

普通高等教育“十二五”规划教材
全国高等医药院校规划教材

供高专高职相关专业用

YAO LI XUE

药理学

主编 孙慧君 张树平

清华大学出版社

普通高等教育“十二五”规划教材
全国高等医药院校规划教材

供高专高职相关专业用

YAO LI XUE

药理学

主编 孙慧君 张树平

常州大学图书馆
藏书章

清华大学出版社

北 京

内 容 简 介

本教材是全国高等医药院校医药类专科药理学规划教材,共分为总论和各论两大部分 42 章。总论分 4 章,重点介绍了药理学的基本概念、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,影响药物作用的因素及合理用药。各论分 38 章,着重阐明了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;介绍了与药理学内容相关的生理、病理生理学等基础知识,并适当加入问题与思考,加强了知识的实用性和针对性,强化药理学与临床应用的联系。

本教材概念清楚、层次分明、由浅入深,有利于培养学生思考、分析和解决问题的能力,提高学生创造性思维能力,可作为医药院校临床医学、临床药学、药学、口腔、检验、护理等专业高专高职学生的教材,也可作为临床医师、药师、护师、从事药学研究以及药厂技术人员的常用参考书。

版权所有,侵权必究。侵权举报电话:010-62782989 13701121933

图书在版编目(CIP)数据

药理学/孙慧君,张树平主编. --北京:清华大学出版社,2012.7
(普通高等教育“十二五”规划教材·全国高等医药院校规划教材)
ISBN 978-7-302-27579-4

I. ①药… II. ①孙… ②张… III. ①药理学—高等职业教育—教材 IV. ①R96

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2011)第 256026 号

责任编辑:李 君

封面设计:戴国印

责任校对:刘玉霞

责任印制:王静怡

出版发行:清华大学出版社

网 址: <http://www.tup.com.cn>, <http://www.wqbook.com>

地 址:北京清华大学学研大厦 A 座 邮 编:100084

社 总 机:010-62770175 邮 购:010-62786544

投稿与读者服务:010-62776969, c-service@tup.tsinghua.edu.cn

质 量 反 馈:010-62772015, zhiliang@tup.tsinghua.edu.cn

印 装 者:北京国马印刷厂

经 销:全国新华书店

开 本:185mm×260mm

印 张:24.75

字 数:657 千字

版 次:2012 年 7 月第 1 版

印 次:2012 年 7 月第 1 次印刷

印 数:1~3000

定 价:49.80 元

产品编号:040016-01

全国高等医药院校药学类及相关 专业规划教材建设成员单位

(按拼音排序)

安徽省立医院
安徽医科大学
安徽医学高等专科学校
北华大学
北京大学
北京理工大学
北京天坛医院
滨州医学院
长春职业技术学院
长治医学院
成都医学院
成都中医药大学
赤峰学院
重庆医科大学
重庆医药高等专科学校
大连大学
大连医科大学
第二军医大学
第三军医大学
福建省漳州卫生职业学院
福建医科大学
复旦大学
广东药学院
广东医学院
广西医科大学
贵阳中医药大学
桂林医学院

哈尔滨商业大学
哈尔滨医科大学
海南医学院
河北医科大学
黑龙江中医药大学
湖北中医药大学
湖南中医药大学
华南理工大学
怀化医学高等专科学校
吉林大学
吉林医药学院
佳木斯大学
江苏联合职业技术学院
九江学院
兰州大学
辽宁大学
辽宁卫生职业技术学院
辽宁医学院
辽宁中医药大学职业及技术学院
牡丹江医学院
南昌大学
南方医科大学
南京医科大学
南京中医药大学
内蒙古医学院
宁夏医科大学
齐齐哈尔医学院

青岛市市立医院
青海卫生职业技术学院
青海医学院
山东大学
山东药品食品职业学院
山东中医药高等专科学校
山西医科大学
陕西中医学院
上海交通大学
沈阳药科大学
沈阳医学院
首都医科大学
四川大学
苏州大学
泰山医学院
天津生物工程职业技术学院
天津医科大学
天津医学高等专科学校
天津中医药大学

潍坊医学院
温州医学院
无锡卫生高等职业技术学校
武汉大学
武汉理工大学
武汉生物工程学院
西安交通大学
西南大学
厦门大学
厦门医学高等专科学校
新疆医科大学
徐州医学院
烟台大学
郑州大学
中国药科大学
中国医科大学
中南大学
中山大学

