

高等医学教育课程改革规划教材

供医药类本科学生学习、研究生入学、专科生和成人自学考试复习使用

药理学学习指导

主编 云 宇 龙 榕



科学出版社

高等医学教育课程改革规划教材

供医药类本科学生学习、研究生入学、专科生和成人自学考试复习使用

药理学学习指导

主 编：云 宇 龙 榕

副主编：杨建宇 王 蕾 秦渝兵 罗海芸

编 者（以姓氏汉语拼音排序）

郭 英 和丽芬 后文俊 黄 宁

李 晨 龙 榕 罗海芸 马加庆

马文婕 孙海梅 王 蕾 秦渝兵

杨 泳 杨建宇 云 宇

科 学 出 版 社

北 京

内 容 简 介

本书归纳总结了多本药理学教材中涉及的主要知识点,同时参照了近年来各类考试中所涉及的药理学试题模式进行编写。全书共分四十四章,每章包括大纲要求、学习要点、复习思考题3部分,【大纲要求】部分参考了全国高等医学院校药理学教材的教学大纲、执业医师及执业药师药理学部分的考试大纲,【学习要点】部分归纳了药理学的基本内容,重点突出,强调“笔记式”框架的构建,【复习题】包括单选题、多选题、判断题、填空题、名词解释、问答题和案例题6种题型,多角度、多层次突出重点内容,有助于同学记忆,适宜复习和考前训练使用。

本书供医药类本科学生学习、研究生入学、专科生和成人自学考试复习、执业医师和执业药师考试复习使用,也可供本专业教师教学及命题使用。

图书在版编目(CIP)数据

药理学学习指导/云宇,龙榕主编. —北京:科学出版社,2016.1

高等医学教育课程改革规划教材

ISBN 978-7-03-047168-0

I. 药… II. ①云… ②龙… III. 药理学—高等职业教育—教学参考资料 IV. R96

中国版本图书馆CIP数据核字(2016)第010474号

责任编辑:张映桥 / 责任校对:刘小梅

责任印制:赵博 / 封面设计:金舵手世纪

版权所有,违者必究。未经本社许可,数字图书馆不得使用

科学出版社 出版

北京东黄城根北街16号

邮政编码:100717

<http://www.sciencep.com>

三河市骏杰印刷有限公司 印刷

科学出版社发行 各地新华书店经销

*

2016年1月第一版 开本:787×1092 1/16

2016年1月第一次印刷 印张:12 1/2

字数:296 000

定价:29.80元

(如有印装质量问题,我社负责调换)

前 言

本书应广大在校学生的需求编写而成,同时兼顾了执业医师和执业药师考试涉及的药理学知识,以满足社会考生的需求。药理学是医学药学课程中的重要基础课程之一,同时也是基础课程中较难学习的课程之一,覆盖内容较广,很多知识点不仅仅需要大量记忆,同时也需要深入理解,学习起来较困难。同时,医学教育改革后本课程学时数大大削减,学生需自主学习的内容大量增加,学习难度进一步加大。为了提高教学和自主学习效率,帮助学生学好本门课程,我系教师结合多年在教学实践中的丰富经验,对重要知识点进行归纳总结,编成本书,希望对药理学学习能够起到事半功倍的作用。

本书归纳总结了多本药理学教材中涉及的主要知识点,同时参照了近年来各类考试中所涉及的药理学试题模式进行编写。全书共分四十四章,每章包括大纲要求、学习要点、复习思考题3部分,【大纲要求】部分参考了全国高等医学院校药理学教材的教学大纲、执业医师及执业药师药理学部分的考试大纲,【学习要点】部分归纳了药理学的基本内容,重点突出,强调“笔记式”框架的构建,【复习题】包括单选题、多选题、判断题、填空题、名词解释、问答题和案例题6种题型,多角度、多层次突出重点内容,有助于同学记忆,适宜复习和考前训练使用。本书在考察“三基”的前提下还提供案例的讨论,培养学生分析问题和解决问题的能力,提高了学生的自主学习效率。

