

高等医药院校教材

供基础、预防、临床、口腔医学类专业用

# 药理学

第三版

江明性、主编

人民卫生出版社



高等医药院校教材

(供基础、预防、临床、口腔医学类专业用)

# 药 理 学

第三版

江明性 主编 (同济医科大学)  
杨藻宸 副主编 (上海医科大学)

王浴生 (华西医科大学) 金有豫 (首都医学院)  
全钰珠 (重庆医科大学) 傅绍萱 (河北医学院)  
孙家钧 (中山医科大学) 姚伟星 (同济医科大学)

人民卫生出版社

(京)新登字 081 号

药 理 学

第三版

汪明佳 主编

人民卫生出版社出版

(北京市崇文区天坛西里 10 号)

人民卫生出版社胶印厂印刷

新华书店北京发行所发行

787×1092毫米16开本 28印张 5插页 651千字

1979年9月第1版 1992年9月第3版第18次印刷

印数: 730 761-761 780

ISBN7-117 00004-X/R·5 定价: 7.45元

这套教材原为卫生部组织的统编教材，迭经修订，现改为卫生部推荐教材，供各地院校选用。全套教材共45种，其中必修课教材37种，选修课教材8种，均经卫生部聘任的高等医学院校临床医学专业教材评审委员会审定。

### 必修课教材

1. 《医用高等数学》 胡纪湘 主编
2. 《医用物理学》第三版 邝华俊 主编
3. 《基础化学》第三版 丁绪亮 主编
4. 《有机化学》第三版 徐景达 主编
5. 《医用生物学》第三版 李璞 主编
6. 《系统解剖学》第三版 郑思竞 主编
7. 《局部解剖学》第三版 徐恩多 主编
8. 《解剖学》 王永贵 主编
9. 《组织学与胚胎学》第三版 成令忠 主编
10. 《生物化学》第三版 顾天爵 主编
11. 《生理学》第三版 周衍椒 主编  
张镜如 副主编
12. 《医用微生物学》第三版 陆德源 主编
13. 《人体寄生虫学》第三版 徐秉锬 主编
14. 《医学免疫学》 郑武飞 主编
15. 《病理学》第三版 武忠弼 主编
16. 《病理生理学》第三版 冯新为 主编
17. 《药理学》第三版 江明性 主编
18. 《医学心理学》 李心天主 编
19. 《法医学》第二版 郭景元 主编
20. 《诊断学》第三版 戚仁铎 主编
21. 《放射诊断学》第二版 吴恩惠 主编
22. 《内科学》第三版 陈灏珠 主编  
李宗明 副主编
23. 《外科学》第三版 裘法祖 主编  
孟承伟 副主编

24. 《妇产科学》第三版 郑怀美 主编
25. 《儿科学》第三版 左启华 主编
26. 《神经病学》第二版 黄友歧 主编
27. 《精神病学》第二版 沈渔邨 主编
28. 《传染病学》第三版 彭文伟 主编
29. 《眼科学》第三版 毛文书 主编  
孙信孚 副主编
30. 《耳鼻咽喉科学》第三版 黄选兆 主编
31. 《口腔科学》第三版 毛祖彝 主编
32. 《皮肤性病学》第三版 王光超 主编
33. 《核医学》第三版 周申 主编
34. 《流行病学》第三版 耿贯一 主编
35. 《卫生学》第三版 王翔朴 主编
36. 《预防医学》 顾学箕 主编
37. 《中医学》第三版 贺志光 主编

### 选修课教材

38. 《医学物理学》 刘普和 主编
39. 《医用电子学》 刘骥 主编
40. 《电子计算机基础》 华蕴博 主编
41. 《医学遗传学基础》 杜传书 主编
42. 《临床药理学》 徐叔云 主编
43. 《医学统计学》 倪宗瓚 主编
44. 《医德学概论》 丘祥兴 主编
45. 《医学辩证法》 彭瑞聪 主编

