

第17版

新编药理学

主 编 陈新谦 金有豫 汤 光



 人民卫生出版社

第17版

新编药理学

主 编 陈新谦 金有豫 汤 光
副 主 编 李大魁 林志彬 李 林
执行主编 金有豫 李 林
主 审 赵相印 王汝龙 林三仁 范光升
编 委 陈新谦 金有豫 李大魁 李 林 李玉珍 林志彬
汤 光 王汝龙 谢惠民 张天禄 赵相印
本版撰稿人 陈新谦 金有豫 李大魁 李 林 李晓蓉 林志彬
鲁云兰 梅 丹 沈 素 孙 燕 汤 光 唐 玉
薛 明 王 强 王育琴 王子平 谢惠民 章国良
张天禄 张晓乐 周际昌



人民卫生出版社

图书在版编目 (CIP) 数据

新编药理学/陈新谦等主编. —17 版. —北京:
人民卫生出版社, 2011. 1
ISBN 978-7-117-13788-1

I. ①新… II. ①陈… III. ①药理学 IV. ①R9
中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2010) 第 231099 号

门户网: www.pmph.com 出版物查询、网上书店
卫人网: www.ipmph.com 护士、医师、药师、中医师、卫生资格考试培训

版权所有, 侵权必究!

敬 请 注 意

医药科学知识不是永恒不变的, 其信息也随之而有变化。作者和出版社尽可能地将新的和准确的资料收入本书, 但由于各种原因难以做到完全无误。因此, 我们郑重地建议读者在应用这些资料时, 再以其他来源的资料进行确认, 特别是对于药物的适应证、禁忌证、用法和用量, 需遵循有关法规和标准以及药品包装中的说明书。

ISBN 978-7-117-13788-1



新 编 药 物 学
第 17 版

主 编: 陈新谦 金有豫 汤 光
出版发行: 人民卫生出版社 (中继线 010-59780011)
地 址: 北京市朝阳区潘家园南里 19 号
邮 编: 100021
E - mail: pmph@pmph.com
购书热线: 010-67605754 010-65264830
010-59787586 010-59787592
印 刷: 北京人卫印刷厂(宏达)
经 销: 新华书店
开 本: 889×1194 1/16 印张: 68
字 数: 2493 千字
版 次: 1951 年 6 月第 1 版 2011 年 1 月第 17 版第 44 次印刷
标准书号: ISBN 978-7-117-13788-1/R·13789
定 价: 148.00 元
打击盗版举报电话: 010-59787491 E-mail: WQ@pmph.com
(凡属印装质量问题请与本社销售中心联系退换)

新编药理学

历年版次

- 第一版 1951年6月 (华东医务生活社)
- 第二版 1951年11月 (华东医务生活社)
- 第三版 1952年1月 (华东医务生活社)
- 第四版 1952年10月 (华东医务生活社)
- 第五版 1952年11月 (华东医务生活社)
- 第六版 1954年10月 (人民卫生出版社)
- 第七版 1957年10月 (人民卫生出版社)
- 第八版 1960年10月 (人民卫生出版社)
- 第九版 1963年12月 (人民卫生出版社)
- 第十版 1974年9月 (人民卫生出版社)
- 第十一版 1981年12月 (人民卫生出版社)
- 第十一版
(增补版) 1983年3月 (人民卫生出版社)
- 第十二版 1985年12月 (人民卫生出版社)
(获1986年全国优秀畅销图书奖)
- 第十三版 1992年1月 (人民卫生出版社)
(1996年获第一届国家医药管理局优秀图书奖一等奖)
- 第十四版 1997年7月 (人民卫生出版社)
(获2000年全国优秀畅销图书奖)
- 第十五版 2003年4月 (人民卫生出版社)
(获2003年全国优秀畅销图书奖)
- 第十六版 2007年1月 (人民卫生出版社)

• (华东医务生活社) 人民卫生出版社前身 •

值此《新编药理学》出版60周年之际和在我国深化医疗卫生体制改革的大好形势下,本书第17版即将与广大读者见面。60年来,在作者的辛勤耕耘以及与出版者和读者的紧密联系,并在“准(确)、新(颖)、实(用)、全(面)”这一编写方针的指导下,本书得以不断地发展提高和修订再版,为读者提供了丰富的医药学知识,为我国的医药卫生事业做出了应有的贡献。因此,本书曾多次荣获全国优秀畅销图书奖,并于2009年被列为“新中国60年最具影响力的600本书”(本书为其中科技类23种图书之一)。这些殊荣,充分说明了本书60年来已奠定了广泛的读者基础,赢得了广大读者的厚爱 and 好评。同时也为第17版的编写修订创造了良好的条件。

第17版内容的编写修订是根据我国深化医疗卫生体制改革的原则精神和国家食品药品监督管理局的相关要求,为紧跟医药学科的发展和不断满足临床医师和药学工作者的需要,以安全合理使用药物为重点,在第16版基础上做了较大的补充和提高。同时,为便于检索和阅读,对第17版的编排和印制也做了较大的改进。具体修订调整如下:

