

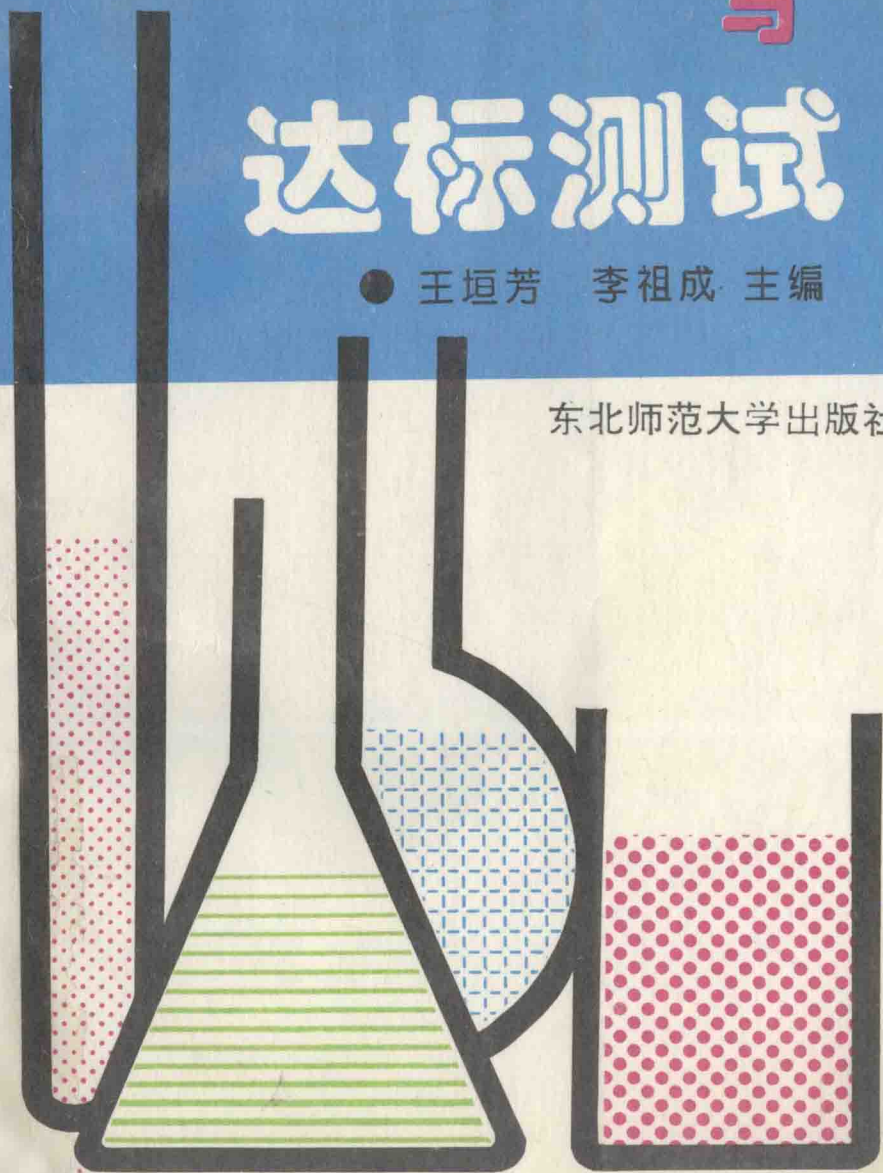
药理学纲要

与

达标测试

● 王垣芳 李祖成 主编

东北师范大学出版社



药理学纲要与达标测试

王垣芳 李祖成 主编

江苏工业学院图书馆
藏书章

东北师范大学出版社

1996·长春

(吉) 新登字 12 号

药理学纲要与达标测试

YAOLIXUE GANGYAO YU DABIAO CESHI

王垣芳 李祖成 主编

责任编辑：侯文富	封面设计：李冰彬	责任校对：田 化
东北师范大学出版社出版 (长春市人民大街 138 号) (邮政编码：130024)	东北师范大学出版社发行 吉林工学院印刷厂制版 吉林工学院印刷厂印刷	
开本：850×1168 毫米 1/32	1996 年 7 月第 1 版	
印张：8.75	1996 年 7 月第 1 次印刷	
字数：214 千	印数：0 001—4 500 册	
ISBN7 - 5602 - 1781 - 8/R • 30	定价：10.00 元	

