

依据最新考试大纲编写

国家执业药师 资格考试 **掌中宝** 系列

药 理 学

主编 季 晖

名师引领 洞悉考试规律
重点突出 复习事半功倍

随书赠送 药师在线
WWW.CMSTPX.COM

30元优惠学习卡
一书 一卡 一号
网上验证

中国医药科技出版社

国家执业药师资格考试

掌中宝系列

常州大学图书馆
藏书

药理学

主 编 李 晖

副主编 戴 丽 李婷婷

中国医药科技出版社

图书在版编目 (CIP) 数据

药理学/季晖主编. —北京: 中国医药科技出版社, 2012. 1
(国家执业药师资格考试掌中宝系列)

ISBN 978 - 7 - 5067 - 5273 - 2

I. ①药… II. ①季… III. ①药理学-药剂人员-资格考试-
自学参考资料 IV. ①R96

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2011) 第 237473 号

美术编辑 陈君杞

版式设计 郭小平

出版 中国医药科技出版社

地址 北京市海淀区文慧园北路甲 22 号

邮编 100082

电话 发行: 010-62227427 邮购: 010-62236938

网址 www.cmstp.com

规格 710×1000mm $\frac{1}{32}$

印张 6 $\frac{1}{8}$

字数 121 千字

版次 2012 年 1 月第 1 版

印次 2012 年 1 月第 1 次印刷

印刷 三河市华新科达彩色印务有限公司

经销 全国各地新华书店

书号 ISBN 978 - 7 - 5067 - 5273 - 2

定价 16.00 元

本社图书如存在印装质量问题请与本社联系调换

目录 Contents

第一篇 药理学总论

第 1 章	绪论	2
第 2 章	药物代谢动力学	3
第 3 章	药物效应动力学	10
第 4 章	影响药物作用的因素	16

第二篇 化学治疗药物

第 5 章	抗微生物药概论	22
第 6 章	β -内酰胺类抗生素	26
第 7 章	大环内酯类、林可霉素类及多肽类抗生素	32
第 8 章	氨基糖苷类抗生素	38
第 9 章	四环素类抗生素和氯霉素	42
第 10 章	人工合成抗菌药	47
第 11 章	抗真菌药	56
第 12 章	抗病毒药	59
第 13 章	抗结核病药和抗麻风病药	64
第 14 章	抗寄生虫药	70

第 15 章	抗恶性肿瘤药	76
--------	--------------	----

第三篇 神经系统药物

第 16 章	传出神经系统药	85
第 17 章	镇静催眠药	93
第 18 章	抗癫痫药和抗惊厥药	98
第 19 章	治疗中枢神经退行性病变药	103
第 20 章	抗精神失常药	109
第 21 章	镇痛药	116
第 22 章	解热镇痛抗炎药	122

第四篇 心血管系统药物

第 23 章	抗心律失常药	128
第 24 章	抗心力衰竭药	135
第 25 章	抗高血压药	140
第 26 章	抗心绞痛药	147
第 27 章	调血脂药和抗动脉粥样硬化药	150
第 28 章	利尿药和脱水药	154

