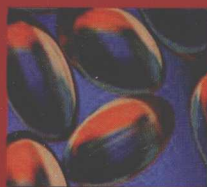
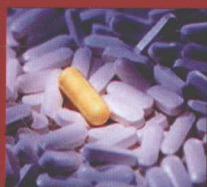


图解药理学系列教材

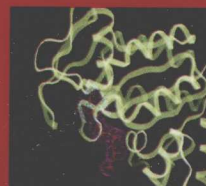
(供临床、药学、基础、预防、中西医结合、护理等专业使用)

图 解

药 理 学



PHARMACOLOGY



主 编 李海涛 花建华 许惠琴

黑龙江人民出版社

图解药理学系列教材

(供临床、药学、基础、预防、口腔、检验、护理等专业用)

图 解

药 理 学

主 编: 李海涛 (南京中医药大学)

花建华 (中国药科大学)

许慧琴 (南京中医药大学)

副主编: 许 立 (南京中医药大学)

卢金福 (南京中医药大学)

编 者: (按姓氏笔画排列)

王宇华 (南京中医药大学)

卢金福 (南京中医药大学)

许惠琴 (南京中医药大学)

许 立 (南京中医药大学)

李海涛 (南京中医药大学)

花建华 (中国药科大学)

何 玲 (中国药科大学)

张 良 (南京中医药大学)

周玲玲 (南京中医药大学)

陈丁丁 (中国药科大学)

袁冬平 (南京中医药大学)

喻 斌 (南京中医药大学)

学生编者: (按姓氏笔画排列) (南京中医药大学)

王光耀 王 黎 史丽萍 刘莲芳 华翠娥 邢 俊 冷文娟

杨 澜 陈 雯 徐文婷 顾 颖 顾立梅 曹 怡

黑 龙 江 人 民 出 版 社

Hei Long Jiang People's Publishing House

图书在版编目 (CIP) 数据

图解药理学 / 李海涛, 花建华, 许惠琴主编. — 哈尔滨: 黑龙江人民出版社, 2008.11
ISBN 978-7-207-08027-1

I. 图… II. ①李…②花…③许… III. 药理学—图解 IV.R96-64

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2008) 第 181173 号

责任编辑: 徐 冲

装帧设计: 张晓薇

图解药理学

主编 李海涛 花建华 许惠琴

出版发行 黑龙江人民出版社

通讯地址 哈尔滨市南岗区宣庆小区 1 号楼

邮 编 150008

网 址 www.longpress.com

电子信箱 [hljrmcbs@ yeah.net](mailto:hljrmcbs@yeah.net)

印 刷 江苏农垦机关印刷厂有限公司

开 本 787×1092 毫米

印 张 36

字 数 500 千

版 次 2008 年 12 月第 1 版 2008 年 12 月第 1 次印刷

书 号 ISBN 978-7-207-08027-1/R · 238

定 价 58.00 元 (全二册)

(如发现本书有印刷质量问题, 印刷厂负责调换)

本社常年法律顾问: 北京市大成律师事务所哈尔滨分所律师赵学利、赵景波

前 言

药理学是医学和药学的桥梁学科。是医学及药学等专业学生的基础课程。随着学科的迅速发展，分子生物学研究促进了对药理学作用机制的阐明，不少内容亟待更新。笔者长期从事药理学一线的教学工作，了解到同学们学习药理的难度，即抽象内容较多，记忆的东西较多，枯燥的名词术语使得学生学习颇感吃力。为改变这一状况，我们尝试用图片解说药理学的一些基础知识，受到学生的欢迎。在此基础上，我们从素质教育、创新能力与实践能力的培养出发，编写了该《图解药理学》一书。将抽象难懂的知识，用清新、明快、简洁的图片配合文字说明阐述清楚，从而加深同学的印象，便于理解和记忆。对一些作用机理的阐述深入浅出，并结合一些疾病的发生发展机制，增加合理用药内容，有利于培养学生综合创新的能力，为将来应用药理学知识解决问题奠定扎实的基础。

本教材特色鲜明，内容新颖，材料精选，通俗易懂。不仅适用于我国医药学本专科学生使用，也适用于医药相关专业人员学习和参考。

李海涛

2008年8月28日于南京

目 录

第1单元：药理学概论

第1章：药理学基本原理	1
第2章：药物动力学	7
第3章：药物效应动力学	20
第4章：影响药理学效应的因素	25

第II单元：作用于自主神经系统的药物

第5章：自主神经药理	30
第6章：胆碱能激动药	38
第7章：胆碱能拮抗药	47
第8章：肾上腺素能激动药	57
第9章：肾上腺素能拮抗药	73

第III单元：作用于中枢神经系统的药物

第10章：作用于中枢神经系统药物概论	83
第11章：局部麻醉药	96
第12章：全身麻醉药	100
第13章：治疗帕金森病的药物	107
第14章：镇静药和抗焦虑药物	114
第15章：抗精神病药	125
第16章：麻醉性镇痛药及其拮抗剂	140
第17章：抗癫痫药	155