1. 调整收录的药物品种 本版正文共收录药物近2100种。补充了第16版应该收录而被遗漏的药物品种以及自2006年以来国内上市的国产和进口的新药品种,如新型带状疱疹镇痛药等共120余种。删除了由于不良反应或毒性而被国家食品药品监督管理局(SFDA)淘汰的药物[仅被美国食品药品监督管理局(FDA)淘汰或制药企业召回者用文字注明,本版未予以删除],如在我国撤市的抗肥胖症药西布曲明等共3种;删除了第16版列于章(或节)末表格中确已不再应用的药物,但为便于个别读者作历史性的检索,在相应的章或节末用文字注明了需了解的相关药物“可查阅本书第16版第××页”。为节省篇幅,对第16版中列于章(或节)末表格中仍在应用的药物,改为连续文字叙述,不列项目标题,以小一号字体排印。

2. 更新和充实相关内容 对各类药物的“综述性介绍”,根据临床的需求更新和补充该类药物药理学及药物治疗学方面的研究进展及分类等内容。并依据国内外药品管理机构(如SFDA、FDA等)正式发布的文件以及相关权威刊物如《药品不良反应信息通报》、《中国药物警戒》等,特别针对有关药物安全有效方面的内容,予以修订充实了部分药物(如口服降血糖药胰岛素增敏剂类的罗格列酮等)的有关项目如“适应证”、“用法和用量”、“不良反应”、“禁忌证”、“注意”、“药物相互作用”等内容。对个别药物的文字内容表述做了删繁就简和调整,使之更加简明、准确和富有条理性。书末全新修订了“附录三、儿科用药剂量表”和“附录五、按对妊娠的危险性等级的药物检索表”的内容。

3. 完善药品标注 为读者便于了解本版收录的药物哪些属于或列入《中华人民共和国药典》(2010年版)、《国家基本药物目录》(2009年版基层版)和《国家基本医疗保险、工伤保险和生育保险药品目录》(2009年版)收录品种,在相关药品名称的右上角分别标注了〔药典(一)〕、〔药典(二)〕、〔药典(三)〕、〔基(基)〕或〔医保(甲,乙)〕。

4. 调整篇章结构、药物内容项目和采用双色印刷 为使内容更加醒目,便于读者查找和阅读,全书正文编排结构改为 15 篇共 83 章,在每章正文之前列出本章目录。对具体药物的内容项目调整为“化学结构式”、“其他名称”、“性状”、“药理学”、“适应证”、“用法和用量”、“不良反应”、“禁忌证”、“注意”、“药物相互作用”等项。对正文所有标题和具体药物的内容项目名称一律采用彩色印刷。同时,为了管理工作的需要,在多数药物品种下列出了该药的国际通用“ATC 编码”。

总之,第 17 版无论在药物品种和内容或是编排结构等方面,较第 16 版有较大的提高。

姜之奇和姚娴老师参加本版的编辑工作,对她们付出的辛勤劳动表示感谢!

《新编药理学》的发展和提高离不开读者的关怀、批评和鼓励。我们衷心地希望和欢迎广大读者对第 17 版提出宝贵的意见和建议,使本书不断改进,更好地为大家服务!

编者

2010 年 12 月 13 日

——写在《新编药理学》出版 60 周年和第 17 版刊行之际

早在 30 多年前我还是一名内科医生的时候,《新编药理学》就是我的案头书,闲时读来,急时翻查,这一翻一读近 20 年,喜爱备至。作为社长和总编辑,这已经是第二次主持《新编药理学》的修订,尤其是作为连续出版 60 年的第 17 版修订出版,我倍感荣幸。

《新编药理学》于 1951 年 6 月由人民卫生出版社前身华东医务生活社正式出版发行,60 年来修订 17 版,印刷 80 次,发行 300 万册,三度评为全国优秀畅销书,荣获“新中国 60 年最具影响力的 600 本书”并位居 23 种科技书第二,60 年间再版不断,畅销不衰,成为人民卫生出版社的重要品牌书。

一部精品的培育,一部传世佳作的诞生,一定是作者、出版发行者还有读者共同参与努力的结果。我们一再强调,是作者的心血和笔墨打造了人卫图书的品牌。优秀的临床工作者不一定写出好的作品,但一部优秀的作品特别是传世佳作,一定出自一流的专家学者;不是所有的优秀书稿都能成为传世佳作,除了规范和高质量的编辑加工外,如何装帧设计,何时宣传推出,怎样策划营销,尤其如何在作者和读者间搭起沟通的桥梁,都需要出版人的辛勤劳动和刻苦努力;优秀作品的最终检验者是市场、是读者,几代医务工作者对《新编药理学》的需求和喜爱,意见和建议,关心和支持,是这部精品长版不衰的源动力。一部《新编药理学》,指导了建国以来几代临床医生和临床药理学工作者合理准确地用药,从而挽救了无数生命。

人民卫生出版社之所以成为我国专业出版领域的大社强社,是因为拥有一批像《新编药理学》这样的精品支撑,是因为拥有国内一流的专家作者群。在《新编药理学》出版 60 周年及第 17 版刊行之际,我们对陈新谦教授、金有豫教授、汤光教授三位主编以及整个编写团队的专家学者,表达衷心的感谢!

随着我国改革开放经济崛起,我国的文化软实力也在不断增强。文化体制改革为人民卫生出版社带来了更好的发展机遇。随着人民卫生出版社美国公司的设立和收购国外医学出版公司全部图书资产的成功尝试,随着世界医药图书大厦的落成,其作为中外医药工作者殿堂的作用越来越显现,人民卫生出版社的国际化进程必将迎来更大的发展空间。这种发展,需要《新编药理学》这样的精品,需要内容由国内领先达到与国际同步,需要作者团队的中外交流与交融,也就是说今天作为中国医务工作者必备的案头书《新编药理学》,明天或将成为世界医务工作者案头必备的书,让我们共同期待并为之努力!

