



医药卫生类专业工学结合精品教材
“互联网+教育”新形态一体化教材

药理学基础

(第二版)

主 编 张 路 才艳红



北京出版集团
北京出版社

图书在版编目(CIP)数据

药理学基础 / 张路, 才艳红主编. --2 版. -- 北京:
北京出版社, 2024. 6

ISBN 978-7-200-18563-8

I. ①药… II. ①张… ②才… III. ①药理学—中等
专业学校—教材 IV. ①R9

中国国家版本馆 CIP 数据核字(2024)第 025763 号

药理学基础(第二版)

YAO WUXUE JICHU

主 编: 张 路 才艳红
出 版: 北京出版集团
北京出版社
地 址: 北京北三环中路 6 号
邮 编: 100120
网 址: www.bph.com.cn
总 发 行: 北京出版集团
经 销: 新华书店
印 刷: 定州启航印刷有限公司
版 印 次: 2024 年 6 月第 2 版 2024 年 6 月第 1 次印刷
成品尺寸: 185 毫米 × 260 毫米
印 张: 18
字 数: 285 千字
书 号: ISBN 978-7-200-18563-8
定 价: 54.00 元

如有印装质量问题, 由本社负责调换

质量监督电话: 010-82685218 010-58572393

目 录

单元一 药理学基础总论 1

任务一	概述	2
任务二	药物对机体的作用——药效学	4
任务三	机体对药物的影响——药动学	9
任务四	影响药物作用的因素	16

单元二 传出神经系统药物 23

任务一	概述	24
任务二	胆碱受体激动药和胆碱酯酶抑制药	29
任务三	抗胆碱药	34
任务四	拟肾上腺素药	39
任务五	抗肾上腺素药	47

单元三 局部麻醉药物 53

单元四 中枢神经系统药物 61

任务一	镇静催眠药	62
任务二	抗癫痫药	66
任务三	抗精神失常药	71
任务四	镇痛药	77
任务五	解热镇痛抗炎药	84
任务六	中枢兴奋药	89

单元五 心血管系统药物 93

任务一	抗高血压药	94
任务二	抗慢性心功能不全药	105
任务三	抗心律失常药	110
任务四	抗心绞痛药	117
任务五	调血脂药	122

单元六 泌尿系统药物 129

任务一	利尿药	130
任务二	脱水药	136

单元七 血液和造血系统药物 139

任务一	抗贫血药	140
任务二	促凝血药	145
任务三	抗凝血药和溶栓药	149
任务四	血容量扩充药	152
任务五	盐类及酸碱平衡调节药	154

单元八 呼吸系统药物 158

任务一	镇咳药	159
任务二	祛痰药	162
任务三	平喘药	165

单元九 消化系统药物 172

任务一	助消化药	173
任务二	抗消化性溃疡药	174
任务三	止吐药及胃肠动力药	181
任务四	泻药与止泻药	182



单元十 抗组胺药 186

单元十一 子宫兴奋药 191

单元十二 激素类及有关药物 198

- 任务一 肾上腺皮质激素类药物····· 199
- 任务二 甲状腺激素和抗甲状腺药物····· 203
- 任务三 降血糖药····· 208

单元十三 抗微生物药 216

- 任务一 概述····· 217
- 任务二 抗生素····· 220
- 任务三 合成抗菌药····· 238
- 任务四 抗结核病药····· 245
- 任务五 抗真菌药和抗病毒药····· 249
- 任务六 消毒防腐药····· 253

单元十四 抗肿瘤药物 260

- 任务一 概述····· 261
- 任务二 常用抗肿瘤药····· 265

参考文献 278



单元二 传出神经系统药物

学习目标

» 理论目标

1. 掌握毛果芸香碱、新斯的明、阿托品、肾上腺素的作用、适应证、不良反应及用药护理。
2. 熟悉多巴胺、麻黄碱、异丙肾上腺素的作用特点、适应证及不良反应。
3. 熟悉山莨菪碱、东莨菪碱、酚妥拉明的适应证。
4. 了解传出神经系统按递质的分类、受体的类型、分布及生理效应。
5. 了解去甲肾上腺素的应用及有机磷酸酯类中毒的解救。

