

高等药科院校教材

# 药理学

主编

刘国卿

中国医药科技出版社

高等药科院校教材

# 药 理 学

主 编 刘国卿

副主编 王敏伟 钱之玉

编 委 (按姓氏笔画排序)

王广基 (中国药科大学)

王世久 (沈阳药科大学)

王敏伟 (沈阳药科大学)

刘国卿 (中国药科大学)

李 锐 (广州中医药大学)

陈一岳 (广东药学院)

吴春福 (沈阳药科大学)

钱之玉 (中国药科大学)

中国医药科技出版社

登记证号：(京) 075 号

### 内 容 提 要

本书是为适应高等药学院校药理学教学特点及药学工作者对药理学知识更新的需要，由中国药科大学、沈阳药科大学、广州中医药大学和广东药学院联合编写的教材。除了使其内容赶上药理学的飞速进展外，还增加了与药物应用及新药研制有关的新理论和新的药物作用机理。考虑到药学专业和药学工作者实际需要，本书特别注意实用性。如增加新药品种，包括某些正在研制开发的新药，增加药物使用方面的知识。本书不仅可供药学专业（包括函授教学）作为教材，也可供广大药学工作者及医护人员参考。

### 图书在版编目 (CIP) 数据

药理学/刘国卿主编. —北京：中国医药科技出版社，  
2000.2

高等药科院校教材

ISBN 7-5067-2053-1

I. 药… II. 刘… III. 药理学-高等学校-教材  
IV. R96

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2000) 第 01720 号

中国医药科技出版社 出版  
(北京市海淀区文慧园北路甲 22 号)  
(邮政编码 100088)

北京市平谷县早立印刷厂 印刷  
全国各地新华书店 经销

\*

开本 787×1092mm  $\frac{1}{16}$  印张 32 $\frac{1}{4}$   
字数 734 千字 印数 12001—17000  
2003 年 12 月第 1 版第 3 次印刷

---

定价：48.00 元

本社图书如存在印装质量问题，请与本社联系调换（电话：62244206）

## 编写前言

药理学在高等药科院校是一门重要的专业课，它是联系临床与药物之间的桥梁。药理学不仅指导临床合理和安全用药，而且是研制开发新药的理论基础。药科院校的学生不仅需要掌握药理学的基础理论知识和实验技能，还需要不断地更新知识，了解国内外药物发展的新动态、新的理论和新的学说，如近年来进展迅速的离子通道、愈分愈细的多种受体亚型、一氧化氮和氨基酸类神经递质以及生物等效性等。这些与新药研制开发密切相关的内容在本书中都有所反映，此外本教材还增加了一章“新药研制与开发”。另一方面，作为执业药师，不论是在医院、药厂或其他涉及药物应用的单位，均需要更多的药物实用知识，故本书中尽量增加了新药品种（包括某些国内即将上市的药物）及药物使用方面的知识等内容。鉴于目前药物滥用和吸毒的严重性，增加了有关成瘾性与戒毒的内容。

本书是由中国药科大学、沈阳药科大学、广州中医药大学及广东药学院联合撰写的。内容上力求符合目前高等药科院校的教学实际。但考虑到药科学生未来实际工作领域的广泛性，故有的章节内容较多，各学校可根据自己的教学要求进行取舍。

除本书的编委承担了撰写任务外，参加编写的还有刘玉兰、巫冠中、宋立艳、傅守廷、陈思维、赵润洲、徐影、刘铮、廖雪珍、廖惠芳、周玖瑶、谭毓治、伍爱婵、李明亚、江涛等。在本书的编写过程中得到了各院校领导的重视，特别是广州中医药大学和广东药学院领导给予了热情支持，在此一并致谢！

