

■ 国家骨干院校建设成果

# 现代实用药理知识

XIANDAI SHIYONG  
YAOLI ZHISHI

主 编：徐兴才 陈 念

生 物 制 药 技 术 从 书



广东高等教育出版社  
Guangdong Higher Education Press

# 现代实用药理知识

主编：徐兴才 陈 念

编委（按姓氏笔画排序）：

王 琼 帅银花 付晓燕  
刘 妍 刘 敬 吴 璇  
张 娜 张建军 赵 斌  
谢 敏 谢朝良



广东高等教育出版社  
Guangdong Higher Education Press

·广州·

## 图书在版编目 (CIP) 数据

现代实用药理知识/徐兴才, 陈念主编. —广州: 广东高等教育出版社, 2015. 3

(生物制药技术丛书)

ISBN 978 - 7 - 5361 - 4867 - 3

I. ①现… II. ①徐… ②陈… III. ①药理学 - 高等职业教育 - 教材  
IV. ① R96

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2015) 第 012197 号

出版发行	广东高等教育出版社 地址: 广州市天河区林和西横路 邮政编码: 510500 电话: (020) 87554152 <a href="http://www.gdgjs.com.cn">http://www.gdgjs.com.cn</a>
印 刷	佛山市浩文彩色印刷有限公司
开 本	787 毫米×1 092 毫米 1/16
印 张	19.75
字 数	465 千
版 次	2015 年 3 月第 1 版
印 次	2015 年 3 月第 1 次印刷
定 价	42.00 元

(版权所有 翻印必究)

# 总序

课程，始终是教育最基本、最关键、最重要的部分。离开课程，教育将一事无成。可以说，课程是实现教育架构，使教育者将自身教育理念、教学目标与教学实施连接起来的桥梁，是教育最核心的要素。

与普通教育不同，职业教育至少有两个学习地点：企业和学校。这意味着，职业教育既要关注行业、企业的需求，凸显其职业性，又要关注学校、学生的需求，凸显其教育性。因此，职业教育作为一种跨界的教育，要集成职业性与教育性这两个目标，就必然要有凸显自身规律的课程开发——跨界的课程开发的方法、途径。

一般来说，课程开发要解决两个问题：一是课程内容如何选择，二是课程内容如何排序。在这里，所谓课程内容的排序，指的是课程内容的结构化问题。例如知识，只有在结构化的情况下才能传递。从某种意义上讲，课程内容的排序甚至比课程内容的选择更具决定性的作用。但是，长期以来，我们的教育却一直没有跳出基于知识存储的课程排序，亦即学科知识结构的藩篱，从而导致学习知识旨在应用知识这一根本目标的丧失——不会应用知识何以创新知识！

近年来，借鉴世界各国职业教育改革的成功经验，特别是德国“双元制”职业教育课程开发的丰硕成果，我国在职业教育课程开发领域也进行了可喜的探索。工作过程系统化课程，这一基于知识应用结构且重在人的可持续发展的课程范式的出现，就是这一积极、有益探索的主要标志。而伴随着国家骨干高等职业院校和中等职业学校的建设进程，职业教育已在百花齐放的改革尝试中，逐步完成从单纯的“围城”式的学校教育向校企合作、工学结合的跨界合作转变。且适应这一转变的工作过程系统化课程，也在改革与实践中逐渐被认可、接受，并在实施中取得了很多成果。

中山火炬职业技术学院，正是在建设国家骨干高职院校过程中，紧紧抓住课程这个核心环节，开展了近三年的“深海探珠”教师下企业活动，深入

探求各职业岗位（群）对人才职业技能的要求，掌握和了解了大量职业岗位人才能力要求的第一手珍贵资料，并结合现代教育理念和教学理论开发课程。在这一卓有成效的改革中，学院对长期以来只是基于存储知识的学科体系课程进行反思，从应用知识的角度，将“高、新、特、精”的办学理念与课程开发结合，以工作过程系统化课程开发为主线，与企业一起共同开发、建设了一批在实践应用的过程中掌握专业知识的精品课程和教材。

