

■ 全国高等学校“十二五”医学规划教材

(供临床医学、临床药学、药学、口腔、麻醉、检验、预防、护理等专业用)



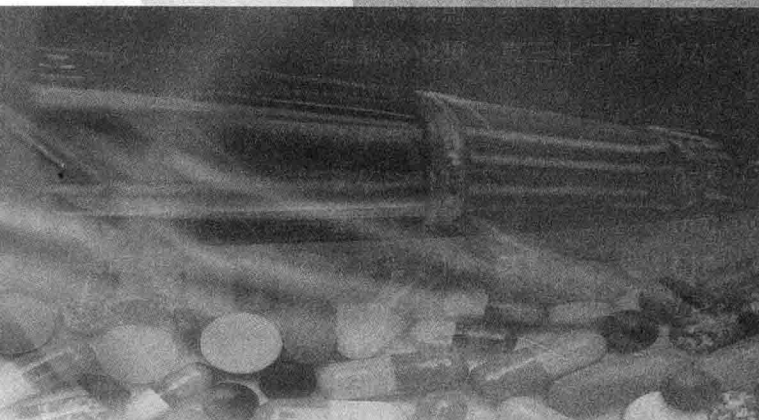
# 药理学

主编 刘克辛

高等教育出版社

■ 全国高等学校“十二五”医学规划教材

(供临床医学、临床药学、药学、口腔、麻醉、检验、预防、护理等专业用)



# 药理学

Yaolixue

主 编 刘克辛

副主编 何 新 张忠泉

编·者(以姓氏笔画为序)

田 鑫(郑州大学) 刘克辛(大连医科大学)

许建华(福建医科大学) 李 华(大连医科大学)

李 芹(天津医科大学) 杨宝学(北京大学)

杨静娴(辽宁中医药大学) 何 新(天津中医药大学)

邹莉波(沈阳药科大学) 宋丽华(长治医学院)

张忠泉(河南大学) 罗学娅(大连大学)

周 红(第三军医大学) 周宇宏(哈尔滨医科大学)

周黎明(四川大学) 赵晓民(泰山医学院)

翟凤国(牡丹江医学院)

高等教育出版社·北京

## 内容简介

本教材共 8 篇 45 章,分为总论和各论两大部分。总论分 4 章,重点介绍药理学的基本概念、研究对象和任务、药代动力学和药效动力学的基本原理和最新进展;各论分 41 章,着重阐明各章药物的体内过程、药理作用、作用机制、临床应用、不良反应、药物相互作用和禁忌证。各章开头的【学习要求】简明扼要提出本章节的重点;章节后的【案例与讨论】使学生消化、理解、活用本章所学重点内容,【本章药物/内容分类总结】利于学生复习和记忆,【问题与思考】使学生通过解答问题掌握重点内容和知识应用方法。教材末附有中英文名词与药物名称索引,供读者查阅。

本教材可作为医药院校临床医学、临床药学、药学、口腔、麻醉、检验、预防、护理等专业本科生教材,也可作为研究生、临床医师、药师、护师、从事药学研究及药厂技术人员的参考书。

## 图书在版编目(CIP)数据

药理学 / 刘克辛主编. -- 北京:高等教育出版社,  
2014. 6

供临床医学、临床药学、药学、口腔、麻醉、检验、  
预防、护理等专业用

ISBN 978 - 7 - 04 - 039838 - 0

I. ①药… II. ①刘… 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(2014)第 115671 号

策划编辑 席 雁

责任编辑 孙葵葵

封面设计 于文燕

责任印制 刘思涵

出版发行 高等教育出版社

社 址 北京市西城区德外大街 4 号

邮政编码 100120

印 刷 北京人卫印刷厂

开 本 787mm × 1092mm 1/16

印 张 33

字 数 740 千字

购书热线 010 - 58581118

咨询电话 400 - 810 - 0598

网 址 <http://www.hep.edu.cn>

<http://www.hep.com.cn>

网上订购 <http://www.landaco.com>

<http://www.landaco.com.cn>

版 次 2014 年 6 月第 1 版

印 次 2014 年 6 月第 1 次印刷

定 价 57.50 元

本书如有缺页、倒页、脱页等质量问题,请到所购图书销售部门联系调换

版权所有 侵权必究

物 料 号 39838 - 00

# 前 言

基于问题的学习 (problem-based learning, PBL) 模式成功地促进了教学改革, 与之相对应的教材改革也不断深入。以 PBL 为编写宗旨的本教材在教学改革不断加强的大环境中与读者见面。

本教材编写坚持贯彻教材的“三基、五性、三特定”的原则, 由始至终围绕着重培养学生的素质 (包括学习能力、科学分析综合能力及科学思维方法和初步科学能力的培养) 来进行。