由于经验不足，加之时间仓促，本书定有缺点和不足之处，盼广大读者给予指正并提出宝贵意见。

刘国卿

2000年1月

# 目 录

|                       |        |
|-----------------------|--------|
| 第一章 绪论                | ( 1 )  |
| 第二章 药物代谢动力学           | ( 3 )  |
| 第一节 药物体内过程            | ( 3 )  |
| 一、药物的吸收               | ( 3 )  |
| 二、药物的分布               | ( 7 )  |
| 三、生物转化                | ( 8 )  |
| 四、药物的排泄               | ( 8 )  |
| 第二节 药动学参数及其应用         | ( 10 ) |
| 一、药时曲线                | ( 10 ) |
| 二、药物消除类型              | ( 11 ) |
| 三、半衰期                 | ( 12 ) |
| 四、表观分布容积              | ( 13 ) |
| 五、清除率                 | ( 13 ) |
| 六、生物利用度               | ( 14 ) |
| 七、多次恒速给药              | ( 14 ) |
| 八、房室模型                | ( 16 ) |
| 九、治疗药物的监测与剂量调整        | ( 16 ) |
| 第三章 药物效应动力学           | ( 18 ) |
| 第一节 药物作用一般规律          | ( 18 ) |
| 一、药物作用的选择性            | ( 18 ) |
| 二、药物作用的双重性            | ( 19 ) |
| 第二节 受体的概念与药物作用机制      | ( 20 ) |
| 一、受体的基本概念             | ( 21 ) |
| 二、受体动力学概念             | ( 23 ) |
| 三、药物的构效关系与药物设计        | ( 26 ) |
| 第三节 受体与细胞内信号转导系统      | ( 27 ) |
| 第四节 受体的调节             | ( 29 ) |
| 第五节 药物量反应和质反应的剂量-效应关系 | ( 29 ) |
| 一、药物的量反应与质反应          | ( 29 ) |
| 二、治疗作用与毒性作用的评价        | ( 31 ) |
| 第四章 影响药物作用的因素         | ( 32 ) |
| 第一节 药物因素              | ( 32 ) |
| 一、药物的剂量和剂型            | ( 32 ) |
| 二、给药的时间和次数            | ( 32 ) |

|                            |        |
|----------------------------|--------|
| 三、反复用药的影响·····             | ( 33 ) |
| 四、药物相互作用·····              | ( 33 ) |
| 第二节 机体因素·····              | ( 34 ) |
| 一、年龄·····                  | ( 34 ) |
| 二、性别·····                  | ( 35 ) |
| 三、病理情况·····                | ( 35 ) |
| 四、遗传因素·····                | ( 36 ) |
| 五、精神因素·····                | ( 36 ) |
| 六、个体差异·····                | ( 36 ) |
| 第三节 环境因素·····              | ( 37 ) |
| 第五章 新药研究与开发·····           | ( 38 ) |
| 第一节 药物研究与进展·····           | ( 38 ) |
| 一、药物研究的历史·····             | ( 38 ) |
| 二、现代药物研究与发展是一项复杂的系统工程····· | ( 38 ) |
| 第二节 新药研究与开发·····           | ( 39 ) |
| 一、我国新药的分类·····             | ( 39 ) |
| 二、新药的申报与审批·····            | ( 39 ) |
| 三、药理学和毒理学研究·····           | ( 40 ) |
| 四、新药的临床试验·····             | ( 42 ) |
| 第六章 传出神经的药理学概论·····        | ( 43 ) |
| 第一节 传出神经系统的解剖与生理·····      | ( 43 ) |
| 一、传出神经系统的解剖学分类·····        | ( 43 ) |
| 二、传出神经系统的生理·····           | ( 44 ) |
| 第二节 传出神经系统的递质·····         | ( 45 ) |
| 一、传出神经突触的超微结构·····         | ( 45 ) |
| 二、神经冲动的化学传递·····           | ( 45 ) |
| 三、传出神经按神经递质分类·····         | ( 46 ) |
| 四、递质的合成、贮存、释放和消散·····      | ( 47 ) |
| 第三节 传出神经系统的受体及效应·····      | ( 49 ) |
| 一、传出神经系统受体的命名与分类·····      | ( 49 ) |
| 二、受体与效应相关的分子基础·····        | ( 49 ) |
| 三、受体的效应·····               | ( 51 ) |
| 第四节 传出神经系统药物的分类·····       | ( 52 ) |
| 一、分类依据·····                | ( 52 ) |
| 二、药物分类·····                | ( 52 ) |
| 第七章 作用于胆碱受体的药物·····        | ( 54 ) |
| 第一节 胆碱受体激动药·····           | ( 54 ) |
| 一、M、N 胆碱受体激动药·····         | ( 54 ) |
| 二、M 胆碱受体激动药 ·····          | ( 55 ) |

