

全国中等卫生职业学校配套教材

供 护理、助产 专业用

药理学基础 学习指导

主 编 徐 红



人民卫生出版社

全国中等卫生职业学校配套教材

供护理、助产专业用

药理学基础学习指导

主编 徐 红

副主编 金光泉 廖淑杰

编者（以姓氏笔画为序）

王开贞（山东省滨州职业学院）

徐 红（山东省滨州职业学院）

刘雪梅（山东省泰安卫生学校）

殷秀霞（河北张家口市卫生学校）

朱锦堂（江苏南通体臣卫生学校）

宿长春（山东省潍坊卫生学校）

陈军成（山东省益都卫生学校）

黄晓斌（江西南昌铁路卫生学校）

金光泉（山东省临沂卫生学校）

曹楚兵（湖南益阳卫生学校）

陈雪艳（山东省潍坊卫生学校）

廖伟坚（福建卫生学校）

段立运（山东省益都卫生学校）

廖淑杰（内蒙通辽市卫生学校）

郝桂兰（山东省聊城职业技术学院）

人 民 卫 生 出 版 社

图书在版编目(CIP)数据

药理学基础学习指导/徐红主编. —北京:
人民卫生出版社, 2003. 6
ISBN 7-117-05551-0

I. 药… II. 徐… III. 药理学-专业学校-教学
参考资料 IV. R9

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2003)第 042114 号

药理学基础学习指导

主 编: 徐 红
出版发行: 人民卫生出版社(中继线 67616688)
地 址: (100078)北京市丰台区方庄芳群园 3 区 3 号楼
网 址: <http://www.pmph.com>
E - mail: pmph@pmph.com
印 刷: 北京市安泰印刷厂
经 销: 新华书店
开 本: 787×1092 1/16 印张: 8.25
字 数: 193 千字
版 次: 2003 年 7 月第 1 版 2005 年 8 月第 1 版第 4 次印刷
标准书号: ISBN 7-117-05551-0/R·5552
定 价: 12.00 元

著作权所有, 请勿擅自用本书制作各类出版物, 违者必究
(凡属质量问题请与本社发行部联系退换)

编写说明

为了配合三年制护理、助产等专业国家规划教材《药理学基础》的教学,在卫生部教材办公室的统一部署和指导下,由《药理学基础》教材编写组徐红副教授等组织编写了这本《药理学基础学习指导》,作为配套教材,供师生教学之用。

该书从章节顺序到具体药物内容,均以《药理学基础》为依据,充分体现了配套的原则。其中学习指导内容是教材中因受篇幅所限制没有交待清楚的疑难问题,涉及基础医学和临床医学各学科有关新进展、新理论等,目的是为了师生教学更实用。习题部分设有A₁和A₂型选择题、填空题、名词解释、问答题四种通用题型及处方分析。题量适中,难易适度,重点突出,每章节之后附有答案,以便核对,最后附两套综合测试卷及答案,供学生总复习时自测之用。

药物名称以中华人民共和国药典(2000年)法定名和别名兼用,以便让学生熟悉临床常用药物的别名,为将来工作打下基础。

本书编写过程中,得到山东省滨州职业学院等编者单位领导的大力支持,在此表示感谢。

由于编者的水平所限,书中难免有误,敬请广大师生批评、指正。

编 者

2003年2月

目 录

第一章 总论.....	(1)
第二章 抗微生物药	(11)
第三章 抗寄生虫病药	(27)
第四章 抗恶性肿瘤药	(31)
第五章 传出神经系统药	(35)
第六章 麻醉药	(45)
第七章 中枢神经系统药	(49)
第八章 心血管系统药	(70)
第九章 利尿药和脱水药	(81)
第十章 作用于血液及造血系统药	(87)
第十一章 抗变态反应药	(93)
第十二章 呼吸系统药物	(96)
第十三章 消化系统药物	(99)
第十四章 子宫收缩及舒张药.....	(102)
第十五章 激素及有关药物.....	(105)
第十六章 特殊解毒药.....	(111)
综合测试卷.....	(115)
综合测试卷答案.....	(125)

