

药理学辅导与练习

主 编 华希明

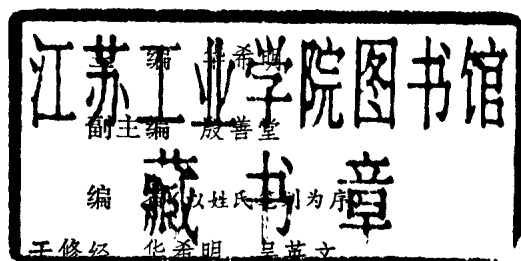
副主编 殷善堂

主 审 吴葆杰

山东大学出版社

中等卫生学校适用

药理学辅导与练习



胡克振 殷善堂

主 审 吴葆杰

山东大学出版社

药理学辅导与练习

主 编 华希明

副主编 殷善堂

山东大学出版社出版

山东省泰安市印刷厂印刷 山东省新华书店发行

开本 787×1092 1/32 印张 12.25 字数 300千字

1988年2月第一版 1988年2月第一次印刷

印数 1—15000册

ISBN 7—5607—0049—7/R·3

定价：2.70元

编写说明

本书是根据1986年颁发的全国中等卫生学校药理学教学大纲的要求，依据杨华书、王秀清分别主编的全国中等卫生学校药理学教材的内容，参考高校药理学教材及有关文献，集体编写的药理教学用书。可供护士、药剂士、助产士、医士、妇幼医士、口腔医士、放射医士等专业在校学生学习的辅导和练习用；也可供医药卫生人员晋升学习及考核选用。

全书内容基本按教材顺序编写，每章或节包括学习要点、参考材料和练习题目。学习要点中简要叙述了教学大纲中规定的重点内容；在参考材料中对药理教学中的疑难问题作了深入的解释，并选编了与学习药理有密切联系的基础和临床知识；练习题目有名词解释、问答题、填空题、是非题、选择题、处方分析等多种类型，多数在书后附有答案；题目前印有“△”号者，因阅过教材及本书学习要点后较易解答，或为培养读者独立解决问题的能力，未编答案。学习要点与参考材料中编入的药物，凡属中国药典1985年版收载者，其正名均与该版药典一致。但在练习题目及其答案中，为让读者熟悉药物的各种异名，有意的在不同条目中对同一药物采用不同名称，故与药典规定不完全一致。

在编写过程中得到了各编写者所在单位及山东省中等卫

校药理学校际学科委员会的大力支持和帮助，王家山讲师为本书绘制了插图，山东大学出版社对本书的出版给予了通力合作和指导，在此一并致以衷心的感谢。

由于我们水平有限，编写经验缺乏，书中定会有缺点和错误，希望同志们批评、指正。

编 者

1987年3月

目 录

第一章 药理学总论	1
第二章 传出神经系统药理概述	23
第三章 拟胆碱药和抗胆碱药	35
第四章 拟肾上腺素药和抗肾上腺素药	52
第五章 麻醉药	72
第六章 镇静催眠药	81
第七章 抗癫痫药	92
第八章 抗精神失常药	100
第九章 抗震颤麻痹药	107
第十章 镇痛药	113
第十一章 解热镇痛抗炎药	125
第十二章 中枢兴奋药	137
第十三章 作用于心血管系统的药物	143
第一节 治疗心功能不全药	143
第二节 抗心律失常药	156
第三节 抗心绞痛药	167
第四节 抗高血压药	175
第十四章 利尿药和脱水药	190
第十五章 组胺和抗组胺药	198
第十六章 作用于呼吸系统的药物	205
第十七章 作用于消化系统的药物	216

