

2018 年执业药师考试真题及参考答案

《药学专业知识一》

一、最佳选择题

1. 关于药物制剂稳定性的说法，错误的是 (B)
- A. 药物化学结构直接影响药物制的稳定性
 - B. 药用辅料要求化学性质稳定，所以辅料不影响药物制剂的稳定性
 - C. 微生物污染会影响制剂生物稳定性
 - D. 制剂物理性能的变化，可能引起化学变化和生物学变化
 - E. 稳定性试验可以为制剂生产、包装、储存、运输条件的确定和有效期的建立提供科学依据

第03讲 药物剂型与制剂 (一)

正保医学教育网
www.med66.com

(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
- ⑥ 调节药物作用：包衣、速释、缓释、靶向
- ⑦ 提高顺应性



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

正保医学教育网
www.med66.com

(七) 药品有效期

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

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


3.因对心脏快速延迟整流钾离子通道(hERG K⁺通道)具有抑制作用,可引起 Q-T 间期延长及至诱发尖端扭转型室性心动过速, 现已撤出市场的药物是(E)

- A.卡托普利
- B.莫沙必利
- C.赖诺普利
- D.伊托必利
- E.西沙必利


第02讲 药物结构与药物活性

正保医学教育网
www.med66.com

2.对心脏快速延迟整流钾离子通道 (hERG) 的影响

许多药物对hERGK⁺通道具有抑制作用,可进一步引起Q-T间期延长,诱发尖端扭转型室性心动过速,产生心脏不良反应。最常见的主要为心脏疾病用药物,如抗心律失常药、抗心绞痛药和强心药。

药物导致的获得性长Q-T综合征成为已上市药品撤出市场的主要原因。药物的安全性评价要包括对心脏复极和Q-T间期的影响。各国新药审批部门要求新药上市前需进行hERG抑制作用的研究。




第08讲 消化系统疾病用药 (二)

正保医学教育网
www.med66.com

莫沙必利:新型胃动力药物,强效、选择性5-HT₄受体激动剂。结构优化克服了西沙必利的心脏副作用,无导致Q-T间期延长和室性心律失常作用。莫沙必利在肝脏中由CYP3A4酶代谢,主要代谢产物为脱4-氟苄基莫沙必利,具有5-HT₃受体拮抗作用。



莫沙必利

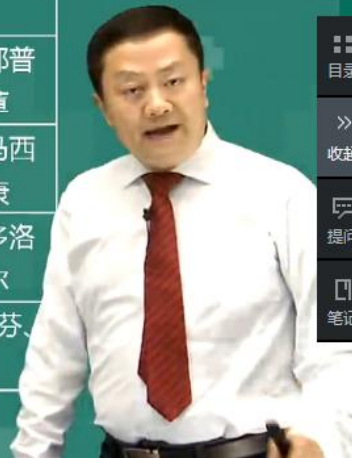


4.根据生物药剂学分类系统,属于第IV类低水溶性、低渗透性的药物是(E)

- A.双氯芬酸
- B.吡罗昔康
- C.阿替洛尔
- D.雷尼替丁
- E.酮洛芬

生物药剂学分类：溶解性（水溶性）和渗透性（脂溶性）

分类	特征	归属	决定因素	代表药
I	高水溶性、 高渗透性	两亲性	胃排空速率	普萘洛尔、依那普利、地尔硫草
II	低水溶性、 高渗透性	亲脂性	溶解速率	双氯芬酸、卡马西平、匹罗昔康
III	高水溶性、 低渗透性	水溶性	渗透效率	雷尼替丁、纳多洛尔、阿替洛尔
IV	低水溶性、 低渗透性	疏水性	难吸收	特非那定、酮洛芬、呋塞米



5.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(D)

- 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

2. 眼用制剂的质量要求

质量要求	考点
pH	缓冲液： <u>磷酸盐、硼酸、硼酸盐</u>
渗透压	<u>与泪液等渗</u> ，滴眼可高渗，洗眼等渗、 渗透压调节剂： <u>氯化钠、葡萄糖、硼酸、硼砂</u>
无菌	眼外伤/术后单剂量，不得添加抑菌剂（三叔苯尼汞） 无外伤多剂量，不得检出金+铜
黏度	黏度调节剂：MC、PEG、PVA、PVP
混悬型	>50 μm 粒子 ≤2，不得检出超过90 μm，F ≥ 0.9
装量	滴眼 ≤10ml，洗眼 ≤200ml
贮存	密封避光、开启后4周



6.在配制液体制剂时，为了增加难溶性药物的溶解度，通常需要在溶剂中加入第三种物质，与难溶性药物形成可溶性的分子间络合物、缔合物和复接等。加入的第三种物质的属于(A)

- A.助溶剂
- B.潜溶剂
- C.增溶剂
- D.助悬剂
- E.乳化剂

5. 液体制剂常用的附加剂

附加剂	考点
增溶剂	表面活性剂→聚山梨酯(吐温)HLB15-18
助溶剂	第三种物质→KI(助溶剂)+I ₂ →KI ₃
潜溶剂	混合溶剂→水+乙醇/丙二醇/甘油/PEG
防腐剂	苯、山、酯、醇、油
矫味剂	甜味剂、芳香剂、胶浆剂、泡腾剂
着色剂	色素
其他	抗氧化剂、pH调节剂、金属离子络合剂



- 目录
- >>
- 收起
- 提问
- 笔记

7. 与抗菌药配伍使用后, 能增强抗细菌药疗效的药物称为抗菌增效剂。属于抗菌增效剂的药物是 C

- A. 氨苄西林
- B. 舒他西林
- C. 甲氧苄啶
- D. 磺胺嘧啶
- E. 氨基曲南

汇总 磺胺类抗菌药

基本结构: 对氨基苯磺酰胺。靶点是细菌的二氢叶酸合成酶。

抗菌增效剂甲氧苄啶是二氢叶酸还原酶可逆性抑制剂。



8. 评价药物安全性的药物治疗指数可表示为 D

- A. ED₉₅/LD₅
- B. ED₅₀/LD₅₀
- C. LD₁/ED₉₉
- D. LD₅₀/ED₅₀
- E. ED₉₉/LD₁



9. 多剂量静脉注射给药的平均稳态血药浓度是 B

- A. C_{max}^{SS} 与 C_{min}^{SS} 的算术平均值
- B. 重复给药达到稳态后, 在一个给药间隔时间内血药浓度-时间曲线下面积除以给药间隔时间的商值
- C. C_{max}^{SS} 与 C_{min}^{SS} 的几何平均值
- D. 药物的血药浓度-时间曲线下面积除以给药时间的商值
- E. 重复给药的第一个给药间隔时间内血药浓度-时间曲线下面积除以给药间隔商值

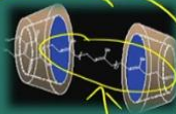
解析: 重复给药达稳态后, 在一个给药间隔时间内血药浓度-时间曲线下的面积除以给药间隔时间的商值, 它用符号 " \bar{C}_{ss} " 表示。

10. 将维 A 酸制成环糊精包合物的目的主要是 B

- A. 降低维 A 酸的溶出度
- B. 提高维 A 酸的稳定性
- C. 减少维 A 酸的挥发损失
- D. 产生靶向作用
- E. 产生缓释效果

考点3——固体制剂速释技术特点

	共同点
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 ✓
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



11. 苯唑西林的生物半衰期 $t_{1/2}=0.5h$ ，其 30% 原形药物经肾排泄，且肾排泄的主要机制是肾小球滤过和肾小球分泌，其余大部分经肝代谢消除，对肝肾功能正常的病人，该药物的肝清除速率常数是 C

- A. $4.6h^{-1}$
- B. $1.98h^{-1}$
- C. $0.42h^{-1}$
- D. $1.39h^{-1}$
- E. $0.42h^{-1}$

12. 为延长脂质体在体内循环时间，通常使用修饰的磷脂制备长循环脂质体，常用的修饰材料是 (D)

- A. 甘露醇
- B. 聚山梨醇
- C. 山梨醇
- D. 聚乙二醇
- E. 聚乙烯醇

医学教育网
www.med66.com

2.脂质体的分类

	分类
按结构	单室、多室、 大多孔
按荷电性	正电性、负电性、中性
按性能	<p>常规、特殊性能</p> <p>热敏感：在相变温度时 释药</p> <p>pH敏感：肿瘤间质的pH低</p> <p>前体：吸附在水溶载体上，包封脂溶性</p> <p>长循环：PEG修饰，降低与巨噬细胞的亲和力</p> <p>免疫：联接抗体，识别靶细胞</p>

13.用于各种高血压，也可用于预防心绞痛的药物是(D)

