

5 年制全国高等医学院校辅导教材

# 药理学

## 要点与自测

■ 娄建石 主编  
杨宝峰



北京大学医学出版社

5年制全国高等医学院校辅导教材

# 药理学要点与自测

主 编： 娄建石 杨宝峰

副主编： 王 玲 李学军 爱 民

编 委 (以姓氏笔画为序)

方治平 教授 (四川大学医学院)

王 玲 教授 (哈尔滨医科大学)

王嘉陵 教授 (华中科技大学同济医学院)

任雷鸣 教授 (河北医科大学)

苏定冯 教授 (第二军医大学)

李学军 教授 (北京大学医学部)

李晓辉 教授 (第三军医大学)

李 智 教授 (中国医科大学)

杨世杰 教授 (吉林大学医学院)

杨宝峰 教授 (哈尔滨医科大学)

杨秋生 教授 (首都医科大学)

张岫美 教授 (山东大学医学院)

胡 刚 教授 (南京医科大学)

娄建石 教授 (天津医科大学)

爱 民 教授 (内蒙古医学院)

黄 民 教授 (中山大学医学院)

北京大学医学出版社

# YAOLIXUE YAODIAN YU ZICE

## 图书在版编目 (CIP) 数据

药理学要点与自测/娄建石, 杨宝峰主编. —北京:  
北京大学医学出版社, 2003  
5年制全国高等医学院校辅导教材  
ISBN 7-81071-514-3

I. 药… II. ①娄…②杨… 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 (2003) 第 102026 号

本书从 2004 年 4 月第 1 次印刷起封面贴防伪标记, 无防伪标记不准销售。

北京大学医学出版社出版发行

(100083 北京市海淀区学院路 38 号 北京大学医学部院内 电话: 010-82802230)

责任编辑: 靳新强

责任校对: 焦 娴

责任印制: 张京生

北京东方圣雅印刷有限公司印刷 新华书店经销

开本: 787mm×1092mm 1/16 印张: 20.5 字数: 520 千字

2004 年 4 月第 1 版 2004 年 4 月第 1 次印刷 印数: 1-8000 册

定价: 28.80 元

版权所有 不得翻印

# 序

为了适应医学教育改革以及加强教材建设的需要，北京大学医学部、首都医科大学、天津医科大学、哈尔滨医科大学、内蒙古医学院等五所医学院校共同研究决定编写一套以本科五年制为基础的医学生教材。

出版这套教材的目的在于：

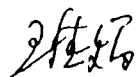
1. 教材内容要更新，以适应于面向 21 世纪医师的要求。近年来，医学科技突飞猛进，疾病谱发生了重大变化，疾病的预防、诊断、治疗的技术手段明显提高。新编写的教材一定要反映这些新的成果。

2. 医师的服务对象是人，医师不仅需要深厚的医学基础知识、临床学科的知识，还需要增加人文社会科学，比如卫生法学、卫生经济学、心理学、伦理学、沟通技巧与人际关系等知识。因此新编写教材应增加新的学科内容以及学科之间的融合和交叉。

3. 教育，包括医学教育要逐步走向全球化，我们培养的医师应得到国际认可。最近，世界医学教育联合会、美国中华医学基金会都制定出了医学教育的国际标准或人才培养的最低基本要求。这也为我们编写这套教材提供了一个参照系。

我们计划编写 30 多种教材，在主编和编者的人选方面精心挑选，既有学术知名度，又有丰富的教学经验，并且认真做到老中青结合。在内容、体例、形式、印刷、装帧等方面要有特色，力求有启发性以引起学生的兴趣，启发创新思维。要提高学生的英语水平，教材中体现英文专业词汇的使用，书后配英文专业词汇只读光盘。

在教材编写和教材建设工作中，目前教育部提出要百花齐放，打破过去一本教材一统天下的局面，我们希望这套教材能在竞争中脱颖而出。这套教材编写过程中得到北京大学医学出版社的大力支持，在此表示感谢！错误不足之处还希望同仁们批评指正。



# 五年制全国高等医学院校教材编审委员会

主任委员 王德炳

副主任委员(按姓氏笔画)

