

普通医药院校创新型系列教材

药理学

Pharmacology

· 许正新 葛晓群 主编



科学出版社

普通医药院校创新型系列教材

药 理 学

许正新 葛晓群 主编

科学出版社

北京

内 容 简 介

本教材根据成人教育的教学规律和课程特点,在满足本科教学大纲的相关规定和要求的基础上,对学生前期所学内容进行了重组,补充了近些年发展起来的新知识、新观点和新理念,按照集中授课和自学相结合的原则进行编排。本教材共分为 43 章,内容包括药理学的基本理论、各章节主要的药理学知识点、重点药物、常用药物,尤其密切关注的是所介绍内容的实用性。重点和代表性的内容、药物则做系统介绍。为扩大学生的知识面及便于学生自学,每章还添加了“知识拓展”和“思考题”,以激发学生的学习兴趣及供需要的学生选择性阅读。

本教材可供高等医药院校医学及医学相关专业本、专科学生、成人高考学员,以及从事各层次医学及医学相关专业教学、管理工作者参考、学习使用。

图书在版编目(CIP)数据

药理学 / 许正新, 葛晓群主编. —北京: 科学出版社, 2015. 9

普通医药院校创新型系列教材

ISBN 978 - 7 - 03 - 045795 - 0

I. ①药… II. ①许… ②葛… III. ①药理学—医学院校—教材 IV. ①R96

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2015)第 226093 号

责任编辑: 闵 捷 陆纯燕
责任印制: 谭宏宇 / 封面设计: 殷 靓

科学出版社 出版

北京东黄城根北街 16 号

邮政编码: 100717

<http://www.sciencep.com>

南京展望文化发展有限公司排版

上海叶大印务发展有限公司印刷
科学出版社发行 各地新华书店经销

*

2015 年 9 月第一 版 开本: 889×1194 1/16

2015 年 9 月第一次印刷 印张: 10 3/4

字数: 315 000

定价: 34.00 元

(如有印装质量问题, 我社负责调换)

普通医药院校创新型系列教材

专家指导委员会

主任委员：阮长耿（中国工程院院士）

副主任委员：史宏灿 鞠永熙

委员：（按姓氏笔画排序）

王 炜	王 艳	王加凤	王建军	王静成
孔 祥	史宏灿	刘永兵	刘歆农	许爱华
严 华	李国利	李湘鸣	杨维平	沈维干
张 育	张振刚	张培建	郁多男	季明春
周晓霞	郑 英	胡 艺	顾 晓	高利增
黄 谦	龚卫娟	梁景岩	葛晓群	鞠永熙

普通医药院校创新型系列教材

《药理学》编辑委员会

主 编：许正新 葛晓群

副主编：夏叶玲 李 巍

编 委：(按姓氏笔画排序)

王冬艳 王锦淳 朱 磊 许正新
李 巍 陈 琴 郑 雪 施长城
姜 新 枫 丽 夏叶玲 崔丽蓉
葛晓群

总序

高等教育改革的关键是提高教育质量,医学教育尤其如此。医药卫生体制改革是一项重大的民生工程,对医学人才培养的结构、质量也提出了更加迫切的要求;同时世界医学也正在发生深刻变化,医学的社会性、公平性、整合性,健康需求的广泛性、医学的国际化都在加速发展,医学发展新趋势对医学教育提出了新挑战。要解决这些问题,关键要改革创新,要通过综合改革,提高质量,提高水平,满足医疗卫生事业和人民群众的健康需求。

2014年6月,国家教育部等六部门出台“关于医教协同,深化临床医学人才培养改革的意见”,意见指出:到2020年,基本建成院校教育、毕业后教育、继续教育三阶段有机衔接的具有中国特色的标准化、规范化临床医学人才培养体系。院校教育质量显著提高,毕业后教育得到普及,继续教育实现全覆盖。

继续医学教育与全日制本科教育相比,具有其自身的规律与特点。继续医学教育在课程设置、教学内容、教学时数、授课方式上都有相应变化,体现了成人教育的成人性、自主性和实践性。扬州大学医学院基于自身学科优势和办学经验,根据国家医学本科专业培养要求,以“优化资源、重视素质、强调创新”为理念,坚持“本科水平、成人特色、重在实用、便于自学”的原则,精心策划和编写了这套教材,体现了科学性、实用性和启发性。使用对象主要是继续医学教育、医药类本科专业学生等,对基层医务工作者、各类专业培训也有适用性。同时也可作为专业教师的参考用书。

