

高等医药院校改革创新教材
供基础、临床、预防、口腔医学类专业用

药理学

主编 陈立 刘克辛
副主编 苗术 范新田 关利新



人民卫生出版社

高等医药院校改革创新教材

供基础、临床、预防、口腔医学类专业用

药 理 学

主 编 陈 立 刘克辛

副主编 苗 术 范新田 关利新

编 委 (以姓氏笔画为序)

王 爽 (中国医科大学)	李丽静 (长春中医药大学)
王艳春 (吉林医药学院)	陈 立 (吉林大学白求恩医学院)
石 卓 (吉林大学白求恩医学院)	陈 霞 (吉林大学白求恩医学院)
包桂兰 (内蒙古民族大学)	陈建光 (北华大学药学院)
曲极冰 (吉林大学白求恩医学院)	苗 术 (齐齐哈尔医学院)
乔 萍 (吉林大学白求恩医学院)	范新田 (北华大学药学院)
任 眇 (吉林医药学院)	罗学娅 (大连大学医学院)
刘克辛 (大连医科大学)	龚冬梅 (哈尔滨医科大学)
关利新 (牡丹江医学院)	翟凤国 (牡丹江医学院)
纪影实 (吉林大学白求恩医学院)	魏征人 (吉林大学白求恩医学院)

人民卫生出版社

图书在版编目 (CIP) 数据

药理学/陈立等主编. —北京: 人民卫生出版社,
2010. 7

ISBN 978-7-117-13018-9

I . ①药… II . ①陈… 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 (2010) 第 088421 号

门户网: www.pmpm.com 出版物查询、网上书店

卫人网: www.ipmpm.com 护士、医师、药师、中医
师、卫生资格考试培训

版权所有，侵权必究！

药 理 学

主 编: 陈 立 刘克辛

出版发行: 人民卫生出版社 (中继线 010-59780011)

地 址: 北京市朝阳区潘家园南里 19 号

邮 编: 100021

E - mail: [pmpm @ pmpm.com](mailto:pmpm@pmpm.com)

购书热线: 010-67605754 010-65264830

010-59787586 010-59787592

印 刷: 北京机工印刷厂

经 销: 新华书店

开 本: 787×1092 1/16 印张: 30

字 数: 748 千字

版 次: 2010 年 7 月第 1 版 2010 年 7 月第 1 版第 1 次印刷

标准书号: ISBN 978-7-117-13018-9/R · 13019

定 价: 58.00 元

打击盗版举报电话: 010-59787491 E-mail: [WQ @ pmpm.com](mailto:WQ@pmpm.com)

(凡属印装质量问题请与本社销售中心联系退换)

前 言

本教材是人民卫生出版社出版的药理学协编教材,此次为第一版。编写的指导思想是在坚持“三基(基本理论、基本知识、基本技能)”、“五性(思想性、科学性、先进性、启发性、适用性)”、“三特定(特定的对象、特定的要求、特定的限制)”原则基础上,做到“新、精、易懂”。教材贴近使用对象,力求扩展学生的知识面,同时充分体现基础与临床的结合及学科交叉的融合,着重培养学生的综合素质,以适应21世纪医学人才培养的需要。

全书分为八篇,四十七章。主要有如下特色:首先,实用性强。本教材主要使用对象是临床医学及其他医学专业五年制本科生,编写内容尽量做到简明扼要,条理清晰,文字精练,内容严谨。对临床较少使用的药物减少笔墨,删除已淘汰的药物。对于一些与药物作用机制没有直接关系的生理机制予以删除。使本教材编写成为一本教师易教,学生易懂的实用教材。第二,富有新颖性与趣味性。为了更好地便于学生理解和学习,在各章开头增加教学基本要求,章后增加重要知识点总结及针对重要知识点所设计的思考题,便于学生了解每章所要掌握、熟悉、了解的内容,消化理解所学的重点内容。多采用图文并茂的方式阐明药物作用机制,使枯燥、深奥、难懂的作用机制直观、生动、简洁、明了。通过对药物分类及药物特点比较等归纳总结,建立表格,避免长篇大论,拖沓冗长,易于学生理解及学习。第三,体现规范化与拓展性。全书各章编写要求形式统一,风格一致。对于药理学领域的进展、新成果,近五年来问世的独具特色的新药,适当引进,从而体现本教材的创新性。