以上教材均由人民卫生出版社出版，新华书店总店科技发行所发行。

## 全国高等医学院校临床医学专业 第二届教材评审委员会

主任委员 裘法祖

副主任委员 高贤华

委员 (以姓氏笔画为序)

方圻 毛文书 刘士杰 刘湘云 乔健天 沈渔邨  
武忠弼 苏应宽 金有豫 南潮 胡纪湘 顾天爵

## 编写说明

1987年5月卫生部医学专业教材编审委员会组织各学科修订教材,本书是编写人员在此后对《药理学》二版(1984年)进行修订编写后的新版本,即《药理学》第三版。

我们在编写过程中努力贯彻教材的思想性、科学性、先进性、启发性与适用性,运用辩证唯物主义和科学发展的观点来阐述药理学的基本规律,力求保持药理学学科的系统,并从我国实际出发,精选较成熟的新理论与新药物。我们希望本书能适合于我国医学生的应用并能有利于培养他们思考、分析、解决问题的能力,开拓思路,启发学生主动地观察、识别、理解学习中的药理学问题,提高创造性的思维能力。

本版教材重点介绍药理学的基础理论,基本知识和基本技能,章节安排与二版大体一致,但将强心甙扩展为抗慢性心功能不全药,抗生素则按 $\beta$ -内酰胺类、大环内酯类,氨基甙类与四环素、氯霉素类分章介绍,对半合成青霉素类、头孢菌素类作了较详细的叙述。

编订中的通用参考书有《医用药理学》第二版(1982)、Goodman and Gilman's《The pharmacological basis of therapeutics》7th ed. 1985,和 Rang and Dale《Pharmacology》1987。

编订过程中曾邀请西安医科大学赵更生,湖北医学院李章文,浙江医科大学卞如濂,哈尔滨医科大学李文汉,重庆医科大学郑明祺等诸位教授参加定稿审稿会,他们对本书内容提出了许多指正和改进性意见,提高了本书的质量。本书索引、目录和插图的编排及编写中的秘书工作都由同济医科大学姚伟星副教授兼顾担任,人民卫生出版社对本书的套色印刷及出版给予了通力合作和帮助,在此谨对上述同志表示衷心感谢。

限于我们的能力,本书一定还有缺点错误和不足之处,恳切希望读者给予批评指正。

江明性 杨藻宸

1989. 2

# 目 录

<b>第一章 药理学总论——绪言</b> .....	1
一、药理学研究对象及学科任务 .....	1
二、药理学的发展 .....	1
<b>第二章 药物对机体的作用——药效学</b> .....	3
<b>第一节 药物的基本作用</b> .....	3
一、药物作用的基本表现 .....	3
二、药物作用的选择性 .....	3
三、药物作用的临床效果 .....	3
<b>第二节 量效关系</b> .....	5
一、量效曲线 .....	5
二、最大效应及作用强度 .....	5
三、量效曲线的坡度及个体差异 .....	6
四、量反应及质反应 .....	6
五、治疗剂量及安全范围 .....	7
<b>第三节 药物作用机制</b> .....	7
一、构效关系 .....	8
二、作用机制 .....	9
三、受体及药物作用 .....	9
<b>第三章 机体对药物的作用——药代动力学</b> .....	14
一、药物的跨膜转运 .....	14
二、吸收 .....	16
三、与血浆蛋白结合 .....	16
四、分布 .....	17
五、生物转化 .....	19
六、排泄 .....	23
七、时效关系及时量关系 .....	25
八、药代动力学基本参数及其概念 .....	26
九、药物消除动力学 .....	28
十、各种药代动力学指标间的关系 .....	31
十一、连续多次给药的药物血浆浓度变化 .....	31
<b>第四章 影响药物作用的因素及合理用药</b> .....	34
一、药物剂型 .....	34
二、给药途径 .....	34
三、联合用药及药物相互作用 .....	35
四、病人生理因素 .....	35
五、病理状态 .....	36
六、病原微生物的耐药性 .....	37
七、其它因素 .....	37

