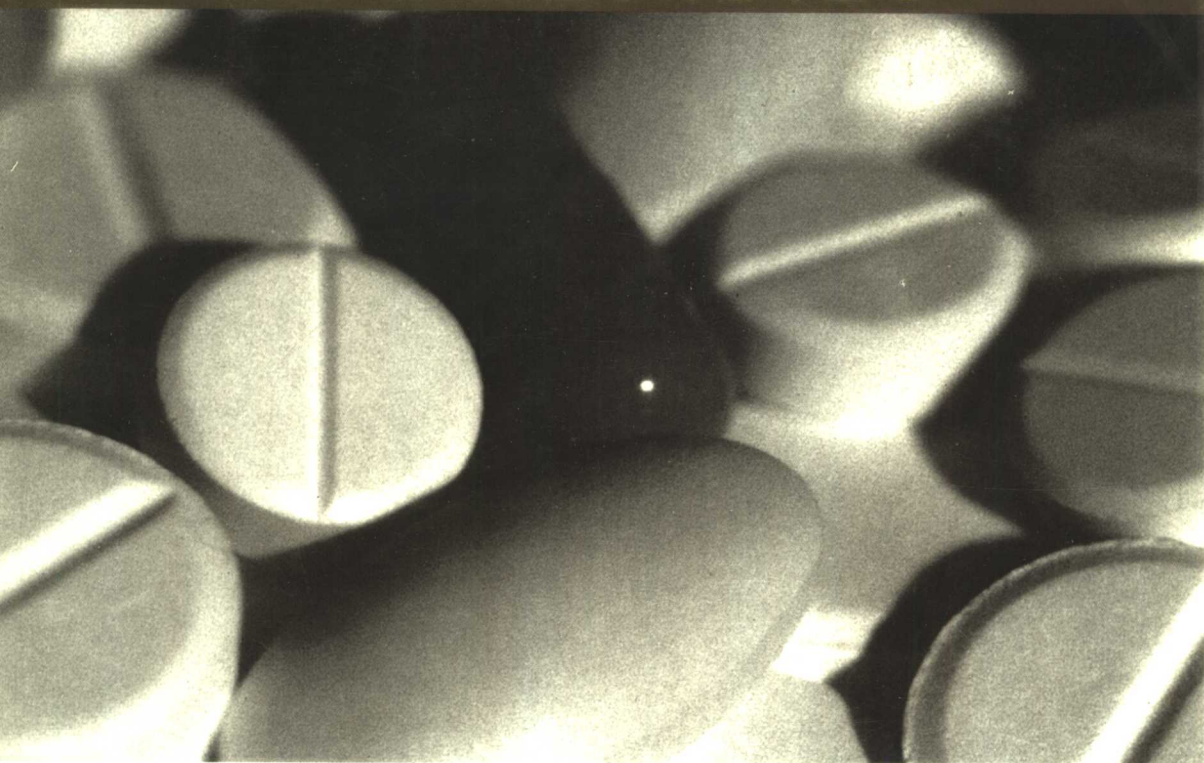


● 医学专业课程考试辅导丛书 ●



新编

配合最新版国家级规划教材

- ▲ 医学院校本科生课程考试辅导
- ▲ 医学专业研究生入学考试辅导
- ▲ 执业医师资格、职称考试辅导

药理学

Y A O L I X U E

应试向导

主 编 张岫美

同济大学出版社

新编药理学应试向导

主 编 张岫美

副主编 孙 霞 王姿颖

编 委 (按编写内容先后为序)

王姿颖 王 进 王立祥

孙 霞 安 杰 魏欣冰

王菊英 张岫美

同 济 大 学 出 版 社

图书在版编目(CIP)数据

新编药理学应试向导/张岫美主编. —上海: 同济大学出版社, 2005. 10

(医学专业课程考试辅导丛书)

ISBN 7-5608-3066-8

I. 新… II. 张… III. 药理学—医学院校—教学参考资料 IV. R96

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2005)第 101219 号

医学专业课程考试辅导丛书

新编药理学应试向导

张岫美 主编

责任编辑 赵 黎 责任校对 徐春莲 封面设计 永 正

出 版 行 同济大学出版社

(上海四平路 1239 号 邮编 200092 电话 021-65985622)