《药理学》编写委员会名单

主 编 孙慧君 张树平

副 主 编 张成义 王国贤

编 者 (按拼音排序)

付彦君 辽宁中医药大学

来丽娜 长治医学院

李 芹 天津医科大学

吕 莉 大连医科大学药学院

孙慧君 大连医科大学药学院

王超云 滨州医学院

王春梅 北华大学药学院

王国贤 辽宁医学院

王金红 潍坊医学院

王来友 广东药学院

王艳春 吉林医药学院

吴云明 徐州医学院药学院

徐道华 广东医学院药学院

张成义 北华大学药学院

张树平 滨州医学院药学院

赵晓民 泰山医学院

周红宇 温州医学院药学院

周利玲 怀化医学高等专科学校

前言

PREFACE

本教材是全国高等医药院校医学类专科、高职用药理学教材。

本教材在编写过程中坚持贯彻教材的三基（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）原则，努力创新教材内容，强化教材功能，自始至终围绕着重培养学生的素质来进行。

本教材共分为2篇42章，包括总论和各论两大部分。总论分4章，重点介绍了药理学的基本概念、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，影响药物作用的因素及合理用药。各论分38章，着重阐明了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。教材中介绍了与药理学内容相关的生理、病理生理学等基础知识，并加强了知识的实用性和针对性，适当加入问题与思考，强化药理学与临床应用的联系。重点着眼于学生基本理论、基本知识的学习和掌握以及应用、创新能力的培养。本教材在编写过程中，各位编委集思广益，对教材的编写提出许多建设性意见，使本教材概念清楚、层次分明、由浅入深，有利于培养学生思考、分析和解决问题的能力，提高学生创造性思维能力。

本教材可作为医药院校临床医学、临床药学、药学、口腔、检验、护理等专业高专高职学生教材，也可作为临床医师、药师、护师、从事药学研究以及药厂技术人员的常用参考书。

此次教材编写得到了编委及编委所在单位的大力支持，从而保证了教材如期完成、交稿。本书引用参考了一些相关专业文献，在此一并表示诚挚谢意。

限于我们的学识和能力，加之编写时间仓促，书中难免有不尽完善之处，如有缺点和错误，敬请同行专家及广大读者予以批评指正，以求在教学中不断修正与提高，更好地适应医药学人才培养的需要。

主编

2012年3月

CONTENTS

目 录

第 1 篇 总 论

第 1 章 绪论 1

- 第 1 节 药理学研究内容和任务 1
- 第 2 节 药理学的发展简史 2
- 第 3 节 新药的研究与开发 2
- 第 4 节 药理学学习方法 3

第 2 章 药物效应动力学 4

- 第 1 节 药物的效应和作用 4
 - 一、药物的基本作用 4
 - 二、药物治疗作用与不良反应 5
- 第 2 节 药物作用机制 6
 - 一、药物的作用机制 6
 - 二、受体学说 6
- 第 3 节 药物效应的量效关系和构效关系 7
 - 一、量效关系 7
 - 二、构效关系 9

第 3 章 药物代谢动力学 10

- 第 1 节 药物的体内过程 10
 - 一、体内过程的基本规律 10
 - 二、药物的吸收及影响因素 12
 - 三、药物的分布及影响因素 13
 - 四、药物的代谢 15
 - 五、药物的排泄 16
- 第 2 节 药物代谢动力学的基本概念 17
 - 一、药物浓度-时间曲线 17
 - 二、药物的转运速率类型 17
 - 三、房室概念与房室模型 18
 - 四、药动学参数计算及意义 19

- 五、多次给药的药-时曲线和稳态血药浓度 21

第 4 章 影响药物作用的因素及合理用药 24

- 第 1 节 影响药物作用的因素 24
 - 一、机体方面因素 24
 - 二、药物方面因素 25
 - 三、其他因素 27
- 第 2 节 合理用药 27
 - 一、合理用药基本原则 27
 - 二、制定最佳治疗方案 28

第 2 篇 各 论

第 5 章 传出神经系统药理学概论 31

- 第 1 节 传出神经系统的分类 31
 - 一、传出神经系统的解剖学分类 31
 - 二、传出神经按递质分类 32
- 第 2 节 传出神经的递质和受体 32
 - 一、突触的结构与神经冲动传递 32
 - 二、传出神经系统的递质 33
 - 三、传出神经的受体 35
- 第 3 节 传出神经系统药物的作用方式和分类 38
 - 一、传出神经系统药物的作用方式 38
 - 二、传出神经系统药物的分类 39

