

国家执业药师资格考试(含部队)

推荐辅导用书

2013

药学专业知识的(一)

连续畅销6年，考试通过有保证！



YZLI0890192670



人民军医出版社

PEOPLE'S MILITARY MEDICAL PRESS

国家执业药师资格考试（含部队）推荐辅导用书

药学专业知 识（一）

YAOXUE ZHUANYE ZHISHI (YI)

国家执业药师资格考试（含部队）推荐辅导用书编委会



YZLI0890192670



人民军 医出版社

PEOPLE'S MILITARY MEDICAL PRESS

北 京

图书在版编目 (CIP) 数据

药学专业知 识 (一) / 赵春杰主编. —2 版. —北京: 人民军医出版社, 2013.4
ISBN 978-7-5091-6508-9

I. ①药… II. ①赵… III. ①药 物学—药 剂人员—资格 考试—自 学参 考资 料 IV. ①R9
中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2013) 第 062950 号

策划编辑: 李玉梅 丁 震 文字编辑: 许 华 陈 鹏 责任审读: 王三荣

出版发行: 人民军医出版社 经销: 新华书店

通信地址: 北京市 100036 信箱 188 分箱 邮编: 100036

质量反馈电话: (010) 51927290; (010) 51927283

邮购电话: (010) 51927252

策划编辑电话: (010) 51927300—8746

网址: www.pmmp.com.cn

印、装: 京南印刷厂

开本: 787mm×1092mm 1/16

印张: 17.5 字数: 514 千字

版、印次: 2013 年 4 月第 2 版第 1 次印刷

印数: 3001—6000

定价: 48.00 元

版权所有 侵权必究

购买本社图书, 凡有缺、倒、脱页者, 本社负责调换

目 录

第一部分 药理学	1
第1章 药物代谢动力学	2
第2章 药物效应动力学	6
第3章 影响药物作用的因素	10
第4章 抗微生物药概论	13
第5章 β 内酰胺类抗生素	16
第6章 大环内酯类、林可霉素类及多肽类抗生素	20
第7章 氨基糖苷类抗生素	24
第8章 四环素类和氯霉素	27
第9章 人工合成抗菌药	31
第10章 抗真菌药	35
第11章 抗病毒药	39
第12章 抗结核病药和抗麻风病药	44
第13章 抗寄生虫药	49
第14章 抗恶性肿瘤药	56
第15章 传出神经系统药物	63
第16章 镇静催眠药	71
第17章 抗癫痫药和抗惊厥药	76
第18章 治疗中枢神经退行性病变药	80
第19章 抗精神失常药	86
第20章 镇痛药	92
第21章 解热镇痛抗炎药	97
第22章 抗心律失常药	101
第23章 抗心力衰竭药	107
第24章 抗高血压药	113
第25章 抗心绞痛药	121
第26章 血脂调节药和抗动脉粥样硬化药	125
第27章 利尿药和脱水药	129
第28章 血液系统药物	133
第29章 呼吸系统药物	138
第30章 消化系统药物	141
第31章 肾上腺皮质激素类药	144
第32章 甲状腺激素和抗甲状腺药	148
第33章 胰岛素和口服降血糖药	151
第34章 性激素类药和影响生殖功能药	154
第35章 免疫调节药	159
第36章 组胺和组胺受体阻断药	161

第二部分 药物分析	165
第 37 章 药典	166
第 38 章 药物分析的基础	173
第 39 章 物理常数测定法	181
第 40 章 滴定分析法	186
第 41 章 分光光度法	192
第 42 章 色谱法	197
第 43 章 体内药物分析方法	206
第 44 章 药物的杂质检查	211
第 45 章 芳酸及其酯类药物的分析	218
第 46 章 巴比妥类药物的分析	222
第 47 章 胺类药物的分析	226
第 48 章 磺胺类药物的分析	231
第 49 章 杂环类药物的分析	234
第 50 章 生物碱类药物的分析	240
第 51 章 甾体激素类药物的分析	245
第 52 章 维生素类药物的分析	249
第 53 章 抗生素类药物的分析	254
第 54 章 糖类药物的分析	259
全真模拟试卷	263
参考答案	272