- A.卡托普利
- B.可乐定
- C.氯沙坦
- D.硝苯地平
- B.哌唑嗪

硝苯地平：对称结构的二氢吡啶类药物，口服经胃肠道吸收完全，1~2小时内达到血药浓度最大峰值，有效作用时间持续12小时，经肝脏代谢，硝苯地平的体内代谢物均无活性，90%由肾脏排泄。用于治疗冠心病，缓解心绞痛。硝苯地平适用于各种类型的高血压。



14.《中国药典》收录的阿司匹林标准中，记载在【性状】项的内容是 B

- A.含量的限度
- B.溶解度
- C.溶液的澄清度
- D.游离水杨酸的限度
- E.干燥失重的限度

3.性状

药物的外观、臭味、溶解度及物理常数等。

(1) 溶解度：“极易溶解”、“易溶”、“溶解”、“略溶”、“微溶”、“极微溶解”、“几乎不溶或不溶”。

极易溶解：溶质1g (ml) 在溶剂不到1mL中溶解；

几乎不溶或不溶：溶质1g (ml) 在溶剂10L中不能完全溶解。

(2) 物理常数：熔点、比旋度、折光率、吸收系数等。



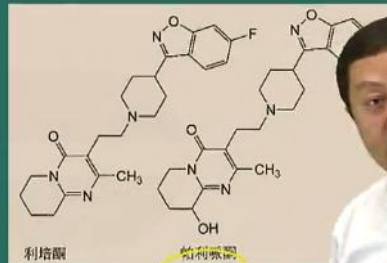
15.利培酮的半衰期大约为 3 小时，但用法为一日 2 次，其原因被认为是利培酮的代谢产物也具有相同的生物活性，利培酮的活性代谢产物是 D

- A.齐拉西酮
- B.洛沙平
- C.阿莫沙平
- D.帕利哌酮
- E.帕罗西汀

3.其他结构药物

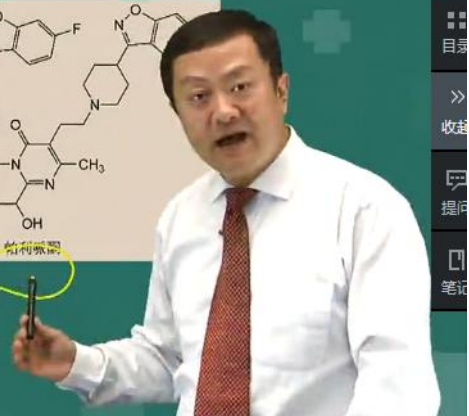
利培酮运用联合原理设计的非经典抗精神病药物。利培酮口服吸收完全，在肝脏受CYP2D6酶催化，生成活性代谢产物帕利哌酮和N-去羟基衍生物。

原药半衰期只有3小时，但主要活性代谢物帕利哌酮的半衰期长达24小时。帕利哌酮药用外消旋体。



利培酮

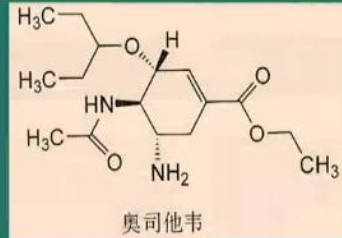
帕利哌酮



16.作用于神经氨酸酶的抗流感毒药物的是(C)

- B.利巴韦林
- C.奥司他韦
- D.膦甲酸钠
- E.金刚烷胺

奥司他韦：流感病毒的神经氨酸酶抑制剂，能有效地阻断流感病毒的复制过程，对流感的预防和治疗发挥重要的作用。



17.关于药物吸收的说法，正确的是(A)

- A.在十二指肠由载体转运吸收的药物，胃排空缓慢有利于其口服吸收
- B.食物可减少药物的吸收，药物均不能与食物同服
- C.药物的亲脂性会影响药物的吸收，油/水分配系数小的药物吸收好
- D.固体药物粒子越大，溶出越快，吸收越好
- E.临床上大多数脂溶性小分子药物的吸收过程是主动转运

18.关于制剂质量要求和特点的说法，正确的是(B)

- A.注射剂应进行微生物限度检查
- B.眼用液体制剂不允许添加抑菌剂
- C.生物制品一般不宜制成注射用浓溶液
- D.若需同时使用眼膏剂和滴眼剂，应先使用眼膏剂
- E.冲洗剂开启使用后，可小心存放，供下次使用

2. 眼用制剂的质量要求

质量要求	考点
pH	缓冲液：磷酸盐、硼酸、硼酸盐
渗透压	与泪液等渗，滴眼可高渗，洗眼等渗、渗透压调节剂：氯化钠、葡萄糖、硼酸、硼砂
无菌	眼外伤/术后单剂量，不得添加抑菌剂（三叔苯尼汞） 无外伤多剂量，不得检出金+铜
黏度	黏度调节剂：MC、PEG、PVA、PVP
混悬型	>50 μm 粒子 ≤2，不得检出超过90 μm，F ≥ 0.9
装量	滴眼 ≤ 10ml，洗眼 ≤ 200ml
贮存	密封避光、开启后4周



3. 输液的质量要求

注射剂的质量要求	输液质量要求
<ul style="list-style-type: none"> pH: 4~9 (血液7.4) 渗透压: 量大、静注等渗或偏高渗 稳定性 安全性 澄明: 可见异物/不溶性微粒 无菌 无热原 	<ul style="list-style-type: none"> ➢ 更加严格 ➢ 不得添加抑菌剂 20 ➢ 检漏



第05讲 灭菌制剂(三)

3. 眼用制剂的临床应用与注意事项

- ① 单用一种, 或间隔10min用另一种, 先滴眼再眼膏
- ② 一人一用
- ③ 使用前净手、清眼、擦泪
- ④ 半固体涂抹后需按摩
- ⑤ 滴眼时轻压泪囊区——减少全身效应
- ⑥ 混悬剂用前混匀
- ⑦ 性状改变禁用



19. 给1型糖尿病患者皮下注射胰岛素控制血糖的机制属于(C)

- A. 改变离子通道的通透性
- B. 影响酶的活性
- C. 补充体内活性物质
- D. 改变细胞周围环境的理化性质
- E. 影响机体免疫功能

正保医学教育网 www.med66.com

【例题】

B型题

A. 噻嗪类利尿药抑制肾小管Na⁺-Cl⁻转运体，从而抑制Na⁺-K⁺、Na⁺-H⁺交换而发挥排钠利尿作用

B. 抗酸药中和胃酸，可用于治疗胃溃疡

C. 胰岛素治疗糖尿病

D. 抗心律失常药可分别影响Na⁺、K⁺或Ca²⁺

E. 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

正保医学教育网 www.med66.com

【例题】

1. 影响细胞离子通道
2. 补充体内物质
3. 干扰核酸代谢
4. 改变细胞周围环境的理化性质
5. 影响生理活性物质及其转运体

【答案】 D; C; E; B; A

20. 静脉注射某药 80 mg，初始血药浓度为 20μg/ml，则该药的表观分布容积 V 为(B)

- A. 0.25L
- B. 4L
- C. 0.4L
- D. 1.6L
- E. 16L

www.med66.com

正保医学教育网 www.med66.com

2. 药动学常用参数

药动学参数	计算	含义
速率常数 (h ⁻¹ / min ⁻¹)	吸收: k _a 尿排泄: k _e 消除 k = k _b + k _{bi} + k _e + ...	速度与浓度的关系，体内过程快慢
生物半衰期 (t _{1/2}) ΔΔΔ	t _{1/2} = 0.693/k	消除快慢——线性不同型、途径、剂量而改变 半衰期短需频繁
表观分布容积 (V)	V = X/C	表示分布特性 药物，血液中 组织摄取多，

21.以 PEG 为基质的对乙酰氨基酚表面的鲸蜡醇层的作用是(B)

- A.促进药物释放
- B.保持栓剂硬度
- C.减轻用药刺激
- D.增加栓剂的稳定性
- E.软化基质

5. 栓剂的附加剂

氢化蓖麻油	硬化剂
Tween 80	增稠剂
水杨酸钠	吸收促进剂
鲸蜡醇	抗氧化剂
对羟基苯甲酸酯	防腐剂
叔丁基对甲酚	表面活性剂

正保医学教育网 www.med66.com

22.患者，男，65岁，患高血压病多年，近三年来一直服用氨氯地平和阿替洛尔，血压控制良好。近期因治疗肺结核，服用利福平、乙胺丁醇。两周后血压升高。引起血压升高的原因可能是(B)

- A.利福平促进了阿替洛尔的肾脏排泄
- B.利福平诱导了肝药酶，促进了氨氯地平的代谢
- C.乙胺丁醇促进了阿替洛尔的肾脏排泄
- D.乙胺丁醇诱导了肝药酶，促进了氨氯地平的代谢
- E.利福平与氨氯地平结合成难溶的复合物

