

医学第七轮教材“轻松突破”系列

翻不完的厚厚的教科书，让人望而生畏；

盼不响的下课铃声，让人焦躁烦闷。

哪里才是需要掌握的要点？

哪里才是考试的重点？

如何记住这些庞杂而生涩的医学知识？

请打开轻松高效的——

药理学

——听课、记忆与测试

“医行天下”医学学习记忆编委会 编



激情与梦想同在——【与“医”共舞——读典故入佳境】



效率与目标共存——【课堂记录——听要点抓考点】



挑战与技巧双赢——【记忆处方——重理解活思维】



实战与应用并举——【课后巩固——练知识增考技】



奋斗与悠闲并重——【抒情畅怀——赏唐诗提素质】



第二军医大学出版社

Second Military Medical University Press

医学第七轮教材“轻松突破”系列

药 理 学

——听课、记忆与测试

“医行天下”医学学习记忆编委会 编

第二军医大学出版社

图书在版编目(CIP)数据

药理学——听课、记忆与测试/“医行天下”医学学习记忆
编委会编—上海：第二军医大学出版社，2009.5

(医学第七轮教材“轻松突破”系列)

ISBN 978-7-81060-906-7

I. 药... II. 医... 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(2009)第 002778 号

出版人 石进英
责任编辑 李睿旻

药理学——听课、记忆与测试

“医行天下”医学学习记忆编委会 编

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

江苏句容排印厂印刷

开本：787×1 092 1/16 印张：17 字数：588 千字

2009 年 5 月第 1 版 2009 年 5 月第 1 次印刷

ISBN 978-7-81060-906-7/R·710

定价：32.00 元

“医行天下”医学学习记忆编委会

(按姓氏笔画排列)

| | | | | |
|-----|-----|-----|-----|-----|
| 王 红 | 王永忠 | 孔繁波 | 龙云霞 | 叶维新 |
| 史丽英 | 刘晶晶 | 朱永杰 | 付 涛 | 白 权 |
| 严玉群 | 吴华忠 | 李 梦 | 李希浩 | 杨红梅 |
| 苏 强 | 汤 宁 | 汤欣怡 | 张 奇 | 张桂蓉 |
| 郑 龙 | 周建建 | 周润华 | 钟先桂 | 袁继国 |
| 郭 丹 | 唐 宁 | 徐 霞 | 曹海军 | 温 艳 |
| 曾文俊 | 谭光明 | 管玉鹃 | | |

前言

有梦想才有希望,有希望才能坚持,有坚持才能成功

“轻松突破”系列丛书是配合医学第七轮统编教材学习,帮助学生高效听课、记忆与成功应考的一套系列书。该系列书的构架如下:

【与“医”共舞——读典故入佳境】 在每一章的前面有一篇与医学有关的典故或者历代名医的故事,以鲜活的例子引导学生对学医产生兴趣,从而以最佳状态进入学习。

【课堂记录——听要点抓考点】 按照第七轮教材的构架和行文,把该记的重点和考试的要点精炼但不遗漏地一一帮助学生纪录下来,相当于一个质量非常高的听课笔记或者授课教案,这样学生就可以尽量地把精力用在老师讲课内容和消化难点上,因而大大提高听课的效率。

【记忆处方——重理解活思维】 正如给病人看病一样,记忆处方是把难点指出来,把医学深奥的理论简单化、生活化,让学生插上记忆的翅膀,基础课将临床结合起来,临床课点出其理论基础。这样不但提高了学生的学习效率,也提高了对医学的兴趣,还能启发学生,使其在以后的工作中能举一反三,灵活应用,因为病人生病并不按照书本上说的得病,只有把知识领会贯通,才能真正地成为一个悬壶济世的好医生。

【课后巩固——练知识增考技】 检验学生学习好坏的标准就是考试,所以,大量的练习是应付考试的最好武器。本套丛书配有高质量的测试题,因为大部分试题是选自研究生入学考试、执业资格考试,所以不但对目前的学习有帮助,而且对以后的考试也非常有指导价值。选择题都配有答案,考虑到版面,其他试题的答案都放在网上,方便学生下载。