由于编者经验、水平有限,在编写中难免会有错误或不当之处,恳请各位读者及同行专家批评指正。

云 宇

2015年8月

目 录

Contents

◆第一章 绪论	1
◆第二章 药物效应动力学	3
◆第三章 药物代谢动力学	11
◆第四章 传出神经系统药理概论	22
◆第五章 胆碱受体激动药	27
◆第六章 抗胆碱酯酶药和胆碱酯酶复活药	30
◆第七章 胆碱受体阻断药	35
◆第八章 肾上腺素受体激动药	39
◆第九章 肾上腺素受体阻断药	44
◆第十章 局部麻醉药	48
◆第十一章 全身麻醉药	52
◆第十二章 镇静催眠药	56
◆第十三章 抗癫痫药与抗惊厥药	61
◆第十四章 抗帕金森病和治疗阿尔茨海默病药	65
◆第十五章 抗精神失常药	68
◆第十六章 镇痛药	73
◆第十七章 解热镇痛抗炎药	79
◆第十八章 作用于心血管离子通道的药物——钙通道阻滞药	84
◆第十九章 抗心律失常药物	88
◆第二十章 利尿药	91
◆第二十一章 抗充血性心力衰竭药	95
◆第二十二章 抗高血压药物	100
◆第二十三章 抗心绞痛药	108
◆第二十四章 抗动脉粥样硬化药	114
◆第二十五章 作用于血液系统的药物	118
◆第二十六章 作用于呼吸系统的药物	122
◆第二十七章 作用于消化系统的药物	125
◆第二十八章 子宫平滑肌兴奋药和抑制药	128

◆第二十九章 肾上腺皮质激素类药物	131
◆第三十章 甲状腺激素及抗甲状腺激素药物	136
◆第三十一章 降血糖药	140
◆第三十二章 抗菌药物概论	144
◆第三十三章 β -内酰胺类抗生素	150
◆第三十四章 大环内酯类、林可霉素类及其他抗生素	157
◆第三十五章 氨基糖苷类抗生素	160
◆第三十六章 四环素类及氯霉素	163
◆第三十七章 人工合成抗菌药	165
◆第三十八章 抗真菌药	168
◆第三十九章 抗病毒药	171
◆第四十章 抗结核药	174
◆第四十一章 抗疟药	177
◆第四十二章 抗血吸虫病药	180
◆第四十三章 抗恶性肿瘤药	182
◆第四十四章 作用于免疫系统的药物	188
◆参考文献	192

第一章

绪论

大纲要求

1. 掌握 药理学、药物、药物效应动力学、药物代谢动力学的定义。
2. 熟悉 药理学的学科地位、任务。
3. 了解 药理学的主要研究方法和发展简史。

学习要点

一、药理学、药物、药物效应动力学、药物代谢动力学的定义

药理学 (pharmacology): 研究药物与机体 (包括病原体) 相互作用及作用规律的学科, 其主要研究内容包括药物效应动力学和药物代谢动力学。

药物 (drug): 能影响机体器官生理功能和 (或) 细胞代谢活动的化学物质, 可用于预防、诊断、治疗疾病和计划生育目的, 与毒物 (poison) 没有化学本质的区别。

药物效应动力学 (pharmacodynamics, 简称药效学): 研究药物对机体的作用, 包括药物的药理效应、作用机制、临床应用及不良反应。

药物代谢动力学 (pharmacokinetics, 简称药代学): 研究机体对药物的作用, 即药物在机体的影响下所发生的变化及其规律, 包括药物的吸收、分布、代谢及排泄过程, 特别是研究血药浓度随时间变化的规律等。

二、药理学的学科地位、任务

药理学是一门桥梁学科, 其学科任务主要包括: ①阐明药物与机体相互作用的基本规律和原理, 指导临床合理用药; ②为新药的研发提供实验资料; ③为探索生命科学提供重要科学依据和研究方法。

三、药理学研究方法

实验药理学方法: 以清醒或麻醉的健康动物的正常器官、组织、细胞、亚细胞、受体分子和离子通道等为实验对象, 进行药效学和药代学的研究。

实验治疗学方法: 以病理模型动物或组织器官为实验对象, 观察药物治疗作用的方法。

临床药理学方法: 以健康志愿者或患者为研究对象, 观察药物的药效学和药代学, 对药物的疗效和安全性进行评价。



复习思考题

一、选择题

(一) 单项选择题

1. 药理学研究的是 ()
 - A. 药物对机体的作用
 - B. 机体对药物的影响
 - C. 药物与机体间的相互作用
 - D. 药物的合理应用
 - E. 以上说法皆对
2. 药效学是研究 ()
 - A. 在药物影响下机体功能的变化
 - B. 提高药物疗效的途径
 - C. 如何提高药物质量
 - D. 机体如何对药物进行处理
 - E. 药物的体内过程
3. 药代学是研究 ()
 - A. 在药物影响下机体功能的改变
 - B. 药物的不良反应
 - C. 如何改进药物给药途径
 - D. 机体如何对药物进行处理
 - E. 药物的临床应用
4. 药物 ()
 - A. 可以预防疾病
 - B. 可以治疗疾病
 - C. 可以用于疾病的诊断
 - D. 与毒药无化学本质的区别
 - E. 以上说法皆对
5. 临床药理学研究对象是 ()
 - A. 离体器官
 - B. 人体
 - C. 小鼠
 - D. 大鼠
 - E. 以上说法皆对

