

CHENGREN

GAODENG

JIAOYU

HULIXUE

ZHUANYE

JIAOCAI



成人高等教育护理学专业教材

总主编 赵 群 陈金宝

# 药 理 学

YAOLIXUE

主 编 魏敏杰

副主编 陈 磊 金万宝

上海科学技术出版社

成人高等教育护理学专业教材

# 药 理 学

Yaolixue

主 编 魏敏杰  
副主编 陈 磊 金万宝



上海科学技术出版社

## 图书在版编目(CIP)数据

药理学/魏敏杰主编. —上海:上海科学技术出版社,  
2010.8

成人高等教育护理学专业教材

ISBN 978-7-5478-0387-5

I. ①药... II. ①魏... III. ①药理学—成人教育:高  
等教育—教材 IV. ①R96

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2010)第 122064 号

上海世纪出版股份有限公司 出版、发行  
上海科学技术出版社

(上海钦州南路 71 号 邮政编码 200235)

新华书店上海发行所经销

苏州望电印刷有限公司印刷

开本 787×1092 1/16 印张:28.25

字数:658 千字

2010 年 8 月第 1 版 2010 年 8 月第 1 次印刷

ISBN 978-7-5478-0387-5/R·99

定价:57.00 元

---

本书如有缺页、错装或坏损等严重质量问题,  
请向工厂联系调换

# 成人高等教育护理学专业教材

## 编写委员会

■主任委员 赵群

■副主任委员 陈金宝

■委员 (以姓氏笔画为序)

于爱鸣	王健	王世伟	王丽宇	王艳梅
王爱平	方瑾	田静	朱闻溪	刘宇
汤艳清	孙田杰	孙海涛	苏兰若	李丹
李小寒	李红丽	李栢林	李福才	佟晓杰
邱雪杉	张波	张喜轩	苑秀华	范玲
罗恩杰	赵斌	赵成海	施万英	徐甲芬
高丽红	曹宇	翟效月	颜红炜	潘兴瑜
潘颖丽	魏敏杰			

■教材编写办公室

刘强 刘伟韬

成人高等教育护理学专业教材

# 药 理 学

编委会名单

■ 主 编 魏敏杰

■ 副主编 陈 磊 金万宝

■ 编 委 (以姓氏笔画为序)

于兆进 王 爽 王 崑 任 婕

孙也之 孙明立 吴慧哲 宋志国

房 月 陈 磊 陈秋晨 金万宝

赵 琳 赵鹏飞 聂红光 唐宏涛

唐秋实 魏敏杰

# 前 言

近年来,随着护理学专业的迅速发展,全日制护理学专业教材建设得到了长足的进步,教材体系日益完善,品种迅速增多,质量逐渐提高。然而,针对成人高等教育护理学专业,能够充分体现以教师为主导、以学生为主体,方便学生自学的教材,可供选择的并不多。根据教育部《关于普通高等教育教材建设与改革的意见》的精神,为了进一步提高成人高等教育护理学专业教材的质量,更好地把握 21 世纪成人高等教育护理学内容和课程体系的改革方向,以中国医科大学为主,聘请北京大学、复旦大学、中山大学和沈阳医学院等单位的专家编写本套教材,由上海科学技术出版社出版。

本套教材编排新颖,版式紧凑,层次清晰,结构合理。每章由三大部分组成:第一部分是导学,告知学生本章需要掌握的内容和重点难点,以方便教师教学和学生有目的地学习相关内容;第二部分是具体教学内容,力求体现科学性、适用性和易读性的特点;第三部分是复习题,便于学生课后复习,其中选择题和判断题的参考答案附于书后。

本套教材的使用对象主要为护理学专业的高起本、高起专和专升本三个层次的学生。其中,对高起本和专升本层次的学习要求相同,对高起专层次的学习要求在每章导学部分予以说明。本套教材中的一些基础课程也适用于其他相关医学专业。

除了教材外,我们还将通过中国医科大学网络教育平台(<http://des.cmu.edu.cn>)提供与教材配套的教学大纲、网络课件、电子教案、教学资源、网上练习、模拟测试等,为学生自主学习提供多种资源,建造一个立体化的学习环境。