第十八章	子宫兴奋药	225
第十九章	作用于血液与造血系统的药物	229
第二十章	调节水盐代谢和酸碱平衡的药物	240
第二十一章	维生素类药物	247
第二十二章	激素类药物和避孕药	257
第二十三章	抗微生物药	270
第一节	概述	270
第二节	抗生素	278
第三节	磺胺药和甲氧苄氨嘧啶	298
第四节	抗结核病药	305
第二十四章	抗寄生虫病药	311
第一节	抗疟药	311
第二节	抗阿米巴病药	316
第三节	抗血吸虫病药	319
第四节	抗肠虫病药	321
第二十五章	抗恶性肿瘤药	324
第二十六章	解毒药	330
第二十七章	诊断用药	334
第二十八章	药物相互作用	336
练习答案		341

第一章 药理学总论

学 习 要 点

(一) 药物和药理学的概念

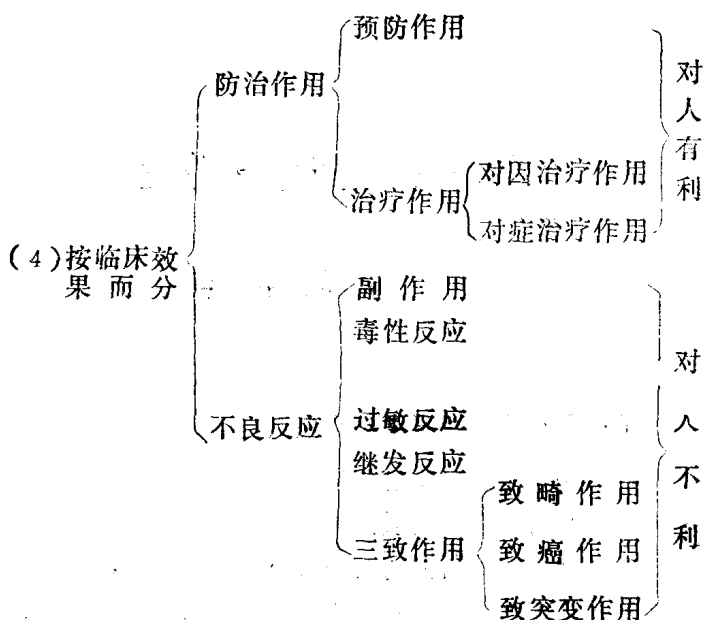
1. 药物 是可影响机体机能，用于预防、治疗、诊断疾病或计划生育的化学物质。

2. 药理学 是研究药物与机体间相互作用，着重阐明应用药物防治疾病的道理及其规律的一门科学。其中包括药物效应动力学（药效学）和药物代谢动力学（药动学），前者研究药物对机体的作用，后者研究机体对药物的影响。

(二) 药效学

1. 药物作用类型

- | | |
|-----------------|--|
| (1) 按对机体机能的影响而分 | { 兴奋作用——增强机能
抑制作用——减弱机能 |
| (2) 按作用的选择性而分 | { 选择作用——有选择性
普遍细胞作用——有普遍性 |
| (3) 按吸收前后而分 | { 局部作用——呈现于药物吸收入血之前
吸收作用——呈现于药物吸收入血之后 |



2. 药物作用原理

(1) 与受体结合 受体是位于细胞膜或细胞内能选择地与一定化学物质结合而引起一定效应的特殊蛋白质。正常情况下，受体是选择性地与生理性化学物质相结合而被激动，引起生理效应。许多药物也可与受体结合。化学物质与受体结合的能力称为亲和力，其与受体结合时可激动受体的性能则称为内在活性。对受体既有一定亲和力，又有一定内在活性的药物，可激动受体，而引起生理效应，称为受体激动药（兴奋药）；对受体有一定亲和力，但无内在活性的药物，可阻断受体而对抗生理效应，称为受体阻断药（对抗药）。有些药物介于二者之间，其亲和力不弱，内在活性较弱，对受体既激动（单独作用时）又阻断（与内在活性较强

