

2011年版新大纲

执业
药师

国家执业药师资格考试指南

药学专业知识（一）

中国执业药师协会 组织编写



人民卫生出版社

2011年版新大纲 国家执业药师资格考试指南

药学专业知识（一）

中国执业药师协会 组织编写

人民卫生出版社

图书在版编目 (CIP) 数据

药学专业知 识 (一)/中国执业药师协会组织编写.

—北京:人民卫生出版社,2011.3

(2011年版新大纲国家执业药师资格考试指南)

ISBN 978-7-117-14124-6

I. ①药… II. ①中… III. ①药 物 学 - 药 剂 人 员 - 资 格 考 核 - 自 学 参 考 资 料 IV. ①R9

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2011)第 019267 号

门户网: www.pmph.com	出版物查询、网上书店
卫人网: www.ipmph.com	护士、医师、药师、中医师、卫生资格考试培训

版权所有,侵权必究!

本书本印次内封贴有防伪标。请注意识别。

药 学 专 业 知 识 (一)

组织编写:中国执业药师协会

主 编:娄建石

出版发行:人民卫生出版社(中继线 010-59780011)

地 址:北京市朝阳区潘家园南里 19 号

邮 编:100021

E-mail: pmph@pmph.com

购书热线:010-67605754 010-65264830

010-59787586 010-59787592

印 刷:北京市后沙峪印刷厂

经 销:新华书店

开 本:787×1092 1/16 印张:26

字 数:665 千字

版 次:2011 年 3 月第 1 版 2011 年 3 月第 1 版第 1 次印刷

标准书号:ISBN 978-7-117-14124-6/R·14125

定 价:55.00 元

打击盗版举报电话:010-59787491 E-mail: WQ@pmph.com

(凡属印装质量问题请与本社销售中心联系退换)

2011年版新大纲《国家执业药师资格考试指南》

出版说明

为指导参加国家执业药师资格考试的考生做好考前复习,根据2011年版《国家执业药师资格考试大纲》,中国执业药师协会组织全国专家编写了考前培训与复习的辅导教材——《国家执业药师资格考试指南》(以下简称《考试指南》)。《考试指南》包括国家执业药师资格考试7个科目,含中药学和药学两类,每个科目包括理论知识和习题精选两部分,各自成分册,共14本。

《考试指南》内容紧扣2011年版《考试大纲》,反映2011年版《考试大纲》的所有考点,有很强的指导性和实用性,能够帮助考生在有限的时间内学习和掌握2011年版《考试大纲》所要求的知识,并得到强化训练,循序渐进,顺利通过考试。

本套教材具有以下特点:

1. 紧扣2011年版《考试大纲》要求

理论知识和习题、模拟题,均依据2011年版《考试大纲》设计、编写,丝丝入扣,保证复习内容范围准确,符合新的《考试大纲》要求。

2. 把握重点

为使考生复习时尽可能把握重点,在本书编写过程中,在紧扣2011年版《考试大纲》要求的基础上,编者分析、参考了近年国家执业药师资格考试的试题,根据考点考试频率和分值分布情况确定理论知识的内容详略和精选习题,并参照近年考题精选“经典考题”而编入理论知识的相关知识点中。在各章理论知识的末尾,编者还依据《考试大纲》对本章的复习重点和方法进行小结,同时分析介绍了近年已考过的哪些知识点,并对考过多次的知识点加以提示,以帮助考生准确、快速掌握复习重点。

考生通过本《考试指南》的认真复习和练习,将会收到明显的效果。

3. 利于实战训练

每个《习题精选》分册按上述编写要求精选有1700~2000道习题,其中包括各章练习题共计1000~1300道(个别分册适当增加了题量),模拟试卷5套(700道题)。模拟题的题型、题量、分数分布等均与历年国家执业药师资格考试试卷一致,以帮助考生进行实战训练。其中标星号(*)者为近年已考的执业药师考题,供考生练习时参考。

《国家执业药师资格考试指南》编写委员会和各分册编委为丛书的撰写、审定付出了大量的辛苦工作,在此一并致谢!