第一章

总 论

【学习指导】

一、时辰对药物作用的影响

生物医学的研究认为,人体的各种生理活动具有某些节律性,这些生物节律是由人体生物钟调控的,随着对人体生物钟研究不断深入,人们发现许多药物对人体的作用、毒性及代谢等也具有时辰节律性,形成了一门新兴学科—时辰药理学,时辰药理学是研究药物与生物节律性相互作用的一门科学,即研究机体的昼夜节律对药物作用和体内过程的影响以及药物对机体昼夜节律的效应。

1. 时辰效应性 时辰效应性是指机体对药物的反应包括作用和副作用等呈现时辰周期性改变,如研究发现洋地黄类药物的敏感性以凌晨4时为最高,约高于其他时间的40倍;胰岛素的降血糖作用上午10时作用最强。

2. 时辰药动学 许多药物在体内吸收、分布、代谢和排泄具有时辰节律性,这种节律性直接影响到血药浓度的高低,如吲哚美辛在早晨7时给药血中浓度最高,口服铁剂在下午7时比上午7时其吸收率可增加一倍。

3. 时辰药物毒性 苯巴比妥下午2时注射可使实验小鼠全部死亡,而晚上至凌晨1时注射则全部存活;又如阿糖胞苷治疗白血病时,可取上午8时、11时给最大剂量,下午8时、11时给最低剂量,此法与常规等量给药比较,其实验动物的存活率可提高50%。

在临床用药时,要考虑时辰因素的影响,使之发挥更大的作用,呈现最小的不良反应。

二、肝药酶

肝脏代谢药物的酶系是肝微粒体药物代谢酶系(Hepatimicrosomal drug-metabolizing systems)简称“药酶”。其中最主要的是细胞色素P-450依赖性混合功能氧化酶,又称为混合功能氧化酶或加单氧酶,其主要存在于肝细胞的滑面内质网上,主要由三部分组成,即血红蛋白类、黄素蛋白类和磷脂类,这三部分共同构成电子传递体系,药物与其结合后,对药物进行氧化作用,使药物活性改变或丧失。

三、受体数目的动态变化

受体作为细胞成分之一,并不是静止和固定不变的,而是处于动态平衡之中,一方面是不断合成和降解的新陈代谢,另一方面,受体的数量可受某些因素的影响而发生增减。生理状态下,许多递质、激素具有调节靶细胞膜受体或胞浆受体数目的能力,使相应的受

体数目增多或减少。在病理状态下,相关受体数目也可发生变化,如支气管哮喘病人,支气管平滑肌的 β 受体数目减少;甲状腺机能亢进病人, β 受体数目成倍增多等。在药物的影响下,受体数目也可发生变化,若长期应用受体激动剂可使相应的受体数目减少,即向下调节(down-regulation)。而长期应用受体拮抗剂时,其受体数目增多,即向上调节(up-regulation)。在生理、病理和药物影响下,受体数目的动态变化对研究疾病的发生和发展以及临床药物治疗具有重要的指导意义。

对受体的进一步研究也证实,不但其数目是可变的,而且其亲和力也是可变的,如哮喘病人其 β 受体对儿茶酚胺类药物的亲和力减弱;而雌激素能使缩宫素和孕酮受体的亲和力增强等。

【试题】

一、 A_1 型题

- 下列对选择作用的叙述,哪项是错误的()
 - 选择性是相对的
 - 与药物剂量大小无关
 - 是药物分类的依据
 - 是临床选药的基础
 - 大多数药物均有各自的选择作用
- 药物的副作用是在下列哪种情况下发生的()
 - 极量
 - 治疗量
 - 最小中毒量
 - 特异质病人
 - 半数致死量
- 受体激动剂与受体()
 - 只具有内在活性
 - 只具有亲和力
 - 既有亲和力又有内在活性
 - 既无亲和力也无内在活性
 - 以上皆否
- 受体阻断剂和受体()
 - 有亲和力而无内在活性
 - 既有亲和力又有内在活性
 - 既无亲和力也无内在活性
 - 无亲和力而有内在活性
 - 具有较强亲和力,却仅有较弱内在活性
- 下列有关部分激动药的叙述,哪项是错误的()
 - 药物与受体有亲和力
 - 药物与受体有较弱的内在活性
 - 单独使用有较弱的受体激动药的效应
 - 与受体激动药合用则增强激动药的效应
 - 具激动药和拮抗药的双重特点
- 药物最常用的给药方法是()
 - 口服给药
 - 舌下给药
 - 直肠给药
 - 肌肉注射
 - 皮下注射
- 弱酸性药物在胃中()
 - 不吸收
 - 大量吸收
 - 少量吸收