(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: 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、氯米特、甲丙氨酯。

酶诱导剂: 两坨米黄泥水, 家里有骡同马。

正保医学教育网 www.med66.com

23.关于药物警戒与药物不良反应监测的说法，正确的是(A)

- A.药物警戒和不良反应监测都对已上市药品进行安全性评价
- B.药物警戒和不良反应监测的对象都仅限于质量合格的药品
- C.不良反应监测的重点是药物滥用与误用
- D.药物警戒不包括研发阶段的药物安全性评价和动物毒理学评价
- E.药物不良反应监测包括药物上市前的安全性监测

项目	药物警戒	药品不良反应监测
监测对象	包括 <u>质量合格药品</u> 和 <u>不合格药品</u>	<u>质量合格的药品</u>
工作内容	包括 <u>ADR监测工作</u> 以及其他工作	<u>ADR监测工作</u>
工作本质	积极主动地评价工作	相对被动的



- 目录
- >> 收起
- 提问
- 笔记

缺少 24 题

- 25.服用阿托品在解除胃肠痉挛时，引起口干、心悸的不良反应属于(B)
- A.后遗效应
 - B.副作用
 - C.首剂效应
 - D.继发性反应
 - E.变态反应

2.根据药品不良反应的性质分类

根据治疗目的、用药剂量大小或严重程度，可分：

(1) 副作用 (副反应)

药物按正常用法用量使用，出现与治疗目的无关的不适反应。

副作用是药物固有的药理作用所产生的，副作用和治疗作用之间可相互转变。难以避免，应事先向患者说明，以免误认为病情加重。



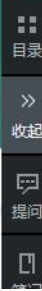
- 目录
- >> 收起
- 提问
- 笔记

缺 26.27 题

- 28.通过阻滞钙离子通道发挥药理作用的药物是 A
- A.维拉帕米
 - B.普鲁卡因
 - C.奎尼丁
 - D.胺碘酮
 - E.普罗帕酮

2. 钙通道阻滞剂

(1) 1,4-二氢吡啶类：1,4-二氢吡啶环是必需药效团。遇光极不稳定，产生硝基苯吡啶衍生物和亚硝基苯吡啶衍生物。柚子汁可导致浓度升高。除尼索地平，所有二氢吡啶类药物均经历肝首过效应。硝苯地平、尼群地平、非洛地平、氨氯地平（吸收不受食物影响）、尼莫地平。



(2) 芳烷基胺类：维拉帕米，含手性碳，右旋体作用强。现用外消旋体。代谢物主要为N-脱甲基化合物。

(3) 苯硫氮草类：地尔硫草，2个手性碳，具4个立体异构体。临床仅用2S, 3S-异构体。地尔硫草首过效应强，生物利用度低，存在肝肠循环。



缺少 29 题

30. 世界卫生组织关于药物“严重不良事件”的定义是(C)

- A. 药物常用剂量引起的与药理学特征有关但非用药目的的作用
- B. 在使用药物期间发生的任何不可预见不良事件，不一定与治疗有因果关系
- C. 在任何剂量下发生的不可预见的临床事件，如死亡、危及生命、需住院治疗或延长目前的住院时间，导致持续的或显著的功能丧失及导致先天性畸形或出生缺陷
- D. 发生在作为预防、治疗、诊断疾病期间或改变生理功能使用于人体的正常剂年时发生的有害的和非目的的药物反应
- E. 药物的一种不良反应，其性质和严重程度与标记的或批准上市的药物不良反应不符，或是未能预料的不良反应

31. 关于气雾剂质量要求和贮藏条件的说法，错误的是 A

- A. 贮藏条件要求是室温保存
- B. 附加剂应无刺激性、无毒性
- C. 容器应能耐受气雾剂所需的压力
- D. 抛射剂应为适宜的低沸点的液体
- E. 严重创伤用气雾剂应无菌

4. 气雾剂的质量要求

3无	毒性、刺激性、致敏性（抛射剂）
抛射剂	低沸点液体
粒径	每喷雾滴、雾粒均匀
剂量	递送剂量均一
安全	泄漏率检查、压力检查
无菌	烧伤、创伤、溃疡用
保存	凉暗处，并避免暴晒、受热、敲打、撞击



32. 患者，女，60岁，因哮喘服用氨茶碱缓释剂，近日，因胃溃疡服用西咪替丁，三日后出现心律失常、心悸、恶心等症状。将西咪替丁换成法莫替丁后，上述症状消失，引起该患者心律失常及心悸等症状的主要原因是 B
- A. 西咪替丁与氨茶碱竞争血浆蛋白
 - B. 西咪替丁抑制肝药酶，减慢了氨茶碱的代谢
 - C. 西咪替丁抑制氨茶碱的肾小管分泌
 - D. 西咪替丁促进氨茶碱的吸收
 - E. 西咪替丁增强组织对氨茶碱的敏感性

(三) 影响药物的代谢

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：**西安两三楼硝烟，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、氯丙嗪、氯霉素、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楼硝烟，派士兵在城墙的红梅树下倚坐。西指西咪替丁，安指胺碘酮，两缕指氯霉素和氯丙嗪，三指三环类抗抑郁药，硝指甲硝唑，烟指异烟肼；派指哌醋甲酯，兵指丙米嗪，在指吩噻嗪类药物，红梅指红霉素，倚指抑制剂唑指咪康唑。

33. 头孢克洛生物半衰期约为 1 h，口服头孢克洛胶囊后，其在体内基本清除干净(90%)的时间约是(C)
- A. 7h
 - B. 2 h
 - C. 3h
 - D. 14h
 - E. 28h

达稳态血药浓度的分数 (达坪分数、 f_{ss})

f_{ss} : t时间内体内血药浓度与达稳态血药浓度之比值

$$n = -3.32 \lg (1 - f_{ss})$$

n为半衰期的个数

$$n = 1 \rightarrow 50\%$$

$$n = 3.32 \rightarrow 90\%$$

$$n = 6.64 \rightarrow 99\%$$

$$n = 10 \rightarrow 99.9\%$$



34. 通过抑制血管紧张素 I 发挥药理作用的药物是 (A)

- A. 依那普利
- B. 阿司匹林
- C. 厄贝沙坦
- D. 硝苯地平
- E. 硝酸甘油

教育网

三、抗高血压药

1. 血管紧张素转换酶 (ACE) 抑制剂

ACE抑制剂可分三类：含巯基的ACE抑制剂、含二羧基的ACE抑制剂和含磷酰基的ACE抑制剂。

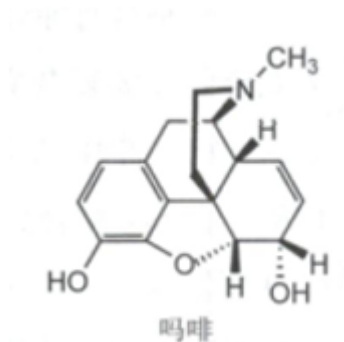
所有ACE抑制剂都能有效阻断血管紧张素I向血管紧张素II转化，同时都具有相似的治疗与生理作用。主要不同之处：作用效果和药动学参数。

ACEI

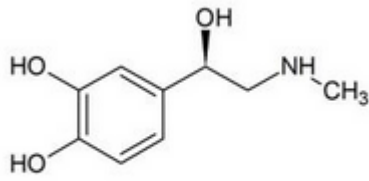


35. 易发生水解降解反应的药物是 (B)

- A. 吗啡

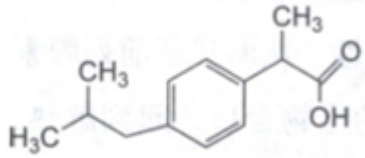


- B. 肾上腺素



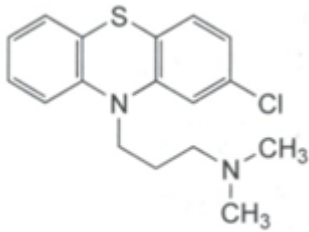
肾上腺素

C. 布洛芬



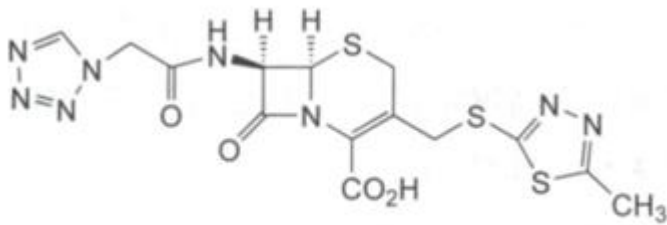
布洛芬

D. 盐酸氯丙嗪



氯丙嗪

E. 头孢唑林



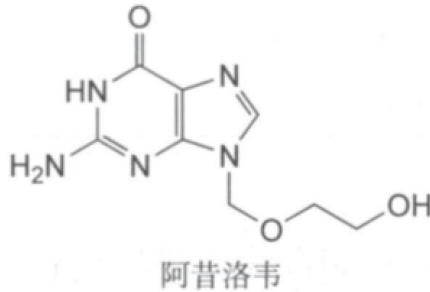
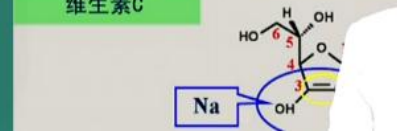
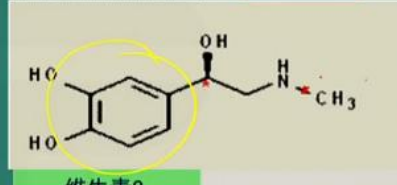
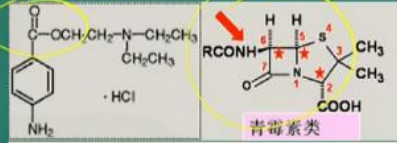
头孢唑林

