



JINYINGJIE.COM

直播学院

2021 中西医执业 医师资格考试

核心考点精学

直播笔记

——金英杰直播学员**专属**——

学霸笔记:

冬虫

笔记内容:

药理学1

适用考生:

王牌直播学员

上课阶段:

王牌直播课-核心精讲

上课时间:

2021年1月26日 19:30



- 学霸笔记
- 课后总结
- 考点梳理
- 查缺补漏



上课提醒

金英杰直播学院
专属内部资料

金英杰直播
智慧学习“医”学就会

金英杰直播学院

中西医专业

药理学 1

直播笔记

整理教辅:冬虫

2021年1月26日

药理学

重点章节：

第1章 药物作用的基本原理

第5章 拟肾上腺素

第15章 抗高血压药

第22章 糖皮质激素

第26章 抗生素

分类

药物名称

作用机制

药理作用

临床应用

不良反应

禁忌症

药物

药物效应动力学（药效学）

机体

药物代谢动力学（药动学）

第一节 药物效应动力学(药效学)

(一) 药物作用与药理效应

1. 药物作用的选择性

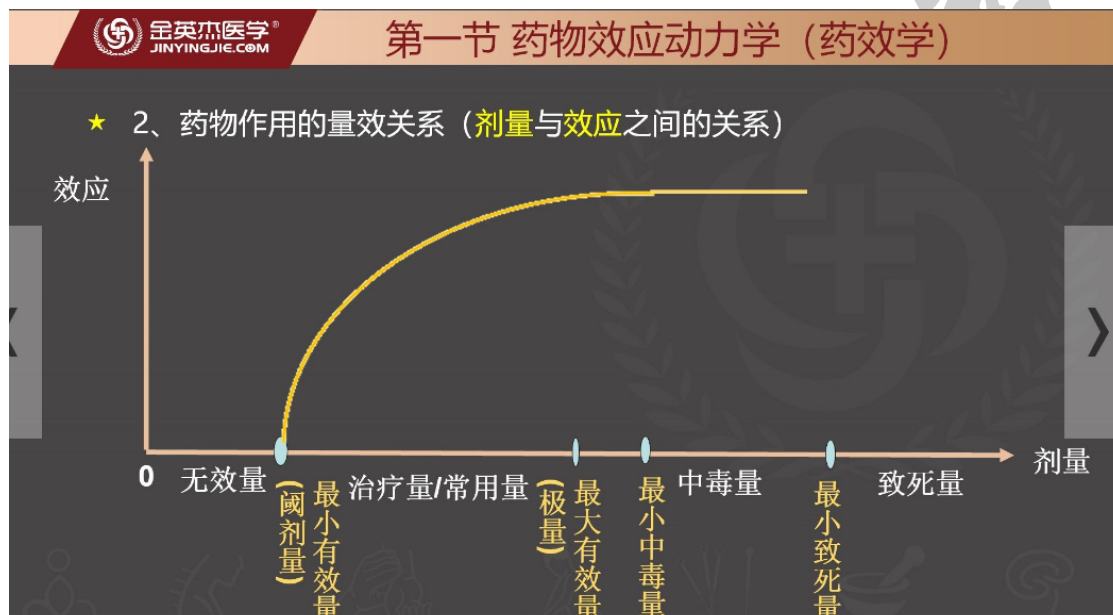
定义:多数药物在适当剂量时只对少数器官或组织产生明显作用而对其他器官或组织的作用较小或不产生作用。

