

PHARMACOLOGY

药理学

葛喜珍 刘建明 主编

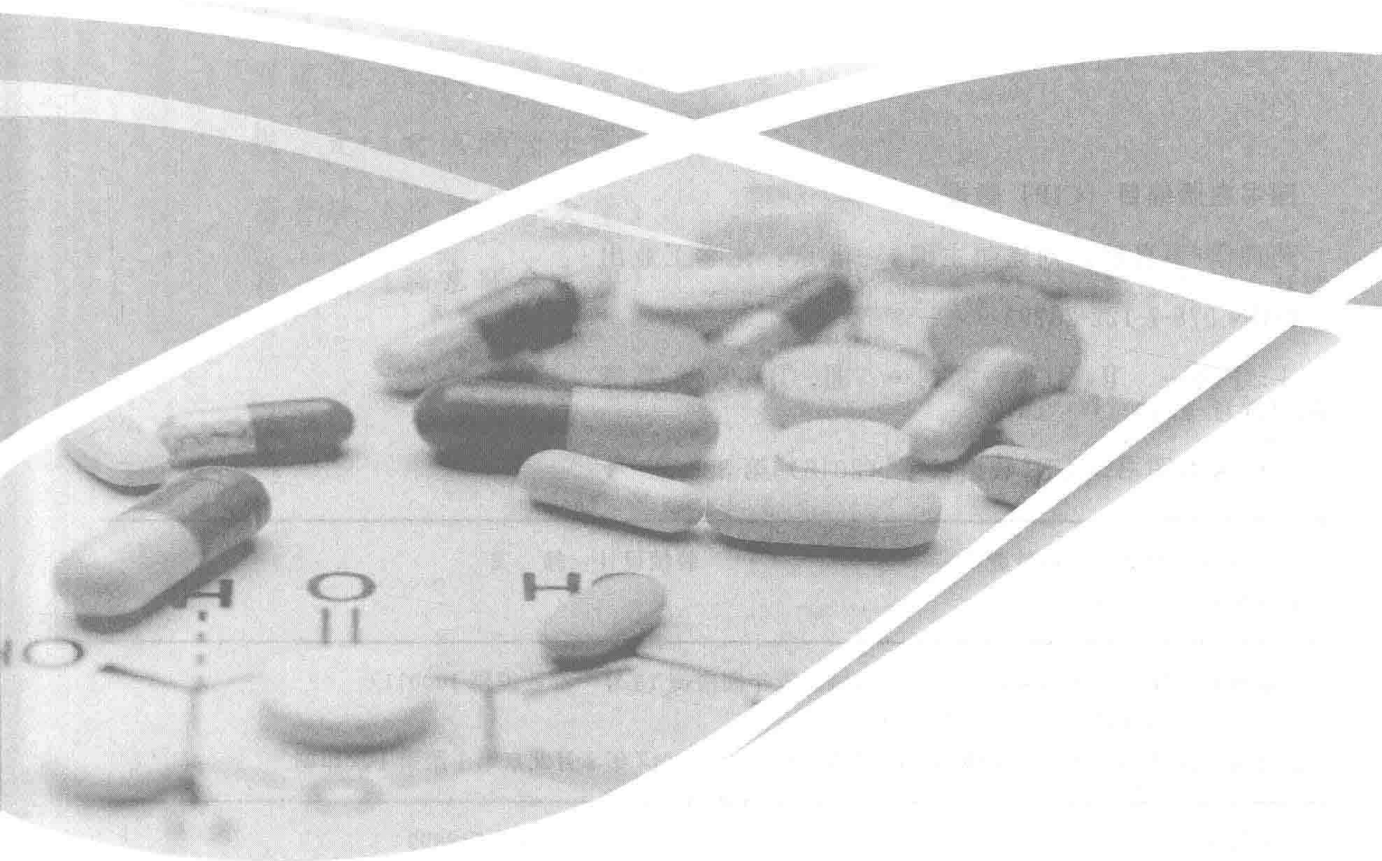


化学工业出版社

PHARMACOLOGY

药理学

葛喜珍 刘建明 主编



《药理学》共分 44 章，内容涵盖西药药理和部分中药药理，重点介绍了药物的药理作用、临床应用和不良反应等基本理论和基本知识，增设了与药物共同机制相关的基本知识、典型代表药物的小常识、药物的最新上市情况。

