

普通高等教育“十一五”国家级规划教材
全国高等医药院校药学类规划教材

配套教材

药理学

学习指导

YAOLIXUE XUEXI ZHIDAO

主编 邹莉波



中国医药科技出版社

全国高等医药教材建设研究会
全国高等医药教材建设研究会教材开发中心



药理学 学习指导

全国高等医药教材建设研究会教材开发中心

王海涛主编

全国高等医药教材建设研究会教材开发中心

普通高等教育“十一五”国家级规划教材
全国高等医药院校药学类规划教材

配套教材

药理学学习指导

主编 邹莉波

编委 (以姓氏笔画为序)

王芳 (沈阳药科大学)

吕俊华 (暨南大学)

朱东亚 (南京医科大学)

向明 (华中科技大学)

许启泰 (河南大学药学院)

李俊 (安徽医科大学)

李卫平 (大连医科大学)

李元建 (中南大学)

吴基良 (咸宁学院)

邹莉波 (沈阳药科大学)

张轩萍 (山西医科大学)

季晖 (中国药科大学)

孟宪丽 (成都中医药大学)

秦正红 (苏州大学)

钱之玉 (中国药科大学)

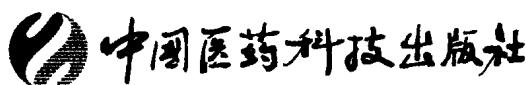
高允生 (泰山医学院)

郭芳 (河北医科大学)

曹永孝 (西安交通大学)

谭毓治 (广东药学院)

潘建春 (温州医学院)



内 容 提 要

本书是普通高等教育“十一五”国家级规划教材、全国高等医药院校药学类规划教材《药理学》（第三版）的配套教材。本书共44章，与《药理学》（第三版）教材章节编排完全一致。本书结构包括学习要点、要点精讲、自测习题及参考答案。以便于学生在课后进行同步复习，帮助学生对课堂授课内容的消化理解，自我检测学习效果。书后附有两套模拟试卷及答案，有利于学生自我检测对药理学知识的综合掌握情况和提高应试技巧。

本书可供高等医药院校药学类专业学生使用，也可供广大药理学专业人员在教学、培训等工作中参考。

图书在版编目（CIP）数据

药理学学习指导 / 邹莉波主编. —北京 : 中国医药科技出版社, 2010. 6

普通高等教育“十一五”国家级规划教材 . 全国高等医药院校药学类
规划教材配套教材

ISBN 978 - 7 - 5067 - 4353 - 2

I. ①药… II. ①邹… III. ①药理学 - 医学院校 - 教学参考资料
IV. ①R96

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2010) 第 051255 号

美术编辑 张 瑰

版式设计 郭小平

出版 中国医药科技出版社

地址 北京市海淀区文慧园北路甲 22 号

邮编 100082

电话 发行：010 - 62227427 邮购：010 - 62236938

网址 www. cmstp. com

规格 787 × 1092mm^{1/16}

印张 23 1/4

字数 533 千字

版次 2010 年 6 月第 1 版

印次 2010 年 6 月第 1 次印刷

印刷 廊坊市华北石油华星印务有限公司

经销 全国各地新华书店

书号 ISBN 978 - 7 - 5067 - 4353 - 2

定价 45.00 元

本社图书如存在印装质量问题请与本社联系调换

全国高等医药院校药学类规划教材常务编委会

名誉主任委员	吴阶平 蒋正华	卢嘉锡
名誉副主任委员	邵明立 林蕙青	
主任委员	吴晓明 (中国药科大学)	
副主任委员	吴春福 (沈阳药科大学) 姚文兵 (中国药科大学) 吴少祯 (中国医药科技出版社) 刘俊义 (北京大学药学院) 朱依谆 (复旦大学药学院) 张志荣 (四川大学华西药学院) 朱家勇 (广东药学院)	
委员 (按姓氏笔画排列)		
	王应泉 (中国医药科技出版社)	
	叶德泳 (复旦大学药学院)	
	刘红宁 (江西中医学院)	
	毕开顺 (沈阳药科大学)	
	吴 勇 (四川大学华西药学院)	
	李元建 (中南大学药学院)	
	李 高 (华中科技大学同济药学院)	
	杨世民 (西安交通大学医学院)	
	陈思东 (广东药学院)	
	姜远英 (第二军医大学药学院)	
	娄红祥 (山东大学药学院)	
	曾 苏 (浙江大学药学院)	
	程牛亮 (山西医科大学)	
秘书	夏焕章 (沈阳药科大学)	
	徐晓媛 (中国药科大学)	
	浩云涛 (中国医药科技出版社)	
	高鹏来 (中国医药科技出版社)	

