

供高职、高专药学专业用

· 全国高等职业技术教育卫生部规划教材 ·

药理学

主 编 王迎新 · 副主编 于天贵



人民卫生出版社

全国高等职业技术教育卫生部规划教材

供高职、高专药学专业用

药 理 学

主 编 王迎新

副主编 于天贵

编者 (以姓氏笔画为序)

于天贵 (山东省卫生学校)

毛理纳 (河南职工医学院)

王迎新 (安徽医学高等专科学校)

余华保 (安徽医学高等专科学校)

张敬芳 (湖北荆门职业技术学院医学院)

李信梅 (江苏省盐城卫生学校)

李德营 (湖北省卫生学校)

罗跃娥 (天津医学高等专科学校)

范志刚 (山西临汾职业技术学院)

樊彦 (安徽中医学院)

人 民 卫 生 出 版 社

图书在版编目 (CIP) 数据

药理学/王迎新主编. —北京: 人民卫生出版社,
2003

ISBN 7-117-05302-X

I. 药… II. 王… III. 药理学 IV. R96

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2002) 第 102244 号

药 理 学

主 编: 王 迎 新

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](http://www.pmph.com)

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

印 刷: 三河市潮河印业有限公司

经 销: 新华书店

开 本: 787×1092 1/16 印张: 23

字 数: 523 千字

版 次: 2003 年 2 月第 1 版 2003 年 2 月第 1 版第 1 次印刷

标准书号: ISBN 7-117-05302-X/R·5303

定 价: 25.00 元

著作权所有, 请勿擅自用本书制作各类出版物, 违者必究

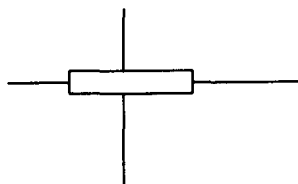
(凡属质量问题请与本社发行部联系退换)

全国高等职业技术教育卫生部规划教材出版说明

医学高等职业技术教育作为我国高等教育的重要组成部分,近年来发展迅速。为保障教育质量,规范课程设置和教学活动,促进我国高等职业技术教育的良性发展,卫生部教材办公室决定组织编写医学高等职业技术教育教材。2001年11月,卫生部教材办公室对我国医学高等职业技术教育现状(专业种类、课程设置、教学要求)进行了调查,并在此基础上提出了医学高等职业技术教育卫生部规划教材的编写原则,即以专业培养目标为导向,以职业技能培养为根本,满足三个需要(学科需要、教学需要、社会需要),力求体现高等职业技术教育的特色。同时,教材编写继续坚持“三基五性”的原则,但基本理论和基本知识以“必须,够用”为度,强调基本技能的培养,特别强调教材的实用性与先进性;考虑到我国高等职业技术教育模式发展中的多样性,在教材的编写过程中,提出了保障出口(毕业时的知识和技能水平),适当兼顾不同起点的要求,以保障教材的适用性。教材编写注意了与专业教育、中等职业教育的区别。从2002年4月起,卫生部教材办公室陆续启动了医学检验、医学影像技术、药学、口腔工艺技术、护理学专业卫生部规划教材的编写工作。

2002年5月,卫生部教材办公室在湖北黄石召开了“全国医学高等职业技术教育药学专业和口腔工艺技术专业卫生部规划教材主编人会议”,正式启动了高等职业技术教育药学专业卫生部规划教材的编写工作。本套教材包括了药学专业的专业基础课和专业课,共计10种。其配套教材亦陆续出版。

无机化学	主 编 黄南珍	天然药物学	主 编 王兴顺
	副主编 欧英富		副主编 李建民
有机化学	主 编 刘 斌	天然药物化学	主 编 吴剑峰
	副主编 李玮路		副主编 叶桂存
分析化学	主 编 谢庆娟	药剂学	主 编 孙耀华
	副主编 潘国石		副主编 江 丰
药物化学	主 编 王玮璞	制剂技术与设备	主 编 江 丰
	副主编 杨运旭 冯丽华		
药物分析	主 编 石东方	药理学	主 编 王迎新
	副主编 牛彦辉		副主编 于天贵