【抒情畅怀——赏唐诗提素质】 常有句话很值得我们深思:高文凭,低素质。同时,现在是个非常现实的社会,我们觉得有必要时刻提醒我们自己是炎黄子孙,有着深厚的历史文化,所以,最后一栏我们用唐诗来结束一章的学习,既放松心情,又能潜意识地提高学生的素质,一举两得。

根据上面的构架,不难看出本套丛书与以往的医学教辅书有着明显突出的特点,概括起来是:

1. 目标明确,紧密配套:每轮教材都有明显的不同,严格配套第七轮教材是本套丛书的宗旨。
2. 听课省时,记忆有方:抓住重点听课,挖掘记忆方法以及顺应记忆规律,把课本学会、学活是该系列的核心。
3. 边学边练,提高考技:取自考研和医师资格考试的试题是帮助学生成功结业的关键。
4. 版式新颖,劳逸结合:注重观赏性和综合美感也是该套丛书的一个亮点。

本套丛书适用于广大医学生使用,同时也是授课教师的较好参考书。由于成书时间仓促,书中难免有不妥之处,请广大读者和同仁批评指正。

编者

2009年3月

目 录

| | |
|-----------------------------------|---------|
| 第一章 药理学总论—绪言 | (1) |
| 第二章 药物代谢动力学 | (3) |
| 第三章 药物效应动力学 | (9) |
| 第四章 影响药物效应的因素 | (16) |
| 第五章 传出神经系统药理概论 | (21) |
| 第六章 胆碱受体激动药 | (25) |
| 第七章 抗胆碱酯酶药和胆碱酯酶复活药 | (27) |
| 第八章 胆碱受体阻断药(I)- M胆碱受体阻断药 | (30) |
| 第九章 胆碱受体阻断药(II)- N胆碱受体阻断药 | (34) |
| 第十章 肾上腺素受体激动药 | (36) |
| 第十一章 肾上腺素受体阻断药 | (46) |
| 第十二章 中枢神经系统药理学概论 | (53) |
| 第十三章 全身麻醉药 | (57) |
| 第十四章 局部麻醉药 | (63) |
| 第十五章 镇静催眠药 | (69) |
| 第十六章 抗癫痫药和抗惊厥药 | (76) |
| 第十七章 治疗中枢神经系统退行性疾病药 | (80) |
| 第十八章 抗精神失常药 | (85) |
| 第十九章 镇痛药 | (92) |
| 第二十章 解热镇痛抗炎药 | (98) |
| 第二十一章 离子通道概论及钙通道阻滞药 | (103) |
| 第二十二章 抗心律失常药 | (107) |
| 第二十三章 肾素-血管紧张素系统药理 | (112) |
| 第二十四章 利尿药 | (116) |
| 第二十五章 抗高血压药 | (123) |
| 第二十六章 治疗充血性心力衰竭的药物 | (129) |
| 第二十七章 调血脂药与抗动脉粥样硬化药 | (135) |
| 第二十八章 抗心绞痛药 | (139) |
| 第二十九章 作用于血液及造血器官的药物 | (145) |

| | | |
|-------|--------------------|-------|
| 第三十章 | 影响自体活性物质的药物 | (152) |
| 第三十一章 | 作用于呼吸系统的药物 | (162) |
| 第三十二章 | 作用于消化系统的药物 | (166) |
| 第三十三章 | 子宫平滑肌兴奋药和抑制药 | (171) |
| 第三十四章 | 性激素类药及避孕药 | (177) |
| 第三十五章 | 肾上腺皮质激素类药 | (180) |
| 第三十六章 | 甲状腺激素及抗甲状腺药 | (188) |
| 第三十七章 | 胰岛素及其他降血糖药 | (193) |
| 第三十八章 | 抗菌药物概论 | (198) |
| 第三十九章 | β -内酰胺类抗生素 | (202) |
| 第四十章 | 大环内酯类、林可霉素类及多肽类抗生素 | (211) |
| 第四十一章 | 氨基糖苷类抗生素 | (216) |
| 第四十二章 | 四环素类及氯霉素类 | (221) |
| 第四十三章 | 人工合成抗菌药 | (227) |
| 第四十四章 | 抗病毒药和抗真菌药 | (233) |
| 第四十五章 | 抗结核病药及抗麻风病药 | (239) |
| 第四十六章 | 抗寄生虫药 | (245) |
| 第四十七章 | 抗恶性肿瘤药物 | (251) |
| 第四十八章 | 影响免疫功能的药物 | (260) |
| 第四十九章 | 基因治疗 | (264) |