第IV单元：作用于心血管系统的药物

第18章：抗高血压药	166
第19章：治疗充血性心力衰竭的药物	180
第20章：抗心律失常药	189

第21章: 抗心绞痛药	206
第22章: 影响血液系统的药物	214
第23章: 抗高脂血症药	229

第V单元: 影响于其他器官的药物

第24章: 影响呼吸系统的药物	235
第25章: 利尿药	246
第26章: 治疗胃肠道疾病的药物和止吐药	258
第27章: 甲状腺激素和抗甲状腺药	269
第28章: 胰岛素和口服降糖药	277
第29章: 肾上腺皮质激素类药物	285

第VI单元: 化学治疗药物

第30章: 抗菌剂化学治疗	299
第31章: 叶酸抑制剂	306
第32章: 细胞壁合成抑制剂	314
第33章: 蛋白质合成抑制剂	331
第34章: 喹诺酮类和泌尿道抗菌药	347
第35章: 抗结核病药	353
第36章: 抗真菌药	362
第37章: 抗原虫药	371
第38章: 抗病毒药	382
第39章: 抗肿瘤药	400

第VII单元: 抗炎药和内泌素

第40章: 抗炎药	429
第41章: 内泌素和内泌素拮抗剂	444

第VIII单元: 免疫抑制剂

第42章: 免疫抑制剂	459
-------------	-----

药理学基本原理

1

I. 药物

药物治疗一直是防治疾病的主要途径，未来也是如此。药物疗法的目的在于预防、治疗和控制各种疾病。在对任何一位病人使用药物之前，医生必须考虑以下八点：（图 1.1）

1. 他们是否必须干涉其中，并且给病人用药。

2. 他们希望病人的身体情况得到怎样的改善。

3. 他们拟用的药必须是达到治疗目的的最佳选择。

4. 他们怎样才能知道药物什么时候起效。

他们需要通过适当的给药途径，使得药物在适当的部位、适当的时刻达到适当的浓度并持续一定的时间。

- 植物
- 动物
- 矿物
- 微生物
- 合成物质

图 1.1 生药学——药物的原料。

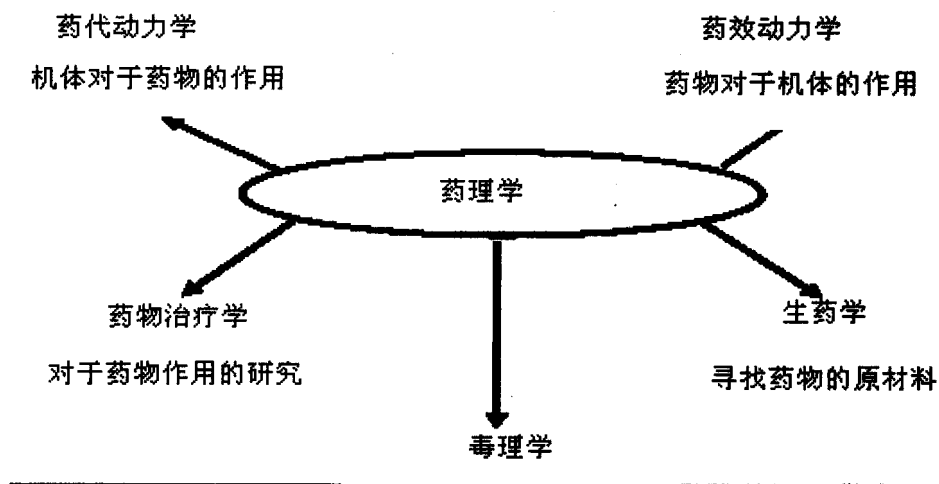


图 1.2 什么是药理学——药物对生物系统作用的研究。

5. 病人达到一种怎样的状况，然后病人自己决定是否停药。

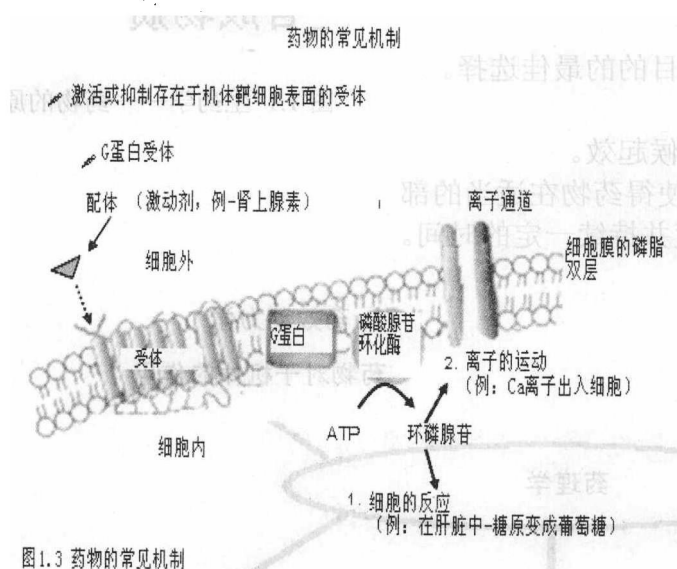
6. 药物可能还有哪些其他效应，这些效应是否对人体有害。要权衡一下是否有利，以及其重要性。例如：要考虑药物作用的利弊关系、有效性和安全性的关系。

