

全国高等学校配套教材
供基础、临床、预防、口腔医学类专业用

药理学

学习指导及习题集

主 编 杨宝峰
副主编 苏定冯

 人民卫生出版社

全国高等学校配套教材

供基础、临床、预防、口腔医学类专业用

药理学学习指导及习题集

主 编 杨宝峰

副主编 苏定冯

编 者 (以姓氏笔画为序)

方理本 (浙江大学医学院)	杨宝峰 (哈尔滨医科大学)
乔国芬 (哈尔滨医科大学)	苏定冯 (第二军医大学)
任雷鸣 (河北医科大学)	陈红专 (上海第二医科大学)
张岫美 (山东大学医学院)	陈建国 (华中科技大学同济医学院)
李 俊 (安徽医科大学)	周宏灏 (中南大学湘雅医学院)
李 智 (中国医科大学)	姚明辉 (复旦大学医学院)
李学军 (北京大学基础医学院)	娄建石 (天津医科大学)
李晓辉 (第三军医大学)	胡 刚 (南京医科大学)
杨世杰 (吉林大学白求恩医学部)	颜光美 (中山大学中山医学院)

人 民 卫 生 出 版 社

图书在版编目 (CIP) 数据

药理学学习指导及习题集/杨宝峰主编. —北京:
人民卫生出版社, 2004. 11

ISBN 7 - 117 - 06461 - 7

I. 药… II. 杨… 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 103805 号

药理学学习指导及习题集

主 编: 杨 宝 峰

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: 原创阳光印业有限公司

经 销: 新华书店

开 本: 787×1092 1/16 印张: 19.75

字 数: 461 千字

版 次: 2005 年 1 月第 1 版 2005 年 1 月第 1 版第 1 次印刷

标准书号: ISBN 7 - 117 - 06461 - 7/R · 6462

定 价: 26.00 元

版权所有, 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)

前 言



《药理学学习指导及习题集》是全国高等学校五年制临床医学专业第6版规划教材《药理学》的配套学习教材，是由该教材参编者共同编写完成的。供高等医药院校本科生、研究生、医师和药师资格考试及医药工作者学习和应试的参考用书。

全书共49章，内容包括学习重点、学习提纲、试题及答案。试题包括：单项选择题、多项选择题、填空、名词解释、简答题和论述题。试题反映了药理学教学大纲的要求，突出药理学基本理论和基本知识，编写内容主要涉及常用药的药理作用、作用机制和临床应用，重要的药代动力学、构效关系、药物相互作用、不良反应和禁忌证等方面的知识。着重培养学生的独立自学、勤于思考、综合分析和解决问题的能力。

本书知识点新、内容系统、题型全面、试题量大、难易不一。通过本辅导教材的学习，能帮助学生更好的理解和掌握全国高等学校五年制临床医学专业《药理学》第6版教材，是学生学好药理学的良师益友。更可作为教师备课、讲课、选题及对各类考生命题时的参考教材。

本书编写得到了参编单位的大力支持，哈尔滨医科大学药理教研室的老师做了大量的编务工作，在此表示衷心感谢。

希望广大师生在使用本书过程中，提出宝贵意见。

杨宝峰 苏定冯

2004. 7

目 录



第一章 药理学总论—绪言	1
第二章 药物代谢动力学	3
第三章 药物效应动力学	23
第四章 影响药物效应的因素	31
第五章 传出神经系统药理概论	33
第六章 胆碱受体激动药	37
第七章 抗胆碱酯酶药和胆碱酯酶复活药	40
第八章 胆碱受体阻断药 (I) —M 胆碱受体阻断药	44
第九章 胆碱受体阻断药 (II) —N 胆碱受体阻断药	49
第十章 肾上腺素受体激动药	52
第十一章 肾上腺素受体阻断药	61
第十二章 中枢神经系统药理学概论	69
第十三章 全身麻醉药	76
第十四章 局部麻醉药	79
第十五章 镇静催眠药	84
第十六章 抗癫痫药和抗惊厥药	87
第十七章 治疗中枢神经系统退行性疾病药	93
第十八章 抗精神失常药	99
第十九章 镇痛药	106
第二十章 解热镇痛抗炎药	115
第二十一章 离子通道概论及钙通道阻滞药	122
第二十二章 抗心律失常药	127
第二十三章 肾素-血管紧张素系统药理	133
第二十四章 利尿药和脱水药	138
第二十五章 抗高血压药	144
第二十六章 治疗充血性心力衰竭的药物	151
第二十七章 抗心绞痛药	164
第二十八章 调血脂药与抗动脉粥样硬化药	170
第二十九章 作用于血液及造血器官的药物	177
第三十章 影响自体活性物质的药物	188



