

21 世纪高等医学院校教材应试辅导丛书

药理学

主编 张小毅 李生莹



- 教材辅导——针对最新人卫 6 版教材
- 应试完全手册——理解 大纲要求
掌握 内容精讲
精通 各类题型
熟练 应试题库
详读 参考答案



第二军医大学出版社

21 世纪高等医学院校教材 **应试新考**丛书

药 理 学

主 编	张小毅	李生莹	
副主编	黄素培	蒋立新	宋 昊
	李继煜	杨宇平	
编 委	李生莹	宋 昊	赵智慧
	张小毅	黄素培	蒋立新
	杨宇平	李继煜	

第二军医大学出版社

图书在版编目(CIP)数据

药理学/张小毅,李生莹主编. —上海:第二军医大学出版社,2005.5
(21世纪高等医学院校教材应试辅导丛书)

ISBN 7-81060-516-X

I. 药... II. ①张...②李... III. 药理学—医学院校—教学参考资料 IV. R96

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2004)第 125458 号

责任编辑 尹 茶

药 理 学

主 编 张小毅 李生莹

第二军医大学出版社出版发行

上海市翔殷路 800 号 邮政编码:200433

发行科电话/传真:021-65493093

全国各地新华书店经销

上海锦佳装璜印刷发展公司印刷

开本: 850×1168 1/32 印张: 16.125 字数: 561 千字

2005 年 5 月第 1 版 2005 年 5 月第 1 次印刷

印数:1~4 000 册

ISBN 7-81060-516-X/R · 372

定价:24.00 元

序

“健康所系，生命相托”。医学生的水平决定着人类的生存质量，医学教育的质量维系着一代又一代医务工作者的医疗水平。为了适应目前迅速发展的医学教育的需要，帮助医学生掌握正确的学习、复习和考试技巧，指导他们出色地通过各类考试，提高他们的思维应变能力，我们特组织一批长期从事医学教育与临床实践，具有丰富教学经验与临床经验的专家、教授，编写了这套“21 世纪高等医学院校教材应试辅导丛书”。

本套丛书以人民卫生出版社最新出版的全国高等医学院校规划教材为基础，以全国统一制定的教学大纲为准则，结合本科生、研究生和执业医师考试实际，总结各位专家、教授数十年的教学和评卷经验，按照现代考试模式编写而成。

本套丛书力求语言简练，重点突出，针对难点、考点讲解详尽，力求选题合理，答案准确。为了便于学习，各分册的编写体例基本以规化教材章节为序。每章分“大纲要求”“内容精讲”“各类试题”“参考答案及解析”四部分。各类试题共设名词解释、填空题、判断题、单项选择题、多项选择题、问答题、论述题等题型，临床科还有病案分析。试题力求信息量大、覆盖面广、重点突出，以全面测试学生的知识面和分析问题、判断问题与解决问题的能力。书后附有模拟考试题。

本套丛书适用于本科院校在校学生考试、研究生考试、执业医师考试及医务工作者在岗考试等复习使用。由于编写能力有限，丛书中不妥之处在所难免，衷心期盼同道专家及读者批评指正。

丛书编写组

2004 年 12 月

答题说明

1. 名词解释:根据教材中的定义、解释,准确回答。
2. 填空题:要求答案简洁明了。
3. 判断题:判断一段文字描述的对错,回答“对(√)”或“错(×)”,无需解题。
4. 单项选择题:包括肯定的和否定的单个最佳选择题两种,答题时要从5个备选答案中选出1个最合适的答案。
5. 多项选择题:共有5个被选答案,从被选答案中挑选2个或2个以上正确答案。
6. 问答题:要求答案条理清晰,言简意赅,内容全面。

