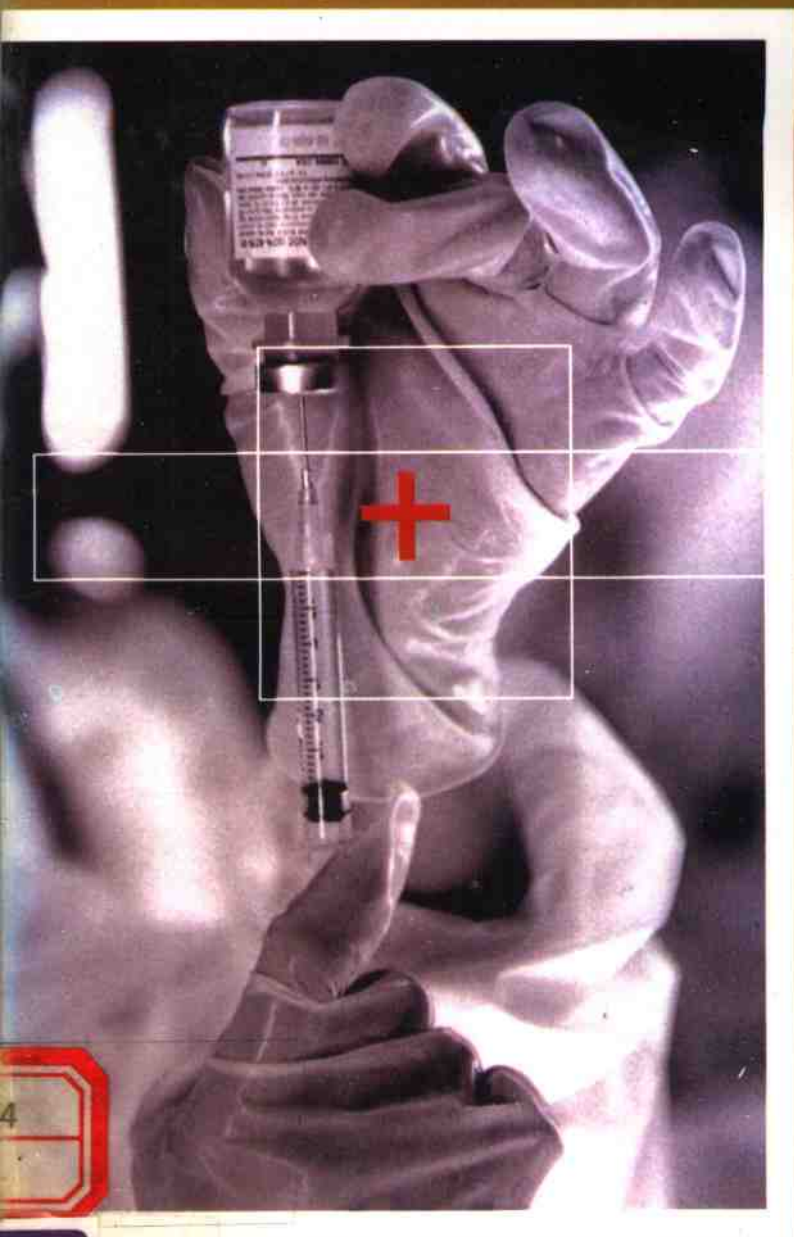


全国高等教育自学考试指定教材辅导用书
高等教育自学考试同步辅导 / 同步训练

药 理 学

欧阳冬生 刘金云 主编



中国人事出版社



全国高等教育自学考试指定教材辅导用书
高等教育自学考试同步辅导/同步训练

药 理 学

全国高等教育自学考试指定教材辅导用书编委会 组编

主 编 欧阳冬生 刘金云
编 者 欧阳冬生 刘金云 严 谨 程泽能
陈国林 王九辉 苑立伟 何彩云
肖 珺

中国人事出版社

图书在版编目(CIP)数据

高等教育自学考试同步辅导·同步训练:药理学:
护理专业/欧阳冬生等主编. — 北京:中国人事出版社,1999. 8
ISBN 7-80139-362-7

I. 高… II. 欧… III. 药理学-高等教育-自学考试-自
学参考资料 IV. G642. 479

中国版本图书馆 CIP 数据核字(1999)第 30038 号

版权所有,翻印必究。
本书封面贴有防伪标签,无标签者不得销售。
(如有缺页和倒装,本社负责退换)

