

卫生部规划教材  
全国高等医药院校教材

供药学类专业用

# 药理学

第四版

李端 主编

人民卫生出版社



全国高等医药院校教材

供药学类专业用

# 药 理 学

第 四 版

李 端 主编

编者（以姓氏笔画为序）

刘玉兰（沈阳药科大学）

李长龄（北京医科大学）

李 端（上海医科大学）

张世玲（山东医科大学）

郑钦岳（第二军医大学）

莫正纪（华西医科大学）

程彰华（上海医科大学）

人 民 卫 生 出 版 社

**图书在版编目(CIP)数据**

药理学/李端主编. —4版. —北京: 人民卫生出版社, 1999

ISBN 7-117-03273-1

I. 药… II. 李… III. 药理学 - 教材  
IV. R96

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (1999) 第 47860 号

**药 理 学**  
**第 四 版**

主 编: 李 端

出版发行: 人民卫生出版社(中继线 67616688)

地 址: (100078) 北京市丰台区方庄芳群园 3 区 3 号楼

网 址: <http://www.pmph.com>

E - mail: [pmph@pmph.com](mailto:pmph@pmph.com)

印 刷: 三河市潮河印刷厂

经 销: 新华书店

开 本: 787×1092 1/16 印张: 29.25 插页: 1

字 数: 671 千字

版 次: 1987 年 9 月第 2 版 2001 年 11 月第 4 版第 15 次印刷

印 数: 132 591—142 605

标准书号: ISBN 7-117-03273-1/R·3274

定 价: 25.80 元

著作权所有, 请勿擅自用本书制作各类出版物, 违者必究

(凡属质量问题请与本社发行部联系退换)

# 全国高等医药院校药学专业 第四轮规划教材修订说明

为适应我国高等药学教育的改革和发展,在总结前三轮药学专业教材编写经验的基础上,卫生部教材办公室于1996年9月决定进行第四轮教材修订,根据药专业的培养目标,确定了第四轮教材品种和修订的指导思想,药学本科教育的培养对象是从事一般药物制剂、鉴定及临床合理用药等工作的药师,教材修订应紧紧围绕培养目标,突出各学科的基本理论、基本知识,同时又反映学科的新进展。该套教材可供药学及相关专业选用。全套教材共22种,均经卫生部聘任的全国药学专业教材评审委员会审定。教材目录如下:

- |                  |        |                 |        |
|------------------|--------|-----------------|--------|
| 1. 高等数学(第三版)     | 毛宗秀 主编 | 11. 药理学(第四版)    | 李 端 主编 |
| 2. 医药数理统计方法(第三版) |        | 12. 药物分析(第四版)   | 刘文英 主编 |
|                  | 刘定远 主编 | 13. 药用植物学(第三版)  | 郑汉臣 主编 |
| 3. 物理学(第三版)      | 王鸿儒 主编 | 14. 生药学(第三版)    | 郑俊华 主编 |
| 4. 物理化学(第四版)     | 侯新朴 主编 | 15. 药物化学(第四版)   | 郑 虎 主编 |
| 5. 无机化学(第三版)     | 许善锦 主编 | 16. 药剂学(第四版)    | 毕殿洲 主编 |
| 6. 分析化学(第四版)     | 孙毓庆 主编 | 17. 天然药物化学(第三版) | 姚新生 主编 |
| 7. 有机化学(第四版)     | 倪沛洲 主编 | 18. 中医学基础(第四版)  | 李向中 主编 |
| 8. 人体解剖生理学(第四版)  |        | 19. 药事管理学(第二版)  | 吴 蓬 主编 |
|                  | 龚茜玲 主编 | 20. 生物药剂学与药代动力学 |        |
| 9. 微生物学与免疫学(第四版) |        |                 | 梁文权 主编 |
|                  | 李明远 主编 | 21. 分子生物学基础     | 史济平 主编 |
| 10. 生物化学(第四版)    | 吴梧桐 主编 | 22. 药学英语(第二版)   | 胡廷熹 主编 |
- 以上教材均由人民卫生出版社出版。