(二) 多项选择题

6. 药理学的研究对象包括 ()
 - A. 药物
 - B. 人体
 - C. 病原体
 - D. 肿瘤细胞
 - E. 药物结构
7. 药效学的研究内容包括 ()
 - A. 在药物影响下机体功能的变化
 - B. 药物的不良反应
 - C. 药物的临床应用
 - D. 机体如何对药物进行处理
 - E. 药物的体内过程

8. 药代学的研究内容包括 ()
 - A. 血药浓度随时间变化的规律
 - B. 药物的药理效应
 - C. 药物的构效关系
 - D. 机体如何对药物进行处理
 - E. 药物的体内过程
9. 药理学的学科任务包括 ()
 - A. 阐明药物与机体相互作用的基本规律和原理
 - B. 指导临床合理用药
 - C. 为新药的研发提供实验资料
 - D. 为探索生命科学提供重要科学依据和研究方法
 - E. 药物的不良反应

二、判断题

1. 药理学是专门研究药物的学科。
2. 药物的血药浓度随时间的变化规律是药效学的主要研究内容之一。
3. 药代学研究的是药物对机体的作用。
4. 药理学主要包括药代学和药效学。
5. 临床药理学的实验对象只包括患者。
6. 药物与毒药之间无化学本质的区别。

三、填空题

1. 药理学是研究_____与_____相互作用及作用规律的学科，其主要研究内容包括_____和_____。
2. 药理学的主要研究方法包括_____、_____和_____。
3. 药效学研究的是_____对_____的作用。
4. 被称为世界上第一部药典的书籍是_____代的_____。
5. 我国最早的本草著作是_____。

四、名词解释

1. pharmacology
2. pharmacokinetics
3. pharmacodynamics
4. drug

五、问答题

1. 什么是药理学？其研究的主要内容是什么？
2. 药理学的学科任务主要是什么？

(王 蕾)

第二章

药物效应动力学

大纲要求

- 1. 掌握** ①药物的基本作用与药物作用两重性的区别。②药物治疗作用和不良反应概念,副作用概念及特性。③药物剂量与效应关系、量-效曲线及曲线上几个特定位点、量反应、质反应、效能、效价强度、治疗指数及意义。④作用于受体的药物分类:亲和力(K_D)及内在活性,激动药、拮抗药(竞争性拮抗药、非竞争性拮抗药)、部分激动药。
- 2. 熟悉** ①药物作用与药理效应的定义。②对因治疗、对症治疗;药物不良反应中的毒性反应、后遗效应、停药反应、变态反应、特异质反应、依赖性概念及特点。③受体的概念及特性;第二信使的概念、种类和功能;受体的调节概念及其临床意义。
- 3. 了解** ①药物作用的特异性和选择性。②药物的局部作用和全身作用。③ pD_2 、 pA_2 的概念和意义。④受体的类型。

学习要点

一、药物作用与药理效应

药物作用(drug action):药物与机体生物大分子的初始作用,是产生药理效应的原因。

药物作用的基本表现:兴奋和抑制。

药理效应(pharmacological effect):药物作用所引起的机体生理功能的改变,是机体对药物作用的反应,即是药物作用的结果。

药物作用和药理效应意义接近,通常并不严加区别,但当两者并用时,应体现先后顺序。

药物作用具有特异性(specificity),即药物在一定剂量下,对不同受体作用的差异性。药物作用特异性取决于药物的化学结构,即构效关系。

药物作用还具有选择性(selectivity),即药物在一定剂量下,对不同组织器官作用的差异性。

药物作用的特异性和选择性并不一定平行,即特异性高的药物不一定引起选择性高的药理效应。

二、药物作用的两重性:治疗作用和不良反应

(一) 治疗作用

治疗作用(therapeutic effect):符合用药目的,具有防治疾病效果的作用。

- 1. 对因治疗(etiological treatment)** 用药目的在于消除原发致病因子(治本)。

2. 对症治疗 (symptomatic treatment) 用药目的在于改善疾病症状 (治标)。

(二) 不良反应

不良反应 (adverse drug reaction, ADR): 不符合用药目的并为患者带来痛苦或不适的反应。

不良反应的种类: 副作用、毒性反应、后遗效应、停药反应、变态反应、特异质反应、依赖性等。

1. 副作用 (side effect) 在治疗剂量下发生的与治疗目的无关的作用。副作用是药物的固有作用, 与药物选择性低有关, 治疗作用与副作用之间会随着治疗目的不同而转换。

