

规划教材图表式同步解读训练

药理学

复习考试指导

艾 静 主编



中国协和医科大学出版社

规划教材图表式同步解读

药理学复习考试指导

主 编 艾 静

编 者 (以姓氏笔画为序)

牛慧芳	新乡医学院
艾 静	哈尔滨医科大学
石 卓	吉林大学基础医学院
朱 蕾	北京协和医学院基础医学院
刘 静	昆明理工大学医学院
孙丽华	哈尔滨医科大学
孙 超	齐齐哈尔医学院
李 芹	天津医科大学
李铁军	上海第二军医大学药学院
杨 俭	南京医科大学
张 妍	哈尔滨医科大学
张岫美	山东大学医学院
崔红霞	齐齐哈尔医学院

中国协和医科大学出版社

图书在版编目 (CIP) 数据

药理学复习考试指导 / 艾静主编. —北京: 中国协和医科大学出版社, 2016. 1
(规划教材图表式同步解读训练)

ISBN 978-7-5679-0344-9

I. ①药… II. ①艾… 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 (2015) 第 107574 号

规划教材图表式同步解读训练
药理学复习考试指导

主 编: 艾 静
责任编辑: 吴桂梅 孙阳鹏

出版发行: 中国协和医科大学出版社
(北京东单三条九号 邮编 100730 电话 65260378)

网 址: www.pumcp.com
经 销: 新华书店总店北京发行所
印 刷: 北京佳艺恒彩印刷有限公司

开 本: 787×1092 1/16 开
印 张: 30.5
字 数: 630 千字
版 次: 2016 年 6 月第 2 版 2016 年 6 月第 1 次印刷
印 数: 1—3000
定 价: 64.00 元

ISBN 978-7-5679-0344-9

(凡购本书, 如有缺页、倒页、脱页及其他质量问题, 由本社发行部调换)

前 言

《药理学》是我国高等医学院校学生必修的一门基础课，是联系基础与临床的桥梁课程。学习和掌握本课程的基本理论知识可以为其他医学课程的学习奠定基础。《药理学复习考试指导》是在第1版的基础上，依据人民卫生出版社出版的“十二五”规划教材《药理学》第8版的内容修订编写的。本书以图表形式将药理学内容进行了比较归纳，以简洁、清晰、直观的方式诠释教材内容，这种编写方式既便于学生理解和记忆药理学知识，又为启迪学生分析归纳和解决问题的能力提供了方法和思路，全书共48章，每章分“学习要求”“学习导图”“名词解释”“知识图解”“经典试题和参考答案”。

本书主要供基础、临床、预防、口腔等医学类专业学生学习使用，也可供研究生入学考试、医师执业资格考试及有关专业的师生自学、复习或教学参考用。

本书的编者都是长年工作在教学科研第一线的中青年骨干教师，理论水平扎实，经验丰富，希望能对读者有所帮助。虽然编者几经修改，反复审校，但难免存在错漏之处，恳请广大读者批评指正。

艾 静

2015年11月

目 录

第一章 药理学总论——绪言	1
第二章 药物代谢动力学	5
第三章 药物效应动力学	16
第四章 影响药物效应的因素	33
第五章 传出神经药理学概论	41
第六章 胆碱受体激动药	51
第七章 抗胆碱酯酶药和胆碱酯酶复活药	60
第八章 胆碱受体阻断药（I）——M 胆碱受体阻断药	70
第九章 胆碱受体阻断药（II）——N 胆碱受体阻断药	80
第十章 肾上腺素受体激动药	87
第十一章 肾上腺素受体阻断药	98
第十二章 中枢神经药理学概论	107
第十三章 全身麻醉药	117
第十四章 局部麻醉药	125
第十五章 镇静催眠药	133
第十六章 抗癫痫药和抗惊厥药	140
第十七章 治疗中枢神经系统退行性疾病药	147
第十八章 抗精神失常药	156
第十九章 镇痛药	169
第二十章 解热镇痛抗炎药	181
第二十一章 离子通道概论及钙通道阻滞药	191
第二十二章 抗心律失常药	202
第二十三章 肾素-血管紧张素系统药理	212
第二十四章 利尿药	219
第二十五章 抗高血压药	230
第二十六章 治疗心力衰竭的药物	244