目 录

第一章	药理学总论—绪言	(1)
第二章	药物代谢动力学	(6)
第三章	药物效应动力学	(20)
第四章	影响药物效应的因素	(32)
第五章	传出神经系统药理概论	(39)
第六章	胆碱受体激动药	(48)
第七章	抗胆碱酯酶药和胆碱酯酶复活药	(55)
第八章	胆碱受体阻断药(Ⅰ)—M胆碱受体阻断药	(65)
第九章	胆碱受体阻断药(Ⅱ)—N胆碱受体阻断药	(74)
第十章	肾上腺素受体激动药	(82)
第十一章	肾上腺素受体阻断药	(92)
第十二章	中枢神经系统药理学概论	(102)
第十三章	全身麻醉药	(108)
第十四章	局部麻醉药	(116)
第十五章	镇静催眠药	(124)
第十六章	抗癫痫药和抗惊厥药	(135)
第十七章	治疗中枢神经系统退行性疾病药	(144)
第十八章	抗精神失常药	(154)
第十九章	镇痛药	(167)
第二十章	解热镇痛抗炎药	(177)
第二十一章	离子通道概论及钙通道阻滞药	(188)
第二十二章	抗心律失常药	(197)
第二十三章	肾素-血管紧张素系统药	(209)
第二十四章	利尿药及脱水药	(217)
第二十五章	抗高血压药	(227)
第二十六章	治疗充血性心力衰竭的药物	(240)

第二十七章	抗心绞痛药	(252)
第二十八章	调血脂药与抗动脉粥样硬化药	(260)
第二十九章	作用于血液及造血器官的药物	(268)
第三十章	影响自体活性物质的药物	(280)
第三十一章	作用于呼吸系统的药物	(297)
第三十二章	作用于消化系统的药物	(306)
第三十三章	子宫平滑肌兴奋药和抑制药	(318)
第三十四章	性激素类药及避孕药	(324)
第三十五章	肾上腺皮质激素类药物	(332)
第三十六章	甲状腺激素及抗甲状腺药	(344)
第三十七章	胰岛素及口服降血糖药	(351)
第三十八章	抗菌药物概论	(358)
第三十九章	β -内酰胺类抗生素	(367)
第四十章	大环内酯类、林可霉素类及多肽类抗生素	(378)
第四十一章	氨基糖苷类抗生素	(387)
第四十二章	四环素类及氯霉素类抗生素	(396)
第四十三章	人工合成抗菌药	(404)
第四十四章	抗病毒药和抗真菌药	(413)
第四十五章	抗结核病药及抗麻风病药	(421)
第四十六章	抗寄生虫药	(429)
第四十七章	抗恶性肿瘤药物	(445)
第四十八章	影响免疫功能的药物	(456)
第四十九章	基因治疗	(465)
模拟试题(一)		(471)
模拟试题(二)		(480)
模拟试题(三)		(488)
模拟试题(四)		(497)
模拟试题(五)		(504)

第一章 药理学总论—绪言

大纲要求

本章应掌握药理学定义;区分药物与毒物;了解药理学的研究对象和学科任务;了解《本草纲目》的贡献及我国药理学的发展简史。

内容精讲

药物(drug)是指可以改变或查明机体的生理功能及病理状态,可用以预防、诊断和治疗疾病的化学物质。毒物是指较小剂量即对机体产生毒害作用,损害人体健康的化学物质。药物和毒物之间并无严格界限,任何药物剂量过大都可产生毒性反应。

药理学(pharmacology)是研究药物的学科之一,是一门为临床合理用药防治疾病提供基本理论的医学基础学科;是研究药物与机体(含病原体)相互作用及其规律和原理的科学,它包括药物对机体的作用及作用机制(即药物效应动力学)以及药物在机体影响下所发生的变化及其规律(即药物代谢动力学)。

药理学是一门实验性学科,它通过动物实验研究和临床研究,阐明药物对机体的作用效应及其原理以及药物在体内的吸收、分布、代谢和排泄过程和这些过程中药物在血液中浓度的变化。在这基础上达到指导临床合理用药,设计和寻找新药以及发展祖国医药学遗产的目的。

药理研究是新药开发和研究中必不可少的关键步骤。新药研究过程包括临床前研究、临床研究和上市后药物监测等过程。

药理学是基础医学与临床医学以及医学与药学的桥梁学科,学习时应了解和掌握药理学的基础规律(药物效应动力学和药物代谢动力学),各类药物中的代表药及常用药物的体内过程、药理作用和临床应用、不良反应以及禁忌证。

