

医学

专业主干课程考试辅导丛书

主编 胡长平

药理学

导学与 应试指南

梳理教材知识体系
精讲重点难点考点
揭示名校命题规律

科学技术文献出版社

医学

执业医师资格考试辅导丛书

（第2版）

药理学

导学 & 应试指南

主编 陈国治 副主编 王 强

编委 陈国治 王 强 王 强

编委 陈国治 王 强 王 强

人民卫生出版社

 医学专业主干课程考试辅导丛书

药理学导学与应试指南

主 编 胡长平

科学技术文献出版社

Scientific and Technical Documents Publishing House

北 京

图书在版编目(CIP)数据

药理学导学与应试指南/胡长平主编. -北京:科学技术文献出版社, 2009. 11

(医学专业主干课程考试辅导丛书)

ISBN 978-7-5023-6461-8

I. 药… II. 胡… 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(2009)第 166366 号

出 版 者 科学技术文献出版社

地 址 北京市复兴路 15 号(中央电视台西侧)/100038

图书编辑部电话 (010)58882938, 58882087(传真)

图书发行部电话 (010)58882866(传真)

邮 购 部 电 话 (010)58882873

网 址 <http://www.stdph.com>

E-mail: stdph@istic.ac.cn

策 划 编 辑 薛士滨

责 任 编 辑 薛士滨

责 任 校 对 赵文珍

责 任 出 版 王杰馨

发 行 者 科学技术文献出版社发行 全国各地新华书店经销

印 刷 者 北京博泰印务有限责任公司

版 (印) 次 2009 年 11 月第 1 版第 1 次印刷

开 本 850×1168 32 开

字 数 517 千

印 张 17.25

印 数 1~5000 册

定 价 32.00 元

© 版权所有 违法必究

购买本社图书,凡字迹不清、缺页、倒页、脱页者,本社发行部负责调换。

(京)新登字 130 号

内 容 简 介

该书以“十一五”规划教材《药理学》为蓝本,并参考国内主流教材,与人卫版《药理学》编排次序一致,每章内容安排由教学大纲要求、教材内容梳理、复习思考题及答案和题解组成。具有涵盖面广、重点突出、深度适宜、实用性强的特点,适合五年制、七年制、八年制基础、临床、预防、口腔医学及相关专业学生参考。

科学技术文献出版社是国家科学技术部系统唯一一家中央级综合性科技出版机构,我们所有的努力都是为了使您增长知识和才干。

前 言

为了使学生更好地理解和掌握普通高等教育“十一五”国家级规划教材《药理学》(人民卫生出版社,第7版)(以下简称人卫版《药理学》)的学习内容,我们编写了与其相适应的辅导教材。本书以药理学教学大纲为主线,以人卫版《药理学》教材为蓝本,并参考了周宏灏主编的《药理学》五年制教材(2008年,科学出版社,第2版。普通高等教育“十一五”国家级规划教材、国家高等学校精品课程教材)编写而成。

本书与人卫版《药理学》的编排次序一致,既突出重点掌握内容,又兼顾熟悉和了解内容,以药理学基本概念、基础知识和基本理论为基础,以章为单元,每个单元的内容由“教学大纲要求”、“教材内容梳理”(包括“基本概念”、“重点和难点”)、“复习思考题”、“答案和题解”组成。出题知识类型方面考虑了基础知识型、理论应用型和实验要求型的适当比例;学生掌握知识的层次上考虑了记忆型、解释型和问题解决型题目的相应比例。本书在编写过程中,力求涵盖面广、重点突出、深度适宜、实用性强,适用于五年制基础、临床、预防和口腔医学及相关专业的学生。同时,对长学年制(七年制、八年制)学生以及从事药理学教学的教师也有重要参考价值。