本书可供高等学校药学类、药品制造类、护理类专业师生作为教材使用，也可供医药及相关行业工作者参考。

图书在版编目 (CIP) 数据

药理学/葛喜珍, 刘建明主编. —北京: 化学工业出版社, 2017.2

ISBN 978-7-122-28793-9

I. ①药… II. ①葛…②刘… 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 (2016) 第 321385 号

责任编辑: 李植峰 章梦婕

装帧设计: 韩 飞

责任校对: 宋 夏

出版发行: 化学工业出版社 (北京市东城区青年湖南街 13 号 邮政编码 100011)

印 装: 高教社 (天津) 印务有限公司

787mm×1092mm 1/16 印张 19¼ 字数 482 千字 2017 年 3 月北京第 1 版第 1 次印刷

购书咨询: 010-64518888 (传真: 010-64519686) 售后服务: 010-64518899

网 址: <http://www.cip.com.cn>

凡购买本书, 如有缺损质量问题, 本社销售中心负责调换。

定 价: 42.00 元

版权所有 违者必究

《药理学》编写人员名单

主 编 葛喜珍 刘建明

副主编 王 丽 冯 里

编 者（按姓名笔画排序）

王 丽（黑龙江农业经济职业学院）

冯 里（连云港中医药高等职业技术学校）

冯淑华（北京联合大学）

李可意（北京联合大学）

刘建明（江西医学高等专科学校）

张 元（北京联合大学）

葛喜珍（北京联合大学）

霍 清（北京联合大学）

前言



本书是由一线教师根据高等学校教学要求、学生学习特点和工作需求编写而成。教材紧扣高等学校教育的培养目标，特别注意实用性与拓展性，删繁就简，突出重点，可供高等学校药学、药品制造、护理等专业类使用，也可供临床医护工作人员参考。

全书共分 44 章，在重点介绍药物的药理作用、临床应用和不良反应等基本理论和基本知识的基础上，结合药学类专业的实际应用，增设了与药物共同机制相关的基本知识、典型代表药物的小常识、药物的最新上市情况；也重点介绍了一线用药，主要包括药物禁忌证、药物相互作用和配伍禁忌、制剂及用法等内容。同时对重点章节进行归纳列表，以利于学生复习总结，为临床用药打下良好基础。

本教材采用文字叙述与图表相结合的形式编写，内容简练、主次分明、深入浅出，多数章节给出了 3~5 道思考题和是非题，以培养学生分析问题和解决问题的能力。

本书由葛喜珍、刘建明主编并审核所有稿件，参加编写和组织工作的还有王丽、冯里、霍清、冯淑华、李可意和张元。其中是非题由葛喜珍编写提供。

本书在编写过程中参考了部分相关资料和书籍，在此不一一列举（详见参考文献）。借本书出版之际，编者谨向有关作者及单位表示真诚的感谢。

由于编者水平有限，书中难免有不妥和疏漏之处，恳请专家和读者不吝赐教，我们将深为感激。

编者
2016 年 12 月



第一章	绪论	1
	一、药理学的性质与任务	1
	二、药物基本目录、处方及非处方药	1
	三、药理学的形成与发展	2
	四、新药的研究与开发	3
	习题	5
第二章	药物效应动力学	6
	第一节 药物作用及主要类型	6
	第二节 药物的作用机制	8
	第三节 药物的量效关系	9
	习题	11
第三章	药物代谢动力学	12
	第一节 药物的转运	12
	第二节 药物的体内过程	13
	第三节 药代动力学基本概念及参数	16
	习题	20
第四章	影响药物作用的因素及合理用药	21
	第一节 影响药物作用的因素	21
	第二节 机体对药物反应性的变化	22
	第三节 合理用药	23
	习题	24
第五章	传出神经系统药物概论	25
	一、神经系统解剖学基础	25
	二、神经元及其之间的相互作用方式	25

