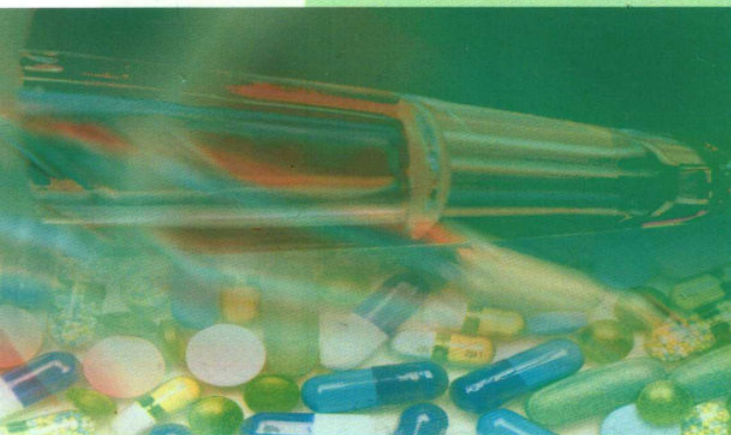


■ 全国高等医药院校“十三五”规划教材

(供临床医学、临床药学、药学、口腔、麻醉、检验、预防、护理等专业用)



药理学

第2版

主编 刘克辛

高等教育出版社

■ 全国高等医药院校“十三五”规划教材

(供临床医学、临床药学、药学、口腔、麻醉、检验、预防、护理等专业用)

药理学

第2版

Yaolixue

主 编 刘克辛
副 主 编 刘昭前 毕惠嫦
编 者 (以姓氏笔画为序)

王 琰 (北京协和医学院)

田 鑫 (郑州大学)

毕惠嫦 (中山大学)

吕 莉 (大连医科大学)

刘克辛 (大连医科大学)

刘英华 (中国人民解放军总医院)

刘昭前 (中南大学)

杨宝学 (北京大学)

杨静娴 (辽宁中医药大学)

张雪梅 (复旦大学)

罗学娅 (大连大学)

周 红 (遵义医科大学)

周宇宏 (哈尔滨医科大学)

周黎明 (四川大学)

孟 强 (大连医科大学)

赵晓民 (山东第一医科大学)

唐 漫 (中国医科大学)

翟凤国 (牡丹江医学院)

编写秘书 孟 强

高等教育

内容简介

本教材共分为8篇、45章,分为总论和各论两大部分。总论分4章,重点介绍了药理学的基本概念、研究对象和任务、药动学和药物效应动力学的基本原理和最新进展;各论分41章,着重阐明各章药物的体内过程、药理作用、作用机制、临床应用、不良反应、药物相互作用和禁忌证。本教材的特点是有“四大板块”:在各章开头有“学习要求”,结合教学大纲要求简明扼要地提出本章节的重点;在每章的后边附有“案例与讨论”,通过案例,力求使学生消化、理解、活用本章所学的重点内容;之后以“本章药物分类总结”的形式,用树状图分类列出本章介绍的药物或重点内容,利于学生复习和记忆;最后是“问题与思考”,以提问的形式与“学习要求”的内容相对应,目的是使学生通过问题,掌握本章的重点内容和知识应用方法。教材末附有专业名词与药名汉英对照索引,供读者查阅。

本教材可作为高等医药院校临床医学、临床药学、药学、口腔、麻醉、检验、预防、护理等专业本科生教材,也可作为研究生、临床医师、药师、护师、从事药学研究及药厂技术人员的参考书。

图书在版编目(CIP)数据

药理学 / 刘克辛主编. --2版. --北京:高等教育出版社, 2019.7

ISBN 978-7-04-052313-3

I. ①药… II. ①刘… III. ①药理学-高等学校-教材-IV. ①R96

中国版本图书馆CIP数据核字(2019)第150815号

策划编辑 瞿德竑 责任编辑 瞿德竑 封面设计 于文燕 责任印制 刁毅

出版发行 高等教育出版社
社址 北京市西城区德外大街4号
邮政编码 100120
印刷 北京佳顺印务有限公司
开本 787mm×1092mm 1/16
印张 32.5
字数 800千字
购书热线 010-58581118
咨询电话 400-810-0598

网 址 <http://www.hep.edu.cn>
<http://www.hep.com.cn>
网上订购 <http://www.hepmall.com.cn>
<http://www.hepmall.com>
<http://www.hepmall.cn>
版 次 2014年6月第1版
2019年7月第2版
印 次 2019年7月第1次印刷
定 价 64.80元

本书如有缺页、倒页、脱页等质量问题,请到所购图书销售部门联系调换
版权所有 侵权必究
物料号 52313-00

《药理学》第1版自2014年出版以来，受到了读者的一致好评。坚实的药理学基础理论与临床安全合理用药的有机结合促进了第1版的成功。本版的撰写以《国家中长期教育改革和发展规划纲要（2010—2020年）》和教育部等六部门联合印发的《关于医教协同深化临床医学人才培养改革的意见》等文件为指导，以全面提升新时代创新人才培养质量为目标。

本教材在编写过程中一如既往地坚持三基（基本理论、基本知识、基本技能）、五性（思想性、科学性、先进性、启发性、适用性）、三特定（特定的对象、特定的要求、特定的限制）的原则要求，同时强调内容安排合理，深浅适宜，适应新时代创新人才培养教育的需求。

