

21世纪高等医学院校
学习指南系列

药理学学习指南

主编 刘吉成

Yaolixue Xuexi Zhinan

21世纪高等医学院校学习指南系列



第二军医大学出版社

21 世纪高等医学院校学习指南系列

药理学学习指南

主 编 刘吉成

副主编 崔红霞 李清漪 杨宏艳

主 审 许 莉

编 者 (以姓氏笔画为序)

王玉春 王春波 刘吉成

齐占鹏 许 莉 孙 超

李清漪 杨宏艳 苏富琴

宋 娟 张全明 苗 术

林 宇 岳苏华 赵学梅

爱 民 崔红霞

第二军医大学出版社

内 容 提 要

本书每章分三大部分内容。第一部分为“重点难点提要”,以文字概括或图表归纳或框架图示的方法精炼了药理学的重点、难点内容,突出了大纲要求,使读者对重点、难点一目了然,便于理解和记忆。第二部分为“自测题”,全书共 3 503 道测试题(含综合试题 58 道),内容涵盖药理学基本概念及各药物的作用特点、机制、临床应用和不良反应,题型包括多选题(A 型题、B 型题、C 型题、X 型题)、概念题、填空题、简答题和论述题。第三部分为“参题答案”。全书内容简明新颖,实用性强,既可作为医药院校研究生、本科生教学参考用书,又可作为医药卫生工作者案头参考书,对学生复习、预习和考试以及执业医师资格考试、研究生入学考试均有帮助。

图书在版编目(CIP)数据

药理学学习指南/刘吉成主编.——上海:第二军医大学出版社,2007.1

ISBN 7-81060-630-1

I. 药... II. 刘... 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(2006)第 089589 号

药 理 学 学 习 指 南

主 编 刘吉成

责任编辑 高 标 倪竞权

第二军医大学出版社出版发行

上海市翔殷路 800 号 邮政编码:200433

发行科电话/传真:021-65493093

全国各地新华书店经销

上海锦佳印刷装璜发展公司印刷

开本:787×1 092 1/16 印张:19.75 字数:473 千字

2006 年 12 月第 1 版 2007 年 1 月第 2 次印刷

印数:3 001~6 000 册

ISBN 7-81060-630-1/R·481

定价:36.60 元

学 习 指 南 系 列

编 委 会

主 任 委 员 刘 吉 成

副 主 任 委 员 张 晓 杰

委 员 (以姓氏笔画为序)

王淑清 刘金煜 刘新堂

孙要武 孙迎春 李 涛

李 莉 李荐中 李静平

杨立群 张 浩 张春娣

张淑丽 苗 术 孟宪洪

崔光成 潘洪明

秘 书 云长海 李福森 韩 霜

前 言

《药理学学习指南》是以全国高等医药教材建设研究会、卫生部规划教材最新版《药理学》为蓝本,参考《全国执业医师考试大纲》、《全国执业药师考试大纲》的要求,以及国内知名院校最新协编教材和硕士、博士生入学考试试题等,由多年从事药理学教学工作、经验丰富的教师编写而成。

本书以文字概括或图表归纳或框架图示的写法精炼了每章的重点、难点内容,突出了大纲要求,使读者对重点、难点一目了然,便于理解和记忆。同时本书注重理论联系实际,体现了综合性、设计性和创新性的知识,同时注意基础与临床的联系,每章都适当增加了用药病例试题,拓宽了学生的知识面。在编写内容上以药理学的基本知识、基本理论为基础,突出重点,兼顾一般,是医学生学习和教师备课的良师益友。本书适用性强,对学生复习、预习和考试以及执业医师资格考试有一定帮助。

全书按《药理学》六版教材顺序,以章为单元,共编辑 3 503 道试题。习题内容涵盖药理学基本概念以及各章药物的作用特点、机制、临床应用和不良反应。习题包括多选题(A 型题、B 型题、C 型题、X 型题)、概念题、填空题、简答题和论述题。最后一章为综合试题,将不同章节的内容横向联系,着重于相似易混淆的知识内容的综合比较。

本书取题代表性强,拟题严谨,力图少而精。全体编写人员倾注了大量的精力。尽管如此,由于我们的水平有限,编写不足之处在所难免,恳请广大读者多提宝贵意见,以便再版时修正。

