

国家执业药师资格考试辅导丛书

国家执业药师资格考试辅导丛书编写委员会 编写

国家执业药师 资格考试 备考指南 和 考点解析

新版

● 专业权威

参加编写的作者都是国内一流药学院校最权威的、辅导经验最丰富的、考试通过率最高的一线培训老师

● 科学高效

根据最新版考试大纲和应试指南编写,以指导考生最科学、最合理、最高效备考为原则。旨在帮助考生明确考试方向、合理安排自学和复习时间,从而极大地提高考试通过率

● 合理实用

采用最合理的编写方式,每个章节均由大纲要求、重点与考点、典型例题和答案四部分组成,便于广大考生明确复习思路,抓住考试重点,大大提高复习效率

药理学和药物分析分册

江苏科学技术出版社

2010

1. **Introduction**
 2. **Background**
 3. **Methodology**
 4. **Results**
 5. **Discussion**
 6. **Conclusion**
 7. **References**
 8. **Appendix**
 9. **Index**
 10. **Table of Contents**
 11. **Abstract**
 12. **Summary**
 13. **Key Words**
 14. **Keywords**
 15. **Subject Headings**
 16. **Indexing**
 17. **Classification**
 18. **Keywords**
 19. **Subject Headings**
 20. **Indexing**
 21. **Classification**
 22. **Keywords**
 23. **Subject Headings**
 24. **Indexing**
 25. **Classification**
 26. **Keywords**
 27. **Subject Headings**
 28. **Indexing**
 29. **Classification**
 30. **Keywords**
 31. **Subject Headings**
 32. **Indexing**
 33. **Classification**
 34. **Keywords**
 35. **Subject Headings**
 36. **Indexing**
 37. **Classification**
 38. **Keywords**
 39. **Subject Headings**
 40. **Indexing**
 41. **Classification**
 42. **Keywords**
 43. **Subject Headings**
 44. **Indexing**
 45. **Classification**
 46. **Keywords**
 47. **Subject Headings**
 48. **Indexing**
 49. **Classification**
 50. **Keywords**
 51. **Subject Headings**
 52. **Indexing**
 53. **Classification**
 54. **Keywords**
 55. **Subject Headings**
 56. **Indexing**
 57. **Classification**
 58. **Keywords**
 59. **Subject Headings**
 60. **Indexing**
 61. **Classification**
 62. **Keywords**
 63. **Subject Headings**
 64. **Indexing**
 65. **Classification**
 66. **Keywords**
 67. **Subject Headings**
 68. **Indexing**
 69. **Classification**
 70. **Keywords**
 71. **Subject Headings**
 72. **Indexing**
 73. **Classification**
 74. **Keywords**
 75. **Subject Headings**
 76. **Indexing**
 77. **Classification**
 78. **Keywords**
 79. **Subject Headings**
 80. **Indexing**
 81. **Classification**
 82. **Keywords**
 83. **Subject Headings**
 84. **Indexing**
 85. **Classification**
 86. **Keywords**
 87. **Subject Headings**
 88. **Indexing**
 89. **Classification**
 90. **Keywords**
 91. **Subject Headings**
 92. **Indexing**
 93. **Classification**
 94. **Keywords**
 95. **Subject Headings**
 96. **Indexing**
 97. **Classification**
 98. **Keywords**
 99. **Subject Headings**
 100. **Indexing**
 101. **Classification**
 102. **Keywords**
 103. **Subject Headings**
 104. **Indexing**
 105. **Classification**
 106. **Keywords**
 107. **Subject Headings**
 108. **Indexing**
 109. **Classification**
 110. **Keywords**
 111. **Subject Headings**
 112. **Indexing**
 113. **Classification**
 114. **Keywords**
 115. **Subject Headings**
 116. **Indexing**
 117. **Classification**
 118. **Keywords**
 119. **Subject Headings**
 120. **Indexing**
 121. **Classification**
 122. **Keywords**
 123. **Subject Headings**
 124. **Indexing**
 125. **Classification**
 126. **Keywords**