|                                        |         |
|----------------------------------------|---------|
| 三、N 胆碱受体激动药·····                       | ( 58 )  |
| 第二节 M 胆碱受体阻断药 ·····                    | ( 58 )  |
| 一、阿托品类生物碱·····                         | ( 58 )  |
| 二、阿托品的合成代用品·····                       | ( 62 )  |
| 三、M <sub>1</sub> 胆碱受体阻断药 ·····         | ( 63 )  |
| 第三节 抗胆碱酯酶药及胆碱酯酶复活剂·····                | ( 63 )  |
| 一、胆碱酯酶·····                            | ( 63 )  |
| 二、抗胆碱酯酶药·····                          | ( 65 )  |
| 三、胆碱酯酶复活药·····                         | ( 70 )  |
| 四、有机磷酸酯类中毒的防治·····                     | ( 72 )  |
| 第四节 N 胆碱受体阻断药·····                     | ( 72 )  |
| 一、N <sub>1</sub> 胆碱受体阻断药——神经节阻断药 ····· | ( 73 )  |
| 二、N <sub>2</sub> 胆碱受体阻断药——骨骼肌松弛药 ····· | ( 73 )  |
| 第八章 作用于肾上腺素受体的药物·····                  | ( 78 )  |
| 第一节 药物的分类及构效关系·····                    | ( 78 )  |
| 一、分类·····                              | ( 78 )  |
| 二、构效关系·····                            | ( 79 )  |
| 第二节 肾上腺素受体激动药·····                     | ( 82 )  |
| 一、 $\alpha$ 、 $\beta$ 受体激动药 ·····      | ( 82 )  |
| 二、 $\alpha$ 受体激动药 ·····                | ( 85 )  |
| 三、 $\beta$ 受体激动药 ·····                 | ( 87 )  |
| 第三节 肾上腺素受体阻断药·····                     | ( 89 )  |
| 一、 $\alpha$ 受体阻断药 ·····                | ( 89 )  |
| 二、 $\beta$ 受体阻断药 ·····                 | ( 92 )  |
| 第九章 局部麻醉药·····                         | ( 100 ) |
| 一、药理作用·····                            | ( 100 ) |
| 二、常用局麻药·····                           | ( 100 ) |
| 第十章 全身麻醉药·····                         | ( 103 ) |
| 第一节 吸入麻醉药·····                         | ( 103 ) |
| 第二节 静脉麻醉药·····                         | ( 104 ) |
| 第十一章 镇静催眠药·····                        | ( 107 ) |
| 第一节 苯二氮草类·····                         | ( 107 ) |
| 第二节 巴比妥类·····                          | ( 111 ) |
| 第三节 其他镇静催眠药·····                       | ( 112 ) |
| 第十二章 抗癫痫药及抗惊厥药·····                    | ( 115 ) |
| 第一节 抗癫痫药·····                          | ( 115 ) |
| 第二节 抗惊厥药·····                          | ( 119 ) |
| 第十三章 抗精神失常药·····                       | ( 121 ) |
| 第一节 精神分裂症的多巴胺学说·····                   | ( 121 ) |

|                    |       |
|--------------------|-------|
| 第二节 抗精神分裂症药物       | (122) |
| 一、吩噻嗪类             | (122) |
| 二、丁酰苯类             | (124) |
| 三、二苯并二氮草类          | (125) |
| 四、苯甲酰胺类            | (125) |
| 五、硫杂蒽类             | (126) |
| 六、其他类              | (126) |
| 第十四章 抗帕金森病药        | (129) |
| 第一节 拟多巴胺药          | (129) |
| 第二节 中枢抗胆碱药         | (133) |
| [附] 抗老年性痴呆药        | (133) |
| 第十五章 抗抑郁症药和抗躁狂药    | (135) |
| 第一节 抗抑郁症药          | (135) |
| 一、三环类抗抑郁药          | (135) |
| 二、第二代抗抑郁药          | (137) |
| 第二节 抗躁狂药           | (138) |
| 第十六章 麻醉性镇痛药        | (140) |
| 第一节 阿片受体和阿片肽       | (140) |
| 第二节 吗啡代用品及其构效关系    | (144) |
| 第三节 药物滥用           | (149) |
| 一、阿片类滥用            | (149) |
| 二、甲基苯丙胺滥用          | (151) |
| 第十七章 中枢兴奋药         | (152) |
| 第一节 大脑皮质兴奋药        | (152) |
| 第二节 延髓呼吸中枢兴奋药      | (154) |
| 第十八章 解热镇痛抗炎药       | (156) |
| 第一节 解热镇痛抗炎药的药理作用基础 | (156) |
| 一、磷脂代谢与药物作用        | (156) |
| 二、药物常见不良反应的发生机理    | (158) |
| 第二节 常用解热镇痛抗炎药      | (159) |
| 一、水杨酸类             | (159) |
| 二、苯胺类              | (162) |
| 三、吡唑酮类             | (162) |
| 四、其他有机酸类           | (163) |
| [附] 抗痛风药           | (167) |
| 第十九章 5-羟色胺和抗偏头痛药   | (169) |
| 第一节 5-羟色胺          | (169) |
| 一、5-羟色胺受体亚型        | (169) |
| 二、作用于5-羟色胺受体的药物    | (170) |

