

科學圖書大庫

藥理學

譯者 郭春祺 邱承英

徐氏基金會出版

科學圖書大庫

藥理學

譯者 郭春祺 邱承美



徐氏基金會出版

美國徐氏基金會科學圖書編譯委員會

科學圖書大庫

監修人 徐銘信 科學圖書編譯委員會主任委員
編輯人 林碧鏗 科學圖書編譯委員會編譯委員

版權所有

不許翻印

中華民國六十三年六月十五日三版

藥 理 學

基本定價 五元二角

譯者 郭春祺 台北婦幼醫院婦科主任
邱承美 淡江文理學院理學士

內政部內版臺業字第1347號登記證

出版者 財團法人臺北市徐氏基金會出版部 臺北郵政信箱3261號 電話783686號
發行人 財團法人臺北市徐氏基金會出版部 林碧鏗 郵政劃撥帳戶第15795號
印刷者 大興圖書印製有限公司 三宜市三和路四段151號 電話979739號 慧明打字排版公司

我們的工作目標

文明的進步，因素很多，而科學居其首。科學知識與技術的傳播，是提高工業生產、改善生活環境的主動力，在整個社會長期發展上，乃人類對未來世代的投資。從事科學研究與科學教育者，各就專長，竭智盡力，發揮偉大功能，共使科學飛躍進展，同把人類的生活，帶進更幸福、更完善之境界。

近三十年來，科學急遽發展之成就，已超越既往之累積，昔之認為絕難若幻想者，今多已成為事實。人類一再親履月球，是各種科學綜合建樹與科學家精誠合作的貢獻，誠令人有無限興奮！時代日新又新，如何推動科學教育，有效造就科學人才，促進科學研究與發展，允為社會、國家的基本任務。培養人才，起自中學階段，學生對普通科學，如物理、數學、生物、化學，漸作接觸，及至大專院校，便開始專科教育，均仰賴師資與圖書的啓發指導，不斷進行訓練。從事科學研究與科學教育的學者，志在貢獻研究成果與啓導後學。旨趣崇高，至足欽佩！

科學圖書是學人們研究、實驗、教學的精華，明確提供科學知識與技術經驗，本具互相啓發作用，富有國際合作性質，歷經長久的交互影響與演變，遂產生可喜的收穫。我國民中學一年級，便以英語作主科之一，然欲其直接閱讀外文圖書，而能深切瞭解，並非數年所可苛求者。因此，本部編譯出版科學圖書，引進世界科技新知，加速國家建設，實深具積極意義。

本基金會由徐銘信氏捐資創辦，旨在協助國家發展科學知識與技術，促進民生樂利。民國四十五年四月成立於美國紐約。初由旅美學人胡適博士、程其保博士等，甄選國內大學理工科優秀畢業生出國深造，前後達四十人，返國服務者十不得一。另贈國內大學儀器設備，輔助教學頗收成效；然審度衡量，仍嫌未能普及，乃再邀承國內外權威學者，設置科學圖書編譯委員會，主持「科學圖書大庫」編譯事宜。主任委員徐銘信氏為監修人，編譯委員林碧蓉氏為編輯人，各編譯委員擔任分組審查及校閱。「科學圖書大庫」首期擬定二千冊，凡四億言，叢書百種，門分類別，細大不捐；分為叢書，合則大庫。從事翻譯之學者五百位，於英、德、法、日文中精選最新基本或實

用科技名著，譯成中文，編譯校訂，不憚三復。嚴求深入淺出，務期文圖並茂，供給各級學校在校學生及社會大眾閱讀，有敎無類，效果宏大。賢明學人同鑑及此，毅然自公私兩忙中，撥冗贊助，譯校圖書，心誠言善，悉付履行，感人至深。其旅居國外者，亦有感於爲國人譯著，助益青年求知，遠勝於短期返國講學，遂不計稿酬菲薄，費時又多，迢迢乎千萬里，書稿郵航交遞，報國熱忱，思源固本，僑居特切，至足欽慰！

