

医学生

课堂笔记及应试指南丛书

药理学



以医学院校本科生教材大纲为指导



以卫生部规划教材为依据



形式新颖、把老师教案与学生笔记融在一起



便于理解、记忆、复习、应试

主编 艾静 王宁 张妍



人民军医出版社

PEOPLE'S MILITARY MEDICAL PRESS

医学生课堂笔记及应试指南丛书

药 理 学

YAOLIXUE

主 审 杨宝峰

主 编 艾 静 王 宁 张 妍

副主编 孙宏丽 龚冬梅 赵 光

编 者 (以姓氏笔画为序)

于楚瑶 王 宁 艾 静 史云辉

孙宏丽 张 妍 赵 光 龚冬梅



人民军医出版社

People's Military Medical Press

北 京

图书在版编目 (CIP) 数据

药理学 / 艾静, 王宁, 张妍主编. — 北京: 人民军医出版社, 2006.5

(医学生课堂笔记及应试指南丛书)

ISBN 7-5091-0079-8

I. 药... II. ①艾...②王...③张... III. 药理学—医学院校—教学参考资料 IV. R96

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2005) 第 130834 号

策划编辑: 丁金玉 **文字编辑:** 伦踪启 **责任审读:** 黄栩兵

出版人: 齐学进

出版发行: 人民军医出版社 **经 销:** 新华书店

通信地址: 北京市 100036 信箱 188 分箱 **邮 编:** 100036

电话: (010) 66882586 (发行部) 51927290 (总编室)

传真: (010) 68222916 (发行部) 66882583 (办公室)

网址: www.pmmp.com.cn

印刷: 三河市春园印刷有限公司 **装订:** 春园装订厂

开本: 787mm × 1092mm 1/16

印张: 22.75 **字数:** 520 千字

版、印次: 2006 年 5 月第 1 版第 1 次印刷

印数: 0001~4500

定价: 56.00 元

版权所有 侵权必究

购买本社图书, 凡有缺、倒、脱页者, 本社负责调换

电话: (010)66882585 51927252

内容提要

本书以全国医学院校教学大纲为依据,以国内医学院校通用的权威教材为基础,收集、整理药理学课堂笔记及各类复习题、考试题,精心编撰而成。全书共分48章,紧扣教材内容,列出每章需要掌握的知识结构、重点、难点内容,而且每章后都有实战测试,以帮助读者加深理解、强化记忆、融会贯通药理学知识。本书既可供医学专业学生和教师使用,也可作为报考研究生人员的参考资料。

责任编辑 丁金玉 伦踪启

前言

药理学是我国高等医学院校学生必修的一门基础课,掌握和熟悉本课程的基本理论、基本知识和基本技能,可以为其他基础课、专业课及临床医学、口腔医学、预防医学和护理学等专业课的学习和研究奠定基础。

医学知识难懂、难记、难背,这是每一个医学生共同的感受。要想学好,关键在于老师的“教”和学生的“学”。教就是老师把知识通过有限的课时,通过板书传达出来,学就是学生通过看书、听课及复习课堂笔记三个环节来把握所学知识。本书就是从教和学出发,以医学院校本科生教学大纲为指导,以卫生部规划教材为依据,组织长期从事药理学一线教学和研究生入学考试命题、评卷工作的专家编写而成的。全书共48章,内容包括:知识框架、考点归纳、综合分析、小节练兵、实战测试。知识框架、考点归纳即是教师授课的重点,也是考核学生的重点;综合分析是对每章的重点、难点、学生易混淆的地方以举例和考题的形式加以突出,使学生更易理解和记忆;小节练兵、实战测试是以选择题的形式考查学生掌握的知识点,巩固所学知识,为各种考试做准备。

本书形式新颖,把老师的教案与学生的笔记融合到一起,在强调知识点的同时,避免空洞死板的概念叙述,强调学习方法的重要性。既能帮助学生进行课前预习,也能使学生在课堂上明确重点和难点内容,提高听课效率,更有助于在课后复习时,对知识的总结归纳、融会贯通,从而减轻学习负担,增强学习效果。本书适于医药院校本科和专科学生使用,也可作为报考研究生的专业课复习及教师教学的参考书。