II. 药理学

药理学关注的是药物怎样起效以及起怎样到达其作用部位，而治疗学关心的是药物的临床应用。

药理学主要包括**药代动力学**和**药效动力学**，这两门学科都是药物在预防、诊断和治疗疾病方面的基础。**药理学**还包括药物的历史、物理以及化学性质（图 1.2）

药物代谢动力学：探究在作用部位决定药物剂量及随时间变化的药物浓度之间关系的因素。主要涉及药物的吸收、分布、代谢、分泌以及药物的一些药动参数。



药物效应动力学：研究药物在作用部位的浓度和所达到的效果强弱之间的关系。它考察药物的作用机制，是药理学最基本的一方面。（图 1.3）

毒理学：药理学的一个分支。主要研究化学药物对人们生活的不良反应，从个体细胞到整个生态系统都是其研究范围。

基因治疗：它为我们提供了一前景：在未来，医生可以做分子水平的手术——替换不表达的基因或者功能缺失的基因，修复功能改变的基因，或者使异常的显性的基因恢复隐性。医生还能够检测到通过生殖

细胞遗传的子宫突变,这将对体细胞缺陷基因的修复有重要的影响,为获得性遗传病的治疗提供了巨大的前景——癌症的治疗就是最好的例子。

III. 药物的发展

新药研发本身是一个花费巨大的过程,因为在所有被试验过的化学药品中,只有不到八千分之一的能够上市。这也是一个漫长的而昂贵的过程,在美国,一个新的化学药品要进入市场,需要长达 10 年的动物实验和人体试验,耗资将近\$80,000,000。

虽然院士在发展基础知识和建立生物技术公司方面起着重要作用,然而新药仍然主要来自制药工业的创新部门。新药的原材料有很多,一些列在了表 1.1 中。这些原料包括单纯偶然发现的药物(例如盘尼西林),民间验方(金鸡纳生物碱类在疟疾治疗中的使用),和理论模型(治疗癌症的化学疗法)。传统的中草药也包括其中。(图 1.4)

制药工业主要靠经济收益和治疗费用的差额来支持其对新药的研究。正如预期的,这两个动机毫无疑问是相悖的,没有一点关系。在特定的情况下,只是困扰一小部分人的疾病就不会被政府所重视。这种状况下,制药公司若生产治疗这些疾病的药物,将会得到免税额的补助,因为生产这些药物没有利润。在制定特定的研究战略时,一些因素必须考虑清楚(表 1.2)。在这些因素中,起决定作用的是对候选药物安全性和有效性的选择。(图 1.5)

一旦一个化合物被认为有治疗价值,在开始人体实验之前,我们必须解决两大问题。首先,我们必须通过动物实验、疾病的实验室模型以及理论考察了解到药物的疗效。其次,我们必须保证其在临床使用剂量时的所具有的毒性是被病人所接受的。人体实验有四个时期(见表 1-3)。I 期临床,制定志愿受试者能忍受的剂量的范围;II 期临床包含一些初始的为了证明疗效的对照试验;III 期临床是用广泛的、多中心的试验去验证早期试验数据;IV 期临床为药品上市后的调查工作,在这个时期常会发现药物的新的适应症以及罕见的不良反应。在中国,早在 I 期临床之前,一个审查中的新药的申请就已被国家食品与药品管理局



图 1.4 青蒿.



图 1.5 制药工业.

(SFDA)存档，在III期临床结束时，可以递交新药上市申请来注册新药。(图 1.6)