出版说明

全国高等医药院校药学类专业规划教材是目前国内体系最完整、专业覆盖最全面、作者队伍最权威的药学类教材。随着我国药学教育事业的快速发展，药学及相关专业办学规模和水平的不断扩大和提高，课程设置的不断更新，对药学类教材的质量提出了更高的要求。

全国高等医药院校药学类规划教材编写委员会在调查和总结上轮药学类规划教材质量和使用情况的基础上，经过审议和规划，组织中国药科大学、沈阳药科大学、广东药学院、北京大学药学院、复旦大学药学院、四川大学华西药学院、北京中医药大学、西安交通大学医学院、华中科技大学同济药学院、山东大学药学院、山西医科大学药学院、第二军医大学药学院、山东中医药大学、上海中医药大学和江西中医学院等数十所院校的教师共同进行药学类第三轮规划教材的编写修订工作。

药学类第三轮规划教材的编写修订，坚持紧扣药学类专业本科教育培养目标，参考执业药师资格准入标准，强调药学特色鲜明，体现现代医药科技水平，进一步提高教材水平和质量。同时，针对学生自学、复习、考试等需要，紧扣主干教材内容，新编了相应的学习指导与习题集等配套教材。

本套教材由中国医药科技出版社出版，供全国高等医药院校药学类及相关专业使用。其中包括理论课教材 82 种，实验课教材 38 种，配套教材 10 种，其中有 45 种入选普通高等教育“十一五”国家级规划教材。

全国高等医药院校药学类规划教材

编写委员会

2009 年 8 月 1 日

前　　言

《药理学学习指导》是在全国高等医药院校药学类规划教材编写委员会指导下编写的教学参考书，是普通高等教育“十一五”国家级规划教材、全国高等医药院校药学类规划教材《药理学》（第三版）的配套教材。可供高等医药院校药学类专业学生使用，也可供广大药理学专业人员在教学、培训等工作中参考。

本书共44章，与《药理学》（第三版）教材章节编排完全一致，以便于学生在课后进行同步复习，帮助学生对课堂授课内容的消化理解和自我检测学习效果。本书结构包括学习要点、要点精讲、自测习题及参考答案。在要点精讲中，浓缩了教材中的主要知识点；在自测习题中，可通过多种题型来强化知识点的掌握，特别强调了知识点的比较，并尽量以表格的形式在参考答案中列出，一目了然，便于理解记忆。在全书的最后附有两套模拟试卷及答案，有利于学生自我检测对药理学知识的综合掌握情况和提高应试技巧。

本书的参编单位共有十八所高等医药院校，与《药理学》（第三版）相同。由于参编单位多，编写时间短，编者自身业务水平有限，本书可能尚存在不足和疏漏之处，恳切希望使用本书的师生给予批评指正，不吝赐教。

邹莉波

2010年2月

CONTENTS

目 录

第一篇 药理学总论

第一章 绪论	(3)
第二章 药物代谢动力学	(6)
第三章 药物效应动力学	(14)
第四章 影响药物作用的因素	(21)

第二篇 化学治疗药物

第五章 抗微生物药物概论	(33)
第六章 β -内酰胺类抗生素	(39)
第七章 大环内酯类、林可霉素类及多肽类抗生素	(46)
第八章 氨基糖苷类抗生素	(53)
第九章 四环素类及氯霉素	(60)
第十章 人工合成抗微生物药	(67)
第十一章 抗真菌药物	(75)
第十二章 抗病毒药物	(83)
第十三章 抗结核病药和抗麻风病药	(89)
第十四章 抗寄生虫药	(96)
第十五章 抗恶性肿瘤药	(104)