经 销 全国各地新华书店

印 刷 同济大学印刷厂印刷

开 本 787mm×960mm 1/16

印 张 25.75

字 数 515 000

印 数 1—5 100

版 次 2005 年 10 月第 1 版 2005 年 10 月第 1 次印刷

书 号 ISBN 7-5608-3066-8/R·132

定 价 34.00 元

本书若有印装质量问题, 请向本社发行部调换

前 言

根据教育部高等教育教材建设的精神,为适应教学改革和素质教育及创新能力培养的需要,帮助学生学习和掌握药理学的基本理论与基本知识,熟悉药理学的考试特点,注重理论结合实践,体现综合性,培养知识面宽、基础扎实,具有观察问题、分析问题和解决问题能力的优秀医学人才,提高应试能力和考试成绩,配合医学本科规划教材《药理学》(第六版,杨宝峰主编,北京:人民卫生出版社,2003)的使用,山东大学药理学研究所组织教师编写《新编药理学应试向导》一书,由同济大学出版社出版。

《新编药理学应试向导》以《药理学》(五年制临床医学规划教材第六版)为主要编写依据,又适当参考了国内外较新的同类教材,紧密结合药理学教学大纲;在编写设计上与《新编药理学应试向导》和《药理学》(第六版)的章节及顺序完全一致,既突出重点掌握内容,又兼顾熟悉和了解的内容,以药理学基本知识、基本理论为基础,以章为单元提出教材精要、学习重点和学习提纲。同时配以不同类型的试题,供学生练习用。

本书的读者对象主要是五年制临床医学、预防医学、口腔医学、放射医学、护理学、药学及其相关专业的学生,亦可作为药理学教师命题时的参考。在编写方面,力求涵盖面广、重点突出、深度适宜、实用性强,对学生的复习、预习和考试有一定的帮助,同时也兼顾了毕业后的执业医师资格考试复习的需要。

在编写格式方面,每章开始部分为教材精要和重点提示,指出学习的重点,依次为测试题和参考答案。教材精要和重点提示以简要文字强调该章的学习重点,对本章的学习内容给出层次分明、条理清晰、内容精练的提纲,重点内容明确;测试题包含有名词解释、选择题和问答题,反映了药理学教学大纲的要求,突出药理学基本理论和基本知识。选择题包括:A型题,答题时,要从五个备选答案中选出一个最合适的答案;B型题,多个问题共用五个或五个以上备选答案,从中选出一个最佳答案,每个备选答案可选一次、多次或不选;X型题,由一个题干和五个备选答案组成,每题可有数个正确答案,答案的数目和组成无规律性。正确答案2~5个,多选或少选均为错误。名词解释用中英文,突出双语教学的特点,并尽可能地结合学生复习的需要,每章有相当部分的问答题。

本书是山东大学医学院药理学研究所教师们多年来教学经验的积累,很多前辈和同仁都为此付出过辛勤的劳动。由于同济大学出版社的大力支持、各位作者的通力合作,因此,使本书能在较短的时间内顺利出版。

限于学识和能力,本书肯定存在错误和不足,恳切希望各位老师和同学提出宝贵的意见和建议,以便进一步修订。

主 编
2005年7月

目 录

前言

第一章 药理学总论——绪言	(1)
第二章 药物代谢动力学	(4)
第三章 药物效应动力学	(15)
第四章 影响药物效应的因素	(25)
第五章 传出神经系统药理概论	(29)
第六章 胆碱受体激动药	(37)
第七章 抗胆碱酯酶药和胆碱酯酶复活药	(43)
第八章 胆碱受体阻断药(Ⅰ)——M胆碱受体阻断药	(51)
第九章 胆碱受体阻断药(Ⅱ)——N胆碱受体阻断药	(60)
第十章 肾上腺素受体激动药	(66)
第十一章 肾上腺素受体阻断药	(79)
第十二章 中枢神经系统药理学概论	(87)
第十三章 全身麻醉药	(90)
第十四章 局部麻醉药	(95)
第十五章 镇静催眠药	(102)
第十六章 抗癫痫药和抗惊厥药	(111)
第十七章 治疗中枢神经系统退行性疾病药	(120)
第十八章 抗精神失常药	(127)
第十九章 镇痛药	(138)
第二十章 解热镇痛抗炎药	(151)
第二十一章 离子通道概论及钙通道阻滞药	(160)
第二十二章 抗心律失常药	(166)
第二十三章 肾素-血管紧张素系统药理	(174)
第二十四章 利尿药与脱水药	(180)
第二十五章 抗高血压药	(187)
第二十六章 治疗充血性心力衰竭的药物	(197)
第二十七章 抗心绞痛药	(206)
第二十八章 调血脂药与抗动脉粥样硬化药	(213)
第二十九章 作用于血液及造血器官的药物	(219)
第三十章 影响自体活性物质的药物	(229)
第三十一章 作用于呼吸系统的药物	(236)
第三十二章 作用于消化系统的药物	(245)
第三十三章 子宫平滑肌兴奋药和抑制药	(253)
第三十四章 性激素类药及避孕药	(260)
第三十五章 肾上腺皮质激素类药物	(267)