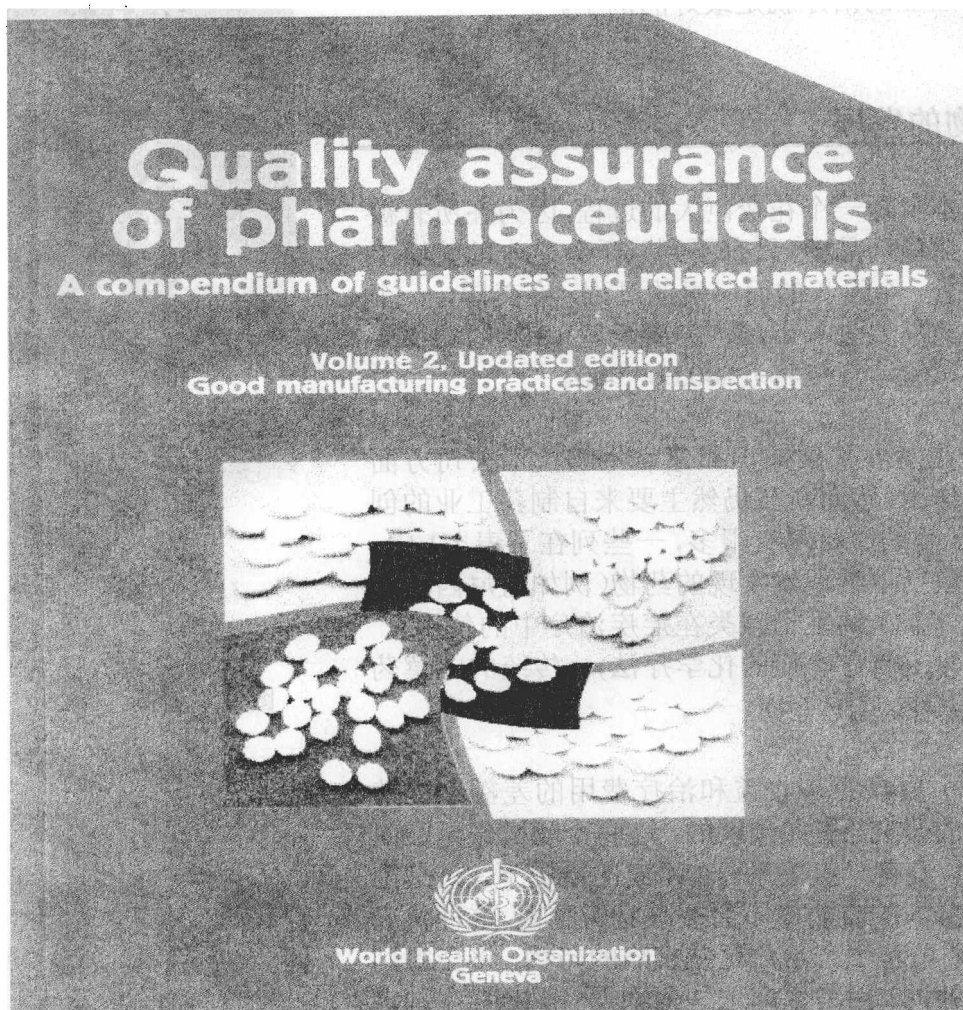


图1.6 药品生产和质量管理 (GMP).

表 1.1 药品起源的例子.

-
- 偶然的发现 (盘尼西林)
 - 民间验方 (金鸡纳生物碱类)
 - 理论模型(癌症化疗的抗代谢药物)
 - 建立在旧资料基础上的构效关系的预测
 - 传统的中草药
-

表 1.2 决定药物发展策略的因素

-
- 选择合适候选药物的难易度
 - 证明药物有效性和安全性的难易度
 - 国家宏观调控

- 公司的技术力量以及市场传统
- 销售潜力 (市场容量)

表 1.3 人体实验的四个时期.

I 期临床: 最早的人体研究

制定健康志愿受试者的耐受剂量的范围

II 期临床: 临床试验

对一定数量具有特种疾病的病人进行的早期研究, 致力于制定有效剂量的范围

III 期临床: 广泛的临床试验

确认之前的试验结果

时期 3 结束时投递新药上市申请(NDA)

国家食品与药品管理局(SFDA)的认可

IV 期临床: 批准后 (上市后) 的研究

发现新的或者罕见的毒性以及新适应症, 这一点通常很重要

IV. 怎样学习药理学

你可能无法记住每个有效的药物的每一个细节。尽管很多学药理学的学生能记住一定量的重要或非重要的信息, 但记忆很有限, 而考试的内容也很有限。因此, 大家可以学习, 通过尝试用一种方法整理所有的材料, 使你需要记忆的知识量达到最小。大家必须提高学习效率, 合理分配时间, 可以通过对药物进行分类和找到其中的联系来记忆。(图 1.7)

在你的一生中, 将不断的有新药面世, 甚至在你学习期间就已经有新药上市, 所以为药物信息制定一个灵活的结构框架是非常必要的。

在当前的政治经济环境下, 我们会听说药价在上升——导致医疗保健开支的一度增长。尽管新药研发的费用非常高, 但从整体的医疗保健支出来看, 如果避免或缩短住院治疗, 药物治疗还是非常廉价的。我们需要以乐观的态度去期待一个时代的到来, 那时, 药物治疗 (包括基因治疗) 的支出占医疗保健预算的大部分, 医院仅作为诊治中心存在, 生命不再是由长期的残疾组成或者因疾病而过早的结束。

General Concepts

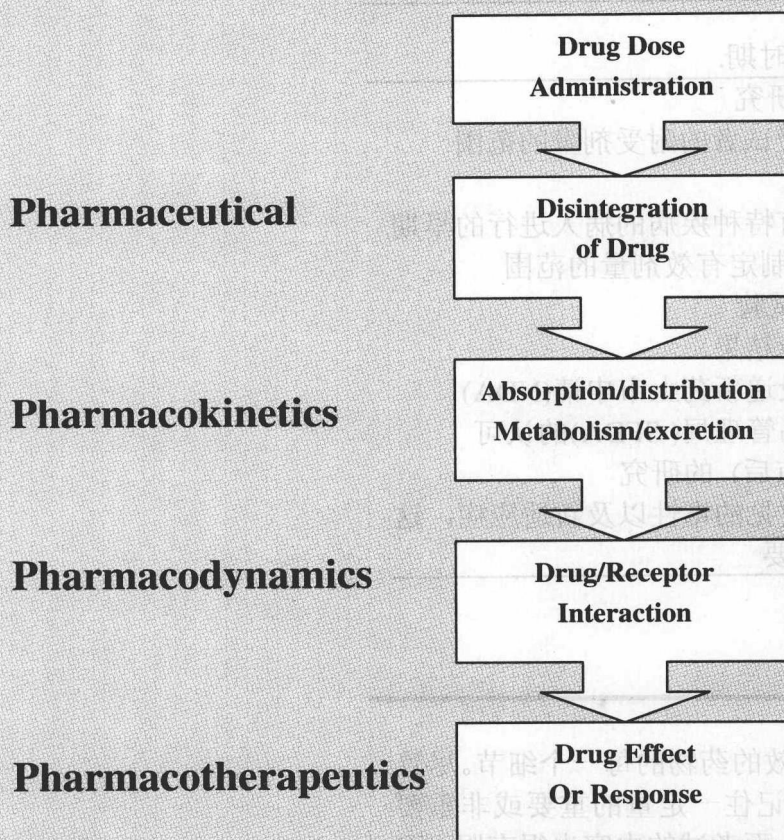


图 1.7 一般概念.