卫生部教材办公室

## 全国药学专业教材第二届评审委员会

主任委员:彭 司 勋

副主任委员:郑 虎

委员(以姓氏笔画为序)

王 夔 安登魁 李万亥 邹立家

郑俊华 胡昌奇 姚新生 梁文权

秘 书:翁玲玲 冉 兰

## 前 言

《药理学》第四版是根据全国高等医药院校药学专业教材评审委员会关于修订药学专业第四轮教材的指导思想，药学专业的专业培养目标，在竺心影教授主编的《药理学》第三版的基础上，由国内6所医药院校的药理学专家、教授共同编写而成，供全国高等医药院校药学类专业使用。

本次教材修订是在总结和交流应用第三版教材经验的基础上，强调了应使该教材符合专业培养目标的要求，力求进一步提高它的思想性、科学性、先进性、启发性和适用性；并且，要努力运用辩证唯物主义观点，重点介绍药理学的基本理论、基本知识和基本技能，尽可能从教学实践出发，结合临床用药、医药科研及药品生产情况。本版教材约60万字，共分8篇（即总论、外周神经系统药理、中枢神经系统药理、内脏系统药理、激素类药物药理、抗病原微生物药的药理、抗寄生虫病药的药理、抗恶性肿瘤药与影响免疫功能药等）46章叙述。书后有附录及中英文药名索引。就其具体内容而言，除保留第三版教材的主要内容和基本写作风格外，删去了三版中“自身活性物质药理”一篇，对中枢神经系统、内脏系统的药理，以及抗病原微生物药和抗寄生虫病药的药理等章节也作了某些删减，有的章节还从分子水平适当增加了一些与阐明药理作用有关的理论和知识；对各系统的药物，也有一些内容更新。

本版教材可供普通高等学校药学专业本科生应用，也可供医学专业本科生等参考。使用本书时，各院校可根据教学大纲要求并结合各校具体情况对教材内容作适当取舍。我们希望通过本书的学习，能培养学生辩证的科学思维方法，提高分析问题和解决问题的能力，也有利于自学。

本教材修订中的主要参考书目有：杨藻宸主编《药理学总论》（第二版，人民卫生出版社，1989）和《医用药理学》（第三版，人民卫生出版社，1994），徐叔云主编《现代实用临床药理学》（华夏出版社，1997），Goodman and Gilman's《The Pharmacological Basis of Therapeutics》（9th ed, 1995），Katzung《Basic and clinical pharmacology》（4th ed, 1995）等。

在本版教材修订过程中，上海医科大学章蕴毅副教授承担秘书工作并参与目录、索引的编写和图表的编排。上海医科大学和药学院的领导也给予了大力支持和帮助，在此一并表示衷心的感谢。

限于我们的知识和能力，《药理学》第四版教材中的缺点和错误在所难免，恳切希望读者给予批评指正。

李 端

1999年2月于上海医科大学

# 目 录

## 第一篇 总 论

<b>第一章 绪言</b> .....	1
第一节 药理学的任务和内容 .....	1
第二节 药理学的发展简史 .....	2
<b>第二章 药物对机体的作用——药效学</b> .....	4
第一节 药物的基本作用 .....	4
一、药物作用的性质和方式 .....	4
二、药物作用的选择性和两重性 .....	4
第二节 受体理论 .....	6
一、受体的基本概念 .....	6
二、受体的特性 .....	7
三、受体类型和受体调节 .....	8
四、受体学说 .....	9
第三节 药效学概述 .....	10
一、作用于受体的药物 .....	10
二、药物作用机制 .....	11
三、药物的构效关系与量效关系 .....	15
<b>第三章 机体对药物的作用——药动学</b> .....	18
第一节 药物的体内过程 .....	18
一、药物的跨膜转运 .....	18
二、药物的吸收和影响因素 .....	21
三、药物的分布和影响因素 .....	22
四、药物的代谢 .....	24
五、药物的排泄 .....	29
第二节 药物代谢动力学基本概念 .....	30
一、血药浓度-时间曲线的意义 .....	30
二、给药途径与药-时曲线 .....	31
三、生物利用度 .....	31
四、表观分布容积 .....	32
五、速率过程和有关参数 .....	33
六、房室模型 .....	35
七、多次用药和给药方案 .....	36
<b>第四章 影响药效的因素</b> .....	39
第一节 机体方面的因素 .....	39
一、年龄和性别的影响 .....	39

