

《药专业知识一》历年考题考点

药物结构中的取代基对生物活性的影响——考题

历年考题举例

- A. 羟基
- B. 硫醚
- C. 羧酸
- D. 卤素
- E. 酰胺

在药物的结构骨架上引入官能团, 会对药物性质或生物活性产生影响

1. 可氧化成亚砷或砷, 使极性增强的官能团是
2. 有较强的吸电子性, 可增加脂溶性及药物作用时间的官能团是
3. 可与醇类成酯, 使脂溶性增大, 利于吸收的官能团是

【答案】BDC

【解析】硫醚可氧化成亚砷或砷, 它们的极性强于硫醚。卤素是很强的吸电子基, 可影响药物分子间的电荷分布和脂溶性及药物作用时间。羧酸成酯可增大脂溶性, 易被吸收。

知识点汇总:

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 (火字旁, 火上浇油, 脂溶性增加)	改变溶解度、解离度、分配系数, 位阻 ↑, 稳定性 ↑	环己巴比妥引入甲基 → 海索比妥, 不易解离
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
巯基	形成氢键能力比羟基低, 但脂溶性高, 更易吸收	解毒药: 与重金属形成不溶性硫醇盐
醚和硫醚	醚类在脂-水交界处定	硫醚类可氧化成亚砷或砷,

	向排布, 易通过生物膜	极性↑ (风流黄: 有硫, 可成亚砷或砷, 磺)
酰胺	增强与受体的结合能力	构成受体或酶的蛋白质和多肽结构中含有大量的酰胺键
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 (伯仲叔按年龄排序, 大哥活性强)
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 (金戈铁马)	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; 但可穿透细菌的细胞壁, 如四代头孢
羟基 (脱胎于 H ₂ O, 水溶性强)	增强与受体结合力, 水溶性↑, 改变活性	(1) 脂肪链上: 活性和毒性下降 (2) 芳环上: 酸性、活性和毒性增强 (3) 成酯/成醚: 活性降低
磺酸、羧酸 (酸可在碱性条件下成盐, 水溶性增强)	引入磺酸基使水溶性和解离度↑, 不易吸收, 仅有磺酸基一般无活性; 引入羧酸水溶性解离度较磺酸小	磺酸和羧酸成酯: 脂溶性增加, 易吸收

药物的立体结构对药物作用的影响——考题

历年考题举例

对映异构体之间具有相同的药理作用, 但强弱不同的手性药物是

- A. 氨己烯酸
- B. 扎考必利
- C. 氯胺酮
- D. 氯苯那敏
- E. 普罗帕酮

【答案】D

【解析】氯苯那敏其右旋体的活性高于左旋体, 产生的原因是由于分子中的手性碳原子离芳环近, 对药物受体相互作用产生空间选择性。

知识点汇总:

类型	药物
对映异构体之间具有等同的药理活性和强度	如: 普罗帕酮、氟卡尼
药理活性相同但是强弱不同	如: 氯苯那敏、萘普生
一个有活性, 一个没有	如: 甲基多巴、氨己烯酸
产生相反的活性	如: 哌西那朵、扎考必利、伊托唑林
产生不同的药理活性	如: 丙氧酚、奎宁
一个有活性, 一个有毒性	如: 氯胺酮、丙胺卡因、乙胺丁醇

药物结构与第 I 相生物转化规律——考题

历年考题举例

保泰松在体内代谢成羟布宗, 发生的代谢反应是

- A. 芳环羟基化
- B. 硝基还原
- C. 烯烃氧化

D. N-脱烷基化

E. 乙酰化

【答案】A

【解析】保泰松羟基化生成羟布宗。

知识点汇总:

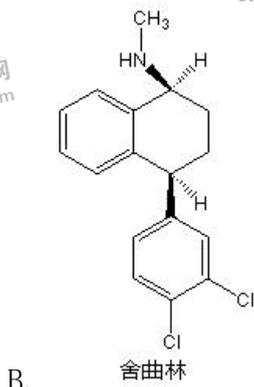
结构特征	生物转化规律	具体药物
含芳环的药物	氧化代谢成环氧化合物然后重排生成酚或被水解为二羟基化合物	普萘洛尔、丙磺舒、氯丙嗪、苯妥英、保泰松、华法林
含烯烃的药物	生成环氧化合物后转化成二羟基化合物	卡马西平
含炔烃的药物	端炔生成烯酮中间体水解成羧酸,非端基炔烃发生 N-烷基化反应	炔雌醇
含饱和碳原子的药物	末端碳和倒数第二个碳氧化、支链碳上发生羟基化	丙戊酸钠
脂环的氧化反应	饱和脂环容易发生氧化反应,引入羟基	四氢萘、醋磺己脲
含卤素的药物	氧化脱卤素	氯霉素
胺类药物	N-脱烷基和氧化脱氨反应	普萘洛尔、氯胺酮、丙咪嗪、苯丙胺
	N-氧化反应	吗啡、胍乙啶、氨苯砜
醚类药物	O-脱烷基化反应,生成醇和酚以及羰基化合物	可待因、吲哚美辛
醇类	氧化成羰基化合物	伯醇 $\xrightarrow{\text{氧化}}$ 醛 $\xrightarrow{\text{氧化}}$ 羧酸 仲醇 $\xrightarrow{\text{氧化}}$ 酮
酮类	生成仲醇	美沙酮
硫醚	S-脱烷基和 S-氧化反应	6-甲基巯嘌呤、阿苯

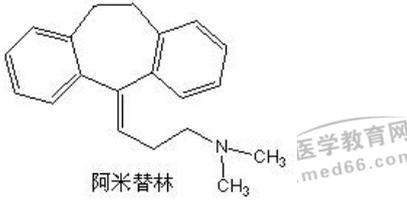
		达唑
含硫羰基化合物	氧化脱硫	硫喷妥
亚砷类药物	氧化成砷或还原成硫醚	舒林酸
含硝基的药物	还原成胺	氯霉素
酯	水解成酸和醇	普鲁卡因
酰胺	水解成酸和胺	普鲁卡因胺、丙胺卡因
	N-氧化为羟胺	非那西丁

抗抑郁药——考题

历年考题举例

在体内可发生去甲基化代谢,其代谢产物仍具有活性抗抑郁的药





【答案】ABCDE

【解析】氟西汀、舍曲林、西酞普兰和阿米替林在体内发生 N-去甲基代谢，代谢产物仍然具有抗抑郁活性；文拉法辛发生的是 O-去甲基代谢，代谢产物仍然具有抗抑郁活性。

知识点汇总:

分类	代表药物	考点
去甲肾上腺素 (NE) 重摄取抑制剂	代表药物	丙米嗪、氯米帕明、地昔帕明、阿米替林、多塞平
	多塞平	两个几何异构体, E 型抑制 NE 重摄取; Z 型抑制 5-HT 重摄取活性较强
5-羟色胺 (5-HT) 重摄取抑制剂	代表药物	氟西汀及去甲氟西汀、舍曲林、氟伏沙明、西酞普兰、帕罗西汀
	氟西汀	口服吸收良好, $t_{1/2}$ 为 4-6 天
	去甲氟西汀	为氟西汀的活性代谢产物, $t_{1/2}$ 为 4-16 天
	舍曲林	代谢产物为 N-去甲基舍曲林
	艾司西酞普兰	西酞普兰的 S-对映体
	帕罗西汀	非线性药动学特征
单胺氧化酶抑制剂	代表药物	吗氯贝胺、托洛沙酮
5-羟色胺与去甲肾上腺素	代表药物	度洛西汀、文拉法辛、米氮平

