

权威/高效/实用/方便
一线教学人员编写



最新版

国家执业药师资格考试 考题纵览与全真模拟系列丛书

曹 霞 赵春芳◎ 主编

药学专业知识（一）

YAOXUE ZHUANYE ZHISHI

- 考点精要
- 历年真题
- 强化习题
- 模拟考试



军事医学科学出版社

国家执业药师资格考试考题纵览与全真模拟系列丛书

药学专业知识(一)

主编 曹 霞 赵春芳

副主编 (按姓氏笔画为序)

石 卓 卢秀花 曲相茹 刘宏雁

乔 萍 谷欣权 张沐新

图书在版编目(CIP)数据

药学专业知识(一)/曹霞,赵春芳主编.
-北京:军事医学科学出版社,2008.2
(国家执业药师资格考试考题纵览与全真模拟系列丛书)
ISBN 978 - 7 - 80245 - 037 - 0

I. 药… II. ①曹… ②赵… III. 药物学 - 药剂人员 - 资格考核 -
自学参考资料 IV. R9

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2008)第 003617 号

出 版: 军事医学科学出版社

地 址: 北京市海淀区太平路 27 号

邮 编: 100850

联系电话:发行部:(010)63801284

63800294

编辑部:(010)66884418,86702315,86702759

86703183,86702802

传 真:(010)63801284

网 址:<http://www.mmsp.cn>

印 装: 京南印刷厂

发 行: 新华书店

开 本: 787mm×1092mm 1/16

印 张: 18.75

字 数: 412 千字

版 次: 2008 年 4 月第 1 版

印 次: 2008 年 4 月第 1 次

定 价: 35.00 元

◆ 本社图书凡缺、损、倒、脱页者,本社发行部负责调换

前　　言

《国家执业药师资格考试考题纵览与全真模拟系列丛书》是根据 2007 考试大纲要求,在深入领会考试大纲、详细分析教材内容、掌握历年命题规律、认真推敲考题类型的基础上由有数年执业药师资格考试辅导教学经验的教师合力编写而成。

《国家执业药师资格考试考题纵览与全真模拟系列丛书》包括《药事管理与法规》、《药学综合知识与技能》、《药学专业知识(一)》、《药学专业知识(二)》、《中医学综合知识与技能》、《中医学专业知识(一)》、《中医学专业知识(二)》等七个分册,每分册习题前附该科目的考试大纲、相应的考前练习题及答案。

如何获得执业药师资格证书,顺利通过考试,其中一个重要的因素是要有一本有效的参考书,而本教材的编写目的正是为了帮助广大考生在全面复习教材和反复阅读考试大纲的基础上,通过做大量的习题来加深理解和掌握教材中的内容及重点、难点问题,达到快速、高效的复习效果。本书编写的主要特点如下:

1. 紧扣大纲:本书是在编者对“考试大纲”和“考试教材”进行反复研究,精心整理后编辑的。
2. 难度适中:编者根据多年的对执业药师考前辅导的经验和对历年考试的分析,保证试题的难度与当年的考题基本一致,以免难题过多,将考生引入钻难题、偏题的死胡同。
3. 重点突出:本书对大纲要求了解掌握、熟悉的知识点进行了不同层次的强化训练,有利于考生在有限的时间内有的放矢、迅速掌握考点。
4. 力求完美:本书全面覆盖大纲规定的知识点,答案力求完善,力争避免出现有争议的问题。

由于编写时间仓促,书中疏漏或不当之处,敬请广大应试人员和读者批评指正。

预祝广大考生顺利通过考试。

编者

2008 年 3 月

药理学部分

主 编 曹 霞(吉林大学药学院)

副 主 编 (按姓氏笔画为序)

石 卓(吉林大学基础医学院)

卢秀花(吉林大学药学院)

曲相茹(吉林大学药学院)

刘宏雁(吉林大学药学院)

乔 萍(吉林大学基础医学院)

谷欣权(吉林大学中日联谊医院)

药物分析

主 编 赵春芳(吉林大学药学院)

副 主 编 张沐新(吉林大学药学院)

编 者 (按姓氏笔画为序)

刘 昕(吉林大学药学院)

张春红(吉林农业大学中药材学院)

雷晓娜(吉林大学药学院)