本教材共 8 篇 45 章, 分为总论和各论两大部分。总论分 4 章, 重点介绍药理学的基本概念、研究对象和任务, 药物代谢动力学和药物效应动力学的基本原理和最新进展; 各论分 41 章, 着重阐明各章药物的体内过程、药理作用、作用机制、临床应用、不良反应、药物相互作用和禁忌证。本教材的特点是有“四大板块”: 在各章开头有【学习要求】, 结合教学大纲要求简明扼要提出本章节的重点; 在每章节后附【案例与讨论】, 通过案例力求使学生消化、理解、活用本章所学重点内容; 【本章药物/内容分类总结】, 用树状图的形式分类列出本章节介绍的药物或重点内容, 利于学生复习和记忆; 【问题与思考】, 以提问的形式与【学习要求】的内容相呼应, 目的是使学生通过解答问题, 掌握本章的重点内容和知识应用方法。有争论的、尚未定论的内容及药物商品名称不出现在本教材中。

本教材的特色在于: ①突出新。目前国内的《药理学》教科书或多或少存在着所选药物陈旧的问题, 因此, 本教材在编写过程中注重理论联系实际, 参考了国内外新版本《药理学》的相关教材和材料, 广泛调查了近年来药物发展的前沿信息, 收集新上市的药物, 删除了疗效不肯定、临床目前已经不使用的药物。②突出实用性。本教材避免了不适用的内容在书中占有大量篇幅和重复内容的出现, 编排时注意对同类型内容的归类和紧密联系, 杜绝重复。强化案例教学, 教会学生如何在临床上应用药理学。③图文并茂。强化以图解方式解释药物作用机制等, 使读者一目了然。图表制作突出新 (内容新)、简 (简单易懂)、趣 (有趣)。

本教材可作为医药院校临床医学、临床药学、药学、口腔、麻醉、检验、预防、护理等专业本科生教材, 也可作为研究生、临床医师、药师、护师、从事药学研究以及药厂技术人员的参考书。

限于我们的学识和能力, 在编写中难免会出现缺点和不足, 敬请广大读者给予批评和指正, 以便在今后再版时加以改正。

刘克辛  
2014 年 3 月

## 第一篇 药理学总论

第一章 绪言	1	关系	33
第一节 药理学的概念、研究对象、 内容和任务	1	一、药物的量效关系	33
第二节 药理学的发展史	2	二、药物的构效关系	35
一、古代本草阶段	2	第三节 药物作用的机制	36
二、近代药理学阶段	2	第四节 药物与受体	36
三、现代药理学阶段	3	一、受体的定义及特征	37
第三节 药理学与新药研究	3	二、受体与药物相互作用	37
第四节 药理学研究方法	4	三、受体的类型及细胞内信号转导 途径	40
一、基础药理学方法	4	四、受体的调节	42
二、临床药理学方法	5	五、受体与疾病的关系	42
第二章 药物代谢动力学	7	六、受体与临床用药	43
第一节 药物的体内过程	7	第四章 影响药物效应的因素	46
一、概述	7	第一节 药物方面的因素	46
二、药物的跨膜转运及药物转 运体	8	一、药物的剂量和剂型	46
三、药物的体内过程	11	二、给药时间及给药间隔 时间	46
第二节 药物的速率过程	21	三、食物的影响	46
一、药动学模型	21	四、联合用药和药物相互 作用	47
二、药物在体内的速率过程	24	第二节 机体方面的因素	48
三、药动学重要参数及其临床 意义	26	一、生理因素	48
四、基于药代动力学基础的临床 给药设计	29	二、病理因素	49
第三章 药物效应动力学	32	三、遗传因素	49
第一节 药物的基本作用	32	四、心理因素——安慰剂 效应	49
一、药物作用与药理效应	32	五、长期用药后机体对药物反应的 改变	49
二、治疗作用与不良反应	32		
第二节 药物效应的量效关系和构效			

## 第二篇 作用于传出神经系统的药物

第五章 传出神经系统药理学概论	53	一、突触的结构与神经冲动的 传递	55
第一节 传出神经系统的分类	53	二、传出神经系统的递质	55
第二节 传出神经系统的递质和 受体	55	三、传出神经系统的受体	57