说 明

本丛书是全国高等教育(护理学专业)自学考试大纲、教材的配套辅导用书。

本书的编写依据:

1. 全国高等教育自学考试指导委员会颁布的《药理学自学考试大纲》;
2. 指定教材《药理学》(全国高等教育自学考试指导委员会组编)。

本书的特点:

本书以自学考试大纲规定的考核知识点及能力层次为线索,按指定教材分章辅导,将自学考试中每一章节可能出现的所有考核知识点按考试题型编写同步练习题,最后附两套模拟试题。

本书在突出重点难点、准确解答疑点的同时,兼顾学科的系统性,对于考生深入学习指定教材的内容,深刻领会考试大纲、教材的精髓,正确解答各种题型,富有切实的指导意义。

编者均为高校从事相应学科教学和研究工作的专家、学者,并具有丰富的自学考试考前辅导经验。

一分耕耘,一分收获,祝有志于自学的朋友能在考试中取得优异成绩。

编 者

1999年6月

目 录

第一章 药理学的基本规律及其在实践中的重要意义	(1)
考核知识点提示	(1)
同步练习	(1)
参考答案	(7)
第二章 传出神经系统药理学	(10)
考核知识点提示	(10)
同步练习	(10)
参考答案	(19)
第三章 局部麻醉药	(24)
考核知识点提示	(24)
同步练习	(24)
参考答案	(27)
第四章 全身麻醉药	(29)
考核知识点提示	(29)
同步练习	(29)
参考答案	(31)
第五章 镇静催眠药	(32)
考核知识点提示	(32)
同步练习	(32)
参考答案	(37)
第六章 抗癫痫药及抗惊厥药	(39)
考核知识点提示	(39)
同步练习	(39)
参考答案	(42)
第七章 抗精神失常药	(43)
考核知识点提示	(43)
同步练习	(43)
参考答案	(47)
第八章 抗震颤麻痹药	(49)
考核知识点提示	(49)
同步练习	(49)
参考答案	(52)
第九章 解热镇痛抗炎药	(53)

考核知识点提示	(53)
同步练习	(53)
参考答案	(55)
第十章 镇痛药	(58)
考核知识点提示	(58)
同步练习	(58)
参考答案	(61)
第十一章 中枢兴奋药	(64)
考核知识点提示	(64)
同步练习	(64)
参考答案	(69)
第十二章 抗心律失常药	(71)
考核知识点提示	(71)
同步练习	(71)
参考答案	(75)
第十三章 强心甙	(78)
考核知识点提示	(78)
同步练习	(78)
参考答案	(82)
第十四章 核心绞痛药	(84)
考核知识点提示	(84)
同步练习	(84)
参考答案	(88)
第十五章 抗动脉粥样硬化药	(89)
考核知识点提示	(89)
同步练习	(89)
参考答案	(90)
第十六章 抗高血压药	(91)
考核知识点提示	(91)
同步练习	(91)
参考答案	(94)
第十七章 利尿药及脱水药	(96)
考核知识点提示	(96)
同步练习	(96)
参考答案	(99)
第十八章 作用于消化系统的药物	(101)
考核知识点提示	(101)
同步练习	(101)

参考答案·····	(104)
第十九章 抗喘、镇咳和祛痰药 ·····	(106)
考核知识点提示·····	(106)
同步练习·····	(106)
参考答案·····	(109)
第二十章 子宫兴奋药 ·····	(110)
考核知识点提示·····	(110)
同步练习·····	(110)
参考答案·····	(112)
第二十一章 作用于血液及造血器官的药物 ·····	(113)
考核知识点提示·····	(113)
同步练习·····	(113)
参考答案·····	(117)
第二十二章 组胺和抗组胺药 ·····	(118)
考核知识点提示·····	(118)
同步练习·····	(118)
参考答案·····	(119)
第二十三章 肾上腺皮质激素类药物 ·····	(121)
考核知识点提示·····	(121)
同步练习·····	(121)
参考答案·····	(124)
第二十四章 性激素类药及避孕药 ·····	(127)
考核知识点提示·····	(127)
同步练习·····	(127)
参考答案·····	(130)
第二十五章 甲状腺激素与抗甲状腺药 ·····	(131)
考核知识点提示·····	(131)
同步练习·····	(131)
参考答案·····	(134)
第二十六章 胰岛素和口服降血糖药 ·····	(135)
考核知识点提示·····	(135)
同步练习·····	(135)
参考答案·····	(138)
第二十七章 磺胺类药物及其他人工合成抗菌药 ·····	(139)
考核知识点提示·····	(139)
同步练习·····	(139)
参考答案·····	(142)
第二十八章 抗生素 ·····	(144)

