

全国高等医学院校教材配套用书
速记助考系列丛书

药理学 要点速记

主编 铁璐

Pharmacology

- ◎ 学习难点
- ◎ 复习要点
- ◎ 考试重点



北京大学医学出版社

全国高等医学院校教材配套用书
速记助考系列丛书

药理学要点速记

主 编 铁 璐

编 者 (按姓名汉语拼音排序)

崔素颖 (北京大学医学部)

崔翔宇 (北京大学医学部)

梅 帆 (北京大学医学部)

铁 璐 (北京大学医学部)

北京大学医学出版社

YAOLIXUE YAODIAN SUJI

图书在版编目(CIP)数据

药理学要点速记/铁璐主编. —北京:北京大学
医学出版社, 2015. 7

(速记助考系列丛书)

ISBN 978-7-5659-0943-6

I. ①药… II. ①铁… III. ①药理学—高等学校—教
学参考资料 IV. ①R96

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2014)第 216630 号

药理学要点速记

主 编: 铁 璐

出版发行: 北京大学医学出版社

地 址: (100191)北京市海淀区学院路 38 号
北京大学医学部院内

电 话: 发行部 010-82802230; 图书邮购 010-82802495

网 址: <http://www.pumpress.com.cn>

E - mail: booksale@bjmu.edu.cn

印 刷: 北京画中画印刷有限公司

经 销: 新华书店

责任编辑: 李 娜 责任校对: 金彤文 责任印制: 李 啸

开 本: 787mm×1092mm 1/32 印张: 8.75

字 数: 228 千字

版 次: 2015 年 7 月第 1 版 2015 年 7 月第 1 次印刷

书 号: ISBN 978-7-5659-0943-6

定 价: 20.00 元

版权所有, 违者必究

(凡属质量问题请与本社发行部联系退换)

出版说明

“速记助考系列丛书”与卫生部第8版教材和教育部“十二五”规划教材配套，将教材中的学习难点、考试重点、复习要点以简洁精要的形式提炼出来。部分内容以表格的形式进行总结归纳，帮助复习记忆。对于最重点的内容，以下划线的形式标记。

- 丛书由北京大学医学部、中国协和医科大学和首都医科大学等知名院校的资深教师，优秀硕士、博士编写，汇集了这些院校多年的教学经验和经典的学习笔记。
- 内容简明扼要，帮助医学生快速掌握教材要点和学科重点，轻松应试。
- 便携式的口袋书，方便随身携带，随时复习。

目 录

第一章 药理学总论——绪言	1
第二章 药物代谢动力学	3
第一节 药物分子的跨膜转运	3
第二节 药物的体内过程	4
第三节 房室模型	8
第四节 药物消除动力学	8
第五节 体内药物的时量关系	9
第六节 药物代谢动力学重要参数	10
第七节 药物剂量的设计和优化	11
第三章 药物效应动力学	13
第一节 药物的基本作用	13
第二节 药物剂量与效应关系	14
第三节 药物与受体	15
第四章 影响药物效应的因素	18
第一节 药物因素	18
第二节 机体因素	18
第五章 传出神经系统药理学概论	21
第一节 概述	21
第二节 传出神经系统的递质和受体	22
第三节 传出神经系统的生理功能	26
第四节 传出神经系统药物的基本作用及其分类	26
第六章 胆碱受体激动药	28
第一节 M、N胆碱受体激动药	28
第二节 M胆碱受体激动药	30
第三节 N胆碱受体激动药	31
第七章 抗胆碱酯酶药和胆碱酯酶复活药	32