由于编者水平有限,本书难免有错漏之处及其他问题,恳请读者批评指正。

编者

2006年5月

目 录

第1章 总 论 /1

实战测试 /2

第2章 药物代谢动力学 /3

实战测试 /11

第3章 药物效应动力学 /14

实战测试 /17

第4章 影响药物效应的因素 /19

第5章 传出神经系统药理概论 /21

实战测试 /25

第6章 胆碱受体激动药 /27

实战测试 /28

第7章 抗胆碱酯酶药和胆碱酯酶复活药 /30

第一节 乙酰胆碱酯酶的作用 /30

第二节 抗胆碱酯酶药 /31

第三节 胆碱酯酶复活药 /33

实战测试 /34

第8章 胆碱受体阻断药 (I) —— M胆碱受体阻断药 /37

- 第一节 阿托品 /37
- 第二节 东莨菪碱 /39
- 第三节 山莨菪碱 /39
- 实战测试 /39

第9章 胆碱受体阻断药 (II) —— N胆碱受体阻断药 /43

- 第一节 N_N 胆碱受体阻断药——神经节阻断药 /43
- 第二节 N_M 胆碱受体阻断药——骨骼肌松弛药 /43
- 实战测试 /44

第10章 肾上腺素受体激动药 /46

- 第一节 α, β 受体激动药 /46
- 第二节 α 受体激动药 /49
- 第三节 β 受体激动药 /50
- 实战测试 /51

第11章 肾上腺素受体拮抗药 /58

- 第一节 α 受体拮抗药 /58
- 第二节 β 肾上腺素受体拮抗药 /60
- 第三节 常用 β 受体拮抗药 /62
- 实战测试 /63

第12章 中枢神经系统药理学概论 /67

- 实战测试 /71

第13章 局部麻醉药 /75

- 实战测试 /77

第14章 全身麻醉药 /80

- 第一节 吸入性麻醉药 /80
- 第二节 静脉麻醉药 /81
- 第三节 复合麻醉 /81
- 实战测试 /82

第15章 镇静催眠药 /85

第一节 苯二氮䓬类 /85

第二节 巴比妥类 /86

实战测试 /87

第16章 抗癫痫药及抗惊厥药 /90

第一节 抗癫痫药 /90

第二节 抗惊厥药 /93

实战测试 /93

第17章 抗帕金森病药 /96

实战测试 /97

第18章 抗精神失常药 /100

实战测试 /107

第19章 镇痛药 /109

实战测试 /115

第20章 解热镇痛抗炎药 /117

实战测试 /122

第21章 离子通道概论 /125

实战测试 /128

第22章 钙通道阻滞药 /130

实战测试 /132

第23章 抗心律失常药 /136

实战测试 /142

第24章 利尿药和脱水药 /147

第一节 常用利尿药 /147

第二节 脱水药 /151

实战测试 /151

第25章 抗高血压药 /154

实战测试 /158

第26章 治疗充血性心力衰竭的药物 /161

第一节 强心甘类 /161

第二节 肾素-血管紧张素-醛固酮系统抑制药 /164

实战测试 /166

第27章 抗心绞痛药 /172

实战测试 /175

第28章 调血脂药与抗动脉粥样硬化药 /178

第一节 调血脂药 /178

第二节 抗氧化剂 /180

第三节 多烯脂肪酸类 /181

第四节 黏多糖和多糖类 /181

实战测试 /181

第29章 作用于血液及造血器官的药物 /186

第一节 抗凝血药 /186

第二节 纤维蛋白溶解药与纤维蛋白溶解抑制药 /188

第三节 抗血小板药 /188

第四节 促凝血药 /189

第五节 抗贫血药及造血细胞生长因子 /189

第六节 血容量扩充药 /190

实战测试 /191

第30章 影响自体活性物质的药物 /195

第一节 膜磷脂代谢产物类药物及拮抗药 /195

第二节 5-羟色胺类药物及拮抗药 /196

第三节 组胺和抗组胺药 /197

第四节 多肽类 /198

第五节 一氧化氮 /198

第六节 腺苷与药理性预适应 /199

实战测试 /199

第31章 作用于呼吸系统的药物 /203

第一节 平喘药 /203

第二节 镇咳药 /206

第三节 祛痰药 /207

实战测试 /207

第32章 作用于消化系统的药物 /212

第一节 抗消化性溃疡药 /212