本书编委会名单

主 编	王垣芳	李祖成		
副主编	于俐军	宋述平	朱 萍	陈雪艳
	高玉庆	苑 青	刘卫东	李俊华
编 委	(以姓氏笔画为序)			
	于俐军	王垣芳	王玉燕	王恩慧
	巴 艳	冯曰珍	刘冬梅	刘卫东
	孙 华	朱 萍	宋述平	李祖成
	李洪凤	李俊华	苑 青	陈雪艳
	姜爱玲	高玉庆	高 波	郭传娟

前 言

为了方便《药理学》与《药理学》的目标教学和帮助自学者学习,我们根据1994年中华人民共和国卫生部颁发的中等卫校药理学和药理学教学大纲,按照中专第一版《药理学》和第三版《药理学》统编教材编写的要求,参考高等教育自学考试《药理学》教材等有关资料编写了本书。

全书共分19个单元,每个单元分列目标、纲要、达标测试题、参考答案和临床新药简介五个部分。本书的特点是:(1)保持了药理学课程的系统性和教材内容的完整性;(2)各单元之学习目标明确,同时围绕单元目标提供了多种类型的达标测试题,并附有参考答案;(3)表述科学,文字简明,多以图表形式进行归纳综合,突出了重点和难点;(4)密切联系临床实际,严格遵循专业培养方向。因此,本书是《药理学》与《药理学》目标教学的适宜参考材料,也是自学考试和晋升复习的较好辅导读物。

由于作者水平所限,可能存在疏漏之处,恳请广大读者指正赐教。

本书编委会

1996年5月

目 录

第一单元 总论

目标	1
纲要	1
达标测试题	12
参考答案	22

第二单元 作用于传出神经系统药物

目标	24
纲要	24
达标测试题	35
参考答案	41
临床新药简介	42

第三单元 麻醉药

目标	43
纲要	43
达标测试题	46
参考答案	48
临床新药简介	48

第四单元 作用于中枢神经系统药物

目标	50
纲要	50
达标测试题	61
参考答案	66
临床新药简介	67

第五单元 抗过敏药

目标	71
----------	----

纲要	71
达标测试题	73
参考答案	75
临床新药简介	76
第六单元 作用于消化系统药物	
目标	77
纲要	77
达标测试题	82
参考答案	86
临床新药简介	87
第七单元 作用于呼吸系统药物	
目标	88
纲要	88
达标测试题	91
参考答案	96
临床新药简介	96
第八单元 利尿药和脱水药	
目标	98
纲要	98
达标测试题	99
参考答案	104
临床新药简介	105
第九单元 作用于心血管系统药物	
目标	106
纲要	106
达标测试题	121
参考答案	129
临床新药简介	131
第十单元 作用于血液和造血系统药物	
目标	133

纲要	133
达标测试题	142
参考答案	148
临床新药简介	149
第十一单元 子宫兴奋药	
目标	151
纲要	151
达标测试题	152
参考答案	155
临床新药简介	156
第十二单元 激素类药物	
目标	157
纲要	157
达标测试题	163
参考答案	169
临床新药简介	171
第十三单元 维生素类药物	
目标	174
纲要	174
达标测试题	175
参考答案	178
第十四单元 抗微生物药	
目标	179
纲要	179
达标测试题	195
参考答案	207
临床新药简介	209
第十五单元 抗寄生虫病药	
目标	212
纲要	212

达标测试题	218
参考答案	227
临床新药简介	228
第十六单元 抗恶性肿瘤药	
目标	230
纲要	230
达标测试题	235
参考答案	244
临床新药简介	245
第十七单元 解毒药	
目标	248
纲要	248
达标测试题	250
参考答案	253
临床新药简介	253
第十八单元 药物相互作用	
目标	254
纲要	254
达标测试题	256
参考答案	260
第十九单元 诊断用药	
目标	261
纲要	261
达标测试题	263
参考答案	266
临床新药简介	267