- D. 全部吸收 E. 以上皆否
8. 影响药物吸收的因素不包括()
- A. 给药途径 B. 药物理化性质 C. 剂型
D. 药物与血浆蛋白的结合力 E. 吸收环境
9. 对同一药物来讲,下列哪种说法是错误的()
- A. 在一定范围内,剂量越大,作用越强
B. 对不同个体来说,用量相同,作用不一定相同
C. 用于妇女时效应可能与男人有别
D. 成人应用时,年龄越大,用量应越大
E. 小儿应用时,体重越重,用量应越大
10. 酸化尿液,可使弱碱性药物经肾排泄时()
- A. 解离↑、再吸收↑、排出↓ B. 解离↓、再吸收↑、排出↓
C. 解离↓、再吸收↓、排出↑ D. 解离↑、再吸收↓、排出↑
E. 解离↑、再吸收↓、排出↓
11. 药物的肝肠循环可影响()
- A. 药物作用发生的快慢 B. 药物的药理活性
C. 药物作用持续时间 D. 药物的分布
E. 药物的代谢
12. 当以一个半衰期为给药间隔时间,经给药几次血中浓度可达到坪值()
- A. 1次 B. 2次 C. 3次 D. 4次 E. 5次
13. 老年人由于各器官功能衰退,用药剂量应为成人的()
- A. 1/2 B. 1/3 C. 2/3 D. 3/4 E. 4/5
14. 药物的半衰期长,则说明该药()
- A. 作用快 B. 作用强 C. 吸收少 D. 消除慢 E. 消除快
15. 对同一药物而言,五者中的最大剂量是()
- A. 最小有效量 B. 最小中毒量 C. 常用量
D. 极量 E. 治疗量
16. 作用产生最快的给药途径是()
- A. 直肠给药 B. 肌注 C. 舌下给药 D. 静注 E. 口服
17. 药酶诱导剂对药物代谢的影响是()
- A. 药物在体内停留时间延长 B. 血药浓度升高
C. 代谢加快 D. 代谢减慢
E. 毒性增大
18. 弱酸性药物在碱性环境中()
- A. 解离度降低 B. 脂溶性增加 C. 易透过血脑屏障
D. 易被肾小管重吸收 E. 经肾排泄加快
19. 药物与血浆蛋白结合率高时,则药物()
- A. 显效快,作用时间短 B. 显效快,作用时间长
C. 显效慢,作用时间长 D. 显效慢,作用时间短

- E. 以上皆否
20. 少数病人应用小剂量药物就产生较强的药理作用,甚至引起中毒,称为()
- A. 习惯性 B. 后天耐受性 C. 成瘾性 D. 选择性 E. 高敏性
21. A 药比 B 药安全,正确的依据是()
- A. A 药的 LD_{50}/ED_{50} 比 B 药大 B. A 药的 LD_{50} 比 B 药小
- C. A 药的 LD_{50} 比 B 药大 D. A 药的 ED_{50} 比 B 药小
- E. A 药的 ED_{50} 比 B 药大
22. 药物排泄的主要途径是()
- A. 肝脏 B. 肾脏 C. 肠道 D. 腺体 E. 呼吸道
23. 药物作用强度随时间变化的动态过程是()
- A. 时效关系 B. 最小有效量 C. 时量关系
- D. 治疗量 E. 量效关系
24. 下列对药物副作用的叙述,正确的是()
- A. 危害多较严重 B. 多因剂量过大引起
- C. 属于一种与遗传有关的特异质反应 D. 不可预知
- E. 与防治作用可相互转化
25. 下列有关毒性反应的叙述,错误的是()
- A. 治疗量时产生 B. 多与剂量有关
- C. 多对机体有明显损害甚至危及生命
- D. 临床用药时应尽量避免毒性反应出现
- E. 分为急性毒性反应和慢性毒性反应
26. 下列有关超敏反应的叙述,错误的是()
- A. 严重时可引起过敏性休克 B. 是一种病理性免疫反应
- C. 与剂量无关 D. 不易预知 E. 与用药时间有关
27. 下列有关药物依赖性的叙述,错误的是()
- A. 精神依赖性又称习惯性 B. 分为身体依赖性和精神依赖性
- C. 多在连续应用时产生 D. 身体依赖性又称心理依赖性
- E. 一旦产生身体依赖性,停药后就会产生戒断症状
28. 下列对主动转运的叙述,错误的是()
- A. 耗能 B. 需载体协助 C. 有竞争性抑制现象
- D. 逆浓度差转运 E. 顺浓度差转运
29. 影响药物分布的因素不包括()
- A. 药物的理化性质 B. 吸收环境 C. 体液的 pH 值
- D. 血脑屏障 E. 药物与血浆蛋白结合率
30. 下列有关药酶抑制剂的叙述,错误的是()
- A. 可使药物在体内停留时间延长 B. 可使血药浓度上升
- C. 可使药物药理活性减弱 D. 可使药物毒性增加
- E. 以上皆否
31. 下列对成瘾性的叙述,错误的是()