第十四章 抗癫痫药和抗惊厥药	126	第一节 概述	159
第一节 抗癫痫药	126	一、药理作用与机制	160
一、常用抗癫痫药	127	二、常见不良反应	162
二、苯二氮革类	131	第二节 非选择性环氧酶抑	
三、其他新型抗癫痫药	131	制药	163
四、应用抗癫痫药的注意		一、水杨酸类	163
事项	132	二、苯胺类	165
第二节 抗惊厥药	133	三、吲哚类	166
第十五章 抗精神失常药	135	四、芳基乙酸类	166
第一节 抗精神分裂症药	135	五、芳基丙酸类	167
一、经典抗精神病药	136	六、烯醇酸类	167
二、非典型抗精神病药	139	七、吡唑酮类	168
第二节 抗躁狂药	141	八、烷酮类	168
第三节 抗抑郁药	142	九、异丁芬酸类	169
一、选择性 5-HT 再摄取抑		第三节 选择性环氧酶-2 抑	
制药	143	制药	169
二、非选择性 NA/5-HT 再摄取抑		第四节 抗痛风药	170
制药	144	一、抑制尿酸生成药	170
三、NA 再摄取抑制药	145	二、促进尿酸排泄药	171
四、选择性 MAO 抑制药	146	三、抑制痛风炎症药	171
五、5-HT <sub>2A</sub> 拮抗药及 5-HT 再		第十八章 镇痛药	173
摄取抑制药	146	第一节 概述	173
六、去甲肾上腺素及多巴胺再摄		第二节 阿片受体激动药	174
取抑制药	147	第三节 阿片受体部分激动药	181
七、其他	147	第四节 其他镇痛药	182
第十六章 治疗神经退行性疾病药物	149	第五节 阿片受体拮抗药	184
第一节 抗帕金森病药	149	第六节 镇痛药的应用原则	185
一、拟多巴胺类药	150	第十九章 中枢兴奋药	187
二、中枢抗胆碱药	153	第一节 主要兴奋大脑皮质的	
三、其他	154	药物	187
第二节 抗阿尔茨海默病药	155	第二节 主要兴奋延髓呼吸中枢的	
一、胆碱酯酶抑制药	155	药物	189
二、NMDA 受体阻断药	157	第三节 促进脑功能恢复的	
三、脑代谢激活药	157	药物	190
第十七章 解热镇痛抗炎药	159		

## 第四篇 作用于心血管系统的药物

- 第二十章 利尿药与脱水药 ..... 193
- 第一节 利尿药作用的生理学
- 基础 ..... 193
- 第二节 常用利尿药 ..... 195
- 一、高效利尿药 ..... 195
- 二、中效利尿药 ..... 199
- 三、低效利尿药 ..... 201
- 第三节 利尿药的应用 ..... 205
- 一、治疗水肿 ..... 205
- 二、治疗非水肿性疾病 ..... 206
- 三、利尿药滥用 ..... 207
- 第四节 脱水药 ..... 207
- 第二十一章 抗高血压药 ..... 210
- 第一节 抗高血压药的作用部位及分类 ..... 210
- 一、肾素-血管紧张素系统抑制药 ..... 210
- 二、钙通道阻滞药 ..... 210
- 三、利尿药 ..... 211
- 四、交感神经阻滞药 ..... 211
- 五、血管舒张药 ..... 211
- 第二节 肾素-血管紧张素系统抑制药 ..... 212
- 一、血管紧张素转化酶抑制药 ..... 212
- 二、血管紧张素 II 受体阻断药 ..... 215
- 第三节 钙通道阻滞药 ..... 217
- 第四节 利尿药 ..... 219
- 第五节 交感神经阻滞药 ..... 220
- 一、中枢性抗高血压药 ..... 220
- 二、神经节阻断药 ..... 221
- 三、抗去甲肾上腺素能神经末梢药 ..... 221
- 四、肾上腺素受体阻断药 ..... 222
- 第六节 血管舒张药 ..... 225
- 一、直接舒张血管药 ..... 225
- 二、钾通道开放药 ..... 226
- 第七节 其他降压药 ..... 227
- 第八节 抗高血压药的应用 ..... 227
- 第二十二章 治疗充血性心力衰竭的药物 ..... 231
- 第一节 充血性心力衰竭的病理生理学变化 ..... 231
- 一、充血性心力衰竭的病理生理学基础 ..... 231
- 二、充血性心力衰竭时神经内分泌变化 ..... 232
- 三、充血性心力衰竭时心肌肾上腺素  $\beta$  受体信号转导的变化 ..... 232
- 第二节 治疗充血性心力衰竭药物的分类 ..... 233
- 第三节 常用治疗充血性心力衰竭的药物 ..... 233
- 一、正性肌力药 ..... 233
- 二、减负荷药 ..... 237
- 第四节 抗心力衰竭的联合用药 ..... 241
- 一、ACEI 与 ARB 联合应用 ..... 241
- 二、ACEI 与抗醛固酮药联合应用 ..... 241
- 三、ACEI 与其他 RAAS 系统抑制药联合应用 ..... 241
- 四、ACEI 与  $\beta$  受体阻断药联合应用 ..... 241
- 五、利尿药联合应用 ..... 242
- 六、临床多种药物联合应用治疗充血性心力衰竭 ..... 242
- 七、慢性心力衰竭治疗的流程 ..... 243
- 第二十三章 抗心绞痛药 ..... 245
- 第一节 硝酸酯类 ..... 246
- 第二节  $\beta$  肾上腺素受体阻断药 ..... 249
- 第三节 钙通道阻滞药 ..... 250
- 第四节 其他抗心绞痛药 ..... 251