二、功能和病理状态的影响 .....	40
三、个体差异和遗传因素 .....	41
四、种属差异 .....	42
<b>第二节 药物方面的影响 .....</b>	<b>43</b>
一、剂量和剂型的影响 .....	43
二、给药途径和反复用药的影响 .....	43
三、药物相互作用 .....	44

## 第二篇 外周神经系统药理

<b>第五章 传出神经系统药理概论 .....</b>	<b>48</b>
<b>第一节 传出神经突触的超微结构 .....</b>	<b>48</b>
<b>第二节 传出神经系统的递质 .....</b>	<b>48</b>
一、传出神经按递质的分类 .....	49
二、递质的合成与贮存 .....	49
三、递质的释放和消除 .....	50
<b>第三节 传出神经系统的受体 .....</b>	<b>52</b>
一、胆碱受体 .....	52
二、肾上腺素受体 .....	52
三、多巴胺受体 .....	52
四、突触前膜受体 .....	52
五、同一组织多种受体的共存 .....	53
<b>第四节 传出神经受体的生物效应 .....</b>	<b>53</b>
<b>第五节 传出神经递质效应的分子机制 .....</b>	<b>54</b>
一、G蛋白偶联受体 .....	55
二、含离子通道的受体 .....	56
<b>第六节 传出神经系统药物的作用方式和分类 .....</b>	<b>56</b>
一、药物作用方式 .....	57
二、传出神经系统药物分类 .....	57
<b>第六章 胆碱受体激动药和作用于胆碱酯酶药 .....</b>	<b>59</b>
<b>第一节 胆碱受体激动药 .....</b>	<b>59</b>
一、M、N胆碱受体激动药 .....	59
二、M胆碱受体激动药 .....	60
三、N胆碱受体激动药 .....	62
<b>第二节 胆碱酯酶抑制剂 .....</b>	<b>62</b>
一、易逆性胆碱酯酶抑制剂 .....	64
二、难逆性胆碱酯酶抑制剂 .....	66
<b>第三节 胆碱酯酶复活剂 .....</b>	<b>67</b>
<b>第七章 胆碱受体阻断药 .....</b>	<b>69</b>
<b>第一节 M胆碱受体阻断药 .....</b>	<b>69</b>
一、阿托品类生物碱 .....	69
二、阿托品的合成代用品 .....	73

第二节	$N_1$ 胆碱受体阻断药——神经节阻断药	74
第三节	$N_2$ 胆碱受体阻断药——骨骼肌松弛药	75
一、	非去极化型肌松药	75
二、	去极化型肌松药	76
<b>第八章</b>	<b>肾上腺素受体激动药</b>	<b>79</b>
第一节	拟交感药的构效关系及分类	79
第二节	$\alpha$ 受体激动药	81
一、	$\alpha_1$ 、 $\alpha_2$ 受体激动药	81
二、	$\alpha_1$ 受体激动药	83
三、	$\alpha_2$ 受体激动药	83
第三节	$\alpha$ 、 $\beta$ 受体激动药	83
第四节	$\beta$ 受体激动药	86
一、	$\beta_1$ 、 $\beta_2$ 受体激动药	86
二、	$\beta_1$ 受体激动药	87
三、	$\beta_2$ 受体激动药	88
<b>第九章</b>	<b>肾上腺素受体阻断药</b>	<b>90</b>
第一节	$\alpha$ 受体阻断药	90
一、	$\alpha_1$ 、 $\alpha_2$ 受体阻断药	90
二、	$\alpha_1$ 受体阻断药	92
第二节	$\beta$ 受体阻断药	92
一、	构效关系与药理作用	93
二、	$\beta$ 受体阻断药的分类	94
<b>第十章</b>	<b>局部麻醉药</b>	<b>99</b>
一、	局麻药应用方法	99
二、	局麻药的化学结构与分类	100
三、	局麻作用与作用机制	100
四、	局麻药的吸收作用	102
五、	影响局麻药作用的因素	102
六、	临床常用局麻药	103