全套教材涉及基础医学、临床医学、护理学、预防医学等相关核心课程,内容丰富翔实、信息量大;理论联系实际、实用性强;语言简洁练达、图文并茂。相信这套教材的出版,必将对临床医学、护理学等专业教育质量的不断提升起到重要的推动作用。



阮长耿

中国工程院院士

2015年4月

前　言

药理学主要研究药物与机体(包括病原体)间相互作用及其规律,其目的是为临床安全、有效、合理用药提供理论依据,属于基础医学与临床医学、医学与药学间的桥梁学科,也是临床医学、药学、护理学、口腔医学、医学检验等相关专业学生必修课程。

本教材的立足点是具有一定药理学基础的专升本各专业的学生和临床医务人员。为适应成人教育各层次人才培养的要求,一方面需要满足本科教学大纲的具体规定和要求,做到应该掌握的重点内容不遗漏,重复性或解释性的内容弱化,另一方面又体现出浓厚的成人教育特点,重在归纳、总结,强调其简单化、实用性、系统性,便于自学。在内容安排上,全书共分为43章,每章前均列出了“学习要点”,对各部分内容把握的明确要求;每章后有“小结”、“思考题”;为扩大学生的知识面及便于其自学,每章还添加了“知识拓展”,以激发学生的兴趣及供需要的学生选择性阅读,拓宽其视野。

本教材主要特色:第一,在内容上力求以各种不同的方式更多地体现相关的新知识、新技能和新理论。通过教育,使学生得以在理论和实践能力诸方面得到全面提升。第二,在方式上既体现必须掌握的已有基础知识,又赋予了新技术、新进展及拓展学习的空间。具体教学过程中,弱化一般性或过于理论化的內容,对于学生已经学过的基础理论和技能,不再过多展开,对于学习中的重点、难点、疑点部分则花较大篇幅阐述,对于一些扩展性知识,要求学生通过学校、社会等各种网络教育平台及课程视频光盘进行自学,最终实现已学过的知识弱化、新的和进展性的知识强化、拓展性的知识网络化。相信通过这些体例设计,能够使学生用较少的学习时间,加深和提高对药理学的理解和认识,提高学习效率,增强学习效果。

本教材的出版,做到成人教育的课前、中、后相贯通,教育前、中、后的评价相结合,学生、教师、网络相协调的效果,与适应目前成人教育的现状和发展趋势、教师的状态和信息技术的具体运用相匹配。

就组织管理而言扬州大学医学院各级领导都很重视本教材的出版工作,多次就编写的形式、内容等组织相关专家讨论、论证。本教材由扬州大学出版基金资助。

限于我们的能力、认识水平、知识结构,加之时间紧张,书中难免有疏漏和错误,在此,恳请广大师生和专家提出宝贵意见,以便今后再版时进行修订。

主 编

2015年3月20日

目 录

总序
前言

第一章 緒言

1

一、药理学的性质与任务	1	三、新药研究与开发	1
二、药物与药理学的发展史	1		

第二章 药物代谢动力学——药动学

3

第一节 药物分子的跨膜转运	3	二、药物消除动力学	5
一、药物通过细胞膜的方式	3	第四节 体内药量变化的时间过程	5
二、影响药物通透细胞膜的因素	3	一、单次给药的时-量曲线下面积	6
第二节 药物的体内过程	4	二、多次给药的稳态血药浓度	6
一、吸收	4	第五节 药物代谢动力学重要参数	6
二、分布	4	一、消除半衰期	6
三、生物转化	4	二、消除速率常数	6
四、排泄	5	三、清除率	6
第三节 房室模型与药物消除动力学	5	四、表观分布容积	7
一、房室模型	5	五、生物利用度	7

