

2021年《药学专业知识一》100 考点+例题

核心考点：常见的药物命名

药物的名称包括药物的通用名、化学名和商品名。

| 名称  | 特点   |
|-----|--|
| 商品名 | 针对药物的最终产品，制药企业自己进行选择的  |
| 通用名 | 也称为国际非专利药品名称（INN），是药典中使用的名称；通常是指有活性的药物物质，而不是最终药品；一个药物只有一个药品通用名 |
| 化学名 | 根据其化学结构式来进行命名  |

【例题】

下列关于药物命名的说法正确的是

- A. 含同样活性成分的同一种药品，可以使用其他企业的商品名
- B. 药品商品名在选用时最好暗示药物的疗效和用途
- C. 药物的化学名是以一个母体为基本结构，然后将其他取代基的位置和名称标出
- D. 国际非专利药品名称通常指的是最终药品
- E. 药品通用名受专利保护

【正确答案】C

【答案解析】含同样活性成分的同一种药品，每个企业应有自己的商品名，不得冒用、顶替别人的药物商品名称。药品商品名在选用时不能暗示药物的疗效和用途。国际非专利药品名称通常指有活性的药物物质，不是最终的药品。药品通用名不受专利和行政保护，是所有文献、资料、教材以及药品说明书中标明有效成分的名称。

核心考点：药物的来源和分类

| 分类   | 来源                  | 具体药物                         |
|------|---------------------|------------------------------|
| 化学药  | 化学合成方法得到            | 小分子的有机或无机药物                  |
| 中药   | 以中国传统医药理论指导采集、炮制、制剂 | 植物药、动物药、矿物药及部分化学、生物制品类药物     |
| 生物制品 | 通过生物技术制得            | 以微生物、细胞及各种动物和人源的组织、液体等生物材料制备 |

【例题】

下列属于化学药的是

- A. 植物药
- B. 动物药
- C. 小分子有机药物
- D. 矿物药
- E. 抗体

【正确答案】C

【答案解析】ABD 属于中药, E 属于生物制品。

### 核心考点: 制剂和剂型的概念

适合于疾病的诊断、治疗或预防的需要而制备的不同给药形式, 称为药物剂型, 简称剂型, 如片剂、胶囊剂、注射剂等。

药物制剂系指将原料药物按照某种剂型制成一定规格并具有一定质量标准的具体品种, 简称制剂。根据制剂命名原则, 制剂名=药物通用名+剂型名, 如维生素 C 片、阿莫西林胶囊、鱼肝油胶丸等。

### 【例题】

为适应治疗或预防的需要而制成的药物应用形式称为

- A. 调剂
- B. 剂型
- C. 方剂
- D. 制剂
- E. 药剂学

【正确答案】B

【答案解析】剂型的概念: 为适应治疗或预防的需要而制成的药物应用形式, 称为药物剂型, 简称剂型。

### 核心考点: 剂型的分类

| 分类方式 | 具体剂型   |
|------|--|
| 形态学  | 液体剂型、气体剂型、固体剂型、半固体剂型   |
| 给药途径 | 胃肠道给药剂型: 散剂、片剂、颗粒剂、胶囊剂、溶液剂、乳剂、混悬剂<br>非经胃肠道给药剂型: 注射剂、贴剂、含片、滴鼻剂、气雾剂、眼膏 |

|      |                         |
|------|-------------------------|
|      | 剂、栓剂                    |
| 分散系统 | 真溶液、乳剂、混悬液、气体分散、固体分散、微粒 |
| 制法   | 不常用, 如浸出、无菌             |
| 作用时间 | 速释、普通和缓控释制剂             |

**【例题】**

下列不属于剂型分类方法的是

- A. 按给药途径分类
- B. 按分散系统分类
- C. 按制法分类
- D. 按形态分类
- E. 按药理作用分类

**【正确答案】** E

**【答案解析】** 本题考查的知识点是剂型分类方法, 包括按形态学分类、按给药途径分类、按分散体系分类、按制法分类、按作用时间分类。

**核心考点: 药物制剂稳定性变化**

| 稳定性变化 | 具体变化   | 具体药物                  |
|-------|--|-----------------------|
| 化学    | 水解   | 酯类和酰胺类药物 (盐酸普鲁卡因、青霉素) |
|       | 氧化   | 酚类和烯醇类药物 (吗啡、维生素 C)   |
|       | 异构化  | 肾上腺素、毛果芸香碱            |
|       | 聚合   | 氨苄西林钠、塞替派             |
|       | 脱羧   | 对氨基水杨酸钠               |
| 物理    | 混悬剂颗粒结块、结晶生长; 乳剂的分层、破裂; 胶体制剂的老化; 片剂崩解度、溶出速度的改变 |                       |
| 生物    | 药物的酶败分解变质                                      |                       |

其中, 水解和氧化是药物降解的两个主要途径。

**【例题】**

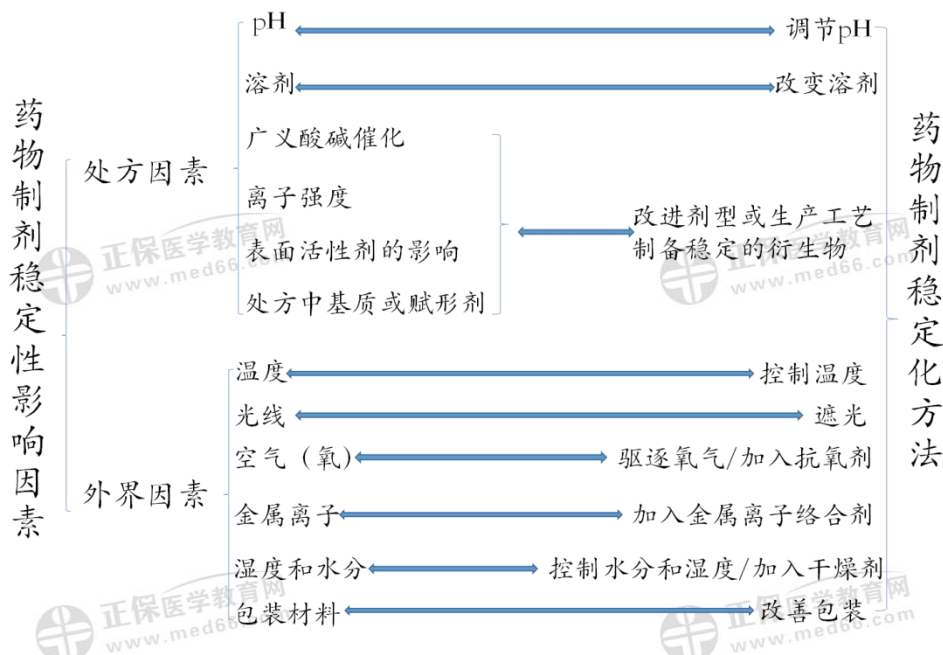
三种现象均属于药物制剂化学稳定性变化的是

- A. 乳剂分层、混悬剂结晶生长、片剂溶出速度改变
- B. 药物水解、结晶生长、颗粒结块
- C. 药物氧化、颗粒结块、溶出速度改变
- D. 药物降解、乳液分层、片剂崩解度改变
- E. 药物水解、药物氧化、药物异构化

【正确答案】E

【答案解析】药物水解、药物氧化、药物异构化均属于药物制剂化学稳定性变化。

核心考点：影响药物制剂稳定性的因素及药物制剂稳定化方法



【例题】

下列不属于影响药物稳定性的处方因素是

- A. 温度
- B. pH 值
- C. 溶剂
- D. 离子强度
- E. 辅料

【正确答案】A

【答案解析】温度属于环境因素。

核心考点：药物稳定性试验方法

|              |  |
|--------------|--|
| 稳定化试验方法      | 考点   |
| 影响因素试验（强化试验） | 用 1 批原料药或 1 批制剂进行；高温、高湿、强光，10 天→筛选工艺、选择包材、确定贮存条件 |
| 加速试验         | 用 3 批供试品进行，超常实验条件下进行，利用分解速度推测降低到某浓度需要的时间         |
| 长期试验（留样观察法）  | 3 批；接近实际贮存条件下贮藏，1—2 年，确定有效期                      |

**【例题】**

下列关于稳定性试验的说法中错误的是

- A. 加速试验可以预测药物的有效期
- B. 长期试验可用于确定药物的有效期
- C. 影响因素试验包括加速试验和长期试验
- D. 长期试验应在实际贮存条件下进行
- E. 加速试验应在超常试验条件下进行

**【正确答案】** C

**【答案解析】**影响因素试验包括的是高温、高湿和强光试验，不是加速试验和长期试验。

**核心考点：抗氧剂的选择**

| 抗氧剂/金属离子络合剂 | 名称                                    |
|-------------|---------------------------------------|
| 水溶性抗氧剂      | 焦亚硫酸钠、亚硫酸氢钠（适用于弱酸性溶液）                 |
|             | 亚硫酸钠、硫代硫酸钠（适用于偏碱性药物溶液）                |
|             | 硫脲、维生素 C、半胱氨酸                         |
| 油溶性抗氧剂      | 叔丁基对羟基茴香醚（BHA）、2,6-二叔丁基对甲酚（BHT）、维生素 E |
| 金属离子络合剂     | 依地酸二钠（EDTA-2Na）、枸橼酸、酒石酸               |

**【例题】**

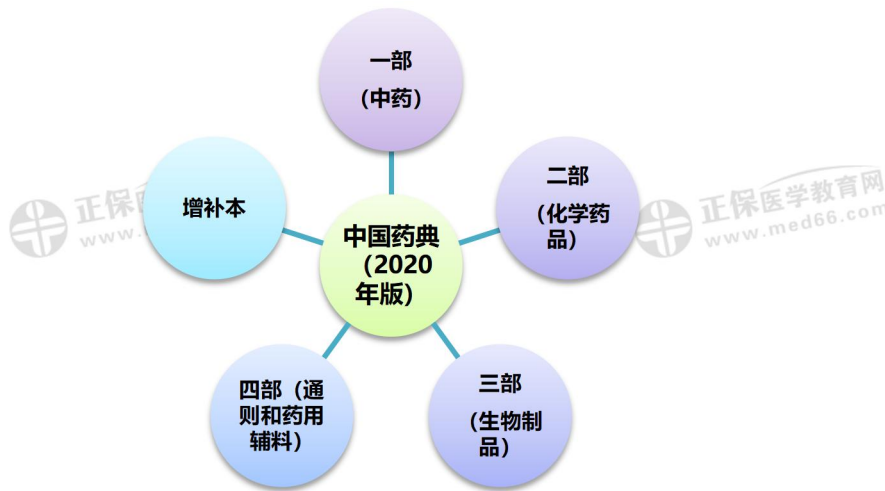
下列属于油溶性抗氧剂的是

- A. 亚硫酸氢钠
- B. 生育酚
- C. 枸橼酸
- D. 亚硫酸钠
- E. 苯丙氨酸

【正确答案】B

【答案解析】油性抗氧化剂常用叔丁基对羟基茴香醚(BHA)、二丁甲苯酚(BHT)、生育酚等。

核心考点：《中国药典》组成



【例题】

药典中，收载阿司匹林“含量测定”部分是

- A. 一部的凡例
- B. 一部的正文
- C. 一部附录
- D. 二部的凡例
- E. 二部的正文

【正确答案】E

【答案解析】考查药典的结构。阿司匹林属于化学药品，所以收载在二部。含量测定属于正文内容，所以答案为E。正文内容包含了品名、有机药物的结构式、分子式与分子量、来源或有机药物的化学名称、含量或效价的规定、处方、制法、性状、鉴别、检查、含量或效价测定、类别、规格、贮藏及制剂等。

核心考点：体内药物检测-体内样品的种类



生物样品如血液、尿液、胆汁、心脏、肝脏、肾脏、胃肠、脑、子宫、骨骼肌等。血液最常用。

### 1. 血样的分类和特点

| 分类 | 特点            |
|----|---------------|
| 全血 | 通常采静脉血，加抗凝剂   |
| 血浆 | 全血+抗凝剂→离心→上清液 |
| 血清 | 全血→离心→上清液     |

这里注意血清是不加抗凝剂的！

2. 尿液：主要用于药物尿液累积排泄量、尿清除率或生物利用度的研究。

#### 【例题】

将采集的全血置含有抗凝剂的离心管中，混匀后，以约  $1500 \times g$  离心力离心 5~10 分钟，分取上清液为

- A. 血浆
- B. 血清
- C. 血小板
- D. 红细胞
- E. 血红素

【正确答案】A

【答案解析】将采集的全血置含有抗凝剂的离心管中，混匀后，以约  $1500 \times g$  离心力离心 5~10 分钟，分取上清液即为血浆。

#### 核心考点：体内药物检测-体内样品的测定法

1. 免疫分析法包括：放射免疫法（灵敏度最高）、荧光免疫法、发光免疫法、酶免疫法及电化学免疫法。带免疫二字，特别专属，多适用于临床样本。

2. 色谱分析法包括：气相色谱法（GC）、高效液相色谱法（HPLC）和色谱-质谱联用法（GC-MS、LC-MS）等。带色谱二字，分离效果好，适用于复杂组分。

#### 【例题】

下列色谱法中不用于体内样品测定的是

- A. 气相色谱法
- B. 高效液相色谱法

- C. 气相色谱-质谱联用
- D. 薄层色谱法
- E. 液相色谱-质谱联用

【正确答案】D

【答案解析】色谱分析包括：气相色谱（GC）、高效液相色谱（HPLC）和色谱-质谱联用（GC-MS、LC-MS）等，这些方法适用于复杂样品中微量药物的专属准确定量，多用于药代动力学研究。

#### 核心考点：创新药质量研究

1. 药品特性检查指导原则。
2. 药品杂质分析指导原则。
3. 注射剂安全性检查法应用指导原则：异常毒性、细菌内毒素（或热原）、降压物质（包括组胺类物质）、过敏反应、溶血与凝聚等。

4. 药品稳定性试验指导原则。

#### 【例题】

（多选题）创新药质量研究中注射剂安全性检查包括

- A. 异常毒性
- B. 细菌内毒素
- C. 降压物质
- D. 过敏反应
- E. 溶血与凝聚

【正确答案】ABCDE

【答案解析】注射剂安全性检查包括异常毒性、细菌内毒素（或热原）、降压物质（包括组胺类物质）、过敏反应、溶血与凝聚等项。

#### 核心考点：仿制药质量一致性评价

1. 药品晶型与杂质模式研究。
2. 药物溶出度评价：试验制剂与参比制剂在不同溶出介质中的溶出度一致性。
3. 仿制药人体生物等效性试验。

#### 【例题】

（多选题）仿制药质量一致性评价包括

- A. 药品晶型研究



- B. 药品杂质模式研究
- C. 药物溶出度评价
- D. 药代动力学研究
- E. 药效动力学研究

【正确答案】ABCDE

【答案解析】仿制药质量一致性评价包括药品晶型与杂质模式研究、药物溶出度评价、仿制药人体生物等效性试验。生物等效性研究方法按照研究方法评价效力，其优先顺序为药代动力学研究、药效动力学研究、临床研究和体外研究。

