

黑龙江省教育科研“十一五”规划重点课题  
卫生职业教育医学基础课程应用性系列教材

# 药理学学习指导

主编 范业宏 张云明

黑龙江科学技术出版社

黑龙江省教育科研“十一五”规划重点课题  
卫生职业教育医学基础课程应用性系列教材

# 药理学学习指导

主编 范业宏 张云明

江苏工业学院图书馆  
藏书章

黑龙江科学技术出版社

中国·哈尔滨

---

图书在版编目(CIP)数据

药理学学习指导 / 范业宏, 张云明主编. — 哈尔滨: 黑龙江科学技术出版社, 2009. 5

(黑龙江省教育科研“十一五”规划重点课题卫生职业教育医学基础课程应用性系列教材)

ISBN 978 - 7 - 5388 - 6173 - 0

I. 药… II. ①范…②张… III. 药理学—职业教育—教学参考资料 IV. R96

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2009)第 070294 号

---

责任编辑 石颖

封面设计 王刚

药理学学习指导

YAOLIXUE XUEXI ZHIDAO

主 审 关振华

主 编 范业宏 张云明

副主编 高琳 朱波 叶宁

---

出 版 黑龙江科学技术出版社

(150090 哈尔滨市南岗区湘江路 77 号)

电话(0451)53642106

印 刷 黑龙江神龙联合制版印务有限责任公司

发 行 黑龙江科学技术出版社

开 本 787 × 1092 毫米 1/16

印 张 8.125

字 数 180 千

版 次 2009 年 5 月第 1 版 · 2009 年 5 月第 1 次印刷

书 号 ISBN 978 - 7 - 5388 - 6173 - 0/R · 1591

定 价 120.00 元(共 5 册)

---

# 《药理学学习指导》编委会

主 审 关振华

主 编 范业宏 张云明

副主编 高 琳 朱 波 叶 宁

编 者 (按姓氏笔画排序)

叶 宁 卢诗军 朱 波

张云明 范业宏 邱洪波

高 琳 樊 蓉

# 目 录

(05)	.....	家畜学	(1)
(13)	.....	兽医微生物学	第八章
(17)	.....	点要时成	
(23)	.....	.....	
(27)	.....	家畜学	
(35)	.....	兽医微生物学	第十章
(39)	.....	点要时成	
<b>第一章 总论</b>	.....		<b>(1)</b>
( 知识要点	.....		(1)
( 习题	.....		(4)
( 参考答案	.....		(8)
<b>第二章 抗微生物药</b>	.....		<b>(11)</b>
( 知识要点	.....		(11)
( 习题	.....		(15)
( 参考答案	.....		(21)
<b>第三章 传出神经系统药物</b>	.....		<b>(24)</b>
( 知识要点	.....		(24)
( 习题	.....		(28)
( 参考答案	.....		(34)
<b>第四章 局部麻醉药</b>	.....		<b>(37)</b>
( 知识要点	.....		(37)
( 习题	.....		(38)
( 参考答案	.....		(39)
<b>第五章 中枢神经系统药</b>	.....		<b>(41)</b>
( 知识要点	.....		(41)
习题	.....		(45)
参考答案	.....		(52)
<b>第六章 抗组胺药、作用于子宫的药物</b>	.....		<b>(54)</b>
知识要点	.....		(54)
习题	.....		(55)
参考答案	.....		(58)
<b>第七章 作用于消化系统的药物</b>	.....		<b>(59)</b>
知识要点	.....		(59)
习题	.....		(61)
参考答案	.....		(64)
<b>第八章 作用于呼吸系统药</b>	.....		<b>(66)</b>
知识要点	.....		(66)
习题	.....		(68)

参考答案 .....	(70)
第九章 利尿药和脱水药 .....	(71)
知识要点 .....	(71)
习题 .....	(72)
参考答案 .....	(75)
第十章 心血管系统药物 .....	(76)
知识要点 .....	(76)
习题 .....	(79)
参考答案 .....	(84)
第十一章 血液和造血系统药物 .....	(86)
知识要点 .....	(86)
习题 .....	(88)
参考答案 .....	(92)
第十二章 激素类及有关药物 .....	(93)
知识要点 .....	(93)
习题 .....	(96)
参考答案 .....	(100)
综合模拟试题(一) .....	(103)
参考答案 .....	(107)
综合模拟试题(二) .....	(109)
参考答案 .....	(113)
综合模拟试题(三) .....	(115)
参考答案 .....	(119)
综合模拟试题(四) .....	(120)
参考答案 .....	(124)
(24) .....	
(25) .....	
(26) .....	
(24) .....	
(22) .....	
(28) .....	
(22) .....	
(28) .....	
(18) .....	
(18) .....	
(20) .....	
(20) .....	
(20) .....	