第五篇 血液、呼吸、消化系统药物

第 29 章	血液系统药	157
第 30 章	呼吸系统药	161
第 31 章	消化系统药	163

第六篇 内分泌系统药物

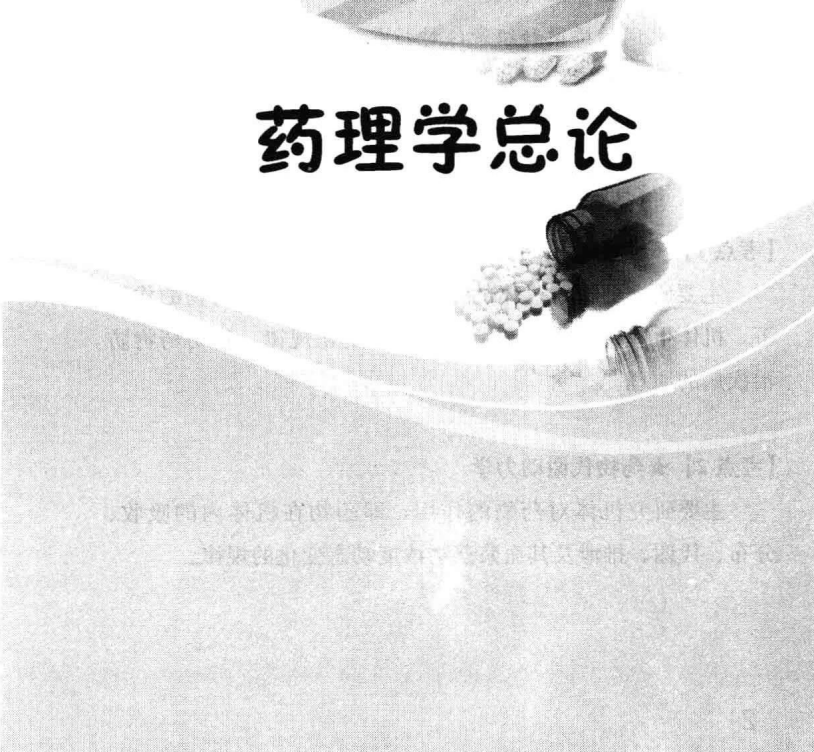
第 32 章	肾上腺皮质激素类药	167
第 33 章	甲状腺激素和抗甲状腺药	171
第 34 章	胰岛素和口服降血糖药	173
第 35 章	性激素类药和影响生殖功能药	176

第七篇 其他类药物

第 36 章	免疫调节药	181
第 37 章	组胺和组胺受体阻断药	183



第一篇



药理学总论

第1章 绪论

阅读提示 药理学是研究药物与机体（包括病原体）之间相互作用的规律及其原理的一门科学，是药学与医学之间的桥梁和纽带，对指导临床合理用药与新药研制开发具有重要的作用。研究内容主要包括药物效应动力学（简称药效学）和药物代谢动力学（简称药动学）。

【考点1】★药物效应动力学

主要研究药物对机体的作用及其机制，即在药物的作用下，机体生理功能及细胞代谢活动的变化规律，阐明药物防治疾病的原理。

【考点2】★药物代谢动力学

主要研究机体对药物的作用，即药物在机体内的吸收、分布、代谢、排泄及其血浆药物浓度动态变化的规律。

第2章 药物代谢动力学

阅读提示 药物代谢动力学是定量研究药物在生物体内吸收、分布、代谢、排泄（简称 ADME）等体内过程规律的科学，其基本过程见图 2-1。本章着重掌握药物的体内过程和主要影响因素，以及重要的药动学参数。

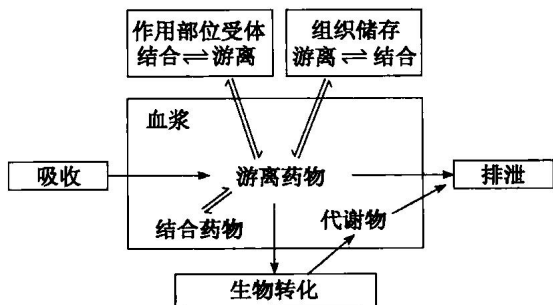


图 2-1 药物体内过程示意图

【考点 1】★药物的跨膜转运

1. 被动转运：包括简单扩散和孔道转运两种方式。

大多数药物以简单扩散的方式转运，影响因素主要有：
①药物的脂溶性：脂溶性高的药物扩散快；②药物的解离度：解离度大的药物难以扩散；③药物的解离常数（ K_a ）和体液的 pH：弱酸性药物在碱性环境中易解离，难以扩散；在酸性环境中不易解离，扩散快。

2. 载体转运：包括主动转运和易化扩散两种方式。

药物跨膜转运的主要方式及其特点

类 别	被动转运 简单扩散	载体转运	
		主动转运	易化扩散
浓度差	顺	逆	顺
扩散推动力	浓度差	能量	浓度差
载体	不需	需要	需要
竞争性抑制与饱和性	无	存在	存在
药物转运形式	大多数	少数	少数

【考点 2】★★药物的吸收及其影响因素

指药物从给药部位到进入血液循环的过程。

1. 消化道吸收：口服是最常用的给药途径，具有方便、安全、经济的优点，小肠是主要吸收部位。有些药物经胃肠道吸收后在进入体循环之前，首先在胃肠道或肝脏被灭活，使进入体循环的实际药量减少，称为首过消除。如硝酸甘油、普萘洛尔、利多卡因、吗啡、维拉帕米等药物有明显的首过消除。舌下含服和直肠给药可避免之。

