



医药学经典教材辅导丛书

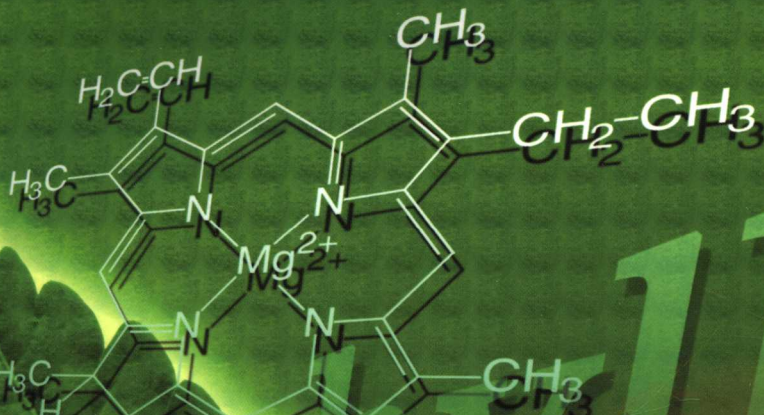
药理学

第6版

同步辅导与习题解析

杨俊卿 主编

- ★ 人卫版教材配套辅导 ★ 医学院校学生复习指南 ★
- ★ 研究生入学考试 ★ 执业医师考试指导 ★



陕西师范大学出版社



医药学经典教材辅导丛书

药理学

第6版

同步辅导与习题解析

主 编	杨俊卿	
主 审	周岐新	
编 委	朱丽霞	杨俊霞
	邱红梅	罗 映
	何百成	
顾 问	黄祖春	赵文龙

陕西师范大学出版社

图书代号:JF5N0825

图书在版编目(CIP)数据

药理学同步辅导与习题解析/杨俊卿编. —西安:陕西师范大学出版社,2005.8
(医药学经典教材辅导丛书)

ISBN 7-5613-3466-4/R·23

I. 药… II. 杨… 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 090819 号

责任编辑 刘 佳 陈光明

装帧设计 王静婧

出版发行 陕西师范大学出版社

社 址 西安市陕西师大 120[#] (邮政编码:710062)

网 址 <http://www.snuph.com>

经 销 新华书店

印 刷 南京金阳彩色印刷有限公司

开 本 787×1092 1/16

印 张 15.75

字 数 320 千

版 次 2005 年 9 月第 1 版

印 次 2005 年 9 月第 1 次印刷

定 价 20.00 元

开户行:光大银行西安电子城支行 账号:0303080-00304001602

读者购书、书店添货或发现印装问题,请与本社营销中心联系、调换。

电 话:(029)85307864 85233753 85251046(传真)

E-mail:if-centre@snuph.com

前 言

《〈药理学〉同步辅导与习题解析》是以杨宝峰教授主编的卫生部规划教材《药理学》第6版为基础,并与之相匹配的参考书。本书基本覆盖了执业医师资格考试大纲要求的内容。参加编写本书的人员均是长期工作在药理学教学第一线的教师,洞悉药理学教学中的重点、难点与考点,因此本书对于《药理学》的学习者来说,具有很好的学习参考价值。

本书依照《药理学》第6版的章节顺序编排内容。由于近几年多数院校药理学教学学时的减少,教师在课堂上难以对《药理学》第6版所有章节的内容进行讲解,因此,我们在编写本书时,针对多数院校药理学教学的实际情况对全书进行了较全面的讲解,试图尽量满足多数院校学生的学习需要。本书每个单元的内容由“重点难点内容”、“练习题”及“参考答案”组成。“重点难点内容”基本涵盖了《药理学》第6版每个章节的重点难点内容,重点难点内容之后是针对相应章节内容的练习题,练习题后面附有参考答案和解析,以便学生对本章节内容的重点、难点与考点进行自测,同时希望学生能根据练习题及解析内容举一反三。书的最后附有综合题、提高题与考试模拟试题,供学生参考和练习。