# 第一章 总论

## 【知识要点】

### 一、药物、药理学、药效学、药动学的概念

1. 药物:是指作用于机体,用于预防、治疗、诊断疾病或用于计划生育的化学物质。
2. 药理学:是研究药物与机体之间相互作用规律和作用机制的一门学科。
3. 药效学:研究药物对机体的作用、作用机制的科学。
4. 药动学:研究药物在体内的吸收、分布、生物转化和排泄等过程的科学。

### 二、药物的基本作用

药物的基本作用

- 兴奋作用:使机体功能活动增强的作用。  
如腺体分泌增加
- 抑制作用:使机体功能活动减弱的作用。  
如腺体分泌减少

### 三、药物作用的主要类型

#### 1. 局部作用和吸收作用

(1) 局部作用:是指未被吸收的药物在用药局部所呈现的作用。

(2) 吸收作用:是指药物吸收入血后随着血液循环分布到组织器官所发生的作用。

两者的区别在于是否吸收入血。

例如:口服碳酸氢钠用于中和胃酸作用,属于局部作用。

#### 2. 选择作用

选择作用是指药物在一定剂量下对某些组织器官作用明显,对有些组织器官作用不明显。

选择作用是相对的,与剂量大小有关;是药物分类和临床选择用药的依据。

#### 3. 防治作用

预防作用:是指提前用药以防止疾病或症状发生的作用。

例如接种卡介苗

治疗作用:包括对因治疗和对症治疗

#### 4. 不良反应

表 1-1 常见不良反应

名称	概念	举例
副作用	副作用是指治疗量时出现的与用药目的不符的作用。副作用和防治作用可随着用药目的不同而相互转化	阿托品用于麻醉前给药时出现的口干和视物模糊
毒性反应	主要是由于用药量过大、用药时间过长或机体对药物过于敏感引起的对机体明显损害的反应	链霉素的耳毒性

续表

名称	概念	举例
变态反应	又称过敏反应,是指少数致敏机体对某些药物产生的一种病理性免疫反应	青霉素引起的过敏性休克
继发反应	由药物的治疗作用引起的不良后果为继发反应	长期应用广谱抗生素导致体内敏感菌被抑制,不敏感菌乘机大量繁殖引起新的感染,成为“二重感染”
后遗效应	停药后血药浓度已降低至最低有效浓度以下时仍残存的药理效应为后遗效应	服用巴比妥类药物催眠时,次日清晨出现的宿睡现象
特异质反应	少数特异体质的病人对某些药物的反应特别敏感,很少的剂量即可产生超出常人的强烈的药理效应。与免疫无关多与遗传异常有关	先天性葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏者服用磺胺类药物易引起溶血反应

#### 四、受体学说

受体与药物结合引起生物效应的两个条件:亲和力与内在活性。

表 1-2 受体激动剂与受体阻断剂的比较

分类	亲和力	内在活性	受体的调节
受体激动剂	+	+	向下调节产生耐受性
受体阻断剂	+	-	向上调节出现停药反跳

#### 五、药动学

1. 跨膜转运 { 被动转运:不耗能、由高浓度向低浓度转运  
主动转运:耗能、由低浓度向高浓度转运、需要载体(高度特异性、饱和现象和竞争性抑制)

#### 2. 吸收

(1) 首关消除是指有些口服的药物首次通过肝脏时被灭活一部分,使进入体循环的药量减少,药效降低的现象。

首关消除明显的药物不宜口服。

舌下给药、直肠给药可避开首关消除。例如:硝酸甘油舌下含服。

(2) 生物利用度是指药物吸收进入人体循环的药物相对量和速度,即生物利用度取决于药物的吸收程度和吸收速度。

#### 3. 分布

- 药物与血浆蛋白结合具有的特点 { ①结合是可逆的  
②暂时失去药理活性  
③由于分子体积增大不易通过血管壁限制转运  
④药物之间具有竞争蛋白结合的置换现象