药理学部分编写说明

药理学是执业药师必备的药学专业知识的重要组成部分;也是国家执业药师资格考试药学专业知识(一)的必考内容。根据国家人事部和国家食品药品监督管理局《执业药师资格考试实施办法》精神和《国家执业药师资格考试药理学考试大纲》的要求,为方便广大考生在较短时间内全面复习考试要求的内容,检验自身专业水平,编写了这部应试习题集。本书内容紧扣 2007 年新版《全国执业药师资格考试大纲》,严格按照大纲要求的范围和深度,注重试题的严谨和准确,力求反映考试大纲的考试要点,适应考试内容的调整。

全国执业药师考试全部为客观性的选择题,共有三种题型:A 型题(最佳选择题,备选答案只有一个正确答案)、B 型题(配伍选择题,每题也只有一个正确答案,A、B、C、D、E 可被重复选择或不选)、X 型题(多项选择题,多选、漏选都不给分)。

本书在编写的过程中,按章节列出了大纲要求,之后对每一部分的知识点进行了分类描述和总结,每一部分对应有强化练习题和参考答案。本书是在各位作者的通力合作及辛勤劳动下完成的,疏漏或不当之处,敬请广大读者和应试人员指正。

药物分析部分编写说明

药物分析知识是执业药师必备的药学专业知识的重要组成部分。根据执业药师的职责与执业活动的需要,根据国家药品监督管理局制订的“考试大纲”,药物分析部分的考试内容主要包括以下几个方面:

1. 药典和药物分析的基础知识。
2. 常用分析方法及其在药品检验中的应用。
3. 药物的杂质检查。
4. 常用药物及其制剂的检查。

药物分析和药理学作为“药学知识”(一)的内容为一张考试卷(100分),药物分析占40%,药理学占60%。考试形式为闭卷,均为选择题(客观题)。题型有A型题(最佳选择题)、B型题(配伍选择题)和X型题(多项选择题)。题量通常为56道选择题(整张试卷为140道选择题)。

为了更好地理解药物分析知识,更好地参加执业药师资格考试,我们根据“应试大纲”参照《国家执业药师资格考试应试指南》教材,并结合多年药物分析教学经验及执业药师培训工作积累编写而成该书。希望对应试人员及相关药学专业人员有所帮助。

本书共计八章,系统介绍了药物分析知识点并编辑了大量选择题。每章分为“基本内容”、“应试要点”、“历年考题”和“强化练习题”四部分。“基本内容”便于读者掌握考试的重点要求;“应试要点”将各知识点细化分解整理,便于读者理解、记忆;“历年考题”使大家对考试既有感性认识又了解考试的方式方法;“强化练习题”是对复习内容的练习和巩固;为便于读者对复习程度的了解,在本书最后编写了“药物分析综合测试题”。

药物分析是一门知识性和实验性并重的学科,内容繁多,学习任务重,在复习时应注意从实验方法中理解各知识点,保持思路清晰,做好应试准备。

在编写过程中,参考了有关书籍和文献,并从体系到内容按专业要求进行了编撰,但由于作者水平有限,书中一定存在错误和不足,请专业同仁及广大读者批评指正。

编者

2007年12月于吉林大学(长春)

目 录

上篇 药理学

第一章 绪言	(1)
第二章 药物代谢动力学	(1)
第三章 药物效应动力学	(7)
第四章 影响药物作用的因素	(12)
第五章 抗菌药物概论	(14)
第六章 β -内酰胺类抗生素	(17)
第七章 大环内酯类及其他抗菌药物	(23)
第八章 氨基糖苷类抗生素	(27)
第九章 四环素类和氯霉素类抗生素	(30)
第十章 人工合成抗菌药物	(33)
第十一章 抗真菌药	(37)
第十二章 抗病毒药	(39)
第十三章 抗结核和抗麻风病药	(41)
第十四章 抗寄生虫病药	(45)
第十五章 抗恶性肿瘤药物	(48)
第十六章 传出神经药物概论	(55)
第十七章 作用于胆碱受体的药物	(59)
第十八章 作用于肾上腺素受体的药物	(67)
第十九章 镇静催眠药	(76)
第二十章 抗癫痫药及抗惊厥药	(79)
第二十一章 精神药物	(82)
第二十二章 治疗中枢神经退行性病变药	(86)
第二十三章 镇痛药	(89)
第二十四章 解热镇痛抗炎药	(93)
第二十五章 抗心律失常药	(96)
第二十六章 抗心力衰竭药	(102)
第二十七章 抗高血压药	(108)
第二十八章 抗心绞痛药	(113)
第二十九章 血脂调节药及抗动脉粥样硬化药	(117)
第三十章 利尿药和脱水药	(121)