选择性高的药物——针对性强,副作用少

选择性低的药物——针对性差，不良反应较多，但作用范围广

选择性:是相对的，与剂量密切相关。

随剂量增加——选择性降低



2、

药物作用的量效关系

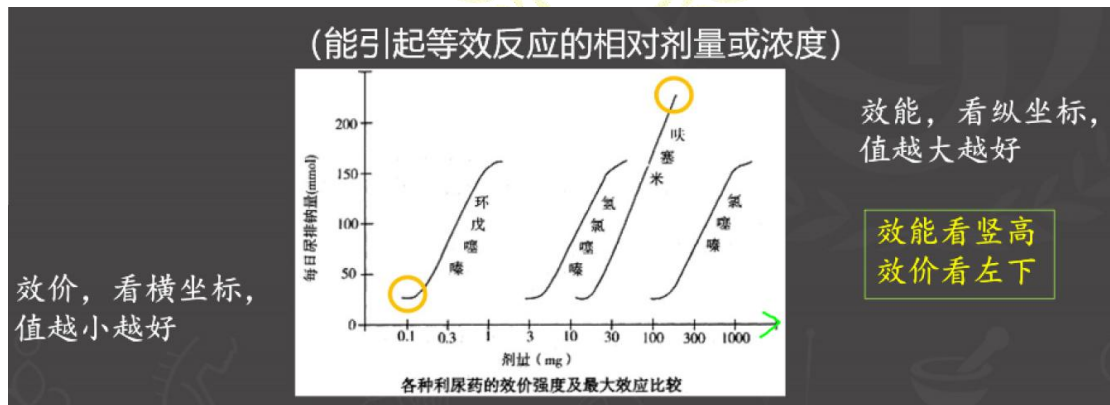
(1) 剂量与反应

药理效应	概念	举例
量反应	药物效应的强弱用数量表示	血压、心率
质反应	药理效应以阳性或阴性、全或无表示	死亡/不死亡 惊厥/不惊厥

(2)量效曲线:药物的效应为纵坐标, 剂量/ 血药浓度为横坐标

①效能:药物产生的最大效应

②效价强度:药物作用强弱的程度



(3)半数效应量: S 型曲线在效应 50%处的剂量。

半数有效量(ED50):引起 50%最大反应强度或引起 50%实验对象出现阳性反应时的药物剂量。 E 有效

半数中毒剂量(TD50) T 中毒

半数致死量(LD50) L 勒死

(4)治疗指数(TI)药物安全性的指标

$TI = LD50 / ED50$ L 死活安全 值越大, 越安全。

(5) 安全范围: ED 95~LD5;之间的距离

第一节 药物效应动力学 (药效学)

★★★ 二、药物的不良反应：药物产生的不符合用药目的或对患者不利的反应。

后遗效应	停药后血药浓度已降至阈浓度以下时仍残存的药理效应	巴比妥类镇静催眠药-宿醉现象-次晨仍有困倦、头昏、乏力等反应
停药反应	长期用药，突然停药，原有疾病重新出现/加剧	反跳现象-普萘洛尔
继发反应 (治疗矛盾)	药物发挥治疗作用所引起的不良反应	长期服用广谱抗生素-二重感染
药物依赖性	连续使用某些药物，产生的一种不可停用的渴求现象	生理依赖性/躯体依赖性/成瘾性 (强烈的戒断症状，生理变化) 心理依赖性/精神依赖性/习惯性 (不产生明显戒断症状，可自制，心理渴求)

药物的不良反应:药物产生的不符合用药目的或对患者不利的反应。

分类	定义	特点/举例
副反应	在治疗剂量时产生与治疗目的无关的作用	轻微，大多自行恢复；可预知，不能避免；与治疗作用可相互转换。 原因-药物的选择性低
毒性反应	用药量过大或时间过长所致机体损害性反应 特殊毒性：三致反应 (致癌、致畸、致突变)	比较严重； 可预知，应该避免； 原因-长期大量/机体敏感性过高
变态反应 (过敏反应)	少数过敏体质对某些药物产生的病理性免疫反应	药热、皮疹、哮喘、溶血性贫血、类风湿性关节炎、过敏性休克等；与原药理作用、剂量、疗程无关，不可预知
特异质反应	先天性遗传异常所致的反应	缺少酶； 与固有药理作用相关，剂量成正比

考点 3 药物作用的主要机制(受体激动药与拮抗药的基本概念)