第一章 药理学总论 绪言



与“医”共舞——读典故入佳境

1997年诺贝尔生理学 and 医学奖获得者史坦利·布鲁希纳

1997年诺贝尔生理医学奖颁发给史坦利·布鲁希纳(Stanley Prusiner)教授。这项殊荣是肯定布鲁希纳在研究引起人类脑神经退化而成痴呆的古兹菲德-雅各病(CJD)病原体的贡献,并发现了朊蛋白(PRION),且在其致病机制的研究方面作出了杰出贡献。

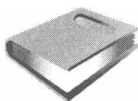
与CJD相类似的疾病还有人类的古鲁症、GSS病、山羊和绵羊的羊瘙痒病以及牛群中的疯牛病,它们都是由类似病原体所引起脑神经退化而产生的。布鲁希纳认为,将来可以开发安定正常病原素的构造的药物,以预防病原素病,阻止它变形;或者干脆把病原素的基因剔除。他已经在动物身上初步证明,剔除掉这部分基因,并不影响动物的健康,但还需进行长期而谨慎的观察。

布鲁希纳是美国加州大学旧金山分校生物化学教授,从事生化、神经和病毒的研究工作。1972年,他的一个病人死于CJD,之后他便致力于寻找这种病原体的工作。



课堂记录——听要点抓考点

1. 药物是指可以改变或查明机体的生理卫生功能及病理状态,可用以预防、诊断和治疗疾病的化学物质。
2. 药理学是研究药物与机体相互作用及作用规律的学科,既研究药物对机体的作用及作用机制,即药物效应动力学(药效学),也研究药物在机体的影响下所发生的变化及其规律,即药物代谢动力学(药动学)。
3. 药理学的学科任务:①阐明药物的作用及作用机制,为临床合理用药、发挥药物最佳疗效、防治不良反应提供理论依据;②研究开发新药,发现药物新用途;③为其他生命科学研究探索提供重要的科学依据和研究方法。
4. 新药是指未曾在中国境内上市销售的药品。已上市药品改变剂型、改变给药途径、增加新适应证亦属新药范围。
5. 新药研发可分为临床前研究、临床研究和上市后药物监测3个阶段。
6. 临床前研究主要由药学和药理学两部分内容组成。药学包括药物制备工艺路线、理化性质及质量控制标准等;药理学包括以实验动物为研究对象的药效学、药动学及毒理学研究。



课后巩固——练知识增考技

一、选择题

【A型题】

1. 新药临床评价的主要任务是

- A. 计算有关试验数据
B. 进行 1~4 期的临床试验
C. 实行双盲给药
D. 选择病人 (答案: B)
2. 药动学是研究
A. 药物作用的动能来源
B. 药物在体内的变化
C. 药物作用的动态规律
D. 药物在体内转运、生物转化及血药浓度随时间变化的规律 (答案: D)
- 【X 型题】
3. 药理学研究的主要任务是
A. 药物的分布
B. 药物的吸收
C. 药动学
D. 药效学 (答案: CD)

二、名词解释

1. 药理学 2. 药物 3. 毒物

三、填空题

1. 药理学是研究_____和_____之间相互作用规律的一门科学。它所阐明的主要内容包括两方面:_____和_____。
2. 新药研制过程大致可分为_____、_____、_____三步。



抒情畅怀——赏唐诗提素质

淮上喜会梁川故人

韦应物

江汉曾为客,相逢每醉还。
浮云一别后,流水十年间。
欢笑情如旧,萧疏鬓已斑。
何因北归去,淮上对秋山。

第二章 药物代谢动力学



与“医”共舞——读典故入佳境

1996 年诺贝尔生理学和医学奖获得者杜赫提和辛克纳吉

20 世纪 70 年代初期,免疫学家已经知道淋巴细胞能破坏并清除外来的病原菌,以及体内被感染的细胞,而未受感染的健康细胞不受影响。当时已经知道具有保护能力的淋巴细胞可分为 T 细胞和 B 细胞,其中 B 细胞产生的抗体能辨识并消灭细菌之类的微生物,但是 T 细胞如何辨认被微生物感染的细胞而加以消灭,这方面的问题尚未得出结论。当时,针对组织器官移植的研究显示,排斥现象是由于 T 细胞和移植器官的主要组织相容抗原作用造成的。除此之外,对于组织相容抗原的正常功能却不清楚。