第 6 章 拟胆碱药 41

- 第 1 节 概述 41
 - 一、乙酰胆碱 41
 - 二、胆碱酯酶 42
- 第 2 节 M 胆碱受体激动药 43
 - 一、胆碱酯类 M 胆碱受体激动药 43

二、生物碱类 M 胆碱受体激动药	44
第 3 节 N 胆碱受体激动药	46
第 4 节 抗胆碱酯酶药	46
一、概述	46
二、常用药物	48

第 7 章 抗胆碱药 53

第 1 节 M 胆碱受体阻断药	53
一、阿托品类生物碱	53
二、阿托品合成代用品	57
第 2 节 N 胆碱受体阻断药	58
一、神经节阻断药	58
二、神经肌肉阻断药	59

第 8 章 拟肾上腺素药 62

第 1 节 α 、 β 受体激动药	63
第 2 节 α 受体激动药	67
一、 α_1 、 α_2 受体激动药	67
二、 α_1 受体激动药	68
三、 α_2 受体激动药	69
第 3 节 β 受体激动药	69
一、 β_1 、 β_2 受体激动药	69
二、 β_1 受体激动药	70
三、 β_2 受体激动药	71

第 9 章 抗肾上腺素药 72

第 1 节 α 受体阻断药	72
一、短效 α_1 、 α_2 受体阻断药	72
二、长效 α_1 、 α_2 受体阻断药	73
三、 α_1 受体阻断药	74
四、 α_2 受体阻断药	75
第 2 节 β 受体阻断药	75
一、 β_1 、 β_2 受体阻断药	77
二、 β_1 受体阻断药	78
第 3 节 α 、 β 受体阻断药	78

第 10 章 局部麻醉药和全身麻醉药 80

第 1 节 局部麻醉药	80
一、局麻药的药理作用	80
二、影响局麻药作用的因素	81

三、局麻药的临床用途	81
四、常用的局部麻醉药	81
第 2 节 全身麻醉药	82
一、吸入麻醉药	82
二、静脉麻醉药	83
三、复合麻醉	84

第 11 章 镇静催眠药和抗焦虑药 86

第 1 节 镇静催眠药	86
一、苯二氮䓬类	86
二、巴比妥类	92
三、其他类镇静催眠药	94
第 2 节 抗焦虑药	96

第 12 章 抗癫痫药和抗惊厥药 98

第 1 节 抗癫痫药	98
一、抗癫痫药	98
二、应用抗癫痫药的注意事项	102
第 2 节 抗惊厥药	103

第 13 章 抗帕金森病药 105

第 1 节 影响多巴胺能神经类药	105
一、左旋多巴及其增效剂	105
二、促多巴胺释放药	107
三、多巴胺受体激动药	107
第 2 节 中枢抗胆碱药	108

第 14 章 抗精神失常药 110

第 1 节 抗精神病药	110
一、吩噻嗪类	110
二、硫杂蒯类	114
三、丁酰苯类	114
四、其他第一代抗精神病药	115
五、特异性多巴胺受体阻断药	115
六、5-HT 受体阻断药	115
七、5-HT ₂ 受体及 D ₂ 受体阻断药	116
第 2 节 抗躁狂药	116
第 3 节 抗抑郁药	117
一、三环类抗抑郁药	118