三、传出神经系统的分类与组成	26
四、作用于传出神经系统的药物	30
习题	31

第六章 拟胆碱药 33

第一节 胆碱受体激动药	33
第二节 胆碱酯酶抑制药	36
习题	38

第七章 抗胆碱药 40

第一节 M 胆碱受体阻断药	40
第二节 N 胆碱受体阻断药	43
习题	44

第八章 拟肾上腺素药 46

第一节 α 受体激动剂	46
第二节 α 、 β 受体激动剂	47
第三节 β 受体激动剂	50
习题	52

第九章 抗肾上腺素药 53

第一节 α 受体阻断药	53
第二节 β 受体阻断药	54
习题	55

第十章 中枢神经系统药理学概论 57

一、中枢神经递质及其受体	57
二、中枢神经系统药的分类	58
三、中枢神经系统药物作用的基本方式	58

第十一章 镇静催眠药 59

第一节 苯二氮草类	59
第二节 巴比妥类	61
第三节 其他类镇静催眠药	63
习题	63

第十二章 解热镇痛抗炎药 65

第一节 概述	65
第二节 常用药物	67
第三节 常用复方制剂	71
习题	72

第十三章 麻醉性镇痛药 73

第一节 阿片受体激动剂	74
第二节 阿片受体部分激动剂	77
第三节 其他类镇痛药	77
第四节 阿片受体拮抗剂	78
习题	78

第十四章 抗精神失常药 80

第一节 抗精神病药	80
第二节 抗抑郁症药	83
习题	84

第十五章 抗帕金森病药 85

第一节 拟多巴胺药	85
第二节 中枢抗胆碱药	87
习题	87

第十六章 抗癫痫药和抗惊厥药 88

第一节 抗癫痫药	88
第二节 抗惊厥药	90
习题	90

第十七章 治疗慢性心功能不全药 92

第一节 概述	92
第二节 常用药物	93
习题	95

第十八章 抗心绞痛药 97

第一节 概述	97
--------------	----

第二节 常用药物	97
习题	99

第十九章 抗高血压药 101

第一节 抗高血压药的分类	101
第二节 常用抗高血压药	101
第三节 其他抗高血压药	104
习题	107

第二十章 利尿药和脱水药 108

第一节 利尿药	108
第二节 脱水药	111
习题	112

第二十一章 抗心律失常药 114

第一节 心律失常的电生理学基础	114
第二节 常用抗心律失常药	116
习题	120

第二十二章 作用于消化系统的药物 122

第一节 抗消化性溃疡药	122
第二节 助消化药	127
第三节 泻药与止泻药	128
第四节 止吐药	130
习题	131

第二十三章 作用于呼吸系统的药物 133

第一节 镇咳药	133
第二节 祛痰药	134
第三节 平喘药	136
习题	139

第二十四章 抗动脉粥样硬化药和降血脂药 140

第一节 调血脂药	140
第二节 抗氧化剂	143

第三节	多烯脂肪酸类·····	144
第四节	保护动脉内皮药·····	144
习题	·····	145

第二十五章 作用于血液及造血系统药 146

第一节	促凝血药·····	146
第二节	抗凝血药·····	148
第三节	抗血小板药·····	150
第四节	抗贫血药·····	151
第五节	促进白细胞增生药·····	153
第六节	血容量扩充药·····	154
习题	·····	154