今科學圖書大庫已出版七百餘冊，都一億八千餘萬言；排印中者，二百餘冊，四千餘萬字。依循編譯、校訂、印刷、發行一貫作業方式進行。就全部複雜過程，精密分析，設計進階，各有工時標準。排版印製之衛星工廠十餘家，直接督導，逐月考評。以專業負責，切求進步。校對人員既重素質，審慎從事，復經譯者最後反覆精校，力求正確無訛。封面設計，納入規範，裝訂注意技術改善。藉技術與分工合作，建立高效率系統，縮短印製期限。節節緊扣，擴大譯校複核機會，不斷改進，日新又新。在翻譯中，亦三百餘冊，七千餘萬字。譯校方式分爲：(1)個別者：譯者具有豐富專門知識，外文能力強，國文造詣深厚，所譯圖書，以較具專門性而可從容出書者屬之。(2)集體分工者：再分爲譯、校二階次，或譯、編、校三階次，譯者各具該科豐富專門之知識，編者除有外文及專門知識外，尚需編輯學驗與我國文字高度修養，校訂者當爲該學門權威學者，因人、時、地諸因素而定。所譯圖書，較大部頭、叢書、或較有時間性者，人事譯務，適切配合，各得其宜。除重質量外，並爭取速度，凡美、德科學名著初版發行半年內，本會譯印之中文本，旋即出書，欲實現此目標，端賴譯校者之大力贊助也。

謹特掬誠呼籲：

自由中國大專院校教授，研究機構專家、學者，與從事科學建設之工程師；

旅居海外從事教育與研究學人、留學生；

大專院校及研究機構退休教授、專家、學者。

主動地精選最新、最佳外文科學名著，或個別參與譯校，或聯袂而來譯校叢書，或就多年研究成果，撰著成書，公之於世。本基金會樂於運用基金，並藉優良出版系統，善任傳播科學種子之媒介。祈學人們，共襄盛舉是禱！

譯 序

現代醫藥之進步，一日千里，其發展之速，實難以想像。往昔構成健康最大威脅之傳染性疾病，由於各種抗生素及免疫學製劑之發明，已被置於完全控制之下，不再成為人們恐懼的對象了。心臟血管病、腎臟病以及代謝病與機能退化等，在老人醫學的急速發展下，防治上亦獲得了重大成就。仍被視為絕症的癌症，在放射醫學及抗癌藥物的積極研究下，亦展露了解決的曙光。即使被認為最奧秘的精神現象，由於擬精神劑之出現，或可對精神狀態加以某種程度的控制，或可用於精神現象之探討，心智活動亦得以作科學的解釋，使此一久被劃為科學禁地之一環，從此為科學研究開放矣。

諸如此類，不單是科學家的輝煌成就，亦為人類文化活動之最大光榮。在為人類如此成就感到驕傲之餘，反觀我們對此一發展的供獻，則又令人不無尚待加倍努力之感。就醫藥方面教科書與參考書而言，創造性著作，固屬鳳毛麟角，即較新之外文翻譯本，亦罕有所見。致一般醫藥從業人員與修習醫藥及有關學科之學生，不得不孜孜於原文之鑽研，這即使不構成太大困難，亦難免在文字上浪費過多時間。時倍而功不著，其必然的結果，將使一部份人因循敷衍，在學者，食而不化，讀書不求甚解；執業者，對使用的藥物，只知因襲使用，不求進一步的瞭解，即對該藥物究竟為怎樣的化合物（化學構造），如何發揮醫療效果（作用機轉）等基本知識，亦多不甚了了。因此，一本閱讀方便，簡明扼要的參考書，實有迫切需要。本書即在此需求的鼓勵之下，從事遂譯。

藥學之翻譯，其最大困難厥為藥品之譯名。常用藥物有許多採用音譯者，這種譯法固屬方便，但有些場合，譯出來實在有不知所云之憾。因此，本書譯名，原則上以意譯為準，根據原文之字義字原譯出，其原出自組織器官者，則從組織器官譯之，如Epinephrine譯為腎上腺素，Heparin譯為肝素；由植物名稱衍化而來者，則從原植物名譯出，如Coumarin譯為香豆素，Ephedrine譯為麻黃素；其由化學名稱縮寫而來者，則以化學全名之縮寫譯出，如Phenelazine譯為苯乙肼，Phenprocoumon譯為苯丙脒香豆素。唯習用已久，普遍為人所熟知的音譯藥品，如阿斯匹林（Aspirin）等，則仍沿用舊譯。化學譯名，悉依教育部公佈化學命名原則，其不在該命名原則範圍之內者，則斟酌適切譯出，如有機鹼之鹽類具有「ium」字尾者

