

全国中医药高职高专配套教材


供 护 理 专 业 用

# 护理药理学

## 学习指导与习题集

主编 姜国贤



 人民卫生出版社

全国中医药高职高专配套教材  
供护理专业用

---

# 护理药理学 学习指导与习题集

---

主 编 姜国贤

副主编 李 玲 陈俊荣

编 者 (以姓氏笔画为序)

王 凡 (江西中医药高等专科学校)

孙 静 (黑龙江中医药大学佳木斯学院)

李 玲 (南阳医学高等专科学校)

何志军 (湖南中医药高等专科学校)

初钰华 (山东中医药高等专科学校)

陈俊荣 (沧州医学高等专科学校)

姜国贤 (江西中医药高等专科学校)

梁 枫 (安徽中医药高等专科学校)

人民卫生出版社

## 图书在版编目 (CIP) 数据

护理药理学学习指导与习题集/姜国贤主编.

—北京: 人民卫生出版社, 2010. 9

ISBN 978-7-117-13289-3

I. ①护… II. ①姜… III. ①护理学—药理学—医学  
院校—教学参考资料 IV. ①R96

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2010) 第 150233 号

门户网: <a href="http://www.pmph.com">www.pmph.com</a>	出版物查询、网上书店
卫人网: <a href="http://www.ipmph.com">www.ipmph.com</a>	护士、医师、药师、中 医 师、卫生资格考试培训

版权所有, 侵权必究!

## 护理药理学学习指导与习题集

主 编: 姜国贤

出版发行: 人民卫生出版社 (中继线 010-59780011)

地 址: 北京市朝阳区潘家园南里 19 号

邮 编: 100021

E - mail: [pmph@pmph.com](mailto:pmph@pmph.com)

购书热线: 010-67605754 010-65264830

010-59787586 010-59787592

印 刷: 北京市卫顺印刷厂

经 销: 新华书店

开 本: 787×1092 1/16 印张: 14

字 数: 341 千字

版 次: 2010 年 9 月第 1 版 2010 年 9 月第 1 版第 1 次印刷

标准书号: ISBN 978-7-117-13289-3/R·13290

定 价: 22.00 元

打击盗版举报电话: 010-59787491 E-mail: [WQ@pmph.com](mailto:WQ@pmph.com)

(凡属印装质量问题请与本社销售中心联系退换)

# 前 言

---

《护理药理学学习指导与习题集》是根据全国高等医药教材建设研究会、卫生部教材办公室 2009 年 3 月全国中医药高职高专卫生部规划教材第二轮修订及新增专业会议精神编写的教学参考书。作为全国中医药高职高专卫生部规划教材《护理药理学》的配套教材，供护理专业学生复习时参考使用，也可作为其他专业人员的参考用书。本书的编写者全部为《护理药理学》教材的编者，保证了本书在内容、深度等方面与教材的良好衔接。

全书共 39 章，每章均按学习重点、难点解析及学法指导、习题、参考答案四大部分编写。学习重点以《护理药理学》教学大纲作为基本内容；难点解析及学法指导部分简要阐释了护理药理学的基本概念、基本规律，各章代表药的药理作用、临床应用、不良反应、用药监护等内容；各章习题的章节顺序与教材一致，习题内容覆盖了教材内容的 90% 以上，包含四种题型：选择题（A<sub>1</sub> 型题、A<sub>2</sub> 型题、B 型题）、名词解释、填空题、问答题；习题后均附有参考答案。学生们在系统学习《护理药理学》教材之后，可以参考本书复习与检查所学知识，并进一步掌握各章节的学习重点，锻炼独立思考、运用知识的能力。书末附有一套模拟试卷及参考答案，有助于提高学生们的综合应用护理药理知识的能力和实战应试技巧。