八、医原性疾病	38
九、合理用药原则	38
<b>第五章 传出神经系统药理概论</b>	40
一、传出神经系统的解剖学分类	40
二、传出神经系统的递质及受体	40
三、传出神经按递质的分类	46
四、传出神经系统效应产生的生化过程	46
五、传出神经系统的生理功能	47
六、传出神经系统药物的基本作用	47
七、传出神经系统药物的分类	49
<b>第六章 拟胆碱药</b>	50
第一节 胆碱受体激动药	50
第二节 胆碱酯酶及抗胆碱酯酶药	53
一、胆碱酯酶	53
二、抗胆碱酯酶药	54
<b>第七章 有机磷酸酯类的毒理及胆碱酯酶复活药</b>	58
第一节 有机磷酸酯类的毒理	58
第二节 胆碱酯酶复活药	59
第三节 有机磷酸酯类中毒的防治	61
<b>第八章 胆碱受体阻断药 (I)——M胆碱受体阻断药</b>	63
第一节 阿托品和阿托品类生物碱	63
第二节 阿托品的合成代用品	66
一、合成扩瞳药	67
二、合成解痉药	67
<b>第九章 胆碱受体阻断药 (II)——N胆碱受体阻断药</b>	69
第一节 $N_1$ 胆碱受体阻断药——神经节阻断药	69
第二节 $N_2$ 胆碱受体阻断药——骨骼肌松弛药	69
一、除极化型肌松药	69
二、非除极化型肌松药	71
<b>第十章 拟肾上腺素药</b>	73
第一节 化学、构效关系及分类	73
一、化学	73
二、构效关系	73
三、分类	74
第二节 $\alpha$ 受体激动药	74
第三节 $\alpha, \beta$ 受体激动药	78
第四节 $\beta$ 受体激动药	81
一、 $\beta_1, \beta_2$ 受体激动药	81
二、 $\beta_1$ 受体激动药	82
三、 $\beta_2$ 受体激动药	82
<b>第十一章 肾上腺素受体阻断药</b>	84

第一节 $\alpha$ 受体阻断药	81
一、 $\alpha_1$ , $\alpha_2$ 受体阻断药	84
二、 $\alpha_1$ 受体阻断药	87
三、 $\alpha_2$ 受体阻断药	87
第二节 $\beta$ 受体阻断药	87
一、 $\beta_1$ , $\beta_2$ 受体阻断药	89
二、 $\beta_1$ 受体阻断药	90
三、内在活性较强的 $\beta$ 受体阻断药	91
第三节 $\alpha$ , $\beta$ 受体阻断药	91
<b>第十二章 局部麻醉药</b>	92
<b>第十三章 中枢神经系统药理概论</b>	97
一、中枢神经系统的主要功能	97
二、中枢神经系统递质及受体	97
三、中枢神经系统的药理特点	100
四、中枢神经药物按作用机制的分类	101
<b>第十四章 全身麻醉药</b>	102
<b>第十五章 镇静催眠药</b>	107
第一节 苯二氮草类	107
第二节 巴比妥类	110
第三节 其它非巴比妥类	111
<b>第十六章 抗癫痫药及抗惊厥药</b>	113
第一节 抗癫痫药	113
一、乙内酰胺类	114
二、巴比妥类	116
三、琥珀酰亚胺类	116
四、苯二氮草类	116
五、其它类	117
第二节 抗惊厥药	118
<b>第十七章 抗震颤麻痹药</b>	120
第一节 拟多巴胺类药	121
第二节 抗胆碱药	123
<b>第十八章 抗精神失常药</b>	125
第一节 抗精神病药	125
一、吩噻嗪类	125
二、硫杂蒟类	129
三、丁酰苯类	129
四、其它类	130
第二节 抗躁狂抑郁症药	130
一、抗抑郁症药	130
二、抗躁狂症药	132
第三节 抗焦虑药	133