IV

，在其中譯之末一字加「金」字邊，以資識別，如Pyridine原譯吡啉，至Pyridinium則譯爲吡啶是。

本書倉促譯出，雖力求完美，但欠妥疏漏可議之處，尙望先進學者、同好諸君指正爲幸。

郭春祺

邱承美

五十九年八月誌

原 序

本版編訂的基本目的，和前一版一樣，在於將每類藥物的基礎知識編成一扼要的大綱，再加進一些新發展的並具有永久性的藥物。對於藥物的作用機轉(mechanism of action)，新藥及藥物的構造式，均曾給予特別的注意，這樣，可使讀者能夠把任何一種新藥立即排在既知的藥物分類中。

本書分爲三個主要部份：化學治療劑(chemotherapeutic agents)、作用於肢體的藥物(somatic agents)以及神經系統藥物(nervous system agents)。在每類藥物中，歷史最久的排在前面，然後是較新的；唯在索引中可按英文字母的順序查出每一藥物。參考文獻，除去每章章末列出者外，均以最短縮的形式插於各適當的章節空間中。

編者冀望這本簡短的小冊子，對於修習藥理學的學生，能夠發揮指導作用，並作爲大部頭教科書的有用補充，以及從事實際工作的醫師的簡便摘要。總之，本書的目的在提供學生一本簡要的縮本與醫師執業上的參考。

Henry W. Elliot 教授對本書的主要部份，尤其是有關作用於神經系統的藥物各節所作的澈底審閱，深表謝意。Marry C. Alessandri, Byron A. Barnes, Harold W. Brown, H. O. J. Collier, Joseph Jerome, Lloyd Miller, Harry Shirkey, Linwood F. Tice 以及 Frank A. Zeloski 諸君，亦提供極有助益的意見。

目 錄

譯 序	III
原 序	V
第一部 概 論	1
1. 藥物的作用	1
第二部 作用於外來侵入物的藥物	7
2. 化學治療	7
3. 磺胺類藥物	11
4. 青黴素	18
5. 紅黴素與青黴素代用品	29
6. 四環黴素及其他廣效抗生素	35
7. 鏈黴素類抗生素	41
8. 甙類與合成性結核病與麻瘋病治療劑	47
9. 其他抗菌藥物	57
10. 多肽抗生素	63
11. 抗黴菌藥物	67
12. 奎寧及合成性抗瘧藥物	71
13. 殺阿米巴藥	81
14. 重金屬	89
15. 金屬結合劑	95
16. 銻化合物及用於熱帶病的合成性藥物	105
17. 驅蟲劑	113
18. 癌的化學治療	123
19. 濾過性毒化學治療	139
20. 殺蟲劑、驅昆蟲劑及殺鼠劑	145
21. 局部用藥	155
第三部 用於身體系統之藥物	177
2.2 強心糖苷	177
2.3 奎尼丁及抗心律不整藥	187
2.4 利尿劑	193

25. 抑制腎小管的藥物	211
26. 液體：血液、血液代用品、電解質	215
27. 用於動脈硬化症的藥物	227
28. 降低血壓藥物	237
29. 平滑肌鬆弛劑	253
30. 平滑肌興奮劑	261
31. 用於貧血的藥物	273
32. 抗凝血劑及凝血劑	285
33. 用於消化道藥物	305
34. 診斷用藥	319
35. 用於免疫及免疫學疾病的藥物	331
36. 腎上腺皮質激素與促腎上腺皮質素	351
37. 甲狀腺及促甲狀腺激素	371
38. 性激素及促性腺激素；腦下垂體前葉	383
39. 用於糖尿病的藥物	407
40. 副甲狀腺激素與鈣代謝	417
41. 維生素	425
42. 用於營養及肥胖症的藥物	439
第四部 作用於神經系統的藥物	449
43. 交感神經興奮劑或腎上腺解藥	449
44. 交感神經抑制劑或交感神經解藥	467
45. 副交感神經興奮劑或膽素能藥物	475
46. 副交感神經抑制劑或抗膽素能藥物	485
47. 神經節藥物	501
48. 肌神經藥物	505
49. 肌肉鬆弛劑	521
50. 全身麻醉劑	527
51. 治療用氣體	541
52. 局部麻醉劑	545
53. 非麻醉性鎮痛劑	555
54. 麻醉性鎮痛劑	567
55. 鎮咳劑	583
56. 鎮靜劑及安眠劑	589