杜赫提和辛克纳吉的研究对组织相容抗原在免疫作用的角色加以明确定位,并且为以后研究免疫系统对抗病毒的作用机制提供了正确方向。他们当时想探讨的问题是: T 细胞如何保护实验小鼠对抗一种脑膜炎病毒 LCMV 的感染? 小鼠在感染病毒后会产生杀手 T 细胞来毒杀受病毒感染的细胞。他们发现一个很有趣的现象,即杀手 T 细胞只会毒杀表现相同组织相容抗原的感染细胞,换言之,两种细胞之间的作用具有组织相容抗原限制性。这项看似简单的实验设计,所获得的结果却为免疫学开启了新的历史,具有攻击性的 T 细胞不仅是认得病毒所带的抗原。时至今日,分子结构的相关研究,使得这种作用机制呈现更清晰的蓝图。

这两位诺贝尔奖获得者的研究,是基础研究对临床医学贡献的极佳例证。除了上述对传染病免疫力的了解以及疫苗的开发外,同样也可被用于发展癌症疫苗的基础。此外对于自体免疫类疾病,例如类风湿关节炎、糖尿病等,也提供了较明确的探究方向。



课堂记录——听要点抓考点

一、药物分子的跨膜转运

(一) 药物通过细胞膜的方式

1. 滤过: 水溶性扩散。
2. 简单扩散(脂溶性扩散): 绝大多数药物以这种方式通过生物膜。
3. 载体转运: ①对转运物质有选择性;②因药物必须与数量有限的载体结合才能通过细胞膜,故具有饱和性;③结构相似的药物或内源性物质可竞争同一载体而具有竞争性,并可发生竞争性抑制。

记忆处方——重理解活思维

有两种方式: 主动转运和易化扩散。

(二) 影响药物通透细胞膜的因素

1. 药物通过细胞膜的速度与可利用的膜面积大小有关。

2. 膜表面大的器官,如肺、小肠,药物通过其细胞膜脂层的速度远比膜表面小的器官(如胃)快。

二、药物的体内过程

(一) 吸收

1. 药物自用药部位进入血液循环的过程称为吸收。
2. 口服:大多数药物在胃肠道内是以简单扩散方式被吸收的。
3. 首过消除:从胃肠道吸收入门静脉系统的药物在到达全身血液循环前必先通过肝脏,如果肝脏对其代谢能力很强,或由胆汁排泄的量,则使进入全身血液循环内的有效药物量明显减少,这种作用称为首过消除。
4. 不同给药途径有不同的吸收过程和特点:吸入、局部用药、舌下给药、注射给药。

(二) 分布

1. 药物吸收后从血循环到达机体各个部位和组织的过程称为分布。
2. 血浆蛋白的结合率:大多数药物在血浆中均可与血浆蛋白不同程度地结合而形成结合型药物,它与未结合的游离型药物同时存在于血液中,并以一定百分数的结合率而达到平衡。
3. 器官血流量和膜的通透性。
4. 组织细胞结合:因为药物与某些组织细胞成分具有特殊的亲和力,使这些组织中的药物浓度高于血浆游离药物浓度,使药物的分布具有一定的选择性。
5. 体液的 pH 值和药物的解离度:弱酸性药物在较碱性的细胞外液中解离增多,因而细胞外液浓度高于细胞内液,升高血液 pH 值可使弱酸性药物由细胞内向细胞外转运,降低血液 pH 值则使弱酸性药物向细胞内转移,弱碱性药物则相反。
6. 体内屏障:①血脑屏障;②胎盘屏障;③血眼屏障。