考点3——易水解药物、易氧化药物

盐酸普鲁卡因
青霉素、头孢
对乙酰氨基酚

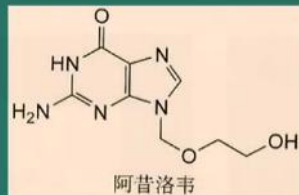
肾上腺素
水杨酸钠
Vc

酯类酰胺易水解
酚类烯醇易氧化

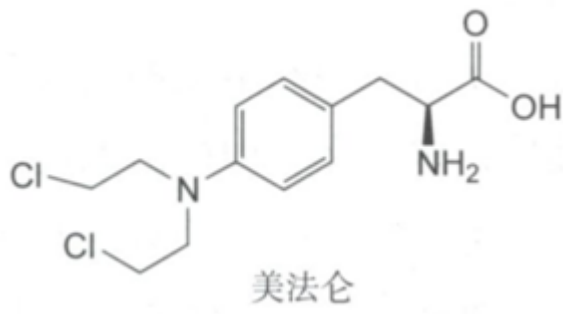


- 36.阿昔洛韦的母核结构是 C
- A.嘧啶环
 - B.咪唑环
 - C.鸟嘌呤环
 - D.吡咯环
 - E.吡啶环

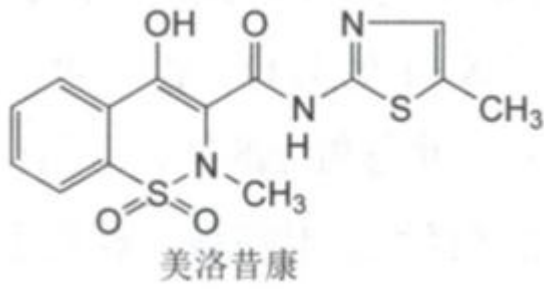
阿昔洛韦：开环鸟苷类似物，糖环中失去C-2' 和C-3' 的嘌呤核苷类似物，其在被磷酸化时专一性的在相应于羟基的位置上磷酸化，并掺入到病毒的DNA中。由于该化合物不含有相当的羟基，是链中止剂，从而使病毒的DNA合成中断。



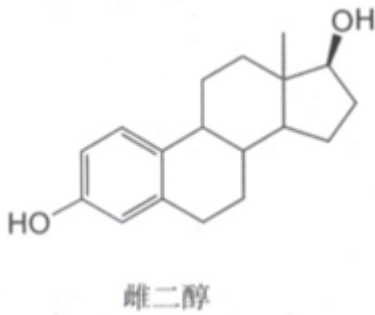
- 37.药物分子与机体生物大分子相互作用方式有共价键合和非共价键合两大类，以共价键合方式与生物大分子作用的药物是 (A)
- A.美法仑



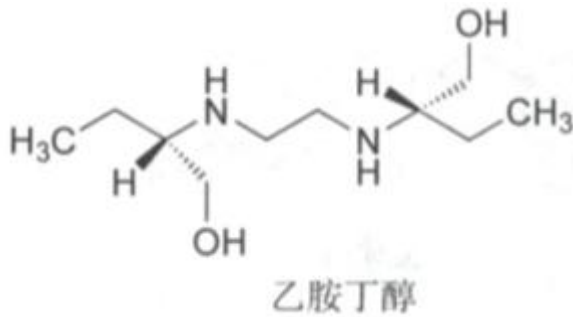
B.美洛昔康



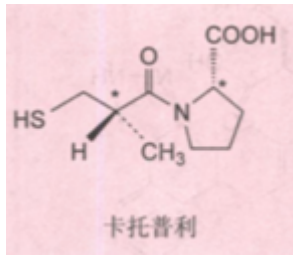
C.雌二醇



D.乙胺丁醇



E.卡托普利



第02讲 药物结构与药物活性

正保医学教育网
www.med66.com

(三) 药物与作用靶标结合的化学本质

药物在和生物大分子作用时，一般是通过键合的形式进行结合，这种键合形式有共价键和非共价键两大类。

1. 共价键键合

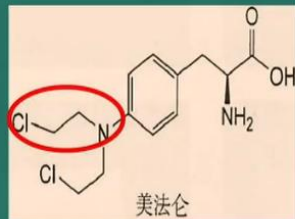
共价键键合是一种不可逆的结合形式，例如烷化剂类抗肿瘤药，与DNA中鸟嘌呤碱基形成共价结合键，产生



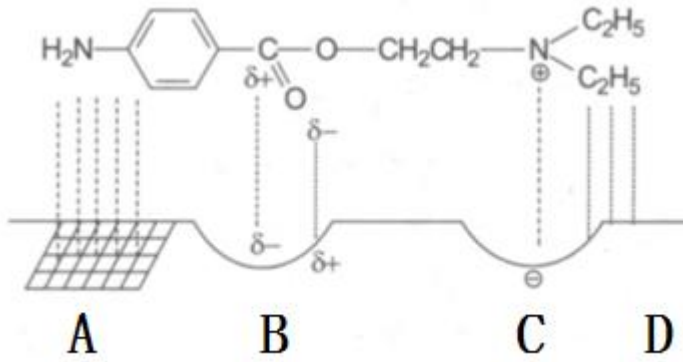
第14讲 抗癌毒药、抗肿瘤药

正保医学教育网
www.med66.com

美法仑：烷基化部分是β-氯乙胺，载体部分是L-苯丙氨酸部分，L-苯丙氨酸为人体必需氨基酸，是一个良好的载体。

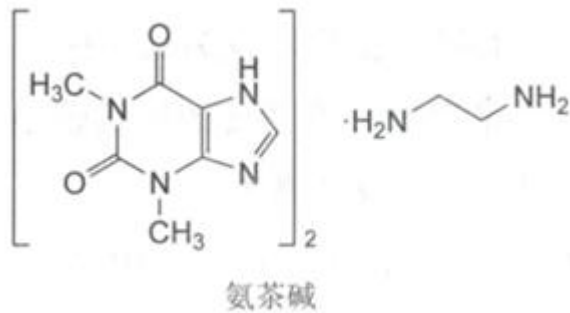


38. 普鲁卡因在体内与受体之间存在多种结合形式，结合模式如图所示：图中，B 区域的结合形式是 (C)



- A. 氢键作用
- B. 离子-偶极作用
- C. 偶极-偶极作用
- D. 电荷转移作用
- E. 疏水作用

39. 氨茶碱结构如图所示:



《中国药典》规定氨茶碱为白色至微黄色的颗粒或粉末，易结块，在空气中吸收二氧化碳，并分解成茶碱，根据氨茶碱的性状，其贮存条件应满足 E

- A. 遮光、密闭，室温保存
- B. 遮光、密封，室温保存
- C. 遮光、密闭，阴凉处保存
- D. 遮光、严封，阴凉处保存
- E. 遮光、熔封，冷处保存

40. 对乙酰氨基酚再体内会转化生成乙酰亚胺酞，乙酰亚胺酞会耗竭肝内贮存的谷胱甘肽，进而与某些肝脏蛋白的巯基结构形成共价加合物引起肝毒性，根据下列药物结构，可以作为对乙酰氨基酚中毒解救药物的是 (题目不全)

- 大剂量服用本品后，乙酰亚胺酐可耗竭肝内储存的谷胱甘肽，进而与某些肝脏蛋白的巯基结合形成共价加成物，引起肝坏死。
- 误使用过量对乙酰氨基酚，应用含有巯基结构药物如谷胱甘肽或乙酰半胱氨酸解毒。
- 对乙酰氨基酚与抗凝血药同用时，可增强抗凝血作用，应调整抗凝血药的剂量。



二、配伍选择题

(43-45)