### 第三篇 中枢神经系统药理

<b>第十一章</b>	<b>全身麻醉药</b>	<b>106</b>
第一节	吸入性麻醉药	106
第二节	静脉麻醉药	108
第三节	复合麻醉	108
<b>第十二章</b>	<b>镇静催眠药</b>	<b>110</b>
第一节	苯二氮草类	110
第二节	巴比妥类	112
第三节	其他镇静催眠药	113
<b>第十三章</b>	<b>抗癫痫药和抗惊厥药</b>	<b>116</b>
第一节	抗癫痫药	116



第二节 抗惊厥药 .....	119
<b>第十四章 抗精神失常药 .....</b>	<b>121</b>
第一节 抗精神病药 .....	121
一、吩噻嗪类 .....	122
二、硫杂蒯类 .....	124
三、丁酰苯类 .....	125
四、二苯氧氮平类 .....	125
五、苯酰胺类 .....	126
六、二苯丁哌啶类 .....	126
第二节 抗躁狂抑郁症药 .....	127
一、抗抑郁症药 .....	127
二、抗躁狂症药 .....	130
第三节 抗焦虑症药 .....	131
<b>第十五章 抗帕金森病药 .....</b>	<b>133</b>
第一节 拟多巴胺类药 .....	133
第二节 中枢性抗胆碱药 .....	135
<b>第十六章 镇痛药 .....</b>	<b>137</b>
第一节 阿片生物碱类镇痛药 .....	137
一、阿片碱类镇痛药 .....	139
二、阿片受体阻断药 .....	141
第二节 人工合成镇痛药 .....	141
第三节 非麻醉性镇痛药 .....	143
<b>第十七章 中枢兴奋药 .....</b>	<b>146</b>
第一节 大脑皮质兴奋药 .....	146
第二节 主要兴奋延髓呼吸中枢的药物 .....	147
第三节 促大脑功能恢复药 .....	148
<b>第十八章 解热镇痛抗炎药与抗痛风药 .....</b>	<b>150</b>
第一节 解热镇痛抗炎药 .....	150
一、水杨酸类 .....	151
二、苯胺类 .....	153
三、吡唑酮类 .....	154
四、吲哚乙酸类 .....	154
五、灭酸类 .....	155
六、丙酸类 .....	155
七、昔康类 .....	156
八、解热镇痛药复方制剂 .....	156
第二节 抗痛风药 .....	157

#### 第四篇 内脏系统药理

<b>第十九章 抗心律失常药 .....</b>	<b>159</b>
第一节 正常心肌电生理 .....	159

一、正常心肌膜电位	159
二、膜反应性	159
三、有效不应期	160
第二节 抗心律失常药的作用机制和分类	160
一、心律失常的形成	160
二、抗心律失常药的作用机制	161
三、抗心律失常药的分类	161
第三节 常用抗心律失常药	162
一、I类——钠通道阻滞药	162
二、II类—— $\beta$ 受体阻断药	168
三、III类——延长动作电位时程药	168
四、IV类——钙通道阻滞药	169
第四节 快速型心律失常的药物选用	170
<b>第二十章 抗慢性心功能不全药</b>	<b>173</b>
第一节 强心甙	174
第二节 非强心甙类正性肌力药	180
第三节 减负荷药	181
一、利尿药	181
二、血管舒张药	181
<b>第二十一章 抗心绞痛及抗动脉粥样硬化药</b>	<b>183</b>
第一节 抗心绞痛药	183
一、硝酸酯类及亚硝酸类	183
二、 $\beta$ 受体阻断药	185
三、钙拮抗药	186
第二节 抗动脉粥样硬化药	186
一、影响胆固醇吸收药	187
二、影响胆固醇和甘油三酯代谢药	188
三、HMG-CoA 还原酶抑制剂	189
四、其他	190
<b>第二十二章 抗高血压药</b>	<b>192</b>
第一节 抗高血压药的分类	192
第二节 常用抗高血压药	193
一、作用于神经中枢部位的药物	193
二、神经节阻断药	194
三、影响肾上腺素能神经递质药	195
四、肾上腺素受体阻断药	196
五、血管扩张药	197
六、钙拮抗剂	198
七、利尿药	198
八、血管紧张素转化酶抑制剂	199
第三节 抗高血压药应用原则	200