 127. **Subject Headings**
 128. **Indexing**
 129. **Classification**
 130. **Keywords**
 131. **Subject Headings**
 132. **Indexing**
 133. **Classification**
 134. **Keywords**
 135. **Subject Headings**
 136. **Indexing**
 137. **Classification**
 138. **Keywords**
 139. **Subject Headings**
 140. **Indexing**
 141. **Classification**
 142. **Keywords**
 143. **Subject Headings**
 144. **Indexing**
 145. **Classification**
 146. **Keywords**
 147. **Subject Headings**
 148. **Indexing**
 149. **Classification**
 150. **Keywords**
 151. **Subject Headings**
 152. **Indexing**
 153. **Classification**
 154. **Keywords**
 155. **Subject Headings**
 156. **Indexing**
 157. **Classification**
 158. **Keywords**
 159. **Subject Headings**
 160. **Indexing**
 161. **Classification**
 162. **Keywords**
 163. **Subject Headings**
 164. **Indexing**
 165. **Classification**
 166. **Keywords**
 167. **Subject Headings**
 168. **Indexing**
 169. **Classification**
 170. **Keywords**
 171. **Subject Headings**
 172. **Indexing**
 173. **Classification**
 174. **Keywords**
 175. **Subject Headings**
 176. **Indexing**
 177. **Classification**
 178. **Keywords**
 179. **Subject Headings**
 180. **Indexing**
 181. **Classification**
 182. **Keywords**
 183. **Subject Headings**
 184. **Indexing**
 185. **Classification**
 186. **Keywords**
 187. **Subject Headings**
 188. **Indexing**
 189. **Classification**
 190. **Keywords**
 191. **Subject Headings**
 192. **Indexing**
 193. **Classification**
 194. **Keywords**
 195. **Subject Headings**
 196. **Indexing**
 197. **Classification**
 198. **Keywords**
 199. **Subject Headings**
 200. **Indexing**
 201. **Classification**
 202. **Keywords**
 203. **Subject Headings**
 204. **Indexing**
 205. **Classification**
 206. **Keywords**
 207. **Subject Headings**
 208. **Indexing**
 209. **Classification**
 210. **Keywords**
 211. **Subject Headings**
 212. **Indexing**
 213. **Classification**
 214. **Keywords**
 215. **Subject Headings**
 216. **Indexing**
 217. **Classification**
 218. **Keywords**
 219. **Subject Headings**
 220. **Indexing**
 221. **Classification**
 222. **Keywords**
 223. **Subject Headings**
 224. **Indexing**
 225. **Classification**
 226. **Keywords**
 227. **Subject Headings**
 228. **Indexing**
 229. **Classification**
 230. **Keywords**
 231. **Subject Headings**
 232. **Indexing**
 233. **Classification**
 234. **Keywords**
 235. **Subject Headings**
 236. **Indexing**
 237. **Classification**
 238. **Keywords**
 239. **Subject Headings**
 240. **Indexing**
 241. **Classification**
 242. **Keywords**
 243. **Subject Headings**
 244. **Indexing**
 245. **Classification**
 246. **Keywords**
 247. **Subject Headings**
 248. **Indexing**
 249. **Classification**
 250. **Keywords**
 251. **Subject Headings**

国家执业药师
资格考试
备考指南
考点解析

西摩·查尔斯·霍普金斯

国家执业药师资格考试辅导丛书

国家执业药师资格考试 备考指南和考点解析

——药理学和药物分析分册

国家执业药师资格考试辅导丛书编写委员会 编写

江苏科学技术出版社

图书在版编目(CIP)数据

国家执业药师资格考试备考指南和考点解析. 药理学和药物分析分册 / 季晖, 柳文媛编著. —南京: 江苏科学技术出版社, 2004. 6

(国家执业药师资格考试辅导丛书)