第三篇 外周神经系统的药物

第十六章 外周神经的药理学概述	(121)
第十七章 作用于胆碱受体的药物	(126)
第十八章 作用于肾上腺素受体的药物	(136)



第四篇 中枢神经系统药物

第十九章 全身麻醉药	(153)
第二十章 镇静催眠药	(158)
第二十一章 中枢兴奋药	(165)
第二十二章 抗癫痫药和抗惊厥药	(170)
第二十三章 治疗中枢神经系统退行性疾病的药物	(175)
第二十四章 抗精神失常药	(186)
第二十五章 镇痛药	(197)
第二十六章 解热镇痛抗炎药	(204)

第五篇 心血管系统药物

第二十七章 离子通道的药理学概述	(215)
第二十八章 抗心律失常药	(222)
第二十九章 治疗心力衰竭的药物	(230)
第三十章 抗高血压药	(238)
第三十一章 抗心肌缺血药	(245)
第三十二章 调血脂药与抗动脉粥样硬化药	(250)
第三十三章 利尿药和脱水药	(256)

第六篇 作用于血液、呼吸、消化系统的药物

第三十四章 作用于血液及造血器官的药物	(267)
第三十五章 作用于呼吸系统的药物	(277)
第三十六章 作用于消化系统的药物	(285)

第七篇 作用于内分泌系统药物

第三十七章 肾上腺皮质激素类药物	(293)
第三十八章 甲状腺激素及抗甲状腺药	(300)
第三十九章 胰岛素及口服降血糖药	(308)
第四十章 作用于生殖系统的药物	(315)

第八篇 其他类药物

第四十一章 影响免疫功能的药物	(325)
第四十二章 影响自体活性物质的药物	(331)
第四十三章 治疗骨质疏松症药	(342)
第四十四章 基因治疗药物进展	(347)
模拟试卷一	(350)
模拟试卷二	(356)

目
录



第一篇 药理学总论

CHAPTER

第一章

绪 论

【学习要点】

1. 掌握药理学研究的内容及其任务。
2. 熟悉药理学在新药发现中的作用及新药研发中承担的工作。
3. 了解药理学发展史。

【要点精讲】

药物是人类用以诊断、预防和治疗疾病的物质。

药理学一方面研究药物对机体的作用及其机制，即在药物作用下，机体的生理功能及细胞代谢活动的变化规律，另一方面研究机体对药物的作用，即药物在机体的吸收、分布、代谢、排泄及其动态变化的规律。

药理学是连接药学和医学、基础医学和临床医学的学科。药理学的任务就是阐明药物有何作用、作用如何产生及药物在体内的动态变化规律。

药理学分为临床前药理学和临床药理学。前者是以动物为研究对象，观察和探讨药物的作用和作用机制，进行药效和安全性评价；后者是以临床患者为研究对象，研究药物对机体的药效学、药动学及其不良反应，确保用药安全有效。

药理学在新药发现和新药研制中都发挥重要作用，新药是指新的化学结构、新的药物组分或新的药理作用的药物。我国《药品管理法》规定：“新药是指未曾在中国境内上市销售的药品”。在新药研制过程中，药理工作者主要承担的任务有：①临床前药理毒理研究，主要包括：药效学研究、药动学研究和毒理学研究。②临床药理学研究：试验研究依次分为Ⅰ、Ⅱ、Ⅲ、Ⅳ期，即为人体安全性评价、疗效初步评价、扩大的多中心临床试验及批准上市后监测。

通过药理学的学习，应掌握药理学的基本概念、基本理论和基本内容；掌握药物的分类和各类代表药物的药理作用、作用机制、临床应用、主要不良反应及其防治；熟悉各类常用药物的药理作用特点，主要临床应用；了解各类相关药物的作用特点和各类药物的主要进展。



