



医学生期末备考**十日通**系列



药理学

期末备考十日通

主编 期末考试专家研究组

- **考前必会** 带你速览学科核心考点，
重点难点，点点不漏
- **考前必做** 帮你突破期末典型考题，
所有题型，一网打尽



中国医药科技出版社



医学生期末备考十日通系列

药理学 期末备考十日通

主编 期末考试专家研究组

中国医药科技出版社

内 容 提 要

本书是《医学生期末备考十日通系列》之一。书中内容以卫生部“十二五”规划教材《药理学》第8版为蓝本进行编写,章节编排与第8版教材一致。每章包括两大版块:一是“考前必会——核心考点纵览”,按照章节权重和教学大纲要求,采用图表和提纲的形式展现知识脉络,归纳梳理学习要点。二是“考前必做——典型考题突破”,选择期末考试常规题型,覆盖高频考点、重点、难点,方便学生同步练习及考前复习和自测,同时提高答题和应试能力;还配有【记忆处方】,提供记忆小窍门。本书适合开设此课程的医学及相关专业学生学习辅导及期末备考使用,也可作为药理学专业考研复习的重要参考。

图书在版编目(CIP)数据

药理学期末备考十日通/期末考试专家研究组主编. —北京:中国医药科技出版社, 2014. 7

(医学生期末备考十日通系列)

ISBN 978 - 7 - 5067 - 6831 - 3

I. ①药… II. ①期… 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 (2014) 第 107546 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](http://www.cmstp.com)

规格 787 × 1092mm 1/16

印张 16 3/4

字数 324 千字

版次 2014 年 7 月第 1 版

印次 2014 年 7 月第 1 次印刷

印刷 三河市万龙印装有限公司

经销 全国各地新华书店

书号 ISBN 978 - 7 - 5067 - 6831 - 3

定价 32.00 元

本社图书如存在印装质量问题请与本社联系调换



《医学生期末备考十日通系列》

编委会

主 编	期末考试专家组			
编 委	付 涛	刘 凯	周 萃	马金凤
	付丽珠	刘 颖	刘保陞	胡留城
	季 恩	陈 俊	梁 琼	康钦利
	李 颖	蒋太春	侯 荣	尹桂君
	雍永金	张树成	张仁君	张道明
	张志军	曾 勇	曾兴文	

前言

Foreword

学会做善于考试的白衣天使

——用最少的的时间攻克期末考试

作为医学生，大家都有一个体会：每到期末来临的时候，所有科目的考试一起来，即使我们有三头六臂、每天 24 小时无休无息也觉得难以对付。基础医学原理多、抽象，因此，难以消化理解。临床医学考点多，内在联系少，所以，记忆难免顾此失彼。

为了减轻医学生的课业负担，《医学生期末备考十日通系列》丛书首创针对医学生期末考试辅导的先河，以国家最新规划教材为依据进行编写，旨在帮助广大医学生扎实地掌握各学科知识，用最少的的时间轻松通过期末考试，因此高效性、针对性和趣味性成为本丛书追求的最高境界。

本丛书包括以下十二个品种，涵盖了基础医学和临床医学的主干课程。

1. 生理学期末备考十日通
2. 生物化学与分子生物学期末备考十日通
3. 病理学期末备考十日通
4. 病理生理学期末备考十日通
5. 系统解剖学期末备考十日通
6. 诊断学期末备考十日通
7. 药理学期末备考十日通
8. 内科学期末备考十日通
9. 外科学期末备考十日通
10. 妇产科学期末备考十日通
11. 儿科学期末备考十日通
12. 神经病学期末备考十日通