I. 概述

我们必须认识到人体内药物运动和变化的四个基本步骤。即药物的吸收、分布、代谢和排泄。上述四个基本步骤决定了药物的起效速度，药物作用的强度和药物作用时间。首先，药物在给药部位的吸收，这使得治疗因子进入血浆。其次，药物可逆性地离开血流并分布到细胞间液和细胞液中（分布）。第三，药物通过肝、肾或其他组织代谢。最后，药物和其代谢产物通过尿液、胆汁或粪便排出体外（排泄）。(图 2.1)

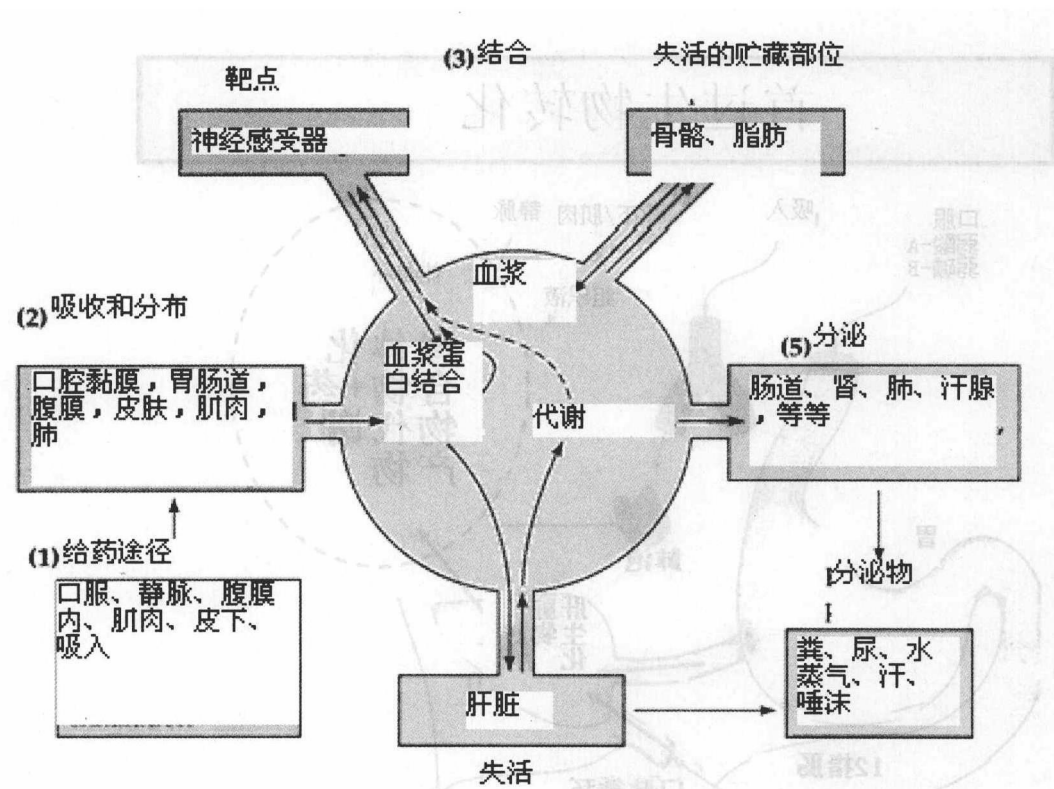


图 2.1 药代动力学

II. 给药途径

A. 肠道内给药

1. 口服

口服是最常用的给药方式，但也是变化最大的途径，并且药物需要经过极为复杂的通路才能达到组织。大多数经胃肠道吸收的药物进入门脉循环，而且在分布到体循环之前到达肝脏。许多药物口服时，由于小肠或肝脏的首过效应而限制了其疗效。(首过效应：从胃肠道吸收进入门静脉系统的药物在到达全身血循环前必先通过肝脏，如果肝脏对其代谢能力很强或由胆汁排泄的量大，则使进入全身血循环的有效药物量明显减少，这种作用称为首关消除。有的药物在被吸收进入肠壁细胞内而被代谢一部分也属首关消除。首关消除也称首关代谢或首关效应)。(图 2.2)