为了很好地完成本套教材的编写任务,我们成立了教材编写委员会。编写委员会主任委员由中国医科大学校长赵群教授担任,副主任委员由中国医科大学网络教育学院常务副院长陈金宝教授担任。编写委员会下设教材编写办公室,由刘强和刘伟韬同志负责各分册协调和部分编务工作等。教材部分绘图工作由齐亚力同志完成。

由于时间仓促,任务繁重,在教材编写中难免存在一些不足,恳请广大教师、学生和读者惠予指正,使本套教材更臻完善,成为科学性更强、教学效果更好、更符合现代成人高等教育要求的教材。

**成人高等教育护理学专业教材**

**编写委员会**

2010 年 5 月

# 编写说明

本教材是根据卫生部十一五教材规划的精神编写的,主要针对成人高等教育,供临床医学、预防医学、护理学和药学等相关专业使用。在编写本教材的过程中,我们充分考虑到了当前成人高等教育自身的优势和特点,也兼顾了当前医务人员的培养目标和药理学教学计划,以及教学大纲的要求,力求能够编写出一本涵盖范围广、内容详实准确、重点突出、重视基础和联系临床实践的药理学教材,充分体现出教材的思想性、科学性、先进性、启发性和适用性。通过本教材的学习,不仅可以使学生全面掌握药理学的相关基础知识,还可以逐渐培养学生的创新能力和思维能力。

进入 21 世纪,随着当代科学技术的高速发展,药理学知识也在不断更新,原有的知识内容已经无法完全体现出药理学最新的进展。因此,本教材在编写的过程中,引入了一部分较为前沿的药理学知识。如今的药理学已经不再只是一门单一的基础学科,而是病理学、生理学、临床医学和药学之间的交叉学科。限于篇幅和学时所限,本教材重点放在对药物作用机制的介绍,而涉及到其他相关学科的基础知识和临床用药原则,仅作简要介绍,不再详细讨论。

本教材在编写与成稿的过程中,得到了中国医科大学药理教研室许多教师的关心和帮助。教师们利用自己的课余时间,对每一个知识点都做了认真的推敲和校对,在较短的时间内完成了教材的编写。中国医科大学网络教学中心亦对此教材的编写工作给予了全力支持。在此一并致以衷心的感谢。

本教材第一篇由魏敏杰、吴慧哲、唐宏涛编写,第二篇由赵琳、金万宝编写,第三篇由陈磊、宋志国编写,第四篇由任婕、孙明立、魏敏杰编写,第五篇由王崑、唐秋实编写,第六篇由王崑、房月编写,第七篇由聂红光、王爽编写,复习题由孙也之、陈秋晨、于兆进编写。