考核知识点提示.....	(144)
同步练习.....	(144)
参考答案.....	(151)
第二十九章 抗真菌药及抗病毒药	(155)
考核知识点提示.....	(155)
同步练习.....	(155)
参考答案.....	(157)
第三十章 抗结核病药和抗麻风病药	(159)
考核知识点提示.....	(159)
同步练习.....	(159)
参考答案.....	(162)
第三十一章 抗阿米巴病药和抗滴虫病药	(163)
考核知识点提示.....	(163)
同步练习.....	(163)
参考答案.....	(166)
第三十二章 抗肠道蠕虫药	(167)
考核知识点提示.....	(167)
同步练习.....	(167)
参考答案.....	(170)
第三十三章 抗恶性肿瘤药	(171)
考核知识点提示.....	(171)
同步练习.....	(171)
参考答案.....	(173)
模拟试卷 (一)	(175)
参考答案.....	(177)
模拟试卷 (二)	(180)
参考答案.....	(182)

第一章 药理学的基本规律及其在实践中的重要意义

考核知识点提示

药理学是研究药物与机体（含病原体）相互作用规律的一门学科。主要包括药物代谢动力学和药物效应动力学。它运用医学的基础理论知识，阐明药物作用的原理，为临床合理用药奠定基础。药理学在护理工作中具有重要意义。

药物代谢动力学研究机体对药物的处置。药物的转运及影响因素，主动转运和被动转运及其特点。药物的吸收、分布、代谢和排泄。药物与血浆蛋白质结合，血脑屏障、胎盘屏障。肝药酶及其诱导与抑制，pH 值对药物解离的影响及其意义。时量关系，首关效应，生物利用度，肝肠循环，半衰期，消除速度常数，表现分布容积， pK_a ，稳态血药浓度，负荷剂量与首次剂量加倍。

药物效应动力学研究药物对机体的作用。药物的量效关系，量反应、质反应，量效关系曲线，效价强度和效能，LD₅₀，ED₅₀。治疗指数。受体，配体，受体的向上调节和向下调节，激动剂，拮抗剂，部分激动剂，部分拮抗剂。停药反跳，耐受性，药物受体作用选择性与药物不良反应。

药物相互作用，酶诱导剂和抑制剂与临床用药。

同步练习

一、单项选择题

1. 药理学是研究()的科学。
A. 药物对机体作用
B. 机体对药物影响
C. 药物与机体（含病原体）相互作用的规律与原理
D. 药物的结构与功能
2. 药动学主要研究()。
A. 机体对药物的处置
B. 药物对机体的影响
C. 药物的生物转化
D. 合理用药
3. 药效学主要研究()。
A. 机体对药物的处置
B. 药物的临床疗效
C. 药物的时—量关系
D. 药物的效应及其机制
4. 关于被动转运的特点，下列哪项描述是错误的？()
A. 消耗能量
B. 无饱和性