二、单胺氧化酶抑制剂 (MAO Inhibitor)	119	三、影响血管紧张素II的抗高血压药 ...	152
三、5-羟色胺再摄取抑制剂	120	四、钙通道阻滞药	155
四、去甲肾上腺素再摄取抑制剂	120	五、中枢性降压药	156
五、其他抗抑郁药	121	六、血管舒张药	157
第 15 章 镇痛药	122	第 3 节 抗高血压药物的合理应用 ...	158
第 1 节 阿片生物碱类	123	一、有效降压和终生治疗	158
第 2 节 人工合成阿片类镇痛药	127	二、保护靶器官	158
一、阿片受体激动药	127	三、平稳降压	158
二、阿片受体部分激动药和激动-拮抗混合型药	129	四、个体化治疗	159
第 3 节 其他镇痛药	130	五、联合用药	159
第 4 节 阿片受体阻断药	131	第 19 章 治疗充血性心力衰竭的药物	161
第 16 章 解热镇痛抗炎药	132	第 1 节 CHF 的病理生理学及治疗	
第 1 节 解热镇痛抗炎药分类及其作用机制	132	CHF 药物的分类	161
一、解热镇痛抗炎药的分类	132	一、CHF 时心肌的功能和结构变化 ...	161
二、药物的药理作用及作用机制	132	二、CHF 时神经内分泌变化	162
第 2 节 水杨酸类	133	三、心力衰竭时心肌肾上腺素 β 受体信号转导的变化	163
第 3 节 苯胺类	135	四、CHF 药物治疗的演变	163
第 4 节 吡唑酮类	136	五、治疗 CHF 药物的分类	163
第 5 节 其他有机酸类	137	第 2 节 肾素-血管紧张素-醛固酮系统抑制药	164
第 6 节 治疗类风湿关节炎的药物 ...	139	一、血管紧张素 I 转化酶 (ACE) 抑制药	164
一、非甾体类抗炎药	139	二、血管紧张素II受体 (AT_1) 拮抗药 ...	166
二、肾上腺皮质激素	140	三、醛固酮拮抗药	167
三、慢作用抗风湿药	140	第 3 节 强心苷类	168
四、免疫抑制剂	141	第 4 节 利尿药	172
五、免疫调节剂	141	第 5 节 β 受体阻断药	172
第 17 章 中枢兴奋药	144	第 6 节 其他治疗 CHF 的药物 ...	174
第 1 节 主要兴奋大脑皮质的药物 ...	144	一、血管扩张药	174
第 2 节 主要兴奋延脑呼吸中枢药物 ...	146	二、非苷类正性肌力药	175
第 18 章 抗高血压药	149	三、钙通道阻滞剂	176
第 1 节 抗高血压药物分类	149	第 20 章 抗心律失常药	178
第 2 节 常用抗高血压药物	150	第 1 节 心肌的电生理和心律失常发生机制	178
一、利尿药	150	一、正常心肌电生理特性	178
二、肾上腺素受体阻断药	151	二、心律失常的发生机制	179
		第 2 节 抗心律失常药的基本电生理作用及分类	180

一、抗心律失常药的基本电生理作用	180
二、抗心律失常药的分类	180
第3节 常用抗心律失常药	181
一、I类钠通道阻滞药	181
二、II类 β 肾上腺素受体拮抗药	184
三、III类延长动作电位时程药	185
四、IV类钙拮抗药	186

第21章 抗心绞痛药 187

一、供氧减少	187
二、耗氧增加	187
第1节 硝酸酯类	188
第2节 β 受体阻断药	190
第3节 钙通道阻滞药	191
第4节 其他抗心绞痛药物	193
第5节 抗心绞痛药物的联合应用	193
一、各类抗心绞痛药物的临床评价	193
二、抗心绞痛药物的联合应用	194
三、各型心绞痛的药物治疗	195

第22章 抗动脉粥样硬化药 197

第1节 调血脂药	197
一、HMG-CoA还原酶抑制剂	198
二、主要影响胆固醇吸收和转化的药物	199
三、影响脂蛋白合成、转运及分解的药物	199
第2节 抗氧化剂	201
第3节 多烯脂肪酸类	202
第4节 动脉内皮保护药	202

