



医学专业必修课程考试同步辅导丛书



配套第七版国家级规划教材

总主编 吴志明 李胜蓝 杨一华

供医学本科生课程考试复习用

供硕士研究生入学考试复习用

主 审 张岫美

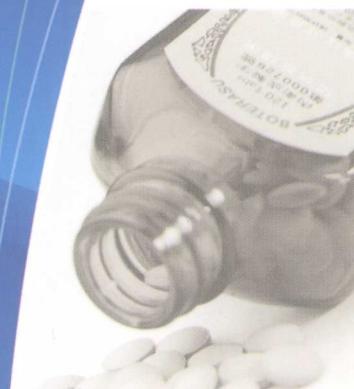
# 药理学应试向导

## Pharmacology Exam Guide

主 编 李胜蓝 段书冬



同济大学出版社  
TONGJI UNIVERSITY PRESS





总主编 吴志明 李胜蓝 杨一华

供医学本科生课程考试复习用

供硕士研究生入学考试复习用

主 审 张岫美

# 药理学应试向导

## Pharmacology Exam Guide

主 编 李胜蓝 段书冬

副主编 张 扬 赵 云 薛青松

编 委 (按姓氏拼音排序)

段书冬 (复旦大学药学院)

高永兴 (复旦大学附属中山医院)

李大力 (复旦大学附属肿瘤医院)

李胜蓝 (复旦大学上海医学院)

娄莉莉 (复旦大学上海医学院)

刘英杰 (上海交通大学附属第六人民医院)

刘 希 (同济大学附属第十人民医院)

慕彰磊 (复旦大学附属华山医院)

孙恒贊 (上海交通大学附属第九人民医院)

唐晓婷 (复旦大学附属中山医院)

王 雪 (复旦大学上海医学院药理研究中心)

吴志明 (复旦大学上海医学院)

薛青松 (复旦大学药学院)

于 莉 (中国医科大学附属盛京医院)

朱美美 (复旦大学附属五官科医院)

朱欣茹 (复旦大学上海医学院药理研究中心)

章佳贊 (复旦大学药学院)

张 扬 (复旦大学附属华山医院)

赵 云 (复旦大学附属华山医院)



## 内 容 提 要

“药理学”为医药学专业主干课程，本书编写以第七版国家级规划教材《药理学》为依据，紧扣教学大纲要求，对教材内容和知识要点进行系统梳理。全书各章均设有【大纲要求】、【内容精析】、【同步练习】和【参考答案】4个栏目，简要提示教学大纲要求，系统解析教材内容，结合大纲精心设计试题，提供参考答案，便于学生同步复习，及时巩固所学知识，完成课程考试。全书另附“词汇讲解”，阐释主要专业词汇及其词根记忆的演绎；并提供数套“模拟试卷”，以供学生自测和考前全面复习。本书适合于医药学本科生的课程考试辅导和研究生入学考试辅导，也可作为医药学本科教学的参考用书。

### 图书在版编目(CIP)数据

药理学应试向导/李胜蓝,段书冬主编.一上海:同济大学出版社,2009.4

(医学专业必修课程考试同步辅导丛书)

ISBN 978 - 7 - 5608 - 3886 - 1

I. 药… II. ①李…②段… 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(2008)第 187023 号

---

医学专业必修课程考试同步辅导丛书

## 药理学应试向导

主 编 李胜蓝 段书冬

责任编辑 沈志宏 责任校对 徐春莲 装帧设计 陈益平

---

出版发行 同济大学出版社 [www.tongjipress.com.cn](http://www.tongjipress.com.cn)

(地址：上海市四平路 1239 号 邮编：200092 电话：021-65985622)

经 销 全国各地新华书店

印 刷 同济大学印刷厂

开 本 787mm×1092mm 1/16

印 张 18.75

印 数 1—5100

字 数 468 000

版 次 2009 年 4 月第 1 版 2009 年 4 月第 1 次印刷

书 号 ISBN 978 - 7 - 5608 - 3886 - 1

---

定 价 32.00 元

---

# 前　　言

“药理学”是基础医学和临床医学的重要桥梁学科之一,对该学科的学习和掌握,关系到对前面基础学科知识的巩固以及对后面临床学科的进一步学习。为了帮助医学生更有效地学习和掌握该门课程,我们精心编写了这本与人民卫生出版社高等医学院校最新版教材相配套的辅导教材。