药物作用的主要机制:受体机制(大多数药物)、非受体机制

分类	亲和力	内在活性	分类
激动药	有	有	完全激动药 (内在活性强-吗啡)
			部分激动药 (内在活性弱-喷他佐辛; 单用激动, 合用拮抗)
拮抗药 (阻滞药)	有	无	竞争性拮抗药 (可逆结合, 曲线不变形, 最大效应不变, 曲线平行右移)
			非竞争性拮抗药 (不可逆结合, 曲线变形, 最大效应下降)

竞争性拮抗药

海马争上游

非竞争性拮抗药

孔雀不开屏

(一)药物的吸收、分布、转化、排泄及其影响因素

1.吸收:药物由给药部位进入血液循环的过程(入血前)

吸收快, 起效快;

吸收多, 生物利用度高, 作用强

静脉注射和静脉滴注, 药物直接进入血液, 没有吸收过程。

不同给药途径吸收快慢依次为:吸入>舌下>肌肉注射>皮下注射>口服>直肠>皮肤。

(1)消化道给药

①口服给药:是常用的给药途径, 吸收部位为胃肠道(主要吸收部位-小肠)

影响因素:药物方面、机体方面

首过消除/首过效应:口服给药时,有些药物在进入体循环之前首先在胃肠道

肠黏膜细胞和肝脏被代谢灭活,导致进入体循环的药量**减少**,药效降低。

首过消除明显的药物不宜口服给药(硝酸甘油)

②舌下给药:吸收较快,可**避免首过消除**。

③直肠给药:可避免药物对上消化道的刺激性。

(2)注射给药

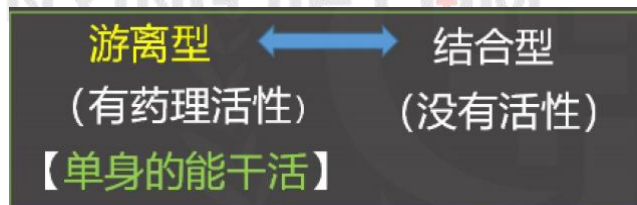
皮下注射、肌内注射——吸收迅速、完全,避免胃肠破坏和首过效应

(3)吸入给药——经呼吸道由肺泡吸收

(4)经皮给药——皮肤,局部/全身

2. 分布:药物吸收后随血液循环到各组织器官的过程。

影响药物分布因素:



(1)血浆蛋白结合率

(2)体内屏障

血脑屏障:药物一般很难进入脑脊液和脑细胞内(脂溶性高、分子量小的药物易于通过)

胎盘屏障:几乎所有药物都能穿过胎盘屏障进入胎儿体内(妊娠期用药注意)

血眼屏障:局部给药

2.分布:

(3)体液 pH 值

酸酸碱碱促吸收, 酸酸碱酸促排泄

酸性药物在酸性条件下易吸收, 碱性药物在碱性条件下易吸收

酸性药物在碱性条件下易排泄,碱性药物在酸性条件下易排泄

(碱化尿液)

(4)器官血流量

3.代谢(生物转化):

药物转化的器官主要是**肝脏**, 还有肠、肾、肺等

方式	第I时相	氧化、还原、水解 (极性大)
	第II时相	结合 (葡萄糖醛酸、硫酸、甘氨酸、谷胱甘肽等)
意义	灭活/活化	
转化酶系统	专一性酶	胆碱酯酶、单胺氧化酶等
	非专一酶	肝药酶P450

分类	定义	与其它药物合用	代表药
肝药酶诱导剂	使肝药酶的数量增加或活性提高	使其他药物的代谢加快, 药效减弱	苯巴比妥、苯妥英钠、卡马西平、利福平等
肝药酶抑制剂	使肝药酶的数量减少或活性减弱	使其他药物的代谢减慢, 药效增强	红霉素、氯霉素、环孢素、保泰松、西咪替丁、异烟肼、酮康唑等