“中山火炬职业技术学院国家骨干院校建设成果”是以职业分析和工作分析为前提，以培养与工作紧密相关的综合职业能力的课程观为指导，按照工作过程系统化课程范式开发的一系列教材和专著，是该院教师与企业技术人员合作的成果，在教育教学的理论创新和实践创新方面，都有所突破。其主要特点在于：一是课程结构以工作过程为导向，内容以完成工作任务为目标，而工作任务的设置则来自职业工作岗位（群）的能力要求，更多地关注了知识来源的应用性；二是教学目标参照了相关行业当前的技术规范和职业资格标准，增加了相关职业的具体资料和参数，以及作品内容的规范要求，更多地关注了知识内涵的实时性；三是教学实施强调“教、学、做”一体化的教学模式，以工作任务的目标完成度或达成度进行教学考核，更多地关注了知识考核的实用性；四是教材编写的承载方式有所突破，增加了直观的图形、案例，图文并茂，提高了教材的可读性，更多地关注了知识掌握的有效性。

总之，这套教材是该院教师走出校门、深入企业、实现职业教育课程开发跨界合作的集中展示，是职业教育产教融合、校企合作、工学结合的职业教育特色的整体呈现。

百尺竿头，要更进一步。在 2014 年开年之际，由衷祈盼中山火炬职业技术学院能有更多的收获，更多的成果，更多的欣喜！



2014 年 1 月 15 日

# 前 言

《现代实用药理知识》是中山火炬职业技术学院生物医药系国家骨干院校建设项目成果教材之一。本教材传承了《药理学》经典的格式规范，以“基础、必备、实用、现代”为基本原则，条理分明、重点突出、内容深厚。结合作者多年来的临床用药和教学经验，充分体现出了现代高职高专院校的人才培养思路，即以培养全面素养为基础、以培养能力为重心，注重培养学生的综合应用能力、实践能力、职业能力和创新能力。本书可作为药学、药物分析、药品营销、医药贸易、生物制药、中药等专业的药学类高职高专选修教材，也可作为成人教育辅导用书，以及医药企业职工培训的参考书。

本教材前面四章的内容重点介绍了药理学的基本理论知识，后面各章主要针对各类、各系统药物，详细介绍了各种药物的临床应用、不良反应，治疗各类常见疾病的选药原则、使用注意事项，以及药物咨询服务的基本要求和方法。

在有关各系统用药的章节中，首先对系统常见主要疾病的发病机理和临床特点进行讲解，循着疾病发病机理来设计选择适当的药物以阻断发病过程，使得疾病达到治愈。这种编写思路的设计有助于激发学生的学习兴趣和热情，同时也便于掌握和记忆。案例内容均针对各类常见疾病的选药原则和使用注意事项进行选择，这将有助于学生从单个疾病的治疗中认识药、学会用药，并更深刻地认识药物的不良反应。

本教材主要具备以下四方面的特点：

**传承经典** 传承了《药理学》教材的经典规范格式，在充分吸纳同类教材优点和经验的基础上，又体现了高职高专人才培养目标和特点的要求。

**内容现代** 以《国家基本药物目录》中收载的药物为主线，条理分明、重点明确、基础突出、内容实用，充分反映了国内药物学领域的研究现状和发展趋势。

**追求实用** 在介绍药理学基本知识和经典理论体系的前提下，深入浅出地讲解各类疾病的发生和发展机理，引导学生学习药理、理解药理、创新药理，借助翔实的案例，激发学生的学习兴趣，将学生由学习药理向应用药理

方面引导。

**注重实践** 结合医学基础理论知识，从疾病的发生和发展环节入手，让学生在案例中学习药理知识，学得快、记得牢、用得对。

本教材的编写人员在医院、药店、药品生产企业均有过专业的从业经验，对于用人单位对人才素质的需求，以及制药类高职高专类学生的人才特点均十分了解。因此，学生通过学习本教材，将扎实地掌握未来在工作岗位上生产、经营、管理各环节所需的基础理论知识，从而为今后开展药物咨询服务、新药评价、药物不良反应监测、药学研究提供现代药理学基础。