#### 4. 肝药酶

(1) 概念:存在于肝脏微粒体混合功能酶系统,可转化多种药物。

(2)特点:①特异性低;②个体差异大;③酶活性可受某些药物诱导或抑制。能使肝药酶活性增强或合成增多的药物称为药酶诱导剂。如苯妥英钠、利福平等。能使肝药酶活性减弱或合成减少的药物称为药酶抑制剂。如异烟肼。经肝代谢的药物与药酶诱导剂合用,药效降低;与药酶抑制剂合用,药效增强,不良反应加重。

### 5. 肾排泄

弱酸性药物在碱性尿液中解离的多,重吸收少,排泄快。

弱碱性药物在酸性尿液中解离的多,重吸收少,排泄快。

丙磺舒可抑制青霉素主动分泌,提高青霉素血药浓度,提高抗菌作用。

6. 肝肠循环:有的药物经胆汁排泄,在肠道再次被吸收入血,形成肝肠循环。存在肝肠循环的药物作用时间延长。

### 7. 半衰期

半衰期是指血浆药物浓度下降一半所需的时间。反映药物在体内消除速度的指标。

意义 { 是临床确定给药间隔的依据  
一次给药后,经 5 个半衰期,药物基本消除  
以半衰期为给药间隔恒量连续给药 5 个半衰期后,达到稳态血药浓度( $C_{ss}$ ),为迅速达到稳态血药浓度,可采用首次加倍

## 六、影响药物作用的因素

### 1. 药物的剂量

极量:出现最大的治疗作用,尚未引起毒性反应的量。

治疗量:是指最小有效量和极量之间的量。

常用量:临床上为了使疗效可靠又安全,常采用比最小有效量大些,比极量小些的量,即常用量。

反应药物安全性的指标 { 治疗指数:是半数致死量与半数有效量的比值( $LD_{50}/ED_{50}$ )  
安全范围:最小有效量与最小中毒量之间的范围

### 2. 机体方面

高敏性:有的人对某些药物特别敏感,应用较小极量即可产生较强的作用。

耐受性:机体对药物的敏感性较低,必须应用较大剂量方可呈现应有的治疗作用,称为耐受性。

耐药性:病原微生物、寄生虫或肿瘤细胞对化学治疗药物的敏感性下降。

{ 习惯性:有些药物应一段时间后,病人在精神上有主观的不适感觉而没有其他生理功能的紊乱,但有继续用药的要求,又称精神依赖性、心理依赖性  
成瘾性:病人在用药时产生欣快感,停药后出现严重的精神和生理功能的紊乱(戒断症状);又称为生理依赖性、身体依赖性

习惯性与成瘾性的本质区别在于是否有戒断症状。

【习 题】

(一) 选择题

A<sub>1</sub> 型题

1. 药物是

- A. 影响机体生理功能的化学物质
- B. 用于防治疾病的化学物质
- C. 干扰机体细胞代谢的化学物质
- D. 用于防治疾病、诊断疾病或用于计划生育的化学物质
- E. 对机体有滋补、营养作用的化学物质

2. 药效学研究

- A. 药物的临床疗效
- B. 机体对药物的处置过程
- C. 药物的消除规律
- D. 机体与药物之间相互作用的规律
- E. 药物对机体的作用规律及作用机制

3. 药动学研究

- A. 药物作用的动态规律
- B. 药物的体内过程及血药浓度随时间变化的规律
- C. 血药浓度的动力学过程
- D. 药物对机体的作用
- E. 药物在体内的化学变化

4. 药理学是研究

- A. 药物的化学结构及制剂工艺的学科
- B. 药物作用规律的学科
- C. 药物在体内变化过程的学科
- D. 药物不良反应的学科
- E. 药物与机体间相互作用规律及机制的学科