由于我们的学识和水平有限,加上编写时间仓促,书中难免会有许多缺点与不足之处,恳请读者和有关专家提出宝贵意见,以便我们在以后及时进行修订。

编者
2005年8月1日

目 录

第一部分 药理学总论.....	1
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.....	4
第四章 影响药物效应的因素及合理用药原则.....	7
第二部分 传出神经系统药物	24
第五章 传出神经系统概论	24
第六章 胆碱受体激动药物	24
第七章 抗胆碱酯酶药和胆碱酯酶复活药	25
第八章 胆碱受体阻断药-M受体阻断药物	28
第九章 胆碱受体阻断药-N受体阻断药物	29
第十章 拟肾上腺素药	30
第十一章 肾上腺素受体阻断药	32
第三部分 局部麻醉药物	51
第四部分 作用于 CNS 的药物.....	56
第十二章 镇静催眠药	56
第十三章 抗癫痫药	57
第十四章 抗帕金森病药	58
第十五章 抗精神病药	59
第五部分 镇痛与解热镇痛药物	73
第十六章 镇痛药	73
第十七章 解热镇痛抗炎药	81
第六部分 作用于内脏器官的药物	87
第十八章 抗心律失常药	87
第十九章 利尿药与脱水药	95
第二十章 抗高血压药.....	102

第二十一章	治疗充血性心力衰竭的药物	111
第二十二章	抗心绞痛药	122
第二十三章	调血脂药与抗动脉粥样硬化药	128
第二十四章	作用于血液及造血器官的药物	132
第二十五章	影响自体活性物质的药物	140
第二十六章	作用于呼吸系统的药物	143
第二十七章	子宫平滑肌兴奋药和抑制药	146
第七部分	作用于内分泌系统药物	151
第二十八章	肾上腺皮质激素类药物	151
第二十九章	甲状腺激素及抗甲状腺药	158
第三十章	胰岛素及口服降糖药	163
第八部分	化学治疗药物	168
第三十一章	抗菌药物概论	168
第三十二章	β -内酰胺类抗生素	171
第三十三章	大环内酯类、林可霉素类及多肽类抗生素	181
第三十四章	氨基苷类抗生素	185
第三十五章	四环素类及氯霉素类抗生素	190
第三十六章	人工合成抗菌药	194
第三十七章	抗真菌药及抗病毒药	201
第三十八章	抗结核病药及抗麻风病药	204
第三十九章	抗寄生虫药	209
第四十章	抗恶性肿瘤药	214
药理学综合题		223
药理学思考提高题(供考研学生参考)		229
药理学模拟试题(一)		232
药理学模拟试题(二)		238

第一部分 药理学总论

重点难点内容

第一章 绪 言

1. 药理学(pharmacology)是研究药物与机体(包括病原体)之间相互作用规律及原理的一门学科。

2. 药物(drug)是用以预防、治疗及诊断疾病的物质,在理论上指凡能影响机体器官生理功能及(或)细胞代谢活动的化学物质都属于药物的范畴。

3. 药效动力学(药效学, pharmacodynamics)研究药物对机体的作用、作用规律及作用机制。

4. 药代动力学(药动学, pharmacokinetics)研究机体对药物的作用及作用规律。

5. 药理学的学科任务是(1)阐明药物作用机制;(2)提高药物疗效;(3)开发新药,研究老药新用;(4)探索细胞生理、生化及病理过程。

第二章 药物代谢动力学

1. 药物分子的跨膜转运

(1) 被动转运(passive transport)

定义:药物依赖膜两侧的浓度差,由高浓度一侧向低浓度一侧的跨膜转运。

特点:顺浓度差,不耗能;不需要载体,无竞争抑制及饱和现象,当膜两侧浓度达到平衡时转运即保持在动态稳定水平。

影响因素:药物方面:分子大小、脂溶性、极性(解离度)等。

转运环境方面:膜两侧药物浓度差、转运面积、血流、pH值等。

常见类型:A. 滤过(filtration) B. 简单扩散(simple diffusion)

绝大多数药物是弱酸性或弱碱性电解质,其解离与pH有关,呈分子状态者易转运。药物解离度计算公式:

弱酸性药物： $10^{\text{pH}-\text{pK}_a} = [\text{A}^-]/[\text{HA}]$

弱碱性药物： $10^{\text{pK}_a-\text{pH}} = [\text{BH}^+]/[\text{B}]$

(2) 载体转运(carrier-mediated transport)

定义：跨膜蛋白在细胞膜的一侧与药物或生理性物质结合后，发生构型改变，在细胞膜的另一侧将结合的内源性物质或药物释出。

特点：有选择性、饱和性、竞争性。

常见类型：A 主动转运：逆浓度差或化学差，耗能。B 易化扩散：不需要能量。

2. 药物的体内过程：包括吸收、分布、代谢和排泄。

(1) 吸收(absorption)