2. 毒性反应 (toxic reaction) 药物剂量过大、疗程过长或消除器官功能低下时体内药物蓄积过多发生的危害性反应。毒性反应包括: 急性毒性反应、慢性毒性反应和特殊毒性反应 (致畸、致癌、致突变)。

3. 后遗效应 (residual effect) 停药后血药浓度已降至最低有效浓度 (阈浓度) 以下时仍残存的药理效应。

4. 停药反应 (withdrawal reaction) 长期使用某种药物, 突然停药后原有疾病重现或加剧, 又称反跳现象或回跃反应。

5. 变态反应 (allergic reaction, 又称过敏反应) 药物引起的免疫反应。反应性质与药物原有效应无关, 反应严重程度差异很大, 多与药物剂量无关, 无法预知。

6. 特异质反应 (idiosyncratic reaction) 少数特异体质患者对某些药物特别敏感或对高剂量药物特别不敏感的反应。先天遗传异常所致, 反应严重程度与剂量成比例, 反应性质可能与常人不同, 但症状与药物固有药理作用基本一致。不是免疫反应, 故不需预先敏化过程。

7. 依赖性 (dependence) 长期用药后, 患者对药物产生主观和客观上需要连续用药的现象。依赖性可分为: 精神依赖性 (psychic dependence), 也称心理依赖性 (psychological dependence) 和躯体依赖性 (physical dependence), 也称生理依赖性 (physiological dependence)。

三、量效关系

量效关系: 在一定范围内, 药理效应与剂量 (或浓度) 之间的依赖关系。

(一) 量反应的量-效曲线

1. 量反应 (graded response) 强弱呈连续增减的量变的药理效应, 可以用量分级表示。

2. 最小有效量 (或最低有效浓度) (minimal effective dose, 或 minimal effective concentration) 能引起药理效应的最小剂量 (浓度), 也称阈剂量 (threshold dose) 或阈浓度 (threshold concentration)。

3. 半最大效应剂量 (或浓度) (concentration for 50% of maximal effect, ED_{50} 或 EC_{50}) 能引起 50% 最大效应的剂量 (或浓度)。

4. 效价强度 (potency) 能引起等效反应 (一般采用 50% 效应量, 即 ED_{50} 或 EC_{50}) 的相对剂量或浓度。效价强度反映药物与受体的亲和力, 其值越小, 则效价强度越大。在



量效曲线图上越往左者,其效价强度越大。

5. 效能 (efficacy) 即药物的最大效应 (maximal effect, $E_{\max}$), 反映药物与受体结合产生效应的能力 (即药物内在活性)。在量-效曲线图上越高者, 其效能越大。

6. 效价强度和效能 不同角度反映药物作用的强弱, 两者并不完全平行。

(二) 质反应的量-效曲线

1. 质反应 (quantal response) 只能用全或无、阳性或阴性、有效或无效表示的药理效应。

2. 半数有效量 (median effective dose, ED_{50}) 引起 50% 实验动物出现有效 (或阳性) 反应的药物剂量。

3. 半数致死量 (median lethal dose, LD_{50}) 引起 50% 实验动物出现死亡的药物剂量。

4. 治疗指数 (therapeutic index, TI) LD_{50}/ED_{50} , 是衡量药物安全性的指标之一。相对而言, 该值越大药物越安全。

四、药物与受体

(一) 受体 (receptor)

1. 受体的概念 细胞膜上或细胞内的特殊蛋白组分, 能识别周围环境中某种微量化学物质 (配体), 与之结合, 通过中介的信息转导与放大系统, 触发相应的生理反应或药理效应。