第一节 胆碱酯酶	32
第二节 抗胆碱酯酶药	33
第三节 胆碱酯酶复活药	36
第八章 抗胆碱药 (I) ——M 胆碱受体阻断药	38
第一节 阿托品及其类似生物碱	38
第二节 颠茄生物碱的合成、半合成代用品	40
第九章 抗胆碱药 (II) ——N 胆碱受体阻断药	42
第一节 神经节阻断药	42
第二节 骨骼肌松弛药	43
第十章 肾上腺素受体激动药	46
第一节 构效关系及分类	46
第二节 α 、 β 肾上腺素受体激动药	47
第三节 α 肾上腺素受体激动药	50
第四节 β 肾上腺素受体激动药	52
第十一章 肾上腺素受体阻断药	54
第一节 α 肾上腺素受体阻断药	54
第二节 β 肾上腺素受体阻断药	57
第三节 α 、 β 肾上腺素受体阻断药	58
第十二章 中枢神经系统药理学概论	59
第一节 中枢神经系统的细胞学基础	59
第二节 中枢神经递质及其受体	59
第三节 中枢神经系统药理学特点	64
第十三章 全身麻醉药	65
第一节 吸入性麻醉药	65
第二节 静脉麻醉药	67
第三节 复合麻醉	67
第十四章 局部麻醉药	69
第十五章 镇静催眠药	72
第一节 苯二氮革类	72
第二节 巴比妥类	73
第三节 非苯二氮革类镇静催眠药	74
第十六章 抗癫痫药和抗惊厥药	76

第一节	抗癫痫药	76
第二节	常用抗癫痫药物	77
第三节	抗惊厥药	81
第十七章	治疗中枢神经系统退行性疾病药	83
第一节	抗帕金森病药	83
第二节	治疗阿尔茨海默病药	88
第十八章	抗精神失常药	92
第一节	抗精神病药	92
第二节	抗躁狂症药	96
第三节	抗抑郁症药	97
第十九章	镇痛药	103
第一节	概述	103
第二节	阿片受体和内源性阿片肽	104
第三节	吗啡及其相关阿片受体激动药	104
第四节	阿片受体部分激动药和激动-拮抗药	108
第五节	其他镇痛药	110
第六节	阿片受体拮抗药	111
第二十章	解热镇痛抗炎药	112
第一节	概述	112
第二节	非选择性环氧合酶抑制药	114
第三节	选择性环氧合酶-2 抑制药	118
第二十一章	离子通道概论及钙通道阻滞药	120
第一节	离子通道概论	120
第二节	作用于离子通道的药物	121
第三节	钙通道阻滞药	122
第二十二章	抗心律失常药	125
第一节	心律失常的电生理学基础	125
第二节	抗心律失常药的基本作用机制和分类	126
第三节	常用抗心律失常药	127
第二十三章	肾素-血管紧张素系统药理	132
第一节	肾素-血管紧张素系统	132
第二节	血管紧张素转化酶抑制药	133

第三节	血管紧张素Ⅱ受体 (AT ₁ 受体) 拮抗药	134
第二十四章	利尿药	136
第一节	利尿药作用的生理学基础	136
第二节	常用利尿药	136
第二十五章	抗高血压药	141
第一节	抗高血压药物的分类	142
第二节	常用抗高血压药物	143
第三节	其他抗高血压药物	145
第二十六章	治疗充血性心力衰竭的药物	148
第一节	概述	148
第二节	肾素-血管紧张素-醛固酮系统抑制药	149
第三节	利尿药	151
第四节	β受体阻断药	151
第五节	正性肌力药	152
第六节	扩血管药	155
第七节	钙增敏药及 Ca ²⁺ 通道阻滞药	155
第二十七章	调血脂药与抗动脉粥样硬化药	156
第一节	调血脂药	156
第二节	抗氧化剂	159
第三节	多烯脂肪酸	159
第四节	黏多糖和多糖类	160
第二十八章	抗心绞痛药	161
第一节	常用的抗心绞痛药物	162
第二节	其他抗心绞痛药物	165
第二十九章	作用于血液及造血器官的药物	166
第一节	抗凝血药	166
第二节	纤维蛋白溶解药与纤维蛋白溶解抑制药	168
第三节	抗血小板药	168
第四节	促凝血药	169
第五节	抗贫血药及造血细胞生长因子	170
第六节	血容量扩充药	171
第三十章	影响自体活性物质的药物	172