前 言

本教材是根据卫生部教材办公室于2002年5月在湖北黄石市召开的全国高等职业技术教育药学专业主编人会议精神和要求编写的,供高等职业技术教育药学专业使用。

编写紧扣高等职业技术教育的培养目标,注意教材的思想性、科学性、启发性,突出实用性和先进性(知识的新颖性)。在编写内容的选择上,以基本理论、基本知识“必需,够用”为度,强调基本技能,并结合我国执业药师考试资格制度的实施,注意本专业的需要,突出药学专业对药理学知识和技能的需求,力求“少而精”。

全书包括药理学基本理论和实验教程两部分,理论部分共分42章,凡涉及药理学总论的内容,编写为第一章总论,有机磷酸酯类中毒与解救作为一节列入抗胆碱药物中,抗菌药物的合理应用单列一章。根据专业特点,对重点药物及常用药物,单列出了药物相互作用;实验教程包括药理学实验的基本知识和技术,及经典、实用的药理学实验25个,各校可根据需要及实验条件进行选择。

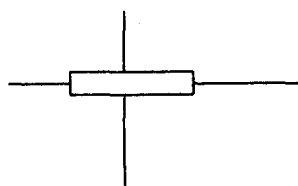
本书的药物,主要遴选自国家药品监督管理局编写的《国家基本药物》及临床上疗效确切而又常用的新特药物。药物中、外文名称和制剂、剂量均以2000年《中华人民共和国药典》和人民卫生出版社出版《新编药理学》(第14版)为依据,医学术语采用全国自然科学名词审定委员会公布的科技名词,并参考了高等医药院校《药理学》本、专科教材。

在本书的编写过程中,得到卫生部教材办公室、各编者单位的支持,特别是安徽医学高等专科学校的领导和教师的大力支持,为提高和保证本教材质量起到了重要作用,在此一并致谢。

我们希望能提供一本有利于教师教、学生学的教材,但由于我们水平与能力有限,编写药学专业高职教材又属初次尝试,缺乏经验,因此教材中有不少缺点和不足之处,恳切希望广大师生和读者予以批评指正,以便总结经验,修改提高。

王迎新 于天贵

2002年10月



目 录

第一章 总论	1
第一节 绪言	1
一、药理学的内容与地位	1
二、药理学发展简史	1
三、新药开发与研究	2
第二节 药物效应动力学	3
一、药物作用	3
二、药物的构效关系和量效关系	5
三、药物作用机制	8
四、药物作用的受体机制	8
第三节 药物代谢动力学	11
一、药物跨膜转运	11
二、药物体内过程	12
三、血药浓度变化的时间过程	16
四、常用药动学参数及其意义	19
五、多次给药的血药浓度变化和给药方案	21
第四节 影响药物效应的因素	22
一、药物方面的因素	22
二、机体方面的因素	24
三、反复用药引起的机体反应性变化	25
第二章 传出神经系统药理概论	27
第一节 传出神经系统的分类	27
一、传出神经按解剖学分类	27
二、传出神经按递质分类	28
第二节 传出神经系统的递质与受体	28
一、传出神经系统的递质	28
二、传出神经系统的受体	30
三、传出神经的生理功能	30
第三节 传出神经系统药物的作用机制与分类	31
一、传出神经系统药物的作用机制	31

二、传出神经系统药物的分类	32
第三章 胆碱受体激动药	33
第一节 M 胆碱受体激动药	33
第二节 抗胆碱酯酶药	34
一、易逆性抗胆碱酯酶药	35
二、难逆性抗胆碱酯酶药	36
第四章 胆碱受体阻断药	39
第一节 M 胆碱受体阻断药	39
一、阿托品类生物碱	39
二、阿托品的合成代用品	41
第二节 N 胆碱受体阻断药	42
一、N ₁ 胆碱受体阻断药	42
二、N ₂ 胆碱受体阻断药	43
第五章 肾上腺素受体激动药	46
第一节 α 、 β 受体激动药	46
第二节 α 受体激动药	50
一、 α_1 、 α_2 受体激动药	50
二、 α_1 受体激动药	51
第三节 β 受体激动药	51
一、 β_1 、 β_2 受体激动药	51
二、 β_1 受体激动药	52
三、 β_2 受体激动药	52
第六章 肾上腺素受体阻断药	54
第一节 α 受体阻断药	54
一、 α_1 、 α_2 受体阻断药	55
二、 α_1 受体阻断药	56
三、 α_2 受体阻断药	56
第二节 β 受体阻断药	56
第七章 麻醉药	60
第一节 局部麻醉药	60
一、概述	60
二、常用局麻药	61
第二节 全身麻醉药	62
一、吸入麻醉药	62
二、静脉麻醉药	63