- A.羟苯乙酯
- B.明胶
- C.乙烯-醋酸乙烯共聚物
- D.β-环糊精
- E.醋酸纤维素酞酸酯

- 43.属于肠溶性高分子缓释材料的是 (E)
- 44.属于水溶性高分子增调材料的是 (B)
- 45.属于不溶性骨架缓释材料的是 (C)

五、缓控释制剂的常用辅料——药物释放阻滞剂

类型	特点
骨架型	<p>亲水：CMC-Na、MC、HPMC、PVP、卡波姆、海藻酸盐、壳聚糖——遇水膨胀形成凝胶屏障</p> <p>不溶：聚甲基丙烯酸酯（Eudragit RS，Eudragit RL）、EC、聚乙烯、硅橡胶</p> <p>生物溶蚀：动物脂肪、蜂蜡、巴西棕榈蜡、氢化植物油、硬脂醇、单甘油酯</p>
包衣膜型（膜控型）	<p>不溶：EC</p> <p>肠溶：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）、羟丙甲纤维素酞酸酯（HPMCP）</p>
增稠剂	明胶、PVP、CMC、PVA、右旋糖酐



(46--48)

- A.完全激动药
- B.部分激动药

C.竞争性拮抗药

D.非竞争性拮抗药

E.反向激动药

46.对受体有很高的亲和力但内在活性不高($\alpha < 1$)的药物属于 (B)

47.对受体有很高的亲和力和内在活性($\alpha = 1$)的药物属于(A)

48.对受体亲和力高、结合牢固, 缺乏内在活性 ($\alpha = 0$) 的药物属于 (D)

正保医学教育网
www.med66.com

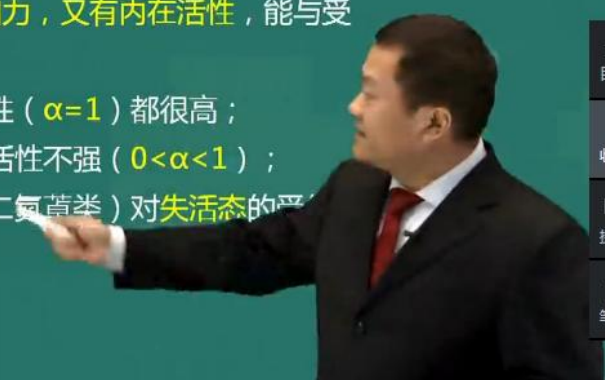
2. 药物分类

(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 ($0 < \alpha < 1$);


反向激动药: 有些药物 (如苯二氮䓬类) 对失活态的受体亲和力大于活化态。



正保医学教育网
www.med66.com

(2) **拮抗药**: 虽具有较强的亲和力, 但缺乏内在活性 ($\alpha = 0$), 故不能产生效应; 但由于占据一定数量受体, 反而可拮抗激动药的作用。

部分拮抗药: 有些药物以拮抗作用为主, 但还有一定的激动受体的效应。



(49~51)

A. 辛伐他汀

B. 氟伐他汀

C. 普伐他汀

D. 西立伐他汀

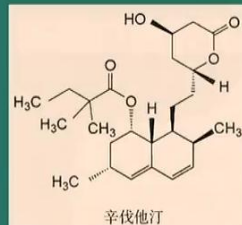
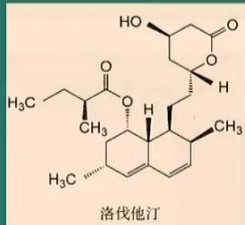
E. 阿托伐他汀

49.含有 3, 5-二羟基戊酸和吡啶环的第一个全合成他汀类调血脂药物是(B)

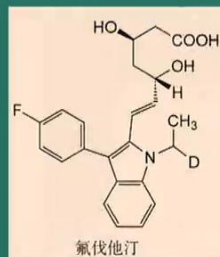
50.含有 3 羟基- δ -内酯环结构片段, 需要在体内水解成 3,5-二羟基戊酸, 才能发挥作用的 HMG-CoA 还原酶抑制剂是(A)

51. 他汀类药物可引起肌痛或横纹肌溶解症的不良反应, 因该不良反应而撤出市场的药物是 D

辛伐他汀：洛伐他汀十氢萘环侧链多一个**甲基取代基**，使其**亲脂性略有提高**。辛伐他汀的活性比洛伐他汀略高。临床上用于治疗高胆固醇血症和混合型高脂血症，也可用于冠心病和缺血性脑卒中的防治。



氟伐他汀：第一个通过全合成得到的他汀类药物，吡啶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。



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，而西立伐他汀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。



- A. 诱导效应
- B. 首过效应
- C. 抑制效应
- D. 肠肝循环
- E. 生物转化

52. 药物在体内经药物代谢的催化作用，发生结构改变的过程称为 (E)

53. 经胃肠道吸收的药物进入体循环前的降解或灭活的过程称为 (B)


正保医学教育网
www.med66.com

(2) 再次认识首过效应

首过

口服 ✓

尚未吸收进入血液循环之前，在肠黏膜和肝脏被代谢

进入血液循环的原形药量↓

生物利用度↓




- A. K_m, V_m
- B. MRT
- C. K_a
- D. Cl
- E. β

在不同药物动力学模型中，计算血药浓度与时间关系会涉及不同参数

54. 双室模型中，慢配置速度常数是 (E)


55. 非房室分析中，平均滞留时间是 (B)

解析： α 称为分布速度常数或快配置速度常数； β 称为消除速度常数或称为慢配置速度常数


正保医学教育网
www.med66.com

四、非房室模式——统计矩

原理：药物输入机体后，其体内的转运是一个随机过程，具有概率性，C-T曲线可以看成是统计分布曲线



零阶矩	血药浓度-时间曲线下面积	血药浓度随时间变化过程
一阶矩	药物在体内的平均滞留时间 (MRT)	药物在体内滞留情况
二阶矩	平均滞留时间的方差 (VRT)	药物在体内滞留时间的变异程度

[56-57]

- A. 经皮给药
- B. 直肠给药
- C. 吸入给药
- D. 口腔黏膜给药
- E. 静脉给药

56. 一次给药作用持续时间相对较长的给药途径是(A)

57. 生物利用度最高的给药途径是 (E)

正保医学教育网
www.med66.com

八、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、库作用



正保医学教育网
www.med66.com

注射给药吸收的相关考点

- ① iv: 无吸收过程, 生物利用度100%
- ② im: 2-5ml, 油溶液、混悬液可长效
- ③ 皮下: 吸收慢, 植入剂、胰岛素
- ④ 皮内: < 0.2ml, 吸收差, 诊断、过敏试验
- ⑤ 动脉: 诊断、治疗, 药物→靶向
- ⑥ 水溶液 > 水混悬液 > 油溶液 > O/W > W/O > 油混悬液



[58-59]

- A. 含片
- B. 普通片
- C. 泡腾片
- D. 肠溶片
- E. 薄膜衣片

58. 《中国药典》规定前解时限为 5 分钟的剂型是(C)

59. 《中国药典》规定崩解时限为 30 分钟的剂型是(E)

3. 片剂的质量要求

质检项目

①外观检查：色泽均匀、外觀光潔

②硬度与脆碎度

③重量差异

④时限问题：分散/可溶3，舌下/泡腾5，普通15，薄膜衣30，肠溶60

平均片重 (g)	片重差异 (%)
< 0.30	±7.5
≥ 0.30	±5.0



[60-61]

- A.溶血性贫血
- B.系统性红斑狼疮
- C.血管炎
- D.急性肾小管坏死
- E.周围神经炎

60.服用异烟肼，慢乙酰化型患者比快乙酰化型患者更易发生(E)

61.葡萄糖-6 磷酸脱氢酶 (G6-PD) 缺陷患者，服用对乙酰氨基酚易发生 A

【例题】

- A.异烟肼对白种人和黄种人均易引起肝损害
- B.异烟肼对白种人和黄种人均易诱发神经炎
- C.异烟肼对白种人易引起肝损害，对黄种人易诱发神经炎
- D.异烟肼对白种人和黄种人均不易诱发神经炎和引起肝损害
- E.异烟肼对白种人易诱发神经炎，对黄种人易引起肝损害

【答案】E



(65-66)

- A.肾小管分泌
- B.肾小球滤过
- C.肾小管重吸收
- D.胆汁排泄
- E.乳汁排泄

65.属于主动转运的肾排泄过程是(A)

66.可能引起肠肝循环的排泄过程是(D)

第02讲 仿真模拟专题

正保医学教育网
www.med66.com

经典例题

11.随胆汁排出的药物或代谢物，在肠道转运期间重吸收而返回门静脉的现象是

A.零级代谢
B.首过效应
C.被动扩散
D.肾小管重吸收
E.肠肝循环

肝肠

(67-68)

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

67.蛋白质和多肽的吸收具有定的部位特异性，其主要吸收方式是(C)