定义：药物自用药部位进入血液循环的过程称为吸收。

影响因素：影响转运的因素，给药途径，制剂(剂型)。

给药途径有：口服、吸入、局部用药、舌下给药、注射给药。

评价参数：

① 首关消除(首过消除、首过效应、首关代谢；first pass elimination)：有些药物在进入体循环之前首先在胃肠道、肠粘膜细胞和肝脏被灭活代谢一部分(主要是在肝脏)，导致进入体循环的实际药量减少，这种现象称为首关消除。

② 生物利用度：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和速度。

③ 峰浓度(peak concentration, C_{max})口服的药-时曲线的最高点，达峰时间(peak time, t_{max})达到峰浓度的时间。

(2) 分布(distribution)

定义：药物吸收后随血循环到达机体各个部位和组织的过程。

影响因素：影响药物转运的因素，组织的亲和力，血浆蛋白结合，特殊屏障作用，血流量等。

血浆蛋白结合：药物进入血液后或多或少地与血浆蛋白结合。特点：结合型药物暂时失去活性，结合具有可逆性，具有饱和和竞争现象。

评价参数：表观分布容积(apparent volume of distribution, V_d)：指静脉注射一定量药物待分布平衡后，按测得的血浆浓度计算该药所占的血浆容积。 $V_d = \frac{X_0}{C_0} = \frac{X}{C}$

再分布(redistribution)：药物先向血流量相对多的组织器官(如脑)分布，然后向血流量相对少的组织器官(如脂肪)转移的现象。

(3) 代谢(biotransformation)

定义：药物作为外源性物质在体内发生化学结构的改变。

步骤：I 相：氧化、还原、水解 II 相：结合

药物在体内的转化必须在酶的催化下才能进行，这些酶分为两类，即专一性酶和非专一性酶。非专一性酶主要指细胞色素 P_{450} 单氧化酶系(以前称肝药酶)。

特点：选择性(专一性)低、个体差异性大、酶活性可被诱导或抑制。

能增强酶活性的药物称肝药酶诱导剂(enzyme inducer)，如苯巴比妥、苯妥英、利福平

等,而能够减弱酶活性的药物称肝药酶抑制剂(enzyme inhibitor),如氯霉素。

(4) 排泄(excretion)

药物的原型或其代谢产物通过排泄器官或分泌器官排出体外的转运过程。

① 肾脏排泄

包括:肾小球滤过、肾小管分泌(属主动转运)、肾小管重吸收(被动吸收)。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。而分泌机制相同的的两类药物合用时经同一载体转运可发生竞争性抑制。

② 消化道排泄

肝肠循环(hepatoenteral circulation):经胆汁排入肠腔的药物部分可再经小肠上皮细胞吸收由肝门静脉重新进入全身循环,这种肝脏、胆汁、小肠间的循环称之肝肠循环。

③ 其它排泄途径:汗液,唾液,泪液,乳汁,皮肤,肺,大便等。

3. 药物代谢动力学重要参数及概念。

(1) 半衰期(half life, $t_{1/2}$)

定义:血浆药物浓度下降一半所需要的时间(反映药物的消除速度)。

(2) 药-时曲线下面积(area under the curve, AUC, g. h. L⁻¹):药-时曲线下所覆盖的面积称曲线下面积,其大小反映药物进入血循环的总量。

(3) 生物利用度

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和速度。

分为绝对生物利用度和相对生物利用度。口服生物利用度 $F = A/D \times 100\%$

绝对生物利用度 = $AUC(\text{oral})/AUC(\text{iv}) \times 100\%$

相对生物利用度 = $AUC_{\text{test}}/AUC_{\text{standard}} \times 100\%$

(4) 达峰时间(t_{max})和峰浓度(C_{max})

(5) 表观分布容积:药物吸收达到平衡或稳态时,按照血药浓度推算体内药物总量在理论上占有的体内容积。 $V_d = \frac{X}{C_{\text{ss}}}$ 。

(6) 清除率:单位时间内机体能将多少升血中的某药物全部清除干净。 $CL = \text{清除速率}(\text{RE})/C_p = V_d \times k_e (\text{L/h})$