应试题库

【名词解释】

1. 药物(drug)
2. 药理学(pharmacology)

3. 药物效应动力学(pharmacodynamics)
4. 药物代谢动力学(pharmacokinetics)
5. 售后调研(post-marketing surveillance)

【填空题】

1. 明代李时珍所著的____是世界闻名的药物学巨著,共收载药物____种,现已译成____种文本。
2. 我国最早的本草著作是____,该书收载____种中药。我国第一部由政府颁发的“药典”是____。
3. 药理学的分支学科有____药理学、____药理学、____药理学、____药理学和____药理学等。
4. 新药研究过程大致分三步,即____、____和____。
5. 新药的临床前研究包括用____进行的____研究和____。

【判断题】

1. 药理学是指导合理用药防治疾病的理论基础,达到安全、有效地防治和诊断疾病。()

【单项选择题】

1. 药物的定义是 ()
A. 一种化学物质 B. 能影响机体生理功能的物质
C. 能干扰细胞代谢活动的化学物质 D. 用以防治及诊断疾病的物质
E. 有滋补、营养、保健、康复作用的物质
2. 药理学研究的主要对象是 ()
A. 药物 B. 机体 C. 器官
D. 化学 E. 作用
3. 药效学是研究 ()
A. 药物的临床疗效 B. 如何改善药物质量
C. 机体如何对药物进行处理 D. 提高药物疗效的途径
E. 在药物影响下机体细胞功能如何发生变化
4. 药代动力学是研究 ()
A. 药物如何影响机体 B. 药物在体内的时间变化
C. 药物效应动力学 D. 机体如何对药物进行处理
E. 合理用药的治疗方案
5. 具有肯定药理效应的药物是 ()

- A. 无效的 药物 B. 有效的 药物 C. 使用过的 药物
D. 没有使用过的 药物 E. 不一定都是临床有效的 药物

【多项选择题】

1. 药理学的学科任务包括 ()
 - A. 阐明药物作用机制
 - B. 研究药物合成及药用植物栽培
 - C. 开发新药,发现药物新用途
 - D. 改善药物质量,提高药物疗效
 - E. 为探索细胞生理生化及病理过程提供实验资料
2. 药理学是 ()
 - A. 研究药物与机体相互作用规律
 - B. 研究药物与机体相互作用原理
 - C. 为临床合理用药提供基本理论
 - D. 为防病和治病提供基本理论
 - E. 医学基础科学
3. 临床药理学是 ()
 - A. 以临床病人为研究和服务对象的应用科学
 - B. 将药理学的基本理论转化为临床应用技术
 - C. 将药理效应转化为实际疗效
 - D. 基础药理学的后继部分
 - E. 药物治疗学的基础
4. 新药研究过程包括 ()
 - A. 临床前研究
 - B. 毒性研究
 - C. 临床研究
 - D. 疗效观察
 - E. 上市后药物监测
5. 关于新药开发与研究,下列叙述哪些正确 ()
 - A. 安慰剂是不含活性药物的制剂
 - B. 双盲法是药剂人员和病人都不能辨别试验药品和对照品
 - C. 单盲法是病人不能辨别试验药品和对照品
 - D. 售后调研是在药物广泛推广使用中重点了解长期使用后出现的不良反应和远期疗效
 - E. 临床前研究是要弄清药物的作用谱和可能发生的毒性反应

【问答题】

1. 药理学的性质和任务是什么?
2. 试述药物代谢动力学及药物效应动力学的规律对运用药物的重要意义。
3. 试述药理学在新药开发中的作用和地位。

参考答案

【名词解释】

1. 药物一般是指可以改变或查明机体生理功能及病理状态,可用以防、治、诊断疾病的化学物质。
2. 药理学是研究药物和机体(包括病原体)相互作用及作用规律的科学,主要由药动学和药效学两部分组成。
3. 药物效应动力学简称药效学,研究药物对机体的作用及作用机制。
4. 药物代谢动力学简称药动学,研究药物在机体的影响下所发生的变化及其规律。
5. 售后调研指新药上市后进行的社会性考察与评价,重点了解长期使用后出现的不良反应和远期疗效(包括无效病历)。