|                               |       |
|-------------------------------|-------|
| 第二节 防治偏头痛药物·····              | (170) |
| <b>第二十章 钙通道阻断药</b> ·····      | (172) |
| 第一节 钙通道与分型·····               | (172) |
| 第二节 钙通道阻断药的分类·····            | (174) |
| 第三节 钙通道阻断药的药理作用·····          | (174) |
| 一、对心脏的作用·····                 | (174) |
| 二、对血管的作用·····                 | (175) |
| 三、对血流动力学的影响·····              | (176) |
| 四、其他作用·····                   | (176) |
| 第四节 临床应用及注意事项·····            | (177) |
| 一、抗高血压病·····                  | (177) |
| 二、抗心绞痛和保护缺血心肌·····            | (177) |
| 三、抗动脉粥样硬化症·····               | (177) |
| 四、其他用途·····                   | (178) |
| 第五节 临床常用的药物·····              | (178) |
| 一、二氢吡啶类药物·····                | (178) |
| 二、硫氮草类·····                   | (182) |
| 三、苯烷胺类药物·····                 | (182) |
| 四、其他类·····                    | (184) |
| <b>第二十一章 钾通道开放剂</b> ·····     | (186) |
| 第一节 钾通道和钾通道调节剂·····           | (186) |
| 第二节 钾通道开放剂的作用机制·····          | (187) |
| 第三节 钾通道开放剂的药理作用·····          | (187) |
| 第四节 临床常用的药物·····              | (188) |
| <b>第二十二章 抗心绞痛药</b> ·····      | (191) |
| 第一节 硝酸酯类·····                 | (192) |
| 第二节 $\beta$ 受体阻断药·····        | (195) |
| 第三节 钙通道阻断药·····               | (196) |
| 第四节 其他抗心绞痛药·····              | (197) |
| [附] 抗血小板和抗血栓药·····            | (198) |
| <b>第二十三章 抗心律失常药</b> ·····     | (199) |
| 第一节 心肌电生理学基础·····             | (199) |
| 一、心肌解剖与生理的基本概念·····           | (199) |
| 二、心肌电生理·····                  | (200) |
| 第二节 抗心律失常药物的基本电生理作用及药物分类····· | (201) |
| 一、心律失常发生的机制·····              | (201) |
| 二、抗心律失常药物的基本药理作用·····         | (202) |
| 三、抗心律失常药物的分类·····             | (203) |
| 第三节 常用的抗心律失常药·····            | (204) |

