

考点 1: 关于药物动力学参数表观分布容积(V)的说法正确的是: 表观分布容积是体内药量与血药浓度间的比例常数, 单位通常是 L 或 L/kg

3. 表观分布容积——V
含义: 体内药量与血药浓度间相互关系的一个比例常数
设想为体内的药物按血浆浓度分布时, 所需要体液的理论容积, 表示这个药物的分布特性。
单位: L或L/kg
计算: $V=X/C$

20mg
0.2mg/L/100L

考点 2: 关于紫杉醇的说法错误的是: 紫杉醇的水溶性大其注射剂通常加入聚氧乙烯麻油等表面活性剂

紫杉醇由于水溶性小, 其注射剂通常加入表面活性剂, 例如, 聚环氧化蓖麻油等助溶, 常会引起血管舒张、血压降低及过敏反应等副作用。紫杉醇临床为广谱抗肿瘤药物, 主要用于治疗卵巢癌、乳腺癌及非小细胞肺癌, 为治疗难治性卵巢癌、肺癌的有效药物之一。

考点 3: 器官移植患者应用免疫抑制剂环孢素, 同时服用利福平会使机体出现排斥反应的原因是: 利福平的药酶诱导作用加快环孢素的代谢

正保医学教育网
www.med66.com

(三) 影响药物的代谢

1. 酶的诱导: 酶诱导使受影响药物的作用减弱或缩短。

酶诱导剂的记忆: 两坨米黄泥水, 家里有骡同马。

利福平、卡马西平、苯巴比妥、苯妥英钠、扑米酮、螺内酯、灰黄霉素、水合氯醛、尼可刹米、格鲁米特、甲丙氨酯。

注解: 两坨指苯妥英钠、苯巴比妥, 米指格鲁米特, 黄指黄霉素, 泥指尼可刹米, 水指水合氯醛; 家指甲丙氨酯, 里指利福平, 有指诱导剂, 骡指螺内酯, 同指扑米酮, 马指卡马西平。

重点药物: 两妥一利。



考点 4: 关于克拉维酸的说法错误的是: 克拉维酸可单独用于治疗耐阿莫西林细菌所引起的感染

第12讲 抗菌药物(一)

正保医学教育网
www.med66.com

- 克拉维酸是一种“自杀性”的酶抑制剂。
- 临床使用克拉维酸和阿莫西林组成的复方制剂, 可使阿莫西林增效130倍, 用于治疗耐阿莫西林细菌所引起的感染。
- 克拉维酸也可与其他 β -内酰胺类抗生素联合使用, 可使头孢菌素类增效2~8倍。



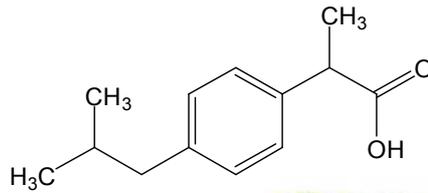
考点 5: 在水溶液中不稳定, 临用时需现配的药物是: 青霉素钠

第12讲 抗菌药物(一)

正保医学教育网
www.med66.com

- 青霉素通常指青霉素G(苄基青霉素), 是第一个在临床使用的抗生素。
- 临床使用其钠或钾盐。
- 青霉素钠盐的刺激性较钾盐小。
- 由于钠盐的水溶液在室温下不稳定、易分解, 因此临床上使用其粉针剂。





考点 6: 布洛芬的药物结构为 **布洛芬**。布洛芬 S 型异构体的活性比 R 型异构体强 28 倍, 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

第06讲 解热、镇痛、抗炎药及抗痛风药

正保医学教育网
www.med66.com

但, **布洛芬**有所不同。尽管布洛芬 (S) - 异构体的活性比 (R) - 异构体强28倍, 但通常以外消旋体上市, 因为布洛芬在体内会发生手性异构体间转化, 无效的 (R) - 异构体可转化为有效的 (S) - 异构体。且在消化道滞留时间越长, 其S/R就越大。

R → S

考点 7: 胃排空

速率加快时, 药效减弱的药物是: **硫糖铝胶囊**

第02讲 药物的胃肠道吸收 (一)

正保医学教育网
www.med66.com

②胃排空快对药物吸收的影响

A——吸收减少的/疗效下降的

胃部吸收**水杨酸**, 跑的太快吸收少

铝镁**硫糖铝**, 作用在胃减疗效

溶解难溶**螺内酯**, 维B特定部位吸

水杨酸盐

氢氧化铝凝胶、三硅酸镁、**胃蛋白酶**、**硫糖铝**

螺内酯、氢氯噻嗪

考点 8: 关于药物动力学中房室模型的说法正确的是: 单室模型是指进入体循环的药物能很快在血液与各部位之间达到动态平衡

三、房室模型——假设的结构

单室模型：当药物进入体循环后，能迅速向体内各组织器官分布，并很快在血液与各组织脏器之间达到动态平衡——**机体各组织药物水平能随血浆药物浓度的变化平行地发生变化。**

双室模型：中央室包括血液及血流供应充沛的组织如心、肝、肾、肺、内分泌腺及细胞外液。**药物进入体循环后，能很快地分布在整个中央室，血液与这些组织中的药物浓度可迅速达到平衡。**周边室代表血流供应较少的组织，如肌肉、皮肤、脂肪组织，**药物的分布比较缓慢。**

考点 9: 关于经皮给

药制剂特点的说法错误的是：经皮给药制剂起效快特别适宜要求起效快的药物

第04讲 缓释、控释制剂 (二)

七、经皮给药制剂——TDDS、TTS

1.特点

优点	缺点
①避免首过效应	①起效慢
②血药浓度恒定、治疗效果↑	②大面积给药，有刺激性、过敏性
③用药次数↓，作用时间↑，顺应性↑	③存在皮肤代谢、储库作用
④患者可自主用药，适于老幼、不宜口服患者	

考点 10: 根据药

物不良反应的性质分类药物产生毒性作用的原因是：给药剂量过大

第02讲 药品不良反应的定义和分类(二)

正保医学教育网
www.med66.com

(2) 毒性作用

在药物剂量过大或体内蓄积过多时发生的危害机体的反应, 较为严重。

包括:

药理学毒性, 如巴比妥类药物过量;

病理学毒性, 如对乙酰氨基酚引起的肝肺损害;

基因毒性, 如氮芥细胞毒性作用引起的



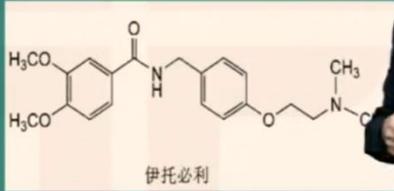
教育网
d66.com

考点 11: 具有阻

断多巴胺 D_2 受体活性和抑制乙酰胆碱酶活性且无致心律失常不良反应的促胃肠动力药物是: 伊托必利

正保医学教育网
www.med66.com

伊托必利: 阻断多巴胺 D_2 受体活性和抑制乙酰胆碱酯酶活性, 中枢神经系统分布少, 无致室性心律失常作用及其他严重药物不良反应和实验室异常, 在相当于30倍西沙必利剂量下不导致Q-T间期延长和室性心律失常。

