

全国医学院校高职高专教材

药 理 学

主 编 成正雄

副主编 周利玲 曾 靖

北京大学医学出版社

全国医学院校高职高专教材

药 理 学

主 编 成正雄
副主编 周利玲 曾 靖
编 委 (以姓氏笔画为序)

王萌梦 (石家庄医学高等专科学校)

成正雄 (长沙医学院)

杨 华 (桂林医学院)
吴虎平 (湖南医药学院)
陈 明 (黔南民族医学高等专科学校)
周利玲 (怀化医学高等专科学校)
周希瑜 (岳阳职业技术学院)
黄宇江 (永州职业技术学院)
曾 靖 (赣南医学院)

北京大学医学出版社

YAO LI XUE

图书在版编目 (CIP) 数据

药理学/成正雄主编. —北京: 北京大学医学出版社,
2006. 8

全国医学院校高职高专教材

ISBN 7-81071-870-3

I. 药... II. 成... III. 药理学—高等学校: 技术
学校—教材 IV. R96

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2006) 第 064410 号

药理学

主 编: 成正雄

出版发行: 北京大学医学出版社 (电话: 010-82802230)

地 址: (100083) 北京市海淀区学院路 38 号 北京大学医学部院内

网 址: <http://www.pumpress.com.cn>

E-mail: booksale@bjmu.edu.cn

印 刷: 北京东方圣雅印刷有限公司

经 销: 新华书店

责任编辑: 张彩虹 责任校对: 杜 悦 责任印制: 郭桂兰

开 本: 787mm×1092mm 1/16 印张: 23.25 字数: 592 千字

版 次: 2006 年 8 月第 1 版 2006 年 8 月第 1 次印刷 印数: 1-8000 册

书 号: ISBN 7-81071-870-3/R·870

定 价: 29.90 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)

前 言

根据教育部对“十一五”期间高等教育教材建设的精神，为适应教育教学改革的需要，全国医学院校高职高专教材编审委员会组织了长沙医学院等十余所院校的专家和教学一线的经验丰富的教师编写了本教材。

本教材以3年制临床医学专科为主体，兼顾高级护理、妇幼医学、美容医学、针灸推拿、医学影像、中医药学、预防医学、药学等专业，反映本学科的基本任务和培养目标。编写过程中，既注意保持教材内容的科学性、系统性和完整性，也注意体现教材的实用性与适用性，特别注重加强学生综合应用所学知识、分析解决问题能力的培养。本教材既体现了新的教学理念，反映了药理学的新进展，又切合高职高专教学的实际。

本书总论设置4章，全面介绍了药理学的基本理论、基本知识，各论设置36章，侧重介绍药物作用机制、作用特点、体内过程特点与临床应用、不良反应与注意事项。

全书药名统一采用2005版药典法定名（药典未明载的以《中国药品通用名称》为准）。医学术语采用全国自然科学名词审定委员公布的科技名词。

本教材编写过程中，参考了国内外有关书籍、相关期刊中的宝贵资料；得到了各有关院校领导及教师的大力支持和指导，谨在此一并深致谢忱。

因时间仓促，编者水平有限，缺点谬误在所难免，恳请医药界同仁及读者批评指正。

编 者

2006年8月

目 录

总 论

第一章 绪 言	3
第一节 药理学的性质与任务	3
第二节 药理学的发展史	3
第三节 药理学研究方法	4
第二章 药物代谢动力学	5
第一节 药物的跨膜转运及影响因素	5
一、被动转运（分配系数）	5
二、主动转运	6
三、膜动转运	6
第二节 药物的体内过程	7
一、吸 收	7
二、分 布	8
三、生物转化	9
四、排 泄	9
第三节 药物代谢动力学基本概念	11
一、体内药量变化的时间过程	11
二、药动学常用参数及其意义	12
三、房室模型	16
四、连续多次给药的药-时曲线和稳态血药浓度	16
第三章 药物效应动力学	18
第一节 药物的基本作用	18
一、药物作用与药理效应	18
二、药物作用的基本类型	18
三、药物作用的选择性	18
四、药物作用的两重性	19
第二节 药物作用机制	21
一、非特异性药物作用机制	21
二、特异性药物作用机制	21
第三节 药物与受体	22
一、受体概念及相关术语	22
二、受体的特性	22
三、受体学说	23
四、受体类型	23