第三十六章	甲状腺激素及抗甲状腺药	(277)
第三十七章	胰岛素及口服降血糖药	(287)
第三十八章	抗菌药物概论	(298)
第三十九章	β -内酰胺类抗生素	(309)
第四十章	大环内酯类、林可霉素类及多肽类抗生素	(320)
第四十一章	氨基糖苷类抗生素	(329)
第四十二章	四环素类及氯霉素类抗生素	(337)
第四十三章	人工合成抗菌药	(343)
第四十四章	抗病毒药及抗真菌药	(349)
第四十五章	抗结核病药及抗麻风病药	(355)
第四十六章	抗寄生虫药	(361)
第四十七章	抗恶性肿瘤药物	(380)
第四十八章	影响免疫功能的药物	(393)
第四十九章	基因治疗	(401)

第一章 药理学总论——绪言

[教材精要]

一、药理学的性质与任务

1. 药物(drug) 是指可以改变或查明机体的生理功能及病理状态,可用以预防、诊断和治疗疾病的化学物质。

2. 药理学(pharmacology) 是研究药物与机体(含病原体)之间相互作用和作用规律的学科,包括药物效应动力学和药物代谢动力学两方面的内容。

3. 药物效应动力学(pharmacodynamics) 简称药效学,是研究药物对机体的作用及作用机制的科学。

4. 药物代谢动力学(pharmacokinetics) 简称药动学,是研究药物在机体的影响下所发生的变化及其规律的科学。

5. 药理学的学科任务

(1) 阐明药物作用机制,为临床合理用药提供理论依据。

(2) 研究开发新药、发现药物新用途。

(3) 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、新药开发与研究

新药是指在我国未上市销售的药物。新药开发与研究的过程包括临床前研究、临床研究和上市后药物监测三个阶段。其中,新药的临床研究又分为四期。

[重点提示]

掌握药物、药理学、药效学和药动学的概念及药理学的学科任务;熟悉新药开发与研究的过程;了解药物与药理学的发展史。

测试题

一、名词解释

1. 药理学(pharmacology) 2. 药物(drug) 3. 药物代谢动力学(pharmacokinetics) 4. 药物效应动力学(pharmacodynamics) 5. 新药(new drug)

二、选择题

A型题

1. 药理学是研究()

A. 药物对机体的作用

B. 机体对药物的作用

C. 药物在体内的过程

D. 药物的不良反应

E. 药物与机体的相互作用

2. 药效学是研究()

A. 药物的临床疗效

B. 药物对机体的作用及作用机制

C. 药物的作用机制

D. 药物作用的影响因素

E. 药物在体内的变化规律

3. 药动学是研究()

- A. 药物作用的动能来源 B. 药物作用的动态规律
C. 药物在体内的变化 D. 药物作用强度随剂量、时间变化的消长规律
E. 药物在体内转运、代谢及血药浓度随时间的消长规律
4. 下列哪项不属于新药的临床前研究()
A. 药物制备工艺研究 B. 人体安全性试验
C. 药物理化性质研究 D. 以实验动物为对象的毒理学研究
E. 药物质量控制标准研究
5. 不属于药理学学科任务的是()
A. 阐明药物作用机制 B. 提高药物疗效
C. 研究开发新药 D. 研制适于临床应用的药物剂型
E. 发现药物新用途
6. 新药的临床研究不包括()
A. 初步的临床药理学试验 B. 人体安全性评价试验
C. 对照临床试验 D. 扩大的多中心临床试验
E. 售后调研

B 型题

(7~8 题)

- A. 药理学 B. 药动学 C. 药效学 D. 实验药理学 E. 临床药理学
7. 研究药物和机体之间相互作用()
8. 研究药物的体内过程()

X 型题

9. 新药研究过程可分为()
A. 临床研究 B. 选药 C. 生产、上市审批 D. 临床前研究 E. 售后调研
10. 药理学的实验方法包括()
A. 实验药理学方法 B. 药动力学方法
C. 实验治疗学方法 D. 临床药理学方法
E. 药效学方法

三、问答题

1. 简述新药临床前研究的内容。
2. 简述新药的临床试验过程。

[参考答案]