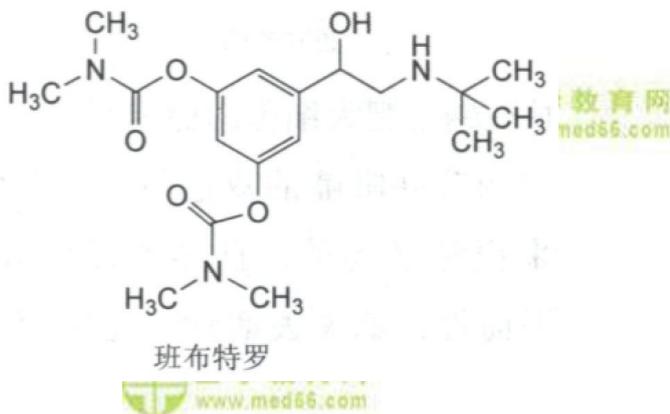


伊托必利



教育网
66.com

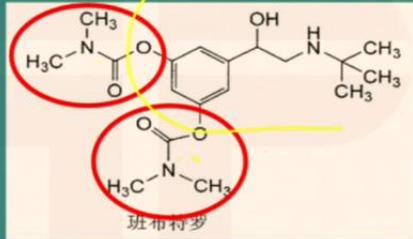
考点 12: 依据药物的化学结构判断属于前药的 β 受体激动剂是



医学教育网
www.med66.com

医学教育网
www.med66.com

班布特罗: 将特布他林苯环上两个酚羟基酯化制成的双二甲氨基甲酸酯前药, 吸收后在体内经肝脏代谢成为有活性的特布他林而发挥作用。



教育网
d66.com

考点 13: 关于药

物效价强度的说法错误的是: 药物效价强度用于药物内在活性强弱的比较

(三) 最大效应 (E_{max}) 或效能

在一定范围内, 增加药物剂量或浓度, 其效应强度随之增加, 但效应增至最大时, 继续增加剂量或浓度, 效应不能再上升, 此效应为一极限, 称最大效应或效能。

效能反映药物的内在活性。

联想到人的身高, 到了一定年龄, 再也不能长个儿了。效能就是S形曲线的最高点。比效能, 就是比S形曲线的个头。



教育网
d66.com

(四) 效价强度

用于作用性质相同的药物之间的等效剂量或浓度的比较, 指能引起等效反应 (一般采用50%效应量) 的相对剂量或浓度, 值越小则强度越大。

联想到百米跑, 同样的距离, 用时最短的就是最能跑的选手, 所以, 数值越小, 就越能跑, 效价强度就越大。

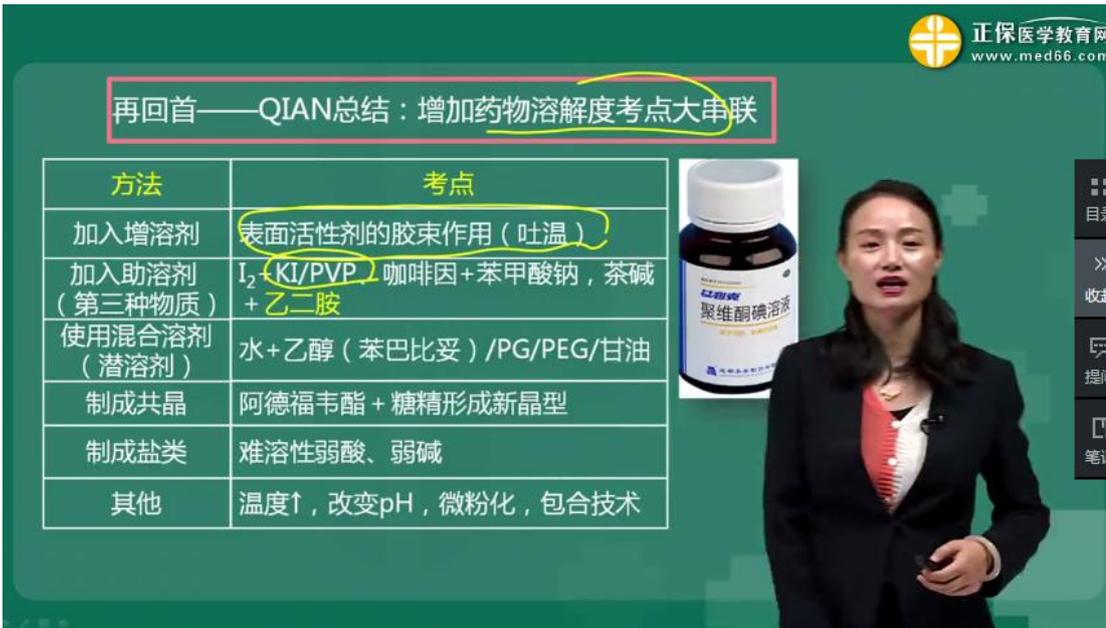


教育网
d66.com

考点 14: 增加药物溶解度的方法不包括: 加入助悬剂

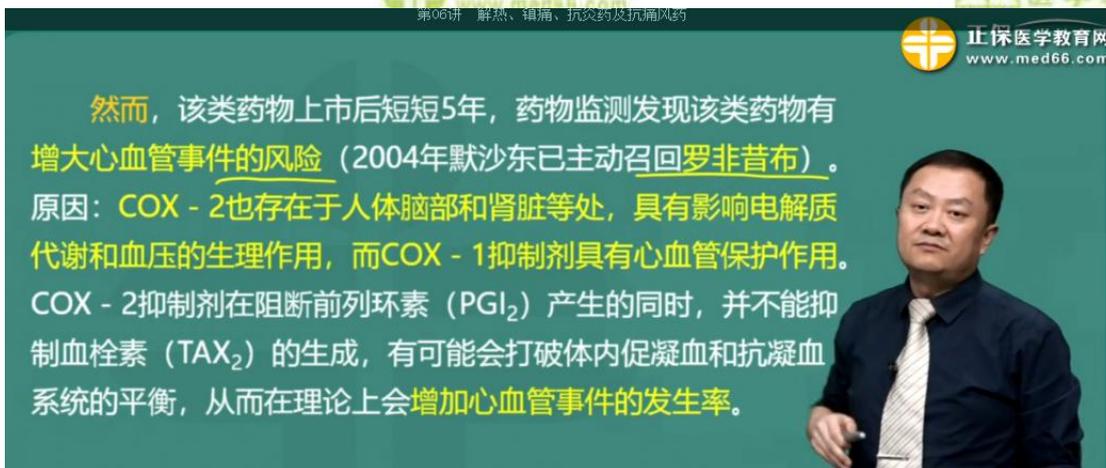
再回首——QIAN总结：增加药物溶解度考点大串联

方法	考点
加入增溶剂	表面活性剂的胶束作用(吐温)
加入助溶剂 (第三种物质)	I ₂ +KI/PVP 咖啡因+苯甲酸钠, 茶碱 +乙二胺
使用混合溶剂 (潜溶剂)	水+乙醇(苯巴比妥)/PG/PEG/甘油
制成共晶	阿德福韦酯+糖精形成新晶型
制成盐类	难溶性弱酸、弱碱
其他	温度↑, 改变pH, 微粉化, 包合技术