本教材共分为8篇45章，第一篇总论分4章，重点介绍了药理学的基本概念、研究对象和任务、药动学和药物效应动力学的基本原理及其最新进展；第二至八篇各论分为41章，着重阐明了各章药物的体内过程、药理作用、作用机制、临床应用、不良反应、药物相互作用和禁忌证等。

本教材在第1版的基础上保存并突出了“四大板块”的作用。在各章开头的“学习要求”中，紧密结合教学大纲的要求，简明扼要地提出本章节的重点；在每章节后边的“案例与讨论”模块中，通过临床案例，力求使学生理解并灵活应用本章所学的重点内容；本教材的特色体现在“本章药物分类总结”模块中，该模块用树状图分类列出本章节介绍的药物或重点内容，目的是使读者对该章节的内容和重点一目了然，便于学生复习和记忆；最后是“问题与思考”，以提问的形式与“学习要求”的内容相对应，目的是使学生通过问题，掌握本章的重点内容并活学活用。教材末附有专业名词与药名中英文对照索引，供读者查阅。

本教材可作为高等医药院校临床医学、临床药学、药学、口腔、麻醉、检验、预防、护理等专业本科生教材，也可作为研究生、临床医师、药师、护师、从事药学研究及药厂技术人员的参考书。

编者集繁忙的教学任务和繁重的教材编写于一身，在编写中难免出现不足之处，敬请广大读者不吝批评指正，以便在今后再版时加以改正和提高，使读者受益。

刘克辛

2019年2月

第一篇 药理学总论

第一章 绪言	1	关系	32
第一节 药理学的概念、研究对象、内容和任务	1	一、药物的量效关系	32
第二节 药理学的发展史	2	二、药物的构效关系	34
一、古代本草阶段	2	第三节 药物作用的机制	34
二、近代药理学阶段	2	第四节 药物与受体	35
三、现代药理学阶段	2	一、受体的定义及特征	35
第三节 药理学与新药研究	3	二、受体与药物相互作用	36
第二章 药动学	6	三、受体的类型及细胞内信号转导途径	38
第一节 药物的体内过程	6	四、受体的调节	40
一、概述	6	五、受体与疾病的关系	41
二、药物的跨膜转运及药物转运体	7	六、受体与临床用药	41
三、药物的体内过程	9	第四章 影响药物效应的因素	44
第二节 药物的速率过程	19	第一节 药物方面的因素	44
一、药动学模型	19	一、药物的剂量和剂型	44
二、药物在体内的速率过程	22	二、给药时间及给药间隔时间	44
三、药动学重要参数及其临床意义	25	三、食物的影响	45
四、基于药动学基础的临床给药设计	27	四、药物相互作用	45
第三章 药物效应动力学	30	第二节 机体方面的因素	48
第一节 药物的基本作用	30	一、生理因素	48
一、药物作用与药理效应	30	二、病理因素	49
二、治疗作用与不良反应	30	三、遗传因素	49
第二节 药物效应的量效关系和构效关系		四、心理因素——安慰剂效应	50
		五、长期用药后机体对药物反应的改变	50

第二篇 传出神经系统药理学

第五章 传出神经系统药理学概论	53	二、传出神经系统的递质	55
第一节 传出神经系统的分类	53	三、传出神经系统的受体	58
第二节 传出神经系统的递质和受体	55	四、传出神经系统的生理功能	58
一、突触的结构与神经冲动的传递	55	第三节 传出神经系统药物的作用	

方式及其分类·····	60	第一节 神经节阻断药·····	82
一、传出神经系统药物的作用方式·····	60	第二节 骨骼肌松弛药·····	82
二、传出神经系统药物的分类·····	60	一、去极化型肌松药·····	83
第六章 拟胆碱药·····	63	二、非去极化型肌松药·····	84
第一节 直接作用于胆碱受体的		第十章 肾上腺素受体激动药·····	86
拟胆碱药·····	63	第一节 化学结构和分类·····	86
一、完全拟胆碱药·····	63	第二节 α 、 β 受体激动药·····	87
二、M胆碱受体激动药·····	64	第三节 α 受体激动药·····	91
三、N胆碱受体激动药·····	66	一、 α_1 、 α_2 受体激动药·····	91
第二节 抗胆碱酯酶药·····	67	二、 α_1 受体激动药·····	93
一、乙酰胆碱酯酶·····	67	三、 α_2 受体激动药·····	93
二、常用抗胆碱酯酶药·····	67	第四节 β 受体激动药·····	93
第七章 有机磷酸酯类抗AChE药中毒		一、 β_1 、 β_2 受体激动药·····	93
及AChE复活药·····	70	二、 β_1 受体激动药·····	94
第一节 有机磷酸酯类抗AChE药		三、 β_2 受体激动药·····	95
中毒·····	70	第十一章 肾上腺素受体阻断药·····	97
第二节 AChE复活药·····	72	第一节 α 受体阻断药·····	97
第八章 抗胆碱药——M胆碱受体		一、 α_1 、 α_2 受体阻断药·····	98
阻断药·····	75	二、 α_1 受体阻断药·····	100
第一节 阿托品类生物碱·····	75	三、 α_2 受体阻断药·····	100
第二节 阿托品的合成代用品·····	79	第二节 β 受体阻断药·····	100
一、合成扩瞳药·····	79	一、 β 受体阻断药的一般特性·····	100
二、合成解痉药·····	80	二、 β_1 、 β_2 受体阻断药·····	104
三、选择性M受体阻断药·····	80	三、选择性 β_1 受体阻断药·····	106
第九章 抗胆碱药——N胆碱受体		第三节 α 、 β 受体阻断药·····	106
阻断药·····	82		