第三章 药物效应动力学——药效学

8

第一节 药物的基本作用	8	二、质反应的量-效曲线	10
一、药物作用与药理效应	8	第三节 药物的作用机制	10
二、治疗效果	8	第四节 药物与受体	10
三、不良反应	9	一、受体的概念与特性	10
第二节 药物剂量与效应关系	9	二、受体的类型	11
一、量反应的量-效曲线	9	三、药物与受体相互作用	11

四、作用于受体的药物分类	11	六、受体的调节	12
五、细胞内信号转导	11		
第四章 影响药物效应的因素			13
第一节 药物方面的因素	13	一、患者的生理因素	13
一、药物剂型和给药途径	13	二、遗传因素	14
二、联合用药及药物相互作用	13	三、病理状态	14
第二节 机体方面的因素	13	四、机体对药物反应的变化	14
第五章 传出神经系统药理学概论			16
第一节 概述	16	第三节 传出神经系统药物基本作用及其分类	17
第二节 传出神经系统的递质及受体	16	一、传出神经系统药物基本作用	17
一、传出神经系统的递质	16	二、传出神经系统药物分类	17
二、传出神经系统的受体	17		
第六章 胆碱受体激动药			19
第一节 M,N 胆碱受体激动药	19	第三节 N 胆碱受体激动药	20
第二节 M 胆碱受体激动药	19		
第七章 抗胆碱酯酶药和胆碱酯酶复活药			21
第一节 胆碱酯酶	21	农药	22
第二节 抗胆碱酯酶药	21	第三节 胆碱酯酶复活药	22
一、易逆性抗胆碱酯酶药	21	一、氯解磷定	23
二、难逆性抗胆碱酯酶药——有机磷酸酯类		二、碘解磷定	23
第八章 胆碱受体阻断药(I)——M 胆碱受体阻断药			24
第一节 阿托品及其类似生物碱	24	二、其他阿托品类生物碱	25
一、阿托品	24	第二节 鞣茄生物碱的合成、半合成代用品	26
第九章 胆碱受体阻断药(II)——N 胆碱受体阻断药			27
第一节 NN受体阻断药——神经节阻断药	27	一、除极化型肌松药	27
第二节 NM受体阻断药——骨骼肌松弛药	27	二、非除极化型肌松药	27
第十章 肾上腺素受体激动药			29
第一节 α肾上腺受体激动药	29	二、间羟胺、去氧肾上腺素和甲氧明	29
一、去甲肾上腺素	29	第二节 α,β肾上腺受体激动药	30

一、肾上腺素	30	第三节 β 肾上腺受体激动药	31
二、多巴胺	30	一、异丙肾上腺素	31
三、麻黄碱	30	二、多巴酚丁胺	31
第十一章 肾上腺素受体阻断药 33			
第一节 α 肾上腺素受体阻断药	33	一、非选择性 β 肾上腺素受体阻断药	35
一、非选择性 α 肾上腺素受体阻断药	33	二、选择性 β_1 肾上腺素受体阻断药	35
二、选择性 α_1 肾上腺素受体阻断药	34	第三节 α, β 肾上腺素受体阻断药	35
三、选择性 α_2 肾上腺素受体阻断药	34	一、拉贝洛尔(柳胺苄心定)	35
第二节 β 肾上腺素受体阻断药	34	二、卡维地洛	35
第十二章 麻醉药 37			
第一节 局部麻醉药	37	第二节 全身麻醉药	38
一、药理作用	37	一、吸入性麻醉药	38
二、麻醉方法	37	二、静脉麻醉药	38
三、常用局麻药	37	三、复合麻醉	38
第十三章 镇静催眠药 40			
第一节 苯二氮䓬类	40	二、扎来普隆	41
第二节 巴比妥类	41	三、佐匹克隆	41
第三节 其他镇静催眠药	41	四、其他	42
一、唑吡坦	41		
第十四章 抗癫痫药和抗惊厥药 43			
第一节 抗癫痫药	43	四、乙琥胺	44
一、苯妥英钠	43	五、丙戊酸钠	44
二、苯巴比妥	43	六、苯二氮䓬类	44
三、卡马西平	43	第二节 抗惊厥药	44
第十五章 抗中枢神经系统退行性疾病药 46			
第一节 抗帕金森病药	46	第二节 治疗阿尔茨海默病药	47
一、拟多巴胺类药	46	一、胆碱酯酶抑制药	47
二、中枢性抗胆碱药	47	二、其他常用治疗 AD 的药物	47
第十六章 抗精神失常药 49			
第一节 抗精神病药	49	二、非典型抗精神病药	50
一、经典抗精神病药	49	第二节 抗躁狂症药	51