《国家执业药师资格考试指南》书目

中药学专业知识(一)
中药学专业知识(一)习题精选
中药学专业知识(二)
中药学专业知识(二)习题精选
中药学综合知识与技能
中药学综合知识与技能习题精选
药学专业知识(一)
药学专业知识(一)习题精选
药学专业知识(二)
药学专业知识(二)习题精选
药学综合知识与技能
药学综合知识与技能习题精选
药事管理与法规
药事管理与法规习题精选

中国执业药师协会

2011年2月

2011年版新大纲《国家执业药师资格考试指南》

解题说明

本书题型与国家执业药师资格考试一致,分为最佳选择题、配伍选择题、多项选择题三种,解题具体要求如下:

最佳选择题,即A型题,每题的备选答案中只有一个最佳答案。在执业药师资格考试时,每题1分。

配伍选择题,即B型题,备选项在前,试题在后。每组若干题,每组题均对应同一组备选答案,每题只有一个正确答案。每个备选答案可重复选用,也可不选用。在执业药师资格考试时,每题0.5分。

多选题,即X型题,每题的备选答案中有2个或2个以上正确答案。少选或多选均不得分。在执业药师资格考试时,每题1分。

其中标星号(*)的题为近几年已考的执业药师考题,供考生复习参考。

本书中各模拟题编排与执业药师资格考试试卷一致,每套140题,共计100分。各科目题型及分数分布情况如下:

各科目题型及分数分布

书 名		A 型题	B 型题	X 型题	合 计	
药学综合知识与技能		40 题,40 分	80 题,40 分	20 题,20 分	140 题,100 分	
药 学 专 业 知 识 (一)	药理学	24 题,24 分	48 题,24 分	12 题,12 分	84 题,60 分	140 题, 100 分
	药物分析	16 题,16 分	32 题,16 分	8 题,8 分	56 题,40 分	
药 学 专 业 知 识 (二)	药剂学	24 题,24 分	48 题,24 分	12 题,12 分	84 题,60 分	140 题, 100 分
	药物化学	16 题,16 分	32 题,16 分	8 题,8 分	56 题,40 分	
中药学综合知识与技能		40 题,40 分	80 题,40 分	20 题,20 分	140 题,100 分	
中 药 学 专 业 知 识 (一)	中药学	24 题,24 分	48 题,24 分	12 题,12 分	84 题,60 分	140 题, 100 分
	中药药剂学	16 题,16 分	32 题,16 分	8 题,8 分	56 题,40 分	
中 药 学 专 业 知 识 (二)	中药鉴定学	24 题,24 分	48 题,24 分	12 题,12 分	84 题,60 分	140 题, 100 分
	中药化学	16 题,16 分	32 题,16 分	8 题,8 分	56 题,40 分	
药事管理与法规		40 题,40 分	80 题,40 分	20 题,20 分	140 题,100 分	40 题, 100 分

编写说明

本书是针对国家执业药师资格考试而编写的应试指导系列丛书的分册之一,是在中国执业药师协会的组织下由全国数家高等医药院校共同参与编写。其内容紧扣《国家执业药师资格考试大纲》,能帮助和指导读者在有限的时间内轻松学习和掌握“考试大纲”所规定的考试内容。

本书根据 2011 年版《国家执业药师资格考试大纲》进行编写,药物分析部分参考了 2010 年版《中国药典》。概要和精练地列出了具体的学习内容,并在相应知识点后面插入“经典考题”、在每章末插入“复习重点及考点分析”。习题部分增加了部分 2009 年和 2010 年国家执业药师资格考试新试题。

为便于巩固学习内容,考生可以在学习的同时参考本书配套的《2011 年版新大纲国家执业药师资格考试指南——药专业知识(一)习题精选》,进行实际考题的练习。

在修订过程中,根据部分读者的意见对书中的错误和习题答案也进行了修改与核对。

本书除了可作为国家执业药师资格考试人员考前复习必备参考书外,也可作为全国医药院校广大在校学生的学习辅导读物。

由于编者水平有限,时间很紧,书中可能有不妥甚至错误、疏漏之处,希望读者在使用过程中不断提出宝贵意见,供我们今后修订时参考。

编者

2011 年 1 月

目 录

药理学部分	1
药物分析部分.....	215

药理学部分

主 编 娄建石

副主编 高卫真

编 者 (以姓氏笔画为序)