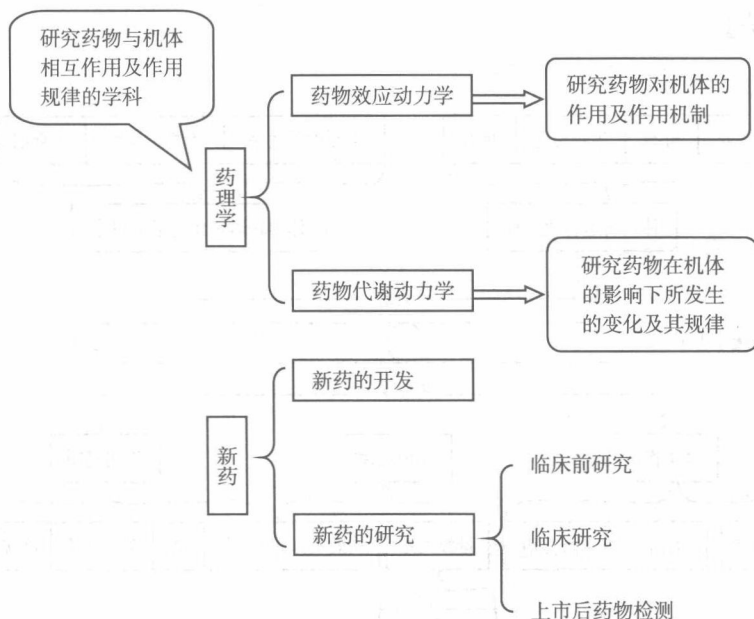
第二十七章 调血脂药与抗动脉粥样硬化药·····	258
第二十八章 抗心绞痛药·····	271
第二十九章 作用于血液和造血器官的药物·····	283
第三十章 影响自体活性物质的药物·····	300
第三十一章 作用于呼吸系统的药物·····	315
第三十二章 消化系统药物·····	326
第三十三章 子宫平滑肌兴奋药和抑制药·····	335
第三十四章 性激素类药及避孕药·····	342
第三十五章 肾上腺皮质激素类药物·····	352
第三十六章 甲状腺激素及抗甲状腺药·····	365
第三十七章 胰岛素及其他降血糖药物·····	373
第三十八章 抗菌药物概论·····	383
第三十九章 β -内酰胺类抗生素·····	391
第四十章 大环内酯类、林可霉素类及多肽类抗生素·····	402
第四十一章 氨基糖苷类抗生素·····	409
第四十二章 四环素类及氯霉素类·····	415
第四十三章 人工合成抗菌药·····	422
第四十四章 抗病毒药和抗真菌药·····	432
第四十五章 抗结核病药及抗麻风病药·····	441
第四十六章 抗寄生虫病药·····	451
第四十七章 抗恶性肿瘤药·····	460
第四十八章 影响免疫功能的药物·····	473

第一章 药理学总论——绪言

学习要求

1. 重点掌握药理学、药物效应动力学和药物代谢动力学的概念。
2. 熟悉药理学的性质与任务。
3. 了解药理学的发展史、新药的研究与开发。

学习导图



【名词解释】

名 词	英 文 名	定义或概念
药物	drug	指可以改变或查明生理功能及病理状态，可用以预防、诊断和治疗疾病的物质
药理学	pharmacology	是研究药物与机体（含病原体）相互作用及作用规律的学科，为临床合理用药防治疾病提供基本理论的基础科学，包括 <u>药物效应动力学</u> 和 <u>药物代谢动力学</u>
<u>药物效应动力学</u>	pharmacodynamics	<u>研究药物对机体的作用。</u> 在整体、系统、器官、细胞及分子水平上阐明药物的作用及其作用机制，对指导临床合理选用药物、合理理解并尽可能减少药物毒副作用提供基础理论依据
<u>药物代谢动力学</u>	pharmacokinetics	<u>研究药物在机体的影响下所发生的变化及其规律。</u> 包括药物在体内的空间变化，如吸收、分布、代谢和排泄过程，以及药物在体内的时间变化