- A. 又称生理依赖性 B. 病人对药物不敏感
C. 病人停药后可产生戒断症状 D. 又称身体依赖性
E. 使用麻醉药品时产生
32. 药物与血浆蛋白结合后,不具有哪项特点()
A. 药物之间具有竞争蛋白结合的置换现象
B. 暂时失去药理活性 C. 不易透过生物膜转运
D. 结合是可逆的 E. 使药物毒性增加
33. 使药物作用时间缩短的因素是()
A. 肝肾功能降低 B. 形成肝肠循环 C. 药酶活性降低
D. 与血浆蛋白结合 E. 弱酸性药和碱化尿液的药物合用
34. 影响药物脂溶扩散的因素不包括()
A. 药物的解离度 B. 药物分子极性 C. 药物的脂溶性
D. 载体的数量 E. 生物膜两侧的浓度差
35. 不利于药物由血液向组织液分布的因素是()
A. 药物的脂溶性高 B. 药物的解离度低
C. 药物与血浆蛋白结合率高 D. 药物与组织亲和力高
E. 药物和血浆蛋白结合率低
36. 下列有关药物的叙述,错误的是()
A. 几乎所有药物均能穿透胎盘屏障,故妊娠期间应禁用可能致畸的药物
B. 弱酸性药物少量在胃中吸收
C. 当肾功能不全时,应禁用或慎用对肾有损害的药物
D. 由肾小管主动分泌排泄的药物之间可有竞争性抑制现象
E. 药物的蓄积均对机体有害
37. 药物的排泄过程是()
A. 药物的排毒过程 B. 药物的重吸收过程
C. 药物的再分布过程 D. 药物的彻底消除过程
E. 药物的分泌过程

二、A₂型题

38. 刘某,女,41岁,患胃溃疡数年,近来发作加剧,伴有泛酸,医生给予抗酸药氢氧化铝口服以中和胃酸,这是利用药物的哪种作用类型()
A. 选择作用 B. 局部作用 C. 吸收作用
D. 预防作用 E. 对因治疗
39. 郑某,男,56岁,患顽固失眠症伴焦虑,长期服用地西泮,开始每晚服5mg即可入睡,半年后每晚服10mg仍不能入睡,这是因为机体对药物产生了()
A. 耐受性 B. 成瘾性 C. 继发反应 D. 个体差异 E. 副作用
40. 刘某,男,43岁,患冠心病,近期心绞痛频发,医生给予硝酸甘油,并特别嘱其要舌下含服,而不采用口服,这是因为()
A. 可使毒性反应降低 B. 防止耐药性产生 C. 可使副作用减小

D. 避开首关消除 E. 防止产生耐受性

41. 李某,男,18岁,患急性扁桃体炎就医,医生处方中的抗菌药为复方磺胺甲基异噁唑,并嘱其首次剂量加倍服用,这是因为()

- A. 可在一个半衰期内达到有效稳态血药浓度
B. 可使毒性反应降低 C. 可使副作用减小
D. 可使半衰期延长 E. 可使半衰期缩短

42. 杨某,女,30岁,因烧伤入院,医生给予哌替啶止痛,连用3天,第4天停用后患者出现烦躁不安、流泪、出汗、恶心、呕吐、惊厥等戒断症状,这表明患者对哌替啶已产生了()