在各参编院校的鼎力相助下,包括吉林大学白求恩医学院、中国医科大学、哈尔滨医科大学、大连医科大学、大连大学医学院、长春中医药大学、北华大学药学院、吉林医药学院、牡丹江医学院、齐齐哈尔医学院的多名教师历经半年时间完成本书的撰写工作。本书由人民卫生出版社出版,定位适用于普通高等医药院校的本科教学,也适用于成人高等医学教学及其他相关人员参考。

尽管编者已竭尽心力、力求完美,但由于学识水平有限及编写时间仓促,书中难免有错漏与不足之处,恳请广大药理学同仁及使用本书的师生给予批评指正。

陈 立 刘克辛

2010年1月

目 录

第一篇 总 论

第一章 药理学总论—绪言	2
一、药理学的研究内容与学科任务.....	2
二、药理学发展简史.....	2
三、药理学的研究方法.....	3
四、药理学与新药研究开发.....	4
第二章 药物代谢动力学	5
第一节 药物的跨膜转运.....	5
一、被动转运.....	5
二、主动转运.....	7
三、膜动转运.....	7
第二节 药物的体内过程及其影响因素.....	8
一、药物的吸收.....	8
二、药物的分布	10
三、药物的代谢	11
四、药物的排泄	14
第三节 药物代谢动力学的解析	15
一、药物代谢动力学模型	15
二、药物消除速率过程	16
三、药动学参数及其临床意义	20
第三章 药物效应动力学	23
第一节 药物的基本作用	23
一、药物作用与药理效应	23
二、药物治疗效果	23
三、药物不良反应	24
第二节 药物剂量和效应关系	25
一、量-效曲线	25
二、量反应	25
三、质反应	26
第三节 药物作用机制	28

一、受体的基础知识	28
二、药物与受体相互作用	29
第四章 影响药物效应的因素	33
第一节 药物因素	33
一、药物的理化性质	33
二、剂量	33
三、给药途径	34
四、给药时间、给药间隔时间	34
五、药物相互作用	34
第二节 机体因素	36
一、生理因素	36
二、病理因素	37
三、心理因素	38
四、长期用药机体对药物反应的改变	38

第二篇 作用于传出神经系统的药物

第五章 传出神经系统药理概论	42
第一节 传出神经系统分类	42
第二节 传出神经系统的递质和受体	43
一、传出神经系统的递质	43
二、传出神经系统的受体	45
第三节 传出神经系统的生理功能	47
第四节 传出神经系统药物基本作用及其分类	48
一、传出神经系统药物的基本作用	48
二、传出神经系统药物的分类	49
第六章 胆碱受体激动药	51
第一节 M胆碱受体激动药	51
一、胆碱酯类	51
二、生物碱类	52
第二节 N胆碱受体激动药	54
第七章 抗胆碱酯酶药和胆碱酯酶复活药	56
第一节 乙酰胆碱酯酶	56
第二节 抗胆碱酯酶药	56
一、易逆性抗 AChE 药	56
二、常用的易逆性抗 AChE 药	58
三、难逆性抗 AChE 药	59
第三节 胆碱酯酶复活药	61

第八章 胆碱受体阻断药	64
第一节 M胆碱受体阻断药	64
一、阿托品和阿托品类生物碱	64
二、阿托品的合成、半合成代用品	68
第二节 N胆碱受体阻断药	70
一、神经节阻断药	70
二、骨骼肌松弛药	70
第九章 肾上腺素受体激动药	74
第一节 构效关系及分类	74
一、构效关系	74
二、分类	74
第二节 α 、 β 受体激动药	75
第三节 α 受体激动药	79
一、 α_1 、 α_2 受体激动药	79
二、 α_1 受体激动药	80
三、 α_2 受体激动药	81
第四节 β 受体激动药	81
一、 β_1 、 β_2 受体激动药	81
二、 β_1 受体激动药	82
三、 β_2 受体激动药	82
第十章 肾上腺素受体阻断药	84
第一节 α 肾上腺素受体阻断药	84
一、 α 肾上腺素受体阻断药的分类	85
二、非选择性 α 肾上腺素受体阻断药	85
三、选择性 α_1 肾上腺素受体阻断药	86
四、选择性 α_2 肾上腺素受体阻断药	86
第二节 β 肾上腺素受体阻断药	86
一、 β 受体阻断药的分类	87
二、常用 β 肾上腺素受体阻断药	90