第一部分

药 理 学

第1章 药物代谢动力学

考点进阶详解

一、药物的体内过程

1. 药物的吸收 是指药物从给药部位进入血液循环的过程。静脉注射无吸收过程。

不同给药途径的吸收快慢顺序依次为：腹腔注射>吸入>舌下>直肠>肌内注射>皮下注射>口服>皮肤。

(1) 临床常用的血管外给药途径有：消化道给药、注射给药、吸入给药、经皮给药。

(2) 影响因素：①药物的理化性质。②药物剂型。③首过消除：有些药物在通过胃肠道黏膜和肝时，部分被代谢灭活，进入体循环的药量减少，称为首过消除，如硝酸甘油、普萘洛尔、利多卡因、丙米嗪、吗啡、维拉帕米、氯丙嗪等。④吸收环境：胃肠道 pH、胃排空和肠蠕动性、吸收面积的大小、吸收部位的血流灌注情况等。

2. 药物的分布 指药物随血液循环向机体各组织部位转移的过程。影响因素包括：

(1) 药物与血浆蛋白的结合率：药物与血浆蛋白结合具有饱和性和可逆性、结合型药物无活性、有竞争置换现象。

(2) 体内特殊屏障：血脑屏障（是脑组织内的特殊结构形成的血浆与脑脊液间的屏障，能阻碍许多大分子、水溶性及解离药物通过的屏障）；胎盘屏障（是胎盘绒毛与子宫血窦间的屏障，通透性与一般生物膜无明显区别，几乎所有的药物均可通过此屏障进入胚胎循环）；血眼屏障（一般给药眼内难以达到有效浓度，需局部或眼周用药）。

3. 药物的代谢 药物在体内发生化学结构的改变。

(1) 药物代谢的意义：药物经转化后，药理活性发生改变。①失活：成为无药理活性的物质。②活化：由无药理活性成为有药理活性或有毒物质。

(2) 药物代谢酶：最关键的是肝微粒体的细胞色素 P₄₅₀ 酶系，由多种酶组成，催化药物的代谢反应，是促进药物生物转化的主要酶系。肝药酶特点是专一性低、活性有限、个体差异大。某些药物可使肝微粒体酶系的活性增强或减弱。

①酶诱导药：长期用药可使药酶活性增强的药物，可使自身或合用的其他药物代谢加快。如苯巴比妥、苯妥英钠、利福平、灰黄霉素、地塞米松、卡马西平、水合氯醛、甲丙氨酯等。

②酶抑制药：能抑制药酶活性的药物，可使自身或合用的其他药物代谢减慢。如氯霉素、别嘌醇、酮康唑、西咪替丁、吩噻嗪类、对氨基水杨酸、异烟肼、保泰松等。

4. 药物的排泄 血液循环中的药物或代谢产物排出体外的过程。

(1) 肾排泄：主要排泄途径，包括肾小球滤过、肾小管主动分泌和肾小管重吸收。

影响因素包括：①肾小球滤过率和血浆蛋白结合率；②肾小管中重吸收量与尿液 pH 有关，改变尿液的 pH，可以改变药物的解离度，酸性药物在碱性尿液中易于排出，碱性药物则相反，如利用碳酸氢钠、枸橼酸钠等碱性药物碱化尿液可使药物的解离度增大，重吸收减少，对苯巴比妥、水杨酸等弱酸性药物中毒进行解救；③分泌机制相同的药物合用时有竞争性抑制，如丙磺舒抑制青霉素自肾小管的主动分泌。

(2) 胆汁排泄：有些药物可自胆汁排泄而后进入十二指肠，再经粪便排出体外。

肝肠循环：由胆汁排泄到十二指肠的部分药物可经肠道黏膜吸收经门静脉重新进入体循环。

药物作用明显延长,如洋地黄、洋地黄毒苷、地西洋、炔雌醇等。

(3) 其他排泄。①乳汁: pH 略低于血浆,碱性药可自乳汁排泄,哺乳婴儿可能受累。②呼吸: 是某些挥发性药物的主要排泄途径,检测呼出气中的乙醇量是诊断酒后驾车的快速简便的方法。③唾液、汗液及粪便: 多数是口服未被吸收的药物。