本书在编写过程中得到编者们在所在院校领导及老师的大力支持与帮助，在此深表谢意！

由于编者水平有限，编写中的疏漏和错误在所难免，恳请各院校师生予以批评指正。

姜国贤

2010 年 6 月

# 题型简介与解题说明

## 一、题型简介

### (一) 客观性试题

包括选择题(A<sub>1</sub>型题、A<sub>2</sub>型题、B型题)、名词解释、填空题。

1. 选择题 选择题由题干和若干个备选答案所组成。

(1) A型题(最佳选择题):由1个题干和5个备选答案组成,题干在前,选项在后。其中只有1个选项为最符合题意的答案即最佳答案,其余选项可以是部分正确或者不正确,属于干扰答案。

A<sub>1</sub>型题:为叙述性题干,用以考核对知识的记忆、理解和简单应用。

A<sub>2</sub>型题:题干为一简单病例、其他临床资料或问题情景。主要考核对知识的分析能力。

(2) B型题(配伍选择题):由一组试题共用一组备选答案。选项在前,题干在后,每题只有1个正确答案。每个选项可重复选用,也可不选用。主要考核对密切相关知识的辨析能力。

2. 名词解释 简要解释某一个概念、基本原理及临床意义。主要考核对知识的记忆和理解。

3. 填空题 提出一个不完整的陈述句,在所空之处(一处或多处)填写恰当的、关键的、重要的字、词。除考核对知识的记忆和理解外,也可考核对知识的应用能力。

### (二) 主观性试题

问答题:能将学过的知识点围绕问题中心用自己的语言简明扼要地阐明。主要考核对知识的应用和综合分析问题能力。

## 二、解题说明

### (一) 客观性试题

按客观评分标准解题。

#### 1. 选择题

A型题:要求在5个备选答案中选出1个最符合题意的最佳答案。

B型题:要求从备选答案中选配1个最合适的答案。

2. 名词解释 要求解说简明、正确,对概念或范畴的解释,应概括其基本特征。

3. 填空题 要求按空格出现先后顺序列出答案。

### (二) 主观性试题

问答题:解题应注意答案的规范,尽可能做到解题客观化。答题时要求围绕问题的中心,简明扼要地阐述或按解答方向,理论结合实际作扼要的分析、归纳或论证。

# 目 录

第一章 总论	1
学习重点	1
难点解析及学法指导	1
习题	7
参考答案	12
第二章 传出神经系统药理概论	14
学习重点	14
难点解析及学法指导	14
习题	15
参考答案	16
第三章 胆碱受体激动药与作用于胆碱酯酶的药	18
学习重点	18
难点解析及学法指导	18
习题	20
参考答案	22
第四章 胆碱受体阻断药	23
学习重点	23
难点解析及学法指导	23
习题	25
参考答案	27
第五章 肾上腺素受体激动药	28
学习重点	28
难点解析及学法指导	28
习题	30
参考答案	33
第六章 肾上腺素受体阻断药	35
学习重点	35
难点解析及学法指导	35
习题	36
参考答案	38
第七章 麻醉药	40
学习重点	40

难点解析及学法指导 .....	40
习题 .....	41
参考答案 .....	44
<b>第八章 镇静催眠药</b> .....	45
学习重点 .....	45
难点解析及学法指导 .....	45
习题 .....	46
参考答案 .....	48
<b>第九章 抗癫痫药</b> .....	50
学习重点 .....	50
难点解析及学法指导 .....	50
习题 .....	51
参考答案 .....	53
<b>第十章 治疗中枢神经系统退行性疾病药</b> .....	55
学习重点 .....	55
难点解析及学法指导 .....	55
习题 .....	56
参考答案 .....	58
<b>第十一章 抗精神失常药</b> .....	59
学习重点 .....	59
难点解析及学法指导 .....	59
习题 .....	61
参考答案 .....	63
<b>第十二章 镇痛药</b> .....	64
学习重点 .....	64
难点解析及学法指导 .....	64
习题 .....	66
参考答案 .....	68
<b>第十三章 解热镇痛抗炎药</b> .....	69
学习重点 .....	69
难点解析及学法指导 .....	69
习题 .....	70
参考答案 .....	72
<b>第十四章 中枢兴奋药与促大脑功能恢复药</b> .....	74
学习重点 .....	74
难点解析及学法指导 .....	74
习题 .....	75