【填空题】

- 1.《本草纲目》 1892 7
- 2.《神农本草经》 365 《新修本草》
- 3.临床 生化 分子 免疫 遗传
- 4.临床前研究 临床研究 上市后药物监测
- 5.动物 系统药理 急慢性毒性观察

【判断题】

1. ✓

【单项选择题】

1. D 2. B 3. E 4. D 5. E

【多项选择题】

1. ACDE 药理学学科任务是为阐明药物作用机制,改善药物质量,提高药物疗效,开发新药、发展药物新用途,并为探索细胞生理生化及病理过程提供实验资料。药物合成属制药学,而药用植物栽培属生药学,两者均属于研究药物本身的药科学。

2. ABCDE 3. ABCD 4. ACE 5. ACDE

【问答题】

1. 药理学是研究药物和机体(包括病原体)相互作用规律及其原理的科学,主要由药效学和药动学两部分组成。它以生理学、生物化学、病理学等作基础,是指导临床各科合理用药及提供理论依据的桥梁学科。其任务是为阐明药物作用机

制,改善药物质量,提高药物疗效,开发新药并为探索细胞生理、生化及病理过程提供实验资料。

2. 为了发挥并维持药物的作用,形成和维持药物在体内的有效浓度,必须按照药物的药代动力学规律制定给药方案。

3. 根据药物的构效关系可指导合成新药;新药在进行临床研究前需提供其有关药效学、药代动力学和毒理学资料,以作为指导用药的参考。

第二章 药物代谢动力学

大纲要求

本章应了解药物代谢动力学的概念;了解药物代谢动力学是研究药物在体内的过程及其动态变化规律;熟悉药物在体内(特别是在血中)的浓度与药物效应的密切关系;掌握药物的体内过程的具体内容及其与用药的关系。

内容精讲

药物代谢动力学是研究药物在体内吸收、分布、代谢和排泄过程,并还用数字原理和方法阐述药物在体内的量变规律。这些参数对于制定和调整给药方案有重要意义。

药物从进入机体到离开机体历经吸收、分布、代谢、排泄4个过程,这是机体对药物的处置。药物分子的跨膜转运方式有滤过(水溶性扩散)、简单扩散(脂溶性扩散)和载体转运(包括主动转运和易化扩散)。

药物吸收的速度和程度可受药物的理化性质、给药途径、药物剂型及生物利用度的影响。药物的首关消除和肝肠循环也可影响药物在血中的浓度。

大多数药物在血浆中均可与血浆蛋白不同程度的可逆性、暂时性的结合,这一结合可影响药物的转运以及药物的活性。不同药物之间可因与血浆蛋白的结合而发生竞争性排挤现象。药物的分布过程与它在血浆或靶组织的浓度相关。机体的各种屏障也可影响药物的分布。

药物代谢通常涉及Ⅰ相和Ⅱ相反应。氧化、还原、分解均为Ⅰ相反应。经Ⅰ相反应后,多数代谢产物是无活性的,但也有少数例外反而活化。在Ⅱ相反应过程中,Ⅰ相反应产物与内源性物质如葡萄糖醛酸、醋酸、甘氨酸等结合使药物活性降低或灭活,并使极性增加,易经肾脏排泄。

细胞色素 P_{450} 为一类亚铁血红素—硫醇盐蛋白的超家族,它参与内源性物质和包括药物、环境化合物在内的外源性物质的代谢。该酶系统的活性有限且个体差异很大,也可受到药物的影响。酶诱导剂可使其活性增加,酶抑制剂可使其活性降低,这一点与药物的相互作用关系密切。