三、复合麻醉	64
第八章 镇静催眠药	66
第一节 苯二氮䓬类	66
第二节 巴比妥类	68
第三节 其他镇静催眠药	70
第九章 抗癫痫药及抗惊厥药	72
第一节 抗癫痫药	72
第二节 抗惊厥药	74
第十章 抗帕金森病药	76
第一节 拟多巴胺药	76
第二节 中枢性抗胆碱药	78
第十一章 抗精神失常药	80
第一节 抗精神病药	80
一、吩噻嗪类	80
二、硫杂蒯类	83
三、丁酰苯类	83
四、其他药物	84
第二节 抗躁狂及抑郁症药	84
一、抗躁狂症药	84
二、抗抑郁症药	85
第三节 抗焦虑症药	87
第十二章 镇痛药	89
第一节 阿片生物碱类镇痛药	89
第二节 人工合成镇痛药	92
第三节 其他镇痛药	93
附：阿片受体拮抗剂	94
第十三章 解热镇痛抗炎药	96
第一节 概述	96
第二节 常用解热镇痛抗炎药	97
一、水杨酸类	97
二、苯胺类	98
三、吡唑酮类	99
四、其他抗炎有机酸类	100
五、解热镇痛药的复方制剂	101

第三节 合理用药原则	101
第十四章 中枢兴奋药	103
第一节 大脑皮层兴奋药	103
第二节 呼吸中枢兴奋药	104
第三节 大脑功能恢复药	104
第十五章 钙通道阻滞药	106
一、钙通道阻滞药分类	106
二、体内过程	106
三、药理作用	107
四、临床应用	108
五、不良反应	108
六、禁忌证	109
第十六章 抗高血压药	110
第一节 抗高血压药的分类	110
第二节 常用抗高血压药	111
一、利尿药	111
二、肾上腺素受体阻断药	111
三、血管紧张素转化酶抑制药	112
四、血管紧张素Ⅱ受体阻断药	114
五、钙通道阻滞药	115
六、交感神经抑制药	116
七、血管舒张药	117
第三节 合理用药原则	118
第十七章 抗心绞痛药	120
第一节 硝酸酯类	120
第二节 β 受体阻断药	122
第三节 钙通道阻滞药	123
第四节 合理用药原则	124
第十八章 抗动脉粥样硬化药	125
第一节 调血脂药	125
一、羟甲基戊二酰辅酶 A 还原酶抑制药	126
二、胆汁酸结合树脂	126
三、烟酸类	127
四、苯氧酸类	127
第二节 抗氧化药	128

第三节 多烯脂肪酸类	128
第四节 血管内皮保护药	128
第十九章 抗心律失常药	130
第一节 心律失常的电生理学基础	130
一、正常心肌电生理	130
二、心律失常发生的电生理学机制	131
第二节 抗心律失常药的分类及作用机制	132
一、抗心律失常药分类	132
二、抗心律失常药作用机制	133
第三节 常用抗心律失常药	133
一、I类——钠通道阻滞药	133
二、II类—— β 受体阻断药	136
三、III类——延长动作电位时程药	137
四、IV类——钙通道阻滞药	137
第四节 合理用药原则	138
第二十章 抗慢性心功能不全药	141
第一节 强心苷	141
第二节 非苷类正性肌力药	145
一、磷酸二酯酶抑制药	145
二、 β 受体激动药	146
第三节 减轻心脏负荷药	146
一、利尿药	146
二、血管舒张药	146
第四节 血管紧张素转化酶抑制药	147
第二十一章 利尿药和脱水药	148
第一节 利尿药	148
一、利尿药作用的生理学基础	148
二、利尿药的分类	149
三、常用利尿药	149
第二节 脱水药	153
第二十二章 血液及造血系统疾病用药	155
第一节 抗贫血药	155
一、铁剂	155
二、维生素类	156
三、造血细胞因子	157
第二节 促凝血药与抗凝血药	158
一、促凝血药	158