57. 抗驚厥劑	603
58. 安神劑	613
59. 興奮劑	631
60. 藥物成癮與酒精	647
61. 擬精神劑及影響精神的其他藥物	657

第一部 概 論

INTRODUCTION

1. 藥物的作用

THE ACTIONS OF DRUGS

在研究藥物 (drugs) 的作用時，一般地，首先考慮其所產生的藥理作用及其發生作用的機轉。

一、藥理作用

PHARMACOLOGICAL ACTIONS

藥物對整個有機體 (organism)，或特定器官 (organs)，或組織 (tissues) 所產生的效應，稱為藥理作用 (pharmacological actions)。例如，有機體可被興奮或被抑制——如被咖啡鹼 (coffeine) 所振奮，或為巴比特魯 (barbiturate) 所催眠是。

二、作用機轉

MECHANISMS OF ACTION

藥物的作用機轉，多可就細胞學的基礎來合理地加以解釋，亦即，由構造 (structure) 上的改變，來說明藥物的作用；如給予秋水仙鹼 (colchicine) 後，發生分裂中期 (metaphase) 細胞聚集；或者，發生功能 (function) 上的改變，如能 (energy) 及功 (work) 的產生，合成能力 (synthetic ability) 或細胞膜透過性 (membrane permeability) 的改變等，均可直接察見或測定之。就更為根本的化學基礎來看，雖然已經確立了某些作用機轉的原理，但大部份均所知者不夠完全。

【非酶性作用 (NONENZYMATIC)】 有些藥物以化學 (或物理) 的方式產生作用；例如，胃酸可被中和，血紅素可被 CO 去活化，金屬可

2 藥理學

被抑除劑 (sequestering agents) 所抓連 (chelated) 而失去作用等。

【酶性作用 (ENZYMATIC) 】 大部份藥物的作用機轉，顯示以酶 (enzymatic) 、輔酶 (coenzymatic) 或補充根 (prosthetic group) 的基礎發生作用，如下諸例。

1. 被解質相似性 (Substrate Resemblance) : 藥物可能與一種酶的被解質 (substrate) 相似，因此可與該種酶相結合，而妨害了被解質的代謝途徑；如此，可能阻害其全部功能，或形成無用的，甚至有害的產物。或者，藥物可使被解質免於分解，而使其具有延長的效果。凡與被解質具有相似性的藥物，稱為抗代謝劑 (antimetabolites) (Woolley, Science , 129,615,1959 ; Bovet , Science , 129,1255,1959) 。此等可能性可以圖 1 的圖解表示之。

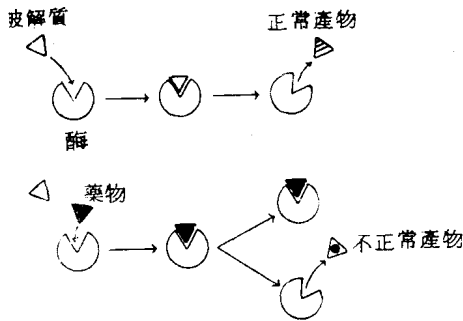


圖 1 藥物對酶性反應的作用

在上一圖解中，一單位被解質，進入一適宜酶的開口處而被轉變成一新的產物，然後被除去。

下一圖解中，被解質進入酶的途徑，為相似形狀的藥物所阻滯，藥物不是保留於被解質之內，就是生成不正常產物而被釋出。

2 在接受體的作用 (Action at Receptors) : 被解質的一個特例，是在接受體 (receptors) 亦為酶時，藥物所發生的作用。一種藥物可能使被解質藉第二種酶的作用，暫時免被分解，以使其對接受體產生較長時間的作用；例如新斯地明 (neostigmine) 束縛膽素脂酶 (cholinesterase) ，使乙酰膽素 (acetylcholine) 對其接受體具有時間較長且較為強烈的作用。

。或者，藥物可阻滯接受體，而切斷其所受之刺激，除非藥物與能夠刺激接受體的自然傳遞體 (natural transmitter) 極為相似，致其本身即可刺激接受體。凡藥物藉釋放傳遞體，阻斷破壞性酶，刺激接受體，或藉其他機轉產生或加強被解質的普通作用者，稱為擬似藥 (mimetic) ；例如，擬交感神經藥 (sympathomimetics) 所產生的作用，與天然兒茶酚胺 (catechol amine) 所產生者相似。這種作用機轉，可以圖 2 的圖解表示之。