由于编者的学识和水平有限,加之时间仓促,书中难免存在疏漏和不足之处,恳请广大读者批评指正。

《药理学》编委会

2010年5月

# 目 录

## 第一篇 总 论

### 第一章 绪论 / 3

### 第二章 药物的体内过程和药物 代谢动力学 / 6

- 第一节 药物的跨膜转运 / 7
- 第二节 药物的体内过程 / 9
- 第三节 药代动力学基本概念 / 15

### 第三章 药物效应动力学 / 29

- 第一节 药物的基本作用 / 30

- 第二节 药物的量效关系与构效关系 / 31

- 第三节 药物作用机制 / 33

- 第四节 药物与受体 / 34

### 第四章 影响药物效应的因素及 合理用药 / 43

- 第一节 药物因素 / 44

- 第二节 机体因素 / 44

- 第三节 合理用药原则 / 49

## 第二篇 传出神经系统药理学

### 第五章 传出神经系统药理学 概论 / 53

- 第一节 传出神经系统的结构与分类 / 53
- 第二节 传出神经系统的递质和受体 / 56
- 第三节 传出神经系统药物的基本作用和分类 / 62

### 第六章 拟胆碱药 / 66

- 第一节 直接作用于胆碱受体的  
拟胆碱药 / 66
- 第二节 抗胆碱酯酶药 / 70

### 第七章 有机磷酸酯类抗胆碱 酯酶药中毒及胆碱酯酶 复活药 / 74

- 第一节 有机磷酸酯类中毒及解救 / 74

- 第二节 胆碱酯酶复活药 / 76

### 第八章 抗胆碱药(I)-M胆碱受体 阻断药 / 79

- 第一节 阿托品和阿托品类生物碱 / 79

- 第二节 阿托品的合成代用品 / 82

第九章 抗胆碱药(Ⅱ)-N胆碱受体  
阻断药 / 87

第一节  $N_N$ 胆碱受体阻断药—神经节  
阻断药 / 87

第二节 骨骼肌松弛药 / 88

第十章 拟肾上腺素药 / 92

第一节 构效关系和分类 / 92

第二节  $\alpha$ 、 $\beta$ 受体激动药 / 93

第三节  $\alpha$ 肾上腺素受体激动药 / 97

第四节  $\beta$ 肾上腺素受体激动药 / 99

第十一章 肾上腺素受体阻断  
药 / 105

第一节  $\alpha$ 肾上腺素受体阻断药 / 105

第二节  $\beta$ 肾上腺素受体阻断药 / 108

第三节  $\alpha$ 、 $\beta$ 肾上腺素受体阻断药 / 112

第三篇 中枢神经及传入神经系统药理学

第十二章 局部麻醉药 / 121

第十三章 全身麻醉药 / 126

第一节 吸入性麻醉药 / 126

第二节 静脉麻醉药 / 128

第三节 复合麻醉 / 128

第十四章 镇静催眠药 / 132

第一节 苯二氮草类 / 133

第二节 巴比妥类 / 135

第三节 其他镇静催眠药 / 136

第十五章 抗癫痫药和抗惊厥  
药 / 140

第一节 抗癫痫药 / 140

第二节 抗惊厥药 / 144

第十六章 抗精神失常药 / 147

第一节 抗精神病药 / 148

第二节 抗躁狂抑郁症药 / 151

第三节 抗焦虑药 / 153

第十七章 抗帕金森病药 / 155

第一节 拟多巴胺类药 / 156

第二节 胆碱受体阻断药 / 158

第十八章 镇痛药 / 160

第一节 阿片生物碱类镇痛药 / 161

第二节 人工合成镇痛药 / 165

第三节 其他镇痛药 / 167

第四节 阿片受体拮抗剂——纳洛酮  
与纳曲酮 / 167

第十九章 中枢兴奋药 / 171

第一节 主要兴奋大脑皮层的药物 / 171

第二节 主要兴奋延脑呼吸中枢的  
药物 / 172

第二十章 解热镇痛抗炎药 / 174

第一节 水杨酸类 / 176

第二节 苯胺类 / 178

第三节 吡唑酮类 / 179

第四节 其他抗炎有机酸类 / 179

第四篇 心血管系统药理学

第二十一章 治疗充血性心力衰竭  
的药物 / 185

第一节 CHF的病理生理学及治疗

CHF药物的分类 / 186

第二节 治疗充血性心力衰竭的药物 / 187

## 第二十二章 钙通道阻滞剂 / 198

## 第二十三章 抗高血压药 / 206

- 第一节 抗高血压药物的分类 / 207
- 第二节 常用抗高血压药 / 207
- 第三节 高血压药物治疗的新概念 / 218

## 第二十四章 抗心绞痛药 / 222

- 第一节 概述 / 222
- 第二节 硝酸酯类 / 224
- 第三节 肾上腺素 $\beta$ 受体阻断药 / 227
- 第四节 钙通道阻断药 / 228
- 第五节 其他抗心绞痛药 / 229
- 第六节 抗心绞痛药联合应用的评价 / 230

## 第二十五章 抗心律失常药 / 233

- 第一节 心脏的电生理学基础 / 234
- 第二节 心律失常发生机制 / 236
- 第三节 抗心律失常药的基本作用机制和分类 / 238
- 第四节 常用抗心律失常药 / 239