第三篇 作用于中枢神经及传入神经系统的药物

第十二章 麻醉药·····	109	第一节 苯二氮革类·····	117
第一节 常用局部麻醉药·····	109	一、常用苯二氮革类药物·····	118
一、药理作用及体内过程·····	109	二、苯二氮革受体拮抗剂·····	121
二、常用局麻药·····	110	第二节 巴比妥类·····	122
三、局部麻醉方法及选药·····	111	第三节 其他镇静催眠药·····	124
四、影响局麻药作用的因素·····	111	第十四章 抗癫痫药及抗惊厥药·····	127
第二节 全身麻醉药·····	112	第一节 抗癫痫药·····	127
一、吸入麻醉药·····	112	一、常用抗癫痫药·····	128
二、静脉麻醉药·····	114	二、苯二氮革类·····	133
三、复合麻醉及选药·····	114	三、其他新型抗癫痫药·····	133
第十三章 镇静催眠药·····	117	四、应用抗癫痫药的注意事项·····	135

第二节 抗惊厥药·····	135	第二节 非选择性环加氧酶抑制药··	166
第十五章 抗精神失常药·····	137	一、水杨酸类·····	166
第一节 抗精神分裂症药·····	137	二、苯胺类·····	169
一、经典抗精神病药·····	138	三、吲哚类·····	169
二、非典型抗精神病药·····	142	四、芳基乙酸类·····	170
第二节 抗躁狂药·····	143	五、芳基丙酸类·····	170
第三节 抗抑郁药·····	144	六、烯醇酸类·····	171
一、选择性5-HT再摄取抑制药··	145	七、吡唑酮类·····	172
二、非选择性NA/5-HT再摄取		八、烷酮类·····	172
抑制药·····	146	九、异丁芬酸类·····	172
三、选择性NA再摄取抑制药·····	147	第三节 选择性环加氧酶-2抑制药··	173
四、单胺氧化酶抑制药·····	148	第四节 抗痛风药·····	174
五、5-HT _{2A} 拮抗药及5-HT再摄取		一、抑制尿酸生成药·····	175
抑制药·····	148	二、促进尿酸排泄药·····	175
六、去甲肾上腺素及多巴胺再摄取		三、抑制痛风炎症药·····	176
抑制药·····	149	七、其他·····	149
七、其他·····	149	第十八章 镇痛药·····	178
第十六章 治疗神经退行性疾病药物··	151	第一节 阿片生物碱类·····	178
第一节 抗帕金森病药·····	151	一、阿片受体激动药·····	179
一、拟多巴胺类药·····	152	二、阿片受体部分激动药·····	184
二、中枢抗胆碱药·····	156	第二节 人工合成镇痛药·····	185
三、其他·····	156	一、阿片受体激动药·····	185
第二节 抗阿尔茨海默病药·····	157	二、阿片受体部分激动药·····	187
一、胆碱酯酶抑制药·····	157	第三节 其他镇痛药·····	188
二、NMDA受体阻断药·····	159	第四节 阿片受体拮抗药·····	189
三、脑代谢激活药·····	159	第五节 镇痛药的应用原则·····	190
第十七章 解热镇痛抗炎药·····	162	第十九章 中枢兴奋药·····	192
第一节 概述·····	162	第一节 主要兴奋大脑皮质的药物··	192
一、药理作用及作用机制·····	163	第二节 主要兴奋延髓呼吸中枢的	
二、常见不良反应·····	165	药物·····	194
		第三节 促进脑功能恢复的药物·····	195

第四篇 作用于心血管系统的药物

第二十章 利尿药与脱水药·····	197	一、治疗水肿·····	208
第一节 利尿药作用的生理学基础··	197	二、治疗非水肿性疾病·····	209
第二节 常用利尿药·····	199	三、利尿药滥用·····	210
一、高效利尿药·····	199	第四节 脱水药·····	210
二、中效利尿药·····	202	第二十一章 抗高血压药·····	213
三、低效利尿药·····	205	第一节 抗高血压药的作用部位及	
第三节 利尿药的应用·····	208	分类·····	213