<b>第十九章 镇痛药</b> .....	134
第一节 阿片生物碱类镇痛药 .....	134
第二节 人工合成镇痛药 .....	138
〔附〕 阿片受体拮抗剂——纳洛酮与纳屈酮 .....	141
第三节 延胡索乙素及罗通定 .....	142
<b>第二十章 中枢兴奋药</b> .....	144
第一节 主要兴奋大脑皮层的药物 .....	144
第二节 主要兴奋延脑呼吸中枢的药物 .....	145
<b>第二十一章 解热镇痛抗炎药</b> .....	148
第一节 水杨酸类 .....	149
第二节 苯胺类 .....	151
第三节 吡唑酮类 .....	152
第四节 其它抗炎有机酸类 .....	154
第五节 解热镇痛药的复方配伍 .....	155
〔附〕 抗痛风药 .....	156
<b>第二十二章 抗心律失常药</b> .....	158
第一节 心律失常的电生理学基础 .....	158
一、正常心肌电生理 .....	158
二、心律失常发生的电生理学机制 .....	159
第二节 抗心律失常药的基本电生理作用及药物分类 .....	161
一、抗心律失常药的基本电生理作用 .....	161
二、抗心律失常药物的分类 .....	162
第三节 常用抗心律失常药 .....	162
一、I类药——钠通道阻滞药 .....	162
二、II类药—— $\beta$ 肾上腺素受体阻断药 .....	168
三、III类药——延长APD的药物 .....	169
四、IV类药——钙通道阻滞药 .....	170
第四节 快速型心律失常的药物选用 .....	174
<b>第二十三章 抗慢性心功能不全药</b> .....	177
第一节 强心甙 .....	177
第二节 非强心甙类的正性肌力作用药 .....	186
第三节 血管舒张药治疗慢性心功能不全 .....	188
一、应用根据 .....	188
二、常用药物 .....	188
三、药物的选用 .....	189
第四节 抗慢性心功能不全的药物选用 .....	189
<b>第二十四章 抗心绞痛药及抗动脉粥样硬化药</b> .....	191
第一节 抗心绞痛药 .....	191
一、硝酸酯类及亚硝酸酯类 .....	191
二、肾上腺素 $\beta$ 受体阻断药 .....	194

三、钙拮抗药·····	195
四、其它抗心绞痛药·····	195
第二节 抗动脉粥样硬化药·····	196
一、降血脂药·····	196
二、改变脂蛋白组成的药物·····	199
三、减少动脉壁摄取脂蛋白的药物·····	199
<b>第二十五章 抗高血压药</b> ·····	201
第一节 抗高血压药物的分类·····	201
第二节 各种抗高血压药·····	202
一、主要作用于去甲肾上腺素能神经中枢部位的抗高血压药·····	202
二、神经节阻断药·····	204
三、抗去甲肾上腺素能神经末梢药·····	204
四、肾上腺素受体阻断药·····	206
五、作用于血管平滑肌的抗高血压药·····	207
六、钙拮抗药·····	209
七、主要影响血容量的抗高血压药-利尿药·····	209
八、影响血管紧张素Ⅱ形成的抗高血压药-血管紧张素Ⅰ转化酶抑制剂·····	210
第三节 抗高血压药物的应用原则·····	211
<b>第二十六章 利尿药及脱水药</b> ·····	214
第一节 利尿药·····	214
一、肾脏生理基础及利尿药作用部位·····	214
二、常用的利尿药·····	217
三、利尿药的临床应用·····	221
第二节 脱水药·····	223
<b>第二十七章 作用于血液及造血器官药</b> ·····	226
第一节 抗凝血药·····	226
第二节 促凝血药·····	231
第三节 抗贫血药·····	233
第四节 血容量扩充剂·····	237
<b>第二十八章 组胺及组胺受体阻断药</b> ·····	240
第一节 组胺·····	240
第二节 H <sub>1</sub> 及H <sub>2</sub> 受体阻断药·····	241
一、H <sub>1</sub> 受体阻断药·····	241
二、H <sub>2</sub> 受体阻断药·····	244
<b>第二十九章 抗喘药、镇咳药及祛痰药</b> ·····	248
第一节 抗喘药·····	248
一、拟肾上腺素药·····	249
二、茶碱·····	251
三、M胆碱受体阻断药·····	252
四、肥大细胞膜稳定药·····	252
五、肾上腺皮质激素类·····	253