第五节 抗心绞痛药的联合应用 … 251	程药 …………… 262
一、 $\beta$ 受体阻断药与硝酸酯类联合应用 …………… 251	四、IV类——钙通道阻滞药 … 263
二、钙通道阻滞药与 $\beta$ 受体阻断药联合应用 …………… 251	五、其他类 …………… 264
第二十四章 抗心律失常药 …………… 253	第四节 抗心律失常药的临床选用 …………… 264
第一节 正常心肌电生理及心律失常发生的机制 …………… 253	第二十五章 调血脂药及抗动脉粥样硬化药 …………… 266
一、正常心肌电生理 …………… 253	第一节 调血脂药 …………… 266
二、心律失常发生的机制 …… 255	一、HMG - CoA 还原酶抑制剂 …………… 266
第二节 抗心律失常药的作用机制 …………… 256	二、影响胆固醇吸收和转化的药物 …………… 269
一、降低自律性 …………… 256	三、影响脂蛋白合成、转运及分解的药物 …………… 271
二、减少后除极和触发活动 … 256	四、其他同类药 …………… 272
三、消除折返 …………… 256	第二节 抗氧化药 …………… 274
第三节 抗心律失常药的分类及常用药物 …………… 256	一、合成型 …………… 274
一、I类——钠通道阻滞药 … 257	二、天然型 …………… 275
二、II类—— $\beta$ 肾上腺素受体阻断药 …………… 261	第三节 多烯脂肪酸类 …………… 275
三、III类——延长动作电位时	第四节 动脉内皮保护药 …………… 276
<b>第五篇 作用于内脏系统及血液系统的药物</b>	
第二十六章 作用于消化系统的药物 … 279	第二十七章 作用于呼吸系统的药物 … 294
第一节 抗消化性溃疡药 …………… 280	第一节 平喘药 …………… 294
一、胃酸分泌抑制药 …………… 280	一、支气管舒张药 …………… 294
二、抗酸药 …………… 284	二、糖皮质激素类 …………… 298
三、黏膜保护药 …………… 285	三、抗过敏平喘药 …………… 299
四、抗幽门螺杆菌药 …………… 287	第二节 镇咳药 …………… 299
第二节 止吐药及胃肠动力药 …… 287	一、中枢性镇咳药 …………… 300
一、 $H_1$ 受体阻断药 …………… 288	二、外周性镇咳药 …………… 300
二、M胆碱受体阻断药 …… 288	第三节 祛痰药 …………… 301
三、多巴胺受体阻断药 …… 288	第二十八章 作用于子宫平滑肌的药物 …………… 303
四、5-HT <sub>3</sub> 受体阻断药 …… 289	第一节 子宫平滑肌兴奋药 …… 303
第三节 泻药 …………… 289	一、垂体后叶激素类 …… 303
一、容积性泻药 …………… 290	二、前列腺素类 …………… 304
二、接触性泻药 …………… 290	三、麦角生物碱类 …… 305
三、润滑性泻药 …………… 290	第二节 子宫平滑肌抑制药 …… 305
第四节 止泻药 …………… 291	一、 $\beta_2$ 受体激动药 …… 305
第五节 利胆药 …………… 292	