### 核心考点：药品质量检查

#### (1) 药品质量检验分类

根据监管目的一般可分为监督抽检和评价抽检。

监督抽检是指药品监督管理部门根据监管需要对质量可疑药品进行的抽查检验；评价抽检是指药品监督管理部门为评价某类或一定区域药品质量状况而开展的抽查检验。

#### (2) 检验工作基本程序

药品检验是药品在进入市场前或临床使用前的质量分析，是药品质量监督与控制的一个重要环节。药品检验工作的基本程序有抽样、检验和出具检验报告等环节。

### 【例题】

药品监督管理部门根据监管需要对质量可疑药品进行的药品质量检验是

- A. 评价抽检
- B. 监督抽检
- C. 复核抽验
- D. 出厂抽验
- E. 委托抽验

【正确答案】B

【答案解析】监督抽检是指药品监督管理部门根据监管需要对质量可疑药品进行的抽查检验，评价抽检是指药品监督管理部门为评价某类或一定区域药品质量状况而开展的抽查检验。

### 核心考点：药物的溶解度、分配系数和渗透性对药效的影响

药物的吸收、分布、排泄过程是在水相和脂相间经多次分配实现的，因此要求药物既具有脂溶性又有水溶性。药物的溶解性可以用脂水分配系数  $P$  表示， $P$  值越大，药物的脂溶性

越高, P 值适宜, 脂溶性适宜, 药效为佳。

**【例题】**

关于药物的分配系数对药效的影响叙述正确的是

- A. 分配系数适当, 药效为好
- B. 分配系数越小, 药效越好
- C. 分配系数越大, 药效越好
- D. 分配系数越小, 药效越差
- E. 分配系数愈小, 药效愈差

**【正确答案】** A

**【答案解析】** 脂水分配系数可以反应药物的水溶性和脂溶性。药物的吸收、分布、排泄过程是在水相和脂相间经多次分配实现的, 因此要求药物既具有脂溶性又有水溶性。

**核心考点: 药物的酸碱性、解离度和  $pK_a$  对药效的影响**

有机药物多数为弱酸或弱碱, 由于体内不同部位 pH 不同, 影响药物的解离程度, 使解离形式和非解离形式药物的比例发生变化。

$$\text{酸性药物: } \lg \frac{[HA]}{[A^-]} = pK_a - pH$$

$$\text{碱性药物: } \lg \frac{[B]}{[HB^+]} = pH - pK_a$$

$pK_a$  是解离常数; pH 是体液的 pH;  $[HA]/[B]$  是非解离型酸/碱药物浓度;  $[A^-]/[HB^+]$  是解离型酸/碱药物浓度。

**【例题】**

下面药物中最易在肠道吸收的是

- A. 奎宁 (弱碱  $pK_a$  8.0)
- B. 苯巴比妥 (弱酸  $pK_a$  7.4)
- C. 阿司匹林 (弱酸  $pK_a$  3.5)
- D. 吡哌美辛 (弱酸  $pK_a$  4.5)
- E. 胍乙啶 (强碱)

**【正确答案】** A

**【答案解析】** 肠道环境为弱碱性, 弱碱性药物在肠中主要是以非解离型存在的, 吸收多, 而弱酸性和强碱性的药物在肠道中主要是以离子形式存在的, 吸收少。

**核心考点: 药物的典型官能团对生物活性的影响**

| 官能团                 | 对生物活性影响                   | 举例                         |
|---------------------|---------------------------|----------------------------|
| 一般能使脂溶性加大, 水溶性变差的基团 |                           |                            |
| 烃基                  | 改变溶解度、解离度、分配系数, 位阻↑, 稳定性↑ | -                          |
| 卤素(吸电子, 脂溶性)        | 影响电荷分布、脂溶性及作用时间           | 安定作用: 氟奋乃静 > 奋乃静           |
| 醚和硫醚                | 醚类在脂-水交界处定向排布, 易通过生物膜     | 硫醚类可氧化成亚砷或砷, 极性↑           |
| 非季铵的胺类              | N上有未共用电子对, 显碱性, 易与受体形成氢键  | 活性: 伯胺 > 仲胺 > 叔胺           |
| 磺酸酯、羧酸酯             | 成酯, 脂溶性↑, 易吸收             | 酯类前药: 增加吸收, 减少刺激           |
| 一般能使水溶性加大, 脂溶性变差的基团 |                           |                            |
| 季铵                  | 季铵易电离成稳定的铵离子              | 作用强, 水溶性大, 难透过生物膜, 往往无中枢作用 |
| 羟基                  | 增强与受体结合力, 水溶性↑, 改变活性      | -                          |
| 磺酸、羧酸               | 酸可在碱性条件下成盐, 水溶性增强         | 磺酸和羧酸成酯: 脂溶性增加, 易吸收        |

**【例题】**

酸类药物成酯后, 其理化性质变化是

- A. 脂溶性增大, 易离子化
- B. 脂溶性增大, 不易通过生物膜
- C. 脂溶性增大, 刺激性增加
- D. 脂溶性增大, 易吸收
- E. 脂溶性增大, 与碱性药物作用强

**【正确答案】** D

**【答案解析】** 成酯后脂溶性增大, 易透过生物膜, 易吸收。

**核心考点:** 药物与作用靶标结合的化学本质

| 键合类型        | 举例                             |
|-------------|--------------------------------|
| 共价键(不可逆)    | 烷化剂类抗肿瘤药物与 DNA 中鸟嘌呤碱基键合形式      |
| 非共价 离子键(盐键) | 去甲肾上腺素体内成铵盐后与 $\beta_2$ 肾上腺素受体 |

| 键 (可逆)          | 作用                                     |
|-----------------|--|
| 氢键 (最常见的非共价键形式) | 磺酰胺类利尿药通过氢键和碳酸酐酶结合; 水杨酸甲酯形成分子内氢键治疗肌肉疼痛 |
| 离子-偶极和偶极-偶极     | 羰基化合物, 如美沙酮和阿片受体的作用                    |
| 电荷转移复合物         | 抗疟药氯喹可以插入到疟原虫的 DNA 碱基对之间的作用            |
| 疏水性相互作用         | 药物非极性部分与生物大分子非极性部分相互作用                 |
| 范德华引力           | 非极性分子中的暂时不对称电荷分布                       |
| 金属离子络合物         | 铂金属络合物; 二巯基丙醇作为锑、砷、汞的螯合解毒剂             |

**【例题】**

盐酸普鲁卡因与药物受体的作用方式不包括

- A. 静电作用
- B. 偶极作用
- C. 范德华力
- D. 共价键
- E. 疏水作用

**【正确答案】** D

**【答案解析】** 本题考查盐酸普鲁卡因与药物受体的作用方式。除 D 答案共价键外, 均正确, 故本题答案应选 D。

**核心考点:** 药物结构与第 I 相生物转化的规律



**【例题】**

不属于药物代谢第 I 相生物转化中的化学反应是

- A. 氧化
- B. 还原
- C. 水解
- D. 羟基化
- E. 与葡萄糖醛酸结合

**【正确答案】** E

**【答案解析】**第 I 相生物转化, 也称为药物的官能团化反应, 是体内的酶对药物分子进行的氧化、还原、水解、羟基化等反应, 在药物分子中引入或使药物分子暴露出极性基团, 如羟基、羧基、巯基、氨基等。与葡萄糖醛酸结合属于第 II 相生物结合。

**核心考点: 药物结构与第 II 相生物转化的规律**

药物第 II 相生物转化规律如下表所示:

| 类型       | 反应          | 参与反应的药物类型及代表药物                               |
|----------|-------------|--|
| 极性和水溶性增强 | 与葡萄糖醛酸的结合反应 | O、N、S、C 的葡萄糖醛苷化和 O、N、S 的葡萄糖醛酸酯化、酰胺化 (吗啡、氯霉素) |
|          | 与硫酸的结合反应    | 羟基、氨基、羟氨基 (沙丁胺醇)                             |
|          | 与氨基酸的结合反应   | 羧酸类 (苯甲酸、水杨酸)                                |
|          | 与谷胱甘肽的结合反应  | 白消安  |

|              |         |                          |
|--------------|---------|--------------------------|
| 极性和水<br>溶性降低 | 乙酰化结合反应 | 伯氨基、氨基酸、磺酰胺、肼、酰肼（对氨基水杨酸） |
|              | 甲基化结合反应 | 酚羟基、胺基、巯基（肾上腺素、褪黑激素）     |

**【例题】**

以下哪种药物的代谢是与 GSH 结合

- A. 对氨基水杨酸
- B. 肾上腺素
- C. 氯霉素
- D. 苯甲酸
- E. 白消安

**【正确答案】** E

**【答案解析】** 抗肿瘤药物白消安与谷胱甘肽的结合，由于甲磺酸酯是较好的离去基团，先和巯基生成硫醚的结合物，然后生成的硫醚和分子中的另一个甲磺酸酯基团作用环合形成氢化噻吩。

**核心考点：组胺 H<sub>1</sub> 受体阻断剂抗过敏药分类**

抗过敏药按化学结构可分为乙二胺类、氨基醚类、丙胺类、三环类、哌嗪类和哌啶类。

**【例题】**

组胺 H<sub>1</sub> 受体阻断药包括下列类别

- A. 氨基醚类
- B. 丙胺类
- C. 三环类
- D. 哌啶类
- E. 哌嗪类

**【正确答案】** ABCDE

**【答案解析】** 本题考点是组胺 H<sub>1</sub> 受体阻断药的结构分类，包括氨基醚类、丙胺类、三环类、哌嗪类、哌啶类等。故本题选 ABCDE。

**核心考点：组胺 H<sub>1</sub> 受体阻断剂抗过敏药-氨基醚类**

盐酸苯海拉明：临床用于皮肤、黏膜变态反应性疾病。

茶苯海明：苯海拉明与 8-氯茶碱成盐。防治晕动症，对肿瘤化疗引起的恶心、呕吐无



效。

**【例题】**

为克服苯海拉明的嗜睡和中枢抑制副作用，与具有中枢兴奋作用的 8-氯茶碱结合成的盐，用于防治晕动症的是

- A. 盐酸苯海拉明
- B. 茶苯海明
- C. 司他斯汀
- D. 马来酸氯苯那敏
- E. 异丙嗪

**【正确答案】** B

**【答案解析】** 茶苯海明是为克服苯海拉明的嗜睡和中枢抑制副作用，与具有中枢兴奋作用的 8-氯茶碱结合成的盐，用于防治晕动症：如晕车、晕船、晕机所致的恶心、呕吐；对肿瘤化疗引起的恶心、呕吐无效。

**核心考点：组胺 H<sub>1</sub> 受体阻断剂抗过敏药-丙胺类**

氯苯那敏和溴苯那敏。H<sub>1</sub> 受体优映体均为 S- (+) -体。临床使用氯苯那敏外消旋体的马来酸盐（扑尔敏）。

马来酸氯苯那敏对组胺 H<sub>1</sub> 受体的竞争性阻断作用甚强，且作用持久。对中枢抑制作用较弱，嗜睡副作用较小，抗胆碱作用也较弱，适用于日间服用，治疗荨麻疹、过敏性鼻炎、结膜炎等。

**【例题】**

氯苯那敏属于

- A. 选择性 β<sub>2</sub> 受体激动剂
- B. α 受体激动剂
- C. α、β 受体激动剂
- D. H<sub>2</sub> 受体阻断剂
- E. H<sub>1</sub> 受体阻断剂

**【正确答案】** E

**【答案解析】** 氯苯那敏属于丙胺类 H<sub>1</sub> 受体阻断剂。

**核心考点：组胺 H<sub>1</sub> 受体阻断剂抗过敏药-三环类**

异丙嗪是最早的吩噻嗪结构的三环类抗组胺药。

第二代抗组胺药氯雷他定为阿扎他定的结构改造物。

地氯雷他定: 氯雷他定的活性代谢物, 第三代  $H_1$  受体阻断药。

**【例题】**

最早发现的吩噻嗪结构的三环类抗组胺药, 能竞争性阻断组胺  $H_1$  受体而产生抗组胺作用的是

- A. 盐酸苯海拉明
- B. 茶苯海明
- C. 司他斯汀
- D. 马来酸氯苯那敏
- E. 异丙嗪

**【正确答案】** E

**【答案解析】** 异丙嗪是最早发现的吩噻嗪结构的三环类抗组胺药, 能竞争性阻断组胺  $H_1$  受体而产生抗组胺作用。

**核心考点: 组胺  $H_1$  受体阻断剂抗过敏药-哌嗪类**

第二代抗组胺药西替利嗪结构中含有一个手性中心, 具有旋光性, 左旋体活性比右旋体活性更强。用于治疗季节性过敏性鼻炎(花粉症)。

**【例题】**

属于哌嗪类  $H_1$  受体阻断剂, 结构中含有一个手性中心, 具有旋光性, 左旋体活性比右旋体活性强, 用于治疗季节性过敏性鼻炎(花粉症)的是

- A. 氯苯那敏
- B. 氯雷他定
- C. 肾上腺素
- D. 麻黄碱
- E. 西替利嗪

**【正确答案】** E

**【答案解析】** 西替利嗪属于哌嗪类  $H_1$  受体阻断剂, 用于治疗季节性过敏性鼻炎(花粉症)。

**核心考点: 组胺  $H_1$  受体阻断剂抗过敏药-哌啶类**

特非那定和阿司咪唑, 因主要导致 Q-T 间期延长和尖端扭转型室性心动过速等心脏不良反应, 被撤市。

卡瑞斯汀: 依巴斯汀的活性代谢物, 抗组胺作用比依巴斯汀更强。

**【例题】**

因主要导致 Q-T 间期延长和尖端扭转型室性心动过速等心脏不良反应, 被撤市的是

- A. 依巴斯汀
- B. 伐地昔布
- C. 特非那定
- D. 卡瑞斯汀
- E. 培哌普利

**【正确答案】** C

**【答案解析】** 特非那定和阿司咪唑, 因主要导致 Q-T 间期延长和尖端扭转型室性心动过速等心脏不良反应, 被撤市。

**核心考点: 拟肾上腺素药- $\alpha$ 、 $\beta$ 受体激动药**

肾上腺素可直接激动  $\alpha$ 、 $\beta$  受体; 麻黄碱可促进肾上腺素能神经末梢释放递质, 间接产生拟肾上腺素作用。

肾上腺素是内源性的体内神经递质, 分子中含邻二酚羟基(儿茶酚胺)。临床上用于过敏性休克、心脏骤停的急救, 控制支气管哮喘的急性发作。

地匹福林: 利用前药原理, 将肾上腺素苯环上的两个羟基酯化, 获得双特戊酯药物。可改善透膜吸收, 并延长作用时间(长链)。

盐酸麻黄碱: 分子中含有 2 个手性碳原子, 共有四个光学异构体, 药用麻黄碱为 (1R, 2S)-赤藓糖型。

**【例题】**

利用前药原理, 将肾上腺素苯环上的两个羟基酯化, 获得双特戊酯药物, 临床用于治疗开角型青光眼, 该药物是

- A. 地匹福林
- B. 多巴胺
- C. 麻黄碱
- D. 去甲肾上腺素
- E. 伪麻黄碱

**【正确答案】** A

**【答案解析】** 利用前药原理, 将肾上腺素苯环上的两个羟基酯化, 获得双特戊酯药物地

匹福林, 该药物可改善透膜吸收, 并延长作用时间。用于治疗开角型青光眼, 在眼内角膜酯酶的作用下, 迅速水解为肾上腺素而发挥作用, 产生散瞳、降眼压作用。

### 核心考点: 拟肾上腺素药- $\alpha$ 受体激动药

$\alpha_1$ 受体激动药可收缩周围血管, 外周阻力增加, 血压上升, 临床主要用于治疗低血压和抗休克。

$\alpha_2$ 受体激动时可反馈抑制去甲肾上腺素的释放, 具有较强的降压作用,  $\alpha_2$ 受体激动药临床主要用于治疗高血压。

盐酸可乐定为良好的中枢性降压药。直接激动脑内  $\alpha_2$ 受体, 导致血压下降, 临床上主要用于原发性及继发性高血压。

甲基多巴: 前药, 较适用于肾性高血压和妊娠高血压。

### 【例题】

较适用于肾性高血压和妊娠高血压的是

- A. 去甲肾上腺素
- B. 可乐定
- C. 甲基多巴
- D. 多巴胺
- E. 多巴酚丁胺

【正确答案】C

【答案解析】甲基多巴治疗高血压、较适用于肾性高血压和妊娠高血压。

### 核心考点: 拟肾上腺素药- $\beta$ 受体激动药

沙丁胺醇市售外消旋体, 可用于各型支气管哮喘。

沙美特罗: 长效  $\beta_2$ 受体激动药。

班布特罗: 特布他林的酯前药。

### 【例题】

沙丁胺醇属于

- A.  $\alpha_1$ 受体激动药
- B.  $\alpha_2$ 受体激动药
- C.  $\beta$ 受体阻断药
- D. 选择性  $\beta_1$ 受体激动药
- E. 选择性  $\beta_2$ 受体激动药