一、名词解释

1. 药理学:是研究药物与机体(含病原体)之间相互作用和作用规律的学科,包括药物效应动力学和药物代谢动力学两方面的内容。
2. 药物:是指可以改变或查明机体的生理功能及病理状态,可用以预防、诊断和治疗疾病的化学物质。
3. 药物代谢动力学:简称药动学,是研究药物在机体的影响下所发生的变化及其规律的科学。
4. 药物效应动力学:简称药效学,是研究药物对机体的作用及作用机制的科学。
5. 新药:指在我国未上市销售的药物。

二、选择题

A 型题

1. E 2. B 3. E 4. B 5. D 6. E

B型题

7. A 8. B

X型题

9. ADE 10. ACD

三、问答题

1. 答:临床前研究主要由药物化学和药理学两部分内容组成。药物化学研究包括药物制备工艺路线、理化性质、质量控制标准等,药理学研究包括以符合《实验动物管理条例》的实验动物为研究对象的药效学研究、药代学研究及毒理学研究。

2. 答:新药的临床试验可分为Ⅰ、Ⅱ、Ⅲ、Ⅳ期。

(1) Ⅰ期临床试验是指初步的临床药理学及人体安全性评价试验;

(2) Ⅱ期临床试验是指随机双盲法对照临床试验;

(3) Ⅲ期临床试验是指扩大的多中心临床试验,即按随机对照原则,进一步评价新药的有效性、安全性;

(4) Ⅳ期临床试验是指新药上市后的监测,也叫售后调研,在广泛及长期使用条件下考察疗效和不良反应。

(王安颖)

第二章 药物代谢动力学

[教材精要]

药物代谢动力学是研究药物进出机体,即吸收、分布、代谢、排泄过程,并运用数学原理和方法阐述药物在机体内的量变规律的一门科学。

一、药物分子的跨膜转运

是指药物在体内通过各种生物膜的运动过程。绝大多数药物是以简单扩散的方式通过生物膜,扩散速度除取决于膜的性质、面积及膜两侧的浓度梯度外,还与药物的性质有关。分子小、脂溶性大、极性小、非解离型的药物易通过生物膜。药物的解离度也因其 pK_a (酸性药物解离常数的负对数)及所在溶液的 pH 不同而不同。非解离型(分子态)药物可以自由通过生物膜,离子型(解离型)药物不易通过生物膜。

多数药物为弱酸性或弱碱性药物。弱酸性药物在酸性环境中解离少,非解离型多,易通过生物膜;弱碱性药物则相反。由于膜两侧 pH 不同,当分布达平衡时膜两侧的药量会有相当大的差异。

二、药物的体内过程

1. 吸收(absorption) 是指药物从用药部位进入血循环的过程。口服药物吸收后经门静脉进入肝脏,有些药物首次进入肝脏就被肝药酶代谢,进入体循环的药量减少,称为首关消除(first pass elimination)。经过肝脏首关消除过程后,进入体循环的药量与实际给药量的相对量和速度,称为生物利用度(bioavailability)。

2. 分布(distribution) 指药物吸收后从血循环到达机体各个部位和组织的过程。药物先向血流量相对多的组织器官分布,然后向血流量相对少的组织器官转移,称为药物的再分布(redistribution)。

影响分布的因素:①药物本身的物理化学性质(包括分子大小、脂溶性、 pK_a 等)。

② 药物与血浆蛋白结合率:结合药不能通过生物膜,只有游离药物才能向组织分布。

③ 组织器官的屏障作用,如血脑屏障、胎盘屏障。

④ 细胞膜两侧体液的 pH 值。

3. 代谢(metabolism) 又称生物转化,是指药物在体内多种药物代谢酶(尤其是肝药酶)作用下,化学结构发生改变的过程。代谢是药物从体内消除的重要方式。分两相反应:Ⅰ相反应包括氧化、还原、水解;Ⅱ相反应为结合。代谢须在酶的催化下进行,这些酶分为非专一性酶和专一性酶两类。前者主要指肝微粒体混合功能氧化酶系统(hepatic microsomal mixed function oxidase system),简称肝药酶。其选择性低,变异性大,酶的活性易发生改变。能增强酶活性的药物称为肝药酶诱导剂(enzyme inducer),能减弱酶活性的药物称为肝药酶抑制剂(enzyme inhibitor)。影响肝药酶活性的药物可产生药物之间的相互作用。