第三十一章	作用于呼吸系统的药物	197
第三十二章	作用于消化系统的药物	204
第三十三章	子宫平滑肌兴奋药和抑制药	210
第三十四章	性激素类药及避孕药	212
第三十五章	肾上腺皮质激素类药物	219
第三十六章	甲状腺激素及抗甲状腺药	229
第三十七章	胰岛素及口服降血糖药	236
第三十八章	抗菌药物概论	243
第三十九章	β -内酰胺类抗生素	248
第四十章	大环内酯类、林可霉素类及多肽类抗生素	256
第四十一章	氨基糖苷类抗生素	260
第四十二章	四环素类及氯霉素类抗生素	266
第四十三章	人工合成抗菌药	271
第四十四章	抗病毒药和抗真菌药	279
第四十五章	抗结核病药及抗麻风病药	283
第四十六章	抗寄生虫药	287
第四十七章	抗恶性肿瘤药物	296
第四十八章	影响免疫功能的药物	304
第四十九章	基因治疗	309

第一章

药理学总论—绪言

[学习重点]

掌握药理学的性质与任务。

了解药物与药理学的发展史及新药的开发与研究。

[学习提纲]

药理学(pharmacology)是研究药物与机体(含病原体)相互作用及作用规律的学科,它既研究药物对机体的作用及作用机制,即药物效应动力学(pharmacodynamics),又称药理学;也研究药物在机体的影响下所发生的变化及其规律,即药物代谢动力学(pharmacokinetics),又称药动学。

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。

药理学是医学教育中的一门边缘或桥梁课程,也是一门重要的医学基础课程。学习时要了解和掌握药理学的基本规律(药物效应动力学和药物代谢动力学),各类药物中的代表药物及常用药物的药效学和药动学及其适应证、禁忌证,以指导临床合理用药。

新药是指化学结构、药品组分或药理作用不同于现有药品的药物。

新药开发是一个非常严格而复杂的过程。可分为临床前研究、临床研究和上市后药物监测(post-marketing surveillance)三个阶段。

临床前研究主要由药物化学和药理学两部分内容组成,前者包括药物制备工艺路线、理化性质及质量控制标准等,后者包括以符合《实验动物管理条例》的实验动物为研究对象的药效学、药动学及毒理学研究。

新药的临床研究一般分为四期。Ⅰ期临床试验是在20~30例正常成年志愿者身上进行初步的药理学及人体安全性试验,是新药人体试验的起始阶段,为后续研究提供科学依据;Ⅱ期临床试验为随机双盲对照临床试验,观察病例不少于100对,主要是对新药的有效性、安全性作出初步评价,并推荐临床给药剂量;Ⅲ期临床试验是新药批准上市前,试生产期间,扩大的多中心临床试验,目的在于对新药的有效性、安全性进行社会性考察,观察例数一般不应少于300例。新药通过该期临床试验后,方能被批准生产、上市。Ⅳ期



临床试验是上市后在社会人群大范围内继续进行的受试新药安全性和有效性评价,在广泛长期使用的条件下考察疗效和不良反应,也叫售后调研(postmarketing surveillance),该期对最终确立新药的临床价值有重要意义。

[试题]

(一) 名词解释

1. 药理学(pharmacology)
2. 药物(drug)
3. 药物效应动力学(pharmacodynamics)
4. 药物代谢动力学(pharmacokinetics)
5. 售后调研(postmarketing surveillance)

(二) 简答及论述

1. 新药研究过程可分为几个阶段?
2. 试述新药的临床研究可分为几期?每期内容是什么?

[答案]

(一) 名词解释

1. 药理学 研究药物与机体(含病原体)相互作用及作用规律的学科。
2. 药物 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。
3. 药物效应动力学 研究药物对机体的作用及作用机制,又称药效学。
4. 药物代谢动力学 研究药物在机体的影响下所发生的变化及其规律,又称药动学。
5. 售后调研 上市后在社会人群大范围内继续进行的受试新药安全性和有效性评价,在广泛长期使用的条件下考察疗效和不良反应,该期对最终确立新药的临床价值有重要意义。