ISBN 7-5345-4196-4

I. 国... II. ①季... ②柳... III. ①药剂人员—资格考核—自学参考资料②药理学—资格考核—自学参考资料③药物分析—资格考核—自学参考资料

IV. R192.8

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2004)第 041748 号

国家执业药师资格考试备考指南和考点解析 ——药理学和药物分析分册

主 编 季 晖 柳文媛
责任编辑 刘玉锋

出版发行 江苏科学技术出版社
(南京市湖南路 47 号, 邮编: 210009)

经 销 江苏省新华书店
照 排 南京紫藤制版印务中心
印 刷 江苏苏中印刷厂

开 本 787mm×1 092mm 1/16
印 张 15.25
字 数 360 000
版 次 2004 年 5 月第 1 版
印 次 2005 年 3 月第 2 次印刷
印 数 4 001—6 500 册

标准书号 ISBN 7-5345-4196-4/R·793
定 价 29.00 元

图书如有印装质量问题, 可随时向我社出版科调换。

国家执业药师资格考试辅导丛书 编写委员会

主任委员	季 晖		
副主任委员	许 红	李 娟	陈永法
	柳文媛	唐伟方	
编 委	(以姓氏笔画为序)		
	王 业	王春暖	田 佳
	冯 锋	冯海萍	毕晓玲
	朱国荣	刘赛月	孙继红
	李 歆	李志裕	吴春勇
	张望松	顾和亚	龚晓健
	章映欢	程 鹏	蓝晓步

主编名单

药理学和药物分析分册

药理学主编：季 晖/药物分析主编：柳文媛

药剂学和药物化学分册

药剂学主编：李 娟/药物化学主编：唐伟方

药事管理和药学综合分册

药事管理主编：许 红/药学综合主编：陈永法

前 言

本丛书是参加国家执业药师资格考试(药学类)考生的备考指南,参加编写的作者都是国内一流药学院校的最权威的、辅导经验最丰富的一线培训老师。在多年执业药师考试培训的基础上,编写小组以最新版国家执业药师资格考试考试大纲和应试指南为核心,以指导考生最科学、最合理、最高效备考为原则编写本书。旨在帮助考生明确考试方向、抓住考试重点、合理安排自学和复习时间,从而极大地提高考试通过率。

本套备考指南共分三册,包括了药专业知识(一):药理学和药物分析分册;药专业知识(二):药剂学和药物化学分册;以及药事管理及药学综合知识与技能分册,包含了所有应试科目,各科的每个章节均由大纲要求、重点与考点、典型例题和标准答案四部分组成。第一部分大纲要求即为国家执业药师资格考试的大纲;第二部分重点与考点着重强调了大纲中要求掌握和熟悉的知识点及考试中经常出现的考点,有的以图或表的形式作了归纳总结,便于广大考生复习时将分散零乱的内容融会贯通,大大节省自学和复习的时间,提高效率;第三部分典型例题中根据大纲的试题类型要求,列举了A型题、B型题和X型题三种题型,便于读者在掌握了有关知识点的基础上,适当地做一些练习,一则熟悉题型,二则加深和强化复习的重点和考点。A型题即最佳选择题,有五个备选答案,其中只有一个最佳答案;B型题即配伍选择题,共用一组备选答案共五个,备选答案在前,试题在后,每题只有一个正确答案,每个备选答案可重复选用,也可不被选用;X型题即多项选择题,五个备选答案中有两个或两个以上的正确答案。