本教材的编写得到了医药企业、医院各方面第一线工作岗位的专业骨干、技术能手的许多宝贵的建议，结合多年来的实际教学经验，大家希望通过努力编撰出一本质量较高的又有利于教学的现代实用药理教材。但由于现代药理学的研究与发展迅速，最新的理论和观点尚未完全收集，因此本教材难免存在着许多不足之处，望广大教师和学生在使用过程中对存在的问题给予指正，不胜感激！

徐兴才 陈念  
2014年9月

# 目 录

<b>第一章 绪 论</b>	.....	( 1 )
第一节 药理学概论	.....	( 1 )
第二节 药理学发展简史	.....	( 2 )
第三节 临床药理学	.....	( 3 )
第四节 药理学的基本概念	.....	( 6 )
<b>第二章 药物代谢动力学</b>	.....	( 12 )
第一节 机体对药物的作用	.....	( 12 )
第二节 药物的速率过程	.....	( 17 )
<b>第三章 药物效应动力学</b>	.....	( 20 )
第一节 药物对机体的作用	.....	( 20 )
第二节 药物的量效关系	.....	( 23 )
第三节 药物的作用机制	.....	( 26 )
<b>第四章 影响药物作用的因素</b>	.....	( 33 )
第一节 机体因素	.....	( 33 )
第二节 药物因素	.....	( 35 )
<b>第五章 传出神经系统药物</b>	.....	( 39 )
第一节 传出神经系统概述	.....	( 39 )
第二节 传出神经系统的递质	.....	( 41 )
第三节 传出神经系统的受体与效应	.....	( 42 )
第四节 传出神经系统药物的作用	.....	( 43 )
<b>第六章 拟胆碱药</b>	.....	( 47 )
第一节 胆碱受体激动药	.....	( 47 )
第二节 胆碱酯酶抑制药	.....	( 49 )
<b>第七章 抗胆碱药</b>	.....	( 53 )
第一节 M 胆碱受体阻断药	.....	( 53 )
第二节 N 胆碱受体阻断药	.....	( 55 )
<b>第八章 拟肾上腺素药</b>	.....	( 59 )
第一节 $\alpha$ , $\beta$ 受体激动药	.....	( 59 )
第二节 $\alpha$ 受体激动药	.....	( 62 )
第三节 $\beta$ 受体激动药	.....	( 64 )
<b>第九章 抗肾上腺素药</b>	.....	( 67 )
第一节 $\alpha$ 肾上腺素受体阻断药	.....	( 67 )
第二节 $\beta$ 肾上腺素受体阻断药	.....	( 70 )

第三节	$\alpha$ , $\beta$ 肾上腺素受体阻断药	( 74 )
<b>第十章</b>	<b>镇静催眠药</b>	( 76 )
第一节	睡眠生理与障碍	( 76 )
第二节	镇静催眠药	( 77 )
<b>第十一章</b>	<b>抗精神失常药</b>	( 85 )
第一节	精神疾病发病机制	( 85 )
第二节	抗精神病药	( 86 )
第三节	抗躁狂、抗抑郁症药物	( 88 )
第四节	抗焦虑药	( 89 )
<b>第十二章</b>	<b>抗癫痫药和抗惊厥药</b>	( 91 )
第一节	癫痫病发病机制	( 91 )
第二节	抗癫痫药	( 92 )
第三节	抗惊厥药	( 94 )
<b>第十三章</b>	<b>抗帕金森病药</b>	( 96 )
第一节	帕金森病发病机制	( 96 )
第二节	抗帕金森病药	( 97 )
<b>第十四章</b>	<b>镇痛药</b>	( 100 )
第一节	疼痛发病机制	( 100 )
第二节	镇痛药	( 101 )
第三节	解热镇痛抗炎药	( 105 )
<b>第十五章</b>	<b>中枢兴奋药</b>	( 112 )
第一节	兴奋大脑皮质药	( 112 )
第二节	兴奋呼吸中枢药	( 113 )
第三节	促进大脑功能恢复药	( 114 )
<b>第十六章</b>	<b>抗高血压药</b>	( 116 )
第一节	高血压病发病机制	( 116 )
第二节	抗高血压药	( 117 )
<b>第十七章</b>	<b>抗慢性心功能不全药</b>	( 125 )
第一节	慢性心功能不全的发病机制	( 125 )
第二节	强心苷	( 126 )
第三节	非强心苷类的正性肌力药	( 127 )
第四节	血管扩张药	( 128 )
第五节	血管紧张素转化酶抑制剂和血管紧张素Ⅱ受体拮抗药	( 129 )
<b>第十八章</b>	<b>抗心律失常药</b>	( 131 )
第一节	心律失常的发病机制	( 131 )
第二节	抗心律失常药的分类及基本作用	( 132 )
第三节	抗心律失常药	( 132 )
<b>第十九章</b>	<b>抗心绞痛药</b>	( 136 )