【正确答案】E

【答案解析】沙丁胺醇属于选择性 $\beta_2$ 受体激动药，可用于各型支气管哮喘以及伴有支气管痉挛的各种支气管及肺部疾患。

### 核心考点：非甾体抗炎药

#### 1. 分类

##### (1) 羧酸类

芳基乙酸类：吲哚美辛、舒林酸、双氯芬酸

芳基丙酸类：布洛芬、萘普生、酮洛芬

##### (2) 非羧酸类

昔康类（1, 2-苯并噻嗪类）：××昔康

昔布类：XX 昔布

#### 2. 构效关系和作用特点

##### (1) 芳基丙酸类

布洛芬在体内无效的（R）异构体可转化为有效的（S）异构体，临床用外消旋体。

##### (2) 昔康类和昔布类

昔康类化合物具有酸性。

昔布类是一类选择性的COX-2抑制药。

### 【例题】

具有手性中心，在体内可发生对映异构体转化的非甾体抗炎药物是

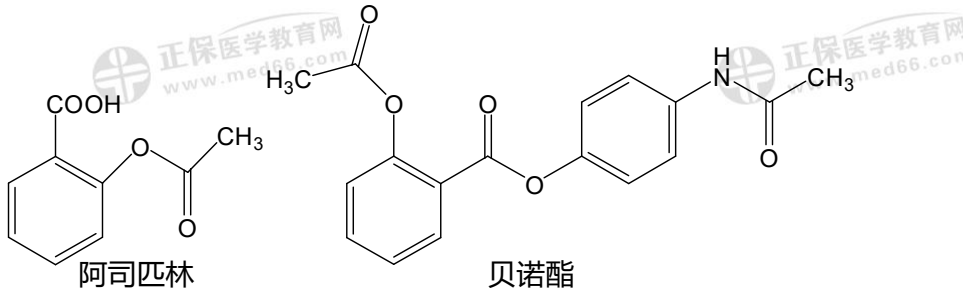
- A. 吲哚美辛
- B. 布洛芬
- C. 双氯芬酸
- D. 吡罗昔康
- E. 塞来昔布

【正确答案】B

【答案解析】布洛芬的R-(-)-异构体在体内可转化为S-(+)-异构体，故使用时不必拆分，目前临床上使用消旋体。

### 核心考点：解热镇痛药的构效关系和作用特点

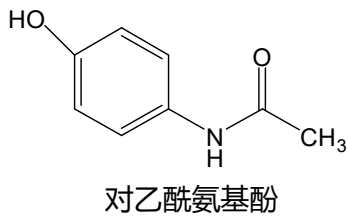
#### (1) 水杨酸类



阿司匹林结构中的酯键可水解产生水杨酸，含有酚羟基可发生氧化反应。

阿司匹林水解生成的水杨酸与三氯化铁试液反应，呈紫堇色。此反应可用于本品的鉴别。

(2) 苯胺类



对乙酰氨基酚结构中含有酰胺键，相对稳定，贮藏不当发生水解。极少数可代谢为对肝肾有毒性的乙酰亚胺酚，引起肝坏死，可用谷胱甘肽或者乙酰半胱氨酸解毒。

【例题】

结构中含有酰胺的药物是

- A. 阿司匹林
- B. 对乙酰氨基酚
- C. 塞来昔布
- D. 萘普生
- E. 舒林酸

【正确答案】B

【答案解析】名称提示结构，对乙酰氨基酚中含有互成对位的乙酰氨基和酚羟基。

核心考点：抗溃疡药的分类

H<sub>2</sub>受体阻断剂：××替丁  
质子泵抑制剂：××拉唑

【例题】

(多选题) 下列哪些药物常用作抗溃疡药

- A. H<sub>1</sub>受体拮抗剂
- B. H<sub>2</sub>受体拮抗剂
- C. β受体拮抗剂



D. 质子泵抑制剂

E. 钙拮抗剂

【正确答案】BD

【答案解析】目前临床上使用的抗溃疡药物主要有  $H_2$  受体拮抗剂和质子泵抑制剂。

**核心考点：抗溃疡药的构效关系和作用特点**

(1)  $H_2$  受体阻断剂

该类药物的基本结构：碱性芳核药效团 + 柔性链 + 氢键键合极性药效团。西咪替丁饱和水溶液呈弱碱性。

(2) 质子泵抑制剂

奥美拉唑在酸质子催化下，可发生奥美拉唑循环或前药循环发挥作用，S 和 R 两种光学异构体疗效一致，但 S 型代谢慢，奥美拉唑的异构体被开发为药物埃索美拉唑上市，是第一个上市的光学活性质子泵抑制剂。

【例题】

以光学异构体形式上市的质子泵抑制剂是

A. 雷尼替丁

B. 法莫替丁

C. 奥美拉唑

D. 埃索美拉唑

E. 兰索拉唑

【正确答案】D

【答案解析】奥美拉唑的异构体被开发为药物埃索美拉唑上市，是第一个上市的光学活性质子泵抑制剂。

**核心考点：促胃肠动力药**

现常用的有多巴胺  $D_2$  受体阻断药甲氧氯普胺，外周性多巴胺  $D_2$  受体阻断药多潘立酮，既能阻断多巴胺  $D_2$  受体又能抑制乙酰胆碱活性的药物伊托必利和选择性  $5-HT_4$  受体激动药莫沙必利等。

【例题】

多潘立酮属于

A. 促胃肠动力药

B. 抗过敏药

- C. 抗溃疡药
- D. 胃黏膜保护药
- E. 抗肿瘤药

【正确答案】 A

【答案解析】 多潘立酮属于胃动力药，为较强的外周性多巴胺 D<sub>2</sub>受体拮抗剂，可促进胃肠道的蠕动，使张力恢复正常，促进胃排空。用于促进胃动力及止吐。故本题答案应选 A。

### 核心考点：抗高血压药

#### 1. 分类

血管紧张素转换酶（ACE）抑制剂：××普利

血管紧张素 II 受体拮抗剂：××沙坦

#### 2. 构效关系和作用特点

##### （1）血管紧张素转换酶（ACE）抑制剂

基于化学结构，ACE 抑制药可以分成三类：含巯基的 ACE 抑制药、含二羧基的 ACE 抑制药和含磷酸基的 ACE 抑制药。

卡托普利是唯一含巯基的 ACE 抑制剂，分子中的脯氨酸片段为关键药效团，但会产生皮疹和味觉障碍。

赖诺普利结构中含有碱性的赖氨酸基团，该类物质中只有赖诺普利和卡托普利是非前药。

福辛普利结构中含有磷酸基，作用效果优于卡托普利，但低于依那普利拉。

##### （2）血管紧张素 II 受体拮抗剂

氯沙坦分子中的四氮唑为酸性基团，代谢物的活性比氯沙坦强。

缬沙坦是不含咪唑环的 A II 受体拮抗剂，其作用稍高于氯沙坦。

坎地沙坦酯与替米沙坦均含有苯并咪唑环，坎地沙坦酯是前药，在体内迅速完全地代谢成坎地沙坦。

### 【例题】

与卡托普利性质不符的是

- A. 具有强碱性
- B. 易被氧化
- C. 结构中含有巯基
- D. 可引起皮疹和味觉障碍

E. 血管紧张素转化酶抑制剂

【正确答案】A

【答案解析】卡托普利含有游离的羧基，显酸性。

**核心考点：调节血脂药**

1. 分类

(1) 羟甲戊二酰辅酶 A (HMG-CoA) 还原酶抑制剂：××他汀

他汀类药物分为：天然的及半合成改造药物，洛伐他汀、辛伐他汀和普伐他汀；人工全合成药物，氟伐他汀钠、阿托伐他汀钙、瑞舒伐他汀钠。

(2) 苯氧乙酸类（教材不列举）

2. 羟甲戊二酰辅酶 A (HMG-CoA) 还原酶抑制剂构效关系和作用特点

洛伐他汀和辛伐他汀结构中含有内酯环，是该类药物中的前药。

洛伐他汀是天然他汀类药物，有 8 个手性中心，改变手性中心的构型将导致活性降低。

他汀类药物会引起肌肉疼痛或横纹肌溶解的副作用，特别是西立伐他汀，由于引起横纹肌溶解，导致病人死亡的副作用而撤出市场

**【例题】**

他汀类药物的特征不良反应是

- A. 干咳
- B. 溶血
- C. 皮疹
- D. 横纹肌溶解
- E. 血管神经性水肿

【正确答案】D

【答案解析】所有他汀类药物可能均有一定程度的横纹肌溶解副作用，而西立伐他汀相关的引起危及生命的横纹肌溶解病例报告频率明显地比其他他汀类药物更频繁。

**核心考点：抗心律失常药-钾通道阻滞药**

钾通道阻滞药：盐酸胺碘酮、索他洛尔、伊布利特、多非利特。

**【例题】**

为钾通道阻滞剂类的抗心律失常药的是

- A. 美西律
- B. 胺碘酮

- C. 维拉帕米  
D. 硝苯地平  
E. 普萘洛尔

【正确答案】 B

【答案解析】 胺碘酮为钾通道阻滞药。

**核心考点：抗心律失常药-β受体阻断药**

1) 非选择性β受体阻断药：

盐酸普萘洛尔、（阿普、氧烯、吲哚、纳多、噻吗）洛尔

2) 选择性β<sub>1</sub>受体阻断药：

酒石酸美托洛尔、（倍他、醋丁、阿替、盐酸艾司）洛尔

3) α、β受体阻断药：

拉贝洛尔（副作用较少，为妊娠高血压的首选降压药物）、卡维地洛、塞利洛尔

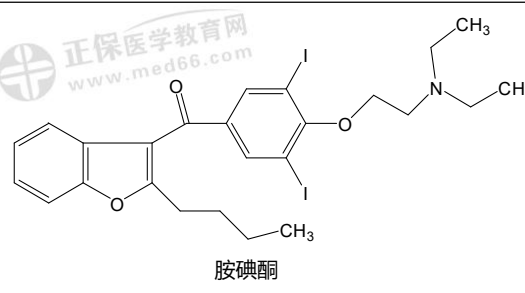
【例题】  
为β受体拮抗剂类抗心律失常药

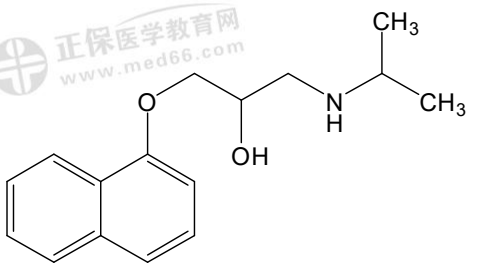
- A. 美西律  
B. 胺碘酮  
C. 维拉帕米  
D. 硝苯地平  
E. 普萘洛尔

【正确答案】 E

【答案解析】 普萘洛尔为钠通道阻滞剂。

**核心考点：抗心律失常药的构效关系与特点**

| 分类     | 药物   | 构效关系与特点                          |
|--------|--|----------------------------------|
| 钾通道阻滞剂 |  <p>胺碘酮</p> | 含有碘原子，易在体内积蓄，长期用药导致心律失常，影响甲状腺素代谢 |

|  |   |   |
|--|---|---|
| <p>芳氧丙醇胺类 <math>\beta</math> 受体拮抗剂</p> |  <p>普萘洛尔</p> | <p>对 <math>\beta_1</math> 受体和 <math>\beta_2</math> 受体均有阻断作用，S-异构体作用比 R-异构体强，外消旋体的毒性比单个对映体强，但临床上仍应用其外消旋体；<br/>有较强的抑制心肌收缩力和引起支气管痉挛及哮喘的副作用</p> |
|--|---|---|

**【例题】**

结构中含有碘原子，长期用药导致心律失常，影响甲状腺素代谢的药物是

- A. 美西律
- B. 胺碘酮
- C. 维拉帕米
- D. 硝苯地平
- E. 普萘洛尔

**【正确答案】** B

**【答案解析】**胺碘酮结构中含有碘原子，易在体内积蓄，长期用药导致心律失常，影响甲状腺素代谢。

**核心考点：硝酸酯类抗心绞痛药**

硝酸酯类药物进入体内后可通过生物转化形成一氧化氮 (NO)，NO 具有高度的脂溶性，能通过细胞膜，激活鸟苷酸环化酶，使细胞内 cGMP 的含量增加，激动依赖性的蛋白激酶引起相应底物磷酸化状态的改变，结果导致肌凝蛋白轻链去磷酸化。由于肌凝蛋白轻链去磷酸化过程调控平滑肌细胞收缩状态的维持，因此可松弛血管平滑肌。

代表药物硝酸甘油舌下含服通过口腔黏膜迅速吸收，避免首过效应，1~2 分钟起效。

**【例题】**

硝酸甘油为

- A. 血管舒张因子
- B. 钠通道阻滞剂
- C.  $\beta$  受体拮抗剂
- D.  $\beta$  受体激动剂
- E. 钙通道阻滞剂

【正确答案】A

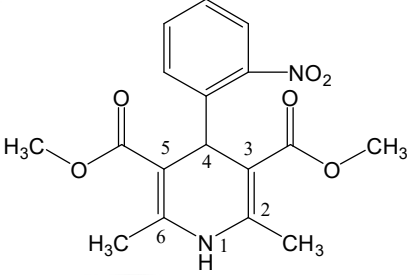
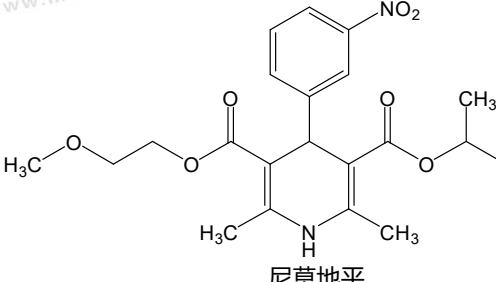
【答案解析】本题考察药物的作用机制。