第三十一章 血液系统药	(126)
第三十二章 呼吸系统药物	(131)
第三十三章 消化系统药物	(135)
第三十四章 子宫收缩药	(139)
第三十五章 组胺及其受体阻断药	(143)
第三十六章 免疫调节药	(146)
第三十七章 肾上腺皮质激素类药物	(149)
第三十八章 甲状腺激素及抗甲状腺药	(155)
第三十九章 胰岛素及口服降血糖药	(160)
第四十章 性激素及作用于生殖系统功能的药物	(165)
药理学模拟试题及参考答案(一)	(170)
药理学模拟试题及参考答案(二)	(175)

下篇 药物分析

第一章 药典、药物分析基础和物理常数	(180)
第二章 常用的化学分析方法	(200)
第三章 常用的仪器分析方法	(210)
第四章 药物的杂质检查	(225)
第五章 芳酸及其酯类、胺类药物分析	(236)
第六章 巴比妥、磺胺、杂环类药物分析	(244)
第七章 生物碱、糖类、甾体激素类药物分析	(253)
第八章 维生素、抗生素类药物分析	(262)
第九章 药物分析含量计算	(268)
药物分析综合试题及参考答案(一)	(273)
药物分析综合试题及参考答案(二)	(277)
药物分析综合试题及参考答案(三)	(281)
药物分析综合试题及参考答案(四)	(285)

上篇 药理学

第一章 绪言

(略)。

第二章 药物代谢动力学

【考点精要】

1. 药物的体内过程

- (1) 药物吸收及其影响因素。
 - (2) 药物分布及其影响因素。
 - (3) 药物代谢过程、药物代谢的结果、药物代谢酶、细胞色素 P450 酶诱导剂及抑制剂。
 - (4) 药物排泄途径、药物排泄的临床意义。
2. 药物代谢动力学参数: 血药浓度-时间曲线下面积、峰浓度、达峰时间、半衰期、清除率、生物利用度、表观分布容积、稳态血药浓度及临床意义。

第一节 药物的体内过程

(一) 药物吸收及其影响因素

1. 吸收: 指药物由给药部位进入血液循环的过程。

2. 影响药物吸收的因素

(1) 药物的理化性质和剂型。

(2) 首过消除: 指某些药物在通过肠黏膜和肝脏时, 部分可被代谢灭活而使进入全身循环的药量减少, 药效降低。

(3) 吸收环境: 胃肠蠕动和排空、胃肠液酸碱度、胃肠内容物、血流量等。

(二) 药物分布及其影响因素

1. 分布: 指药物吸收后随血液循环转运到各组织中的过程。

2. 影响药物分布的因素

(1) 药物与血浆蛋白结合: 不同的药物以一定比例与血浆蛋白结合, 随着药量增加, 结合部位达到饱

和后, 增加药量将使血中游离药物浓度剧增, 导致药效增强或产生毒性反应。联合用药时若两种药物出现蛋白结合竞争现象, 血中游离浓度增加。

(2) 体内特殊屏障: 血脑屏障; 胎盘屏障; 血眼屏障。

(3) 其他因素: 局部器官血流量、组织亲和力、细胞内外液的 pH 值等。

(三) 药物的代谢过程

1. 代谢: 药物作为外源性物质在体内发生化学结构的改变称为转化或生物转化。大多数药物失去活性(减弱或消失), 称为灭活。少数药物经过代谢被活化而增强药理活性。

2. 药物代谢酶: 药物的转化过程必须在酶的催化下才能进行, 这些催化药物酶统称为药物代谢酶。微粒体酶系中氧化药物的酶称为微粒体混合功能氧化酶系。

(1) 酶诱导剂: 长期应用能增强酶活性的药物。

(2) 酶抑制剂: 长期应用能够减弱酶活性的药物。

(四) 药物的排泄

1. 排泄: 指药物及其代谢物经机体的排泄器官或分泌器官排出体外的过程。

(1) 肾脏排泄: 药物及代谢物经肾脏排泄时有三种方式: 肾小球滤过、主动肾小管分泌和被动肾小管重吸收。尿液 pH 值影响弱酸性或弱碱性药物的重吸收程度。经肾小管分泌的两类药物合用时可发生竞争性抑制。