人民卫生出版社社长兼总编辑



2010 年 12 月 12 日

第16版

序

《新编药理学》第16版将于2007年伊始与大家见面。这一版的内容有较大的变化,及时反映了医学科学研究、药物发展和加强管理方面的新进展。

首先,在药物品种和内容上比第15版增加了新药品80余种和新制剂20余种,特别是近来新上市的或即将上市的药品,如抗菌药的达托霉素和帕尼培南、调节血脂药瑞舒伐他汀、免疫抑制药芬戈莫德(FTY720)、脑保护药依达拉奉和两性霉素B的新制剂等。另外,对于第15版原有药物的一些如药理及应用、用法、注意等内容也根据新进展进行了修订或补充;并加强了一些类别药物的综述性前言,以便读者更好地了解该类药物的发展概况。

其次,对某些药物或制剂的名称和成分(本书第15版序所述的,由于当时改革工作尚未结束而未及改动的一些药物或制剂的名称和成分),如氨基酸及其复方制剂和生物制品中的疫苗等,第16版均按《中国药典》(2005年版)或新的药品标准进行了规范。

再者,根据《中国药典》(2005年版)、《国家基本药物目录》(2004年版)、药品管理部门发布的有关公告和法规,第16版更新了药品的上角标记、一些药物(如穿心莲、鱼腥草、头孢替安、奥美拉唑等)的用药方法或注意事项以及附录一“麻醉药品和精神药品品种目录”。

为了便于读者阅读,本版在版面编排上有一些改进:将药物相互作用的内容单独以表格的方式列于该类药物之后;将《中华人民共和国药典临床用药须知》2005年版附录“儿科用药剂量表”中的有关品种,按照本书的章节顺序列表编排后作为本书的附录三,供参考,不再于该药中叙述其儿科用药剂量;为了节约篇幅,对于在第15版中收录的、但目前已很少应用的某些药物,只在相应的文后多以列表形式注明其在第15版中的页码,可供如需要了解有关内容的读者查阅。

本书第15版的几位撰写者和审阅者,由于工作或健康原因,未能参加第16版的修订工作,在此向他们对本书所做的贡献表示由衷的敬意!本版增聘林三仁和范光升教授为审阅者,将可加强对本书临床内容的审阅力量,谨致以谢意和欢迎!对姜之奇和姚娴老师参加本版编辑工作的辛勤劳动也致以感谢!

《新编药理学》的发展和进步离不开读者的关怀、批评和鼓励。我们衷心地希望和欢迎广大读者们不断提出宝贵意见和建议,使本书能不断改进,更好地为大家服务!

编者

2006年12月

新編藥物學

陳新謙 編著

版權所有 ★ 不准翻印

一九五一年六月出版

新編藥物學

編著 陳新謙

出版發行 華東醫務生活社

社址：上海高安路五十二號
濟南經二路三〇一號

印刷 濟南振業印刷廠

00001—10000

華東醫務生活社出版

1951.6.

序

這本小書是在華東醫務生活社同志們的督促鼓勵之下，用了大約三個月的功夫，擠出課餘休息的時間匆忙寫成的。寫成以後，我雖幾次想把原稿從頭到尾好好整理一遍，但由於工作太忙，始終未能作到。甚至於到最後校對的時候，也沒有能仔細校閱，因為我不巧又在南京生了病。現在檢討起來，實在覺得對不起讀者。

本書的主要對象是中級醫務人員。爲了不祇供給讀者一般基本的知識，而且還希望爲讀者預備下一些必要的學習提高的材料，因此在本書內，新藥介紹得比較多，附錄材料也相當豐富、複雜；中級水平的讀者，可能一時還接受不了，甚至於還會嫌多、嫌亂。那末怎樣辦呢？如何才能使讀者讀起來方便呢？——我們是這麼辦：利用印刷上的條件，把藥品中最主要的（常用的）、次要的，以及比較不大重要的（比較少用到的），加以區分；我們在最主要的藥品之下，印上——，次要藥品的下面印着～～，比較不重要的藥品則不印什麼符號。這樣，讀者可以挑主要的藥品先學會，次要的以及比較不重要的，可作爲參考或留待以後學習。

此外，爲了行文簡潔，並讓讀者看書時方便輕快起見，所有作爲重量單位的 gm.（公分）都省掉了，而用得不多的 mg.（公絲）、c. c.（公撮）則仍然保留。

過去寫技術性教材的人，常常愛專繙某一外國（尤其是英美）的材料，不大照顧到本國的具體情況和需要，因此讀者讀起來就往往感覺隔膜；對實際工作的幫助也就不大。我寫本書時會注意到這一點，所以取材比較廣泛而有選擇，並特別注意搜集我國實際的材料。但由於材料來源的限制，加上自己對我國藥界情況了解的不够，「心有餘而力不足」，結果還是離理想很遠。

雖然是這麼粗糙的一本小書，也是在一些同志們的熱心幫助之下才得以完成的。首先要感謝的，是齊魯大學的張子聖、黃文興兩先生；承他們校閱本書原稿，並提出許多寶貴的意見。山東醫學院藥科的申作洵、王化雨二同志，在本書的校稿方面，曾盡過一些力量，尤其值得深深感謝。

