

《药理学》

书籍信息

版次：31

页数：

字数：

印刷时间：2015年10月01日

开本：大16

纸张：胶版纸

包装：平装

是否套装：否

国际标准书号ISBN：9787030457950

丛书名：普通医药院校创新型系列教材

编辑推荐

《药理学》可供高等医药院校医学及医学相关专业本、专科学生、成人高考学员，以及从事各层次医学及医学相关专业教学、管理者参考、学习使用。

内容简介

《药理学》根据成人教育的教学规律和课程特点，在满足本科教学大纲的相关规定和要求的基础上，对学生前期所学内容进行了重组，补充了近些年发展起来的新知识、新观点和新理念，按照集中授课和自学相结合的原则进行编排。《药理学》共分为43章，内容包括药理学的基本理论、各章节主要的药理学知识点、重点药物、常用药物，尤其密切关注的是所介绍内容的实用性。重点和代表性的内容、药物则做系统介绍。为扩大学生的知识面及便于学生自学，每章还添加了“知识拓展”和“思考题”，以激发学生的学习兴趣及供需要的学生选择性阅读。

目录

总序	
前言	
第一章 绪言	
第二章 药物代谢动力学——药动学	
第三章 药物效应动力学——药效学	
第四章 影响药物效应的因素	
第五章 传出神经系统药理学概论	
第六章 胆碱受体激动药	
第七章 抗胆碱酯酶药和胆碱酯酶复活药	
第八章 胆碱受体阻断药()——M胆碱受体阻断药	
第九章 胆碱受体阻断药()——N胆碱受体阻断药	
第十章 肾上腺素受体激动药	
第十一章 肾上腺素受体阻断药	
第十二章 麻醉药	
第十三章 镇静催眠药	
第十四章 抗癫痫药和抗惊厥药	
第十五章 抗中枢神经系统退行性疾病药	
第十六章 抗精神失常药	

第十七章 镇痛药 第十八章 解热镇痛抗炎药 第十九章 钙通道阻滞药 第二十章 抗心律失常药第二十一章 抗高血压药 第二十二章 治疗心力衰竭的药物 第二十三章 调血脂药与抗动脉粥样硬化药第二十四章 抗心绞痛药 第二十五章 利尿药和脱水药 第二十六章 作用于血液系统及造血器官的药物 第二十七章 组胺和抗组胺药 第二十八章 作用于呼吸系统的药物。第二十九章 作用于消化系统的药物 第三十章 子宫平滑肌兴奋药与抑制药第三十一章 肾上腺皮质激素类药物 第三十二章 甲状腺激素及抗甲状腺药第三十三章 胰岛素及其他降血糖药 第三十四章 抗菌药物概论第三十五章 β-内酰胺类抗生素 第三十六章 大环内酯类、林可霉素类及万古霉素、杆菌肽第三十七章 氨基糖苷类抗生素及多黏菌素第三十八章 四环素类及氯霉素类 第三十九章 人工合成抗菌药第四十章 抗真菌药及抗病毒药 第四十一章 抗结核病药与抗麻风病药 第四十二章 抗寄生虫药 第四十三章 抗恶性肿瘤药 主要参考文献

[显示全部信息](#)

在线试读部分章节

**章绪言

掌握：药理学、药物、药效学和药动学的概念。

熟悉：新药研究与开发的过程。

了解：了解我国“本草”的贡献和现代药理学发展。

一、药理学的性质与任务

药物是指可以改变或查明机体的生理功能及病理状态，用以预防、诊断和治疗疾病的物质。药理学是指研究药物与机体（含病原体）相互作用及作用规律的学科。它既研究药物对机体的作用及作用机制，即药物效应动力学（简称药效学）；也研究药物在机体的影响下所发生的变化及其规律，即药物代谢动力学（简称药动学）。

药理学的学科任务主要包括：阐明药物的作用及作用机制，为临床合理用药、发挥药物的**疗效、防治不良反应提供理论依据；研究、开发新药，发现药物新用途；为其他生命科学的研究探索提供重要的科学依据和研究方法。

二、药物与药理学的发展史

早期的药物发展源于人们的社会实践活动。在漫长的历史进程中，人们逐渐从生产、生活经验中认识到许多天然物质可以治疗疾病，后人将此经验传授下来，由此留下了一系列的历史典籍。著名的著作有：公元1世纪前后的《神农本草经》、**部以政府名义颁发的唐代的《新修本草》及明朝药物学家李时珍编著的《本草纲目》等。而现代的药物发展与药理学的建立则是基于实践基础上的，与现代科学技术的发展紧密相关。

