



医学双纲双试 通关宝典

YIXUE SHUANGGANG SHUANGSHI
TONGGUAN BAODIAN

主编 ○ 孙秀兰 顾 军

药 理 学

YAOLIXUE

一书含双纲，轻松过双试

凝聚核心内容，精析考试真题

中国医药科技出版社

1998, 1999, 2000, 2001, 2002, 2003, 2004, 2005, 2006, 2007, 2008, 2009, 2010, 2011, 2012, 2013, 2014, 2015, 2016, 2017, 2018, 2019, 2020, 2021, 2022, 2023, 2024, 2025, 2026, 2027, 2028, 2029, 2030, 2031, 2032, 2033, 2034, 2035, 2036, 2037, 2038, 2039, 2040, 2041, 2042, 2043, 2044, 2045, 2046, 2047, 2048, 2049, 2050, 2051, 2052, 2053, 2054, 2055, 2056, 2057, 2058, 2059, 2060, 2061, 2062, 2063, 2064, 2065, 2066, 2067, 2068, 2069, 2070, 2071, 2072, 2073, 2074, 2075, 2076, 2077, 2078, 2079, 2080, 2081, 2082, 2083, 2084, 2085, 2086, 2087, 2088, 2089, 2090, 2091, 2092, 2093, 2094, 2095, 2096, 2097, 2098, 2099, 2100, 2101, 2102, 2103, 2104, 2105, 2106, 2107, 2108, 2109, 2110, 2111, 2112, 2113, 2114, 2115, 2116, 2117, 2118, 2119, 2120, 2121, 2122, 2123, 2124, 2125, 2126, 2127, 2128, 2129, 2130, 2131, 2132, 2133, 2134, 2135, 2136, 2137, 2138, 2139, 2140, 2141, 2142, 2143, 2144, 2145, 2146, 2147, 2148, 2149, 2150, 2151, 2152, 2153, 2154, 2155, 2156, 2157, 2158, 2159, 2160, 2161, 2162, 2163, 2164, 2165, 2166, 2167, 2168, 2169, 2170, 2171, 2172, 2173, 2174, 2175, 2176, 2177, 2178, 2179, 2180, 2181, 2182, 2183, 2184, 2185, 2186, 2187, 2188, 2189, 2190, 2191, 2192, 2193, 2194, 2195, 2196, 2197, 2198, 2199, 2200, 2201, 2202, 2203, 2204, 2205, 2206, 2207, 2208, 2209, 2210, 2211, 2212, 2213, 2214, 2215, 2216, 2217, 2218, 2219, 2220, 2221, 2222, 2223, 2224, 2225, 2226, 2227, 2228, 2229, 2230, 2231, 2232, 2233, 2234, 2235, 2236, 2237, 2238, 2239, 2240, 2241, 2242, 2243, 2244, 2245, 2246, 2247, 2248, 2249, 2250, 2251, 2252, 2253, 2254, 2255, 2256, 2257, 2258, 2259, 2260, 2261, 2262, 2263, 2264, 2265, 2266, 2267, 2268, 2269, 2270, 2271, 2272, 2273, 2274, 2275, 2276, 2277, 2278, 2279, 2280, 2281, 2282, 2283, 2284, 2285, 2286, 2287, 2288, 2289, 2290, 2291, 2292, 2293, 2294, 2295, 2296, 2297, 2298, 2299, 2300, 2301, 2302, 2303, 2304, 2305, 2306, 2307, 2308, 2309, 2310, 2311, 2312, 2313, 2314, 2315, 2316, 2317, 2318, 2319, 2320, 2321, 2322, 2323, 2324, 2325, 2326, 2327, 