4. 排泄(excretion) 是指药物及其代谢产物经机体的排泄器官或分泌器官排出体外的过程。排泄途径主要有肾脏和胆汁。改变尿液的 pH 值可明显改变弱酸性或弱碱性药物的解离度,从而改变药物在肾小管的重吸收程度。而分泌机制相同的两类药物经同一载体转运可发生竞争性抑制。经胆汁排泄到小肠的药物可进行肠肝循环

(enterohepatic cycle)。药物还可以通过唾液、乳汁、汗腺及泪液等途径排泄。

三、房室模型

如果给药后,体内药物瞬时在各部位达到平衡,可看成一室模型(one-compartment model)。多数情况下,药物在某些部位的药物浓度可以和血液中的浓度迅速达到平衡,而在另一些部位的转运有一延迟的、但彼此近似的速率过程,前者称为中央室,后者称为周边室,又称二室模型(two-compartment model)。

四、药物消除动力学

1. 一级消除动力学(first-order elimination kinetics) 单位时间内体内药物按恒定比率消除,又叫恒比消除,也称线性动力学(linear kinetics)。其微分方程式为: $\frac{dC}{dt} = -k_1C$;积分方程式为: $C_t = C_0 e^{-k_1 t}$ 。多数药物以一级动力学消除。

2. 零级消除动力学(zero-order elimination kinetics) 单位时间内体内药物按恒定的量消除,又叫恒量消除,也称非线性动力学(nonlinear kinetics)。其微分方程式为: $\frac{dC}{dt} = -k_0$;积分方程式为: $C = -k_0 t + C_0$ 。通常是因为药物在体内的消除能力达到饱和而致。

3. 混合消除动力学 一些药物在体内可表现为混合消除动力学,即当体内药量超过机体代谢能力时按零级动力学消除,降至最大消除能力以下时,按一级动力学消除。通常以米-曼氏方程式(Michaelis-Menten)表示: $\frac{dC}{dt} = -\frac{V_{max} \times C}{K_m + C}$,又叫米-曼氏消除(Michaelis-Menten elimination)。

五、体内药物的药量-时间关系

1. 一次给药的药-时曲线下面积(AUC) 单剂量一次给药后不同时间的血浆药物浓度变化以药-时曲线表示。药-时曲线的最高点称为峰浓度(peak concentration, C_{max}),达到峰浓度的时间称达峰时间(peak time, T_{max})。药-时曲线下所覆盖的面积称为曲线下面积(area under curve, AUC),其大小反映药物进入血循环后的总量。

2. 多次给药的稳态血浆浓度 按照一级动力学规律消除的药物,其体内药物总量随着多次给药而逐步增多,直至从体内消除的药物量和进入体内的药物量相等时,体内药物总量不再增加而达到稳定状态,此时的血浆药物浓度称为稳态浓度(steady-state concentration, C_{ss})。多次给药后药物达到稳态浓度的时间仅决定于药物的消除半衰期。一般来说,药物在剂量和给药间隔时间不变时,经过4~5个半衰期可分别达到稳态浓度的94%和97%。

六、药物代谢动力学重要参数

1. 消除半衰期(half life, $t_{1/2}$) 它是指血浆药物浓度下降一半所需要的时间。其长短可反映体内药物消除速度。按一级动力学消除药物的半衰期计算公式: $t_{1/2} = 0.693/k$;按零级动力学消除药物的半衰期计算公式: $t_{1/2} = 0.5 \frac{C_0}{k}$ 。

2. 清除率(clearance, CL) 是指机体清除器官在单位时间内清除药物的血浆容积,即单位时间内有多少毫升血浆中所含药物被机体清除,也被称为血浆清除率(plasma clearance),是衡量药物从体内消除快慢的指标。其计算公式为:

$$CL = \frac{A}{AUC_{0-\infty}}$$

3. 表观分布容积(apparent volume of distribution, V_d) 理论上药物均匀分布应占有的体液容积称为表观分布容积(apparent volume of distribution, V_d)。其计算公式为 $V_d = \frac{A}{C}$ 。

4. 生物利用度(bioavailability, F) 经任何给药途径给予一定剂量的药物后到达全身血循环内药物的百分率称为生物利用度, 其计算公式为: 生物利用度 = $\frac{A}{D} \times 100\%$ 。生物利用度还可反映血管外给药后能被吸收进入人体循环的分数或百分数。包括相对生物利用度和绝对生物利用度。