第二节 消化功能调节药 /214

实战测试 /216

第33章 子宫平滑肌兴奋药和抑制药 /219

第一节 子宫平滑肌兴奋药 /219

第二节 子宫平滑肌抑制药 /221

实战测试 /221

第34章 性激素类药及避孕药 /223

第一节 雌激素类药及雌激素拮抗药 /223

第二节 孕激素类药 /224

第三节 雄激素类药和同化激素类药 /225

第四节 避孕药 /226

实战测试 /227

第35章 肾上腺皮质激素类药物 /231

第一节 糖皮质激素 /231

第二节 盐皮质激素 /235

第三节 促皮质素及皮质激素抑制剂 /235

实战测试 /236

第36章 甲状腺激素及抗甲状腺药 /240

第一节 甲状腺激素 /240

第二节 抗甲状腺药 /241

第三节 促甲状腺激素与促甲状腺释放激素的临床应用 /244

实战测试 /245

第37章 胰岛素及口服降血糖药 /248

实战测试 /251

第38章 抗菌药物概论 /254

第一节 常用术语 /254

第二节 抗菌药物的作用机制 /255

第三节 细菌的耐药性 /256

第四节 抗菌药物的合理应用原则 /257

实战测试 /259

第39章 β 内酰胺类抗生素 /262

第一节 分类、抗菌作用机制和耐药机制 /262

第二节 青霉素类 /264

第三节 头孢菌素类抗生素 /268

第四节 其他 β 内酰胺类抗生素 /270

第五节 β 内酰胺酶抑制药及其复方制剂 /272

实战测试 /273

第40章 大环内酯类、林可霉素类及肽类抗生素 /277

第一节 大环内酯类 /277

第二节 林可霉素类 /280

第三节 肽类抗生素 /280

实战测试 /282

第41章 氨基糖苷类抗生素及多粘菌素 /285

第一节 氨基糖苷类抗生素 /285

第二节 多粘菌素类 /288

实战测试 /288

第42章 四环素类及氯霉素类 /291

实战测试 /293

第43章 人工合成抗菌药 /296

第一节 喹诺酮类抗菌药 /296

第二节 磺胺类抗菌药 /298

第三节 其他合成类抗菌药 /301
实战测试 /301

第44章 抗病毒药和抗真菌药 /304

第一节 抗病毒药 /304
第二节 抗真菌药 /308
实战测试 /311

第45章 抗结核病药及抗麻风病药 /314

第一节 抗结核病药 /314
第二节 抗麻风病药 /318
实战测试 /318

第46章 抗寄生虫药 /321

第一节 抗疟药 /321
第二节 抗阿米巴病药及抗滴虫病药 /325
第三节 抗血吸虫病药和抗丝虫病药 /326
第四节 抗蠕虫药 /327
实战测试 /328

第47章 抗恶性肿瘤药物 /331

实战测试 /337

第48章 免疫调节药 /340

第一节 概论 /340
第二节 免疫抑制药 /341
第三节 免疫刺激药 /344
实战测试 /345

知识框架

掌握药理学相关的基本概念。

考点归纳

本章需要解决的问题是药物和毒物的关系、药理学的基本概念和研究方法。

（一）药物和毒物关系

药物和毒物之间并无严格界限。

1. **药物** 是指可以改变或查明机体的生理功能及病理状态，可用以预防、诊断和治疗疾病的化学物质。

2. **毒物** 是指在较小剂量即对机体产生毒害作用、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。

（二）药理学的基本概念和研究方法

1. **基本概念** 药理学是研究药物与机体（含病原体）相互作用及作用规律的科学。研究内容包括：

（1）研究药物对机体的作用及作用机制，即药物效应动力学（pharmacodynamics），又称药效学。

（2）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），又称药动学。

2. 研究方法

（1）**实验药理学方法**：以健康动物（包括清醒动物和麻醉动物）和正常器官、组织、细胞、亚细胞、受体分子和离子通道等为实验对象，进行药物效应动力学和药物代谢动力学的研究。实验药理学方法对于分析药物作用、作用机制及药物代谢动力学的过程具有重