第二节 镇咳药 .....	254
第三节 祛痰药 .....	254
一、祛痰药 .....	255
二、粘痰溶解药 .....	255
<b>第三十章 作用于消化系统的药物 .....</b>	<b>257</b>
第一节 抗消化性溃疡药 .....	257
一、抗酸药 .....	257
二、H <sub>2</sub> 受体阻断药 .....	258
三、M胆碱受体阻断药 .....	258
四、胃壁细胞H <sup>+</sup> 泵抑制剂 .....	259
第二节 助消化药 .....	260
第三节 泻药 .....	260
一、容积性泻药 .....	260
二、渗透性泻药 .....	260
三、接触性泻药 .....	261
四、泻药的临床应用 .....	262
第四节 止泻药 .....	262
<b>第三十一章 子宫兴奋药 .....</b>	<b>264</b>
<b>第三十二章 性激素类药及避孕药 .....</b>	<b>270</b>
第一节 雌激素类药及抗雌激素类药 .....	272
一、雌激素类药 .....	272
二、抗雌激素类药 .....	273
第二节 孕激素类药 .....	273
第三节 雄激素类药和同化激素类药 .....	275
一、雄激素类药 .....	275
二、同化激素类药 .....	277
第四节 避孕药 .....	277
一、主要抑制排卵的避孕药 .....	278
二、抗着床避孕药 .....	279
三、主要影响子宫和胎盘功能的避孕药 .....	279
四、男性避孕药 .....	280
五、其它 .....	280
<b>第三十三章 肾上腺皮质激素类药物 .....</b>	<b>282</b>
第一节 糖皮质激素 .....	283
第二节 促皮质素及皮质激素抑制剂 .....	290
一、促皮质素 .....	290
二、皮质激素抑制剂 .....	291
第三节 盐皮质激素 .....	291
第四节 甘草 .....	292
<b>第三十四章 甲状腺激素及抗甲状腺药 .....</b>	<b>294</b>
第一节 甲状腺激素 .....	294

第二节 抗甲状腺药 .....	296
一、硫脲类 .....	296
二、碘及碘化物 .....	297
三、放射性碘 .....	298
<b>第三十五章 胰岛素及口服降血糖药 .....</b>	<b>300</b>
第一节 胰岛素 .....	300
第二节 口服降血糖药 .....	302
一、磺酰脲类 .....	302
二、双胍类 .....	303
<b>第三十六章 抗菌药物概论 .....</b>	<b>305</b>
第一节 常用术语 .....	305
第二节 抗菌药作用机制 .....	306
一、抗叶酸代谢 .....	306
二、抑制细菌细胞壁合成 .....	306
三、影响胞浆膜的通透性 .....	307
四、抑制蛋白质合成 .....	307
五、抑制核酸代谢 .....	307
第三节 细菌的耐药性 .....	307
(一) 耐药性产生机制 .....	307
(二) 避免细菌耐药性的措施 .....	308
<b>第三十七章 磺胺药及其它合成抗菌药 .....</b>	<b>309</b>
第一节 磺胺药 .....	309
第二节 其它合成抗菌药 .....	313
一、甲氧苄氨嘧啶 .....	313
二、硝基咪唑类 .....	314
三、喹诺酮类 .....	314
<b>第三十八章 <math>\beta</math>-内酰胺类抗生素 .....</b>	<b>317</b>
一、青霉素类 .....	317
二、头孢菌素类 .....	323
三、其它 $\beta$ -内酰胺类抗生素 .....	327
<b>第三十九章 大环内酯类、林可霉素类及其它抗生素 .....</b>	<b>330</b>
一、大环内酯类抗生素 .....	330
二、林可霉素 .....	331
三、万古霉素 .....	332
四、杆菌肽 .....	332
<b>第四十章 氨基甙类抗生素及多粘菌素 .....</b>	<b>334</b>
第一节 氨基甙类抗生素 .....	334
一、氨基甙类抗生素的共性 .....	334
二、各种氨基甙类药理特点及应用 .....	338
三、应用注意及药物相互作用 .....	339
第二节 多粘菌素类 .....	340

