

全国医学高等专科学校辅导教材

药理学

学习指导

(第3版)

主编 张 远
张 力
于信民

北京大学医学出版社

全国医学高等专科学校辅导教材

药理学学习指导

(第3版)

主 编 张 远 张 力 于信民

副主编 李建恒 爱 民 梁翠茵

编 者 (按姓氏笔画为序)

于信民	菏泽医学专科学校	张 力	河北北方学院
马俊江	北京大学医学部	张 远	北京大学医学院
王新华	河北工程大学医学院	张 冲	内蒙古医学院
田 健	菏泽医学专科学校	张树平	滨州医学院
李 涛	齐齐哈尔医学院	宫凌涛	哈尔滨医科大学大庆校区
李卫东	北京大学医学部	爱 民	内蒙古医学院
李学军	北京大学医学部	梁翠茵	首都医科大学燕京医学院
李建恒	河北大学	梅爱敏	承德医学院
李晓天	长春医学高等专科学校	章国良	北京大学医学部
吴 艳	大庆医学高等专科学校	潘 燕	北京大学医学部
吴国忠	上海医学高等专科学校	薛永志	内蒙古科技大学包头医学院

北京大学医学出版社

全国高等院校药学专业教材

图书在版编目 (CIP) 数据

药理学学习指导/张远, 张力, 于信民主编. —3版.

北京: 北京大学医学出版社, 2008.1

ISBN 978-7-81116-411-4

I. 药… II. ①张… ②张… ③于… III. 药理学—高等学校—教学参考资料 IV. R96

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2007) 第 190650 号

主编

张远 张 力 于信民

(有代画学习指导)

书 名

药理学学习指导

药理学学习指导

书 名

药理学学习指导

药理学学习指导

书 名

药理学学习指导

药理学学习指导

书 名

药理学学习指导

药理学学习指导

书 名

药理学学习指导

药理学学习指导

书 名

药理学学习指导

药理学学习指导

书 名

药理学学习指导

药理学学习指导

书 名

药理学学习指导

药理学学习指导

书 名

药理学学习指导 (第 3 版)

主 编: 张 远 张 力 于信民

出版发行: 北京大学医学出版社 (电话: 010-82802230)

地 址: (100083) 北京市海淀区学院路 38 号 北京大学医学部院内

网 址: <http://www.pumpress.com.cn>

E - mail: booksale@bjmu.edu.cn

印 刷: 莱芜市圣龙印务有限责任公司

经 销: 新华书店

责任编辑: 赵 曼 责任校对: 金彤文 责任印制: 张京生

开 本: 787mm×1092mm 1/16 印张: 16 字数: 404 千字

版 次: 2008 年 1 月第 3 版 2008 年 1 月第 1 次印刷 印数: 1-8000 册

书 号: ISBN 978-7-81116-411-4

定 价: 24.40 元

版权所有, 违者必究

(凡属质量问题请与本社发行部联系退换)

北京大学医学出版社

第3版前言

为了适应医学教育改革以及加强教材建设的需要,我们根据新世纪医学教育改革的精神及第2版在使用过程中的反馈意见对《药理学学习指导》2版进行了认真的修订。本书自1995年出版以来,得到了广大教师和学生的肯定。本次再版调整了编写院校,扩大了参与的学校,邀请了很多活跃在教学第一线的具有丰富教学经验的教师参加编写。

编写《药理学学习指导》旨在帮助读者在系统学习药理学知识的同时,不断巩固加深所学内容,测试所学基本理论知识的掌握程度,检验合理选用药物的能力,进而更牢固地掌握重点内容,提高独立思考、综合分析和解决实际问题的能力。

《药理学学习指导》每章包括内容提要、测试题和参考答案三部分。测试题有填空题、名词解释、选择题和问答题四部分。参考答案附于各章测试题之后,便于读者查找。在书的最后还有两套模拟试卷便于读者自测。

本书除适用于医学高等专科学校学生,参加成人高等教育的考试者对《药理学》的学习、复习和备考外,内容也与国家执业医师资格考试、临床助理医师资格考试、国家执业药师资格考试的要求接轨。