【知识图解】

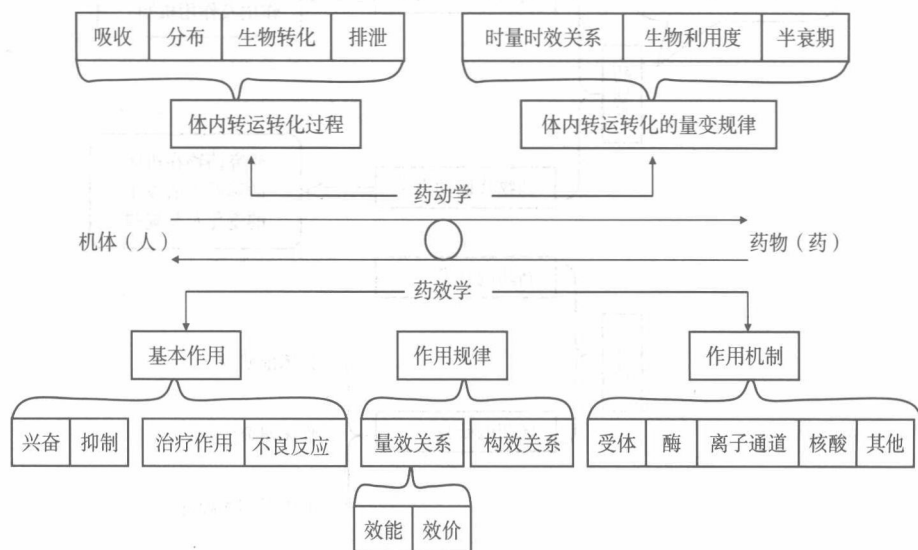


图 1-1 药动学和药效学的基本内容

经典试题

一、填空题

1. 药理学是研究药物与① 机体 包括② _____ 间相互作用的③ _____ 的科学。
2. 药物一般是指可以改变或查明机体的① _____ 及② _____, 可用于③ _____、④ _____、⑤ _____ 疾病的物质。

二、选择题

【A型题】

- D. 1. 药物是
- A. 一种化学物质
- B. 能影响机体功能的物质
- C. 能干扰细胞代谢活动的化学物质
- D. 用以预防、诊断或治疗疾病的物质
- E. 有营养、保健作用的物质

- E. 2. 药理学是研究
- A. 药物效应动力学
- B. 与药物有关的生理学
- C. 药物代谢动力学
- D. 药物的化学结构
- E. 药物与机体相互作用的规律与原理

- C. 3. 新药进行临床试验必须提供
- A. 系统药理研究数据
- B. 新药的作用谱
- C. 临床前研究资料
- D. 半数致死量 (LD_{50})
- E. 急、慢性毒理研究数据

【B型题】

- A. 《神农本草经》
- B. 《神农本草经集注》
- C. 《新修本草》

D. 《本草纲目》

E. 《本草纲目拾遗》

1. 世界上第一部药典是
2. 我国最早的药物专著是
- D. 3. 明代杰出医药学家李时珍的巨著是

【C型题】

- A. 药物对机体的作用及其原理
- B. 机体对药物的影响及其规律
- C. 二者均是
- D. 二者均不是

- A B C. 1. 药理学是研究
- B A. 2. 药物代谢动力学是研究
- A B. 3. 药物效应动力学是研究

【X型题】

- A B C D E. 1. 关于药理学的概念, 叙述正确的是
- A. 医学基础科学
- B. 为防病治病提供理论基础
- C. 研究药物与机体相互作用的规律
- D. 研究药物与机体相互作用的原理
- E. 为临床合理用药提供基本理论
2. 新药的研究过程有
- A. 临床前研究
- B. 毒性研究
- C. 临床研究

- D. 疗效观察
E. 集合调研
3. 药理学的学科任务是
- A. 阐明药物的作用及机制，为合理用药提供理论依据
- B. 开发研究新药
C. 发现药物的新用途
D. 整理和发掘祖国医药遗产
E. 为其他生命科学提供重要科学依据和研究方法