» 能力目标

1. 教会患者正确使用滴眼液。
2. 学会观察本单元药物的疗效与不良反应。
3. 能够熟练用药护理，并正确指导患者合理用药。

» 素质目标

1. 加强职业道德观念，全心全意为人民、为社会服务的意识。
2. 具有良好的法律意识，自觉遵守有关医疗卫生的法律法规，合理、安全用药。



传出神经系统是外周神经系统的一部分，包括自主神经系统和运动神经系统，前者又分为交感神经和副交感神经，主要支配心肌、平滑肌和腺体等效应器；后者用来支配骨骼肌。作用于传出神经系统的药物主要影响传出神经系统的递质及受体，通过拟似或拮抗传出神经的功能，从而调节内脏器官或骨骼肌的生理变化。

任务一 概述

一、传出神经的分类

（一）传出神经的解剖学分类

1. 植物神经（自主神经）

植物神经包括交感神经和副交感神经。自中枢发出后，经过神经节更换神经元，再到达所支配的效应器。因此植物神经有节前纤维和节后纤维之分。

2. 运动神经

运动神经是自中枢发出后，不更换神经元，直达所支配骨骼肌的神经。

（二）传出神经按递质分类

在正常情况下，当神经冲动到达传出神经末梢时，从突触前膜释放传递信息的化学物质，称为递质（介质）。通过递质激动突触后膜相应受体，引起各种生理效应。传出神经的主要递质有乙酰胆碱（ACh）和去甲肾上腺素（NA）（图 2-1）。

1. 胆碱能神经

胆碱能神经是合成和释放乙酰胆碱的神经。包括交感神经和副交感神经节前纤维及支配肾上腺髓质的交感神经纤维、副交感神经节后纤维、部分支配汗腺和骨骼肌血管的交感神经节后纤维、运动神经。