素再摄取抑制剂	
抗抑郁药在体内可发生去甲基化代谢, 其代谢产物仍具有活性抗抑郁的包	
括:	
丙米嗪——地西帕明	
氯米帕明——去甲氯米帕明	
阿米替林——去甲替林	
氟西汀——去甲氟西汀	
舍曲林——N-去甲舍曲林	
文拉法辛——O-去甲文拉法辛	
西酞普兰——N-去甲西酞普兰	

镇痛药——考题

历年考题举例

体内可以代谢成吗啡, 具有成瘾性的镇咳药物是

- A. 可待因
- B. 布洛芬
- C. 对乙酰氨基酚
- D. 乙酰半胱氨酸
- E. 羧甲司坦

【答案】A

【解析】可待因体内可以代谢成吗啡, 具有成瘾性, 镇痛活性弱, 具有镇咳作用。

知识点汇总:

分类	考点	
天然生物碱及其类似物	吗啡	有效构型左旋吗啡, 具酸碱性
	可待因	体内可以代谢成吗啡, 具有成瘾性, 镇痛活性弱, 具有镇咳作用
	海洛因	吗啡 3、6 位羟基同时酯化

	羟考酮	阿片受体纯激动剂; 无极量限制; 控释片具有双相吸收模式: 速释相和缓释相
合成镇痛药	哌替啶	代谢产物去甲基哌替啶, 无镇痛作用; 其易蓄积产生中枢毒性, 引发癫痫
	美沙酮	R 旋体镇痛作用强, S 旋体作用弱, 药用其外消旋体
其他合成镇痛药	布桂嗪 (强痛定)	显效速度快, 一般注射后 10 分钟起效, 连续使用本品可致耐受和成瘾
	曲马多	有两个手性中心, 临床用其外消旋体; 活性代谢产物是 O-脱甲基曲马多; 对呼吸抑制的作用小, 几无成瘾性

组胺 H₁ 受体阻断剂抗过敏药——考题

模拟题举例

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 H₁ 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

【答案】 E

【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 H₁ 受体而产生抗组胺作用。

知识点汇总:

分类	考点
----	----

氨基醚类	代表药	苯海拉明、茶苯海明、氯马斯汀、司他斯汀
	苯海拉明	具有肝药酶诱导作用, 加速自身代谢, 24 小时内几乎全部排出
丙胺类	代表药	氯苯那敏
	氯苯那敏	临床实用外消旋体马来酸氯苯那敏
三环类	代表药	异丙嗪、赛庚啶、酮替芬、氯雷他定
	异丙嗪	最早发现的吩噻嗪结构的三环类抗组胺药
	氯雷他定	氯雷他定可看成是在阿扎他啶的苯环上引入被原子, 并将碱性氮甲基部分换以中性的氨甲酸乙酯得到; 地氯雷他定是氯雷他定的活性代谢产物
哌嗪类	代表药	氯环利嗪、西替利嗪
	西替利嗪	氯环利嗪分子中引入亲水性基团羧甲氧烷基, 得到西替利嗪; 左旋体活性比右旋体活性更强; 左西替利嗪对 H ₁ 受体的亲和力约为右旋体的 30 倍, 是西替利嗪的 2 倍; 不易透过血-脑脊液屏障
哌啶类	代表药	特非那定、非索非那定、依巴斯汀、卡瑞斯汀、阿司咪唑、诺阿司咪唑、咪唑斯汀、左卡巴斯汀、依美斯汀、氮卓斯汀
	非索非那定	是特非那定的活性代谢产物, 含有羧基无中枢镇静作用, 无心脏毒性
	诺阿司咪唑	为阿司咪唑的活性代谢物, 抗组胺作用比阿司咪唑强 40 倍, 毒性低

非甾体抗炎药——考题

历年考题举例

分子中含有甲基亚砷基苯基需经代谢生成甲硫基后才有生物活性的药物是

- A. 对乙酰氨基酚
- B. 舒林酸
- C. 赖诺普利
- D. 缬沙坦
- E. 氢氯噻嗪

【答案】B

【解析】舒林酸属前体药物，它在体外无效，在体内经肝代谢，甲基亚砷基被还原为甲硫基化合物而显示生物活性。

知识点汇总:

分类		考点
芳基乙酸类	吲哚美辛	蛋白结合率高，在室温空气中稳定，对光敏感
	舒林酸	在体外无效，体内代谢产生甲硫基化合物产生活性，为前体药物
	双氯芬酸	非甾体药物中剂量最小
芳基丙酸类	布洛芬	S型异构体的活性优于R型异构体，但布洛芬通常以外消旋体上市，其原因是布洛芬R型异构体在体内会转化为S型异构体
	萘丁美酮	非酸性前体药物
昔康类	吡罗昔康（炎痛昔康）、美洛昔康、依索昔康、替诺昔康、氯诺昔康	1,2-苯并噻嗪结构，分子含烯醇构效团
昔布类	塞来昔布、罗非昔布	COX-2 抑制剂 增大心血管事件风险（原因在阻断前列环素(PGI ₂)的生成但不能抑制血栓素(TXA ₂)的生成)

抗溃疡药——考题

历年真题举例

艾司奥美拉唑(埃索美拉唑)是奥美拉唑的 S 型异构体, 其与奥美拉唑的 R 型异构体之间的关系是

- A. 具有不同类型的药理活性
- B. 具有相同的药理活性和作用持续时间
- C. 在体内经不同细胞色素酶代谢
- D. 一个有活性, 一个无活性
- E. 一个有药理活性, 另一个有毒性作用

【答案】C

【解析】(+)-R-奥美拉唑的 5 位甲基被药物代谢酶 CYP2C19 羟基化而失活; (-)-S-异构体则主要被同工酶 CYP3A4 作用。

知识点汇总:

分类		考点
组胺 H ₂ 受体阻断剂 (**替丁)	雷尼替丁、西咪替丁、法莫替丁、尼扎替丁、罗沙替丁	①H ₂ 受体拮抗剂都具有两个药效团: 碱性的芳环结构和平面的极性基团; ②雷尼替丁为反式体, 顺式体无活性; ③将罗沙替丁分子中的羟基进行乙酰化, 得到前药罗沙替丁乙酸酯
质子泵抑制剂 (**拉唑)	奥美拉唑、埃索美拉唑、兰索拉唑、泮托拉唑、雷贝拉唑	①奥美拉唑具有酸碱两性; ②具有肝肠循环或前药循环; ③作用机制是通过细胞膜进入强酸性的胃壁细胞分泌酸小管口, 酸质子对苯并咪唑环上氮原、子质子化而活化, 发生分子内的亲核反应, 通过发生 Smiles 重排、生成次磺酸和次磺酰胺, 然后与 H ⁺ , K ⁺ -ATP 酶上 Cys813 和 Cys892 的巯基共价结合, 形成二硫化酶抑制剂复合物而阻断质子泵分泌 H ⁺ 的作用

		④艾司奥美拉唑（埃索美拉唑）是奥美拉唑的 S 型异构体，其与奥美拉唑的 R 型异构体之间的关系是在体内经不同细胞色素酶代谢
--	--	---------------------------------------------------------------

调节血脂药——考题

历年考题举例

阿托伐他汀的作用机制是通过抑制羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶产生降血脂作用，阿托伐他汀抑制酶活性的必需药效团是

- A. 异丙基
- B. 吡咯环
- C. 氟苯基
- D. 3, 5-二羟基羧酸结构片段
- E. 酰苯胺基

【答案】D

【解析】羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑制剂类药物的结构中，3, 5-二羟基羧酸是产生酶抑制活性的必需结构（药效团）。