由于编者水平所限,书中可能有不妥甚至错误之处,希望读者在使用过程中,不断提出宝贵意见,供今后修改时参考。

国家执业药师资格考试辅导丛书编写委员会

目 录

上篇 药理学

第一至四章 药理学总论	1
大纲要求	1
重点和考点	2
第一章 绪言	2
第二章 药效学	2
第三章 药物动力学	4
第四章 影响药物作用的因素	6
典型例题	7
答案	14
第五至十章 传出神经系统药理学	15
大纲要求	15
重点和考点	16
第五章 传出神经系统药理概论	16
第六章 胆碱受体激动药	18
第七章 抗胆碱酯酶药和胆碱酯酶复活药	18
第八章 胆碱受体阻断药	19
第九章 肾上腺素受体激动药	20
第十章 肾上腺素受体阻断药	21
典型例题	21
答案	30
第十一至十九章 传入神经及中枢神经系统药理学	31
大纲要求	31
重点和考点	32
第十一章 局部麻醉药	32
第十二章 镇静催眠及抗惊厥药	32
第十三章 抗癫痫药	33
第十四章 抗精神失常药	33
第十五章 抗帕金森病药	35
第十六章 镇痛药	35
第十七章 中枢兴奋药	37

第十八章 解热镇痛抗炎药	37
第十九章 全身麻醉药	38
典型例题	38
答案	51
第二十章至第二十四章 心血管系统药理学	52
大纲要求	52
重点和考点	53
第二十章 抗心律失常药	53
第二十一章 抗慢性心功能不全药	54
第二十二章 抗高血压药	55
第二十三章 抗心绞痛药	57
第二十四章 调血脂药和抗动脉粥样硬化药	58
典型例题	58
答案	71
第二十五章至第三十章 内脏系统及抗组胺药药理学	72
大纲要求	72
重点和考点	73
第二十五章 利尿药和脱水药	73
第二十六章 作用于血液的药物	73
第二十七章 呼吸系统药物	74
第二十八章 消化系统药物	74
第二十九章 组胺和组胺受体阻断药	75
第三十章 影响子宫平滑肌药物	75
典型例题	75
答案	81
第三十一章至第三十四章 内分泌系统药理学	83
大纲要求	83
重点和考点	83
第三十一章 肾上腺皮质激素类药	83
第三十二章 性激素类药和避孕药	85
第三十三章 甲状腺激素及抗甲状腺激素药	85
第三十四章 胰岛素及口服降血糖药	86
典型例题	86
答案	91
第三十五章至第四十九章 化学治疗及影响免疫功能药物药理学	92
大纲要求	92
重点和考点	94
第三十五章 抗菌药物概论	94

第三十六章 β -内酰胺类抗生素	95
第三十七章 大环内酯类及其他抗生素	96
第三十八章 氨基糖苷类抗生素	97
第三十九章 四环素类和氯霉素类抗生素	98
第四十章 人工合成抗菌药物	99
第四十一章 抗真菌药	100
第四十二章 抗结核病药和抗麻风病药	100
第四十三章 抗疟药	102
第四十四章 抗阿米巴病药和抗滴虫药	102
第四十五章 抗肠蠕虫药	102
第四十六章 抗血吸虫和抗丝虫病药	102
第四十七章 抗恶性肿瘤药	102
第四十八章 抗病毒药	103
第四十九章 免疫抑制剂和免疫增强剂	104
典型例题	104
答案	119

下篇 药物分析

第一章 药物分析的基础知识	121
大纲要求	121
重点和考点	121
典型例题	124
答案	126
第二章 药典的知识	127
大纲要求	127
重点和考点	127
典型例题	129
答案	130
第三章 物理常数测定法	131
大纲要求	131
重点和考点	131
典型例题	132
答案	134
第四章 化学分析法	135
大纲要求	135
重点和考点	135
典型例题	140
答案	141

第五章 分光光度法	143
大纲要求	143
重点和考点	143
典型例题	146
答案	148
第六章 色谱法	149
大纲要求	149
重点和考点	149
典型例题	152
答案	153
第七章 其他方法	155
大纲要求	155
重点和考点	155
典型例题	156
答案	157
第八章 药物的杂质检查	158
大纲要求	158
重点和考点	158
典型例题	160
答案	162
第九章 芳酸及其酯类药物的分析	163
大纲要求	163
重点和考点	163
典型例题	165
答案	167
第十章 胺类药物的分析	168
大纲要求	168
重点和考点	168
典型例题	170
答案	172
第十一章 巴比妥类药物的分析	173
大纲要求	173
重点和考点	173
典型例题	174
答案	175
第十二章 磺胺类药物的分析	176
大纲要求	176
重点和考点	176