二、药动学重要参数

1. 药-时曲线下面积 (AUC) 血药浓度-时间曲线与横坐标围成的面积,代表一次用药后的吸收总量,反映药物的吸收程度。

2. 峰浓度 (C_{\max}) 药物经血管外给药吸收后的血药浓度最大值。

3. 达峰时间 (t_{\max}) 给药后达到药峰浓度所需的时间。

4. 半衰期 ($t_{1/2}$) 是指血药浓度下降一半所需的时间,是决定给药间隔时间的重要参数之一。按一级动力学消除的药物, $t_{1/2}$ 是一恒定值。单次给药后,经过 3.3 个 $t_{1/2}$, 约有 90% 的药物从体内消除; 5 个 $t_{1/2}$, 约 97% 的药物从体内消除。多剂量给药, 经 5 个 $t_{1/2}$ 后, 血药浓度达到稳态。 $t_{1/2}$ 反映药物消除快慢的程度; $t_{1/2}$ 因肝肾功能不良会改变, 需调整给药剂量与间隔时间。

5. 表观分布容积 (V_d) 是指药物在体内达到动态平衡时, 体内药量与血药浓度的比值。 $V_d = D/C =$ 体内药量/血药浓度, 并不代表真正的生理体积, 其意义在于可反映药物在体内分布范围。 V_d 大的药物与组织蛋白结合多, 主要分布在细胞内液及组织间液; V_d 小的药物多与血浆蛋白结合, 集中在血浆, V_d 也是临床确定给药剂量的重要参数。

6. 生物利用度 (F) 是指药物经血管外给药后, 药物被吸收入血液循环的速度和程度, 是评价制剂优劣的重要指标。

绝对生物利用度 $F = AUC_{\text{ext}} / AUC_{\text{iv}} \times 100\%$ 。 iv 和 ext 分别代表静脉给药和血管外途径给药。

相对生物利用度 $F = AUC_T / AUC_R \times 100\%$ 。 T 和 R 分别表示受试制剂和参比制剂。

7. 稳态血药浓度 (C_{ss}) 在临床治疗中多数药物都是重复给药以达到有效治疗浓度, 并维持在一定水平, 给药速率与消除速率达到平衡时的血药浓度。

考点总结

序号	内容	重要知识点	考频	试题题干
1	药物的体内过程(2012年)	1. 途径、首过消除的概念及代表药(2010年) 2. 药物与血浆蛋白结合的特点 3. 代谢药酶的诱导和抑制特点及代表药(2008、2009、2012年) 4. 排泄途径、改变尿液 pH 对药物在肾小管重吸收的影响(2008年)、肝肠循环概念及代表药	历年常考	药物的体内过程包括; 下列药物中, 具有药酶诱导作用的药物有; 肝药酶抑制药有; 治疗弱酸性药物中毒, 碱化尿液可选用的药物有
2	药动学参数	AUC(2011年)、 C_{\max} (2008年)、 t_{\max} 、 $t_{1/2}$ (2011、2012年)、 F (2008年)、 V_d (2008、2011年)、 C_{ss} 的概念及意义	历年常考	血管外给药后, 药物被吸收入血液循环的速度和程度称为; 反应药物吸收程度的是; 某药的半衰期为 5h, 单次给药后, 约 97% 的药物从体内消除需要的时间是

经典试题

一、A型题（最佳选择题）

- 弱碱性药物
 - 在酸性环境中易跨膜转运
 - 在胃中易于吸收
 - 酸化尿液时易被重吸收
 - 酸化尿液可加速其排泄
 - 碱化尿液可加速其排泄
- 评价药物吸收程度的药动学参数是
 - 药-时曲线下面积
 - 清除率
 - 消除半衰期
 - 药峰浓度
 - 表观分布容积
- 某药的半衰期为 5h，单次给药后，约 97% 的药物从体内消除需要的时间是
 - 10h
 - 25h
 - 48h
 - 120h
 - 240h
- 为了很快达到稳态血液浓度，可采取的给药方法是
 - 药物恒速静脉滴注
 - 一个半衰期口服给药一次时，首剂加倍
 - 一个半衰期口服给药一次时，首剂用维持量
 - 每五个半衰期给药一次
 - 每五个半衰期增加给药一次
- 直接进入体循环，没有吸收过程的给药途径是
 - 口服给药
 - 静脉注射
 - 舌下含服
 - 经皮给药
 - 吸入给药

二、B型题（配伍选择题）

(6~8 题共用备选答案)

- A. $t_{1/2}$

- B. 生物利用度
 C. 表观分布容积
 D. 稳态血药浓度
 E. 峰浓度
- 血管外给药后，药物被吸收进入血液循环的速度和程度称为
 - 药物在体内达到动态平衡时，体内药量与血药浓度的比值称为
 - 药物经血管外给药吸收后的血药浓度最大值称为