2328, 2329, 2330, 2331, 2332, 2333, 2334, 2335, 2336, 2337, 2338, 2339, 2340, 2341, 2342, 2343, 2344, 2345, 2346, 2347, 2348, 2349, 2350, 2351, 2352, 2353, 2354, 2355, 2356, 2357, 2358, 2359, 2360, 2361, 2362, 2363, 2364, 2365, 2366, 2367, 2368, 2369, 2370, 2371, 2372, 2373, 2374, 2375, 2376, 2377, 2378, 2379, 2380, 2381, 2382, 2383, 2384, 2385, 2386, 2387, 2388, 2389, 2390, 2391, 2392, 2393, 2394, 2395, 2396, 2397, 2398, 2399, 2400, 2401, 2402, 2403, 2404, 2405, 2406, 2407, 2408, 2409, 2410, 2411, 2412, 2413, 2414, 2415, 2416, 2417, 2418, 2419, 2420, 2421, 2422, 2423, 2424, 2425, 2426, 2427, 2428, 2429, 2430, 2431, 2432, 2433, 2434, 2435, 2436, 2437, 2438, 2439, 2440, 2441, 2442, 2443, 2444, 2445, 2446, 2447, 2448, 2449, 2450, 2451, 2452, 2453, 2454, 2455, 2456, 2457, 2458, 2459, 2460, 2461, 2462, 2463, 2464, 2465, 2466, 2467, 2468, 2469, 2470, 2471, 2472, 2473, 2474, 2475, 2476, 2477, 2478, 2479, 2480, 2481, 2482, 2483, 2484, 2485, 2486, 2487, 2488, 2489, 2490, 2491, 2492, 2493, 2494, 2495, 2496, 2497, 2498, 2499, 2500, 2501, 2502, 2503, 2504, 2505, 2506, 2507, 2508, 2509, 2510, 2511, 2512, 2513, 2514, 2515, 2516, 2517, 2518, 2519, 2520, 2521, 2522, 2523, 2524, 2525, 2526, 2527, 2528, 2529, 2530, 2531, 2532, 2533, 2534, 2535, 2536, 2537, 2538, 2539, 2540, 2541, 2542, 2543, 2544, 2545, 2546, 2547, 2548, 2549, 2550, 2551, 2552, 2553, 2554, 2555, 2556, 2557, 2558, 2559, 2560, 2561, 2562, 2563, 2564, 2565, 2566, 2567, 2568, 2569, 2570, 2571, 2572, 2573, 2574, 2575, 2576, 2577, 2578, 2579, 2580, 2581, 2582, 2583, 2584, 2585, 2586, 2587, 2588, 2589, 2590, 2591, 2592, 2593, 2594, 2595, 2596, 2597, 2598, 2599, 2600, 2601, 2602, 2603, 2604, 2605, 2606, 2607, 2608, 2609, 2610, 2611, 2612, 2613, 2614, 2615, 2616, 2617, 2618, 2619, 2620, 2621, 2622, 2623, 2624, 2625, 2626, 2627, 2628, 2629, 2630, 2631, 2632, 2633, 2634, 2635, 2636, 2637, 2638, 2639, 2640, 2641, 2642, 2643, 2644, 2645, 2646, 2647, 2648, 2649, 2650, 2651, 2652, 2653, 2654, 2655, 2656, 2657, 2658, 2659, 2660, 2661, 2662, 2663, 2664, 2665, 2666, 2667, 2668, 2669, 2670, 2671, 2672, 2673, 2674, 2675, 2676, 2677, 2678, 2679, 26