(7) 消除速率常数:单位时间内药物被消除的百分速率数。

(8) 稳态浓度(steady-state concentration, C_{ss}):一级动力学消除的药物,定时定量反复多次给药经5个 $t_{1/2}$ 后所达到的血药浓度称稳态浓度。此时血药浓度稳定在下一次给药前的谷浓度和药后的峰浓度之间。任何途径给药都需经过5个 $t_{1/2}$ 达 C_{ss} ,停止给药经过5个 $t_{1/2}$ 体内药物基本全部消除。当给药时间间隔为一个 $t_{1/2}$ 时,首次剂量加倍可立即达到 C_{ss} 。为维持 C_{ss} 所需剂量称维持量(D_m)。立即达到有效血浓所需要的剂量称负荷量(D_L)。当给药时间间隔为一个 $t_{1/2}$ 时,负荷量等于2倍的维持量。

4. 药物消除动力学

(1) 一级消除动力学

指体内药物在单位时间内消除的药物百分率不变,也就是单位时间内消除的药物量与血浆药物浓度成正比。

$t_{1/2} = 0.693/k_e$ (k_e :一级消除动力学的消除速率常数,反映体内药物的代谢和排泄速率)

特点:(1)恒比消除;(2)半衰期恒定;(3)对数血药浓度与时间呈直线关系: $\log C_t = \log C_0 - k_e t/2.303$;(4)是大多数药物在体内的消除方式。

(2) 零级消除动力学

药物在体内以恒定的速率消除,即不论血浆药物浓度高低,单位时间内消除的药物量不变。

特点:① 恒量消除;② 半衰期不定;③ 血药浓度与时间呈直线关系: $C_t = C_0 - k_0 t$;(4)少数药物的消除方式。

第三章 药物效应动力学

1. 药物作用与药理效应

药物作用:药物对机体的初始作用(动因)

药理效应:药物作用的结果,是机体反应的表现。

药理基本作用是机体器官原有功能水平的改变,功能提高称为兴奋,功能降低称为抑制。

2. 药物作用的选择性

药物对机体不同组织器官在作用性质或作用强度方面的差异称为药物作用的选择性。选择性高的药物多数药理活性高,应用时针对性强,可以准确地治疗疾病;选择性低的药物虽然针对性不强,应用时副作用多,但作用范围广。

3. 药物作用的治疗效果

(1) 治疗效果(therapeutic effect):符合用药目的或能达到防治疾病效果的作用

① 对因治疗(治本)(etiological treatment):用药目的在于消除原发病因子,彻底治愈疾病。

② 对症治疗(治标)(symptomatic treatment):用药目的在于改善疾病症状,减轻病人痛苦。

(2) 不良反应(adverse drug reaction, ADR):凡与用药目的无关,并为病人带来不适或痛苦的反应

① 副反应(side reaction):药物在治疗剂量时引起的,与治疗目的无关的药理作用,给病人带来轻微的不舒适或痛苦,是药物本身固有的作用,是可以预料的,不可避免。

② 毒性反应(toxic reaction):剂量过大或用药时间过长或机体对药物敏感性过高时产生的严重的不良反应。

特殊的慢性毒性:致癌(carcinogenesis)、致畸(teratogenesis)、致突变(mutagenesis)。

③ 后遗效应(residual effect):停药后血药浓度降至阈浓度以下时残存的药理效应。

④ 停药反应(回跃反应)(withdrawal reaction):指突然停药后原有疾病加剧。

⑤ 变态反应(过敏反应)(allergic reaction):药物作为抗原或半抗原所引发的病理性免

疫反应,过敏体质易发生,反应性质与药物原有效应无关,与剂量无关,难以预料。

⑥ 特异质反应(idiosyncrasy):少数特异体质病人对某些药物所产生的遗传性异常反应。

4. 量效关系(dose-effect relationship)

药理效应按作用性质可以分为:量反应和质反应

量反应(graded response):效应的强弱呈连续增减的变化,可用具体数量或最大效应的百分率表示。

质反应(quantal response, all-or-non response):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。质反应以阳性或阴性、全或无的方式表示。

在一定范围内,药理效应与药物剂量或药物浓度成比例。用效应强度为纵坐标,以药物剂量(整体动物用)或药物浓度(离体器官用)为横坐标作图则得量-效曲线。

最小有效量(minimum effective concentration, C_{min} , 阈浓度, threshold concentration):刚能引起效应的最小药量或最小药物浓度。

极量(maximum dose):最大治疗量。

最大效应(效能, maximum effect, efficacy, E_{max}):随着剂量或浓度的增加,效应也增加,当效应增加到一定程度后,若继续增加药物剂量或浓度而其效应不再继续增强,这一药理效应的极限称为效能。