石 卓 曲极冰 刘艳霞 刘晓东
杨芳炬 何景华 陈 立 陈 霞
周黎明 孟 林 翁鸿博 高卫真
魏敏杰

目 录

第一章 总论.....	4	一、青霉素类	25
第一节 药物代谢动力学.....	4	二、头孢菌素类	28
一、药物的体内过程.....	4	三、其他 β -内酰胺类	30
二、药物代谢动力学参数及其 应用	8	第三节 大环内酯类、林可霉素类 及多肽类抗生素	31
第二节 药物效应动力学	10	一、大环内酯类	31
一、药物的基本作用	10	二、林可霉素类	33
二、药物作用的两重性	10	三、多肽类	34
三、药物的量效关系	12	第四节 氨基苷类抗生素及多黏 菌素	35
四、药物的作用机制	13	一、氨基苷类	35
第三节 影响药物作用的因素	15	二、多黏菌素	37
一、药物因素	15	第五节 四环素类及氯霉素类抗 生素	38
二、机体因素	16	一、四环素类	38
第二章 化学治疗药物	20	二、氯霉素类	38
第一节 抗微生物药物概论	20	第六节 人工合成抗菌药物	39
一、抗菌药物的常用术语	20	一、氟喹诺酮类	39
二、抗菌药物的主要作用机制	21	二、磺胺类药及甲氧苄啶	42
三、细菌的耐药性	22	第七节 抗真菌药	43
四、抗微生物药物的合理 应用	23	一、抗浅表真菌感染药	43
第二节 β -内酰胺类抗生素	25		

二、抗深部真菌感染药	44	二、抗惊厥药	100
第八节 抗病毒药	46	第四节 治疗中枢神经退行性	
一、抗人免疫缺陷病毒药	46	病变药	100
二、抗流感病毒药	47	一、抗帕金森病药	101
三、抗疱疹病毒药	48	二、抗老年痴呆症药	105
四、抗肝炎病毒药	48	第五节 抗精神失常药物	106
第九节 抗结核病与抗麻风病药	50	一、抗精神病药	107
一、抗结核病药	50	二、抗躁狂症药	112
二、抗麻风病药	53	三、抗抑郁症药	113
第十节 抗寄生虫病药物	54	第六节 镇痛药	117
一、抗疟药	54	一、阿片受体激动药	117
二、抗阿米巴病药与抗滴虫		二、阿片受体部分激动药和激动-	
病药	56	拮抗药	124
三、抗血吸虫病药	57	三、其他镇痛药	125
四、抗肠蠕虫病药	58	四、阿片受体拮抗剂	126
第十一节 抗恶性肿瘤药	59	第七节 解热镇痛抗炎药	126
一、抗恶性肿瘤药物的分类与作		一、非选择性环氧酶抑制药	128
用机制	60	二、选择性环氧酶-2 抑制药	131
二、干扰核酸生物合成的药物	61	三、抗痛风药	132
三、直接破坏 DNA 结构和功能		第四章 心血管系统药物	134
的药物	62	第一节 抗心律失常药	134
四、干扰 RNA 转录的药物	63	一、心律失常的电生理学基础	134
五、影响蛋白质合成与功能的		二、常用的抗心律失常药	137
药物	64	三、抗心律失常药物的选择	144
六、影响体内激素平衡的药物	65	第二节 抗心力衰竭药	145
第三章 神经系统药物	67	一、肾素-血管紧张素系统	
第一节 传出神经系统药物	67	抑制药	145
一、胆碱受体激动药	67	二、强心苷	146
二、胆碱酯酶抑制药及胆碱酯酶		三、利尿药	150
复活药	68	四、其他类药物	151
三、M 胆碱受体阻断药	71	第三节 抗高血压药物	152
四、N 胆碱受体阻断药	75	一、概述	152
五、肾上腺素受体激动药	76	二、常用抗高血压药物	153
六、肾上腺素受体阻断药	81	三、其他抗高血压药	157
第二节 镇静催眠药	86	四、抗高血压药的合理应用	160
一、苯二氮草类	86	第四节 抗心绞痛药	161
二、巴比妥类	90	一、硝酸酯类	162
三、其他镇静催眠药	92	二、 β 肾上腺素受体阻断药	164
第三节 抗癫痫药及抗惊厥药	93	三、钙通道阻滞药	165
一、抗癫痫药	93	四、其他抗心绞痛药	166