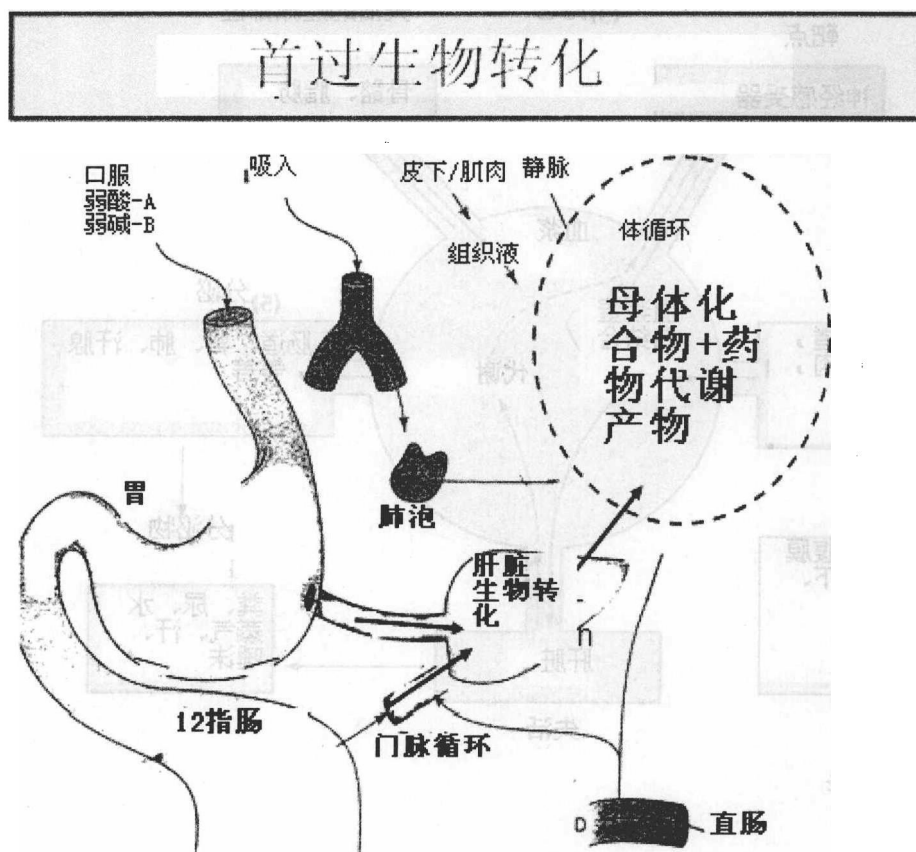


图 2.2 首过效应

2. 舌下给药

置于舌下可使药物扩散至毛细血管网，进而直接进入体

循环。这种给药途径的优点是药物可绕过小肠和肝脏而不被代谢失活。

3. 直肠给药

50%的直肠血流绕过门脉循环，因此药物在肝脏的生物转化可降至最低。止吐药常通过直肠给药。

B. 肠道外给药

1. 静脉注射(IV)

静脉注射是最常用的肠外给药途径。对于口服不能吸收的药物通常没有其他选择。此种途径可使药物迅速起效，而且可以最大程度地控制循环药物浓度。动脉注射(IA)也应考虑相同的问题。(图 2.3)

2. 肌肉注射 (IM)

肌肉注射的药物可以是水溶液或特殊处理的贮藏制剂，一般是非水溶性药物悬液如乙二醇或花生油。

3. 皮下注射(SC)

该途径与肌肉注射一样，需要先吸收而且比静脉注射吸收慢。(图 2.4)

C 其他给药方式

1. 吸入给药(inhalation)

吸入给药可使药物经较大的呼吸道黏膜表面和肺上皮迅速吸收，产生几乎与静脉注射同样快的效应。

2. 经鼻给药(intranasal)

去氨基精加压素就是采用经鼻给药方式来治疗糖尿病性尿崩症；治疗骨质疏松的鲑鱼降钙素(一种肽类激素)也是制成鼻喷剂使用。毒品可卡因通常经鼻嗅吸入给药。

3. 鞘内注射 / 心室内给药 (intrathecal / intraventricular)

某些情况下必须将药物直接注入脑脊液(CSF)，如用甲氨蝶呤治疗急性淋巴细胞白血病。

4. 局部给药(topical)

若需要药物发挥局部效应，则采用局部给药方式。

5. 经皮给药(transdermal)