典型例题	176
答案	177
第十三章 杂环类药物的分析	179
大纲要求	179
重点和考点	179
典型例题	181
答案	183
第十四章 生物碱类药物的分析	184
大纲要求	184
重点和考点	184
典型例题	185
答案	186
第十五章 糖类和苷类药物的分析	188
大纲要求	188
重点和考点	188
典型例题	190
答案	191
第十六章 甾体激素类药物的分析	192
大纲要求	192
重点和考点	192
典型例题	194
答案	196
第十七章 维生素类药物分析	197
大纲要求	197
重点和考点	197
典型例题	199
答案	200
第十八章 抗生素类药物的分析	202
大纲要求	202
重点和考点	202
典型例题	205
答案	207
第十九章 药物制剂分析	208
大纲要求	208
重点和考点	208
典型例题	211
答案	213

第二十章 常见药物鉴别、检查及含量测定方法	215
2004 年国家执业药师资格考试药专业知识(一)全真模拟试题	220
答案	230

上篇 药理学

第一至四章 药理学总论

大纲要求

第一章 绪 言

1. 熟悉药理学的性质和任务。
2. 了解药理学的发展历程。

第二章 药效学

1. 掌握药物的基本作用 药物作用、药理效应、药物作用的两重性、对症治疗、对因治疗、副作用、毒性反应、后遗效应、停药反应、变态反应、特异质反应等。
2. 掌握药物的量效关系及主要术语 量反应、质反应、最小有效量、极量、半数有效量、半数致死量、效能、效应强度、治疗指数、安全范围。
3. 掌握受体的概念和特征。
4. 熟悉受体激动药、拮抗药、竞争性拮抗药和非竞争性拮抗药的概念。
5. 了解受体的类型及药物与受体相互作用的信号转导。

第三章 药物动力学

1. 掌握药物的吸收、分布及其影响因素, P450 酶系及其抑制剂和诱导剂, 药物排泄途径及影响肾排泄的因素, 血浆蛋白结合率和肝肠循环的概念。
2. 掌握药动学基本概念及其重要参数之间的相互关系 药时曲线下面积、生物利用度、药峰时间、药峰浓度、消除半衰期、表观分布容积、清除率等。

第四章 影响药物作用的因素

了解影响药物作用的药物方面和机体方面的因素。

重点和考点

第一章 绪 言

1. **药理学** 主要研究药物与机体(包括病原体)相互作用的规律和机制。
2. **药效学** 主要研究药物对机体的作用及其机制,即在药物的作用下,机体器官生理功能及细胞代谢活动发生变化的规律。
3. **药动学** 主要研究机体对药物的作用,即药物在体内的吸收、分布、代谢、排泄及其动态变化的规律。

第二章 药效学

2

一、药物作用及药理效应

1. **药物作用** 指药物与机体生物分子相互作用所引起的初始作用。
2. **药理效应** 指药物引起机体功能生理、生化的继发性改变,有兴奋和抑制两种基本类型:使机体功能增强的称为兴奋作用,使功能减弱的称为抑制作用。

药理效应具有专一性和选择性,药物在体内对某些组织器官产生明显的作用,而对其他组织器官作用很弱或几乎无作用,称为选择性。

二、药物作用的两重性

1. 治疗作用

(1) 对因治疗:消除原发致病因子,以便彻底治愈疾病,如抗生素杀灭体内病原微生物。

(2) 对症治疗:消除原发致病因子,以便改善疾病的症状,如阿司匹林退热。

2. 不良反应

(1) 副作用:治疗剂量下出现的与治疗目的无关的作用,是由于药物作用选择性低、作用广泛造成的。

(2) 毒性反应:药物剂量过大或用药时间过长,药物在体内蓄积过多造成的危害性反应。

(3) 后遗效应:停药后,血浆中药物浓度已降至阈浓度以下时残存的生物效应。

(4) 停药反应:突然停药后原有疾病加剧的现象,又称为反跳反应。

(5) 变态反应:药物引起的机体的免疫病理反应,又称为过敏反应,反应与药物

的药理作用和剂量无关。

(6) 特异质反应: 与遗传有关, 是由于机体生化机制的异常所致, 是一种遗传性生化缺陷, 比如红细胞葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏的病人, 服用磺胺药时引起的溶血反应。