|                              |       |
|------------------------------|-------|
| 一、钠通道阻断药·····                | (204) |
| 二、 $\beta$ 肾上腺素受体阻断药·····    | (211) |
| 三、延长动作电位时程的药物·····           | (212) |
| 四、钙通道阻断药·····                | (214) |
| 第四节 快速型心律失常的药物选用·····        | (214) |
| <b>第二十四章 抗慢性心功能不全药</b> ····· | (218) |
| 第一节 CHF 病理生理及其分子生物学基础·····   | (218) |
| 一、CHF 基本病理生理·····            | (218) |
| 二、CHF 的心脏调节与分子生物学的变化·····    | (219) |
| 第二节 强心甙·····                 | (220) |
| 第三节 非强心甙类的正性肌力作用药·····       | (228) |
| 一、 $\beta$ 受体药·····          | (228) |
| 二、多巴胺类·····                  | (229) |
| 三、磷酸二酯酶抑制药·····              | (229) |
| 四、其他类·····                   | (230) |
| 第四节 血管紧张素转化酶抑制剂·····         | (230) |
| <b>第二十五章 抗高血压药</b> ·····     | (233) |
| 第一节 抗高血压药的分类·····            | (233) |
| 第二节 常用抗高血压药·····             | (234) |
| 一、利尿降压药·····                 | (234) |
| 二、作用于交感神经系统的降压药·····         | (235) |
| 三、钙通道阻断药·····                | (240) |
| 四、血管扩张药·····                 | (240) |
| 五、作用于肾素-血管紧张素-醛固酮系统的药物·····  | (243) |
| 第三节 抗高血压药的合理选用·····          | (247) |
| <b>第二十六章 治疗高脂血症药</b> ·····   | (250) |
| 第一节 血浆脂质和脂蛋白的代谢·····         | (250) |
| 一、参与脂蛋白代谢的各种因素及其功能·····      | (250) |
| 二、各种脂蛋白代谢·····               | (252) |
| 三、脂代谢紊乱与动脉粥样硬化的关系·····       | (253) |
| 第二节 调血脂药·····                | (254) |
| 一、HMG-CoA 还原酶抑制剂·····        | (254) |
| 二、苯氧酸类·····                  | (255) |
| 三、胆酸结合树脂·····                | (256) |
| 第三节 抗氧化剂·····                | (257) |
| 第四节 多不饱和脂肪酸类·····            | (258) |
| 第五节 保护动脉内皮药·····             | (258) |
| <b>第二十七章 利尿药及脱水药</b> ·····   | (261) |
| 第一节 利尿药·····                 | (261) |

|                                |              |
|--------------------------------|--------------|
| 一、肾泌尿生理及利尿药作用部位·····           | (261)        |
| 二、常用利尿药·····                   | (264)        |
| 第二节 脱水药·····                   | (270)        |
| <b>第二十八章 用于血液系统药物·····</b>     | <b>(273)</b> |
| 第一节 抗凝血药·····                  | (273)        |
| 第二节 促纤维蛋白溶解药·····              | (276)        |
| 第三节 抗血小板药·····                 | (277)        |
| 第四节 促凝血药·····                  | (278)        |
| 第五节 抗贫血药·····                  | (279)        |
| 第六节 促进白细胞增生药·····              | (282)        |
| <b>第二十九章 作用于呼吸系统的药物·····</b>   | <b>(285)</b> |
| 第一节 平喘药·····                   | (285)        |
| 一、 $\beta$ 受体激动药·····          | (285)        |
| 二、茶碱·····                      | (286)        |
| 三、M胆碱受体阻断药·····                | (286)        |
| 四、肾上腺皮质激素·····                 | (286)        |
| 五、抗过敏平喘药·····                  | (287)        |
| 第二节 镇咳药·····                   | (287)        |
| 第三节 祛痰药·····                   | (288)        |
| <b>第三十章 组胺受体阻断药·····</b>       | <b>(291)</b> |
| 第一节 $H_1$ 受体阻断药·····           | (291)        |
| 第二节 $H_2$ 受体阻断药·····           | (293)        |
| <b>第三十一章 作用于消化系统的药物·····</b>   | <b>(295)</b> |
| 第一节 助消化药·····                  | (295)        |
| 第二节 抗消化性溃疡药·····               | (295)        |
| 一、抗酸药·····                     | (295)        |
| 二、 $H_2$ 受体阻断药·····            | (296)        |
| 三、 $M_1$ 胆碱受体阻断药·····          | (296)        |
| 四、胃壁细胞 $H^+$ 泵抑制药·····         | (296)        |
| 五、粘膜保护药·····                   | (297)        |
| 第三节 止吐药·····                   | (297)        |
| 第四节 泻药·····                    | (298)        |
| 一、容积性泻药·····                   | (298)        |
| 二、接触性泻药·····                   | (298)        |
| 三、润滑性泻药·····                   | (298)        |
| 第五节 止泻药·····                   | (298)        |
| 第六节 利胆药·····                   | (299)        |
| <b>第三十二章 子宫平滑肌兴奋药与松弛药·····</b> | <b>(301)</b> |
| 第一节 子宫平滑肌兴奋药·····              | (301)        |