第一节 心绞痛的发病机制 .....	(136)
第二节 抗心绞痛药 .....	(137)
<b>第二十章 抗高脂血症药</b> .....	(140)
第一节 高脂血症的发病机制 .....	(140)
第二节 抗高脂血症药 .....	(141)
<b>第二十一章 利尿药和脱水药</b> .....	(144)
第一节 利尿药 .....	(144)
第二节 脱水药 .....	(147)
<b>第二十二章 呼吸系统用药</b> .....	(150)
第一节 呼吸系统疾病常见症状 .....	(150)
第二节 镇咳药 .....	(151)
第三节 祛痰药 .....	(152)
第四节 平喘药 .....	(153)
<b>第二十三章 消化系统用药</b> .....	(158)
第一节 消化系统疾病常见症状 .....	(158)
第二节 抗消化性溃疡药 .....	(159)
第三节 消化功能调节药 .....	(162)
<b>第二十四章 血液和造血系统用药</b> .....	(170)
第一节 血液系统常见疾病 .....	(170)
第二节 抗贫血药 .....	(171)
第三节 促凝血药与抗凝血药 .....	(173)
第四节 抗血栓药 .....	(176)
第五节 血容量扩充药 .....	(177)
<b>第二十五章 抗糖尿病药</b> .....	(180)
第一节 糖尿病发病机制 .....	(180)
第二节 抗糖尿病药 .....	(181)
<b>第二十六章 组胺与抗组胺药</b> .....	(186)
第一节 H <sub>1</sub> 受体阻断药 .....	(187)
第二节 H <sub>2</sub> 受体阻断药 .....	(188)
<b>第二十七章 肾上腺皮质激素类药物</b> .....	(190)
第一节 糖皮质激素类药 .....	(190)
第二节 盐皮质激素类药 .....	(194)
<b>第二十八章 性激素及避孕药</b> .....	(196)
第一节 雌激素类药与抗雌激素类药 .....	(196)
第二节 孕激素类药与抗孕激素类药 .....	(198)
第三节 雄激素类药与同化激素类药 .....	(199)
第四节 避孕药 .....	(200)
<b>第二十九章 甲状腺激素类药及抗甲状腺药</b> .....	(204)