第三篇 作用于中枢神经系统的药物

第十一章 镇静催眠药	94
第一节 苯二氮草类	94
第二节 巴比妥类	96
第三节 其他镇静催眠药	98
第十二章 抗癫痫药和抗惊厥药	100
第一节 抗癫痫药	100
第二节 抗惊厥药	106

第十三章 抗帕金森病药和治疗阿尔茨海默病药	108
第一节 抗帕金森病药	108
一、拟多巴胺类药	108
二、中枢抗胆碱药	111
第二节 治疗阿尔茨海默病	113
一、胆碱酯酶抑制剂	113
二、胆碱受体激动剂	114
三、代谢激活剂与神经保护药	115
第十四章 抗精神失常药	117
第一节 抗精神病药	117
一、吩噻嗪类	118
二、硫杂蒽类	121
三、丁酰苯类	121
四、其他抗精神病药物	122
第二节 抗躁狂症药	124
第三节 抗抑郁症药	125
一、三环类抗抑郁药	126
二、单胺氧化酶抑制剂	127
三、NA 再摄取抑制药	128
四、选择性 5-HT 再摄取抑制药	129
五、5-HT 及 NA 再摄取抑制剂	130
六、NA 和特异性 5-HT 能抗抑郁药	131
七、NA 及多巴胺再摄取抑制剂	131
第十五章 镇痛药	133
第一节 阿片生物碱类镇痛药	133
第二节 人工合成镇痛药	138
第三节 阿片受体拮抗药	141
第十六章 解热镇痛抗炎药	143
第一节 概述	143
第二节 非选择性环氧酶抑制药	145
一、水杨酸类	145
二、苯胺类	147
三、吲哚类和茚乙酸类药物	147
四、芳基乙酸类	148
五、芳基丙酸类	148
六、烯醇酸类	149
七、吡唑酮类	149
八、烷酮类	150
第三节 选择性环氧酶-2 抑制剂	150

第十七章 麻醉药	153
第一节 局部麻醉药.....	153
第二节 全身麻醉药.....	157
一、吸入性麻醉药.....	157
二、静脉麻醉药.....	160
三、复合麻醉.....	161

第四篇 作用于心血管系统的药物

第十八章 钙通道阻滞药	164
第一节 钙通道及钙通道阻滞药的分类.....	164
一、钙通道.....	164
二、钙通道阻滞药的分类.....	166
第二节 钙通道阻滞药.....	166
第三节 代表性的钙通道阻滞药.....	169
第十九章 抗心律失常药	171
第一节 心律失常的电生理学基础及抗心律失常药物作用机制.....	171
一、正常心脏电生理特性.....	171
二、抗心律失常药物作用机制.....	172
第二节 抗心律失常药物分类.....	174
第三节 常用抗心律失常药.....	175
一、I类——钠通道阻滞药.....	175
二、II类——β受体拮抗药.....	178
三、III类——延长动作电位时程药.....	178
四、IV类——钙通道阻滞药.....	179
五、其他抗心律失常药.....	180
六、抗心律失常药应用原则.....	180
第二十章 抗心绞痛药	182
第一节 概述.....	182
第二节 硝酸酯类.....	183
第三节 β肾上腺素受体阻断药.....	187
第四节 钙通道阻滞药.....	188
第五节 其他抗心绞痛药物.....	190
第二十一章 利尿药	192
第一节 利尿药作用的生理学基础.....	192
一、肾小球滤过.....	192
二、肾小管分泌.....	192
三、肾小管和集合管重吸收.....	193
第二节 常用利尿药.....	196