第五节 调血脂药和抗动脉粥样硬化药			
硬化药	167		
一、调血脂药	167		
二、其他抗动脉粥样硬化药	171		
第六节 利尿药和脱水药	174		
一、利尿药	174		
二、脱水药	180		
第五章 血液、呼吸、消化系统药物	182		
第一节 血液系统药	182		
一、抗凝血药	182		
二、促凝血药	183		
三、抗血小板药	184		
四、纤维蛋白溶解药	184		
五、抗贫血药	184		
六、造血细胞生长因子	185		
第二节 呼吸系统药	186		
一、平喘药	186		
二、镇咳药	187		
三、祛痰药	188		
第三节 消化系统药	188		
一、抗消化性溃疡药	188		
二、助消化药	190		
三、止吐药和促胃肠运动药	190		
四、泻药和止泻药	190		
第六章 内分泌系统药物	192		
第一节 肾上腺皮质激素类药	192		
第二节 甲状腺激素及抗甲状腺药	196		
一、甲状腺激素	196		
二、抗甲状腺药	197		
第三节 胰岛素及口服降血糖药	199		
一、胰岛素	199		
二、口服降血糖药	201		
第四节 性激素类药及影响生殖功能药	203		
一、子宫兴奋药	203		
二、性激素类药	204		
三、孕激素类药与抗孕激素类药	206		
四、避孕药	209		
五、治疗男性性功能障碍药	210		
第七章 其他类药物	211		
第一节 免疫调节药	211		
一、免疫抑制药	211		
二、免疫增强药	211		
第二节 组胺及组胺受体阻断药	213		

第一节 药物代谢动力学

药物代谢动力学简称药动学,是研究药物在体内变化规律的一门学科。主要研究内容为两部分:一是药物的体内过程,包括吸收、分布、代谢和排泄四个基本过程;二是药物在体内随时间变化的速率过程。

一、药物的体内过程

药物由给药部位进入机体产生药效,然后再由机体排出,其间经历吸收、分布、代谢和排泄四个基本过程,这个过程称为药物的体内过程。代谢和排泄都是药物在体内逐渐消失的过程,统称为消除;分布与消除又统称为处置;吸收、分布、排泄仅是药物发生空间位置上的迁移,统称为转运;若发生化学结构和性质上的变化称之为转化,其产物称为代谢物。药物在体内的存在方式有两种:不论是在血中还是在器官组织中药物都以游离型和结合型两种形式存在。在血浆中药物主要与血浆白蛋白结合,结合型药物常失去药理活性,只有游离型药物才有药理活性。

经典考题

A型题

药动学是研究

- A. 机体如何对药物进行处置
- B. 药物如何影响机体
- C. 药物在体内外发生动力学变化的原因和规律
- D. 合理用药的方案
- E. 药物对机体的作用

答案: A

解析: 药动学是研究机体对药物的处置,即药物在体内的吸收、分布、代谢及排泄过程的动态变化。上述诸过程也称药物的体内过程。

(一) 药物的转运方式

药物的转运方式有多种,最主要的是被动转运,其次是主动转运。

被动转运指药物由浓度高的一侧向浓度低的一侧进行的跨膜转运。包括简单扩散和滤过。转运的动力来自于膜两侧的浓度差,差值越大转运动力越大。因此又称之为顺浓度梯度转运或下山转运,大多数药物属于此种转运方式。其特点为:①不需要载体;②不消耗能量;③转运时无饱和现象;④不同药物同时转运时无竞争性抑制现象;⑤当膜两侧浓度达到平衡时转运即保持在动态稳定水平。