药理学

WRITE

◆ ◆ ◆ ◆ ◆



医学双纲双试通关宝典

药 理 学

YAO LI XUE

主 编 孙秀兰 顾 军

副主编 吴文宁 郭若冰

中国医药科技出版社

内 容 提 要

本书是“医学双纲双试通关宝典”系列之一,共7篇42章,全面介绍了药理学的基础知识以及各系统的药理学知识。本书将医学名
校教学大纲和执业医师考试大纲串起为主线,以现行医学教材为蓝
本,将其学习要点、考试重点归纳成“核心内容”跟随于双纲之后,
随后列举执业医师资格考试历年考点、配有执业医师资格考试题,并
附答案和精心解析,还补充有供学生自测的练习题。

本系列丛书主要针对医学院校基础、预防、临床、口腔类医学专
业及相关专业学生在校学习、备考之用,同时可作为其步入临床之后
参加执业医师考试的复习用书。

图书在版编目(CIP)数据

药理学/孙秀兰,顾军主编. —北京:中国医药科技出版
社,2012.2

(医学双纲双试通关宝典)

ISBN 978-7-5067-5335-7

I. ①药… II. ①孙… ②顾… III. ①药理学-医学院
校-教学参考资料 IV. ①R96

中国版本图书馆CIP数据核字(2011)第261356号

美术编辑 陈君杞

版式设计 郭小平

出版 中国医药科技出版社

地址 北京市海淀区文慧园北路甲22号

邮编 100082

电话 发行:010-62227427 邮购:010-62236938

网址 www.cmstp.com

规格 787×1092mm $\frac{1}{32}$

印张 9 $\frac{1}{4}$

字数 186千字

版次 2012年2月第1版

印次 2012年2月第1次印刷

印刷 北京密东印刷有限公司

经销 全国各地新华书店

书号 ISBN 978-7-5067-5335-7

定价 19.00元

本社图书如存在印装质量问题请与本社联系调换

编写说明

医学专业是公认学习负担较重的专业，为了帮助考生顺利通过一次次的考试，如在校考试、执业医师资格考试，我们组织编写了这套《医学双纲双试通关宝典》。

本系列丛书按课程设立分册，除《解剖学》、《药理学》稍有不同以外，都具有以下模块。

教学大纲、执业医师资格考试大纲 双纲对比出现，各自侧重点一目了然。

核心内容 根据现行医学教材提取的最精华内容，层次清晰，化繁为简，兼顾各种考试重点、学习要点，又充分保留学科系统的完整性。

执业医师资格考试题 精选执业医师资格考试真题，附有答案和解析，提供解题思路。

使用方法：学习相关课程时，对照教学大纲，记忆重点内容，同时学有余力的同学可以参照了解执业医师资格考试大纲的要求，熟悉执业医师资格考试的题型，以便在开始学习课程之初就建立执业医师资格考试的思维模式，围绕执业医师资格考试的需要学习相关课程。

毕业工作后，这本小册子不像一般参考书被束之高阁，还可随身携带翻阅，温故知新，作为执业医师资格考试考前准备用书。

希望这套小书能够帮助同学们顺利通过每一次考试！

由于时间仓促，若有不当之处，欢迎同仁和读者批评指正！衷心感谢！

（有何意见和建议请发邮件至 8287053@qq.com）

目 录

CONTENTS

第一篇 药理学总论

- 第一章 药理学总论——绪言 / 2
- 第二章 药物代谢动力学 / 4
- 第三章 药物效应动力学 / 16

第二篇 传出神经药理学

- 第四章 传出神经系统药理概论 / 28
- 第五章 胆碱受体激动药 / 35
- 第六章 抗胆碱酯酶药和胆碱酯酶复活药 / 39
- 第七章 胆碱受体阻断药 (I) ——M 胆碱受体阻断药 / 44
- 第八章 胆碱受体阻断药 (II) ——N 胆碱受体阻断药 / 50
- 第九章 肾上腺素受体激动药 / 53
- 第十章 肾上腺素受体阻断药 / 61

第三篇 中枢神经及传入神经系统药理学

- 第十一章 局部麻醉药 / 70
- 第十二章 镇静催眠药 / 73
- 第十三章 抗癫痫药和抗惊厥药 / 79
- 第十四章 抗帕金森病药 / 85
- 第十五章 抗精神失常药 / 91
- 第十六章 镇痛药 / 101
- 第十七章 解热镇痛抗炎药 / 109

第四篇 心血管药理学

- 第十八章 钙通道阻滞药 / 118
- 第十九章 抗心律失常药 / 123
- 第二十章 肾素 - 血管紧张素系统药理 / 135
- 第二十一章 利尿药和脱水药 / 138
- 第二十二章 抗高血压药 / 145
- 第二十三章 治疗充血性心力衰竭的药物 / 159
- 第二十四章 抗心绞痛药 / 169
- 第二十五章 调血脂药与抗动脉粥样硬化药 / 175
- 第二十六章 作用于血液及造血器官的药物 / 181