第二节 肾素-血管紧张素系统抑制药·····	214	五、利尿药联合应用·····	244
一、血管紧张素转化酶抑制药·····	215	六、临床多种药物联合应用治疗充血性心力衰竭·····	244
二、血管紧张素Ⅱ受体阻断药·····	218	七、慢性心力衰竭治疗的流程·····	245
第三节 钙通道阻滞药·····	219	第二十三章 抗心绞痛药·····	247
第四节 利尿药·····	222	第一节 概述·····	247
第五节 交感神经阻滞药·····	223	一、心绞痛的病理生理学·····	247
一、中枢性抗高血压药·····	223	二、心绞痛的分型·····	247
二、神经节阻断药·····	224	三、常用抗心绞痛药物·····	248
三、去甲肾上腺素能神经末梢阻断药·····	224	第二节 硝酸酯类·····	248
四、肾上腺素受体阻断药·····	225	第三节 β 受体阻断药·····	251
第六节 血管扩张药·····	228	第四节 钙通道阻滞药·····	252
一、直接扩张血管药·····	228	第五节 其他抗心绞痛药·····	253
二、钾通道开放药·····	229	第六节 抗心绞痛药的联合应用·····	253
第七节 其他降压药·····	230	一、 β 受体阻断药与硝酸酯类·····	253
第八节 抗高血压药物的应用·····	230	二、钙通道阻滞药与 β 受体阻断药·····	253
第二十二章 治疗充血性心力衰竭的药物·····	233	第二十四章 抗心律失常药·····	255
第一节 充血性心力衰竭的病理生理学变化·····	233	第一节 正常心肌电生理及心律失常发生的机制·····	255
一、充血性心力衰竭的病理生理学基础·····	233	一、正常心肌电生理·····	255
二、充血性心力衰竭时神经内分泌变化·····	234	二、心律失常发生的机制·····	258
三、充血性心力衰竭时心肌肾上腺素 β 受体信号转导的变化·····	234	第二节 抗心律失常药的作用机制·····	259
第二节 治疗充血性心力衰竭药物的分类·····	234	第三节 抗心律失常药的分类及常用药物·····	259
第三节 常用治疗充血性心力衰竭的药物·····	235	一、I类 钠通道阻滞药·····	259
一、正性肌力药·····	235	二、II类 β 受体阻断药·····	264
二、减负荷药·····	240	三、III类 延长动作电位时程药·····	265
第四节 抗心力衰竭的联合用药·····	243	四、IV类 钙通道阻滞药·····	266
一、ACEI与ARB联合应用·····	243	五、其他类·····	267
二、ACEI与抗醛固酮药联合应用·····	243	第四节 抗心律失常药的合理应用及临床选用·····	268
三、ACEI与其他RAAS系统抑制药联合应用·····	243	第二十五章 调血脂药及抗动脉粥样硬化药·····	270
四、ACEI与 β 受体阻断药联合应用·····	244	第一节 调血脂药·····	270

第二节 抗氧化药·····	277	第三节 多烯脂肪酸类·····	279
一、合成型·····	278	第四节 动脉内皮保护药·····	279
二、天然型·····	278	第五节 PCSK9抑制剂·····	280

第五篇 作用于内脏系统及血液系统的药物

第二十六章 作用于消化系统的药物··	283	一、 β_2 受体激动药·····	309
第一节 抗消化性溃疡药·····	283	二、其他·····	310
一、胃酸分泌抑制药·····	283	第二十九章 作用于血液及造血系统的	
二、抗酸药·····	287	药物·····	312
三、黏膜保护药·····	288	第一节 抗凝血药·····	312
四、抗幽门螺杆菌药·····	290	一、血液凝固的机制·····	312
第二节 止吐药及胃肠动力药·····	290	二、纤维蛋白溶解系统·····	312
一、 H_1 受体阻断药·····	291	三、常用抗凝血药·····	314
二、M胆碱受体阻断药·····	291	四、体外抗凝血药·····	317
三、多巴胺(D_2)受体阻断药·····	291	第二节 抗血小板药·····	317
四、5-HT ₃ 受体阻断药·····	292	一、抑制血小板代谢酶类的药物·····	318
第三节 泻药·····	292	二、阻碍ADP介导的血小板活化的	
一、容积性泻药·····	292	药物·····	320
二、接触性泻药·····	293	三、血小板GP II b/IIIa受体	
三、润滑性泻药·····	293	阻断药·····	320
第四节 止泻药·····	294	四、凝血酶抑制剂·····	321
第五节 利胆药·····	294	第三节 纤维蛋白溶解药·····	321
第二十七章 作用于呼吸系统的药物··	297	第四节 促凝血药·····	323
第一节 平喘药·····	297	第五节 抗贫血药·····	325
一、支气管扩张药·····	297	一、铁制剂·····	325
二、抗炎平喘类·····	300	二、叶酸类·····	326
三、抗过敏平喘药·····	301	三、维生素B ₁₂ ·····	326
第二节 镇咳药·····	302	第六节 造血细胞生长因子·····	327
一、中枢性镇咳药·····	302	一、促红细胞生成素·····	328
二、外周性镇咳药·····	302	二、促白细胞生成药·····	328
第三节 祛痰药·····	303	三、促血小板生成药·····	329
第二十八章 作用于子宫平滑肌药·····	306	第七节 血容量扩充药·····	330
第一节 子宫平滑肌兴奋药·····	306	第三十章 组胺及抗组胺药·····	332
一、垂体后叶激素类·····	306	第一节 组胺类·····	332
二、前列腺素类·····	308	第二节 抗组胺药·····	334
三、麦角生物碱类·····	308	一、 H_1 受体阻断药·····	334
第二节 子宫平滑肌抑制药·····	309	二、 H_2 受体阻断药·····	336