第23章 利尿药及脱水药 204

第1节 利尿药	204
一、利尿药作用的生理学基础	204
二、常用的利尿药	207
第2节 脱水药	211

第24章 作用于血液和造血系统的药物 214

第1节 抗凝血药及促凝血药	214
一、抗凝血药	214

二、促凝血药	218
--------	-----

第2节 抗血小板药 219

第3节 纤维蛋白溶解药 220

第4节 作用于造血系统的药物 221

第5节 抗贫血药 222

第6节 血容量扩充药 224

第25章 组胺及抗组胺药 227

第1节 组胺及组胺受体激动药 227

第2节 抗组胺药 228

一、 H_1 受体阻断药 228

二、 H_2 受体阻断药 229

第26章 作用于呼吸系统的药物 231

第1节 平喘药 231

一、抗炎平喘药 231

二、支气管扩张药 232

三、抗过敏平喘药 235

第2节 镇咳药 237

一、中枢性镇咳药 237

二、外周性镇咳药 238

第3节 祛痰药 238

一、刺激性祛痰药 239

二、黏液溶解药 239

三、黏液调节药 239

第27章 作用于消化系统的药物 241

第1节 治疗消化性溃疡的药物 241

一、抗酸药 241

二、抑制胃酸分泌药 242

三、胃黏膜保护药 244

四、抗幽门螺杆菌药 245

第2节 调节消化功能药 246

一、助消化药 246

二、止吐药 246

三、增强胃肠动力药 247

四、泻药 248

五、止泻药 250

六、利胆药 250

第 28 章 子宫兴奋药 252

- 第 1 节 垂体后叶素类 252
- 第 2 节 麦角生物碱类 253
- 第 3 节 前列腺素类 254

第 29 章 性激素类药物 256

- 第 1 节 性激素的分泌调节及作用
机制 256
 - 一、性激素的分泌及调节 256
 - 二、性激素的作用机制 257
- 第 2 节 雌激素类药及抗雌激素类药 257
 - 一、雌激素类药 257
 - 二、抗雌激素类药 258
- 第 3 节 孕激素类药及抗孕激素类药 258
 - 一、孕激素类药 258
 - 二、抗孕激素类药 259
- 第 4 节 雄激素类药及同化激素类药 260
 - 一、雄激素类药 260
 - 二、同化激素类药 261

第 30 章 肾上腺皮质激素类药物 262

- 第 1 节 糖皮质激素 262
- 第 2 节 常用的糖皮质激素类药物 271
 - 一、全身用药的糖皮质激素 271
 - 二、局部外用制剂 272
 - 三、吸入性糖皮质激素 273
- 第 3 节 盐皮质激素 273
- 第 4 节 促皮质素及皮质激素抑制药 273
 - 一、促皮质素 273
 - 二、皮质激素抑制药 274

第 31 章 甲状腺激素及抗甲状腺药 276

- 第 1 节 甲状腺激素 276
- 第 2 节 抗甲状腺药 279
 - 一、硫脲类 279
 - 二、碘及碘化物 280
 - 三、放射性碘 281
 - 四、 β 肾上腺素受体拮抗药 282

第 32 章 胰岛素和口服降血糖药 283

- 第 1 节 胰岛素及人胰岛素类似物 283
 - 一、胰岛素 (insulin) 283
 - 二、人胰岛素类似物 286
- 第 2 节 口服降血糖药 287
 - 一、磺酰脲类 287
 - 二、双胍类 288
 - 三、胰岛素增敏药 289
 - 四、 α -葡萄糖苷酶抑制剂 289
 - 五、其他类口服降血糖药 290

第 33 章 化学治疗药物概述 291

- 第 1 节 常用术语 291
- 第 2 节 抗微生物药物作用机制 292
- 第 3 节 细菌的耐药性 293
 - 一、细菌耐药性产生的机制 293
 - 二、细菌获得耐药性的方式 294
- 第 4 节 抗菌药物的合理应用 294
 - 一、抗菌药临床应用的基本原则 294
 - 二、抗菌药的预防性应用 295
 - 三、抗菌药物的联合应用 295
 - 四、肝肾功能减退患者抗菌药的应用 295

第 34 章 β -内酰胺类抗生素 297

- 第 1 节 青霉素类抗生素 298
 - 一、天然青霉素 298
 - 二、半合成青霉素 300
- 第 2 节 头孢菌素类抗生素 301
 - 一、第一代头孢菌素 302
 - 二、第二代头孢菌素 303
 - 三、第三代头孢菌素 303
 - 四、第四代头孢菌素 304
- 第 3 节 其他 β -内酰胺类抗生素 304
 - 一、碳青霉烯类 304
 - 二、头霉素类 305
 - 三、单环 β -内酰胺类 305
 - 四、氧头孢烯类 305
- 第 4 节 β -内酰胺酶抑制剂 305

第 35 章	大环内酯类、林可霉素类及万古霉素类抗生素	307
第 1 节	大环内酯类抗生素	307
一、	大环内酯类抗生素的共性	308
二、	常用大环内酯类抗生素	309
第 2 节	林可霉素类抗生素	310
第 3 节	万古霉素类抗生素	312

第 36 章	氨基糖苷类及多黏菌素类 ..	314
第 1 节	氨基糖苷类抗生素的共性 ..	314
第 2 节	常用氨基糖苷类抗生素的特点及应用	316
第 3 节	多黏菌素类	317