第三节 抗抑郁症药	51	三、选择性 5-HT 再摄取抑制剂	52
一、5-HT 及 NA 再摄取抑制剂	51	四、其他	52
二、选择性 NA 再摄取抑制剂	52		
第十七章 镇痛药			53
第一节 阿片生物碱类镇痛药	53	第三节 阿片受体部分激动药和激动-拮抗药	55
一、吗啡	53	第四节 阿片受体拮抗药	55
二、可待因	54	一、纳洛酮	55
第二节 人工合成的阿片受体激动药	54	二、纳曲酮	55
第十八章 解热镇痛抗炎药			57
第一节 非选择性环氧合酶抑制药	57	二、对乙酰氨基酚	58
一、阿司匹林	57	第二节 选择性环氧合酶-2 抑制剂	58
第十九章 钙通道阻滞药			60
第一节 钙通道阻滞药的分类	60	第二节 钙通道阻滞药的药理作用和临床应用	60
一、选择性钙通道阻滞药	60	第三节 常用钙通道阻滞药	61
二、非选择性钙通道阻滞药	60		
第二十章 抗心律失常药			63
第一节 心律失常的电生理学基础	63	第三节 常用抗心律失常药	65
一、正常心肌电生理学特征	63	一、I类——钠通道阻滞药	65
二、心律失常发生的电生理学机制	63	二、II类——β受体阻断药	66
第二节 抗心律失常药的基本电生理		三、III类——延长动作电位时程药	66
作用及药物分类	64	四、IV类——钙通道阻滞药	67
一、抗心律失常药的基本电生理作用	64	五、其他类药	67
二、抗心律失常药物的分类	64		
第二十一章 抗高血压药			68
第一节 抗高血压药物的分类	68	第三节 其他抗高血压药物	71
第二节 常用抗高血压药物	68	一、中枢性降压药	71
一、利尿药	68	二、血管扩张药	71
二、钙通道阻滞药	69	三、神经节阻断药	71
三、肾上腺素受体阻断药	69	四、去甲肾上腺素能神经末梢阻断药	72
四、肾素-血管紧张素系统抑制药	69	五、其他新型抗高血压药	72

第二十二章 治疗心力衰竭的药物

73

第一节 肾素-血管紧张素-醛固酮系统抑制药	73	第三节 β受体阻断药	74
一、血管紧张素Ⅰ转化酶抑制剂(ACE I)	73	第四节 强心苷类正性肌力药	75
二、血管紧张素Ⅱ受体(AT ₁)阻断药	74	第五节 血管扩张药	76
三、醛固酮拮抗药——螺内酯	74	第六节 非苷类正性肌力药	76
第二节 利尿药	74	第七节 其他治疗心力衰竭的药物	76

第二十三章 调血脂药与抗动脉粥样硬化药

78

第一节 调血脂药	78	第二节 抗氧化剂	79
一、主要降低 TC 和 LDL 的药物	78	第三节 其他类	79
二、主要降低 TG 和 VLDL 的药物	79		

第二十四章 抗心绞痛药

81

第一节 硝酸酯类	81	第二节 β受体阻断药	82
一、硝酸甘油	81	第三节 钙通道阻滞药	82
二、硝酸异山梨酯	82		

第二十五章 利尿药和脱水药

84

第一节 利尿药	84	三、保钾利尿药(低效能利尿药)	85
一、袢利尿药(高效利尿药)	84	四、碳酸酐酶抑制药	85
二、噻嗪类及类噻嗪类利尿药(中效利尿药)	85	第二节 脱水药	85

第二十六章 作用于血液系统及造血器官的药物

87

第一节 抗凝血药	87	一、维生素 K	89
一、肝素类	87	二、凝血因子制剂	90
二、香豆素类	88	三、纤维蛋白溶解抑制药	90
三、枸橼酸钠	88	第五节 抗贫血药及造血细胞生长因子	90
第二节 抗血小板药	89	一、抗贫血药	90
第三节 纤维蛋白溶解药	89	二、造血细胞生长因子	91
第四节 促凝血药	89	第六节 血容量扩充药	92