第一单元 总 论

〔目 标〕

1. 阐述药物的基本作用、作用类型、作用原理（受体学说）。
2. 叙述药物的体内过程组成环节及影响因素，分析药物消除与蓄积的决定因素，解释半衰期、坪值的临床意义。
3. 综合、分析影响药物作用的因素；药物方面的因素、机体方面的因素。
4. 简述药理学概念，识别处方、医嘱，进行剂量换算和注射液稀释。

〔纲 要〕

1.1 概述

1.1.1 药物与毒物的概念

药物是指用来预防、治疗、诊断疾病或用于计划生育的化学物质。毒物是指能损害人类健康的化学物质。药物和毒物间无明确的界限。

1.1.2 药理学和药理学概念

药理学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科学。它研究药物与机体（包括病原体）间相互作用的规律及其原理，即药理学既研究药物对机体的作用规律（药效学），又研究机体对药物的影响（药动学）。

药理学是研究药物的性能、作用、制剂、剂量，以指导合理用药的一门医学基础课。

1.2 药物的作用与作用原理

1.2.1 药物的作用

药物对生活机体发生的影响或生活机体对药物发生的反应称为药物的作用。

A. 药物的基本作用

药物对机体机能活动的影响即药物的基本作用，可分为两类：兴奋作用——使机体机能活动增强者称之；抑制作用——使机体机能活动减弱者称之。

B. 药物作用的类型

按药物的作用部位、作用范围及作用效果可分为局部作用与吸收作用；选择作用与普遍细胞作用；防治作用与不良反应。

(1) 局部作用与吸收作用 药物被吸收入血前，在其应用部位所发生的作用称为局部作用；吸收作用是指当药物被机体吸收入血，随体液分布到各组织器官后所呈现的作用。

(2) 选择作用和普遍细胞作用 药物进入机体后对某些器官或组织作用特别明显，称为选择作用；与此相反，有的药物对与它接触的组织器官都有类似的作用，称为普遍细胞作用。选择作用产生的原因有：① 药物在体内各组织器官的分布不同；② 机体对药物的敏感性和受体分布不同；③ 组织器官的生物机能不同；④ 组织结构的不同。选择作用的意义：① 是药物分类的依据；② 是临床选药的基础。

(3) 防治作用与不良反应——药物作用的两重性 凡符合用药目的或能达到防治效果的作用统称防治作用，它包括预防作用和治疗作用。预防作用是指在疾病或症状发生之前用药以防止其发生的药物作用。治疗作用是指能消除或减轻已有病症的药物作用。治疗作用按治疗目的或治疗效果不同分为对症治疗和对因治疗，前者是指针对疾病症状的治疗；后者是指消除疾病原因的治疗。对因治疗又称“特效治疗”，所用的药物称为“特效药”。凡不符合用药目的甚至不利于病人的反应统称为不良反应。其类型有：① 副作用 指药物在治疗量时，与治疗作用同时出现的、与用药目的无关的作用。其原因是药物作用范围较大、选择性较低。其特点为：1) 随治疗目的的改变而改变；2) 为药物本身所固有，

可以预知；3) 有的可设法避免或减轻。② 毒性反应 是指由于用药剂量过大、时间过久或机体对药物特别敏感，致使药物对机体产生明显损害的反应，它是药物作用的延伸，多可预知。③ 继发反应 是在应用药物治疗后所引起的不良后果。④ 变态反应 是指少数人接受某些药物后发生的病理性免疫反应，它与药物剂量、药物作用或毒性无关，最常见的为过敏反应。⑤ 致畸作用和致癌作用。

1.2.2 药物作用的原理

A. 药物与受体结合

(1) 受体的概念 受体是位于细胞膜上或细胞内能选择性地与一定的化学物质结合而引起一定效应的特殊蛋白质。

(2) 受体学说 ① 占领学说；② 速率学说；③ 变构学说。

(3) 与受体结合的药物分类及特点 见表 1-1

表 1-1 与受体结合的药物分类及特点

分 类	亲和力	内在活性	对受体的作用
受体激动剂	有	强	占据受体，激活受体
受体阻断剂	有	无	占据受体，不激活受体
			竞争性阻断激动剂与受体结合
部分激动剂	有	弱	占据受体，激活部分受体，可对 抗激动剂的部分效应