影响药物跨膜转运最主要的理化特性就是药物的溶解性和解离性。溶解性是指药物具有

的脂溶性和水溶性。由于膜是脂质双层结构,所以脂溶性强的药物容易跨膜转运,而水溶性强的药物不易跨膜转运。水溶性药物又分为两类:一类是极性分子,另一类是解离型分子。解离型是指水溶性药物在溶液中溶解后生成离子型分子,具有此种特性的药物多属于弱酸性和弱碱性药物,它们在溶液中仅部分地解离,其程度取决于所在溶液的 pH 值,常以 pK_a 表示其解离度。当药物解离 50% 时所在溶液的 pH 值即定为该药的解离度, pK_a 。各药都有其固定的 pK_a 值。改变溶液 pH 值可以明显地影响弱酸性或弱碱性药物的解离度,进而影响其跨膜转运。

经典考题

A 型题

1. 药物与血浆蛋白结合后,药物

- A. 作用增强 B. 代谢加快 C. 转运加快 D. 排泄加快 E. 暂时失去药理活性

答案: E

解析: 药物与血浆蛋白结合的生理特性之一就是使药物暂时失去生理活性。

2. 服用巴比妥类药物时,如果碱化尿液,则其在尿中

- A. 解离度增高,重吸收减少,排泄加快 B. 解离度增高,重吸收增多,排泄减慢
C. 解离度降低,重吸收减少,排泄加快 D. 解离度降低,重吸收增多,排泄减慢
E. 排泄速度不改变

答案: A

解析: 巴比妥类药物为弱酸,在体液 (pH 7.4) 中,有近 50% 或更多以分子型存在,能透过血脑屏障,到达中枢,因此具有活性。故碱化尿液,会增加药物的解离。服用时并用碳酸氢钠或乳酸钠碱化尿液,减少其在肾小管中的重吸收,加速药物排泄。

主动转运指药物不依赖于膜两侧浓度差的跨膜转运,可以从浓度低的一侧向浓度高的一侧转运,因此又称为逆浓度梯度转运或上山转运。此种转运必须依赖机体提供的转运系统方能进行,包括载体和能量。其特点为:①需要载体,载体对药物有特异选择性;②需要消耗能量;③受载体转运能力的限制,当载体转运能力达到最大时有饱和现象;④不同药物同时被同一载体转运时,有竞争性抑制现象发生;⑤当膜一侧的药物转运完毕后转运即停止。

经典考题

B 型题

[1~3]

- A. 皮下注射 B. 皮内注射 C. 静脉注射 D. 肌内注射 E. 吸入给药

1. 无吸收过程的给药途径是
2. 一般混悬型注射剂不可用的是
3. 易发生即刻毒性反应的给药途径是

答案: 1. C 2. C 3. C

解析: 静脉注射直接进入血管没有吸收过程,皮下注射、皮内注射及肌内注射有从结缔组织或肌肉组织向毛细血管或淋巴管渗透的过程。一般混悬型注射剂不宜用静脉注射,混悬型注射剂中的颗粒易堵塞血管,造成血管栓塞。吸入给药可自黏膜吸收。静脉注射无吸收过程,直接由静脉进入体循环,因此易发生即刻毒性反应。

(二) 药物的吸收及其影响因素

药物的吸收是药物由给药部位进入血液循环的过程。除静脉注射和静脉滴注给药外,其他给药途径都存在吸收过程。药物吸收后由肝门静脉进入肝脏,然后再进入体循环。有些药物在进入体循环之前首先在胃肠道、肠黏膜细胞和肝脏被灭活代谢一部分(主要是在肝脏),导致进入体循环的实际药量减少,这种现象称为首过消除。衡量药物吸收快慢、高低、多少的参数有达峰时间、达峰浓度、生物利用度等。这些参数可以间接反映药效的快慢、强弱。