(2) 胆汁排泄: 药物经肝脏转化形成极性较强的水溶性代谢物, 而后从胆汁排泄。

肝肠循环:有的药物随胆汁排泄到小肠中部分被肠黏膜上皮细胞吸收,由肝门静脉重新进入全身循环。

(3) **肠道排泄:**主要分三部分:①口服后肠道中未吸收部分;②随胆汁排泄到肠道的部分;③由肠黏膜分泌排入肠道的部分。

(4) **其他途径排泄:**许多药物可通过唾液、乳汁、汗液、泪液排泄。挥发性药物、全身麻醉药可通过肺呼气排出体外。

第二节 药物代谢动力学参数

1. 血药浓度-时间曲线:给药后血药浓度随时间变化,这种变化以药物浓度(或对数浓度)为纵坐标,以时间为横坐标绘出曲线图,称为药物浓度时间曲线图。

2. 血药浓度-时间曲线下面积:由坐标轴和药-时曲线围成的面积称为曲线下面积,表示一段时间内吸收到血中的相对累积量。

3. 峰浓度:指血管外给药后药物在血浆中的最高浓度值,代表药物吸收的程度。

4. 达峰时间:指血管外给药后药物在血浆中的最高浓度出现的时间,代表药物吸收的速度。

5. 半衰期:指血浆中药物浓度下降一半所需的时间。绝大多数药物在体内属于一级速率变化,其 $t_{1/2}$ 为一恒定值,且与血浆药物浓度高低无关。

6. 清除率:指单位时间内多少毫升血浆中的药物被清除,是肝清除率(CL_H)、肾清除率(CL_R)和其他消除途径清除率的总和。即 $CL_s = CL_H + CL_R + \dots$

7. 生物利用度:指血管外给药后能被吸收进入机体全身循环的分数或百分数。

8. 表观分布容积:指理论上药物均匀分布应占有的体液容积,单位是 L 或 L/kg。

9. 稳态血药浓度:按半衰期间隔连续给药,经 4~5 个半衰期血药浓度达到有效治疗浓度,并维持在一定水平。此时给药速率与消除速率达到平衡,其血药浓度称为稳态浓度,又称坪值。

【强化模拟练习题】

A型题

1. 诱导肝药酶的药物是

- A. 阿司匹林
- B. 多巴胺
- C. 去甲肾上腺素

D. 苯巴比妥

E. 阿托品

2. 在时量曲线与阈浓度相交的两点之间的距离称为

- A. 最大药效浓度持续时间
- B. 峰浓度持续时间
- C. 效应持续时间
- D. 最小有效浓度持续时间
- E. 药物消除一半时间

3. 可能引起首关消除的给药途径是

- A. 喷雾给药
- B. 舌下给药
- C. 静脉注射
- D. 肌内注射
- E. 口服给药

4. 药物按一级动力学消除时,其半衰期

- A. 固定不变
- B. 随给药次数而变化
- C. 与给药剂量成正比
- D. 随血浆浓度而变化
- E. 随药物剂型而变化

5. pK_a 大于 7.5 的弱酸性药物,在胃液中($pH =$

1. 4) 基本都是

- A. 不吸收,形成保护膜
- B. 非离子型,可以吸收
- C. 离子型,吸收慢而不完全
- D. 非离子型,完全不吸收
- E. 离子型,吸收快而完全

6. 药物进入血液循环后首先

- A. 储存在脂肪
- B. 在肝脏代谢
- C. 由肾脏排泄
- D. 与血浆蛋白结合
- E. 作用于靶器官

7. $pK_a = 8.4$ 的弱酸性药物在血浆中的解离度为

- A. 100%
- B. 10%
- C. 50%
- D. 60%
- E. 20%

8. 有关药物吸收描述不正确的是

- A. 药物经胃肠道吸收主要是被动转运
- B. 舌下或直肠给药吸收少,起效慢
- C. 弱酸性药物在酸性环境中吸收增多
- D. 皮肤给药除脂溶性高的药物外都不易吸

收

- E. 吸收指药物自给药部位进入血液循环的过程

9. 一次静脉给药 5 mg, 血药浓度为 0.35 mg/L
则表观分布容积为

- A. 14 L
B. 1.4 L
C. 28 L
D. 5 L
E. 50 L

10. 肝微粒体药物代谢酶系中主要氧化酶是

- A. 醇脱氢酶
B. 假性胆碱酯酶
C. P-450 酶
D. 醛氧化酶
E. 黄嘌呤氧化酶

11. 按一级动力学消除的药物, 其血浆半衰期为

- A. $2.303/K_e$
B. $K_e/0.693$
C. $0.693/K_e$
D. $K_e/2.303$
E. $0.301/K_e$

12. 离子障是

- A. 一种特殊生物膜
B. 非离子型药物和离子型药物均不能自由通过
C. 非离子型药物和离子型药物均可以自由通过
D. 非离子型药物可以自由通过, 而离子型的则不能通过
E. 离子型药物可以自由通过, 而非离子型的则不能通过