2. 去甲肾上腺素能神经

去甲肾上腺素能神经是合成和释放去甲肾上腺素的神经。大部分交感神经节后纤维属于此类神经。

此外，肾血管和肠系膜血管等效应器官上，还有多巴胺能神经，可以释放递质多巴胺（DA）。



有机磷农药中毒的机制



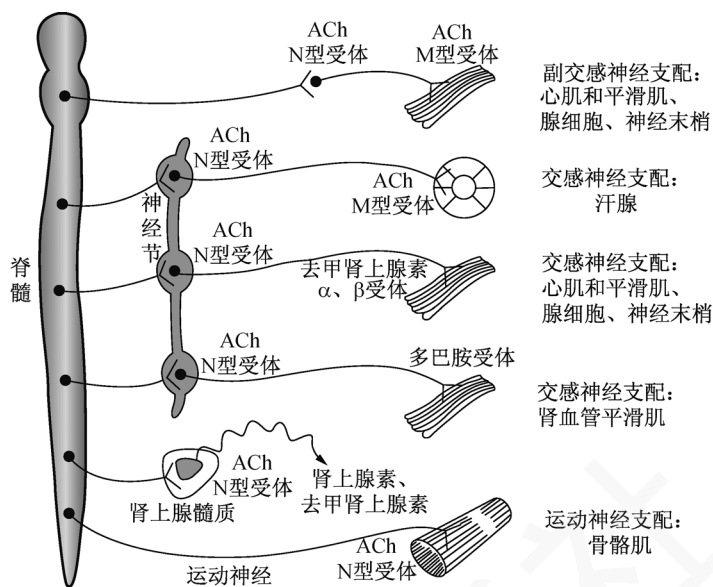


图 2-1 传出神经递质分类图

二、传出神经受体的分类及效应

传出神经的受体能选择性地与一定递质或药物结合而产生效应。按其选择性的不同，可将这些受体分为胆碱受体和肾上腺素受体（图 2-2、表 2-1）。

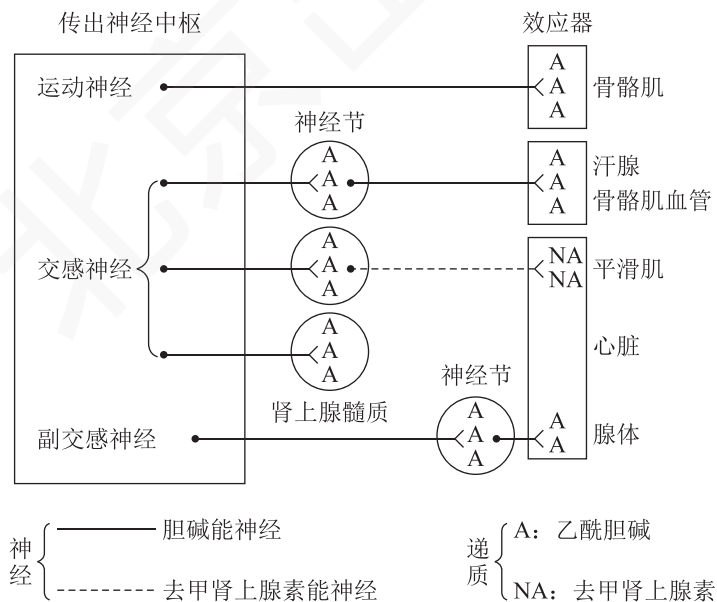


图 2-2 传出神经受体分布及效应图



表 2-1 传出神经受体及其兴奋时的主要效应

受体类型	分布	效应
胆碱受体		
M ₁	胃腺	胃液分泌增加
M ₂	心脏、内脏平滑肌、瞳孔括约肌、腺体、血管、突触前膜	心脏抑制、内脏平滑肌收缩、缩瞳、腺体分泌、血管扩张、ACh、NA 释放减少
N ₁	植物神经节、肾上腺髓质	神经节兴奋、分泌肾上腺素
N ₂	骨骼肌	骨骼肌收缩
肾上腺素受体		
α ₁	血管（皮肤、黏膜、内脏）	血管收缩
α ₂	突触前膜	ACh 或 NA 释放减少
β ₁	心肌、肾近球细胞、突触前膜	心脏兴奋、肾素分泌、NA 释放增加
β ₂	支气管、血管（骨骼肌、冠脉） 脂肪、糖代谢	支气管扩张、血管扩张脂肪分解、糖原分解
多巴胺受体	血管（心、脑、肾、肠系膜、冠脉）	血管扩张

（一）胆碱受体

胆碱受体是指能选择性地与乙酰胆碱结合的受体。可分为 M 受体和 N 受体。

1. M 受体（毒蕈碱型胆碱受体）

M 受体是指能选择性地与毒蕈碱结合的胆碱受体，又分为 M₁ 和 M₂ 受体。M₁ 受体主要分布于胃腺和神经节细胞等处；M₂ 受体主要分布于心脏、平滑肌、腺体和传出神经突触前膜。M 受体激动时呈现 M 样作用，表现为心脏抑制、血管扩张、腺体分泌增加、内脏平滑肌收缩、瞳孔缩小、抑制乙酰胆碱或去甲肾上腺素释放等效应。

2. N 受体（烟碱型胆碱受体）

N 受体是指能选择性地与烟碱结合的胆碱受体，又分为 N₁ 和 N₂ 受体。N₁ 受体分布于传出神经节细胞、肾上腺髓质等处；N₂ 受体分布于骨骼肌上。N 受体激动时呈现 N 样作用，表现为神经节兴奋、肾上腺髓质分泌、骨骼肌收缩等效应。