核心考点：钙通道阻滞剂类抗心绞痛药

(1) 1,4-二氢吡啶类：1,4-二氢吡啶环是必需药效团。

(2) 芳烷基胺类：维拉帕米。

(3) 苯硫氮草类：地尔硫草，2个手性碳，首过效应强，生物利用度低。

| 分类        | 药物   | 构效关系与特点   |
|-----------|--|---|
| 1,4-二氢吡啶类 |  <p>硝苯地平</p>  | 1,4-二氢吡啶环是必需药效团；该类药物遇光极不稳定，分子内部发生光催化的歧化反应，注意避光；该类药物与柚子汁同服会导致药物体内浓度增加  |
|           |  <p>尼莫地平</p> | 容易通过血-脑屏障而作用于脑血管及神经细胞，选择性扩张脑血管，用于预防和治疗蛛网膜下出血后脑血管痉挛所致的缺血性神经障碍、高血压和偏头痛等 |

【例题】

可用于高血压治疗，也可用于缓解心绞痛的药物是

- A. 辛伐他汀
- B. 可乐定
- C. 氯沙坦
- D. 硝苯地平
- E. 哌唑嗪

【正确答案】D

【答案解析】硝苯地平能抑制心肌对钙离子的摄取，使心肌收缩力减弱，降低心肌耗氧量，增加冠脉血流量，还可通过扩张周边血管，降低血压，改善脑循环，用于治疗冠心病，缓解心绞痛，还可治疗高血压。



### 核心考点: 抗血栓药-抗凝血药

#### 1. 香豆素类

口服有效, 体外无抗凝作用。常用药包括华法林钠、双香豆素和醋硝香豆素, 与维生素 K 相似。抑制维生素 K 环氧还原酶。

#### 2. 凝血酶抑制药

达比加群酯: 以原药和前药两种形式进入门静脉, 在肝脏中完全转化为达比加群。

阿加曲班: 结构中包含精氨酸、哌啶和四氢喹啉的三脚架结构。

#### 3. 凝血因子 X<sub>a</sub> 抑制药

直接作用于凝血因子 X<sub>a</sub> 的抗凝血药有良好的抑制初期血栓形成的疗效。

代表药: 阿哌沙班和利伐沙班。

#### 【例题】

属于凝血酶抑制药的是

- A. 华法林
- B. 达比加群酯
- C. 替罗非班
- D. 阿哌沙班
- E. 氯吡格雷

【正确答案】B

【答案解析】凝血酶抑制药包括达比加群酯、阿加曲班。

### 核心考点: 抗血栓药-血小板二磷酸腺苷受体阻断药

氯吡格雷、噻氯匹定、普拉格雷、坎格雷洛和替卡格雷等。

氯吡格雷有一个手性碳原子, 为 S-构型, 体外无活性, 为前药。临床主要用于预防缺血性脑卒中、心肌梗死及外周血管病等。

#### 【例题】

属于血小板二磷酸腺苷受体阻断药的是

- A. 华法林
- B. 达比加群酯
- C. 替罗非班
- D. 阿哌沙班
- E. 氯吡格雷

【正确答案】E

【答案解析】临床应用的血小板二磷酸腺苷受体阻断药主要有氯吡格雷和噻氯匹定。近年有普拉格雷、坎格雷洛和替卡格雷等药物。

**核心考点：抗血栓药-糖蛋白 GP II<sub>b</sub>/III<sub>a</sub> 受体阻断药**

糖蛋白 GP II<sub>b</sub>/III<sub>a</sub> 受体阻断药主要分为肽类和小分子非肽类阻断药，用于临床的肽类药物主要包括单克隆抗体阿昔单抗和依替巴肽；小分子非肽类药物有替罗非班。

【例题】

属于糖蛋白 GP II<sub>b</sub>/III<sub>a</sub> 受体阻断药的是

- A. 华法林
- B. 达比加群酯
- C. 替罗非班
- D. 阿哌沙班
- E. 氯吡格雷

【正确答案】C

【答案解析】替罗非班属于糖蛋白 GP II<sub>b</sub>/III<sub>a</sub> 受体阻断药。

**核心考点：降血糖药**

(1) 胰岛素分泌药

磺酰脲类：甲苯磺丁脲、格列××

非磺酰脲类：×格列奈

(2) 胰岛素增敏剂

双胍类：二甲双胍

噻唑烷二酮类：×格列酮

(3) α-葡萄糖苷酶抑制剂：阿卡波糖、米格列醇、伏格列波糖

(4) 二肽基肽酶-4 抑制药：××列汀

(5) 二钠葡萄糖协同转运蛋白 2 抑制药：舍格列净、瑞格列净

【例题】

属于非磺酰脲类的胰岛素分泌促进剂药物有

- A. 格列齐特
- B. 格列吡嗪
- C. 瑞格列奈

D. 格列美脲

E. 氟尿嘧啶

【正确答案】C

【答案解析】ABD 属于磺酰脲类胰岛素分泌促进剂，氟尿嘧啶不是降血糖药物。

### 核心考点：抗代谢抗肿瘤药

(1) 嘧啶类抗代谢物

尿嘧啶抗代谢物：氟尿嘧啶、替加氟、卡莫氟

胞嘧啶抗代谢物：盐酸阿糖胞苷、XX 他滨

(2) 嘌呤抗代谢物拮抗剂：XX 嘌呤

(3) 叶酸抗代谢物拮抗剂：甲氨蝶呤、培美曲塞、亚叶酸钙

【例题】

属嘌呤类抗代谢物的药物是

A. 甲氨蝶呤

B. 巯嘌呤

C. 羟喜树碱

D. 氟尿嘧啶

E. 阿糖胞苷

【正确答案】B

【答案解析】嘌呤类抗代谢物有巯嘌呤、硫鸟嘌呤等。

### 核心考点：靶向抗肿瘤药

多为酪氨酸激酶抑制剂，伊马替尼（第一个上市的蛋白酪氨酸激酶抑制剂）。

吉非替尼是第一个选择性表皮生长因子受体酪氨酸激酶抑制剂，用于非小细胞肺癌、转移性非小细胞肺癌治疗。

索拉非尼是口服的、作用于多个激酶靶点的抗肿瘤药物，用于晚期肾细胞癌治疗的治疗，能够获得明显而持续的治疗作用。

【例题】

下列属于多靶点蛋白激酶抑制剂类抗肿瘤药物是

A. 甲磺酸伊马替尼

B. 吉非替尼

C. 厄洛替尼

D. 索拉非尼

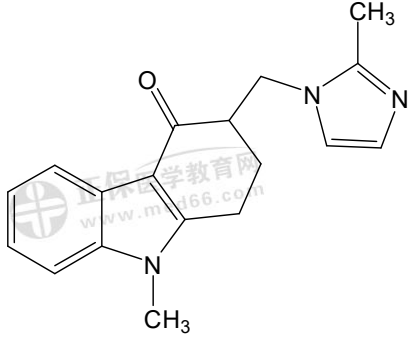
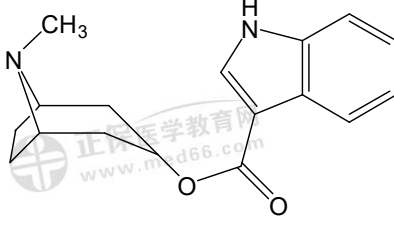
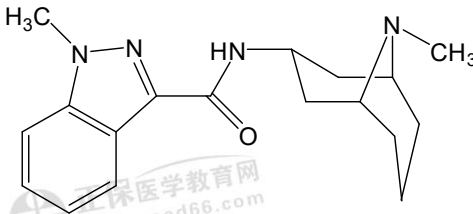
E. 硼替佐米

【正确答案】D

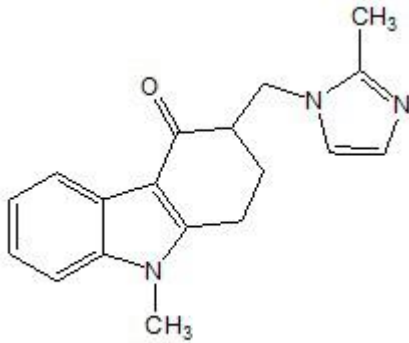
【答案解析】索拉非尼是口服的、作用于多个激酶靶点的抗肿瘤药物，用于晚期肾细胞癌治疗的治疗。

**核心考点：放疗与化疗的止吐药**

拮抗 5-HT<sub>3</sub> 受体的止吐药已经成为抗肿瘤治疗中辅助使用的止吐药，主要有昂丹司琼，格拉司琼，托烷司琼，帕洛诺司琼和阿扎司琼等。

| 分类                      | 药物  | 构效关系与特点   |
|-------------------------|---|---|
| 5-HT <sub>3</sub> 受体拮抗剂 |  <p>昂丹司琼</p>  | 由咔唑酮和 2-甲基咪唑组成，咔唑环上的 3 位碳为手性碳，临床上使用外消旋体               |
|                         |  <p>托烷司琼</p> | 由吲哚环和托品醇组成，对外周神经元和中枢神经内 5-HT <sub>3</sub> 受体具高选择性拮抗作用 |
|                         |  <p>格拉司琼</p> | 由吲哚环和含氮双环组成，半衰期较长，每日仅需注射一次；选择性高，无锥体外系反应等副作用           |

【例题】



昂丹司琼

具有哪些特性

- A. 结构中含有咪唑结构
- B. 具有手性碳原子，其 S 体活性大于 R 体活性
- C. 具有手性碳原子，其 R 体活性大于 S 体活性
- D. 为选择性的 5-HT<sub>3</sub>受体拮抗剂
- E. 结构中含有咪唑环

【正确答案】ACDE

【答案解析】昂丹司琼分子是由咪唑酮和 2-甲基咪唑组成，咪唑环上的 3 位碳具有手性，其中 (R) 体的活性较大，临床上使用外消旋体。昂丹司琼为强效、高选择性的 5-HT<sub>3</sub>受体拮抗剂。

核心考点：口服固体制剂的常用辅料-稀释剂、润湿剂、黏合剂

| 用途                       | 举例  |
|--------------------------|---|
| 稀释剂/填充剂（主药剂量小于 50mg 时加入） | 淀粉、乳糖、糊精、蔗糖、预胶化淀粉、微晶纤维素（MCC，干黏合剂）、无机盐类、甘露醇  |
| 润湿剂                      | 蒸馏水、乙醇  |
| 黏合剂                      | 淀粉浆、甲基纤维素（MC）、羟丙纤维素（HPC，可用于粉末直接压片）、羟丙甲纤维素（HPMC）、羧甲基纤维素钠（CMC-Na）、乙基纤维素（EC）、聚维酮（PVP）、明胶、聚乙二醇（PEG） |

【例题】

下列不属于黏合剂的是

- A. CMC-Na
- B. HPC
- C. MC

D. MCC

E. HPMC

【正确答案】D

【答案解析】MCC：微晶纤维素，属于常用的填充剂；注意此题中各个缩写的含义，ABCE都属于片剂常用的黏合剂。

**核心考点：口服固体制剂的常用辅料-崩解剂**

| 用途                      | 举例  |
|-------------------------|---|
| 崩解剂（缓控释片、口含片、咀嚼片、舌下片不加） | 干淀粉、羧甲基淀粉钠（CMS-Na）、低取代羟丙基纤维素（L-HPC）、交联羧甲基纤维素钠（CCMC-Na）、交联聚维酮（PVPP）、泡腾崩解剂（碳酸盐/碳酸氢盐+酸类） |

**【例题】**

下列辅料中，崩解剂是

A. PEG

B. HPMC

C. PVP

D. CMC-Na

E. CCMC-Na

【正确答案】E

【答案解析】交联羧甲基纤维素钠（CCMC-Na）是崩解剂，其它选项均为黏合剂。

**核心考点：口服固体制剂的常用辅料-润滑剂**

| 用途  | 举例                                   |
|-----|--------------------------------------|
| 润滑剂 | 硬脂酸镁（MS）、微粉硅胶、滑石粉、氢化植物油、聚乙二醇、十二烷基硫酸钠 |

**【例题】**

下列辅料中不可作为润滑剂的是

A. 微粉硅胶

B. 甲基纤维素

C. 月桂醇硫酸镁

D. 滑石粉



E. 氢化植物油

【正确答案】B

【答案解析】甲基纤维素是常用的黏合剂，不是润滑剂。

核心考点：口服固体制剂的常用辅料-释放调节剂

| 释放调节剂 | 材料种类      | 常见品种  |
|-------|-----------|---|
| 骨架型   | 亲水性凝胶骨架材料 | 羧甲基纤维素钠 (CMC-Na)、甲基纤维素 (MC)、羟丙甲纤维素 (HPMC)、聚维酮 (PVP)、卡波姆、海藻酸盐、脱乙酰壳多糖 (壳聚糖) |
|       | 不溶性骨架材料   | 聚甲基丙烯酸酯 (EudragitRS, EudragitRL)、乙基纤维素 (EC)、聚乙烯、无毒聚氯乙烯、乙烯-醋酸乙烯共聚物、硅橡胶     |
|       | 生物溶蚀性骨架材料 | 动物脂肪、蜂蜡、巴西棕榈蜡、氢化植物油、硬脂醇、单硬脂酸甘油酯   |
| 包衣膜型  | 不溶性高分子材料  | 乙基纤维素 (EC)  |
|       | 肠溶性高分子材料  | 丙烯酸树脂 L 和 S 型、醋酸纤维素酞酸酯 (CAP)、醋酸羟丙甲纤维素琥珀酸酯 (HPMCAS) 和羟丙甲纤维素酞酸酯 (HPMCP)     |

【例题】

下列辅料中不用于骨架型缓释材料的是

- A. 聚乙烯
- B. 羟丙基纤维素酞酸酯
- C. 聚维酮
- D. 壳聚糖
- E. 甲基纤维素

【正确答案】B

【答案解析】羟丙基纤维素酞酸酯为包衣膜型材料。

核心考点：口服固体制剂的薄膜包衣材料

| 分类   | 材料  |
|------|---|
| 包衣材料 | 胃溶型<br>羟丙甲纤维素 (HPMC)、羟丙基纤维素 (HPC)、丙烯酸树脂 IV 号、聚乙烯吡咯烷酮 (PVP) 和聚乙烯缩乙醛二乙氨乙酸 (AEA) |
| 材料   | 肠溶型<br>虫胶、醋酸纤维素酞酸酯 (CAP)、丙烯酸树脂类 (I、II、III 类)、羟丙甲纤维素酞酸酯 (HPMCP)                |
|      | 水不溶型<br>乙基纤维素 (EC)、醋酸纤维素  |
| 其他   | 增塑剂<br>水溶性增塑剂 (如丙二醇、甘油、聚乙二醇等) 和非水溶性增塑剂 (如甘油三醋酸酯、乙酰化甘油酸酯、邻苯二甲酸酯等)              |
|      | 致孔剂 (释放调节剂)<br>蔗糖、氯化钠、表面活性剂和 PEG  |
|      | 遮光剂<br>二氧化钛   |