本丛书围绕“学会做善于考试的白衣天使”这一目标，每个分册的章节结构总体由两部分组成：

考前必会——核心考点纵览：按照章节，依据教学大纲要求，采用大量的图表和要言不烦的形式，梳理归纳知识要点，帮助你在短期内快速掌握期末考试的考点。

考前必做——典型考题突破：选择期末考试中常用的题型，形式多样，并附有详细的参考答案。用试题及其答案将知识点串联起来，并有助于你提前感受考试的氛围。还可通过自测，了解自己对本学科知识的掌握情况，便于及时调整和补习，练记结合，提高解题和应试能力，从而在短期内取得好成绩。

另外，有些分册还配有【记忆处方】，有趣有效的速记方法使考点不再零散、死板难记，激发你的学习兴趣而变被动应考为主动复习，使你的期末备考事半功倍。

为不断提高我社考试图书品质，更好地为大家服务，欢迎广大读者提出宝贵意见，我们将在今后的工作中不断修订完善。反馈信息请发送至邮箱：kszx405@163.com。在此谨致谢意！

愿本丛书陪伴你一起度过快乐、充实的学习时光！

期末考试专家研究组

2014 年 6 月

目录

Contents

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	10
第四章	影响药物效应的因素	18
第五章	传出神经系统药理概论	22
第六章	胆碱受体激动药	27
第七章	抗胆碱酯酶药和胆碱酯酶复活药	29
第八章	胆碱受体阻断药 (I) ——M 胆碱受体阻断药	33
第九章	胆碱受体阻断药 (II) ——N 胆碱受体阻断药	37
第十章	肾上腺素受体激动药	39
第十一章	肾上腺素受体阻断药	48
第十二章	中枢神经系统药理学概论	56
第十三章	全身麻醉药	58
第十四章	局部麻醉药	62
第十五章	镇静催眠药	67
第十六章	抗癫痫药和抗惊厥药	74
第十七章	治疗中枢神经系统退行性疾病药	78
第十八章	抗精神失常药	82
第十九章	镇痛药	91
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	106
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	115
第二十五章	抗高血压药	122
第二十六章	治疗心力衰竭的药物	128
第二十七章	调血脂药与抗动脉粥样硬化药	134
第二十八章	抗心绞痛药	138
第二十九章	作用于血液及造血器官的药物	144
第三十章	影响自体活性物质的药物	151
第三十一章	作用于呼吸系统的药物	162
第三十二章	作用于消化系统药物	167

第三十三章	子宫平滑肌兴奋药和抑制药	172
第三十四章	性激素类药及避孕药	176
第三十五章	肾上腺皮质激素类药	179
第三十六章	甲状腺激素及抗甲状腺药	186
第三十七章	胰岛素及其他降血糖药	191
第三十八章	抗菌药物概论	197
第三十九章	β -内酰胺类抗生素	201
第四十章	大环内酯类、林可霉素类及多肽类抗生素	210
第四十一章	氨基糖苷类抗生素	215
第四十二章	四环素类及氯霉素类	220
第四十三章	人工合成抗菌药	225
第四十四章	抗病毒药和抗真菌药	232
第四十五章	抗结核病药及抗麻风病药	238
第四十六章	抗寄生虫药	244
第四十七章	抗恶性肿瘤药物	249
第四十八章	影响免疫功能的药物	256

第一章 药理学总论——绪言

考前必会 核心考点纵览

药物	指可以改变或查明机体的生理功能及病理状态，用以预防、诊断和治疗疾病的物质
药理学	研究药物与机体（含病原体）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）
药理学任务	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为其他生命科学的研究探索提供重要的科学依据和研究方法
新药	化学结构、药品组分或药理作用不同于现有药品的药物。包括：我国未生产过的药品；已上市药品改变剂型、改变给药途径、增加新适应证或制成新的复方剂型
临床前研究	由药物化学和药理学两部分内容组成，前者包括药物制备工艺路线、理化性质及质量控制标准等，后者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

临床研究分期

分期	内容	受试者	例数与要求
I	初步的临床药理学及人体安全性评价试验	健康志愿者	20 ~ 30
II	随机盲法对照试验	病人	≥100
III	扩大的多中心临床试验	病人	≥300 例
IV	新药上市后监测	病人	>2000