（二）肾上腺素受体

肾上腺素受体是指能选择性地与去甲肾上腺素或肾上腺素结合的受体，可分为 α 受体和 β 受体。





1. α 受体（ α 型肾上腺素受体）

α 受体又分为 α_1 受体和 α_2 受体。 α_1 受体主要分布于突触后膜，如皮肤、黏膜、内脏血管及瞳孔开大肌等处； α_2 受体主要分布于突触前膜。 α 受体激动时产生 α 型作用，表现为血管收缩、瞳孔扩大、抑制乙酰胆碱或去甲肾上腺素释放。

2. β 受体（ β 型肾上腺素受体）

β 受体又分为 β_1 受体和 β_2 受体。 β_1 受体主要分布于心肌和肾近球细胞上； β_2 受体主要分布于支气管、骨骼肌血管及冠脉血管平滑肌、去甲肾上腺素能神经突触前膜等处。 β 受体激动时产生 β 型作用，表现为心脏兴奋、肾素分泌、支气管平滑肌松弛、骨骼肌及冠脉血管扩张、糖原分解、去甲肾上腺素释放。

此外，外周神经组织的多巴胺受体分布于肾血管、肠系膜血管和冠脉血管。多巴胺受体激动时，可使这些血管扩张。



考点提示

α 型作用、 β 型作用、DA型作用、M样作用、N样作用是要重点记忆的内容，是学好传出神经系统药物的基础。

三、传出神经系统药物的作用方式和分类

传出神经系统药物的作用方式包括直接与受体结合，产生激动受体或阻断受体的效应，或影响递质的体内过程，激活酶、抑制酶的活性。

（一）直接作用于受体

传出神经系统药物能直接与受体结合，如果产生激动受体的效应，则称为该受体的激动药，例如胆碱受体激动药和肾上腺素受体激动药；如果结合后不产生或较少产生激动受体的效应，且阻断递质或激动药与受体的结合，则称为该受体的阻断药，例如胆碱受体阻断药和肾上腺素受体阻断药。

（二）影响递质

1. 影响递质的合成

如密胆碱能抑制乙酰胆碱的生物合成。



2. 影响递质的释放

如麻黄碱和间羟胺在直接激动肾上腺素受体的同时，还能促进去甲肾上腺素能神经末梢释放去甲肾上腺素。

3. 影响递质的生物转化

如胆碱酯酶抑制剂能通过抑制胆碱酯酶的活性，阻止乙酰胆碱的水解，使乙酰胆碱蓄积产生激动胆碱受体的效应。

4. 影响递质的转运和贮存

如利舍平可抑制去甲肾上腺素能神经末梢囊泡对去甲肾上腺素的再摄取，使囊泡中的去甲肾上腺素不能贮存，逐渐减少而耗竭，从而发挥拮抗去甲肾上腺素能神经的作用。



考点提示

理解、掌握传出神经系统药物的分类方法，对于加强药物的记忆有重要帮助，并由此推导出药物的应用注意事项及护理要点。

根据药物的作用方式和对受体作用的选择性，可对传出神经系统药物进行分类（表 2-2）。

表 2-2 传出神经系统的药物分类

	分类		药物
拟胆碱药	胆碱受体激动药	M、N 受体激动药	氨甲酰胆碱
		M 受体激动药	毛果芸香碱
		N 受体激动药	烟碱（小量）
	胆碱酯酶抑制剂		新斯的明、吡斯的明、毒扁豆碱、有机磷
抗胆碱药	胆碱受体阻断药	M 受体阻断药	阿托品、东莨菪碱、山莨菪碱、后马托品、溴丙胺太林、哌仑西平
		N ₁ 受体阻断药	美卡拉明、咪噻芬、樟磺咪芬
		N ₂ 受体阻断药	琥珀胆碱、筒箭毒碱、泮库溴铵
	胆碱酯酶复活药		碘解磷定、氯解磷定
拟肾上腺素药 （肾上腺素受体激动药）		α、β 受体激动药	肾上腺素、多巴胺、麻黄碱
		α 受体激动药	去甲肾上腺素、间羟胺、去氧肾上腺素
		β 受体激动药	异丙肾上腺素、多巴酚丁胺、沙丁胺醇、克伦特罗、特布他林