<b>第四十一章 四环素类及氯霉素</b>	342
第一节 四环素类	342
一、天然四环素类	342
二、半合成四环素类	344
第二节 氯霉素	344
<b>第四十二章 抗真菌药及抗病毒药</b>	347
第一节 抗真菌药	347
一、灰黄霉素	347
二、两性霉素	347
三、制霉菌素	348
四、咪唑类抗真菌药	348
第二节 抗病毒药	349
一、金刚烷胺	349
二、碘苷	349
三、无环鸟苷	350
四、聚肌胞	350
<b>第四十三章 抗结核病药及抗麻风病药</b>	352
第一节 抗结核病药	352
一、各类抗结核病药	352
二、抗结核病药的用药原则	355
第二节 抗麻风病药	356
一、砒类	356
二、其它	356
<b>第四十四章 抗菌药的合理使用</b>	358
一、抗菌药临床应用的基本原则	358
二、抗菌药的联合应用	360
三、肝、肾功能障碍与抗菌药应用的关系	361
四、抗菌药的预防应用	362
五、抗感染治疗失败的原因	363
<b>第四十五章 抗疟药</b>	365
第一节 概述	365
一、疟原虫生活史及抗疟药作用环节	365
二、抗疟药的分类	366
三、疟原虫的耐药性	366
第二节 常用抗疟药	367
一、主要用于控制症状的抗疟药	367
二、主要用于控制复发及传播的抗疟药	370
三、主要用于预防的抗疟药	371
<b>第四十六章 抗阿米巴病药及抗滴虫病药</b>	373
第一节 抗阿米巴病药	373
第二节 抗滴虫病药	376

<b>第四十七章 抗血吸虫病药及抗丝虫病药</b> .....	378
第一节 抗血吸虫病药.....	378
第二节 抗丝虫病药.....	380
<b>第四十八章 抗肠蠕虫药</b> .....	382
一、抗线虫药.....	382
二、抗绦虫药.....	384
<b>第四十九章 抗恶性肿瘤药</b> .....	387
第一节 抗恶性肿瘤药的作用及分类.....	387
一、对生物大分子的作用及药物分类.....	388
二、对细胞增殖动力学的影响.....	388
第二节 常用的抗肿瘤药物.....	390
一、影响核酸生物合成的药物.....	390
二、直接破坏 DNA 并阻止其复制的药物.....	393
三、干扰转录过程阻止 RNA 合成的药物.....	398
四、影响蛋白质合成的药物.....	399
五、激素类.....	400
第三节 联合应用抗肿瘤药物的原则.....	400
<b>第五十章 影响免疫功能的药物</b> .....	404
第一节 免疫抑制药.....	405
第二节 免疫增强药.....	406
<b>附录 I 药物代谢动力学数据</b> .....	408
<b>附录 II 药物的相互作用</b> .....	417
<b>药名中文索引</b> .....	421
<b>药名外文索引</b> .....	428

# 第一章 药理学总论——绪言

## 一、药理学的研究对象及学科任务

**药理学** (pharmacology) 是一门为临床合理用药防治疾病提供基本理论的医学基础科学。它研究药物与机体(包括病原体)间相互作用的规律及其原理。**药物** (drug, pharmakon) 一般是指可用以改善或查明生理功能及病理状态的各种物质产品。它们在较低浓度时能影响机体某些细胞生理活动及代谢过程。古代药物都是天然产物, 主要是植物, 也有动物和矿物; 近代药物多为天然药物的有效成分或人工合成品, 并制成便于病人服用、符合防治要求、能安全贮运的各种**制剂** (preparation), 如片剂、注射剂、酏剂、软膏等。