参考答案 .....	77
<b>第十五章 利尿药与脱水药</b> .....	78
学习重点 .....	78
难点解析及学法指导 .....	78
习题 .....	80
参考答案 .....	82
<b>第十六章 抗高血压药</b> .....	84
学习重点 .....	84
难点解析及学法指导 .....	84
习题 .....	86
参考答案 .....	89
<b>第十七章 抗心绞痛药</b> .....	91
学习重点 .....	91
难点解析及学法指导 .....	91
习题 .....	92
参考答案 .....	94
<b>第十八章 抗心律失常药</b> .....	96
学习重点 .....	96
难点解析及学法指导 .....	96
习题 .....	97
参考答案 .....	100
<b>第十九章 抗充血性心力衰竭药</b> .....	102
学习重点 .....	102
难点解析及学法指导 .....	102
习题 .....	104
参考答案 .....	107
<b>第二十章 调血脂药及抗动脉粥样硬化药</b> .....	108
学习重点 .....	108
难点解析及学法指导 .....	108
习题 .....	109
参考答案 .....	111
<b>第二十一章 抗过敏反应药</b> .....	112
学习重点 .....	112
难点解析及学法指导 .....	112
习题 .....	113
参考答案 .....	115
<b>第二十二章 作用于呼吸系统的药物</b> .....	116
学习重点 .....	116
难点解析及学法指导 .....	116



习题·····	118
参考答案·····	120
<b>第二十三章 作用于消化系统的药物</b> ·····	121
学习重点·····	121
难点解析及学法指导·····	121
习题·····	123
参考答案·····	126
<b>第二十四章 作用于血液及造血器官的药</b> ·····	127
学习重点·····	127
难点解析及学法指导·····	127
习题·····	130
参考答案·····	132
<b>第二十五章 子宫平滑肌兴奋药与松弛药</b> ·····	134
学习重点·····	134
难点解析及学法指导·····	134
习题·····	135
参考答案·····	136
<b>第二十六章 肾上腺皮质激素类药</b> ·····	138
学习重点·····	138
难点解析及学法指导·····	138
习题·····	139
参考答案·····	142
<b>第二十七章 甲状腺激素和抗甲状腺药</b> ·····	143
学习重点·····	143
难点解析及学法指导·····	143
习题·····	145
参考答案·····	147
<b>第二十八章 胰岛素和口服降血糖药</b> ·····	148
学习重点·····	148
难点解析及学法指导·····	148
习题·····	150
参考答案·····	152
<b>第二十九章 抗菌药概论</b> ·····	153
学习重点·····	153
难点解析及学法指导·····	153
习题·····	155
参考答案·····	156
<b>第三十章 <math>\beta</math>-内酰胺类抗生素</b> ·····	158
学习重点·····	158

难点解析及学法指导·····	158
习题·····	161
参考答案·····	162
<b>第三十一章 大环内酯类、林可霉素类及万古霉素类抗生素·····</b>	<b>164</b>
学习重点·····	164
难点解析及学法指导·····	164
习题·····	166
参考答案·····	167
<b>第三十二章 氨基苷类及多黏菌素类抗生素·····</b>	<b>169</b>
学习重点·····	169
难点解析及学法指导·····	169
习题·····	171
参考答案·····	172
<b>第三十三章 四环素类抗生素及氯霉素·····</b>	<b>174</b>
学习重点·····	174
难点解析及学法指导·····	174
习题·····	176
参考答案·····	177
<b>第三十四章 人工合成抗菌药·····</b>	<b>179</b>
学习重点·····	179
难点解析及学法指导·····	179
习题·····	181
参考答案·····	182
<b>第三十五章 抗结核病药·····</b>	<b>184</b>
学习重点·····	184
难点解析及学法指导·····	184
习题·····	185
参考答案·····	186
<b>第三十六章 抗真菌药与抗病毒药·····</b>	<b>188</b>
学习重点·····	188
难点解析及学法指导·····	188
习题·····	189
参考答案·····	191
<b>第三十七章 抗寄生虫药·····</b>	<b>192</b>
学习重点·····	192
难点解析及学法指导·····	192
习题·····	194