本书在编写过程中得到了各位作者及所在单位的热情支持;中南大学药学院邓汉武教授审阅了全书,提出了很多宝贵意见,在此一并致谢。

参加本书编写的人员虽是长期工作在药理学教学第一线的教师,具有丰



富的教学经验,洞悉药理学教学的重点、难点和考点,但由于编写时间较短,加之学识有限,本书缺点和错误在所难免,恳请读者批评指正。

胡长平 陈小平

目 录

第 1 章	绪论	1
第 2 章	药物代谢动力学	7
第 3 章	药物效应动力学	20
第 4 章	影响药物作用的因素及合理用药	31
第 5 章	传出神经系统药理概论	37
第 6 章	胆碱受体激动药	56
第 7 章	抗胆碱酯酶药和胆碱酯酶复活药	63
第 8 章	胆碱受体阻断药 (I)—M 胆碱受体阻断药	75
第 9 章	胆碱受体阻断药 (II)—N 胆碱受体阻断药	85
第 10 章	肾上腺素受体激动药	93
第 11 章	肾上腺素受体阻断药	104
第 12 章	中枢神经系统药理学概论	112
第 13 章	全身麻醉药	119
第 14 章	局部麻醉药	126
第 15 章	镇静催眠药	131
第 16 章	抗癫痫药和抗惊厥药	141
第 17 章	治疗中枢神经系统退行性疾病药	149
第 18 章	抗精神失常药	160
第 19 章	镇痛药	170
第 20 章	解热镇痛抗炎药	180
第 21 章	离子通道概论及钙通道阻滞药	192
第 22 章	抗心律失常药	199
第 23 章	肾素-血管紧张素系统药理	215



第 24 章	利尿药和脱水药	222
第 25 章	抗高血压药	234
第 26 章	治疗心力衰竭的药物	246
第 27 章	调血脂药与抗动脉粥样硬化药	257
第 28 章	抗心绞痛药	268
第 29 章	作用于血液及造血器官的药物	278
第 30 章	影响自体活性物质的药物	294
第 31 章	作用于呼吸系统的药物	313
第 32 章	作用于消化系统的药物	327
第 33 章	子宫平滑肌兴奋药和抑制药	336
第 34 章	性激素类药及避孕药	347
第 35 章	肾上腺皮质激素类药物	355
第 36 章	甲状腺激素及抗甲状腺药	370
第 37 章	胰岛素及口服降血糖药	380
第 38 章	抗菌药物概论	391
第 39 章	β -内酰胺类抗生素	403
第 40 章	大环内酯类、林可霉素类及多肽类抗生素	417
第 41 章	氨基糖苷类抗生素	427
第 42 章	四环素类及氯霉素类抗生素	439
第 43 章	人工合成抗菌药	449
第 44 章	抗病毒药和抗真菌药	464
第 45 章	抗结核病药及抗麻风病药	478
第 46 章	抗寄生虫药	491
第 47 章	抗恶性肿瘤药物	506
第 48 章	影响免疫功能的药物	519
第 49 章	基因治疗药物	533

第 1 章

绪 论

第一节 教学大纲要求

- (1)掌握药理学、药物、药效动力学、药代动力学的概念。
- (2)熟悉药理学的学科任务。
- (3)了解药物与药理学的发展简史。

第二节 教材内容梳理

一、基本概念

1. 药物(drug) 指能够影响生物机体的生理功能和生化过程,用于疾病的预防、诊断和治疗的物质。

2. 药理学(pharmacology) 研究药物和机体(包括病原体)的相互作用及其规律的一门学科。包括药效动力学和药代动力学两个基本研究内容:

(1)药物效应动力学(药效学, pharmacodynamics):研究药物对机体的作用和产生作用的机制。

(2)药物代谢动力学(药动学, pharmacokinetics):研究机体对药物的吸收、分布、代谢、排泄及其体内动态规律。



3. 毒理学(toxicology) 研究化学物质(包括药物)对生物机体的不良作用,也属于药理学范畴。

4. 药学(pharmacy) 研究药物的发现、开发、制备、生产、销售和发放的学科。

二、重点和难点

(一)药理学的任务

1. 研究药物的代谢动力学和效应动力学,为临床合理用药提供依据。
2. 阐明生物机体的生物化学和生理学过程及其本质。
3. 开发新药,提供安全、有效的药理学证据。

(二)药理学在新药开发中的作用

新药上市须经过临床前评价和临床评价两个阶段:

1. 临床前评价

- (1)药学研究:药物的制备工艺、理化性质、质量控制标准等;
- (2)药理学研究:以动物为对象研究药物的药效学、药动学和毒理学。

2. 临床评价分四期临床试验(clinical trial)