吕兆丰 杨成旺 陈 嫵 赵士斌 郝希山 程德基

秘书长 陆银道

委 员 (按姓氏笔画)

马大庆	马明信	王正伦	王建中	王荣福	王晓燕
王嘉德	卢思奇	吕兆丰	朱文玉	仲生海	庄鸿娟
刘 斌	安 威	安云庆	毕力夫	孙衍庆	李 璞
李若瑜	李凌松	杨成旺	杨宝峰	杨照徐	辛 兵
谷鸿喜	宋诗铎	张文清	张金钟	张振涛	陆银道
陈 力	陈 嫵	陈明哲	陈锦英	赵士斌	郝希山
娄建石	宫恩聪	贾建平	高秀来	唐 方	唐朝枢
曹德品	崔 浩	梁万年	韩德民	程 焱	程德基
童坦君	廖秦平	蔡景一	蔡焯基	樊立华	樊寻梅
戴 红					

# 前 言

根据教育部对“十五”期间高等教育教材建设的精神，适应教育教学改革和素质教育及创新能力培养的需要，北京大学医学出版社、北京大学医学部及国内部分医学院校主管教学工作的领导于2001年8月8日在北京大学医学部召开了教材建设研讨会。经讨论决定出版一套医学五年制本科课程教材。《药理学》为本套教材之一，同时配套出版《药理学要点与自测》一书。

为使学生学好药理学基本理论、基本知识，《药理学要点与自测》注重理论与实践的紧密结合，体现综合性、设计性和创新性，以及医学基础学科和临床学科的联系，使学生拓宽知识面、加强基础，培养具有观察问题、分析问题和解决问题的能力。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。本书的学习对象是五年制临床医学专业及相关专业。其特点是实用性强，对学生的复习、预习和考试有一定的帮助，同时也兼顾了毕业后的执业医师资格考试。

本书的编写格式以章为单元给出学习重点和学习提纲，同时配以不同类型的试题，供学生练习用，在每章最后给出试题答案。在学习重点中以简要文字强调本章的学习重点，分为掌握、熟悉和了解三个层次。在学习提纲中，对本章学习内容给出层次分明、条理清晰、内容精练、重点突出的提纲。试题分为选择题、判断题、填空题、名词解释、简答题和论述题。选择题为单选题（A型题）、多选题（X型题）。单选题要求从5个备选项中选择1个作为正确选项。多选题要求从5个备选项中选择1~5个作为正确选项。判断题只要求对试题回答是正确还是错误。填空题要求在试题空项内填上正确内容。在答案部分，选择题按顺序给出正确选项，名词解释给出正确解释。简答题给出简单或扼要答案。论述题给出答题要点。

本教材在编写过程中参考了国内外多种最新版本的药理学专著和教材，各位作者也将本校教学经验和部分试题写进本书中。本书中药品名称按《中华人民共和国要点2000版》和《中国通用药名》为准，微生物名称按新版《医用微生物学》专著所列名称。

全书在写作风格上力求实用性，内容丰富而文字精练。在编写过程中，各参编单位给予了大力支持，各位编委尽职尽责，确保本教材按期完成。天津医科大学和哈尔滨医科大学的领导和药理学教研室的教师、研究生们为本教材的编写做了大量工作，其中孟林副教授和王玲副教授担当了本书的编务工作，许多药理学前辈给予了指导和帮助，在此一并感谢。