三、剂量的概念及量效关系

最小有效量: 出现疗效所需的最小剂量; 最小中毒量: 出现中毒反应的最小剂量; 治疗量: 在最小有效量和最小中毒量之间, 可产生期望的疗效而又不易中毒的剂量; 极量: 达到最大的治疗作用但尚未引起毒性反应的剂量; 半数有效量(ED_{50}): 产生 50% 最大效应时的剂量; 半数致死量(LD_{50}): 引起半数动物死亡的剂量。

量反应: 药理效应的强度呈连续性量的变化, 可用数或量的分级表示, 如 B_p 、 H_r 等; 质反应: 药理效应表现出反应性质的变化, 只能用阳性或阴性表示, 也称全或无反应, 如生存或死亡等; 效能: 药物产生最大效应的能力, 反映药物的内在活性; 效应强度: 药物达到一定效应时所需的剂量, 反映药物与受体的亲和力。

四、药物的安全性评价

1. 治疗指数 LD_{50}/ED_{50} , 是评价药物安全性的指标之一, 比值越大越安全。

2. 安全范围 LD_5/ED_{95} , 也是评价药物安全性的指标, 其值越大越安全。

五、受体学说

1. 受体(R) 是指存在于细胞膜上、胞浆内或胞核中的大分子蛋白质, 能识别周围环境中某些微量化学物质, 首先与之结合, 并产生相应的药理效应。受体的主要特征是具有饱和性、专一性、可逆性、高灵敏性、高亲和性和多样性。

2. 配体(L) 是指能与受体特异结合的物质, 内源性配体有递质、激素等; 药物(D) 为外源性配体。

3. 激动药 既有亲和力, 又有内在活性。

(1) K_D (解离常数): 表示 L 与 R 的亲和力, 即引起 50% 最大效应时的药物浓度。 K_D 值越大, 表示 L 与 R 亲和力越小。

(2) pD_2 (亲和力常数): 反映激动药与 R 的亲和力, $pD_2 = -\log K_D$, 数值越大表示亲和力越强。

(3) 完全激动药: 内在活性为 1。

(4) 部分激动药: 内在活性在 0~1 之间。

4. 拮抗药 只有亲和力, 无内在活性(0)。

(1) pA_2 : 反应竞争性拮抗药的拮抗强度, 数值越大表示拮抗强度越强。

(2) 竞争性拮抗药: 指与激动药互相竞争与 R 结合, 结合是可逆的, 量效曲线平行右移, 最大效应(E_{max}) 不变。

(3) 非竞争性拮抗药: 与 R 的结合是不可逆的, 量效曲线最大效应(E_{max}) 下降。

第三章 药物动力学

一、药物的转运

药物的转运指药物的吸收、分布、排泄;药物的代谢称为生物转化。

1. 药物的被动转运 分为简单扩散和滤过两种。

简单扩散(大多数药物以此方式转运),影响因素主要有:

- (1) 药物的脂溶性:脂溶性高的药物扩散快。
- (2) 药物的解离度:解离度大的药物难以扩散。
- (3) 药物的解离常数(K_a)和体液的 pH:弱酸性药物在碱性环境中易解离,难以扩散;在酸性环境中不易解离,扩散快。