参加编书的单位有齐齐哈尔医学院、青岛医学院、内蒙古医学院、郑州科技大学医学院。在本书编写过程中,得到了编写单位领导及有关专家的关心、支持与指导,在此表示衷心的感谢。

编 者

2006 年 7 月

答题说明

1. 名词解释:根据新版教材中的定义、解释,准确回答。

2. 填空题:要求答案简洁明了。

3. 判断是非题:判断一段文字描述的对错,回答“对(√)”或“错(×)”,无需解题。

4. 选择题:

A 型题:从 5 个备选答案中选出 1 个最合适的答案。

B 型题:属配伍题,即多个问题共用 5 个备选答案,从中选出 1 个最佳答案,每个备选答案可选一次、多次或不选。

C 型题:多个问题共用 4 个备选答案,从中选出 1 个最佳答案,每个备选答案可选一次、多次或不选。

X 型题:为多项选择题:共有 5 个备选答案,从备选答案中挑选 2 个或 2 个以上正确答案。

5. 简答题:要求答案条理清晰,言简意赅,内容全面。

6. 论述题:要求论点明确,层次清楚,论述合理。

目 录

第一章	药理学总论——绪言	(苏富琴 王春波)(1)
第二章	药物代谢动力学	(苏富琴 王春波)(4)
第三章	药物效应动力学	(苏富琴 王春波)(14)
第四章	影响药物效应的因素	(苏富琴 王春波)(25)
第五章	传出神经系统药理概论	(杨宏艳)(29)
第六章	胆碱受体激动药	(杨宏艳)(35)
第七章	抗胆碱酯酶药和胆碱酯酶复活药	(杨宏艳)(41)
第八章	胆碱受体阻断药(Ⅰ)——M胆碱受体阻断药	(杨宏艳)(48)
第九章	胆碱受体阻断药(Ⅱ)——N胆碱受体阻断药	(杨宏艳)(54)
第十章	肾上腺素受体激动药	(李清漪)(58)
第十一章	肾上腺素受体阻断药	(李清漪)(65)
第十二章	中枢神经系统药理学概论	(杨宏艳)(71)
第十三章	全身麻醉药	(杨宏艳)(77)
第十四章	局部麻醉药	(宋 娟)(84)
第十五章	镇静催眠药	(宋 娟)(88)
第十六章	抗癫痫药和抗惊厥药	(宋 娟)(92)
第十七章	治疗中枢神经系统退行性疾病药	(宋 娟)(98)
第十八章	抗精神失常药	(杨宏艳)(103)
第十九章	镇痛药	(林 宇)(112)
第二十章	解热镇痛抗炎药	(林 宇)(120)
第二十一章	离子通道及钙通道阻滞药	(崔红霞)(128)
第二十二章	抗心律失常药物	(刘吉成 崔红霞)(135)
第二十三章	肾素——血管紧张素系统药理	(崔红霞 刘吉成)(145)
第二十四章	利尿药和脱水药	(刘吉成 崔红霞)(153)
第二十五章	抗高血压药	(崔红霞 刘吉成)(161)
第二十六章	治疗充血性心力衰竭的药物	(刘吉成 崔红霞)(171)