由于时间比较仓促及编写人员的水平和能力所限,本书存在的不妥之处恳请读者批评,指正。

编 者

2008年1月

第一章 总论	(1)	测试题	(43)
第一节 概述	(1)	参考答案	(44)
内容提要	(1)	第六节 抗肾上腺素药	(46)
测试题	(2)	内容提要	(46)
参考答案	(3)	测试题	(47)
第二节 药物效应动力学	(4)	参考答案	(48)
内容提要	(4)	第三章 麻醉药	(50)
测试题	(5)	第一节 全身麻醉药	(50)
参考答案	(8)	内容提要	(50)
第三节 药物代谢动力学	(9)	测试题	(51)
内容提要	(9)	参考答案	(53)
测试题	(12)	第二节 局部麻醉药	(54)
参考答案	(16)	内容提要	(54)
第四节 影响药物效应的因素	(18)	测试题	(55)
内容提要	(18)	参考答案	(56)
测试题	(19)	第四章 镇静、催眠和抗焦虑药	(58)
参考答案	(20)	内容提要	(58)
第二章 传出神经系统药理	(22)	测试题	(59)
第一节 传出神经系统药理概论	(22)	参考答案	(61)
内容提要	(22)	第五章 抗精神失常药	(63)
测试题	(23)	内容提要	(63)
参考答案	(25)	测试题	(65)
第二节 拟胆碱药	(26)	参考答案	(66)
内容提要	(26)	第六章 抗癫痫药和抗惊厥药	(69)
测试题	(28)	内容提要	(69)
参考答案	(30)	测试题	(71)
第三节 M胆碱受体阻断药	(31)	参考答案	(73)
内容提要	(31)	第七章 抗帕金森病药	(74)
测试题	(33)	内容提要	(74)
参考答案	(35)	测试题	(76)
第四节 N胆碱受体阻断药	(36)	参考答案	(78)
内容提要	(36)	第八章 镇痛药	(80)
测试题	(37)	内容提要	(80)
参考答案	(39)	测试题	(82)
第五节 拟肾上腺素药	(40)	参考答案	(84)
内容提要	(40)	第九章 中枢兴奋药	(87)

内容提要	(87)	测试题	(143)
测试题	(88)	参考答案	(145)
参考答案	(89)		
第十章 解热镇痛抗炎药	(90)	第十九章 作用于消化系统的	
内容提要	(90)	药物	(147)
测试题	(91)	内容提要	(147)
参考答案	(93)	测试题	(150)
第十一章 抗高血压药	(95)	参考答案	(152)
内容提要	(95)	第二十章 作用于血液和造血系统	
测试题	(98)	的药物	(154)
参考答案	(100)	内容提要	(154)
第十二章 治疗慢性心功能不全药	(102)	测试题	(158)
内容提要	(102)	参考答案	(160)
测试题	(105)	第二十一章 子宫兴奋药	(162)
参考答案	(109)	内容提要	(162)
第十三章 抗心律失常药	(111)	测试题	(163)
内容提要	(111)	参考答案	(164)
测试题	(113)	第二十二章 组胺与抗组胺药	(166)
参考答案	(116)	内容提要	(166)
第十四章 钙通道阻滞药	(118)	测试题	(167)
内容提要	(118)	参考答案	(168)
测试题	(119)	第二十三章 激素类药物	(169)
参考答案	(121)	第一节 肾上腺皮质激素类	
第十五章 抗心绞痛药	(123)	药物	(169)
内容提要	(123)	内容提要	(169)
测试题	(125)	测试题	(170)
参考答案	(127)	参考答案	(172)
第十六章 调血脂药	(129)	第二节 性激素类药及避孕药	(174)
内容提要	(129)	内容提要	(174)
测试题	(131)	测试题	(176)
参考答案	(132)	参考答案	(178)
第十七章 利尿药和脱水药	(133)	第三节 甲状腺素及抗	
内容提要	(133)	甲状腺药	(180)
测试题	(134)	内容提要	(180)
参考答案	(136)	测试题	(181)
第十八章 作用于呼吸系统的		参考答案	(183)
药物	(138)	第四节 胰岛素及口服降	
内容提要	(138)	血糖药	(184)
		内容提要	(184)
		测试题	(186)