2. 受体的特性 高度特异性、高度亲和力 (灵敏性)、饱和性、可逆性、多样性。

3. 受体的类型

(1) G 蛋白偶联受体: 激活后通过 G 蛋白的传导, 将信号传至效应器蛋白。数目最多, 如肾上腺素受体、M 胆碱受体和多巴胺受体等。

G 蛋白偶联受体中介的效应需经细胞内第二信使将获得的信息增强、分化、整合并传递给效应机制, 才能发挥其特定的生理功能或药理效应。

胞内第二信使包括环磷腺苷 (cAMP)、环磷鸟苷 (cGMP)、肌醇磷脂、钙离子等。

(2) 配体门控离子通道受体: 激活后离子通道开放, 如 N 胆碱受体和 γ -氨基丁酸 (GABA) 受体。

(3) 酪氨酸激酶受体: 激活后使酪氨酸酶激活, 产生磷酸化, 激活蛋白激酶, 如胰岛素受体。

(4) 细胞内受体: 激活后调节某些特殊基因的转录, 如甾体激素、甲状腺激素、 V_D 及 V_A 受体。

4. 受体的调节

(1) 受体脱敏: 一般为长期使用激动药, 导致受体反应降低或数目减少 (受体向下调节) 继而引起药理效应减弱, 与机体对某些药物产生耐受性有关。

(2) 受体增敏: 一般为长期使用拮抗药, 导致受体超敏、高反应性, 或受体数目增多 (受体向上调节), 突然停药可引起反跳现象。

(二) 药物与受体的相互作用

1. 亲和力 药物与受体结合的能力。解离常数 (K_D) 可反映亲和力大小。 K_D 越大,



则亲和力越小。也可用亲和力指数 (pD_2 , K_D 负对数) 表示, pD_2 越大, 则亲和力越强。

2. 内在活性 药物与受体结合产生效应的能力。

3. 作用于受体的药物分类 (表 2-1)

表 2-1 作用于受体的药物分类

	亲和力	内在活性
完全激动药	强	强
部分激动药	强	较弱
拮抗药	强	无

4. 部分激动药特点 具有激动药和拮抗药的双重特性, 单独存在或浓度很低时为弱激动药, 与一定量完全激动药同时存在时则为拮抗药。

5. 拮抗药特点 因无内在活性本身不产生作用, 但占据受体妨碍内源性配体或激动药与受体结合, 从而拮抗内源性配体或激动药的效应。

(1) 竞争性拮抗药: 使激动药量-效曲线平行右移, E_{max} 不变。作用强度可用拮抗参数 pA_2 [激动药在加入竞争性拮抗药后, 2 倍浓度的激动药才可产生原浓度 (未加拮抗药时) 激动药的效应, 此时拮抗药的摩尔浓度的负对数称为 pA_2] 表示。 pA_2 越大, 拮抗作用越强。

(2) 非竞争性拮抗药: 使激动药量效曲线右移, E_{max} 下降。



复习思考题

一、选择题

(一) 单项选择题

1. 药物的基本作用是 ()

- A. 治疗作用和不良反应
- B. 局部作用和全身作用
- C. 兴奋作用和抑制作用
- D. 选择性作用和非选择性作用
- E. 特异性作用

2. 下列药物哪些是对因治疗 ()

- A. 硝酸甘油
- B. 头孢拉定
- C. 阿司匹林
- D. 卡托普利
- E. 吗啡

3. 副作用发生在 ()

- A. 治疗量
- B. 低于治疗量
- C. 中毒量
- D. 极量
- E. ED_{50}

4. 某患者使用东莨菪碱预防晕车, 但觉得口

干, 想喝水, 这是药物的 ()

- A. 停药反应
- B. 副作用
- C. 特异质反应
- D. 后遗效应
- E. 毒性反应

5. 连续多次使用地西洋治疗失眠, 效果减弱, 为获得治疗效果需不断增加地西洋用量, 这是因为药物产生了 ()

- A. 副作用
- B. 依赖性
- C. 成瘾性
- D. 耐受性
- E. 耐药性

6. 下列哪个参数可以更好地表示药物安全性 ()

- A. 最小有效量
- B. 半数有效量
- C. 半数致死量
- D. 治疗指数
- E. 等效剂量

7. 下列药物中安全性较高的是 ()

- A. $ED_{50}=50mg/kg$, $LD_{50}=100mg/kg$
- B. $ED_{50}=20mg/kg$, $LD_{50}=50mg/kg$
- C. $ED_{50}=30mg/kg$, $LD_{50}=50mg/kg$
- D. $ED_{50}=10mg/kg$, $LD_{50}=50mg/kg$