第五篇 内脏系统药理学及抗组胺药

- 第二十七章 影响自体活性物质的药物 / 192
- 第二十八章 作用于呼吸系统的药物 / 195
- 第二十九章 作用于消化系统的药物 / 202

第六篇 内分泌系统药理学

- 第三十章 肾上腺皮质激素类药物 / 208
第三十一章 甲状腺激素及抗甲状腺药 / 217
第三十二章 胰岛素及口服降血糖药 / 222

第七篇 化学治疗药物及其他

- 第三十三章 抗菌药物概论 / 228
第三十四章 β -内酰胺类抗生素 / 233
第三十五章 大环内酯类、林可霉素类及多肽类抗生素 / 242
第三十六章 氨基糖苷类抗生素 / 247
第三十七章 四环素类及氯霉素类抗生素 / 253
第三十八章 人工合成抗菌药 / 257
第三十九章 抗病毒药和抗真菌药 / 265
第四十章 抗结核病药及抗麻风病药 / 270
第四十一章 抗寄生虫药 / 275
第四十二章 抗恶性肿瘤药 / 278



第一篇 药理学总论



第一章 药理学总论——绪言

教学大纲

- ☞ 熟悉药物、药理学、药物效应动力学和药物代谢动力学的定义。
- ☞ 了解药理学的性质和研究任务，药物与药理学的发展史，新药的研究和开发。
- ☞ 药理学发展简史，我国本草学的成就，现代药理学的产生和其发展概况，我国药理学发展和成就。



核心内容

药物 (drug) 是指可改变或查明机体生理功能及病理状态，用以预防、诊断、治疗疾病的化学物质。药物与毒物并无严格的界线。

药理学 (pharmacology) 是研究药物与机体 (含病原体) 相互作用及其作用规律的科学。包括药物对机体作用及其作用机制，即药物效应动力学 (pharmacodynamics)，又称药效学，也研究药物在机体影响下所发生的变化及其规律，即药物代谢动力学 (pharmacokinetics)，又称药动学。

药理学以生理学、生物化学、病理学为基础，为防治疾

病、合理用药提供基本理论、基本知识和科学思维方法，是基础医学与临床医学以及医学与药学的桥梁。

药理学的科学任务是：阐明药物作用及作用机制，为临床用药提供理论依据；研究开发新药，发现药物的新用途；为生命科学的研究提供重要的科学依据和研究方法。

新药是指化学结构、药品组分或药理作用不同于现有药品的药物。新药的研究包括临床前研究、临床研究和上市后药物检测。

三 练习题与答案 三

单项选择题

1. 药理学的主要任务是
 - A. 研究药物代谢动力学
 - B. 研究药物效应动力学
 - C. 研究药物与机体相互作用规律及作用机制的科学
 - D. 研究药物临床应用的科学
 - E. 研究药物化学结构的科学
2. 药效动力学是研究
 - A. 药物对机体的作用和作用规律的科学
 - B. 药物作用原理的科学
 - C. 药物对机体的作用规律和作用机制的科学
 - D. 药物对机体的作用规

律和作用机制的科学

- E. 药物的不良反应
- (3~6 题共用备选答案)
- A. 《神农本草经》
 - B. 《药理学》
 - C. 《新修本草》
 - D. 《本草纲目》
 - E. 《药典》
3. 我国最早的药学专著
 4. 我国上第一部药典
 5. 明代杰出医药学家李时珍的科学巨著
 6. 有关药物知识的专著

参考答案：

1. C 2. D 3. A 4. C 5. D
6. B

第二章 药物代谢动力学

教学大纲

- ☞ 掌握药物代谢动力学的基本规律，各种基本参数及其概念。时量关系、时量曲线、药代动力学基本参数及其概念、峰值浓度 ($C_{\max}$)、达峰时间 (T_{peak})、曲线下面积 (AUC)、表观分布容积 (V_d)， $t_{1/2}$ ，血浆清除率 (CL)，一级消除动力学、零级消除动力学的特点。连续给药时的血药稳态浓度 (C_{ss})。房室模型。
- ☞ 熟悉药物的体内过程 (吸收、分布、生物转化、排泄)。药物的体内过程，药物吸收的途径及影响药物跨膜转运的因素，首关效应，药物与血浆蛋白结合意义，药物的分布，血脑屏障及胎盘屏障，药物的生物转化，肝药酶及细胞色素 P450 酶系特性，肝药酶的诱导与抑制，药物排泄，肝肠循环及意义。