**【例题】**

以下为胃溶型薄膜衣材料的是

- A. 乙基纤维素
- B. PVP
- C. 醋酸纤维素
- D. 丙烯酸树脂 II 号
- E. 丙烯酸树脂 I 号

**【正确答案】** B

**【答案解析】** PVP: 聚乙烯吡咯烷酮, 属于胃溶型的薄膜衣材料。乙基纤维素和醋酸纤维素属于水不溶型的薄膜衣材料; 丙烯酸树脂 I 号、II 号属于肠溶性薄膜衣材料。

**核心考点: 口服散剂特点**

- ①一般为细粉, 粒径小、比表面积大、易分散、起效快;
- ②制备工艺简单, 剂量易于控制, 便于特殊群体如婴幼儿与老人服用;
- ③包装、贮存、运输及携带较方便;
- ④对于中药散剂, 其包含各种粗纤维和不能溶于水的成分, 完整保存了药材的药性。

缺点: 由于散剂的分散度较大, 往往对制剂的吸湿性、化学活性、气味、刺激性、挥发性等性质影响较大, 故对光、湿、热敏感的药物一般不宜制成散剂。

**【例题】**

关于散剂特点的说法,错误的是

- A. 粒径小、比表面积大
- B. 易分散、起效快
- C. 尤其适宜湿敏感药物
- D. 包装、贮存、运输、携带较方便
- E. 便于婴幼儿、老人服用

【正确答案】C

【答案解析】由于散剂的分散度较大,往往对制剂的吸湿性、化学活性、气味、刺激性、挥发性等性质影响较大,故对光、湿、热敏感的药物一般不宜制成散剂。

**核心考点: 口服片剂的质量要求**

| 项目    | 具体要求   |
|-------|--|
| 硬度    | >50N   |
| 脆碎度   | <1%  |
| 重量差异  | 平均片重<0.30g, 重量差异限度±7.5%;<br>平均片重≥0.30g, 重量差异限度±5.0%            |
| 崩解时限  | 普通片剂 15min; 分散片、可溶片 3min; 舌下片、泡腾片 5min; 薄膜衣片 30min; 肠溶衣片 60min |
| 含量均匀度 | 小剂量药物或作用比较剧烈的药物符合要求  |
| 卫生学要求 | 符合要求   |

**【例题】**

下列关于片剂质量要求的叙述中正确的是

- A. 脆碎度小于 2%为合格品
- B. 平均片重为 0.2g 的片剂, 重量差异限度是±5%
- C. 普通片剂的崩解时限是 5 分钟
- D. 舌下片泡腾片崩解时限为 3 分钟
- E. 小剂量的药物或作用比较剧烈的药物, 应符合含量均匀度的要求

【正确答案】E

【答案解析】脆碎度小于 1%为合格品, 平均片重为 0.2g (小于 0.30g) 的片剂, 重量差异限度是±7.5%, 普通片剂的崩解时限是 15 分钟; 分散片、可溶片为 3 分钟; 舌下片、

泡腾片为 5 分钟；薄膜衣片为 30 分钟；肠溶衣片要求在盐酸溶液中 2 小时内不得有裂缝、崩解或软化现象，在 pH6.8 磷酸盐缓冲液中 1 小时内全部溶解并通过筛网等。

**核心考点：胶囊剂的特点**

| 优点                | 缺点   |
|-------------------|--|
| 掩盖不良嗅味            | 囊壳受温湿度影响大  |
| 提高稳定性             | 生产成本较高（与片剂比较）  |
| 起效快，生物利用度高（与片剂比较） | 特殊群体（老幼）口服困难   |
| 液态药物固体剂型化         | 不适宜制成胶囊的药物：  |
| 实现药物缓释、控释和定位释放    | 水溶液或稀乙醇溶液药物；风化性药物；强吸湿性的药物；醛类药物；含有挥发性、小分子有机物的液体药物；O/W 型乳剂药物 |

**【例题】**

下列适合制成胶囊剂的药物是

- A. 易风化的药物
- B. 吸湿性的药物
- C. 药物的稀醇水溶液
- D. 具有臭味的药物
- E. 油性药物的 O/W 乳状液

**【正确答案】** D

**【答案解析】** 胶囊剂型对内容物具有一定的要求，一些药物不适宜制备成胶囊剂。例如：

- ①会导致囊壁溶化的水溶液或稀乙醇溶液药物；
- ②会导致囊壁软化的风化性药物；
- ③会导致囊壁脆裂的强吸湿性的药物；
- ④会导致明胶变性的醛类药物；
- ⑤会导致囊材软化或溶解的含有挥发性、小分子有机物的液体药物；
- ⑤会导致囊壁变软的 O/W 型乳剂药物。

**核心考点：胶囊剂的质量要求**

| 项目     | 质量要求  |
|--------|---|
| 水分（中药） | ≤9.0%   |
| 装量差异限度 | 平均装量 < 0.30g，装量差异限度 ±10%；<br>平均装量 ≥ 0.30g，装量差异限度 ±7.5%（中药 ±10%） |

|      |                        |
|------|------------------------|
| 崩解时限 | 硬胶囊 30min; 软胶囊、肠溶胶囊 1h |
|------|------------------------|

**【例题】**

《中国药典》规定肠溶胶囊全部崩解的时限是

- A. 10min
- B. 15min
- C. 20min
- D. 30min
- E. 60min

**【正确答案】** E

**【答案解析】** 盐酸溶液中检查 2 小时（不加挡板），不得有裂缝或崩解现象；取出吊篮，用少量水涤；人工肠液中检查（加挡板）1 小时应全部崩解。

**核心考点：口服滴丸剂的定义**

滴丸剂指药物与适宜的基质加热熔融混匀，再滴入不相混溶、互不作用的冷凝介质中制成的球形或类球形制剂。

**【例题】**

药物与基质加热熔融混匀后，滴入不相混溶、互不作用的冷凝液中收缩成球形的制剂

- A. 胶丸
- B. 滴丸剂
- C. 脂质体
- D. 靶向乳剂
- E. 微球

**【正确答案】** B

**【答案解析】** 滴丸剂系指固体或液体药物与适宜的基质加热熔融后溶解、乳化或混悬于基质中，再滴入不相混溶、互不作用的冷凝液中，由于表面张力的作用使液滴收缩成球状而制成的制剂，主要供口服用。

**核心考点：口服滴丸剂的特点**

(1) 设备简单、操作方便、工艺周期短、生产率高，质量稳定，剂量准确，受热时间短，易氧化及具挥发性的药物可增加稳定性。

(2) 可使液态药物固化。

- (3) 用固体分散技术制备的滴丸具有吸收迅速、生物利用度高的特点。
- (4) 发展了耳、眼科用药的新剂型，可起到延效作用。

**【例题】**

从滴丸剂组成及制法看，关于滴丸剂的特点，说法错误的是

- A. 工艺周期长
- B. 发展了耳、眼科用药新剂型
- C. 基质容纳液态药物量大，故可使液态药物固化
- D. 设备简单、操作方便、利于劳动保护
- E. 用固体分散技术制备的滴丸具有吸收迅速，生物利用度高的特点

**【正确答案】** A

**【答案解析】** 此题重点考查滴丸剂的特点。滴丸剂设备简单、操作方便、工艺周期短、生产率高。

**核心考点：口服滴丸剂的基质**

(1) 水溶性基质：聚乙二醇类（聚乙二醇 6000、聚乙二醇 4000 等），硬脂酸钠、甘油明胶、泊洛沙姆、聚氧乙烯单硬脂酸酯（S-40）。

(2) 脂溶性基质：硬脂酸、单硬脂酸甘油酯、氢化植物油、虫蜡、蜂蜡。

**【例题】**

口服滴丸剂的脂溶性基质是

- A. 明胶
- B. 硬脂酸
- C. 泊洛沙姆
- D. 聚乙二醇 4000
- E. 聚乙二醇 6000

**【正确答案】** B

**【答案解析】** 滴丸剂所用的基质一般具备类似凝胶的不等温溶胶凝胶互变性，分为两大类：

水溶性基质常用的有聚乙二醇类（如聚乙二醇 6000、聚乙二醇 4000 等）、泊洛沙姆、明胶等。

脂溶性基质常用的有硬脂酸、单硬脂酸甘油酯、氢化植物油、虫蜡、蜂蜡等。

**核心考点：口服液体制剂的溶剂**



| 项目 | 具体品种                      |
|----|---------------------------|
| 溶剂 | 极性溶剂: 水、甘油、二甲基亚砷          |
|    | 半极性溶剂: 乙醇、丙二醇、聚乙二醇        |
|    | 非极性溶剂: 脂肪油、液状石蜡、油酸乙酯、乙酸乙酯 |

**【例题】**

下列属于极性溶剂的是

- A. 丙二醇
- B. 乙醇
- C. 聚乙二醇
- D. 二甲基亚砷
- E. 液状石蜡

**【正确答案】** D

**【答案解析】** 二甲基亚砷属于极性溶剂; 而丙二醇、乙醇和聚乙二醇属于半极性溶剂, 而液体石蜡属于非极性溶剂。

**核心考点: 口服液体制剂的附加剂-增溶剂、助溶剂、潜溶剂**

| 项目  | 具体品种             |
|-----|------------------|
| 增溶剂 | 聚山梨酯、聚氧乙烯脂肪酸酯    |
| 助溶剂 | 苯甲酸钠、碘化钾、聚乙烯吡咯烷酮 |
| 潜溶剂 | 乙醇、丙二醇、甘油、聚乙二醇   |

**【例题】**

制备复方碘溶液时, 加入的碘化钾的作用是

- A. 增溶剂
- B. 助溶剂
- C. 极性溶剂
- D. 潜溶剂
- E. 防腐剂

**【正确答案】** B

**【答案解析】** 难溶性药物与加入的第三种物质在溶剂中形成可溶性分子间的络合物、缔合物或复盐等, 以增加药物在溶剂中的溶解度。这第三种物质称为助溶剂。助溶剂多为某些

有机酸及其盐类如苯甲酸、碘化钾等, 酰胺或胺类化合物如乙二胺等, 一些水溶性高分子化合物如聚乙烯吡咯烷酮等。

**核心考点: 口服液体制剂的附加剂-防腐剂、矫味剂、着色剂**

| 项目  | 具体品种                          |
|-----|-------------------------------|
| 防腐剂 | 苯甲酸(钠)、山梨酸(钾)、对羟基苯甲酸酯(尼泊金)、乙醇 |
| 矫味剂 | 甜味剂: 蔗糖、山梨醇、甘露醇、甜菊苷、阿司帕坦      |
|     | 芳香剂: 柠檬、薄荷水、桂皮水、香精            |
|     | 胶浆剂: 阿拉伯胶、琼脂、纤维素类             |
|     | 泡腾剂: 有机酸+碳酸氢钠                 |
| 着色剂 | 焦糖、胡萝卜素、姜黄、胭脂红、苏木、柠檬黄         |

**【例题】**

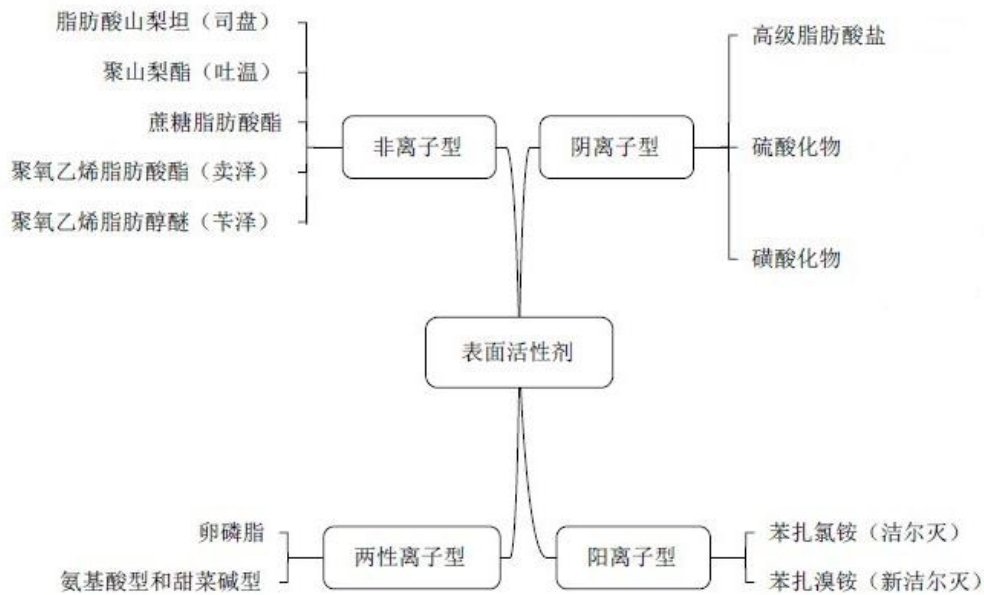
适宜用作矫味剂的物质不包括

- A. 糖精钠
- B. 单糖浆
- C. 焦糖
- D. 泡腾剂
- E. 薄荷水

**【正确答案】** C

**【答案解析】** 此题重点考查矫味剂的种类。常用的有天然和合成的甜味剂、芳香剂、胶浆剂、泡腾剂, 糖精钠和单糖浆是甜味剂, 薄荷水是芳香剂。焦糖是着色剂不是矫味剂。

**核心考点: 表面活性剂的分类**



**【例题】**

属于非离子型表面活性剂的是

- A. 苯扎溴铵
- B. 吐温
- C. 磺酸化物
- D. 卵磷脂
- E. 苯扎氯铵

**【正确答案】** B

**【答案解析】** 磺酸化物属于阴离子型表面活性剂。吐温属于非离子型表面活性剂。苯扎氯铵、苯扎溴铵属于阳离子型表面活性剂。

**核心考点：低分子溶液剂的举例**

| 分类   | 实例   |
|------|--|
| 溶液剂  | 对乙酰氨基酚口服液：PEG400-助溶剂、稳定剂<br>地高辛口服液：β-环糊精-增溶剂 |
| 芳香水剂 | 薄荷水：滑石粉-分散剂+吸附、助滤<br>金银花露                    |
| 酯剂   | 薄荷酯  |
| 酊剂   | 颠茄酊、橙皮酊                                      |
| 酞剂   | 地高辛酞剂  |

糖浆剂

复方磷酸可待因糖浆、硫酸亚铁糖浆

**【例题】**

属于低分子溶液剂的是

- A. 薄荷水
- B. 胃蛋白酶合剂
- C. 纳米银溶胶
- D. 布洛芬口服混悬剂
- E. 鱼肝油乳

**【正确答案】** A

**【答案解析】** 薄荷水属于芳香水剂，是低分子溶液剂。B 是高分子溶液剂，C 是溶胶剂，D 是口服混悬剂，E 是口服乳剂。

**核心考点：口服混悬剂的质量要求**

| 项目          | 要求  |
|-------------|---|
| 沉降容积比 F     | 沉降物的容积与沉降前混悬液的容积之比；F 值在 0~1 之间，F 愈大混悬剂就愈稳定          |
| 絮凝度 $\beta$ | 由絮凝所引起的沉降物容积增加的倍数； $\beta$ 值愈大，絮凝效果愈好，混悬剂的稳定性愈高     |
| 重新分散性       | 优良的混悬剂在贮存后再振摇，沉降物应能很快重新分散，从而保证服用时的均匀性、分剂量的准确性       |
| 微粒大小        | 混悬剂中微粒的大小，直接关系到混悬液的稳定性，还会影响混悬剂的药效及生物利用度             |
| 流变学         | 主要是用旋转黏度计测定混悬液的流动曲线，由流动曲线的形状确定混悬液的流动类型，以评价混悬液的流变学性质 |