第六篇 作用于内分泌系统的药物

第三十一章 肾上腺皮质激素类药物···	339	一、主要抑制排卵的避孕药·····	355
第一节 糖皮质激素类药物·····	340	二、抗着床避孕药·····	356
第二节 盐皮质激素·····	347	三、主要影响子宫和胎盘功能的 避孕药·····	356
第三节 促肾上腺皮质激素及皮质 激素抑制药·····	347	四、外用避孕药·····	357
一、促肾上腺皮质激素·····	347	第三十三章 甲状腺激素及抗 甲状腺药·····	359
二、皮质激素抑制药·····	348	第一节 甲状腺激素·····	359
第三十二章 性激素类药物及避孕药···	350	第二节 抗甲状腺药·····	361
第一节 雌激素类药及选择性雌激素 受体调节药·····	351	一、硫脲类·····	361
一、雌激素类药·····	351	二、碘和碘化物·····	362
二、选择性雌激素受体调节药·····	352	三、放射性碘·····	363
第二节 孕激素类药及抗孕激素 类药·····	353	四、 β 受体阻断药·····	363
一、孕激素类药·····	353	第三十四章 降血糖药·····	365
二、抗孕激素类药·····	354	第一节 胰岛素·····	365
第三节 雄激素类药和同化激素 类药·····	354	第二节 口服降血糖药·····	368
一、雄激素类药·····	354	一、磺酰脲类·····	368
二、同化激素类药·····	355	二、双胍类·····	369
第四节 避孕药·····	355	三、噻唑烷二酮类·····	369
		四、 α -葡萄糖苷酶抑制剂·····	370
		五、其他新型降血糖药·····	370

第七篇 化学治疗药物

第三十五章 抗菌药物概论·····	373	一、抗菌药物治疗性应用的基本 原则·····	379
第一节 常用术语·····	373	二、抗菌药物预防性应用的基本 原则·····	379
第二节 抗菌药物的作用机制·····	374	三、抗菌药物在特殊病理、生理 状况患者中应用的基本原则···	380
一、抑制细菌细胞壁合成·····	374	四、抗菌药物的联合应用·····	380
二、增加细菌质膜的通透性·····	375	五、抗菌药物在临床应用中的 管理·····	380
三、抑制细菌核酸的复制与修复···	375	第三十六章 人工合成抗菌药物·····	383
四、抑制细菌蛋白质合成·····	376	第一节 喹诺酮类抗菌药·····	383
第三节 细菌耐药性的产生及其 机制·····	376	一、概述·····	383
一、细菌耐药性的种类·····	376	二、常用氟喹诺酮类抗菌药·····	384
二、细菌产生耐药性的机制·····	377		
三、耐药基因的转移方式·····	378		
第四节 抗菌药物合理应用的原则···	379		

第二节 磺胺类药物·····	386	一、主要用于抗深部真菌感染药··	427
第三节 其他人工合成类抗菌药·····	388	二、主要用于抗表浅部真菌感染药·····	431
第三十七章 β -内酰胺类抗生素和其他作用于细胞壁的抗生素··	391	第二节 抗病毒药·····	432
第一节 概述·····	391	一、抗HIV药·····	432
一、分类·····	391	二、抗流感病毒药·····	436
二、抗菌作用机制·····	391	三、抗乙型肝炎病毒药·····	438
三、耐药机制·····	392	四、抗疱疹病毒药·····	438
第二节 常用 β -内酰胺类抗生素··	393	五、广谱抗病毒药·····	440
一、青霉素类·····	393	第三节 抗结核病药·····	441
二、头孢菌素类·····	398	一、第一线抗结核病药·····	441
三、其他 β -内酰胺类抗生素·····	402	二、第二线抗结核病药·····	444
四、糖肽类与其他类抗生素·····	405	三、新一代抗结核病药·····	445
第三十八章 氨基糖苷类抗生素·····	409	四、抗结核病药的应用原则·····	445
第一节 氨基糖苷类抗生素共性·····	409	第四节 抗麻风病药·····	446
一、抗菌作用机制·····	409	一、砒类·····	446
二、耐药机制·····	409	二、其他·····	447
三、体内过程·····	410	第四十二章 抗寄生虫病药·····	450
四、临床应用·····	410	第一节 抗疟药·····	450
五、不良反应·····	410	一、疟原虫的生活史及抗疟药的作用环节·····	450
六、药物相互作用·····	411	二、抗疟药的分类·····	451
第二节 常用氨基糖苷类抗生素·····	412	三、常用抗疟药·····	451
第三十九章 四环素类抗生素及氯霉素·····	416	第二节 抗阿米巴病药和抗滴虫病药·····	456
第一节 四环素类·····	416	一、抗阿米巴病药·····	456
一、四环素类抗生素的共性·····	416	二、抗滴虫病药·····	458
二、常见四环素类抗生素·····	418	第三节 抗血吸虫病药和抗丝虫病药·····	459
第二节 氯霉素·····	420	一、抗血吸虫病药·····	459
第四十章 大环内酯类及其他抗生素··	422	二、抗丝虫病药·····	460
第一节 大环内酯类·····	422	第四节 驱肠蠕虫药·····	461
一、大环内酯类的共性·····	422	一、驱蛔虫药·····	461
二、常用大环内酯类药物·····	422	二、驱钩虫药·····	462
第二节 林可霉素类·····	424	三、驱蛲虫药·····	463
第三节 多肽类抗生素·····	424	四、驱鞭虫药·····	463
一、万古霉素类·····	424	五、驱绦虫药·····	463
二、多黏菌素类·····	424	第四十三章 抗恶性肿瘤药物·····	466
三、杆菌肽·····	425	第一节 抗肿瘤药物的药理学基础··	466
第四十一章 抗真菌药、抗病毒药、抗结核病药及抗麻风病药··	427	一、肿瘤细胞增殖动力学·····	466
第一节 抗真菌药·····	427		