|                               |              |
|-------------------------------|--------------|
| 第二节 子宫平滑肌松弛药·····             | (305)        |
| <b>第三十三章 性激素与避孕药·····</b>     | <b>(307)</b> |
| 第一节 性激素的分泌调节及作用机制·····        | (307)        |
| 一、性激素的分泌调节·····               | (307)        |
| 二、性激素的作用机制·····               | (307)        |
| 第二节 性激素类药物·····               | (308)        |
| 一、雌激素类药物·····                 | (308)        |
| 二、抗雌激素类药物·····                | (310)        |
| 三、孕激素类药物·····                 | (311)        |
| 四、抗孕激素类药物·····                | (313)        |
| 五、雄激素类药物·····                 | (313)        |
| 六、同化激素·····                   | (315)        |
| 第三节 避孕药·····                  | (315)        |
| 一、主要用于抑制排卵的避孕药·····           | (316)        |
| 二、抗着床避孕药·····                 | (317)        |
| 三、男性避孕药·····                  | (317)        |
| 四、外用避孕药·····                  | (317)        |
| [附] 影响子宫及胎盘功能药物·····          | (317)        |
| <b>第三十四章 肾上腺皮质激素类药物·····</b>  | <b>(320)</b> |
| 第一节 糖皮质激素·····                | (321)        |
| 第二节 盐皮质激素·····                | (325)        |
| 第三节 促肾上腺皮质激素·····             | (326)        |
| <b>第三十五章 甲状腺激素及抗甲状腺药·····</b> | <b>(327)</b> |
| 第一节 甲状腺激素·····                | (327)        |
| 第二节 抗甲状腺药·····                | (329)        |
| 一、硫脲类·····                    | (329)        |
| 二、碘及碘化物·····                  | (330)        |
| 三、放射性碘·····                   | (331)        |
| 四、 $\beta$ 受体阻断药·····         | (331)        |
| <b>第三十六章 胰岛素及口服降血糖药·····</b>  | <b>(333)</b> |
| 第一节 胰岛素·····                  | (333)        |
| 第二节 口服降血糖药·····               | (334)        |
| 一、磺酰脲类·····                   | (335)        |
| 二、双胍类·····                    | (336)        |
| <b>第三十七章 抗菌药物概述·····</b>      | <b>(338)</b> |
| 第一节 常用术语·····                 | (338)        |
| 第二节 抗菌药物的主要作用机制·····          | (339)        |
| 一、抑制细菌细胞壁合成·····              | (340)        |
| 二、抑制细胞膜功能·····                | (342)        |

|                                      |       |
|--------------------------------------|-------|
| 三、抑制或干扰细菌细胞蛋白质合成·····                | (342) |
| 四、抑制 DNA、RNA 的合成·····                | (342) |
| 第三节 细菌的耐药性·····                      | (342) |
| 一、耐药性产生机制·····                       | (342) |
| 二、避免细菌耐药性的产生·····                    | (343) |
| 第四节 抗菌药物的合理选用·····                   | (343) |
| 一、抗菌药合理应用的基本原则·····                  | (343) |
| 二、抗菌药的联合应用·····                      | (345) |
| 第三十八章 青霉素类抗生素·····                   | (346) |
| 一、天然青霉素·····                         | (347) |
| 二、半合成青霉素·····                        | (348) |
| 第三十九章 头孢菌素类及其他 $\beta$ -内酰胺类抗生素····· | (353) |
| 第一节 头孢菌素类·····                       | (353) |
| 第二节 其他 $\beta$ -内酰胺类·····            | (357) |
| 一、单环 $\beta$ -内酰胺类·····              | (357) |
| 二、 $\beta$ -内酰胺酶抑制剂·····             | (358) |
| 三、碳青霉烯类·····                         | (358) |
| 第四十章 大环内酯类及其他抗生素·····                | (362) |
| 第一节 大环内酯类·····                       | (362) |
| 第二节 克林霉素·····                        | (365) |
| 第三节 多肽类抗生素·····                      | (366) |
| 第四十一章 氨基苷类抗生素·····                   | (369) |
| 第一节 氨基苷类概述·····                      | (369) |
| 第二节 常用的氨基苷类抗生素·····                  | (371) |
| 第四十二章 四环素类与氯霉素类抗生素·····              | (376) |
| 第一节 四环素类·····                        | (376) |
| 第二节 氯霉素类·····                        | (379) |
| 第四十三章 喹诺酮类药物·····                    | (382) |
| 第一节 喹诺酮类概述·····                      | (382) |
| 第二节 常用喹诺酮类药物·····                    | (385) |
| 第四十四章 合成抗菌药·····                     | (389) |
| 第一节 磺胺类·····                         | (389) |
| 第二节 抗菌增效剂·····                       | (393) |
| 第三节 硝基呋喃类·····                       | (394) |
| 第四十五章 抗真菌药·····                      | (396) |
| 一、多烯类·····                           | (396) |
| 二、非烯类·····                           | (397) |
| 三、咪唑类·····                           | (398) |
| 第四十六章 抗病毒药·····                      | (401) |