一、高效能利尿药.....	196
二、中效能利尿药.....	199
三、低效能利尿药.....	200
第二十二章 肾素-血管紧张素系统抑制药	207
第一节 肾素-血管紧张素系统	207
一、RAS 的组成	207
二、体液 RAS 与局部 RAS	208
三、RAS 的功能	208
第二节 血管紧张素转化酶抑制药.....	209
一、构效关系和药物分类.....	209
二、药理学共性.....	210
三、常用药物.....	212
第三节 血管紧张素Ⅱ受体阻断药.....	213
一、药理学共性.....	213
二、常用药物.....	214
第二十三章 抗高血压药.....	216
第一节 抗高血压药物的分类.....	216
第二节 各类抗高血压药物.....	217
一、利尿药.....	217
二、交感神经抑制药.....	217
三、肾素-血管紧张素系统抑制药	221
四、钙通道阻滞药.....	222
五、血管平滑肌扩张药.....	223
六、其他类型的抗高血压药物.....	224
第三节 抗高血压药物的应用原则.....	225
一、根据高血压程度选用药物.....	225
二、根据合并症选用药物.....	225
三、采用个体化治疗方案.....	226
四、高血压治疗的新要点.....	226
第二十四章 治疗充血性心力衰竭的药物.....	228
第一节 充血性心力衰竭的病理生理学.....	228
一、CHF 的心脏功能及结构变化	228
二、CHF 的神经内分泌变化	229
三、CHF 时心肌肾上腺素 β 受体信号转导的变化	230
第二节 治疗心力衰竭药物的分类.....	230
第三节 常用治疗充血性心力衰竭药物.....	231
一、利尿药.....	231
二、肾素-血管紧张素系统抑制药	232
三、 β 受体阻断药	233

四、血管扩张药.....	234
五、强心苷类.....	235
六、非苷类正性肌力药.....	240
七、钙通道阻滞药.....	242
第二十五章 调血脂药及抗动脉粥样硬化药.....	244
第一节 调血脂药.....	244
一、HMG-CoA 还原酶抑制剂	245
二、影响胆固醇吸收和转化的药物.....	247
三、影响脂蛋白合成、转运及分解的药物	248
第二节 抗氧化剂.....	250
一、合成型抗氧化剂.....	250
二、天然型抗氧化剂.....	251
第三节 多烯脂肪酸.....	251
第四节 动脉内皮保护药.....	252

第五篇 作用于内脏系统及血液系统的药物

第二十六章 呼吸系统药物.....	256
第一节 平喘药.....	256
一、抗炎平喘药.....	256
二、支气管扩张药.....	258
三、抗过敏平喘药.....	261
第二节 镇咳药.....	262
一、中枢性镇咳药.....	262
二、外周性镇咳药.....	263
第三节 祛痰药.....	264
一、痰液稀释药.....	264
二、黏痰溶解药.....	264
第二十七章 消化系统药物.....	266
第一节 抗消化性溃疡药.....	266
一、碱性抗酸药.....	266
二、抑制胃酸分泌药.....	267
三、增强胃黏膜屏障作用药物.....	270
四、抗幽门螺杆菌药.....	272
第二节 消化功能调节药.....	272
一、助消化药.....	272
二、止吐药与增强胃肠动力药.....	272
三、止泻药与吸附药.....	274
四、泻药.....	275

五、利胆药	276
第二十八章 作用于子宫平滑肌的药物	278
第一节 子宫平滑肌兴奋药	278
第二节 子宫平滑肌抑制药	281
第二十九章 作用于血液及造血系统的药物	283
第一节 抗凝血药	283
第二节 抗血小板药	287
一、抑制血小板代谢的药物	287
二、干扰 ADP 介导血小板活化的药物	289
三、血小板 Gp II b/III a 受体阻断药	289
第三节 纤维蛋白溶解药	289
第四节 促凝血药	291
第五节 抗贫血药	292
一、铁剂	292
二、叶酸类和维生素 B ₁₂	293
第六节 血容量扩充药	294