参考答案.....	(187)	参考答案.....	(214)
第二十四章 抗菌药物.....	(189)	第二十五章 人工合成抗菌药.....	(216)
第一节 抗菌药概论及抗菌药物的 合理应用.....	(189)	内容提要.....	(216)
内容提要.....	(189)	测试题.....	(217)
测试题.....	(190)	参考答案.....	(219)
参考答案.....	(192)	第二十六章 抗真菌药和抗 病毒药.....	(221)
第二节 β -内酰胺类抗生素	(193)	内容提要.....	(221)
内容提要.....	(193)	测试题.....	(223)
测试题.....	(197)	参考答案.....	(224)
参考答案.....	(199)	第二十七章 抗结核病药.....	(225)
第三节 大环内酯类及其他 抗生素.....	(200)	内容提要.....	(225)
内容提要.....	(200)	测试题.....	(226)
测试题.....	(202)	参考答案.....	(228)
参考答案.....	(204)	第二十八章 抗寄生虫药.....	(229)
第四节 氨基糖苷类及多粘菌素类 抗生素.....	(205)	内容提要.....	(229)
内容提要.....	(205)	测试题.....	(231)
测试题.....	(208)	参考答案.....	(232)
参考答案.....	(209)	第二十九章 抗恶性肿瘤药.....	(234)
第五节 四环素类和氯霉素类 抗生素.....	(211)	内容提要.....	(234)
内容提要.....	(211)	测试题.....	(236)
测试题.....	(212)	参考答案.....	(238)
		模拟试卷(一)	(240)
		模拟试卷(二)	(245)

第一章 总 论

第一节 概 述

内容提要

(一) 药理学

药理学是研究药物与机体（包括病原体）相互作用的规律及原理的学科。研究内容包括药物对机体的作用和效应的规律，即药效学（pharmacodynamics）及药物的体内过程变化及规律，即药动学（pharmacokinetics）。

药物 $\xrightarrow[\text{体内过程（药动学）}]{\text{作用、效应（药效学）}}$ 机体

(二) 药物和制剂

1. 药物：是指用于预防、治疗或诊断疾病，而对用药者无害的各种物质。药物通常分为天然药物、化学药物和生物药物三类。
2. 制剂：药物经过加工，制成便于病人使用、符合治疗要求、能安全运输和贮存的剂型，如片剂、酏剂、注射剂、软膏等。

(三) 药理学的任务

1. 阐明药物对机体的作用和作用原理。
2. 为临床科学合理用药提供理论基础，提高治疗效果。
3. 新药的研究和开发。

(四) 新药研究步骤

1. 临床前研究：包括药学、药理学和毒理学研究。
2. 临床研究：分为Ⅰ、Ⅱ、Ⅲ期。
3. 售后调研：即临床研究的Ⅳ期，考察广泛、长期使用后的疗效和不良反应。

(五) 国家对药品的管理

对不同类别药品有特殊的管理规定。

测试题

一、填空题

1. 药理学包括_____和_____。
2. 药物是_____物质。
3. 药效学是研究_____。
4. 药动学是研究_____。
5. 新药研究过程包括_____、_____和_____。

二、名词解释

1. 药理学
2. 药效学
3. 药动学
4. 药物
5. 制剂

三、选择题

1. 药理学是研究
 - A. 药物的学科
 - B. 药物与机体相互作用的规律和原理
 - C. 药物效应动力学
 - D. 药物代谢动力学
 - E. 药物在临床应用的学科
2. 药物在体内发生效应要经过
 - A. 药剂学过程
 - B. 药物代谢动力学过程
 - C. 药物效应动力学过程
 - D. 上述三过程
 - E. 药理学过程
3. 药物是指
 - A. 天然的和人工合成的物质
 - B. 能影响机体生理功能的物质
 - C. 预防、治疗或诊断疾病的物质
 - D. 干扰细胞代谢活动的物质
 - E. 能损害机体细胞代谢的物质
4. 临床前研究内容主要包括
 - A. 药学、药理学、毒理学
 - B. 药学、毒性、药理学
 - C. 化学、药理学、毒理学
 - D. 药学、制剂学、药理学
 - E. 化学、稳定性、药理学
5. 新药临床评价的主要任务是
 - A. 合理使用一个药物
 - B. 合理评价一个药物
 - C. 进行双盲法用药
 - D. 进行 I ~ IV 期临床试验
 - E. 正确地选择病人
6. 新药要进行临床试验必须提供
 - A. 急慢性实验动物资料
 - B. 系统药学研究资料
 - C. 系统药理学研究资料
 - D. 新药的作用特点资料
 - E. 临床前研究资料
7. 新药开发研究的目的在于
 - A. 有利于开发祖国医药学宝库
 - B. 市场竞争的需要
 - C. 新药的疗效优于老药
 - D. 为人们提供更为安全有效的药物
 - E. 证明有药理效应和临床疗效的新药