(9~11 题共用备选答案)

- A. 血药浓度-时间曲线下面积
 B. 达峰时间
 C. 表观分布容积
 D. 半衰期
 E. 峰浓度
- 反映药物吸收程度的是
 - 反映药物体内分布广泛程度的是
 - 反映药物消除快慢程度的是

三、X型题（多项选择题）

- 关于药物与血浆蛋白结合的叙述中，正确的是
 - 是永久性的
 - 结合后药理活性暂时消失
 - 是可逆的
 - 结合后不能通过毛细血管壁
 - 特异性较低
- 药物的体内过程包括
 - 吸收
 - 激动受体
 - 分布
 - 代谢
 - 排泄
- 下列药物中，具有药酶诱导作用的药物有
 - 灰黄霉素
 - 苯巴比妥
 - 氯霉素

D. 苯妥英钠

E. 利福平

参考答案:

1. D 2. A 3. B 4. B 5. B 6. B 7. C 8. E 9. A 10. C 11. D 12. BCDE
13. ACDE 14. ABDE

第2章 药物效应动力学

■ 考点进阶详解

一、药物的基本作用

1. 药物的治疗作用 指患者用药后所引起的符合用药目的的作用。

(1) 对因治疗: 针对病因治疗, 用药目的在于消除原发致病因子, 彻底治愈疾病。如抗菌药。

(2) 对症治疗: 用药目的在于改善疾病症状, 但不能消除病因。如解热镇痛药。

提倡“急则治其标, 缓则治其本”, 有时应“标本兼治”。

2. 药物的不良反应 指凡不符合用药目的, 并给患者带来不适或痛苦的反应。根据治疗目的、用药剂量大小及不良反应严重程度, 可以分为以下几类。

(1) 副作用: 药物在治疗剂量时出现的与治疗无关的不适反应。一般不严重, 多数可以恢复, 但难以避免。如阿托品治疗胃肠痉挛时引起的心悸、便秘等副作用; 阿托品在麻醉前给药, 可抑制呼吸道腺体分泌, 但口干即成为副作用, 故有时副作用和治疗作用可以互相转变。

(2) 毒性反应: 因药物剂量过大或在体内蓄积过多发生的危害机体的反应, 一般较严重, 是可以预知和避免的。①急性毒性: 短期内过量用药而立即发生的毒性。②慢性毒性: 长期用药在体内蓄积而逐渐发生的毒性。致癌、致畸胎、致突变的“三致反应”也属于慢性毒性范畴。

(3) 变态反应(过敏反应): 是指机体受药物刺激产生的异常免疫反应, 引起机体生理功能障碍或组织损伤。反应与药理作用、使用剂量和疗程无关, 药理拮抗药解救无效。如青霉素过敏。对于易过敏的药物或过敏体质者, 用药前应进行过敏试验。

(4) 后遗效应: 指停药后血药浓度已降至阈浓度以下时仍残存的药理效应, 如应用巴比妥类的宿醉现象。

(5) 继发反应: 由于药物治疗作用引起的不良反应, 如二重感染。

(6) 停药反应: 指长期用药, 突然停药后原有疾病的加剧, 又称反跳反应。如长期服用 β 受体阻滞药, 应逐步减量以免发生危险。

(7) 特异质反应: 指某些药物可使少数病人出现特异性的不良反应, 反应性质可能与正常人不同, 是一种遗传性生化缺陷。如红细胞葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏患者, 服用磺胺等具有氧化作用的药物时, 可引起溶血。

二、药物剂量和效应关系(量-效关系)

1. 量-效关系 是指用药剂量与药物效应之间的关系, 一般随用药剂量增加而药物效应增强。以横坐标为剂量, 纵坐标为药理效应绘制的曲线称量效曲线。

2. 药理效应按性质分为 ①量反应: 药理效应强弱呈连续增减的量变, 可用数或量的分级表示, 如血压的升降、平滑肌的舒缩等。②质反应: 有些药理效应只能用全或无、阳性或阴性表示, 如死亡与生存、抽搐与不抽搐等。