二、其他·····	306	第三节 纤维蛋白溶解药·····	317
<b>第二十九章 作用于血液及造血系统的</b>		第四节 促凝血药·····	319
<b>药物</b> ·····	308	第五节 抗贫血药·····	321
<b>第一节 抗凝血药</b> ·····	308	一、铁制剂·····	321
一、血液凝固的机制·····	308	二、叶酸类·····	322
二、纤维蛋白溶解系统·····	308	三、维生素 B <sub>12</sub> ·····	322
三、常用抗凝血药·····	310	<b>第六节 造血细胞生长因子</b> ·····	323
四、体外抗凝血药·····	313	一、促红细胞生成素·····	324
<b>第二节 抗血小板药</b> ·····	313	二、促白细胞生成药·····	324
一、抑制血小板代谢酶类的		三、促血小板生成药·····	325
<b>药物</b> ·····	314	<b>第七节 血容量扩充药</b> ·····	325
二、阻碍 ADP 介导的血小板活化		<b>第三十章 组胺及抗组胺药</b> ·····	328
<b>的药物</b> ·····	316	<b>第一节 组胺类</b> ·····	328
三、血小板 GP II b/III a 受体阻		<b>第二节 抗组胺药</b> ·····	330
<b>断药</b> ·····	316	一、H <sub>1</sub> 受体阻断药·····	330
四、凝血酶抑制药·····	317	二、H <sub>2</sub> 受体阻断药·····	331
<b>第六篇 作用于内分泌系统的药物</b>			
<b>第三十一章 肾上腺皮质激素类药物</b> ···	333	一、主要抑制排卵的避孕药···	349
<b>第一节 糖皮质激素</b> ·····	334	二、抗着床避孕药·····	350
<b>第二节 盐皮质激素</b> ·····	341	三、主要影响子宫和胎盘功能的避	
<b>第三节 促皮质素及皮质激素抑</b>		<b>孕药</b> ·····	350
<b>制药</b> ·····	342	四、外用避孕药·····	350
一、促皮质素·····	342	<b>第三十三章 甲状腺激素及抗甲状</b>	
二、皮质激素抑制药·····	342	<b>腺药</b> ·····	352
<b>第三十二章 性激素类药物及避孕药</b> ···	344	<b>第一节 甲状腺激素</b> ·····	352
<b>第一节 雌激素类药及选择性雌激素受</b>		<b>第二节 抗甲状腺药</b> ·····	353
<b>体调节药</b> ·····	345	一、硫脲类·····	354
一、雌激素类药·····	345	二、碘和碘化物·····	355
二、选择性雌激素受体调		三、放射性碘·····	356
<b>节药</b> ·····	346	四、β 肾上腺素受体阻断药···	356
<b>第二节 孕激素类药及抗孕激素</b>		<b>第三十四章 降血糖药</b> ·····	358
<b>类药</b> ·····	347	<b>第一节 胰岛素</b> ·····	358
一、孕激素类药·····	347	<b>第二节 口服降血糖药</b> ·····	361
二、抗孕激素类药·····	348	一、磺酰脲类·····	361
<b>第三节 雄激素类药和同化激素</b>		二、双胍类·····	362
<b>类药</b> ·····	348	三、噻唑烷二酮类·····	363
一、雄激素类药·····	348	四、α-葡萄糖苷酶抑制药···	363
二、同化激素类药·····	349	五、其他新型降血糖药·····	363
<b>第四节 避孕药</b> ·····	349		

## 第七篇 化学治疗药物

第三十五章 抗菌药概论	367	一、青霉素类	388
第一节 常用术语	368	二、头孢菌素类	393
第二节 抗菌药物的作用机制	369	三、其他 $\beta$ -内酰胺类抗 生素	398
一、抑制细菌细胞壁合成	369	四、糖肽类与其他类抗 生素	401
二、增加胞质膜的通透性	370	第三十八章 氨基糖苷类抗生素	405
三、抑制核酸的复制与修复	370	第一节 氨基糖苷类抗生素的 共性	405
四、抑制蛋白质合成	370	一、抗菌作用机制	405
第三节 细菌耐药性的产生及其 机制	370	二、耐药机制	405
一、细菌耐药性的种类	371	三、体内过程	406
二、细菌产生耐药性的机制	371	四、临床应用	406
三、耐药基因的转移方式	373	五、不良反应	406
第四节 抗菌药物合理应用的 原则	373	六、应用注意事项	407
一、抗菌药物治疗性应用的基本 原则	374	第二节 常用氨基糖苷类抗 生素	407
二、抗菌药物预防性应用的基本 原则	374	第三十九章 四环素类抗生素及氯 霉素	411
三、抗菌药物在特殊病理、生理状况 患者中应用的基本原则	374	第一节 四环素类	411
四、抗菌药物的联合应用	374	一、四环素类抗生素的共性	411
五、抗菌药物在临床应用中的 管理	375	二、常见四环素类抗生素	413
第三十六章 人工合成抗菌药物	377	第二节 氯霉素	415
第一节 喹诺酮类抗菌药	377	第四十章 大环内酯类及其他抗生素	417
一、概述	377	第一节 大环内酯类	417
二、常用氟喹诺酮类抗 菌药	378	一、大环内酯类的共性	417
第二节 磺胺类药物	380	二、常用大环内酯类药物	417
第三节 其他人工合成类抗菌药	382	第二节 林可霉素类	419
第三十七章 $\beta$ -内酰胺类抗生素和其他作 用于细胞壁的抗生素	385	第三节 多肽类抗生素	419
第一节 概述	385	一、万古霉素类	419
一、分类	385	二、多黏菌素类	419
二、抗菌作用机制	385	三、杆菌肽	420
三、耐药机制	387	第四十一章 抗真菌药、抗病毒药、抗结核 病药及抗麻风病药	422
第二节 常用 $\beta$ -内酰胺类抗 生素	388	第一节 抗真菌药	422
		一、主要用于抗深部真菌感 染药	422
		二、主要用于抗表浅部真菌感	