在本书呈献给各位教师和学生之际，各位作者虽尽心尽力，但难免有疏漏之处，敬请各位读者予以指正。

娄建石 杨宝峰

2003年2月

# 目 录

第一章	药理学绪论	(1)
第二章	药物效应动力学	(3)
第三章	药物代谢动力学	(9)
第四章	影响药物效应的因素及合理用药的原则	(16)
第五章	自主神经系统药理学概论	(21)
第六章	M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	(28)
第八章	胆碱受体阻断药(Ⅰ) - M胆碱受体阻断药	(34)
第九章	胆碱受体阻断药(Ⅱ) - N胆碱受体阻断药	(38)
第十章	肾上腺素受体激动药	(41)
第十一章	肾上腺素受体阻断药	(53)
第十二章	中枢神经系统药理学概论	(63)
第十三章	局部麻醉药	(69)
第十四章	全身麻醉药	(73)
第十五章	镇静催眠药	(80)
第十六章	抗癫痫药和抗惊厥药	(87)
第十七章	抗帕金森病和治疗老年性痴呆症药	(93)
第十八章	抗精神病药	(98)
第十九章	解热镇痛抗炎药	(105)
第二十章	镇痛药	(111)
第二十一章	中枢兴奋药	(117)
第二十二章	钙通道阻滞药	(121)
第二十三章	抗心律失常药	(125)
第二十四章	利尿药和脱水药	(133)
第二十五章	抗高血压药	(141)
第二十六章	治疗充血性心力衰竭药	(147)
第二十七章	抗心绞痛药	(156)
第二十八章	调血脂药与抗动脉粥样硬化药	(163)
第二十九章	作用于血液及造血器官的药物	(172)
第三十章	组胺及抗组胺药	(187)
第三十一章	镇咳、祛痰及平喘药	(190)
第三十二章	作用于消化系统的药物	(195)
第三十三章	子宫平滑肌兴奋药	(201)
第三十四章	性激素类药及避孕药	(204)
第三十五章	抗骨质疏松药	(211)

第三十六章	肾上腺皮质激素类药物·····	(220)
第三十七章	甲状腺激素及抗甲状腺药·····	(227)
第三十八章	胰岛素及口服降血糖药·····	(231)
第三十九章	抗菌药物概论·····	(236)
第四十章	$\beta$ -内酰胺类抗生素·····	(243)
第四十一章	大环内酯类、林可霉素类及肽类抗生素·····	(251)
第四十二章	氨基糖苷类抗生素及多粘菌素·····	(259)
第四十三章	四环素类及氯霉素类·····	(267)
第四十四章	人工合成抗菌药·····	(273)
第四十五章	抗真菌及抗病毒药物·····	(282)
第四十六章	抗结核药和抗麻风药·····	(289)
第四十七章	抗疟药·····	(295)
第四十八章	抗阿米巴病药及抗滴虫病药·····	(298)
第四十九章	抗血吸虫病药及抗丝虫病药·····	(302)
第五十章	驱肠虫药·····	(304)
第五十一章	抗恶性肿瘤药·····	(306)
第五十二章	免疫调节药·····	(314)



# 第一章 药理学绪论

## 一、学习重点

1. 掌握药物、药品的概念和区别，掌握药理学的概念、主要内容、特点、任务和目的。
2. 了解国内外药理学发展的分支学科情况。
3. 熟悉药理学主要研究方法和研究水平。
4. 了解药理学的基本知识。
5. 注意药理学的学习方法。

## 二、学习提纲

(一) 药物 (drug) 指用于预防、治疗、诊断疾病，有目的地调节机体各种功能和改变机体所处病理状态的物质。

(二) 药品 (medicine) 指原料药 (化学药、生物药、天然药) 经过制成一定的剂型，可供临床应用的药物。

(三) 药理学 (pharmacology)

1. 概念：研究药物与生物体之间相互作用规律和原理的学科。
2. 研究内容：药物效应动力学和药物代谢动力学。
3. 特点：①基础与临床结合；②理论和实践结合；③科学与法律结合。
4. 任务：①阐明药物防病治病等方面的机制；②科学、合理地用药，提高治疗效果；③新药研发。
5. 医学生学习目的：①掌握药物的基本规律，合理使用药物；②正确认识药物对机体的利弊，保障病人的生命安全；③对药物出现的各种反应和变化能够给出科学的解释。

(四) 药理学发展

1. 分支学科：①从交叉角度上有基础药理学、临床药理学、分子药理学、中药药理学、遗传药理学、生化药理学、时间药理学等；②从系统角度上有神经精神药理学、心血管药理学、内分泌药理学、化疗药药理学、抗炎免疫药理学等；③从应用角度上有医用药理学、护用药理学、眼科药理学等。