68.细胞外的 K^+ 及细胞内的 Na^+ 可通过 Na,K^+ ATP 酶逆浓度差跨膜转运，这种过程称为(D)

正保医学教育网
www.med66.com

③药物的跨膜转运方式 | 2017

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	药物
被动转运： 滤过、简单扩散	-	-	-	-	-	大部分药物
载体转运	主动转运	+	+	+	+	VB、生命必需
	易化扩散	+	-	-	+	高极性：核苷
膜动转运： 胞饮、吞噬、胞吐					+	蛋白质、多肽、微粒

随堂练习

- A.主动转运 B.简单扩散
C.易化扩散 D.膜动转运 E.滤过

1.药物借助载体或酶促系统，消耗机体能量，从膜的低浓度向高浓度一侧转运的药物转运方式是

2.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，不消耗能量的药物转运方式是

3.药物扩散速度取决于膜两侧药物的浓度梯度，药物的脂水分配系数及药物在膜内扩散速度的药物转运方式是



(74-76)

- A.酒石酸
B.硫代硫酸钠
C.焦亚硫酸钠
D.依地酸二钠
E.维生素 E

- 74.用于弱酸性药物液体制剂的常用抗氧化剂是(C)
75.用于油性液体制剂的常用抗氧化剂是(E)
76.用于碱性药物液体制剂的常用抗氧化剂是(B)

4.注射剂的附加剂

常用附加剂种类	举例
抗氧化剂	亚硫酸钠、硫代硫酸钠：偏碱 亚硫酸氢钠、焦亚硫酸钠：偏酸
金属离子螯合剂	乙二胺四乙酸二钠 (EDTA · 2Na)
缓冲剂 (调节pH)	醋酸-醋酸钠、枸橼酸钠、酒石酸 钠、乳酸
助悬剂	CMC、明胶、果胶
增溶/润湿/乳化剂	吐温、PVP、卵磷脂、普朗尼克F


(77-79)

- A.继发性反应
B.毒性反应
C.特异质反应
D.变态反应
E.副作用


77.长期应用广谱抗菌药物导致的“二重感染”属于(A)


78.少数病人用药后发生与遗传因素相关(但与药物本身药理作用无关)的有害反应属于(C)

79.服用药剂量过大或体内蓄积过多时发生的危害机体的反应属于(B)

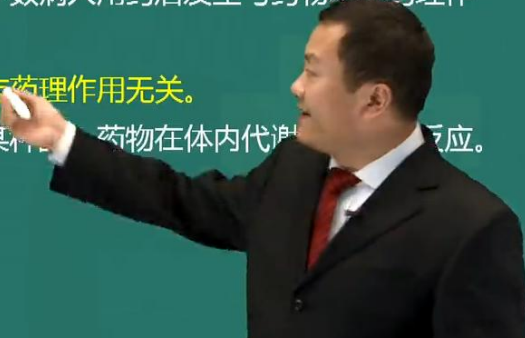
 正保医学教育网
www.med66.com

(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。不发生于首次用药，初次接触时需要诱导期，停止给药反应消失。



 正保医学教育网
www.med66.com

(7) **特异质反应 (特异性反应)**
因先天性遗传异常，少数病人用药后发生与药物本身药理作用无关的有害反应。
该反应和遗传有关，与药理作用无关。
大多是由于机体缺乏某种酶，使药物在体内代谢异常所致。



 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，其反应较为严重。
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脏损害；
基因毒性，如氮芥细胞毒性作用引起的机体损伤。



(83-84)

A.溶出度

B.热原

- C.重量差异
- D.含量均匀度
- E.干燥失重

83.在药品质量标准中，属于药物安全性检查的项目是(B)

84.在药品的质量标准中，属于药物有效性检查的项目是(A)

正保医学教育网
www.med66.com


5.检查

安全性检查：“无菌”、“热原”、“细菌内毒素”；

有效性检查：抗酸药物的“制酸力”、难溶性药物的粒度、含乙炔基药物的“乙炔基”（注意与含量测定相区分）；

均一性检查：制剂的均匀程度。重量差异、含量均匀度；

纯度检查：药物中杂质检查。一般杂质、特殊杂质。



[85-86]

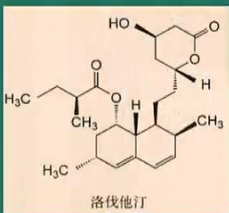
- A.吡啶环
- B.氢化萘环
- C.嘧啶环
- D.吡咯环
- E.吡啶环

85.HMG-CoA 还原酶抑制剂洛伐他汀(结构式)含有的骨架结构是(B)


86.HMG-CoA 还原酶抑制剂瑞舒伐他汀(结构式)含有的骨架结构是(C)

正保医学教育网
www.med66.com

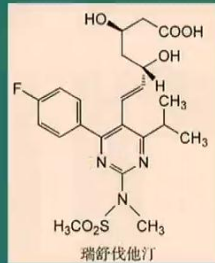
洛伐他汀：天然HMG-CoA还原酶抑制剂，内酯结构，体外无HMG-CoA还原酶抑制作用，水解为3，5-二羟基戊酸才表现出活性。竞争性抑制HMG-CoA还原酶，选择性高，能显著降低LDL水平，并能提高血浆中HDL水平。临床上用于治疗高胆固醇血症和混合型高脂血症，也可用于缺血性脑卒中的防治。



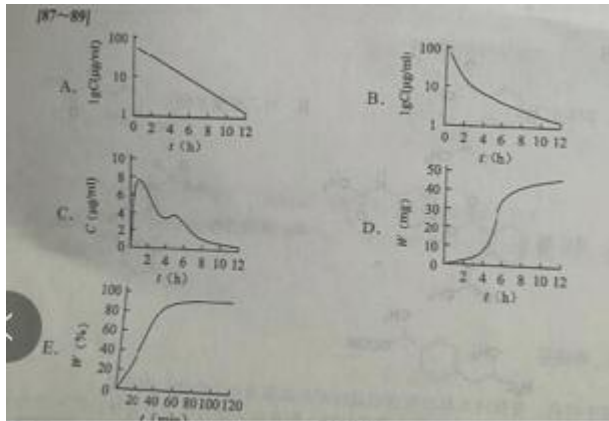
洛伐他汀



瑞舒伐他汀：全合成的他汀类药物，其分子双环部分改成了多取代的嘧啶环。本品适用于经饮食控制和其他非药物治疗仍不能适当控制血脂异常的原发性高胆固醇血症或混合型血脂异常症。

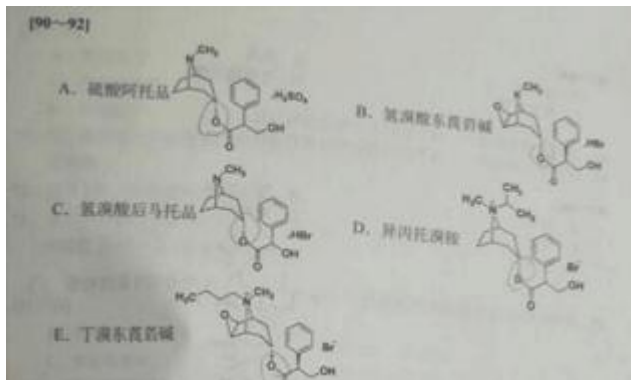


[87-89]



- 87.符合普通片剂溶出规律的溶出曲线表现为 (E)
- 88.具有双室模型特征的某药物静脉注射给药，其血药浓度时间一曲线表现为 (B)
- 89.具有肠-肝循环特征的某药物血管外给药，其血药浓度时间一曲线表现为 (C)

[90-92]



- A.硫酸阿托品
- B.氢溴酸东莨菪碱

C. 氢溴酸后马托品

D. 异丙托溴铵

E. 丁溴东莨菪碱

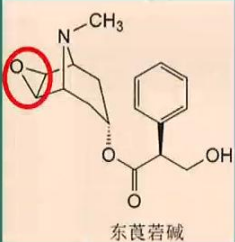
90. 含有氧桥结构，中枢作用较强，用于预防和治疗晕动症的药物是(B)

91. 含有季铵结构，不易进入中枢，用于平喘的药物是(D)


92. 含有 α -羟基苯乙酸酯结构，作用快、持续时间短，用于眼科检查和散瞳的药物是(A)

正保医学教育网 www.med66.com

东莨菪碱的醇部分（亦称东莨菪醇）在6,7位间比阿托品多一个 β -取向的氧桥基团，这使得东莨菪碱的脂溶性增强，易进入中枢神经系统，是莨菪生物碱中中枢作用最强的药物。其酸结构部分为左旋托品酸，因此东莨菪碱具左旋性，遇稀碱液时易发生消旋化。