2. 注射部位的吸收：特点是吸收迅速而完全，但用药不

方便。静脉注射时药物直接进入体循环，不存在吸收过程，起效最快；肌肉注射因注射局部血流丰富，吸收快；皮下注射吸收均匀而缓慢。

3. 肺部吸收：药物通过肺上皮细胞或气管黏膜吸收，特点是吸收迅速，但剂量难以掌握，有些药物对肺上皮有一定刺激。

4. 经皮吸收：特点是吸收缓慢且不规则，不易控制剂量，作用持久。

【考点3】★★药物的分布及其影响因素

指药物从血液到组织器官的过程。

1. 药物分布的规律性：①首先分布于脑、心、肝、肾等血流量较大的器官，然后再分布到肌肉、皮肤、脂肪等血流量较小的组织，称为再分布。②分布有选择性，如碘集中于甲状腺组织。

2. 主要影响因素有药物的理化性质、体液 pH、血浆蛋白结合率、膜通透性。①药物与血浆蛋白结合的特点：主要与白蛋白结合；结合是疏松的、可逆的，结合型药物与游离型药物处于动态平衡之中；结合型药物暂时失去药理活性；结合后分子量变大，不能通过毛细血管壁，不被排泄，“储存”于血液中；结合有置换现象，当两个结合率高的药物合用时会出现置换作用，一种药物被另一种药物置换出来，导致前者在血浆中游离型药物的浓度急剧增加，引起毒性反应。②生理屏障：血脑屏障、胎盘屏障。

【考点 4】★★★药物的代谢

主要在肝脏经生物转化失去药理活性。

1. 药物代谢的意义：代谢灭活，代谢活化——前药，毒性增加。

2. 转化的类型和过程：I 相反应——氧化、还原、水解；II 相反应——结合（葡萄糖醛酸、甘氨酸、硫酸等），使极性进一步加大，有利于排出体外。

3. 药物代谢酶：促进药物代谢的主要为肝微粒体中的细胞色素 P450 酶，其特点是对底物的选择性不高，活性个体差异大；使药酶活性增加，药物代谢加速的称为药酶诱导剂，如苯巴比妥、利福平、卡马西平、灰黄霉素、苯妥英钠、地塞米松等；使药酶活性减弱，药物代谢减慢的称为药酶抑制剂，如氯霉素、别嘌醇、酮康唑、西咪替丁、异烟肼等。

【考点 5】★★药物的排泄及其影响因素

指药物通过排泄器官排出体外的过程。

1. 肾排泄：为主要排泄途径，影响因素主要为肾小管的重吸收和分泌作用。

肾小管的重吸收作用为简单扩散的方式，改变尿液的 pH 可影响其重吸收，弱酸性药物在碱性尿液中解离度大，不易被重吸收；弱碱性药物在碱性尿液中解离度小，易被重吸收。如弱酸性药物苯巴比妥、水杨酸等中毒时，可用碱化尿液的方法增加其在尿液中的解离度，阻止其再吸收，加速排泄。

肾小管的分泌作用为主动转运过程，两个分泌机制相同的药物合用时有竞争性抑制作用，如丙磺舒竞争性抑制青霉素、吲哚美辛自肾小管的主动分泌。

2. 胆汁排泄：由胆汁排泄到十二指肠的部分药物可在肠道被再吸收，形成肝肠循环，在药动学上表现为药时曲线出现双峰现象，药效学上表现为药物的作用明显延长，如洋地黄毒苷、地高辛、吗啡、地西洋、炔雌醇等。

3. 其他途径：乳汁、唾液、肺。

【考点6】★★药物的消除动力学类型

1. 一级消除动力学为绝大多数药物的消除方式，具有以下特点：

(1) 药物消除速率与血中药物浓度成正比，即恒比消除，血药浓度高，单位时间内消除的药量多，当血药浓度降低后，药物消除速率也按比例下降。

(2) 药物 $t_{1/2}$ 恒定，不因血药浓度高低而变化，也不受给药途径的影响。一次用药约经 5 个 $t_{1/2}$ 体内药量消除 96% 以上，恒速（定时定量）给药时，经 5 个 $t_{1/2}$ 后血药浓度达到稳态浓度（ C_{ss} ）。

2. 零级消除动力学的特点

(1) 血浆药物按恒定消除速度（单位时间消除的药量）进行消除，与血药浓度无关，即恒量消除。多数情况下是药物剂量过大，超过机体最大消除能力所致，此时体内药物以最大消除速率衰减，即恒量消除。