- A. 耐受性 B. 生理依赖性 C. 副作用
D. 变态反应 E. 继发反应

43. 周某,女,58岁,患慢性心功能不全,医生处方中选用地高辛每日0.25mg口服,并嘱其连续用药期间须选择同一药厂、同一剂型,最好为同一批号的产品,这是因为()

- A. 生物利用度相对稳定,可确保疗效,又不致中毒
B. 更换其他药厂的产品无效 C. 为厂家推销产品
D. 利益驱动有关 E. 医生用药习惯

44. 郑某,女,26岁,患癫痫大发作就诊,医生处方用苯妥英钠100mg,一日3次,但患者擅自增加用量至每次200mg,一日3次,服至第8天时,病人出现共济失调、头痛、精神错乱,与血药浓度过高有关,这种现象称为()

- A. 反跳现象 B. 蓄积性中毒 C. 过敏反应
D. 特异质反应 E. 后遗效应

45. 朱某,男,37岁,因过食生冷后出现腹泻、腹痛就诊,医生给予解痉药阿托品0.3mg,服药后腹痛、腹泻缓解,但患者感视物模糊、口干等,这属于药物的何种不良反应()

- A. 毒性反应 B. 依赖性 C. 耐受性 D. 副作用 E. 变态反应

46. 赵某,男,28岁,患肺结核病,医生给予抗结核药物利福平、异烟肼和链霉素治疗,用药一个月后病人出现了耳鸣,继而听力丧失,请问患者发生的是哪种类型的不良反应()

- A. 副作用 B. 继发反应 C. 后遗作用 D. 变态反应 E. 毒性反应

三、填空题

47. 根据用药目的不同,治疗作用可分为____治疗和____治疗。

48. 副作用是指药物在____剂量时出现,与____目的无关的作用,并与____作用可以相互转化。

49. 毒性反应一般是由于剂量____或用药时间____或病人对药物的敏感性____而引起的对机体有明显损害的反应。

50. 药物的不良反应包括____、____、____、____、____、____、____、____。

51. 药物的三致作用包括____、____、____,其属于____毒性反应。
52. 药物与受体结合引起生物效应,须具备的两个条件是____和____。
53. 长期使用受体激动药,可使相应受体数目____,称为____调节,从而使药物作用____,表现为耐受性。而向上调节则为某些药物停药后出现____现象的原因。
54. 弱酸性药物在弱碱性环境中,解离度____,分子极性____,脂溶性____,被动转运____。
55. 影响药物吸收的因素有许多。一般来说,药物分子____、脂溶性____、溶解度____、解离度____者易被吸收。
56. 药酶抑制剂可使肝药酶活性____,导致经肝代谢药物在体内停留时间____,血药浓度____,药理活性____,毒性____,故合用时应____药物剂量。
57. 肾排泄药物的方式有____和____。
58. 经胆汁排泄的药物被排入肠道后,可被重吸收而形成____,使作用时间____排泄速度____。
59. 药物与受体结合的能力称为____,药物激活受体的能力称为____。据此将与受体结合呈现作用的药物分为____、____和____三类。
60. 在影响药物作用的因素中,机体方面的因素有____、____、____、____、____、____。
61. 给药途径有____、____、____、____、____、____等。
62. 催眠药应在____服用,助消化药物需____或____服,驱肠虫药宜在____或____时服用,对胃肠道有刺激性的药物宜在____服用。
63. 两种或两种以上的药物同时或先后应用称为____或____临床联合用药的目的是____、____或____。

四、名词解释

- | | | |
|-----------|-----------|-----------|
| 64. 药动学 | 65. 抑制作用 | 66. 药物 |
| 67. 药理学 | 68. 选择作用 | 69. 治疗量 |
| 70. 药效学 | 71. 不良反应 | 72. 兴奋作用 |
| 73. 首关消除 | 74. 药酶诱导剂 | 75. 安全范围 |
| 76. 对症治疗 | 77. 治疗指数 | 78. 耐受性 |
| 79. 预防作用 | 80. 受体激动药 | 81. 局部作用 |
| 82. 吸收作用 | 83. 副作用 | 84. 毒性反应 |
| 85. 亲和力 | 86. 内在活性 | 87. 受体阻断药 |
| 88. 极量 | 89. 血浆半衰期 | 90. 坪值 |
| 91. 生物利用度 | 92. 药酶抑制剂 | 93. 精神药品 |
| 94. 麻醉药品 | 95. 对症治疗 | 96. 超敏反应 |
| 97. 常用量 | | |

五、问答题

98. 区别精神依赖性和身体依赖性。

99. 比较口服给药和注射给药的优缺点及适用范围。

100. 何为血浆半衰期?有何临床意义?