第一节	甲状腺激素类药	(204)
第二节	抗甲状腺药	(205)
<b>第三十章</b>	<b>子宫兴奋药</b>	(209)
第一节	垂体后叶素类	(209)
第二节	前列腺素类	(210)
第三节	麦角生物碱类	(211)
<b>第三十一章</b>	<b>抗菌药</b>	(213)
第一节	抗生素概述	(213)
第二节	$\beta$ -内酰胺类抗生素	(216)
第三节	大环内酯类抗生素	(222)
第四节	氨基糖苷类抗生素	(224)
第五节	四环素类与氯霉素抗生素	(226)
第六节	其他抗生素	(228)
第七节	合成抗生素	(229)
<b>第三十二章</b>	<b>抗真菌药和抗病毒药</b>	(235)
第一节	抗真菌药	(235)
第二节	抗病毒药	(238)
<b>第三十三章</b>	<b>抗结核病药及抗麻风病药</b>	(245)
第一节	抗结核病药	(245)
第二节	抗麻风病药	(248)
<b>第三十四章</b>	<b>抗寄生虫药</b>	(251)
第一节	抗疟药	(251)
第二节	抗阿米巴病药和抗滴虫病药	(254)
第三节	抗血吸虫病药和抗丝虫病药	(256)
第四节	抗肠蠕虫病药	(257)
<b>第三十五章</b>	<b>抗恶性肿瘤药物</b>	(260)
第一节	恶性肿瘤的发病机制	(260)
第二节	常用抗肿瘤药物	(264)
<b>第三十六章</b>	<b>麻醉药</b>	(274)
第一节	局部麻醉药	(274)
第二节	全身麻醉药	(276)
<b>第三十七章</b>	<b>常用药理实验技术</b>	(280)
实训一	药理学实验实训基本知识和技能	(280)
实训二	药物血浆半衰期测定	(288)
实训三	药物半数致死量测定	(291)
实训四	模拟药房药品的摆放及管理	(294)
实训五	处方调剂程序及药品说明书解读	(296)
实训六	模拟药品使用咨询	(301)

# 第一章 绪论



## 学习目的与培养目标

### ◆ 学习目的

学习药理学的基本理论、基本概念和研究内容。

### ◆ 知识目标

掌握药物的基本作用和主要不良反应；掌握受体激动剂、受体阻断剂的概念；掌握药物的体内过程，以及半衰期的临床意义。

### ◆ 能力和职业目标

掌握相关药理学知识，为患者提供用药咨询服务。

## 第一节 药理学概论

### 一、基本概念

药物是指用来防治和诊断疾病的物质。从理论上说，凡能影响机体器官生理功能及（或）细胞代谢活动的化学物质都属于药物的范畴。

药理学（Pharmacology）是一门为临床合理用药防治疾病提供基本理论的医学基础学科，研究的是药物与机体（包括病原体）相互作用的规律，以及在使用化学物质治疗疾病时对机体机能造成的影响。

药理学一方面研究在药物影响下机体功能如何发生变化，另一方面研究药物在体内的作用过程，前者称为药物效应动力学（Pharmacodynamics，简称“药效学”），后者称为药物代谢动力学（Pharmacokinetics，简称“药动学”）。

药理学是以生理学、生化学、病理学等为基础，为指导临床各科合理用药提供理论基础的桥梁学科，它与药物化学、调剂学、制药学等学科有着明显的区别。药理学经常将毒物作为研究对象，因此要注意将毒物学（Toxicology）与药理学区别开来，药理学指的是药物在医药治疗方面的应用。

## 二、研究内容

药理学是基础医学与临床医学、医学与药学之间的桥梁学科，人们在药理学科学的理论指导下进行临床实践，同时又在实验研究的基础上丰富药理学理论。

药理学的研究内容包括药效学和药动学，前者研究药物对机体的作用，包括药物的作用和效应、作用机制及临床应用等；后者研究药物在机体的作用下所发生的变化及其规律，包括药物在体内的吸收、分布、代谢和排泄过程，特别是血药浓度随时间变化的规律、影响药物疗效的因素等。

## 三、研究任务

药理学的学科任务是为了阐明药物作用机制、改善药物质量、提高药物疗效、开发新药和发现药物新用途，并为探索细胞生理、生化及病理过程提供实验资料。

其具体三大研究任务为：第一，药理学是医学院校学生必修的一门课，指导临床用药。第二，评价药物疗效以及在经济方面有些什么不同。第三，药理学是生命科学的重要组成部分，这其中包括两个方面：一方面是指药物研究通常除了指导临床用药，还对学术发展有极大的推动作用；另一方面是指药物研究本身就是生命科学的一个重要部分。