5. 生物等效性(bioequivalence) 含有同一有效成分且剂量、剂型和给药途径相同的药品, 若其有效成分的生物利用度无显著差别, 则称为生物等效。

七、药物剂量的设计和优化

1. 靶浓度(target concentration) 合理的给药方案是要使稳态血浆药物浓度(C_{ss})达到一个有效而不产生毒性反应的治疗浓度范围, 该浓度范围即靶浓度。

2. 维持量(maintenance dose) 为维持稳态血浆药物浓度所需的药物剂量称为维持量。

3. 负荷量(loading dose) 立即达到有效血药浓度所需要的药物剂量称为负荷量。

4. 个体化治疗(individualized treatment) 在制订一个药物的合理治疗方案时, 根据可能引起药物代谢动力学参数改变的患者情况对剂量进行调整。

[重点提示]

掌握首关消除概念及细胞膜两侧 pH 对药物吸收和分布的影响; 掌握药代动力学基本参数的药理学意义。熟悉药物消除动力学、时量曲线及多次给药的血药浓度变化。了解房室模型及意义; 了解药物的吸收、分布、生物转化、排泄的基本概念及影响因素。

测试题

一、名词解释

1. 吸收(absorption)
2. 分布(distribution)
3. 首过消除(first pass elimination)
4. 生物利用度(bioavailability, F)
5. 离子障(ion-trapping)
6. 血脑屏障(blood-brain barrier)
7. 胎盘屏障(placental barrier)
8. 肝药酶诱导剂(enzyme inducer)
9. 肝药酶抑制剂(enzyme inhibitor)
10. 肠肝循环(enterohepatic cycle)
11. 一室模型(one-compartment model)
12. 二室模型(two-compartment model)
13. 消除速率常数
14. 一级消除动力学(first-order elimination kinetics)
15. 零级消除动力学(zero-order elimination kinetics)
16. 混合消除动力学(mixed elimination kinetics)
17. 药-时曲线
18. 曲线下面积(area under curve, AUC)
19. 达峰时间(peak time, T_{max})
20. 稳态血药浓度(steady-state concentration, C_{ss})
21. 消除半衰期(half life, $t_{1/2}$)
22. 清除率(plasma clearance, CL)
23. 表观分布容积(apparent volume of distribution,

Vd) 24. 生物等效性(bioequivalence) 25. 个体化治疗(individualized treatment)

二、选择题

A 型题

1. 某药在体内遵循一级动力学消除,其血浆 $t_{1/2}$ 为 24h,若按固定单剂量每天服药一次,连续用药多少天后可达稳态血药浓度()
A. 1d B. 3d C. 5d D. 7d E. 9d
2. 某药 $t_{1/2}$ 为 24h,若该药按一级动力学消除,一次服药后约经几天体内药物基本消除干净()
A. 1d B. 3d C. 5 天 D. 7d E. 9d
3. 大多数药物在体内跨膜转运的方式是()
A. 主动转运 B. 简单扩散 C. 易化扩散 D. 胞饮 E. 膜孔滤过
4. 药物 pKa 的意义为()
A. 弱酸性药物的 pKa 越大,其酸性越强
B. 弱酸性药物的 pKa 越小,其酸性越强
C. 弱碱性药物的 pKa 越大,其酸性越强
D. 弱碱性药物的 pKa 越小,其碱性越强
E. 室温下药物和受体解离 50% 时溶液的 pH 值
5. 弱酸性药物阿司匹林的 pKa 为 3.5,它在 pH5.5 的尿液中,解离型药物的百分率为()
A. 1% B. 9% C. 99.9% D. 91% E. 99%
6. 在碱性尿液中弱碱性药物()
A. 解离少,肾小管再吸收多,排泄快
B. 解离多,肾小管再吸收少,排泄慢
C. 解离少,肾小管再吸收多,排泄慢
D. 排泄速度不变
E. 解离多,肾小管再吸收多,排泄慢
7. 在酸性尿液中弱碱性药物()
A. 解离多,肾小管再吸收多,排泄慢 B. 解离多,肾小管再吸收多,排泄快
C. 解离多,肾小管再吸收少,排泄快 D. 解离少,肾小管再吸收多,排泄慢
E. 解离多,肾小管再吸收少,排泄慢
8. 易通过血脑屏障的药物应具有的特性为()
A. 分子大,极性低 B. 分子大,极性高
C. 分子小,极性低 D. 分子小,极性高
E. 分子大,脂溶性低
9. 药物经肝脏生物转化后都会()
A. 分子变小 B. 极性增高 C. 毒性增加 D. 脂溶性增高 E. 活性增加
10. 某弱酸性药物的 pKa 为 4.4,其在血液(pH7.4)中的药物浓度为尿液(pH5.4)中的多少倍()
A. 100 B. 99 C. 91 D. 0.1 E. 0.01
11. 肝药酶()