本书编写主要依据人民卫生出版社全国高等医药院校第七版教材《药理学》,在此基础上还补充参考了七年制、八年制《药理学》教材,以及国内部分医学院校的自编教材和国外经典教材的相关资料,从药理学总论到基因治疗药物等各论,按教材章节顺序编排,紧扣教学大纲要求。同时,考虑到不同层次读者的需要,我们力求做到重要知识点全面覆盖,重点突出,图文并茂,考点、难点详尽分析。

全书共分四十九章,每一章由【大纲要求】、【内容精析】、【同步练习】和【参考答案】四个部分组成。

【大纲要求】根据教学大纲要求,对学生需要掌握、熟悉和了解的内容给出明确提示。

【内容精析】系统分析各章节的重点内容,力求做到框架结构清晰、脉络层次分明、难点内容细致解析,并给予精要的提示和概括。

【同步练习】考点知识全面覆盖,题型参考执业医师考试,包括名词解释、各类选择题、填空题和简答题等各类常考题型,便于学生复习之余及时自测,及时巩固所学知识。

【参考答案】便于学生自我测试后参考,及时更正和补充知识点。

全书最后另附“词汇讲解”和“模拟试卷”,以帮助学生复习、记忆专业英语词汇和进行应试总复习。

本书适合于医药学本科生课程考试复习、硕士研究生入学考试复习及药理学教师备课使用,也可作为“药理学”的配套学习用书。

深感目前市场上医学参考书良莠不齐,难免会对学生产生误导。本书作者力求能提供给广大医学生一本真正实用、有效的参考书。本书的编写得到了复旦大学上海医学院、同济大学医学院、上海交通大学医学院、中国医科大学和山东大学医学院等高等医学院校同行的大力支持和通力合作,使得本书的编写得以顺利完成,在此一并表示衷心的感谢。

由于时间限制和作者水平有限、经验不足,书中难免有错误疏漏之处,恳请同行和广大读者予以批评和指正。

主　　编

2008年12月8日于复旦枫林

# 目 录

## 前 言

<b>第一章 药理学总论——绪言</b>	1
<b>第二章 药物代谢动力学</b>	3
第一节 药物分子的跨膜转运	3
第二节 药物的体内过程	3
第三节 房室模型	4
第四节 药物消除动力学	4
第五节 体内药物的药量-时间关系	4
第六节 药物代谢动力学重要参数	4
第七节 药物剂量的设计和优化	5
<b>第三章 药物效应动力学</b>	10
第一节 药物的基本作用	10
第二节 药物剂量与效应关系	10
第三节 药物与受体	11
<b>第四章 影响药物效应的因素</b>	17
第一节 药物因素	17
第二节 机体因素	17
<b>第五章 传出神经系统药理概论</b>	21
第一节 概述	21
第二节 传出神经系统的递质和受体	21
第三节 传出神经系统的生理功能	21
第四节 传出神经系统药物基本作用及其分类	22
<b>第六章 胆碱受体激动药</b>	25
第一节 M胆碱受体激动药	25
第二节 N胆碱受体激动药	25