四、问答题

1. 药理学研究的主要内容有哪些?
2. 试述药理学在新药开发中的作用和地位。

参考答案

参考答案

一、填空题

1. 药效动力学 药代动力学
2. 用于预防、治疗或诊断疾病而对用药者无害的
3. 药物对机体的作用
4. 药物的体内过程规律
5. 临床前研究 临床研究 售后调研

二、名词解释

1. 药理学是研究药物与机体相互作用规律及其原理的科学。
2. 药效学是研究药物对机体的作用或在药物影响下机体细胞功能如何发生变化。
3. 药动学是研究药物的吸收、分布、生物转化和排泄等体内过程的变化及规律。
4. 药物是指用以防治及诊断疾病的物质。在理论上,凡能影响机体器官生理功能及细胞代谢的物质都属药物范畴。对药物的基本要求是安全、有效,故对其质量、适应证、用法和用量均有严格的规定,符合有关规定标准的才可供临床应用。
5. 制剂是药物经加工后制成便于病人使用,能安全运输、贮存,又符合治疗要求的剂型如片剂、注射剂、软膏等。

三、选择题

1. B 2. D 3. C 4. A 5. D 6. E 7. D

四、问答题

1. 药理学是研究药物与机体相互作用的规律及原理的科学,主要研究内容包括 (1) 药物对机体的作用及效应规律,即药效学。(2) 药物的体内过程,即阐明药物在体内吸收、分布、生物转化及排泄等过程中的变化及规律,即药动学。
2. 新药在进行临床研究前需提供与该药有关的药效学、药代动力学和毒理学的资料,作为临床研究用药的参考;药物的构效关系可指导合成新药。

第二节 药物效应动力学

内容提要

药物效应动力学研究药物作用于机体引起的生理、生化效应及其机制、药物剂量与效应关系的规律。分析药物的效应和作用，可从不同角度进行，如兴奋、抑制、直接、间接、选择性、治疗作用和不良反应等。

(一) 药物的基本作用

药物作用的基本表现是兴奋和抑制。药物使机体某些器官或组织的原有功能水平提高称为兴奋，如升压；使原有的功能水平降低称为抑制，如降压。一些药物对不同的器官和组织可分别产生兴奋和抑制作用，如肾上腺素引起皮肤粘膜的血管收缩，此为兴奋作用；又引起骨骼肌血管扩张和支气管平滑肌松弛，此为抑制作用。

(二) 药物作用的选择性

药物作用的选择性是指在一定剂量范围内，多数药物吸收后只对一两种器官或组织产生明显作用，而对其他器官或组织作用很小或无作用。选择性作用是相对的，与药物化学结构的特异性以及不同组织器官对药物的亲和力和敏感性不同有关。选择性高的药物药理活性强，针对性也强；选择性低的药物作用广泛，针对性差，不良反应多。

(三) 药物作用的量效关系

量效关系是指定量分析药物剂量与效应之间规律的关系，可用图解表示，以药物效应为纵坐标，药物剂量或浓度为横坐标。

(四) 效能和效价强度

效能（最大效应）指药物产生最大效应的能力。达到最大效应后，继续增加药物的剂量，效应不再进一步增加，而引起毒性反应；效价强度指产生相同效应的各个药物在其达到一定的效应时所需的剂量或浓度。

(五) 药物的量效曲线

以药物剂量或浓度为横坐标，效应为纵坐标作图即为量效曲线。通常呈长尾S形，如改为对数剂量，则为接近对称的S形曲线。由量效曲线可知：① 最小有效量（阈剂量）；② 效能；③ 效价强度；④ 曲线斜率；⑤ 个体差异。

(六) 受体

1. 受体 是存在于细胞膜上或胞浆内的大分子蛋白质，能与药物结合并传递信息，产生特定的生理效应。

2. 药物与受体结合引起效应的条件 一是亲和力,指药物与受体结合的能力;二是内在活性,指药物与受体结合后能产生效应的能力。

3. 受体的调节 受体的数目及反应性可受神经递质、激素及药物等的调节。长期应用激动剂可使相应受体数目减少,称为向下调节,与此药物的耐受性产生有关。若长期应用拮抗药,可使受体数目增加,称为向上调节,此为突然停药,产生敏感性增加、病情反跳的原因之一。