最後，希望讀者在讀過本書後，把對本書的意見以及發現書中有問題的地方，寫信告知我們。如果本書萬一有改版的機會，我們相信，靠了讀者們的幫助，一定可以把它改好一些的。

陳新謙 一九五一年四月

目录

第 1 篇 引论.....	1
第 1 章 药物学总论.....	1
第 2 章 药物治疗的药理学基础 (药物与机体的相互作用).....	3
第 3 章 合理使用药物.....	12
第 4 章 药物的制剂和贮存.....	29
第 5 章 药品和处方管理.....	32
第 2 篇 抗感染药物.....	34
第 6 章 抗生素.....	34
第 7 章 化学合成的抗菌药.....	91
第 8 章 抗结核药.....	105
第 9 章 抗麻风病药及抗麻风病反应药.....	112
第 10 章 抗真菌药.....	115
第 11 章 抗病毒药.....	122
第 12 章 抗寄生虫病药.....	134
第 3 篇 主要作用于中枢神经系统的药物.....	157
第 13 章 中枢神经系统兴奋药.....	157
第 14 章 镇痛药.....	163
第 15 章 解热镇痛抗炎药.....	179
第 16 章 抗痛风药.....	209
第 17 章 抗癫痫药.....	213
第 18 章 镇静药、催眠药和抗惊厥药.....	225
第 19 章 抗震颤麻痹药.....	234
第 20 章 抗精神病药.....	245
第 21 章 抗焦虑药.....	267
第 22 章 抗躁狂药.....	281
第 23 章 抗抑郁药.....	282
第 24 章 抗脑血管病药.....	302
第 25 章 抗老年痴呆药和改善脑代谢药.....	315
第 26 章 麻醉药及其辅助用药.....	326

目录

第 28 章	拟肾上腺素药和抗肾上腺素药	347
第 5 篇	主要作用于心血管系统的药物	362
第 29 章	钙通道阻滞药	362
第 30 章	治疗慢性心功能不全的药物	372
第 31 章	抗心律失常药	377
第 32 章	防治心绞痛药	386
第 33 章	周围血管舒张药	393
第 34 章	降血压药	398
第 35 章	抗休克的血管活性药	412
第 36 章	调节血脂药及抗动脉粥样硬化药	416
第 6 篇	主要作用于呼吸系统的药物	426
第 37 章	祛痰药	426
第 38 章	镇咳药	430
第 39 章	平喘药	437
第 7 篇	主要作用于消化系统的药物	460
第 40 章	治疗消化性溃疡和胃食管反流病药物	460
第 41 章	胃肠解痉药	481
第 42 章	助消化药	485
第 43 章	促胃肠动力药及止吐药和催吐药	487
第 44 章	泻药和止泻药	496
第 45 章	微生态药物	502
第 46 章	肝胆疾病辅助用药	504
第 47 章	治疗炎性肠病药	518
第 48 章	其他消化系统用药	521
第 8 篇	影响血液及造血系统的药物	525
第 49 章	促凝血药	525
第 50 章	抗凝血药	533
第 51 章	血浆及血浆代用品	544
第 52 章	抗贫血药	548
第 53 章	促进白细胞增生药	553

目录

第 54 章	抗血小板药物	557
第 9 篇	主要作用于泌尿和生殖系统的药物	566
第 55 章	主要作用于泌尿系统的药物	566
第 56 章	主要作用于生殖系统和泌乳功能的药物	591
第 10 篇	激素及其有关药物	608
第 57 章	垂体激素及其有关药物	608
第 58 章	肾上腺皮质激素和促肾上腺皮质激素	609
第 59 章	性激素和促性腺激素	621
第 60 章	避孕药	638
第 61 章	胰岛素和其他影响血糖的药物	650
第 62 章	甲状腺激素类药物和抗甲状腺药物	664
第 11 篇	主要影响变态反应和免疫功能的药物	669
第 63 章	抗变态反应药	670
第 64 章	免疫抑制药	690
第 65 章	免疫增强药	704
第 12 篇	抗肿瘤药物	721
第 66 章	抗肿瘤药	721
第 13 篇	维生素类、营养类药物、酶制剂以及调节水、电解质和酸碱平衡的药物	774
第 67 章	维生素类	774
第 68 章	酶类和其他生化制剂	783
第 69 章	调节水、电解质和酸碱平衡用药	789
第 70 章	营养药	799
第 71 章	抗肥胖症药	817
第 14 篇	各科用药	818
第 72 章	老年病用药	818
第 73 章	外科用药和消毒防腐收敛药	836
第 74 章	皮肤科用药	847

目录

第 75 章 眼科用药	863
第 76 章 耳鼻喉科和口腔科用药	876
第 77 章 妇产科外用药	881
第 15 篇 其他类药物	884
第 78 章 解毒药	884
第 79 章 防治矽肺的药物	898
第 80 章 防治放射病的药物	898
第 81 章 药用附加剂	899
第 82 章 诊断用药	905
第 83 章 生物制品	917
附录	939
一、麻醉药品和精神药品目录	939
二、药物的近似溶解度	941
三、儿科用药剂量表	942
四、按体表面积计算小儿药物用量	959
五、按对妊娠的危险性等级的药物检索表	960
六、哺乳期妇女慎用的药物	980
七、运动员禁忌的药物	983
八、常见农药及毒物中毒急救一览表	985
九、某些药物及化学物品的血药浓度	988
十、临床药代动力学的数学术语及其定义	990
十一、某些药物的代谢动力学参数	991
十二、肝、肾功能低下时药物的 $t_{1/2}$ 和剂量的调整	995
十三、医药卫生学科常用计量单位和医用计量单位换算系数	998
中文药名索引	1000
英文药名索引	1045