参 考 答 案

一、填空题

1. ①机体 ②病原体 ③规律
2. ①生理功能 ②病理状态 ③预防 ④诊断 ⑤治疗

二、选择题

【A型题】

1. D 2. E 3. C

【B型题】

1. C 2. A 3. D

【C型题】

1. C 2. B 3. A

【X型题】

1. ABCDE 2. ACE 3. ABCDE

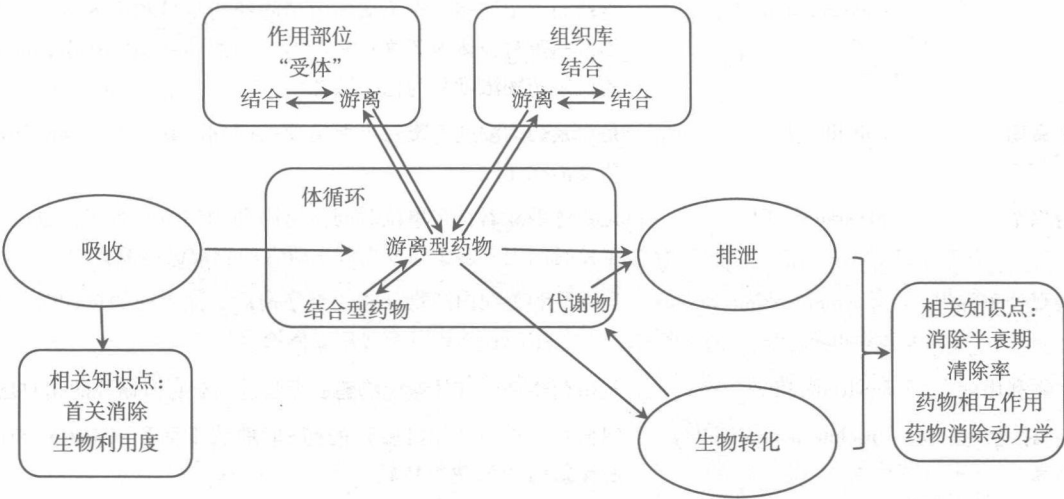
(艾 静)

第二章 药物代谢动力学

学习要求

- 1. 掌握首关消除、肠肝循环的概念。
- 2. 掌握药物代谢动力学重要参数半衰期、清除率、表观分布容积、生物利用度的概念及药理学意义。
- 3. 掌握药物一级消除动力学与零级消除动力学的特性。
- 4. 熟悉药物在体内所遇到的特殊屏障。
- 5. 熟悉药物相互作用规律。
- 6. 了解药物剂量的设计和优化。

学习导图



【名词解释】

名 词	英 文 名	定义或概念
离子障	ion trapping	离子状态药物极性高, 不易通过细胞膜的脂质层的现象
吸收	absorption	药物由用药部位进入血液循环的过程
pK_a 值		是弱酸性物质或弱碱性物质 50% 解离时溶液的 pH 值
首关消除	first pass elimination	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, 则使进入全身血循环内的有效药物量明显减少
分布	distribution	药物吸收后从血循环到达机体各个器官和组织的过程
肠肝循环	enterohepatic cycle	部分药物经肝脏转化形成极性较强的水溶性代谢产物被分泌到胆汁内, 经由胆道及胆总管进入肠腔, 然后随粪便排泄出去, 经胆汁排入肠腔的药物部分可再经小肠上皮细胞吸收经肝脏进入血液循环, 这种肝脏、胆汁、小肠间的循环称肠肝循环
一级消除动力学	first-order elimination kinetics	是体内药物按 <u>恒定比例消除</u> , 也就是单位时间内消除的药物量与血浆药物浓度呈正比
零级消除动力学	zero-order elimination kinetics	是药物在体内以 <u>恒定的速率</u> 消除, 即不论血浆药物浓度高低, 单位时间内消除的药物量不变
稳态浓度	steady-state concentration, C_{ss}	按照一级动力学规律消除的药物, 其体内药物总量随着不断给药而逐步增多, 直至从体内消除的药物量和进入体内的药物量相等时, 体内药物总量不再增加而达到稳定状态, 此时的血浆药物浓度称为稳态浓度
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。其长短可反映体内药物消除速度
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体积血浆中所含药物被机体清除
表观分布容积	apparent volume of distribution, V_d	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
生物利用度	bioavailability	是指药物经血管外途径给药后吸收进入全身血循环的相对量
绝对生物利用度	absolute bioavailability	以血管外给药(如口服)的药-时曲线下面积(AUC)和静脉注射的 AUC 进行比较
相对生物利用度	comparative bioavailability	对同一血管外给药途径的某一种药物制剂(如不同剂型、不同药厂生产的相同剂型、同一药厂生产的同一品种的不同批号等)的 AUC 与相同的标准制剂进行比较