<b>第二十三章 利尿药和脱水药</b> .....	202
<b>第一节 利尿药</b> .....	202
一、利尿药作用的生理学基础 .....	202
二、常用利尿药 .....	204
三、利尿药的临床应用原则 .....	209
<b>第二节 脱水药</b> .....	209
<b>第二十四章 血液及造血系统药理</b> .....	212
<b>第一节 抗贫血药</b> .....	212
<b>第二节 促凝血药和抗凝血药</b> .....	214
一、促凝血药 .....	216
二、抗凝血药 .....	217
<b>第三节 纤维蛋白溶解药</b> .....	219
<b>第四节 抗血小板药</b> .....	220
<b>第五节 升高白细胞的药物</b> .....	220
<b>第六节 血容量扩充药</b> .....	221
<b>第二十五章 消化系统药理</b> .....	224
<b>第一节 助消化药</b> .....	224
<b>第二节 抗消化性溃疡药</b> .....	224
一、抗酸药 .....	224
二、胃酸分泌抑制药 .....	225
三、溃疡粘膜保护药 .....	226
四、抗幽门螺杆菌药 .....	227
<b>第三节 泻药和止泻药</b> .....	227
一、泻药 .....	227
二、止泻药 .....	228
<b>第四节 止吐药</b> .....	228
<b>第五节 胆石溶解药和利胆药</b> .....	229
<b>第六节 治疗肝昏迷的药物</b> .....	230
<b>第二十六章 呼吸系统药理</b> .....	233
<b>第一节 平喘药</b> .....	233
一、 $\beta$ 肾上腺素受体激动药 .....	233
二、茶碱类 .....	233
三、抗胆碱药 .....	234
四、抗过敏平喘药 .....	234
五、糖皮质激素 .....	235
<b>第二节 祛痰药</b> .....	236
<b>第三节 镇咳药</b> .....	236
一、中枢性镇咳药 .....	236
二、外周性镇咳药 .....	237
<b>第二十七章 组胺受体阻断药</b> .....	239
<b>第一节 组胺受体阻断药的分类</b> .....	239

第二节 H <sub>1</sub> 受体阻断药 .....	240
第三节 H <sub>2</sub> 受体阻断药 .....	242
<b>第二十八章 子宫平滑肌兴奋药和子宫平滑肌松弛药 .....</b>	<b>244</b>
第一节 子宫平滑肌兴奋药 .....	244
第二节 子宫平滑肌松弛药 .....	246

### 第五篇 激素类药物药理

<b>第二十九章 肾上腺皮质激素 .....</b>	<b>250</b>
第一节 盐皮质激素 .....	251
第二节 糖皮质激素 .....	251
第三节 促皮质素 .....	255
<b>第三十章 性激素类药与避孕药 .....</b>	<b>258</b>
第一节 性激素类药 .....	258
一、雌激素类药 .....	259
二、孕激素类药 .....	261
三、抗雌激素类药 .....	263
四、雄激素类药 .....	263
五、同化激素 .....	264
第二节 避孕药 .....	265
一、女用避孕药 .....	265
二、抗早期及中期妊娠药 .....	267
三、男用避孕药 .....	268
<b>第三十一章 甲状腺激素及抗甲状腺药 .....</b>	<b>270</b>
第一节 甲状腺激素 .....	270
第二节 抗甲状腺素药 .....	272
一、硫脲类 .....	272
二、碘及碘化物 .....	273
三、β受体阻断药 .....	273
<b>第三十二章 胰岛素和口服降血糖药 .....</b>	<b>275</b>
第一节 胰岛素 .....	275
第二节 口服降血糖药 .....	278
一、磺酰脲类 .....	278
二、双胍类 .....	279
三、葡萄糖苷酶抑制药 .....	280