2. 突出贡献：①发现了受体。②促进了药物发展。③促进药法规建设。

(五) 药理学主要研究方法 实验药理学和实验治疗学，前者以动物为研究对象；后者以人为研究对象。药理学研究水平包括整体、器官或组织、细胞、亚细胞、分子水平等。并将其划分为在体实验 (in vivo) 和离体实验 (in vitro)。

(六) 药学基本知识

1. 药物分类：①按药物自然状态分为天然药、化学药和生物药三类；②按药物的管理分为普通药和特殊药两类；③按药物产地不同分为国产药和进口药两类；④按药物的使用分为处方药和非处方药两类；⑤按医疗保险分为基本药和非基本药。

2. 常用药物制剂：①口服剂型有片剂、丸剂、胶囊剂、口服液、糖浆剂和合剂等；②

注射剂有水剂、油剂、混悬剂和粉针剂等；③吸入剂型有气雾剂和喷雾剂等；④外用剂型有膏剂、膜剂、擦剂、洗剂和滴剂等。

3. 药品标示：药物名称有通用名、化学名、药品名、商品名、别名和代号等；还要有批准文号、批号、有效期、包装单位、药品说明书、生产厂家和通讯地址等。

4. 药品管理：对不同类别药品应按规定予以密封、低温、避光保存，特殊药品按有关规定特殊管理。

(七) 药理学学习方法 ①紧密结合基础；②紧密结合临床；③重视药理实验；④认识药物的双重性；⑤了解药理学的内在联系。

### 三、试题

#### (一) 名词解释

1. 药物

3. 药理学

2. 药品

#### (二) 简答题

1. 我国在药理学发展中做出了哪些贡献？
2. 药理学在临床实践中有何应用价值？
3. 国家对哪些药品有特殊规定？

### 四、答案

#### (一) 名词解释

1. 药物：指用于预防、治疗、诊断疾病，有目的地调节机体各种功能和改变机体所处病理状态的物质。
2. 药品：指原料药(化学药、生物药、天然药)经过制成一定的剂型,可供临床应用的药物。
3. 药理学：研究药物与生物体之间相互作用规律和原理的学科。

#### (二) 简答题

1. 我国在药理学发展中做出了哪些贡献？
  - (1) 中医药。
  - (2) 阿片受体的发现。
2. 药理学在临床实践中有何应用价值？
  - (1) 药物防病治病的原理。
  - (2) 保障病人安全用药，减少不良反应发生。
  - (3) 有利于个体化治疗，提高治疗效果。
  - (4) 权衡利弊，合理使用药物。
3. 国家对哪些药品有特殊管理规定？
  - (1) 精神药品。
  - (2) 麻醉药品。
  - (3) 放射性药品。
  - (4) 毒性药品。
  - (5) 进口药品。
  - (6) 生物制品。

(天津医科大学 姜建石)

## 第二章 药物效应动力学

### 一、学习重点

1. 掌握药物作用的概念、方式、范围、选择性和效应的概念、特异性、基本表现。
2. 掌握治疗作用和不良反应的概念和类别。
3. 掌握药物作用机制的分类和受体理论的基本内容。
4. 掌握药物量效关系中的重要术语，如效能、效价强度、LD<sub>50</sub>、ED<sub>50</sub>、TI等。
5. 掌握激动药和拮抗药的分类和区别。
6. 了解药物与受体相互作用的规律和学说。