考点 15: 选择性 COX-2 抑制剂罗非昔产生心血管不反应的原因是: 阻断前列环素(PGI₂)的生成但不能抑制血栓素(TXA₂)的生成

然而, 该类药物上市后短短5年, 药物监测发现该类药物有增大心血管事件的风险(2004年默沙东已主动召回罗非昔布)。原因: COX-2也存在于人体脑部和肾脏等处, 具有影响电解质代谢和血压的生理作用, 而COX-1抑制剂具有心血管保护作用。COX-2抑制剂在阻断前列环素(PGI₂)产生的同时, 并不能抑制血栓素(TAX₂)的生成, 有可能会打破体内促凝血和抗凝血系统的平衡, 从而在理论上会增加心血管事件的发生率。

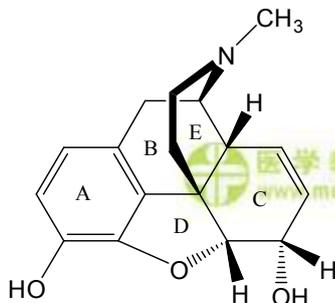


考点 16: ACE 抑制剂含有锌离子作用的极性基团, 为改善药物在体内的吸收将其大部分制成前药, 但也有非前药型的 ACE 抑制剂。属于非前药型的 ACE 抑制剂是



赖诺普利和卡托普利也是当前唯一使用的两个非前药的ACE抑制剂。主要用于治疗高血压, 可单独应用或与其他降压药如利尿药合用; 也可治疗心力衰竭, 可单独应用或与强心药、利尿药合用。

卡托普利

考点 17: 吗啡

吗啡

可以发生的 II 相代谢反应是: 葡萄糖醛酸结合反应

二、药物结构与第 II 相生物转化的规律: **结合** 四大两小

1. 与葡萄糖醛酸的结合反应: **O-、N-、S-和C-**四种类型。如**吗啡**3-酚羟基与6-仲醇羟基, 与葡萄糖醛酸结合。如新生用**氯霉素**, 不能发生葡萄糖醛酸结合代谢, 导致“灰婴综合征”。
2. 与硫酸的结合反应: **羟基、氨基、羟氨基**。如沙丁胺醇的酚羟基与硫酸结合。
3. 与氨基酸的结合反应: **羧酸类药物和代谢物的结合**。如**甘氨酸**最常见。如**苯甲酸**和**水杨酸**与甘氨酸结合。
4. 与谷胱甘肽的结合反应: 如抗肿瘤药物**白消安**。



考点 18: 部分激动剂的特点是: 与受体亲和力高, 但内在活性较弱

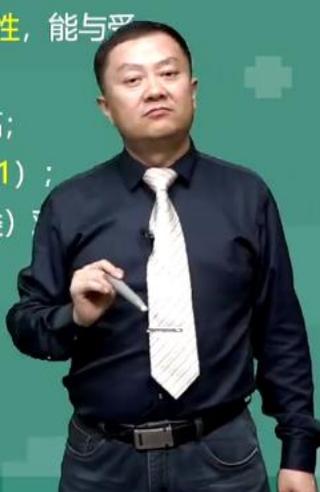
2. 药物分类

(1) **激动药**: 与受体既有亲和力, 又有内在活性, 能与受体结合, 并激活受体而产生效应。

完全激动药: 亲和力和内在活性 ($\alpha=1$) 都很高;

部分激动药: 亲和力高, 内在活性不强 ($0 < \alpha < 1$);

反向 (负性) 激动药: 有些药物 (如苯二氮草类) 与受体的受体亲和力大于活化态。



考点 19: 对肝微粒体酶活性具有抑制作用的药物是: 异烟肼

2. 酶的抑制: 酶被抑制的结果使另一药物的代谢减慢, 因而加强或延长其作用。

酶抑制剂的记忆: **西安两三缕硝烟, 派兵在红梅倚坐。**

胺碘酮、丙米嗪、哌醋甲酯、甲硝唑、红霉素、咪康唑、丙嗪、氟霉素、西咪替丁、异烟肼 三环类抗抑郁药。

注解: 西安城墙上看到两三缕硝烟, 派士兵在城墙的烽火台下倚坐。西指西咪替丁, 安指胺碘酮, 两缕指氟霉素和氟哌啶醇, 三指三环类抗抑郁药, 硝指甲硝唑, 烟指异烟肼; 派指派兵指丙米嗪, 在指吩噻嗪类药物, 红梅指红霉素, 倚指咪康唑指咪康唑。重点药物: **两氟一咪异烟肼。**



考点 20: 热源不具备的性质是: 挥发性

QIAN总结: 热原性质及去除方法

热原基本性质	热原去除方法总结QIAN
耐热性	高温法180 2 250 30
水溶性、过滤性	凝胶滤过法、超滤法、反渗透法
被吸附性	吸附法、离子交换法
不挥发性	蒸馏水器上附有隔沫装置
酸碱、氧化破坏	酸碱法: 重铬酸钾硫酸清洁液、稀NaOH



考点 21: 关于注射剂特点的说法, 错误的是: 给药方便, 特别适用于幼儿患者

2. 注射剂的特点

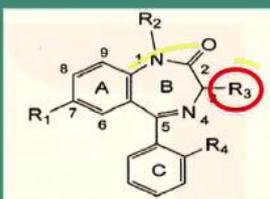
优点	缺点
①药效迅速、剂量准确、作用可靠	①给药不方便, 疼痛
②适用 <u>不宜口服给药的患者/药物</u>	②易发生交叉污染、安全性不及口服制剂
③可局部位位	③生产不便, 成本价格高



考点 22: 地西洋与奥沙西洋的化学结构比较, 奥沙西洋的极性明显大于地西洋的原因是: 奥沙西洋的分子中存在羟基

(2) B环: 地西洋体内代谢时在3位上引入羟基可以增加其分子的极性, 易与葡萄糖醛酸结合排出体外。

3位羟基衍生物可保持原有药物的活性, 临床上较原药物更加安全, 如奥沙西洋(地西洋的代谢产物)。



考点 23: 醋酸可的松滴眼剂(混悬液)的处方组成包括醋酸可的松(微晶)、聚山梨酯 80、硝酸苯汞、硼酸、羧甲基纤维素、蒸馏水等

处方中作为渗透压调节剂是: 硼酸

处方中作为助悬剂的是: 羧甲基纤维素

处方中作为抑菌剂的是: 硝酸苯汞



第05讲 灭菌制剂(五)

正保医学教育网
www.med66.com

4. 举例

① 醋酸可的松滴眼液 (混悬液)

醋酸可的松 (微晶) (主药)	5.0g
聚山梨酯-80 (表面活性剂)	0.8g
硝酸苯汞 (抑菌剂)	0.02g
硼酸 (pH/等渗调节剂)	20.0g
羧甲基纤维素钠 (助悬剂)	2.0g