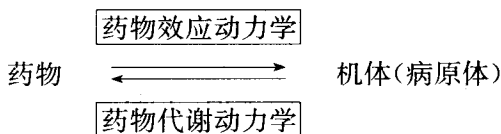
第二十七章	抗心绞痛药	(刘吉成 崔红霞)	(181)
第二十八章	调血脂药与抗动脉粥样硬化药	(林 宇)	(188)
第二十九章	作用于血液及造血器官的药物	(林 宇)	(191)
第三十章	影响自体活性物质的药物	(王玉春 赵学梅)	(198)
第三十一章	作用于呼吸系统的药物	(王玉春 赵学梅)	(202)
第三十二章	作用于消化系统的药物	(王玉春 赵学梅)	(207)
第三十三章	子宫平滑肌兴奋药和抑制药	(杨宏艳)	(212)
第三十四章	性激素类药及避孕药	(杨宏艳)	(217)
第三十五章	肾上腺皮质激素类药物	(张全明 岳苏华)	(224)
第三十六章	甲状腺激素及抗甲状腺药	(张全明 岳苏华)	(233)
第三十七章	胰岛素及口服降血糖药	(张全明 岳苏华)	(237)
第三十八章	抗菌药物概论	(孙 超 爱 民)	(242)
第三十九章	β 内酰胺类抗生素	(孙 超 爱 民)	(247)
第四十章	大环内酯类、林可霉素类及多肽类抗生素	(孙 超 爱 民)	(255)
第四十一章	氨基糖苷类抗生素	(李清漪)	(260)
第四十二章	四环素类及氯霉素类抗生素	(李清漪)	(265)
第四十三章	人工合成抗菌药	(李清漪)	(270)
第四十四章	抗病毒药与抗真菌药	(齐占朋 赵学梅)	(275)
第四十五章	抗结核病药与抗麻风病药	(齐占朋 赵学梅)	(279)
第四十六章	抗寄生虫药	(李清漪)	(283)
第四十七章	抗恶性肿瘤药	(齐占朋 赵学梅)	(288)
第四十八章	影响免疫功能的药物	(齐占朋 赵学梅)	(294)
第四十九章	基因治疗	(李清漪)	(298)
综合试题		(杨宏艳)	(301)

第一章 药理学总论——绪言

Introduction to Pharmacology

【重点难点提要】

药理学(pharmacology)是一门为临床合理用药、防治疾病提供基本理论的医学基础学科。它从药效学和药动学两方面研究药物与机体(包括病原体)间的相互作用的规律及其原理,以及指导临床合理用药。



药理学是联系基础医学与临床医学的桥梁学科,药理学的方法是实验性的。按实验对象可分为:①实验药理学方法;②实验治疗学方法;③临床药理学方法。药理学分支:生化药理学、分子药理学、免疫药理学、遗传药理学、临床药理学等。基因药理学是一门新兴的科学。

药理学研究是新药研究和开发必不可少的关键步骤。新药研究是一个逐步选择与淘汰的过程。新药研究过程大致可分三步,即临床前研究、临床研究和售后调研。

【自测题】

一、选择题

A 型题

1. 具有肯定药理效应的药物是:

- A. 有效的药物 B. 不一定都有效的药物 C. 无效的药物
D. 使用过的药物 E. 没有使用过的药物

2. 药物的定义是:

- A. 一种使细胞致死的物质
B. 一种影响细胞活力的化学制剂
C. 一种易于经过消化吸收的化学物质
D. 用于人体以治疗、预防和诊断疾病的化学物质
E. 有滋补、营养、保健、康复作用的物质

3. 药理学的方法是实验性的,是指:

- A. 采用动物进行实验研究 B. 仅以人体为研究对象
C. 采用离体、在体实验方法进行研究
D. 所提供的实验数据是临床用药的重要参考资料
E. 在严格控制的条件下观察药物对机体或其组成部分的作用规律并分析其客观作用原理

4. 新药开发的重要性在于:

- A. 为人们提供更好的药物
 - B. 新药的疗效优于老药
 - C. 市场竞争的需要
 - D. 药物效应肯定的新药,其临床疗效好
 - E. 开发祖国医药宝库
5. 新药进行临床实验必须提供:
- A. 系统药理研究数据
 - B. 新药作用谱
 - C. 临床前研究资料
 - D. LD_{50}
 - E. 急、慢性毒理研究数据

B 型题

- A. 研究药物与机体之间相互作用和作用规律的科学
 - B. 研究药物的临床疗效的科学
 - C. 研究药物对机体的作用和作用规律的科学
 - D. 研究机体对药物的作用和作用规律的科学
 - E. 研究药物的化学结构与效应之间关系的一门科学
6. 药动学是:
7. 药效学是:
8. 药理学是:

X 型题

9. 关于新药开发与研究,下列叙述正确的是:
- A. 安慰剂是不含活性药物的制剂
 - B. 双盲法是药剂人员和病人都不能辨别试验药品和对照品
 - C. 单盲法是病人不能辨别试验药品和对照品
 - D. 售后调研是在药厂广泛推广使用中重点了解长期使用后出现的不良反应和远期疗效
 - E. 临床前研究是要弄清楚药物的作用谱和可能发生的毒性反应