第1篇 引 论

● 第1章 药理学总论	1
● 第2章 药物治疗的药理学基础(药物与机体的相互作用)	3
● 第3章 合理使用药物	12
● 第4章 药物的制剂和贮存	29
● 第5章 药品和处方管理	32

第1章 药理学总论

1.1 我国药理学史	1	1.2.1 药物的来源	2
1.2 药物的来源及植物药的成分	2	1.2.2 较重要的植物药化学成分	2

药理学是一门综合性学科。它包含药学许多方面的内容,并且与一些专门学科如药物治疗学、药理学、药剂学、药物化学等在内容上有一定程度的交叉,因此它涉足的领域具有相当的广度,但深度往往不如各有关专门学科。尽管如此,药理学仍是一门实用性很强的学科,也在与时俱进和不断提高。虽然现在各级医药院校一般都没有开设药理学课程,但药理学类的书籍却大量出版,而且历久不衰,特别是本书长期出版,经历了60年之久,这表明作为信息,药理学仍具有强大的生命力,它拥有广大的医药专业读者,在获取基本医药知识、提高医疗和用药水平上发挥着不容忽视的作用。之所以能如此,是由于它的内容实用性强,能指导医疗、药学等方面的实际工作,适合广大医药人员学习、参考的需要。

1.1 我国药理学史

药理学是一门古老的学科,在西方是如此,在我国也是如此。

我华夏之邦素称文明古国,向来以历史悠久、文化发达著称于世。我国医药起源很早,古代典籍有“伏羲氏尝味百草”、“神农尝百草”之说,虽然伏羲、神农是否实有其人尚待确定,但肯定有人将前人的发现、经验进行归纳、总结和提提高。这也表明我国早在原始社会,人们通过长期的生产、生活实践,已逐渐认识了某些植物、动物、矿物药的治疗作用。

根据现有史料,远在公元前11世纪以前的夏代和商代,我国就已有酒和汤液的发明。周代的《诗经》、《山海经》等著作中已记载许多种药物。长沙马王堆三号汉墓出土帛书《五十二病方》(据考证是公元前3世纪的写本)记载的药物达242种。秦汉之际,新的药物品种更不断增加。西汉初

年已有药物著作在民间流传。汉平帝元始5年(公元5年)曾征集天下通晓方术本草者来京师,“本草”已成为药理学的通称。《神农本草经》约成书于公元1~2世纪间。它总结了东汉以前的药物知识,是我国现存最早的药物学专著,收载药物365种。以后许多朝代都曾编修过本草。南北朝时陶弘景将《神农本草经》加以整理补充,汇编成《本草经集注》,药物由365种增加到730种,这是《神农本草经》以后药理学的又一次整理提高。显庆2年(公元657年)唐政府组织长孙无忌、苏敬等20余人编撰本草,并向各地征集药物标本,绘制成图,于显庆4年编成,收载药物850种,取名《新修本草》。这是我国第一部由国家颁行的药理学权威著作,有人认为它是世界上最早的一部国家药典。宋代官方与私人均从事本草的编修。宋初,政府曾组织编修《开宝本草》、《嘉祐本草》和《图经本草》,并颁行全国。四川名医唐慎微独力编成《经史证类备急本草》(简称《证类本草》),收载药物达1558种,附单方验方3000余首,为保存我国古代本草史料作出了贡献。明代李时珍所编《本草纲目》,集历代本草之大成,收载药物1892种,附方11000余首,共有插图1160幅,内容非常丰富。1596年出版以后,不仅在国内广为流传,而且还陆续译成德、日、英、法文等文字,传播海外,成为国际上研究药理学和生物学的宝贵参考资料。清代赵学敏编著《本草纲目拾遗》,收《本草纲目》未收载之药700余种,同时还博采国外及民间医药资料,内容很有参考价值。

鸦片战争(1840年)以后,我国海禁大开,西方医药大量传入,从而于传统医药之外逐渐形成另一西方医药体系。反映在药理学著作方面,既有传统本草著述(如吴其浚的《植物名实图考》、屠道和的《本草汇纂》)和中西结合的生药学

(如赵黄等的《现代本草——生药学》)的编撰,又有单纯介绍西方药物的著译作品,如傅约翰(亦译为傅兰雅)的《西药大成》及洪士提反的译作《万国药方》等。

以后,药理学著作的编撰出版逐渐增多,至新中国建立以前,陆续出版的有戴虹溥的《新体实用药理学》、梁心的《新纂药理学》、吴建瀛的《实用药理学》、顾学裘的《现代药理学》等,对普及西方药物知识起了有益作用。新中国建立以后,特别是改革开放之后,药理学书籍更如雨后春笋和百花争艳般地大量呈现。有的内容丰富,各具特色,对我国医药事业的发展起到重要的作用。

1.2 药物的来源及植物药的成分

1.2.1 药物的来源

来源有二,一是自然界,二是人工制备(包括仿生药物)。来自自然界的药物为天然药物,包括中药及部分西药;来自人工制备的药物为化学药物,包括大部分西药。

天然药物,特别是中药,大都已经过长时期的临床使用,其疗效多已肯定,使用安全性较高,因此近年来受到各国医药界的重视。相比之下,化学药物则由于某些品种不良反应较大,有的不良反应还需要较长期使用后始能发现,其潜在的不安全性使人们转而注意天然药物。但习惯上认为中药较为安全的看法也被近来发生的某些“木通”类的肾毒性所改变。