续 表

名 词	英 文 名	定义或概念
药学等同	chemical equivalence	如果药品含有同一有效成分，而且剂量、剂型和给药途径相同，则他们在药学方面是等同的
生物等效	bioequivalence	两个药学等同的药品，若它们所含的有效成分的生物利用度无显著差别，则称为生物等效

【知识图解】

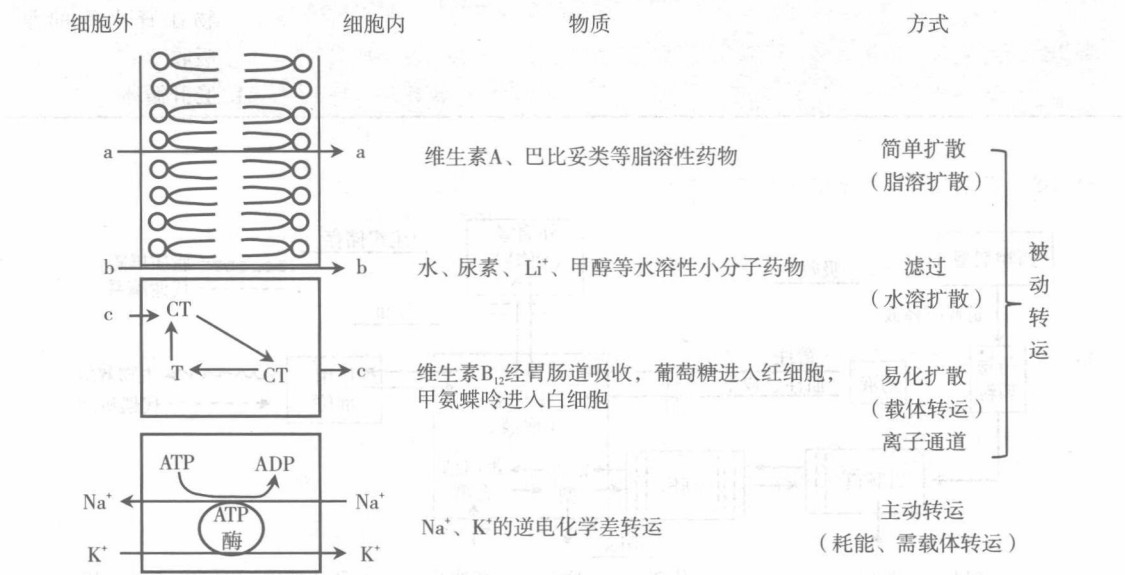


图 2-1 药物转运方式模式图

表 2-1 药物的体内过程

	吸 收	分 布	生物转化	排泄
定义	药物从用药部位进入血液循环的过程	药物经血液循环到达各组织器官的过程	药物在体内发生的生物转化，又称药物代谢	药物从体内排至体外的过程
方式	1. 口服（消化道吸收） 2. 吸入（肺吸收） 3. 局部用药（皮肤、黏膜） 4. 舌下给药 5. 注射给药（静脉、肌内、皮下）		I 相反应：氧化、还原、水解反应 II 相反应：结合反应	主要经尿排泄 其次经粪排泄 其他途径，如汗液、唾液、泪液、乳汁、头发、皮肤，量较少

续 表

	吸收	分 布	生物转化	排泄
影响 因素	1. 药物理化性质 2. 制剂类型 3. 吸收环境	1. <u>血浆蛋白结合率</u> 2. <u>器官血流量</u> 3. <u>组织细胞结合</u> 4. <u>体液 pH 值和药物解离度</u> 5. <u>体内屏障（血脑、胎盘、血眼屏障）</u>	1. 肝药酶 2. 药物影响 (1) 药酶诱导剂 (苯巴比妥) 等 (2) 药酶抑制剂 (氯霉素) 等	1. 肾为主要排泄器官，肾功能受损药物易蓄积 2. 经同一机制在肾小管分泌的药物可发生竞争性抑制 3. 尿液的 pH 值可影响弱酸或弱碱性药物在肾小管的重吸收 4. 肠肝循环