(二) 简答及论述

1. 新药研究过程可分为临床前研究、临床研究和上市后药物监测三个阶段。
2. 新药的临床研究一般分为四期。I期临床试验是在20~30例正常成年志愿者身上进行初步的药理学及人体安全性试验,是新药人体试验的起始阶段,为后续研究提供科学依据;II期临床试验为随机双盲对照临床试验,观察病例不少于100对,主要是对新药的有效性、安全性作出初步评价,并推荐临床给药剂量;III期临床试验是新药批准上市前,试生产期间,扩大的多中心临床试验,目的在于对新药的有效性、安全性进行社会性考察,观察例数一般不应少于300例。新药通过该期临床试验后,方能被批准生产、上市。IV期临床试验是上市后在社会人群大范围内继续进行的受试新药安全性和有效性评价,在广泛长期使用的条件下考察疗效和不良反应,也叫售后调研(postmarketing surveillance),该期对最终确立新药的临床价值有重要意义。

(杨宝峰)



第二章

药物代谢动力学

[学习重点]

掌握基本参数及概念:生物利用度、血药峰值浓度、血浆半衰期、表观分布容积、清除率和房室概念。肝药酶诱导剂及抑制剂,首过消除等基本概念。

掌握药物消除动力学:零级动力学、一级动力学与药物半衰期($t_{1/2}$)的理论与实际意义。连续多次给药的血药浓度变化:经5个 $t_{1/2}$ 血药浓度达稳态血药浓度(坪值);首次负荷剂量。

熟悉药物的跨膜转运:被动转运和主动转运(重点阐明单纯扩散的理论和实际意义)。

了解吸收、分布、生物转化与排泄及其影响因素。

[学习提纲]

(一) 药物分子的跨膜转运

1. 药物通过细胞膜的方式 药物在体内通过各种细胞膜的方式有滤过(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)。药物分子借助于流体静压或渗透压随体液通过细胞膜的水性通道(aqueous channel)由细胞膜的一侧到达另一侧称为滤过,为被动转运(passive transport)方式。绝大多数药物按简单扩散方式通过生物膜。非极性药物分子以其所具有的脂溶性溶解于细胞膜的脂质层,顺浓度差通过细胞膜称简单扩散,也是一种被动转运方式,故又称被动扩散(passive diffusion)。许多内源性生理物质和药物通过细胞膜上的跨膜蛋白(trans-membrane protein)进出细胞,跨膜蛋白在细胞膜的一侧与药物或生理性物质结合后,发生构型改变,在细胞膜的另一侧将结合的内源性物质或药物释出,这种转运方式称为载体转运。载体转运有主动转运和易化扩散两种方式。主动转运(active transport)需要耗能,能量可直接来源于ATP的水解,或是间接来源于其他离子如 Na^+ 的电化学梯度。主动转运可逆电化学差转运药物。易化扩散(facilitated diffusion)不需要能量,不能逆电化学差转运,所以实际上是一种被动转运。

2. 影响药物通透细胞膜的因素 药物通过细胞膜的速度与可利用的膜面积大小有关。膜表面大的器官,如肺、小肠,药物通过其细胞膜脂层的速度远比膜表面小的器官



(如胃)快。

药物以简单扩散方式通过细胞膜时,除了受药物的解离度和体液 pH 值影响外,药物分子跨膜转运的速度还符合 Fick 定律:

$$\text{通透量(单位时间分子数)} = (C_1 - C_2) \times \frac{\text{面积} \times \text{通透系数}}{\text{厚度}}$$

上式表明药物通过细胞膜的速率与膜两侧的药物浓度差($C_1 - C_2$)、膜面积、药物分子的通透系数(药物分子的脂溶度)和细胞膜的厚度等因素有关。此外,血流量的改变也可影响细胞膜两侧药物浓度差,药物被血流带走的速度决定了膜一侧的药物浓度,血流量丰富、流速快时,不含药物的血液能迅速取代含有较高浓度的药物的血液,从而得以维持很大的浓度差,使药物跨膜速率增高。扩血管药物吸收快,缩血管药物吸收慢,便是因为它们改变了用药部位的血液流量。

(二) 药物的体内过程

1. 吸收 药物自用药部位进入血液循环的过程称为吸收。口服、吸入、局部用药、舌下给药、注射给药,不同给药途径有不同的药物吸收过程和特点。从胃肠道吸收入门静脉系统的药物在到达全身血循环前必先通过肝脏,如果肝脏对其代谢能力很强,或由胆汁排泄的量,则使进入全身血循环内的有效药物量明显减少,这种作用称为首过消除。有的药物在被吸收入肠壁细胞内而被代谢一部分也属首过消除。首过消除也称首过代谢(first pass metabolism)或首过效应(first pass effect)。