5. 药物的基本作用是指

- A. 预防作用与治疗作用
- B. 局部作用与全身作用
- C. 兴奋作用与抑制作用
- D. 选择性作用
- E. 副作用与治疗作用

6. 药物产生副作用是由于

- A. 病人对药物敏感
- B. 药物的安全范围小
- C. 药物作用的选择性低,作用范围广
- D. 用药剂量不当
- E. 用药时间过长

7. 副作用是在下列什么剂量时出现的

- A. 最小有效量
- B. 治疗量
- C. 最小中毒量
- D. 最小致死量
- E. 极量

8. 连续用药后机体对药物敏感性降低是

- A. 习惯性
- B. 耐受性
- C. 过敏性
- D. 成瘾性
- E. 耐药性

9. 药物产生过敏反应与下列哪项因素密切相关

- A. 年龄体重
- B. 药物剂量
- C. 药物毒性
- D. 体质
- E. 用药时间

10. 服用巴比妥类药物次晨出现的宿睡现象是

- A. 副作用      B. 后遗效应      C. 继发反应      D. 毒性反应      E. 过敏反应
11. 对药物毒性反应的正确认识是
- A. 治疗量时出现, 机体明显损害      B. 大剂量时出现, 机体轻微损害
- C. 大剂量时出现的机体明显损害      D. 治疗量时出现, 机体轻微损害
- E. 与剂量大小无关
12. 某患者因患有肺结核, 选用利福平、异烟肼和链霉素治疗, 用药两个月后患者相继出现耳鸣、听力减退、耳聋, 问发生了哪种类型不良反应
- A. 副作用      B. 后遗效应      C. 继发反应      D. 毒性反应      E. 过敏反应
13. 长期用药后突然停药, 机体出现戒断症状的是
- A. 习惯性      B. 耐受性      C. 过敏反应      D. 成瘾性      E. 耐药性
14. 药物治疗指数是指
- A.  $LD_{50}$  与  $ED_{50}$  之间的距离      B.  $ED_{95}/LD_5$  的比值
- C.  $ED_{90}/LD_{10}$  的比值      D.  $ED_{50}/LD_{50}$  的比值
- E.  $LD_{50}/ED_{50}$  的比值
15. 反映药物安全性的指标是
- A. 半数致死量      B. 最小有效量      C. 治疗指数      D. 最小中毒量      E. 半数有效量
16. 安全范围是指
- A. 有效量与中毒量间的范围      B.  $ED_{50}$
- C. 最小有效量与极量间的范围      D. 最大治疗量与最小中毒量间的范围
- E. 最小有效量与最小中毒量之间的范围
17. 药物的内在活性是指
- A. 药物与受体结合的能力      B. 药物激动受体的能力
- C. 药物跨膜转运的能力      D. 药物对受体亲和力的大小
- E. 药物脂溶性的高低
18. 受体激动药
- A. 有内在活性      B. 既有亲和力, 又有内在活性      C. 有亲和力
- D. 有亲和力, 无内在活性      E. 无亲和力, 有内在活性
19. 药物与受体结合后, 能否激动受体, 取决于
- A. 药物的作用强度      B. 药物的剂量大小
- C. 药物的内在活性      D. 药物的脂溶性大小
- E. 药物的分子量大小
20. 长期应用受体阻断剂, 受体数目增多的现象是
- A. 受体的向上调节      B. 受体的向下调节
- C. 药物的内在活性增强      D. 药物的脂溶性过低
- E. 药物的亲和力降低
21. 生物利用度是指
- A. 药物消除的速度      B. 药物跨膜转运的速度
- C. 药物分布到靶器官的量      D. 药物被机体吸收利用的程度