### 二、学习提纲

#### (一) 药物的作用和效应

1. 作用 (action): 药物与生物体作用部位 (靶位) 反应的过程。
2. 效应 (effect): 药物与生物体反应过程的结果。
3. 直接作用 (direct action): 指药物作用于器官组织的靶位后所产生的效应为直接作用。
4. 间接作用 (indirect action): 指由药物作用于器官组织的靶位后所产生的效应又引发了另一种效应，常常通过神经反射或体液调节引起。又称继发作用 (secondary action)。
5. 局部作用 (local action): 指药物在用药部位产生的作用。
6. 全身作用 (systemic action): 指药物自用药部位吸收入血后分布到全身而产生的作用，也称吸收作用。
7. 选择性 (selectivity): 指在治疗剂量时，药物吸收入血后常只选择性地作用于某一个或几个器官组织的靶位，而对其它器官组织的靶位不发生作用。
8. 特异性 (specificity): 指药物产生的某种专门效应。这与药物的选择性有关，选择性越高，特异性越强；选择性越低，特异性越弱。
9. 兴奋 (excitation): 指凡能提高机体器官组织功能的效应。
10. 抑制 (inhibition): 指凡能降低机体器官组织功能的效应。
11. 治疗作用 (therapeutic action): 凡能改善患者异常的生理、生化功能或病理过程，使身体状况恢复正常的作用。它又分为对因和对症治疗。
12. 对因治疗 (etiological treatment): 指应用药物消除致病因子，以彻底治愈疾病，亦称治本。
13. 对症治疗 (symptomatic treatment): 指应用药物改善症状，亦称治标。

#### (二) 药物的不良反应

1. 不良反应 (adverse reaction): 凡是不符合用药目的并给病人带来不适或痛苦的有害反应，统称之不良反应。任何药物都有一定的不良反应。多数不良反应是预先知道的，也有些不良反应是预先不知道的。
2. 副作用 (side reaction): 指药物在治疗量时出现的与治疗目的无关的作用。

3. 毒性反应 (toxic reaction): 指对机体器官组织产生功能或器质性的损害。

4. 变态反应 (allergic reaction): 指某些药物引起少数过敏体质者所产生的免疫反应, 除药物本身外其代谢产物或制剂中的杂质等都可以作为致敏原, 引发免疫反应。变态反应也称过敏反应 (anaphylactic reaction)。

5. 后遗效应 (residual effect): 停药后血药浓度降到阈值以下时所残存的药理效应。

6. 停药反应 (withdrawal reaction): 指长期应用某些药物, 突然停药所出现的症状。包括反跳现象和停药症状。

7. 反跳现象 (rebound phenomenon): 指突然停药后使原有病症加重。

8. 停药症状 (withdrawal symptoms): 停药后出现原有疾病所没有的症状。

9. 继发反应 (secondary reaction): 指药物治疗作用之后所产生的不良后果, 又称为治疗矛盾。

10. 耐受性 (tolerance): 指连续用药后出现的药物反应性下降。若在很短时间内产生称为快速耐受性或急性耐受性 (tachyphylaxis), 反之若在长期用药后产生则称为慢速耐受性或慢性耐受性 (bradyphylaxis)。

11. 耐药性 (resistance): 病原体和肿瘤细胞在长期用药后产生的耐受性。又称抗药性。

12. 依赖性 (dependence): 指长期用药后病人对药物产生主观和客观上需要连续用药的现象。

13. 习惯性 (habituation): 若仅产生精神上的依赖性, 停药后病人只表现为主观上的不适, 没有客观上的体征表现。

14. 成瘾性 (addiction): 若病人对药物不但产生精神依赖性, 还有躯体依赖性, 停药后病人产生精神和躯体的体征表现。

15. 戒断症状 (abstinent syndrome): 停药后病人产生严重精神和躯体功能紊乱的症状。

### (三) 药物的作用机制

1. 作用机制 (mechanism of action): 指药物产生效应的原理。主要包括以下几个方面: ①物理化学机制; ②作用于机体细胞的靶位, 包括有酶、受体、离子通道、载体和基因。

2. 受体 (receptor): 是位于细胞膜或细胞内一些具有识别、结合特异生物活性分子, 转导信号, 产生相应生物效应的蛋白分子。

3. 配体 (ligand): 是与受体特异性结合的体内活性物质或外源性药物。

4. 受体的特性: ①灵敏性 (sensitivity); ②立体特异性 (specificity); ③多样性 (multiple variation); ④竞争性 (competivity); ⑤饱和性 (saturability); ⑥可逆性 (reversibility); ⑦调节性 (regulativity)。