(三) 药物的分布及其影响因素

药物的分布是药物吸收后随血液循环到各组织器官中的过程。药物的分布有明显的规律性。一是药物先向血流量相对多的组织器官分布,然后向血流量相对少的组织器官转移,这种现象称为再分布。机体中有些组织对药物的通透性具有特殊的屏障作用,如血脑屏障、胎盘屏障及血眼屏障等。血脑屏障是血液与脑组织、血液与脑脊液、脑脊液与脑组织三种隔膜的总称。

经典考题

X 型题

1. 影响药物分布的因素有

- A. 药物理化性质 B. 体液 pH C. 血脑屏障 D. 胎盘屏障 E. 血浆蛋白结合率

答案: ABCDE

解析: 药物的理化性质、体液 pH、血浆蛋白结合率和膜通透性是影响药物分布的主要因素,膜通透性主要以血脑屏障和胎盘屏障为主。

2. 与药物的消除速率有关的因素包括

- A. 药物的表观分布容积 B. 药物的半衰期 C. 药物的生物利用度
D. 药物与组织的亲和力 E. 药物透过血脑屏障的能力

答案: ADE

解析: 与血浆蛋白结合率高的药物体内消除慢;药物与组织的亲和力及透过血脑屏障的能力影响药物在体内的分布,进而影响药物的表观分布容积。药物消除的主要类型为一级动力学消除,其公式为 $dVC/dt = -kVC$, 式中 k 为比例常数, V 为表观分布容积, C 为药物浓度。由公式可见消除速率与表观分布容积有关,故而本题选 ADE。而生物利用度是评价制剂吸收程度的指标。

(四) 药物的生物转化

药物的生物转化是药物在体内发生化学结构改变的过程。体内能够使药物发生转化的器官主要是肝脏,其次是肠、肾、肺等组织。转化过程分为两个时相, I 相包括氧化、还原、水解,使药物分子结构中引入或暴露出极性基团,如产生羟基、羧基、巯基、氨基等; II 相为结合,是药物分子结构中的极性基团与体内的化学成分如葡萄糖醛酸、硫酸、甘氨酸、谷胱甘肽等经共价键结合,生成易溶于水且极性高的代谢物排出体外。药物经过转化后其药理活性发生改变。大多数药物失去活性(减弱或消失),称为灭活,少数药物可以被活化而出现药理活性。药物的转化必须在酶的催化下才能进行。这些催化酶分为两类,即专一性酶和非专一性酶。前者有胆碱酯酶、单胺氧化酶等,分别转化乙酰胆碱和单胺类药物等。非专一性酶主要指存在于肝细胞微粒体的混合功能氧化酶系统,简称肝药酶。该酶系统主要由细胞色素 P450、黄素蛋白类等组成。其中最关键的酶为细胞色素 P450。肝药酶的特性在于:①选择性低,它能催化多种药物;②变异性较大,常因遗传、年龄、营养状态、机体状态、疾病的影响而产生明显的个体差异;③酶活性易受外界因素影响而出现增强或减弱现象。能够增强酶活性的药物称为酶诱导

剂,而能够减弱酶活性的药物称为酶抑制剂。

经典考题

A 型题

下列哪个药物是肝药酶诱导剂

- A. 氯霉素 B. 对氨基水杨酸 C. 异烟肼 D. 地西泮 E. 苯巴比妥

答案: E

解析: 肝药酶可以受到某些药物诱导剂的诱导而活性增加,如苯巴比妥、水合氯醛、苯妥英钠、利福平等;也可受到某些肝药酶抑制剂的抑制而活性减弱,如氯霉素、对氨基水杨酸、异烟肼、保泰松等。