**【例题】**

以下关于混悬剂的说法正确的是

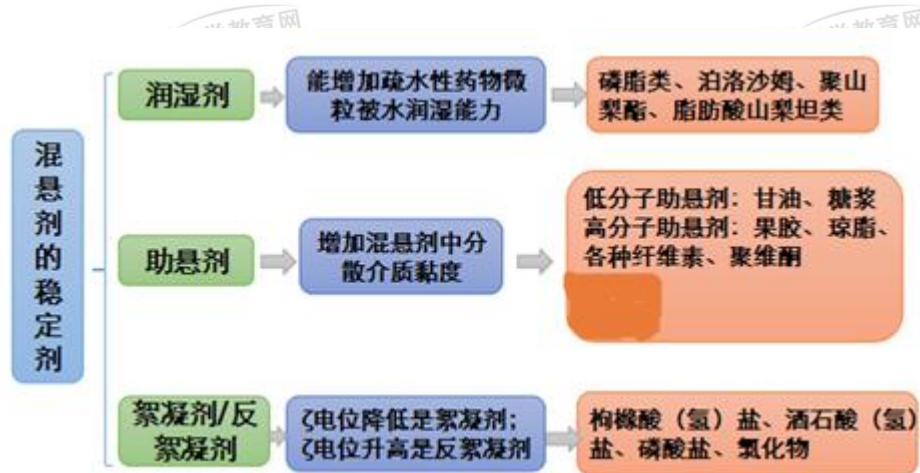
- A. F 值越小混悬剂越稳定
- B.  $\beta$  值越小混悬剂越稳定
- C. 混悬剂中微粒大小对其稳定性影响不大
- D. 可用浊度仪测定混悬液的流变学

E. 优良的混悬剂在贮存后再振摇, 沉降物应能很快重新分散

【正确答案】 E

【答案解析】 F 值和  $\beta$  值越大混悬剂越稳定, 微粒大小直接影响混悬剂的稳定性。主要是用旋转黏度计测定混悬液的流动曲线, 由流动曲线的形状确定混悬液的流动类型, 以评价混悬液的流变学性质。

核心考点: 口服混悬剂的稳定剂



【例题】

混悬剂中使微粒 Zeta 电位升高的电解质是

- A. 润湿剂
- B. 反絮凝剂
- C. 絮凝剂
- D. 助悬剂
- E. 稳定剂

【正确答案】 B

【答案解析】 如加入电解质后使  $\zeta$  电位升高, 阻碍微粒之间的碰撞聚集, 这个过程称为反絮凝, 能起反絮凝作用的电解质称为反絮凝剂。

核心考点: 乳剂的稳定性

| 现象 | 原因                       |
|----|--------------------------|
| 分层 | 分散相和分散介质之间的密度差           |
| 絮凝 | $\zeta$ 电位降低             |
| 转相 | 乳化剂性质变化, 如 O/W 转化为 W/O 型 |



|    |                             |
|----|-----------------------------|
| 合并 | 乳化膜部分破裂                     |
| 破裂 | 微生物污染, 温度过高或过低, 加入与乳化剂作用的物质 |
| 酸败 | 微生物污染, 油、乳化剂等发生变质           |

**【例题】**

乳剂由 O/W 型转变为 W/O 型的现象称为乳剂的

- A. 絮凝
- B. 分层
- C. 转相
- D. 合并
- E. 破坏

**【正确答案】** C

**【答案解析】** 乳剂由于某些条件的变化而改变乳剂的类型称为转相, 由 O/W 型转变为 W/O 型或由 W/O 型转变为 O/W 型。

**核心考点: 注射剂的附加剂**

| 注射剂的附加剂     | 举例   |
|-------------|--|
| 抗氧化剂        | 亚硫酸钠、硫代硫酸钠: 用于弱碱性溶液;<br>亚硫酸氢钠、焦亚硫酸钠: 用于弱酸性溶液 |
| 金属离子螯合剂     | 乙二胺四乙酸二钠/依地酸二钠 (EDTA-2Na)                    |
| 缓冲剂 (调节 pH) | 醋酸-醋酸钠、枸橼酸-枸橼酸钠、酒石酸-酒石酸钠、乳酸                  |
| 助悬剂         | 羧甲基纤维素、明胶、果胶                                 |
| 稳定剂         | 肌酐、甘氨酸、烟酰胺、辛酸钠                               |
| 增溶/润湿/乳化剂   | 吐温、PVP、卵磷脂、普朗尼克、脱氧胆酸钠                        |
| 抑菌剂         | 三氯叔丁醇、苯甲醇、苯酚、甲酚、尼泊金                          |
| 局麻剂 (止痛)    | 盐酸普鲁卡因、利多卡因                                  |
| 等渗调节剂       | 氯化钠、葡萄糖、甘油                                   |
| 填充剂         | 乳糖、甘露醇、甘氨酸                                   |



|     |                 |
|-----|-----------------|
| 保护剂 | 乳糖、蔗糖、麦芽糖、人血红蛋白 |
|-----|-----------------|

**【例题】**

在某注射剂中加入亚硫酸氢钠，其作用可能为

- A. 抑菌剂
- B. 金属螯合剂
- C. 缓冲剂
- D. 抗氧剂
- E. 增溶剂

**【正确答案】** D

**【答案解析】** 表面活性剂在注射剂中可以用作增溶剂、润湿剂、乳化剂。亚硫酸氢钠是注射剂中常用的抗氧剂。

**核心考点：注射剂的质量要求**

| 检查项目 | 质量要求                      |
|------|---------------------------|
| pH   | 和血液 pH 相等或相近；一般为 4~9      |
| 渗透压  | 与血浆渗透压相同或略偏高              |
| 稳定性  | 具有必要的物理稳定性和化学稳定性          |
| 安全性  | 对机体无毒性、无刺激性，降压物质符合规定      |
| 澄明   | 溶液型注射液应澄明，不得含有可见的异物或不溶性微粒 |
| 无菌   | 不含任何活的微生物                 |
| 无热原  | 不含热原                      |

**【例题】**

关于注射剂的说法错误的是

- A. 注射剂给药不方便，易发生交叉感染
- B. 注射剂药效迅速、剂量准确
- C. 注射剂应具有与血浆相同的或略偏低的渗透压
- D. 注射剂内不应含有任何活的微生物
- E. 注射剂 pH 一般控制在 4~9 的范围内

**【正确答案】** C

**【答案解析】** 注射剂应具有与血浆相同的或略偏高的渗透压。

**核心考点：影响药物溶解度的因素及增加溶解度的方法**

| 影响因素      | 增加溶解度方法     |
|-----------|-------------|
| 药物分子结构与溶剂 | 制成盐类；使用混合溶剂 |
| 温度        | 提高温度        |
| 药物的晶型     | 制成共晶        |
| 粒子大小      | 微粉化         |
| 加入第三种物质   | 加入增溶剂、助溶剂   |

**【例题】**

下述哪种方法不能增加药物的溶解度

- A. 加入助溶剂
- B. 加入增溶剂
- C. 使用混合溶剂
- D. 制成可溶性盐
- E. 加入助悬剂

**【正确答案】** E

**【答案解析】** 增加药物溶解度的方法除了 ABCD 四项外，还有一种就是制成共晶；而助悬剂主要是增加分散介质的黏度，以降低微粒沉降速度，增加微粒的亲水性，防止结晶的转型。但助悬剂不能增加药物溶解度，所以此题选 E。

**核心考点：注射用无菌粉末的特点**

- (1) 临用前用灭菌注射用水或生理盐水溶解后注射
- (2) 适用于水中不稳定，尤其是对湿热敏感的抗生素和生物制品

**【例题】**

对于易溶于水，但在水溶液中不稳定的药物适合制成

- A. 溶胶型注射剂
- B. 乳剂型注射剂
- C. 溶液型注射剂
- D. 混悬型注射剂
- E. 注射用无菌粉末

**【正确答案】** E

【答案解析】水中不稳定的药物制备成注射用无菌粉末，临用前再用灭菌注射用水稀释溶解，这样可以保证药品的稳定性。

**核心考点：冻干制剂常见问题及产生原因**

| 问题         | 原因                                  |
|------------|-------------------------------------|
| 含水量偏高      | 装入液层过厚、真空度不够、干燥时供热不足、干燥时间不够、冷凝器温度偏高 |
| 喷瓶         | 预冻温度过高或时间太短、产品冻结不实、升华供热过快、局部过热      |
| 产品外观不饱满或萎缩 | 首先形成的外壳结构较致密、样品黏度较大                 |

**【例题】**

冷凝器温度偏高会导致

- A. 含水量偏高
- B. 喷瓶
- C. 产品外形不饱满
- D. 异物
- E. 装量差异大

**【正确答案】** A

【答案解析】含水量偏高的原因：装入液层过厚、真空度不够、干燥时供热不足、干燥时间不够、冷凝器温度偏高等。

**核心考点：脂质体的质量要求**

| 检查项目      | 要求                  |               |
|-----------|---------------------|---------------|
| 形态、粒径及其分布 | 注射给药脂质体的粒径应小于 200nm |               |
| 包封率       | ≥80%                |               |
| 载药量       | 越大越易满足临床需要          |               |
| 稳定性       | 物理稳定性               | 渗漏率表示         |
|           | 化学稳定性               | 磷脂氧化指数、磷脂量的测定 |

**【例题】**

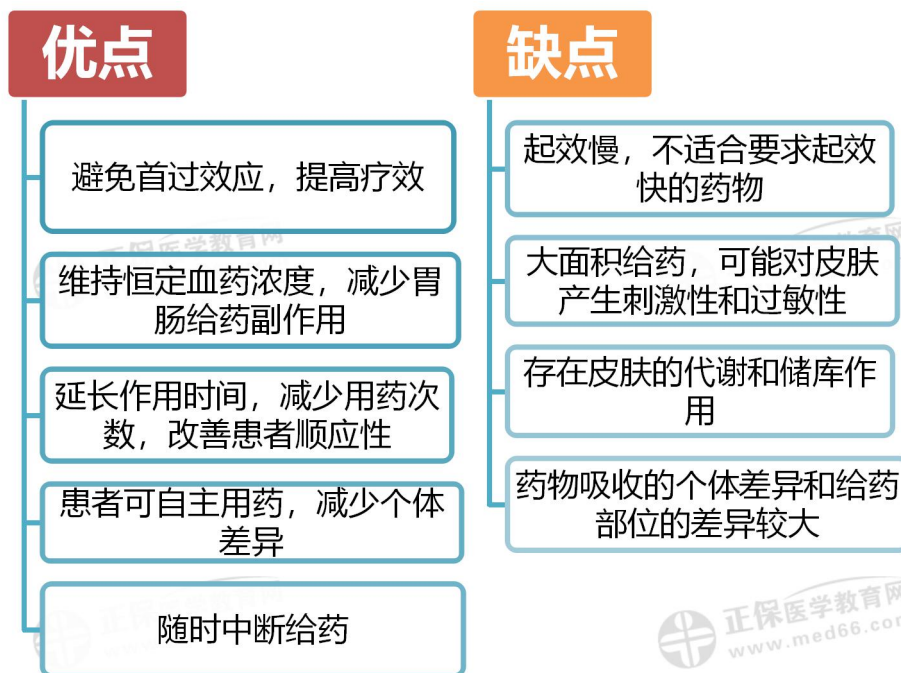
脂质体的包封率不得低于

- A. 50%
- B. 60%
- C. 70%
- D. 80%
- E. 90%

【正确答案】D

【答案解析】通常要求脂质体的药物包封率达 80%以上。

核心考点：贴剂的特点



【例题】

下列属于贴剂的缺点的是

- A. 可以避免肝脏的首过效应
- B. 存在皮肤代谢与储库作用
- C. 可以延长药物的作用时间，减少给药次数
- D. 透过皮肤吸收可起全身治疗作用
- E. 适用于婴儿、老人和不宜口服的病人

【正确答案】B

【答案解析】贴剂的局限性：（1）由于起效慢、不适合要求起效快的药物；（2）大面积给药，可能对皮肤产生刺激性和过敏性；（3）存在皮肤的代谢与储库作用；（4）药物吸

收的个体差异和给药部位的差异较大。

**核心考点：眼用制剂附加剂**

| 种类     | 品种                                       |
|--------|--|
| pH 调节剂 | 磷酸盐缓冲液、硼酸缓冲液、硼酸盐缓冲液（硼酸和硼砂配制）             |
| 渗透压调节剂 | 氯化钠、葡萄糖、硼酸、硼砂                            |
| 抑菌剂    | 三氯叔丁醇、对羟基苯甲酸甲酯与丙酯混合物、氯化苯甲羟胺、硝酸苯汞、硫柳汞、苯乙醇 |
| 黏度调节剂  | 甲基纤维素、聚乙二醇、聚维酮、聚乙烯醇                      |
| 其他附加剂  | 增溶剂、助溶剂、抗氧剂                              |

**【例题】**

下列不用于调节眼用制剂黏度的是

- A. 苯乙醇
- B. 甲基纤维素
- C. 聚维酮
- D. 聚乙烯醇
- E. 聚乙二醇

**【正确答案】** A

**【答案解析】** 苯乙醇为抑菌剂。

**核心考点：皮肤给药的液体制剂的分类及特点**

| 分类  | 定义   | 特点                           |
|-----|--|------------------------------|
| 搽剂  | 原料药物用乙醇、油或适宜的溶剂制成的溶液、乳状液或混悬液，供无破损皮肤揉擦用的液体制剂                | 无破损皮肤用，使用时用力揉搓               |
| 涂剂  | 含原料药物的水性或油性溶液、乳状液、混悬液，供临用前用消毒纱布或棉球等柔软物料蘸取涂于皮肤或口腔与喉部黏膜的液体制剂 | 大多为消毒或消炎药物的甘油溶液，也可用乙醇、植物油为溶剂 |
| 涂膜剂 | 原料药物溶解或分散于含有膜材料溶剂中，涂搽患处后形成薄膜的外用液体制剂                        | 启用后最多使用 4 周                  |
| 洗剂  | 含原料药物的溶液、乳状液、混悬液，供清洗或涂抹无破损皮肤或腔道用的液体制剂                      | 易变质的洗剂临用前配制                  |