植物性天然药物(植物药)在天然药物(包括中药)中占较大比例,它的化学成分一直受到人们的注意。经过近百年来研究,其成分现已大体为人们所了解。

1.2.2 较重要的植物药化学成分

(1) 生物碱(胂碱):是一类含氮的碱性有机物质,大多数是无色或白色的结晶性粉末或细小结晶,味苦,少数是液体(如槟榔碱)或有颜色(如小檗碱)。在水内多数难溶,比较易溶于有机溶剂如醚、氯仿、醇等(但与酸化合成盐后,就易溶于水,能溶或稍溶于醇,而难溶于醚、氯仿等)。这类成分一般都具有相当强烈的生理作用。重要的生物碱如:吗啡、可待因(含于阿片)、奎宁(含于金鸡纳皮)、咖啡因(含于茶叶、咖啡豆)、阿托品(含于颠茄等)、东莨菪碱(含于洋金花)、土的宁(含于番木鳖)、吐根碱(含于吐根)、麻黄碱(含于麻黄)、可卡因(含于古柯叶)、毒扁豆碱(含于毒扁豆)、毛果芸香碱(含于毛果芸香叶)、麦角新碱、麦角胺(含于麦角)、小檗碱(含于黄连、黄柏、三颗针等)、延胡索乙素(含于元胡)、汉防己甲素(含于粉防己)等。

(2) 多聚糖:(简称多糖)是由十个以上的单糖基通过苷键连接而成的,一般多聚糖常由几百甚至几千个单糖组成。许多中草药中含有的多糖具有免疫促进作用,如黄芪多糖。从香菇分离出的香菇多糖具有明显的抑制实验动物肿瘤生长的作用。鹿茸多糖则可抗溃疡。

(3) 苷(配糖体;糖杂体):是糖或糖的衍生物与另一称为苷元(甙元或配基)的非糖物质,通过糖端的碳原子连接而成的化合物。苷的共性在糖的部分,而苷元部分几乎包罗各种类型的天然成分,故其性质各异。苷大多数是无色无臭的结晶或粉末,味苦或无味;多能溶于水与稀醇,亦能溶于其他溶剂;遇湿气及酶或酸、碱时即能被分解,生成苷元和糖。苷类可根据苷键原子不同而分为氧苷、硫苷、氮苷和碳苷,其中氧苷为最常见。

氧苷以苷元不同,又可分为醇苷、酚苷、氰苷、酯苷、吲哚苷等,现简述如下:

1) 醇苷:如具有适应原样作用的红景天苷和具有解痉止痛作用的獐牙菜苦苷均属醇苷。醇苷苷元中不少属于萜类和甾醇类化合物,其中强心苷和皂苷是重要的类型。含有强心苷的药物有洋地黄、羊角拗、夹竹桃、铃兰等。皂苷是一类比较复杂的苷类化合物,广泛存在于植物界,它大多可以溶于水,振摇后可生成胶体溶液,并具有持久性、似肥皂溶液的泡沫。皂苷是由皂苷元和糖、糖醛酸或其他有机酸所组成。按照皂苷被水解后所生成的苷元的结构,皂苷可分为两大类:甾体皂苷和三萜皂苷。薯蓣科薯蓣属许多植物所含的薯蓣皂苷元属于甾体皂苷;三萜皂苷在自然界的分布也很广泛,种类很多,如桔梗、人参、三七、甘草、远志、柴胡等均含有三萜皂苷。

2) 酚苷:黄酮、蒽醌类化合物通过酚羟基而形成黄酮苷、蒽醌苷。如芦丁、橙皮苷均属黄酮苷,分解后可产生具有药理活性的黄酮;大黄、芦荟、白番泻叶等含有蒽醌苷,分解后产生的蒽醌具有导泻作用。

3) 氰苷:氰苷易水解而产生羟腈,后者很不稳定,可迅速分解为醛和氢氰酸。如苦杏仁苷属于芳香族氰苷,分解所释出的少量氢氰酸具有镇咳作用。

4) 酯苷:如土槿皮中的抗真菌成分属酯苷。

5) 吲哚苷:如中药所含的靛苷是一种吲哚苷,其苷元吲哚醇氧化成靛蓝,具有抗病毒作用。

(4) 黄酮:为广泛存在于植物界中的一类黄色素,大都与糖类结合为苷状结构存在。多具有降血脂、扩张冠脉、止血、镇咳、祛痰、减低血管脆性等作用。银杏、毛冬青、黄芩、陈皮、枳实、紫菀、满山红、紫花杜鹃、小叶枇杷、芫花、槐米、蒲黄等都含有此成分。

(5) 内酯和香豆素(精):内酯属含氧的杂环化合物。香豆素系邻羟基桂皮酸的内酯,为内酯中的一大类,单独存在或与糖结合成苷,可有镇咳、祛痰、平喘、抑菌、扩张冠脉、抗辐射等作用,含存于秦皮、矮地茶、补骨脂、蛇床子、白芷、前胡等。其他内酯含存于穿心莲、白头翁、当归、银杏叶等,具有各自的特殊作用。

(6) 甾醇:常与油脂类共存于种子和花粉粒中,也可能与糖结合成苷。 β -谷甾醇(黄柏、黄芩、人参、附子、天门冬、铁包金等含有)、豆甾醇(柴胡、汉防己、人参、款冬、黄柏等含