红绿环抱夕阳美, 异乡独坐葡萄醉

4.排泄:药物及其代谢物被排出体外的过程。

肾脏是最主要的排泄器官。包括肾小球滤过、肾小管被动重吸收、肾小管主动分泌。还可经**肺、胆汁、腺体排泄**。

肾脏	肾小球滤过	大多数 游离型 药物及其代谢产物被滤过
	肾小管被动重吸收	脂溶性高、非解离型 易被重吸收
	肾小管主动分泌排泄	主动转运
胆汁	肝肠循环	有些药物可随着 胆汁 ，经肠黏膜上皮细胞吸收，经肝脏重新进入体循环（小肠、肝脏、胆汁间循环，作用时间 延长 ）

(二)半衰期和连续多次给药的药-时曲线

1.半衰期($t_{1/2}$):指血药浓度**下降一半**所需要的时间 $t_{1/2}=0.693/k$

①临床上连续多次给药,每隔1个 $t_{1/2}$ 用药一-次

②临床上连续多次给药,每隔1个 $t_{1/2}$ 用药一-次,通过4~6个 $t_{1/2}$ 后,体内药量

可达稳态水平的 **93.5%~98.4%** (首次剂量加倍可迅速达到稳态血药浓度 C_{ss} 坪值)

③停药后经过 **4-5个 $t_{1/2}$** 后血药浓度消除 **95%**以上,药物基本消除

半衰期计算题: $5 * t_{1/2}$

影响药物效应的因素

药物因素:药物的剂型、剂量、给药方式、联合用药(药动学因素、

药效学因素是主要方面)

机体因素:儿童、老年人、女性

1.药动学方面

吸收	改变胃肠道pH、吸附/络合/结合, 影响胃排空和肠蠕动, 改变肠壁功能
分布	竞争血浆蛋白结合
代谢	影响肝药酶、影响非微粒体酶
排泄	影响尿液pH、竞争转运载体

2.药效学方面

协同作用	相加作用	$1+1=2$
	增强作用	$1+1 > 2$
	增敏作用	敏感性增强
拮抗作用	药理学拮抗	一个受体
	生理性拮抗	两个受体
	化学性拮抗	中毒解救
	生化性拮抗	肝药酶

3.特殊人群因素

儿童	吸收慢、代谢/排泄慢
老人	吸收慢、代谢/排泄慢
女性	四期: 月经期、妊娠期、分娩期、哺乳期



药物的不良反应:药物产生的不符合用药目的或对患者不利的反应。

副反应	在 治疗剂量 时产生与治疗目的无关的作用	可预知, 不能避免, 大多轻微 (药物的选择性低)
毒性反应	用 药量过大 或时间过长所致机体损害性反应	比较严重, 可以预知, 应该避免
三致反应	致癌、致畸、致突变作用	
变态反应 (过敏反应)	少数过敏 体质对某些药物产生的病理性 免疫 反应	药热、皮疹等; 与 剂量无关
后遗效应	停药 后血药浓度已降至阈浓度以下时仍 残存 的药理效应	巴比妥类 催眠药次晨仍有困倦、头昏、乏力等反应
停药反应	长期用药, 突然 停药 , 原有 疾病加剧	反跳现象-降压药
继发反应	治疗矛盾	长期服用 广谱抗生素-二重感染
药物依赖性	一旦中断用药, 出现强烈的 戒断症状	生理依赖、心理依赖

三、药物作用的主要机制

分类	亲和力	内在活性	分类
激动药	有	有	完全激动药 (内在活性强-吗啡)
			部分激动药 (内在活性弱-喷他佐辛; 单用激动, 合用拮抗)
拮抗药 (阻滞药)	有	无	竞争性拮抗药 (可逆结合, 曲线不变形, 最大效应不变, 曲线平行右移)
			非竞争性拮抗药 (不可逆结合, 曲线变形, 最大效应下降)

吸收	静脉注射和静脉滴注, 没有吸收过程 吸收快慢为: 吸入>舌下>肌内注射>皮下注射>口服>直肠>皮肤 口服给药, 首过效应, 被肝代谢灭活, 药效降低
分布	血脑屏障: 药物一般很难进入脑内 (有用) 胎盘屏障: 几乎所有药物都能穿过胎盘 (没用)
代谢	肝 肝药酶诱导剂/抑制
排泄	肾 酸酸碱碱促吸收, 酸碱碱酸促排泄

