



普通高等教育“十三五”规划教材

全国普通高等教育基础医学类系列教材

杨俊卿 秦大莲 主编

# 药理学

(第二版)

PHARMACOLOGY

供基础、临床、预防、口腔、护理等  
医学类专业使用



科学出版社



普通高等教育“十三五”规划教材

# 全国普通高等教育基础医学类系列教材

供基础、临床、预防、口腔、护理等医学类专业使用

# 药理学

(第二版)

杨俊卿 秦大莲 主编



科学出版社  
北京

## 内 容 简 介

本教材重视教学内容和课程体系改革,遵循“三基”(基本理论、基本知识和基本技能)、“五性”(思想性、科学性、先进性、启发性与实用性)的原则,突出如下特点:①教材内容的选择上兼顾了经典与前沿的有机结合,特别是总论的基础理论与基本知识,以及各论新的药物介绍;②在每章前有学习要求,末尾有本章内容小结,最后还有2~3个思考题,其中有小病例题,以便于教师教学参考和学生复习;③每章的主要内容部分尚配有以文本框形式出现的药物发展简史,以提高学生对药理学学习兴趣,也拓展学生的视野,训练学生的科学思维。

本教材可供基础、临床、预防、口腔、护理、麻醉、法医、精神等医学类专业使用。

### 图书在版编目(CIP)数据

药理学/杨俊卿,秦大莲主编.—2版.—北京:  
科学出版社,2018.2  
普通高等教育“十三五”规划教材 全国普通高等教  
育基础医学类系列教材  
ISBN 978-7-03-055847-3

I. ①药… II. ①杨… ②秦… III. ①药理学—高等  
学校—教材 IV. ①R96

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2017)第 304896 号

责任编辑:闵捷

责任印制:谭宏宇/封面设计:殷靓

科学出版社 出版

北京东黄城根北街16号

邮政编码:100717

<http://www.sciencep.com>

南京展望文化发展有限公司排版

上海叶大印务发展有限公司印刷

科学出版社发行 各地新华书店经销

\*

2013年9月第一版 开本:889×1194 1/16

2018年2月第二版 印张:28 3/4

2018年2月第四次印刷 字数:931 000

定价:75.00元

(如有印装质量问题,我社负责调换)

## 专家指导委员会

主任委员

**李昌龙**

副主任委员

(以姓氏笔画为序)

**王应雄 孙俊 胡华强 程晓斌**

委员

(以姓氏笔画为序)

**王应雄**(重庆医科大学基础医学院)

**王聚乐**(西藏大学医学院)

**龙汉安**(西南医科大学科技处)

**庄田畋**(贵阳中医学院基础医学院)

**孙俊**(昆明医科大学基础医学院)

**阮绪芝**(湖北医药学院基础医学院)

**李昌龙**(四川大学华西基础医学与法医学院)

**李德林**(昆明医科大学海源学院)

**杨林**(成都大学医护学院)

**杨明**(贵州医科大学基础医学院)

**余华荣**(重庆医科大学基础医学院)

**张波**(川北医学院基础医学院)

**张本斯**(大理大学基础医学院)

**张宗诚**(成都医学院基础医学院)

**罗军敏**(遵义医学院基础医学院)

**胡华强**(中国科技出版传媒股份有限公司)

**柯亨宁**(宁夏医科大学基础医学院)

**钟近洁**(新疆医科大学基础医学院)

**夏阳**(电子科技大学医学院)

**高永翔**(成都中医药大学基础医学院)

**黄世稳**(广西右江民族医学院基础医学院)

**淤泽傅**(云南中医学院基础医学院)

**梁伟波**(四川大学华西基础医学与法医学院)

**韩毅**(昆明医科大学基础医学院)

**程晓斌**(陆军军医大学基础医学部)

秘书长

**梁伟波**(四川大学华西基础医学与法医学院)

# 《药理学》(第二版)

## 编辑委员会

主 编  
杨俊卿 秦大莲

副主编  
陈晓红 吴 红 云 宇 宛 蕾

编 委  
(以姓氏笔画为序)