要意义。

(2) 实验治疗学方法: 是以病理模型动物或组织器官为实验对象, 观察药物治疗作用的一种方法。实验治疗学方法既可在整体进行, 也可用培养细菌、寄生虫及肿瘤细胞等方法在体外进行。

(3) 临床药理学方法: 以健康志愿者或病人为对象, 研究药物的药效学、药动学和药物的不良反应, 并对药物的疗效和安全性进行评价, 促进新药开发, 推动药物治疗学发展, 确保合理用药。

实战测试

一、名词解释

1. 药理学
2. 药物
3. 药物效应动力学
4. 药物代谢动力学

二、简答题

药理学的研究方法是什么?

测试答案

一、名词解释

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

二、简答题

答: 三种方法: 实验药理学方法、实验治疗学方法、临床药理学方法。

(艾 静 龚冬梅)

知识框架

1. 掌握内容 药物作用的两重性：治疗作用、不良反应的种类及其基本概念（副反应、毒性反应、后遗效应、停药反应、变态反应、继发反应、特异质反应等）；量反应的量效曲线、质反应的量效曲线、最大效能、效价（强度）及 ED_{50} ， LD_{50} ；药物安全性的评价标准；治疗指数及安全范围；药物作用的受体理论（受体的概念、本质、功能、特性、受体的调节）。
2. 熟悉内容 药物与受体结合产生效应的条件；亲和性与内在活性；配体、激动药、拮抗药、竞争性拮抗药、非竞争性拮抗药的基本概念；药物作用的选择性及其实际意义；药物选择作用的相对性。
3. 了解内容 药物作用的基本方式：兴奋（提高）或抑制（降低）；药物作用的可逆性、药物作用量变到质变的规律；受体发挥作用本质，第二信使学说。

考点归纳

（一）概念

1. 体内过程 药物从用药部位进入机体至排出体外的过程，又称机体对药物的处置过程。

转运：吸收、分布、排泄；转化：代谢

2. 药物代谢动力学 以数学的方法定量地研究药物的体内过程，研究体内、血浆、细胞内，尤其是血浆内药物浓度随时间变化的规律的科学。

3. 药物代谢动力学的意义 制定合理的给药方案，减少毒性，提高疗效。研制、改进新药、新剂型等。

（二）药物的转运

药物的吸收、分布、排泄的过程，是药物通过各种生物膜的过程，称药物的跨膜转运，或药物的转运，分两种方式：

1. 被动转运 药物依膜两侧的浓度差, 从浓度高处向浓度低处转运, 绝大多数药物的转运属被动转运。

(1) 特点: 不耗能、不需载体、无饱和现象、无竞争性抑制、膜两侧浓度相等时转运停止。

(2) 影响因素: 主要是理化特性、分子量、脂溶性、极性、解离度等。

分子量小、脂溶性高、极性小、非解离型的药物易于通过生物膜, 其中药物解离受体内外因素的影响, 对转运影响很大, 用药时要特别注意。

大多数药物是弱酸性或弱碱性的, 在水溶液中不像强酸、强碱那样 100% 解离, 仅部分解离, 其解离的多少取决于本身的解离特性 (pK_a) 及所处溶液的 pH 值。

pH 值影响解离就影响了药物转运, 这种影响可用 Handerson-Hasselbalch 公式说明:

K_a 为解离常数

弱酸

$$K_a = \frac{[H^+][A^-]}{[HA]} \quad \frac{[\text{离子}]}{[\text{分子}]}$$

弱碱

$$K_a = \frac{[H^+][B]}{[BH^+]}$$

pK_a 为解离常数的负对数

弱酸:

$$pK_a = pH - \log \frac{[A^-]}{[HA]} \quad pH - pK_a = \log \frac{[A]}{[HA]}$$

$$10^{pH - pK_a} = \frac{[A^-]}{[HA]} \quad \frac{[\text{解离}]}{[\text{非解离}]}$$

当 $pH = pK_a$ $[A^-] = [HA]$ 解离 = 非解离

弱碱:

$$pK_a = pH - \log \frac{[B]}{[BH^+]} \quad pK_a - pH = \log \frac{[BH^+]}{[B]}$$

$$= pH + \log \frac{[B]}{[BH^+]}$$

$$10^{pK_a - pH} = \frac{[BH^+]}{[B]} \quad \frac{[\text{解离}]}{[\text{非解离}]}$$

当 $pK_a = pH$ $[BH^+] = [B]$ 解离 = 非解离

由上式可以看出, pK_a 即为弱酸性或弱碱性药物在 50% 解离时溶液的 pH 值。各药有其固定的 pK_a 值。

当溶液的 pH 值与 pK_a 值的差异以数学值增减时, 解离型药物与非解离型药物浓度的差异以相应的指数变化。因此, 溶液 pH 值的微小变化可明显影响药物的解离度, 从而影响药物的转运。