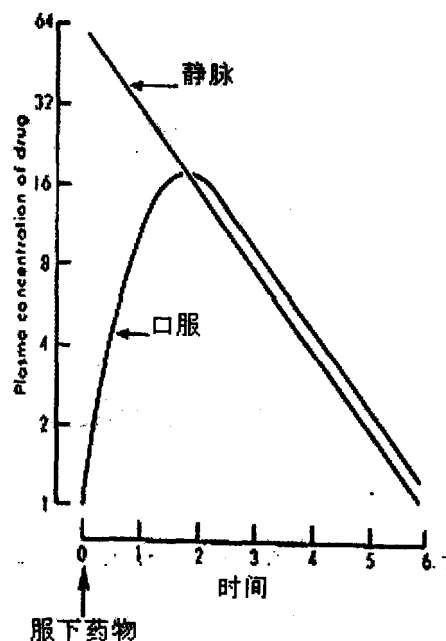


图 2.3 血浆药物浓度曲线

将药物擦在皮肤上，可使药穿透皮肤发挥全身效应，常采用透皮贴剂的方式，如抗心绞痛药硝酸甘油的使用。

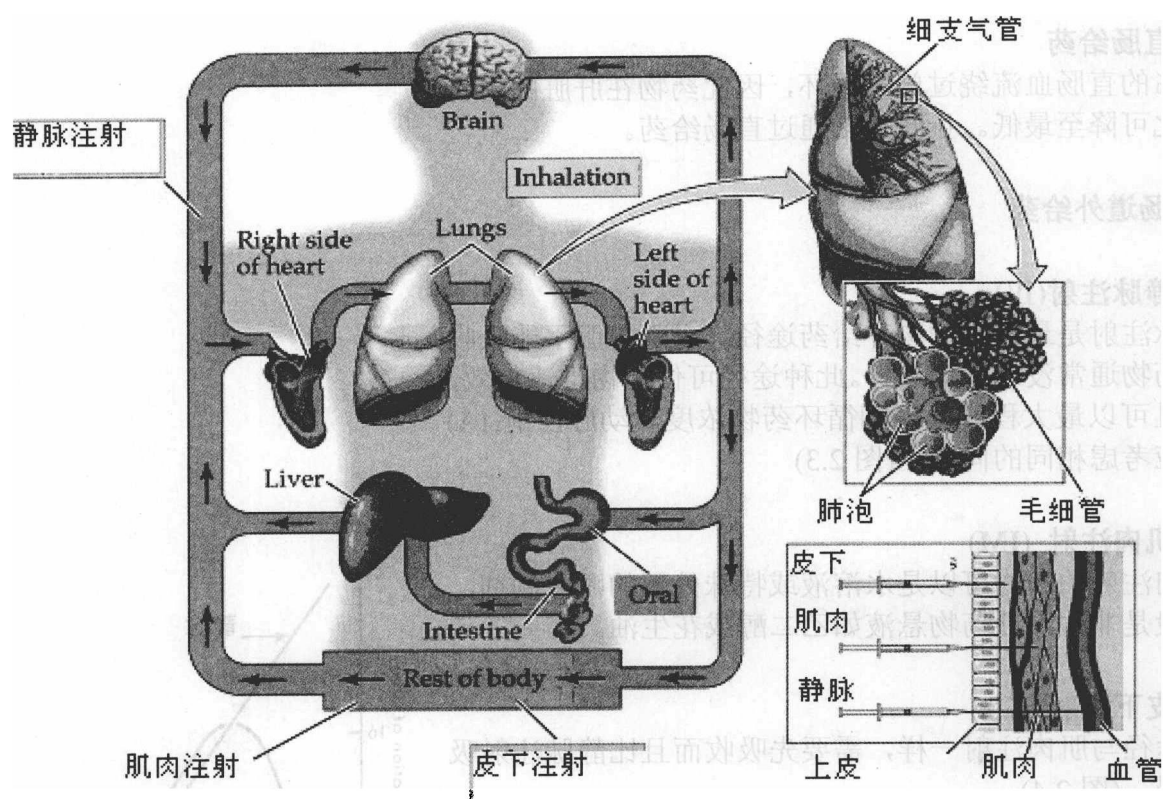


图 2.4 给药途径

III. 药物的吸收

吸收是指药物从给药部位到血液循环的过程。吸收速度和效率与给药途径有关。(图 2.5)

A. 药物在胃肠道中的转运

药物根据其化学特性，可通过被动扩散或主动转运的方式经胃肠道吸收。

1. 被动扩散(passive diffusion)

药物被动扩散的驱动力是腔室隔膜的浓度梯度，即药物从高浓度区扩散到低浓度区。被动扩散不需要载体，没有饱和性，没有结构特异性。大多数药物都是通过该方式进入体内。

2. 主动运输(activetransport)

药物在特殊载体蛋白的作用下跨过生物膜。与天然代谢物结构相似的一些药物利用这些特殊的载体蛋白完成跨

膜主动转运。主动转运需要消耗能量并且通过水解三磷酸腺苷释放能量来驱动。(图 2.6)