## 第二十六章 抗高血脂血症药 / 247

- 第一节 调血脂药 / 248
- 第二节 抗氧化剂 / 253
- 第三节 多烯脂肪酸 / 254
- 第四节 黏多糖和多糖类 / 255

## 第五篇 内脏系统药理学及抗组胺药

## 第二十七章 利尿药和脱水药 / 259

- 第一节 利尿药 / 259
- 第二节 脱水药 / 266

## 第二十八章 作用于消化系统的药物 / 270

- 第一节 治疗消化性溃疡的药物 / 270
- 第二节 消化功能调节药 / 273

## 第二十九章 作用于呼吸系统的药物 / 278

- 第一节 平喘药 / 278
- 第二节 镇咳药 / 283
- 第三节 祛痰药 / 284

## 第三十章 子宫兴奋药 / 287

## 第三十一章 作用于血液及造血系统的药物 / 291

- 第一节 抗凝血药 / 292
- 第二节 纤维蛋白溶解药与纤维蛋白溶解抑制药 / 295
- 第三节 抗血小板药 / 297
- 第四节 促凝血药 / 299
- 第五节 抗贫血药 造血细胞生长因子 / 300
- 第六节 血容量扩充药 / 303

## 第三十二章 组胺和抗组胺药 / 306

## 第六篇 内分泌系统药理学

## 第三十三章 肾上腺皮质激素类药物 / 313

- 第一节 糖皮质激素 / 314
- 第二节 盐皮质激素 / 319
- 第三节 促皮质素及皮质激素抑制药 / 319

## 第三十四章 性激素类药及计划生育药 / 323

- 第一节 雌激素类药与抗雌激素类药 / 323
- 第二节 孕激素类药 / 325
- 第三节 雄激素类药和同化激素类药 / 326

第四节 计划生育药 / 327

第三十五章 甲状腺激素和  
抗甲状腺药 / 331

第一节 甲状腺激素 / 331

第二节 抗甲状腺药 / 334

第七篇 化学治疗药及其他

第三十七章 人工合成的抗菌  
药 / 349

第一节 喹诺酮类抗菌药 / 350

第二节 磺胺类抗菌药 / 353

第三节 其他合成抗菌药 / 355

第三十八章 抗生素 / 359

第一节  $\beta$ -内酰胺类抗生素 / 360

第二节 大环内酯类、林可霉素及多肽类  
抗生素 / 365

第三节 氨基糖苷类抗生素 / 367

第四节 四环素类抗生素 / 370

第三十九章 抗真菌药及  
抗病毒药 / 379

第一节 抗真菌药 / 379

第二节 抗病毒药 / 382

第四十章 抗结核病药及  
抗麻风病药 / 385

第一节 抗结核病药 / 386

第二节 抗麻风病药 / 389

第四十一章 抗疟药 / 392

第四十二章 抗阿米巴病药和

第三十六章 胰岛素和口服  
降血糖药 / 339

第一节 胰岛素 / 340

第二节 口服降血糖药 / 342

抗滴虫病药 / 399

第一节 抗阿米巴病药 / 399

第二节 抗滴虫药 / 401

第四十三章 抗吸虫病药及  
抗丝虫病药 / 403

第四十四章 抗肠蠕虫药 / 405

第四十五章 抗恶性肿瘤药 / 409

第一节 概论 / 409

第二节 抗代谢药 / 411

第三节 生物碱类药 / 413

第四节 烷化剂 / 414

第五节 抗癌抗生素类 / 415

第六节 其他类药 / 417

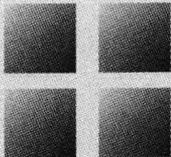
第四十六章 影响免疫功能的  
药物 / 421

第一节 免疫抑制药 / 422

第二节 免疫增强药 / 423

参考答案 / 427

参考文献 / 433



# 第一篇

---

## 总 论



# 第一章

## 绪论

### 一、药理学的性质与任务

药理学(Pharmacology)是研究药物(drug)与生物体(包括机体和病原体)相互作用及作用规律的科学。药理学的学科任务是阐明药物与机体之间的相互作用及其机制,为药物的合理应用,提供可靠的依据,保证临床治疗的效果。药理学的内容可以概括为两个方面:一方面可以研究药物对机体的作用及作用机制,即药物效应动力学(Pharmacodynamics),简称药效学;另一方面也可以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(Pharmacokinetics),简称药动学。药理学涉及基础医学当中的生理学、生物化学、病理学以及免疫学等诸多学科,并且以他们为基础,为合理用药和疾病的治疗提供基本知识和基本理论。以药效学和药动学为基础,为新药的开发提供新的途径;药理学的基本理论和研究进展可为其他相关学科的发展提供重要的科学资料。