(三) 代谢

1. 药物代谢部位:体内各种组织均有不同程度的代谢药物的能力。

记忆处方——重理解活思维

肝脏是最主要的药物代谢器官。

2. 药物代谢步骤:大多数药物代谢发生于吸收进入血液后和肾脏排泄之前,也有少数药物代谢发生于肠腔和肠壁细胞内。
3. 药物代谢通常涉及 I 相和 II 相反应。
4. 细胞色素 P₄₅₀ 单氧化酶系:细胞色素 P₄₅₀ (CYP₄₅₀, 简称 CYP) 为一类亚铁血红素-硫醇盐蛋白的超家族,它参与内源性物质和包括药物、环境化合物在内的外源性物质的代谢。
5. 酶诱导可引起合用的底物药物代谢速率加快,因而药理作用和毒性反应增强或减弱。
6. 有些药物可抑制肝微粒体酶的活性,导致同时应用的一些药物代谢减慢。

(四) 排泄

1. 肾脏排泄:
 - (1) 肾小球滤过。
 - (2) 肾小管分泌:近曲小管细胞能以主动方式将药物自血浆分泌入肾小管内。
 - (3) 肾小管重吸收:①尿液酸性增高时,碱性药物解离程度随之增高,重吸收减少,酸性药物则相反。②尿液碱性增高时,酸性药物解离程度随之增高,重吸收减少,碱性药物相反。
 - (4) 肾功能受损时,以肾脏排泄作为主要消除途径的药物消除速度减慢,因此,给药量应相应减少,以避免产生蓄积作用。
2. 消化道排泄:
 - (1) 被分泌到胆汁内的药物及其代谢产物经由胆道及胆总管进入肠腔,然后随粪便排泄出去,经胆汁排入肠腔的药物部分可再经小肠上皮细胞吸收经肝脏进入血液循环,这种肝脏、胆汁、小肠间的循环称肠肝循环。

(2) 较大药量反复进行肠肝循环可延长药物的半衰期和作用维持时间。

记忆处方——重理解活思维

若中断药物的肝肠循环,其半衰期和作用时间均可缩短。

(3) 强心苷中毒后,口服考来烯胺可在肠内和强心苷形成络合物,中断其肠肝循环,加快从粪便中排泄。

3. 其他途径的排泄:

(1) 药物可经汗液、唾液和泪液排泄,但量很少,不重要。

(2) 药物经乳汁排泄的特点与上述相同。

(3) 药物可经头发和皮肤排泄,但量很少,以高度敏感的方法测定这些组织内的有毒金属具有法医学意义。

三、房室模型

房室概念: 将机体视为一个系统,系统内部按动力学特点分为若干房室。房室被视为一个假设空间,它的划分与解剖学部位或生理学功能无关,只要体内某些部位的转运速率相同,均视为同一室。

四、药物消除动力学

| | |
|---------|--|
| 一级消除动力学 | 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,血浆药物浓度高,单位时间内消除的药物就多,血浆药物浓度降低时,单位时间内消除的药物也相应降低 |
| 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 |

五、体内药物的药量-时间关系

(一) 一次给药的药-时曲线下面积

静脉注射形成的曲线,由急速下降的以分布为主的分布相和缓慢下降的以消除(包括代谢和排泄)为主的消除相两部分组成,而口服给药形成的曲线则是由迅速上升的以吸收为主的吸收相和缓慢下降的以消除为主的消除相两部分组成。

(二) 多次给药的稳态血浆浓度

1. 多次给药后药物达到稳态浓度的时间仅决定于药物的消除半衰期,一般来说,药物在剂量和给药间隔时间不变时,经 4~5 个半衰期可分别达到稳态浓度的 94% 和 97%。

2. 提高给药频率或增加给药剂量均不能使稳态浓度提前达到,而只能改变体内药物总量(即提高稳态浓度水平)或峰浓度($C_{ss, \max}$)与谷浓度($C_{ss, \min}$)之差。