参考答案.....	195
<b>第三十八章 抗恶性肿瘤药</b> .....	197
学习重点.....	197
难点解析及学法指导.....	197
习题.....	199
参考答案.....	200
<b>第三十九章 影响免疫功能的药物</b> .....	202
学习重点.....	202
难点解析及学法指导.....	202
习题.....	203
参考答案.....	205
<b>附 模拟试卷及参考答案</b> .....	206

# 第一章 总 论

## 学习重点

1. 掌握药物效应动力学与药物代谢动力学中的基本概念、药物作用的主要类型、不良反应的类型及特点。
2. 熟悉药物作用的受体机制；影响药物作用的因素；护士在用药监护中的注意事项。

## 难点解析及学法指导

### 一、绪言

#### (一) 药理学及护理药理学概念

药物是指能影响机体组织器官生理功能和(或)细胞代谢过程,用于预防、诊断、治疗疾病及计划生育的化学物质。按其来源分为天然药物、合成药物和基因工程药三类。药理学是研究药物与机体(含病原体)之间相互作用及作用规律的一门学科。其研究内容包括:①药物效应动力学(药效学),是研究药物对机体的作用及作用机制的学科;②药物代谢动力学(药动学),是研究药物在机体的影响下所发生的变化及其规律的学科。

随着医学科学的不断发展,药理学的内容愈来愈丰富,研究也更加深入,使药理学出现了许多分支。护理药理学也是药理学的一门分支学科,是以人作为研究对象,阐述临床如何合理用药和护理工作者在合理用药中的地位和作用。

#### (二) 护理工作相关的药品知识

1. 药品的名称 药品的名称可分为通用名、商品名、汉语拼音、英文名及化学名等。
2. 药品的批号 指同一次投料、同一生产工艺所生产的药品,通常以生产日期表示。
3. 药品的有效期 有效期的表示方法有三种:①直接标明有效期;②标明有效年限;③直接标明失效期,国外进口药品采用 EXP. Date 或 Use before 标明失效期。
4. 药品的分类 较常见的分类如:①以剂型为主的综合分类。②按药品的使用分类:包括处方药和非处方药。处方药指必须凭执业医师或执业助理医师处方才可调配、购买和使用的药品;非处方药(OTC)指不需要凭医师处方即可自行判断、购买和使用的药品。③按药品的管理分类:包括普通药品与特殊药品。特殊药品包括麻醉药品、精神药品、医疗用毒性药品、放射性药品。

#### (三) 护士在用药监护中的职责

1. 执行好用药医嘱。

2. 给药时严格做到“三查”和“七对”。
3. 许多药物的疗效与服药时间密切相关，护士应了解最佳用药时间，指导患者按时服药。
4. 做好用药宣教工作，向患者正确解释用药后可能出现的不良反应，让患者做到心中有数，从而更好地配合治疗。
5. 用药期间，注意观察药物的疗效和不良反应，并做好记录。主动询问症状，检查体征，以便及时发现并处理，避免药源性疾病的发生。

## 二、药物效应动力学

### (一) 药物的基本作用

药物的基本作用是指药物对机体原有功能活动的影响，表现为兴奋和抑制作用。凡能使机体功能活动增强的作用称为兴奋作用；凡能使机体功能活动减弱的作用称为抑制作用。药物的兴奋作用和抑制作用在一定条件下可以发生转化。