【自测习题】

一、名词解释

1. 药物 2. 临床前药理学 3. 新药 4. 药品

二、填空题

1. 药物效应动力学是研究_____对_____的作用及其机制，即在_____作用下及_____的变化规律。
2. 药动学研究_____对_____的作用，即_____在体内的_____、_____、_____、_____及其动态变化规律。
3. 药理学研究形成了许多分支学科，从机体系统分：有_____、_____、_____、_____等；从临床应用分：有_____、_____、_____、_____、_____等；从研究水平分：有_____、_____、_____、_____、_____。
4. 新药研究的一般过程为_____，_____，_____，_____。
5. 目前我国新药申请临床研究应包括_____，_____，_____。

三、简答题

1. 简述药理学的研究内容和任务。
2. 新药研制过程中，药理工作者主要承担的研究工作有哪些？
3. 如何学好药理学？

【参考答案】

一、名词解释

1. 药物：指能影响和调节机体生理、生化和病理过程，用以诊断、预防和治疗疾病的物质，是人类与疾病作斗争的重要武器。
2. 临床前药理学：是以动物为研究对象，在实验条件下，从整体、器官、组织、细胞和分子水平上，观察和探讨药物作用及其机制，进行药效和安全性评价。
3. 新药：指新的化学物质、新的药物组分和新的药理作用的药物。在我国，指未曾在国境内上市销售的药品。
4. 药品：指用于预防、治疗及诊断疾病，有目的调节人的生理功能，并有适应证或功能主治、用法和用量的物质。

二、填空题

1. 药物 机体 药物 机体生理功能 细胞代谢活动
2. 机体 药物 药物 吸收 分布 代谢 排泄
3. 心血管药理学 精神药理学 生殖药理学 内分泌药理学 医用药理学 护理药理学



眼科药理学 老年药理学 围产期药理学 生化药理学 时间药理学 行为药理学 细胞药理学 分子药理学

4. 目标化合物的寻找和获得 药效学筛选 药学研究 药理毒理学研究及临床研究
5. 综述资料 药学研究资料 药理毒理研究资料

三、简答题

1. 研究药物与机体相互作用和机制：①研究药物对机体的作用及其机制；②研究机体对药物的作用及研究药物的体内过程。任务就是阐明药物有何作用，作用如何产生及药物在体内的动态变化规律。

2. 主要承担：①临床前药理研究，主要包括药效学研究、药动学研究、毒理学研究等；②临床研究，参与受试药物的临床评价，完成临床Ⅰ、Ⅱ、Ⅲ、Ⅳ期试验。

3. 通过学习：①掌握“三基”（即药理学的基本概念、基本理论和基本内容）；各类代表药物作用、作用机制、临床应用、主要不良反应及其防治等；②熟悉各类常用药物作用特点、临床应用；了解各类相关药物作用特点及各类药物的新进展。

(钱之玉)



药物代谢动力学

【学习要点】

- 掌握药物吸收、分布、代谢和排泄的体内过程及其影响因素，掌握药物动力学主要参数的概念和临床意义。
- 熟悉一级与零级动力学过程、线性与非线性消除及房室模型。
- 了解主要公式推导和运算，了解药物动力学主要新进展。

【要点精讲】

药物代谢动力学是定量研究药物在体内吸收、分布、代谢和排泄等体内过程规律的一门学科。

一、药物体内过程

(一) 药物的跨膜转运

药物从生物膜的一侧跨膜到达另一侧的过程，称为药物的跨膜转运，主要有被动转运、孔道转运及特殊转运等形式。

1. **被动转运** 即药物利用生物膜的脂溶性，进行顺浓度差的跨膜转运。其转运速率与药物浓度差、油水分布系数成正比。这种转运特点有：顺浓度梯度转运，膜对药物无选择性，膜对药物通过量无饱和现象，无竞争抑制等。只有非离子化的药物才能跨膜转运。膜两侧 pH 的大小和药物的 pK_a 决定药物的离子化程度，决定药物的转运方向。弱酸性巴比妥类药物中毒时，服用 NaHCO_3 碱化血液和尿液，能促进药物由脑内向血液、由血液向尿液转运，可以解毒。