东莨菪碱



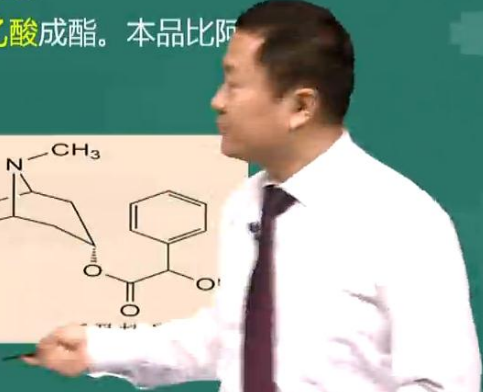
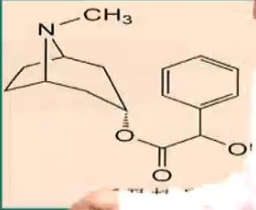
正保医学教育网 www.med66.com

丁溴东莨菪碱：东莨菪碱季铵化产物，季铵难进中枢，降低中枢神经系统作用，为外周抗胆碱药。

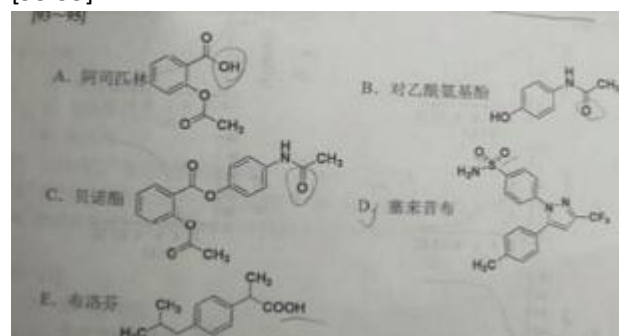
后马托品：由托品醇与羟基苯乙酸成酯。本品比阿托品作用快而弱，持续时间短。



丁溴东莨菪碱



[93-95]




93.属于前药，在体内水解成原药后发挥解热镇痛及抗炎作用的药物是(C)

94.虽然(S)-异构体的活性比(R)-异构体强，但在体内会发生手性转化，以外消旋体上市的药物是 (E)

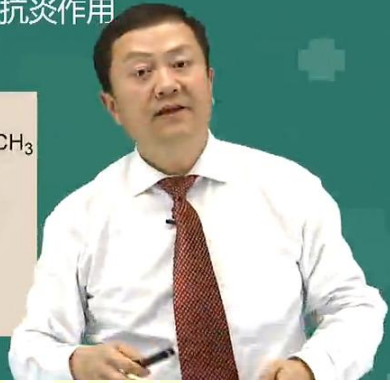
95.选择性抑制 COX-2 的非甾体抗炎药，胃肠道副作用小，但在临床使用中具有潜在心血管事存风险的药物是 (D)

正保医学教育网
www.med66.com

贝诺酯：对乙酰氨基酚 + 阿司匹林，酯前药，胃肠道反应相对小，在体内水解成原药，具有解热、镇痛及抗炎作用

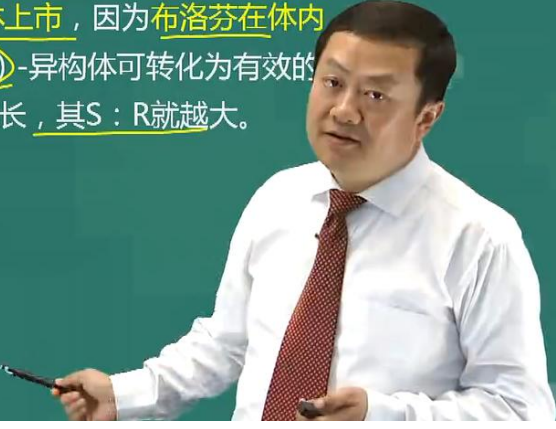



贝诺酯



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。



(2) 昔布类：一类选择性的COX-2抑制剂。

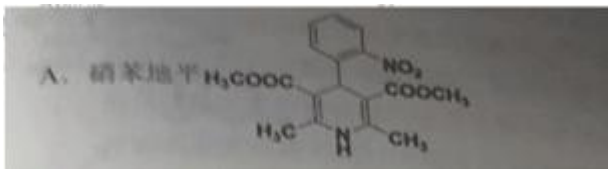
人体内的环氧化酶有两种COX-1和COX-2，二者的生理性质有很大区别。

COX-1是一种结构酶，空间狭窄，存在于胃肠道、肾等多数组织中，通过促进PG及血栓烷A₂的合成，保护胃肠道黏膜、调节肾脏血流和促进血小板聚集等内环境稳定。因此，对COX-1的抑制会导致对胃肠道的副作用。

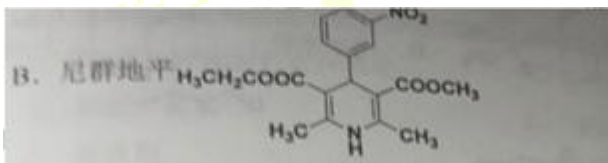


[96-98]

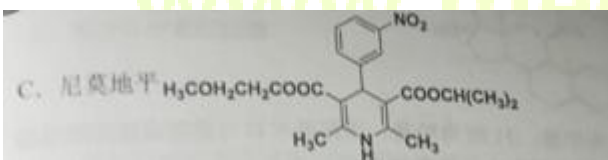
A. 硝苯地平



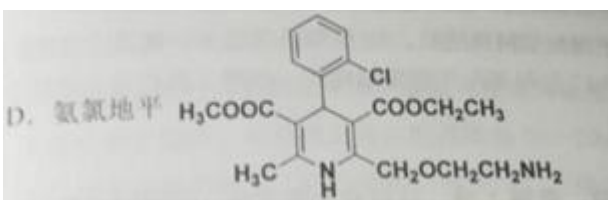
B. 尼群地平



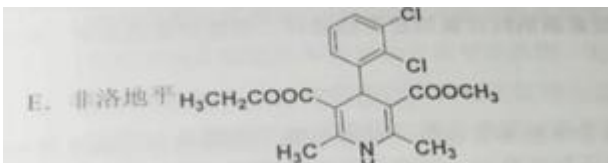
C. 尼莫地平



D. 氨氯地平



E. 非洛地平



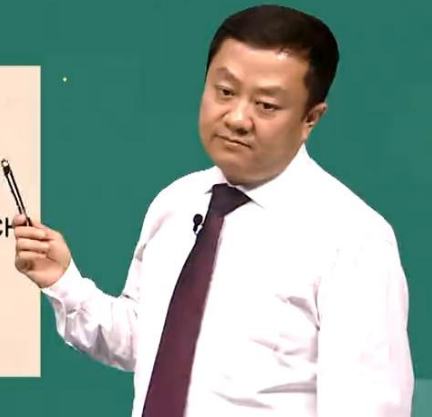
96.1.4-二氢吡啶环的4位为3-硝基苯基，能够通过血脑屏障，选择性扩张脑血管，增加血流量，对局部缺血具有保护作用的药物是 (C)

97.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）

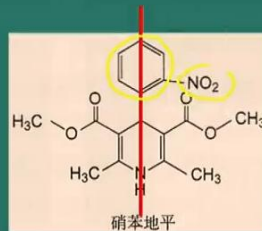
98.1.4-一氢吡啶环的2位为2-氨基乙氧基甲基，外消旋体和左旋体均已用于临床的药物是(D)



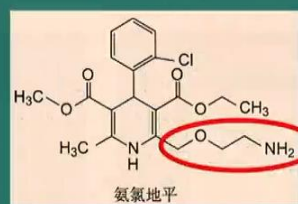
尼莫地平：用于预防和治疗蛛网膜下出血后脑血管痉挛所致的缺血性神经障碍、高血压和偏头痛等。



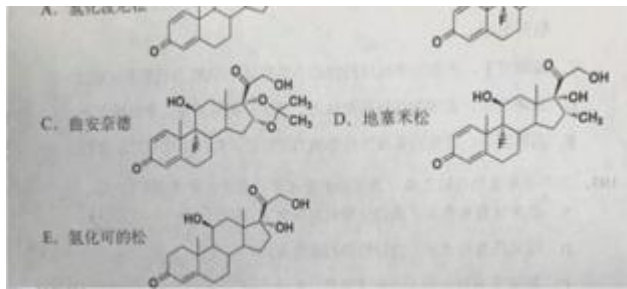
硝苯地平：对称结构的二氢吡啶类药物，口服经胃肠道吸收完全，1~2小时内达到血药浓度最大峰值，有效作用时间持续12小时，经肝脏代谢，硝苯地平的体内代谢物均无活性，80%由肾脏排泄。用于治疗冠心病，缓解心绞痛。硝苯地平适用于各种类型的高血压。