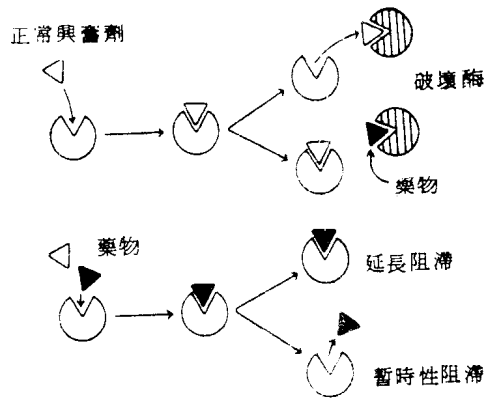


圖 2 藥物作用於接受體的表示圖

上圖為正常刺激物質進入接受體，結果發生刺激。當刺激物質被破壞性酶“擠”出接受體之後，刺激即行終止。藥物藉其破壞或阻斷破壞性酶作用而加強或延長刺激。

下圖為藥物進入接受體而把正常刺激物質排開，因而接受體可能被阻斷；或者，假如藥物與自然刺激物質足夠相似的話，亦可能發生刺激。因藥物而產生的阻斷（或刺激）可能為長期的，亦可能為暫時的，決定於其在接受體中保留時間的長短。

3. 補充根的改變 (Prosthetic Group Alternation) : 藥物可取代或改變酶的補充根，使其失去作用。例如，HCN 可與細胞色素氧化酶 (cytochrome oxidase) 中 Fe 的游離價 (free valences) 相結合，而使之失去活性，但却不與卟啉核 (porphyrin nucleus) 相結合。

如前所述，與被解質具有相似性的藥物，與輔酶具有相似性並與之競爭的藥物，亦均稱為抗代謝劑。

4 藥理學

4 蛋白質改變 (Protein Alteration) : 藥物可改變酶的蛋白質構造 ; 例如 , 砷 (arsenic) 可與 $-SH$ 根結合 , 結果導致蛋白質發生扭曲。

【酶干擾的程度或性質 (DEGREE OR QUANTITY OF ENZYMIC INTERFERENCE) 】 干擾可為暫時性的 , 也可為永久性的 , 其機轉不盡相同 , 但下列三類大致可概括其主要的範疇 :

1. 競爭性干擾 (Competitive Interference) : 一種被解質 (或輔酶) 與藥物競爭使用同一酶。每一實例中 , 與酶的結合為可逆的。是故 , 其最後的平衡 , 決定於媒質 (medium) 中被解質與藥物的相對濃度。 (質量作用定律) 。磺胺藥物 (sulfonamides) 對於對氨基苯甲酸 (P - aminobenzoic acid) 的干擾 , 即明顯地屬於這一類。同類競爭性干擾 , 與濃度具有相當程度的關係。

2. 非競爭性干擾 (Noncompetitive Interference) : 藥物或多或少地與酶呈牢固的結合 , 而且 , 即使有過量的被解質 , 亦不易將藥物取代。

3. 不同的接受體 (Different Receptors) : 當具有相反作用的不同接受體 , 可被一競爭性藥物所刺激時 , 競爭可能出於藥理的而非化學的。這種情形 , 見於當瞳孔被散瞳劑所擴大時 , 可被縮瞳劑所收縮。

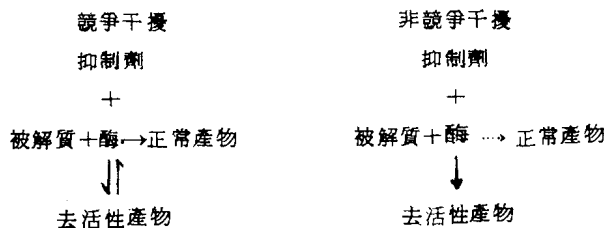


圖3 競爭性與非競爭干擾

左 : 在競爭性干擾中 , 被解質與抑制劑競爭 , 但干擾可為過量被解質所逆轉 , 因並未失去活性。通常在被解質與抑制劑之間 , 具有相似性。

右 : 在非競爭性干擾中 , 過量的被解質將不能逆轉抑制作用 , 因酶被持久地去活性 (最少對此一被解質 , 不一定對其他被解質) 。抑制劑常為一抓連金屬 , (chelating metal) , 如 Hg ; 但此抑制作用 , 可能為其他藥劑 , 如 BAL , 所逆轉 , 因其對 Hg 具有較大的親合性。