效价强度(potency):能引起等效反应(常采用 50%效应量)的相对浓度或剂量,其值越小则强度越大。

半数有效量(median effective dose, ED_{50}):能引起 50%的实验动物出现阳性反应时的药物剂量。

半数有效浓度(concentration for 50% of maximum effect, EC_{50})引起半数试验动物反应的药物浓度。

半数致死量(median lethal dose, LD_{50}):能引起 50%的实验动物死亡的药物剂量

治疗指数(therapeutic index, TI): LD_{50}/ED_{50} 的比值

安全范围:指 95%有效量与 5%致死量之间的距离,即 $ED_{95}-LD_5$ 之间的距离,其范围越大越安全

5. 受体与药物的作用

(1) 受体(receptor):存在于细胞膜或细胞内,能识别、结合特异性配体(ligand)并发挥特定效应的大分子物质。

(2) 配体:能与受体结合的物质,分内源性配体和外源性配体。

(3) 受体的特点:①灵敏性(sensitivity);②特异性(specificity);③饱和性(saturability);④可逆性(reversibility);⑤多样性(multiple-variation)。

(4) 受体与药物的相互作用

占领学说(occupation theory)

受体只有与药物结合才能被激活并产生效应,而效应的强度与被占领受体的数量成正比,药物与受体的相互作用是可逆的;被占领的受体数目增多时,药物效应增强,当全部受体

被占领时,出现最大效应(E_{max})。

$[A]+[R]=[AR] \rightarrow E, K_D=[A][R]/[AR], K_D$:解离常数;由于 $[R_T]=[R]+[AR]$
(R_T :代表受体总数)

$[AR]/[R_T]=[A]/(K_D+[A])$;因为只有 AR 是有效的

$E/E_{max}=[AR]/[R_T]=[A]/(K_D+[A])$,当 $[A]=0, E=0$;当 $[A] \gg K_D, [AR]/[R_T]$
 $=100\%, E_{max}, [AR]_{max}=[R_T]$

当 $[AR]/[R_T]=50\%, EC_{50}, K_D=[A]$; K_D 代表药物与受体的亲和力(affinity),即药物与受体结合的能力。 K_D 越大,亲和力越低。 $pD_2 = -\log K_D$, pD_2 与亲和力成正比;内在活性(intrinsic activity): α ;即药物激动受体的能力。 $0 \leq \alpha \leq 100\%, E/E_{max} = \alpha [AR]/[R_T]$

储备受体(spare receptor):剩余的未被占领的受体。

激动药(agonist):既有亲和力又有内在活性($\alpha=0$)的药物。依其内在活性的大小分为:

完全激动药(full agonist):亲和力强,内在活性强($\alpha=1$)

部分激动药(partial agonist, mixed agonist):亲和力强,内在活性不强($\alpha < 1$)

拮抗药(antagonist):能与受体结合,具有很强亲和力而无内在活性 $\alpha=0$ 的药物。按其
与受体结合是否具有可逆性分为:

竞争性拮抗药(competitive antagonist):与激动药竞争相同受体,结合是可逆的。增加
激动药的剂量,可达最大效应。激动药的量效反应曲线可以被竞争性拮抗药平行右移。

pA_2 是拮抗参数(antagonism parameter):当有一定浓度的拮抗药存在时,激动剂增加
1 倍时才能达到原来效应,此时拮抗药的摩尔浓度负对数即拮抗参数, $pA_2 = -\log[I] = -\log KI$ 。

非竞争性拮抗药(noncompetitive antagonist):与受体的结合是相对不可逆的或同一受
体的不同位点,引起受体构型的改变,干扰激动药与受体的正常结合。增加激动药的剂量,
也不能达最大效应。量效反应曲线可以被竞争性拮抗药右移,效价强度减小,效能减小。

6. 受体类型

(1) 配体门控离子通道型受体(ligand-gated ion channel receptors),又称离子通道型受
体,它们存在于快速反应细胞的膜上,由单一肽链往返四次穿透细胞膜形成 1 个亚单位,并
由 4~5 个亚单位组成穿透细胞膜的离子通道,受体激动时离子通道开放使细胞膜去极化或
超级化,引起兴奋或抑制效应。N、GABA 受体等属门控离子通道型受体。

(2) G 蛋白耦联受体(G protein-coupled receptors)是一类由 GTP 结合调节蛋白(简称
为 G 蛋白,G-protein)组成的受体超家族,可将配体带来的信号传送到效应器蛋白,产生生
物效应。有 G_s, G_i, G_t (transducin)、 G_o 等形式。 $\alpha, \beta, D, 5-HT, M, \text{阿片}, \text{嘌呤}, PG$ 等受体属
G 蛋白耦联受体。