执业医师资格考试大纲

- ☞ 吸收：首关消除。
- ☞ 分布：①血-脑屏障；②胎盘屏障。
- ☞ 体内药量变化的时间过程：生物利用度。
- ☞ 药物消除动力学：①一级消除动力学；②零级消除动力学。



核心内容

一、药动学

主要研究药物的吸收、分布、转化、排泄的规律及影响因素。

(一) 药物通过细胞膜的方式

有滤过（水溶扩散）、简单扩散（脂溶性扩散）和载体转运（包括主动转运和易化扩散）。

表 2-1 转运类型和特点

类 型	特 点
被动转运	顺浓度差、不耗能、不需要载体、不受饱和限速及竞争抑制的影响
简单扩散 (脂溶扩散)	是大多数药物扩散方式, 其扩散速度受膜两侧药物浓度差、药物脂溶性、解离度和所在溶液 PH 等因素影响
滤过 (膜 孔扩散)	分子量小的水溶性药物借助膜两侧的渗透压差, 浓度差通过膜孔 (亲水通道) 而扩散
载体转运	需要载体参与, 有饱和、限速及竞争抑制的现象
易化扩散 (载体转运)	兼有载体转运 (需载体, 有饱和性和竞争性地抑制) 和被动转运 (顺浓度差、不耗能) 的特点。其转运的速度远比要被动转运快得多
主动转运	主动转运 (active transport) 指逆浓度差的载体转运 (它可使药物在体内聚集于某一器官或组织), 需要消耗能量

简单扩散是药物转运中一种最常见、最重要的转运方式。分子量小、脂溶性大、极性小的药物较易进行单扩散。

药物在体液内都以非解离型和解离型两种形式存在, 离子化程度影响药物跨膜被动转运, 进而影响药物吸收分布排泄。非解离型药物因其脂溶性大, 能溶入脂质膜中, 易于通过生物膜; 而解离型药物脂溶性小, 不易通过生物膜, 被限

制在膜的一侧，称为离子障。药物的离子化程度取决于药物的 pK_a 值及所在溶液的 pH 值，其关系可以用公式 $[\lg(\text{离子化药物}/\text{未离子化药物}) = |pH - pK_a|]$ 表示。

简单扩散的通透量除了和上述药物性质和状态相关外，还与膜两侧药物浓度差、膜的通透面积成正比，与膜的厚度成反比。

(二) 吸收

是指药物自用药部位转运进入血液循环的过程，多数药物通过被动转运吸收，少数药物经主动转运吸收。

表 2-2 各种吸收途径的特点

药途径	吸收途径	特点及影响因素
静脉注射		直接注入血液，无吸收过程，起效快，用于急救，昏迷病人，剂量易控制，易出现不良反应故应注意注射速度
肌内注射	经毛细血管壁吸收	吸收迅速而完全，受剂型和局部血流影响
舌下给药	经口腔黏膜的毛细血管吸收	可避免首过效应和胃酸破坏
口服给药	从胃肠黏膜吸收	最常用，方便、经济和安全的给药方法，但吸收慢而不规则，受首关消除等许多因素影响
直肠给药	经直肠黏膜吸收	无首关效应，不能口服或注射的病人使用对胃有强烈刺激或首关效应大的药物时可直肠给药
呼吸道给药	经呼吸道黏膜吸收	喷雾或吸入，吸收迅速，用于小分子、脂溶性，挥发性的药物或气体
经皮给药	经皮吸收	脂溶性药物可以缓慢吸收。促皮吸收剂如氮酮可促进吸收