### (四) 药物的量效关系

1. 量效关系 (dose - effect relationship): 在一定范围内, 随着药物剂量增加, 药物效应也相应增加, 这种关系称为量效关系。

2. 阈剂量 (threshold dose): 刚刚能引起药效的剂量, 亦称最小有效量 (minimal effective dose)。

3. 治疗量 (therapeutic dose): 大于阈剂量能产生治疗效果而又不致引起毒性反应的剂量, 亦称常用量。

4. 极量 (maximal dose): 较治疗量大, 比最小中毒量小, 是国家药典规定允许使用的最大剂量。

5. 中毒量 (toxic dose): 超过极量而引起毒性反应的剂量。

6. 致死量 (lethal dose): 导致中毒而致死的剂量。

7. 量效曲线 (dose-effect curve): 以药物的剂量或浓度为横坐标, 药物的效应为纵坐标做图, 绘出剂量与效应之间关系的曲线, 又称剂量 - 反应曲线 (dose - response curve)。

8. 效能 (efficacy): 指量反应当中的最大效应, 即使继续增加剂量 (或浓度), 药效也不再提高, 又称最大效应 (maximal effect,  $E_{max}$ )。

9. 半最大效应浓度 (concentration for 50% of maximal effect,  $EC_{50}$ ): 即能引起 50% 最大效应的浓度, 亦称半效能浓度。

10. 效价强度 (potency): 引起同等效应 (50% 最大效应) 的剂量或浓度, 其数值越小强度越大, 又称等效剂量 (equivalent dose)。

11. 半数致死量 (median lethal dose,  $LD_{50}$ ): 使半数群体死亡的剂量。

12. 半数有效量 (median effective dose,  $ED_{50}$ ): 使半数群体产生药效或某一反应的剂量。

13. 治疗指数 (therapeutic index, TI): 半数致死量与半数有效量之间的比值, 即  $TI = LD_{50}/ED_{50}$ 。

14. 安全界值 (safety margin): 即  $LD_5$  与  $ED_{95}$  的比值。

15. 可靠安全系数 (certain safety factor, CSF): 即  $LD_1$  与  $ED_{99}$  的比值。

#### (五) 药物与受体反应动力学

1. 亲和力 (affinity): 指药物与受体结合的能力。

2. 内在活性 (intrinsic activity): 指药物与受体结合产生效应的能力。

3. 激动药 (agonist): 指既有亲和力又有内在活性, 能与受体结合并使之激活而产生效应的药物。

4. 完全激动药 (full agonist): 内在活性常数  $\alpha = 1$ , 与受体结合后能产生较强的激动效应。

5. 部分激动药 (partial agonist): 内在活性常数  $\alpha < 1$ , 与受体结合后产生激动效应的同时还能产生较弱的拮抗效应。

6. 拮抗药 (antagonist): 指与受体有较强的亲和力, 而无内在活性的药物。

7. 部分拮抗药 (partial antagonist): 内在活性常数  $\alpha > 0$ , 与受体结合后产生拮抗效应的同时还能产生较弱的激动效应。

8. 竞争性拮抗药 (competitive antagonist): 能和受体产生可逆性结合, 与激动药相互竞争同种受体, 使其亲和力降低, 而对内在活性不变。

9. 非竞争性拮抗药 (noncompetitive antagonist): 能与受体产生相对不可逆结合, 使激动药与受体的亲和力不变, 而内在活性降低。

#### (六) 药物与受体的相互作用学说

1. 占领学说: 药物与受体结合产生的效应强度与药物所占领的受体数量成正比, 若受体全被占领则可产生最大效应。

2. 速率学说: 药物与受体结合产生效应强度与药物 - 受体复合物的解离速度有关。产生激动效应的药解离速率大, 产生部分激动效应的药较小, 产生拮抗的药最小。

3. 二态模型学说: 受体有活化状态 ( $R^*$ ) 和失活状态 ( $R$ ) 两种构象, 可互相转化。激动药与  $R^*$  有亲和力, 结合后可产生效应; 拮抗药与  $R$  有亲和力, 结合后不产生效应。两种