(4) 药物与受体结合后的继发反应 药物与受体结合后引起继发性变化而发挥药理作用，如改变细胞膜通透性或酶的活性，影响代谢等。

B. 药物作用的其他原理

药物的作用原理除受体学说外，还可通过改变理化条件、改变酶的活性、影响代谢、影响生物膜功能或影响体内活性物质等

发挥作用。

1.3 药物的体内过程

药物体内过程的主要环节包括药物的吸收、分布、代谢和排泄等。

1.3.1 药物的跨膜转运

药物在体内通过生物膜的运动过程，称药物的跨膜转运。其方式分为：① 被动转运，如简单扩散、膜孔滤过和易化扩散；② 主动转运；③ 胞饮转运。大多数药物通过简单扩散的方式转运。

1.3.2 药物的吸收

药物由给药部位进入血循环的过程称吸收。其吸收的快慢和多少直接影响药物的作用。影响药物吸收的因素如下：

A. 物理化学性质 药物的分子大小、脂溶性、解离度及药物的酸碱度均可影响药物吸收。

B. 药物制剂 制剂的类型、溶剂的性质、颗粒大小及片剂崩解度等均可影响吸收。水溶液最易吸收、油溶液次之，而混悬液或胶状液较难吸收。

C. 生物利用度 药物制剂被机体吸收利用的程度称为生物利用度。 $\text{生物利用度} = (\text{实际吸收药量} / \text{给药量}) \times 100\%$

D. 给药途径 各种给药途径药物吸收快慢的次序为：吸入 > 肌注 > 皮下注射 > 直肠、舌下 > 口服 > 粘膜 > 皮肤，静脉注射给药无吸收过程。

E. 吸收环境 药物接触的面积大、血流丰富、停留时间长可使吸收量增多；胃排空时间、pH 值、肠蠕动功能、局部血液循环等因素均可影响药物的吸收。药物在小肠中吸收量多于胃，是因为小肠吸收面积比胃大、且有合适的 pH 值。

F. 首过消除（第一关卡效应） 某些药物在第一次通过肠粘膜和肝脏时，部分被破坏，使进入体循环的药量减少，称为首过消除。舌下给药和直肠给药无首过消除。

1.3.3 药物的分布

药物从血液通过各种生理屏障转运到各组织器官的过程称为分布,药物的分布不仅影响药物的消除速度,也影响药效和毒性。药物在体内分布不均匀的主要影响因素有:①药物的理化性质和体液的pH值;②药物与血浆蛋白的结合率;③药物与组织的亲合力;④局部器官血流量;⑤药物通过体内屏障(如血脑屏障、胎盘屏障)的能力。药物与血浆蛋白结合有以下特点:①可逆性;②结合型不易透过生物膜(但不影响主动转运);③暂时失活;④有饱和性和竞争现象。

1.3.4 药物的生物转化

药物在体内发生的化学变化称生物转化或药物的代谢。其方式有:氧化、还原、水解和结合。多数药物经生物转化后失去活性,称为“灭活”,或称“解毒”;也可相反,有的药物本身无活性,经生物转化后变成有活性的产物,称“活化”。

药酶 药物生物转化过程都需要酶系统参加,其中最重要的是肝细胞内的微粒体混合功能酶系统,该酶系统可促进多种药物发生转化,故称肝药酶或药酶。

药酶诱导剂 凡能使药酶活性增强或合成加速的药物称药酶诱导剂。

药酶抑制剂 凡能使药酶活性降低或合成减少的药物称药酶抑制剂。

1.3.5 药物的排泄

药物的原形或其代谢产物通过排泄器官排出体外的过程,称为排泄。其主要途径是肾脏,另外胆汁、乳汁、唾液腺、胃肠道等也有少量排泄。影响药物排泄的主要因素是肾脏功能和尿液pH值。尿液酸碱度对药物排泄的影响 见表1-2。