|                                 |       |
|---------------------------------|-------|
| <b>第四十七章 抗结核药和抗麻风病药</b> .....   | (406) |
| 第一节 抗结核药.....                   | (406) |
| 第二节 抗结核病药的应用原则.....             | (410) |
| 第三节 抗麻风病药.....                  | (411) |
| <b>第四十八章 抗疟药</b> .....          | (413) |
| 第一节 疟原虫的生活史及药物作用环节.....         | (413) |
| 第二节 常用抗疟药.....                  | (415) |
| 一、主要用于控制症状的抗疟药.....             | (415) |
| 二、主要用于病因性预防的抗疟药.....            | (418) |
| 三、主要用于控制复发和传播的药物.....           | (419) |
| 四、抗疟药的合理应用.....                 | (420) |
| <b>第四十九章 抗阿米巴病药和抗滴虫病药</b> ..... | (422) |
| 第一节 主要作用于肠内外阿米巴病药.....          | (422) |
| 第二节 主要作用于肠腔内阿米巴病药.....          | (424) |
| 第三节 主要作用于肠腔外阿米巴病药.....          | (425) |
| 第四节 抗滴虫病药.....                  | (425) |
| <b>第五十章 抗肠蠕虫药</b> .....         | (427) |
| 第一节 驱线虫药.....                   | (427) |
| 第二节 驱绦虫药.....                   | (430) |
| 第三节 驱肠虫药的合理选用.....              | (431) |
| <b>第五十一章 抗血吸虫和抗丝虫病药</b> .....   | (433) |
| 第一节 抗血吸虫病药.....                 | (433) |
| 第二节 抗丝虫病药.....                  | (435) |
| <b>第五十二章 抗恶性肿瘤药</b> .....       | (437) |
| 第一节 肿瘤细胞增殖周期和化疗药物作用的关系.....     | (437) |
| 第二节 抗恶性肿瘤药的作用机制与分类.....         | (439) |
| 第三节 常用的抗恶性肿瘤药物.....             | (440) |
| 一、影响核酸生物合成的药物.....              | (440) |
| 二、直接破坏 DNA 阻止其复制的药物 .....       | (443) |
| 三、嵌入 DNA 中干扰转录过程的药物 .....       | (448) |
| 四、干扰有丝分裂影响蛋白质合成的药物.....         | (450) |
| 五、内分泌药物.....                    | (452) |
| 第四节 抗恶性肿瘤药物的合理应用.....           | (453) |
| <b>第五十三章 免疫抑制剂和免疫增强剂</b> .....  | (456) |
| 第一节 免疫应答和免疫病理反应.....            | (456) |
| 一、免疫应答反应.....                   | (456) |
| 二、免疫病理反应.....                   | (457) |
| 第二节 免疫抑制剂.....                  | (457) |

---

|                     |       |
|---------------------|-------|
| 第三节 免疫增强剂·····      | (458) |
| 第五十四章 维生素及微量元素····· | (462) |
| 第一节 维生素·····        | (462) |
| 一、水溶性维生素·····       | (462) |
| 二、脂溶性维生素·····       | (469) |
| 第二节 微量元素·····       | (473) |
| 汉语拼音索引 ·····        | (477) |
| 英文索引·····           | (489) |

# 第一章 绪 论

药理学 (pharmacology) 是研究药物与机体之间互相作用规律的一门科学, 也是药与医学之间的桥梁和纽带。药理学具有边缘学科或杂交学科 (hybrid Science) 的特性, 从广泛的基础和应用学科中吸取理论和先进技术为本学科所用, 同时又能推动有关基础和学科理论和技术的发展。药理学与医学的密切结合, 在指导临床合理用药与新药的研制开发中起着重要的作用, 故在药学院校药理学是一门专业课。广义上讲, 药理学包涵药物多方面的知识, 如药物的历史、来源、理化性质、生化和生理作用、作用机理、吸收、分布、生物转运和治疗用途等, 临床医生及医科学校学生对药物作用机理的充分理解, 才能指导合理用药。近年来我国新药研制和开发工作蓬勃发展, 它既向药理学研究提出新的要求, 如药物的临床前研究, 药效和安全的评价, 药物的等效性研究等, 同时也推动和促进了我国药理学的发展。