101. 综述影响药物作用的因素。

【试题答案】

1. B 2. B 3. C 4. A 5. D 6. A 7. C 8. D 9. D 10. D 11. C 12. E 13. D
14. D 15. B 16. D 17. C 18. E 19. C 20. E 21. A 22. B 23. A 24. E 25. A
26. E 27. D 28. E 29. B 30. C 31. B 32. E 33. E 34. D 35. C 36. E 37. D
38. B 39. A 40. D 41. A 42. B 43. A 44. B 45. D 46. E

47. 对因 对症

48. 治疗 用药 防治

49. 过大 过久 过高

50. 副作用 毒性反应 变态反应 后遗效应 继发反应 药物依赖性

51. 致癌 致畸 致突变 慢性

52. 亲和力 内在活性

53. 减少 向下 减弱 反跳

54. 大 大 小 难

55. 小 大 大 小

56. 降低 延长 上升 增强 增大 减少

57. 肾小球滤过 肾小管分泌

58. 肝肠循环 延长 减慢

59. 亲和力 内在活性 受体激动药 受体阻断药 部分受体激动药

60. 年龄与体重 性别 个体差异 病理状态 心理精神因素 昼夜节律

61. 口服 注射 吸入 舌下给药 直肠给药 皮肤粘膜给药

62. 睡前 饭前 饭时 空腹 半空腹 饭后

63. 联合用药 配伍用药 增强疗效 降低不良反应 延缓耐药性产生

64. 研究机体对药物的影响,即研究药物在机体内的吸收、分布、生物转化和排泄,称为药物代谢动力学,简称药动学。

65. 使机体原有功能活动减弱的药物作用成为抑制作用。

66. 药物是用于治疗、预防、诊断疾病和计划生育的化学物质。

67. 药理学是研究药物的作用、临床应用、不良反应及用药注意事项等内容的一门科学。

68. 多数药物在一定剂量下,对某组织或器官产生明显的作用,而对其他组织或器官作用不明显或无作用,此称为选择作用。

69. 最小有效量与极量之间的量称为治疗量。

70. 研究药物对机体的作用规律和作用机制的科学称为药效学。

71. 不符合用药目的并对机体不利的反应称为不良反应。

72. 使机体原有功能活动增强的药物作用称为兴奋作用。

73. 由胃肠道吸收的药物,经门静脉进入肝,有些药物首次通过肝时即被转化灭活,

使进入体循环的药量减少,药效降低,这种现象称为首关消除。

74. 能使药酶活性增强或合成增加的药物称为药酶诱导剂。

75. 最小有效量和最小中毒量之间的范围称为安全范围。

76. 用于缓解疾病症状的治疗称为对症治疗。

77. 半数致死量与半数有效量的比值称为治疗指数。

78. 有些患者对药物的敏感性较低,必须应用较大剂量方可呈现治疗作用,这种现象称为耐受性。

79. 在疾病或症状发生之前用药所产生的作用称为预防作用。

80. 药物与受体既有亲和力,又具有内在活性,则该药物称为该受体的激动药。

81. 药物被吸收入血之前,在用药局部所产生的作用称为局部作用。

82. 药物进入血液循环后,随血流分布到全身各组织器官所呈现的作用称为吸收作用。

83. 药物在治疗量时出现的与用药目的无关的作用称为副作用。

84. 由于用药剂量过大、用药时间过长或机体敏感性过高引起的对机体有明显损害的反应称为毒性反应。

85. 药物与受体结合的能力称为亲和力。

86. 药物激动受体的能力称为内在活性。

87. 药物与受体只有亲和力,而没有内在活性,该药物称为该受体的阻断药。