第二十七章 组胺和抗组胺药

94

第一节 组胺	94	一、H ₁ 受体阻断剂	94
第二节 抗组胺药	94	二、H ₂ 受体阻断剂	95

第二十八章 作用于呼吸系统的药物	97
第一节 平喘药	97
一、支气管扩张药	97
二、抗炎平喘药	98
三、抗过敏平喘药	98
第二节 镇咳药	98
一、中枢性镇咳药	98
二、外周性镇咳药	99
第三节 祛痰药	99
一、痰液稀释药	99
二、黏痰溶解药	99
第二十九章 作用于消化系统的药物	100
第一节 抗消化性溃疡药	100
一、抗酸药	100
二、抑制胃酸分泌药	100
三、胃黏膜保护药	101
四、抗幽门螺杆菌药	101
第二节 消化功能调节药	101
一、助消化药	101
二、止吐药	101
三、增强胃肠动力药	101
四、泻药	101
五、止泻药与吸附药	101
六、利胆药	102
第三十章 子宫平滑肌兴奋药与抑制药	103
第一节 子宫平滑肌兴奋药	103
一、缩宫素	103
二、麦角生物碱	104
第二节 子宫平滑肌抑制药	104
三、前列腺素类	104
第三十一章 肾上腺皮质激素类药物	106
第一节 糖皮质激素	106
第二节 盐皮质激素	108
第三节 促皮质素及皮质激素抑制药	108
一、促皮质素	108
二、皮质激素抑制药	109
第三十二章 甲状腺激素及抗甲状腺药	110
第一节 甲状腺激素	110
第二节 抗甲状腺药	110
一、硫脲类	110
二、碘及碘化物	111
三、放射性碘	111
四、β受体阻断药	111
第三十三章 胰岛素及其他降血糖药	113
第一节 胰岛素	113
第二节 口服降血糖药	114
一、磺酰脲类	114
二、双胍类	114
三、胰岛素增敏药	114
四、α-葡萄糖苷酶抑制药及餐时血糖调节药	114
第三节 其他新型降血糖药	115
一、以胰高血糖素肽-1(GLP-1)为作用靶点的药物	115
二、胰淀粉样多肽类似物	115

第三十四章 抗菌药物概论	116
第一节 抗菌药物的常用术语	116
第二节 抗菌药物的作用机制	117
第三节 细菌耐药性	117
第四节 抗菌药物的合理应用原则	117
第三十五章 β-内酰胺类抗生素	119
第一节 青霉素类	119
一、天然青霉素	119
二、半合成青霉素	120
第二节 头孢菌素类	121
第三节 其他 β -内酰胺类	121
第三十六章 大环内酯类、林可霉素类及万古霉素、杆菌肽	124
第一节 大环内酯类抗生素	124
一、红霉素	124
二、罗红霉素	124
三、克拉霉素	125
四、阿奇霉素	125
第二节 林可霉素类抗生素	125
一、万古霉素类	125
二、杆菌肽	126
第三十七章 氨基糖苷类抗生素及多黏菌素	127
第一节 氨基糖苷类抗生素	127
一、氨基糖苷类抗生素的共性	127
二、常用氨基糖苷类抗生素	128
第二节 多黏菌素类抗生素	128
第三十八章 四环素类及氯霉素类	130
第一节 四环素类抗生素	130
一、四环素	130
二、多西环素	130
第二节 氯霉素类抗生素	131
第三十九章 人工合成抗菌药	132
第一节 喹诺酮类抗菌药	132
一、喹诺酮药物概述	132
二、常用喹诺酮类药物的特点	132
第二节 磺胺类抗菌药	133
一、磺胺类药物概述	133
二、常用的磺胺类药物	133
三、常用的磺胺类药物	133
四、其他合成抗菌药	133
五、甲氧苄啶(TMP)	133
六、硝基呋喃类药物	133
七、硝基咪唑类药物	134
第四十章 抗真菌药及抗病毒药	135
第一节 抗真菌药	135
一、抗生素类	135
二、唑类	135
三、丙烯胺类	135
四、嘧啶类	136
第二节 抗病毒药	136