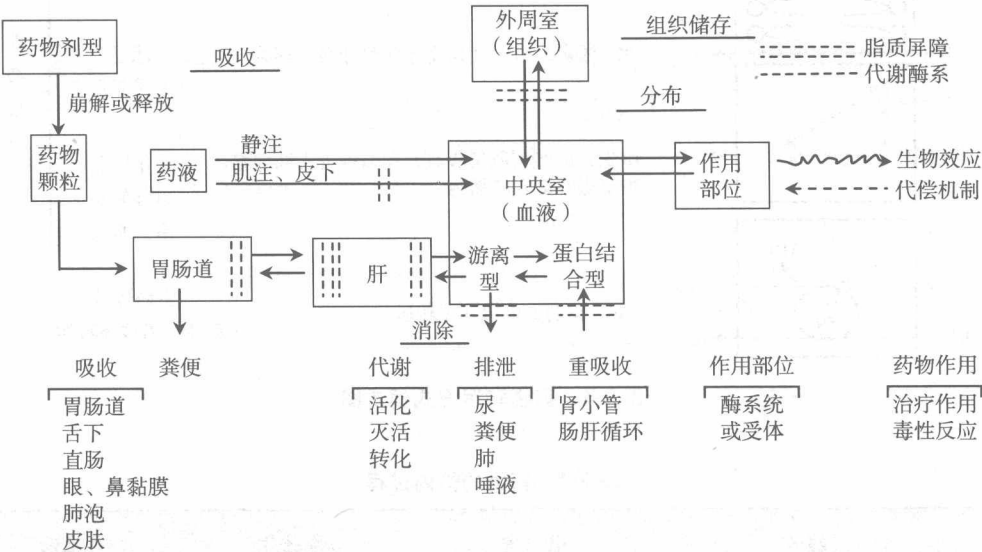


图 2-2 药物在体内的转运与转化情况

表 2-2 药酶诱导剂和药酶抑制剂对药物代谢的影响

	对药酶活性的影响	使药物在体内停留时间	血药浓度	药理活性	毒性
药酶诱导剂	活性增强促进药物转化	缩短	下降	减弱	减小
药酶抑制剂	活性降低减慢药物转化	延长	上升	增强	增大

表 2-3 常见的药酶诱导剂和药酶抑制剂及其所影响的药物

药酶诱导剂或抑制剂	受影响的药物
1. 诱导剂	
巴比妥类	巴比妥类、苯妥英钠、卡马西平、氯丙嗪、氯霉素、可的松、香豆素类、洋地黄毒苷、地高辛、阿霉素、口服甾体避孕药、保泰松、奎宁、睾酮、水杨酸类、布洛芬、普萘洛尔、奎尼丁、利多卡因、维拉帕米、硝酸甘油、维生素 K、西咪替丁、螺内酯、糖皮质激素、抗组胺药、异烟肼、多西环素等
苯妥英钠	糖皮质激素、地高辛、茶碱、维生素 D、口服避孕药、保泰松、卡马西平、香豆素类、呋替啶、利多卡因等
保泰松	氨基比林、可的松、地高辛等
利福平	糖皮质激素、香豆素类、口服避孕药、地高辛、普萘洛尔、苯妥英钠、甲磺丁脲、可乐定、奎尼丁等
灰黄霉素	华法林
卡马西平	丙戊酸钠、乙琥胺、苯妥英钠、保泰松、糖皮质激素、口服避孕药、多西环素、洋地黄毒苷等
螺内酯	香豆素类、巴比妥类、地西洋
2. 抑制剂	
氯霉素、异烟肼	苯妥英钠、巴比妥类、卡马西平、氯丙嗪、香豆素类、口服避孕药、甲磺丁脲等
西咪替丁	苯二氮草类、香豆素类、苯妥英钠、卡马西平、普萘洛尔、三环类抗抑郁药、洋地黄毒苷、利多卡因、维拉帕米、口服避孕药等
保泰松	苯妥英钠、甲磺丁脲
环丙沙星	香豆素类、茶碱
红霉素	卡马西平、地高辛、口服避孕药、环孢素 A