二、填空题

10. 药物是用于_____、_____、_____的化学物质。
11. 我国政府颁发的第一部药典是_____。
12. 明朝伟大的医学家李时珍写出的药物学著作是_____。

三、名词解释

- 13. 药物(drug)
- 14. 药效学(Pharmacodynamics)
- 15. 药动学(Pharmacokinetics)
- 16. 新药(new drug)

四、简答题

17. 举例说明分子生物学技术用于药理学研究的优越性

五、判断是非题

18. 药效学是研究药物对机体的作用。
19. 《神农本草经》是我国第一部由政府颁布的药典。
20. IV期临床又叫做“售后调研”。
21. I期临床是随机双盲临床试验。
22. I期临床是在正常成年志愿者身上进行初步的药理学及人体安全性试验。

【参考答案】

1. B 2. D 3. E 4. A 5. C 6. D 7. C 8. A 9. ACDE
10. 预防 诊断 治疗
11. 《新修本草》
12. 《本草纲目》
13. 药物(drug)是指能够影响生物机体的生理功能和生化过程,用于疾病的预防、诊断和治疗的物质。
14. 药效学(Pharmacodynamics)是研究药物对机体的作用规律和作用机制的科学。
15. 药动学(Pharmacokinetics)研究机体对药物的影响,即应用动力学(kinetics)原理与数学模式,定量地描述与概括药物的体内过程及体内药物浓度随时间的变化的规律的科学。
16. 新药(new drug)是指化学结构、药品组分或药理作用不同于现有药品的药物。我国《药品管理法》规定“新药指我国未生产过的药品”;“已生产过的药品通过改变剂型、改变给药途径、增加新的适应证或制成新的复方制剂,亦属新药范围”。
17. 随着自然科学技术及生理学、生物化学、细胞生物学、分子生物学等学科,特别是单克隆技术、基因重组技术及基因敲除技术的发展,药理学与时俱进。从植物药中不断提纯其活性成分,得到纯度较高的药物;药动学的发展使临床应用从单凭经验发展为科学计算;药理学将针对疾病的根本病因,发展病因特异性药物治疗;生化药理学和分子药理学的发展把药物作用机制的研究从宏观引入到微观,即从原来的系统、器官水平进入到分子水平。受体及其亚基的克隆、通道蛋白的克隆等加深了我们对生命本质的认识及药物分子与生物大分子之间相互作用规律的认识,推动了药理学和其他生命科学的发展。
18. √ 19. × 20. √ 21. × 22. √

(苏富琴 王春波)

第二章 药物代谢动力学

Pharmacokinetics

【重点难点提要】

1. 药物的解离度与跨膜转运

常用的药物多属弱酸性或弱碱性化合物,在水溶液中仅能部分地解离,而解离型药物不易通过生物膜,故溶液 pH 值的改变可影响药物的转运。据 Henderson-Hasselbalch 公式,弱酸性和弱碱性药物的反应计算式分别为:

$$10^{\text{pH}-\text{pKa}} = \frac{[\text{A}]}{[\text{HA}]} \quad \text{即} \quad \frac{[\text{解离型}]}{[\text{非解离型}]} \quad 10^{\text{pKa}-\text{pH}} = \frac{[\text{BH}^+]}{[\text{B}]} \quad \text{即} \quad \frac{[\text{非解离型}]}{[\text{解离型}]}$$

当体液的 pH 值发生微小的变化时,对弱酸或弱碱性药物的解离度(脂溶性)有显著影响。弱酸性药物的转运规律(膜两侧的 pH 不同)为:弱酸性药物易由酸侧移向碱侧,扩散平衡后,碱侧多于酸侧,中毒时应碱化尿液。弱碱性药物正好相反。

2. 肝药酶

肝药酶为肝微粒体混合功能酶系统的简称,主要是细胞色素 P450 酶系统。该酶系统专一性低,活性有限,个体差异很大,易受药物的诱导和抑制。肝药酶诱导剂能加速药物代谢,是产生自身耐受性及与其他药物交叉耐受性的原因;肝药酶抑制剂能减少药物代谢。故联合用药时应注意药物对肝药酶的影响,适当调整给药方案。

3. 一级消除动力学和零级消除动力学的特点(图 2-1)