二、抗肿瘤药物的药理学机制·····	467	药物·····	478
三、肿瘤的耐药性及其机制·····	469	五、调节体内激素平衡的药物·····	481
四、常用抗恶性肿瘤药物的分类·····	470	六、分子靶向药物·····	482
第二节 常用的抗恶性肿瘤药物·····	471	第三节 抗恶性肿瘤药物常见的不良	
一、干扰核酸生物合成的药物·····	471	反应及防治措施·····	484
二、直接影响DNA结构与功能的		一、近期毒性·····	484
药物·····	473	二、远期毒性·····	485
三、干扰转录过程及阻止RNA		第四节 抗恶性肿瘤药物的合理	
合成的药物·····	477	应用·····	485
四、抑制蛋白质合成与功能的			

第八篇 影响免疫功能的药物及解毒药

第四十四章 影响免疫功能的药物·····	489	第四十五章 常见中毒及其解毒药·····	499
第一节 免疫应答和免疫病理反应·····	489	第一节 金属中毒解毒药·····	499
一、免疫应答·····	489	一、巯基络合剂·····	499
二、免疫病理反应·····	489	二、氨基络合剂·····	500
第二节 免疫抑制药·····	490	三、其他络合剂·····	500
一、免疫抑制药分类·····	490	第二节 氰化物中毒解毒药·····	501
二、常用的免疫抑制药·····	491	一、高铁血红蛋白形成剂·····	501
第三节 免疫调节药·····	495	二、供硫剂·····	501
一、免疫调节药的分类·····	495	第三节 亚硝酸盐中毒解毒药·····	502
二、常用的免疫调节药·····	495	第四节 有机氟中毒解毒药·····	502
第四节 影响免疫功能药物的应用			
原则·····	497	参考文献·····	504
一、免疫抑制药的应用原则·····	497	专业名词与药名汉英对照索引·····	505
二、免疫调节药的应用原则·····	497		

第一篇

药理学总论

第一章 绪 言

◆学习要求◆

1. 掌握药理学、药物的概念。
2. 熟悉药理学研究内容和任务。
3. 了解新药研究的三个过程。

第一节 药理学的概念、研究对象、内容和任务

药理学 (pharmacology) 是研究药物与生物体 (包括机体和病原体) 之间相互作用规律和原理的学科。药理学的发展与其他相关学科, 如生药学、植物化学、药物化学、药物分析、药剂学、药物治疗学及毒理学等的发展密切相关。它既是医学教育中的一门边缘学科, 又是基础医学与临床医学及医学与药学的桥梁学科。它运用基础医学理论知识, 阐明药物的作用及其机制、明确治疗效果、揭示不良反应, 为研究和开发新药奠定理论和实验基础。因此, 药理学是医学、药学及医药相关学科共同的重要课程。

药物 (drug) 指可以改变或查明机体的生理功能和病理状态, 可用于预防、治疗、诊断疾病的物质。药物可来源于植物、动物、矿物质并可通过化学合成及基因工程获得。药物和毒物 (poison) 之间没有严格的界限。任何药物在用量超过治疗浓度时, 都可能达到中毒浓度而产生毒性作用。

药理学研究的对象主要是人和动物, 其次是病原体。药理学研究的内容主要包括两方面: ①药物效应动力学 (pharmacodynamics) (简称药效学), 即研究药物对机体的作用及作用机制, 并涉及临床应用、不良反应等。②药物代谢动力学 (pharmacokinetics) (亦称药代动力学、药物动力学, 简称药动学), 研究机体对药物的作用, 即研究药物在机体内所发生的变化及其规律, 包括药物的吸收、分布、代谢、排泄及血药浓度随时间变化的规律。药理学研究方法主要是通过临床观察和动物实验, 在严格控制的条件下对人、动物及病原体进行各种指标的观察和测定, 分析结果, 发现规律和阐明原理。这些原理和规律是指导合理用药、防治疾病的基础, 即治疗学的药理学基础。

药理学的学科任务包括: ①阐明药物与机体相互作用的基本规律和原理, 即在阐明药效学和药动学基本原理的基础上, 正确指导临床合理用药。②研究和发现新的药物, 开发

老药新用途。③揭示生命活动的规律。

第二节 药理学的发展史

一、古代本草阶段

药理学是在药物学的基础上发展起来的。药物的历史可追溯到五、六千年前。我国最早的一部药物学著作《神农本草经》是公元1世纪前后著成的，书中记载了动物、植物、矿物药共365种，其中有不少药物至今仍沿用；唐朝的《新修本草》是我国第一部由政府颁发的药典，全书共收载药物884种；明朝药物学家李时珍（图1-1）编著的《本草纲目》是闻名世界的一部药物学巨著，全书52卷，约190万字，共收载药物1892种、药方11000余条、插图1160幅。已译成英、日、朝、德、法、俄、拉丁等多种文字，传播到世界各地，是全世界关注的重要药物学文献之一。