13. 按零级动力学消除的药物, 半衰期为

- A. $0.5C_0/K$
B. $K/0.5C_0$
C. $K/0.5$
D. $0.693/K$
E. $0.5/K$

14. 药物的代谢及排泄速度决定其

- A. 副作用的多少
B. 效能的高低
C. 起效的快慢
D. 作用持续时间的长短
E. 药理作用的强弱

15. 大多数药物的体内转运方式为

- A. 简单扩散
B. 易化扩散
C. 胞饮
D. 滤过
E. 主动转运

16. 有关药物在体内转运的论述错误的是

- A. 药物解离或非解离的多少, 取决于药物所在体液的 pH 值
B. pK_a 是药物 50% 解离时的 pH 值
C. 弱酸性药物在弱酸性环境容易跨膜转运
D. 弱碱性药物在弱酸性环境不易跨膜转运
E. pK_a 值高的药物容易跨膜转运

17. 某药的半衰期为 18 小时, 一次给药后药物在体内基本消除的时间是

- A. 1 天
B. 2 天
C. 4 天
D. 10 天
E. 15 天

18. 弱酸性药物在碱性尿液中

- A. 解离多, 重吸收少, 排泄慢
B. 解离少, 重吸收少, 排泄快
C. 解离多, 重吸收多, 排泄快
D. 解离少, 重吸收多, 排泄慢
E. 解离多, 重吸收少, 排泄快

19. 时量曲线下的面积反映

- A. 药物吸收的量
B. 生物利用度
C. 吸收速度
D. 消除速度
E. 药物剂量

20. 舌下给药的优点是

- A. 所有药物都能迅速吸收
B. 不被胃液破坏
C. 保证用药安全
D. 避免首关消除
E. 副作用少

21. 某药剂量相等的两种制剂口服后达峰时间不等, 是因为

- A. 吸收速度不等
B. 肾脏排泄速度不等
C. 血浆蛋白结合率不等
D. 分布部位不等
E. 肝脏代谢速度不等

22. 弱碱性药物在碱性尿液中
 A. 解离少,重吸收少,排泄快
 B. 解离多,重吸收少,排泄快
 C. 解离多,重吸收多,排泄快
 D. 解离少,重吸收多,排泄慢
 E. 解离多,重吸收少,排泄慢
23. 以半衰期为给药间隔,为立即达到稳态血药浓度可首次给予
 A. 1/2 剂量
 B. 2 倍剂量
 C. 3 倍剂量
 D. 4 倍剂量
 E. 5 倍剂量
24. 决定药物给药间隔的主要因素是
 A. 起效快慢
 B. 消除速度
 C. 吸收速度
 D. 作用强弱
 E. 血浆蛋白结合率
25. 药物 pK_a 与体液环境 pH 的差值以算术值增减时,药物的离子型与非离子型浓度比值的变化为
 A. 算术值
 B. 平方根
 C. 对数值
 D. 指数值
 E. 乘方值
26. 某弱酸性药物, $pK_a = 3.4$,在血浆中的解离百分率约为
 A. 100%
 B. 50%
 C. 99%
 D. 90%
 E. 99.99%
27. 有机弱酸类药物
 A. 酸化尿液加速其排泄
 B. 碱化尿液加速其排泄
 C. 在胃液中离子型多
 D. 在胃液中吸收减少
 E. 在胃液中极性大,脂溶性小
28. 多数药物可采用的有效、安全、快速的给药方法是
 A. 每个 $t_{1/2}$ 给予半个有效量并将首次剂量加倍
 B. 每个 $t_{1/2}$ 给予 1 个有效量并将首次剂量加倍
29. 说明药物可能分布在血浆的 V_d 值是
 A. 5 L
 B. 10 L
 C. 50 L
 D. 100 L
 E. 40 L
30. 关于表现分布容积小的药物,正确的是
 A. 与血浆蛋白结合少,较集中于脂肪组织
 B. 与血浆蛋白结合多,较集中于血浆
 C. 与血浆蛋白结合多,多在细胞间液
 D. 与血浆蛋白结合多,多在细胞内液
 E. 与血浆蛋白结合少,多在细胞内液
31. 静脉注射某药 500 mg,测其血药浓度为 16 $\mu\text{g}/\text{ml}$,则其表观分布容积约为
 A. 31 L
 B. 16 L
 C. 8 L
 D. 4 L
 E. 100 L
32. 药物按零级动力学消除是
 A. 单位时间内以恒定速度消除
 B. 半衰期是常数
 C. 单位时间内以不定的量消除
 D. 单位时间内以恒定比例消除
 E. 半衰期随初始浓度变化
33. 易化扩散是
 A. 无饱和现象
 B. 不需载体顺浓度梯度跨膜转运
 C. 靠载体顺浓度梯度跨膜转运
 D. 大多数药物的转运方式
 E. 靠载体逆浓度梯度跨膜转运
34. 主动转运的特点是
 A. 通过载体转运,不耗能
 B. 无饱和及竞争抑制现象
 C. 不通过载体转运,不耗能
 D. 不通过载体转运,需要耗能
 E. 通过载体转运,需要耗能