2. 分布 药物一旦被吸收入血循环内,便可能分布到机体的各个部位和组织。药物吸收后从血循环到达机体各个部位和组织的过程称为分布(distribution)。药物在体内的分布受很多因素影响,包括药物的脂溶度、毛细血管通透性、器官和组织的血流量、与血浆蛋白和组织蛋白结合能力、药物的 pKa 和局部的 pH 值、药物转运载体的数量和功能状态、特殊组织膜的屏障作用等。

3. 代谢 药物作为一种异物进入体内后,机体要动员各种机制使药物从体内消除,代谢是药物在体内消除的重要途径。药物经代谢后作用一般均降低或完全消失。但也有经代谢后药理作用或毒性(包括致突变、致癌、致畸在内)反而增高者。肝脏是最主要的药物代谢器官,药物代谢通常涉及 I 相(phase I)和 II 相(phase II)反应。I 相反应通过引入或脱去功能基团(-OH, -NH₂, -SH)使原形药生成极性增高的代谢产物。这些代谢产物多为无活性的,不再产生药理作用,但也有一些仍然具有活性。氧化、还原、水解均为 I 相反应。在 II 相反应过程中,内源性物质葡萄糖醛酸、硫酸、醋酸、甘氨酸等与 I 相反应产物形成的新功能基团结合,生成具有高度极性的结合物而后经尿排泄。参与 I 相反应的 CYP₄₅₀ 氧化酶和 II 相反应的结合酶的活性可因某些药物如利福平(rifampicin)、乙醇(ethanol)、卡马西平(carbamazepine)等的反复应用而被诱导,导致酶活性增高。具有遗传多态性特征的药物代谢酶的被诱导程度受其表型和基因型多态性的制约,野生型纯合子的可诱导性显著高于野生型杂合子,更高于突变型纯合子。有些药物本身就是它们所诱导的药物代谢酶的底物,因此在反复应用后,药物代谢酶的活性增高,其自身代谢也加快,这一作用称自身诱导。

4. 排泄 药物及其代谢产物主要经尿排泄,其次经粪排泄。挥发性药物主要经肺随呼吸出气体排泄。药物的汗液和乳汁排泄也是药物的排泄途径。肾脏是最重要的药物排泄

器官,肾脏对药物的排泄方式为肾小球滤过和肾小管分泌,肾小管重吸收是对已经进入尿内的药物的回收再利用过程。被分泌到胆汁内的药物及其代谢产物经由胆道及胆总管进入肠腔,然后随粪便排泄出去,经胆汁排入肠腔的药物部分可再经小肠上皮细胞吸收经肝脏进入血液循环,这种肝脏、胆汁、小肠间的循环称肠肝循环(enterohepatic cycle)。

(三) 房室模型

房室概念是将机体视为一个系统,系统内部按动力学特点分为若干房室,房室被视为一个假设空间,它的划分与解剖学部位或生理学功能无关,只要体内某些部位的转运速率相同,均视为同一室。因在多数情况下,药物可进、出房室,故称为开放性房室系统。通常有两种开放性模型,即开放性一室模型(one-compartment open model)和开放性二室模型(two-compartment open model)。如果给药后,体内药物瞬时在各部位达到平衡,即血液浓度和全身各组织器官部位浓度迅速达到平衡,可看成一室模型。但多数情况下,药物在某些部位的药物浓度可以和血液中的浓度迅速达到平衡,而在另一些部位中的转运有一延后的、但彼此近似的速率过程,迅速和血液浓度达到平衡的部位被归并为中央室,随后达到平衡的部位则归并为周边室,称二室模型。若转运到周边室的速率过程仍有较明显的快慢之分,就成为三室模型。反映二室模型动力学过程的数学公式为: $C_t = Ae^{-\alpha t} + Be^{-\beta t}$ 式中 C_t 为 t 时的血浆药物浓度, α 为分布相的速率常数,称分布速率常数, β 为消除相的速率常数,称消除速率常数,分别反映体内药物分布和消除的速度。

(四) 药物消除动力学

一级消除动力学(first-order elimination kinetics)和零级消除动力学(zero-order elimination kinetics)。

一级消除动力学是体内药物在单位时间内消除的药物百分率不变,也就是单位时间内消除的药物量与血浆药物浓度成正比,血浆药物浓度高,单位时间内消除的药物多,血浆药物浓度降低时,单位时间内消除的药物也相应降低。反映药物在体内按一级动力学消除引起的血浆内药物浓度的衰减规律的方程式为: $\frac{dC}{dt} = -k_e C$, C 为体内可消除的药物; k_e 为消除速率常数(elimination rate constant),反映体内药物的代谢和排泄速率,负值表示药物经消除而减少; t 为时间。零级消除动力学是药物在体内以恒定的速率消除,即不论血浆药物浓度高低,单位时间内消除的药物量不变。零级动力学的计算公式为 $\frac{dC}{dt} = -k_0$, 此处的 k_0 为零级消除速率常数(zero elimination rate constant)。