一、抗疱疹病毒药	136	三、抗流感病毒药	136
二、抗艾滋病病毒药	136	四、其他	137

第四十一章 抗结核病药与抗麻风病药 138

第一节 抗结核病药	138	三、抗结核病药的应用原则	139
一、一线抗结核病药	138	第二节 抗麻风病药	140
二、二线抗结核病药	139		

第四十二章 抗寄生虫药 141

第一节 抗疟药	141	第三节 抗血吸虫病和抗丝虫病药	143
一、主要用于控制症状的药物	141	一、抗血吸虫病药	143
二、主要用于阻止复发和传播的药物	142	二、抗丝虫病药	143
三、主要用于病因性预防的药物	142	第四节 抗肠蠕虫药	143
第二节 抗阿米巴病药	142		

第四十三章 抗恶性肿瘤药 145

第一节 抗恶性肿瘤药的药理学基础	145	物	147
一、抗肿瘤药物的作用机制	145	四、抑制蛋白质合成与功能的药物	147
二、耐药性产生的机制	145	五、影响体内激素平衡的药物	148
第二节 常用的抗恶性肿瘤药	146	六、分子靶向药物	148
一、影响核酸生物合成的药物	146	七、其他	149
二、影响 DNA 结构与功能的药物	146	第三节 抗恶性肿瘤药的联合应用	149
三、嵌入 DNA 干扰转录过程和阻止 RNA 合成的药			

主要参考文献 151

第一章 絮 言

学习要点

- 掌握：药理学、药物、药效学和药动学的概念。
- 熟悉：新药研究与开发的过程。
- 了解：了解我国“本草”的贡献和现代药理学发展。

一、药理学的性质与任务

药物是指可以改变或查明机体的生理功能及病理状态,用以预防、诊断和治疗疾病的物质。药理学是指研究药物与机体(含病原体)相互作用及作用规律的学科。它既研究药物对机体的作用及作用机制,即药物效应动力学(简称药效学);也研究药物在机体的影响下所发生的变化及其规律,即药物代谢动力学(简称药动学)。

药理学的学科任务主要包括:阐明药物的作用及作用机制,为临床合理用药、发挥药物的最佳疗效、防治不良反应提供理论依据;研究、开发新药,发现药物新用途;为其他生命科学的研究探索提供重要的科学依据和研究方法。

二、药物与药理学的发展史

早期的药物发展源于人们的社会实践活动。在漫长的历史进程中,人们逐渐从生产、生活经验中认识到许多天然物质可以治疗疾病,后人将此经验传授下来,由此留下了一系列的历史典籍。著名的著作有:公元1世纪前后的《神农本草经》、第一部以政府名义颁发的唐代的《新修本草》及明朝药物学家李时珍编著的《本草纲目》等。而现代的药物发展与药理学的建立则是基于实践基础上的,与现代科学技术的发展紧密相关。

三、新药研究与开发

现代科技的发展使得新药研究和开发不断走向深入。所谓新药,是指化学结构、药品组成或药理作用不同于现有药品的药物。其发展大致可分为临床前研究、临床研究和上市后药物监测三个阶段。临床前研究主要由药学研究及临床前药理研究两部分组成。前者包括药物的理化性质、药品制备工艺路线及质量控制标准等;后者则是以实验动物为基础的药效学、药动学和毒理学研究。

知识拓展

新药的研究和开发需要经历漫长的过程,耗费大量的人力、物力和财力,经过一系列严格的筛选和反复论证,最终才能走上临床,为患者的健康保驾护航,正因如此,每一个新药刚开始上市的时候,其价格都比较高,但随着用药时间的延长和其开发成本的逐步收回,后期其价格将有较大的回落。

小 结

药理学是指研究药物与机体(含病原体)相互作用及作用规律的学科,其内容包括药效学和药动学两

个方面。药理学的学科任务主要包括：阐明药物的作用及作用机制；研究、开发新药，发现药物新用途及其他生命科学的研究探索提供重要的科学依据和研究方法。

【思考题】

名词解释：① 药理学，② 药物，③ 药效学，④ 药动学。

(许正新)