第一节	膜磷脂代谢产物类药物及拮抗药	173
第二节	5-羟色胺类药物及拮抗药	174
第三节	组胺和抗组胺药	175
第四节	腺苷类	176
第三十一章	作用于呼吸系统的药物	177
第一节	平喘药	177
第二节	镇咳药	179
第三节	祛痰药	180
第三十二章	作用于消化系统的药物	181
第一节	治疗消化性溃疡的药物	181
第二节	消化功能调节药	183
第三十三章	子宫平滑肌兴奋药和抑制药	184
第一节	子宫平滑肌兴奋药	184
第二节	子宫平滑肌抑制药	186
第三十四章	性激素类药及避孕药	187
第一节	雌激素类药及雌激素拮抗剂	187
第二节	孕激素类药物	189
第三节	雄激素类药和同化激素类药	191
第四节	避孕药	192
第三十五章	肾上腺皮质激素类药物	195
第一节	概述	195
第二节	糖皮质激素	196
第二节	盐皮质激素	199
第三节	皮质激素抑制药	199
第三十六章	甲状腺激素及抗甲状腺药	200
第一节	甲状腺激素	200
第二节	抗甲状腺药	201
第三十七章	胰岛素及其他降血糖药	206
第一节	胰岛素	206
第二节	口服降血糖药	207
第三节	其他新型降血糖药	210
第三十八章	抗菌药物概论	212

第一节	抗菌药物的常用术语	212
第二节	抗菌药物的作用机制	213
第三节	细菌的耐药性	214
第四节	抗菌药物的合理应用原则	215
第三十九章	β -内酰胺类抗生素	216
第一节	分类和抗菌作用机制	216
第二节	青霉素类抗生素	217
第三节	头孢菌素类抗生素	220
第四节	其他 β -内酰胺类抗生素	222
第五节	β -内酰胺酶抑制药及复方制剂	223
第四十章	大环内酯类、林可霉素类及多肽类抗生素	224
第一节	大环内酯类抗生素	224
第二节	林可霉素类抗生素	227
第三节	多肽类抗生素	227
第四十一章	氨基糖苷类抗生素	230
第一节	概述	230
第二节	常用的氨基糖苷类抗生素	232
第四十二章	四环素及氯霉素类抗生素	234
第一节	四环素类	234
第二节	氯霉素	236
第四十三章	人工合成抗菌药	238
第一节	喹诺酮类	238
第二节	磺胺类	240
第三节	甲氧苄啶 (TMP)	241
第四节	硝基呋喃类	242
第四十四章	抗病毒药及抗真菌药	243
第一节	抗病毒药	243
第二节	抗真菌药	245
第四十五章	抗结核病药和抗麻风病药	248
第一节	抗结核病药	248
第二节	抗结核药的用药原则	251
第三节	抗麻风病药	251

第四十六章	抗寄生虫药	253
第一节	抗疟药	253
第二节	抗阿米巴病药及抗滴虫药	255
第三节	抗血吸虫病药和抗丝虫病药	256
第四节	抗肠蠕虫药	256
第四十七章	抗恶性肿瘤药	257
第一节	抗肿瘤药的作用机制	257
第二节	抗肿瘤药的分类	257
第三节	常用抗肿瘤药	258
第四节	抗恶性肿瘤药的毒性反应	262
第四十八章	影响免疫功能的药物	264
第一节	免疫抑制剂	264
第二节	免疫增强剂	266

药理学总论——绪言

一、药理学的性质与任务

药物：指可以改变或查明机体的生理功能及病理状态，用于预防、诊断和治疗疾病的药物。

药理学：是研究药物与机体（含病原体）相互作用及作用规律的学科。

药理学可分为药物效应动力学（药效学）和药物代谢动力学（药动学）。其中药效学是研究药物对机体（或病原体）的影响，包括作用、效应、作用原理（作用机制）、不良反应等；药动学是研究机体对药物的影响，包括药物的吸收、分布、生物转化、排泄及血药浓度随时间变化的规律。