(五) 体内药物的药量-时间关系

1. 一次给药的药-时曲线下面积(AUC) 口服的药-时曲线的最高点称峰浓度(peak concentration, C_{max}),达到峰浓度的时间称达峰时间(peak time, T_{max})。药-时曲线下所覆盖的面积称曲线下面积(area under curve, AUC),其大小反映药物进入血循环的总量。

2. 多次给药的稳态血浆浓度 按照一级动力学规律消除的药物,其体内药物总量随着不断给药而逐步增多,直至从体内消除的药物量和进入体内的药物量相等时,体内药物总量不再增加而达到稳定状态,此时的血浆药物浓度称为稳态浓度(steady-state concentration)。

(六) 药物代谢动力学重要参数

1. 消除半衰期(half life, $t_{1/2}$) 药物消除半衰期是血浆药物浓度下降一半所需要的时间。其长短可反映体内药物消除速度。按一级动力学消除的药物经过一个 $t_{1/2}$ 后,体内尚存 50%, 经过 2 个 $t_{1/2}$ 后,尚存 25%, 经过 5 个 $t_{1/2}$, 体内药物消除约 97%, 也就是说, 约经 5 个 $t_{1/2}$, 药物可从体内基本消除。

2. 清除率(clearance, CL) 清除率是机体消除器官在单位时间内清除药物的血浆容积, 也就是单位时间内有多少毫升血浆中所含药物被机体清除。因为它是体内肝脏、肾脏和其他所有消除器官清除药物的总和, 故实际上是总体清除率(total body clearance), 又因为是根据血浆药物浓度计算的, 也称血浆清除率(plasma clearance)。清除率以单位时间的容积(ml/min 或 L/h)表示。清除率的计算公式为: $CL = \frac{A}{AUC_{0 \rightarrow \infty}}$, A 为体内药总量。

3. 表观分布容积(apparent volume of distribution, V_d) 当血浆和组织内药物分布达到平衡后, 体内药物按此时的血浆药物浓度在体内分布时所需体液容积称表观分布容积(apparent volume of distribution, V_d)。 $V_d = \frac{A}{C_0}$, A 为体内药物总量, C_0 为血浆和组织内药物达到平衡时的血浆药物浓度。

4. 生物利用度(bioavailability) 经任何给药途径给予一定剂量的药物后到达全身血液循环内药物的百分率称生物利用度, 即: 生物利用度 = $\frac{A}{D} \times 100\%$, A 为体内药物总量, D 为用药剂量。生物等效性(bioequivalence) 如果药品含有同一有效成分, 而且剂量、剂型和给药途径相同, 则它们在药学方面应是等同的。两个药学等同的药品, 若它们所含的有效成分的生物利用度无显著差别, 则称为生物等效。

(七) 药物剂量的设计和优化

1. 维持量(maintenance dose) 为了维持选定的稳态浓度或靶浓度, 需调整给药速度以使进入体内的药物速度等于体内消除药物的速度。这种关系可用下述公式表示:

$$\text{给药速度} = \frac{CL \times C_{ss}}{F}$$

如以靶浓度表示, 则为:

$$\text{给药速度} = \frac{CL \times \text{靶浓度}}{F}$$

所谓给药速度, 是给药量和给药间隔时间之比, 也即单位间隔时间的给药量。

2. 负荷量(loading dose) 如果病人急需达到稳态治疗浓度以迅速控制病情时, 可用负荷量给药法。负荷量是首次剂量加大, 然后再给予维持剂量, 使稳态治疗浓度(即事先为该病人设定的靶浓度)提前产生。

3. 个体化治疗(individualized treatment) 在正常人群中, 许多药物的 F、CL、 V_{ss} 值的一个标准差分别是 20%、50% 和 30%, 这意味着达到 C_{ss} 的时间 95% 在期望值的 35% ~ 270% 之间, 这样大的变异范围对于治疗范围很窄的药物是不容许的, 因此, 对这类药物, 应测出 $C_{ss, \max}$ 值, 直接估算 F、CL、 V_{ss} , 使给药方案较为精确。

[试题]