第一节 神经节阻断药 .....	38
第二节 骨骼肌松弛药 .....	38
<b>第十章 肾上腺素受体激动药 .....</b>	<b>42</b>
第一节 构-效关系及分类 .....	42
第二节 $\alpha$ 肾上腺素受体激动药 .....	42
第三节 $\alpha, \beta$ 肾上腺素受体激动药 .....	43
第四节 $\beta$ 肾上腺素受体激动药 .....	45
<b>第十一章 肾上腺素受体阻断药 .....</b>	<b>50</b>
第一节 $\alpha$ 肾上腺素受体阻断药 .....	50
第二节 $\beta$ 肾上腺素受体阻断药 .....	51
第三节 $\alpha, \beta$ 肾上腺素受体阻断药 .....	52
<b>第十二章 中枢神经系统药理学概论 .....</b>	<b>56</b>
第一节 中枢神经系统的细胞学基础(略) .....	56
第二节 中枢神经递质及其受体 .....	56
第三节 中枢神经系统药理学特点 .....	57
<b>第十三章 全身麻醉药 .....</b>	<b>59</b>
第一节 吸入性麻醉药 .....	59
第二节 静脉麻醉药 .....	60
第三节 复合麻醉 .....	60
<b>第十四章 局部麻醉药 .....</b>	<b>63</b>
<b>第十五章 镇静催眠药 .....</b>	<b>67</b>
第一节 苯二氮草类 .....	67
第二节 巴比妥类 .....	67
第三节 其他镇静催眠药 .....	68
<b>第十六章 抗癫痫药和抗惊厥药 .....</b>	<b>70</b>
第一节 抗癫痫药 .....	70
第二节 常用抗癫痫药 .....	70
第三节 抗惊厥药 .....	71
<b>第十七章 治疗中枢神经系统退行性疾病药 .....</b>	<b>73</b>
第一节 抗帕金森病药 .....	73
第二节 治疗阿尔茨海默病药 .....	74
<b>第十八章 抗精神失常药 .....</b>	<b>77</b>
第一节 抗精神病药 .....	77
第二节 抗躁狂症药 .....	79
第三节 抗抑郁药 .....	79
<b>第十九章 镇痛药 .....</b>	<b>83</b>



第一节 概述 .....	83
第二节 吗啡及其相关阿片受体激动药 .....	83
第三节 阿片受体部分激动药和激动-拮抗药 .....	86
第四节 其他镇痛药 .....	86
第五节 阿片受体拮抗药 .....	86
<b>第二十章 解热镇痛抗炎药 .....</b>	<b>90</b>
第一节 概述 .....	90
第二节 非选择性环氧酶抑制药 .....	91
第三节 选择性环氧酶-2 抑制剂 .....	93
<b>第二十一章 离子通道概论及钙通道阻滞药 .....</b>	<b>97</b>
第一节 离子通道概论 .....	97
第二节 作用于钾离子通道的药物 .....	97
第三节 钙通道阻滞药(CCB) .....	98
<b>第二十二章 抗心律失常药 .....</b>	<b>103</b>
第一节 心脏的电生理学基础 .....	103
第二节 心律失常发生机制 .....	103
第三节 抗心律失常药物基本作用机制和分类 .....	103
第四节 常用抗心律失常药重要特点 .....	104
<b>第二十三章 肾素-血管紧张素系统药物 .....</b>	<b>110</b>
第一节 肾素-血管紧张素系统 .....	110
第二节 血管紧张素转化酶抑制药 .....	111
第三节 血管紧张素Ⅱ受体(AT <sub>1</sub> 型)拮抗药 .....	112
<b>第二十四章 利尿药和脱水药 .....</b>	<b>116</b>
第一节 利尿药 .....	116
第二节 脱水药(渗透性利尿药) .....	118
<b>第二十五章 抗高血压药 .....</b>	<b>122</b>
第一节 抗高血压药物的分类 .....	122
第二节 常用抗高血压药物 .....	122
第三节 其他经典抗高血压药物 .....	123
第四节 高血压药物治疗的新概念 .....	124
<b>第二十六章 治疗充血性心力衰竭的药物 .....</b>	<b>131</b>
第一节 CHF 的病理生理学及治疗 CHF 药物的分类 .....	131
第二节 肾素-血管紧张素-醛固酮系统抑制药 .....	131
第三节 β受体阻断药 .....	131
第四节 强心苷类 .....	131
<b>第二十七章 调血脂与抗动脉粥样硬化药 .....</b>	<b>138</b>