## 第二节 药理学发展简史

### 一、传统本草学阶段

远古时代人们为了生存，从生活经验中得知某些天然物质可以治疗疾病与伤痛，这是药物的始源。这些有用的实践经验流传至今，例如饮酒止痛、大黄导泻、棟实祛虫、柳皮退热等。民间医药实践经验累积集成书籍，这在我国及埃及、希腊、印度等均有记载，例如在公元1世纪前后我国的《神农本草经》（收载药物365种）及埃及的《埃伯斯医药籍》（*Ebers' Papyrus*）等。

唐代的《新修本草》是我国第一部药典，收载药物884种。明朝李时珍的《本草纲目》（1596）在药物发展史上有着巨大贡献，是我国传统医学的经典著作，全书共52卷，约190万字，收载药物1892种，插图1160帧，药方11000余条，是现今研究中药的必读书，在国际上有7种文字译本流传，全世界广为传播，在世界药物发展史上留下了光辉一页。

## 二、近代药理学阶段

在欧洲文艺复兴时期（14世纪）后，人们的思维开始摆脱宗教束缚，认为事各有因，只要客观观察都可以认识。瑞士医生帕拉塞尔苏斯（Paracelsus）（1493—1541）批判了古希腊医生盖伦（Galen）恶病质唯心学说，结束了医学史上1500余年的黑暗时代。后来英国解剖学家哈维（W. Harvey）（1578—1657）发现了血液循环，开创了实验药理学新纪元。意大利生理学家冯塔娜（F. Fontana）（1720—1805）通过动物实验对千余种药物进行了毒性测试，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。这一结论后来为德国化学家苏特尔（F. W. Sertürner）（1783—1841）首先从罂粟中分离提纯吗啡所证实。18世纪后期，英国工业革命不仅促进了工业生产，也带动了自然科学的发展。其中有机化学的发展为药理学提供了物质基础，从植物中不断提纯其活性成分，得到纯度较高的药物，如依米丁、奎宁、士的宁、可卡因等。之后还开始了人工合成新药，如德国微生物学家P. Ehrlich从近千种有机砷化合物中筛选出治疗梅毒有效的新胂凡纳明。

## 三、现代药理学阶段

药理学作为一门学科的发展始于德国的布海姆（R. Buchheim）（1820—1879），他建立了第一个药理实验室，写出第一本药理学教科书，也是世界上第一位药理学教授。其学生斯米德伯格（O. Schmiedeberg）（1838—1921）继续发展了实验药理学，开始研究药物的作用部位，被称为器官药理学。受体原是英国生理学家兰利（J. N. Langley）（1852—1925）提出的药物作用学说，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前所未有的药理新领域及新药，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。近年来，药动学的发展使临床用药从单凭经验发展为科学计算，并促进了生物药学（Biopharmaceutics）的发展。药效学方面逐渐向微观世界深入，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，届时将能进一步收到药到病除的效果。

## 第三节 临床药理学

临床药理学是研究药物与人体相互作用规律的一门学科，是在20世纪60年代新崛起的学科，学科间相互渗透的特点尤为突出。在早期，临床药理学被简单地视为“用人体做试验”，如我国封建社会就有“君有病饮药臣先尝之”的记载。

不同于基础药理学研究，临床药理学的研究是在人体内进行的。种属差异，如人种间的差异，以及人与动物间的差异，使得临床药理学不支持将一种通过动物实验的药物

直接推广进入到临床，如麻黄碱的扩瞳作用对于白种人较强，黄种人次之，黑种人则几乎没有作用。层出不穷的药品安全事件，使得临床药理学研究受到世界各国的关注，同时也确立了它在新药研究中的重要位置。