第 37 章	四环素类及氯霉素	319
第 1 节	四环素类	319
第 2 节	氯霉素	321

第 38 章	人工合成抗菌药	323
第 1 节	喹诺酮类药物	323
一、	喹诺酮类抗菌药的共性	323
二、	常用喹诺酮类抗菌药	326
第 2 节	磺胺类药物	328
一、	磺胺类抗菌药的共性	329
二、	常用磺胺类抗菌药	330
第 3 节	其他合成类抗菌药	331
一、	甲氧苄啶	331
二、	硝基咪唑类	331
三、	硝基呋喃类	333

第 39 章	抗结核病药及抗麻风病药 ..	335
第 1 节	抗结核病药	335
第 2 节	抗麻风病药	341
一、	砒类	341
二、	其他药物	341

第 40 章	抗真菌药及抗病毒药	343
第 1 节	抗真菌药	343
一、	抗生素类抗真菌药	343

二、	唑类抗真菌药	344
三、	丙烯胺类抗真菌药	345
四、	嘧啶类抗真菌药	345
第 2 节	抗病毒药	345
一、	一般抗病毒药	345
二、	抗艾滋病病毒药	346

第 41 章	抗寄生虫药	349
---------------	--------------------	-----

第 1 节	抗疟药	349
一、	疟原虫的生活史及抗疟药的 作用环节	349
二、	常用的抗疟药	350
第 2 节	抗阿米巴病药及抗滴虫病药 ..	352
一、	抗阿米巴病药	352
二、	抗滴虫病药	354
第 3 节	抗血吸虫病药及抗丝虫病药 ..	354
一、	抗血吸虫病药	354
二、	抗丝虫病药	355
第 4 节	抗肠蠕虫药	356

第 42 章	抗恶性肿瘤药	358
---------------	---------------------	-----

第 1 节	抗肿瘤药物分类及药理学 基础	358
一、	抗恶性肿瘤药的分类	358
二、	抗肿瘤药的药理作用机制	359
第 2 节	常用抗恶性肿瘤药物	361
一、	干扰核酸生物合成的药物	361
二、	影响 DNA 结构与功能的药物	365
三、	干扰转录过程和阻止 RNA 合成的 药物	370
四、	干扰蛋白质合成与功能的药物 ..	371
五、	影响体内激素平衡的药物	373
六、	其他抗恶性肿瘤药物	374
第 3 节	抗肿瘤药物的合理应用及 毒性反应	376
一、	抗肿瘤药物的应用原则	376
二、	抗恶性肿瘤药毒性反应及处理 ..	377

主要参考文献	379
---------------------	-----

第1篇

总论

第1章

绪论

学习要求

1. 掌握药理学、药物的概念。
2. 熟悉药理学的学科任务。
3. 了解新药研究过程。

第1节 药理学研究内容和任务

药物(drugs)指可以查明或改善机体的生理功能或病理状态,用于预防、诊断和治疗疾病的化学物质。药物可来源于天然的植物、矿物、动物和微生物,也可通过化学或生物学的方法合成。常用的药物有化学药物、中草药、生物药品,例如中成药、抗生素、生化药品、血清疫苗、避孕药、保健药品、血液制剂和诊断药物等。随着基因治疗的研究与应用,未来也会有基因药物问世。药理学(pharmacology)是研究药物与生物体(包括机体和病原体)之间相互作用的规律和原理的学科,是基础医学与临床医学、医学与药学之间的桥梁学科,是医学、药学以及和医药有关的相关学科共同的重要课程,为临床防治疾病、合理用药提供基础理论知识及科学的思维方法。

药理学研究的主要内容包括药物效应动力学和药物代谢动力学。药物效应动力学(pharmacodynamics,药效学)研究药物对机体的作用及作用机制;而药物代谢动力学(pharmacokinetics,药动学)则研究药物在机体的影响下所发生的变化及其规律。

药理学的学科任务包括阐明药物与机体相互作用的基本规律和原理,为疾病的药物治疗奠定基础,使药物发挥最佳疗效,减少不良反应;阐明药物的作用特点及影响因素,指导临床合理用药;研究和开发新的药物;阐明生物机体的运动规律,推动生命科学的发展。