<b>第二十八章</b>	<b>抗心绞痛药</b>	144
第一节	概述	144
第二节	硝酸酯类	145
第三节	β肾上腺素受体拮抗剂	146
第四节	钙通道阻滞药	146
第五节	其他抗心绞痛药物	147
<b>第二十九章</b>	<b>血液及造血系统药理</b>	151
第一节	抗凝血药	151
第二节	纤维蛋白溶解药与纤维蛋白溶解抑制药	152
第三节	抗血小板药	153
第四节	促凝血药	153
第五节	抗贫血药及造血细胞生长因子	154
第六节	血容量扩充药	156
<b>第三十章</b>	<b>影响自体活性物质</b>	162
第一节	膜磷脂代谢产物类药物及拮抗药	162
第二节	5-羟色胺类药物及拮抗药	163
第三节	组胺和抗组胺药	163
第四节	一氧化氮及其供体与抑制剂	164
第五节	腺苷与药理性预适应	164
<b>第三十一章</b>	<b>作用于呼吸系统的药物</b>	168
第一节	平喘药	168
第二节	镇咳药	170
第三节	祛痰药	171
<b>第三十二章</b>	<b>作用于消化系统的药物</b>	175
第一节	消化性溃疡及抗溃疡药	175
第二节	消化功能调节药	177
<b>第三十三章</b>	<b>子宫平滑肌兴奋药和抑制药</b>	184
第一节	子宫平滑肌兴奋药	184
第二节	子宫平滑肌抑制药	185
<b>第三十四章</b>	<b>性激素类药及避孕药</b>	187
第一节	性激素类药	187
第二节	避孕药	188
<b>第三十五章</b>	<b>肾上腺皮质激素类药物</b>	192
第一节	糖皮质激素	192
第二节	盐皮质激素	196
第三节	促皮质素及皮质激素抑制药	196
<b>第三十六章</b>	<b>甲状腺激素及抗甲状腺药</b>	200
第一节	甲状腺激素	200



第二节 抗甲状腺药 .....	201
第三节 促甲状腺激素与促甲状腺释放激素的临床应用 .....	202
<b>第三十七章 胰岛素及其他降血糖药 .....</b>	<b>207</b>
第一节 胰岛素 .....	207
第二节 口服降血糖药 .....	208
<b>第三十八章 抗菌药物概论 .....</b>	<b>213</b>
第一节 抗菌药物的常用术语 .....	213
第二节 抗菌药物的作用机制 .....	213
第三节 细菌耐药性 .....	214
第四节 抗菌药物合理应用原则 .....	215
<b>第三十九章 <math>\beta</math>-内酰胺类抗生素 .....</b>	<b>217</b>
第一节 分类、抗菌作用机制和耐药机制 .....	217
第二节 青霉素类抗生素 .....	218
第三节 头孢菌素类抗生素 .....	218
第四节 其他 $\beta$ -内酰胺抗生素 .....	219
第五节 $\beta$ -内酰胺酶抑制药及其复方制剂 .....	219
<b>第四十章 大环内酯类、林可霉素类及多肽类抗生素 .....</b>	<b>223</b>
第一节 大环内酯类抗生素 .....	223
第二节 林可霉素类抗生素 .....	223
第三节 多肽类抗生素 .....	224
<b>第四十一章 氨基糖苷类抗生素 .....</b>	<b>226</b>
<b>第四十二章 四环素类及氯霉素类 .....</b>	<b>230</b>
第一节 四环素类 .....	230
第二节 氯霉素类 .....	230
<b>第四十三章 人工合成抗菌药 .....</b>	<b>233</b>
第一节 喹诺酮类抗生素 .....	233
第二节 磺胺类抗生素 .....	234
<b>第四十四章 抗病毒药和抗真菌药 .....</b>	<b>240</b>



第三节	抗血吸虫药和抗丝虫	249
第四节	抗蠕虫药	250
<b>第四十七章</b>	<b>抗恶性肿瘤药物</b>	253
第一节	抗恶性肿瘤药物的药理学基础	253
第二节	常用抗恶性肿瘤药物	253
第三节	细胞毒类抗恶性肿瘤药的存在问题和应用原则	256
<b>第四十八章</b>	<b>影响免疫功能的药物</b>	259
第一节	免疫应答和免疫病理反应	259
第二节	免疫抑制剂	259
第三节	免疫增强药	260
<b>第四十九章</b>	<b>基因治疗药物</b>	264
第一节	基因治疗概论	264
第二节	基因转移方法	264
第三节	基因治疗的应用	264
<b>附录 A</b>	<b>词汇讲解</b>	267
<b>附录 B</b>	<b>模拟试卷(一)</b>	275
	模拟试卷(二)	281
	模拟试卷(三)	286