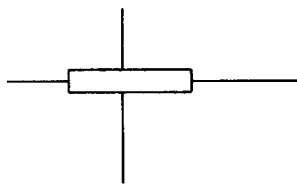
二、抗凝血药	159
第三节 纤维蛋白溶解药	161
第四节 抗血小板药	162
第五节 促白细胞增生药	163
第六节 血容量扩充药	163
第二十三章 组胺受体阻断药	166
第一节 H_1 受体阻断药	166
第二节 H_2 受体阻断药	167
第二十四章 作用于消化系统的药物	170
第一节 助消化药	170
第二节 抗消化性溃疡药	170
一、抗酸药	171
二、抑制胃酸分泌药	172
三、胃粘膜保护药	173
四、抗幽门螺杆菌药	174
第三节 泻药与止泻药	174
一、泻药	174
二、止泻药	175
第四节 止吐药	176
一、多巴胺受体阻断药	176
二、5-羟色胺受体阻断药	177
第二十五章 作用于呼吸系统的药物	179
第一节 平喘药	179
一、 β_2 肾上腺素受体激动药	179
二、茶碱类药	180
三、M 胆碱受体阻断药	181
四、过敏介质阻释药	181
五、糖皮质激素类药	182
第二节 镇咳药	182
一、中枢性镇咳药	182
二、外周性镇咳药	183
第三节 祛痰药	183
一、痰液稀释药	183
二、粘痰溶解药	184
第二十六章 子宫兴奋药	186
一、垂体后叶素类	186
二、麦角生物碱类	187

三、前列腺素类	187
第二十七章 肾上腺皮质激素类药物	189
第一节 糖皮质激素类药	189
第二节 盐皮质激素类药	194
附：促皮质素及皮质激素抑制药	194
第二十八章 甲状腺激素及抗甲状腺药	196
第一节 甲状腺激素	196
第二节 抗甲状腺药	197
一、硫脲类	197
二、碘及碘化物	198
三、放射性碘	199
四、 β 肾上腺素受体阻断药	199
第二十九章 胰岛素及口服降血糖药	201
第一节 胰岛素	201
第二节 口服降血糖药	203
一、磺酰脲类	203
二、双胍类	204
三、葡萄糖苷酶抑制药	204
四、胰岛素增敏药	204
第三十章 性激素类药及抗生育药	206
第一节 性激素类药	206
一、雌激素类及抗雌激素类药	206
二、孕激素类药	208
三、雄激素类及同化激素类药	209
第二节 抗生育药	210
一、避孕药	210
二、抗早孕药	212
第三十一章 维生素类	214
一、水溶性维生素	214
二、脂溶性维生素	217
第三十二章 抗菌药物概论	220
一、常用术语	220
二、抗菌药物的作用机制	221
三、细菌耐药性及其产生机制	222

第三十三章 抗生素	223
第一节 β -内酰胺类抗生素	223
一、青霉素类	224
二、头孢菌素类	227
三、非典型 β -内酰胺类	229
第二节 大环内酯类、林可霉素及其他抗生素	230
一、大环内酯类	230
二、林可霉素和克林霉素	232
三、万古霉素类	233
第三节 氨基糖苷类及多粘菌素类抗生素	234
一、氨基糖苷类	234
二、多粘菌素类	236
第四节 四环素类抗生素及氯霉素	237
一、四环素类	237
二、氯霉素	239
第三十四章 人工合成抗菌药	243
第一节 喹诺酮类	243
一、概述	243
二、常用喹诺酮类药物	245
第二节 磺胺类药物和甲氧苄啶	247
一、磺胺类药物	247
二、甲氧苄啶	249
第三节 其他抗菌药物	250
一、硝基咪唑类	250
二、小檗碱	250
第三十五章 抗结核病药及抗麻风病药	252
第一节 抗结核病药	252
一、常用药物	252
二、结核病的治疗原则	255
第二节 抗麻风病药	255
第三十六章 抗真菌药及抗病毒药	258
第一节 抗真菌药	258
一、抗浅部真菌药	258
二、抗深部真菌药	259
三、抗浅部及深部真菌药	260
第二节 抗病毒药	261
第三十七章 消毒防腐药	265