(3) 具有酪氨酸激酶活性的受体(tyrosine-kinase receptors)

胰岛素(insulin)、上皮细胞生长因子(epidermal growth factor, EGF)、血小板衍生的生
长因子(platelet-derived growth factor, PDGF)、转化生长因子 β (transforming growth fac-
tor- β , TGF- β)、胰岛素样生长因子(insulin-like growth factor)等受体属具有酪氨酸激酶活
性的受体。

(4) 细胞内受体(cellular receptor)

甾体激素、vitamin A、D、甲状腺激素等受体属细胞内受体。

7. 第二信使(second messenger)

腺苷(cyclic adenosine-3',5'-monophosphate, cAMP), cAMP 是 ATP 经 AC 作用的产物。 β 受体、 D_1 受体、 H_2 受体等激动药通过 G_s 作用使 AC 活化, ATP 水解而使细胞内 cAMP 增加。 α 受体、 D_2 受体、 M_2 受体、阿片受体等激动药通过 G_i 作用抑制 AC, 细胞内 cAMP 减少。cAMP 受磷酸二酯酶(phospho-diesterase, PDE)水解为 5'-AMP 后灭活。cAMP 能激活蛋白激酶 A(PKA)而使胞内许多蛋白酶磷酸化(ATP 提供磷基)而活化,例如磷酸化酶、酯酶、糖原合成酶等活化而产生能量。钙离子通道磷酸化后激活,钙离子内流而使神经、心肌、平滑肌等兴奋。

环磷鸟苷(cyclic guanosine-3',5'-monophosphate, cGMP), cGMP 是 GTP 经鸟苷酸环化酶(GC)作用的产物,也受 PDE 灭活。cGMP 作用与 cAMP 相反,使心脏抑制、血管舒张、肠腺分泌等。cGMP 可激活蛋白激酶 C(PKC)而引起各种效应。

肌醇磷脂(phosphatidylinositol): IP_3 、DG 等

钙离子(calcium ion)。

8. 受体的调节(the regulation of receptor)

(1) 受体脱敏(receptor desensitization)或称向下调节(down-regulation)是指在长期使用一种激动药后,组织或细胞对激动药的敏感性和反应性下降的现象。如异丙肾上腺素治疗哮喘产生的耐受性。

(2) 受体增敏(receptor hypersensitization)或称向上调节(up-regulation)指受体长期反复与拮抗药接触产生的受体数目增加或对药物的敏感性升高。如长期应用普萘洛尔突然停药出现的反跳现象(rebound)。

第四章 影响药物效应的因素及合理用药原则

1. 药物因素

(1) 药物剂型

(2) 联合用药及药物相互作用

① 配伍禁忌(incompatibility):指药物在体外配伍直接发生物理或化学反应而影响药物疗效或毒性反应。

② 药物相互作用(interaction):两种及两种以上药物合用产生的药效学或药动学方面的作用。协同(synergism)、拮抗(antagonism)等作用。

A 药动学方面的相互作用:吸收、血浆蛋白结合、肝脏生物转化和肾脏排泄。

B 药效学方面的相互作用:生理性协同或拮抗、受体水平的协同或拮抗及干扰递质转运。

2. 机体因素

(1) 生理因素:①年龄 新生儿、老年人药动学特点;②体重;③性别;④个体差异。

(2) 精神因素的作用及安慰剂在新药研究中的作用。

(3) 病理因素:①心脏疾病;②肝脏疾病;③肾脏疾病;④胃肠疾病;⑤营养不良;⑥酸碱平衡失调及⑦电解质紊乱。

(4) 遗传因素。

3. 机体对药物反应性变化

(1) 致敏反应(sensitization)

(2) 快速耐受性(tachyphylaxis):药物在短时间内反复应用数次后药效递减直至消失。

(3) 耐受性(tolerance):指连续用药后机体对药物的反应强度降低。

(4) 依赖性(dependence)与药物滥用(drug abuse):指长期用药后病人对药物产生主观和客观上需要连续用药的现象。仅产生精神依赖性停药后可出现习惯性(habituation),若既产生精神依赖还有身体依赖,停药可产生戒断症状者,称为成瘾性(addiction)。