第2节 药理学的发展简史

药理学的发展史源于药物的发展史。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,书中收录了动物药、植物药、矿物药共365种,其中不少药物仍沿用至今。此后,历代学者对《神农本草经》不断地进行修订和增补。唐代的《新修本草》是我国第一部也是世界第一部由政府颁布的药典,收载药物884种。明朝医药学家李时珍所著的《本草纲目》是世界闻名的一部药物学巨著,全书16部,52卷,约190万字,共收载药物1892种,药方11 000余条,已译成英、日、朝、德、法、俄及拉丁等7种文本,传播于世界各地,至今仍是全世界关注的重要药物学文献之一。

药理学的建立和发展与现代科学技术的发展密切相关。100多年来,有机化学、制药工业、生理学、生物化学等学科的发展及新技术的不断涌现,极大地推动了药物学及药理学的发展与进步。19世纪初叶,有机化学的发展使人们可以从有治疗作用的植物中提取活性成分,从而使药物的研究和开发进入一个崭新的阶段。1803年,德国化学家F. W. Sertuner首先从阿片中提取出吗啡,并用犬证明其镇痛作用。20世纪初的1909年,德国微生物学家P. Ehrlich发现砷凡纳明(606)可以用于治疗梅毒,开创了应用化学合成药物治疗疾病的新纪元。20世纪30年代磺胺类药物的发现以及40年代英国的H. W. Florey在20年代英国的A. Fleming发现青霉素的基础上,建立青霉素的提取工艺,使人类进入以抗生素为代表的化学治疗药物时代。近几十年来,随着科学研究的深入,药理学产生了许多新的分支,如实验药理学、生化药理学、遗传药理学、免疫药理学和临床药理学等。

我国现代药理学始于20世纪初,主要是在中草药方面进行一些研究,如对麻黄、常山的研究等,科研工作进展缓慢。1949年以来,我国药理学工作者逐渐增多,药理学基础理论研究及中西药物创新性研究等得到重视,并取得很大成就,如治疗血吸虫病的酒石酸锑钾和呋喃丙胺的研究,为治疗和消灭血吸虫病做出了巨大的贡献。我国科学家发现吗啡镇痛作用的部位主要在第三脑室周围和导水管周围的灰质,对探讨镇痛药的作用机制产生了重要影响。在对中草药药理的研究中,先后研究与开发了山莨菪碱(抗胆碱药)、汉防己甲素(钙拮抗药)、川芎嗪(抗心绞痛药)、青蒿素(抗疟药)、喜树碱、紫杉醇(抗肿瘤药)、罗通定(镇痛药)等新药,并阐明了这些药物的药理作用及作用机制,对中西医结合起到了积极的推动作用。

第3节 新药的研究与开发

按照我国1985年颁布的《新药审批办法》的规定,新药指未在国内上市销售的从植物、动物、矿物等物质中提取的有效成分及其制剂;新发现的药材及其制剂;未在国内外获准上市的化学原料药及其制剂、生物制品;治疗艾滋病、恶性肿瘤、罕见病等疾病且具有明显临床治疗优势的新药;治疗尚无有效治疗手段的疾病的新药。已生产的药品,如增加新的适应证、改变给药途径或改变剂型的也属新药范围。新药研究大致可分为临床前研究、临床研究和售后调研三个步骤。临床前研究主要是对药物的化学研究(药物制备工艺、理化性质及质量控制标准等)和药理学(药效学、药动学及毒理学等)研究;新药的临床研究一般分为四期,各期在一定例数的正常健康人(观察对药物耐受情况及药动学)、患者(观察药物疗效及安全性)中,采用随机、双盲、对照的研究方法进行,其结果经审定后方可被批准作为新药生产和上市销售;药品上市后还要继续进行药品的安全性和有效性评价,也称为售后调研。

第4节 药理学学习方法

药理学运用基础医学理论知识,即生理学、生物化学、病理学、病理生理学、微生物学和免疫学等理论阐明药物的作用原理,目的是为临床合理用药奠定理论基础。因此,学习药理学应注意其与上述基础医学学科的联系。

药物通过兴奋或抑制机体原有的生理功能和生物代谢过程产生药理作用,任何药物都不会产生与机体原有功能无关的作用。学习每一类药物时都应紧密联系相关基础医学知识,加深对药物药理作用、作用机制等内容的理解,深入理解并重点掌握具有代表性的药物。在学习过程中,要抓住重点,既要掌握药理学的基础理论、基本知识,又要掌握具体药物的药理作用、作用机制、临床应用、不良反应、与其他药物的相互作用以及药动学特点等。在每个章节的学习中,既要注意掌握具有代表性的“重点药”,又要在全面掌握“重点药”的基础上了解或熟悉“非重点药”,比较其与“重点药”的异同点及主要特点。