万莉红 (四川大学)  
王 红 (重庆医科大学)  
王 蕾 (昆明医科大学)  
云 宇 (昆明医科大学)  
李小强 (空军军医大学)  
杨丹莉 (遵义医学院)  
杨俊卿 (重庆医科大学)  
吴 红 (天津医科大学)  
吴建明 (西南医科大学)  
陈晓红 (陆军军医大学)  
罗 映 (重庆医科大学)

宛 蕾 (贵州医科大学)  
胡 浩 (西安交通大学)  
秦大莲 (西南医科大学)  
黄起壬 (南昌大学)  
曹 蕾 (西安交通大学)  
龚其海 (遵义医学院)  
蒋青松 (重庆医科大学)  
熊玉霞 (西南医科大学)  
滕 佳 (昆明医科大学海源学院)  
颜晓燕 (成都医学院)

# 第二版前言

药理学是连接基础医学与临床医学、医学与药学的桥梁学科,在医学与药学中有着举足轻重的地位。本教材可供临床、基础、麻醉、影像、护理、口腔、中西医结合、药学、法医、预防、检验等专业学生使用,也可作为相关人员的参考用书。

本教材是在科学出版社组织下,由西南地区主要高等医药院校陆军军医大学、空军军医大学、西安交通大学、四川大学、天津医科大学、南昌大学、西南医科大学、贵州医科大学、成都医学院、遵义医学院、昆明医科大学以及重庆医科大学的专家教授共同编写完成,编委会成员长期从事药理学教学科研第一线,具有丰富的教学经验和较强的科研能力。本次修订也是在第一版的基础上完成,在此谨向第一版全体编委的辛苦努力表示衷心感谢!

本教材重视教学内容和课程体系改革,遵循“三基”(基本理论、基本知识和基本技能)“五性”(思想性、科学性、先进性、启发性与实用性)的原则,突出如下特点:①教材内容的选择上兼顾了经典与前沿的有机结合;②在每章前有学习要求,末尾有本章内容小结,最后还有2~3个思考题,其中一个为小病例题,以便于教师教学参考和学生复习;③每章的主要内容部分尚配有以文本框形式出现的药物发展简史,以提高学生对药理学的学习兴趣,拓展学生的视野,训练学生的科学思维。本教材编写中参考了最新的执业医师资格考试和执业药师考试大纲、*Goodman and Gilman's the pharmacological basis of therapeutics (12<sup>th</sup> ed)*、*Basic and clinical pharmacology (12<sup>th</sup> ed)*等国内外参考书籍。

尽管教材得到了全体编写人员的精心打造,但是由于经验和水平的限制,书中的错漏、瑕疵在所难免,恳请各位同仁及读者不吝赐教,提出宝贵意见。

主 编

2017年10月

# 第一版前言

药理学是连接基础医学与临床医学、医学与药学的桥梁学科,在医学与药学中有着举足轻重的地位。本教材可供基础、临床、预防、口腔、护理等专业学生使用,也可作为相关人员的参考用书。

本教材是在科学出版社组织下,由西南地区主要高等医药院校第三军医大学、泸州医学院、贵阳医学院、成都医学院、遵义医学院以及重庆医科大学的专家教授共同编写完成,编委会成员长期从事药理学教学科研第一线,具有丰富的教学经验和较强的科研能力。

本教材重视教学内容和课程体系改革,遵循“三基”(基本理论、基本知识和基本技能)“五性”(思想性、科学性、先进性、启发性与实用性)的原则,突出如下特点:①教材内容的选择上兼顾了经典与前沿的有机结合;②在每章前有学习要求,末尾有本章内容小结,最后还有2~3个思考题,其中一个为病例题,以便于教师教学参考和学生学习复习;③每章的主要内容部分尚配有以文本框形式出现的药物发展简史,以提高学生对药理学的学习兴趣,拓展学生的视野,训练学生的科学思维。本教材编写中参考了执业医师资格考试要求和执业药师考试大纲、*Goodman and Gilman's the pharmacological basis of therapeutics* (12<sup>th</sup> ed)、*Basic and clinical pharmacology* (12<sup>th</sup> ed)等国内外参考书籍。