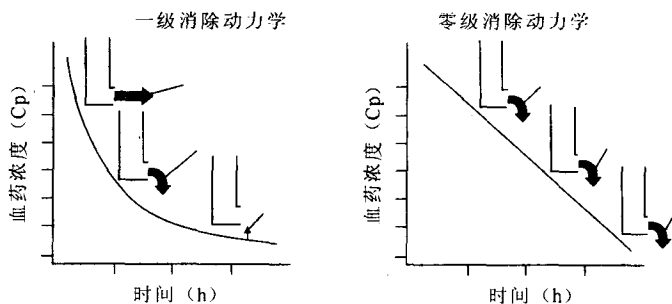


图 2-1 一级消除动力学和零级消除动力学的特点

一级消除动力学特点:①当进入体内的药物较少,未超过机体的消除能力时,体内药物以一定百分比(恒比)衰减。②药物 $T_{1/2}$ 恒定,与 C_0 和给药途径无关。一次给药经 5 个 $T_{1/2}$,体内药量消除 96% 以上,恒速给药时经 5 个 $T_{1/2}$ 血药浓度可达稳态。③消除速度与 C_0 有关。④时量关系曲线:普通坐标为凹型曲线,纵坐标为对数时呈直线(线性动力学过程),直线斜率为 $-K_e/2.303$;⑤多次给药时,增加剂量, C_{ss} 升高, AUC 相应增加,但达 C_{ss} 时间不变,也不能按比例药物消除完毕的时间。零级消除动力学的特点:①药量过大,超过机体最大消除能力,药物的消除是以恒定的剂量消除(恒量衰减)。②药物血浆 $T_{1/2}$ 不恒定,随 C_0 变化。当血药浓度降至机体消除能力之下,转为一级动力学。③消除速度与 C_0 无关。④时量关系曲线:普通坐

标为直线,斜率为 $-K$,纵坐标为对数时呈凸型曲线(非线性动力学)。⑤多次给药时,增加剂量可以超比例升高血药浓度,理论上没有 C_{ss} ,消除时间大大延长,易致蓄积中毒。

4. 连续多次给药的血药浓度变化

①恒速静脉滴注时血药浓度无波动地上升,经过5个 $T_{1/2}$ 达稳态(C_{ss});②恒速静滴时,药物 C_{ss} 与滴速(R)及药物 $T_{1/2}$ 成正比,与 V_d 成反比, $C_{ss}=1.44R \cdot T_{1/2}/V_d$;③给药间隔时间(τ)不变,每次用药剂量(D)愈大,血药浓度波动愈大, C_{ss} 愈高,但达 C_{ss} 时间不变,否则反之。④ D 不变,给药 τ 愈短,血药浓度的波动愈小, C_{ss} 愈高,但达 C_{ss} 时间不变,否则反之。⑤单位时间内用药总量不变,给药间隔时间愈短,血药浓度的波动愈小,反之亦然。但 C_{ss} 不变,达 C_{ss} 时间不变。⑥负荷剂量(D_l)即体内药物迅速达 C_{ss} 所需的剂量。分次给药, $D_l=2D_m$ (D_m 为维持量)。

5. 药物剂量的设计和优化

确定靶浓度(C_p)→找出 CL 和 V_d 的正常值→校正 CL 和 V_d (根据体重、肝肾功能等)→确定负荷量(D_l)和维持量(D_m)(公式: $D_l=C_p \cdot V_d/F$; $D_m=DL(1-e^{-\beta})$, $R=C_p(CL)$ →观察患者的血药浓度和效应→根据血药浓度修正 CL 和 V_d →调整维持量(D_m),完善治疗方案。