第二十六章 自体活性物质和组胺及组胺受体阻断药 155

第一节	膜磷脂代谢产物类药物及 5-羟色胺类药物 ·····	155
第二节	组胺和抗组胺受体药物·····	156

第二十七章 肾上腺皮质激素类药物 158

第一节	糖皮质激素·····	158
第二节	促肾上腺皮质激素及皮质激素抑制药·····	162
习题	·····	163

第二十八章 胰岛素及口服降血糖药 164

第一节	胰岛素·····	164
第二节	口服降血糖药·····	166
习题	·····	167

第二十九章 甲状腺激素及抗甲状腺药 169

第一节	甲状腺激素·····	169
第二节	抗甲状腺药·····	170
习题	·····	172

第三十章 性激素类药及避孕药 173

第一节	雌激素类药及雌激素拮抗药·····	173
第二节	孕激素类药·····	174

第三节	雄激素类药和同化激素类药	175
第四节	避孕药	177
习题		179

第三十一章 抗病原微生物药物概论 180

一、常用术语	180
二、抗菌药物的作用机制	181
三、细菌耐药性	182
习题	183

第三十二章 β -内酰胺类抗生素 184

第一节	概述	184
第二节	青霉素类	186
第三节	头孢菌素类	189
第四节	其他 β -内酰胺类抗生素	191
习题		192

第三十三章 合成抗菌药 193

第一节	喹诺酮类	193
第二节	磺胺类	197
第三节	硝咪唑类	200
习题		201

第三十四章 氨基糖苷类与多肽类抗生素 202

第一节	氨基糖苷类抗生素	202
第二节	多肽类抗生素	204
习题		206

第三十五章 大环内酯类、林可霉素类抗生素 207

第一节	大环内酯类抗生素	207
第二节	林可霉素类抗生素	209
习题		209

第三十六章 四环素类及氯霉素类抗生素 211

第一节	四环素类	211
-----	------	-----

第二节 氯霉素类.....	212
习题.....	214

第三十七章 抗病毒药和抗真菌药 215

第一节 抗病毒药.....	215
第二节 抗真菌药.....	218

第三十八章 抗结核病药及抗麻风病药 220

第一节 抗结核病药.....	220
第二节 抗麻风病药.....	224

第三十九章 抗疟药 227

第一节 概述.....	227
第二节 常用抗疟药.....	227

第四十章 抗阿米巴病药及抗滴虫病药 231

第一节 抗阿米巴病药.....	231
第二节 抗滴虫病药.....	233

第四十一章 抗肠蠕虫药 234

第一节 常用抗肠蠕虫药.....	234
第二节 抗肠蠕虫药的制剂和用法.....	236

第四十二章 影响免疫功能的药 238

第一节 概述.....	238
第二节 常用免疫抑制药.....	238
第三节 常用免疫调节药.....	241
第四节 影响免疫功能的药物的临床应用.....	243
习题.....	244

第四十三章 抗恶性肿瘤药 245

第一节 概述.....	245
第二节 常用的抗肿瘤药物.....	247
第三节 抗肿瘤药物的联合应用和毒性反应.....	255

习题.....	256
---------	-----

第四十四章	中药药理	258
-------	------	-----

第一节	解表药.....	258
第二节	清热药.....	264
第三节	活血化瘀药.....	267
第四节	补虚药.....	271
第五节	止血药.....	281
第六节	利水渗湿药.....	283
第七节	理气药.....	283
第八节	温里药.....	285
第九节	平肝息风药.....	286
第十节	泻下药.....	287
第十一节	祛风湿药.....	288

附录一	阅读药品说明书的注意事项	290
-----	--------------	-----

附录二	常用的药物剂型	291
-----	---------	-----

参考文献	294
------	-----

第一章 绪论

一、药理学的性质与任务

药物 (drug) 是指能影响机体细胞的生理、生化或病理过程, 并用以预防、治疗和诊断疾病的化学物质或其制剂, 包括避孕药及保健药。药物经加工制成便于患者使用、符合治疗要求、能安全运输和贮存的各种剂型称制剂。

药物来源在古代主要包括植物、动物和矿物。现代药物主要包括天然产物的活性成分、人工合成药及其生物制剂。

药理学 (pharmacology) 是研究药物的学科之一, 它是研究药物与机体 (包括病原体) 间相互作用规律及其作用原理, 为临床合理用药、防治疾病提供基本理论的医学基础学科。药理学一方面研究在药物影响下机体细胞功能如何发生变化, 另一方面研究药物本身在体内的过程, 即机体如何对药物进行处理, 前者称为药物效应动力学, 简称“药效学”; 后者称为药物代谢动力学, 简称“药动学”。