构象比例不同，药物结合程度不同，激动和拮抗程度亦不同。

### 三、试题

#### (一) 单项选择题

1. 研究药物对机体作用规律和机制的科学是
    - A. 药理学
    - B. 药代学
    - C. 药效学
    - D. 治疗学
    - E. 药物学
  2. 产生副作用时的药物剂量是
    - A. 阈剂量
    - B. 治疗量
    - C. 极量
    - D. 中毒量
    - E. 致死量
  3. 下列哪种表达式的安全性最高
    - A.  $LD_1/ED_{99}$
    - B.  $LD_5/ED_{95}$
    - C.  $LD_{50}/ED_{50}$
    - D.  $LD_{95}/ED_5$
    - E.  $LD_{99}/ED_1$
  4. 部分激动药的内在活性常数是
    - A.  $\alpha < 0$
    - B.  $\alpha = 0$
    - C.  $\alpha < 1$
    - D.  $\alpha = 1$
    - E.  $\alpha > 1$
  5. 竞争性拮抗药对亲和力和内在活性的影响是
    - A. 亲和力不变，内在活性降低
    - B. 亲和力降低，内在活性降低
    - C. 亲和力不变，内在活性不变
    - D. 亲和力增强，内在活性增强
    - E. 亲和力降低，内在活性不变
1. 关于量反应量效曲线的正确描述是
    - A. 在一定范围内药物的效应随用药剂量的增加而增强
    - B. 当效应增加到最大强度后，再增加剂量，效应不再增加
    - C. 引起效应的最小剂量称为阈剂量
    - D. 药物效应的持续时间随用药量增大而延长
    - E. 药物的  $t_{1/2}$  随用量增加而延长
  2. 药物的不良反应有
    - A. side effects
    - B. resistance
    - C. dependence
    - D. habituation
    - E. addiction
  3. 受体具有下列哪些特性
    - A. sensitivity
    - B. specificity
    - C. tolerance
    - D. competitiveness
    - E. reversibility
  4. 指出下列哪些药物产生作用时作用机制与受体有关
    - A. 吗啡
    - B. 阿司匹林
    - C. 肾上腺素
    - D. 甘露醇
    - E. 阿托品
  5. 指出下列哪些药物产生作用时其作用机制与酶有关
    - A. 阿司匹林
    - B. 阿霉素
    - C. 氨茶碱
    - D. 新斯的明
    - E. 可乐定

#### (二) 多项选择题

1. 关于量反应量效曲线的正确描述是

### (三) 判断题

1. 药量越小引起药效越强, 其效能越高。
2. 药物注射入脑脊液后对中枢神经的作用属于全身作用。
3. 肿瘤细胞对长期应用药物产生的敏感性降低称为耐药性。
4. 后遗效应是指停药后血药浓度已降至 0 时残存的生物效应。
5. 部分拮抗药是指能对抗激动药部分作用的药。

### (四) 填空题

1. 根据治疗目的不同, 可将药物的治疗作用分为\_\_\_\_\_和\_\_\_\_\_治疗。
2. 药物作用于靶位后所产生的效应为\_\_\_\_\_, 而通过神经反射或体液调节引起的\_\_\_\_\_。
3. 药物在治疗量时出现的与治疗目的无关的作用称为\_\_\_\_\_。
4. 亲和力指\_\_\_\_\_的能力。
5. 根据亲和力和内在活性的不同, 将药物划分为\_\_\_\_\_和\_\_\_\_\_。

### (五) 名词解释

全部名词已在学习提纲中给出, 此处不再重复。

### (六) 简答题

1. 简述药物的作用机制。
2. 简述受体的调节和药物作用的关系。

### (七) 论述题

1. 试述药物的不良反应。
2. 简述受体的特性。

## 四、答案

### (一) 单项选择题

- 1.C      2.B      3.A      4.C      5.E

### (二) 多项选择题

- 1.ABCD      2.ABCDE      3.ABDE      4.ACE      5.ACD

### (三) 判断题

1. ×      2. ×      3. ✓      4. ×      5. ×

### (四) 填空题

1. 对因治疗    对症
2. 直接作用    间接作用
3. 副作用
4. 药物与受体结合
5. 激动药    拮抗药

### (五) 名词解释

全部名词的答案已在学习提纲中给出, 此处不再重复。

### (六) 简答题

1. 简述药物的作用机制。  
(1) 理化条件的改变;