现代药理学由于发展迅速, 已分化出很多分支。但主要的又分为临床前药理学 (preclinical pharmacology) 和临床药理学 (clinical pharmacology)。临床前药理学又称动物药理学或比较药理学。由于安全、法律和道德的原因, 实验只能先在动物身上进行, 根据动物的实验资料再外推到人。也就是说, 在绝大多数情况下, 新药研究必须先动物后人体。由于种属差异, 药物的最后评价依赖于临床药理学, 包括正常人试用的 I 期临床和药效及毒理作用观察的 II 期和 III 期临床。药物临床评价最基本的要求是安全 and 有效, 即使是已上市的新药或老药或同类别药物也需进行再评价。

从工作内容上讲, 药理学可分为药效学 (pharmacodynamics) 和药动学 (pharmacokinetics)。药效学主要回答的问题是药物对机体有何作用 (what the drug does to the body), 即研究药物的生化、生理作用和药物的作用机理。药效学借助于很多学科的理论和技术, 如生理学、生物化学、细胞和分子生物学、免疫学、微生物学、遗传学及病理学; 药动学所涉及的范围是机体对药物的处置 (what the body does to the drug), 包括药物的吸收、分布、生物转化和排泄, 这些因素以及药物剂量决定了药物在靶部位作用的浓度, 因而药物作用的强度是时间的函数。小分子药物或蛋白质药物通过生物膜的被动或主动转运和在体内的分布, 受到很多方面因素如药物的理化性质和机体生物化学和酶学规律的调控。

按系统分类, 药理学又分为神经精神药理学 (neuropsychopharmacology)、心血管药理学 (cardiovascular pharmacology)、免疫药理学 (immunopharmacology)、生殖药理学 (reproductive pharmacology) 等。化学治疗 (chemotherapy) 则包括所有用于治疗病原体引起的疾病的药物, 如细菌、病毒、寄生虫等。

按照研究手段的进展, 即从宏观到微观, 药理学又分为: 经典药理学、生化药理学 (biochemical pharmacology)、细胞药理学 (cellular pharmacology)、分子药理学 (molecular pharmacology) 和量子药理学等。

毒理学 (toxicology) 也属于药理学的范畴, 它主要涉及药物的不良作用。药物毒

理学是新药研制的重要环节,只有在动物实验证明是安全的物质才能过渡到人体实验,进行临床药理学评价。毒理学也包括对非药用的化学品的研究,如杀虫剂、农用化学品及环境污染给机体造成的毒害作用,称为工业毒理学和环境毒理学。

西方近代药理学始于18世纪末和19世纪初,从植物中提取化学单体并进行动物实验,如从罂粟分离出吗啡,从金鸡纳树皮分离出奎宁等。20世纪40年代末期是药物发展的蓬勃时期,青霉素及大批抗生素的出现挽救了千百万人的生命,从植物药分离的降压药利血平、口服利尿药、口服降血糖药及 $\beta$ -受体阻断药、 $H_2$ 受体阻断剂、钙通道拮抗剂等,都是划时代的突破性进展。

现在仍有一些疾病尚缺乏有效的药物,如病毒性疾病、肿瘤、慢性神经元退行性疾病、老年性痴呆、帕金森氏病等。

中国的药物学研究有着悠久的历史。最早记载药物的著作是约2000年前的《神农本草经》。明代李时珍撰写的《本草纲目》是总结前人的经验和自己的长期观察而写成的一本巨著,至今仍有参考价值。

我国近代药理学的进展始于20世纪20年代化学学科的发展,如从麻黄中分离提取的麻黄碱确定为麻黄的有效成分,极大地推动了拟交感胺类药物的研制,由此开发出一系列的抗哮喘药和升压药,为临床提供了不少有效药物。

近50年来中草药研究进展迅速,为全世界瞩目,尤其是抗疟药青蒿素的成功,受到各国的重视和采用。另一方面,以中医理论为指导,中西医结合研究复方中药也取得了进展。近年来采用“血清药理学”手段研究中药复方的药理作用已取得一定的成效。

(中国药科大学 刘国卿)