六、药物代谢动力学重要参数

(一) 消除半衰期

1. 药物消除半衰期($t_{1/2}$)是血浆药物浓度下降一半所需要的时间。

记忆处方——重理解活思维

其长短可反映体内药物消除的速度。

2. 按一级动力学消除的药物的 $t_{1/2}$ 计算: $t_{1/2} = \frac{0.693}{k_8}$ 。

3. 按零级动力学消除的药物的 $t_{1/2}$ 计算: $t_{1/2} = 0.5 \frac{C_0}{k_0}$ 。

(二) 清除率

清除率(CL)是机体消除器官在单位时间内清除药物的血浆容积,也就是单位时间内有多少毫升血浆中所含药物被机体清除。

(三) 表观分布容积

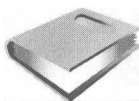
当血浆和组织内药物分布达到平衡后,体内药物按此时的血浆药物浓度在体内分布时所需体液容积称表观分布容积(V_d)。

(四) 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液循环内药物的百分率称生物利用度。

七、药物剂量的设计和优化

| | |
|-----|--|
| 维持量 | (1) 在大多数情况下,临床多采用多次间歇给药或是持续滴注,以使稳态血浆药物浓度维持在一个治疗浓度范围。因此,要计算药物维持剂量; (2) 为了维持选定的稳态浓度或靶浓度,需调整给药速度以使进入体内的药物速度等于体内消除药物的速度 |
| 负荷量 | (1) 因维持量给药通常需要 4~5 个 $t_{1/2}$ 才能达到稳态治疗浓度,增加剂量或者缩短给药间隔时间均不能提前达到稳态,只能提高药物浓度,因此如果病人急需达到稳态治疗浓度以迅速控制病情时,可用负荷量给药法; (2) 负荷量是首次剂量加大,然后再给予维持剂量,使稳态治疗浓度(即事先为该病人设定的靶浓度)提前产生 |



课后巩固——练知识增考技

一、选择题

【A 型题】

- 某药半衰期为 12 h,一次服药后大约经几天体内药物基本消除
A. 2
B. 1
C. 3
D. 4
(答案: C)
- 某药血浆半衰期为 24 h,若按一定剂量每天服药 1 次,约第几天血药浓度可以达稳态
A. 3
B. 2
C. 4
D. 5
(答案: D)
- 药物主动转运
A. 依赖于膜两侧药物浓度差
B. 消耗能量
C. 不受其他化学品的干扰
D. 转运速度没有饱和限制
(答案: B)
- 药物与血浆蛋白结合
A. 结合药物暂时失去活性
B. 结合后药效增强
C. 结合是牢固的
D. 见于所有药物
(答案: A)
- 在碱性尿中弱酸性药物
A. 解离多,再吸收多
B. 解离少,再吸收少
C. 解离少,再吸收多
D. 解离多,再吸收少
(答案: D)
- 按一级动力学消除的药物,其半衰期
A. 固定不变
B. 随给药剂量而变
C. 口服比静脉注射长
D. 随给药次数而变
(答案: A)
- 按每个半衰期恒量重复给药时,为缩短达到稳态血浓度的时间,可以

- A. 首次剂量加倍
B. 首次剂量增加 3 倍
C. 连续恒速静脉滴注
D. 增加每次给药量 (答案: A)
8. 能被保泰松增强生物转化的药物是
A. 氨基比林、可的松、洋地黄毒苷
B. 苯妥英钠、红霉素
C. 司可巴比妥、利福平
D. 双香豆素、乙醇 (答案: A)
9. 生物利用度是指口服药物的
A. 吸收入血液循环的量
B. 实际给药量
C. 消除的药量
D. 吸收入血液循环的量与实际给药量的相对量和速度 (答案: D)