- E. $ED_{50}=40\text{mg/kg}$, $LD_{50}=50\text{mg/kg}$
8. A 药比 B 药效价强度高, 正确的依据是 ()
- A. A 药的 ED_{50} 比 B 药大
B. A 药的 ED_{50} 比 B 药小
C. A 药的 LD_{50} 比 B 药大
D. A 药的 LD_{50} 比 B 药小
E. A 药的 LD_{50}/ED_{50} 比 B 药大
9. 关于药物的亲和力, 下列说法正确的是 ()
- A. 药物穿透生物膜的能力
B. 药物与受体结合后产生效应的能力
C. 可以用解离常数 K_D 表示, K_D 越大, 表明亲和力越低
D. 药物水溶性的大小
E. 药物脂溶性的强弱
10. 关于药物的内在活性, 下列说法正确的是 ()
- A. 药物水溶性的大小
B. 药物与受体结合后产生效应的能力
C. 药物与受体结合的能力
D. 药物穿透生物膜的能力
E. 药物脂溶性的强弱
11. 部分激动药的特点是 ()
- A. 有较强的亲和力, 有较强的内在活性
B. 有较强的亲和力, 无内在活性
C. 无亲和力, 有较强的内在活性
D. 有较强的亲和力, 内在活性较弱
E. 无亲和力, 无内在活性
12. 药物与受体结合后, 可以激动或阻断受体, 这取决于药物的 ()
- A. 亲和力 B. 内在活性
C. 脂溶性 D. 剂量
E. 选择性
13. 某药物的量-效曲线向右平行移动, 提示 ()
- A. 药物的效能增加
B. 药物的效能减弱
C. 药物的效价强度增加
D. 药物的效价强度减弱
E. 药物作用机制的改变
14. 药物作用是指 ()
- A. 药物产生药理效应的能力
B. 药物和生物大分子间的初始作用
C. 药物的内在活性
D. 药物的理化性质
E. 药物的脂溶性
15. 受体的本质是 ()
- A. 配体的一种 B. 第二信使
C. 神经递质 D. 酶
E. 蛋白质
16. 某一长期使用糖皮质激素的患者, 停药 3 个月, 皮质功能仍未恢复, 这属于药物的 ()
- A. 停药反应 B. 副作用
C. 特异质反应 D. 后遗效应
E. 毒性反应
17. 副作用的产生是由于 ()
- A. 患者的遗传变异
B. 药物的安全范围小
C. 患者的特异性体质
D. 患者的肝肾功能不良
E. 药物作用的选择性低
18. 量-效曲线图上, A 药在 B 药的左侧, 且 B 药的量-效曲线比 A 药高, 则下述哪种评价是正确的 ()
- A. B 药的效价强度和最大效能均较大
B. A 药的效价强度和最大效能均较大
C. A 药的效价强度比 B 药大
D. A 药的效能比 B 药大
E. B 药的效价强度比 A 药大
19. 药物的效能反映药物的 ()
- A. 内在活性 B. 时-效关系
C. 亲和力 D. 量-效关系
E. 效价强度
20. N 胆碱受体属于 ()
- A. G 蛋白偶联受体
B. 离子通道受体

C. 酪氨酸激酶受体

D. 细胞内受体

E. 以上均不是

21. 药理效应是 ()

A. 药物的初始作用

B. 药物作用的原因

C. 药物作用的特异性

D. 药物作用的选择性

E. 药物作用的结果

22. pD_2 是 ()

A. 解离常数

B. 解离常数的负对数

C. 拮抗常数的负对数

D. 拮抗常数

E. 氢离子浓度的负对数

23. 拮抗参数 pA_2 是 ()

A. 使激动药的效应增加 1 倍时所加竞争性拮抗药浓度的负对数

B. 使激动药的效应不变时所加竞争性拮抗药浓度的负对数

C. 使激动药的效应增加 1 倍时所加激动药浓度的负对数

D. 使激动药的浓度增加 1 倍时所加竞争性拮抗药浓度的负对数

E. 使激动药的浓度增加 1 倍时所加非竞争性拮抗药浓度的负对数

(二) 多项选择题

24. 药物作用的两重性包括 ()

A. 治疗作用

B. 兴奋作用

C. 抑制作用

D. 不良反应

E. 局部作用和全身作用

25. 以下哪些属于药物的不良反应 ()

A. 毒性反应

B. 副作用

C. 停药反应

D. 过敏反应

E. 首关消除

26. 以下哪些属于药物的第二信使 ()

A. cAMP

B. ATP

C. GTP

D. cGMP

E. Ca^{2+}

27. 竞争性拮抗药的特点是 ()

A. 本身能产生与激动药相反的药理效应

B. 能减弱激动药的最大效应

C. 使激动药的量-效曲线平行右移

D. 不能改变激动药的效能

E. 削弱激动药的效价强度

28. 部分激动药的特点是 ()

A. 本身可以产生药理效应

B. 具有激动药与拮抗药的双重特性

C. 内在活性较弱

D. 亲和力较强

E. 与完全激动药合用, 可以拮抗完全激动药的作用

29. 配体与受体结合的化学力包括 ()