(五) 药物的排泄

排泄是指药物及其代谢物经机体的排泄器官或分泌器官排出体外的过程。机体的排泄或分泌器官主要是肾脏,其次是胆道、肠道、唾液腺、乳腺、汗腺、肺等。药物及代谢物经肾脏排泄时有三种方式:肾小球滤过、肾小管主动分泌和肾小管重吸收。按被动转运规律,脂溶性高、极性小、非解离型的药物和代谢产物易经肾小管上皮细胞重吸收入血。此时改变尿液 pH 值可以明显改变弱酸性或弱碱性药物的解离度,从而改变药物重吸收程度。肾脏排泄药物时主要受血浆蛋白结合率和肾血流量的影响。有的药物在肝细胞内与葡萄糖醛酸结合后分泌到胆汁中,随后排泄到小肠中被水解,游离型药物可经肠黏膜上皮细胞吸收,由肝门静脉重新进入全身循环,这种在小肠、肝、胆汁间的循环称为肝肠循环。有肝肠循环的药物其作用时间明显延长。其他影响药物排泄的因素还有:酸化、碱化尿液和联合用药时,若改变尿液 pH 可以影响弱酸性或弱碱性药物的肾脏排泄。肾血流量减少、肾功能不全及衰竭时可减慢药物的排泄。当原形药物或活性代谢物经肾脏排泄时可以产生药理作用或毒性。联合用药时可以通过促进或抑制肾小管分泌而影响药物的排泄。某些药物经尿液、唾液、泪腺、汗腺、乳汁等体液排泄时可以有颜色的改变,必须要预先告诉患者,以免引起不必要的恐慌。

经典考题

A 型题

1. 弱碱性药物

- A. 在酸性环境中易跨膜转运 B. 在胃中易于吸收 C. 酸化尿液时易被重吸收
D. 酸化尿液可加速其排泄 E. 碱化尿液可加速其排泄

答案: D

解析: 弱酸性或弱碱性药物在肾小管内可通过简单扩散重吸收,尿液的 pH 可影响它们的解离度。弱碱性药物酸化尿液可增加其解离度,减少肾小管的重吸收,加速其排泄。

B 型题

[2~4]

- A. 简单扩散 B. 主动转运 C. 首过消除 D. 肝肠循环 E. 易化扩散
2. 药物分子依靠其在生物膜两侧形成的浓度梯度的转运过程称为
3. 药物经胃肠道吸收在进入体循环之前代谢灭活,进入体循环的药量减少称为
4. 药物随胆汁排入十二指肠可经小肠重吸收称为

答案: 2. A 3. C 4. D

解析:被动转运是指药物从高浓度的一侧向低浓度一侧转运的方式,其动力就是膜两侧的浓度差。此方式又可分为简单扩散和滤过两种。故2题选A。3题与4题的题干分别为“首过消除”和“肝肠循环”的定义。

二、药物代谢动力学参数及其应用

药物代谢动力学是研究药物在体内转运和转化的动力学规律,并按其规律将机体模拟为房室模型,并计算出药物的体内动力学参数。

(一) 时量曲线及曲线下面积

药物在体内的转运及转化形成了药物的体内过程,从而产生药物在不同器官、组织、体液间的浓度变化,并且是一个随时间变化而改变的动态过程,称之为动力学过程或速率过程。

给药后药物随时间迁移发生变化,这种变化以药物浓度(或对数浓度)为纵坐标,以时间为横坐标绘出曲线图,称为药物浓度-时间曲线图,简称浓度-时间曲线或时量曲线。

达峰浓度(C_{max})是指用药后所能达到的最高药物浓度,达峰时间(t_{max})是指用药后达到最高浓度的时间。药时曲线下面积(AUC)指药时曲线与坐标轴围成的区域,表示一段时间内药物在血浆中的相对累积量,它是计算生物利用度的主要参数。