【自测题】

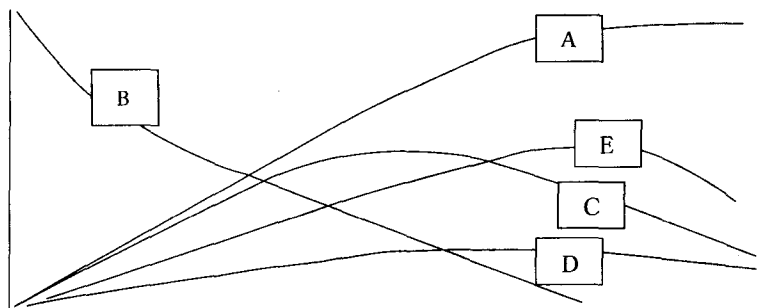
一、选择题

A 型题

- 某药剂量相等的两种制剂口服后曲线下面积相等,但达峰时间不同,是因为:
 - 肝脏代谢速度不同
 - 肾脏排泄速度不同
 - 血浆蛋白结合率不同
 - 分布部位不同
 - 吸收速度不同
- 苯巴比妥可使氯丙嗪血药浓度明显降低,这是因为苯巴比妥:
 - 减少氯丙嗪的吸收
 - 增加氯丙嗪与血浆蛋白结合
 - 诱导肝药酶使氯丙嗪代谢增加
 - 降低氯丙嗪的生物利用度
 - 增加氯丙嗪的分布
- 某药半衰期为10h,一次给药后,药物在体内基本消除的时间为:
 - 10h左右
 - 20h左右
 - 1d左右
 - 2d左右
 - 5d左右
- 大多数药物的跨膜转运方式是:
 - 主动转运
 - 单纯扩散
 - 易化扩散
 - 滤过
 - 胞饮
- 生理pH值范围内,弱酸或弱碱性药物的解离与吸收说法哪点不对:
 - 弱酸性药物在酸性环境下解离少,易吸收
 - 弱酸性药物在碱性环境下解离少,易吸收
 - 弱碱性药物在碱性环境下解离少,易吸收
 - 弱碱性药物在酸性环境下解离多,不易吸收
 - pK_a 是弱酸性药在溶液中50%解离时的pH值
- 药物的吸收与哪种因素无关:

- A. 机体的解毒作用 B. 给药途径 C. 药物的溶解性
D. 药物的剂量 E. 局部血液循环
7. 弱酸性药物从胃肠道吸收的主要部位是：
A. 胃黏膜 B. 小肠上段 C. 横结肠 D. 乙状结肠 E. 小肠下段
8. 弱碱性药物从胃肠道最容易吸收的部位是：
A. 胃黏膜 B. 小肠上段 C. 横结肠 D. 乙状结肠 E. 小肠下段
9. 下列情况可称为首关消除的是：
A. 苯巴比妥钠肌肉注射被肝药酶代谢，使血药浓度降低
B. 硝酸甘油舌下给药，自口腔黏膜吸收，经肝代谢后药效降低
C. 青霉素口服后被胃酸破坏，使吸收入血的药量减少
D. 普萘洛尔口服，经肝脏灭活代谢，使进入体循环的药量减少
E. 所有这些均是
10. 某药一次给药后的血浆药物浓度为 32mg/L。该药 $T_{1/2} = 1.5h$ ，按一级动力学消除，经 450min 后血浆药物浓度应为：
A. 2mg/L B. 4mg/L C. 8mg/L D. 1mg/L E. 0.5mg/L
11. 下列 5 种药物在小肠中吸收最好的是：
A. 乙酰水杨酸 $pK_a 3.5$ B. 麻黄碱 $pK_a 9.4$ C. 苯巴比妥 $pK_a 7.9$
D. 磺胺嘧啶 $pK_a 6.9$ E. 水杨酸 $pK_a 3.0$
12. 某弱酸性药物 $pK_a = 3.4$ ，在血浆中解离的百分率为：
A. 10% B. 90% C. 99% D. 99.9% E. 99.99%
13. 阿司匹林的 $pK_a = 3.5$ ，它在 $pH = 7.5$ 的肠液中未解离的比例为：
A. 1% B. 0.1% C. 0.01% D. 10% E. 99%
14. 某弱酸性药物在 $pH = 5$ 时，非解离部分为 90.9%，该药 pK_a 的接近数值为：
A. 2 B. 3 C. 4 D. 5 E. 6
15. 多数药物在体内都是以结合形式存在的，常与药物结合的物质是：
A. 白蛋白 B. 球蛋白 C. 血红蛋白
D. 游离脂肪酸 E. 高密度脂蛋白
16. 影响药物在体内分布的因素有：
A. 药物的理化性质及局部器官的血流量 B. 各种细胞膜屏障
C. 药物与血浆蛋白的结合率 D. 体液 pH 值和药物的解离度
E. 所有这些
17. 药物的灭活和消除速度决定药物作用的：
A. 起效快慢 B. 强度与持续时间 C. 后遗效应大小
D. 不良反应的大小 E. 直接作用和间接作用
18. 对于弱酸性药物来说，正确的是：
A. 若尿液 pH 值降低，则药物解离度小，重吸收少，排泄加快
B. 若尿液 pH 值降低，则药物解离度大，重吸收多，排泄减慢
C. 若尿液 pH 值提高，则药物解离度大，重吸收少，排泄加快
D. 若尿液 pH 值提高，则药物解离度大，重吸收多，排泄减慢