三、治療應用的其他必需條件

OTHER REQUIREMENTS FOR THERAPEUTIC USE

爲了能夠發生效力，一種藥物不但需要產生具有活性的特殊化學組態 (conformation)，同時，需要幾種第二特徵 (secondary characteristics)，如必須能夠達於其作用的部位，不致產生不能接受的毒性，必須能夠被充份排泄等。

【吸收 (ABSORPTION)】

由腸胃道或體表的吸收爲一被動的過程，脂溶性 (lipoid solubility) 與非離子化 (nonionization) 可能使之有利於吸收。

水溶性 (aqueous solubility) 有利於輸液注射後的吸收。

【分佈 (DISTRIBUTION)】

1. 吸收後的藥物，可隨水的分佈而被帶至全身；或者，因不能通過特殊膜，由各種器官將之自血流中抽出，或被局部酶所破壞，而使其分佈受到限制。

2. 藥物通過細胞膜，藉擴散作用 (diffusion) 或主動唧噥作用 (active pumping) 而進出細胞。

(a) 高脂溶性或常脂溶性成分、低離子化、或無血漿蛋白的結合等，均有利於擴散。

(b) 相反地，主動傳遞 (active transport)，則需要特異酶與能的損耗，以對抗擴散的成分而傳遞藥物。水溶性且能呈離子化的藥物，常可藉此一方式通過細胞膜。通過細胞的主動傳遞包括三個步驟：由血漿擴散於細胞；有些藥物在細胞內與蛋白質結合，使其濃度增加 (高達 100 倍)；藉主動機轉自細胞排出，進入另一媒質中。

3. 血腦柵 (blood-brain barrier) 能限制很多藥物進入中樞神經系統，因此具有特別重要性。大多數藥物進入大腦，不論是包圍毛細血管的星狀細胞 (astrocytes) 或是脈絡膜叢 (choroid plexus) 的固形細胞層，均顯示依賴於對完整細胞的通過。大多數藥物的進入大腦，係藉被動擴散 (passive diffusion)，如通過一脂質篩膜；但，有的則具有特殊的傳遞機轉，而且對另一些藥物並無柵的存在 (Wilson, J. Pharmacol & Exper. Ther., 133. 332. 1961)。

【代謝轉變 (METABOLIC TRANSFORMATION)】

轉變包括氧化 (oxidation)、還原 (reduction)、水解 (hydrolysis)、去水 (dehydration)、烷基化 (alkylation)、醯胺化 (amidation)、結合 (conjugation)、乙醯化 (acetylation) 等。

藥物大部份的轉變，均促進或加速排泄，有的偶或增加毒性 (例如磺胺

類的乙醯化)。

假如藥物在體內需要時間藉代謝過程行化學轉變以使之成功一種活性式 (active form) 時，則其作用可能被延緩。

【儲存 (STORAGE)】

藥物可與血漿卵蛋白 (plasma albumin)、脂肪 (fat)、骨 (bone)、肝細胞 (liver cells)、腎細胞 (kidney cells)、膠原 (collagen) 或其他組織相結合而儲存，與血漿成分相平衡，在被釋出之前呈非活性 (inactive) 式。

藥物亦可在角蛋白 (keratin) 形成中而儲存 (As, Sb, griseofulvin)，而不與血漿中者相平衡。

【毒性 (TOXICITY)】

藥物的毒性必須低至能夠使用其有足夠劑量。

毒性可能因代謝缺陷、排泄缺陷、或過敏性敏感而加強其毒性。

毒性作用有兩種型式：

1. 藥理學毒性：因劑量的增加而使其效力呈直線增加。

2. 特異質 (idiosyncrasy)：與藥理作用無關，但與過敏性、遺傳的異常或其他不尋常的原因有關；除去統計學的統計而外，別無其他方法可以預測。

【排泄 (EXCRETION)】 排泄途徑包括腎臟的腎小球過濾作用 (glomerular filtration) 或腎小管排泄作用 (tubular excretion)。經由糞便的排泄，係來自分泌於膽汁 (bile) 中而排於小腸者。肺及皮膚亦可排泄某些藥物。

排泄的途徑並不十分重要，只要能足以保持足夠的治療水準，並防止藥物或其代謝物在血液中聚集即可。排泄的緩慢，有利於有效治療血中濃度的達成與保持。