经典考题

A型题

药时曲线下面积代表

- A. 药物的剂量 B. 药物的吸收速度 C. 药物的分布速度
D. 进入体循环药物的相对量 E. 药物的排泄量

答案: D

解析:药时曲线下面积(AUC)与进入体循环的药量成比例,反映进入体循环药物的相对量。

(二) 半衰期及其临床意义

半衰期($t_{1/2}$)指血浆中药物浓度下降一半所需的时间。 $t_{1/2}$ 的意义在于:①它反映药物消除快慢的程度,也反映体内消除药物的能力;② $t_{1/2}$ 与药物转运和转化关系为,一次用药后经过4~6个 $t_{1/2}$ 后体内药量消除93.5%~98.4%。同理,若每隔1个 $t_{1/2}$ 用药一次,则经过4~6个 $t_{1/2}$ 后体内药量可达稳态水平的93.5%~98.4%;③按 $t_{1/2}$ 的长短不同常将药物分为五类,超短效为 $t_{1/2} \leq 1h$,短效为1~4h,中效为4~8h,长效为8~24h,超长效为 $>24h$;④肝肾功能不良者,其 $t_{1/2}$ 将改变,绝大多数药物的 $t_{1/2}$ 延长。可通过测定患者肝肾功能,调整用药剂量或给药间隔。

经典考题

A型题

按一级动力学消除的药物,达到稳态血药浓度的时间长短取决于

- A. 剂量大小 B. 半衰期 C. 给药途径 D. 分布速度 E. 生物利用度

答案: B

解析:按一级动力学消除的药物,达到稳态血药浓度的时间长短取决于药物半衰期而与其他因素无关。

(三) 清除率

机体总体清除率是指体内诸消除器官在单位时间内清除药物的血浆容积,是肝、肾及其他消除途径清除率的总和。

(四) 生物利用度

生物利用度指血管外给药后能被吸收入体循环的分数或百分数。

经典考题

A型题

相对生物利用度是

- A. $\frac{\text{口服等量药物后 } AUC}{\text{静注等量药物后 } AUC} \times 100\%$ B. $\frac{\text{受试药物 } AUC \times \text{参比药物剂量}}{\text{标准药物 } AUC \times \text{受试药物剂量}} \times 100\%$
- C. $\frac{\text{口服药物 } AUC}{\text{进入体循环的药物}} \times 100\%$ D. $\frac{\text{口服等量药物后剂量}}{\text{静注等量药物后剂量}} \times 100\%$
- E. $\frac{\text{口服等量药物后 } C_{\max}}{\text{经注等量药物后 } C_{\max}} \times 100\%$

答案: B

解析: 生物利用度(F)是指药物经血管外给药后,药物能被吸收入体循环的速度和程度的一种量度,是用来评价制剂吸收程度的指标。选项 A 为绝对口服生物利用度。由于药物剂型不同,故可以某一制剂为标准,与受试制剂比较,称为相对生物利用度 $F = \frac{AUC_T \times D_R}{AUC_R \times D_T} \times 100\%$ (AUC 表示曲线下面积)。

(五) 表观分布容积及其意义

表观分布容积指理论上药物均匀分布应占有的体液容积,以 L 或 L/kg 表示。它并非指药物在体内占有的真实体液容积,所以称为表观分布容积。通过此数值可以了解药物在体内的分布情况。如一个 70kg 体重的正常人, V_d 在 5L 左右时表示药物大部分分布于血浆; $V_d = 10 \sim 20L$ 时则分布于全身体液中; $V_d > 40L$ 时则表示药物分布到组织器官中; $V_d > 100L$ 时则集中分布至某个器官内或大范围组织内,前者如碘集中于甲状腺,后者指骨骼或脂肪组织等。

经典考题

X型题

药物表观分布容积的意义在于

- A. 提示药物在血液及组织中分布的相对量 B. 用以估算体内的总药量
- C. 用以推测药物在体内的分布范围 D. 反映机体对药物的吸收及排泄速度
- E. 用以估算欲达到有效血药浓度应投给的药量

答案: ABCE

解析: 当药物在体内分布达到动态平衡时,体内药量与血药浓度的比值称为表观分布容积。通过它可以提示药物在血液及组织中分布的相对量,估算体内的总药量,推测药物在体内的分布范围,估算欲达到有效血药浓度应投给的药量。

(六) 稳态浓度及其临床意义

在临床治疗中多数药物都是重复给药以期达到有效治疗浓度,并维持在一定水平。此时给药速率与消除速率达到平衡,其血药浓度称为稳态浓度(C_{ss}),又称坪值。当间隔 1 个半衰