35. 相对生物利用度等于

- A. (试药 AUC/标准药 AUC) × 100%
- B. (标准药 AUC/试药 AUC) × 100%
- C. (口服等量药后 AUC/静脉注射定量药后 AUC) × 100%
- D. (静脉注射定量药后 AUC/口服等量药后 AUC) × 100%
- E. 药物吸收速度

36. 弱酸性或弱碱性药物的 pK_a 都是该药在溶液中

- A. 100% 离子化时的 pH 值
- B. 10% 离子化时的 pH 值
- C. 50% 离子化时的 pH 值
- D. 20% 非离子化时的 pH 值
- E. 99% 非离子化时的 pH 值

37. 一级动力学转运特点描述中错误的是

- A. 血药浓度与时间作图为一直线
- B. 消除速率与血药浓度成正比
- C. 被动转运属一级动力学
- D. 血药浓度对数值与时间作图为直线
- E. 半衰期恒定

B型题

[1~5]

- A. 剂量
- B. 血浆蛋白结合率
- C. 消除速率常数
- D. 吸收速度
- E. 生物利用度

1. 反映药物制剂质量

2. 影响表观分布容积大小

3. 决定半衰期长短

4. 决定起效快慢

5. 决定作用强弱

[6~10]

- A. 血药浓度波动大
- B. 血药浓度波动小
- C. 血药浓度不波动
- D. 血药浓度高
- E. 血药浓度低

6. 给药间隔大

7. 给药间隔小

8. 给药剂量大

9. 给药剂量小

10. 静脉滴注

[11~15]