A. 离子键

B. 共价键

C. 氢键

D. 范德华力

E. 亲和力

30. 有关效能和效价强度的叙述, 正确的是 ()

A. 效能是药物的最大效应

B. 效能高的药物效价强度也高

C. 效价强度用药物产生同等效应时的剂量来衡量

D. 半最大效应浓度 (EC_{50}) 越小的药物其效价强度越大

E. 效价强度是药物的最大效应

31. 下列药物中能产生竞争性拮抗作用的是 ()

A. 毛果芸香碱与肾上腺素

B. 毛果芸香碱与阿托品

C. 地西洋与氟马西尼

D. 纳洛酮与吗啡

E. 去甲肾上腺素与硝酸甘油

32. 下列有关内在活性的描述, 正确的是 ()

A. 内在活性是药物与受体结合的能力

B. 内在活性是药物与受体结合后引起效应的能力

C. 内在活性越大, 则药物效价强度越强

D. 内在活性越大, 则药物效能越强

E. 内在活性越大, 则药物作用维持时间



越长

33. 有关量-效关系的描述, 正确的是 ()

- A. 在一定范围内, 药理效应强度与血浆药物浓度呈正相关
- B. 质反应的量-效曲线可以反映药物效能和效价强度
- C. ED_{50} 是只在质反应中出现的剂量
- D. 量反应的量-效关系呈常态分布曲线
- E. 量反应的量-效曲线可以反映药物效能和效价强度

34. 可作为用药安全性的指标有 ()

- A. LD_{50}/ED_{50}
- B. 治疗窗
- C. $ED_{95} \sim LD_5$ 之间的距离
- D. ED_{50}/LD_{50}
- E. LC_{50}/EC_{50}

35. 下列正确的描述是 ()

- A. 药物可通过占领受体发挥效应
- B. 药物激动受体一定可以产生兴奋效应
- C. 抑制的效应一定是通过阻断受体实现
- D. 肾上腺素受体属于 G 蛋白偶联受体
- E. 药理效应的大小与被占领的受体数目成正比

36. 关于副作用, 以下说法正确的是 ()

- A. 在治疗量发生
- B. 与患者体质异常有关
- C. 与药物选择性低有关
- D. 与治疗作用之间会随着治疗目的不同而转换
- E. 是药物固有的作用

二、判断题

1. 药物的量-效关系是指在任意浓度范围内药物剂量与效应之间的依赖关系。

2. 药物不良反应仅指在正常剂量下发生的, 给患者带来痛苦或不适的作用。

3. 药物的基本作用是指药物治疗作用和不良反应。

4. 在量反应中, ED_{50} 指的是导致 50% 的动物出现有效反应的剂量。

5. 效能高的药物其效价强度也一定高。

6. 治疗指数越大的药物其安全性也越高。

7. 胰岛素受体属于酪氨酸激酶受体。

8. 作用于同一受体的药物是激动药还是拮抗药取决于药物的内在活性。

9. A 药的治疗指数比 B 药的高, 提示 A 药肯定比 B 药安全。

10. 部分激动药具有激动药与拮抗药的双重特性。

11. 量反应在一定条件下可以转变为质反应。

12. 在量反应中, ED_{50} 越小, 则药物的效价强度越大。

13. 在质反应中, LD_{50} 越小, 表明药物越安全。

14. 在量反应中, 最大效应越大者意味着其效能越高。

15. 内在活性越大的药物其效价强度越高。

16. 非竞争性拮抗药能降低激动药的最大效应。

17. K_D 越小, 则 pD_2 越大, 意味着药物亲和力越高。

18. pA_2 越大, 则意味着拮抗药的拮抗能力越强。

19. 激动受体就会产生兴奋的效应。

20. 副作用的产生主要与患者体质异常有关。

21. 横坐标为对数浓度时, 量反应的量-效曲线为对称 S 形曲线。

22. 剂量越小变态反应的程度越轻。

23. 随着剂量的增加, 药物的药理效应会一直增强。

24. 效能和效价强度都可以反映药物作用的强弱。

25. 竞争性拮抗药不会影响激动药的最大效应。

26. 受体都位于细胞膜上, 可以传递药物信息至细胞内。

27. 长期阻断受体会引起受体的向下调节, 停药时出现反跳现象。

28. 特异性高的药物产生的药理效应选择性一定高。

29. 竞争性拮抗药会降低激动药对受体的亲和力。

30. 部分激动药的亲和力与内在活性皆较弱。

31. 药物作用是产生药理效应的原因。

32. 葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺陷患者服治疗量的伯氨喹所致的溶血反应属于过敏反应。