考前必做 典型考题突破

一、名词解释

1. 药理学
2. 药物
3. 毒物
4. 药效学
5. 药动力

二、判断题

1. 药物与毒物是相对的，药物用量过大会

使人中毒，某些毒物用量恰当则可以治病。
2. 药理学是联系基础医学与临床医学的桥梁学科，也是联系药学与医学的桥梁学科。

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. 药效学主要研究_____。

3. 药动学主要研究_____。
4. 新药研制过程大致可分为_____、_____、_____三步。

四、选择题

【A 型题】

1. 新药的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
 - E. 合理应用药物
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
 - E. 药物作用强度随剂量、时间变化的消除规律

【X 型题】

1. 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
 - E. 药物的生物转化

五、问答题

1. 药理学的学科任务是什么?

2. 药物是指能够对生物机体某种生理或生化过程产生影响,可用于预防、治疗、诊断疾病或计划生育的化学物质。

3. 毒物是指能够损害人类健康的化学物质。药物在用量过大时都会产生毒性。药物与毒物之间并无绝对界限。

4. 主要研究药物对机体的作用规律及其原理。

5. 主要研究机体对药物的作用及其作用规律。

二、判断题

1. ☒ 2. ☐

三、填空题

1. 药物 机体 (包括病原体) 药效学 药动学
2. 药物对机体的作用规律及其原理
3. 机体对药物的作用及其作用规律
4. 临床前研究 临床研究 售后调研

四、选择题

【A 型题】

1. B 2. D

【X 型题】

1. CD

五、问答题

1. 药理学的学科任务有以下几方面:
 - (1) 阐明药物作用的基本规律及作用机制。
 - (2) 研究药物可能的临床用途。
 - (3) 为临床合理用药提供基本理论。
 - (4) 寻找及开发新药,发现老药新用途。
 - (5) 为探索细胞生理生化及病理过程提供实验资料。

参考答案

一、名词解释

1. 药理学是研究药物与机体 (包括病原体) 之间相互作用规律的一门科学,它包括药物效应动力学和药物代谢动力学两方面。

第二章 药物代谢动力学

考前必会 核心考点纵览

一、药物分子的跨膜转运

(一) 药物通过细胞膜的方式

滤过	水溶性扩散
简单扩散	脂溶性扩散，绝大多数药物按此种方式通过生物膜
载体转运	特点是对转运物质有选择性（specificity），饱和性（saturation）和竞争性。方式：主动转运（active transport）和易化扩散（facilitated diffusion）

(二) 影响药物通透细胞膜的因素

- 1. 药物解离度、脂溶度、体液 pH。
- 2. 膜表面积、厚度、浓度差：药物跨膜转运速度符合 Fick 定律：通透量（分子数/分钟）= $(C_1 - C_2) \times [\text{面积} \times \text{通透系数} / \text{厚度}]$ 。
- 3. 血流量（影响浓度差）。
- 4. 细胞转运蛋白的量和功能：营养状况、蛋白质摄入量、基因多态性。

二、药物的体内过程

(一) 吸收

口服	大多数药物在胃肠道内是以简单扩散方式被吸收的
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，或由胆汁排泄的量大，则使进入全身血循环内的有效药物量明显减少，这种作用称为首过消除
吸入	气体和挥发性药物（全麻药）直接进入肺泡，吸收迅速（异氟烷、恩氟烷）
局部给药	皮肤、黏膜（眼、鼻、阴道）吸收。脂溶性药物可通过皮肤/黏膜进入血液。例如硝苯地平贴皮剂、硝酸甘油软膏
舌下给药	吸收快；避开首过消除，如异丙肾上腺素、硝酸甘油、甲基睾丸素
注射给药	简单扩散和滤过，吸收快而全，毛细血管壁孔径 $40\text{\AA}$ ，大多水溶性药可滤过