续表

	分类	药物
抗肾上腺素药 (肾上腺素受体阻断药)	α 、 β 受体阻断药	拉贝洛尔
	β 受体阻断药	酚妥拉明、妥拉苏林、酚苄明、哌唑嗪
	β 受体阻断药	普萘洛尔、噻吗洛尔、美托洛尔、阿替洛尔、吲哚洛尔

任务二 胆碱受体激动药和胆碱酯酶抑制药

典型案例

患者，女，42岁。因工作繁忙、经常熬夜，眼睑水肿，眼结膜充血，伴有头痛、眼胀、视觉障碍，视物模糊不清。检查显示眼压明显升高（40 mmHg）、视野缩小、视神经萎缩。医生诊断为：青光眼。

请思考：

1. 患者视力下降的主要原因是什么？
2. 你认为可选用本单元哪些药物进行治疗？其降低眼内压机制是什么？
3. 应用时需注意什么？

一、M 受体激动药

直接激动胆碱受体的药物可分为三类：第一类，M、N 受体激动药。如乙酰胆碱、氨甲酰胆碱。乙酰胆碱因效应广泛、不良反应多，且在组织中水解迅速，故临床实用价值较小，常用作实验研究工具药。第二类，M 受体激动药。如毛果芸香碱。第三类，N 受体激动药。以烟碱为代表，无临床实用价值。

毛果芸香碱（匹鲁卡品）

毛果芸香碱是从毛果芸香科植物叶中提取的生物碱，也能被人工合成。

【作用】直接激动 M 受体，产生 M 样作用。对眼和腺体的作用最明显。

1. 对眼的作用

（1）缩瞳：瞳孔括约肌上有 M 受体，受胆碱能神经支配，激动时瞳孔缩小。毛果芸香碱可激动瞳孔括约肌上的 M 受体，使瞳孔括约肌收缩，瞳孔缩小。





(2) 降低眼压：眼内压是指眼内房水对眼球壁的压力（图 2-3）。房水回流障碍可使眼内压升高，毛果芸香碱能通过激动睫状肌上的 M 受体，使虹膜向中心拉紧，其根部变薄，前房角间隙扩大，房水易于通过滤帘及巩膜静脉窦进入血液循环，使眼压降低。

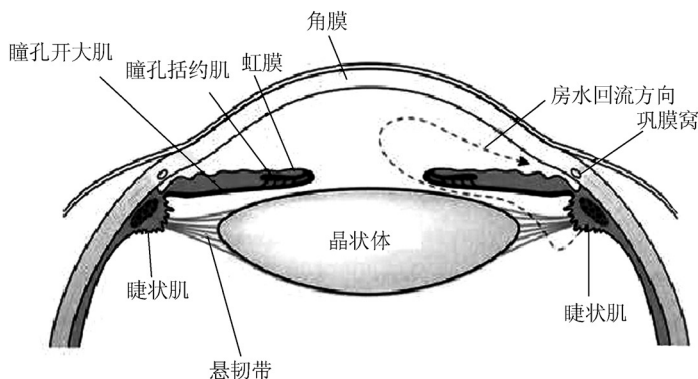


图 2-3 房水循环示意图

(3) 调节痉挛（导致近视）：眼睛的调节主要取决于晶状体曲度的变化。毛果芸香碱能激动睫状肌上的 M 受体，使睫状肌向瞳孔中心方向收缩，悬韧带松弛，晶状体变凸，视近物清楚，而视远物会模糊不清，此作用称为调节痉挛。