五、受体与药物	24
六、药物作用于受体后的信号转导	25
七、受体调节	25
第四节 药物的构效关系与量效关系	26
一、药物的构效关系	26
二、药物的量效关系	26
三、药物的安全性评价	28
第四章 影响药物效应的因素	30
第一节 药物方面的因素	30
一、药物的剂量、剂型和给药途径	30
二、用药时间与间隔	30
三、联合用药及药物相互作用	31
第二节 机体方面的因素	32
一、年 龄	32
二、性 别	32
三、遗传因素	33
四、病理状态	33
五、心理因素	33
六、机体对药物反应的变化	34

各 论

第五章 传出神经系统药理学概论	37
第一节 概 述	37
第二节 传出神经系统递质和受体	37
一、传出神经系统递质	38
二、传出神经系统受体	39
第三节 传出神经系统的生理功能	39
一、传出神经系统相关受体的分布以及受体激动后产生的生理效应	39
二、传出神经系统受体的功能及其分子机制	40
第四节 传出神经系统药物基本作用及其分类	40
一、传出神经系统药物基本作用	40
二、传出神经系统药物分类	41
第六章 拟胆碱药	42
第一节 胆碱受体激动药	42
一、激动 M、N 受体类	42
二、主要激动 M 受体类	43
三、主要激动 N 受体类	44
第二节 抗胆碱酯酶药和胆碱酯酶复活药	45
一、抗胆碱酯酶药	45
二、胆碱酯酶复活药	49

第七章 胆碱受体阻断药	50
第一节 M受体阻断药	50
一、阿托品类生物碱	50
二、颠茄生物碱的合成代用品	52
第二节 神经节阻断药	53
第三节 骨骼肌松弛药	53
一、除极型肌松药	54
二、非除极型肌松药	54
第八章 肾上腺素受体激动药	56
第一节 肾上腺素受体激动药构效关系及分类	56
一、构效关系	56
二、分 类	56
第二节 α 肾上腺素受体激动药	57
第三节 α 、 β 肾上腺素受体激动药	59
第四节 β 肾上腺素受体激动药	62
第九章 肾上腺素受体阻断药	64
第一节 α 肾上腺素受体阻断药	64
一、非选择性 α 受体阻断药	65
二、选择性 α_1 受体阻断药	66
三、选择性 α_2 受体阻断药	66
第二节 β 肾上腺素受体阻断药	67
一、非选择性 β 受体阻断药	69
二、选择性 β_1 受体阻断药	69
第三节 α 、 β 肾上腺素受体阻断药	69
第十章 局部麻醉药	71
第十一章 镇静催眠抗惊厥药	74
第一节 镇静催眠药	74
一、苯二氮䓬类	74
二、巴比妥类	78
三、其他镇静催眠药	79
第二节 抗惊厥药	80
第十二章 抗癫痫药与抗帕金森病药	81
第一节 抗癫痫药	81
一、概 述	81
二、常用抗癫痫药物	81
三、抗癫痫新药	84
四、癫痫的治疗原则	84
第二节 抗帕金森病药	85
一、中枢拟多巴胺类药	86
二、中枢胆碱受体阻断药	87

第十三章 抗精神失常药	89
第一节 抗精神病药	89
一、吩噻嗪类	89
二、丁酰苯类	93
三、硫杂蒯类	93
四、其他结构的抗精神病药	94
第二节 抗躁狂药和抗抑郁药	94
一、抗躁狂药	94
二、抗抑郁药	96
第三节 抗焦虑药	99
第十四章 镇痛药	100
第一节 阿片生物碱类镇痛药	100
第二节 人工合成镇痛药	104
第三节 其他镇痛药	106
第四节 阿片受体阻断药	107
第十五章 解热镇痛抗炎药	108
第一节 解热镇痛抗炎药的基本作用	108
一、解热作用	108
二、镇痛作用	108
三、抗炎作用	109
第二节 常用解热镇痛抗炎药	109
一、水杨酸类	109
二、苯胺类	111
三、吡唑酮类	112
四、其他抗炎有机酸类	112
五、解热镇痛药的复方配伍	114
第三节 抗痛风药	114
第十六章 中枢兴奋药与促大脑功能恢复药	116
第一节 中枢兴奋药	116
一、主要兴奋大脑皮质的药物	116
二、主要兴奋延髓呼吸中枢的药物	118
第二节 促大脑功能恢复药	119
第十七章 抗高血压药	121
第一节 概 述	121
第二节 常用抗高血压药	122
一、利尿药	122
二、钙拮抗药	122
三、 β 受体阻断药	124
四、作用于肾素-血管紧张素系统药	125
五、中枢性降压药	127