- C. 无竞争抑制现象 D. 大多数药物转运属被动转运
5. 关于主动转运的特点正确的是()。
- A. 需要消耗能量 B. 不依赖于膜两侧的药物浓度差
C. 需要载体 D. 以上答案都正确
6. 关于 pK_a 下列描述正确的是()。
- A. pK_a 即酸性或碱性药物 50% 解离时的溶液的 pH 值
B. 各药的 pK_a 可因外界温度不同而发生变化
C. $pK_a = pH - \log \frac{[\text{解离型}]}{[\text{非解离型}]}$
D. 药物的 pK_a 越大, 药物越易通过生物膜
7. $pH - pK_a = 1$ 时, 弱酸性药物有()解离。
- A. 50% B. 90% C. 99% D. 1%
8. 丙磺舒与青霉素()。
- A. 在代谢过程中存在竞争抑制 B. 在吸收过程中存在竞争抑制
C. 在排泄上存在竞争抑制 D. 竞争血浆蛋白结合
9. 利尿酸可诱发痛风, 因为()。
- A. 利尿酸可抑制尿酸的排泄 B. 利尿酸可加速尿酸的排泄
C. 利尿酸可促进尿酸的合成 D. 利尿酸可减少尿酸的合成
10. 关于药物的生物转化下列哪项是错误的()。
- A. 药物经转化后活性消失 B. 药物的转化有赖于酶的催化
C. 一种药物代谢酶不一定只催化一类药物的生物转化
D. 生物转化是药物的消除方式之一
11. 肝药酶()。
- A. 仅存在于肝脏 B. 活性存在个体差异
C. 活性主要受年龄因素的影响 D. 活性在同一个个体终生不变
12. 下列哪个药物为肝药酶的诱导剂?()
- A. 巴比妥 B. 西米替丁 C. 氯霉素 D. 异烟肼
13. 下列哪个药物为肝药酶的抑制剂?()
- A. 利福平 B. 异烟肼 C. 苯妥因钠 D. 青霉素
14. 药物的吸收是指()。
- A. 从用药部位进入血液的过程 B. 从血液时入器官、组织和细胞的过程
C. 从用药部位进入作用部位的过程 D. 从作用部位进入血液的过程
15. 关于零级动力学消除, 正确的说法是()。
- A. 半衰期有固定值
B. 多数药物的消除属零级动力学消除
C. 恒速给药经过 5 个半衰期后达到稳态血药浓度
D. 单位时间内消除的药物量相同, 故又称定量消除
16. 关于一级动力学消除, 下列哪项描述是错误的?()
- A. 体内多数药物按一级动力学消除 B. 半衰期没有固定值。
C. 又可称为定比消除

- D. 恒速给药经过 5 个半衰期后达到稳态血药浓度
17. 半衰期()。
- A. 不同的药物具有相同的半衰期 B. 它是表示药物消除速度的一个参数
C. 它是表示药物生物转化速度的一个参数 D. 它与药物在体内的排泄没有关系
18. 关于房室概念, 错误的说法是()。
- A. 与生理学上的体液房室概念相同
B. 药理学上的房室只是一个抽象的概念
C. 房室的划分取决于药物在体内的转运及或转化速率
D. 若时量曲线表现为一直线, 可将机体视为单一房室
19. 一次用药经过 2 个半衰期后在体内的存留量为()。
- A. 50% B. 25% C. 75% D. 0%
20. 关于表观分布容积, 下列说法正确的是()。
- A. 是指药物在体内占有的体液容积 B. 是药效学的重要参数之一
C. 从表观分布容积可以了解药物在体内的分布情况
D. 表观分布容积大于 100L 则表示药物分布于全身体液
21. 关于稳态血药浓度 (C_{ss}) 下列说法错误的是()。
- A. 恒速给药经过 4~6 个半衰期后血药浓度达到稳态
B. 缩短用药的时间间隔不能缩短达到 C_{ss} 的时间
C. 增加单次给药的剂量可缩短达到 C_{ss} 的时间
D. 增加单次给药的剂量可提高 C_{ss} 值
22. 静脉给药时 C_{ss} ()。
- A. 与静滴速度成正比, 与半衰期成反比 B. 与静滴速度和半衰期成正比
C. 与静滴速度和半衰期成反比 D. 与静滴速度成反比, 与半衰期成正比
23. 为使血浆药物浓度提前达到 C_{ss} 可采取()。
- A. 给药前应用一次负荷剂量 B. 缩短给药间隔
C. 加大每次给药剂量 D. 以上都不是
24. 药效学的研究内容不包括()。
- A. 药物的剂量与效应之间的关系 B. 药物的吸收与分布
C. 药物的生理生化效应 D. 药物的不良反应
25. 肾上腺素引起血管收缩, 血压升高称为该药物的()。
- A. 效应 B. 作用 C. 治疗作用 D. 不良反应
26. 关于量效关系, 下列说法错误的是()。
- A. 药物效应与其剂量的关系称量效关系
B. 量效曲线是用于反映量效关系的曲线
C. 药物的效应强度与药物的剂量成正比
D. 药物只有达到了最小效应量或浓度时才能产生效应
27. 下列哪项药物效应属量反应? ()
- A. 血压升高的 mmHg B. 心率增减的次数
C. 尿量增减的毫升数 D. 以上都是
28. 下列哪项药物效应属质反应? ()