染药 .....	426	五、驱绦虫药 .....	457
第二节 抗病毒药 .....	427	<b>第四十三章 抗恶性肿瘤药</b> .....	460
一、抗 HIV 药 .....	427	第一节 抗肿瘤药的药理学	
二、抗流感病毒药 .....	431	基础 .....	460
三、抗乙型肝炎病毒药 .....	432	一、肿瘤细胞增殖动力学 .....	460
四、抗疱疹病毒药 .....	433	二、抗肿瘤药的药理学	
五、广谱抗病毒药 .....	435	机制 .....	461
第三节 抗结核病药 .....	435	三、肿瘤的耐药性及其	
一、第一线抗结核病药 .....	436	机制 .....	463
二、第二线抗结核病药 .....	438	四、常用抗肿瘤药的	
三、新一代抗结核病药 .....	439	分类 .....	465
四、抗结核病药的应用原则 .....	440	第二节 常用抗肿瘤药 .....	466
第四节 抗麻风病药 .....	440	一、干扰核酸生物合成的	
一、砒类 .....	440	药物 .....	466
二、其他 .....	441	二、直接影响 DNA 结构与功能的	
<b>第四十二章 抗寄生虫病药</b> .....	444	药物 .....	468
第一节 抗疟药 .....	444	三、干扰转录过程和阻止 RNA 合	
一、疟原虫的生活史及抗疟药的		成的药物 .....	471
作用环节 .....	444	四、抑制蛋白质合成与功能的	
二、抗疟药的分类 .....	445	药物 .....	472
三、常用抗疟药 .....	445	五、调节体内激素平衡的	
第二节 抗阿米巴病药和抗滴虫		药物 .....	473
病药 .....	450	六、酶抑制药、生长因子受体抑制	
一、抗阿米巴病药 .....	450	药及促细胞分化药 .....	474
二、抗滴虫病药 .....	452	七、其他 .....	476
第三节 抗血吸虫病药和抗丝虫		第三节 抗肿瘤药的应用原则 .....	476
病药 .....	453	一、针对不同患者, 确定化疗	
一、抗血吸虫病药 .....	453	目标 .....	476
二、抗丝虫病药 .....	454	二、选用适合药物, 使用足够	
第四节 驱肠蠕虫药 .....	455	剂量 .....	476
一、驱蛔虫药 .....	455	三、抗肿瘤药联合应用的基本	
二、驱钩虫药 .....	456	原则 .....	477
三、驱蛲虫药 .....	457	四、抗肿瘤药的毒副作用与防治	
四、驱鞭虫药 .....	457	原则 .....	478

## 第八篇 影响免疫功能的药物及解毒药

<b>第四十四章 影响免疫功能的药物</b> .....	483	一、免疫应答 .....	483
第一节 免疫应答和免疫病理		二、免疫病理反应 .....	484
反应 .....	483	第二节 免疫抑制药 .....	484

一、免疫抑制药的分类·····	485	一、巯基络合剂·····	492
二、常用免疫抑制药·····	485	二、氨基络合剂·····	493
第三节 免疫调节药·····	488	三、其他络合剂·····	493
一、免疫调节药的分类·····	488	第二节 氰化物中毒解毒药·····	494
二、常用免疫调节药·····	488	一、高铁血红蛋白形成剂·····	494
第四节 影响免疫功能药物的应用		二、供硫剂·····	494
原则·····	490	第三节 亚硝酸盐中毒解毒药·····	495
一、免疫抑制药的应用		第四节 有机氟中毒解毒药·····	495
原则·····	490	<b>参考文献</b> ·····	497
二、免疫调节药的应用		<b>药理学专业名词汉英对照索引</b> ·····	498
原则·····	490		
<b>第四十五章 常见中毒及其解毒药</b> ·····	492		
第一节 金属中毒解毒药·····	492		

---

---

# 第一篇

---

## 药理学总论

### 第一章 绪 言

#### 【学习要求】

1. 掌握药理学、药物的概念。
2. 熟悉药理学研究内容和任务。
3. 了解新药研究的三个过程。

#### 第一节 药理学的概念、研究对象、内容和任务

药理学 (pharmacology) 是研究药物与生物体 (包括机体和病原体) 之间相互作用规律和原理的学科。药理学的发展与其他相关学科, 如生药学、植物化学、药物化学、药物分析、药剂学、药物治疗学及毒理学等的发展密切相关。它既是医学教育中的一门边缘学科, 又是基础医学与临床医学及医学与药学的桥梁学科。它运用基础医学理论知识, 阐明药物的作用及其机制、明确治疗效果、揭示不良反应, 为研究和开发新药奠定理论和实验基础。因此, 药理学是医学、药学及医药相关学科共同的重要课程。