知识点汇总：

分类	药物	考点
羟甲戊二酰辅酶 A (HMG-CoA) 还原酶抑制剂	构效关系	构效基团：3, 5-二羟基羧酸
	此类药物不良反应	他汀类药物可引起肌痛或横纹肌溶解症的不良反应，西立伐他汀导致“拜斯亭事件”，因此撤市
	洛伐他汀	为天然他汀类药物； 含有内酯结构，是前体药物； 有 8 个手性中心，改变构型，活性降低； 可竞争性抑制 HMG-CoA 还原酶，显著降低 LDL 水平，提高 HDL 水平
	辛伐他汀	半合成的他汀类药物；

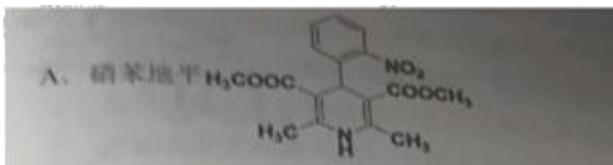
	含有内酯结构, 是前体药物; 在洛伐他汀十氢萘环的侧链上多一个甲基, 使亲脂性略有提高, 活性提高
普伐他汀	半合成的他汀类药物; 洛伐他汀的内酯环开环, 十氢萘环 2 位的甲基用羟基取代而得的药物; 比洛伐他汀具有更大的亲水性, 减少了副作用
氟伐他汀	含有环 B 基本结构; 第一个通过全合成得到的他汀类药物, 用吡啶环替代洛伐他汀分子中的双环, 内酯可开环与钠成盐得到氟伐他汀钠
阿托伐他汀	全合成的他汀类药物; 用吡咯环替代洛伐他汀分子中的双环, 内酯开环; 通过抑制 HMG-CoA 还原酶降低了胆固醇的从头合成, 降低血液中低密度脂蛋白的量
瑞舒伐他汀	合成的他汀类药物; 分子中的双环部分改成了多取代的嘧啶环

抗心绞痛药——考题

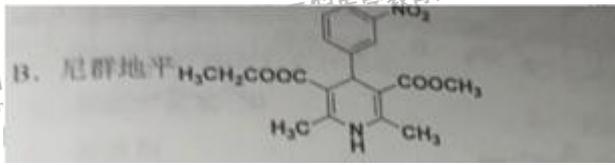
历年真题举例

分子结构具有对称性, 可用于治疗冠心病, 并能缓解心绞痛的药物是

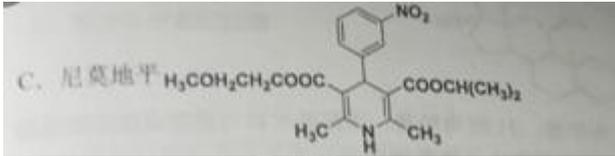
A. 硝苯地平



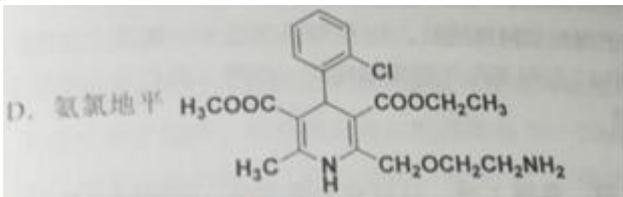
B. 尼群地平



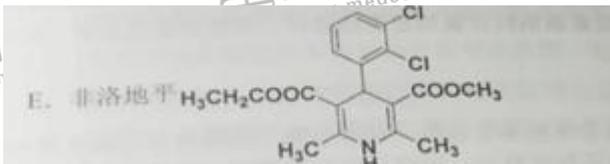
C. 尼莫地平



D. 氨氯地平



E. 非洛地平



【答案】A

【解析】提示结构具有对称性，药物结构中有对称轴，结构中有可以重合的部分，通过观察结构可以看出硝苯地平的吡啶环左右是对称的，所以可以选出 A 答案。

知识点汇总:

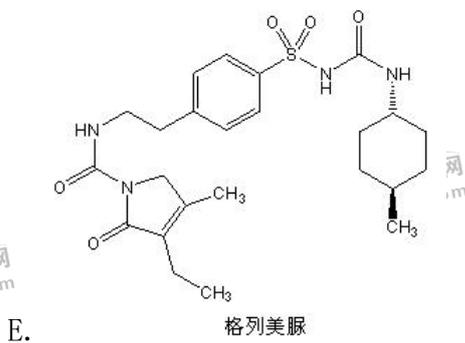
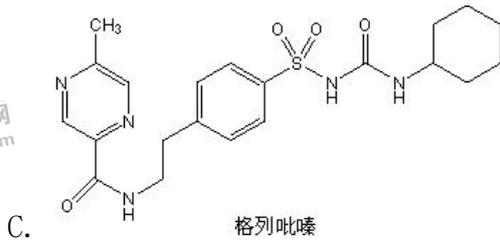
分类	药物	考点
硝酸酯类	硝酸甘油	有挥发性和爆炸性，不宜以纯品形式放置和运输； 舌下含服能避免首过效应； 具有快速耐受性
	硝酸异山梨酯	有稳定型和不稳定型两种晶型，药用稳定型，不稳定型在 30℃放置数天后，即转为稳定型； 进入人体后被代谢为有抗心绞痛活性的 2-单硝酸异山梨酯和 5-硝酸异山梨酯
	单硝酸异山梨酯	硝酸异山梨酯的活性代谢产物，水溶性增大，副作用降低

1,4-二氢吡啶类	构效关系	1,4-二氢吡啶环是该类药物的必须药效团; 遇光极不稳定, 易发生歧化反应, 需避光; 该类物质与柚子汁同服会导致药物体内浓度增加
	硝苯地平	结构具有对称性; 用于各种高血压, 也可用于预防心绞痛
	尼群地平	4位碳原子具手性, 目前临床用外消旋体; 选择性作用于血管平滑肌
	非洛地平	选择性扩张小动脉, 不引起体位性低血压; 有促尿钠排泄和利尿作用
	苯磺酸氨氯地平	是氨氯地平分子中的1,4-二氢吡啶环的2位甲基被2-氨基乙氧基甲基取代, 3,5位羧酸酯的结构不同, 因而4位碳原子具手性, 可产生两个光学异构体, 临床用其外消旋体和左旋体
	尼莫地平	容易通过血-脑屏障而作用于脑血管及神经细胞, 选择性扩张脑血管保护局部缺血
芳烷基胺类	维拉帕米	呈弱碱性, 化学稳定性好; 含有手性碳原子, 右旋体比左旋体的作用强, 现用外消旋体; 代谢物是N-去甲维拉帕米, 保持了部分母体活性
苯硫氮草类	地尔硫草	两个手性碳原子, 四个立体异构体, 活性大小顺序为顺式D->顺式DL->顺式L->反式DL-体, 临床用顺式D-异构体, 即(2S,3S)-异构体; 经肝肠循环, 主要代谢途径为脱乙酰基、N-脱甲基和O-脱甲基化, 去乙酰基地尔硫草有活性

口服降血糖药——考题

历年考题举例

根据磺酰脲类降糖药的构效关系,当脲上取代基为甲基环己基时,甲基阻碍了环己烷上的羟基化反应,因此具有高效、长效降血糖作用。下列降糖药中,具有上述结构特征的是



【答案】E

【解析】直接根据提示找甲基环己基取代基,选出E。

知识点汇总:

分类	药物	考点
磺酰脲类胰岛素分泌促进剂	格列齐特	脲上取代基为八氢环戊烷并吡咯
	格列本脲	甲苯磺丁分子中脲上丁基被环己基取代, 苯环上甲基被苯甲酰胺乙基取代的衍生物
	格列吡嗪	为格列本脲分子中的苯甲酰胺基被吡嗪甲酰基取代的衍生物
	格列美脲	格列本脲分子中的苯甲酰胺基被二氢吡咯甲酰基替代的衍生物, 同时环己基被 4-甲基环己基取代物, 甲基处在环己烷的平伏键上, 占据主代谢位点, 因而长效; 高效、长效, 有独立于胰岛素的胰外作用, 可与胰岛素同时使用
非磺酰脲类胰岛素分泌促进剂 (“餐时血糖调节剂”)	瑞格列奈	瑞格列奈是氨甲酰甲基苯甲酸的衍生物, 含有一手性碳, 临床上使用活性强的 (+) - (S) - 异构体
	那格列奈	D-苯丙氨酸衍生物, 其降糖作用比前体 D-苯丙氨酸强; 手性药物, (-) - (R) - 体活性高
双胍类胰岛素增敏剂	二甲双胍	含双胍类结构, 强碱性; 属于胰岛素增敏剂; 肾功能减退时易引起高乳酸血症或乳酸性酸中毒
噻唑烷二酮类胰岛素增敏剂	吡格列酮	可看作苯丙酸的衍生物; 使胰岛素对受体靶组织的敏感性增加, 细胞核的过氧化酶-增殖体活化受体是起作用的靶点
α -葡萄糖苷酶抑制剂	阿卡波糖、伏格列波糖	该类药物可抑制葡萄糖苷酶的活性延缓葡萄糖的吸收; 对 1、2 型糖尿病均适用

调节骨代谢与形成药物——考题

历年考题举例

在体内经过两次羟基化产生活性物质的药物是

- A. 阿仑膦酸钠
- B. 利塞膦酸钠
- C. 维生素 D₃
- D. 阿法骨化醇
- E. 骨化三醇

【答案】C

【解析】维生素 D₃ 须在肝脏和肾脏两次羟基化, 先在肝脏转化为骨化二醇 C₂₅(OH)₂D₃, 然后再经肾脏代谢为骨化三醇 (1, 25(OH)₂D₃), 才具有活性。

知识点汇总:

分类	药物	考点
双膦酸盐类	依替膦酸二钠	具有双向作用, 小剂量抑制骨吸收, 大剂量抑制骨矿化和骨形成; 用于防治各种骨质疏松症
	阿仑膦酸钠	为氨基双膦酸盐, 其抗骨吸收作用较依替膦酸钠强, 没有骨矿化抑制作用
促进钙吸收药物	维生素 D ₃	可促进钙、磷的吸收, 促进骨代谢, 维持血钙、血磷的平衡; 维生素 D ₃ 须在肝脏和肾脏两次羟基化, 须先在肝脏转化为骨化二醇, 然后再经肾脏代谢为骨化三醇才具有活性
	阿法骨化醇 骨化三醇	老年人肾中 1α-羟化酶活性几乎消失, 无法将维生素 D ₃ 活化, 现已开发出阿法骨化醇和骨化三醇; 阿法骨化醇稳定性较好, 在体内进一步转化为骨化三醇

β-内酰胺类抗菌药物——考题

历年考题举例

第三代头孢菌素在 7-位的氨基侧链上以 2-氨基噻唑-α-甲氧亚氨基乙酰基居多, 对多数 β-内酰胺酶高度稳定, 属于第三代头孢菌素的药物是

- A.
- B.
- C.
- D.
- E.

【答案】E

【解析】五个药物分别为头孢氨苄、头孢克洛、头孢唑林、头孢匹罗和头孢曲松。

知识点汇总:

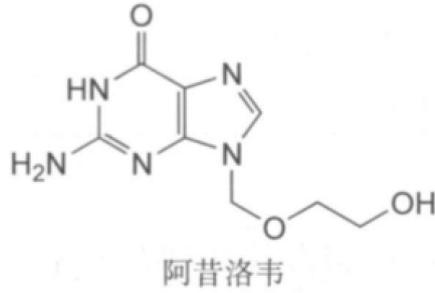
药物	考点
青霉素	含有四元的 β-内酰胺环与五元的四氢噻唑环骈合的结构, 具有较大的分子张力, 酸性或碱性条件均可使 β-内酰胺环发生裂解; 临床上常用青霉素钠或青霉素钾, 不耐酸 (不能口服)、

	<p>不耐酶、抗菌谱窄;</p> <p>含有 3 个手性碳原子;</p> <p>青霉噻唑基是青霉素类药物特有的结构, 因此存在交叉过敏反应</p>
氨苄西林	<p>青霉素 6 位酰胺侧链引入苯甘氨酸得到;</p> <p>具有抗革兰阴性菌活性</p>
阿莫西林	<p>氨苄西林结构中苯甘氨酸的苯环 4 位引入羟基得到, 口服生物利用度提高;</p> <p>氨苄西林和阿莫西林水溶液不稳定, 会生成聚合物</p>
哌拉西林	<p>在氨苄西林 6 位侧链的氨基上引入哌嗪酮酸基团得到哌拉西林</p>
头孢类构效	<p>基本母核为 β-内酰胺环与六元氢化噻嗪环骈合得到, 多数的头孢菌素类抗生素均具有耐酸的性质, 因而可以口服;</p> <p>β-内酰胺环氮原子上的孤对电子可以与氢化噻嗪环中的双键形成共轭, 使 β-内酰胺环趋于稳定;</p> <p>7 位的酰胺基是抗菌谱的决定性基团</p>
头孢氨苄 (第一代)	<p>侧链为苯甘氨酸</p>
头孢唑林 (第一代)	<p>C-3 位甲基上连有 5-甲基-2-巯基-1, 3, 4-噻二唑的杂环;</p> <p>在 C-7 位的氨基上连有四氮唑乙酰基</p>
头孢克洛 (第二代)	<p>头孢氨苄的 C-3 位甲基以卤素替代得到;</p> <p>可口服</p>
头孢呋辛 (第二代)	<p>C-7 位的氨基上连有顺式的 α-甲氧肟基呋喃乙酰基侧链, 使对 β-内酰胺酶高度稳定;</p> <p>分子中的羧基与乙酰氧基-1-醇成酯得到头孢呋辛酯 (前药), 脂溶性提高, 可以口服</p>
头孢哌酮	<p>在头孢羟氨苄的 C-7 位氨基上引入乙基哌嗪二酮侧链,</p>

(第三代)	抗菌活性增强, 对铜绿假单胞菌的作用较强; C-3 位甲基上引入硫代甲基四氮唑杂环
头孢曲松 (第三代)	C-3 位上引入酸性较强的 6-羟基-1,2,4-三嗪-5-酮, 使其具有非线性的剂量依赖性药动学(另 2 个非线性药动学药物是苯妥英钠和帕罗西汀); 钠盐的形式注射给药
头孢匹罗 (第四代)	含有正电荷的季铵基团, 穿透力强, 对 β -内酰胺酶稳定, 对大多数细菌有高度活性
氧青霉烷类 克拉维酸	由 β -内酰胺环和氢化异噁唑环骈合而成, 张力大, 因此易接受 β -内酰胺酶中亲核基团的进攻, 进行不可逆的烷化, 使 β -内酰胺酶彻底失活; 克拉维酸和阿莫西林组成的复方制剂, 可使阿莫西林增效
青霉烷砜类 舒巴坦	为广谱的、不可逆竞争性 β -内酰胺酶抑制剂; 舒他西林: 将氨苄西林与舒巴坦以 1:1 的形式以次甲基相连形成双酯结构的前体药物; 舒巴坦增强了头孢哌酮对 β -内酰胺酶的稳定性, 可制成复方制剂
碳青霉烯类 亚胺培南	对大多数 β -内酰胺酶稳定; 通常与肾肽酶抑制剂西司他丁合并使用, 保护亚胺培南在肾脏中不被肾肽酶破坏, 并减轻药物的肾毒性
单环 β -内酰胺类 氨曲南	N 原子上连有强吸电子磺酸基团, 更有利于 β -内酰胺环打开; C-2 位的 α 甲基可以增加对 β -内酰胺酶的稳定性