表 1-2 尿液酸碱度对药物排泄的影响

	弱酸性药物			弱碱性药物		
	解离度	重吸收	排泄	解离度	重吸收	排泄
碱性尿液	↑	↓	↑	↓	↑	↓
酸性尿液	↓	↑	↓	↑	↓	↑

肝肠循环 有些药物经胆汁排入肠内后，部分可被肠道再吸收、形成肝肠循环，使药物排泄减慢，作用时间延长。

1.3.6 药物的消除与蓄积

A. 药物的消除

药物的生物转化和排泄过程，总称为药物的消除。消除的方式有恒比消除和恒量消除。

恒比消除 是指每经一定时间、消除一定的比值，其半衰期恒定。多数药物以这种方式消除。

恒量消除 是指每经一定时间，消除一定的数量，其半衰期不恒定，药物血浓度愈高、半衰期愈长，见于用药剂量过大、超过了机体恒比消除的能力。

B. 药物的蓄积

反复多次给药时，体内药量累积增多的过程，称药物的蓄积。蓄积到一定程度而产生防治效应的称为蓄积作用；蓄积过多而引起的中毒称为蓄积中毒。

C. 吸收与消除对药物作用的影响（图 1-1）

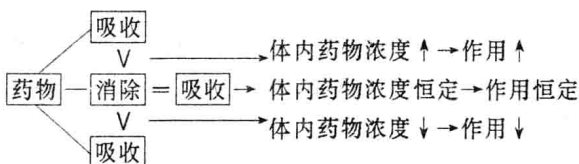


图 1-1 吸收与消除对药物作用的影响

D. 半衰期

药物在血浆中的浓度下降一半所需的时间称半衰期,用 $t_{1/2}$ 表示。其意义是:① 决定给药次数或给药间隔时间;② 预计连续用药达到坪值的时间;③ 预计停药后药物消除的时间。

E. 坪值

以半衰期为给药间隔时间,在经给药 4—5 次后,血中药物浓度即达到一个恒定水平,此称为“坪值”。坪值的高低与每日给药总量成正比。若病情紧急,需要迅速显效时,可首次加倍量,即可在一个半衰期内达坪值。

1.4 影响药物作用的因素

1.4.1 药物方面的因素

A. 药物的结构

结构相似的药物,其作用性质相似或相反。

B. 药物的性状

药物的挥发性、溶解度、颗粒大小及药物的稳定性等,均可影响药物的吸收,从而影响药物的作用。

C. 药物的剂量

剂量是决定药物作用强度的主要因素,在一定范围内,药物的作用随剂量的增加而增加,但超过一定范围,则可发生由量变到质变的现象,引起中毒甚至死亡。此即剂量对药物作用的影响,又称量—效关系。

(1) 最小有效量:开始呈现疗效的最小剂量。

(2) 极量:是指治疗量的最大限度,又称最大治疗量。

(3) 治疗量:指最小有效量与极量之间的剂量范围。

(4) 常用量:比最小有效量大而比极量小的剂量范围。

(5) 安全范围:指最小有效量与最小中毒量之间的范围。

(6) 治疗指数:指半数致死量 (LD_{50}) 与半数有效量 (ED_{50}) 的比值。它是衡量药物安全性的指标。治疗指数愈大,或

安全范围愈大，则临床应用时愈安全。

1.4.2 机体方面的因素

影响药物作用的机体方面的因素有：年龄、体重、性别、个体差异、病理状态、精神状态和环境等。个体差异对药物作用的影响 见表 1-3。

表 1-3 个体差异对药物作用的影响

个体差异		对药物敏感性	药物作用	停药反应	原因
过敏性		高	特异		遗传、免疫
高敏性		高	强		遗传、免疫
耐受性	先天	低	弱		遗传
	后天	低	弱		反复用药
依赖性	习惯性	低	弱	渴望再用	反复用药
	成瘾性	低	弱	渴望再用 戒断症状	反复用药

1.4.3 给药方法方面的因素

给药途径、给药时间和次数、配伍用药及反复用药均可影响药物的作用。给药途径不同，不仅影响药物作用的速度和强度，甚至影响药物作用的性质。配伍用药的目的是：使药物疗效增强和不良反应减少。配伍用药的结果 见图 1-2。

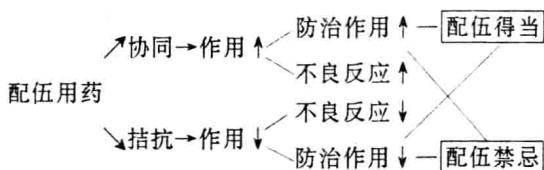


图 1-2 配伍用药结果