### (二) 药物作用的主要类型

#### 1. 局部作用和吸收作用

(1) 局部作用：是指药物未被吸收入血，在用药部位所产生的作用。

(2) 吸收作用：是指当药物被机体吸收入血后分布到全身各组织器官而产生的作用。

2. 药物作用的选择性 亦称为选择作用，是指药物在治疗剂量下对某组织或器官产生特别明显的作用，而对其他组织或器官作用很弱，甚至无作用。

3. 防治作用和不良反应 根据药物的作用与用药目的是否一致，可将药物的作用分为防治作用和不良反应，即药物作用的两重性。

(1) 防治作用：包括预防作用和治疗作用。预防作用即在疾病发生之前用药，以防止疾病的发生。而治疗作用是指凡符合用药目的或能达到治疗效果的作用。根据治疗目的不同，治疗作用分为：①对因治疗：指用药目的是消除原发致病因子，彻底治愈疾病，又称“治本”。②对症治疗：即用药缓解疾病症状，但不能消除病因，又称“治标”。治疗时应坚持“急则治标，缓则治本，标本兼治”的原则。

(2) 不良反应：是指凡与用药目的无关，并给患者带来不适或痛苦的反应。任何药物都有一定的不良反应。根据其程度和性质不同，可分为副作用、毒性反应、变态反应、后遗效应等。

副作用：是指药物在治疗剂量时出现的与用药目的无关的作用。副作用常常难以避免，这是由于药物作用的选择性低所致。但副作用一般症状较轻，对机体危害不大。副作用和治疗作用可随着用药目的的不同而互相转化。副作用是药物本身所固有的，可以预测，并可设法避免或减轻。

毒性反应：是指在剂量过大或药物在体内蓄积过多时发生的危害性反应。一般比较严重，但是可以预知，应该尽量避免发生。包括急性毒性反应和慢性毒性反应。有些药物长期应用可致畸、致癌、致突变，简称“三致反应”，也属于慢性毒性反应的范畴。

变态反应：也称过敏反应，是少数致敏的机体对某些药物产生的一种病理性免疫反应。常见于过敏体质的患者。变态反应的发生与否和剂量无关，发生程度则和剂量有关。其反应性质与药物原有效应无关，为预防药物变态反应的发生，应详细询问过敏史，有些易致变态反应的药物用药前要按规定做皮肤过敏试验，对该药有过敏史或过敏试验阳性者

禁用。

后遗效应：是指停药后血药浓度已降至阈浓度以下时残存的药理效应。

药物依赖性：是指某些药物反复应用后，机体所产生的一种精神或行为的反应，一旦停药就会表现出主观不适症状，甚至出现严重的生理功能紊乱。包括精神依赖性和身体依赖性两种类型。

精神依赖性是指药物反复应用后，突然停药可发生强烈的用药欲望，以达到精神上的欣快感。主要特征为：①停用药物后精神感觉不适，渴求继续用药；②连续应用一般无加大用量的要求；③一般不引起戒断反应；④危害的主要是用药者本人。

身体依赖性是指药物反复应用后，突然停药可产生严重的生理功能障碍，出现戒断症状。主要特征有：①强迫性地要求继续用药，不择手段地得到药品；②连续应用需不断加大剂量；③引起戒断反应；④不仅危害本人，也严重危害社会安定。

### （三）药物剂量与效应的关系

药物效应与剂量在一定范围内成正比，随着血药浓度的增加，药效增强，这种剂量与效应的关系称为量-效关系。量-效关系也常用浓度-效应关系表示。

1. 量反应型量-效关系 药物效应强度随着剂量的增加而连续地变化，可用具体数量或最大反应的百分率表示。

效能是指药物所能产生的最大效应，用  $E_{\max}$  表示，它反映药物本身的内在活性；而效价是指引起同等效应的相对浓度或剂量。具有相同作用的不同药物，其效能不一定相同，而达到同等效应所需的剂量也不一定相同。产生同等效应所需药物剂量越小，说明该药效价越强。由于药物的最大效应和效价强度并不平行，因此，比较相同效应的两种或两种以上药物时，应从效能和效价强度两项指标综合考虑。