3. 药理学基本概念

(1) 最小有效量(阈剂量或阈浓度): 出现疗效所需的最小剂量。

(2) 最大效应(E_{max})或效能: 是指在一定范围内, 增加药物剂量或浓度, 其效应强度随之增加, 但效应增至最大时, 继续增加剂量或浓度, 效应不能再上升。反映药物的内在活性。

(3) **效价强度**: 是指能引起等效反应 (一般用 50%效应量) 的相对剂量或浓度, 用于作用性质相同的药物之间的等效剂量的比较。反映药物与受体的亲和力。用量越大, 效价强度越小。

(4) **半数有效量 (ED₅₀)**: 是指引起 50%阳性反应 (质反应) 或 50%最大效应 (量反应) 的浓度或剂量。

(5) **半数致死量 (LD₅₀)**: 引起半数动物死亡的剂量。

(6) **治疗指数 (TI)**: 半数致死量和半数有效量的比值 (LD₅₀/ED₅₀), 比值越大, 相对安全性越大, 反之越小。

(7) **安全范围**: LD₅ 与 ED₅₀ 或 LD₁ 与 ED₉₉ 之间的距离, 值越大越安全。

三、药物作用机制的类型

1. 作用于特定靶点 受体、酶、核酸、离子通道、载体、免疫系统等。

2. 非特异性作用 无特异性作用机制, 有些药物通过简单的理化反应发挥作用; 有些药物作用主要与其理化性质有关, 通过改变环境的理化条件而发挥作用; 有些药物补充机体所需物质。

四、药物与受体

1. 受体的特征

(1) **饱和性**: 受体的数量是有限的, 能结合的配体量也是有限的。

(2) **特异性**: 特定的受体只能与其特定的配体结合, 产生特定的生理效应。

(3) **可逆性**: 配体与受体的结合是可逆的, 可被另一种特异性配体所置换。

(4) **高灵敏度**: 很低浓度的配体就能与受体结合而产生显著效应。

(5) **多样性**: 同一受体可分布于不同组织或同一组织的不同区域, 受体密度不同。

2. **受体类型** 根据受体蛋白结构、信息转导过程、效应性质、受体位置等特点, 可分为 G-蛋白偶联受体 (第二信使包括 cAMP、cGMP、IP₃、DG、Ca²⁺等)、配体门控的离子通道受体、酶活性受体、细胞核激素受体。

五、激动药与拮抗药

根据药物的亲和力和内在活性, 可分为激动药和拮抗药。

1. **激动药** 能激活受体的配体, 与受体有较强的亲和力和较强的内在活性。

(1) **完全激动药**: 具有较强的亲和力和内在活性 ($\alpha=1$)。

(2) **部分激动药**: 与受体有较强的亲和力和较弱的内在活性 ($0<\alpha<1$)。

(3) **负性激动药**: 药物能引起与原来激动药相反的生理效应。

2. **拮抗药** 与受体有较强的亲和力, 但无内在活性 ($\alpha=0$), 因占据受体而拮抗激动药的作用。

(1) **竞争性拮抗药**: 可与激动药竞争与相同受体结合, 产生竞争性抑制作用, 使激动药的量效曲线平行右移, 斜率和高度 (E_{\max}) 不变。

(2) **非竞争性拮抗药**: 与受体牢固或不可逆结合, 使激动药的量效曲线右移, 斜率和高度 (E_{\max}) 降低。

六、受体的调节

1. **受体脱敏** 长期使用激动药, 组织或细胞对激动药的敏感性和反应性下降的现象, 受体下调。

2. **受体增敏** 长期使用拮抗药, 组织或细胞对激动药的敏感性和反应性增高的现象, 受体上调。

考点总结

内 容	重要知识点	考 频	试题题干
药物的基本作用	治疗作用、对因治疗、对症治疗、不良反应、副作用(2011年)、毒性反应(2008年)、后遗效应、停药反应(2008年)、变态反应、继发反应、特异质反应(2008年)的概念及意义(2008、2011年)	历年常考	药物剂量过大或体内蓄积过多时会发生; 药物产生副作用的原因
药物量效关系	量效关系、量效曲线、量反应、质反应、最小有效量、效价强度(2010、2012年)、效能(2010、2012年)、半数有效量、半数致死量、治疗指数(2012年)的概念及意义	历年常考	反映药物内在活性的是
药物的作用机制	1. 受体的特性、类型(2008年) 2. 激动药、拮抗药的特点(2011年)	历年常考	下列物质属第二信使的有; 与受体有亲和力, 内在活性强的药物是