(一) 单选题



1. 药物代谢动力学研究()
 - A. 药物进入血液循环与血浆蛋白结合及解离的规律
 - B. 药物吸收后在机体细胞分布变化的规律
 - C. 药物经肝脏代谢为无活性产物的过程
 - D. 药物从给药部位进入血液循环的过程
 - E. 药物体内过程及体内药物浓度随时间变化的规律
2. 按一级动力学消除的药物,其血浆半衰期等于()
 - A. $0.693/ke$ B. $ke/0.693$ C. $2.303/ke$ D. $ke/2.303$ E. $0.301/ke$
3. 一个 $pK_a = 8.4$ 的弱酸性药物在血浆中的解离度为()
 - A. 10% B. 40% C. 50% D. 60% E. 90%
4. $pK_a < 4$ 的弱酸性药物如地西洋,在胃肠道 pH 范围内基本都是()
 - A. 离子型,吸收快而完全
 - B. 非离子型,吸收快而完全
 - C. 离子型,吸收慢而不完全
 - D. 非离子型,吸收慢而不完全
 - E. 全部吸收
5. 弱酸性或弱碱性药物的 pK_a 都是该药在溶液中()
 - A. 90% 离子化时的 pH 值
 - B. 80% 离子化时的 pH 值
 - C. 50% 离子化时的 pH 值
 - D. 80% 非离子化时的 pH 值
 - E. 90% 非离子化时的 pH 值
6. 离子障是指()
 - A. 离子型药物可以自由穿过,而非离子型的则不能穿过
 - B. 非离子型药物不可以自由穿过,而离子型的也不能穿过
 - C. 非离子型药物可以自由穿过,而离子型的也能穿过
 - D. 非离子型药物可以自由穿过,而离子型的则不能穿过
 - E. 离子型和非离子型均可穿过
7. 药物进入血循环后首先()
 - A. 作用于靶器官
 - B. 在肝脏代谢
 - C. 在肾脏排泄
 - D. 储存在脂肪
 - E. 与血浆蛋白结合
8. 某药按零级动力学消除,其消除半衰期等于()
 - A. $0.693/k$ B. $k/0.5C_0$ C. $0.5 C_0/k$ D. $k/0.5$ E. $0.5/k$
9. 药物的生物转化和排泄速度决定其()
 - A. 副作用的多少
 - B. 最大效应的高低
 - C. 作用持续时间的长短
 - D. 起效的快慢
 - E. 后遗效应的大小
10. 大多数药物是按下列哪种机制进入体内()
 - A. 易化扩散
 - B. 简单扩散
 - C. 主动转运
 - D. 过滤
 - E. 吞噬
11. $pK_a > 7.5$ 的弱酸性药物如异戊巴比妥,在胃肠道 pH 范围内基本都是()
 - A. 离子型,吸收快而完全
 - B. 非离子型,吸收快而完全
 - C. 离子型,吸收慢而不完全
 - D. 非离子型,吸收慢而不完全
 - E. 不能吸收

12. 某药在 $\text{pH} = 5$ 时的非解离部分为 90.9%, 其 pK_a 的近似值是()
 A. 6 B. 5 C. 4 D. 3 E. 2
13. 某药按一级动力学消除时, 其半衰期()
 A. 随药物剂型而变化 B. 随给药次数而变化
 C. 随给药剂量而变化 D. 随血浆浓度而变化
 E. 固定不变
14. 某药的半衰期为 8h, 一次给药后药物在体内基本消除的时间是()
 A. 1 天 B. 2 天 C. 4 天 D. 6 天 E. 8 天
15. 在碱性尿液中弱酸性药物()
 A. 解离多, 重吸收少, 排泄快 B. 解离少, 重吸收多, 排泄快
 C. 解离多, 重吸收多, 排泄快 D. 解离少, 重吸收多, 排泄慢
 E. 解离多, 重吸收少, 排泄慢
16. 时量曲线下面积反映()
 A. 消除半衰期 B. 消除速度
 C. 吸收速度 D. 生物利用度
 E. 药物剂量
17. 有首关消除的给药途径是()
 A. 直肠给药 B. 舌下给药 C. 静脉给药
 D. 喷雾给药 E. 口服给药
18. 舌下给药的优点是()
 A. 经济方便 B. 不被胃液破坏 C. 吸收规则
 D. 避免首关消除 E. 副作用少
19. 在时量曲线上, 曲线在峰值浓度时表明()
 A. 药物吸收速度与消除速度相等 B. 药物的吸收过程已经完成
 C. 药物在体内的分布已达到平衡 D. 药物的消除过程才开始
 E. 药物的疗效最好
20. 某药剂量相等的两种制剂口服后曲线下面积相等, 但达峰时间不同, 是因为()
 A. 肝脏代谢速度不同 B. 肾脏排泄速度不同
 C. 血浆蛋白结合率不同 D. 分布部位不同
 E. 吸收速度不同
21. 在时量曲线中血药浓度上升达到最小有效浓度之间的时间距离称为()
 A. 药物消除一半时间 B. 效应持续时间
 C. 峰浓度时间 D. 最小有效浓度持续时间
 E. 最大药效浓度持续时间
22. 在碱性尿液中弱碱性药物()
 A. 解离多, 重吸收少, 排泄快 B. 解离少, 重吸收多, 排泄快
 C. 解离多, 重吸收多, 排泄快 D. 解离少, 重吸收多, 排泄慢
 E. 解离多, 重吸收少, 排泄慢