药理学研究的主要对象是机体, 属于广义的生理科学范畴。它与主要研究药物本身的药理学, 如生药学、药物化学、药剂学、制药学等学科有着明显的区别。药理学是以生理学、生物化学、病理学等为基础, 为指导临床各科合理用药提供理论基础的桥梁学科。药理学的学科任务是要为阐明药物作用机制、改善药物质量、提高药物疗效、开发新药、发现药物新用途并为探索细胞生理、生化及病理过程提供实验资料。

二、药物基本目录、处方及非处方药

基本药物是能满足基本医疗卫生需求, 剂型适宜、保证供应、基层能够配备、国民能够公平获得的药品, 其主要特征是安全、必需、有效、价廉。基本药物目录中的药品包括化学药品、生物制品、中成药。不纳入国家基本药物目录遴选范围的药品包括: 含有国家濒危野生动、植物药材的; 主要用于滋补保健作用, 易滥用的; 非临床治疗首选的; 因严重不良反应, 国家食品药品监督管理部门明确规定暂停生产、销售或使用的; 违背国家法律、法规, 或不符合伦理要求的。

处方药简称“Rx 药”, 是必须凭执业医师或执业助理医师处方才可调配、购买和使用的药品。这种药通常都具有一定的毒性及其他潜在的影响, 用药方法和时间都有特殊要求, 必须在医生指导下使用。普通处方用白色纸张书写; 急诊处方用淡黄色纸张书写, 右上角标注“急诊”; 儿科处方用淡绿色纸张书写, 右上角标注“儿科”; 麻醉药品和第一类精神药品处方用淡红色纸张书写, 右上角标注“麻、精一”; 第二类精神药品处方用白色纸张书写, 右上角标注“精二”。普通处方、急诊处方、儿科处方保存期限为 1 年, 医疗用毒性药品、第二类精神药品处方保存期限为 2 年, 麻醉药品和第一类精神药品处方保存期限为 3 年。

非处方药又称柜台发售药品 (over the counter drug), 简称“OTC 药”, 是不需要凭医师处方即可自行判断、购买和使用的药品。这类药毒副作用较少、较轻, 而且也容易察觉,

不会引起耐药性、成瘾性，与其他药物相互作用也小，在临床上使用多年，疗效肯定。非处方药主要用于病情较轻、稳定、诊断明确的疾病。总之，非处方药属于可以在药店购买的药品，要遵循见病服药、对症服药、明白服药、依法（用法、用量）服药。



小资料

甲、乙类非处方药

非处方药分为甲类非处方药和乙类非处方药两种，分别使用红色和绿色的“OTC”标志。甲类非处方药不需医生处方就可以购买和出售，但必须在药店出售，并在药师指导下使用；乙类非处方药有着长期安全使用的记录，除药店外，还可在药监部门批准的宾馆、商店等商业企业中零售。无论甲类非处方药还是乙类非处方药，在经过审批之后都可以在大众媒体上发布宣传广告。



小资料

药品商品名、通用名

一种药品常有多个厂家生产，许多药品生产企业为了树立品牌，往往给自己的药品注册独特的商品名以示区别，因此同一药品可以有多个商品名。例如，对乙酰氨基酚复方制剂的商品名就有百服宁、泰诺林、必理通等。患者在用药时，不论商品名称是什么，都要认准通用名，即药品的法定名称，也就是国家标准规定的药品名称。依据《中华人民共和国商标法》规定，通用名不能作为商标或商品名注册，因此通用名可以帮助识别药品，避免重复用药。《中华人民共和国药品管理法》和《药品说明书和标签管理规定》（国家食品药品监督管理局令第24号）规定，在药品包装上或药品说明书上应标有药品通用名。