经典试题

一、A型题(最佳选择题)

- 药物副作用是指
 - 药物蓄积过多引起的反应
 - 在治疗剂量时, 机体出现与治疗目的无关的不适反应
 - 停药后血药浓度已降至阈浓度以下时产生的不适反应
 - 极少数人对药物特别敏感产生的反应
 - 过量药物引起的肝、肾功能障碍
- 半数有效量(ED_{50})是指
 - 药物产生最大效应时所需剂量的一半
 - 引起50%阳性反应(质反应)或50%最大效应(量反应)的浓度或剂量
 - 一半动物产生毒性反应的剂量
 - 产生等效反应所需剂量的一半
 - 常用治疗量的一半
- 关于受体, 正确的是
 - 与配体结合无饱和性
 - 与配体结合不可逆性
 - 结合配体的结构多样性
 - 是位于细胞核上的基因片断
 - 均有相应的内源性配体
- 五种药物的 LD_{50} 和 ED_{50} 值如下所示, 最有临床意义药物是
 - $LD_{50}: 50\text{mg/kg}, ED_{50}: 25\text{mg/kg}$
 - $LD_{50}: 25\text{mg/kg}, ED_{50}: 15\text{mg/kg}$
 - $LD_{50}: 25\text{mg/kg}, ED_{50}: 20\text{mg/kg}$
 - $LD_{50}: 25\text{mg/kg}, ED_{50}: 10\text{mg/kg}$
 - $LD_{50}: 25\text{mg/kg}, ED_{50}: 5\text{mg/kg}$
- 激动药使受体数目减少的现象是
 - 受体向上调节
 - 受体向下调节
 - 改变受体分布
 - 受体偶联G蛋白加强
 - 受体与G蛋白脱偶联

二、B型题(配伍选择题)

(6~8题共用备选答案)

- 最小有效量
 - 效能
 - 效价强度
 - 治疗指数
 - 安全范围
- 反映药物内在活性的是
 - LD_{50} 与 ED_{50} 的比值是
 - 引起等效反应的相对剂量或浓度是

(9~10题共用备选答案)

- 激动药
- 部分激动药
- 负性激动药
- 受体调节药

E. 拮抗药

9. 与受体有亲和力, 内在活性强的药物是

10. 与受体有较强的亲和力, 但缺乏内在活性的药物是

(11~12 题共用备选答案)

A. 量反应

B. 停药反应

C. 不良反应

D. 变态反应

E. 质反应

11. 平滑肌舒缩反应的测定

12. 疗效用痊愈、显效、无效为指标表示

三、X 型题 (多项选择题)

13. 下列何种治疗为对因治疗

A. 强心苷治疗心瓣膜引起的心力衰竭

B. 氢氯噻嗪治疗水肿

C. 青霉素治疗肺炎球菌性肺炎

D. 氯喹治疗疟疾

E. 碳酸氢钠治疗消化性溃疡

14. 关于药物效价强度, 正确的是

A. 药物产生最大效应的能力

B. 药物达到一定效应所需的剂量

C. 反映药物本身的内在活性

D. 反映药物与受体的亲和力

E. 常用产生50%最大效应时的剂量来表示

15. 药物产生毒性反应的原因有

A. 用药剂量过大

B. 机体对药物过于敏感

C. 药物有抗原性

D. 用药时间过长

E. 机体有遗传性疾病

参考答案:

1. B 2. B 3. E 4. E 5. B 6. B 7. D 8. C 9. A 10. E 11. A 12. E 13. CD

14. BDE 15. AD

第3章 影响药物作用的因素

考点进阶详解

一、药物方面的因素

1. 药物剂量和疗程

(1) 给药剂量：一定范围内，随剂量增加药效增强，超量则引起不良反应甚至中毒。临床一般采用常用量。同一药物不同剂量下，药理作用不同，用途不同，不良反应也随之变化。如镇静催眠药，剂量由小到大，体现为抗焦虑、镇静、催眠、抗惊厥和抗癫痫作用。另外，需要注意个体差异，做到给药个体化。

(2) 给药时间：不同的用药时间也可影响到药物的疗效和不良反应的发生。一般情况下，饭前用药吸收好，作用发挥快；饭后用药吸收较差，作用较慢。对于某些特殊的药物需要根据特点调整给药时间。另外需要注意正确的服药方法。