- A. 潜伏期
- B. T_{max}
- C. 持续期
- D. 残留期
- E. 血浆半衰期

11. 血药浓度下降一半需要的时间

12. 血药浓度维持在有效血药浓度以上的时间

13. 血药浓度下降至有效血药浓度以下直至完全消除的时间

14. 从给药开始至达到最低有效血药浓度的时间

15. 自给药开始血药浓度达到峰值的时间

X型题

1. 药物与血浆蛋白结合后

- A. 有利于药物吸收
- B. 减慢药物排泄
- C. 活性增加
- D. 影响药物代谢
- E. 不能透过血脑屏障

2. 药物吸收后主要经过

- A. 肾脏排出
- B. 肠道排出
- C. 乳汁排出
- D. 肺排出
- E. 胆囊排出

3. 多次用药影响药理曲线的因素有

- A. 每日用药总量
- B. 药物的表观分布容积
- C. 给药间隔时间
- D. 药物血浆半衰期
- E. 药物的生物利用度

4. 下列与药物的清除率有关的因素是

- A. 表观分布容积
- B. 药物与组织亲和力
- C. 血浆半衰期
- D. 透过血脑屏障的能力
- E. 生物利用度

5. 药酶诱导剂是

- A. 利福平
- B. 氯霉素
- C. 水合氯醛
- D. 苯巴比妥
- E. 苯妥英钠

6. 下列可发生首过效应的是
 A. 口服药物经门静脉到肝脏被转化
 B. 药物与血浆蛋白的结合
 C. 药物在肠黏膜经酶的灭活
 D. 胃酸对药物的破坏
 E. 注射部位的吸收
7. 有明显首关消除的药物是
 A. 硝酸甘油
 B. 硫酸镁
 C. 吗啡
 D. 地西泮
 E. 普萘洛尔
8. 影响药物分布的因素有
 A. 药物的理化性质
 B. 药物的血浆蛋白结合率
 C. 体液的 pH 值
 D. 机体的生理屏障
 E. 组织器官血流量
9. 肝药酶抑制剂是
 A. 异烟肼
 B. 氯霉素
 C. 西咪替丁
 D. 利福平
 E. 苯巴比妥
10. 影响药物吸收的因素有
 A. 吸收部位的 pH 值
 B. 肠内容物的量
 C. 胃排空速度
 D. 吸收部位的血流量
 E. 吸收面积大小
11. 药物体内过程的四个环节包括
 A. 吸收
- B. 分布
 C. 代谢
 D. 排泄
 E. 解离
12. 肝药酶的特点
 A. 对底物选择性低, 多种酶代谢多种药物
 B. 由多种酶组成
 C. 个体差异大
 D. 可被某些药物诱导或抑制
 E. 对底物专一

【答案】

A型题

1. D 2. C 3. E 4. A 5. B 6. D
 7. B 8. B 9. A 10. C 11. C 12. D
 13. A 14. D 15. A 16. E 17. C 18. E
 19. B 20. D 21. E 22. D 23. B 24. B
 25. D 26. E 27. B 28. B 29. A 30. B
 31. A 32. A 33. C 34. E 35. A 36. C
 37. A

B型题

1. E 2. B 3. C 4. D 5. A 6. A
 7. B 8. D 9. E 10. C 11. E 12. C
 13. D 14. A 15. B

X型题

1. ABDE 2. ABCDE 3. ABCDE 4. AC
 5. ACDE 6. AC 7. ACE 8. ABCDE
 9. ABC 10. ABCDE 11. ABCD 12. ABCD

(石 卓)

第三章 药物效应动力学

【考点精要】

1. 药物的基本作用
 - (1) 对因治疗、对症治疗。
 - (2) 药物不良反应:副作用、毒性反应、后遗效应、停药反应、变态反应、继发反应、特异质反应。
2. 药物量效关系:量效关系、量效曲线、量反应、质反应、最小有效量、效价、效能、半数有效量、半数致死量及药物应用中的意义。
3. 药物的作用机制:药物作用机制的主要类型。
4. 受体学说:受体的特征、受体的类型、激动药及拮抗药、受体的调节、信号转导。

第一节 药物的基本作用

(一) 治疗作用

1. 治疗作用:指符合用药目的的作用。
 - (1) 对因治疗:用药目的在于消除原发致病因素。
 - (2) 对症治疗:用药目的在于改善疾病症状。
 - (3) 补充疗法:用药目的在于补充体内营养或代谢物质的不足。

(二) 药物不良反应

1. 不良反应:凡不符合用药目的作用,甚至给病人带来痛苦或危害的反应。
 - (1) 副作用:由于药物选择性作用低,作用范围广,在治疗剂量下引起的与用药目的无关的作用,一般较轻微,停药后可恢复。
 - (2) 毒性反应:由于用药剂量过大或用药时间过长引起的严重机体损害性反应。药理作用的延伸。
 - (3) 后遗效应:指停药后,血浆药物浓度下降至阈浓度以下时残存的生物效应。
 - (4) 停药反应:指病人长期用某种药物,突然停药后原来疾病复或加重的现象。
 - (5) 变态反应:药物引起的免疫反应,反应性质与药物原有疗效无关,其临床表现包括免疫反应的各种类型。
 - (6) 继发反应:指继发于药物治疗作用之后的不良反应。
 - (7) 特异质反应:指少数病人由于遗传因素对某些药物的反应性发生了改变。

(8) 依赖性:长期应用某些药物表现出强迫要求连续或定期使用该药的行为或其他反应,其目的是感受药物的精神效应,或避免由于停药引起的身体不适。

第二节 药物量效关系

1. 量效关系:在一定范围内同一药物的剂量(或浓度)增加或减少时,药物的效应随之增强或减弱,药物的这种剂量(或浓度)与效应之间的关系称为量效关系。
2. 量效曲线或浓度-效应曲线:定量的反映药物作用特点,通常以药理效应的强度为纵坐标,药物剂量或浓度为横坐标。
3. 量反应:其强弱呈连续性量的变化,通过逐渐增加或减少药量测得。
4. 质反应:其强弱随药物剂量或浓度的增减表现为性质的变化,以阳性或阴性、全或无的方式表现。
5. 最小有效量:指引起效应的最小剂量,亦称阈剂量。
6. 效价强度:用于作用性质相同的药物之间的等效剂量的比较,达到等效时所用药量较小者效价强度大,所用药量大者效价强度小。
7. 效能:在一定范围内增加药物剂量,效应强度随之增加,但当效应增强到最大时,继续增加剂量,效应不再增强。这一药理效应的极限称为效能。
8. 半数有效量:指在质反应中引起 50% 实验对象出现阳性反应时的药物剂量。
9. 半数致死量:引起实验动物死亡一半的剂量。
10. 治疗指数:指药物的 LD_{50} 与 ED_{50} 的比值,表示药物的安全性。