三、药理学的形成与发展

药理学的形成大致可分为两个阶段，即药物学（本草学）阶段和药理学阶段。现代药理学是从药物学（本草学）的基础上发展起来的。

（1）药物学（本草学）阶段 从公元前1世纪的《神农本草经》至明朝的《本草纲目》，是通过口尝身受、实际体验的方法，用朴素的唯物论解释药物的作用（以“四气五味”表述作用性质，以归经学说表述作用部位），并对药物进行筛选和评定，对药物的生态、形态、性味、功能和应用进行记载，在我国劳动人民同疾病作斗争中起到了重要的作用。

（2）药理学阶段 药理学真正成为一门现代科学是从19世纪开始的，Buchheim在德国建立了第一间药理实验室，写出了第一本药理学教科书，也是世界上第一位药理学教授。药理学通过现代科学技术，用科学的理论解释药物的作用，深度发展出现了生化药理学、分子药理学等。化学的发展使人们能从植物药中提取有效成分和合成新药。生物化学在药理学的发展中也具有极其重要的意义。激素、维生素的药理学就是生物化学发展的成果，尤其是近代的理论研究（如受体学说、药物代谢等）都是靠生物化学的理论和技術发展起来的。生物化学的进步为药理学的发展提供了可靠的科学方法，使人们能够观察药物对生理功能的影响，从而打破了药物作用的神秘观点。随着生物化学和分子生物学的发展，药理学从整体、器官、细胞和亚细胞水平进入到分子水平。而随着自然科学的相互渗透，又出现了一系列药理学与其他学科之间的边缘学科，如临床药理学、精神药理学、免疫药理学、时辰药理

学等。

四、新药的研究与开发

新药研究、开发的过程就是从新化合物的发现到新药成功上市的过程，是一项相当复杂而系统的技术创新工程，是一个由分子生物学、生物化学、有机化学、计算机化学、药理毒理学和临床医学等多学科合作来完成的集体项目。须通过严格的科学试验研究，证明药物的有效性和安全性，并进行严格的科学审查，从而取得国家食品药品监督管理局发给的允许上市的证明文件。具体过程包括药物从发现、筛选有效成分或结构式的确定开始，经过临床前研究、临床研究、审批注册和上市，属于高科技的创新性研究，具有系统性、集成性、动态性等特点。

(一) 临床前研究

在第一阶段的研究方案完成后即可开展临床前研究。临床前研究应当执行《药物非临床研究质量管理规范》(good laboratory practice, GLP)。临床前研究内容包括药物进入临床研究之前所进行的化学合成或天然产物提纯研究、药物分析研究、药效学、药动学和毒理学研究以及药剂学的研究。具体包括以下内容。

1. 新药的药学研究

新药的药学研究主要包括工艺路线、结构确证、质量稳定性和质量标准等研究。

(1) 工艺路线 由合成、半合成、天然产物中提取的单体或组分，均要说明其制备工艺、路线的依据并附参考资料，如制剂应详细叙述制备工艺及在制备贮存过程中可能产生的降解产物。

(2) 结构确证 采用元素分析、红外分光光度法、紫外分光光度法、核磁共振、质谱等方法确证结构。若为高分辨质谱可免做元素分析。

(3) 稳定性研究 为了保证药物的安全有效，必须稳定。这就要求探讨药物的变化条件、途径、速度和机制，找出延缓变化过程的方法，制定出合适的有效期，因此新药申请必须呈报有关稳定性的研究情况。

(4) 制定质量标准 应根据生产工艺中可能带入的杂质，而有针对性地进行检查(如副反应产物、分解物、未反应的原料中间体、异构体、残留溶剂等)。

2. 新药的临床前药理研究

新药的临床前药理研究包括主要药效学研究、一般药理学研究、药代动力学研究和毒理学研究。

(1) 主要药效学研究 应根据新药的不同药理作用，按该类型药品评价药效的研究方法和判断标准进行。原则是新药的主要药效作用应当用体内和体外两种试验方法获得证明。各种试验，均应有空白对照和已知药品对照；应当有两种以上剂量及不同的给药方法。溶于水的物质应做静脉注射。