- A. 死亡或治愈
B. 药物作用维持的时间
C. 心率增减的次数
D. 血红蛋白的增加量
29. 效能是()。
A. 药物达到一定剂量或浓度时产生的效应
B. 药物所能产生的最大效应
C. 与药物浓度密切相关的药物效应指标
D. 以上都不是
30. 关于受体下列哪项是错误的?()
A. 是存在于生物体内的一种特殊物质
B. 能与其特异性结合的物质称为配体
C. 配体与受体间均以氢键结合
D. 受体的性质和数量变化可导致疾病
31. 激动剂的特点是()。
A. 具有亲和力和较大的内在活性 ($\alpha=1$)
B. 具有亲和力但无内在活性 ($\alpha=0$)
C. 既无亲和力又无内在活性 ($\alpha=0$)
D. 具有亲和力, 且具有一定的内在活性 ($0<\alpha<1$)
32. 拮抗剂的特点是()。
A. 具有亲和力和较大的内在活性 ($\alpha=1$)
B. 具有亲和力但无内在活性 ($\alpha=0$)
C. 既无亲和力又无内在活性 ($\alpha=0$)
D. 具有亲和力, 且具有一定的内在活性 ($0<\alpha<1$)
33. 下列关于部分激动剂的说法错误的是()。
A. 具有较强的亲和力和较弱的内在活性
B. 单独使用时表现出较弱的激动作用
C. 与激动剂合用时表现出拮抗作用
D. 吗啡为部分激动剂
34. 关于受体的调节, 下列说法正确的是()。
A. 受体的数目和反应性可以发生变化
B. 长期使用受体激动剂可导致向上调节
C. 长期使用受体拮抗剂可导致向上调节
D. 受体调节仅限于受该药作用同类受体
35. 下列哪种现象与受体调节有关()。
A. 停用 β 受体阻滞剂后血压升高
B. 使用 β 受体阻滞剂后心率减慢
C. 吗啡与镇痛新合用后镇痛作用减弱
D. 青霉素所致的过敏性休克

二、多项选择题

1. 药物的处置包括()。
A. 吸收
B. 分布
C. 生物转化
D. 排泄
E. 与受体结合
2. 下列哪些因素可影响药物的被动转运?()
A. 药物的分子量
B. 药物的脂溶性
C. 药物的极性
D. 药物的解离状态
E. 膜两侧的药物浓度
3. 下列哪些药物可诱导肝药酶的活性?()
A. 苯妥英钠
B. 利福平
C. 异烟肼
D. 洋地黄毒甙
E. 安定
4. 关于 pH 值对药物解离的影响下说法正确的是()。
A. $\text{pH}-\text{pK}_a=0$ 时, 则有 100% 的药物解离
B. 弱酸性药物在 pH 高的环境中解离少, 不易经膜转运
C. 弱碱性药物在 pH 高的环境中解离多, 容易经膜转运
D. 当 pH 值与 pK_a 值的差值以数学值增减时, 解离型药物与未解离药物的浓度比值以指

数值变化

E. 离子形式的药物比分子形式的药物更难经膜被动转运

5. 主动转运的特点包括()。

A. 消耗能量

B. 需要载体

C. 属一级动力学过程

D. 转运能力有饱和性

E. 存在着竞争性抑制

6. 下列哪些过程属主动转运?()

A. 丙磺舒排泄

B. 青霉素排泄

C. 利尿酸排泄

D. 尿酸排泄

E. 肾小管对水的重吸收

7. 下列哪些药物可抑制酶的活性?()