一、醇类	265
二、酚类	265
三、醛类	266
四、酸类	266
五、卤素类	267
六、氧化剂	267
七、表面活性剂	268
八、其他药物	268
 第三十八章 抗菌药物的合理应用	270
一、抗菌药临床应用的基本原则	270
二、抗菌药的联合应用	272
三、肝肾功能损害时抗菌药的应用	273
 第三十九章 抗寄生虫药	274
第一节 抗疟药	274
一、疟原虫的生活史及抗疟药的作用环节	274
二、常用抗疟药	275
第二节 抗阿米巴病药及抗滴虫病药	278
一、抗阿米巴病药	278
二、抗滴虫病药	280
第三节 抗血吸虫病药	280
第四节 抗丝虫病药	281
第五节 抗肠蠕虫病药	281
 第四十章 抗恶性肿瘤药	285
第一节 概述	285
一、细胞增殖周期与抗恶性肿瘤药基本作用	285
二、抗恶性肿瘤药的分类	286
三、抗恶性肿瘤药的不良反应	287
第二节 常用抗恶性肿瘤药	288
一、烷化剂	288
二、抗代谢药	288
三、抗肿瘤抗生素	289
四、抗肿瘤植物药	290
五、激素类药	291
六、其他药物	291
第三节 合理用药原则	292
 第四十一章 免疫功能调节药	294
第一节 免疫抑制药	294

第二节 免疫增强药	295
实验	297
药理学实验的基本知识和技术	297
一、药理学实验的目的和要求	297
二、动物实验的基本知识和技术	298
三、实验结果的整理和实验报告的撰写	303
四、处方	304
实验一 药物的基本作用	306
实验二 剂量对药物作用的影响	307
实验三 不同给药途径对药物作用的影响	307
实验四 肝脏功能状态对药物作用的影响	308
实验五 药物血浆半衰期 ($t_{1/2}$) 的测定	309
实验六 传出神经系统药对动物腺体分泌的影响	310
实验七 传出神经系统药对兔瞳孔的作用	311
实验八 传出神经系统药对动物血压的影响	312
实验九 传出神经系统药对离体兔肠的作用	313
实验十 有机磷酸酯类中毒及其解救	315
实验十一 药物对动物自发活动的影响	316
实验十二 地西泮抗土的宁惊厥的作用	317
实验十三 氯丙嗪对小白鼠激怒反应的影响	318
实验十四 氯丙嗪对小白鼠的耐缺氧影响	319
实验十五 药物的镇痛作用 (扭体法)	320
实验十六 强心甙对离体蛙心的作用 (斯氏法)	320
实验十七 利多卡因抗氯仿诱发小鼠室颤	322
实验十八 普萘洛尔对乌头碱诱发大鼠心律失常的保护作用	322
实验十九 利尿药和脱水药对家兔尿量的影响	323
实验二十 药物对肠蠕动的的影响	324
实验二十一 药物对凝血时间的影响	325
实验二十二 药物对离体子宫的兴奋作用	326
实验二十三 糖皮质激素对炎症毛细血管通透性的影响 (小鼠耳片法)	327
实验二十四 链霉素的急性中毒及解救	328
实验二十五 药物半数致死量 (LD_{50}) 的测定	328
附录	332
某些药物代谢动力学数据	332
中文药名索引	336
英文药名索引	345



第一章 总论

第一节 绪言

一、药理学的内容与地位

药物(drug)是指能影响机体组织器官生理功能及(或)细胞代谢过程,用以预防、治疗、诊断疾病及计划生育的化学物质。

药理学(pharmacology)是研究药物与机体相互作用及作用规律的一门科学。其研究内容主要包括:①药物效应动力学(pharmacodynamics):研究药物对机体的作用,包括药物的作用、作用机制等,简称药效学;②药物代谢动力学(pharmacokinetics):研究机体对药物的影响,包括药物在体内的吸收、分布、代谢、排泄等动态过程,以及血药浓度随时间而变化的规律,简称药动学。药效学和药动学在体内是同时进行并相互联系的。药理学研究这两方面的问题,其目的在于阐明药物的作用机制,药物与机体相互作用的基本规律和原理,为指导临床合理用药提供理论基础;为开发研制高效、安全的新药提供线索;为探索生命的本质提供重要的科学资料。

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,既与生理学、生物化学、病理学、免疫学等医学基础理论有广泛的联系,还与内科学、外科学等临床医学密切相关。同时,也与主要研究药物本身的生药学、药物化学、药剂学、制药学等紧密相关。