- E. 药物吸收进入血液循环的量
22. 生物利用度是反映什么的指标
- A. 蓄积 B. 分布 C. 吸收 D. 生物转化 E. 消除
23. 药物最常用的给药途径是
- A. 静脉注射 B. 雾化吸入 C. 肌肉注射 D. 皮下注射 E. 口服
24. 首关消除明显的药物不宜
- A. 肌肉注射 B. 舌下含服 C. 口服 D. 静脉注射 E. 皮下注射
25. 弱酸性药物在碱性尿液中
- A. 解离少,重吸收少,排泄慢 B. 解离多,重吸收多,排泄慢  
C. 解离多,重吸收少,排泄快 D. 解离少,重吸收少,排泄快  
E. 解离少,重吸收多,排泄慢
26. 药物与血浆蛋白结合后其
- A. 作用增强 B. 暂时失活 C. 转运加快 D. 代谢加快 E. 排泄加快
27. 药物在体内代谢的主要器官是
- A. 胃肠 B. 肺脏 C. 脾脏 D. 肾脏 E. 肝脏
28. 参与大多数药物在体内生物转化的酶是
- A. 单胺氧化酶 B. 葡萄糖醛酸转移酶  
C. 脱氢酶 D. 肝脏微粒体混合功能氧化酶(肝药酶)  
E. 水解酶
29. 经肝药酶转化的药物与药酶诱导剂合用后其效应
- A. 超强化 B. 完全消除 C. 无变化 D. 增强 E. 减弱
30. 机体排泄药物的主要器官是
- A. 肾脏 B. 汗腺 C. 唾液腺 D. 胃肠道 E. 胆道
31. 药物半衰期( $t_{1/2}$ )是指
- A. 稳态血药浓度下降一半所需时间 B. 组织中药物浓度下降一半所需时间  
C. 肝脏药物浓度下降一半所需时间 D. 有效血药浓度下降一半所需时间  
E. 血浆药物浓度下降一半所需时间
32. 为了迅速达到稳态血药浓度,可采取
- A. 增加单次给药量 B. 首次剂量加倍  
C. 增加给药次数,不改变单次给药量 D. 缩短给药间隔,增加单次给药量  
E. 延长给药间隔
33. 半衰期的长短取决于
- A. 消除速度 B. 给药速度 C. 吸收速度 D. 转运速度 E. 转化速度
34. 某药物半衰期为 8 小时,一次给药后从体内基本消除的最短时间是
- A. 1 天左右 B. 2 天左右 C. 3 天左右 D. 5 天左右 E. 10 天左右
35. 某女,38 岁,因患急性扁桃腺炎就诊,医生给予复方磺胺甲基异恶唑,并嘱首次剂量加倍服用,原因是
- A. 减小副作用 B. 延长作用时间

C. 预防耐药性形成 D. 在一个半衰期内达到稳态血药浓度

E. 缩短半衰期

36. 某男, 63 岁, 心慌、气短、呼吸困难, 心率 120 次/分, 口唇紫绀、颈静脉怒张、肝脾肿大、下肢水肿, 诊断为充血性心力衰竭, 给予地高辛每日 0.25mg 治疗, 已知地高辛半衰期为 36 小时, 估计病人用药后约几天上述症状得到改善

A. 3 天 B. 5 天 C. 7 天 D. 9 天 E. 11 天 (三)

37. 男, 35 岁, 因胃肠绞痛就诊, 医生给予解痉药阿托品 0.3mg 口服, 服药后症状缓解, 但患者出现视物模糊、口干等症状, 这是以下何种不良反应

A. 毒性反应 B. 副作用 C. 继发作用 D. 变态反应 E. 后遗效应

38. 男, 53 岁, 患冠心病, 近期心绞痛发作, 医生给予硝酸甘油 0.5mg, 嘱其舌下含服, 其目的是

A. 减少毒性反应 B. 避免首关消除 C. 防止产生耐受性

D. 防止耐药性产生 E. 减少胃肠道反应

### B<sub>1</sub> 型题

(39 ~ 40 题共用备选答案)

- A. 链霉素的耳毒性
- B. 服用巴比妥类药物次晨出现的宿睡现象
- C. 麻醉前给阿托品引起术后的尿潴留和腹胀
- D. 青霉素引起的过敏性休克
- E. 二重感染

39. 属于继发反应的是

40. 属于副作用的是

(41 ~ 43 题共用备选答案)

- A. 耐受性 B. 高敏性 C. 成瘾性 D. 耐药性 E. 习惯性

41. 连续用药机体对药物的敏感性降低

42. 长期应用抗生素细菌对药物敏感性降低

43. 少数病人应用小剂量药物就产生较强的药理作用, 甚至引起中毒

(44 ~ 46 题共用备选答案)

A. 在治疗剂量时出现, 与用药目的无关的作用

B. 与剂量大小及药理作用无关, 不易预知

C. 剂量过大或用药时间过长, 造成机体明显损害的反应

D. 停药后血药浓度降到有效浓度以下还残存的药效

E. 菌群失调症

44. 毒性反应

45. 继发反应

46. 变态反应

(二) 名词解释

47. 药物

48. 药效学

49. 副作用

50. 选择作用

51. 毒性反应    52. 后遗效应    53. 二重感染    54. 成瘾性  
55. 极量    56. 治疗量    57. 常用量    58. 治疗指数  
59. 受体激动药    60. 首关消除    61. 生物利用度    62. 肝肠循环  
63. 半衰期    64. 稳态血药浓度    65. 耐受性    66. 药酶诱导剂  
67. 配伍禁忌