核苷类抗病毒药——考题

历年考题举例



的母核结构是

阿昔洛韦

- A. 嘧啶环
- B. 咪唑环
- C. 鸟嘌呤环
- D. 吡咯环
- E. 吡啶环

【答案】C

【解析】阿昔洛韦的母核结构是鸟嘌呤环。

知识点汇总:

分类	药物	考点
开环核苷类	阿昔洛韦	母核结构是鸟嘌呤环； 是链中止剂，使病毒的DNA合成中断
	更昔洛韦	侧链比阿昔洛韦多一个羟甲基，对巨细胞病毒（CMV）的作用比阿昔洛韦强
	喷昔洛韦	更昔洛韦侧链上的氧原子被碳原子取代得到，更昔洛韦的生物电子等排生物
	泛昔洛韦	喷昔洛韦的前体药物，口服后代谢产生喷昔洛韦，生物利用度高
非开环核苷类	齐多夫定	是脱氧胸腺嘧啶核苷的类似物，脱氧核糖部分的3位上有叠氨基取代； 抗逆转录酶病毒药物
	司他夫定	为脱氧胸腺嘧啶核苷的脱水产物，2', 3'位引入双键，对酸稳定，口服吸收良好
	拉米夫定	双脱氧硫代胞苷化合物，有两种异构体，都具有较强的抗HIV-1的作用，但其β-L-(-)的异构

		体对胞苷-脱氧胞苷脱氢酶有拮抗作用
恩曲他滨		拉米夫定胞嘧啶碱基的 5 位以氟取代得到

靶向抗肿瘤药——考题

历年考题举例

酪氨酸激酶抑制剂

- A. 伊马替尼
- B. 他莫昔芬
- C. 氨鲁米特
- D. 氟他胺
- E. 紫杉醇

【答案】A

【解析】属于酪氨酸激酶抑制剂的是 XX 替尼。

知识点汇总:

分类	药物	考点
酪氨酸激酶抑制剂	代表药	尼洛替尼、达沙替尼、吉非替尼、厄洛替尼、奥西替尼、舒尼替尼、索拉菲尼、阿帕替尼、克唑替尼、埃克替尼
	伊马替尼	体内外均有活性； 易产生耐药性
	吉非替尼	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

口服固体制剂的常用辅料——考题

历年考题举例

适宜作片剂崩解剂的辅料是

- A. 微晶纤维素
- B. 甘露醇
- C. 羧甲基淀粉钠
- D. 糊精
- E. 羟丙纤维素

【答案】C

【解析】微晶纤维素是填充剂和干黏合剂，甘露醇是填充剂，羧甲基淀粉钠是崩解剂，糊精是填充剂，羟丙纤维素是黏合剂。

知识点汇总:

用途	举例
稀释剂/填充剂	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)
崩解剂	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)
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
释放调节剂	骨架型释放调节剂 亲水性凝胶骨架材料: 羧甲基纤维素钠 (CMC-Na)、甲基纤维素 (MC)、羟丙基甲基纤维素 (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、乙基纤维素 (EC)、聚乙烯、无毒聚氯乙烯、乙烯-醋酸乙

		烯共聚物、硅橡胶等 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: 不溶性骨架材料 EC
	释放调节剂	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)、醋酸羟丙基甲基纤维素琥珀酸酯 (HPMCAS) 和羟丙基甲基纤维素酞酸酯 (HPMCP) 等
芳香剂		芳香油、香精
甜味剂		阿司帕坦、蔗糖

口服固体制剂——薄膜包衣材料——考题

历年考题举例

- A. 丙二醇
- B. 醋酸纤维素酞酸酯
- C. 醋酸纤维素
- D. 蔗糖
- E. 乙基纤维素

片剂的薄膜包衣材料通常由高分子成膜材料组成, 并可添加增塑剂、致孔剂(释放调节剂)、着色剂与遮光剂等。

1. 常用的致孔剂是

【答案】D

【解析】常见的致孔剂有蔗糖、氯化钠、表面活性剂和 PEG 等。

2. 常用的增塑剂是

【答案】A

【解析】增塑剂主要有水溶性增塑剂(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)。

知识点汇总:

分类	材料
----	----

包衣材料	胃溶型	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)
	肠溶型	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	乙基纤维素 (EC)、醋酸纤维素
其他	增塑剂	水溶性增塑剂 (丙二醇、甘油、聚乙二醇); 非水溶性增塑剂 (甘油三醋酸酯、乙酰化甘油酸酯、邻苯二甲酸酯)
	致孔剂 (释放调节剂)	蔗糖、氯化钠、表面活性剂和 PEG
	遮光剂	二氧化钛
	着色剂	柠檬黄、胭脂红

口服片剂的特点——考题

历年考题举例

关于片剂特点的说法, 错误的是

- A. 用药剂量相对准确、服用方便
- B. 易吸潮, 稳定性差
- C. 幼儿及昏迷患者不宜吞服
- D. 种类多, 运输携带方便, 可满足不同临床需要
- E. 易于机械化、自动化生产

【答案】B

【解析】片剂受外界空气、水分、光线等影响较小, 化学性质更稳定。

优点	①剂量准确; ②受外界环境影响较小, 化学性质更稳定; ③生产机械化、自动化程度高, 生产成本低、产量大, 售价较低;
----	-------------------------------------------------------------------

	④种类较多, 可满足不同临床医疗需要; ⑤运输、使用、携带方便
缺点	①幼儿及昏迷患者等不易吞服; ②制备工序较其他固体制剂多, 技术难度更高; ③某些含挥发性成分的片剂, 贮存期内含量会下降

片剂制备中的常见问题及原因——考题

历年考题举例

若使用过量, 可能导致片剂崩解迟缓的制剂辅料是

- A. 表面活性剂
- B. 络合剂
- C. 崩解剂
- D. 稀释剂
- E. 黏合剂

【答案】E

【解析】崩解剂系指促使片剂在胃肠液中迅速破裂成细小颗粒的辅料。表面活性剂可以改变生物膜通透性, 促进药物的吸收。黏合剂使用过量使片剂的结合力过强导致崩解迟缓。

知识点汇总:

常见问题	原因
裂片	物料中细粉太多; 物料的塑性较差, 结合力弱; 工艺因素
松片	黏性力差; 压缩压力不足
崩解迟缓	压片时压力过大; 增塑剂或黏合剂使片剂的结合力过强; 崩解剂性能较差
溶出超限	不崩解; 颗粒过硬; 药物溶解度差
含量不均匀	片重差异超限; 药物的混合不均匀; 可溶性成分的迁移

口服固体制剂重量/装量差异——考题

模拟考题举例

某胶囊剂的平均装量为 0.2g, 它的装量差异限度为

- A. $\pm 10\%$
- B. $\pm 8\%$
- C. $\pm 7.5\%$
- D. $\pm 5\%$
- E. $\pm 3\%$

【答案】 A

【解析】 胶囊剂的平均装量在 0.3g 以下时重量差异限度为 $\pm 10\%$, 平均装量在 0.3g 及以上时, 装量差异限度为 $\pm 7.5\%$ 。

知识点汇总:

剂型	平均片重/装量	差异限度
片剂 (重量)	$< 0.30\text{g}$	$\pm 7.5\%$
	$\geq 0.30\text{g}$	$\pm 5.0\%$
胶囊剂 (装量)	$< 0.30\text{g}$	$\pm 10\%$
	$\geq 0.30\text{g}$	$\pm 7.5\%$ (中药 $\pm 10\%$)