的受体激动物共存时)，其中以激动作用为主者称为部分激动药，以阻断作用为主者称为部分阻断药。

(2) 其它原理 改变理化性质、改变酶活性、影响代谢、影响生物膜功能或影响活性物质的体内过程等。

(三) 药动学

1. 药物的转运

(1) 转运方式

① 被动转运 $\left\{ \begin{array}{l} \text{简单扩散} \\ \text{(多数药物如此转运)} \\ \text{易化扩散} \\ \text{(需载体或通道)} \end{array} \right\} \begin{array}{l} \text{顺浓度差或电位} \\ \text{差, 不需供能。} \end{array}$

② 主动转运 需泵(耗能载体)，可逆浓度差进行，需供能。

(2) 吸收

① 影响吸收的因素 药物及其制剂的性状、给药途径、胃肠活动、吸收环境的 pH 值及有关物质、局部血流等皆可影响药物的吸收。

② 生物利用度 是指药剂被机体吸收利用的程度。其计算公式如下：

$$\text{生物利用度} = \frac{\text{实际吸收药量}}{\text{给药量}} \times 100\%$$

③ 首次通过(第一关卡)效应 口服吸收的某些药物，在首次通过肠粘膜及肝脏时，可经受代谢灭活，致进入体循环的药量减少，此现象称首次通过(第一关卡)效应。

④ 吸收对作用的影响 药物被吸收越快越多，其吸收作

用就越快越强，而局部作用则越短越弱。

(3) 分布

①影响分布的因素 药物的理化性质、体液的 pH、药物与血浆蛋白的结合率、药物与组织的亲和力、细胞膜屏障等皆可影响药物的分布。

②分布对作用的影响 药物作用的强度取决于药物在靶器官分布的浓度。

(4) 排泄

①肾脏排泄 尿量及尿液 pH 可影响药物的排泄。

②胆汁排泄 某些药物可经肝进入胆汁而排入肠道，然后随粪便排出或再被吸收而形成肝肠循环(肠肝循环)。

③其它排泄途径 有些药物可经乳汁排出而影响乳儿；挥发性药物可经肺随呼气排出。

④排泄对作用的影响 一般来说，药物排泄快者作用时间短，排泄慢者作用时间长。

2. 药物的转化

(1) 转化方式 氧化、还原、水解、结合。

(2) 影响转化的因素

①肝脏功能 使体内药物转化的主要器官是肝脏。肝脏功能健全时，药物转化容易；肝脏功能不良时，则药物转化困难。

②药酶活性 肝内药酶能促进药物转化，该酶活性如何对药物转化影响很大。药酶活性又受药酶诱导剂和药酶抑制剂的影中。

· (3) 转化对作用的影响 药物转化后多失去原有的药理作用，但也有些药物经转化后的产物仍有或才有药理作用。

3. 药物的消除

(1) 消除方式 有转化及排泄等方式。

(2) 半衰期($t_{1/2}$)

① 血浆半衰期 是指血浆中药物浓度下降一半所需的时间。一般所说的半衰期即指血浆半衰期。一般用药间隔时间宜接近或等于半衰期。如每个半衰期用药一次，经4~5个半衰期后血中药物可达稳态浓度——坪值。

② 生物半衰期 是指药物引起的生物效应下降一半所需的时间。

(3) 消除类型

① 恒比消除 如每经一定时间，药物按恒定比值进行消除，称为恒比消除。临床用药多如此消除，半衰期恒定。

② 恒量消除 如每经一定时间，药物按恒定数量进行消除，称为恒量消除。药物用量超过机体对其消除能力时则如此消除，半衰期不恒定。

4. 药物的蓄积 在所用药物尚未自体内完全消除的情况下，再反复用药使体内药量积累而增多的过程称为药物的蓄积。适度的蓄积可提高疗效。过度的蓄积可引起中毒。

(四) 影响药物作用的因素

1. 药物 结构、性状及剂量等皆可影响药物作用。在一定范围内，剂量愈大，作用愈强。随着剂量的增加所引起的最大效应称为效能。而在一定剂量时所引起的效应的强度则称为效价（可用等效剂量表明之：等效剂量愈小表示效价愈强）。剂量过大可致中毒或死亡，特别是毒药和剧药用量过大易发生危险，应注意安全。一般将最小有效量与最小中毒量之间的范围称为安全范围。临床应用的常用量和极量（一