六、 α_1 受体阻断药	128
七、血管平滑肌舒张药	129
八、去甲肾上腺素能神经末梢阻滞药	130
九、神经节阻断药	130
第三节 新型抗高血压药	131
一、钾通道开放药(钾外流促进药)	131
二、肾素抑制药	131
三、5-HT受体阻断药	132
四、前列环素合成促进药	132
五、内皮素受体阻断药	132
第四节 抗高血压药的合理应用	133
第十八章 抗心律失常药	134
第一节 概述	134
一、心律失常的发生机制	134
二、心律失常发生的电生理学机制	135
三、抗心律失常药的基本作用与分类	135
第二节 常用抗心律失常药及应用原则	137
一、常用抗心律失常药	137
二、抗心律失常药应用原则	143
第十九章 治疗充血性心力衰竭药物	144
第一节 概述	144
一、充血性心力衰竭的病理生理学基础	144
二、治疗充血性心力衰竭药物的分类	146
第二节 治疗充血性心力衰竭的常用药	146
一、肾素-血管紧张素-醛固酮系统(RAAS)抑制药	146
二、利尿药	148
三、 β 受体阻断药	149
四、强心苷类	150
五、其他治疗CHF的血管扩张药	155
六、其他治疗CHF的药物——非苷类正性肌力作用药	156
第二十章 抗心绞痛药	157
第一节 概述	157
一、心绞痛的病理生理学基础	157
二、抗心绞痛药的作用与分类	158
第二节 常用抗心绞痛药及其合理应用	158
一、硝酸酯类	158
二、 β 受体阻断药	160
三、钙通道阻滞药	161
四、其他抗心绞痛药	162
五、抗心绞痛药物的合理应用	163

第二十一章 调血脂药与抗动脉粥样硬化药	164
第一节 调血脂药	164
一、主要降低 TC 和 LDL 的药物	164
二、主要降低 TG 及 VLDL 的药物	166
第二节 抗血小板药	168
第三节 抗氧化剂	168
第二十二章 作用于血液及造血系统药物	171
第一节 促凝血药	171
一、促进凝血因子活性药	171
二、凝血因子制剂	172
三、抗纤维蛋白溶解药	173
第二节 抗凝血药	174
一、抗凝血药	175
二、纤维蛋白溶解药	177
三、抗血小板药	179
第三节 抗贫血药	180
第四节 促白细胞生成药	183
第五节 血容量扩充药	184
第二十三章 利尿药和脱水药	185
第一节 利尿药	185
一、利尿药分类	185
二、利尿药作用的生理学基础	185
三、常用利尿药	187
第二节 脱水药	192
第二十四章 拟组胺药与抗组胺药	194
第一节 组胺受体激动药	194
第二节 组胺受体阻断药	196
一、H ₁ 受体阻断药	196
二、H ₂ 受体阻断药	197
第二十五章 消化系统疾病用药	198
第一节 助消化药	198
第二节 抗消化性溃疡药	199
一、抗酸药	199
二、抑制胃酸分泌药	200
三、抗幽门螺杆菌药	202
四、胃、十二指肠黏膜保护药	202
第三节 胃肠运动功能调节药	204
一、胃肠动力药	204
二、胃肠解痉药	206
第四节 止吐药与催吐药	206