- (2) 参与或干扰细胞物质代谢过程；
- (3) 作用于细胞膜；
- (4) 改变生理递质的释放或激素的分泌；
- (5) 作用于受体。

2. 简述受体的调节和药物作用的关系。

- (1) 久用激动药使受体向下调节，数目减少，药物对激动药的敏感性减弱。
- (2) 久用拮抗药使受体向上调节，数目增加，药物对激动药的敏感性增强。

(七) 论述题

1. 试述药物的不良反应。

- (1) 副作用：药物在治疗量下出现与治疗目的无关的作用；
- (2) 毒性反应：药物使机体产生病理变化或有害的反应；
- (3) 后遗效应：指血浆中药物浓度在阈浓度以下时的残存效应；
- (4) 继发反应：药物发挥治疗作用的不良后果，继发于药物治疗作用之后的不良反应；
- (5) 变态反应：指机体对药物产生的一种过敏反应；
- (6) 停药反应：指药物停用后出现的反应；
- (7) 耐受性：指长期用药后机体对药物的反应性降低；
- (8) 依赖性：指长期用药后机体产生需要连续用药的现象。

2. 简述受体的特性。

- (1) 灵敏性；
- (2) 立体特异性；
- (3) 多样性；
- (4) 竞争性；
- (5) 饱和性；
- (6) 可逆性；
- (7) 调节性。

(天津医科大学 姜建石)



## 第三章 药物代谢动力学

### 一、学习重点

1. 掌握药物体内转运（吸收、分布、生物转化和排泄）的基本过程和机制。
2. 掌握药物代谢动力学基本参数的概念和意义。
3. 掌握药时曲线的意义和描述速率过程的数学方程式。
4. 了解药物代谢动力学各种房室模型的意义。

### 二、学习提纲

（一）概念：药物代谢动力学（pharmacokinetics，简称药代动力学、药代学）主要是研究机体对药物的作用，也就是研究药物及其代谢物在体内吸收、分布、生物转化和排泄的体内药物浓度随时间的变化过程及其影响因素。

（二）药物的体内过程（process of drug in the body）

药物在体内进行吸收、分布、生物转化和排泄的过程，都必须通过多种生物膜，通过生物膜的运动称为转运（transport）。药物的转运方式和生物膜特性、药物的理化性质（如脂溶性、离子化）及分子大小有关。其转运方式可分为被动转运（passive transport）和载体转运（carrier - mediated transport）两大类型。

被动转运是指药物经高浓度侧经细胞膜向低浓度侧的转运过程，该过程不消耗细胞能量、无饱和现象，也不被其他物质的竞争而受抑制。因此，又称为顺流转运。它又可分为滤过和简单扩散。

载体转运又称特殊转运（specialized transport），这种转运由载体中介。生物膜的双脂质中镶嵌的蛋白质具有载体作用，当它被催化时能与底物结合，产生构型改变，允许底物通过。载体转运又可分为主动转运和易化扩散两种。

此外，还有一些物质（某些大分子、脂溶性维生素及重金属）可通过胞饮（pinocytosis）方式转运。

#### 1. 药物的吸收（absorption）

药物从给药部位进入血循环的过程称为吸收。影响药物吸收的因素主要分为药物和机体两方面。药物的吸收和药物的解离度和脂溶性密切相关；胃排空及肠蠕动功能、血流量以及首过效应都会显著影响药物的吸收。

#### 2. 药物的分布（distribution）

药物从给药部位进入血循环后，通过各种生理屏障向机体各组织转运，称为分布。早期主要分布在血流较丰富的组织，如肝、肾等处。之后药物随着各组织的血流量及膜的通透性进行再分布。药物进入血循环后可不同程度地与血浆蛋白结合（protein binding），药物与血浆蛋白结合对药物的吸收、分布、消除和药物作用强度均会有影响。

药物与组织的结合，这是药物对某些细胞成分具有特殊亲和力，如果该药的组织亲和力大于血浆时，该药就主要分布在组织中，药物在体内的分布依赖于与血浆蛋白结合及组织亲