图1-1 明朝药物学家
李时珍（1518—1593）

二、近代药理学阶段

药理学的建立和发展与现代科学技术的发展紧密相关。19世纪初，有机化学和实验生理学的兴起，为药理学的建立奠定了理论和实验的基础。这一阶段的研究对药理学最突出的贡献就是从具有治疗作用的植物中分离、提纯有效成分：1806年，从鸦片中提取获得吗啡；1823年，从金鸡纳树皮中分离得到奎宁；1833年，从颠茄及洋金花中提取有效成分而使阿托品问世。这一时期的研究对药理学的另一突出贡献是在化学和实验生理学方法的基础上，建立了实验药理学整体动物和离体器官研究方法。1878年，英国人J.N.Langley根据阿托品与毛茛菪香碱对猫唾液分泌的拮抗作用，提出了受体（receptor）的概念，为受体学说的建立奠定了实验基础。德国人Rudolf Buchheim（图1-2）创立了全球第一个药理学实验室，写出第一本药理学教科书，首次使药理学成为一门独立的学科。



图1-2 德国药理学家 Rudolf
Buchheim（1820—1879）

三、现代药理学阶段

1909年，德国微生物学家Ehrlich（图1-3）发现砷凡纳明（606）能治疗锥虫病和梅毒，从而开创了应用化学合成药物治疗疾病的新纪元。1928年，英国细菌学家A.Fleming（图1-4）发现了青霉素；1940年，英国微生物学家H.W.Florey在A.Fleming的研究基础上，从青霉菌培养液中分离、提取了青霉素，使化学治疗进入抗生素治疗时代。近几十年来，药理学又取得了很大发展，由过去的只与生理学相联系的单一学科发展成为与生物物理学、生物化学，以及分子生物学等多学科密切联系的一门综合学科。飞速的发展促使

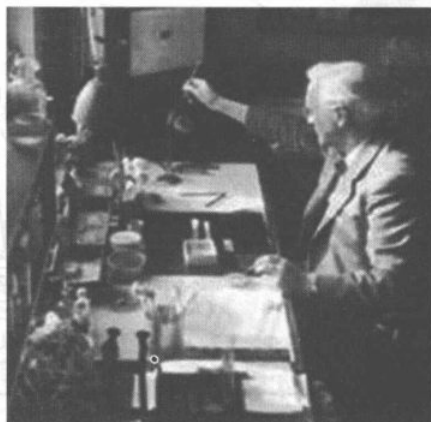


图 1-3 德国微生物学家 Ehrlich (1854—1915)

图 1-4 英国细菌学家 A.Fleming (1881—1955)

药理学产生了许多新的分支,如生物化学药理学、分子药理学、免疫药理学、遗传药理学、临床药理学等。目前,药理学的发展已从整体水平、器官水平进入到分子水平、基因水平。

中华人民共和国成立前,我国药理学工作者很少,科研工作主要是在中草药方面,如对麻黄、常山的研究,虽然也取得了一些成果,但进展十分缓慢。中华人民共和国成立以后,药理学研究工作逐步得到发展,中药的研究受到了重视,并取得很大的成就。例如,研制了安全有效并可供口服的非锑剂抗血吸虫病药吡喹酮,这些工作为治疗和消灭血吸虫病做出了巨大的贡献。在中草药药理的研究中,对强心苷(如羊角拗苷、黄夹苷)、肌松药(如防己科植物)、镇痛药(如罗通定)、抗胆碱药(如山莨菪碱)、钙拮抗剂(如粉防己碱)、治疗乙肝辅助用药(如五味子)、血管舒张药(如川芎嗪)、抗肿瘤药(如喜树碱、紫杉醇)及抗疟药(如青蒿素)等进行了大量研究工作,阐明了这些药物的药理作用及作用机制,对中西医药物治疗的结合起到了推动作用。

第三节 药理学与新药研究

药理学在新药研究中的作用是不可或缺的。所有的新药都必须经过临床前药理试验和临床药理试验研究,在确认新药的安全性和有效性之后,经过国家食品药品监督管理局的严格审查、批准之后才能批量生产、上市。按照我国 1985 年颁布的《新药审批办法》的规定,新药系指未曾在我国境内上市销售的药品。已生产的药品,凡增加新的适应证、改变给药途径和改变剂型的亦属新药范围。新药可以通过实践经验或通过理论指导(如构效关系)合成和筛选而发现,然后经过研究、开发、生产等过程直至应用。新药的研究大致可分为两个过程:临床前研究和临床研究(图 1-5),总的目标是证明其安全性和有效性。临床前研究包括新药的药学(生产工艺、质量控制和稳定性等)研究、药理学(药效学和药动学)研究,以及毒理学(急性毒性、慢性毒性和特殊毒性等)研究。临床前研究的资料须经过有关部门审核后方能进行临床研究。新药的临床研究一般分为四期,Ⅰ期临床试验是对正常健康志愿者进行的初步药理学及人体安全性试验(观察其耐受情况和药动学),一般需要 20~30 例;Ⅱ期临床试验为随机、双盲、对照试验,对新药的安全性和有