有)、麦角甾醇(麦角、灵芝、猪苓等含有)及胆甾醇(即胆固醇,含于牛黄、蟾酥等)都属本类成分。

(7) 木脂素:多存在于植物的木部和树脂中,因此而得名。多数为游离状态,也有一些结合成苷。五味子、细辛、红花、连翘、牛蒡子含此成分。

(8) 萜类:为具有 $(C_5H_8)_n$ 通式的化合物以及其含氧与饱和程度不等的衍生物。中草药的一些挥发油、树脂、苦味素、色素等成分,大多属于萜类或含有萜类成分。

(9) 挥发油(精油):挥发油是一类混合物,其中常含数种乃至十数种化合物,主要成分是萜类及其含氧衍生物,具有挥发性,大多是无色或微黄色透明液体,具有特殊的香味,多比水轻,在水内稍溶或不溶,能溶于醇、醚等。其主要用途是调味、祛风、防腐、镇痛、通经、祛痰、镇咳、平喘等。含挥发油的中药很多,如:陈皮、丁香、薄荷、茴香、八角茴香、桂皮、豆蔻、姜、桉叶、细辛、白芷、当归、川芎、芸香草等。

(10) 树脂:均为混合物,主要的组成成分是二萜和三萜类

衍生物,有的还包括木脂素类。多由挥发油经化学变化后生成,不溶于水,能溶于醇及醚。如松香就是一种树脂。树脂溶解于挥发油,即为“油树脂”。油树脂内如含有芳香酸(如苯甲酸、桂皮酸等),则称为“香胶”或“树香”,也称作“香树脂”。

(11) 树胶:是由树干渗出的一种固胶体,为糖类的衍生物。能溶于水,但不溶于醇,例如阿拉伯胶、西黄芪胶等。

(12) 鞣质:从音译又名“单宁”。中药中含此成分较多的是五倍子、茶、大黄、石榴皮,其他树皮、叶、果实也常含有。鞣质多具收敛涩味,遇三氯化铁液变黑色,遇蛋白质、胶质、生物碱等能起沉淀,氧化后变为赤色或褐色。常见的五倍子鞣质亦称鞣酸,用酸水解时,分解出糖与五倍子酸,因此也可看作是苷。临床上用于止血和解毒。

(13) 有机酸:本成分广泛存在于植物中,未熟的果实内尤多,往往和钙、钾等结合成盐,常见的有枸橼酸、苹果酸、蚁酸、乳酸、琥珀酸、酒石酸、草酸、鞣酸等。

(陈新谦)

第2章 药物治疗的药理学基础(药物与机体的相互作用)

2.1 药物的作用和药效学及其基本概念	3	2.2.1.4 药物的排泄	5
2.1.1 药物对机体(含病原体)的作用	3	2.2.2 药物代谢动力学	6
2.1.2 选择性作用	4	2.2.2.1 生物膜及药物转运	6
2.1.3 局部作用和吸收作用	4	2.2.2.2 房室概念及房室模型	7
2.1.4 药物与受体的相互作用	4	2.2.2.3 表观分布容积	8
2.2 药物的体内过程和药物代谢动力学及其基本概念	4	2.2.2.4 速率常数及消除速率常数	8
2.2.1 药物的体内过程	4	2.2.2.5 半衰期	9
2.2.1.1 药物的吸收	4	2.2.2.6 生物利用度	10
2.2.1.2 药物的分布	5	2.2.2.7 临床给药方案的计算	10
2.2.1.3 药物的代谢	5	2.2.2.8 体内药量的估计	11
		2.2.2.9 口服负荷剂量(D_L)的计算	12

药物之所以能用于预防、治疗或诊断疾病,就在于药物与机体接触后,药物与机体之间可相互作用而产生特定的影响,它包括药物对机体(含病原体)的作用和机体对药物的作用;前者在药理学上属于药效学的范围,后者属于药物代谢动力学的范围。因此药物与机体的相互作用就成为药物治疗的药理学基础。

2.1 药物的作用和药效学及其基本概念

2.1.1 药物对机体(含病原体)的作用

主要是对生理功能的兴奋或抑制。有些药物可使人体原有的生理功能加强,称为“兴奋”,如戊四氮可兴奋被抑制的呼

吸中枢;有些则使生理功能减弱,称为“抑制”,如阿托品可使痉挛的胃肠平滑肌松弛。在人体内,同一药物对不同的器官可以产生不同的作用,例如肾上腺素对心脏呈兴奋作用,而对支气管平滑肌呈抑制作用(使其松弛)。由于药物剂量的增减,兴奋和抑制也可互相转化,例如戊四氮在治疗剂量时兴奋呼吸中枢,剂量过大时则引起阵挛性惊厥,并进一步转化为中枢抑制。

药物对病原体的作用,则主要是通过干扰病原体的代谢而抑制其生长繁殖,例如:青霉素抑制细菌细胞壁的合成;氯霉素抑制细菌核蛋白体的合成;氯喹同疟原虫的核蛋白结合(主要是与脱氧核糖核酸即DNA相结合)而抑制DNA的复制,使核酸合成减少,从而影响其生长繁殖。

2.1.2 选择性作用

一种药物对于机体各器官组织的作用并不是一样的,往往是对某一个或几个器官组织的某些功能影响特别明显,而对其他器官组织的影响则并不突出。这就是药物的选择作用。例如洋地黄之对于心脏,苯巴比妥之对于中枢神经系统,都具有选择作用。但选择作用一般说来是相对的,而非绝对的,也就是说,一种药物往往同时对几个组织或器官的功能都产生影响,只不过其作用强度有量的区别而已。一种药物只有一种作用的情况是很少见的。选择性高的药物,往往不良反应较少、疗效较好,临床应用可以有针对性地治疗某种疾病。有些药物小剂量时只选择作用于个别器官,大剂量时则引起较广泛的全身性毒性反应,故应注意剂量的掌握。