23. 以一级动力学消除的药物,若以一定时间间隔连续给一定剂量,达到稳态血药浓度时间的长短决定于()
- A. 给药剂量 B. 生物利用度 C. 曲线下面积(AUC)
D. 给药次数 E. 半衰期
24. 每隔一个半衰期给药一次时,为立即达到稳态血药浓度可首次给予()
- A. 5 倍剂量 B. 4 倍剂量 C. 3 倍剂量
D. 加倍剂量 E. 半倍剂量
25. 诱导肝药酶的药物是()
- A. 阿司匹林 B. 多巴胺 C. 去甲肾上腺素
D. 苯巴比妥 E. 阿托品
26. 决定药物每天用药次数的主要因素是()
- A. 血浆蛋白结合率 B. 吸收速度 C. 消除速度
D. 作用强弱 E. 起效快慢
27. pK_a 与 pH 的差值以数学值增减时,药物的离子型与非离子型浓度比值的变化为()
- A. 平方根 B. 对数值 C. 指数值 D. 数学值 E. 乘方值
28. 最常用的给药途径是()
- A. 口服给药 B. 静脉给药 C. 肌肉给药
D. 经皮给药 E. 舌下给药
29. 葡萄糖的转运方式是()
- A. 过滤 B. 简单扩散 C. 主动转运 D. 易化扩散 E. 胞饮
30. 甲基多巴的转运方式是()
- A. 过滤 B. 简单扩散 C. 主动转运 D. 易化扩散 E. 胞饮
31. 与药物在体内的分布及肾排泄关系比较密切的转运方式是()
- A. 主动转运 B. 过滤 C. 简单扩散 D. 易化扩散 E. 胞饮
32. 绝对口服生物利用度等于()
- A. (静脉注射定量药物后 AUC/口服等量药物后 AUC) $\times 100\%$
B. (口服等量药物后 AUC/静脉注射定量药物后 AUC) $\times 100\%$
C. (口服定量药物后 AUC/静脉注射定量药物后 AUC) $\times 100\%$
D. (口服一定药物后 AUC/静脉注射定量药物后 AUC) $\times 100\%$
E. (静脉注射等量药物后 AUC/口服定量药物后 AUC) $\times 100\%$
33. 口服生物利用度可反映药物吸收速度对()
- A. 蛋白结合的影响 B. 代谢的影响 C. 分布的影响
D. 消除的影响 E. 药效的影响
34. 负荷剂量是()
- A. 一半有效血药浓度的剂量 B. 一半稳态血药浓度的剂量
C. 达到一定血药浓度的剂量 D. 达到有效血药浓度的剂量
E. 维持有效血药浓度的剂量
35. 有效、安全、快速的给药方法,除少数 $t_{1/2}$ 很短或很长的药物,或按零级动力学消除



的药物外,一般可采用()