第三节 药物的作用机制

药物作用机制的主要类型:

- (1) 理化反应
- (2) 参与或干扰细胞的代谢
- (3) 影响生理物质转运
- (4) 对酶的影响

- (5)作用于细胞膜的离子通道
- (6)影响核酸的代谢
- (7)非特异性作用
- (8)受体

第四节 受体学说

1. 受体的特征: 敏感性、特异性、饱和性、可逆性、多样性、亲和性、竞争性。

2. 受体的类型

- (1)G蛋白偶联受体。
- (2)配体门控离子通道受体。
- (3)具有酪氨酸激酶活性的受体。
- (4)细胞内受体。

3. 激动药: 指既有亲和力又有内在活性的药物, 它们能与受体结合并激动受体而产生效应。

4. 拮抗药: 有较强的亲和力, 无内在活性($\alpha = 0$), 与受体结合不能激活受体而拮抗激动药的作用。

5. 向下调节: 受体周围的生物活性物质浓度高或长期受激动药作用时使受体数量减少, 表现为该受体对激动药的敏感性降低, 出现脱敏或耐受现象。

6. 向上调节: 受体长期受阻断药作用使其数目增加, 敏感性增高, 可能表现出超敏或高敏性, 停药症状或“反跳”现象。

7. 信号转导

(1)G蛋白偶联受体: 激动剂作用于G蛋白偶联受体后, 引起GTP结合G蛋白并激活之, 活化的G蛋白激活效应器蛋白(效应器酶), 引起第二信使增加或减少, 产生细胞效应。

(2)配体门控离子通道受体: 配体与受体结合变构引起离子通道开放或关闭, 改变离子跨膜转运, 导致膜电位的变化, 传递信息。

(3)酶活性受体: 受体被激活后直接调节蛋白磷酸化, 调节细胞内信号转导和基因转录。

(4)转录因子: 调节核内信号转导和基因转录过程, 细胞效应很慢, 需若干小时。

【强化模拟练习题】

A型题

1. 药物的治疗指数是
 - A. LD_5/ED_{95} 的比值
 - B. ED_{95}/ED_{50} 比值
 - C. LD_{50}/ED_{50} 的比值
 - D. LD_5/ED_{80} 的比值
 - E. LD_1/ED_{99} 的比值

2. 静脉滴注氨基糖苷类药物速度过快, 可致神经肌肉阻断引起呼吸停止, 这是药物的

- A. 慢性毒性
- B. 特异质反应
- C. 变态反应
- D. 反跳现象
- E. 急性毒性

3. pD_2 是

- A. ED_{50} 时的药物剂量
- B. 拮抗指数
- C. 解离常数的负对数
- D. 拮抗常数的负对数
- E. 解离常数

4. 下列最有临床意义的药物是

- A. LD_{50} 为50 mg/kg, ED_{50} 为50 mg/kg
- B. LD_{50} 为50 mg/kg, ED_{50} 为100 mg/kg
- C. LD_{50} 为50 mg/kg, ED_{50} 为40 mg/kg
- D. LD_{50} 为50 mg/kg, ED_{50} 为30 mg/kg
- E. LD_{50} 为50 mg/kg, ED_{50} 为10 mg/kg

5. 产生副作用的药理基础是

- A. 药物排泄慢
- B. 药物作用选择性低
- C. 药物剂量过大
- D. 病人反应敏感
- E. 用药时间过长

6. 药物的 ED_{50} 是

- A. 50% 最大效应的剂量
- B. 50% 动物死亡的剂量
- C. 50% 动物中毒的剂量
- D. 100% 有效的剂量
- E. 100% 动物死亡的剂量

7. 产生竞争性拮抗作用的是

- A. 毛果芸香碱与去甲肾上腺素
- B. 间羟胺与麻黄碱
- C. 毛果芸香碱与阿托品
- D. 阿托品与肾上腺素
- E. 普萘洛尔与吗啡

8. 产生后遗效应的血药浓度是

- A. 药物初始浓度
- B. 无效浓度
- C. 峰浓度
- D. 有效血药浓度
- E. 药物消除至阈浓度以下的血药浓度