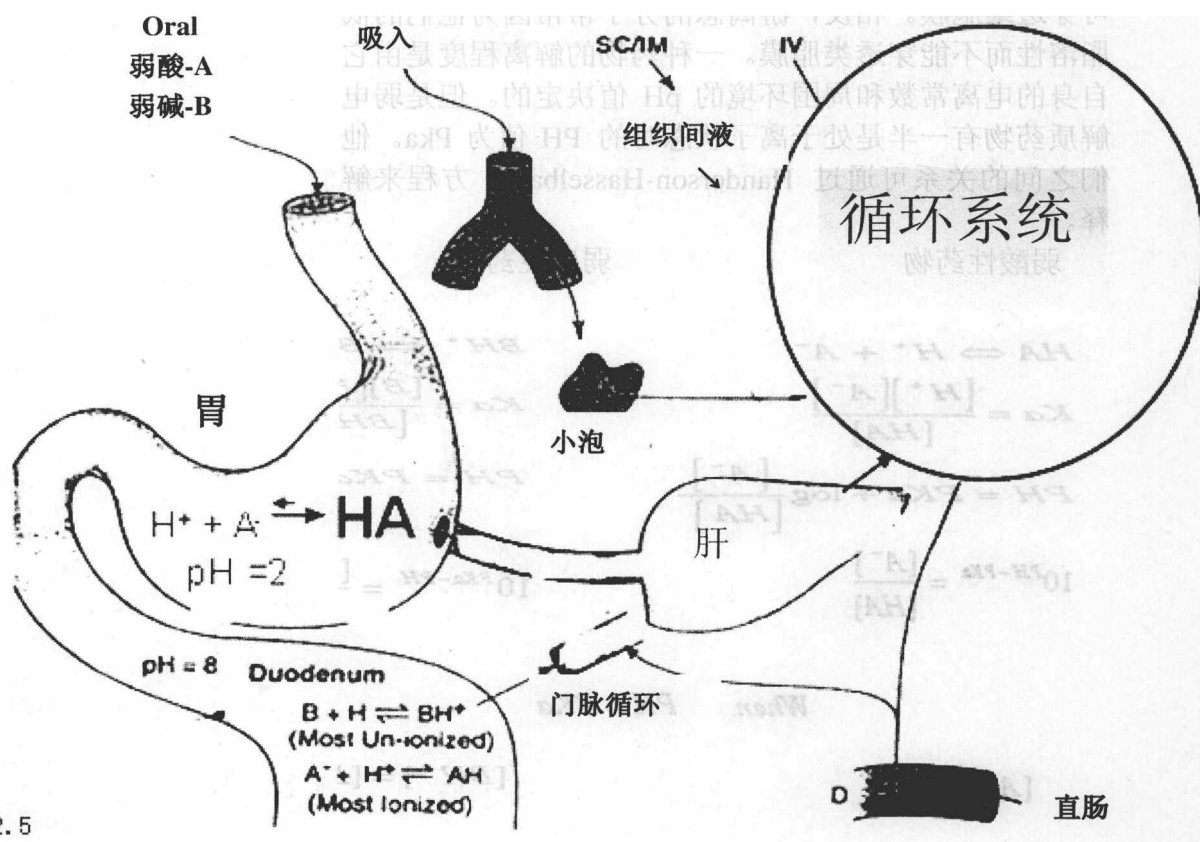


图 2.5

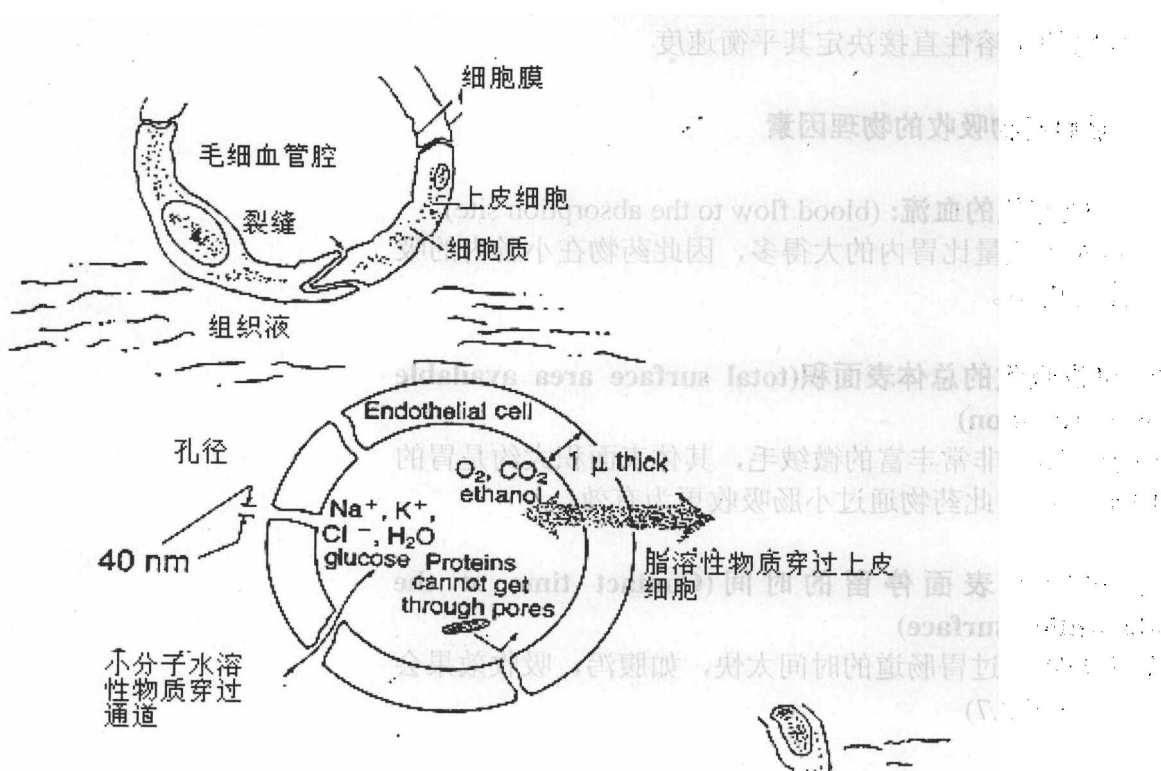


图 2.6 药物吸收的机理