I 期是初步的人体药理学及安全性评价,观察人对新药的耐受程度和药物代谢动力学,为制定给药方案提供依据。

II 期为随机盲法对照试验,对新药的有效性、安全性做出初步评价,推荐临床给药剂量。

III 期为扩大的多中心随机对照临床试验,进一步评价新药的有效性和安全性。

IV 期是上市后监测,在广泛使用条件下考察新药的疗效和不良反应。

(三)药物与药理学的发展史

1. 古人类在和疾病作斗争的长期实践中,认识了许多能治疗疾病的天然物质,形成了最早的药物学著作,如:1500 BC,埃及,《亚伯斯古医籍》;1500BC,



《印度草医学》;汉代(206BC~220),《神农本草经》;明末 1578 年,《本草纲目》。

2. 现代药理学的产生和发展

16 世纪初,瑞士医生 Paracelsus 提出药物由其有效活性成分发挥作用,推广应用酊剂提取物(鸦片酊)。

Johann Jakob Wepfer(1620—1695 年)首次用动物实验研究药物的药理、毒理作用,被誉为“药理学祖父”。

1806 年德国药剂师 Fredrick Surturner 从罂粟中分离出吗啡。纯化合物的出现使能重复定量给药,从而产生科学药理学。

“实验学之父”Claude Bernard(1813—1878 年)证实箭毒作用于神经-肌肉接头,这是药物作用机制的最早研究。

Rudolf Buchheim(1820—1879 年)提出药物作用为细胞和药物相互作用所致,成为“受体”理论先驱。建立第一个药理学实验室,撰写第一本药理学教科书。

德国药理学家 Oswald Schmiedeberg(1838—1921 年)提出一系列药理学概念,如药物的构效关系、受体、选择性毒性等,是现代药理学创始人。

第三节 复习思考题

一、试题

(一)A 型选择题

1. 药理学是研究

- A. 药物与机体相互作用规律及其原理的科学 B. 药物作用的科学
C. 临床合理用药的科学 D. 药物实际疗效的科学 E. 药物作用和作用规律的科学

2. 药效学是研究

- A. 药物的临床疗效 B. 药物的作用机制 C. 药物对机体的作用及其作用机制 D. 药物作用的影响因素 E. 药物在体内的变化规律



3. 药动学是研究

A. 药物作用的动力来源 B. 药物作用的动态规律 C. 药物的体内过程及其动态变化规律 D. 药物在体内血药浓度的变化 E. 药物在体内消除的规律

(二)B 型选择题

A. 天然提取药物 B. 半合成药物 C. 全合成药物 D. 蛋白药物
E. 药用植物

1. 哌替啶属于
2. 吗啡属于
3. 罂粟属于
4. 头孢唑啉属于
5. 胰岛素属于

(三)X 型选择题

1. 药理学的学科任务包括

A. 阐明药物作用机制 B. 对药物疗效和安全性进行评价 C. 研究药物合成及药用植物栽培 D. 开发新药、发现药物新用途 E. 为探索细胞生理生化及病理过程提供实验资料

2. 新药研究过程有

A. 临床前研究 B. 毒性研究 C. 临床研究 D. 疗效观察 E. 售后调研

3. 关于新药研发下列叙述正确的是

A. 安慰剂是含有活性药物的制剂 B. 双盲法是研究人员和病人均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

(四)名词解释

1. 药理学(pharmacology)
2. 药物效应动力学(pharmacodynamics)



3. 药物代谢动力学(pharmacokinetics) 4. 毒理学(toxicology)

(五) 问答题

1. 药理学和药学、毒理学有何联系和区别?
2. 简述药理学的主要研究内容。
3. 试述药理学研究在新药开发中的应用?