三、新药研究与开发

现代科技的发展使得新药研究和开发不断走向深入。所谓新药，是指化学结构、药品组成或药理作用不同于现有药品的药物。其发展大致可分为临床前研究、临床研究和上市后药物监测三个阶段。临床前研究主要由药学研究及临床前药理研究两部分组成。前者包括药物的理化性质、药品制备工艺路线及质量控制标准等；后者则是以实验动物为基

础的药效学、药动学和毒理学研究。新药的研究和开发需要经历漫长的过程，耗费大量的人力、物力和财力，经过一系列严格的筛选和反复论证，*终才能走上临床，为患者的健康保驾护航，正因如此，每一个新药刚开始上市的时候，其价格都比较高，但随着用药时间的延长和其开发成本的逐步收回，后期其价格将有较大的回落。

小结 **章绪言 掌握：药理学、药物、药效学和药动学的概念。

熟悉：新药研究与开发的过程。

了解：了解我国“本草”的贡献和现代药理学发展。一、药理学的性质与任务 药物是指可以改变或查明机体的生理功能及病理状态，用以预防、诊断和治疗疾病的物质。药理学是指研究药物与机体（含病原体）相互作用及作用规律的学科。它既研究药物对机体的作用及作用机制，即药物效应动力学（简称药效学）；也研究药物在机体的影响下所发生的变化及其规律，即药物代谢动力学（简称药动学）。药理学的学科任务主要包括：阐明药物的作用及作用机制，为临床合理用药、发挥药物的**疗效、防治不良反应提供理论依据；研究、开发新药，发现药物新用途；为其他生命科学的研究探索提供重要的科学依据和研究方法。二、药物与药理学的发展史 早期的药物发展源于人们的社会实践活动。在漫长的历史进程中，人们逐渐从生产、生活经验中认识到许多天然物质可以治疗疾病，后人将此经验传授下来，由此留下了一系列的历史典籍。著名的著作有：公元1世纪前后的《神农本草经》、**部以政府名义颁发的唐代的《新修本草》及明朝药物学家李时珍编著的《本草纲目》等。而现代的药物发展与药理学的建立则是基于实践基础上的，与现代科学技术的发展紧密相关。三、新药研究与开发 现代科技的发展使得新药研究和开发不断走向深入。所谓新药，是指化学结构、药品组成或药理作用不同于现有药品的药物。其发展大致可分为临床前研究、临床研究和上市后药物监测三个阶段。临床前研究主要由药学研究及临床前药理研究两部分组成。前者包括药物的理化性质、药品制备工艺路线及质量控制标准等；后者则是以实验动物为基础的药效学、药动学和毒理学研究。新药的研究和开发需要经历漫长的过程，耗费大量的人力、物力和财力，经过一系列严格的筛选和反复论证，*终才能走上临床，为患者的健康保驾护航，正因如此，每一个新药刚开始上市的时候，其价格都比较高，但随着用药时间的延长和其开发成本的逐步收回，后期其价格将有较大的回落。小结 药理学是指研究药物与机体（含病原体）相互作用及作用规律的学科，其内容包括药效学和药动学两个方面。药理学的学科任务主要包括：阐明药物的作用及作用机制；研究、开发新药，发现药物新用途及为其他生命科学的研究探索提供重要的科学依据和研究方法。【思考题】

名词解释： 药理学， 药物， 药效学， 药动学。（许正新）

第二章药物代谢动力学——药动学 药理学 药理学第二章药物代谢动力学——药动学

第二章药物代谢动力学——药动学 掌握： 首过消除、肝肠循环、消除半衰期、清除率、表观分布容积、生物利用度、药物与血浆蛋白结合的概念及其实际意义； 肝药酶的特性及肝药酶诱导剂和抑制剂在临床用药中的意义； 药物消除动力学特点，一级消除动力学与零级消除动力学有何不同。 熟悉： 药物的体内过程及影响药物在体内的吸收、分布、生物转化和排泄的因素； 多次给药的时量关系； 维持量、负荷量及稳态血药浓度的概念及其意义。

了解：药物体内跨膜转运的方式及影响药物跨膜转运的因素。药物代谢动力学又称为体内过程，是研究药物在机体内的吸收、分布、生物转化和排泄的动态变化规律的一门科学。在此过程中，药物要通过各种单层（如小肠上皮细胞）或多层（如皮肤）细胞膜。尽管各种细胞结构不尽相同，但其细胞膜是药物在体内转运的基本屏障，药物的通过