口服液体制剂的附加剂——考题**历年考题举例**

为提高难溶性药物的溶解度常需要使用潜溶剂, 不能与水形成潜溶剂的物质是

- A. 乙醇
- B. 丙乙醇
- C. 胆固醇
- D. 聚乙二醇
- E. 甘油

【答案】C

【解析】常与水形成潜溶剂的有乙醇、丙二醇、甘油和聚乙二醇等。

知识点汇总:

1. 促进药物溶解的附加剂

附加剂	举例
增溶剂	聚山梨酯类、聚氧乙烯脂肪酸酯类
助溶剂	苯甲酸、碘化钾、乙二胺、聚乙烯吡咯烷酮
潜溶剂	乙醇、丙二醇、甘油、聚乙二醇

2. 防腐剂

苯甲酸与苯甲酸钠、对羟基苯甲酸酯类、山梨酸与山梨酸钾、乙醇、甲酸、苯甲醇、甘油、三氯甲烷、桉油、桂皮油、薄荷油等。

3. 矫味剂

分类	具体品种
甜味剂	天然: 蔗糖、单糖浆、橙皮糖浆、桂皮糖浆 合成: 糖精钠, 阿司帕坦
芳香剂	天然: 柠檬、薄荷挥发油 人造: 苹果香精、香蕉香精
胶浆剂	阿拉伯胶、羧甲基纤维素钠、琼脂、明胶、甲基纤维素
泡腾剂	有机酸+碳酸氢钠

4. 着色剂

(1) 天然色素: 胡萝卜素、姜黄为黄色素; 叶绿酸铜钠盐为绿色素; 胭脂红、苏木为红色素; 焦糖为棕色素; 乌饭树叶、松叶兰为蓝色素; 氧化铁为棕红色的矿物性色素。

(2) 合成色素: 我国批准的合成色素有胭脂红、柠檬黄、苋菜红等。

表面活性剂的分类——考题

模拟考题举例

下列哪种物质属于阳离子型表面活性剂

- A. 十二烷基硫酸钠
- B. 司盘 20
- C. 泊洛沙姆
- D. 苯扎氯铵
- E. 蔗糖脂肪酸酯

【答案】 D

【解析】 此题目选项中 A 属于阴离子表面活性剂, D 属于阳离子表面活性剂, 其余选项属于非离子型表面活性剂。

知识点汇总:

分类	代表
阴离子表面活性剂	高级脂肪酸盐 (肥皂类)、硫酸化物、磺酸化物
阳离子表面活性剂	苯扎氯铵 (商品名为洁尔灭)、苯扎溴铵 (商品名为新洁尔灭)
两性离子表面活性剂	卵磷脂、氨基酸型、甜菜碱型
非离子表面活性剂	脂肪酸山梨坦类 (司盘)、聚山梨酯 (吐温)、蔗糖脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪酸酯 (卖泽)、聚氧乙烯脂肪醇醚类 (苯泽)、聚氧乙烯-聚氧丙烯共聚物 (泊洛沙姆、普朗尼克)

混悬剂的附加剂——考题

历年考题举例

- A. 着色剂
- B. 助悬剂
- C. 湿润剂
- D. pH 调节剂
- E. 溶剂

布洛芬口服混悬液的处方组成: 布洛芬、羟丙甲纤维素、山梨醇、甘油、枸橼酸和水。

1. 处方组成的枸橼酸是作为
2. 处方组成中的甘油是作为
3. 处方组成中的羟丙甲纤维素是作为

答案: D、C、B

解析: 布洛芬为主药, 甘油为润湿剂, 羟丙甲纤维素为助悬剂, 山梨醇为甜味剂, 枸橼酸为 pH 调节剂, 水为溶剂。

知识点汇总:

1. 润湿剂: 磷脂类、泊洛沙姆、聚山梨酯类、脂肪酸山梨坦类等。
2. 助悬剂

分类	代表
低分子助悬剂	甘油、糖浆
高分子助悬剂	天然: 果胶、琼脂、白芨胶、西黄蓍胶、海藻酸钠 合成或半合成: 纤维素类

3. 絮凝剂与反絮凝剂: 枸橼酸(氢)盐、酒石酸(氢)盐、磷酸盐和一些氯化物(如三氯化铝)等。

注射剂的特点——考题

历年考题举例

关于注射剂特点的说法, 错误的是

- A. 给药后起效迅速
- B. 给药剂量易于控制
- C. 适用于不宜口服用药的患者
- D. 给药方便, 特别适用于幼儿患者
- E. 安全性不及口服制剂

【答案】D

【解析】注射给药不方便, 注射时易引起疼痛。

知识点汇总:

优点	①起效迅速、剂量准确、作用可靠; ②可适用于不宜口服给药的患者和不宜口服的药物
----	--------------------------------------------

	③可发挥局部定位作用
缺点	①注射给药不方便, 注射时易引起疼痛 ②易发生交叉污染、安全性差; ③制造过程复杂, 生产费用大, 价格高

注射剂的附加剂——考题

历年考题举例

紫杉醇注射液中通常含有聚氧乙烷蓖麻油, 其作用是

- A. 助悬剂
- B. 稳定剂
- C. 等渗调节剂
- D. 增溶剂
- E. 金属螯合剂

【答案】D

【解析】聚氧乙烷蓖麻油在注射剂中作增溶剂。

知识点汇总:

注射剂的附加剂	举例
抗氧化剂	亚硫酸钠、硫代硫酸钠、亚硫酸氢钠、焦亚硫酸钠
金属螯合剂	乙二胺四乙酸二钠 (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、磷酸氢二钠-磷酸二氢钠、碳酸氢钠-碳酸钠
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	聚氧乙烷蓖麻油、吐温、PVP、聚乙二醇-40-蓖麻油、卵磷脂、普朗尼克、脱氧胆酸钠
抑菌剂	苯酚、甲酚、氯甲酚、苯甲醇、三氯叔丁醇、硝酸苯汞、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

热原的性质和除去方法——考题

历年考题举例

热原不具备的性质是

- A. 水溶性
- B. 耐热性
- C. 挥发性
- D. 可被活性炭吸附
- E. 可滤过性

【答案】C

【解析】热原的性质有水溶性、不挥发性、耐热性、过滤性、其他性质：热原能被强酸、强碱、强氧化剂如高锰酸钾、过氧化氢以及超声波破坏。热原在水溶液中带有电荷，也可被某些离子交换树脂所吸附。

知识点汇总：

性质	除去方法
水溶性	-
不挥发性	蒸馏法制备注射用水
耐热性	高温法/湿热法
过滤性	凝胶滤过/超滤/反渗透
可吸附性	活性炭/离子交换树脂吸附法
其他	酸碱法、超声破坏法

脂质体质量要求——考题

历年考题举例

在脂质体的质量要求中，表示脂质体物理稳定性的项目是

- A. 载药量
- B. 渗漏率
- C. 磷脂氧化指数
- D. 释放度
- E. 包封率

【答案】 B

【解析】 渗漏率表示脂质体物理稳定性。

知识点汇总:

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
物理稳定性	用渗漏率表示
化学稳定性	磷脂氧化指数、磷脂量的测定
防止氧化的措施	防止氧化的一般措施有冲入氮气, 添加抗氧化剂, 例如生育酚、金属离子络合剂等; 也可直接采用氢化饱和磷脂

微囊的囊材——考题

模拟考题举例

下列属于半合成高分子囊材的是

- A. 阿拉伯胶
- B. 聚糖
- C. 聚乙烯醇
- D. 聚氨基酸
- E. 醋酸纤维素酞酸酯

【答案】 E

【解析】 阿拉伯胶和聚糖属于天然高分子囊材, 而聚乙烯醇和聚氨基酸分别属于非生物降解和生物降解类的合成高分子囊材。

知识点汇总:

分类	具体品种
天然高分子囊材	明胶、阿拉伯胶、海藻酸盐、壳聚糖
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; 可在一定 pH 条件下溶解: 聚丙烯酸树脂、聚乙烯醇

皮肤给药制剂的特点——考题**模拟考题举例**

皮肤给药制剂的特点有

- A. 可直接作用于疾病部位, 发挥局部治疗作用
- B. 长时间维持恒定的血药浓度, 避免峰-谷现象, 降低药物的不良反应
- C. 避免肝脏的首关效应和胃肠因素的干扰
- D. 发现副作用时可随时中断给药
- E. 可通过给药面积调节给药剂量, 提高治疗剂量的准确性

【答案】 ABCDE

【解析】 皮肤给药制剂的特点:

- (1) 可直接作用于疾病部位, 发挥局部治疗作用。
- (2) 避免肝脏的首关效应和胃肠因素的干扰。
- (3) 避免药物对胃肠道的副作用。
- (4) 长时间维持恒定的血药浓度, 避免峰-谷现象, 降低药物的不良反应。

(5) 减少给药次数, 患者可自主用药, 特别适合于儿童、老人及不易口服给药的患者, 提高患者的用药依从性。

(6) 发现副作用时可随时中断给药。

(7) 可通过给药面积调节给药剂量, 提高治疗剂量的准确性。

乳膏剂的基质和附加剂——考题

模拟考题举例

不属于乳膏剂中水包油型乳化剂的是

- A. 钙皂
- B. 钠皂
- C. 十二烷基硫酸钠
- D. 聚山梨酯
- E. 三乙醇胺皂

【答案】 A

【解析】 钙皂属于油包水型乳化剂。

知识点汇总:

基质		举例
油相		硬脂酸、石蜡、蜂蜡、高级脂肪醇、凡士林、液状石蜡、植物油
水相		水
乳化剂	O/W型	钠皂、三乙醇胺皂类、脂肪醇硫酸(酯)钠类(十二烷基硫酸钠)和聚山梨酯
	W/O型	钙皂、羊毛脂、单甘油酯、脂肪醇

气雾剂的抛射剂和附加剂——考题

历年考题举例

在气雾剂中不需要使用的附加剂是

- A. 抛射剂
- B. 遮光剂
- C. 抗氧剂
- D. 润湿剂
- E. 潜溶剂

【答案】B

【解析】气雾剂中药物本身就是封装于遮光的耐压容器中,所以一般不需要再添
加遮光剂。

知识点汇总:

种类	举例
抛射剂	氢氟烷烃: HFA-134a (四氟乙烷) 和 HFA-227 (七氟丙烷); 碳氢化合物: 主要品种有丙烷、正丁烷和异丁烷; 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

眼用制剂的附加剂——考题

历年考题举例

为了减少对眼部的刺激性,需要调整滴眼剂的渗透压与泪液的渗透压相近、用作
滴眼剂渗透压调节剂的辅料是

- A. 羟苯乙酯
- B. 聚山梨酯-80
- C. 依地酸二钠
- D. 硼砂
- E. 羧甲基纤维素钠

【答案】D

【解析】眼用制剂的渗透压调节剂常用的有氯化钠、葡萄糖、硼酸、硼砂等。

知识点汇总:

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、抗氧化剂

栓剂——考题**历年考题举例**

用作栓剂水溶性基质的是

- A. 可可豆脂
- B. 甘油明胶
- C. 椰油酯
- D. 棕榈酸酯
- E. 混合脂肪酸酯

答案: B

解析: 栓剂的水溶性基质包括甘油明胶、聚乙二醇 (PEG) 和泊洛沙姆。其他选项为脂溶性基质。

知识点汇总:

栓剂特点	
局部作用栓剂	通常不吸收, 主要发挥润滑、抗菌消炎、局麻等作用, 例如用于通便的甘油栓和用于治疗阴道炎的蛇黄栓

全身作用栓剂	主要是直肠栓, 通过与直肠黏膜接触发挥药效, 如吗啡栓、苯巴比妥钠栓等
栓剂的基质	
油脂性基质	可可豆脂、椰油酯、棕榈酸酯、混合脂肪酸甘油酯
水溶性基质	甘油明胶、聚乙二醇、泊洛沙姆
栓剂的附加剂	
抗氧化剂	BHA、BHT、没食子酸酯
防腐剂	对羟基苯甲酸酯
硬化剂	白蜡、鲸蜡醇、硬脂酸、巴西棕榈蜡
增稠剂	氢化蓖麻油、单硬脂酸甘油酯、硬脂酸铝
吸收促进剂	非离子型表面活性剂、脂肪酸、脂肪醇和脂肪酸酯类、尿素、水杨酸钠、苯甲酸钠、羟甲基纤维素钠、环糊精类衍生物
表面活性剂	-

药动学参数定义、公式及临床意义——考题

历年考题举例

药物的半衰期越长则该药

- A. 起效越快
- B. 疗效越好
- C. 消除越快
- D. 消除越慢
- E. 代谢越快

【答案】D

【解析】半衰期越大, 药物从体内消除越慢

知识点汇总:

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	$k =$	速率常数越大, 表明

	速度与浓度的关系	$0.693/t_{1/2}$	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
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	$V = X/C$	分布容积大提示分布广或者组织摄取量多
清除率 (Cl)	单位时间从体内消除的含药血浆体积	$Cl = kV$	清除率越大, 药物体内消除的越快

药物的转运方式——考题

历年考题举例

维生素 B₂ 在小肠上段进行转运的方式

- A. 滤过
- B. 简单扩散
- C. 主动转运
- D. 易化扩散
- E. 膜动转运

【答案】C

【解析】维生素 B₂ 在小肠上段进行主动转运。

知识点汇总:

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	无	无	无	无	无
	简单扩散	顺	无	无	无	无	无
载体转运	主动转运	逆	是	有	有	有	有
	易化扩散	顺	无	有	有	有	-
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					

主动转运教材举例: 胆酸和维生素 B₂ 的主动转运只在小肠上段进行, 维生素 B₁₂ 在回肠末端部位吸收。一些生命必需物质 (如 K⁺、Na⁺、I⁺、单糖、氨基酸、水溶性维生素) 和有机酸、碱等弱电解质的离子型化合物等, 能通过主动转运吸收。

食物对药物吸收的影响——考题

模拟考题举例

食物对药物吸收的影响包括

- A. 使胃肠道内的体液减少
- B. 增加胃肠道内容物的黏度
- C. 延长胃排空时间
- D. 促进胆汁分泌
- E. 与药物产生物理或化学相互作用

【答案】ABCDE

【解析】食物影响药物吸收的因素有: ①食物要消耗胃肠内水分, 使胃肠道内的体液减少, 固体制剂的崩解、药物的溶出变慢; ②食物的存在增加胃肠道内容物的黏度, 妨碍药物向胃肠道壁的扩散, 使药物吸收变慢; ③延长胃排空时间; ④食物 (特别是脂肪) 促进胆汁分泌, 能增加一些难溶性药物的吸收量; ⑤食物改

变胃肠道 pH 影响弱酸弱碱性药物吸收; ⑥食物与药物产生物理或化学相互作用, 影响吸收。

知识点汇总:

食物影响药物吸收的因素有: ①食物要消耗胃肠内水分, 使胃肠道内的体液减少, 固体制剂的崩解、药物的溶出变慢; ②食物的存在增加胃肠道内容物的黏度, 妨碍药物向胃肠道壁的扩散, 使药物吸收变慢; ③延长胃排空时间; ④食物(特别是脂肪)促进胆汁分泌, 能增加一些难溶性药物的吸收量; ⑤食物改变胃肠道 pH, 影响弱酸弱碱性药物吸收; ⑥食物与药物产生物理或化学相互作用, 影响吸收。

影响结果	相关药物
增加吸收量	维生素 C、头孢呋辛、维生素 B2、异维 A 酸、对氯苯氧基异丁酸、普萘洛尔、更昔洛韦、地丙苯酮、三哇仑、咪达唑仑、特非拉定
降低吸收速率	非诺洛芬、吲哚美辛
降低吸收速率与吸收量	卡托普利、乙醇、齐多夫定、利福平、普伐他汀、林可霉素、异烟肼、溴苄胺托西酸盐、卡托普利、头孢菌素、红霉素
降低吸收速率, 不影响吸收量	阿司匹林、卡普脲、头孢拉定、克林霉素、氯巴占、地高辛、甲基地高辛、奎尼丁、西咪替丁、格列苯脲、氧氟沙星、环丙沙星
降低吸收速率, 增加吸收量	呋喃妥因、酮康唑
不影响吸收速率, 增加吸收量	芬维 A 胺
无影响	保泰松、甲基多巴、磺胺异二甲嘧啶、丙基硫胺嘧啶

常见的药物代谢酶诱导剂——考题

模拟考题举例

以下药物相互作用叙述错误的是

- A. 乙醇可降低双香豆素类作用
- B. 巴比妥类药物可增加氯丙嗪的血药浓度
- C. 氯醛比林可降低华法林的血药浓度
- D. 苯妥英可促进口服避孕药代谢, 导致避孕失败
- E. 利福平可降低甲苯磺丁脲的血药浓度

【答案】B

【解析】B 应为巴比妥类药物为肝药酶诱导剂, 可降低氯丙嗪的血药浓度。

知识点汇总:

诱导剂	受影响的药物
乙醇	双香豆素类
巴比妥类	氯丙嗪、皮质类固醇、双香豆素、多西环素、口服避孕药、苯妥英、巴比妥类
利福平	双香豆素、甲苯磺丁脲、口服避孕药
氯醛比林	华法林
格鲁米特	双香豆素类
灰黄霉素	华法林
苯妥英	皮质类固醇、双香豆素类、口服避孕药、甲苯磺丁脲
保泰松	皮质类固醇、双香豆素类、氨基比林
甲苯海拉明	氯丙嗪

常见的药物代谢酶抑制剂——考题

历年考题举例

以下药物属于肝药酶抑制剂的是

- A. 双香豆素类

- B. 甲苯磺丁脲
- C. 氯霉素
- D. 5-氨基水杨酸
- E. 利福平

【答案】 ABCD

【解析】 利福平属于肝药酶诱导剂。

知识点汇总:

抑制剂	受影响的药物
双香豆素类	苯妥英, 甲苯磺丁脲
华法林	甲苯磺丁脲
磺胺苯吡唑	甲苯磺丁脲
甲苯磺丁脲	华法林
羟布宗	双香豆素
别嘌醇	6-巯基嘌呤
西咪替丁	环孢素
氯霉素	巴比妥类、苯妥英、甲苯磺丁脲、双香豆素
地昔帕明	苯丙胺
去氧甲睾酮	羟布宗
5-氨基水杨酸	异烟肼
单胺氧化酶抑制剂	酪胺、巴比妥类

药物的不良反应——考题

历年考题举例

药物不良反应中的后遗效应是指

- A. 药物在治疗剂量时, 与治疗目的无关的药理作用所引起的反应
- B. 因药物剂量过大或用药时间过长而对机体产生有害的作用
- C. 停药后血药水平降低到最低有效浓度以下后遗留的效应
- D. 反复应用某种药物后, 如果停药可出现一系列综合征
- E. 由药物引起的一类遗传学性异常反应

【答案】C

【解析】后遗效应指停药后血药浓度降至阈浓度以下所残存的药理效应。

知识点汇总:

不良反应	概念及举例
副作用	概念: 在药物按正常用法用量使用时, 出现的与治疗目的无关的不适反应。
	举例: 阿托品用于解除胃肠痉挛时, 会引起口干、心悸、便秘等副作用; 用于麻醉前给药时, 其抑制腺体分泌作用可减少呼吸道分泌, 可以防止分泌物阻塞呼吸道及吸入性肺炎的发生, 从而成为治疗作用。
毒性反应	概念: 在剂量过大或药物在体内蓄积过多时发生的危害性反应。
后遗效应	概念: 停药后, 血药浓度已降至最小有效浓度以下时残存的药理效应。
	举例: 服用巴比妥类催眠药后, 次晨出现的乏力、困倦等“宿醉”现象; 长期应用肾上腺皮质激素, 可引起肾上腺皮质萎缩, 一旦停药, 可出现肾上腺皮质功能低下, 数月难以恢复。
停药反应	概念: 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。
	举例: 长期应用β受体阻断药普萘洛尔治疗高血压、心绞痛等, 可使β受体密度上调而对内源性去甲肾上腺素能神经递质的敏感性增高, 如突然停药, 则会出现血压升高或心绞痛发作; 长期服用中枢性降压药可乐定治疗高血压, 突然停药, 次日血压明显升高
继发反应	概念: 是继发于药物治疗作用之后的不良反应, 是治疗剂量下治疗作用本身带来的间接结果
	举例: 长期应用广谱抗生素, 使敏感细菌被杀灭, 而非敏感

	菌(如厌氧菌、真菌)大量繁殖,造成二重感染
变态反应	概念: 机体受药物刺激所发生的异常免疫反应,引起机体生理功能障碍或组织损伤,也称过敏反应
特异质反应	概念: 少数特异体质患者对某些药物反应异常敏感。这种反应不是免疫反应,故不需预先的敏化过程 举例: 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
依赖性	概念: 长期应用某种药物后所造成的一种强迫要求连续或定期使用该药的行为或其他反应。“爽”或“避免不爽”

药理学基本概念——考题

历年考题举例

A、B、C三种药物的LD₅₀分别为20、40、60mg/kg; ED₅₀分别为10、10、20mg/kg,三种药物的安全性大小顺序应为

- A. A>C>B
- B. B>C>A
- C. C>B>A
- D. A>B>C
- E. C>A>B

【答案】B

【解析】治疗指数(TI)=LD₅₀/ED₅₀。表示药物的安全性。

知识点汇总:

斜率	斜率大的药物,药量微小的变化就可以引起效应的明显改变,反之亦然。
最小有效量(阈剂量)	引起药理效应的最小药量是阈剂量,引起药理效应的最低药物浓度称为阈浓度。
最大效应(效	在一定范围内,增加药物剂量或浓度,所能达到的最大效

能)	应是效能。
效价强度	引起等效反应(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 ₅₀)	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。表示药物的药效。数值越大, 表明药效越差; 数值越小, 表明药效越强。
半数致死量 (LD ₅₀)	引起 50%试验动物死亡的量。表示药物的毒性。数值越大, 药物的毒性越小; 数值越小, 毒性越大。
治疗指数 (TI) LD ₅₀ /ED ₅₀	表示药物的安全性, 数值越大越安全。
安全范围	ED ₉₅ 和 LD ₅ 之间距离, 范围越大越安全。

受体的特性——考题

历年考题举例

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

【答案】E

【解析】受体特性包括: 饱和性、特异性、可逆性、灵敏性、多样性。

知识点汇总:

特性	概念
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
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

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。共价键结合是不可逆的, 所以药物与受体的结合形式, 不包括共价键
灵敏性	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
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