2. 其他作用

可使腺体分泌增加，以汗腺、唾液腺分泌增加最为明显，对其他腺体如泪腺、胃腺、胰腺、呼吸道腺体分泌亦增加；还可兴奋肠道、支气管、子宫、膀胱及胆管平滑肌；对心血管影响较小，可使心率减慢。

【适应证】主要用于眼科。

1. 青光眼

眼压升高是青光眼的主要特征，可分为闭角型和开角型两种。毛果芸香碱对闭角型青光眼疗效好，用药后由于缩瞳作用，使前房角间隙扩大，可迅速降低眼压，从而缓解或消除青光眼症状。毛果芸香碱对开角型青光眼也有一定疗效。

2. 虹膜炎

多与扩瞳药交替使用，以防止虹膜与晶状体的粘连。

3. 用于阿托品类 M 受体阻断药中毒的解救，需全身用药。



考点提示

毛果芸香碱对眼睛的作用：缩瞳、降眼压、调节痉挛，用于治疗青光眼。这是需要重点记忆的内容。





【不良反应及用药护理】

局部应用毛果芸香碱时不良反应较小，但吸收过量可引起流涎、出汗、恶心、呕吐、腹痛、腹泻、胸闷、支气管痉挛及呼吸困难等 M 受体过度兴奋症状，可用阿托品对抗。滴眼时应用手指压迫眼内眦并停留 1 分钟，以免药液经鼻泪管流入鼻腔吸收而引起全身不良反应。

二、抗胆碱酯酶药

抗胆碱酯酶药又称胆碱酯酶抑制药，能抑制胆碱酯酶活性，使胆碱能神经末梢释放的乙酰胆碱不被水解，导致大量蓄积而激动 M 受体和 N 受体，从而呈现 M 样和 N 样作用。本类药物按其胆碱酯酶结合后水解速度的快慢，可分为两类：一类是易逆性胆碱酯酶抑制药，如新斯的明、毒扁豆碱等；另一类是难逆性胆碱酯酶抑制药，这类药物与胆碱酯酶活性中心结合后，很难从酶的活性中心水解，造成 ACh 在体内的大量堆积中毒，如有机磷酸酯类。



青光眼的常用制剂及用法

（一）易逆性胆碱酯酶抑制药

新斯的明（普鲁斯的明）

本药脂溶性低，口服吸收少且不规则，故口服用量应比注射用量大 10 倍以上。因不易透过血脑屏障，故无明显中枢作用。滴眼时，不易透过角膜，故对眼的作用较弱。

【作用】本药通过可逆性的与胆碱酯酶结合并抑制胆碱酯酶的活性，使乙酰胆碱蓄积而呈现 M 样和 N 样作用。此外，本药还可直接激动骨骼肌细胞上的 N_2 受体，促进运动神经末梢释放乙酰胆碱发挥强大的骨骼肌兴奋作用。

本药对骨骼肌兴奋作用最强，对胃肠及膀胱平滑肌兴奋作用较强，而对眼、腺体、心血管和支气管平滑肌作用较弱。

【适应证】

1. 重症肌无力

这是一种神经肌肉接头传导功能减退的自身免疫性疾病，出现进行性肌无力，临床主要体征为眼睑下垂，咀嚼和吞咽困难，肢体无力，严重时可导致呼吸困难。本药可明显改善肌无力的症状。一般病例多采用口服给药，严重者可皮下或肌肉注射给药。



4. 抗休克

在补足血容量基础上，通过兴奋心脏、增加心排血量及扩张血管作用，治疗中心静脉压升高和心排血量低的感染性休克。

【不良反应及用药护理】

常见的不良反应有心悸、头痛、头晕，对哮喘、缺氧的患者易引起心律失常，可产生耐受性，用药过程中要注意控制心率，以免诱发或加剧心绞痛。禁用于冠心病、心肌炎、甲亢及糖尿病患者。