药物的排泄多为被动转运,某些药物自肾小管的排泄(分泌)可为主动转运。

药物多自肾排泄,故肾功能对药物的排泄影响较大,具有重要的临床意义。其他的排泄途径还有经消化道排泄,经汗液、唾液、乳汁和皮肤排泄等。

药物的体内过程对于药物在体内形成和维持血药浓度都有密切关系,并因而影响药物作用开始的快慢、作用的强弱和持续时间的长短。

药物的消除动力学可分为一级消除动力学(线性动力学)及零级消除动力学(非线性动力学)。多数药物的消除动力学为一级消除动力学。消除速率常数 k_e 是重要的药物代谢动力学参数之一,反映体内药物的代谢和排泄速率。半衰期 ($t_{1/2}$) 是血浆药物浓度下降一半所需要的时间,它是表达药物清除速度的另一参数。按一级动力学消除的药物,如按 $t_{1/2}$ 的间隔给药,经过 4~5 个半衰期后,血药浓度可达稳定状态(稳态血药浓度)。

药物可按其在血浆消除的速率分成一室模型或二室模型的药物。表观分布容积是理论上或计算所得的表示药物应占有的体液容积。利用表观分布容积值可以从血浆浓度计算出机体内药物总量或计算出要求达到某一血浆有效浓度时所需的药物剂量。

应试题库

【名词解释】

1. 药物的吸收(absorption)
2. 药物的排泄(excretion)
3. 首关消除(first pass elimination)
4. 离子障(ion trapping)
5. 再分布(redistribution)
6. 生物利用度(bioavailability)
7. 稳态浓度(steady-state concentration, C_{ss})
8. 表观分布容积(apparent volume of distribution, V_d)
9. 半衰期($t_{1/2}$) (half life)
10. 一级消除动力学(first-order elimination kinetics)
11. 负荷剂量(loading dose)
12. 房室概念(compartment concept)

【填空题】

1. 机体对药物的处置包括____及____。
2. 药物在体内的过程有____、____、____和____。

3. pK_a 是该药在溶液中____离子化时的 pH 值。
4. 肝药酶的特点为____、____、____、____、____。
5. 被动转运即药物从浓度____的一侧向____的一侧扩散,不消耗____,不需____参与,不受____和____的影响,又称为____转运。
6. 经被动转运通过细胞膜的弱酸性药物,其转运环境的 pH 值越大,则药物呈离子状态者越____,由于呈离子状态者脂溶性____,所以此药通过细胞膜也越____。
7. 生理情况下,由于机体细胞外液的 pH 约为____,细胞内液的 pH 值约为____,故弱碱性药物____进入细胞,当弱碱性药物中毒时,可通过____化血液,从而使药物从____转入____,增加药物____解救之。
8. 药物通过生物转化,绝大多数成为____性高的____溶性产物,____从肾排泄。

【判断题】

1. 简单扩散是多数药物进入体内的机制,扩散速度除取决于机体方面的因素外,还取决于药物分子量、脂溶性及极性。 ()
2. 舌下给药比口服给药吸收迅速,所以舌下给药时首关消除量就比口服给药的大。 ()
3. 药物的生物转化常称为药物消除。 ()
4. 普萘洛尔口服,经肝代谢,使进入体循环的药量减少的现象为首关消除。 ()
5. 血浆蛋白结合率表示药物与血浆蛋白结合的程度,即血中与蛋白结合的药物占总药量的百分数。药物与血浆蛋白的结合是不可逆性的。 ()
6. 药物效应下降一半的时间为血浆半衰期。 ()
7. 经过肝脏首关消除过程后能被吸收入体循环的药物相对量和速度称生物利用度。 ()
8. 表观分布容积为一定量药物在体内分布平衡后,按测得的血浆浓度计算该药应占有的血浆容积。 ()
9. 弱酸性药物在 pH 值低的环境中解离度小,易跨膜转运。 ()