测试题

一、填空题

1. 用数或量表示的药理效应叫_____,用阳性或阴性表示的药理效应叫_____。
2. 药物的量效曲线可分为_____和_____两种,从_____中可求得 ED_{50} 及 LD_{50} 的参数。
3. 药物的治疗作用可分为_____和_____。
4. 药物与机体接触,在用药局部所表现的作用称为_____作用。
5. 药物只对某些器官组织产生明显作用,而对其他器官组织作用很小或无,称为药物作用的_____。
6. 药物作用的基本表现是使机体器官组织_____和(或)_____。
7. 药物的不良反应包括_____、_____、_____和_____。
8. 一群动物中引起一半动物出现阳性反应的量叫_____,引起半数动物死亡的量叫_____, LD_{50}/ED_{50} 之比值称为_____。
9. 药物与受体相互作用可将药物分为_____、_____和_____等三类。
10. 长期用激动药,可使相应受体_____,这种现象称为_____,是机体对药物产生_____的原因之一。
11. 长期用拮抗药,可使相应受体_____,这种现象称为_____,突然停药时可产生_____。
12. 拮抗药根据量效曲线的不同可分为_____和_____拮抗药。
13. 药物作用的受体学说主要有_____、_____和_____等。

二、名词解释

- | | |
|------------------------|-----------|
| 1. 效能 | 9. 毒性反应 |
| 2. 效价强度 | 10. 后遗效应 |
| 3. 最小有效量 | 11. 变态反应 |
| 4. 半数有效量 (ED_{50}) | 12. 选择性作用 |
| 5. 半数致死量 (LD_{50}) | 13. 质反应 |
| 6. 对因治疗 | 14. 量反应 |
| 7. 对症治疗 | 15. 治疗指数 |
| 8. 副作用 | 16. 安全范围 |

17. 受体激动药
18. 受体拮抗药
19. 部分激动药

三、选择题

- 强心苷治疗慢性心功能不全，其对心脏的作用是
 - 直接作用
 - 局部作用
 - 继发作用
 - 细胞作用
 - 选择性作用
- 药物的选择性取决于
 - 药物在体内吸收的速度
 - 组织器官对药物的敏感性
 - 药物的脂溶性大小
 - 药物剂量大小
 - 体液的 pH
- 半数致死量 (LD_{50}) 表示
 - 药物的极量
 - 药物的安全度
 - 药物的急性毒性
 - 药物的治疗指数
 - 评价新药优于老药的指标
- 药物的治疗指数是指
 - ED_{95}/LD_5 的比值
 - ED_{90}/LD_{10} 的比值
 - ED_{50}/ID_{50} 的比值
 - LD_{50}/ED_{50} 的比值
 - ED_{50} 与 LD_{50} 之间的距离
- 测定 A 药的 LD_{50} 值比 B 药大，表明
 - A 药的毒性比 B 药大
 - A 药的毒性比 B 药小
 - A 药的效能比 B 药大
 - A 药的效能比 B 药小
 - B 药的安全性大
- 药物的安全范围是指
 - LD_{50}/ED_{50}
 - LD_{50}
 - ED_{50}
 - LD_5 与 ED_{95} 之间的距离
 - LD_{95} 与 ED_5 之间的距离
- 关于半数有效量的概念正确的是
 - LD_{50}
 - 引起 50% 阳性反应的剂量
 - 临床有效量的一半
 - 引起 50% 毒性反应的剂量
 - 临床有效量的 95%
- 部分激动药是指
 - 被结合的受体只能一部分被活化
 - 能拮抗激动药的部分生理效应
 - 亲和力较强，内在活性较弱
 - 亲和力较弱，内在活性较弱
 - 亲和力较强，内在活性较强
- 后遗效应是指
 - 药物浓度下降至阈浓度以下所残存的生物效应
 - 血药浓度下降一半所残存的生物效应
 - 短期内暂存的药理效应
 - 短期内暂存的生物效应
 - 指机体对药物的依赖性
- 肌注阿托品治疗肠绞痛，引起口干作用称为
 - 毒性反应
 - 副作用
 - 治疗作用
 - 变态反应
 - 后遗效应
- 注射青霉素过敏引起的过敏性休克是
 - 副作用
 - 毒性反应
 - 后遗效应
 - 变态反应