学习的目的是为了更好地应用。通过学习药理学这门课程,掌握药理学的基础理论、基本技能和基本思维方法,为临床合理用药打好基础,并在医药领域的工作实践中继续学习、不断积累新知识。

学习重点

药物指可以查明或改善机体的生理功能或病理状态,用于预防、诊断和治疗疾病的化学物质。药理学(pharmacology)是研究药物与生物体(包括机体和病原体)之间相互作用的规律和原理的学科,是基础医学与临床医学、医学与药学之间的桥梁学科;其研究的主要内容包括药物效应动力学和药物代谢动力学。药物效应动力学研究药物对机体的作用及作用机制,而药物代谢动力学则研究药物在机体的影响下所发生的变化及其规律。药理学的学科任务包括:阐明药物与机体相互作用的基本规律和原理,为疾病的药物治疗奠定基础,使药物发挥最佳疗效,减少不良反应;阐明药物的作用特点及影响因素,指导临床合理用药;研究和开发新的药物;阐明生物机体的运动规律,推动生命科学的发展。新药指未在国内上市销售的从植物、动物、矿物等物质中提取的有效成分及其制剂;新发现的药材及其制剂;未在国内获准上市的化学原料药及其制剂、生物制品;治疗艾滋病、恶性肿瘤、罕见病等疾病且具有明显临床治疗优势的新药;治疗尚无有效治疗手段的疾病的新药。新药研究大致可分为临床前研究、临床研究和售后调研三个步骤。

思 考 题

1. 试述药物的概念。
2. 试述药理学的概念及药理学的主要研究内容。
3. 新药的概念是什么?新药的研究步骤有哪些?

(孙慧君)

第2章

药物效应动力学

学习要求

1. 掌握药物作用、药物效应的概念，不良反应的概念及其分类，半数致死量、半数有效量的定义，治疗指数的定义及其意义，效价和效能的区别，激动药和拮抗药的概念。
2. 熟悉药效学的概念，了解量反应量效曲线和质反应量效曲线的意义。
3. 了解受体的概念、特点和受体的调节。

药物效应动力学 (pharmacodynamics, 药效学) 研究药物对机体产生的生理、生化效应和引起这些效应的机制, 以及药物剂量与效应之间关系的规律, 是药理学的重要内容之一。药效学对指导临床合理用药、充分发挥药物的最佳疗效、尽可能减少药物毒副作用具有重要意义。

第1节 药物的效应和作用

一、药物的基本作用

药物的基本作用是使机体器官原有的功能水平发生改变。药物作用 (drug action) 是药物与机体细胞间的相互作用, 药物效应 (effect) 是药物引起的机体器官原有功能水平的改变。药物作用是动因, 药物效应是药物作用的结果, 二者意义接近, 通常相互通用。药理效应的基本类型是兴奋 (excitation) 或抑制 (inhibition), 使功能提高称为兴奋, 如肾上腺素升高血压、呋塞米使尿量增多等, 使功能降低称为抑制, 如胰岛素使血糖降低、阿司匹林使发热者的体温降低等。药物作用是药物防治疾病的主要依据。

药物在用药局部所产生的作用为局部作用, 如磺胺米隆用于烧伤后的感染。药物的吸收作用亦称全身作用, 指药物被机体吸收入血后分布到组织、器官所呈现的作用, 如氢氯噻嗪的利尿作用。药物作用还具有选择性 (selectivity), 即药物在一定剂量下引起机体产生效应的范围的专一或广泛程度。有些药物在适当剂量时仅对某个或少数几个器官或组织作用强, 而对其他器官或组织作用弱或没有作用, 如强心苷类药物主要兴奋心肌、巴比妥类药物抑制中枢神经系统等。药物的选择性常与药物剂量有关, 在较小治疗量时, 药物表现较高的选择性; 但随用药剂量加大, 其作用范围也扩大, 如应用 15~30mg 的苯巴比妥可呈现镇静作用, 而用 60~100mg 时则呈现催眠作用, 更大剂量时则可抑制呼吸。一般认为作用特异性强及 (或) 效应选择性高的药物应用时针对性较强。反之, 选择性低的药物副作用较多。