第六篇 作用于内分泌系统的药物

第三十章 肾上腺皮质激素类药	298
第一节 糖皮质激素类药物	298
第二节 盐皮质激素	303
第三节 促皮质素及皮质激素抑制剂	304
一、促皮质素	304
二、皮质激素抑制剂	304
第三十一章 甲状腺激素及抗甲状腺药	306
第一节 甲状腺激素	306
第二节 抗甲状腺药	309
一、硫脲类	309
二、碘及碘化物	310
三、放射性碘	311
四、β 肾上腺素受体阻断药	311
第三十二章 胰岛素及口服降血糖药	314
第一节 胰岛素及胰岛素类似物	314
一、胰岛素	314
二、人胰岛素类似物	317
第二节 口服降血糖药	318
一、促胰岛素分泌剂	318
二、胰岛素增敏剂	321

三、延缓葡萄糖吸收的药物.....	323
第三节 其他新型降血糖药.....	324
一、以胰高血糖素样肽-1为作用靶点的药物	324
二、胰淀粉样多肽类似物.....	324
第三十三章 性激素类与避孕药物.....	326
第一节 性激素的分泌调节及作用机制.....	326
第二节 雌激素类药与抗雌激素类药.....	326
一、雌激素类药.....	326
二、抗雌激素类药.....	328
第三节 孕激素与抗孕激素类药物.....	328
一、孕激素类药.....	328
二、抗孕激素类药.....	329
第四节 雄激素类与抗雄激素类药物.....	329
一、雄激素类药.....	329
二、抗雄激素类药.....	330
第五节 避孕药.....	331
一、主要抑制排卵药.....	331
二、干扰孕卵着床药.....	332
三、抗早孕药.....	332
四、杀精子药.....	332
第三十四章 组胺及组胺受体激动药.....	334
第一节 组胺和组胺受体激动药.....	334
第二节 抗组胺药.....	335
一、H ₁ 受体阻断药	336
二、H ₂ 受体阻断药	337
三、H ₃ 受体阻断药	338

第七篇 化学治疗药物

第三十五章 抗微生物药物概论.....	340
第一节 抗微生物药物的常用术语.....	341
第二节 抗微生物药物的作用机制.....	342
一、抑制细菌细胞壁的合成.....	342
二、改变胞浆膜的通透性.....	343
三、抑制蛋白质的合成.....	343
四、影响核酸代谢.....	343
五、影响叶酸代谢.....	343
第三节 细菌耐药性.....	344
一、细菌耐药性的产生.....	344

二、耐药性的种类.....	344
三、耐药性的机制.....	344
四、耐药基因的转移方式.....	345
五、多重耐药的产生与对策.....	346
第三十六章 β-内酰胺类抗生素	349
第一节 β-内酰胺类抗生素分类、抗菌作用机制及耐药性	349
一、β-内酰胺类抗生素分类	349
二、抗菌作用机制.....	349
三、耐药性.....	350
第二节 青霉素类抗生素.....	351
一、天然青霉素.....	352
二、半合成青霉素.....	353
第三节 头孢菌素类抗生素.....	355
第四节 其他 β-内酰胺类抗生素	357
一、碳青霉烯类	357
二、头霉素类.....	358
三、单环 β-内酰胺类	358
四、氧头孢烯类.....	358
第五节 β-内酰胺酶抑制剂	359
第三十七章 大环内酯类、林可霉素类及万古霉素类	361
第一节 大环内酯类抗生素	361
一、大环内酯类抗生素的共性.....	362
二、常用大环内酯类抗生素特点及应用.....	364
第二节 林可霉素类抗生素	365
第三节 万古霉素类抗生素	366
第三十八章 氨基糖苷类及多粘菌素类	369
第一节 氨基糖苷类抗生素	369
一、氨基糖苷类抗生素的共性.....	369
二、常用氨基糖苷类抗生素特点及应用	372
第二节 多粘菌素类抗生素	373
第三十九章 四环素类及氯霉素	375
第一节 四环素类抗生素	375
第二节 氯霉素	377
第四十章 人工合成抗菌药	380
第一节 喹诺酮类抗菌药	380
第二节 磺胺类抗菌药	384
一、用于全身性感染的磺胺药	386
二、用于肠道感染的磺胺药	386
三、外用磺胺药	386