### 第六篇 抗病原微生物药物药理

<b>第三十三章 抗菌药物概述 .....</b>	<b>282</b>
第一节 化学治疗概念 .....	282
第二节 抗菌药物的作用机制 .....	283
一、抑制细菌细胞壁合成 .....	283
二、影响细胞膜通透性 .....	283

三、抑制蛋白质合成	283
四、抑制核酸代谢	284
五、影响叶酸代谢	284
第三节 细菌耐药性及其产生机制	284
第四节 抗菌药物应用的基本原则	284
一、严格按照适应证选药	285
二、抗菌药物的联合应用	289
<b>第三十四章 喹诺酮类、磺胺类与其它合成抗菌药物</b>	<b>291</b>
第一节 喹诺酮类	291
一、概述	291
二、各种常用喹诺酮类	292
第二节 磺胺类	294
第三节 其他合成抗菌药物	296
一、甲氧苄啶	296
二、硝基咪唑类	297
<b>第三十五章 <math>\beta</math>-内酰胺类抗生素</b>	<b>300</b>
第一节 青霉素类	300
一、天然青霉素	300
二、半合成青霉素	303
第二节 头孢菌素类	306
第三节 其他 $\beta$ -内酰胺类	310
一、碳青霉烯类	310
二、单环 $\beta$ -内酰胺类	310
三、 $\beta$ -内酰胺酶抑制剂	310
四、氧头孢烯类	311
<b>第三十六章 大环内酯类、林可霉素类及其他抗生素</b>	<b>314</b>
第一节 大环内酯类	314
一、红霉素类	314
二、其它大环内酯类	316
第二节 林可霉素及克林霉素	316
第三节 万古霉素及去甲万古霉素	317
<b>第三十七章 氨基甙类与多粘菌素类抗生素</b>	<b>319</b>
第一节 氨基甙类	319
一、氨基甙类的共同特点	320
二、各种氨基甙类特点及应用	322
第二节 多粘菌素类	324
<b>第三十八章 四环素类及氯霉素</b>	<b>325</b>
第一节 四环素类	325
第二节 氯霉素	327
<b>第三十九章 抗真菌药与抗病毒药</b>	<b>329</b>
第一节 抗真菌药	329

一、全身性抗真菌药 .....	329
二、局部应用抗真菌药 .....	332
第二节 抗病毒药物 .....	333
一、概    述 .....	333
二、常用抗病毒药 .....	333
<b>第四十章 抗结核病药与抗麻风病药 .....</b>	<b>339</b>
第一节 抗结核病药 .....	339
一、常用抗结核病药 .....	339
二、其他抗结核病药 .....	342
三、抗结核病药的应用原则 .....	342
第二节 抗麻风病药 .....	343

## 第七篇 抗寄生虫病药

<b>第四十一章 抗疟药 .....</b>	<b>346</b>
第一节 疟原虫生活史及抗疟药作用环节 .....	346
一、无性生殖阶段 .....	347
二、有性生殖阶段 .....	347
第二节 常用抗疟药及其分类 .....	347
一、主要用于控制疟疾症状的抗疟药物 .....	347
二、主要用于控制复发和传播的抗疟药 .....	350
三、主要用于预防的抗疟药 .....	350
<b>第四十二章 抗阿米巴病药及抗滴虫病药 .....</b>	<b>352</b>
第一节 抗阿米巴病药 .....	352
第二节 抗滴虫病药 .....	354
<b>第四十三章 抗血吸虫病药及抗丝虫病药 .....</b>	<b>356</b>
第一节 抗血吸虫病药 .....	356
第二节 抗丝虫病药 .....	357
<b>第四十四章 抗肠道蠕虫病药 .....</b>	<b>359</b>
第一节 广谱驱肠虫药 .....	359
第二节 其他抗肠虫药 .....	361