A. 保泰松

B. 西米替丁

C. 异烟肼

D. 氟霉素

E. 苯巴比妥

8. 按零级动力消除的特点()。

A. 药物自体内按恒定的速度消除

B. 血浆半衰期可变化

C. 消除速度与药物浓度相关

D. 消除速度与药物浓度无关

E. 是进入体内药物多, 超过了机体消除药物的能力

9. 药物的作用机制包括()。

A. 改变内环境的理化性质

B. 干扰或参与机体的代谢过程

C. 影响生物膜

D. 影响生理性递质或激素

E. 影响激素与受体的相互作用

10. 配体与受体结合的化学力包括()。

A. 共价键结合

B. 离子键结合

C. 偶极键结合

D. 氢键结合

E. 范德华引力

三、填空题

1. 药理学是研究药物与机体相互作用的学科。药物对机体的作用称为_____, 机体对药物的影响称为_____。

2. 药物的转运与转化称为药物的_____。

3. 一些能被肝药酶转化的药物本身又是一种酶诱异剂, 这可能是该药久用后产生_____的原因之一。

4. 由于分布、代谢和排泄, 药物浓度衰减称为药物的_____。

5. 恒速给药经_____个半衰期后, 血药浓度达到稳态。

6. 从表观分布容积可了解药物在体内的分布情况。如为 5L 则表示药物基本分布于_____; 10L 表示药物分布于_____; 40L 表示药物分布于_____; 100L 以上表示药物集中分布于某一器官。

7. 给药速度与消除速度达到平衡, 此时的血药浓度即_____。

8. 药物效应与剂量的关系称_____。

9. 药物所能产生的最大效应称_____。

10. 药物与受体的结合决定于药物对受体的_____, 结合后能否产生效应决定于该药是否具有_____。

11. 哮喘病人长期应用受体激动剂后可引起该药作用减弱产生耐受性, 这可能与受体的_____有关。

12. 停药“反跳”现象常与受体_____调节有关。

13. 药物与血浆蛋白结合后, 药理活性暂时_____ ; 药物与血浆蛋白结合的特_____, 两个药物可能因竞争同一蛋白结合而产生_____现象。

14. 生物利用度是指药物经首关消除后进入体循环的_____和_____。

四、名词解释题

1. 药理学

2. 药动学

3. 药效学

4. pK_a

5. 主动转运

6. 被动转运

7. 零级消除动力学

8. 一级消除动力学

9. 表观分布容积 (Vd)

10. 半衰期 ($t_{1/2}$)

11. 首次剂量加倍

12. 稳态血药浓度

13. 量效关系

14. 半数致死量 (LD_{50})

15. 半数有效量 (ED_{50})

16. 最小有效浓度

17. 效能

18. 向上调节

19. 向下调节

20. 肝药酶

21. 激动剂

22. 拮抗剂

23. 部分激动剂

24. 部分拮抗剂

25. 肝药酶诱导剂

26. 肝药酶抑制剂

27. 同类受体调节

28. 异类受体调节

29. 受体

30. 配体

31. 药物的消除

32. 药物的处置

33. 药物的转运

34. 首过效应

35. 血脑屏障

36. 胎盘屏障

37. 肝肠循环

38. 生物利用度

39. 消除速率常数

40. 效价强度

41. 治疗指数

42. 量效关系曲线

五、简答题

1. 简述药物经肝转化后其生物活性的变化。

2. 简述胃肠液 pH 值变化对弱酸性和弱碱性药物吸收的影响。

3. 主动转运的特点。

4. 简述引起肝药酶活性个体差异的因素。

5. 简述药物作用的机制

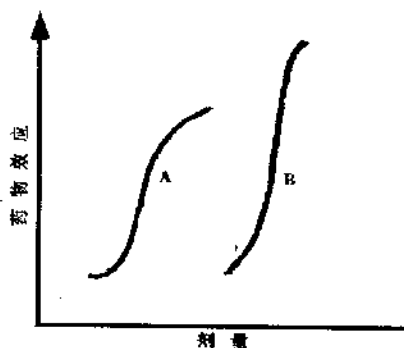
6. 从受体调节角度解释停药“反跳”现象和耐受性。

六、论述题

1. 举例说明药物与受体作用的选择性与药物不良反应的关系。

2. 长期服用利福平或异烟肼的结核病患者, 在使用口服抗凝药双香豆素时可能发生什么结果? 为什么?

3. 比较图 1 中 A、B 两药的效价强度和效能。



(图 1)

参考答案

一、单项选择题

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

二、多项选择题

- | | | | | |
|---------|----------|---------|----------|-----------|
| 1. ABCD | 2. ABCDE | 3. AB | 4. DE | 5. ABE |
| 6. ABCD | 7. ABCD | 8. ABDE | 9. ABCDE | 10. ABCDE |

三、填空题

- | | |
|----------------------------|------------------|
| 1. 药效学 药动学 | 2. 处置 |
| 3. 耐受性 | 4. 消除 |
| 5. 5 | 6. 血浆 红细胞外液 全身体液 |
| 7. 稳态血药浓度 | 8. 量效关系 |
| 9. 效能 | 10. 亲和力 内在活性 |
| 11. 向下调节(或受体数目减少,或受体敏感性降低) | |
| 12. 向上调节 | 13. 消失 低 置换 |
| 14. 相对量(或剂量)速度 | |