(2) 药物血浆 $t_{1/2}$ 不是一个恒定数值，它随药物血浆浓度高低而变化。当血药浓度降至最大消除能力以下时，则转变为一级动力学消除。

【考点 7】★★★药代动力学重要参数

1. 血药浓度曲线下面积 (AUC)：反映在服用某一剂量后一定时间内吸收入血的药物相对量。

2. 半衰期 ($t_{1/2}$)：血药浓度下降一半所需的时间，反应体内药物消除的快慢。 $t_{1/2}$ 是临床制定给药方案的主要依据，一般每隔一个 $t_{1/2}$ 给药一次。 $t_{1/2} = 0.693/K$ 。按一级动力学消除的药物，每隔一个 $t_{1/2}$ 给药一次，约经 5 个 $t_{1/2}$ 达到稳态血药浓度 (C_{ss})；一次给药后，约经 5 个 $t_{1/2}$ 从体内基本消除 (95% 以上)。

3. 表观分布容积 (V_d)：按血药浓度推算体内药物总量在理论上应占有的体液容积，反映药物在体内分布广窄的程度。 V_d 值大表示药物在体内分布范围广；反之， V_d 小表示药物在体内分布范围窄。

4. 消除率 (Cl)：单位时间内机体能将多少升体液中的药物消除掉，是反映药物从体内消除的重要参数。

5. 生物利用度 (F)：指药物能被吸收进入血液循环的速度和程度的一种量度，是评价制剂吸收程度的重要指标。

$$\text{绝对生物利用度：} F = \frac{AUC_{\text{ext}}}{AUC_{\text{iv}}} \times 100\%$$

$$\text{相对生物利用度：} F = \frac{AUC_T}{AUC_R} \times 100\%$$

6. 连续多次恒速给药：经过 5 个 $t_{1/2}$ ，消除速度与给药速度相等，即达到稳态血药浓度 (C_{ss})。如需立即达到有效浓度，可开始时采用负荷剂量。口服给药时，负荷剂量为常规剂量的 1 倍，即首剂加倍可迅速达到 C_{ss} 。

第3章 药物效应动力学

阅读提示 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。本章着重掌握药物的基本作用（包括治疗作用和不良反应）及其作用机制（尤其是受体学说）以及药物剂量与效应之间的关系。

【考点1】★★药物的治疗作用

1. 对因治疗：消除原发致病因子，以便彻底治愈疾病，如抗生素杀灭体内病原微生物。
2. 对症治疗：改善疾病的症状，如阿司匹林退烧。

【考点2】★★★药物的不良反应

1. 副作用：治疗剂量下出现的与治疗目的无关的作用，是由于药物作用选择性低、作用广泛造成的。如阿托品用于解除胃肠痉挛时，引起的口干、心悸、便秘等副作用。
2. 毒性反应：药物剂量过大或用药时间过长，药物在体内蓄积过多造成的危害性反应。分为急性毒性反应和慢性毒

性反应。

3. 后遗效应：停药后，血浆中药物浓度已降至阈浓度以下时残存的生物效应。如服用长效巴比妥类催眠药后，次晨仍有“宿醉”现象。

4. 停药反应：突然停药后原有疾病加剧的现象，又称为反跳反应。如长期服用可乐定降压药，停药次日血压可剧烈回升。

5. 变态反应：药物引起的机体的免疫病理反应，又称为过敏反应，反应与药物的药理作用和剂量无关。

6. 特异质反应：与遗传有关，是由于机体生化机制的异常所致，是一种遗传性生化缺陷，比如红细胞葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏的病人，服用磺胺药时引起的溶血反应。

【考点3】★★药物的量效关系

1. 量效关系：指在一定剂量范围内药物效应与剂量具有相关性。

2. 量效曲线：用效应强弱作为纵坐标、药物浓度作为横坐标作图得直方双曲线。如将药物浓度改用对数值作图则呈典型的对称S型曲线，即为量效曲线。

3. 量反应：药理效应的强度呈连续性量的变化，可用数或量的分级表示，如BP、Hr等；质反应：药理效应表现出反应性质的变化，只能用阳性或阴性表示，也称全或无反应，如生存或死亡等。

4. 最小有效量：出现疗效所需的最小剂量；最小中毒量：