**【例题】**

专供无破损皮肤表面揉擦用的液体制剂称为

- A. 涂膜剂
- B. 乳剂
- C. 搽剂
- D. 涂剂
- E. 洗剂

**【正确答案】** C

**【答案解析】**搽剂系指原料药物用乙醇、油或适宜的溶剂制成的溶液、乳状液或混悬液，供无破损皮肤揉擦用的液体制剂。

**核心考点：气雾剂的特点**

(1) 优点

- ☆ 便携、耐用、方便
- ☆ 比雾化器容易准备，治疗时间短
- ☆ 剂量均一性良好
- ☆ 气溶胶形成与病人的吸入行为无关
- ☆ 所有 MDIs 的操作和吸入方法相似
- ☆ 高压下的内容物可防止病原体侵入

(2) 缺点

- ☆ 可能会造成患者肺部剂量较低和（或）不均一
- ☆ 通常肺部沉积量较低
- ☆ 无法递送大剂量药物
- ☆ 大多数现有的 MDIs 没有剂量计数器

**【例题】**

下列有关气雾剂特点的叙述错误的是

- A. 简洁、便携、耐用、方便、多剂量
- B. 比雾化器容易准备，治疗时间短
- C. 良好的剂量均一性
- D. 可用于递送大剂量药物
- E. 高压下的内容物可防止病原体侵入



【正确答案】D

【答案解析】气雾剂阀门系统对药物剂量有所限制，无法递送大剂量药物，所以此题 D 说法错误，此题应该选 D。

核心考点：气雾剂的抛射剂和附加剂

| 种类  | 举例   |
|-----|--|
| 抛射剂 | 氢氟烷烃：HFA-134a（四氟乙烷）和 HFA-227（七氟丙烷）<br>碳氢化合物：主要品种有丙烷、正丁烷和异丁烷<br>压缩气体：主要有二氧化碳、氮气、一氧化氮等 |
| 潜溶剂 | 乙醇、丙二醇、甘油、聚乙二醇   |
| 润湿剂 | 蒸馏水和乙醇   |

【例题】

可作为气雾剂抛射剂的是

- A. 乙醇
- B. 七氟丙烷
- C. 聚山梨酯 80
- D. 维生素 C
- E. 液状石蜡

【正确答案】B

【答案解析】常用的抛射剂有氢氟烷烃、碳氢化合物及压缩气体。七氟丙烷属于氢氟烷烃。

核心考点：栓剂基质



**【例题】**

下面属于栓剂油脂性基质的是

- A. 棕榈酸酯
- B. 聚乙二醇 4000
- C. 聚乙二醇 1000
- D. 甘油明胶
- E. 泊洛沙姆

**【正确答案】** A

**【答案解析】** 棕榈酸酯属于半合成脂肪酸甘油酯，其属于栓剂的油脂性基质；BCDE 都属于水溶性基质。

**核心考点：微囊的特点**

- (1) 提高药物的稳定性。
- (2) 掩盖药物的不良臭味。
- (3) 防止药物在胃内失活，减少药物对胃的刺激性。
- (4) 控制药物的释放。
- (5) 使液态药物固态化。
- (6) 减少药物的配伍变化。
- (7) 使药物浓集于靶区，提高疗效，降低毒副作用。

**【例题】**

以下关于药物微囊化的特点不正确的是

- A. 可提高药物的稳定性
- B. 掩盖药物的不良臭味
- C. 减少药物对胃的刺激性
- D. 减少药物的配伍变化
- E. 加快药物的释放

**【正确答案】** E

**【答案解析】** 微囊可以延缓药物的释放，延长药物作用时间，达到长效目的，不能快速释放。

**核心考点：微囊化材料**

| 分类       |       | 具体品种   |
|----------|-------|--|
| 天然高分子囊材  |       | 明胶、阿拉伯胶、海藻酸盐   |
| 半合成高分子囊材 |       | 羧甲基纤维素盐、醋酸纤维素酞酸酯、乙基纤维素、甲基纤维素、羟丙甲纤维素  |
| 合成高分子囊材  | 生物降解  | 聚碳酸酯、聚氨基酸、聚乳酸 (PLA)、丙交酯乙交酯共聚物 (PLGA)、聚乳酸-聚乙二醇嵌段共聚物等 (PLA 和 PLGA 是被 FDA 批准的可降解材料) |
|          | 非生物降解 | 不受 pH 影响: 聚酰胺、硅橡胶;<br>可在一定 pH 条件下溶解: 聚丙烯酸树脂、聚乙烯醇                                 |

**【例题】**

下列辅料中, 可生物降解的合成高分子囊材是

- A. CMC-Na
- B. HPMC
- C. EC
- D. PLGA
- E. CAP

**【正确答案】** D

**【答案解析】** PLA 和 PLGA 是被 FDA 批准的可降解材料, 且已上市。

**核心考点:** 药物的转运方式-被动转运

| 转运方式 |      | 浓度梯度 | 消耗能量 | 饱和性 | 竞争性 | 特异性 | 抑制剂影响 |
|------|------|------|------|-----|-----|-----|-------|
| 被动转运 | 滤过   | 顺    | 否    | 无   | 无   | 无   | 无     |
|      | 简单扩散 | 顺    | 否    | 无   | 无   | 无   | 无     |

**【例题】**

关于被动扩散 (转运) 特点的说法, 错误的是

- A. 不需要载体
- B. 不消耗能量
- C. 是从高浓度区域向低浓度区域的转运

- D. 转运速度与膜两侧的浓度差成反比
- E. 无饱和现象

【正确答案】D

【答案解析】被动转运是物质从高浓度区域向低浓度区域的转运。转运速度与膜两侧的浓度差成正比，转运过程不需要载体，不消耗能量。膜对通过的物质无特殊选择性，不受共存的其他物质的影响，即无饱和现象和竞争抑制现象，一般也无部位特异性。药物大多数以这种方式通过生物膜。被动转运包括滤过和简单扩散。

**核心考点：药物的转运方式-载体转运**

| 转运方式 |      | 浓度梯度 | 消耗能量 | 饱和性 | 竞争性 | 特异性 | 抑制剂影响 |
|------|------|------|------|-----|-----|-----|-------|
| 载体转运 | 主动转运 | 逆    | 是    | 有   | 有   | 有   | 有     |
|      | 易化扩散 | 顺    | 否    | 有   | 有   | 有   | -     |

**【例题】**

有关易化扩散的特征错误的是

- A. 不消耗能量
- B. 有饱和状态
- C. 具有结构特异性
- D. 转运速率较被动转运大大提高
- E. 不需要载体进行转运

【正确答案】E

【答案解析】易化扩散又称中介转运，是指一些物质在细胞膜载体的帮助下，由膜的高浓度一侧向低浓度一侧转运的过程。

**核心考点：药物的转运方式-膜动转运**

| 转运方式 |    | 概念             |
|------|----|----------------|
| 膜动转运 | 胞饮 | 摄取液体到细胞内       |
|      | 吞噬 | 摄取微粒或大分子物质到细胞内 |
|      | 胞吐 | 大分子物质从细胞内转到细胞外 |

**【例题】**

细胞通过膜动转运摄取液体的转运方式是

- A. 滤过
- B. 简单扩散
- C. 胞饮
- D. 吞噬
- E. 胞吐

**【正确答案】** C

**【答案解析】**细胞通过膜动转运摄取液体称为胞饮,摄取的是微粒或大分子物质称吞噬,大分子物质从细胞内转运到细胞外称为胞吐。

**核心考点: 注射给药**

| 注射类别 | 注射部位    | 注射量    | 特点                |
|------|---------|--------|-------------------|
| 静脉注射 | 静脉血管    | 数毫升至数升 | 无吸收过程, 生物利用度 100% |
| 肌肉注射 | 肌肉内     | 2~5ml  | 油溶液或混悬剂可发挥长效作用    |
| 皮下注射 | 表皮与肌肉之间 | 1~2ml  | 适用于需延长作用时间的药物     |
| 皮内注射 | 真皮      | ≤0.2ml | 用于诊断和过敏试验         |
| 动脉注射 | 靶组织或器官  | -      | 用于肿瘤治疗            |

**【例题】**

不存在吸收过程的给药途径是

- A. 静脉注射
- B. 腹腔注射
- C. 口服给药
- D. 肌肉注射
- E. 肺部给药

**【正确答案】** A

**【答案解析】** 本题考查药物的吸收。吸收是指药物从给药部位到达全身体循环的过程。因此腹腔注射、肌肉注射、口服给药、肺部给药都有吸收过程,静脉注射则没有。故本题答案应选 A。

**核心考点: 药理学基本概念**

|                       |  |
|-----------------------|--|
| 斜率                    | •斜率大的药物，药量微小的变化，即可引起效应的明显改变，反之亦然。              |
| 最小有效量                 | 指引起药理效应的最小药量，引起药理效应的最低药物浓度称为阈浓度。               |
| 最大效应/效能               | 指在一定范围内，增加药物剂量或浓度，所能达到的最大效应。                   |
| 效价强度                  | 起等效反应（一般采用50%效应量）的相对剂量或浓度，其值越小则强度越大。           |
| 半数有效量ED <sub>50</sub> | 引起50%阳性反应（质反应）或50%最大效应（量反应）的浓度或剂量。             |
| 半数致死量LD <sub>50</sub> | 引起50%试验动物死亡的量，数值越大，药物的毒性越小。                    |
| 治疗指数（TI）              | D <sub>95</sub> /ED <sub>50</sub> ，数值越大越安全。    |
| 安全范围                  | D <sub>95</sub> 和LD <sub>5</sub> 之间距离，范围越大越安全。 |

**【例题】**

患者，男性，60岁，患充血性心力衰竭，采用利尿药治疗。药物A和B具有相同的利尿机制。5mg药物A与500mg药物B能够产生相同的利尿强度，这提示

- A. 药物B的效能低于药物A
- B. 药物A比药物B的效价强度高100倍
- C. 药物A的毒性比药物B低
- D. 药物A比药物B更安全
- E. 药物A的作用时程比药物B短

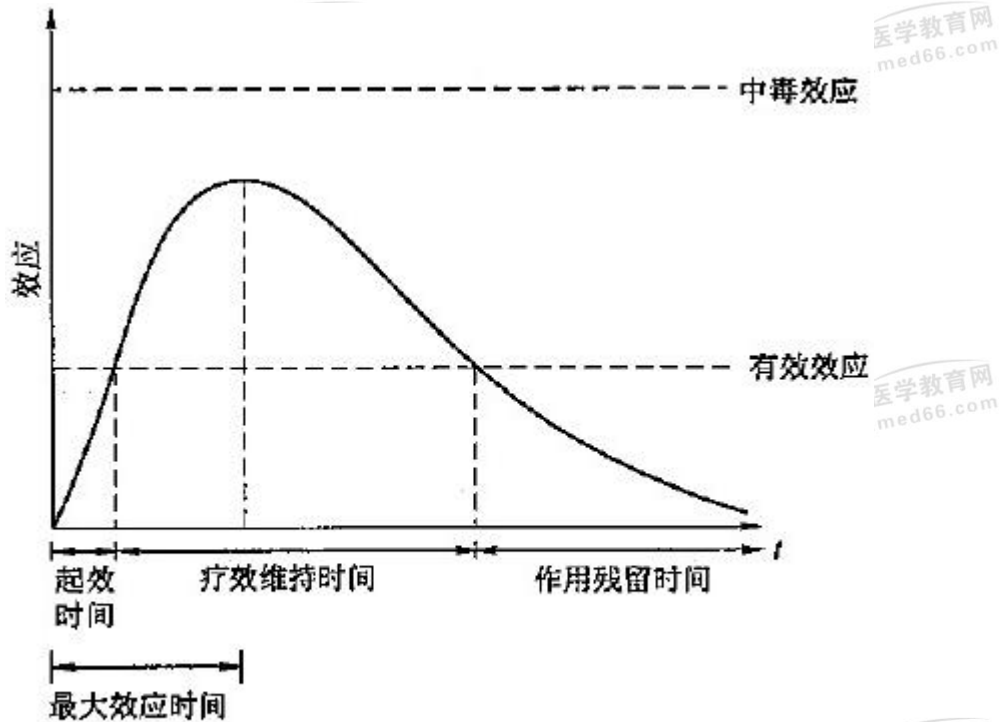
**【正确答案】** B

**【答案解析】** 药物效价强度是指达到某效应的药物剂量，5mg药物A与500mg药物B能够产生相同的利尿强度，即相同的效应，其B药物剂量是A药物的100倍，效价强度A比B强100倍。

**核心考点：**药物的时-效曲线中的药理学概念

结合时-效曲线图进行区分掌握。





### 单次用药的时-效曲线

从时-效曲线衍生出如下药理学基本概念，有重要的临床意义。

**起效时间**指给药至时-效曲线与有效效应线首次相交点的时间，代表药物发生疗效以前的潜伏期。

**最大效应时间**即给药后作用达到最大值的时间。

**疗效维持时间**指从起效时间开始到时-效曲线下降到与有效效应线再次相交点之间的时间。这一参数对连续多次用药时选择用药的间隔时间有参考意义。

**作用残留时间**指曲线从降到有效效应线以下到作用完全消失之间的时间。如在此段时间内第二次给药，则须考虑前次用药的残留作用。

#### 【例题】

时-效曲线上从起效时间开始到时-效曲线下降到与有效效应线再次相交点之间的时间为

- A. 起效时间
- B. 最大效应时间
- C. 达峰时间
- D. 疗效维持时间
- E. 作用残留时间

【正确答案】D

【答案解析】疗效维持时间指从起效时间开始到时效曲线下降到与有效效应线再次相交点之间的时间。

**核心考点：药物的治疗作用**

| 治疗作用     | 定义            | 举例   |
|----------|---------------|--|
| 对因治疗     | 消除原发致病因子      | 抗生素杀灭病原微生物                                 |
| 对症治疗     | 改善患者疾病症状      | 解热镇痛药降低体温、缓解疼痛；<br>硝酸甘油缓解心绞痛；<br>抗高血压药降低血压 |
| 补充（替代）治疗 | 补充体内营养或代谢物质不足 | 补充铁剂治疗缺铁性贫血；补充胰岛素治疗糖尿病                     |

**【例题】**

属于对因治疗的药物作用方式

- A. 胰岛素降低糖尿病患者的血糖
- B. 阿司匹林治疗感冒引起的发热
- C. 硝苯地平降低高血压患者的血压
- D. 硝酸甘油缓解心绞痛的发作
- E. 青霉素治疗脑膜炎奈瑟菌引起的流行性脑脊髓膜炎

【正确答案】E

【答案解析】（1）对因治疗：用药后能消除原发致病因子，治愈疾病的药物治疗。如使用抗生素杀灭病原微生物，达到控制感染性疾病；（2）对症治疗：用药后能改善患者疾病的症状。如应用解热镇痛药降低高热患者的体温，缓解疼痛；硝酸甘油缓解心绞痛；抗高血压药降低患者过高的血压等属于对症治疗。（3）补充疗法（替代疗法）：补充体内营养或代谢物质不足。如铁制剂治疗缺铁性贫血、糖尿病患者补充胰岛素等属于补充疗法（替代疗法）。