Handwritten notes: 混悬液, PP, PEG, PVA

考点 24: 脂溶性药物依靠药物分子在膜两侧的浓度差, 从膜的高浓度一侧向低浓度一侧转运药物的方式是: 简单扩散

借助载体帮助, 消耗能量, 从膜的低浓度一侧向高浓度一侧转运药物的方式是: 主动转运

借助载体帮助, 不消耗能量, 从膜的高浓度一侧向低浓度一侧转运药物的方式是: 易化扩散

第01讲 药物体内过程基础知识

正保医学教育网
www.med66.com

③ 药物的跨膜转运方式 [2015-2018] 顺→高低

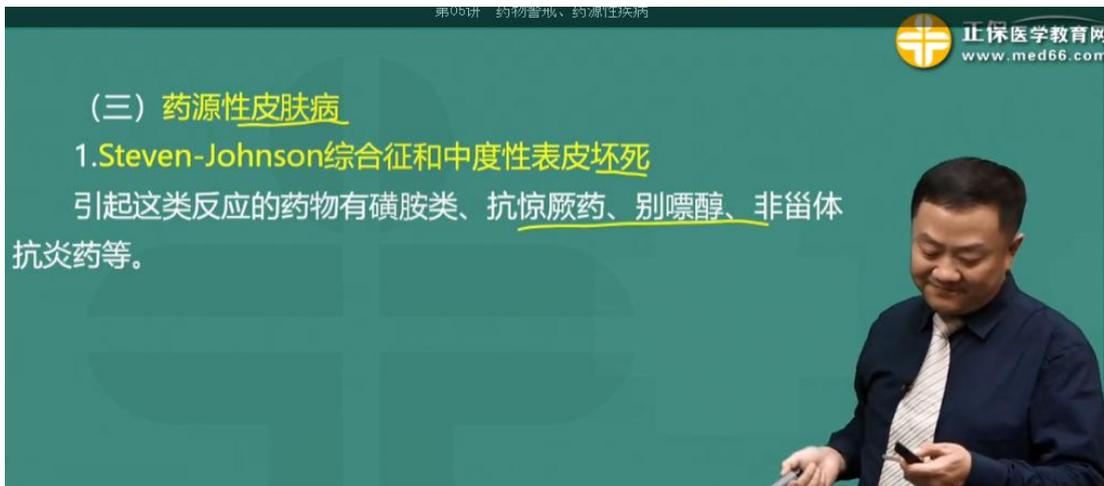
转运方式	借助载体	逆浓度差	消耗能量	饱和、竞争抑制	部位特异性
被动转运: 滤过、简单扩散	-	顺	-	-	-
载体转运	主动转运	+	+	+	+
	易化扩散	+	-	+	+
膜动转运: 胞饮、吞噬、胞吐					+

考点 25: 可引起急性肾小管坏死的药物是: 两性霉素



考点 26: 可引起

中毒性表皮坏死的药物是: 磺胺甲噁唑



考点 27: 按药品不良反应新分类方法, 不能根据药理学作用预测, 减少剂量不会改善症状的不良反应属于: H 类反应(过敏反应)

按药品不良反应新分类方法, 取决于药物的化学性质, 严重程度与药物的浓度而不是剂量有关的不良反应属于: C 类反应(化学反应)

第02讲 药品不良反应的正文和分类 (二)

3.药品不良反应新的分类

D 递药

A类: 药物对人体呈剂量相关的反应, 可据药物或赋形剂的药理学和作用模式来预知, 最为常见 (传统分类A类)。

B类: 促进微生物Bugs生长引起;

F类: 家族Family遗传缺陷引起; **伐木累**

C类: 药物或赋形剂的化学Chemical性质引起;

D类: (特定给药Delivery方式)、**E类:** (撤药Exit反应)、

G类: (致癌、致畸等基因Gene毒性反应)、**H类:** (过敏Hypersensitivity反应)、**U类:** (未分类Unclassified反应)。

考点 28: 苯扎溴铵在外用液体制剂中作为: 防腐剂

第06讲 液体制剂 (一)

2.液体制剂常用的附加剂

潜溶剂	混合溶剂→水 + 乙醇/丙二醇/甘油/PEG
助溶剂	第三种物质→KI (助溶剂) + I ₂ →KI ₃
增溶剂	表面活性剂→聚山梨酯 (吐温) HLB15-18

考点 29: 碘化钾

在碘酊中作为: 助溶剂

为了增加甲硝唑溶解度, 使用水-乙醇混合溶剂作为: 潜溶剂

重要的防腐剂

防腐剂	考点
苯甲酸/苯甲酸钠	pH4
山梨酸/山梨酸钾	pH4
对羟基苯甲酸酯类 (尼泊金) 2, 3, 7	内服, 甲、乙、丙、丁, 含聚山梨 酯不宜选用
苯扎溴铵(新洁尔灭)	外用
其他	20%乙醇、30%甘油、苯酚、甲酸、 苯甲醇、三氯叔丁醇、三氯甲烷、 硝酸苯汞、硫柳汞、薄荷油、桉油

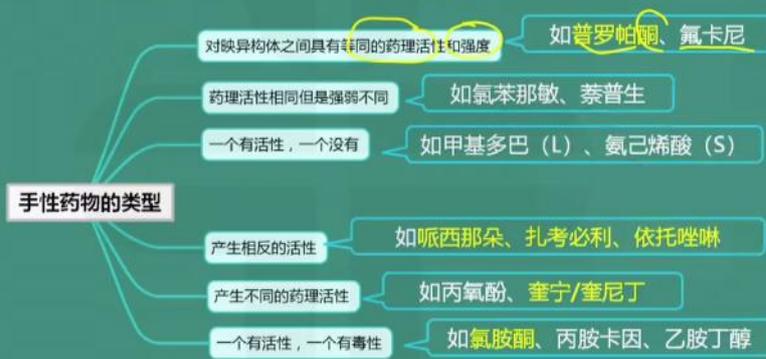


考点 30: 对映异构体之间具有相同的药理作用, 但强弱不同的手性药物是: 氯苯那敏

对映异构体之间具有相同的药理作用和强度的手性药物是: 普罗帕酮

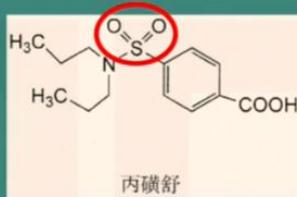
对映异构体中一个有活性, 一个无活性的手性药物是: 氨己烯酸

手性药物对映体间药物活性的差异



考点 31: 抑制尿酸盐在近曲小管的主动重吸收, 增加尿酸的排泄而降低血中尿酸盐的浓度, 与水杨酸盐和阿司匹林同用时, 可抑制本品的排尿酸作用的药物是: 丙磺舒

丙磺舒: 抑制尿酸盐在近曲小管的主动重吸收, 增加尿酸的排泄而降低血中尿酸盐的浓度, 可缓解或防止尿酸盐结晶的生成, 减少关节的损伤, 亦可促进已形成的尿酸盐的溶解。无抗炎镇痛作用, 用于慢性痛风的治疗。

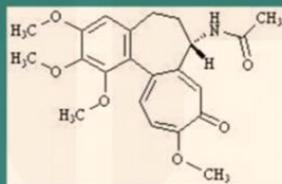


考点 32: 从百合

科植物丽江山慈菇的球茎中得到的种生物碱, 能抑制细胞有丝分裂, 有一定的抗肿瘤作用, 可以控制尿酸盐对关节造成的炎症, 可在痛风急症时使用的药物是: 秋水仙碱

三、抗痛风药

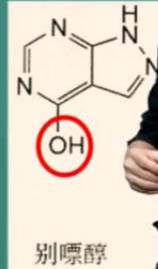
秋水仙碱: 天然产物, 丽江山慈菇球茎中的一种生物碱。遇光变深色, 避光密闭保存。有一定的抗肿瘤作用, 并可以控制尿酸盐对关节造成的炎症, 可在痛风急症时使用。长期用药产生骨髓抑制, 胃肠道反应是严重中毒的前兆, 症状出现应立即停药。不良反应与剂量明显相关, 口服安全。