四、名词解释题

1. 药理学: 是研究药物与机体(含病原体)相互作用规律的学科。
2. 药动学: 药物在机体影响下发生的变化及规律, 即药物代谢动力学。是药理学的一个组成部分。
3. 药效学: 药物对机体的作用及其原理, 即药物效应动力学。是药理学的一个组成部分。
4. pK_a : 即弱酸性或弱碱性药物 50% 解离时的溶液的 pH 值。
5. 主动转运: 药物依赖载体, 消耗能量, 从生物膜浓度低的一侧向浓度高的一侧运转称主动转运。
6. 被动转运: 药物依赖生物膜两侧的浓度差, 从高浓度一侧向低浓度一侧进行的扩散性运动称被动转运。
7. 零级消除动力学: 用药量过多, 超过了机体消除能力, 机体以最大速度进行恒量消除, 称零级消除动力学。
8. 一级消除动力学: 即机体内药物单位时间按恒定比例进行消除, 又称恒比消除。
9. 表观分布容积: 是通过体内药物总量与血浆浓度计算出来的理论参数, 表示药物理论上应占有的体液容积, 而非药物在体内真正占有的体液容积, 故称“表观”分布容积。
10. 半衰期: 一般指血浆药物浓度下降一半所需的时间。
11. 首次剂量加倍: 为使血药浓度迅速达到稳态血药浓度, 首次给予负荷剂量。一般说来, 口服药物, 如服药间隔与其 $t_{1/2}$ 接近时, 其负荷剂量为常规剂量的一倍, 此即“首次剂量加倍”。

12. 稳态血药浓度：恒速恒量给药，经过4~6个 $t_{1/2}$ 后，给药速度与消除速度达到平衡，血药浓度维持在一定水平，此时的血药浓度即稳态血药浓度。
13. 量效关系：药物效应的强弱与药物的剂量或浓度呈一定的关系，即量效关系。
14. 半数致死量：引起半数动物死亡的浓度或剂量称半数致死量。
15. 半数有效量：引起50%阳性反应或50%最大效应的药物浓度或剂量称半数有效量。
16. 最小有效浓度：药物产生效应所需的最小药物浓度称最小有效浓度。
17. 效能：药物所能产生的最大效应称为效能。
18. 向上调节：受体周围的生物活性物质浓度低或强大长期的阻滞作用时，可使受体数目增加，称为向上调节或上增调节。
19. 向下调节：受体周围的生物活性物质浓度高或强大，长期的激动作用时，可使受体数目减少称为向下调节或衰减性调节。
20. 肝药酶：肝脏微粒体混合功能酶系统主要存在于肝细胞内质网中，故又称肝药酶。该系统主要的酶为细胞色素—p450。
21. 激动剂：既具有亲和力和，又具有内在活性($\alpha=1$)的药物。
22. 拮抗剂：仅具有亲和力，不具有内在活性($\alpha=0$)的药物。
23. 部分激动剂：具有较强的亲和力和较弱的内在活性($0<\alpha<1$)的药物，单独使用时表现以激动为主的效应，如镇痛新。
24. 部分拮抗剂：具有较强的亲和力和较弱的内在活性($0<\alpha<1$)，使用时表现以拮抗作用为主，同时还有一定激动作用的药物，如心得平。
25. 肝药酶诱导剂：引起肝药酶活性增强的化学物质或药物称肝药酶诱导剂。
26. 肝药酶抑制剂：引起肝药酶活性减弱的化学物质（或药物）称肝药酶抑制剂。
27. 同类受体调节：受体调节表现于同类受体如 β -受体阻滞剂或 β -受体激动剂可使 β -受体发生向上或向下调节，称为同类受体调节。
28. 异类受体调节：受体调节表现于不同类受体，如去甲肾上腺素引起的细胞对前列腺素的反应降低，称为异类受体调节。
29. 受体：存在于细胞膜、胞浆等的蛋白质大分子，具有严格的立体专一性，具有能识别和结合特异分子（配体）的位点。这种细胞成分称为受体。
30. 配体：能与受体特异性结合的物质通称为配体（或配基）。
31. 药物的消除：进入血液循环的药物，由于分布、代谢和排泄过程而使血药浓度衰减称为药物的消除。
32. 药物的处置：药物的吸收、分布、代谢和排泄总称为药物的处置。
33. 药物的转运：药物通过生物膜的过程称药物的转运或跨膜转运。
34. 首过效应：有些药物，首次通过肝脏时发生生物转化，进入体循环量减少，称首过效应或第一关卡效应或首关消除。
35. 血脑屏障：组织学上血脑屏障是由血—脑、血—脑脊液及脑脊液—脑等三种屏障的总称，实际上阻碍药物穿透的主要是前两者。
36. 胎盘屏障：是胎盘绒毛与子宫血窦间的屏障。
37. 肝肠循环：有些药物在肝脏与葡萄糖醛酸等结合后排入胆汁，随胆汁达到小肠后被水解，游离药物被重吸收，称为肝肠循环。
38. 生物利用度：一般指口服药物给药后被吸收进入体循环的相对量和速度：