方式和影响因素相似。 **节药物分子的跨膜转运 一、药物通过细胞膜的方式 药物分子通过细胞膜的方式有滤过、简单扩散、载体转运和膜动转运四种形式。其中，滤过是水溶性的极性或非极性药物分子借助于流体静压或渗透压随体液通过细胞膜的水性通道而进行的跨膜转运，又称水溶性扩散。简单扩散是指脂溶性药物经过细胞膜的脂质层，顺浓度差通过细胞膜的过程，又称脂溶性扩散。绝大多数药物按此方式通过生物膜。载体转运则是药物分子或内源性物质在细胞膜的一侧通过与细胞膜上的特殊跨膜蛋白（载体）结合后将其转运到细胞膜的另一侧的转运方式，按其是否需要耗能和是否能逆电化学梯度转运可分为主动转运和异化扩散两种方式。其具有饱和现象和竞争性拮抗等共同特征。膜动转运是大分子物质通过细胞膜的一种转运方式，根据转运方向的不同分为胞饮和胞吐两种不同的方式。 二、影响药物通透细胞膜的因素 绝大多数药物均为弱酸性或弱碱性有机化合物，它们在体液中均有不同程度的解离。由于分子型（非解离型）药物疏水而亲脂，易通过细胞膜；而离子型（解离型）极性高，不易通过细胞膜脂质层，故而药物通过细胞膜的速率和药物的解离度、体液的pH、膜两侧药物的浓度差，以及细胞膜的通透性、面积和厚度，血流量，细胞膜转运蛋白的量和功能等因素有关。

第二节药物的体内过程 一、吸收 药物自给药部位进入血液循环的过程称为吸收。血管外给药途径均存在吸收过程。而不同的给药途径则存在着不同的吸收过程和特点。 1.口服 口服是*常用的给药途径。大多数药物在胃肠道内以简单扩散的方式被吸收。其中，从胃肠道吸收进入门静脉系统的药物在到达全身血液循环前必先通过肝脏和肠壁细胞，如果肝脏或肠壁细胞对其代谢能力很强，或由胆汁排泄的量较大，则进入全身血液循环内的有效药物量明显减少，这种作用称为首关消除。首关消除高的药物，口服给药时机体可利用的有效药物量少。

2.吸入一些气态药物或易气化的药物或制剂，也可采取吸入途径给药。 3.局部用药直接在皮肤、眼、鼻、咽喉、阴道或直肠等处给药，使药物产生局部作用或吸收作用。 4.舌下给药 舌下给药**的好处是，这种给药方式可在很大程度上避免首过消除，起效也很迅速。 5.注射给药包括静脉注射、肌肉注射和皮下注射等。其中，静脉注射不存在吸收过程，起效极快。 二、分布 药物吸收后从血液循环到达机体各个部位和组织的过程称为分布。药物在体内的分布受很多因素影响，包括： 1.血浆蛋白的结合率 大多数药物在体内血浆中均可与血浆蛋白不同程度地结合，由此又有结合型药物和游离型药物之分。决定血浆蛋白结合率的因素为游离型药物浓度、血浆蛋白量和药物与血浆蛋白的亲合力，亦即解离常数 KD 的大小。结合型药物不能跨膜转运，是药物在血液中的一种暂时储存形式。但因为结合是可逆的，所以药物与血浆蛋白的结合影响药物在体内的分布和转运速度及作用强度和消除速率。药物与血浆蛋白结合的特异性低，与相同血浆蛋白结合的药物之间，就会发生竞争性置换的相互作用。 2.器官血流量 药物由血液向组织器官的分布速度主要取决于该组织器官的血液流量的大小和膜的通透性。一般而言，血流量大的组织或器官其药物的分布较快，尤其是在分布的早期，随后还可出现再分布现象，如静脉注射硫喷妥钠等药。 3.组织细胞结合 有些药物与特定的组织细胞成分有特殊的亲和力，这些组织细胞中的药物浓度高于血浆游离药物浓度，因此，药物的分布具有一定的选择性。多数情况下，药物和组织的结合是可逆的，为药物在体内的一种储存形式，但也有一些药物可与组织发生不可逆结合而引起毒性反应。 4.体液的pH和药物的解离度 体液的pH对药物的分布具有影响。一般而言，升高血液的pH可使弱酸性药物由细胞内向细胞外转运，降低血液pH则使弱酸性药物向细胞内转运。弱碱性药物则相反。 5.体内屏障 体内的特殊屏障包括：血脑屏障、胎盘屏障和血眼屏障等。它们也能影响药物的体内分布。