考点 33: 通过抑

制黄嘌呤氧化酶而抑制尿酸的生成, 在肝脏中可代谢为有活性的别黄嘌呤的药物是: 别嘌醇

别嘌醇: 通过抑制黄嘌呤氧化酶抑制尿酸生成。经肝脏代谢为有活性的别黄嘌呤, 别黄嘌呤对黄嘌呤氧化酶也有抑制作用, 半衰期比别嘌醇更长。该活性代谢物所起的作用是别嘌醇作用的一个重要组成部分, 能够使尿酸的生物合成减少, 降低血中尿酸的浓度, 减少尿酸盐在骨、关节及肾脏的沉着。



考点 34: 在分子中引入可增强与受体的结合力, 增加水溶性, 改变生物活性的基团是: 羟基
含有孤对电子、在体内可氧化成亚砷或砷的基团是: 硫醚
可影响分子间的电荷分布、脂溶性及药物作用时间的吸电子基团是: 卤素

药物分子结构改变对药物脂水分配系数的影响比较大,

- 引入极性较大的羟基 (-OH, 脱胎于H₂O) 时, 药物的水溶性加大, 脂水分配系数下降5~150倍。
- 引入吸电子的卤素原子 (F, Cl, Br, I), 亲脂性增大, 脂水分配系数增加;
- 引入硫原子 (S, 想象硫磺)、烃基 (烷基, 碳链, 如-CH₂CH₃, 火字旁, 火上浇油) 或将羟基换成烷氧基 (如-OCH₂CH₃), 药物的脂溶性也会增大。



考点 35: 在制剂制备中, 常用作注射剂和滴眼剂溶剂的是: 注射用水
在临床使用中, 用作注射用无菌粉末溶剂的是: 灭菌注射用水

制药用水考点总结

注射剂的溶剂	考点
饮用水	非灭菌制剂饮片提取
纯化水	普通制剂溶剂、稀释剂、中药注射剂饮片提取
注射用水	注射、滴眼: 溶剂、稀释剂、容器清洗
灭菌注射用水	注射用灭菌粉末溶剂、注射剂的稀释剂

0 纯化水



粗精

考点 36: 与二甲双胍合用能增加降血糖作用的非磺酰脲类胰岛素分泌促进剂是: 瑞格列奈

(2) 非磺酰脲类胰岛素分泌促进剂

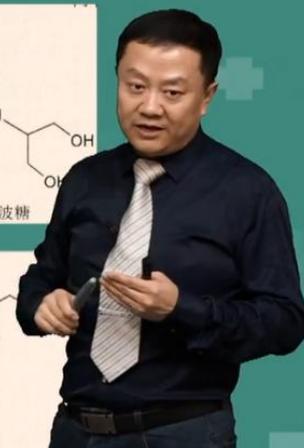
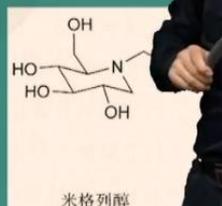
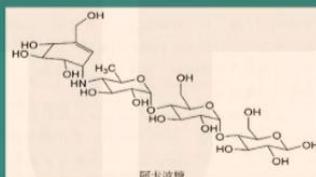
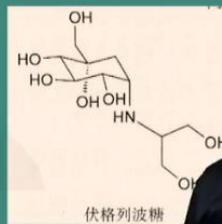
一类具有**氨基酸**结构的新型口服降糖药。该类药物与磺酰脲类的区别: 对K⁺-ATP通道具有“快开”和“快闭”作用, 显著较其他口服降糖药起效迅速, 作用时间短, 使胰岛素的分泌达到模拟人体生理模式—餐时胰岛素迅速升高, 餐后及时回落到基础分泌状态, 被称为“餐时血糖调节剂”。



考点 37: 与二甲双胍合用能增加降血糖作用的 α-葡萄糖苷酶抑制剂是: 阿卡波糖

3. α-葡萄糖苷酶抑制剂

均为单糖或多糖类物质, 主要有阿卡波糖、**米格列醇**和**伏格列波糖**, 可竞争性地与 α-葡萄糖苷酶结合, 抑制该酶的活性, 从而减慢糖类水解产生葡萄糖的速度, 并延缓葡萄糖的吸收。此类药物对1、2型糖尿病均适用。



考点 38: 药用辅料的作用有: 使制剂成型; 使制备过程顺利进行; 降低药物毒副作用; 提高药物疗效; 提高药物稳定性

(四) 药用辅料
1. 药用辅料的作用

- ① 赋型
- ② 使制备顺利进行
- ③ 提高稳定性
- ④ 提高疗效: 胰酶肠溶衣片
- ⑤ 降低毒副: 芸香草油肠溶滴丸, 基质硬脂酸钠+虫蜡
- ⑥ 调节药物作用: 包衣、速释、缓释、靶向
胰酶肠溶衣片助消化, 注射治疗蛇毒咬伤
- ⑦ 提高顺应性

QIAN剂型辅料作用总结

考点 39: 使用包合技术可以: 提高药物的溶解度; 掩盖药物的不良气味; 使液体药物固体化, 减少挥发成分的损失; 提高药物稳定性

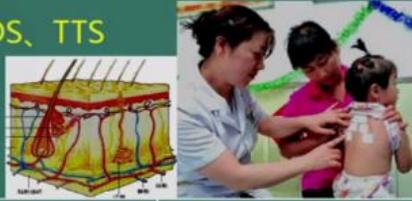
QIAN总结: 固体速释技术特点对比

	共同点	不同点
固体分散技术	① 提高稳定性 ② 掩盖不良气味 ③ 减少刺激性	① 水溶载体速溶, 难溶载体缓释, 肠溶载体控释 ② 容易老化
包合技术	④ 液体药物固体化/粉末化 ⑤ 调节释药速度 ⑥ 增加溶解度, 提高生物利用度	可减少挥发性成分损失

考点 40: 关于经皮给药制剂特点的说法错误的是: 经皮给药制剂起效快特别适宜要求起效快的药物

七、经皮给药制剂——TDDS、TTS

1.特点



优点	缺点
①避免首过效应 ②血药浓度恒定、治疗效果↑ ③用药次数↓, 作用时间↑, 顺应性↑ ④患者可自主用药, 适于老幼、不宜口服患者	①起效慢 ②大面积给药, 有刺激性、过敏性 ③存在皮肤代谢、储库作用



目录
>>
收起
提问
笔记

学教育网
www.med66.com

考点 41: 关于药品有效期的说法, 正确的是: 有效期可用加速试验预测, 用长期试验确定

(六) 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)	高温、高湿、强光, 10天一筛选工艺、选择包材、确定贮存条件
加速试验	化学动力学理论: 含量降低与分解速度有关
长期试验 (留样观察法)	接近实际贮存条件下贮藏, 1-2年, 确定有效期



目录
>>
收起
提问
笔记

学教育网
www.med66.com

(七) 药品有效期——必须掌握

半衰期 (药物降解50%所需的时间)

$$t_{1/2} = \frac{0.693}{k}$$

有效期 (药物降解10%所需的时间)