(2) 一般药理学研究 包括神经系统、心血管系统及呼吸系统的药理研究。如为复方则要求证明在药效和毒副作用方面具有一定的优点。

(3) 药代动力学研究 主要研究新药的吸收速率、吸收程度，在体内重要器官的分布和维持情况，以及排泄的速度和程度等。通过这方面的研究以提供新药的生物利用度、体内半衰期、血药浓度、特殊亲和作用、蓄积作用等资料，可为早期临床选择适宜剂量和给药方案提供依据。

(4) 毒理学研究 主要明确新药的毒性强度、毒性发展过程、是否可逆以及有关的预防措施，为估计人的耐受剂量范围、选择临床使用最佳剂量、提示临床可能出现的中毒反应症状及其可能的毒副作用提供资料。毒理学研究包括全身毒性、局部毒性、长期毒性、特殊毒性（致畸、致突变、致癌等“三致”实验和药物依赖性试验）等。

通过上述研究，应当对临床前的药理、毒理作出明确的结论和评价，突出说明新药的药效、主要的药理和毒理作用，提出临床适用的范围，指出该药在临床研究中可能出现的不良反应及应重点观察的不良反应。

(二) 临床研究

临床前研究工作完成后，整理报批资料。由研究单位独立或与其他单位一起向药品监督管理部门提出申请，按程序进行临床试验的申请与报批。得到国家食品药品监督管理局（CFDA）的正式批文后，按批文的规定内容和现行的《药物临床试验质量管理规范》（good clinical practice, GCP）规定，进行临床试验（包括生物等效性试验）。根据《药品注册管理办法》的规定，申请新药注册应当进行临床试验。临床试验分为Ⅰ期、Ⅱ期、Ⅲ期、Ⅳ期。

(1) Ⅰ期临床试验 初步的临床药理学及人体安全性评价试验。观察人体对于新药的耐受程度和药代动力学，为制定给药方案提供依据。

(2) Ⅱ期临床试验 治疗作用初步评价阶段。其目的是初步评价药物对目标适应症患者的治疗作用和安全性，也包括为Ⅲ期临床试验研究设计和给药剂量方案的确定提供依据。此阶段的研究设计可以根据具体的研究目的，采用多种形式，包括随机盲法对照临床试验。

(3) Ⅲ期临床试验 治疗作用确证阶段。其目的是进一步验证药物对目标适应症患者的治疗作用和安全性，评价利益与风险的关系，最终为药物注册申请的审查提供充分的依据。试验一般应为具有足够样本量的随机盲法对照试验。

(4) Ⅳ期临床试验 新药上市后应用研究阶段。其目的是考察在广泛使用条件下的药物的疗效和不良反应，评价在普通或者特殊人群中使用的利益与风险关系以及改进给药剂量等。

生物等效性试验，是指用生物利用度研究的方法，以药代动力学参数为指标，比较同一种药物的相同或者不同剂型的制剂，在相同的试验条件下，其活性成分吸收程度和速度有无统计学差异的人体试验。

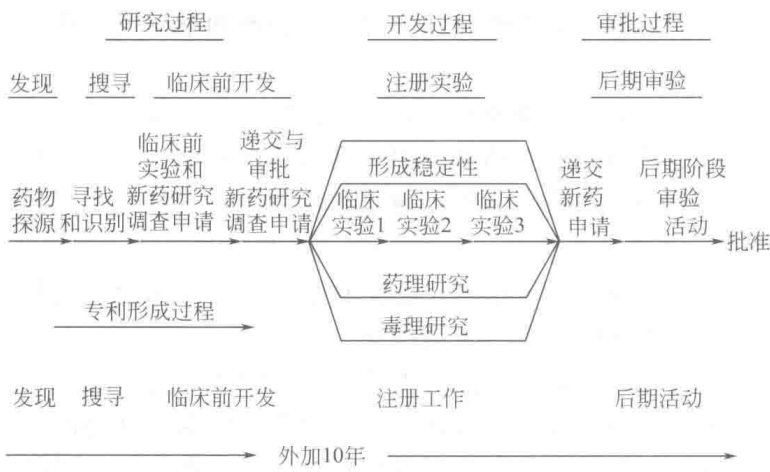


图 1-1 新药开发流程