(5) 耐药性(drug resistance):指病原体及肿瘤细胞等对化学治疗药物的敏感性降低,也称抗药性。

4. 合理用药原则

(1) 明确诊断。

(2) 根据药理学特点选择药物。

(3) 了解掌握影响药物作用的因素——个体化用药。

(4) 对因对症治疗并重。

(5) 对病人始终负责。

练习题

一、单选题(从以下 4~5 个备选答案中,选择 1 个最佳答案填在题干后的括号内)

1. 同一坐标上两药的 S 型量效曲线, B 药在 A 药的右侧且高出后者 20%, 下述那种评价是正确的()
A. A 药和 B 药效价强度和效能相等
B. A 药的效价强度和效能均较小
C. A 药效价强度和效能均较大
D. A 药的效价强度较大而效能较小
E. A 药的效价强度较小而效能较大
2. 弱酸性药物阿司匹林($pK_a 3.5$)和苯巴比妥($pK_a 7.4$)在胃中吸收情况哪种是正确的()
A. 均不吸收
B. 均完全吸收
C. 吸收程度相同
D. 前者大于后者
E. 后者大于前者
3. side reaction 是在下述哪种剂量时产生不良反应()
A. 治疗量
B. 无效量
C. 极量
D. LD_{50}
E. 中毒量
4. 当 X 轴为对数剂量, Y 轴为累加阳性率时, 质反应的量效反应曲线的图形为()
A. 对数曲线
B. 直线
C. 对称的 S 型曲线

- D. 对称的钟型曲线 E. 正态分布曲线
5. 遵循一级动力学消除的某药 $t_{1/2}$ 为 12 小时, 每天给药两次, 每次固定剂量, 几天后血药浓度即大于稳态的 98% ()
- A. 1.5 天 B. 2.5 天 C. 3 天
D. 3.5 天 E. 7 天
6. 药物被动转运的主要特点是()
- A. 顺浓度差进行 B. 从高浓度到低浓度 C. 不耗能
D. 不需载体 E. 以上均是
7. 促进药物生物转化的主要酶系统是()
- A. 单胺氧化酶 B. 细胞色素 P₁₅₀ 酶系统 C. 辅酶 II
D. 水解酶 E. 葡萄糖醛酸转移酶
8. 下列何种不良反应与药物的药理作用最可能无关()
- A. 副作用 B. 后遗效应 C. 致畸性
D. 致癌性 E. 变态反应
9. 评价药物安全性大小的最佳指标是()
- A. 治疗指数 B. 效价强度 C. 效能
D. 半数致死量 E. 半数有效量
10. 肝脏药物代谢酶的特点是()
- A. 专一性高 B. 个体差异小
C. 主要为细胞色素 P₁₅₀ 酶系 D. 活性稳定
E. 以上均不是
11. 药物的作用是指()
- A. 药物改变器官的功能 B. 药物改变器官的代谢
C. 药物引起机体的兴奋效应 D. 药物引起机体的抑制效应
E. 药物导致效应的始初反应
12. 首关消除主要发生在下列何种给药途径()
- A. 静脉注射 B. 肌肉注射 C. 口服
D. 吸入 E. 以上均不是
13. 下述提法哪种不正确()
- A. 药物消除是指生物转化和排泄的过程 B. 生物转化是指药物被氧化
C. 肝药酶主要是指细胞色素 P₁₅₀ 酶系统 D. 苯巴比妥具有肝药酶诱导作用
E. 西米替丁具有肝药酶抑制作用
14. 下列药物的作用哪一个是难预料的()
- A. 治疗作用 B. 副作用 C. 毒性作用
D. 后遗作用 E. 变态反应
15. 若肠道的 pH 值为 6.0, 下列何药口服最易从肠道吸收()
- A. 阿司匹林, 弱酸, pKa3.5 B. 对乙酰氨基酚, 弱酸, pKa9.5
C. 阿托品, 弱碱, pKa9.7 D. 地西洋, 弱碱, pKa3.3