【单项选择题】

1. 大多数药物在体内通过细胞膜的方式是 ()
- A. 主动转运 B. 胞饮 C. 膜孔滤过
- D. 易化扩散 E. 简单扩散

2. 下列关于药物被动转运的叙述哪一条是错误的 ()
- A. 药物从浓度高侧向低侧扩散 B. 不消耗能量而需载体
C. 不受饱和限速与竞争性抑制的影响
D. 受药物分子量大小、脂溶性和极性影响
E. 当细胞膜两侧药物浓度平衡时转运停止
3. 下列关于药物主动转运的叙述哪一条是错误的 ()
- A. 可受其他化学品的干扰 B. 消耗能量
C. 有化学结构特异性 D. 比被动转运较快达到平衡
E. 转运速度有饱和限制
4. 易化扩散是 ()
- A. 不耗能, 不逆浓度差, 特异性高, 有竞争性抑制的主动转运
B. 不耗能, 不逆浓度差, 特异性不高, 有竞争性抑制的主动转运
C. 不耗能, 不逆浓度差, 特异性高, 有竞争性抑制的特殊转运
D. 耗能, 不逆浓度差, 特异性高, 有竞争性抑制的被动转运
E. 转运速度有饱和限制
5. 下列关于 pH 与 pK_a 和药物解离的关系叙述中哪个是错误的 ()
- A. $pH=pK_a$ 时, $[HA]=[A^-]$
B. pK_a 即是弱酸或弱碱性药液 50% 解离时的 pH 值, 每个药都有固定的 pK_a
C. pH 的微小变化对药物解离度影响不大
D. pK_a 小于 5 的弱碱性药物在肠道基本上都是解离型的
E. pK_a 大于 7.5 的弱酸性药在胃中基本不解离
6. 某弱酸性药在 $pH=4$ 的液体中有 50% 解离, 其 pK_a 值为 ()
- A. 2 B. 3 C. 4
D. 5 E. 6
7. 某碱性药物的 $pK_a=9.8$, 如果增高尿液的 pH 值, 则此药在尿中 ()
- 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. 排泄速度并不改变
8. 酸化尿液, 可使弱碱性药物经肾排泄时 ()
- A. 解离 $\uparrow$ 、再吸收 $\uparrow$ 、排出 $\downarrow$ B. 解离 $\downarrow$ 、再吸收 $\uparrow$ 、排出 $\downarrow$

- C. 解离↓、再吸收↓、排出↑ D. 解离↑、再吸收↓、排出↑
E. 解离↑、再吸收↓、排出↓
9. 在酸性尿液中弱酸性药物 ()
A. 解离多,再吸收多,排泄慢 B. 解离少,再吸收多,排泄慢
C. 解离多,再吸收多,排泄快 D. 解离少,再吸收少,排泄快
E. 以上都不对
10. 吸收是指药物进入 ()
A. 胃肠道过程 B. 靶器官过程 C. 细胞外液过程
D. 细胞内过程 E. 血液循环过程
11. 大多数药物在胃肠道的吸收是按 ()
A. 有载体参与的主动转运 B. 一级动力学被动转运
C. 零级动力学被动转运 D. 易化扩散转运
E. 胞饮的方式转运
12. 下列关于药物吸收的叙述中错误的是 ()
A. 皮下或肌注给药通过毛细血管吸收
B. 某些口服给药通过首关消除而吸收减少
C. 吸收是指药物从给药部位进入血液循环的过程
D. 舌下或肛肠给药可因通过肝破坏而效应下降
E. 皮肤给药除脂溶性大的以外都不易吸收
13. 临床上可用丙磺舒以增加青霉素的疗效,原因是 ()
A. 在杀菌作用上的协同作用 B. 两者竞争肾小管的分泌通道
C. 对细胞代谢有双重阻断作用 D. 延缓抗药性产生
E. 以上都不对
14. 下列关于可以影响药物吸收的因素的叙述中错误的是 ()
A. 饭后口服给药 B. 用药部位血流量减少
C. 微循环障碍 D. 口服生物利用度高的药吸收少
E. 口服经首关效应后破坏少的药物效应强
15. 与药物吸收无关的因素是 ()
A. 给药途径 B. 药物的剂型 C. 药物的理化性质
D. 药物与血浆蛋白的结合率 E. 药物的首关效应
16. 难以通过血脑屏障的药物是 ()
A. 分子大,极性高 B. 分子小,极性低 C. 分子大,极性低