(3) 疗程：给药的次数应根据药物的消除速率、病情需要而定。对 $t_{1/2}$ 短的药物，给药次数相应增加，对于消除慢的或毒性大的药物应规定每日的用量和疗程。肝、肾功能减低时，应适当减少给药次数，以防止蓄积中毒。

①耐受性：指连续用药后机体对药物的反应强度递减，需加大剂量才能维持原有疗效。少数药物在短时间内，应用几次后很快出现耐受，称为快速耐受性，如麻黄碱。机体对某药产生耐受性后，又对另一种药物敏感性也降低，称为交叉耐受性，如乙醇和巴比妥。

②耐药性（抗药性）：在化学治疗中，病原微生物对抗菌药物的敏感性降低甚至消失。由一种药物诱发，同时对其他多种结构或作用机制完全不同的药物产生交叉耐药，导致化疗失败，称为多药耐药。

③药物依赖性：某些麻醉药品或精神药品，直接作用于中枢神经系统，使之兴奋或抑制，连续使用可使机体对药物产生生理的或心理的或兼而有之的一种依赖或需求。

a. 生理依赖性（身体依赖性）：是由于反复用药造成身体适应状态而产生欣快感，一旦中断用药，可出现强烈的戒断综合征。

b. 精神依赖性（心理依赖性）：是指用药后产生愉快满足的感觉，使用药者在精神上渴望周期性或连续用药，以达到舒适感。

2. 给药途径 不同给药途径的药物吸收速度不同，一般规律是静脉注射 >（快于）吸入 > 肌肉注射 > 皮下注射 > 口服 > 直肠 > 贴皮给药。

给药途径不同，有些药物的作用也可能不同，如硫酸镁肌内注射或静脉注射产生镇静、解痉和降低颅内压的作用，口服则导泻。

3. 药物相互作用 两种或多种药物合用或先后应用，引起药物作用和效应的变化。

(1) 药动学相互作用①妨碍药物吸收（如胃肠道 pH 改变、形成络合物、影响胃排空和肠蠕动）。②影响分布和转运（竞争与血浆蛋白结合）。③影响药物代谢（药酶诱导、药酶抑制）。④影响药物排泄（竞争肾小管主动排泌、改变血液尿液 pH）。

(2) 药效学方面①协同作用：合并用药可使药物的疗效或毒性较单一用药时有所增强。a. 相加作用：两药合用的效应是两药作用之和，如降压药的联合使用。b. 增强作用：两药合用的效应大于其个别效应的代数和，如磺胺类药物与甲氧苄啶的合用。c. 增敏作用：某药可使组织或受体对另一药的敏

感性增强,如钙增敏剂。②拮抗作用:合并用药使原有的药物效应减弱,小于其分别作用的。a. 药理性拮抗:如拮抗药与激动药。b. 生理性拮抗:两个激动药分别作用于生理作用相反的受体。c. 生化性拮抗:如药酶诱导剂使同用其他的药物代谢加快。d. 化学性拮抗:通过药物间化学中和或络合等反应作用,如重金属中毒用二巯丙醇与之络合进行解救。

二、机体方面的因素

1. 年龄 对于婴幼儿、老年人,其对药物的反应性、耐受性和器官功能与成年人不同,故剂量与成年人不同。如新生儿肝功能发育不完全,服用氯霉素可致灰婴综合征;儿童服用四环素可致四环素牙;老年人对某些中枢抑制药反应增强,服用非甾体抗炎药易致胃肠出血。

2. 性别 妇女受月经、妊娠、分娩、哺乳期等影响,选择药物要注意。如在妊娠的最初3个月内,禁用抗代谢药、激素等能引起致畸的药物;临产前禁用吗啡等镇痛药,因可抑制胎儿的呼吸;哺乳期用药避免影响婴儿的药物,因有些药物可进入乳汁。

3. 病理因素 病人的功能状态、病理状态、其他疾病等可影响药物的作用。如解热镇痛药对正常体温无影响,但对发热患者有退热作用。

4. 精神因素 患者对医生的信任和乐观情绪有利于疾病的治疗,对药效产生正面影响;对医生的排斥和悲观情绪不利于疾病的治疗,对药效产生负面影响。患者服用不具药理活性的安慰剂,也可取得一定的疗效。