二、参考答案

(一) A 型选择题

1. A 2. C 3. C

(二) B 型选择题

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

(三) X 型选择题

1. ABDE 2. ABCDE 3. BCDE

(四) 名词解释

1. 是研究药物和机体(包括病原体)的相互作用及其规律的一门学科。
2. 研究药物对机体的作用和产生作用的机制。
3. 研究机体对药物的吸收、分布、代谢、排泄及其体内动态规律。
4. 研究化学物质(包括药物)对生物机体的不良作用,也属于药理学范畴。

(五) 问答题

1. 药理学是研究药物与机体相互作用及其规律的学科,而药学则是研究药物的发现、开发、制备、生产、销售和发放的学科。毒理学是研究化学物质(包括药物)对生物机体的不良作用,也属于药理学范畴,它研究的对象除了药物外,还包括其他毒性物质,如工业污染物,各种化合物、有机或无机物等。



2. 药理学主要包括药物效应动力学和药物代谢动力学两个基本研究内容:药物效应动力学是定性定量地阐述药物对机体的作用和产生作用的机制;药物代谢动力学则研究药物在机体内的转运,即药物在体内的吸收、分布、代谢、排泄过程及动态变化规律。

3. 新药上市须经过临床前评价和临床评价两个阶段

(1)临床前评价包括:①药学研究:药物的制备工艺、理化性质、质量控制标准等;②药理学研究:以动物为对象研究药物的药效学、药动学和毒理学。

(2)临床评价分四期临床试验(clinical trial)

I 期是初步的人体药理学及安全性评价,观察人对新药的耐受程度和药物代谢动力学,为制定给药方案提供依据。

II 期为随机盲法对照试验,对新药的有效性 & 安全性做出初步评价,推荐临床给药剂量。

III 期为扩大的多中心随机对照临床试验,进一步评价新药的有效性和安全性。

IV 期是上市后监测,在广泛使用条件下考察新药的疗效和不良反应。

(彭维杰 罗 丹)

第 2 章

药物代谢动力学

第一节 教学大纲要求

- (1)掌握药代动力学基本参数的药理学意义,首关消除概念及细胞膜两侧pH对药物吸收和分布的影响。
- (2)熟悉药物消除动力学、时量曲线及多次给药的血药浓度变化。
- (3)了解药物的吸收、分布、生物转化、排泄的基本概念及影响因素。了解房室模型及意义。

第二节 教材内容梳理

一、基本概念

药物自进入机体到离开机体历经吸收、分布、代谢及排泄过程,这是机体对药物的处置,这些处置可以概括为药物的转运(吸收、分布、排泄)和药物的转化(代谢)。

(一)药物分子的跨膜转运

1. 药物通过细胞膜的方式



(1)简单扩散(simple diffusion, passive diffusion):脂溶性药物直接溶于膜的类脂相而通过。绝大多数药物按此种方式通过生物膜。特点:①转运速度与药物脂溶度成正比;②顺浓度差,不耗能;③转运速度与浓度差成正比;④转运速度与药物解离度(pKa)有关。

离子障(ion trapping):分子状态药物疏水而亲脂,易通过细胞膜;离子状态药物极性高,不易通过细胞膜的脂质层。

(2)滤过(filtration):水溶性小分子药物通过细胞膜的水通道,受流体静水压或渗透压的影响。

(3)主动转运(active transport):依赖细胞膜内特异性载体转运。特点:①逆浓度梯度,耗能;②特异性(选择性);③饱和性;④竞争性。

(4)易化扩散(facilitated diffusion):在膜蛋白的帮助下药物从高浓度侧向低浓度侧跨膜转运。特点:顺浓度梯度,不耗能。

2. 影响药物通透细胞膜的因素

(1)药物的解离度和体液的酸碱度:药物的解离度也因其 pKa(解离常数的负对数)及所在溶液的 pH 不同而不同。非解离型(分子态)药物可以自由通过生物膜,离子型(解离型)药物不易通过生物膜。多数药物为弱酸性或弱碱性药物。弱酸性药物在酸性环境中解离少,分子态多,易通过生物膜;弱碱性药物则相反。由于膜两侧 pH 不同,当分布达平衡时膜两侧的药量会有相当大的差异。

(2)药物通透性、浓度差和膜面积与厚度。

(3)血流量。

(4)细胞膜转运蛋白的量和功能。

(二)药物的体内过程

吸收、分布、代谢和排泄。

1. 吸收(absorption) 从给药部位进入血循环的过程。

不同给药途径的药物吸收过程和特点:

(1)口服给药(oral ingestion):①吸收部位主要在小肠;②停留时间长,经绒毛吸收面积大;③毛细血管壁孔道大,血流丰富;④pH5~8,对药物解离影