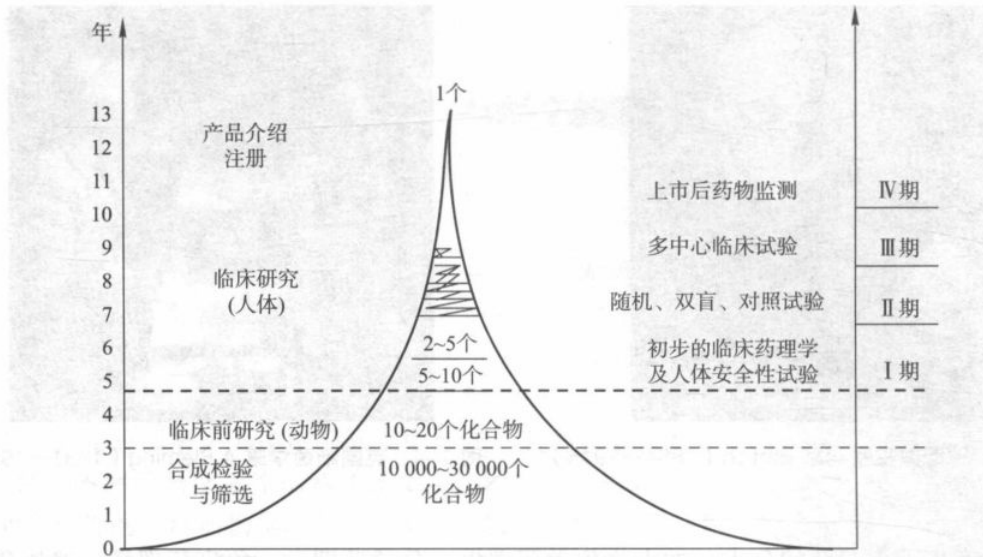


图 1-5 新药的研发过程

效性作出初步评价，推荐临床用量，患者不少于 100 对；Ⅲ期临床试验是在新药批准上市前进行的多中心临床试验，对新药的安全性和有效性进行社会考察，受试患者数不少于 300 例；Ⅳ期临床试验是在药品上市后在社会人群范围内继续进行安全性和有效性评价，即上市后药物监测，又称售后调研，是为了考察药品广泛、长期使用后的疗效和不良反应。

为了更好地控制新药研发过程中的临床风险，美国 FDA 在 2006 年提出了 0 期临床试验。0 期临床试验是指在新药研究完成临床前试验，但还未正式进入临床试验之前，容许新药研制者使用微剂量（一般不大于 100 μg ，或小于标准剂量的 1%）对少量人群（6 人左右，健康志愿者或者病人）进行药物试验，以收集必要的有关药物安全及药代动力学的试验数据。

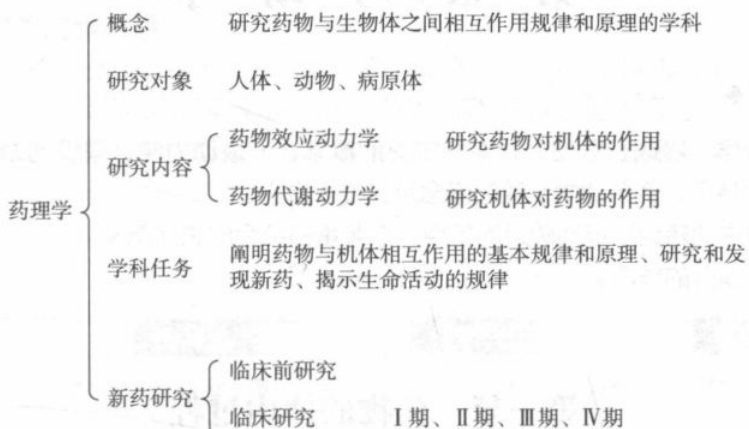
在新药研究的漫长过程（平均需要 12~13 年，图 1-5）中，药理学研究是成药性的关键步骤之一。

◆案例与讨论◆

案例：试列举一药物说明如何学习药理学。

讨论：列举药物为抗心绞痛药物硝酸甘油。硝酸甘油属于硝酸酯类药物，它的基本药理作用是舒张血管平滑肌，因此，可用来扩张冠状动脉，它的临床应用主要是治疗心绞痛。虽然硝酸甘油口服吸收良好，但是由于口服后在肝大部分被代谢（首过效应大），进入全身血液循环的药量大大减少，即生物利用度低，因此在临床上采用舌下含服方法避开首过效应，这是硝酸甘油的主要药代动力学特点。由于硝酸甘油还可扩张面部血管，因此，有时服用后可发生面部皮肤潮红，这是硝酸甘油的主要不良反应。硝酸甘油不宜与阿托品合用，因为后者可抑制唾液腺分泌，不利于硝酸甘油含服时在口中溶解，这是药物相互作用。学习每个药物的药理学都应该从以上几个方面入手。

◆本章药物分类总结◆



◆问题与思考◆

1. 什么是药理学、药效学和药动学？药物的本质是什么？有什么用途？
2. 结合药理学研究内容和学科任务阐述药理学的意义。
3. 简述新药研究的三个过程。

(刘克辛)

数字课程学习



教学PPT



自测题