- A. 专一性高,活性高,个体差异小 B. 专一性低,活性高,个体差异大
C. 专一性高,活性有限,个体差异大 D. 专一性低,活性有限,个体差异小
E. 专一性低,活性有限,个体差异大
12. 药物按零级动力学消除,则()
A. 吸收与代谢平衡 B. 单位时间内消除恒定量的药物
C. 单位时间内消除恒定比例的药物 D. 血浆浓度达到稳定水平需 5 个半衰期
E. 药物完全消除需 5 个半衰期
13. 药物的 $t_{1/2}$ 是指()
A. 药物的血浆浓度下降一半所需的时间
B. 药物的稳态血药浓度下降一半所需的时间
C. 药物的有效血药浓度下降一半所需的时间
D. 药物的中毒血药浓度下降一半所需的时间
E. 药物的最高血药浓度下降一半所需的时间
14. 已知某药按一级动力学消除,上午 8:00 时测其血药浓度为 $100\mu\text{g/L}$,晚上 20:00 时其血药浓度为 $12.5\mu\text{g/L}$,该药的 $t_{1/2}$ 为()
A. 2h B. 4h C. 6h D. 8h E. 10h
15. 下列有关胎盘屏障的叙述,错误的是()
A. 是胎盘绒毛与子宫血窦间的屏障 B. 通透性与一般毛细血管相同
C. 几乎所有药物均可通过 D. 可阻止药物从母体进入胎儿血循环中
E. 妊娠妇女原则上应禁用一切影响胎儿发育的药物
16. 下列有关生物利用度的叙述错误的是()
A. 与药物的作用强度无关 B. 与药物的作用速度有关
C. 首关消除对其有影响 D. 口服吸收的量与服药量之比
E. 与曲线下面积成正比
17. 按一级动力学消除的药物,其 $t_{1/2}$ ()
A. 随给药剂量而变 B. 固定不变
C. 随给药次数而变 D. 口服比静脉注射长
E. 静脉注射比口服长
18. 某心力衰竭患者长期口服地高辛,疗效较好,后因三叉神经痛应用苯妥英钠,结果出现心力衰竭症状,原因是()
A. 苯妥英钠有致心力衰竭的不良反应 B. 苯妥英钠减少地高辛的吸收
C. 苯妥英钠诱导肝药酶加速地高辛代谢 D. 苯妥英钠与地高辛竞争血浆蛋白
E. 苯妥英钠促进地高辛排泄
19. 生物利用度是指口服药物的()
A. 实际给药量 B. 吸收的速度
C. 吸收入血循环的总量 D. 消除的药量
E. 吸收入血循环的相对量和速度
20. 新生儿应用磺胺异噁唑发生致死性核黄疸的原因是()
A. 首过消除高 B. 生物利用度低
C. 该药将胆红素由血浆蛋白置换 D. 新生儿肝脏解毒功能差
E. 该药与脑组织亲和力高