般不得超过此量)皆在安全范围之内。一般将半数致死量(LD_{50})与半数有效量(ED_{50})的比值称为治疗指数(LD_{50}/ED_{50} =治疗指数)。安全范围或治疗指数愈大,用药愈安全。

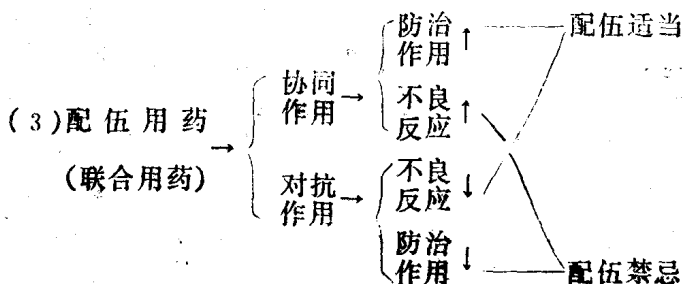
2. 机体 年龄、体重、性别、病理状态或精神状态不同的人用药后发生的反应会有差别。即使在年龄、体重、性别等条件都相同的情况下,也会有少数个体对药物的反应强度或性质与一般个体有差异,即个体差异,可表现为耐受性、高敏性或特异质等差异性。

3. 用法

(1) 给药途径 常用者有口服与注射,各有特点,比较如下:

给药途径	方法	安全性	费用	生效时间	易被消化液破坏的药物	昏迷、呕吐和吞咽困难的患者
口服	简便	大	少	慢	不适用	不适用
注射	复杂	小	多	快	适用	适用

(2) 反复用药 有些药物反复应用可引起习惯性或成瘾。易成瘾的毒性药品称为麻醉药品,应严加管理。



(五) 药物制剂的类型及处方法

1. 制剂的类型 (剂型)

(1) 溶液剂 一般是不挥发性药物的水溶液。可供口服或外用。

(2) 合剂 是多种药物配制成的供口服用的水溶液或混悬液。

(3) 注射剂 是供注射用的药物灭菌溶液、混悬液或粉末。

(4) 酊剂 是药物的乙醇浸出液或溶液。可供口服或外用。

(5) 片剂 是药物经加工压制成片状的制剂。以口服为主, 有的供外用或植入用。

(6) 冲剂 是药物的细粉或提取物与糖粉调和制成干燥颗粒状的用水冲化内服的制剂

(7) 散剂 是一种或多种药物混合制成的粉末状制剂。可供口服或外用。

(8) 胶囊剂 是将药物装于胶囊中供口服用的制剂。

(9) 软膏剂 是药物与适宜基质制成具有适当稠度的膏状外用制剂。

(10) 眼膏剂 是药物与适宜的基质制成供眼用的细腻灭菌软膏。

2. 处方法 按个计数的制剂宜用单量法开写处方。不按个计数的制剂用宜总量法开写处方。

参 考 材 料

(一) **药物的直接作用与间接作用** 药物对其直接接触的机体部位所产生的原发性影响称为直接作用。多数药物的直接作用都有一定的选择性。由于直接作用的结果而呈现的继发性影响称为间接作用。药物的间接作用可通过神经反射或体液联系而发生。无论药物是呈现局部作用还是呈现吸收作用时，虽其直接作用会有一定的局限性或选择性，但都可通过间接作用引起广泛性或全身性反应。

(二) **过敏反应** 是机体免疫系统被抗原激活后所发生的病理性免疫反应。多数药物为低分子化合物，本身无完全抗原性，单独不能激活机体免疫系统产生免疫反应。但有些药物具有半抗原性，能与蛋白质结合成完全抗原，激活机体免疫系统，再次接触可引起病理性免疫反应——过敏反应。这种反应有下列特点：