(二) 分布

- 1. 药物吸收后从血液循环到达机体各个部位和组织的过程称为分布（distribution）。
- 2. 体液的 pH 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 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。清蛋白（albumin）—弱酸性药物； α_1 -酸性糖蛋白（ α_1 -acid glycoprotein）—弱碱性药物；脂蛋白（lipoprotein）—脂溶性强的药物。

（三）代谢

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。但肝脏是最主要的药物代谢器官
药物代谢步骤	大多数药物代谢发生在吸收进入血液后肾脏排泄之前，也有少数药物代谢发生在肠腔和肠壁细胞内。药物代谢通常涉及 I 相（氧化、还原、水解引入或脱去基团（-OH、-CH ₃ 、-NH ₂ 、-SH））和 II 相（内源性葡萄糖醛酸、硫酸、醋酸、甘氨酸等与药物或 I 期反应的代谢物结合）反应
细胞色素 P ₄₅₀ 单氧化酶系（CYP ₄₅₀ ，简称 CYP）	为一类亚铁血红素-硫醇盐蛋白（heme-thiolate proteins）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
药酶诱导	苯巴比妥、利福平，环境污染物等。光面肌浆网增生，引起自身耐受性或交叉耐受性
药酶抑制	西咪替丁、普罗地芬等竞争酶的代谢途径

（四）排泄

1. 肾脏排泄

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
肾小管重吸收	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。而尿液碱性增高时，酸性药物解离程度随之增高，重吸收减少，碱性药物相反
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，以避免蓄积作用。不以肾脏排泄作为主要消除途径的药物则无须减量

2. 消化道排泄 强心苷（cardiac glycoside）中毒后，口服考来烯胺（cholestyramine）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 药物也可经汗液、唾液和泪液排泄，但量很少，不甚重要。

三、房室模型

房室模型的定义：以简化的数学模式图（房室空间）来分析药物在体内的动态变化（分布与消除）。

一室模型	假设条件：① 将机体视“匀一元”；② 均匀分布于血液及组织
二室模型	假设条件：① 中央室（血液、血流丰富组织）；② 周边室（血流少、缓慢的组织）；③ 药物先分布于中央室，后分布于周边室；④ 药物从中央室消除

四、药物消除动力学

	一级动力学	零级动力学
定义	单位时间内转运或消除按恒比消除	单位时间内转运或消除按恒量消除

续表

	一级动力学	零级动力学
转运速率与血药浓度的关系	转运速率与浓度 C 成正比	转运速率与浓度无关
$t_{1/2}$ 与血药浓度基本公式	$t_{1/2}$ 恒定, 不受给药途径与浓度影响 $dC/dt = -kC$ $t_{1/2} = 0.693/K = 0.693Vd/Cl$	$t_{1/2}$ 受血药浓度影响, 血药浓度高 $t_{1/2}$ 延长 $dC/dt = -k_0$ $t_{1/2} = C_0/2k_0$
C - t 作图	指数曲线	直线
出现情况	大多数药物的消除方式, 在药量较小, 血药浓度较低时	少数药物的消除方式, 在药量较大, 血药浓度较高时

五、体内药物的药量 - 时间关系

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
多次给药的稳态血浆浓度	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，约经 4 ~ 5 个半衰期可分别达到稳态浓度的 94% 和 97%。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（peak concentration, $C_{ss,max}$ ）与谷浓度（trough concentration, $C_{ss,min}$ ）之差

六、药物代谢动力学重要参数

消除半衰期	药物消除半衰期（half life, $t_{1/2}$ ）是血浆药物浓度下降一半所需要的时间。反映体内药物消除速度。按一级动力学消除的药物的 $t_{1/2}$ 计算： $t_{1/2} = \frac{0.693}{k_e}$ 。按零级动力学消除的药物的 $t_{1/2}$ 计算： $t_{1/2} = 0.5 \frac{C_0}{k_0}$
清除率（clearance, 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
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（apparent volume of distribution, V_d ）
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循环内药物的百分率称生物利用度（bioavailability）