以弱酸性药物为例:

$$\text{pH}-\text{pK}_a = \log \frac{[\text{A}^-]}{[\text{HA}]} = \frac{[\text{解离}]}{[\text{非解离}]}$$

$$10^{\text{pH}-\text{pK}_a} = \frac{[\text{A}^-]}{[\text{HA}]} = \frac{[\text{解离}]}{[\text{非解离}]}$$

当 $\text{pH}-\text{pK}_a = -1$ 时 10% 解离, $\text{pH} = \text{pK}_a$ 时 50% 解离, $\text{pH}-\text{pK}_a = -2$ 时, 99% 非解离, 1% 解离。

例如:阿司匹林 ($\text{pK}_a = 3.5$) 在胃内 (pH 为 1.5) 解离情况:

$$\frac{[\text{A}^-]}{[\text{HA}]} = 10^{1.5-3.5} = 10^{-2} = 0.01 \quad 1\% \text{ 解离} \quad 99\% \text{ 非解离}$$

每个药物的 pK_a 值是一定的, 酸性药物 pK_a 值越小则酸性越强, 碱性药物 pK_a 值越高则碱性越强。

由此可知:弱酸性药物在 pH 值低 (酸性) 环境中解离度小 (非解离多), 经膜转运容易, 在胃液中易吸收, 在酸性尿液中易被肾小管再吸收。弱碱性药物在 pH 值高 (碱性) 环境中解离度小, 经膜转运容易, 在肠液中易吸收, 在碱性尿液中易再吸收。

被动转运意义: ①可以推论药物由胃肠道吸收的难易程度, 如弱酸性药物易从胃吸收, 弱碱性药物易从肠吸收; ②可推测药物在体内分布的情况, 弱酸性药物主要分布在细胞外液 ($\text{pH} = 7.4$), 弱碱性药物易进入细胞 ($\text{pH} = 7.0$); ③改变尿液 pH , 可改变药物排出速度, 如巴比妥 (弱酸性) 中毒时, 应用碱性药物增加尿的 pH 值的, 使在尿中解离 $\uparrow$, $\downarrow$ 肾小管上皮细胞对巴比妥的重吸收, 加速其排出。

2. 主动转运 是药物需载体及能量的跨膜转运 (与膜两侧浓度差无关)。

特点: ①耗能; ②有饱和性 (底物浓度高至一定程度, 转运达饱和); ③有竞争性。两种药物经同一载体转运时呈竞争抑制, 如青霉素和丙磺舒、依他酸和尿酸等; ④不需浓度差。可逆浓度差转运, 所以药物可集中于某一组织; ⑤需有载体。载体对药物有选择性, 有饱和性。

很少的药物经主动转运, 主动转运多表现为自肾小管分泌的排泄过程。

(三)、药物的体内过程 (ADME 系统)

吸收 $\rightarrow$ 分布 $\rightarrow$ 代谢 $\rightarrow$ 排泄

1. 吸收 是指药物从用药部位向血液循环中转运的过程。

吸收: 速度, 起效快慢; 量, 作用强度。

影响因素:

(1) 理化特性: 分子量、酸碱性、溶解性、解离度。

(2) 给药途径: 口服、舌下、直肠、吸入、皮下注射、肌肉注射、静脉注射、皮肤。

速度: 吸入 $>$ 舌下 $>$ 直肠 $>$ 肌肉注射 $>$ 皮下注射 $>$ 口服 $>$ 皮肤 (促皮吸收剂月桂氮革酮, 如硝苯地平、硝酸甘油)。

舌下、直肠不经过肝门静脉, 可避免首关消除。