## 一、临床药理学与新药开发

新药是指化学结构、药品组分或药理作用不同于现有药品的药物。我国的《药品注册管理办法》规定，化学药品新药是指“未曾在中国境内上市销售的药品”，“改变给药途径且尚未在国内外上市销售的药品”等。新药的研究与开发是一项科技含量高、投资多、周期长、风险大、效益高的系统工程。不断发现和提供安全、高效、适应疾病谱及质量可控的新药，对于保护人民健康、发展国民经济具有重要的意义。新药从发现到生产直至临床应用，一般要经历创新阶段和开发阶段：在创新阶段要制定合成或分离提纯产物的有效成分，并在病理模型上进行筛选，从而发现有开发价值的化合物，即先导化合物；再研究先导化合物的构效关系，按国家关于新药审批办法的有关规定进行工艺学研究、制剂研究、质量控制、药效学评价、安全性评价、临床药理研究等。

药物科学的发展为新药开发提供了理论基础和技术条件，市场经济竞争也促进了新药快速发展。美国食品与药物管理局（FDA）近十年来每年批准上市的新药都在20种以上。我国近年来引进新药品种很多，但需要加快创新。临床有效的药物都具有相应的药理效应，但具有肯定药理效应的药物却不一定都是临床有效的药物。例如抗高血压药都能降低血压，但降压药并不都是抗高血压药，更不一定是能减少并发症、延长寿命的好药。因此，新药开发研究必须有一个逐步选择与淘汰的过程。为了确保药物对病人的疗效和安全，新药开发不仅需要可靠的科学实验结果，各国政府还对新药生产上市的审批与管理制定了法规，对人民健康及工商业经济权益予以法律保障。

新药来源包括天然产物、半合成及全合成化学物质。过去选药主要方法是依靠实践经验，现在可以根据有效药物的植物分类学找寻近亲品种进行筛选或从有效药物化学结构与药理活性关系推断，定向合成系列产品，然后进行药理筛选。近年来对于机体内在抗病物质（蛋白成分）利用脱氧核糖核酸（DNA）基因重组技术，即将DNA的特异基因区段分离并植入能够迅速生长的细菌或酵母细胞，以获得大量所需蛋白药物。此外，还可对现有药物进行化学结构改造（半合成）或改变剂型，也可获得疗效更好、毒性更小或应用更方便的药物。

新药研究过程大致可分为两个阶段：

(1) 临床前研究。这一研究阶段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，以及要弄清新药的作用谱和可能发生的毒性反应。在经过药物管理部门的初步审批后才能进行临床试验，目的在于保证用药安全、有效、可控。临床前药理研究是整个新药评价系统工程中不可逾越的桥梁阶段，其所获结论对新药从实验研究过渡到临床应用具有重要价值。

(2) 临床研究。临床研究一般分为四期：I期临床试验是在20~30例正常成年志愿

者身上进行的初步药理学及人体安全性试验，是新药人体试验的起始阶段，为后续研究提供科学依据；Ⅱ期临床试验为随机双盲对照试验，观察病例不少于100例，对新药的有效性、安全性做出初步评价，并推荐临床用量；Ⅲ期临床试验是在新药批准上市前进行的多中心临床试验，观察例数不少于300例，对新药的有效性和安全性进行社会考察，新药通过该期临床试验后，方能被批准生产、上市；Ⅳ期临床试验是在药品上市后，在社会人群较大范围内( $>2000$ 例)继续进行的药品安全性和有效性评价，在广泛长期使用的条件下考察远期疗效(包括无效病例)和不良反应，也称为售后调研，该期对最终确立新药的临床价值有重要意义。

## 二、临床药理学在新药评价中的主要任务

观察新药在人体内的代谢特征是临床药理学在新药评价中的主要任务，必须在国家有关机构审批后才能由设备先进的医院在有经验的临床药理学家指导下进行。近年来，数学、物理、化学和电子技术的广泛应用，使得药效学评价达到微观的程度，而气相色谱、高效液相色谱、放射免疫等技术的应用，解决了过去不能解决的药物微量分析问题。

有目的、有计划、有组织地在群体病人中评价某一药物的长期疗效和不良反应，是临床药理研究的一项经常性工作。如美国糖尿病研究组从1961年开始到1966年，参加协作的12所大学共征集1027名患者来观察预防糖尿病发展过程中的血管并发症，结果发现服用甲苯磺丁脲组的病人发生心血管病死率明显高于其他用药组，于是于1969年停止使用甲苯磺丁脲。