## 第八篇 抗恶性肿瘤药与影响免疫功能药

<b>第四十五章 抗恶性肿瘤药 .....</b>	<b>364</b>
第一节 概述 .....	364
一、抗恶性肿瘤药物按作用机制分类 .....	364
二、肿瘤细胞增殖周期与药物治疗的关系 .....	364
第二节 常用抗肿瘤药物 .....	366
一、干扰核酸生物合成的药物 .....	366
二、破坏 DNA 结构和功能的药物 .....	371
三、嵌入 DNA 干扰核酸合成的药物 .....	376
四、干扰蛋白质合成的药物 .....	378

五、影响激素功能的抗癌药物 .....	380
第三节 联合应用抗肿瘤药物的原则 .....	381
<b>第四十六章 影响免疫功能的药物 .....</b>	<b>385</b>
第一节 免疫抑制剂 .....	386
第二节 免疫兴奋剂 .....	389
第三节 细胞因子 .....	391
附录 1 一些常用药物的药动学参数表 .....	395
附录 2 老幼剂量折算表 .....	425
附录 3 从身高体重折算体表面积 (m <sup>2</sup> ) 表 .....	426
中文药名索引 .....	428
英文药名索引 .....	441



# 第一篇 总 论

## 第一章 绪 言

### 第一节 药理学的任务和内容

药物 (drug) 是指用于治疗、预防和诊断疾病的化学物质, 是人类与疾病作斗争的重要武器。自然界存在的化学物质种类繁多, 但作为药物应用者为数有限。无论一种化学物质是来自于自然界的天然产物, 还是用化学方法制备的合成化合物, 乃至用生物工程技术获得的产品等, 如要使其成为药物, 以至能安全有效地用于临床, 必须首先经过大量的、极其严格的药理学研究。

#### (一) 药理学的任务

药理学 (pharmacology) 是研究药物与机体间相互作用规律的一门学科。它的任务主要是研究下列两方面问题:

1. 药物效应动力学 药物效应动力学 (pharmacodynamics) 简称药效学, 主要研究药物对机体的作用及其规律, 阐明药物防治疾病的机制。

2. 药物代谢动力学 药物代谢动力学 (pharmacokinetics) 简称药动学, 主要研究机体对药物的处置 (disposition) 的动态变化。包括药物在机体内的吸收、分布、生物转化 (或称代谢) 及排泄的过程, 特别是血药浓度随时间而变化的规律。

药效学和药动学两个过程是同时进行着, 并且有着相互的联系。药理学探讨这两方面的问题, 其目的在于: 充分发挥药物的治疗效果, 防治不良反应; 帮助医药卫生工作者合理用药; 为寻找新药提供线索; 也有助于阐明药物的作用机制, 进一步了解机体功能的生理生化过程的本质。

#### (二) 药理学的内容

药理学是基础医学与临床医学之间的桥梁科学, 也是药学与医学之间的桥梁科学。它运用生理学、生物化学、微生物学、免疫学等医学基础理论和知识, 运用药剂学、药物分析化学、合成药物化学、天然药物化学等药学基础理论和知识, 阐明药物对机体 (包括病原体) 的作用 (action) 和作用机制 (mechanism of action)、在临床上的主要适应证 (indication)、不良反应 (adverse reaction) 和禁忌证 (contraindication)、药物体内过程和用法等。

药理学研究是一门实验性的学科, 常利用生物体包括整体动物、麻醉动物、离体器官、组织、细胞或微生物培养等的实验方法, 在严格控制实验条件下, 观察药物的作用、毒副反应及药动学等。