1. 仅见于少数个体，与体质特异（过敏体质）有关。
2. 有的人血中可发现相应抗体，并在过敏试验时引起阳性反应。
3. 不同药物引起的过敏反应症状可以相同，常见反应有发热、皮疹、过敏性休克等。
4. 与剂量关系不大。

(三) **药物与受体结合的方式** 药物与受体可通过下列化学键而结合：

1. **范德华氏键** 是两个不同分子的任何两个原子彼此接近时互相吸引而形成的化学键。其结合力弱，但如药物的立

体结构与受体吻合，可形成很多这样的键而结合力加强。

2. 氢键 结合力比范德华氏键稍强。在生物学中这种结合多以两个氧原子（或一个氧原子和一个氮原子）与一个氢原子连接。

3. 离子键 是由电荷相反的离子互相吸引而形成的化学键。其结合有力，但不稳定。

4. 共价键 是由于原子和原子通过共用电子对而产生的结合力。

药物与受体多数通过离子键、氢键或范德华氏键相结合，是可逆的；少数是通过共价键而牢固地结合，这种结合难逆或不可逆。

（四）药物对受体作用的方式 对这方面问题的解释有下列学说：

1. 占领学说 认为药物与受体结合后使受体被活化而引起效应，效应的大小与被结合（占领）的受体数目成正比。现知并非全部受体都被激动药占领后才引起最大效应。

2. 速率学说 认为药物引起的效应的强弱取决于药物-受体复合物的解离速率。受体激动药与受体结合形成复合物后又迅速解离，每次结合发生碰撞时就提供一个能量来源，产生刺激作用。受体阻断药与受体结合后难解离或不解离，从而占据受体而对抗受体激动物的作用。部分激动药与部分阻断药则处于受体激动药与受体阻断药之间。解离速率是决定药物内在活性的因素之一。

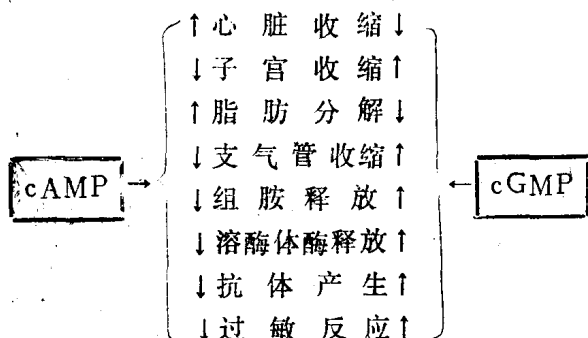
3. 变构学说（二态模型学说） 认为受体有两种构象状态，即活化状态与失活状态，且可互变。活化状态的受体与受体激动药有亲和力，两者结合时可引起生理效应；失活状

态的受体与受体阻断药有亲和力，两者结合后不引起生理效应。

(五) 受体激动后引起效应的作用原理

1. 细胞膜受体作用原理

(1) 激活酶 有些物质激动有关受体后，是通过激活腺苷酸环化酶或鸟苷酸环化酶，促使环磷酸腺苷(cAMP)或环磷酸鸟苷(cGMP)的形式，引起效应。cAMP与cGMP为广泛存在于生命组织中在细胞内起调节作用的一个环核苷酸，它们既可调节生理机能，又可传递药理信息，并可参与病理过程。在许多方面，这两种环核苷酸的作用相反，现将它们的作用比较如下：



(2) 改变膜通透性 有的物质激动相应受体后可使突触后细胞膜对离子通透性发生变化，导致除极化而使细胞兴奋或导致超极化而使细胞抑制。

2. 细胞内受体作用原理 甾体激素可进入靶细胞内，与细胞内受体结合，形成活性复合物进入细胞核，作用于DNA