药物 (drug) 指可以改变或查明机体的生理功能和病理状态, 可用于预防、治疗、诊断疾病的物质。药物可来源于植物、动物、矿物质并可通过化学合成及基因工程获得。药物和毒物 (poison) 之间没有严格的界限。任何药物在用量超过治疗浓度时, 都可能达到中毒浓度而产生毒性作用。

药理学研究的对象主要是人和动物, 其次是病原体。药理学研究内容主要包括两方面: ① 药物效应动力学 (pharmacodynamics) (简称药效学), 即研究药物对机体的作用及

作用机制，并涉及临床应用、不良反应等。② 药物代谢动力学 (pharmacokinetics) (亦称药代动力学、药物动力学，简称药动学)，研究机体对药物的作用，即研究药物在机体内所发生的变化及其规律，包括药物的吸收、分布、代谢、排泄及血药浓度随时间变化的规律。药理学研究方法主要是通过临床观察和动物实验，在严格控制的条件下对人、动物及病原体进行各种指标的观察和测定，分析结果，发现规律和阐明原理。这些原理和规律是指导合理用药、防治疾病的基础，即治疗学的药理学基础。

药理学的学科任务包括：① 阐明药物与机体相互作用的基本规律和原理，即在阐明药效学和药动学基本原理的基础上，正确指导临床合理用药。② 研究和发现新的药物，开发老药新用途。③ 揭示生命活动的规律。

## 第二节 药理学的发展史

### 一、古代本草阶段

药理学是在药物学的基础上发展起来的。药物的历史可追溯到五、六千年前。我国最早的一部药物学著作《神农本草经》是公元1世纪前后著成的，书中记载了动物、植物、矿物药共365种，其中有不少药物至今仍沿用；唐朝的《新修本草》是我国第一部由政府颁发的药典，全书共收载药物884种；明朝药物学家李时珍（图1-1）编著的《本草纲目》是闻名世界的一部药物学巨著，全书52卷，约190万字，共收载药物1892种、药方11000余条、插图1160幅。已译成英、日、朝、德、法、俄、拉丁等多种文字，传播到世界各地，是全世界关注的重要药物学文献之一。



图1-1 明朝药物学家李时珍 (1518—1593)

### 二、近代药理学阶段

药理学的建立和发展与现代科学技术的发展紧密相关。19世纪初，有机化学和实验生理学的兴起，为药理学的建立奠定了理论和实验的基础。这一阶段的研究对药理学最突出的贡献就是从具有治疗作用的植物中分离、提纯有效成分：1806年，从鸦片中提取获得吗啡；1823年，从金鸡纳树皮中分离得到奎宁；1833年，从颠茄及洋金花中提取有效成分而使阿托品问世。这一时期的研究对药理学的另一突出贡献是在化学和实验生理学方法的基础上，建立了实验药理学的整体动物和离体器官研究方法。1878年，英国人J. N. Langley根据阿托品与毛茛菪香碱对猫唾液分泌的拮抗作用，提出了受体(receptor)的概念，为受体学说的建立奠定了实验基础。德国人Rudolf Buchheim（图1-2）创立了全球第一个药理学实验室，写出第一本药理学教科书，首次使药理学成为一门独立的学科。



图1-2 德国药理学家 Rudolf Buchheim (1820—1879)

### 三、现代药理学阶段

1909年,德国微生物学家 Ehrlich (图1-3)发现砷凡纳明(606)能治疗锥虫病和梅毒,从而开创了应用化学合成药物治疗疾病的新纪元。1928年,英国细菌学家 A. Fleming (图1-4)发现了青霉素;1940年,英国微生物学家 H. W. Florey 在 A. Fleming 的研究基础上,从青霉菌培养液中分离、提取了青霉素,使化学治疗进入抗生素治疗时代。近几十年来,药理学又取得了很大发展,由过去的只与生理学相联系的单一学科发展成为与生物物理学、生物化学,以及分子生物学等多学科密切联系的一门综合学科。飞速的发展促使药理学产生了许多新的分支,如生物化学药理学、分子药理学、免疫药理学、遗传药理学、临床药理学等。目前,药理学的发展已从整体水平、器官水平上升到分子水平、基因水平。



图1-3 德国微生物学家 Ehrlich (1854—1915)



图1-4 英国细菌学家 A. Fleming (1881—1955)