2. **孔道转运** 生物膜上有水通道和蛋白质分子通道，某些物质，包括水和一些电解质等通过这些通道进行转运。

3. **特殊转运过程** 即非脂溶性，也非小分子的物质，仍能够透过生物膜，往往逆浓度差，即从浓度低侧向浓度高侧转运，其常借助主动转运载体转运、受体介导转运等进行药物转运。特点有：①能从低浓度侧向高浓度侧转运；②有饱和性；③转运药物有选择性；



④能竞争同一载体，可产生拮抗作用。特殊转运还包括易化扩散，需要有载体，存在饱和性和竞争性，但不消耗能量，为顺浓度差转运。

(二) 药物的吸收

药物吸收是指药物从给药部位进入血液循环的过程。吸收程度表示药物进入人体循环的量，一般以生物利用度表示。口服给药，药物经胃肠道和肝脏代谢分解，一些药物进入人体循环的药物量减少，称为首过效应（首关效应）或第一关卡效应。一些常用的药物如硝酸甘油、普萘洛尔、利多卡因、丙米嗪、吗啡、维拉帕米和氯丙嗪都有明显的首过效应。

小肠是药物吸收的主要部位。小肠除了具有较大的吸收面积外，药物在小肠内停留时间长，血流丰富，也是吸收的有利条件。大多数药物是在十二指肠和空肠吸收，回肠主要吸收胆盐和维生素B₁₂，大肠主要吸收水分和盐类。

影响胃肠吸收因素主要有：不流动水层、胃肠排空时间、药物剂型、首过效应、外排机制、疾病及药物的相互作用等。

药物在其他部位被吸收的有：口腔和直肠黏膜、皮肤、肺部、眼部、鼻腔黏膜、肌肉和皮下组织等。

(三) 药物的分布

药物进入血液后，再随血液运转送到机体各组织中，称为药物分布。药物分布类型取决于生理因素和药物的理化性质。组织血流速率、生理性屏障、药物与组织的亲和力、药物脂溶性及其与血浆蛋白结合等均影响药物分布。

药物进入血液后，以一定比例与血浆蛋白结合，但只有游离的药物才能产生效应，进行代谢与排泄，而结合型药物起着药库作用。在一定浓度范围内，血浆中药物蛋白结合率是常数，即线性结合，但血浆中药物超过一定浓度，则出现非线性结合，游离药物浓度剧增。药物与血浆蛋白结合选择性差，当理化性质相近的药物间，可相互竞争与血浆蛋白结合，导致另一种药物游离型药物浓度升高，至疗效增强或毒性增大。因此，对治疗窗窄的药物，应注意这种相互作用。临床应用时，尤其应注意非甾体抗炎药物与香豆素类或磺酰脲类药物的联合用药。

(四) 药物的代谢

1. 药物代谢过程 药物进入机体后，若发生化学结构变化称为药物代谢，又称生物转化。代谢是药物从体内清除的主要方式之一。

肝脏是药物代谢的主要器官。药物在体内代谢分为两个时相，即Ⅰ相代谢和Ⅱ相代谢。前者包括氧化、还原或水解，催化此相代谢，主要在微粒体中的细胞色素酶系；后者为结合反应，即药物与葡萄糖醛酸、硫酸、乙酰基、甘氨酸等结合。催化Ⅱ相反应的代谢酶，主要有葡萄糖醛酸转化酶，谷胱甘肽-S-转移酶、磺酰基转移酶和乙酰基转移酶等。

药物经代谢后，产生下列变化：产生活性或失去活性，产生毒性等，药物经代谢后才产生活性的药物，称其为前药。

2. 药物代谢酶 在肝脏，参与药物Ⅰ相代谢的以P450酶最为重要，为一种多功能酶系，可催化氧化、还原、水解等；P450酶对底物结构的特异性不强，每种酶都有广泛底物；P450酶存在明显的种族、性别和年龄的差异，并具有多态性。使P450酶的量和活性明显增加的药物称药酶诱导剂，主要有苯巴比妥、卡马西平、利福平、地塞米松、异烟肼