药理学既研究药物对机体的作用规律, 又研究机体对药物的影响, 前者称**药物效应动力学**, 简称**药效学** (pharmacodynamics), 后者称**药物代谢动力学**, 简称**药动学** (pharmacokinetics)。药理学的学科任务就是要阐明药物对机体的作用及作用机制, 同时也要阐明药物在机体内吸收、分布、生物转化及排泄等过程中药物效应及血药浓度随时间消长的规律, 在阐明这两个问题的基础上以求达到指导临床合理用药的目的。它也为寻找新药或老药新用提供线索, 以及为阐明生物机体的生物化学及生物物理现象提供科学资料。例如洋地黄原是民间治疗水肿用的药物, 经过药理研究才知道它是作用于心脏的强心药而非利尿药。又如对阿片受体的研究导致体内抗痛系统的发现。

药理学的方法是实验性的, 即在严密控制的条件下观察药物的作用及其体内过程。对于新药必须先经过动物实验, 了解其作用规律及毒性后再转入临床试用。但在发掘祖国医学遗产或为老药开辟新用途时, 也常在临床应用的基础上为解决某一特定问题而进行动物实验。

在医学教学课程中, 药理学是运用生理学、生化学、病理学、微生物学和免疫学等知识理解药理作用, 为在临床医疗实践中充分发挥药物的治疗作用和防治不良反应提供理论基础的桥梁科学。近年来国内外出现临床药理学课程, 其目的着重于解决临床用药实际问题, 还为新药临床前评价及售后调研 (postmarketing surveillance) 服务。

## 二、药理学的发展

### (一) 我国本草的著作与贡献

《神农本草经》是我国最早的药书, 也是全世界第一部药物学著作, 大约成书于公元一世纪前后, 作者已不可考。该书收载 365 种中药, 它所指出的大黄导泻、麻黄治喘、常山截疟、楝实和雷丸祛虫及海藻治瘰至今仍然行之有效。其中有些药物经过近代研究而提出的有效成分至今仍用于临床, 如麻黄碱、小蘗碱、大黄甙等。历代药物学家对本草都有新的增补。到 1596 年 (明代), 李时珍通过毕生对于药物的调查、去伪存真, 写成《本草纲目》共 52 卷、约 190 万字, 收载药物 1892 种, 插图 1160 帧, 药方 11000 余条。对药物的生态、形态、性味、功能作了比较系统的记述。我国本草以四气五味、

阴阳五行学说说明药物的性味功用，在脏腑学说的基础上形成药物归经学说，说明药物作用的部位，为现代药理学提供大量有用的知识和需要进一步研究的课题。

## （二）药理学的发展史

药理学真正成为一门现代科学是从十九世纪开始的。在17~18世纪，西欧资本主义兴起，社会生产力有了新的发展，化学和生理学的发展为药理学的发展准备了科学基础。1804年德国 F. W. Serturmer 从阿片中提出吗啡，在狗身上证明其镇痛作用。1819年法国 F. Magendie 用青蛙实验确立了土的宁的作用部位是在中枢神经系统的脊髓部位。这些工作为药理学创造了实验方法。自此以后诸如催眠药、解热镇痛药、局部麻醉药等大量地被介绍到临床。在此时期德国 R. Buchheim 及其学生 O. Schmiedeberg 开创了实验药理学，研究药物作用的部位，被称为器官药理学。

本世纪内药理学有长足的进步。1909年德国 P. Ehrlich 发现砷凡纳明(606)能治疗梅毒，开创了应用化学药物治疗传染病的新纪元。接着1935年德国 G. Domagk 发现磺胺药百浪多息能治疗细菌感染。1940年英国 H. W. Florey 在 A. Fleming 研究基础上从青霉菌培养液中提出了青霉素，从而进入了抗生素的新时代。此外，近年来还在精神病、高血压、冠心病、病毒感染和肿瘤等方面开辟了药物治疗新领域。