5. 时辰因素 根据人体的昼夜节律,选择最佳用药时间,使之与人体生理节律同步,以达到最佳疗效,避免药物因持续性高浓度而产生不良反应。如糖皮质激素分泌高峰在上午8时作用,宜上午7—8时一次服用。

6. 遗传因素 临床用药个体间存在明显的差异。

(1) 种族差异:许多药物代谢酶的遗传多态性存在于种族之间。如乙酰转移酶为磺胺类药物、异烟肼、对氨基水杨酸、普鲁卡因胺等药物在体内的代谢酶,此酶对于亚洲人多为快乙酰化型,对于白种人多为慢乙酰化型。

(2) 特异体质:某些个体对药物产生不同于正常人的反应,与遗传缺陷有关。遗传学葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏者,服用伯氨喹、磺胺类、阿司匹林、对乙酰氨基酚,可引起缺血性贫血。

(3) 个体差异:在基本条件相同的情况下,少数病人对药物的反应不同,称个体差异。不同个体对药物的敏感性不同,有超敏性、低敏性。

(4) 种属差异:不同动物种属间对同一药物的反应和药动学有很大差异。

考点总结

内容	重要知识点	考频	试题题干
药物因素	1. 影响药物作用的药物因素 2. 耐受性(2011年)、快速耐受性、耐药性(2011年)、药物依赖性、生理依赖性、精神依赖性的概念 3. 不同给药途径,药物起效速度和作用不同 4. 协同(增强、相加、增敏)、拮抗(生理性、药理性、生化性、化学性)	历年 偶考	连续用药后,机体对药物的反应性降低称为
机体因素	1. 影响药物作用的机体方面因素(2011年) 2. 儿童(2008年)、老年人用药特点	历年 偶考	影响药物作用的机体因素包括:儿童处于非清醒状况、伴有呕吐,宜采用的给药途径为

经典试题

一、A型题（最佳选择题）

- 对同一药物来讲，下列描述中错误的是
 - 在一定范围内剂量越大，作用越强
 - 对不同个体，用量相同，作用不一定相同
 - 用于妇女时，效应可能与男性有别
 - 成年人应用时，年龄越大，用量应越大
 - 小儿应用时，可根据其体重计算用量
- 儿童处于非清醒状况、伴有呕吐，宜采用的给药途径为
 - 口服给药
 - 舌下给药
 - 直肠给药
 - 鼻腔给药
 - 吸入给药
- 对某些老年人，服药后会出现兴奋、甚至精神失常的药物是
 - 苯二氮草
 - 阿司匹林
 - 依那普利
 - 阿托品
 - 阿莫西林

二、B型题（配伍选择题）

（4~7题共用备选答案）

- 快速耐受性
 - 药物依赖性
 - 耐药性
 - 耐受性
 - 反跳现象
- 长期注射吗啡可产生
 - 麻黄碱短期内连续用可产生
 - 长期应用抗病原微生物药可产生
 - 硝酸甘油连续用药一段时间后可产生

参考答案：

1. D 2. C 3. D 4. B 5. A 6. C 7. D 8. C 9. B 10. C 11. D 12. E 13. ABCD
14. ABCD 15. BCD

（8~12题共用备选答案）

- 相加作用
 - 药理性拮抗作用
 - 增强作用
 - 生理性拮抗
 - 化学性拮抗
- SMZ+TMP 合用
 - 受体的拮抗药与激动药之间的相互作用
 - 应用普鲁卡因注射液进行局麻时，加入少量肾上腺素
 - 分别作用于生理作用相反的特异性受体的激动药之间的相互作用
 - 静脉注射鱼精蛋白注射液解救肝素过量引起的出血

三、X型题（多项选择题）

- 影响药物作用的机体方面的因素有
 - 年龄
 - 性别
 - 病理状态
 - 精神因素
 - 剂型
- 药物影响其作用的本身因素有
 - 药物的剂型
 - 药物的剂量
 - 药物的生物利用度
 - 药物的给药途径
 - 药物的有效期是否已过
- 由于影响药物代谢而产生药物相互作用的有
 - 口服降糖药与口服抗凝药合用时出现低血糖或导致出血
 - 酮康唑与特非那定合用导致心律失常
 - 氯霉素与双香豆素合用导致出血
 - 利福平与口服避孕药合用导致避孕失败
 - 地高辛与考来烯胺同服时疗效降低