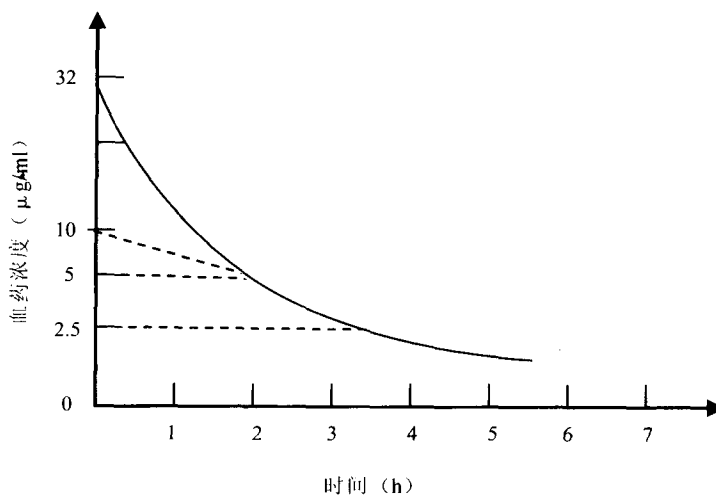
- E. 若尿液 pH 值降低, 则药物解离度小, 重吸收少, 排泄减慢
19. 无首关消除的药物是:
A. 硝酸甘油 B. 氢氯噻嗪 C. 普萘洛尔 D. 吗啡 E. 哌替啶
20. 一种药物快速静脉注射后, 血药浓度曲线应是下列图中的哪一曲线:



A. A 曲线 B. B 曲线 C. C 曲线 D. D 曲线 E. E 曲线

21~23 题

给一体重 50kg 的妇女静脉注射 300mg 的一种药物后, 定时测定血药浓度, 绘制曲线如下:



21. 此药的表观分布容积为:
A. 3L B. 10L C. 30L D. 50L E. 300L
22. 该药的消除半衰期是:
A. 30min B. 1h C. 2h D. 3h E. 4h
23. 该药的消除速率常数为:
A. 0.1/h B. 0.2/h C. 0.69/h D. 0.35/h E. 1.38/h
24. 普萘洛尔口服吸收良好, 但经过肝脏后, 只有 30% 的药物到达体循环, 以致血药浓度较低, 下列哪种说法较合适:
A. 药物活性低 B. 药物效价强度低 C. 生物利用度低
D. 化疗指数低 E. 药物排泄快

25. 关于药物体内转化哪点是错误的:
- 生物转化是药物从机体消除的唯一方式
 - 药物在体内代谢的主要氧化酶是细胞色素 p450
 - 肝药酶的专一性很低
 - 有些药物可抑制肝药酶合成
 - 肝药酶的数量、活性个体差异较大
26. 地高辛 $T_{1/2}$ 为 36h, 按每日给予治疗剂量, 欲达血浆稳态浓度约需:
- 10d
 - 5d
 - 12d
 - 7~8d
 - 2d
27. 苯巴比妥过量中毒, 为了促使其快速排泄:
- 碱化尿液, 使解离度增大, 增加肾小管再吸收
 - 碱化尿液, 使解离度减小, 增加肾小管吸收
 - 碱化尿液, 使解离度增大, 减少肾小管再吸收
 - 酸化尿液, 使解离度增大, 减少肾小管再吸收
 - 酸化尿液, 使解离度减小, 减少肾小管再吸收
28. 临床上可以用丙磺舒增加青霉素疗效, 是因为:
- 在杀菌作用上有协同作用
 - 二者竞争在肾小管的分泌通道
 - 对细菌代谢有双重阻断作用
 - 延缓抗药性产生
 - 减少青霉素的分布