### 二、药理学的发展

早期的药理学是作为药物学的分支逐渐发展起来的。

现代药理学真正的建立和发展与科学技术有着密切的关系。在19世纪初,英国解剖学家W. Harvey(1578—1657)发现了血液循环,开创了实验药理学新纪元。意大利生理学家F. Fontana(1720—1805)通过动物毒性测试,得出了天然药物都有其活性成分,选择作用于机体某个部位而引起典型反应的客观结论。德国化学家F. W. Serturmer从罂粟中分离提纯吗啡,并证实它具有镇痛的作用。随着有机化学的不断发展,也为药理学提供了物质基础,从植物药中得到纯度较高活性成分的药物,如依米丁、奎宁、土的宁、可卡因等。英国学者J. N. Langley于1878年提出了受体的概念,为受体学说的建立奠定了基础。现已被证实是许多特异性药物作用的关键机制。此后药理学得到飞跃发展,第二次世界大战结束后出现了许多药理新领域并发现了许多新药,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。

近年药动学的发展使临床用药从单凭经验掌握发展为科学计算,并促进了生物药理学的发展。药效学方面向微观世界深入,阐明了许多药物作用的分子机制,也促进了分子生物学本身的发展。展望今后,药理学将针对疾病的根本原因,发展病因特异性药物治疗,那时将能进一步收到药到病除的效果。

如今的药理学已经不再是过去的只和生理学联系的单一学科,而是发展为一个涵盖了生物化学、生物物理学以及分子生物学等多学科综合在一起的一门交叉学科。另一方面,药理学的分支也在逐渐的细化,包括:分子药理学、遗传药理学和生化药理学等分支学科。

### 三、新药的研究

药物通常是指可以改变或查明机体的生理功能及病理状态,预防、诊断和治疗疾病的一种物质。

药物的来源可以是天然的植物、矿物、动物和微生物,或者是它们的提取物;也可通过化学或其他的方法进行人工合成的产物。毒物(toxicant)是指在较小剂量即对机体产生毒害作用,同时损害人体健康的化学物质。任何药物剂量过大都可产生毒性反应。因此,在一定程度上,药物和毒物之间并没有明确的界限。

根据《药品管理法实施条例》中对“新药”做出权威界定:“未曾在中国境内上市销售的药品就是新药”,这与原《药品管理法》中关于新药是指“在我国首次生产的药品”的规定有很大的不同。按照对“新药”的这一规定,今后我国制药企业首次生产国外已经在中国上市销售过的药品将按照仿制药品的要求申报审批。

新药的研发过程大致包括三个阶段:临床前研究、临床研究和上市后药物监测。临床前研究包括用动物进行的系统药理研究及急慢性毒性观察。对于具有选择性药理效应的药物,在进行临床试验前还需要测定该药物在动物体内的吸收、分布及消除过程。临床前研究是要弄清新药的作用谱及可能发生的毒性反应。临床研究首先需要找出药物的安全剂量,再选择有特异指征的患者按采用双盲法观察,然后进行治疗结果统计分析,客观地判断疗效。以此为依据制定适应证、禁忌证、剂量疗程及说明可能发生的不良反应。上市后药物监测是指新药问市后进行的社会性考查与评价,在广泛的推广应用中重点了解长期使用后出现的不良反应和远期疗效(包括无效病例)。