2. 质反应型量-效关系 如果药理效应不是随着药物剂量或浓度的增减呈连续性量的变化，而表现为反应性质的变化，称为质反应。质反应以全或无、阳性或阴性的方式表现，结果以反应的阳性百分率或阴性百分率来表示，如死亡与存活、惊厥与不惊厥等，其研究对象为一个群体。在动物实验中，能引起 50% 实验动物产生效应的剂量称半数有效量 (50% effect dose,  $ED_{50}$ )，能引起 50% 实验动物死亡的剂量称半数致死量 (50% lethal dose,  $LD_{50}$ )。 $ED_{50}$  是反映药物治疗效应的重要参数， $LD_{50}$  是反映药物毒性大小的重要参数。

量-效关系可用于药物安全性分析，常用的安全性指标有：①治疗指数 (TI)：是指药物的  $LD_{50}$  与  $ED_{50}$  的比值 ( $LD_{50}/ED_{50}$ )，用以表示药物的安全性，此值越大一般表示药物越安全，但不完全可靠。②安全范围：是指用  $ED_{95} \sim LD_5$  或  $ED_{99} \sim LD_1$  间的距离来衡量药物的安全性，其范围越大药物越安全。

### （四）药物作用的机制

药物的种类繁多，性质各异，作用机制也复杂多样。

1. 药物作用的受体机制 受体是存在于细胞膜上或细胞内，能识别、结合特异性配体并通过信息传递引起特定生物效应的大分子物质。能与受体结合并产生效应的配体主要有神经递质、自体活性物质及药物等。

药物与受体具有如下特性：①灵敏性；②特异性；③饱和性；④可逆性；⑤多样性。药物与受体结合引起生物效应必须具备亲和力和内在活性两个条件。亲和力是指药物与受

体相结合的能力；内在活性是指药物与受体结合后产生效应的能力。根据药物是否具有内在活性及其大小可将与受体相互作用的药物分为两类。

(1) 激动药：是指既具有亲和力又有内在活性的药物，它们能与受体结合，激动受体而产生效应。可分为：①完全激动药：药物与受体结合具有较强的亲和力和较强的内在活性的药物。②部分激动药：对受体有较强亲和力，但只有较弱的内在活性的药物。

(2) 拮抗药：亦称阻断药，是指有较强的亲和力而无内在活性的药物。拮抗药包括竞争性拮抗药和非竞争性拮抗药。

受体的数量、分布和亲和力，可受生理、病理、药物等因素的影响而发生改变，称为受体调节。其中向上调节是指受体的数目增多、亲和力增加或效应增强。向下调节是指受体的数目减少、亲和力降低或效应减弱。

## 2. 药物作用的其他机制

### 三、药物代谢动力学

#### (一) 药物的跨膜转运

药物的跨膜转运是指药物在转运和生物转化时均需多次通过生物膜的过程。药物通过生物膜的方式有滤过、简单扩散和载体转运。绝大多数药物在体内按简单扩散方式转运。弱酸性药在酸性环境中，解离度小，易透过生物膜；但在碱性环境中，则解离度大，不易透过生物膜。载体转运主要有主动转运和易化扩散两种方式。

#### (二) 药物的体内过程

1. 吸收 药物自给药部位进入血液循环的过程称为吸收。除静脉给药直接进入血液循环外，其他给药途径均存在吸收过程。

(1) 消化道给药：包括口服给药、舌下给药、直肠给药等方式。其中口服给药为最常见的给药途径。有些经胃肠道吸收的口服药物，首次通过小肠黏膜和肝脏时，部分被该处的药酶代谢灭活，使进入体循环的药量减少的现象称为首过消除，也称首过效应。首过消除多的药物不宜口服给药。