尽管教材得到了全体编写人员的精心打造,但是由于经验和水平的限制,书中的错漏、瑕疵在所难免,恳请各位同仁及读者不吝赐教,提出宝贵意见。

主 编

2013年3月

# 目 录

第二版前言  
第一版前言

## 绪 论 001

- 第一节 药理学研究内容与学科任务 001      第三节 药理学研究方法与新药的药理学研究 002  
第二节 药理学发展简史 002

## 第一章 药物效应动力学 004

- 第一节 药物的基本作用 004      第三节 药物作用的受体机制 008  
第二节 药物作用的基本规律 004

## 第二章 药物代谢动力学 013

- 第一节 药物的跨膜转运 013      第三节 药代动力学模型 017  
第二节 药物的体内过程 014      第四节 血药浓度的动态变化 017

## 第三章 影响药物效应的因素 020

- 第一节 药物因素 020      第三节 用药方面的因素 022  
第二节 机体方面的因素 021

## 第四章 传出神经系统药理学概论 025

- 第一节 概述 025      第三节 传出神经系统药物的分类 031  
第二节 传出神经系统的递质和受体 026



<b>第五章 拟胆碱药和抗胆碱药</b>			033
第一节 胆碱受体激动药	033	第三节 M胆碱受体拮抗药	041
第二节 胆碱酯酶抑制药和胆碱酯酶复活药	036	第四节 N胆碱受体拮抗药	046
<b>第六章 肾上腺素受体激动药和拮抗药</b>			051
第一节 肾上腺素受体激动药	051	第二节 肾上腺素受体拮抗药	059
<b>第七章 中枢神经系统递质及其受体</b>			067
第一节 中枢神经递质的概念	067	第二节 中枢神经递质与受体	068
<b>第八章 麻醉药</b>			073
第一节 局部麻醉药	073	第三节 复合麻醉	081
第二节 全身麻醉药	076		
<b>第九章 镇静催眠药</b>			084
第一节 苯二氮草类	085	第三节 其他镇静催眠药	089
第二节 巴比妥类镇静催眠药	087		
<b>第十章 抗癫痫药和抗惊厥药</b>			092
第一节 抗癫痫药	092	第二节 抗惊厥药	098
<b>第十一章 抗精神失常药</b>			100
第一节 抗抑郁症药	100	第三节 抗躁狂症药	110
第二节 抗精神病药	105		
<b>第十二章 镇痛药</b>			112
第一节 概述	112	第五节 阿片受体拮抗剂	119
第二节 阿片受体和内源性阿片肽	113	第六节 非阿片类中枢性镇痛药	120
第三节 阿片受体激动剂	114	第七节 镇痛药应用的基本原则	121
第四节 阿片受体激动-拮抗剂	118		

<b>第十三章 解热镇痛抗炎药及抗痛风药</b>	<b>123</b>
第一节 解热镇痛抗炎药	123
第二节 抗痛风药	129
<b>第十四章 治疗中枢神经系统退行性疾病的药物</b>	<b>132</b>
第一节 抗帕金森病药	132
第二节 治疗阿尔茨海默病药	136
第三节 其他具有中枢作用的药物	138
<b>第十五章 利尿药及脱水药</b>	<b>142</b>
第一节 利尿药	142
第二节 脱水药	148
<b>第十六章 抗高血压药</b>	<b>151</b>
第一节 概述	151
第二节 常用抗高血压药	153
第三节 经典降压药	160
第四节 其他新型抗高血压药	162
第五节 抗高血压药应用原则	163
<b>第十七章 调血脂药和抗动脉粥样硬化药</b>	<b>165</b>
第一节 动脉粥样硬化与血脂异常	165
第二节 调血脂药	166
第三节 其他抗动脉粥样硬化药	171
<b>第十八章 抗心绞痛药</b>	<b>175</b>
第一节 概述	175
第二节 常用抗心绞痛药物	176
第三节 其他抗心绞痛药物	181
<b>第十九章 抗心律失常药物</b>	<b>183</b>
第一节 心律失常的电生理学基础	183
第二节 抗心律失常药的作用机制	188
第三节 抗心律失常药的分类及常用药物	188
第四节 抗心律失常的用药原则及药物选择	196
第五节 抗心律失常药的致心律失常作用	196
<b>第二十章 抗充血性心力衰竭药</b>	<b>198</b>
第一节 概述	198
第二节 治疗充血性心力衰竭的常用药物	200
第三节 其他治疗充血性心力衰竭的药物	207