$F(\text{生物利用度}) = \text{吸收进入体循环药量} / \text{给药剂量}$

39. 消除速率常数: 单位时间内药物消除的百分率。

40. 效价强度: 引起等效反应(一般采用 50% 效应量)的相对药物浓度或剂量。反映药物与受体的亲和力, 其值越小, 则强度越大。

41. 治疗指数: 半数中毒量或浓度与半数有效量或浓度的比值。它是反映药物安全性的指标。

42. 量效关系曲线: 以药物的效应为纵座标, 药物的浓度或剂量为横座标做图即为量效关系曲线。如果效应为量反应则曲线为“量反应”量效关系曲线; 如果效应为质反应指标, 则曲线为“质反应”量效关系曲线。

五、简答题

1. 答: 药物经肝脏转化后, 其生物活性可消失、增强(或产生活性)或保持不变。

2. 答: 胃肠液 pH 值增高, 弱酸性药物解离增加; 胃肠吸收减少; pH 值降低, 弱酸性药物解离减少, 胃肠吸收增多。pH 值的改变对弱碱性药物吸收的影响规律与弱酸性药物相反。

3. 答: ①消耗能量; ②需要载体; ③不依赖膜两侧的药物浓度差; ④载体有特异性选择性和饱和性。

4. 答: ①先天因素(遗传因素); ②年龄、营养状态、机能状态、疾病状态; ③肝药酶诱导剂和抑制剂的影响。

5. 答: 药物作用的机制主要包括: ①改变细胞周围环境的理化性质; ②干扰或参与代谢过程; ③对生物膜的影响; ④对生理递质或激素的影响; ⑤与受体的相互作用。

6. 答: 长期使用受体激动剂, 可引起受体的数量减少(向下调节), 导致该受体对药物的敏感性降低, 出现减敏、去敏或耐受现象。相反, 长期使用拮抗剂, 可使用受体产生向上调节, 表现为该受体对生物活性物质的敏感性增高, 出现增敏或高敏或出现停药反跳现象。

六、论述题

1. 答: 某些与受体相互作用产生效应的药物的不良反应往往与其对各种受体亚型的选择性不强有关。如氯丙嗪治疗精神病时, 由于其作用选择性不强, 在作用于边缘系统的多巴胺受体产生抗精神作用的同时, 也可阻断纹状体的多巴胺受体产生以震颤为主的症状及运动障碍。此外, 氯丙嗪可阻断乙酰胆碱受体, 肾上腺素受体和 5-HT 受体, 产生体位性低血压, 鼻塞、口干、便秘、嗜睡、淡漠、反应迟钝等药物不良反应。

2. 答: 长期服用利福平的患者, 在使用口服抗凝药双香豆素时可能出现疗效降低或治疗失败。这是因为利福平是一种肝药酶诱导剂, 长期服用利福平可引起肝药酶的活性增高, 导致双香豆素在体内代谢加快, 故按常规剂量用药可能出现疗效降低或治疗失败。相反, 如服用异烟肼, 在使用口服抗凝药双香豆素时可能出现抗凝作用增强或出血倾向。这是因为异烟肼是肝药酶抑制剂, 其对双香豆素代谢的影响与利福平刚好相反。

3. 答: ①效价强度的概念; ②效能的概念; ③效能: A 药 < B 药; 效价强度: A 药 > B 药。