B 型题

- | | | |
|---------|---------------|-----------|
| A. 吸收速度 | B. 消除速度 | C. 血浆蛋白结合 |
| D. 剂量 | E. 零级或一级动力学消除 | |
29. 药物作用快慢取决于:
30. 半衰期长短取决于:
31. V_d 大小主要涉及:
- 立即
 - 1 个 $T_{1/2}$
 - 2 个 $T_{1/2}$
 - 5 个 $T_{1/2}$
 - 10 个 $T_{1/2}$
32. 每次剂量减半, 达到新的 C_{ss} 需要:
33. 每次剂量加倍, 达到新的 C_{ss} 需要:
34. 给药间隔时间缩短一半, 达到新的 C_{ss} 需要:

C 型题

- | | | | |
|------------|------------|---------|---------|
| A. 药物的吸收过程 | B. 药物的消除过程 | C. 两者均无 | D. 两者均有 |
|------------|------------|---------|---------|
35. 血浆的消除率取决于:
36. 药时曲线下面积(AUC)取决于:
37. 生物利用度取决于:

X 型题

38. 下列属于被动转运的有:
- 滤过
 - 水溶性扩散
 - 易化扩散
 - 主动转运
 - 简单扩散
39. 可避免首关消除的给药方式有:
- 口服
 - 舌下含服
 - 直肠中、下段给药

- D. 直肠上段给药 E. 吸入
40. 下列给药方式属于局部给药的是:
- A. 沙丁胺醇气雾吸入解除支气管痉挛
B. 去甲肾上腺素稀释后口服治疗上消化道出血
C. 硝酸甘油胸前区贴膜治疗心绞痛
D. 氟氢松局部涂抹治疗接触性皮炎 E. 以上均是
41. 药物与血浆蛋白结合:
- A. 是可逆的 B. 不利吸收
C. 药理活性暂时消失 D. 加速药物在体内分布
E. 若被其他药物置换,必导致其游离血药浓度升高
42. 促进药物生物转化的主要酶系统——肝药酶表现为:
- A. 反应专属性强 B. 个体差异大 C. 易受药物的诱导
D. 不易受药物抑制 E. 使多数药物代谢转化
43. 影响药物从体内肾脏排泄速度的因素有:
- A. 药物极性 B. 尿液 pH 值 C. 肾功能状况
D. 给药剂量 E. 同类药物(弱酸性或弱碱性)的竞争性抑制
44. 药物按零级动力学消除的特点为:
- A. 血浆半衰期不是固定数值 B. 药物自体内按恒定速度消除
C. 消除速度与 C_0 (初始血药浓度) 高低有关
D. 时量曲线用普通坐标时为直线,其斜率为 $-K$
E. 进入体内药量少,机体消除药物能力有余
45. 药物消除的方式包括:
- A. 生物转化 B. 与血浆蛋白结合 C. 肝肠循环
D. 肾排泄 E. 再分布到脂肪组织

二、填空题

46. 弱酸性和弱碱性药物的 pK_a 都是该药物在溶液中 _____ 离子化时的 _____ 值,各药都有其固定的 _____ 值。
47. 药物的排泄途径有 _____、_____、_____、_____、_____ 等。
48. 除了少数半衰期特长或特短的药物或零级动力学外,一般可采用 _____ 半衰期,给予 _____ 量,并将 _____ 量加倍,是有效、安全、迅速的给药方法。
49. 肝微粒体药物代谢酶中主要的酶系是 _____,与 _____ 形成一个氧化还原系统。重要的肝药酶诱导剂是 _____,当与双香豆素使用时,可使后者的 _____ 作用减弱。
50. 体内药物按恒比衰减,每个半衰期给药一次时,经 _____ 个半衰期血浆药物浓度达到稳态浓度。某药半衰期为 80min,如按此方式消除,血药浓度由 78mg 降到 9.75mg 需要 _____ h。
51. 吸烟诱导的 CYP_{450} 是 _____,乙醇诱导的 CYP_{450} 是 _____。
52. 促进苯巴比妥排泄的方法是 _____ 体液,促进水杨酸钠排泄的方法是 _____ 体液。
53. 每隔一个半衰期给药一次,欲迅速达 C_{ss} ,可采用 _____ 法。