一、止吐药	206
二、催吐药	208
第五节 泻药与止泻药	208
一、泻药	208
二、止泻药	210
第六节 肝胆疾病用药	211
一、利胆药与胆石溶解药	211
二、治疗肝昏迷药	212
第二十六章 呼吸系统疾病用药	213
第一节 镇咳药	213
一、中枢性镇咳药	213
二、外周性镇咳药	214
第二节 祛痰药	215
一、黏痰溶解药	215
二、痰液稀释药(恶心性祛痰药)	216
三、刺激性祛痰药	216
第三节 平喘药	217
一、支气管扩张药	217
二、糖皮质激素类药	220
三、过敏介质阻释药	221
第二十七章 子宫平滑肌收缩药与舒张药	223
第一节 子宫平滑肌收缩药	223
一、垂体后叶素类	223
二、麦角生物碱类	225
三、中草药	226
第二节 子宫平滑肌舒张药	227
第二十八章 肾上腺皮质激素类药	228
第一节 糖皮质激素类药	228
第二节 盐皮质激素类药	233
第三节 促皮质素与皮质激素抑制药	233
一、促皮质素	233
二、皮质激素抑制药	234
第二十九章 甲状腺激素类药与抗甲状腺药	235
第一节 甲状腺激素类药	235
第二节 抗甲状腺药	237
一、硫脲类	237
二、碘与碘化物	238
三、放射性碘	239
四、 β 受体阻断药	240

第三十章 胰岛素与口服降血糖药	241
第一节 胰岛素	241
第二节 口服降血糖药	243
一、磺酰脲类	243
二、双胍类	244
三、胰岛素增敏药	245
四、 α -葡萄糖苷酶抑制剂	245
五、其他类口服降血糖药	245
第三十一章 性激素类药与避孕药	246
第一节 性激素的分泌调节及作用机制	246
第二节 雌激素类药与抗雌激素类药	246
一、雌激素类药	246
二、抗雌激素类药	247
第三节 孕激素类药与抗孕激素类药	248
一、孕激素类药	248
二、抗孕激素类药	249
第四节 雄激素类药与同化激素类药	249
一、雄激素类药	249
二、同化激素类药	250
第五节 避孕药	250
一、抑制排卵药	250
二、抗孕卵着床药	251
三、抗早孕药	251
第三十二章 化学治疗药物概论	253
第一节 抗菌药物常用术语	253
第二节 抗菌药物的作用机制	254
第三节 细菌的耐药性	255
第四节 抗菌药物应用的基本原则	255
一、合理选用抗菌药物	256
二、抗菌药物的联合使用	257
第三十三章 抗生素	258
第一节 β -内酰胺类抗生素	258
一、青霉素类	258
二、头孢菌素类	262
三、其他 β -内酰胺类	264
四、 β -内酰胺类抗生素的复方制剂	265
第二节 大环内酯类抗生素	266
一、天然大环内酯类	266
二、合成大环内酯类	267
第三节 氨基糖苷类抗生素	268

第四节 四环素类抗生素	271
一、天然四环素类	272
二、半合成四环素类	273
第五节 氯霉素类抗生素	274
第六节 林可霉素类抗生素	275
第七节 多肽类抗生素	276
一、万古霉素类	276
二、多粘菌素类	277
第三十四章 人工合成抗菌药	278
第一节 喹诺酮类药	278
一、概述	278
二、常用氟喹诺酮类	280
第二节 磺胺类	282
第三节 其他合成抗菌药	285
一、甲氧苄啶	285
二、硝基呋喃类	285
第三十五章 抗结核病药	287
一、一线抗结核病药	287
二、二线抗结核病药	290
三、新一代抗结核病药	290
四、抗结核病药的应用原则	290
第三十六章 抗真菌药与抗病毒药	292
第一节 抗真菌药	292
一、抗生素类	292
二、唑类	293
三、丙烯胺类	294
四、嘧啶类	294
第二节 抗病毒药	294
一、常用抗病毒药	294
二、抗 HIV 药	297
第三十七章 抗寄生虫病药	299
第一节 抗疟药	299
一、主要用于控制症状的抗疟药	300
二、主要用于控制复发和传播的抗疟药	303
三、主要用于病因性预防的抗疟药	303
四、抗疟药的合理应用	304
第二节 抗阿米巴病药与抗滴虫病药	305
一、抗阿米巴病药	305
二、抗滴虫病药	306
第三节 抗血吸虫病药与抗丝虫病药	307