(2) 注射给药：静脉给药直接进入血液循环，无吸收过程，故发挥作用快。肌内注射较皮下注射吸收快。

(3) 吸入给药。

(4) 经皮给药。

2. 分布 药物被机体吸收后经血液循环到达各组织器官的过程称为分布。多数药物在体内的分布是动态的、不均匀的。其影响因素主要有：

(1) 药物与血浆蛋白结合：药物与血浆蛋白具有不同程度的可逆性结合，游离型和结合型可相互转化，处于动态平衡中。结合型药物分子量增大，不易通过生物膜，暂时失去药理活性，而游离型药物能够转运到作用部位产生药效。两种药物合用时可与血浆蛋白竞争结合而发生置换现象，使游离型药物比例加大，作用增强。

(2) 器官血流量：人体各组织器官的血流量是不均一的。体内血流量大的组织器官药物分布速度快。药物在体内可再分布，如静脉注射硫喷妥钠，首先分布到血流量最大的脑组织，立即产生麻醉作用；因其脂溶性高，然后又向血量少的脂肪组织转移，因而患者可迅速苏醒。

(3) 药物与组织的亲和力：有些药物与某些组织有特殊的亲和力，导致药物在该组织

中浓度较高。

(4) 体液的 pH 和药物的理化性质。

(5) 体内屏障：体内有各种屏障可影响药物分布，主要包括：①血脑屏障：是指血液与脑细胞、血液与脑脊液及脑组织与脑脊液之间的隔膜的总称。②胎盘屏障：有些药物可能影响胎儿发育或引起畸胎，故妊娠期间应慎用，以防胎儿中毒或导致畸形。③血眼屏障。

3. 药物的代谢 代谢是指药物在体内发生化学结构改变的过程，也称生物转化。大部分药物的生物转化在肝脏进行。生物转化可改变药物的药理活性：灭活、活化、不被代谢。

(1) 代谢步骤：药物在体内的代谢一般分两步进行：第一步包括氧化、还原、水解反应，药物经第一步反应引起药理活性加强或减弱；第二步是结合反应，结合后的产物活性降低或消失，易经肾排出。

(2) 药物代谢酶：①专一性酶：是针对特定的化学结构基团进行代谢的特异性酶，可催化特定的底物。②非专一性酶：一般指肝细胞微粒体的混合功能酶系统，简称肝药酶。是非特异性酶。其主要的氧化酶为细胞色素 P450 酶系，是肝内促进药物代谢的主要酶系统。其特性主要有：专一性低；个体差异较大；酶活性有限；药物对肝药酶活性可产生影响，表现出增强或抑制肝药酶的活性。

(3) 药酶的诱导剂和抑制剂：数种药物合用可发生竞争性抑制现象。凡能增强肝药酶活性的药物称为药酶诱导剂，如苯巴比妥、利福平等，当药物与药酶诱导剂合用时，则代谢加快，药效减低。凡能抑制肝药酶活性的药物称为药酶抑制剂，如氯霉素、西咪替丁等，当药物与药酶抑制剂合用时，代谢减慢，药效增强。

4. 药物的排泄 药物以原形或代谢产物自体内排至体外的过程称为排泄。排泄的主要器官是肾脏，其次包括消化道、呼吸道以及胆汁、汗腺、乳腺、唾液腺等。

(1) 肾脏排泄：大多数游离型药物及其代谢产物主要经肾小球滤过进入肾小管，部分又可自肾小管重吸收，其重吸收的程度取决于药物的理化性质和尿液的 pH。弱碱性药物在酸性尿中解离度大，脂溶性小，重吸收少，排泄增加。若两种药物以同一载体转运时，两者之间可发生竞争性抑制从而影响药物的排泄。

(2) 胆汁排泄：分泌到胆汁内的药物及其代谢产物可经胆汁排泄进入肠道。有些药物在肠腔内再次被小肠上皮细胞重吸收进入血液循环，称为肝肠循环。

(3) 其他排泄途径。

### (三) 药物代谢动力学过程

1. 药时曲线 药物的体内过程是一个连续变化的动态过程，体内的药量或血药浓度随时间的变化而改变。这种动态变化的过程可用时量关系来表示，通常在给药后不同时间采血测定血药浓度，以时间为横坐标，血药浓度为纵坐标，可绘出血药浓度-时间曲线，称为药时曲线或时量曲线。以非静脉一次给药为例，药物的时量曲线可分为潜伏期、持续期及残留期三个阶段。