药理学的任务：① 阐明药物的作用及作用机制；② 研究开发新药；③ 为其他生命科学研究提供重要的科学依据和研究方法。

药理学实验方法包括：① 实验药理学方法；② 实验治疗学方法；③ 临床药理学方法。

二、药物与药理学的发展史

我国第一部政府颁发的药典是唐代的《新修本草》。明代李时珍所著的《本草纲目》是一部世界闻名的药物学巨著。

现代药理学的发展：

19 世纪初：建立了实验药理学整体动物水平的研究方法。

19 世纪 20 年代：开始了器官药理学研究。

19 世纪 70 年代：提出了受体概念。

20 世纪中叶：新药发展的黄金时代，出现了许多新药，如抗生素、抗癌药、抗精神病药、抗高血压药、抗组胺药、抗肾上腺素药等。

三、新药开发与研究

新药：指化学结构、药品组分或药理作用不同于现有药品的药物。

我国《药品管理法》中规定新药指我国未生产过的药品改变剂型、改变给药途径、增加新的适应证或制成新的复方制剂，亦属新药范围。

新药研究过程可分为：临床前研究、临床研究和上市后药物检测，具体如下：

1. 新药临床前研究

(1) 药物化学研究：药物制备工艺路线、理化性质及质量控制标准。

(2) 药理学研究：以实验动物为研究对象的药效学、药动学及毒理学研究。

2. 新药临床研究

(1) I 期临床试验：受试者为 20~30 例正常成年志愿者，了解药物的耐受程度和人体药动学过程。

(2) II 期临床试验：受试者不少于 100 例患者，固定适应证，进行疗效和不良反应观察（随机、双盲、对照），并推荐临床给药剂量。

(3) III 期临床试验：批准试生产后的临床试验，扩大观察新药的疗效、适应证、不良反应，确定是否批准正式生产。

(4) IV 期临床试验（上市后药物检测）：上市后在社会人群大范围内继续进行的新药安全性和有效性评价。

（铁 璐）

第二章

药物代谢动力学

第一节 药物分子的跨膜转运

一、药理通过细胞膜的方式

药理通过细胞膜的方式包括：滤过、简单扩散、载体转运和膜动转运。

(一) 滤过（水溶性扩散）

是指水溶性的极性或非极性药物分子借助于流体静压或渗透压随体液通过细胞膜的水溶性通道而进行的跨膜转运，为被动转运方式。

(二) 简单扩散（脂溶性扩散）

是指脂溶性药物溶于细胞膜的脂质层，顺浓度差通过细胞膜。绝大多数药物按此方式通过生物膜，当药物的脂溶性越大（油水分配系数）和膜两侧的浓度差越大，扩散就越快。

(三) 载体转运

是指转运体在细胞膜的一侧与药物或生理性物质结合后，发生构型改变，在细胞膜的另一侧将结合的内源性物质或药物释出。特点包括选择性、饱和性和竞争性。可分为：

1. 主动转运 耗能，可逆电化学差转运药物。
2. 易化扩散 不需要能量，不能逆电化学差转运药物。

(四) 膜动转运

是指大分子物质通过膜的运动而转运。可分为：

1. 胞饮（吞饮或入胞） 是指某些液态蛋白质或大分子物质通过细胞膜的内陷形成吞饮小泡而进入细胞内。
2. 胞吐（胞裂外排或出胞） 是指胞质内的大分子物质以外泌囊泡的形式排出细胞的过程。

二、影响药物通透细胞膜的因素

(一) 药物的解离度和体液的酸碱度

药物的解离程度取决于体液 pH 和 药物的解离常数 (K_a)，pK_a 为 K_a 的负对数值。

离子型（解离型）药物：极性大，脂溶性小，难跨膜转运；分子型（非解离型）药物：极性小，脂溶性大，易跨膜转运。

酸遇酸，碱遇碱，难解离，脂溶性高，易转移；酸遇碱，碱遇酸，易解离，脂溶性低，难转移。

(二) 药物浓度差以及细胞膜通透性、面积和厚度

通透量(单位时间分子数) = $(C_1 - C_2) \times \frac{\text{面积} \times \text{通透系数}}{\text{厚度}}$