## 第二十一章 影响自体活性物质的药物 211

- |                       |     |              |     |
|-----------------------|-----|--------------|-----|
| 第一节 组胺及作用于组胺受体的药物     | 211 | 第四节 血管活性肽类药物 | 220 |
| 第二节 5-HT 和影响 5-HT 的药物 | 214 | 第五节 影响腺苷类的药物 | 223 |
| 第三节 膜磷脂代谢产物类药物及其阻断剂   | 217 | 第六节 一氧化氮     | 224 |

## 第二十二章 肾上腺皮质激素类药 227

- |              |     |                  |     |
|--------------|-----|------------------|-----|
| 第一节 糖皮质激素    | 228 | 第三节 促皮质素及皮质激素抑制药 | 234 |
| 第二节 盐皮质激素类药物 | 234 |                  |     |

## 第二十三章 胰岛素及口服降血糖药 237

- |         |     |            |     |
|---------|-----|------------|-----|
| 第一节 胰岛素 | 238 | 第二节 口服降血糖药 | 241 |
|---------|-----|------------|-----|

## 第二十四章 甲状腺激素及抗甲状腺药 249

- |           |     |           |     |
|-----------|-----|-----------|-----|
| 第一节 甲状腺激素 | 249 | 第二节 抗甲状腺药 | 252 |
|-----------|-----|-----------|-----|

## 第二十五章 性激素与作用于生殖系统的药物 258

- |                    |     |                           |     |
|--------------------|-----|---------------------------|-----|
| 第一节 概述             | 258 | 第六节 子宫平滑肌兴奋药和子宫平滑肌<br>松弛药 | 266 |
| 第二节 雌激素类药物及抗雌激素药   | 259 | 第七节 抗前列腺增生药               | 269 |
| 第三节 孕激素类药物         | 261 | 第八节 抗勃起功能障碍药              | 272 |
| 第四节 雄激素类药物和同化激素类药物 | 262 |                           |     |
| 第五节 避孕药            | 263 |                           |     |

## 第二十六章 治疗骨质疏松的药物 275

- |             |     |            |     |
|-------------|-----|------------|-----|
| 第一节 概述      | 275 | 第四节 骨矿化促进药 | 281 |
| 第二节 抑制骨吸收药  | 276 | 第五节 其他药物   | 282 |
| 第三节 促进骨形成药物 | 280 |            |     |

## 第二十七章 影响免疫功能药物 284

- |           |     |               |     |
|-----------|-----|---------------|-----|
| 第一节 免疫抑制剂 | 284 | 第三节 常用中药免疫调节剂 | 291 |
| 第二节 免疫增强剂 | 288 |               |     |