2. 药物的消除与蓄积 药物经代谢和排泄等方式使药物活性降低和消失的过程称消除。药物在体内的消除主要有两种类型。

(1) 一级消除动力学：又称恒比消除，指单位时间内药物按恒定的比例进行消除。绝



大部分药物的消除属于此类型。

(2) 零级消除动力学：又称恒量消除，指单位时间内药物按恒定数量进行消除。当用药量过大，超过机体恒比消除能力的极限时，机体只能按恒量方式消除。

当多次反复用药时，药物进入体内的速率大于消除速率，使药物在体内的浓度逐渐增加，称为药物的蓄积。

#### (四) 药代动力学的基本参数

1. 血浆半衰期 ( $t_{1/2}$ ) 是指血浆中药物浓度下降一半所需要的时间。由于多数药物是按恒比消除，其半衰期是固定的。半衰期的临床意义：①拟定给药间隔时间。通常给药间隔时间约为一个半衰期，半衰期长，给药间隔时间长；半衰期短，给药间隔时间短。但当肝肾功能不全时，药物在体内的消除减慢， $t_{1/2}$  延长，易发生蓄积中毒，应适当减少用药剂量或延长给药间隔时间。②预测达到稳态血药浓度的时间。按恒量、恒定间隔时间给药，约经 4~5 个半衰期可达到稳态血药浓度。③预测药物基本消除的时间。单次用药后，按一级动力学消除的药物通常经 4~5 个半衰期体内药物消除达到或超过了 95%，可认为药物已基本消除。④作为药物分类的依据。

2. 稳态血药浓度 ( $C_{ss}$ ) 临床治疗常采用多次用药以维持有效血药浓度，以恒速恒量给药，体内药量逐渐增多，如果按  $t_{1/2}$  为给药间隔时间，一般经 4~5 个  $t_{1/2}$ ，从体内消除的药量和进入体内的药量相等，血药浓度维持在一个相对稳定的水平，称稳态血药浓度 (又称坪值)。

3. 生物利用度 是指经任何给药途径给予一定剂量的药物后，其到达全身血液循环内药物的百分率。生物利用度越高，被吸收进入血液的药量越多，药效越好。

#### 四、影响药物作用的因素

药物进入机体后，其产生的药效差异可能会很大。这是因为药物作用受到药物方面、机体方面、给药方面因素的影响。

##### (一) 药物方面的因素

1. 药物的化学结构 药物的性质和药理作用取决于药物的化学结构。化学结构相似的药物可以产生相似的药理作用，也可以产生相反的药理作用。

2. 药物的剂型 同种药物不同的剂型，所产生的药物效应也可能不同。

3. 药物剂量 剂量就是用药的分量。血药浓度的高低取决于用药剂量的大小，在一定范围内，剂量越大，血药浓度越高，作用越强。但超过一定范围，则可能发生中毒，甚至死亡。其中常用量是指比最小有效量大些，比极量小些的剂量范围；治疗量指最小有效量和极量之间的剂量范围。

##### (二) 机体方面的因素

1. 年龄 中华人民共和国药典所规定的常用量是适用于 18~60 岁的成人用量，14 岁以下的用药剂量是儿童剂量，60 岁以上的用药剂量是老人剂量。

2. 性别 一般情况下男女性别对药物的反应无明显差别。在女性的“三期”，即月经期、妊娠期、哺乳期，用药尤要注意。月经期女性不宜服用泻药和抗凝血药，以免引起盆腔充血、月经增多。妊娠期有些药物可通过胎盘，对胎儿的发育产生影响。在哺乳期，因为乳腺对药物没有屏障作用，药物可通过乳汁影响哺乳儿。

3. 个体差异 是指少数人由于遗传因素的差异对药物的反应表现出与一般人有显著