(三) 填空题

68. 药物作用的两重性是指治疗作用和不良反应。  
69. 药物不良反应包括副作用、毒性反应、过敏反应、继发反应和停药综合征。  
70. 药物与受体结合引起生物效应的两个前提条件是药物与受体结合和药物与受体结合后引起受体构象改变。  
71. 长期应用受体拮抗药,可使相应受体数量减少,这种现象称为受体下调,突然停药可产生反跳现象。  
72. 长期应用受体激动药,可使相应受体数量增加,这种现象称为受体上调,它是机体对药物产生耐受性的原因之一。

(四) 判断题

73. 药物的基本作用包括治疗作用和不良反应。 ( )  
74. 口服抗酸药治疗消化性溃疡,属于药物吸收作用。 ( )  
75. 随着用药目的的改变,防治作用与副作用可以互相转变。 ( )  
76. 变态反应的发生与剂量无关,与药物原有作用无关,不易预知。 ( )  
77. 受体部分激动药与完全激动药合用时可起到协同作用。 ( )  
78. 脂溶性高、非解离型药物重吸收多,排泄慢。 ( )  
79. 经胆汁排泄的药物,在肠道内又被重吸收进入门静脉,形成肝肠循环。 ( )  
80. 凡能增强药酶活性或增加药酶生成的药物,称为药酶诱导剂。 ( )  
81. 治疗指数越大,药物毒性越大,越不安全。 ( )  
82. 药物的血浆半衰期可确定给药间隔,半衰期长,给药间隔时间就长。 ( )  
83. 习惯性和成瘾性都有主观需要连续用药的要求,二者的本质区别在于是否具有戒断症状。 ( )

(五) 简答题

84. 简述半衰期的意义。  
85. 区别习惯性与成瘾性。  
86. 什么是药物的选择性? 选择性什么意义?  
87. 什么是药酶抑制剂? 有何临床意义?

【参考答案】

1. D 2. E 3. B 4. E 5. C 6. C 7. B 8. B 9. D 10. B 11. C 12. D 13. D  
14. E 15. C 16. E 17. B 18. B 19. C 20. A 21. D 22. C 23. E 24. C 25. C  
26. B 27. E 28. D 29. E 30. A 31. E 32. B 33. A 34. B 35. D 36. C 37. B  
38. B 39. E 40. C 41. A 42. D 43. B 44. C 45. E 46. B

47. 药物:是指作用于机体,用于预防、治疗、诊断疾病或用于计划生育的化学物质。
48. 药理学:研究药物对机体的作用、作用机制的科学。
49. 副作用:是指药物在治疗量时出现的与用药目的无关的作用。
50. 选择作用:药物在一定剂量下对某些组织或器官作用特别明显,而对其他组织或器官的作用不明显或没有作用。
51. 毒性反应:由于用药剂量过大、用药时间过长或机体敏感性过高导致的对机体有明显损害的反应。
52. 后遗效应:停药后血药浓度已降至有效浓度以下时仍残存的药理效应。
53. 二重感染:长期应用广谱抗生素抑制或杀灭了敏感菌,不敏感菌则大量繁殖,导致菌群失调引起新的感染。
54. 成瘾性:又称身体依赖性,是由于反复用药造成机体的适应状态,中断用药可出现戒断症状,表现为烦躁不安、流泪、出汗、疼痛、恶心、呕吐、惊厥等,甚至危及生命。
55. 极量:能引起最大效应而未引起中毒的剂量,又称最大治疗量。
56. 治疗量:介于最小有效量与极量之间可使机体产生明显效应而不引起毒性反应的剂量。
57. 常用量:临床上为了使疗效可靠又安全,常采用比最小有效量大些,比极量小些的量。
58. 治疗指数:是评价药物毒性及安全性的指标。常用半数致死量(LD<sub>50</sub>)与半数有效量(ED<sub>50</sub>)之比表示。治疗指数越大,安全性越大。
59. 受体激动药:是指与受体有较强亲和力,又有较强内在活性的药物。
60. 首关消除:某些口服药物首次通过肝脏时即被转化灭活,使进入体循环的药量减少,药效降低,这种现象被称为首关消除。
61. 生物利用度:药物被机体吸收利用的程度。
62. 肝肠循环:从胆汁排入十二指肠的结合型药物在肠道经水解后再吸收入门静脉,这种小肠肝脏间的循环称为肝肠循环。
63. 半衰期:血浆药物浓度下降一半所需要的时间。
64. 稳态血药浓度:是指恒比消除的药物恒量恒速给药,约经过5个半衰期,消除速度与给药速度相等,血药浓度趋于稳定水平,此时的血药浓度称为稳态血药浓度。
65. 耐受性:机体对药物的敏感性较低,需要用较大的剂量才能达到应有的药效,称为机体对药物产生耐受性。
66. 药酶诱导剂:能使肝药酶活性增强或合成增多的药物称为药酶诱导剂。
67. 配伍禁忌:药物在体外配伍时发生物理、化学的相互作用而降低疗效,甚至产生毒性影响药物的使用。
68. 防治作用 不良反应
69. 副作用 毒性反应 过敏反应 后遗效应 继发反应 药物依赖性
70. 亲和力 内在活性
71. 增多 向上调节 反跳现象
72. 减少 向下调节 耐受性