## （三）近代药理学的新进展

近二三十年来，随着医学基础理论及新技术的迅猛发展，药理学也正在向纵深突飞猛进。药物作用的研究已深入到受体及分子水平，出现了钙离子通道及各种受体阻断药，抗菌药扩大至抗病毒领域，抗寄生虫药在抗血吸虫、抗阿米巴及抗疟疾方面出现了大量有效新药，新一代的抗生素层出不穷，前列腺素研究解释了非甾体抗炎药的作用也开辟了其自身的用途。在心血管疾病方面已能有效地控制高血压及消退水肿。对于心肌缺血性疾病从防治心绞痛发展至治疗再灌注损伤，大大地降低了心脑血管的死亡率。强心甙治疗心功能不全已有200余年，现在受到了非甾类强心药及扩血管药的挑战。在祖国医药方面，大量的天然药物成为开发利用的重点对象，除了药用外还扩大至食品饮料以至日用化妆、卫生用品。其中的许多中药的有效成分如镇痛药罗痛定、抗胆碱药山莨菪碱、抗疟药青蒿素、抗癌药三尖杉酯碱及鬼臼毒素、抗心肌缺血药丹参酮、钙通道阻滞药粉防己碱、肌松药环宁轮等被大量发掘并投入临床应用，取得良好效果。许多中药复方的研究不仅证实了疗效，还在理论上阐明了组方的科学原理。目前我国正处在改革开放的新时期，科研体制改革必将大大促进药理学的进一步发展。

(中山医科大学 孙家钧)



## 第二章 药物对机体的作用——药效学

### 第一节 药物的基本作用

#### 一、药物作用的基本表现

**药物作用** (action) 严格地说是指药物与机体组织间的初始作用，实际上常与它所引起机体在功能或形态上的**效应** (effect) 互相通用。例如去甲肾上腺素对血管的作用是激活血管平滑肌细胞的 $\alpha$ 受体，其效应是所继发的血管收缩及血压上升。在药物对机体发生作用的过程中，药物是外因，机体是内因，外因通过内因而发挥作用，即通过影响机体细胞所固有的生理功能而发挥作用。因此，药物的效应实际上是机体器官原有功能水平的改变。功能的提高称为**兴奋** (excitation)，功能降低称为**抑制** (inhibition)。例如精神振奋和镇静思睡分别是大脑兴奋和抑制的表现。同一药物对不同器官的作用可能引起性质相反的效应，例如吗啡抑制痛觉通路及呼吸中枢，却兴奋胃肠道、胆道及泌尿道平滑肌。

药物对机体的效应还表现在体液成分的改变，例如肾上腺素使血糖升高，胰岛素使血糖下降。某些药物作用表现为组织形态学方面的改变，例如腐蚀药对局部组织的破坏作用。某些药物可以杀灭入侵的微生物或寄生虫。少数药物还能改变机体的反应性，例如免疫抑制药抑制机体免疫反应等。还有些药物本身就是机体营养代谢物质或激素，对相应的缺乏症起补充治疗效果。

#### 二、药物作用的选择性

某些药物对机体的作用比较广泛，另一些药物则对某些器官系统有一定的选择性作用。某些药物选择性较高，另一些则较低。某些药物小剂量时只选择性地作用于个别脏器，大剂量时则引起较广泛的全身性毒性反应。药物作用的选择性是由于某组织细胞对药物的反应性高或药物与其亲和力大所致。一般地说，药物分布在某器官的浓度较高则易对该器官呈现选择性作用，但也有些药物不一定集中在靶器官，例如吗啡主要作用于中枢神经系统，却集中分布于肝脏，穿透血脑屏障进入脑组织的量很少，这更能说明其选择性作用。选择性高的药物多数药理活性也很高，应用时针对性较强，可以准确地治疗某种疾病或某一种症状。选择性低的药物虽然针对性不强，应用时副作用较多，但作用范围广。例如广谱抗生素、广谱抗肠虫药等，应用时也有其方便之处。

#### 三、药物作用的临床效果

用药的目的在于防治疾病，凡符合用药目的或能达到防治效果的作用叫做**治疗作用** (therapeutic action)。其余不符合用药目的，甚或给病人带来痛苦的反应统称为**不良反应** (untoward reaction)。在多数情况下，这两种后果会同时出现，这是药物作用的两重性。医生用药要充分发挥药物的治疗作用而减少或避免不良反应。在特殊