一、抗血吸虫病药	307
二、抗丝虫病药	308
第四节 抗肠蠕虫病药	308
一、抗线虫病药	308
二、抗绦虫病药	310
第三十八章 抗恶性肿瘤药	311
第一节 抗恶性肿瘤药的基本作用与分类	311
一、抗恶性肿瘤药的作用基础	311
二、抗恶性肿瘤药分类	312
三、抗恶性肿瘤药的不良反应	313
第二节 常用抗恶性肿瘤药	313
一、烷化剂	313
二、抗代谢药	314
三、抗肿瘤抗生素	316
四、植物药	318
五、激素类药	319
六、其他类药	319
第三节 临床用药原则	320
第三十九章 免疫功能调节药	321
第一节 免疫抑制药	321
第二节 免疫增强药	323
第四十章 解毒药	326
第一节 重金属及类金属中毒解毒药	326
第二节 氰化物中毒解毒药	328
一、高铁血红蛋白形成剂	328
二、供硫剂	329
第三节 灭鼠药中毒解毒药	329
一、抗凝血类灭鼠药中毒解毒药	329
二、磷毒鼠药中毒解毒药	330
三、有机氟灭鼠药中毒解毒药	330
四、毒鼠强中毒解毒药	330
第四节 蛇毒中毒解毒药	331
第五节 药物中毒解毒药	331
参考文献	334
中文索引	335
英文索引	348

总 论

第一章 绪 言

第一节 药理学的性质与任务

药理学 (pharmacology) 是一门研究药物与机体 (含病原体) 相互作用及作用规律的学科。药物 (drug) 指可以改变机体的生理功能及生化代谢水平, 用以诊断、预防和治疗疾病以及用于计划生育的化学物质。毒物是指在较小剂量即可对机体产生毒害作用, 损害人体健康的化学物质。药物和毒物之间并无严格界限, 任何药物剂量过大或使用时间过久都可能产生毒性反应。

药理学主要研究两方面的内容: ① 药物对机体的作用及作用机制, 即药物效应动力学 (pharmacodynamics, PD), 简称药效学; ② 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 (pharmacokinetics, PK), 简称药动学。

药理学是以基础医学中的生物化学、生理学、病理生理学、病理学、分子生物学、微生物学、免疫学等为基础, 为防治疾病、合理用药提供基本知识、基本理论和科学的思维方法, 是基础医学与临床医学以及医学与药学之间的桥梁。药理学的学科任务包括: ① 阐明药物的作用规律与其机制, 为临床合理用药、发挥药物最佳疗效、减少或避免不良反应提供理论依据; ② 研究开发新药, 发现现有药物的新用途; ③ 为其他医学学科的研究探索提供重要的科学依据和研究方法。

第二节 药理学的发展史

药理学的发展大致可以分为以下三个阶段:

1. 传统本草学阶段 药物的历史可追溯到 6000 年以前, 药物的最初发现是从尝试各种食物时遇到中毒后寻找解毒物开始的, 人们从生产斗争、生活经验中认识到某些天然物质可以治疗疾病与伤痛, 其中有不少流传至今, 例如楝实祛虫、柳皮退热等。我国早在公元 1 世纪前后就著有《神农本草经》, 全书收载药物 365 种, 其中不少药物仍沿用至今, 如大黄导泻、常山截疟。唐朝的《新修本草》是我国第一部由政府颁发的药典, 收载药物 884 种。明代大药学家李时珍著的《本草纲目》是世界闻名的一部药理学巨著, 全书 52 卷, 约 190 万字, 共收载药物 1892 种, 该书被译成 7 种文字, 传播到世界各地, 已成为世界重要的药理学文献之一。

2. 近代药理学阶段 药理学的建立和发展与现代科学技术的发展紧密相关。19 世纪初, 在化学和实验生理学发展的基础上, 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, 如 J. N. Langley (英) 1878 年根据阿托品拮抗匹鲁卡品对猫唾液分泌的作用研究, 提出了受体概念, 为受体学说的建立奠定了基础。有机化学和实验医学的发展又使药物的研究和开发进入了一个崭新的阶段。从具有治疗作用的植物中分离得到有效成分是这一阶段的突出成就。如 1803 年, F. W. Sertürner (德) 从罂粟中分离、