- A. 每一个半衰期给予半个有效量并将首次剂量加倍
 - B. 每一个半衰期给予1个有效量并将首次剂量加倍
 - C. 每半个半衰期给予半个有效量并将首次剂量加倍
 - D. 每半个半衰期给予1个有效量并将首次剂量加倍
 - E. 每一个半衰期给予2个有效量并将首次剂量加倍
36. 关于表观分布容积小的药物,下列哪项是正确的()
- A. 与血浆蛋白结合少,较集中于血浆
 - B. 与血浆蛋白结合多,较集中于血浆
 - C. 与血浆蛋白结合少,多在细胞内液
 - D. 与血浆蛋白结合多,多在细胞内液
 - E. 与血浆蛋白结合多,多在细胞间液
37. 苯巴比妥可使氯丙嗪血药浓度明显降低,这是因为苯巴比妥()
- A. 减少氯丙嗪的吸收
 - B. 增加氯丙嗪与血浆蛋白结合
 - C. 诱导肝药酶使氯丙嗪代谢增加
 - D. 降低氯丙嗪的生物利用度
 - E. 增加氯丙嗪的分布
38. 保泰松可使苯妥英钠的血药浓度明显升高,这是因为保泰松()
- A. 增加苯妥英钠的生物利用度
 - B. 减少苯妥英钠与血浆蛋白结合
 - C. 减少苯妥英钠的分布
 - D. 增加苯妥英钠的吸收
 - E. 抑制肝药酶使苯妥英钠代谢减少
39. 药物的 pKa 是指()
- A. 药物完全解离时的 pH
 - B. 药物 50% 解离时的 pH
 - C. 药物 30% 解离时的 pH
 - D. 药物 80% 解离时的 pH
 - E. 药物全部不解离时的 pH
40. 药物按零级动力学消除是()
- A. 单位时间内以不定的量消除
 - B. 单位时间内以恒定比例消除
 - C. 单位时间内以恒定速度消除
 - D. 单位时间内以不定比例消除
 - E. 单位时间内以不定速度消除
41. 易化扩散是()
- A. 靠载体逆浓度梯度跨膜转运
 - B. 不靠载体顺浓度梯度跨膜转运
 - C. 靠载体顺浓度梯度跨膜转运
 - D. 不靠载体逆浓度梯度跨膜转运
 - E. 简单扩散
42. 丙磺舒延长青霉素药效的原因是丙磺舒()
- A. 也有杀菌作用
 - B. 减慢青霉素的代谢
 - C. 延缓耐药性的产生
 - D. 减慢青霉素的排泄
 - E. 减少青霉素的分布
43. 消除速率是单位时间内被()
- A. 肝脏消除的药量
 - B. 肾脏消除的药量
 - C. 胆道消除的药量
 - D. 肺部消除的药量

- E. 机体消除的药量
44. 主动转运的特点是()
- A. 通过载体转运,不需耗能 B. 通过载体转运,需要耗能
C. 不通过载体转运,不需耗能 D. 不通过载体转运,需要耗能
E. 以上都不是
45. 甲基多巴的吸收是靠细胞中的()
- A. 胞饮转运 B. 离子障转运 C. pH 被动扩散
D. 载体主动转运 E. 载体易化扩散
46. 相对生物利用度等于()
- A. (试药 AUC/标准药 AUC) × 100%
B. (标准药 AUC/试药 AUC) × 100%
C. (口服等量药后 AUC/静脉注射等量药后 AUC) × 100%
D. (静脉注射等量药后 AUC/口服等量药后 AUC) × 100%
E. (试药 AUC/标准药 AUC) × 50%
47. 某药半衰期为 36h,若按一级动力学消除,每天用维持剂量给药约需多长时间基本达到有效血药浓度()
- A. 2 天 B. 3 天 C. 8 天 D. 11 天 E. 14 天
48. 静脉注射某药 500mg,其血药浓度为 16 μ g/ml,则其表观分布容积应约为()
- A. 31L B. 16L C. 8L D. 4L E. 2L
49. 某药的表观分布容积为 40L,如欲立即达到 4mg/L 的稳态血药浓度,应给的负荷剂量是()
- A. 13mg B. 25mg C. 50mg D. 100mg E. 160mg
50. 维拉帕米的清除率为 1.5L/min,几乎与肝血流量相等,加用肝药酶诱导剂苯巴比妥后,其清除率的变化是()
- A. 减少 B. 增加 C. 不变 D. 增加 1 倍 E. 减少 1 倍
51. 药物的排泄途径不包括()
- A. 汗腺 B. 肾脏 C. 胆汁 D. 肺 E. 肝脏
52. 药物通过肝脏代谢后不会()
- A. 毒性降低或消失 B. 作用降低或消失 C. 分子量减少
D. 极性增高 E. 脂溶性加大
53. 无首关消除的药物是()
- A. 硝酸甘油 B. 氢氯噻嗪 C. 普萘洛尔
D. 吗啡 E. 利多卡因
54. 药物在肝脏生物转化不属于第一步反应的是()
- A. 氧化 B. 还原 C. 水解 D. 结合 E. 去硫
55. 不直接引起药效的药物是()
- A. 经肝脏代谢了的药物 B. 与血浆蛋白结合了的药物
C. 在血循环的药物 D. 达到膀胱的药物
E. 不被肾小管重吸收的药物