# 第一章 药理学总论——绪言

## 【大纲要求】

掌握:药物、药理学、药效学、药动学定义;区分药物和毒物。

熟悉:新药开发和研究。

了解:药理学研究对象和学科任务。

## 【内容精析】

### 一、药理学的性质和任务

#### 1. 基本概念

- (1) 药物指可以改变或查明机体的生理功能及病理状态,可用于预防、诊断和治疗疾病的化学物质。
- (2) 药理学指研究药物与机体(含病原体)相互作用及作用规律的科学,包括研究药效学和药动学。
- (3) 药效学即药物效应动力学,指药物对机体的作用及作用机制。
- (4) 药动学即药物代谢动力学,指药物在机体影响下所发生的变化及规律。

#### 2. 药理学学科任务

- (1) 药效学、药动学研究,指导临床合理用药;
- (2) 开发新药或老药新用途;
- (3) 与其他生命科学研究互相启发。

#### 3. 药理学的试验方法 包括实验药理学方法、实验治疗学方法和临床药理学方法。

### 二、学习药理学的重要意义

药理学是一门连接基础医学和临床医学的基础学科,也是医学和药学的桥梁。每一个医学生都应当掌握各类药物中典型代表药的临床应用、作用机制、代谢规律、适应证、禁忌证、主要不良反应和与其他药物的相互作用,做到合理用药。

### 三、新药开发与研究

- (1) 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。
- (2) 新药研究过程包括临床前研究、临床研究和上市后药物检测。

## 【同步练习】

### 一、名词解释

1. 药物(drug)    2. 药理学(pharmacology)

### 二、选择题

#### A型题

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_

## 第一章 药理学总论——绪言

3. 新药研究过程分为\_\_\_\_\_、\_\_\_\_\_和\_\_\_\_\_三个阶段。

### 四、简答题

药理学的概念和学科任务是什么？

### 【参考答案】

#### 一、名词解释

- 药物 指可以改变或查明机体的生理功能及病理状态,可用于预防、诊断和治疗疾病的化学物质。
- 药理学 指研究药物与机体相互作用及作用规律的科学,包括了研究药物对机体作用及作用机制和药物在机体影响下的变化规律。

#### 二、选择题

##### A型题

1. C    2. D    3. B

#### 三、填空题

1. 实验药理学方法    实验治疗学方法    临床药理学方法    2. 《本草纲目》    1892    3. 临床前研究  
临床研究    上市后药物监测

#### 四、简答题

药理学的概念和学科任务是什么？

答:药理学是研究药物与机体相互作用及作用规律的科学,包括研究药物对机体作用及作用机制和药物在机体影响下的变化规律。其学科任务是:①阐明药物和机体的相互作用和作用机制,指导临床合理用药;②研究开发新药,发现药物新用途;③为其他生命科学研究提供重要的研究方法和科学依据。

(李胜蓝)



## 第二章 药物代谢动力学

### 【大纲要求】

**掌握:**药物转运的两种基本方式;被动转运和主动转运的概念和特点、首关消除、生物利用度、药物与血浆蛋白结合的意义;药物的肾脏排泄特点和临床应用;房室模型、一级消除动力学、零级消除动力学、药-时曲线下面积、消除半衰期。

**了解:**药物代谢动力学概念;药物代谢步骤及药物因诱导或抑制代谢药物的酶而相互影响;表观分布容积、维持量、负荷量概念及应用。

### 【内容精析】

#### 第一节 药物分子的跨膜转运

##### 一、药物通过细胞膜的方式

1. 被动转运和主动转运 见表 2-1。

表 2-1 被动转运与主动转运的比较

	浓 度	载 体	耗 能	竞 争 性 抑 制	饱 和 性
被 动 转 运	从 高 到 低	不 需 载 体	不 需 要	无	无
主 动 转 运	从 低 到 高	需 特 殊 载 体	需 要	有	有

2. 简单扩散 绝大多数药物按此种方式通过生物膜。

分子状态(非解离型)药物疏水而脂溶性高,易通过生物膜;离子状态(解离型)药物亲水而脂溶性低,极性高,不易通过生物膜被吸收,这种现象称为离子障。

依据 Henderson-Hasselbalch 公式和推导,可得

$$\text{弱酸性药物} \quad \text{HA} \rightleftharpoons \text{H}^+ + \text{A}^- \quad \frac{[\text{A}^-]}{[\text{HA}]} = 10^{\text{pH}-\text{pK}_a}$$

$$\text{弱碱性药物} \quad \text{B} + \text{H}^+ \rightleftharpoons \text{BH}^+ \quad \frac{[\text{BH}^+]}{[\text{B}]} = 10^{\text{pK}_b-\text{pH}}$$