由于在药物、食物与毒物之间并无绝对的界限, 如食盐、葡萄糖及维生素等均为食物成份。在人体缺乏上述物质时, 生理盐水、葡萄糖注射液和维生素等就成了药物。所有的药物用量过多都会引起毒性反应, 如充血性心力衰竭或高血压患者, 饮用过多的食盐或补给生理盐水过量, 反而会使原有的疾病加重。因此, 药物与毒物之间仅存在着剂



量的差别。对于研究药物对机体的毒性反应，中毒机制及其防治方法，尽管已形成一门独立的学科毒理学 (toxicology)，但它也是药理学研究不可缺少的内容之一。

对于新药研究，必须进行临床前的药理实验研究，充分了解其药效学、药动学作用规律及毒性后，才能申请临床试用。70年代以后，系以临床病人为研究和服务对象的应用学科——临床药理学 (clinical pharmacology) 迅速发展起来，它将药理学的基本理论和知识推向临床应用，并与临床应用技术结合起来，将药理效应转化为临床疗效，大大丰富了药理学的内容。因此，可把临床药理学看为基础药理学的后继部分。

### (三) 学习方法和要求

在药理学的学习方法上，要理论联系实际，在熟悉和掌握药物基本作用规律以后，熟悉药物按药理作用的分类；在分析每类药物共性的基础上，要全面掌握重点药物的作用、药动学特性、作用机制、主要用途、重要不良反应和禁忌证；再比较鉴别出同类的其他药物的特性。

在实验方面，要求掌握常用的整体动物实验、离体实验方法的原理及基本操作；仔细观察实验结果，逐步提高分析问题和解决问题的能力。

要学会查阅药理学文献和参考书的方法，以便为今后掌握更多的药学知识，及时进行知识更新，以适应药理学和新药研究、老药新用、临床合理用药及药物制剂改革等迅速发展的需要。

## 第二节 药理学的发展简史

《神农本草经》是我国最早的一部药物学著作，早在公元一世纪前后就系统地总结了我国古代劳动人民所积累的药物知识。该书收载药物 365 种，其中大部分药物至今仍广为应用，如大黄导泻、麻黄止喘、海藻治瘰、常山截疟等。唐代 (公元 659 年) 的《新修本草》，收载药物 844 种，是世界上第一部由政府颁布的药典。《新修本草》比西方最早的纽伦堡药典还早 883 年。明代 (公元 1596 年) 李时珍通过长期从事医药实践：行医、采药、考证、调查、总结用药经验等，写成的巨著《本草纲目》，分 52 卷，收载药物 1892 种，约 190 万字。他提出了科学的药物分类法，叙述药物的生态、形态、性味和功能，促进了祖国医药的发展。该书已受到国际医药界的广泛重视，分别被译成英、日、朝、德、法、俄、拉丁等国文字，对药物学的发展作出了杰出贡献。

药理学的建立和发展与现代科学技术的发展密切相关。在西方国家，有关药物的知识，起初也停留在药物学 (materia medica) 阶段。19 世纪初，由于化学、生物学及生理学的发展，德国 Sertürner (1804) 从阿片中提出吗啡，用狗实验证明有镇痛作用。法国 Magendi (1819) 和 Bernald (1856)，用青蛙做的经典实验，分别确定了土的宁作用于脊髓，筒箭毒碱作用于神经肌肉接头，阐明了它们的药理特点，为药理学的发展提供了可靠的实验方法。在此基础上，德国 Buchheim 及其 Schmiedberg (1832~1921) 创立了实验药理学，用动物实验方法，研究药物对机体的作用，分析药物的作用部位，从而对现代药理学的建立和发展作出了伟大贡献。

本世纪初，德国 Ehrlich (1909) 发现腓凡纳明 (606) 能治疗锥虫病和梅毒，从而开始用合成药物治疗传染病。以后，德国 Domagk (1935) 发现磺胺类可治疗细菌感染。英国 Florey (1940) 在 Fleming (1928) 研究的基础上，从青霉菌培养液中分离出青霉