【X 型题】

10. 消除半衰期 $t_{1/2}$
A. 按一级动力学消除药物, 经 5 个 $t_{1/2}$ 后, 体内 97% 药物被消除
B. 按零级动力学消除药物, 其 $t_{1/2}$ 与药物浓度无关
C. 按一级动力学消除药物, 其 $t_{1/2}$ 与药物浓度无关
D. 按零级动力学消除药物, 经 5 个 $t_{1/2}$ 后, 体内 97% 药物被消除 (答案: AC)
11. 能诱导肝药酶的药物是
A. 苯巴比妥
B. 灰黄霉素
C. 保泰松
D. 苯妥英钠 (答案: ABCD)
12. 药物与血浆蛋白结合
A. 药理活性暂时消失
B. 药物分子变大, 不易通过毛细血管
C. 可驱动药物的吸收
D. 是永久性的 (答案: ABC)
13. 药物的体内过程包括
A. 分布
B. 吸收
C. 生物转化
D. 排泄 (答案: ABCD)
14. 药物在体内与葡萄糖醛酸、硫酸等结合后
A. 脂溶性降低
B. 易从肾中排泄
C. 水溶性增加
D. 分子极性增加 (答案: ABCD)
15. 能抑制肝药酶的药物是
A. 异烟肼
B. 司可巴比妥
C. 西咪替丁
D. 双香豆素 (答案: ABCD)
16. 关于主动转运的叙述, 正确的是
A. 逆电化学梯度转运
B. 逆浓度梯度转运
C. 需要耗能
D. 具有化学结构特异性 (答案: ABCD)
17. 表观分布容积的叙述, 正确的是
A. 不反映体液的真实容量
B. 反映体液的真实容量
C. 药物吸收达到平衡时, 体内药物总量按血药浓度推算, 理论上应占有的体液容积
D. 多数药物的 V_d 值小于血浆容积 (答案: AC)

二、名词解释

- | | | | |
|------------|-------------|--------------|-----------|
| 1. 零级消除动力学 | 2. 一级消除动力学 | 3. 稳态血药浓度 | 4. 肝药酶诱导剂 |
| 5. 肝药酶抑制剂 | 6. 首关消除 | 7. 药物血浆蛋白结合率 | 8. 药物的消除 |
| 9. 肝肠循环 | 10. 药物血浆半衰期 | 11. 生物利用度 | |

三、填空题

1. 影响药物吸收的因素有 _____、_____、_____ 和 _____。

2. 药物被动转运的特点是_____、_____、_____和_____。药物主动转运的特点是_____、_____和_____。
3. 影响药物分布的主要因素有_____、_____、_____、_____和_____。
4. 药物生物转化的主要器官为_____。药物自体内排泄的途径有_____、_____、_____、_____、_____等。
5. 药物的消除是_____和_____的总称。
6. 根据药物的疗效可把药物的体内过程分为_____、_____和_____3个时期。
7. 大多数药物消除为_____，血中药物浓度过高、机体排泄能力达到饱和时，药物的消除则为_____。
8. 各种给药途径吸收速度，由快到慢的次序为_____、_____、_____、_____、_____、_____等。
9. 功能不良时，应禁用或慎用_____或_____的药物。
10. 药物必须能穿透_____，才具有中枢作用。
11. 药物与血浆蛋白结合后，具有以下特点：_____、_____、_____和_____。

四、问答题

试述体液 pH 值如何影响弱酸性和弱碱性药物在体内的吸收、分布和排泄。



抒情畅怀——赏唐诗提素质

赋得^①暮雨送李胄

韦应物

楚江^②微雨里，建业^③暮钟时。
漠漠帆来重，冥冥鸟去迟。
海门^④深不见，浦树远含滋。
相送情无限，沾襟^⑤比散丝^⑥。

注释：

- ① 赋得：分题赋诗，分到的什么题目，称为“赋得”。这里分得的题目是“暮雨”。
- ② 楚江：指长江。建业：今江苏南京。暮钟时：敲暮钟的时候。
- ③ 建业：今江苏南京。
- ④ 海门：长江入海处，在今江苏省海门市。
- ⑤ 沾襟：打湿衣襟。此处为双关语，兼指雨、泪。
- ⑥ 散丝：指细雨，这里喻流泪。

第三章 药物效应动力学



与“医”共舞——读典故入佳境

幸福的基础是身体健康。

——[法]居里夫人



课堂记录——听要点抓考点

一、药物的基本作用

(一) 药物作用与药理效应

1. 药物作用是指药物对机体的初始作用,是动因。
2. 药理效应是药物作用的结果,是机体反应的表现。
3. 功能提高称为兴奋,功能降低称为抑制。
4. 多数药物是通过化学反应而产生药理效应的。
5. 这种化学反应的专一性使药物的作用具有特异性。
6. 药物作用特异性的物质基础是药物的化学结构。
7. 药物作用的选择性是指在一定的剂量下,药物对不同组织器官作用的差异性。
8. 选择性形成的基础:药物体内分布的差异、机体组织细胞的结构不同、生化功能存在差异。