——药品被批准使用的期限

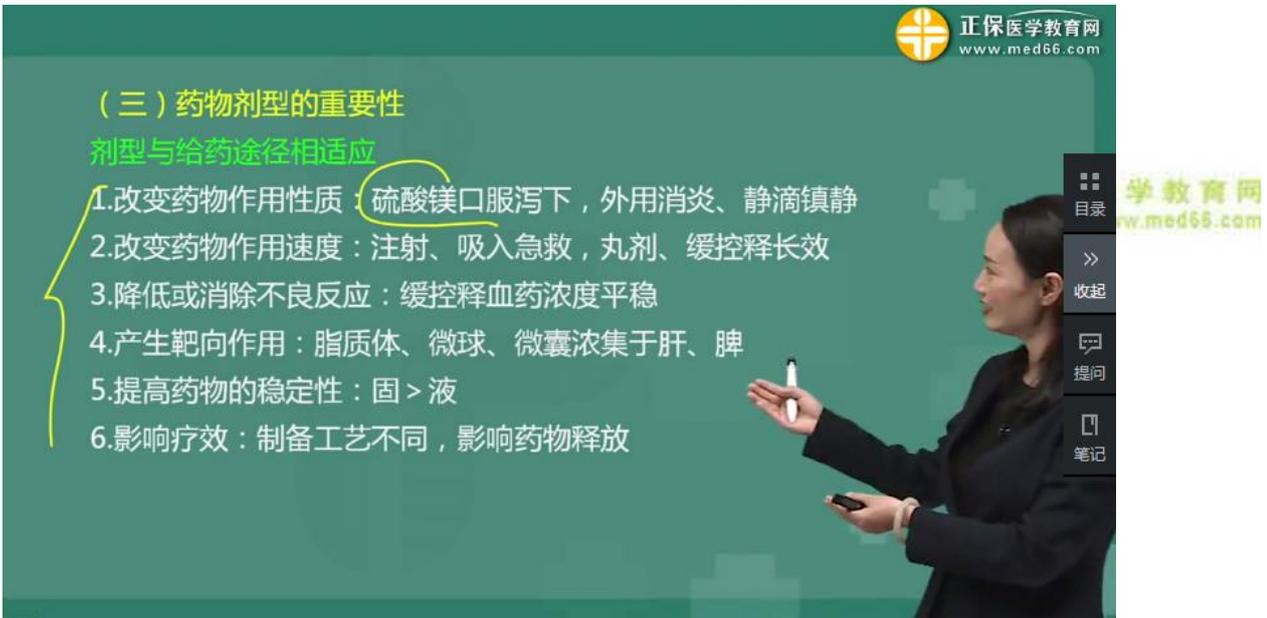
$$t_{0.9} = \frac{0.1054}{k}$$


考点 42: 将药物制成不同剂型的目的和意义不包括: 改变药物的构型

(三) 药物剂型的重要性

剂型与给药途径相适应

1. 改变药物作用性质: 硫酸镁口服泻下, 外用消炎、静滴镇静
2. 改变药物作用速度: 注射、吸入急救, 丸剂、缓控释长效
3. 降低或消除不良反应: 缓控释血药浓度平稳
4. 产生靶向作用: 脂质体、微球、微囊浓集于肝、脾
5. 提高药物的稳定性: 固 > 液
6. 影响疗效: 制备工艺不同, 影响药物释放



考点 43: 不属于脂质体作用特点的是: 药物相容性差, 可延长药物作用时间

4. 脂质体的特点

特点	应用
靶向性和淋巴定向性	用于肿瘤
降低药物毒性	富集在肝脾骨髓, 心脏、肾脏积累量少
细胞亲和性与组织相容性	吸附、交换、内吞、融合
缓释和长效性	减少肾排泄、代谢, 延长滞留时间
提高药物稳定性	青霉素G/V钾盐

DEG

考点 44: 分子中含有吲哚环和托品醇, 对中枢和外周神经 5-HT₃ 受体具有高选择性拮抗作用的药物是



托烷司琼: 由吲哚环和托品醇组成, 对外周神经元和中枢神经内 5-HT₃受体具高选择性拮抗作用, 高效预防癌症化疗的呕吐。

托烷司琼

考点 45: 关于片剂特点的说法, 错误的是: 易吸潮, 稳定性差

1. 片剂的特点

药物 + 辅料 → 混合 → 压制 → 圆形、异形片

优点: ①以片数为剂量单位, 剂量准确、服用方便。

②受外界空气、水分、光线等影响较小, 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, 应用广泛:

(分散片)、长效(缓释片)、口腔疾病(含片)、阴道片,

(阴道片),



目录

>> 收起

提问

笔记

学教育网
www.med66.com

考点 46: 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

奥美拉唑的S和R两种光学异构体疗效一致。但药物代谢选

择性却有所区别。(+) -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, 体内清除率大大低于(+) -R-异构体。



目录

>> 收起

提问

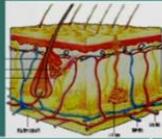
笔记

学教育网
www.med66.com

考点 47: 既可以局部使用, 也可以发挥全身疗效, 且能避免肝脏首过效应的剂型是: 贴剂

七、经皮给药制剂——TDDS、TTS

1.特点



优点	缺点
<ul style="list-style-type: none"> ①避免首过效应 ②血药浓度恒定、治疗效果↑ ③用药次数↓, 作用时间↑, 顺应性↑ ④患者可自主用药, 适于老幼、不宜口服患者 	<ul style="list-style-type: none"> ①起效慢 ②大面积给药, 有刺激性、过敏性 ③存在皮肤代谢、储库作用



学教育网
www.med66.com

考点 48: 热原不具备的性质是: 挥发性

1.热原的性质

①耐热性——通常的注射剂灭菌条件, 不能完全破坏热原

- 650°C : 1min
- 250°C : 30 - 45min
- 180°C-200°C : 2h

②水溶性: 磷脂上连接多糖

③不挥发性: 蒸馏法制备注射用水, 蒸馏水器上附有隔沫装置

④滤过性: 直径约1~5nm, 可用超滤膜去除

⑤被吸附性: 被离子交换树脂、活性炭吸附

⑥其他: 被强酸、强碱、强氧化剂、超声波破坏



目录

>> 学教育网

收起

提问

笔记

笔记

学教育网
www.med66.com

考点 49: 与药物剂量和本身药理作用无关, 不可预测的药物不良反应是: 特异质反应

(2) **B型**不良反应

与药物常规药理作用无关的异常反应。难以预测在具体患者身上是否会出现, 与用药剂量无关, 发生率较低, 但死亡率较高。

①遗传药理学不良反应 (特异质反应);
②药物变态反应 (过敏反应)。



考点 50: 抛射剂是气雾剂喷射药物的动力, 常用作抛射剂的是: 四氟乙烷 (HFA-134a)

6. 抛射剂的种类

抛射剂	代表品种
氢氟烷烃类	HFA-134a (四氟乙烷) HFA-227 (七氟丙烷)
碳氢化合物	丙烷、正丁烷、异丁烷
压缩气体	CO ₂ 、N ₂ 、NO
氯氟烷烃 (氟里昂、CFC)	F ₁₁ 、F ₁₂ 、F ₁₁₄



考点 51: 口服片剂的崩解是影响其体内吸收的重要过程, 常用做片剂崩解剂的是: 交联聚维酮 (PVPP)