<b>第二十八章 呼吸系统药物</b>				292
第一节 平喘药	292	第三节 祛痰药		298
第二节 镇咳药	297			
<b>第二十九章 消化系统药物</b>				301
第一节 治疗消化性溃疡药物	301	第三节 用于胆道与肝脏疾病的药物		311
第二节 消化道功能调节药	308	第四节 治疗急性胰腺炎的药物		313
<b>第三十章 作用于血液系统及造血系统的药物</b>				316
第一节 抗凝血药	316	第五节 抗贫血药		325
第二节 抗血小板药	320	第六节 造血生长因子		327
第三节 纤维蛋白溶解药	322	第七节 血容量扩充药		330
第四节 促凝血药	323			
<b>第三十一章 抗菌药物概论</b>				332
第一节 常用术语	332	第三节 细菌的耐药性		334
第二节 抗菌药物的作用机制	333	第四节 抗菌药的合理使用		335
<b>第三十二章 <math>\beta</math>-内酰胺类及其他影响细胞壁合成的抗生素</b>				338
第一节 概述	338	第四节 $\beta$ -内酰胺酶抑制剂及复方制剂		346
第二节 $\beta$ -内酰胺类抗生素	340	第五节 其他影响细胞壁合成的抗生素		347
第三节 非典型 $\beta$ -内酰胺类抗生素	345			
<b>第三十三章 大环内酯类及林可霉素类抗生素</b>				352
第一节 大环内酯类抗生素	352	第二节 林可霉素类		355
<b>第三十四章 氨基糖苷类及多黏菌素类抗生素</b>				357
第一节 概述	357	第三节 多黏菌素类抗生素		361
第二节 主要的氨基糖苷类抗生素	360			
<b>第三十五章 四环素类及氯霉素</b>				363
第一节 四环素类抗生素	363	第二节 氯霉素		365

<b>第三十六章 人工合成抗菌药物</b>			368
第一节 喹诺酮类抗菌药	368	第三节 其他合成抗菌药物	374
第二节 磺胺类抗菌药	372		
<b>第三十七章 抗结核病药与抗麻风病药</b>			377
第一节 抗结核病药	377	第二节 抗麻风病药	383
<b>第三十八章 抗真菌药</b>			385
第一节 抗真菌抗生素	385	第二节 人工合成抗真菌药	386
<b>第三十九章 抗病毒药</b>			391
第一节 概述	391	第二节 常用抗病毒药	392
<b>第四十章 抗寄生虫药物</b>			401
第一节 抗疟药	401	第三节 抗血吸虫病药和抗丝虫病药物	407
第二节 抗阿米巴病药及抗滴虫药物	405	第四节 抗蠕虫病药物	409
<b>第四十一章 抗恶性肿瘤药</b>			412
第一节 抗恶性肿瘤药物概述	412	第三节 其他抗恶性肿瘤药物	427
第二节 传统抗恶性肿瘤药物	415		
<b>第四十二章 常见中毒及解毒药</b>			431
第一节 金属中毒解毒药	431	第二节 氰化物中毒解毒药	433
<b>索引</b>			436
<b>主要参考文献</b>			446

# 绪 论

## 学习要求

**掌握：**① 药物、毒物、药理学、药效学和药代动力学的定义；② 药理学的组成部分。

**熟悉：**新药的定义、新药的药理学研究内容。

**了解：**药理学发展简史。

## 第一节 药理学研究内容与学科任务

### 一、药物

药物的英文名“drug”源自希腊语“drogen”(含干草之意)。广义上讲,凡能影响(或帮助体现)机体的生化过程、生理功能及病理状态,用于预防、诊断和治疗疾病以及计划生育的物质都属于药物范畴。毒物(poison)是指安全范围很小,在很小的剂量即可对机体产生明显毒性的物质。药物与毒物没有质的区别,任何药物在一定条件下均可成为毒物,而毒物在某些特定的条件下也可成为有治疗作用的药物。药物的来源主要包括植物、动物(包括人体)、微生物、矿物和人工合成或半合成等。

### 二、药理学学科性质及研究内容

药理学(pharmacology)是研究药物与机体(包括病原体)间相互作用及作用规律的一门学科。药理学起源于生理学,以机体和药物为研究对象,以生理学、生物化学、病理学、病理生理学、微生物与寄生虫学、免疫学、分子生物学、药物化学等学科为基础,为指导临床合理用药、防治疾病提供基本理论、基础知识和科学思维,是基础医学与临床医学、医学与药学之间的桥梁学科。

药理学一方面研究和阐明药物对机体及病原体的作用、作用机制及作用规律,即药物效应动力学(pharmacodynamics),简称药效学,包括药物的药理作用、作用机制、临床应用、不良反应和禁忌证等;另一方面研究机体对药物的处置过程,即药物代谢动力学(pharmacokinetics),简称药代动力学、药物动力学、药动学,包括药物的体内过程(吸收、分布、生物转化和排泄)和体内药物量或浓度随时间的动态变化。