七、药物剂量的设计和优化

维持量	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（maintenance dose）。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
-----	--

续表

负荷量	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（loading dose）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
-----	--

考前必做 典型考题突破

一、名词解释

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

二、判断题

- 1. 药物口服方便、安全、吸收较快、较完全是最佳的给药途径。
- 2. 药物经生物转化后，均失去药理活性。
- 3. 同一药物，剂量相同而剂型不同，所产生的血浆药物浓度也可以不同。
- 4. 有肝药酶诱导剂存在的情况下，使用药物应减少剂量。
- 5. 弱碱性药物在酸性体液中易于解离，解离型药物为极性，易于通过生物膜。
- 6. 碱化尿液可加速碱性药物排泄。
- 7. 为避免首关消除现象发生，常采用肌肉注射给药、直肠给药、舌下含化给药和口服给药等。
- 8. 药物的血浆半衰期是指血浆药物浓度下降一半所需要的时间。
- 9. 由于药物半衰期各有不同，因此每日给药3次的方法是不适用于所有药物的。
- 10. 休克病人采用静脉给药的目的主要是为

了缩短药物发挥疗效的潜伏期。

三、填空题

- 1. 药物的体内过程包括药物的_____、_____和_____。
- 2. 药物跨膜转运的方式有_____和_____。
- 3. 药物自给药部位进入血液循环的过程称药物的_____。静脉注射药物时，药物直接进入血循环，不需经过_____过程，作用_____而_____。
- 4. 影响药物吸收的因素有_____、_____、_____和_____。
- 5. 药物被动转运的特点是_____、_____和_____。药物主动转运的特点是_____、_____、_____和_____。
- 6. 影响药物分布的主要因素有_____、_____、_____和_____。
- 7. 药物生物转化的主要器官为_____。药物自体内排泄的途径有_____、_____、_____、_____等。
- 8. 药物的消除是_____和_____的总称。
- 9. 根据药物的疗效可把药物的体内过程分为_____、_____和_____3个时期。
- 10. 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_____。
- 11. 各种给药途径吸收速度，由快到慢的次序为_____、_____、_____、_____。

____、____、____等。

12. 功能不良时, 应禁用或慎用____或____的药物。

13. 药物必须能穿透____, 才具有中枢作用。

14. 药物与血浆蛋白结合后, 具有以下特点: ____、____、____和____。

四、选择题

【A型题】

1. 某药半衰期为 12h, 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
- E. 5

2. 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
- E. 以上都不对

3. 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
- E. 结合率高的药物排泄快

4. 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
- E. 静脉注射比口服长

5. 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
- E. 以上都不是

6. 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

E. 吸收的速度

【X型题】

1. 消除半衰期 $t_{1/2}$

- A. 按一级动力学消除药物, 经五个 $t_{1/2}$ 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, 经五个 $t_{1/2}$ 后, 体内 97% 药物被消除
- E. 血浆药物浓度降低一半所需时间