半数致死量(LD50):

效应 50%处的剂量。 L 勒死

治疗指数 $TI = LD50/ED50$ L 死活安全

半衰期($t_{1/2}$)指血药浓度下降一半所需要的时间。 *5

M受体			N2受体	α 受体	β_1 受体	β_2 受体
眼	腺体	平滑肌	骨骼肌	血管	心脏	支气管

M 眼腺平滑肌

N 块骨 A 型血

BB 心支气管

胆碱受体激动药

M 受体激动药(拟胆碱药):直接激动 M 受体, 产生 M 样作用

药物	作用部位	药理作用	临床应用	不良反应
毛果芸香碱 ★★★	眼	缩瞳 (瞳孔括约肌收缩)		
		降低眼内压	(闭角型) 青光眼	
		调节痉挛 (近视-远物模糊)	虹膜睫状体炎 (与扩瞳药交替使用)	
	腺体	促进腺体分泌 (汗腺、唾液腺)	缓解口腔干燥	流涎、出汗
	平滑肌	兴奋平滑肌		恶心、呕吐

胆碱受体拮抗药

M 受体拮抗药(抗胆碱药):阻断 M 受体, 较大剂量阻断 N₁ 受体。

药物	作用部位	药理作用	临床应用	不良反应
阿托品 ★★★	眼	扩瞳 (瞳孔括约肌松弛)	检查眼底、儿童验光配镜	怕光
		升高眼内压		禁用青光眼
		调节麻痹 (远视-近物模糊)	虹膜睫状体炎	视物模糊
	腺体	抑制腺体分泌 (汗腺、唾液腺)	麻醉前给药(减少呼吸道分泌)、严重盗汗、流涎症	口干、皮肤干燥
	平滑肌	松弛平滑肌	内脏绞痛(胃肠) 胆肾绞痛需合用哌替啶	禁用幽门梗阻、 前列腺肥大

胆碱受体拮抗药

M受体拮抗药(抗胆碱药):阻断M受体,较大剂量阻断N1受体。

药物	作用部位	药理作用	临床应用	不良反应
阿托品	兴奋心脏	加快心率	缓慢型心律失常	心悸
	扩张小血管	改善微循环	感染性休克	皮肤潮红
	兴奋中枢		有机磷中毒解救	眩晕、惊厥

毛果芸香碱	减	向下	缩瞳	降低眼内压	调节痉挛	近视
阿托品	托	向上	扩瞳	升高眼内压	调节麻痹	远视

阿托品类生物碱		中东麻醉 山外休克	
药物	药理作用	临床应用	
(中枢强) 东莨菪碱	抑制腺体分泌	麻醉前给药	
	抑制中枢	帕金森病	
	防晕防吐	晕动病(防晕防吐)	
(外周强) 山莨菪碱	改善微循环	感染中毒性休克 (改善微循环)	
	解痉	内脏平滑肌绞痛	
		血管神经性头痛	
人工合成品 (654-2)		眩晕症	

阿托品的人工合成代用品

分类	药物	药理作用	临床应用
合成散瞳药	后马托品	扩瞳	眼科检查、验光 (起效快,持续时间短,不良反应轻)
合成解痉药	溴化丙胺太林 (普鲁苯辛)	解痉、减少 胃液分泌 中枢安定	胃、十二指肠溃疡, 胃肠痉挛
	贝那替康 (胃复康)		



金英杰医学
JINYINGJIE.COM



金英杰医学
JINYINGJIE.COM



金英杰医学
JINYINGJIE.COM

医学培训知名品牌
致力于建立完整的医学服务产业链



金鹰直播课



王牌直播课



王牌联盟班



上课提醒

医学优选,金英杰教育

全国免费咨询热线: 400-900-9392 客服及投诉电话: 400-606-1615

地址: 北京市海淀区学清路甲38号金码大厦B座22层



金英杰医学
JINYINGJIE.COM



金英杰医学
JINYINGJIE.COM