### 三、药理学学科任务

药理学的学科任务主要是阐明并利用药物与机体(包括病原体)相互作用的规律,为指导临床合理用药及防治疾病提供理论依据;促进研发新药和发现药物新用途;促进其他生命科学的发展。

## 第二节 药理学发展简史

远古时代的人们在寻找并尝食新品种食物时常发生中毒,被迫寻找解救药物,在人与自然和疾病的漫长斗争史中获知某些天然物质可以治疗疾病和伤痛,这是药物的始源。早在公元1世纪前后我国的《神农本草经》记载药物365种,其中一些沿用至今。在公元7世纪的唐代有了世界上第一部由政府颁布的药典《新修本草》,记载了药物884种。明朝的大药物学家李时珍完成了世界闻名的医药巨著《本草纲目》,全书共52卷,约190万字,记载药物1892种,插图1160帧,药方11000余条,现今仍是中医中药研究的必读书籍,在国际上有7种文字译本流传。

现代药理学起源于欧洲,得益于生理学和化学的发展。英国解剖学家W. Harvey对血液循环的发现,使实验药理学得以开端,意大利生理学家F. Fontana通过对千余种药物的动物毒性测试后认为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反应。世界上第一位药理学教授德国的R. Buchheim建立了第一个药理实验室,编写了第一本药理教材,实验药理学基本形成,从而使药理学成了一门独立的学科。他的学生O. Schmiedeberg发展了实验药理学,对药物的作用部位进行研究,创立了器官药理学。于1803年德国化学家F. W. Serturmer从罂粟中分离提纯得到吗啡,并证明了其镇痛作用。德国微生物学家P. Ehrlich筛选出有效治疗梅毒的新肿凡纳明,开启了合成药物的时代。英国生理学家J. N. Langley提出的药物作用的受体假说,为药物作用机制的阐明和新药的研发提供了重要理论基础。由于生理学、生物化学、病理学、病理生理学、微生物与寄生虫学、免疫学、药物化学等学科,特别是分子生物学的迅猛发展与相互融合,20世纪末人类基因组计划的实施进一步推动了药理学的发展,形成了生化药理学、免疫药理学、神经药理学、遗传药理学、分子药理学等药理学分支学科,大大充实和丰富了药理学的内容。

## 第三节 药理学研究方法与新药的药理学研究

### 一、药理学研究方法

药理学是一门实验性学科,充分融合生理学、生物化学、病理学、病理生理学、微生物与寄生虫学、免疫学、药物化学和分子生物学等学科的研究技术、方法与手段。药理学研究可分体外实验与体内实验,前者主要通过细胞、组织、器官、细菌或病毒培养进行实验,观察药物的作用及机制;后者主要是在整体动物上进行药效学与药代动力学研究。药理学实验研究都需要设置严格、合理的对照。对于新药而言,前述体外及在体动物研究内容属于临床前研究范畴,以人(包括临床患者)为研究和服务对象的应用学科则属于临床药理学。

### 二、新药的药理学研究

新药来源包括天然产物、半合成及全合成化学物质。参考我国药品注册管理法规定,新药可以简单定义为“未曾在中国境内外上市销售的药品”,从分类上包括化学药品新药、中药与天然药物新药和生物制品新药及其制剂等。

新药的药理学研究主要是为了保证新药的安全性与有效性。新药的研究过程可分为临床前研究、临床研究。临床前研究的药理学研究包括体外实验和在体动物实验,主要进行系统的新药药效学、药代动力学和毒理学评价,获得新药临床前安全性与有效性数据,在经过药物管理部门的审批后才能进行临床试验,目的在于保证用药的安全。