记忆处方——重理解活思维

药物作用特异性与选择性并不一定平行。

(二) 治疗效果

治疗效果,也称疗效,是指药物作用的结果有利于改变病人的生理、生化功能或病理过程,使患病的机体恢复正常。

| | |
|------|---|
| 对因治疗 | 用药目的在于消除原发病因子,彻底治愈疾病,称为对因治疗 |
| 对症治疗 | (1) 用药目的在于改善症状,称为对症治疗; (2) 对症治疗不能根除病因,但对病因未明暂时无法根治的疾病却是必不可少的 |

(三) 不良反应

1. 凡与用药目的无关,并为病人带来不适或痛苦的反应统称为药物不良反应。

记忆处方——重理解活思维

多数不良反应是药物固有的效应,在一般情况下是可以预知的,但不一定是能够避免的。

2. 少数较严重的不良反应较难恢复,称为药源性疾病,如庆大霉素引起的神经性耳聋。

| | |
|-------|--|
| 副反应 | (1) 因为选择性低,药理效应涉及多个器官,当某一效应作为治疗目的时,其他效应就成为副反应(通常也称副作用);例如阿托品用于解除胃肠痉挛时,可引起口干、心悸、便秘等不良反应; (2) 副反应是指在治疗剂量下发生的,是药物本身固有的作用,多数较轻微并可以预料 |
| 毒性反应 | (1) 是指在剂量过大或药物在体内蓄积过多时发生的危害性反应,一般比较严重; (2) 一般是可以预知的,应该避免发生; (3) 急性毒性多损害循环、呼吸及神经系统功能,慢性毒性多损害肝、肾、骨髓、内分泌等功能; (4) 致癌、致畸胎和致突变反应也属于慢性毒性范畴 |
| 后遗效应 | 后遗效应是指停药后血药浓度已降至阈浓度以下时残存的药理效应 |
| 停药反应 | 停药反应是指突然停药后原有疾病加剧,又称回跃反应 |
| 变态反应 | (1) 是一类免疫反应; (2) 非肽类药物作为半抗原与机体蛋白结合为抗原后,经过接触 10 d 左右的敏感化过程而发生的反应,也称过敏反应,常见于过敏体质病人; (3) 反应性质与药物原有效应无关,用药理拮抗药解救无效; (4) 反应的严重程度差异很大,与剂量无关,停药后反应逐渐消失,再用时可能再发; (5) 致敏物质可能是药物本身,也可能是其代谢物,也可能是制剂中的杂质; (6) 临床用药前虽常做皮肤过敏试验,但仍有少数假阳性或假阴性反应 |
| 特异质反应 | (1) 这是一类先天遗传异常所致的反应,但与药物固有的药理作用基本一致,反应严重程度与剂量成比例,药理性拮抗药救治可能有效; (2) 这种反应不是免疫反应,故不需预先敏感化过程 |

二、药物剂量与效应关系

1. 药理效应与剂量在一定范围内成比例,这就是剂量-效应关系(简称量-效关系)。
2. 用效应强度为纵坐标、药物剂量或药物浓度为横坐标作图,则得量-效曲线。
3. 药理效应按性质可以分为量反应和质反应两种情况。
4. 效应的强弱呈连续增减的变化,可用具体数量或最大反应的百分率表示者称为量反应。
5. 从量反应的量效曲线可以看出下列几个特定位点:

| | |
|----------------------|--|
| 最小有效量或最低有效浓度 | 即刚能引起效应的最小药量或最小药物浓度,亦称阈剂量或阈浓度 |
| 最大效应(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,若继续增加药物浓度或剂量而其效应不再继续增强,这一药理效应的极限称为最大效应,也称效能 |
| 半最大效应浓度(EC_{50}) | 指能引起 50%最大效应的浓度 |
| 效价强度 | 指能引起等效反应(一般采用 50%效应量)的相对浓度或剂量,其值越小则强度越大。药物的最大效应与效价强度含意完全不同,两者并不平行 |