(三) 血流量

血流量丰富，流速快，加快药物跨膜转运速率。

(四) 细胞膜转运蛋白的量和功能

细胞膜转运蛋白的数量影响药物跨膜转运。

第二节 药物的体内过程

一、吸收

吸收：指药物自用药部位进入血液循环的过程。大多数药物的吸收过程为被动转运，少数属于主动转运。

影响药物在体内吸收的因素：包括药物的理化性质（如药

物酸碱性)、给药途径、药物的剂型、给药部位的状况等,其中给药途径对吸收的影响最重要。不同的给药途径,药物吸收的快慢依次为:腹腔注射>吸入>舌下>肌内注射>皮下注射>口服>皮肤。血管内直接给药(如静脉注射)因避开了吸收屏障而直接进入血液,无吸收过程。

首关消除:也称为首关代谢或首关效应,指有些药物在进入全身血液循环前首先在胃肠道、肠壁细胞和肝灭活代谢一部分(主要在肝),导致进入全身血液循环内的有效药物量明显减少。

二、分布

分布:指药物吸收后从血液循环到达机体各个器官和组织的过程。

影响药物在体内分布的因素:包括药物的理化性质、药物与血浆蛋白质和组织蛋白质结合能力、器官和组织分布的血流量、体液 pH 和药物的解离度、体内屏障作用等。

(一) 血浆蛋白的结合率

由游离型药物浓度、血浆蛋白质量和药物与血浆蛋白质的亲和力所决定。

1. 结合是可逆的,以血浆蛋白质结合率(%)表示。
2. 结合型药物:无活性,不被动转运,不代谢,不排泄。
3. 结合可饱和,两种高结合药物可竞争结合,游离型药物增多,作用增强或毒性增加。
4. 老年、某些疾病血浆蛋白质含量降低,游离型药物增多。

(二) 器官血流量

血流丰富的器官药物分布较快。

再分布:指吸收的药物通过血液循环迅速向全身组织输送,首先向血流大的器官分布,然后向血流量小的组织输送的现象。

(三) 组织细胞结合

药物与某些组织亲和力强，则在该组织中的浓度高，这是药物作用部位具有选择性的重要原因。

(四) 体液 pH 和药物的解离度

在生理条件下，弱酸性药物在细胞外液浓度高于细胞内液，升高血液 pH 可促使其由细胞内向细胞外转运，弱碱性药物则相反。

(五) 体内屏障

1. 血脑屏障 指脑组织内毛细血管与神经胶质细胞形成的血浆与脑脊液之间的屏障。只有脂溶性高的药物才能以简单扩散通过血脑屏障；而当出现炎症，增加血脑屏障的通透性也会提高药物在脑脊液中的浓度。

2. 胎盘屏障 胎盘绒毛与子宫血窦之间的屏障。

3. 血眼屏障 指循环血液与眼球内组织液之间的屏障。

三、代谢

代谢：又称为生物转化，指药物在体内经酶或其他作用，发生化学结构的变化。肝是最主要的药物代谢器官。

(一) 药物代谢意义

总体上是解毒和灭活，但也有可能会出现活化及毒性增强，如活化（可的松→氢化可的松）；活性代谢产物（可待因→吗啡）；毒性增强（异烟肼→乙酰肼→肝毒性）。

(二) 药物代谢时相

分为如下两个时相：

1. I 相反应 氧化、还原、水解反应。

2. II 相反应——结合反应 与葡萄糖醛酸、硫酸、甘氨酸等结合。

(三) 药物代谢酶（药酶）

指催化药物代谢的酶。

1. 非专一性酶 肝微粒体混合功能氧化酶（肝药酶），包