2. 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
- E. 利福平

3. 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
- E. 特异性高

4. 药物的体内过程包括

- A. 分布
- B. 吸收
- C. 生物转化
- D. 排泄
- E. 主动转运

5. 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
- E. 以上都不是

6. 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
- E. 乙醇

7. 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
- E. 具有竞争性抑制现象

8. 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
- E. 多数药物的 V_d 值大于血浆容积

五、问答题

试述体液 pH 如何影响弱酸性和弱碱性药物在体内的吸收、分布和排泄。

参考答案

一、名词解释

1. 口服药物在通过胃肠黏膜及肝时, 经代谢灭活后, 进入体循环的药量明显减少, 药效相应降低, 称为首关消除。

2. 血液中与蛋白结合的药物与总药量的比值, 称药物血浆蛋白结合率。亦可理解为常用量的药物与血浆蛋白结合的百分率。

3. 药物在体内的生物转化与排泄统称为药物的消除。

4. 药物随胆汁排入十二指肠, 由肠道吸收后经门静脉再次入肝, 这种循环称药物肝肠循环。

5. 血浆药物浓度下降一半所需要的时间, 称为药物血浆半衰期。

6. 经过首关消除后能吸收进入体循环的药物相对分量和速度, 称为生物利用度。

7. 单位时间内血中药物按恒定的数量进行消除, 称为零级消除动力学, 又称恒量消除。

8. 单位时间内血中药物浓度按恒定的比例进行消除, 称为一级消除动力学, 又称为恒比消除。

9. 根据药动学原理, 固定剂量, 固定给药间隔时间, 经过 5 个 $t_{1/2}$ 时间, 药物的消除速度与给药速度相等, 血药浓度在一定范围内波动, 此时即称为稳态血药浓度。

10. 可使肝药酶活性增强, 加速自身及另一些药物的代谢, 使药理作用明显减弱或药效时间缩短的药物, 称肝药酶诱导剂。

11. 可抑制肝药酶活性, 减慢药物代谢, 使其药理作用明显加强或药效时间延长的药物, 称肝药酶抑制剂。

二、判断题

1. × 2. × 3. √ 4. × 5. × 6. ×
7. × 8. √ 9. √ 10. √

三、填空题

1. 吸收 分布 生物转化 排泄
2. 被动转动 主动转动
3. 吸收 吸收 快 强
4. 药物自身的理化性质 药物剂型 给药途径 吸收环境 (体液 pH) 首关消除
5. 不消耗能量 不需要载体 无饱和性 无竞争抑制现象 耗能 需载体 有饱和性 有竞争抑制现象
6. 血浆蛋白结合率 体内特殊屏障 (血脑屏障、血眼屏障、血睾屏障等) 局部器官血流量 药物的理化特性 组织亲和力
7. 肝 肾 胆汁 乳汁 呼吸道 唾液腺和汗腺
8. 药物的代谢 排泄
9. 潜伏期 持续期 残留期
10. 一级动力学消除 (恒比消除) 零级动力学消除 (恒量消除)
11. 吸入 舌下含化或直肠给药 肌内注射 皮下注射 口服 皮肤和黏膜给药
12. 对肝有损害的药物 经肝代谢才有活性
13. 血脑屏障
14. 暂时失去药理活性 影响药物的分布 (不易分布到效应器官) 影响代谢与排泄

(不易被代谢和排泄)作用时间延长

四、选择题

【A型题】

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

【X型题】

1. ACE 2. ABCDE 3. ABC 4. ABCD
5. ABCD 6. ABCDE 7. ABCDE 8. ACE

五、问答题

(1) 体液 pH 的改变主要通过药物的解离、非解离分子比值的改变而影响弱酸性和弱碱性药物的吸收。弱碱性药物在碱性环境的小肠内解离度小, 主要以非解离型存在, 故在小肠吸收较多。同理: 弱酸性药物在酸性环境的胃内较易吸收, 但多数弱酸性药物仍以肠道吸收为主, 这是因为随着胃蠕动、排空、药物进入肠道, 肠黏

膜表面积较大和肠壁附近接近中性。

(2) 体液 pH 改变可影响药物在体内的分布。若提高血液 pH, 可使弱酸性药物在细胞外液增多; 使弱碱性药物向细胞内转移增多。利用这一原理, 当巴比妥类药物中毒时, 静脉滴注碳酸氢钠使血液和尿液碱化, 毒物不易进入细胞内, 尤其不易进入脑细胞, 同时又促使毒物自尿排泄, 起到解毒目的。

(3) 尿液 pH 改变决定药物排泄。弱酸性药物在碱性尿中解离多, 重吸收少, 排泄多; 反之, 在酸性尿中解离少, 重吸收多, 排泄少。同理, 弱碱性药物在酸性尿中重吸收少, 排泄多; 在碱性尿中, 重吸收多, 排泄少。