正保医学教育网
www.med66.com

③崩解剂

干淀粉：适于水不溶性或微溶性药物
羧甲基淀粉钠 (CMS-Na)
低取代羟丙纤维素 (L-HPC)
交联聚维酮 (PVPP)
泡腾崩解剂：碳酸氢钠+枸橼酸



学教育网
www.med66.com

目录
>>
收起
提问
笔记

考点 52: 发挥全身治疗作用的栓剂处方中往往需要加入吸收促进剂以增加药物的吸收, 常用作栓剂吸收促进剂的是: 聚山梨酯 80

正保医学教育网
www.med66.com

5. 栓剂的附加剂

①表面活性剂：增加药物的亲水性、穿透性
②抗氧化剂：叔丁基羟基茴香醚 (BHA)、2, 6-二叔丁基
甲酚 (BHT)、没食子酸酯类
③防腐剂
④硬化剂：白蜡、鲸蜡醇、硬脂酸、巴西棕榈蜡
⑤增稠剂：氢化蓖麻油、单硬脂酸甘油酯、硬脂酸
⑥吸收促进剂：非离子型表面活性剂、脂肪醇、脂肪胺、
脂肪酸酯类、尿素、水杨酸钠、苯甲酸钠、羟甲基
糊精类衍生物



学教育网
www.med66.com

目录
>>
收起
提问
笔记

考点 53: 由药物的治疗作用引起的不良后果 (治疗矛盾): 继发反应



正保医学教育网
www.med66.com

(5) 继发性反应 (治疗矛盾)

由于药物的治疗作用所引起的不良后果。

不是药物本身的效应, 而是药物主要作用的间接结果。

生于首次用药, 初次接触时需要诱导期, 停止给药反应消失。

长期使用广谱抗生素。

学教育网
www.med66.com

目录
>>
收起
提问
笔记

考点 54: 精神活性药物在滥用的情况下, 机体出现的一种特殊精神状态和身体状态, 称为: 药物依赖性



正保医学教育网
www.med66.com

(二) 药物依赖性

药物依赖性: 药物与机体相互作用所形成的一种特殊精神状态和身体状态。

1. 精神依赖性 (心理依赖性): 一旦产生很难祛除;
2. 身体依赖性 (生理依赖性): 可基本消除各种症状;
3. 交叉依赖性: 另一性质相似的药物。

学教育网
www.med66.com

目录
>>
收起
提问
笔记

考点 55: 重复用药后, 机体对药物的反应性逐渐减弱的现象, 称为: 耐受性

正保医学教育网
www.med66.com

一、药物方面的因素

耐受性: 机体连续多次用药后, 其反应性会逐渐降低, 需要加大药物剂量才能维持原有疗效。

机制: 药物诱导肝药酶, 加速了自身代谢; 连续用药使受体数量下调, 对药物的反应性降低; 机体调节机制产生适应性变化等。



考点 56: 反映药物在体内吸收速度的药动学参数是: 达峰时间 (t_{max})

正保医学教育网
www.med66.com

一、生物利用度 (BA)

1. 生物利用程度 (EBA)

吸收的多少——C - t 曲线下面积 (AUC)

绝对生物利用度 $F = \frac{AUC_T}{AUC_{iv}} \times 100\%$, 相对生物利用度 $F = \frac{AUC_D}{AUC_R} \times 100\%$

T: 试验制剂 R: 参比制剂 iv: 静脉注射剂

2. 生物利用速度 (RBA)

吸收的快慢——达峰时间 (t_{max})

3. 研究方法: 血药浓度法、尿药数据法、药理效应法



考点 57: 用于导泻时硫酸镁的给药途径是: 口服给药

(三) 药物剂型的重要性

剂型与给药途径相适应

1. 改变药物作用性质: 硫酸镁口服泻下, 外用消炎、静滴镇静
2. 改变药物作用速度: 注射、吸入急救, 丸剂、缓控释长效
3. 降低或消除不良反应: 缓控释血药浓度平稳
4. 产生靶向作用: 脂质体、微球、微囊浓集于肝、脾
5. 提高药物的稳定性: 固 > 液
6. 影响疗效: 制备工艺不同, 影响药物释放

考点 58: 减慢药物的体内排泄, 延长药物半衰期, 会让药物在血药浓度-时间曲线上产生双峰现象的因素是: 肠肝循环

胆汁排泄 **2016-2018**

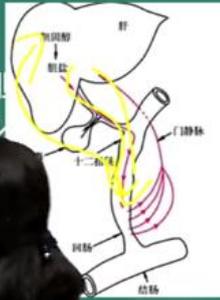
①胆汁是由肝细胞不断生成的, 生成后由肝管流出, 经总胆管流至十二指肠, 或由肝管转运入胆囊管而贮存于胆囊, 当进食时再由胆囊排出至十二指肠上部。

②被动扩散、主动转运 (为主)

③肠肝循环: 随胆汁排入十二指肠的药物或其代谢物在肠道中重新被吸收, 经门静脉返回肝脏, 重新进入血液循环。

④药物: 己烯雌酚、卡马西平、氯霉素、吲哚美辛

⑤双峰现象



考点 59: 对比暴露或不暴露于某药品的两组患者, 采用前瞻性或回顾性研究方法观察或验证药品不良反应的发生率或疗效, 这种研究方法属于: 队列研究



正保医学教育网
www.med66.com

(二) 分析性研究

1. 队列研究 (定群研究)

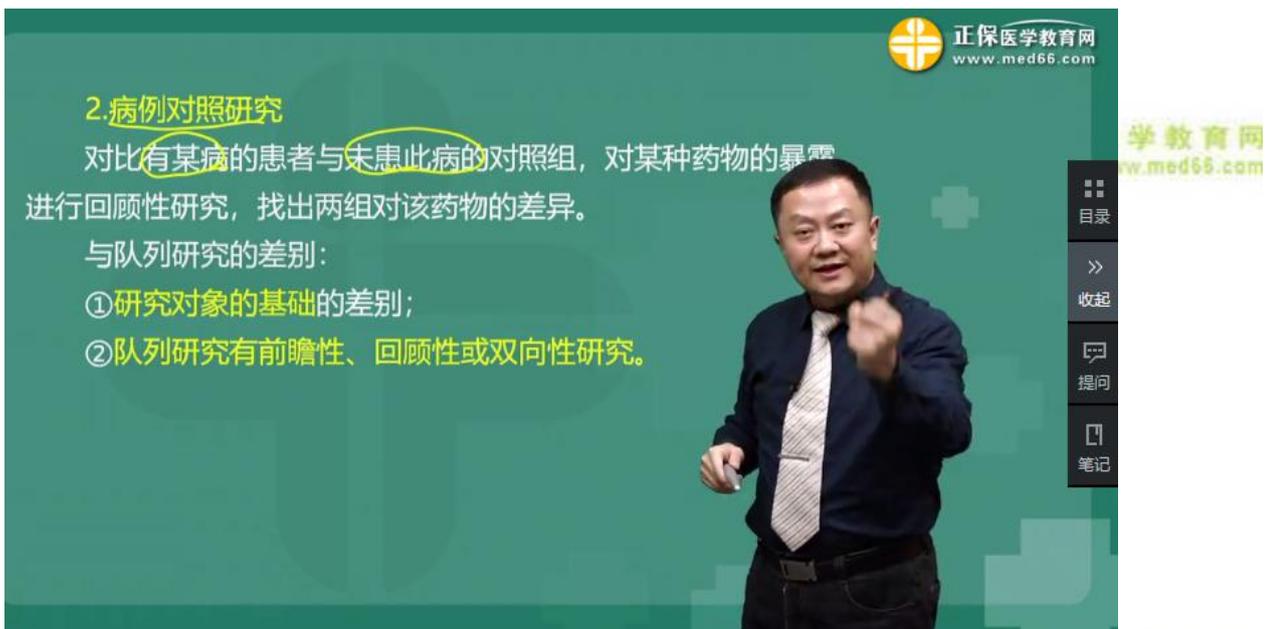
样本分为两组, 一组暴露于某一药物的患者, 与另一组未暴露于该药物的患者进行对比观察, 验证其结果的差异。