## 三、中药药理学

中药药理学是以中医基本理论为指导，用药理学的方法研究中药对机体各种功能的影响及其作用原理的科学，重点研究与中医理论有关的现代科学研究中药的成果，通过研究和实验了解中药药理的概貌。中药药理学的研究目的，主要是使医务工作者在用药时进一步认识中药防病治病的作用原理，以及产生疗效的物质基础，是中药学范畴中一个重要的组成部分。

利用现代科学方法研究中药，已有八十余载。20世纪20年代初，中国学者首先对麻黄的成分麻黄碱、伪麻黄碱和麻黄定碱进行了系统的化学及药理研究，由于发现它的特异药理作用，其论文报告不仅震动国内，也受到国外的极大重视，并引起世界学者对麻黄碱及其他中药研究的兴趣，使麻黄碱成为世界性的重要药物。由于当时社会动荡、战乱不断，设备简陋，从事研究的人员极少，故研究进展缓慢，成果不多，主要进行了一些单味药的研究，而且没有化学、药理与临床三者的协作。化学方面主要对延胡索、钩藤、麻黄、常山、防己等数十种药材进行研究；药理则主要对麻黄、黄连、常山、延胡索、仙鹤草等数十种药材进行了研究。新中国成立后，政府对中医中药的整理研究和发展十分重视，做出继承、发扬、整理、提高中医中药的重要批示，建立了从中央到地方各省市的中医中药研究机构和各级中医医院，使中药药理和临床研究进入了一个新的阶

段，研究范围从单方发展到复方，研究课题从资源调查到生药鉴定、炮制、化学、药理直至临床，单味药品种之多及研究范围之广，诚属空前。对延胡索、粉防己、人参、黄连、葛根、川芎、丹参、三七、枳实、枳壳、灵芝、莪术、大黄、青蒿、青木香、益母草、天花粉等研究均较深入，还从抗微生物、抗寄生虫、抗肿瘤、解热、镇痛、强心、利尿、抗高血压、抗心律不齐等方面进行了大量的筛选。不但对传统中药研究较多，还研究了很多草药，如穿心莲、四季青、毛冬青、矮地茶、福寿草、满山红等，并已提供临床应用，大大丰富了药物品种。综括中草药药理研究，其中部分阐明了中医药理论（如活血化瘀、扶正培本等治则），搞清了某些中药的有效成分（如延胡索乙素、青蒿素、川芎嗪等），改良了某些剂型（如感冒冲剂），发现了某些药的新用途（如枳实、青皮、鹤草芽等）。但中药的成分是复杂的，作用也是多方面的，一个成分绝不能代表一味中药，某个作用也不能概括其全部功效，中药很多问题有待进一步研究。

## 第四节 药理学的基本概念

### 一、药物的基本作用

#### (一) 药理作用与药理效应

(1) 药物作用：指药物与机体细胞间的初始作用，是动因，是分子反应机制，有其特异性。

(2) 药理效应：药物作用的结果，是机体反应的表现，对不同脏器有其选择性。最基本的药理学效应包括兴奋和抑制。

(3) 药理效应的选择性：即药理效应的专一性，是药物引起机体产生效应的范围，是药物分类的依据，又是临床用药时指导用药和拟定治疗剂量的依据。药物的选择性与药物本身的化学结构有关。

#### (4) 药物作用的两重性：

①治疗作用。指药物所引起的符合用药目的的作用。

②不良反应。指那些不符合药物治疗目的并给患者带来痛苦或危害的反应。

#### (二) 药物的治疗作用及其分类

凡符合用药目的或达到防治效果的作用称为治疗作用。按治疗目的分为：

①对因治疗。针对病因治疗称为对因治疗，也称治本。用药目的在于消除原发致病因子，彻底治愈疾病。

②对症治疗。用药物改善疾病症状，但不能消除病因，称为对症治疗，也称治标。用药目的在于改善症状。