为了方便记忆,可以统一为(带氢的那个为分子):  $\frac{[\text{HA}]}{[\text{A}^-]} = \frac{[\text{BH}^+]}{[\text{B}]} = 10^{\text{pK}_a-\text{pH}}$

心里要有这样的直观认识:若 pH 值固定,对弱酸性药物,  $\text{pK}_a$  越小,解离百分率越高;对弱碱性药物,  $\text{pK}_b$  越大,解离百分率越高。

酸性药物  $[\text{A}^-]$   $[\text{BH}^+]$



## 二、分布

药物体内分布的决定因素：血浆蛋白结合率、器官血流量、组织蛋白结合、体液 pH 值和药物解离度、体内屏障。

## 三、代谢

(1) 肝脏是最主要的药物代谢器官。药物经肝脏代谢后作用一般均降低或完全消失，但也有药理作用或毒性增强者，如过量使用对乙酰氨基酚引起的肝细胞坏死。

(2) 药物代谢酶的诱导与抑制：参与I相反应的细胞色素P450(CYP)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、乙醇、卡马西平等的反复应用而被诱导，导致酶活性增高；有些药物可抑制肝微粒体酶的活性，导致同时应用的一些药物代谢缓慢，这类抑制物和药物代谢酶结合，竞争性抑制其他底物的代谢。

## 四、排泄

主要经尿排泄，其次经粪排泄。

(1) 肾脏是最重要的药物排泄器官。经肾小球滤过、肾小管分泌、肾小管重吸收药物随尿液排出体内。

(2) 肾小管的分泌是主动转运，重吸收是被动扩散。肾小管分泌中的竞争性抑制现象：丙磺舒和青霉素竞争排泄，使后者的药效增强，可用于少数重症感染；噻嗪类利尿药、水杨酸、保泰松与尿酸竞争肾小管排泄机制，引起痛风发作。

(3) 药物的解离程度影响肾小管的重吸收，同离子障对药物吸收的作用：未解离的易重吸收，解离的不易重吸收。当巴比妥类药物中毒时碱化尿液，使其解离程度提高，减少肾小管的重吸收，以利药物的排泄。

## 第三节 房室模型

### 一、一室模型

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。

### 二、二室模型

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，而在另一些部位的转运中有一延后的、但彼此相似的速率过程，迅速和血液达到平衡的部位为中央室，随后达到平衡的部位为周边室，称为二室模型。

## 第四节 药物消除动力学

药物消除动力学的定义 见表 2-2。

表 2-2 药物消除动力学的定义

	定    义	曲    线	▲公式	▲ $t_{1/2}$
一级	单位时间内消除的药物与血浆药物浓度成正比	药-时曲线呈曲线，半对数坐标图上为直线	$\lg C_t = \frac{-k_e t}{2.303} + \lg C_0$	$\frac{0.693}{k_e}$
零级	单位时间内消除的药量不变	药-时曲线呈直线，半对数坐标图上为曲线	$C_t = C_0 - k_0 t$	$0.5 \frac{C_0}{k_0}$

## 第五节 体内药物的药量-时间关系

### 一、一次给药的药-时曲线下面积

1. 静脉注射 分布相(急速下降)十消除相(缓慢下降)。

2. 口服给药 吸收相(迅速上升)十消除相(缓慢下降)。

### 二、多次给药的稳态血浆浓度

稳态浓度：按照一级动力学规律消除的药物，口服多次给药后，其体内药物总量随着不断给药而逐步增多，直至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。

## 第六节 药物代谢动力学重要参数

### 一、清除半衰期( $t_{1/2}$ )

血浆药物浓度下降一般所需要的时间。其长短反映体内药物消除速度。按一级动力学消除的药物，

约经 5 个  $t_{1/2}$ , 体内药物消除约 97%, 基本消除。

### 二、清除率(CL)

是机体消除器官在单位时间内清除药物的血浆容积, 就是单位时间内有多少毫升血浆中所含药物被机体清除。

### 三、表观分布容积( $V_d$ )

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。

$$V_d = \frac{A}{C_0} \text{ 式中, } A \text{ 为体内药物总量; } C_0 \text{ 为血浆和组织内药物达到平衡时的血浆药物浓度。}$$