(三) 分布

分布可以分为药物在循环系统的运输和向各个组织器官转移两个过程。

运输中，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。但只有游离型的药物才能转运到

器官组织中，血液中也有未结合的游离型药物，两者同时存在，并可以相互转化。

药物向器官组织的转移，首要药物要能到达相应的器官，器官血流量及体内特别部位的屏障影响转运。体内特别部位的屏障包括血脑屏障、胎盘屏障和血眼屏障。需要注意的是胎盘屏障无屏障作用，几乎所有的药物均可通过此屏障进入胚胎循环。

药物与组织细胞结合是由于药物与某些组织细胞成分具有特殊的亲合力，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。个别药物可首先向血流量大的器官分布，然后再向血流量少、但脂溶性更强的组织转移，称为再分布。

药物进入到组织内，还要进行跨膜转运，所以体液的 pH 和药物的解离度也会影响药物的分布。由于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 则使弱酸性药物向细胞内转移，弱碱性药物则相反。

综上，分布和血浆蛋白的结合率、器官血流量、组织细胞结合、体液的 pH 和药物的解离度及体内特别部位的屏障相关。

（四）代谢

药物分布到组织细胞发挥药物作用后，接着就要进行代谢。药物经代谢后作用一般降低或消失，但也有作用或毒性升高的。代谢又称为生物转化。

体内各种组织均有不同程度的代谢药物的能力，但肝脏是最主要的药物代谢器官，此外，胃肠道、肺、皮肤、肾也可产生有意义的药物代谢作用。

药物在体内的转化一般都是在酶的催化下进行，肝脏的

CYP450 酶系统是代谢的主要酶系统。药物代谢酶的会受到诱导活性加强，或者抑制，活性降低。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。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。这类抑制物和药物代谢酶结合，竞争性抑制其他底物的代谢。

（五）排泄

排泄是指药物及其代谢物被排出体外的最终过程。

肾脏是药物排泄的主要器官，药物及代谢产物主要经肾脏排泄。气体及挥发性药物可由肺随呼气排出。

肾脏排泄药物与下列三种方式有关：①肾小球滤过。②肾小管被动重吸收。③肾小管主动分泌。只有极少数的药物可经肾小管主动分泌排泄。

二、一级消除动力学、零级消除动力学的基本概念及特点

（一）零级消除动力学和一级消除动力学

表 2-3 零级消除动力学和一级消除动力学的特点

	消除速度	与血药浓度关系	酶	半衰期	血药浓度下降	给药剂量	不良反应发生率
一级	恒比消除	无关	不饱和	不变	快	小	低
零级	恒量消除	正比	饱和	与血药浓度成正比	慢	大	高

（二）药物代谢动力学基本参数

包括峰值浓度（ $C_{\max}$ ）、达峰时间（ T_{peak} ）、曲线下面积（AUC）、表观分布容积（ V_d ）、消除半衰期（ $t_{1/2}$ ）、血浆清除率（CL）。

生物利用度是指经肝脏首关消除过程后能被吸收进入体

循环的药物相对量和速度。生物利用度也是评价药物制剂质量的一个十分重要的指标。通常用吸收百分率表示，即给药量与吸收进入体循环的药量的比值。

半衰期一般指消除半衰期，即血浆中药物浓度下降一半所需的时间。绝大多数药物的消除过程属于一级消除动力学，半衰期总是一个固定值，不受初始血药浓度高低的影响，取决于药物消除速率常数 (K_e)。

生物等效性是指对于含同一有效成分，且剂型、剂量和给药途径相同的两种不同的药品，它们所含的有效成分的生物利用度无显著差别。

(三) 药物剂量的设计和优化

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。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。

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。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。

执业医师资格考试历年考点

考点 药物与血浆蛋白结合及其意义·(2000)

要点 药物进入血液循环后可与血浆蛋白质结合成为结合型药物，未与蛋白质结合的药物则称为游离型药物。血浆中只有游离型药物能透过细胞膜分布到各器官组织及靶部位发挥药理作用。药物和血浆蛋白的结合具有可逆性和饱和性。