**核心考点：药品不良反应-后遗效应、继发性反应**

1. 后遗效应

停药后血药浓度已降低至最低有效浓度以下时仍残存的药理效应。

巴比妥类催眠药引起“宿醉”现象；

长期使用肾上腺皮质激素引起肾上腺皮质功能下降。

## 2. 继发性反应

由于药物的治疗作用所引起的不良后果, 又称治疗矛盾。

长期使用广谱抗生素引起二重感染。

### 【例题】

应用巴比妥类药醒后出现的眩晕、困倦等属于

A. 反跳现象

B. 毒性反应

C. 变态反应

D. 后遗效应

E. 继发性反应

### 【正确答案】D

【答案解析】后遗效应: 停药后血药浓度已降低至最低有效浓度以下时仍残存的药理效应。如巴比妥类催眠药引起“宿醉”现象。

### 核心考点: 药品不良反应-变态反应、特异质反应、依赖性、停药反应

#### 1. 变态反应

机体受药物刺激所发生异常的免疫反应。

剂量无关(极小剂量即可发生); 常见于过敏体质; 不易预知。

#### 2. 特异质反应

指少数特异体质患者对某些药物反应异常敏感。现已知道特异质反应多是先天遗传异常所致的反应。

先天性葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏的疟疾患者服用伯氨喹后, 容易发生急性溶血性贫血和高铁血红蛋白血症;

假性胆碱酯酶缺乏者, 应用骨骼肌松弛药琥珀胆碱后, 由于延长了肌肉松弛作用而常出现呼吸暂停反应。

#### 3. 依赖性

依赖性可分为生理依赖性和精神依赖性:

生理使赖性又称躯体依赖性, 是指中枢神经系统对长期使用的药物所产生的一种身体适应状态; 一旦停药, 将发生一系列生理功能紊乱, 称为戒断综合征。

精神依赖性是指多次用药后使人产生欣快感, 导致用药者在精神上对所用药物有一种渴

求连续不断使用的强烈欲望，继而引发强迫用药行为，以获得满足和避免不适感，也称为成瘾性。

#### 4. 停药反应

患者长期应用某种药物，突然停药后出现原有疾病加剧的现象，又称回跃反应或反跳。

普萘洛尔、可乐定（突然停药，血压升高）

#### 【例题】

假性胆碱酯酶缺乏者，应用琥珀胆碱由于延长了肌肉松弛作用而常出现呼吸暂停反应属于

- A. 变态反应
- B. 特异质反应
- C. 毒性反应
- D. 副反应
- E. 后遗效应

【正确答案】B

【答案解析】假性胆碱酯酶缺乏者，应用骨骼肌松弛药琥珀胆碱后，由于延长了肌肉松弛作用而常出现呼吸暂停反应。属于特异质反应。

#### 核心考点：药物的作用机制

| 类型     | 特点  | 举例   |
|--------|---|--|
| 作用于受体  | 大多数药物作用机制   | 胰岛素、阿托品（M受体）、肾上腺素（ $\alpha$ 、 $\beta$ 受体）                    |
| 影响酶活性  | 抑制酶活性   | 依那普利（ACE）、阿司匹林（COX）、地高辛（ $\text{Na}^+$ - $\text{K}^+$ -ATP酶） |
|        | 激活酶活性   | 尿激酶、碘解磷定（复活胆碱酯酶）   |
|        | 影响代谢酶   | 苯巴比妥（诱导肝药酶）、氯霉素（抑制肝药酶）                                       |
| 影响离子通道 | 利多卡因（ $\text{Na}^+$ ）、硝苯地平（ $\text{Ca}^{2+}$ ）                |  |
| 干扰核酸代谢 | 氟尿嘧啶（掺入肿瘤细胞DNA、RNA中）、磺胺药（抑制叶酸代谢干扰核酸合成）、喹诺酮类（抑制DNA螺旋酶和拓扑异构酶IV） |  |
| 补充体内物质 | 铁剂治疗缺铁性贫血、胰岛素治疗糖尿病；补充维生素、多种微量元素                               |  |

|                   |  |
|-------------------|--|
| 改变细胞周围环境<br>的理化性质 | 氢氧化铝（抗酸药中和胃酸）、甘露醇（利尿）、硫酸镁（渗透性泻药）         |
| 影响生理活性物<br>质及其转运体 | 噻嗪类利尿药（抑制 $\text{Na}^+-\text{Cl}^-$ 转运体） |
| 影响免疫功能            | 环孢素（抑制免疫）、左旋咪唑（免疫增强药）                    |
| 非特异性作用            | 消毒防腐药、调节血液酸碱平衡药                          |

**【例题】**

磺胺类药物的作用机制

- A. 作用于受体
- B. 影响理化性质
- C. 影响离子通道
- D. 干扰核酸代谢
- E. 补充体内物质

**【正确答案】** D

**【答案解析】** 磺胺类抗菌药通过抑制敏感细菌体内叶酸的代谢而干扰核酸的合成。

**核心考点：受体的性质**

(1) 饱和性：受体数量是有限的，其能结合的配体量也是有限的，受体饱和后在药物的作用上反映为最大效应。

(2) 特异性：又称专一性、专属性、选择性，受体对配体的化学结构与立体结构有很高的专一性，特定的受体只能与特定的配体结合。

(3) 可逆性：绝大多数配体与受体结合是通过非共价键，如范德华力、离子键、氢键等，是可逆的。

(4) 灵敏性：受体能够识别周围环境中微量的配体，只要很低浓度的配体就能与受体结合而产生显著的效应。如乙酰胆碱。

(5) 多样性：同一受体可广泛分布于不同组织或同一组织不同区域。

**【例题】**

关于受体所具有的性质，不正确的是

- A. 灵敏性
- B. 可逆性

- C. 特异性
- D. 饱和性
- E. 持久性

【正确答案】 E

【答案解析】 受体的性质：多样性、灵敏性、可逆性、特异性、饱和性。

**核心考点：受体的信号转导**

(1) 第一信使

细胞外信使物质，多肽类物质、神经递质、细胞因子及药物属于第一信使

(2) 第二信使

胞浆内信使物质，包括环磷酸腺苷 (cAMP)、环磷酸鸟苷 (cGMP)、二酰基甘油 (DAG)、三磷酸肌醇 (IP<sub>3</sub>)、钙离子 (Ca<sup>2+</sup>)、甘碳烯酸类、一氧化氮 (NO，同时具有第一信使和第二信使特征)

(3) 第三信使

细胞核内信使，生长因子、转化因子

**【例题】**

已确定的第二信使不包括

- A. cAMP
- B. cGMP
- C. 钙离子
- D. 甘油二酯
- E. 三酰甘油

【正确答案】 E

【答案解析】 G 蛋白偶联受体介导来自这些配体的信号通过第二信使 (cAMP、cGMP、IP<sub>3</sub>、DAG、Ca<sup>2+</sup>) 转导至效应器，从而产生生物效应。DAG 就是甘油二酯。

**核心考点：受体的激动药和拮抗药的分类**

| 分类  | 特点           |                                      |
|-----|--------------|--------------------------------------|
| 激动药 | 完全激动药 (吗啡)   | 与受体有较强亲和力，内在活性较强                     |
|     | 部分激动药 (喷他佐辛) | 与受体有较强亲和力，但内在活性不强，与激动药并用还可拮抗激动药的部分效应 |



|     |              |  |
|-----|--------------|--|
|     | 反向激动药        | 对失活态的受体亲和力大于活化态, 结合后引起与激动药相反的效应, 如苯二氮(十卓)类 |
| 拮抗药 | 竞争性拮抗药 (阿托品) | 与受体有较强亲和力而无内在活性, $E_{max}$ 不变、曲线平行右移       |
|     | 非竞争性拮抗药      | 与受体有较强亲和力而无内在活性, $E_{max}$ 下降              |

**【例题】**

受体完全激动剂的特点是

- A. 亲和力高, 内在活性强
- B. 亲和力高, 无内在活性
- C. 亲和力高, 内在活性弱
- D. 亲和力低, 无内在活性
- E. 亲和力低, 内在活性弱

**【正确答案】** A

**【答案解析】** 将既有亲和力又有内在活性的药物称为激动药, 它们能与受体结合并激活受体而产生效应。根据亲和力和内在活性, 激动药又能分为完全激动药和部分激动药。完全激动药对受体有很高的亲和力和内在活性; 部分激动药对受体有很高的亲和力, 但内在活性不强。

**核心考点: 药物效应的协同作用**

(1) 相加作用

阿司匹林合用对乙酰氨基酚解热镇痛作用相加

阿替洛尔合用氢氯噻嗪降压作用相加

氨基糖苷类抗生素间合用毒性增加

(2) 增强作用

磺胺甲噁唑合用甲氧苄啶抗菌作用增强

普鲁卡因合用肾上腺素局麻作用延长

(3) 增敏作用

钙增敏药增加肌钙蛋白 C 对  $Ca^{2+}$  的亲和力

**【例题】**

$\beta$  受体阻断剂与利尿药合用后降压作用大大增强, 这种现象称为

- A. 敏化作用
- B. 拮抗作用
- C. 增强作用
- D. 互补作用
- E. 相加作用

【正确答案】E

【答案解析】 $\beta$ 受体阻断剂与利尿药合用后降压作用大大增强属于协同作用中的相加作用。

### 核心考点：药物效应的拮抗作用

#### (1) 生理性拮抗

自体活性物质组胺可作用于  $H_1$  组胺受体，引起支气管平滑肌收缩，使小动脉小静脉和毛细血管扩张，毛细血管通透性增加，引起血压下降，甚至休克；

肾上腺素作用于  $\beta$  肾上腺素受体使支气管平滑肌松弛，小动脉、小静脉和毛细血管前括约肌收缩，可迅速缓解休克，用于治疗过敏性休克；

组胺和肾上腺素合用则发挥生理性拮抗作用。

#### (2) 生化性拮抗

苯巴比妥与避孕药合用导致避孕效应降低

#### (3) 化学性拮抗

鱼精蛋白解救肝素过量引起的出血

#### (4) 药理性拮抗

组胺  $H_1$  受体阻断药苯海拉明可阻断组胺  $H_1$  受体激动药的作用；

$\beta$  受体阻断药可阻断异丙肾上腺素的  $\beta$  受体激动作用。

### 【例题】

下列属于药理性拮抗的是

- A. 肾上腺素拮抗组胺治疗过敏性休克
- B.  $\beta$  受体阻断药可阻断异丙肾上腺素的  $\beta$  受体激动作用
- C. 苯巴比妥与避孕药合用，导致避孕失败
- D. SMZ+TMP 抗菌作用增强
- E. 氨基糖苷类药物合用肾毒性增加

【正确答案】B

【答案解析】ABC 属于拮抗作用，DE 属于协同作用。肾上腺素拮抗组胺治疗过敏性休克属于生理性拮抗，苯巴比妥与避孕药合用，导致避孕失败属于生化性拮抗，β受体阻断药可阻断异丙肾上腺素的β受体激动作用属于药理性拮抗。

**核心考点：药动学参数及临床意义-速率常数（k）、生物半衰期（ $t_{1/2}$ ）**

| 参数                 | 定义                     | 公式                | 临床意义               |
|--------------------|------------------------|-------------------|--------------------|
| 速率常数（k）            | 用来描述药物体内过程速度与浓度的关系     | $k=0.693/t_{1/2}$ | 速率常数越大，表明其体内过程速度越快 |
| 生物半衰期（ $t_{1/2}$ ） | 药物在体内的量或血药浓度降低一半所需要的时间 | $t_{1/2}=0.693/k$ | 半衰期越大，药物从体内消除越慢    |

**【例题】**

某药物在体内按一级动力学消除，如果  $k=0.0346h^{-1}$ ，该药物的消除半衰期约为

- A. 3.46h
- B. 6.92h
- C. 12h
- D. 20h
- E. 24h

**【正确答案】D**

【答案解析】根据公式： $t_{1/2}=0.693/k$  计算，其中  $t_{1/2}$  为药物半衰期。  
 $t_{1/2}=0.693/k=0.693/0.0346h^{-1}=20h$ 。

**核心考点：药动学参数及临床意义-表观分布容积（V）、清除率（Cl）**

| 参数        | 定义                    | 公式      | 临床意义                             |
|-----------|-----------------------|---------|----------------------------------|
| 表观分布容积（V） | 体内药量与血药浓度间相互关系的一个比例常数 | $V=X/C$ | 水溶性或极性大的药物表观分布容积较小；亲脂性药物表观分布容积较大 |
| 清除率（Cl）   | 单位时间从体内消除的含药血浆体积      | $Cl=kV$ | 肝脏或肾脏功能出现障碍时，Cl 变小               |

**【例题】**

静脉注射某药 80mg，初始血药浓度为  $20\mu g/ml$ ，则该药的表观分布容积 V 为

- A. 0.25L

B. 4L

C. 0. 4L

D. 1. 6L

E. 16L

【正确答案】B

【答案解析】根据公式  $V=X_0/C_0$ ，其中  $V$  是表观分布容积， $X_0$  为静脉剂量， $C_0$  为初始浓度。

所以  $V=80\text{mg}/20\mu\text{g/ml}=4\text{L}$ 。

### 核心考点：时辰药理学与药物应用

#### （一）心血管药物的时辰应用

##### 1. 硝苯地平对心肌缺血昼夜节律的影响

硝苯地平日平均剂量 80mg 对心肌缺血有明显的改善作用。

##### 2. 阿司匹林对心肌梗死昼夜节律的影响

隔日口服阿司匹林 325mg 可以明显抑制上午 6~9 时的心肌梗死的发作高峰。

##### 3. 抗高血压药对血压昼夜节律的影响

拉贝洛尔 100~200mg，每日 2~3 次，早晨 06: 00 时给药，血压、心率的昼夜节律曲线变得平坦。

硝苯地平对血压的昼夜波动影响较强，口服 20~60mg，每日 2 次，可有效降低血压，并可明显控制血压的节律性波动，但不影响心率的昼夜节律。

维拉帕米抑制血压昼夜波动作用与硝苯地平相似而较弱，但能抑制心率的昼夜节律。

#### （二）平喘药物的时辰应用

$\beta_2$  受体激动剂平喘药可采取剂量晨低夜高给药方法。

特布他林 08: 00 时口服 5mg，20: 00 时服 10mg，可使该药的血药浓度昼夜保持相对稳定，有效控制哮喘发作；

晚间临睡前口服沙丁胺醇缓释片 16mg，可获较好疗效。

茶碱类药物白天吸收快，而晚间吸收较慢，采取日低夜高的给药剂量。

#### （三）糖皮质激素类药物的时辰应用

糖皮质激素 08: 00 时 1 次予以全天剂量比 1 天多次给药效果好，不良反应也少。

#### （四）胰岛素的时辰应用

糖尿病患者的空腹血糖、尿糖都有昼夜节律（非糖尿病患者无此节律）。胰岛素泵维持血糖水平的相对稳定。

(五) 抗肿瘤药物的时辰应用

抗肿瘤药物起伏式给药, 较之阶梯式(在一天中有高、低两种剂量)或均分式(将一天总量平均分配于各次注射)给药法优越。

**【例题】**

糖皮质激素欲想达到较好的治疗效果可采取的给药方法是

- A. 08:00 时 1 次给予全天剂量
- B. 晨高夜低
- C. 19:00 时给药
- D. 晨低夜高
- E. 21:00 时给药

**【正确答案】** A

**【答案解析】** 糖皮质激素 08:00 时 1 次予以全天剂量比 1 天多次给药效果好, 不良反应也少。