### 四、生物利用度

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。生物利用度 =  $\frac{A}{D} \times 100\%$ 。

式中,  $A$  为体内药物总量;  $D$  为用药剂量。

### 五、生物等效性

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, 若它们含有的有效成分的生物利用度无显著差别, 则称为生物等效。

## 第七节 药物剂量的设计和优化

### 一、维持量( $D_m$ )给药法

临幊上采用多次间歇给药或者持续静脉滴注, 使稳态血浆药物浓度维持在治疗浓度范围。

### 二、负荷量( $D_l$ )

给药法: 为了使稳态治疗浓度提前达到而采用的给药方法。

## 【同步练习】

### 一、名词解释

1. 简单扩散 (simple diffusion)
2. 载体转运 (carrier-mediated transport)
3. 药物吸收 (absorption)
4. 药物排泄 (excretion)
5. 一室模型 (one-compartment model)
6. 二室模型 (two-compartment model)
7. 稳态浓度 (steady-state concentration)
8. 半衰期 (half life,  $t_{1/2}$ )
9. 表观分布容积 (apparent volume of distribution,  $V_d$ )
10. 生物利用度 (bioavailability)

### 二、选择题

#### A型题

1. 大多数药物通过生物膜的转运方式是( )  
A. 易化扩散      B. 简单扩散      C. 滤过      D. 载体转运      E. 吞饮
2. 药物被动转运的特点中不包括( )  
A. 耗能      B. 不需载体      C. 无饱和性      D. 无竞争性抑制      E. 顺浓度梯度
3. 一弱酸性药物  $pK_a$  为 3.4, 在 pH 值为 7.4 的血浆中其解离百分率为( )  
A. 10%      B. 90%      C. 99%      D. 99.9%      E. 99.99%
4. 某弱碱性药物  $pK_a$  为 8.4, 在 pH 值为 7.4 的血浆中其解离百分率为( )  
A. 90%      B. 99%      C. 99.9%      D. 99.99%      E. 99.999%



## 第二章 药物代谢动力学

- A. 维生素B<sub>12</sub>经胃肠道吸收      B. 葡萄糖进入红细胞      C. 甲氨蝶呤进入白细胞  
D. 甲醇经胃肠道吸收      E. 以上都是
10. 药物的首关消除可发生于( )  
A. 静脉给药后      B. 皮下注射      C. 肌内注射      D. 吸入      E. 口服给药后
11. 与药物体内分布有关的因素不包括下列哪项( )  
A. 血浆蛋白结合率      B. 血-脑屏障      C. 体液pH值      D. 药物解离度      E. 肝肾功能
12. 容易通过血-脑屏障的药物的特点( )  
A. 分子量大,极性高      B. 分子量小,极性低      C. 分子量大,极性低  
D. 分子量小,极性高      E. 以上都不对
13. 对于体内屏障的说法,错误的是( )  
A. 只有脂溶性高的药物才可通过血-脑屏障      B. 血-脑屏障的通透性一成不变  
C. 胎盘对药物的通透性与一般毛细血管相似,几乎所有药物都能穿过胎盘进入胎儿体内  
D. 作用于眼的药物以局部应用为好,与血-眼屏障的作用有关  
E. 孕妇应禁用可致畸和对胎儿有毒的药物
14. 下列给药途径中吸收最快的是( )  
A. 皮下注射      B. 口服      C. 皮内注射      D. 肌内注射      E. 吸入
15. 某药物半衰期为6小时,一次服药后多长时间体内药物基本消除( )  
A. 6小时      B. 12小时      C. 18小时      D. 24小时      E. 2天
16. 血浆蛋白和药物结合后,以下说法错误的是( )  
A. 失去药理活性      B. 是可逆性结合      C. 影响药物的消除  
D. 延缓了药物生物转化      E. 易化了跨膜转运
17. 药物在肝脏内经结合反应后都会( )  
A. 极性升高      B. 极性降低      C. 活性减小      D. 分子量减小      E. 脂溶性升高
18. 关于肝药酶,不正确的是( )  
A. 存在于肝和其他许多内脏器官      B. 作用专一性不强  
C. 作用很广泛,包括了使底物氧化、还原、水解、结合      D. 促进体内物质转化  
E. 个体差异大,受遗传因素影响
19. 口服色甘酸钠( $pK_a = 2.0$ )后在胃肠道( )  
A. 在胃中大部分解离,基本吸收      B. 在胃中基本不解离,基本吸收  
C. 在肠道中大部分解离,基本吸收      D. 在肠道中基本不解离,基本吸收  
E. 以上都不对
20. 某药物按一级消除动力学消除,其血浆半衰期( $K_e$ 为消除速率常数)是( )  
A.  $2.303/K_e$       B.  $K_e/2.303$       C.  $0.693/K_e$       D.  $K_e/0.693$       E.  $0.301/K_e$
21. 某药物在体内按一级动力学消除,两次抽血,测得其血浆药物浓度分别为16 mmol/L和4 mmol/L,两次抽血时间间隔为8小时,则药物的半衰期为( )  
A. 2小时      B. 3小时      C. 4小时      D. 5小时      E. 6小时
22. 某催眠药按一级动力学消除,其消除速率常数为0.7/h,测得静脉注射时血浆药物浓度为1 mg/L,患者睡醒后为0.125 mg/L,问患者睡了多久( )  
A. 2小时      B. 3小时      C. 4小时      D. 5小时      E. 6小时
- B型题
- A. 在尿中大部分解离,重吸收减少      B. 在尿中大部分未解离,重吸收减少  
C. 在尿中大部分解离,重吸收增加      D. 在尿中大部分未解离,重吸收增加      E. 没有影响
1. 苯巴比妥类中毒时碱化尿液( )  
2. 弱碱性药物在pH值7.0的尿液中( )  
A. 1个 $t_{1/2}$       B. 2个 $t_{1/2}$       C. 5个 $t_{1/2}$       D. 8个 $t_{1/2}$       E. 9个 $t_{1/2}$   
3. 经过多长时间后恒量给药可以达到稳态血药浓度( )