21. 关于药物与血浆蛋白结合的叙述正确的是()
- A. 结合是不可逆的 B. 所有药物都与血浆蛋白结合
- C. 结合后药效增强 D. 结合后暂时失去活性
- E. 结合率高的药物排泄快
22. 某药血浆蛋白结合部位被另一药物置换后,其作用()
- A. 不变 B. 减弱 C. 增强 D. 消失 E. 不定
23. 丙磺舒与青霉素合用的目的在于()
- A. 抗菌机制相似 B. 增加青霉素吸收
- C. 减少青霉素排泄 D. 诱导肝药酶
- E. 抑制肝药酶
24. 促进药物生物转化的主要酶系统是()
- A. 单胺氧化酶 B. 葡萄糖醛酸转移酶
- C. 细胞色素 P₁₅₀ 酶系统 D. 辅酶 II
- E. 水解酶
25. 某药按一级动力学消除,是指()
- A. 消除速率常数随血药浓度高低而变
- B. 血浆半衰期恒定 C. 药物消除量恒定
- D. 增加剂量可使有效血药浓度维持时间按比例延长
- E. 代谢及排泄药物的能力已饱和
26. 静脉注射某药 2mg,其血药浓度为 0.1mg/dl,经计算其表观分布容积为()
- A. 1 L B. 2 L C. 5 L D. 20 L E. 200 L
27. 某药在口服和静脉注射相同剂量后的时量曲线下面积相等,表明()
- A. 口服吸收完全 B. 药物未经肝肠循环
- C. 口服吸收迅速 D. 属一室分布模型
- E. 口服的生物利用度低
28. 地高辛 $t_{1/2}$ 为 33.5 h,每日给维持量,达稳态血药浓度的时间约为()
- A. 2d B. 3d C. 5d D. 7d E. 9d
29. 按 $t_{1/2}$ 恒量重复给药时,为缩短达到稳态血药浓度的时间,可()
- A. 首剂量加倍 B. 首剂量增加 3 倍
- C. 连续恒速静脉滴注 D. 增加给药次数
- E. 增加每次给药量
30. 某弱碱性药物 $pK_a=9.8$,如果降低尿液的 pH,则此药在尿液中()
- A. 解离少,重吸收多,排泄加快 B. 解离少,重吸收少,排泄减慢
- C. 解离多,重吸收多,排泄加快 D. 解离少,重吸收多,排泄减慢
- E. 解离多,重吸收少,排泄加快
31. 有关药物从肾脏排泄的正确叙述是()
- A. 与血浆蛋白结合的药物易从肾小球滤过
- B. 药物的排泄与尿液 pH 值无关
- C. 解离的药物易从肾小管重吸收
- D. 改变尿液 pH 值可改变药物的排泄速度
- E. 药物的血浆浓度与尿液中的浓度相等

- ### B 型题

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

- (41~44 题)

44. 异烟肼增加双香豆素出血概率的原因 ()

45. 药物通过简单扩散转运方式通过生物膜时 ()

- A. 不消耗能量但需要载体协助
 - B. 受药物分子量大小、脂溶性和极性的影响
 - C. 药物由浓度高侧向浓度低侧扩散
 - D. 当细胞膜两侧药物浓度平衡时转运停止
 - E. 不同药物间转运无饱和与竞争性抑制现象
46. 零级消除动力学的特点是()
- A. 消除速度与血药浓度无关
 - B. 半衰期恒定
 - C. 单位时间消除药量与血药浓度无关
 - D. 体内药量以恒定百分比消除
 - E. 体内药量超过机体消除能力
47. 药物跨膜转运用 Fick 定律揭示()
- A. 其转运速度与膜表面积成正比
 - B. 其转运速度与膜厚度成正比
 - C. 其转运速度与膜两侧浓度差成正比
 - D. 其转运速度与药物脂溶性成正比
 - E. 其转运速度与药物分子量大小成正比
48. 药物与血浆蛋白结合后()
- A. 不易由肾脏排泄
 - B. 主动转运减慢
 - C. 暂时失去药理活性
 - D. 不易通过血脑屏障
 - E. 代谢加快
49. 药物 $t_{1/2}$ 的意义为()
- A. 确定给药间隔
 - B. 预测药物达 C_d 的时间
 - C. 预测药物的 V_d
 - D. 预测药物的生物利用度
 - E. 预测药物消除的时间
50. 消除 $t_{1/2}$ ()
- A. 按一级动力学消除的药物,其 $t_{1/2}$ 与药物浓度无关
 - B. 按零级动力学消除的药物,其 $t_{1/2}$ 与药物浓度无关
 - C. 按一级动力学消除的药物,经 5 个 $t_{1/2}$ 后体内约 97% 的药物被消除
 - D. 按零级动力学消除的药物,经 5 个 $t_{1/2}$ 后体内约 97% 的药物被消除
 - E. 血浆药物浓度降低一半所需要的时间
51. 苯巴比妥中毒时给予碳酸氢钠的目的是()
- A. 促进苯巴比妥在血液中解离
 - B. 促进苯巴比妥在肝脏转化速率
 - C. 减少药物向脑内分布
 - D. 促进苯巴比妥从脑中向血中转移
 - E. 减少苯巴比妥从肾小管重吸收
52. 影响药物在体内分布的因素有()
- A. 药物的理化性质
 - B. 体液 pH 值、血浆蛋白结合率
 - C. 体内各种特殊屏障
 - D. 给药剂量
 - E. 组织亲和力和脏器的血流量
53. 药物经生物转化后()
- A. 大多数药物活性增强
 - B. 大多数药物活性减弱或消失
 - C. 仅少数药物活性减弱或消失
 - D. 仅少数药物活性增强
 - E. 对药物的活性无影响
54. 下列关于 pH 与 pKa 和药物解离的关系的叙述正确的是()
- A. pH 的微小变化对药物解离度影响不大