三、生物转化 药物在体内经酶或其他作用使药物的化学结构发生改变，此过程称为生物转化，又称为代谢。生物转化的场所主要是肝，另外还有其他一些部位（如肺、肠黏膜、肾、肾上腺、皮肤等处）也参与了一些药物的体内转化。体内药物的生物转化可分为两个过程，**个过程是氧化、还原或水解（相反应）。经过这一过程，药物通常失去活性；但也有一些药物却是经过这一过程才能被激活，转化为活性代谢物（如可的松、泼尼松等药需经肝脏还原酶作用转化为氢化可的松和泼尼松龙后才具有生物活性，严重的肝功能不全患者，此转化过程受限，宜直接使用其活性形式氢化可的松和泼尼松龙）；另有一些药物则可通过生物转化转变为毒性代谢产物。第二个过程（相反应）是结合反应。参与这一反应的基团有：葡萄糖醛酸、甘氨酸、硫酸等。经过这一过程，药物的极性和水溶性增大，易于排出。不同药物的转化途径不同，有的只经过一个过程，有的需经过两个过程，有的则不须经过生物转化而直接排出体外。药物的生物转化是在酶的催化下进行的，这些催化药物生物转化的酶统称为药物代谢酶，简称为药酶。肝脏中药酶的种类多而且含量丰富，是药物代谢的主要器官。催化药物生物转化的酶有两种类型：一种是专一性的酶，如胆碱酯酶（ChE）、单胺氧化酶（MAO）、儿茶酚胺O甲基转移酶（COMT）等。它们分别催化相应的药物转化（详见第五章）。另一种是非专一性的酶，根据其在细胞内的存在部位分为微粒体酶系和非微粒体酶系，其中以前者比较重要。肝药酶在药物的生物转化中起着极其重要的作用。其活性的高低直接影响着药物生物转化的快慢。有些药物可通过影响肝药酶的活性而影响该药本身或其他药物的生物转化。其中，凡能加速肝药酶的合成或增强其活性的药物称为肝药酶的诱导剂，如苯巴比妥、苯妥英钠、利福平、保泰松、灰黄霉素等；凡能抑制肝药酶的合成或降低其活性的药物称为肝药酶的抑制剂，如西咪替丁、氯霉素、异烟肼、酮康唑等。

四、排泄 药物以原形或其代谢产物的形式经不同途径排出体外的过程称为排泄。排泄的主要器官是肾脏，其次是经胆汁从粪便中排出。挥发性药物则主要经肺随呼出气体排出。其中，分布、生物转化和排泄合称为消除。由于大多数药物是通过肾脏途径排泄的，其间存在着原型药物的重吸收过程，因此，调节尿液的pH能影响药物的重吸收过程和药物的体内浓度。

第三节房室模型与药物消除动力学 一、房室模型 目前广泛应用的药代动力学模式是以房室概念为基础的房室模型。该模型将机体视作一个系统，系统内部按动力学特点分为若干房室。此处所指的房室与解剖学上的具体部位和生理学功能无关，只要体内某些部位药物的转运速率相同或相近，就作为同一房室。房室模型的提出是为了使复杂的生物系统简单化，从而能定量地分析药物在体内的动态过程。

二、药物消除动力学 体内药物的消除动力学过程有三种形式：一级消除动力学、零级消除动力学和混合消除动力学。

1.一级消除动力学 一级消除动力学是体内药物按恒定比例消除，也就是说，单位时间内药物的消除量与血浆药物浓度成正比。以一级动力学消除的药物其药时曲线在常规坐标图上作图时呈曲线，在半对数坐标图上则为直线，故称为线性动力学过程。大多数药物在体内按一级动力学方式消除。

2.零级消除动力学 零级消除动力学是体内药物按恒定的速率消除，亦即不论血浆药物浓度多少，单位时间内药物的消除量不变。以零级动力学消除的药物其药时曲线在半对数坐标图上呈曲线，故称为非线性动力学消除。通常是因为药物在体内的消除能力达到饱和所致。

3.混合消除动力学 部分药物在体内可表现为混合消除动力学，即在低浓度或低剂量时，按一级动力学消除，浓度或剂量升高到一定程度后，因消除能力饱和，单位时间内消除的药物量不再改变，按零级动力学消除。

第四节体内药量变化的时间过程 血浆药物浓度随时间的变化而发生相应变化的规律，称时量关系。将时量关系用图形来表示（横坐标为时间，纵坐标为血药浓度），即得时量

曲线，又称“药时曲线”。一、单次给药的时量曲线下面积 典型的单次口服给药后时量曲线的血药浓度有一个上升—达峰—下降这一随时间变化的过程。此上升段主要反映药物的吸收过程；下降段主要反映药物的消除过程。其中，曲线的上升段至峰值顶点间的距离，亦即从开始给药至血药浓度达高峰时的时间间隔，称达峰时间（ T_{max} ）；曲线**处的血药浓度称为峰浓度（ C_{max} ）；时量曲线下所覆盖的面积称为时量曲线下面积（AUC），其大小与吸

[显示全部信息](#)

本站所提供下载的PDF图书仅提供预览和简介，请支持正版图书。

[更多资源请访问www.tushupdf.com](http://www.tushupdf.com)