#### 四、我国现代药理学展望

我国现代药理学在 20 世纪初逐渐发展起来的。例如:对血吸虫病的治疗进行了更加系统的研究和探索,改进了酒石酸锑钾的治疗方案,使得血吸虫病的疗效有了很大的提高;在理论上验证了吗啡的镇痛作用部位是在第三脑室周围灰质,这一结论相比于国外学者发现吗啡受体早 10 余年;另外,在中药药理学的研究中也取得了很大的成就,先后研发了山莨菪碱、粉防己碱、青蒿素和喜树碱等新药。20 世纪 80 年代后,随着理论水平和科研水平的不断提高,我国的药理学也取得了进一步的发展,如五味子及其有效成分的抗肝损伤作用的研究以及在此基础上,新药联苯双酯和双环醇的研制成功;白芍总苷抗类风湿关节炎的基础和临床研究及新药开发;中药淫羊藿、枸杞子、何首乌及其有效成分延缓衰老的机制研究。进入 21 世纪,我国药理学的发展面临着更大的机遇和挑战,在“十一五”规划中,提出充分运用现代技术,加强作用机制新、疗效高、毒副作用小的具有自主知识产权和市场竞争力的创新药物的研制。重点开发抗肿瘤药物、心脑血管系统药物、抗病毒感染药物、神经精神系统药物、降血糖药物、老年病药物等。同时紧跟世界生物医药技术发展潮流,重点开发单克隆抗体、细胞因子等重组药物和预防疾病的疫苗,以及疾病诊断防疫用的 PCR、生物芯片等体外生物诊断检测新产品。根据“十一五”规划的内容,又提出了“重大新药创制”的项目,包括“创新药物研究开发”、“药物大品种技术改造”、“创新药物研究开发技术平台建设”、“企业创新药物孵化基地建设”和“新药研究开发关键技术研究”等项目,旨在进一步提供我国医药行业的自主创新能力。

尽管我国的药理学的发展取得了巨大的进步,但是距离当今世界的最前沿的研究水平仍然有一定的距离。作为一名医疗工作者,只有不断学习迎头赶上,才能推动我国的药理学不断向前发展。

### 复 习 题

#### 【A 型题】

1. 药物的概念是:

- A. 预防、诊断和治疗疾病的活性物质  
B. 预防疾病的活性物质  
C. 防治疾病的活性物质  
D. 治疗疾病的活性物质

( )



## 第二章

# 药物的体内过程和药物代谢动力学

### 导 学

#### 内容及要求

药物代谢动力学主要研究的是药物在体内吸收、分布、生物转化、排泄的规律的一门科学。药物主要通过单纯扩散方式进行跨膜转运,应掌握膜两侧 pH 对药物跨膜转运的影响。掌握首关消除、生物利用度、表观分布容积的药理学意义和计算公式;掌握肝药酶的特性、肝药酶诱导剂、肝药酶抑制剂及其对药物作用的影响;掌握肾小管重吸收和肝肠循环的药理学意义及两者对药物作用的影响;掌握药物消除及消除速率的基本概念,熟悉典型的量效曲线、房室模型、多次定时定量重复给药的动力学及其计算;掌握药物的消除速率常数( $k$ )、半衰期( $t_{1/2}$ )、清除率( $Cl$ )、稳态血药浓度( $C_{ss}$ )等。

#### 重点、难点

(1) 药物的跨膜转运:被动转运和主动转运(重点阐明单纯扩散的理论和实际意义)。

(2) 吸收、分布、生物转化与排泄及其影响因素。

(3) 基本参数及概念:生物利用度、血药峰值浓度、血浆半衰期、表观分布容积、清除率和房室概念。肝药酶诱导剂及抑制剂,首关消除等基本概念。

(4) 药物消除动力学:零级动力学、一级动力学与药物半衰期( $t_{1/2}$ )的理论与实际意义。连续多次给药的血药浓度变化:经过 5 个  $t_{1/2}$  血药浓度达稳态坪值;首次负荷剂量。

#### 专科生的要求

(1) 专科生应掌握膜两侧 pH 对药物跨膜转运的影响及其有关运算;掌握首关消除、生物利用度、表观分布容积的计算公式和意义;掌握肾小管重吸收和肝肠循环