2. 药物的载体转运 分为主动转运和易化扩散两种。

3. 药物跨膜转运的主要方式及其特点(表上篇 3-1)。

表上篇 3-1 药物跨膜转运的主要方式及其特点

类 别	被动转运 简单扩散	载体转运	
		主动转运	易化扩散
浓度差	顺	逆	顺
扩散推动力	浓度差	能量	浓度差
载体	不需	需要	需要
竞争性抑制与饱和性	无	存在	存在
药物转运形式	大多数	少数	少数

二、药物的吸收

药物的吸收指药物从给药部位到血液循环的过程。

1. 胃肠道给药 口服是最常用的给药途径,有首关消除:指有些药物经胃肠道吸收后在进入体循环之前,首先在胃肠道或肝脏被灭活,使进入体循环的实际药量减少。舌下含服和直肠给药可避免之。

2. 注射给药 特点是吸收迅速而完全,但用药不方便。

- (1) 静脉注射:直接进入体循环。
- (2) 肌肉注射:血流丰富,吸收快。
- (3) 皮下注射:吸收均匀而缓慢。

3. 吸入给药 特点是吸收迅速,但剂量难以掌握。

4. 经皮给药 特点是吸收缓慢且不规则,不易控制剂量,作用持久。

三、药物的分布

药物的分布指药物从血液到组织器官的过程,主要影响因素有药物的理化性

质、体液 pH、血浆蛋白结合率、膜通透性。

1. 药物与血浆蛋白结合的特点 主要与白蛋白结合;结合是疏松、可逆的,结合型药物与游离型药物处于动态平衡之中;结合型药物暂时失去药理活性;结合后分子量变大,不能通过毛细血管壁,不被排泄,“储存”于血液中;结合有置换现象,当两个结合率高的药物合用时会出现置换作用,一种药物被另一种药物置换出来,导致前者在血浆中游离型药物的浓度急剧增加,引起毒性反应。

2. 生理屏障 血脑屏障、胎盘屏障。

四、药物的生物转化

药物主要在肝脏经生物转化失去药理活性。

1. 转化的类型和过程

(1) I 相反应: 氧化、还原、水解。

(2) II 相反应: 结合(葡萄糖醛酸、甘氨酸、硫酸等)。

2. 影响因素 促进药物生物转化的主要因素为肝微粒体中的细胞色素 P450 酶,其特点是对底物的选择性不高,活性的个体差异大。

(1) 药酶诱导剂: 使药酶活性增加,药物代谢加速,如苯巴比妥、利福平、卡马西平、灰黄霉素、苯妥英钠、地塞米松等。

(2) 药酶抑制剂: 使药酶活性减弱,药物代谢减慢,如氯霉素、别嘌醇、酮康唑、西咪替丁、异烟肼等。

5

五、药物的排泄

药物的排泄指药物通过排泄器官排出体外的过程。

1. 肾排泄 为主要排泄途径,影响因素主要为肾小管的重吸收和分泌作用。

(1) 肾小管的重吸收作用: 简单扩散的方式,改变尿液的 pH 可影响其重吸收,弱酸性药物在碱性尿液中解离度大,不易被重吸收;弱碱性药物在碱性尿液中解离度小,易被重吸收。如弱酸性药物苯巴比妥、水杨酸等中毒时,可用碱化尿液的方法增加其在尿液中的解离度,阻止其再吸收,加速排泄。

(2) 肾小管的分泌作用: 主动转运过程,两个分泌机制相同的药物合用时具有竞争性抑制作用,如丙磺舒竞争性抑制青霉素自肾小管的主动分泌,提高青霉素的血药浓度。

2. 胆汁排泄 由胆汁排泄到十二指肠的部分药物可在肠道被再吸收,形成肝肠循环,在药动学上表现为药时曲线出现双峰现象,药效学上表现为药物的作用明显延长,如洋地黄、地高辛和地西洋等。

3. 其他途径 乳汁、唾液、肺。

六、药动学参数及基本概念

1. 药时曲线下面积(AUC) 药时曲线分为吸收分布相(曲线的上升段)、平衡相(曲线的中间段)、消除相(曲线的下降段)三相。AUC 是评价药物吸收程度的一个重要指标。