73. × 74. × 75. √ 76. √ 77. × 78. √ 79. √ 80. √ 81. × 82. √  
83. √

84. ①确定给药间隔时间;②预测连续给药达到稳态血药浓度的时间;③估计停药后药物在体内基本消除的时间;④根据半衰期将药物分为短效类、中效类和长效类。

85. 习惯性(心理依赖性、精神依赖性)是指有些药物应用一段时间后,病人在精神上有主观的不适感觉而没有其他生理功能的紊乱,但有继续用药的要求。病人在用药时产生欣快感,停药后出现严重的精神和生理功能的紊乱(戒断症状),称为成瘾性(生理依赖性、身体依赖性)。二者本质区别在于是否有戒断症状。

86. 药物的选择性是指在治疗剂量范围内,药物对有些组织器官或系统发挥作用,而对其他组织器官作用很小或无作用,药物的这种特性称为选择性。

意义:①选择作用是相对的;②选择性高的药物针对性强,不良反应少;③选择性低的药物,作用广泛,针对性差,副作用多;④临床用药时,既要考虑药物的选择性,也要考虑给药剂量,既保证疗效,又安全。

87. 凡能减弱药酶活性或减少药酶生成的药物,称为药酶抑制剂。

意义:经肝代谢的药物与药酶抑制剂合用,可减缓药物的代谢,增高血药浓度,增强疗效。

## 第二章 抗微生物药

### 【知识要点】

#### 一、抗生素

#### 1. $\beta$ -内酰胺类

##### 青霉素

抗菌机制:抑制转肽酶,使粘肽合成减少,造成细胞壁缺损,失去保护性屏障作用,细菌膨胀裂解死亡。属于繁殖期杀菌剂。

抗菌谱: $G^+$ 球菌、 $G^+$ 杆菌、 $G^-$ 球菌、螺旋体、放线菌。

金葡菌对青霉素产生耐药性的原因:金葡菌与青霉素反复接触以后会产生青霉素酶,使青霉素的 $\beta$ -内酰胺环裂解,使其失去抗菌活性。

#### 临床应用

- ①革兰阳性球菌感染 化脓性链球菌感染引起的咽炎、扁桃体炎、中耳炎等,肺炎链球菌引起的大叶性肺炎、支气管炎
- ②革兰阴性球菌感染 淋病奈瑟菌引起的淋病、脑膜炎奈瑟菌引起的脑膜炎
- ③革兰阳性杆菌感染 白喉、破伤风等,因青霉素对这些细菌产生的外毒素无作用,所以必须及时合用相应的抗毒素
- ④螺旋体感染 钩端螺旋体病、梅毒、回归热
- ⑤放线菌感染 放线菌引起的局部肉芽肿样炎症、脓肿

不良反应:青霉素的严重不良反应是过敏性休克。表现为呼吸困难、胸闷、面色苍白、发绀、出冷汗、脉搏细弱、血压下降、昏迷、惊厥等,如不及时挽救可危及生命。

#### 防治措施

- ①询问过敏史
- ②皮试:凡初次注射、停药3天以上再次用药以及更换批号时均应做皮试,皮试阳性者禁用
- ③现用现配
- ④避免饥饿状态下给药
- ⑤备好抢救药物肾上腺素
- ⑥用药后观察 30min
- ⑦避免滥用和局部用药
- ⑧避免与其他药物混合注射
- ⑨一旦发生过敏性休克,立即皮下或肌肉注射 0.1% 肾上腺素 0.5~1ml