4. 经多长时间后药物自体内排出 95% ( )
- 药物吸收过程
  - 药物的体内分布
  - 药物光学异构
  - 药物的肝脏代谢和肾脏排泄
  - 药物的血浆蛋白结合率
5. 药物开始发挥作用的快慢取决于( )
6. 药物的半衰期长短取决于( )
7. 药物体内分布最重要的影响因素( )
8. 药物的生物利用度取决于( )
9. 药物的表观分布容积取决于( )

## C型题

- A. 主动转运      B. 被动转运      C. 二者都是      D. 二者都不是
1. 药物从胃肠道的吸收大部分是( )
2. 简单扩散属于( )
3. 药物从肾小管的排泄属于( )
4. 需要载体的是( )
- A. 一级消除动力学      B. 零级消除动力学      C. 二者都是      D. 二者都不是
5. 药物体内消除已达饱和的是( )
6. 药物按等比例消除的是( )
7. 药物按等量消除的是( )
8. 半衰期不变的是( )
- A. 肝药酶诱导剂      B. 肝药酶抑制剂      C. 二者都是      D. 二者都不是
9. 苯巴比妥类药物使抗生素的药效变弱, 属于( )
10. 使药物作用变强的是( )
- A. 药物的转化      B. 药物的转运      C. 二者都是      D. 二者都不是
11. 包括了药物在体内的吸收、分布的是( )
12. 药物的体内过程包括( ).

## X型题

1. 零级消除动力学的药物, 其( )
- $t_{1/2}$ 恒定
  - 机体内药物按等量消除
  - 是因为体内肝肾消除饱和所致
  - 药物消除速率与体内药物血浆浓度无关
  - 多次给药时 AUC 增加,  $C_{ss}$  和消除时间不变
2. 一级消除动力学的药物, 以下说法正确的是( )
- $t_{1/2}$ 恒定
  - 药物消除速率与体内药物血浆浓度成正比
  - 多次给药时 AUC 增加,  $C_{ss}$  和消除时间不变
  - 时-量曲线呈对数曲线, 斜率为  $-k$
3. 药物清除率(CL)是( )
- 单位时间内药物被清除的百分率
  - 其值和药物血浆浓度有关
  - 取决于药物消除速率
  - 其值和药物剂量无关