第三节 其他合成抗菌药.....	387
第四十一章 抗结核病药及抗麻风病药.....	390
第一节 抗结核病药.....	390
一、各类抗结核病药.....	390
二、抗结核药的治疗原则.....	393
第二节 抗麻风病药.....	394
一、砜类.....	394
二、其他药物.....	395
第四十二章 抗真菌药和抗病毒药.....	396
第一节 抗病毒药.....	396
一、抗流感病毒药物.....	396
二、抗疱疹病毒药.....	398
三、抗艾滋病病毒药.....	399
第二节 抗真菌药.....	401
一、抗生素类抗真菌药.....	402
二、嘧啶类抗真菌药.....	403
三、唑类抗真菌药.....	404
四、丙烯胺类抗真菌药.....	405
第四十三章 抗菌药物的合理应用.....	407
第一节 抗菌药物临床应用原则.....	407
一、明确病原学诊断.....	407
二、根据抗菌药物的作用特点及药动学特性合理选用抗菌药.....	407
三、根据患者的特殊生理及病理状态合理用药.....	408
第二节 抗菌药的预防性应用.....	410
一、抗菌药在内科及儿科的预防性应用.....	410
二、抗菌药在外科中的预防性应用.....	410
第三节 抗菌药物的联合应用.....	412
第四十四章 抗寄生虫药.....	413
第一节 抗疟药.....	413
一、主要用于控制症状的抗疟药.....	414
二、主要用于控制复发和传播的抗疟药.....	416
三、主要用于病因性预防的抗疟药.....	417
第二节 抗阿米巴病药及抗滴虫病药.....	417
一、肠道内抗阿米巴病药.....	418
二、肠道外抗阿米巴病药.....	419
三、兼有肠道内外抗阿米巴病药.....	419
四、抗滴虫病药.....	420
第三节 抗血吸虫病药和抗丝虫病药.....	420
一、抗血吸虫病药.....	420

二、抗丝虫病药.....	421
第四节 抗肠蠕虫药.....	422
第四十五章 抗恶性肿瘤药物.....	427
第一节 抗恶性肿瘤药的药理学基础.....	427
一、抗肿瘤药物的发展.....	427
二、抗肿瘤药物的分类及其药理作用机制.....	427
第二节 常用抗恶性肿瘤药物.....	429
一、干扰核酸生物合成的药物.....	429
二、直接影响 DNA 结构与功能的药物	432
三、干扰转录过程和阻止 RNA 合成的药物	435
四、干扰蛋白质合成与功能的药物.....	436
五、影响体内激素平衡的药物.....	437
六、其他抗恶性肿瘤药物.....	438
第三节 抗恶性肿瘤药物应用中的常见问题及应用原则.....	441
一、毒性反应.....	441
二、耐药性.....	441
三、抗恶性肿瘤药物的应用原则.....	442

第八篇 作用于免疫系统的药物及基因治疗

第四十六章 作用于免疫系统的药物.....	446
第一节 免疫应答反应和免疫病理反应.....	446
一、免疫应答反应.....	446
二、免疫病理反应.....	446
第二节 免疫抑制药.....	447
一、免疫抑制药的临床应用.....	447
二、肾上腺糖皮质激素类.....	448
三、神经钙蛋白抑制剂.....	448
四、抗代谢类.....	449
五、抗体类.....	449
六、抗生素类.....	450
第三节 免疫增强药.....	450
一、免疫增强药的临床应用.....	450
二、微生物制剂.....	450
三、细胞因子类.....	451
四、化学制剂类.....	452
五、中药类.....	452
第四十七章 基因治疗.....	454
第一节 基因治疗概论.....	454

一、基因治疗类型.....	454
二、基因治疗途径.....	455
第二节 基因转移方法.....	455
第三节 基因治疗应用.....	456
一、肿瘤的基因治疗.....	456
二、心血管疾病的基因治疗.....	459
三、遗传病基因治疗.....	459
第四节 基因治疗问题和前景.....	460