二、药理学发展简史

在古代,人类为了生存,从生产、生活经验中认识到某些天然植物、动物或矿物可以治疗疾病和伤痛,如饮酒止痛、大黄导泻、麻黄止喘、常山截疟等,这是人类认识药物的开始。随着人们医药实践经验的积累和新的药物品种不断发现,专门记载药物知识的书籍开始出现。公元一世纪前后成书的《神农本草经》是我国最早的一部药物专著,该书收载药物365种,其中不少药物仍沿用至今。唐代(公元659年)的《新修本草》,收载药物884种,是我国最早的一部药典,也是世界上第一部由政府颁布的药典。明代杰出的药物学家李时珍通过长期医药实践,于1596年写出了闻名于世的巨著《本草纲目》,全书52卷,收载药物1892种、药方11000余条、插图1160幅,是现今研究中药

的必读书籍,受到国际医药界的广泛重视,已译成英、日、朝、德、法、俄、拉丁等七种文本,对药物学的发展作出了杰出的贡献。

药理学作为一门现代科学是从19世纪开始发展起来的,是与现代科学技术的发展密不可分的。19世纪初,由于化学、生物学及生理学的发展,促进了实验药理学的形成与发展。意大利人F·Fontana通过动物实验对千余种药物进行了毒性测试,得出了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典型反应的客观结论。德国人F·W·Sertürner首先从罂粟中分离提纯吗啡,用狗实验证明有镇痛作用。法国人F·Magendi用青蛙实验,确定了土的宁的作用部位在脊髓。这些研究工作为药理学的发展提供了可靠的实验方法。20世纪初,德国人P·Ehrlich从大量有机砷化合物中筛选出治疗梅毒有效的肿凡纳明,从而开始用合成药物治疗传染病。1940年,英国人Flory在H·W·Fleming研究的基础上,从青霉菌培养液中分离出青霉素,并开始将抗生素应用于临床,促进了化学治疗学的发展。

近年来,随着其他相关学科特别是分子生物学、细胞生物学、生物工程的迅猛发展,以及新技术在药理学中的应用,如组织和细胞培养、微电极测量、同位素技术、电子显微镜、电子计算机技术、各种色谱技术和生物工程超微量分离分析技术等的应用,药理学有了很大发展。对药理学研究也从器官和细胞水平深入到分子和量子水平。在药理学的深度和广度方面,出现了许多药理学的分支学科,如神经药理学、免疫药理学、遗传药理学、分子药理学、量子药理学、时辰药理学、临床药理学等。

三、新药开发与研究

新药(new drug)指我国未生产过的药品。已生产的药品改变剂型、改变给药途径、增加新的适应证或制成新的复方制剂,亦属新药范畴。新药开发和研究是一个非常严格而复杂的过程,是不断地发现和提供安全、有效和适应疾病谱变化的药物源泉,对于保护人民健康具有十分重要的意义。近年来,随着新技术的进步与发展,新药研制的进程已大大加速,各国政府十分重视这一工作,多数国家对新药的试验研究及新药生产上市的审批和管理都有明确的法律条文规定,并受到政府专门机构严密的监控。

新药的来源主要包括:①分离、提取、改造动物、植物药有效成分;②定向合成新化合物;③内源性活性物质的模拟合成和改造;④对已知化合物进行结构修饰;⑤人工导向药物;⑥生物技术和基因重组。

新药评价是药理学中一项既有很强的理论性、又有重大实践意义的科学,它关系着新药的开发与研究,制药工业与药理研究工作的进展和疾病防治水平的提高。主要分为临床前评价和临床评价。临床前评价除药学研究如工艺路线、理化性质、质量标准、稳定性之外,还包括根据其适应证而进行的临床前药理学研究,内容包括主要药效学和一般药理学研究,还包括毒理学、药代动力学等方面的内容。该项研究一般在动物中进行。通过临床前评价,目的是要确定一个新化合物是否具备进入临床试验的条件,弄清新药的作用谱及可能出现的毒性反应。这阶段工作的最后体现形式是完成全部申请临床试验所需的资料。

新药的临床评价是以人体为对象,研究药物在人体内作用规律及人体与药物之间相互作用过程,其研究目的是对新药在人体中的安全性及有效性进行评价。其主要内容包