前瞻性队列研究、回顾性队列研究、双向队列研究

学教育网
www.med66.com

目录
>>
收起
提问
笔记

考点 60: 对比患有某疾病的患者组与未患此病的对照组对某种药物的暴露进行回顾性研究, 找出两组对该药物的差异, 这种研究方法属于: 病例对照研究



正保医学教育网
www.med66.com

2. 病例对照研究

对比有某病的患者与未患此病的对照组, 对某种药物的暴露进行回顾性研究, 找出两组对该药物的差异。

与队列研究的差别:

- ① 研究对象的基础的差别;
- ② 队列研究有前瞻性、回顾性或双向性研究。

学教育网
www.med66.com

目录
>>
收起
提问
笔记

考点 61: 反映药物最大效应的指标是: 效能

正保医学教育网
www.med66.com

(三) 最大效应 (E_{max}) 或效能

在一定范围内, 增加药物剂量或浓度, 其效应强度随之增加。但效应增至最大时, 继续增加剂量或浓度, 效应不能再上升, 此时效应为一极限, 称**最大效应或效能**。

效能反映药物的**内在活性**。

联想到人的**身高**, 到了一定年龄, 再也不能长个儿了。就是S形曲线的最高点。比效能, 就是比S形曲线的个头。



正保医学教育网
www.med66.com

考点 62: 产生药理效应的最小药量是: 阈剂量

正保医学教育网
www.med66.com

(二) 最小有效量

最小有效量 (阈剂量): 引起药理效应的**最小药量**。

最小有效浓度 (阈浓度): 引起药理效应的**最低药物浓度**。

注意换个说法, 意思不变: **刚刚能**引起药理效应的**药量或浓度**。



正保医学教育网
www.med66.com

考点 63: 反映药物安全性的指标是: 治疗指数

正保医学教育网
www.med66.com

治疗指数 (TI) : LD_{50}/ED_{50} 。

联想到LED灯, 所以是 LD_{50}/ED_{50} , LD_{50} 在上, ED_{50} 在下。
表示药物的**安全性**, 数值越大越安全。

但, 治疗指数大的药物**不一定安全**, 因为量效曲线与毒效曲线的首尾仍可能出现重叠, 即 ED_{95} 可能大于5%的中毒死亡量 (LD_5)。

联想: 安全的药物, 最好是起效剂量和中毒剂量之间离
远越好, 中间有个**安全窗, 缓冲带**。



学教育网
www.med66.com

考点 63: 用于评价表面活性剂性质的参数是:HLB

正保医学教育网
www.med66.com

表面活性剂的HLB值与其应用性质有密切关系

↑ 亲水	18	起泡剂 增溶剂
	15	
	12	油/水乳化剂
	9	润湿剂
	6	
	3	水/油乳化剂
↓ 亲油	0	消泡剂

QIAN

亲水亲油平衡值 **HLB**

数大亲水小亲油

15以上可增溶

7到9做润湿剂

8前8后各不同

油包水来水包油

7-11



学教育网
www.med66.com

考点 64: 用于评价药物脂溶性的参数是: lgP

药物在体内的吸收、分布、排泄需在水相和脂相(有机相, 油相)间多次分配, 因此要求药物兼具脂溶性和水溶性。

脂水分配系数: 评价药物亲水性或亲脂性大小的标准表示, 定义: 药物在生物非水相中物质的量浓度与在水相中的量浓度之比。

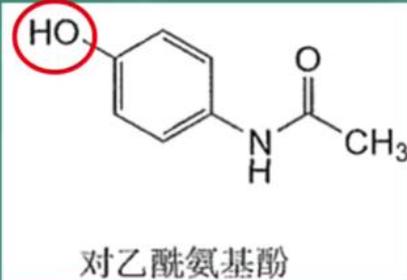
$$P = \frac{C_{org}}{C_w}$$

脂水分配系数, 脂前水后, 所以是脂相除以水相(下); P值越大, 脂相中浓度相对越高, 脂溶性越高。



考点 65: 在体内代谢过程中, 少部分可由细胞色素 P450 氧化酶系统代谢为具有肝毒性乙酰亚胺醌代谢物的药物是: 对乙酰氨基酚

对乙酰氨基酚: 主要与体内葡萄糖醛酸或硫酸结合直接从肾脏排出, 极少部分可由细胞色素P450氧化酶系统代谢为对肝有毒害的N-羟基衍生物, 此物质还可转化成毒性代谢产物乙酰亚胺醌(具肾毒性和肝毒性)。

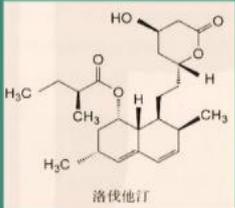
CC(=O)Nc1ccc(O)cc1

对乙酰氨基酚



考点 66: 含有环 A 基本结构, 临床上用于治疗高胆固醇血症和混合型高脂血症的天然的前药型 HMG-CoA 还原酶抑制剂是: 洛伐他汀

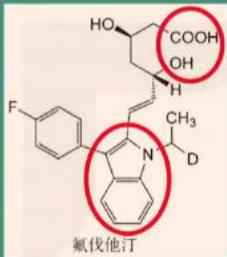
洛伐他汀: 天然HMG-CoA还原酶抑制剂, **内酯结构**, 体外无HMG-CoA还原酶抑制作用, 水解为3, 5-二羟基戊酸才表现出活性。竞争性抑制HMG-CoA还原酶, 选择性高, 能显著降低LDL水平, 并能提高血浆中HDL水平。临床上用于治疗高胆固醇血症和混合型高脂血症, 也可用于缺血性脑卒中的防治。



洛伐他汀

考点 67: 含有环 B 基本结构, 水溶性好, 口服吸收迅速而完全, 临床上具有调血脂作用, 还具有抗动脉粥样硬化的作用, 可用于降低冠心病发病率和死亡率的第一个全合成的含 3, 5-二羟基羧酸药效团的 HMG-COA 还原酶抑制剂的是: 氟伐他汀

氟伐他汀: 第一个通过全合成得到的他汀类药物, **吲哚环**替代洛伐他汀分子的双环, **内酯环打开**与钠成盐后得到氟伐他汀钠。氟伐他汀水溶性好, 口服吸收迅速而完全, 与蛋白结合率较高。本品具强效降血脂作用, 还能抗动脉硬化的潜在功能, 降低冠心病发病率及死亡率。



氟伐他汀

考点 68: 因引起危及生命的横纹肌溶解副作用, 导致“拜斯亭事件”发生而撤出市场的 HMG-COA 还原酶抑制剂的是: 西立伐他汀

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。实际上，所有他汀类药物可能均有一定程度的横纹肌溶解副作用，而他汀类药物相关的引起危及生命的横纹肌溶解病例报告明显地比其他他汀类药物更频繁。



- 目录
- >>
- 收起
- 提问
- 笔记

学教育网
www.med66.com