2.1.3 局部作用和吸收作用

药物应用于机体时,根据其作用部位的不同,可分为局部作用和吸收作用。前者系指药物在用药部位所呈现的作用(如普鲁卡因的局部麻醉作用),后者则指药物被机体吸收以后所呈现的作用(如服氯喹后出现的抗疟作用)。

2.1.4 药物与受体的相互作用

多年以前,有人就曾提出,药物所以能够发生作用,是由于它与机体效应器的某一部位相结合,这一部位当时被称为“接受物质”,以后又被称为“受体”(receptor)或“受点”(receptor site)。现已确知,“受体”是位于细胞膜或细胞内的一种蛋白质,能同体内神经传导介质、激素及其他内源性活性物质或某些药物相结合,从而引起一系列生化反应,表现为细胞或组织器官功能的兴奋或抑制。受体有高度的特异性。如和乙酰胆碱结合的受体,称为“胆碱受体”。受体还可有其亚型,如胆碱受体分成毒蕈碱型(M)和烟碱型(N)两类。前者可以分为M₁、M₂、M₃、M₄、M₅等类;后者又分为两型:1型(N₁,又称N_A型)和2型(N₂,又称N_B型)。

已知的受体有胆碱受体、肾上腺素受体、多巴胺受体、5-羟色胺受体、吗啡受体(阿片受体)、组胺受体(包括组胺H₁受体和H₂受体),以及各种激素(如肾上腺皮质激素、性激素、胰岛素等)的受体等。

当然,并不是所有药物都是通过与受体结合而产生作用的,例如某些吸入性全身麻醉药,它们产生麻醉作用,据认为就不是通过与特殊受体的结合,而可能是由于它们易溶于类脂质,能浓集于富含脂质的神经组织,使神经细胞膜的通透性发生变化,从而引起神经冲动传导障碍。

既具有与受体结合的亲和力,又具有内在活性的药物,可以与相应的受体结合,并激动受体,继而产生一定的生物效应(如心脏收缩、腺体分泌等),这类药物称为受体激动剂(agonist),如乙酰胆碱,可与胆碱受体结合并激动之。只具有与受体结合的亲和力,但不具有内在活性的药物,可以与相应的受体结合,但不能激动受体,甚至可以阻滞激动剂与之

结合而发生效应,这类药物称为受体拮抗剂(antagonist)或阻滞剂,如阿托品,可以与胆碱受体结合而阻断乙酰胆碱与之结合从而拮抗乙酰胆碱的效应。

药物与受体结合后,通过信号传导系统引起细胞的反应,这是一种重要的药物作用机制。

细胞膜上受体的数目或反应性可受其周围的生物活性物质或药物(激动剂或拮抗剂)的作用或浓度的影响而发生改变。上述药物或药物浓度高、作用过强或长期激动受体,可使受体数目减少,称为衰减性或向下性调节。反之,可使受体数目增多,称为上增性或向上调节。向下调节与机体对长期应用激动剂或产生耐受性有关,如哮喘患者久用异丙肾上腺素治疗可以产生疗效降低;而向上调节则与长期应用拮抗剂后敏感性增加或撤药症状有关,如高血压患者应用普萘洛尔时突然停药可引起反跳现象。

2.2 药物的体内过程和药物代谢动力学及其基本概念

2.2.1 药物的体内过程

药物进入机体后,药物在机体的影响下,可以发生一系列的运动和体内过程:如药物自用药部位被吸收进入(静脉注射则直接进入)血液循环;然后分布于各器官组织、组织间隙或细胞内;有些药物则在血浆、组织中与蛋白质结合;或在各组织(主要是肝脏)发生化学反应而被代谢;最后,药物可通过各种途径离开机体(排泄);即药物的吸收、分布、代谢和排泄过程。它们可归纳为两大方面:一是药物在体内位置的变化,即药物的转运,如吸收、分布、排泄;二是药物的化学结构的改变,即药物的转化(又称生物转化),亦即狭义的代谢。由于转运和转化以致引起药物在体内量或浓度(血浆内、组织内)的变化,而且这一变化可随用药后的时间移行而发生动态变化。众所周知,药物对机体的作用或效应是依赖于药物的体内浓度,因而上述各过程对于药物的作用也就具有重要的意义。

2.2.1.1 药物的吸收

药物的吸收是它从用药部位转运至血液的过程。其吸收快、慢、难、易,可受多种因素的影响:

(1) 药物本身的理化性质:脂溶性物质因可溶于生物膜的一类脂质中而扩散,故较易吸收;小分子的水溶性物质可自由通过生物膜的膜孔扩散从而被吸收;而如硫酸钡,它既不溶于水又不溶于脂肪,虽大量口服也不致引起吸收中毒,故可用于胃肠造影。非解离型药物可被转运,故酸性有机药物如水杨酸类、巴比妥类,在酸性的胃液中不离解,呈脂溶性,故在胃中易于吸收。而碱性有机药物如生物碱类,在胃液中大部分离解,故难以吸收,到肠内碱性环境中才被吸收。改变吸收部位环境的pH值,使脂溶性药物不离解部分的浓度提高时,吸收就会增加,例如用碳酸氢钠使胃液pH值升高