多巴酚丁胺

多巴酚丁胺主要选择性地激动 β_1 受体。与异丙肾上腺素相比正性肌力作用较强，可使心收缩力增强，心排血量增加，对心率影响小，很少增加心肌耗氧量。适用于心肌梗死伴有心力衰竭的患者。偶见心律失常，禁用于心房颤动患者。



拟肾上腺素药常用制剂及用法

知识链接

过敏性休克

过敏性休克是由Ⅰ型变态反应所引起的，由于大量释放过敏介质，而引起小血管扩张，毛细血管通透性增加，血压下降，支气管平滑肌痉挛呼吸困难等，如不及时抢救可因喉头水肿，呼吸、循环衰竭死亡。

任务五 抗肾上腺素药

典型案例

患者，男，28岁。手指麻木、疼痛1年就诊。查体：患者双手指尖端发白，厥冷，伴麻木感。诊断：雷诺病。

请思考：

1. 可选用何种药物治疗？为什么？
2. 应如何做好用药护理？



体内儿茶酚胺处于低水平时，可表现 β 受体激动作用，使心率加快、心排血量增加等。具有内在拟交感活性的药物，其对心脏的抑制作用和对支气管的收缩作用均较弱。

4. 膜稳定作用

有些 β 受体阻断药具有局麻作用和奎尼丁样作用（直接抑制心肌细胞），这些作用都是由其降低细胞膜对离子的通透性所致，故称为膜稳定作用。但产生此作用所需的浓度是临床所需浓度的几十倍，故临床意义不大。

【适应证】

用于治疗高血压、心绞痛和心肌梗死、心律失常和甲亢。

【不良反应及用药护理】

1. 一般不良反应

中枢神经系统症状，有多梦、幻觉、失眠、头晕、乏力和精神抑郁等；胃肠道反应，如恶心、呕吐、腹痛和腹泻等。

2. 抑制心脏功能

本药可引起急性心功能不全、房室传导阻滞甚至心脏停搏，故心功能不全、心动过缓、房室传导阻滞患者禁用。

3. 诱发或加重支气管哮喘

本药可诱发或加重支气管哮喘，故支气管哮喘患者禁用。

4. 反跳现象

长期用 β 受体阻断药突然停药，可出现原有症状加重，这是由于受体向上调节所致。因此长期用药必须逐渐减量停药。

5. 少数人可出现低血糖症状

因 β 受体阻断药可增强降糖药的作用，同时掩盖低血糖症状而出现严重后果，所以与降糖药合用时，需注意患者的症状。



传出神经系统药物
常用制剂及用法





知识链接

肾上腺素受体阻断药对肾上腺素受体有较强的亲和力,但不具有或仅有轻度的激动受体的内在活性,与受体结合后可阻断去甲肾上腺素和肾上腺素受体激动药对受体的激动,呈现抗肾上腺素作用,这种作用称为内在拟交感活性。

直击护考

选择题

 A_1/A_2 型题

1. 过敏性休克宜首选用的药物是()。
A. 阿托品
B. 肾上腺素
C. 间羟胺
D. 麻黄碱
E. 酚妥拉明
2. 毛果芸香碱的缩瞳作用是()。
A. 虹膜向中心拉紧
B. 虹膜根部变薄
C. 前房角间隙扩大
D. 房水易于回流
E. 以上均是
3. 治疗手术后腹胀气或尿潴留可选用()。
A. 毛果芸香碱
B. 毒扁豆碱
C. 阿托品
D. 新斯的明
E. 东莨菪碱
4. 阿托品禁用于()。
A. 胆肾绞痛
B. 心动过缓
C. 前列腺肥大
D. 盗汗
E. 麻醉前给药
5. 应用大剂量阿托品,可出现的作用是()。
A. 解除支气管平滑肌痉挛
B. 解除小血管痉挛,改善微循环
C. 扩张小血管,用于高血压
D. 兴奋心脏,减慢传导
E. 抑制中枢,用于催眠