表 2-4 尿液酸碱度对药物排泄的影响

	弱酸性药物			弱碱性药物		
	解离度	重吸收	排泄	解离度	重吸收	排泄
碱性尿液	↑	↓	↑	↓	↑	↓
酸性尿液	↓	↑	↓	↑	↓	↑

表 2-5 药物一级消除动力学与零级消除动力学之比较

	一级消除动力学	零级消除动力学
别名	等比消除	等量消除
概念	血浆中药物消除的速率与血药浓度成正比的消除方式	血浆中药物在单位时间内以恒定的量消除
数学表达式	$\frac{dC}{dt} = -K_e C$	$\frac{dC}{dT} = -K_0$
血浆半衰期	为定值, 与血药浓度无关	不固定, 与血药浓度有关
作用	是药物的主要消除方式	当药物总量超过机体最大消除能力时, 机体采用零级消除动力学
药-时曲线 半对数坐标图 坐标图	呈直线 (线性动力学) 呈曲线	呈曲线 (非线性动力学) 呈直线, 其斜率为 K
其他特点	每隔 1 个 $t_{1/2}$ 给药一次, 经 5 个 $t_{1/2}$ 血药浓度达稳态	机体以最大能力消除药物

经典试题

一、填空题

1. 药物的体内过程包括① 吸收、② 分布、③ 代谢 和④ 排泄。
2. 弱酸性药物在 pH 值高的碱性环境中解离① 快，② 难 透过细胞膜；降低血液的 pH 值，则可使进入细胞的药物③ 增加。
3. 口服药物吸收的主要部位是① 小肠，其特点是 pH 值② 适中，吸收的面积③ 大，吸收的作用时间④ 长。
4. 影响药物在体内分布的因素有① 血浆蛋白、② 器官血流、③ 组织亲和力、④ 屏障作用 和⑤ 药物理化性质。
5. 药物与血浆蛋白的结合影响药物在体内的① 分布、② 转运率、③ 作用强度 ④ 消除速率。
6. 药物代谢的主要器官是① 肝脏；药物排泄的主要器官是② 肾脏。
7. 药物通过生物转化，绝大多数成为① 水 性高的② 水 溶性产物，③ 易 从肾排泄。
8. 消除速率常数的缩写是① K；半衰期的缩写是② $t_{1/2}$ ，表观分布容积的缩写是③ V_d，稳态血药浓度的缩写是④ C_{ss}。

二、选择题

【A型题】

1. 大多数药物跨膜转运的方式是

- A. 滤过
B. 易化扩散
C. 简单扩散
D. 胞饮
E. 膜泵转运

2. 阿司匹林的 pK_a 值为 3.5, 它在 pH 值为 7.5 的肠液中可被吸收

- A. 1%
B. 0.1%
C. 0.01%
D. 10%
E. 99%

3. 在酸性尿液中弱碱性药物

- A. 解离少, 再吸收多, 排泄慢
B. 解离多, 再吸收多, 排泄快
C. 解离多, 再吸收多, 排泄慢
D. 解离多, 再吸收少, 排泄快
E. 解离少, 再吸收少, 排泄慢

4. 促进药物生物转化的主要酶系统是

- A. 辅酶 II
B. 单胺氧化酶
C. 水解酶
D. 葡萄糖醛酸转移酶
E. 细胞色素 P450 酶系统

5. 使肝药酶活性增加的药物是

- A. 氯霉素
B. 利福平
C. 异烟肼

D. 奎尼丁

E. 西咪替丁

6. 某药与肝药酶抑制剂合用可使其效应

- A. 减弱
B. 增强
C. 不变
D. 消失
E. 无减弱, 后消失

7. 临床上可用丙磺舒增加青霉素的疗效, 其原因是

- A. 有协同杀菌作用
B. 延缓抗药性产生
C. 双重阻断细菌代谢
D. 抑制肝药酶的活性
E. 二者竞争肾小管的分泌通道

8. 药物在血浆中与血浆蛋白结合, 可使药物的

- A. 作用增强
B. 代谢加快
C. 排泄加快
D. 转运加快
E. 药理活性暂时不表现出来

9. 临床所用的药物治疗量是指

- A. 有效量
B. 最小有效量
C. 半数有效量
D. 阈剂量
E. $t_{1/2}$ 和 LD_{50}

10. 多次给药方案中, 缩短给药间隔可

- A. 提高生物利用度