- E. 应激效应
12. 关于激动药的概念正确的是
- 与受体有较强的亲和力和内在活性
 - 与受体有较强的亲和力但无内在活性
 - 与受体有较弱的亲和力和内在活性
 - 与受体无亲和力, 但有内在活性
 - 与受体无亲和力与内在活性
13. 出现明显副作用的剂量应是
- 治疗量
 - 小于治疗量
 - 大于治疗量
 - 极量
 - ED_{50} 量
14. 药物的内在活性(效应力)是指
- 药物脂溶性强弱
 - 药物水溶性大小
 - 药物穿透生物膜的能力
 - 药物能产生效应的能力
 - 药物对受体亲和力的高低
15. 青霉素治疗肺部感染是
- 对因治疗
 - 对症治疗
 - 局部治疗
 - 全身治疗
 - 直接治疗
16. 肾上腺素治疗支气管哮喘是
- 对因治疗
 - 对症治疗
 - 局部治疗
 - 全身治疗
 - 直接治疗
- C. 局部治疗
- D. 全身治疗
- E. 直接治疗
17. 连续用药产生敏感性下降称为
- 抗药性
 - 耐受性
 - 快速耐受性
 - 成瘾性
 - 反跳现象
18. 长期应用抗病原微生物药可产生
- 耐药性
 - 耐受性
 - 快速耐受性
 - 成瘾性
 - 反跳现象
19. 短期内连续应用麻黄碱可产生
- 耐受性
 - 耐药性
 - 快速耐受性
 - 成瘾性
 - 反跳现象
20. 从一条已知的量效曲线上看不出哪一项内容
- 最小有效浓度
 - 最大有效浓度(ED_{100})
 - 最小中毒浓度(LD_1)
 - 半数有效浓度
 - 最大效能

四、问答题

- 何谓药物作用的选择性? 选择性作用有何意义?
- 何谓药物的基本作用?
- 从药物的量效曲线能说明哪些问题?

参考答案

一、填空题

1. 量反应 质反应
2. 量反应 质反应 质反应量效曲线
3. 对因治疗 对症治疗
4. 局部
5. 选择性
6. 兴奋 抑制
7. 副作用 毒性反应 后遗效应 变态反应
8. 半数有效量 (ED_{50}) 半数致死量 (LD_{50}) 治疗指数
9. 激动药 拮抗药 部分激动药
10. 数目减少 向下调节 耐受性
11. 数目增加 向上调节 反跳现象
12. 竞争性 非竞争性
13. 占领学说 速率学说 二态模型学说

二、名词解释

1. 效能：药物所能达到的最大效应的能力就是该药的效能，即最大效应，如再增加药物剂量，效应不再进一步增强。
2. 效价强度：产生相同效应的各个药物在其达到一定的治疗强度时所需的剂量。
3. 最小有效量：刚能引起效应的剂量称最小有效量，亦称阈剂量。
4. 半数有效量 (ED_{50})：能引起半数实验动物 (50%) 阳性反应的剂量。
5. 半数致死量 (LD_{50})：引起 50% 实验动物死亡的剂量。
6. 对因治疗：应用药物消除致病原因的治疗。如抗生素杀灭体内的致病微生物。
7. 对症治疗：应用药物来减轻或消灭疾病症状的治疗。如发烧时的解热作用。
8. 副作用：在治疗剂量时出现的与治疗目的无关的作用。如阿托品引起的口干。
9. 毒性反应：由于用药剂量过大而产生的药物中毒反应，对机体有明显损害甚至危及生命。可有急性毒性、慢性毒性及特殊毒性 (致畸、致癌、致突变)。
10. 后遗效应：停药后血浆药物浓度已降到阈浓度以下时所残存的生物效应。
11. 变态反应：人体对药物过敏所引起的反应，与用药剂量无关。
12. 选择性作用：治疗剂量的药物吸收入血后，只对某个或几个器官组织产生明显的作用，对其他器官组织作用很小或不发生作用。
13. 质反应：药物效应以阳性或阴性 (全或无) 表示的反应。
14. 量反应：可以数量 (或可测量的值) 分级表示的药理效应，如血压、心率、呼吸等。
15. 治疗指数：是药物安全性的指标，以 LD_{50}/ED_{50} 的比值表示，此值越大越安全。
16. 安全范围：指 ED_{95} 与 LD_5 之间的距离。