新中国成立前,我国药理学工作者很少,科研工作主要是在中草药方面,如对麻黄、常山的研究,虽然也取得了一些成果,但进展十分缓慢。新中国成立以后,药理学研究工作逐步得到发展,中药的研究受到了重视,并取得很大的成就。例如,研制了安全有效并可供口服的非锑剂抗血吸虫病药吡喹酮,这些工作为治疗和消灭血吸虫病做出了巨大的贡献。在中草药药理的研究中,对强心苷(如羊角拗苷、黄夹苷)、肌松药(如防己科植物)、镇痛药(如罗通定)、抗胆碱药(如山莨菪碱)、钙拮抗剂(如粉防己碱)、治疗乙型肝炎辅助用药(如五味子)、血管舒张药(如川芎嗪)、抗肿瘤药(如喜树碱、紫杉醇)及抗疟药(如青蒿素)等进行了大量研究工作,阐明了这些药物的药理作用及作用机制,对中西医药物治疗的结合起到了推动作用。

### 第三节 药理学与新药研究

药理学在新药研究中的作用是不可或缺的。所有的新药都必须经过临床前药理试验和临床药理试验研究,在确认新药的安全性和有效性之后,经过国家食品药品监督管理局的严格审查、批准之后才能批量生产、上市。按照我国1985年颁布的《新药审批办法》的规定,新药系指未曾在我国境内上市销售的药品。已生产的药品,凡增加新的适应证、改变给药途径和改变剂型的亦属新药范围。新药可以通过实践经验或通过理论指导(如构效关系)合成



和筛选而发现，然后经过研究、开发、生产等过程直至应用。新药的研究大致可分为三个过程：临床前研究、临床研究和上市后药物监测（图 1-5），总的目标是证明其安全性和有效性。临床前研究包括新药的药学（生产工艺、质量控制和稳定性等）研究、药理学（药效学和药动学）研究，以及毒理学（急性毒性、慢性毒性和特殊毒性等）研究。临床前研究的资料须经过有关部门审核后方能进行临床研究。新药的临床研究一般分为四期，I 期临床试验是对正常健康志愿者进行的初步药理学及人体安全性试验（观察其耐受情况和药动学），一般需要 20~30 例；II 期临床试验为随机、双盲、对照试验，对新药的安全性和有效性作出初步评价，推荐临床用量，患者不少于 100 对；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，对新药的安全性和有效性进行社会考察，受试患者数不少于 300 例；IV 期临床试验是在药品上市后在社会人群范围内继续进行安全性和有效性评价，即上市后药物监测，又称售后调研，是为了考察药品广泛、长期使用后的疗效和不良反应。

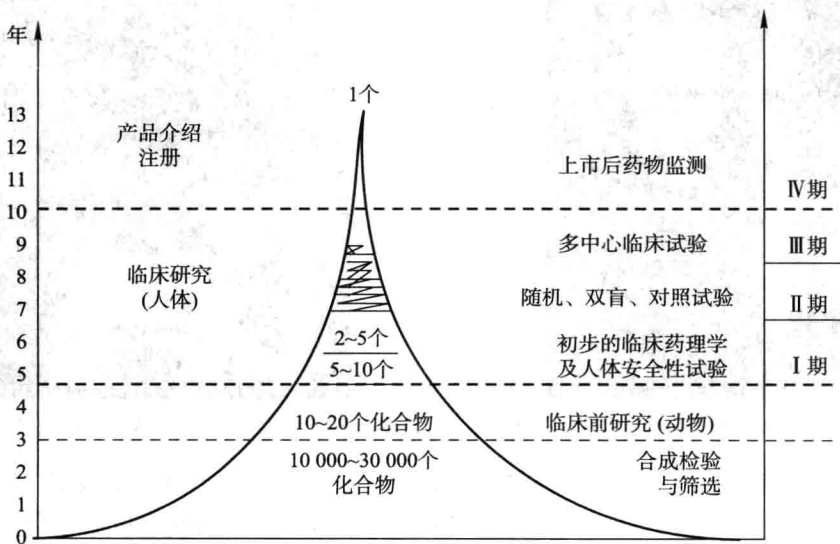


图 1-5 新药的研发过程

为了更好地控制新药研发过程中的临床风险，美国 FDA 在 2006 年提出了 0 期临床试验。0 期临床试验是指在新药研究完成临床前试验，但还未正式进入临床试验之前，容许新药研制者使用微剂量（一般不大于 100  $\mu\text{g}$ ，或小于标准剂量的 1%）对少量人群（6 人左右，健康志愿者或者病人）进行药物试验，以收集必要的有关药物安全及药代动力学的试验数据。

在新药研究的漫长过程（平均需要 12~13 年，图 1-5）中，药理学研究是成药性的关键步骤之一。

## 第四节 药理学的研究方法

作为实验性科学的药理学，其研究方法可分为两类。

### 一、基础药理学方法

基础药理学方法是以动物为研究对象，研究药物与动物机体相互作用的规律。其内容