三、填空题

1. 药物效应动力学研究的是_____对_____的作用。

2. 药物作用的基本表现是_____和_____。

3. 药物作用的两重性是_____和_____。

4. 根据治疗目的, 治疗作用分为_____和_____。

5. 不良反应包括的种类有_____, _____, _____, _____, _____等。

6. 副作用是_____剂量出现的与_____无关的作用。

7. 后遗效应是指停药后, 血药浓度低于_____以下时残存的药理效应。

8. 停药反应是指长期使用药物, _____停药时原有疾病重现或加重。

9. 药理效应按性质可分为_____和_____两类。

10. 根据受体占领学说, 药物产生效应不仅需要_____, 还需要_____。

11. 受体的激动药既有亲和力又有_____。

12. 受体的调节方式有_____和_____两种。

13. 根据受体蛋白结构、信号转导过程等特点受体可以分为_____, _____, _____等类型。

14. 请列举四种第二信使: _____, _____, _____, _____。

15. 竞争性拮抗药可以使激动药的量-效曲线_____, 但_____不变。

16. 治疗指数是_____和_____的比值。

17. 不良反应指的是与_____无关的, 并给患者带来痛苦或不适的反应。

18. 药理作用使得机体器官原有功能提高称为_____; 功能降低称为_____。

19. 变态反应的性质与药物原有药理效应_____, 严重程度多与剂量_____。

20. 根据内在活性的不同, 可以把作用于受体的药物分为_____, _____, _____三类。

四、名词解释

1. adverse drug reaction

2. side effect

3. toxic reaction

4. residual effect

5. withdrawal reaction

6. dose-effect relationship

7. efficacy

8. potency

9. therapeutic index

五、问答题

1. 什么是药物的不良反应? 其种类有哪些?

2. 在某一药物的量-效曲线上可以得到哪些信息? 半数有效量与半最大效应剂量的区别是什么?

3. 从药物与受体作用的角度简述完全激动药、部分激动药和拮抗药的特点。

4. 效价强度与效能在临床用药上有何意义?

5. 简述药物作用与药理效应的区别与联系。

6. 试比较竞争性拮抗药与非竞争性拮抗药对激动药量-效曲线的不同影响。

7. 什么是药物作用的特异性? 什么是药物作用的选择性?

8. 什么是亲和力? 什么是内在活性?

六、案例题

某患者长期使用 β -受体阻断药普萘洛尔治疗高血压, 后因发生间歇性跛行而停止使用该药, 突然停药时出现了心肌梗死, 该现象属于药物的哪种不良反应, 应如何避免, 并请解释该现象发生的原因是什么?

(王 蕾)

第三章

药物代谢动力学

大纲要求

1. 掌握 ①单纯扩散及影响因素（特别强调药物所处环境 pH 和药物解离度对药物跨膜转运的影响），离子障的概念。②吸收、首关消除、肝肠循环的概念。③消除的概念，一级消除动力学的概念和特点，稳态血药浓度的概念。④药代动力学基本参数：消除半衰期、生物利用度的概念、计算公式，理解其药理学意义。

2. 熟悉 ①被动转运、主动转运、易化扩散的概念及特点。②肝药酶概念及特性。药物分布、再分布，血浆蛋白结合率，结合型药物的特点，血脑屏障和胎盘屏障。药物的生物转化：药酶抑制剂、药酶诱导剂；药物的排泄：肾脏排泄，胆汁排泄。③零级消除动力学的概念、特点。④表观分布容积概念及意义；负荷量、清除率的含义。

3. 了解 各种给药途径对药物吸收的影响。

学习要点

一、药物分子的跨膜转运

药物分子跨膜转运的方式：简单扩散（被动扩散）、载体转运（易化扩散、主动转运）、滤过。

（一）简单扩散（simple diffusion）

1. 主要方式 这是大多数药物跨膜转运的方式。脂溶性高、极性小、分子型（非解离型）的药物容易简单扩散。

2. 特点 顺浓度梯度转运、扩散转运速度与浓度差成正比，不消耗能量，不需要载体，无饱和现象，不产生竞争性抑制。

3. pH 的影响 改变溶液 pH 可明显影响弱酸性或弱碱性药物的解离度，进而影响其简单扩散的程度（表 3-1）。

表 3-1 环境 pH 与药物 pK_a 对药物解离度的影响

	酸性环境	碱性环境
弱酸性药物	解离度↓，容易简单扩散 吸收：吸收↑ 排泄：重吸收↑，排泄↓	解离度↑，不容易简单扩散 吸收：吸收↓ 排泄：重吸收↓，排泄↑