临床研究是以健康志愿者或新药适应证患者为研究对象,进一步评价新药的安全性与有效性,分为4

期。Ⅰ期临床试验一般以 20~30 例健康志愿者为研究对象,观察新药人体药代动力学特征和耐受性,为Ⅱ期临床试验提供安全有效的合理实验方案依据。Ⅱ期临床试验以不少于 100 例的适应证患者为研究对象,初步评价药物在目标适应证患者的治疗作用及安全性,为Ⅲ期临床试验研究方案设计和给药方案提供参考依据。Ⅲ期临床试验的病例数不少于 300 例,进行多中心、随机盲法对照研究,进一步验证新药的安全性、有效性、药物相互作用,获得效益/风险比值等。此期实验结束,可以申请新药证书。Ⅳ期临床试验又称为售后调研(postmarketing surveillance),是指新药上市后进行的社会性考查与评价,在广泛的推广应用中重点了解长期使用后出现的药物安全性和有效性,包括药物的新用途,但是重点在于不良反应监测,特别是在特殊人群。

近年来,针对神经系统疾病、恶性肿瘤和心血管疾病等严重威胁生命的疾病领域的创新药物的 0 期临床试验已受到重视,其又称为“微剂量”试验。其研究剂量为低于从临床前毒理学研究获得的动物安全性数据而推导得出的拟用于人体可能产生临床药理学作用剂量的 1/100,且最大剂量不超过 100  $\mu\text{g}$ 。适于对一组结构相似的不超过 5 个化合物或剂型进行“微剂量”研究,以获得人体药代动力学数据和药效学数据。0 期临床试验的目的主要是从有效性进行考虑,以利于提高研发效率,尽早明确有前景的先导化合物、剔除没有优势的化合物。

## 小 结

药物指凡能影响(或帮助体现)机体的生化过程、生理功能及病理状态,用以预防、诊断和治疗疾病以及计划生育的物质。毒物指安全范围很小,在很小的剂量即可对机体产生明显毒性的物质,药物与毒物没有质的区别。药理学是研究药物与机体(包括病原体)相互作用及规律的一门学科,包括药效学(研究药物对机体的作用与规律)和药代动力学(研究机体对药物的处置过程)。新药的研究过程主要包括临床前研究和临床研究,后者主要包括Ⅰ期、Ⅱ期、Ⅲ期和Ⅳ期临床试验。

### 【思考题】

1. 简述药理学的定义及组成部分。
2. 简述新药的药理学研究内容。

(杨俊卿)



## 第一章

# 药物效应动力学

### 学习要求

**掌握:** ① 药效学中的重要概念;② 药物作用的受体机制。

**熟悉:** ① 药物作用的选择性、两重性、量-效关系;② 药物的基本作用。

**了解:** 药物作用的非受体机制。

药物效应动力学(pharmacodynamics, PD),简称药效学,主要研究和阐明药物对机体(及病原体)的作用、作用机制及作用规律,是药理学研究的重要组成部分。

## 第一节 药物的基本作用

### 一、药物的作用与效应

药物作用(action)指药物对机体的初始作用,即药物进入机体后与机体靶分子(如受体等)之间的相互作用;药物效应(effect)指药物作用的结果,是在药物作用的基础上,通过一系列复杂的中间过程,最后引起机体生理、生化功能或形态的改变。前者为因,后者为果。如 ACh 激动 M 胆碱受体,这是药物作用,而导致的瞳孔缩小为药物效应。由于两者密不可分,在一般情况下并不严格区分。

### 二、药物作用的基本表现

药物作用的基本表现为兴奋(excitation)和抑制(inhibition),前者指药物使机体原有的机能活动增强,后者指药物使机体原有的机能活动降低。药物兴奋和抑制作用是相对的,可随药物剂量、作用靶器官的改变而变化。如过度的中枢神经系统兴奋可引起惊厥,而持续惊厥又可转为中枢神经系统抑制。ACh 激动 M 胆碱受体,导致的瞳孔括约肌收缩,同时又可以导致心肌传导速度抑制、心肌收缩力减弱、心率减慢。

药物作用于机体的方式可根据作用的产生是否依赖于吸收入血可分为局部作用和吸收作用;根据产生的效应与药物作用靶点的关系又可分为直接作用和间接作用。

## 第二节 药物作用的基本规律

### 一、药物作用的选择性

药物作用具有选择性(selectivity),即指药物效应具有组织器官专一性。对机体某一(些)组织器官功能