17. 受体激动药：能激活受体，对相应受体有较强的亲和力，也有较强的内在活性的药物，如异丙肾上腺素。
18. 受体拮抗药：与受体的亲和力较强，但无内在活性，它能阻断激动药与受体的结合，如阿托品。
19. 部分激动药：与受体有较强亲和力，但内在活性较弱。
20. 受体向上调节：受体的数目增多、敏感性增强。长期应用拮抗药可出现此现象。
21. 受体向下调节：受体的数目减少、敏感性减弱。长期应用激动药可出现此现象。

三、选择题

- | | | | | | | | |
|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 1. E | 2. B | 3. C | 4. D | 5. B | 6. D | 7. B | 8. C |
| 9. A | 10. B | 11. D | 12. A | 13. A | 14. D | 15. A | 16. B |
| 17. B | 18. A | 19. C | 20. C | | | | |

四、问答题

1. 药物的选择性是指在治疗剂量范围内，药物仅对某些器官组织或系统发挥作用，而对其他器官组织作用很小或无作用。选择性作用有重要的临床意义，一般地说，选择性高的药物针对性强，可以准确地治疗某些疾病，不良反应少。选择性低的药物，作用广泛，针对性差，副作用多。
2. 药物的基本作用是指药物要发挥其作用是通过影响机体某些器官或组织所固有的功能而实现的，因此使原有的功能水平提高为兴奋，使原有的功能水平降低为抑制，兴奋和抑制是药物作用的两种基本类型。
3. 从药物的量效曲线可知：① 最小有效量（阈剂量）；② 曲线斜率；③ 最大效应（效能）；④ 效价强度；⑤ 个体差异。

第三节 药物代谢动力学

内容提要

药物代谢动力学简称药动学，研究药物的体内过程，包括药物的吸收、分布、排泄和代谢（生物转化），也研究体内药物浓度随时间变化及药物消除的规律，并以数学公式计算其动力学参数。

药物跨膜转运的方式主要有滤过、简单扩散和载体转运，载体转运包括主动转运和易化扩散。

（一）滤过

药物分子通过生物膜的水性信道在流体静压和渗透压的作用下，由膜的一侧转运到另一侧称为滤过，如肾小球滤过。

(二) 简单扩散

绝大多数药物按此种方式通过生物膜,属于被动转运,其特点如下:

- (1) 药物从高浓度的一侧向低浓度的一侧扩散,又称下山转运,当两侧浓度达到平衡状态时,转运停止。
- (2) 不消耗能量。
- (3) 不需载体参与,故无饱和性和竞争抑制现象。
- (4) 小分子、高脂溶性、极性小、非解离型的药物易转运。

(三) 载体转运

1. 主动转运:其特点如下:

- (1) 逆浓度转运,即从浓度低的一侧向浓度高的一侧转运,又称上山转运。
- (2) 需消耗能量。
- (3) 需有特异性的载体,故有选择性、饱和性和竞争性抑制现象。

2. 易化扩散:它与主动转运不同的是药物从高浓度一侧向低浓度一侧转运不消耗能量,属于被动转运。

(四) 体液 pH 对简单扩散的影响

常用的药物多为弱酸性或弱碱性化合物,它们在体液中的解离度取决于药物的 pK_a 和溶液的 pH。非解离型的药物易通过细胞膜。

(1) 弱酸性药物在 pH 低的环境中解离度小,非解离型多,容易从 pH 低的体液向 pH 高的体液转运。如弱酸性药物在酸性胃液中及酸化的尿液中容易被吸收和再吸收。

(2) 弱酸性药物则在 pH 较高的环境中解离度大,再吸收少,排泄快,故在碱性肠液中不易被吸收,在碱化的尿液中不易被重吸收。因而弱酸性药巴比妥类中毒时,碱化尿液加速了这些药物的排出。

(五) 首关消除

首关消除亦称首关效应或第一关卡效应,指口服某些药物,先经门静脉进入肝,在进入体循环前被代谢灭活或结合储存,使进入体循环的药量明显减少的现象。

(六) 生物利用度

生物利用度是指药物吸收进入血液循环的速度和程度。生物利用度 (F) 用进入体循环的药量 (A) 占用药剂量 (D) 的百分数来表示: $F = \frac{A}{D} \times 100\%$,生物利用度高,说明药物吸收良好,反之,则药物吸收差,它是检验药品质量的重要指标之一。

(七) 药物与血浆蛋白结合

药物进入血液循环后可不同程度地与血浆蛋白结合,药物在血循环中以结合型和游离型(活性型)两种形式存在。治疗剂量的药物与血浆蛋白结合的百分率称为药物的血浆蛋白结