- E. 麻黄碱,弱碱, $pK_a 8.7$
16. 药动学房室模型中,确定房室数目的依据()
- A. 器官的大小
B. 组织血流
C. 药物在组织器官中的转运速率
D. 药物在组织器官中的分布
E. 以上均不是
17. 质反应量-效曲线的特点不包括()
- A. 反应方式为全或无
B. 以 100% 效应率为纵轴
C. 以剂量为横轴
D. 累加量效曲线呈常态分布
E. 不能反映个体对药物的敏感性或耐受性
18. 药物代谢动力学参数中的 K_e 代表()
- A. 分布容积
B. 消除速率常数
C. 生物可用度
D. 血浆清除率
E. 以上均不是
19. 同一受体的完全激动剂、拮抗剂和部分激动剂的共同特点是()
- A. 与该受体有较高亲和力
B. 对该受体所在靶器官有较高效力
C. 均经同一代谢途径代谢
D. 均有相似的血浆蛋白结合率
E. 以上均不是
20. 恒量恒速给药最后形成的血药浓度为()
- A. 有效血药浓度
B. 稳态血药浓度
C. 峰浓度
D. 阈浓度
E. 中毒浓度
21. 按一级动力学消除的某药,其 $t_{1/2} = 5$ 小时,一次静注后至少约经多少小时可自机体排出 95% 以上的药物()
- A. 5 小时
B. 10 小时
C. 15 小时
D. 25 小时
E. 50 小时
22. 弱酸性药物在碱性尿液中()
- A. 解离多,再吸收多,排泄慢
B. 解离少,再吸收多,排泄慢
C. 解离多,再吸收少,排泄快
D. 解离少,再吸收少,排泄快
E. 以上均不对
23. 药物作用的选择性取决于()
- A. 药物剂量的大小
B. 药物脂溶性的高低
C. 药物 pK_a 的大小
D. 药物在体内的吸收
E. 组织器官对药物的敏感性
24. 以下叙述,不属于 adverse reaction 的是()
- A. 眼底检查,用后马托品引起的瞳孔扩大
B. 使用氨基糖苷类引起的肾损害
C. 久服四环素引起的伪膜性肠炎
D. 肌注 penicillin G 钾盐引起局部疼痛
E. 以上均不是
25. 代表激动剂与特定受体亲和力大小的最佳指标是()
- A. pD_2
B. pA_2
C. K_a
D. pD_2''
E. K_m
26. 某药物的 $t_{1/2}$ 为 36 小时,若按一级动力学消除,每隔一个 $t_{1/2}$ 维持量给药,该药物达到稳态血药浓度的时间是()

- A. 2 天 B. 5 天 C. 7.5 天
 D. 11 天 E. 15 天
27. 某弱酸性药物 $pK_a=3.4$,其在血浆($pH=7.4$)中的解离百分率是()
 A. 10% B. 90% C. 99%
 D. 99.9% E. 99.99%
28. 某弱碱性药物在血液中的游离型占 91%,若血液的 pH 为 7.4,该药的 pK_a 值是()
 A. 2.6 B. 4.7 C. 6.4
 D. 8.4 E. 9.3
29. 药物转运的主要形式为()
 A. 被动扩散 B. 简单扩散 C. 滤过
 D. 主动转运 E. 易化扩散
30. 肌注 atropine 治疗肠绞痛时,引起的口干属于()
 A. 治疗作用 B. 后遗效应 C. 毒性反应
 D. 变态反应 E. 副反应
31. 药物代谢主要的酶系为()
 A. 水解酶系 B. 氧化酶系 C. 结合酶系
 D. 细胞色素 P_{450} 酶系 E. 还原酶系
32. 药物安全性评价的最佳指标为()
 A. TI B. LD_{50} C. ED_{50}
 D. efficacy E. potency
33. 下列何种物质不是第二信使?()
 A. 环磷酸腺苷 B. 环磷酸鸟苷 C. 二酰甘油
 D. 钙离子 E. G 蛋白
34. 为使按一级动力学消除的药物迅速达到稳态血药浓度,并维持体内药量在 $D\sim 2D$ 之间,应采用如下哪种给药方案()
 A. 首剂给 $2D$,维持量为 $2D$,给药间隔为 $t_{1/2}$
 B. 首剂给 $2D$,维持量为 D ,给药间隔为 $2t_{1/2}$
 C. 首剂给 $2D$,维持量为 D ,给药间隔为 $t_{1/2}$
 D. 首剂给 $3D$,维持量为 D ,给药间隔为 $t_{1/2}$
 E. 首剂给 $3D$,维持量为 $2D$,给药间隔为 $t_{1/2}$
35. 下列说法正确的是()
 A. 弱碱性药物在酸性环境中易于吸收
 B. 所有的给药途径都有首关消除
 C. 药物与血浆蛋白结合后,持久失去活性
 D. 与作用于肝药酶的药物合用时,药物应增加剂量
 E. 弱酸性药在酸性环境中排泄减少
36. 已测得血药浓度,根据下列何指标可算出体内药量()
 A. $t_{1/2}$ B. ED_{50} C. CL