88. 极量是指出现最大治疗作用,但尚未引起毒性反应的量,又称最大治疗量。

89. 血浆药物浓度下降一半所需要的时间称为血浆半衰期。

90. 每隔一个半衰期重复恒量给药一次,体内药量将逐渐累积,给药 5 次后,基本达到稳态血药浓度,此被称为坪值。

91. 药物被机体吸收利用的程度称为生物利用度。

92. 能使肝药酶活性减弱或合成减少的药物称为药酶抑制剂。

93. 易产生精神依赖性的药品称为精神药品。

94. 易产生身体依赖性的药品称为麻醉药品。

95. 针对致病原因的治疗称为对因治疗。

96. 超敏反应又称变态反应或过敏反应,是指已被致敏的机体对某些药物产生的一种异常的或病理性的免疫反应。

97. 临床为使药物疗效可靠而安全,常采用比最小有效量大,比极量小的量,即为常用量。

98. 精神依赖性又称心理依赖性或习惯性,是指连续用药,突然停药后,病人产生继续用药的强烈欲望,并产生强迫用药行为,以求获得满足或避免不适,但不产生戒断症状。身体依赖性又称为生理依赖性 or 成瘾性,是指反复用药后,一旦停药就会出现戒断症状,表现为烦躁不安、流泪、出汗、疼痛、恶心、呕吐、惊厥等,甚至危及生命。身体依赖者为求得继续用药,可不择手段,甚至丧失道德人格。

99. 口服给药是临床最常用的给药途径。此法优点是简便安全,缺点是药物吸收慢且不规则,易受消化酶和胃肠内容物的影响;此法适用于大多数药物和病人,但不适用于急救、昏迷和呕吐等病人。

注射给药是把药液直接注入体内的方法。此法优点是用量准确,缺点是技术性操作要求较高,不够经济安全,适用范围是危急不能口服的病人。

100. 药物的血浆半衰期是指血药浓度下降一半所需要的时间。血浆半衰期的临床意义是:①用来制定合理的给药间隔时间。在临床上,根据药物的半衰期决定给药间隔时间,既可保证血药浓度维持在满意治疗水平,又可避免毒性反应的发生。大多数药物的给药间隔时间约为一个半衰期。②估计药物达到稳态血药浓度的时间。重复恒量给药,经过 5 个半衰期,血药浓度可达稳态血浓度的 97% 左右,这时可认为药物已在体内达到有效血浓度。③估计体内药物或毒物的残留量。在药物或毒物中毒时,经过 5 个半衰期体内药物或毒物消除可达 97% 左右,这时可认为体内药物或毒物已基本消除。

101. 影响药物作用的因素主要包括以下四个方面:

(1) 药物的体内过程方面的因素主要包括:①药物的跨膜转运;②药物的吸收;③药物在体内的分布;④药物的生物转化;⑤药物的排泄;⑥药物的消除与蓄积。

(2) 机体方面的因素主要包括:①年龄和体重;②性别;③个体差异;④心理精神因素;⑤病理状态;⑥昼夜节律。

(3) 药物方面的因素主要包括:①药物的化学结构;②药物的剂量。

(4) 给药方法方面的因素主要包括:①给药途径;②给药时间和次数;③联合用药。

(王开贞)

第二章

抗微生物药

【学习指导】

一、青霉素结合蛋白

晚近研究表明,β-内酰胺类抗生素可特异性地与敏感细菌细胞膜上的靶位结合,从而抑制细菌细胞壁肽聚糖合成而导致细菌死亡。该靶位可与放射性核素标记的青霉素 G 结合,因此将其称为青霉素结合蛋白(penicillia bending proteins)。青霉素结合蛋白存在于细菌细胞膜上,占膜蛋白的 1%,其数目、分子大小和与 β-内酰胺类抗生素的结和量,可因细菌菌种不同而异。

青霉素结合蛋白具有酶活性,参与细菌细胞壁肽聚糖的合成,后者是维持细菌细胞壁完整性所必须的,β-内酰胺类抗生素与其结合后,因细胞壁的完整性受损,影响了细菌的正常形态及分裂增殖,使细菌形成渗透压稳定的球形体,继而溶解死亡。

某些细菌也可通过改变青霉素结合蛋白的结构,使其对 β-内酰胺类抗生素的亲合力降低,或使其数量增多而产生耐药性。

二、青霉素脑病

鞘内注射或静脉滴注大剂量青霉素、氨苄西林、羧苄西林或甲氧苯青霉素时,因药物在脑脊液中浓度过多,可引起肌肉阵挛、抽搐、昏迷等反应,类似癫痫发作,称为青霉素脑病。因此,鞘内注射或静脉滴注以上青霉素时,剂量不宜过大。因老年人的耐受性降低,肾功能不全的病人排泄延缓,更易发生青霉素脑病,临床用药时应予注意。

三、DNA 回旋酶

喹诺酮类药物的抗菌作用机制是通过抑制细菌的 DNA 回旋酶而抑制 DNA 合成。在 DNA 复制或转录过程中,随着双螺旋的解开,复制叉向前推进,DNA 双股螺旋会出现正超螺旋,这将会妨碍复制叉的移动及 DNA 的复制,此时由回旋酶使双股 DNA 断开(切割),让一段 DNA 穿过,形成负超螺旋,并再封闭断口。喹诺酮类药物抑制回旋酶的断裂与再连接功能,使 DNA 复制受抑,导致敏感菌死亡。

DNA 回旋酶为拓扑异构酶 II,是细菌完成复制所必需的酶。

四、伪膜性肠炎与难辨梭菌

除万古霉素类外,几乎所有抗菌药物都可引起伪膜性肠炎,多于抗菌药物应用过程中

或停药 2~3 周内发生。临床表现为大量水泻,每日 10 余次以上,大便常含粘液,部分有血便,少量可排出斑块状假膜,伴发热、腹痛、腹胀、恶心及呕吐,重症患者可迅速出现脱水、电解质紊乱、循环衰竭等症状。病死率约 30%。过去认为与抗菌药物有关的伪膜性肠炎是金葡菌产生的外毒素所致,现已证实为难辨梭菌的外毒素引起,金葡菌也可在伪膜性肠炎患者的大便中被检出,但只是伴随菌而已。

【试题】

一、A₁ 型题

1. 下列有关药物、机体、病原体三者之间关系的叙述,错误的是()
 - A. 药物对机体有防治作用和不良反应
 - B. 机体对病原体有抵抗能力
 - C. 机体对药物有耐药性
 - D. 药物对病原体有抑制或杀灭作用
 - E. 以上皆否
2. 下列有关青霉素 G 性质的描述,错误的是()
 - A. 水溶液性质不稳定
 - B. 有过敏反应,甚至引起过敏性休克
 - C. 不耐酶,青霉素酶可令其失去活性
 - D. 半衰期为 4~6 小时
 - E. 口服可被胃酸破坏
3. 青霉素对下列哪种病原体无效()
 - A. 脑膜炎奈瑟菌
 - B. 螺旋体
 - C. 流感嗜血杆菌
 - D. 放线菌
 - E. 白喉棒状杆菌
4. β -内酰胺类抗生素的抗菌机制是()
 - A. 抑制菌体细胞壁合成
 - B. 影响胞浆膜的通透性
 - C. 抑制细菌核酸合成
 - D. 抑制菌体蛋白质合成
 - E. 影响菌体叶酸代谢
5. 青霉素类中对铜绿假单胞菌有作用的抗生素是()
 - A. 青霉素 G
 - B. 苯唑西林
 - C. 羧苄西林
 - D. 氨苄西林
 - E. 以上皆否
6. 下列有关头孢菌素的叙述,错误的是()
 - A. 与青霉素有交叉过敏反应
 - B. 耐酶,对抗药金葡菌有效
 - C. 第一代头孢菌素有肾毒性
 - D. 为抑菌剂
 - E. 主用于敏感菌引起的严重感染
7. 青霉素 G 对下列何种疾病无效()
 - A. 猩红热
 - B. 疏松结缔组织炎
 - C. 流脑
 - D. 大叶性肺炎
 - E. 伤寒
8. 下列何药对铜绿假单胞菌无作用()
 - A. 庆大霉素
 - B. 羧苄西林
 - C. 四环素
 - D. 头孢三嗪
 - E. 抗敌素
9. 下列对羧苄西林的叙述,错误的是()