氨氯地平：氨氯地平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，4位碳原子具手性，两个光学异构体，临床用外消旋体和左旋体。本品的生物利用度近100%，其吸收不受食物影响。主要在肝脏代谢。



[99-100]



99. 药物分子中的 16 位为甲基，21 位为羟基，该羟基可以与磷酸或琥珀酸成脂，进一步与碱金属成盐，增加水溶性，该药物为 (E)

100. 药物分子中 9 位氟原子增加了抗炎活性，16 位羟基降低 9 位氟原子带来的钠潴留副作用，将此羟基和 17 位羟基与丙酮生成缩酮，改善了药物动力学性质，该具有缩酮结构的药物是 (C)

三、综合分析选择题

101. 关于苯妥英钠药效学、药动学特征的说法，正确的是 (A)

- A. 随着给药剂量增加，药物消除可能会明显减慢，会引起血药浓度明显增
- B. 苯妥英钠在临床上不属于治疗窗窄的药物，无需监测其血药浓度
- C. 苯妥英钠的安全浓度范围较大，使用时较为安全
- D. 制定苯妥英钠给药方案时，只需要根据半衰期制定给药间隔
- E. 可以根据小剂量时的动力学参数预测高剂量的血药浓度

102. 关于静脉注射苯妥英钠的血药浓度-时间曲线的说法，正确的是 (A)

- A. 低浓度下，表现为线性药物动力学特征：剂量增加，消除半衰期延长
- B. 低浓度下，表现为非线性药物动力学特征：不同剂量的血药浓度时间曲线
- C. 高浓度下，表现为非线性药物动力学特征：AUC 与剂量不成正比
- D. 高浓度下，表现为线性药物动力学特征：剂量增加，半衰期不变
- E. 高浓度下，表现为非线性药物动力学特征：血药浓度与剂量成正比

103. 关于苯妥英钠在较大浓度范围的消除速率的说法，正确的是 B

- A. 用米氏方程表示，消除快慢只与参数 V_m 有关
- B. 用米氏方程表示，消除快慢与参数 K_m 和 V_m 有关
- C. 用米氏方程表示，消除快慢只与参数 K_m 有关
- D. 用零级动力学方程表示，消除快慢体现在消除速率常数 K_0 上
- E. 用一级动力学方程表示，消除快慢体现在消除速率常数 k 上

104. 已知苯妥英钠在肝肾功能正常病人中 $C_{ss} = 12 \mu\text{g/ml}$, $V_d = 10 \text{mg/kg-d}$ ，当每天给药剂量为 3mg/(kgd) ，则稳态血药浓度 $C_{ss} = 5 \mu\text{g/ml}$ ；当每天给药剂量为 6mg/(kgd) ，则稳态血药浓度 $C_{ss} = 18 \mu\text{g/ml}$ 。已知 C. 若希望达到稳态血药浓度 $12 \mu\text{g/ml}$ ，则病人的给药剂量是 (E)

- A. 3.5mg/(kgd)
- B. 40mg/(kgd)
- C. 4.35mg/(kgd)
- D. 5.0mg/(kgd)
- E. 5.6mg/(kgd)

患者，女，78岁，因患高血压病长期口服硝苯地平控释片(规格为30mg)，每日1次，每次1片，血压控制良好。近两日因气温程降，感觉血压明显升高，于18时自查血压达170/10mmHg，决定加服1片药，担心起效慢将其碾碎后吞服，于19时再次自测血压降至110/70mmHg，后续又出现头晕、恶心、心悸、胸闷，随后就医。

105.关于导致患者出现血压明显下降及心悸等症状的原因的说法，正确的是(C)

- A.药品质量缺陷所致
- B.由于控释片破碎使大量的硝苯地平实释
- C.部分缓释片破碎使硝苯地平剂量损失，血药浓度未达有效范围
- D.药品正常使用情况下发生的不良反应
- E.患者来在时辰药理学范畴正确使用药物


正保医学教育
www.med66.com

二、缓控释制剂口服注意事项

- 1.用药次数、剂量：避免过多、过少
- 2.服用方法：非分剂量不要掰开、压碎或咀嚼，可分剂量服用的通常外观有一分割痕
- 3.服药间隔时间：12h、24h






106.关于口服缓释、控释制剂的临床应用与注意事项的说法，错误的是(A)

- A.控释制剂的药物释放速度恒定，偶尔过量服用不会影响血药浓度
- B.缓释制剂用药次数过多或增加给药剂量可导致血药浓度增高
- C.部分缓释制剂的药物释放速度由制剂表面的包衣膜决定
- D.控释制剂的服药间隔时间通常为12小时或24小时
- E.缓释制剂用药次数不够会导致药物的血药浓度过低，达不到应有的疗效


正保医学教育
www.med66.com

一、缓控释制剂的特点

优点

- 1.给药次数↓，顺应性↑，适于长期用药的慢性病患者
- 2.总剂量↓，发挥药物的最佳治疗效果
- 3.血药浓度平稳，峰谷现象↓，毒副作用↓，耐药性↓
- 4.部分剂型，如透皮、植入，im避免首过效应




107.硝苯地平控释片的包衣材料是(C)

- A.卡波姆
- B.聚维酮
- C.醋酸纤维素
- D.羟丙甲纤维素
- E.醋酸纤维素酞酸酯

正保医学教育网
www.med66.com

五、缓控释制剂的常用辅料——药物释放阻滞剂

类型	特点
骨架型	<p>亲水：CMC-Na、MC、HPMC、PVP、卡波姆、海藻酸盐、壳聚糖——遇水膨胀形成凝胶屏障</p> <p>不溶：聚甲基丙烯酸酯（Eudragit RS，Eudragit RL）、EC、聚乙烯、硅橡胶</p> <p>生物溶蚀：动物脂肪、蜂蜡、巴西棕榈蜡、氢化植物油、硬脂醇、单甘油酯</p>
包衣膜型（膜控型）	<p>不溶：EC</p> <p>肠溶：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）、羟丙甲纤维素酞酸酯（HPMCP）</p>
增稠剂	明胶、PVP、CMC、PVA、右旋糖酐

紫杉醇(Taxol)是从美国西海岸的短叶红豆杉的树支中提取得到的具有紫杉烯环结构的二萜类化合物，属有丝分裂抑制剂或纺锤体毒素。多西他赛(Docetaxel)是由 10-去乙酰基紫杉醇进行半合成得到的紫杉烷类抗肿瘤药物，结构上与紫杉醇有两点不同，一是第 10 位碳上的取代基，二是 3 位上的侧链。多西他赛的水溶性比紫杉醇好，毒性较小，抗肿瘤谱更广

108.按药物来源分类，多西他赛属于 E

- A.天然药物
- B.半合成天然药物
- C.合成药物
- D.生物药物
- E.半合成抗生素

正保医学教育网
www.med66.com

多西他赛：由10-去乙酰基紫杉醇进行半合成得到的又一个紫杉烷类抗肿瘤药物，结构上与紫杉醇有两点不同：一是10位碳上的取代基，二是3'位上的侧链。

多西他赛

10-去乙酰基紫杉醇

109. 紫杉醇注射液中通常含有聚氧乙烯蓖麻油，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

110. 根据构效关系判断，属于多西他赛结构的是
图片稍后更新

111. 下列药物在体内发生生物转化反应，属于第 I 相反应的有 ACDE

- A. 苯妥英钠代谢生成羟基苯妥英
- B. 对氨基水杨酸在乙酰辅酶
- C. 卡马西平代谢生成卡马西平
- D. 地西洋经脱甲基和羟基化生成奥沙西洋
- E. 硫喷妥钠经氧化脱硫生成戊巴比妥

正保医学教育网
www.med66.com

一、药物结构与第I相生物转化的规律

代谢规律：总体趋势由极性小/水溶性差，变得极性大/水溶性好，走肾、走水，易于排泄，更安全。 结构的变化：多数药物是增加羟基，和/或减少极性小的基团。

1. 含芳环的药物：氧化代谢，生成酚。

Phenytoin (苯妥英) → Hydroxyphenytoin (羟基苯妥英)
S(-)-Warfarin (S(-)-华法林) → 7-Hydroxywarfarin (7-羟基华法林)

正保医学教育网
www.med66.com

2. 烯烃和炔烃的药物

环氧化-水解反应，二羟基化合物。

Carbamazepine (卡马西平) → Carbamazepine 10,11-epoxide (卡马西平10,11-环氧化物) → 10S,11S-dihydroxycarbamazepine (10S,11S-二羟基卡马西平)

112. 依据检验目的不同，整理药品检验可分为不同的类别。关于药品检验的说法中正确的有

- A.委托检验系药品生产企业委托具有相应检测能力并通过资质认定或认可的检验机构对本企业无法完成的检验项目进行检验
- B.抽查检验系国家依法对生产、经营和使用的药品按照国家药品标准进行抽查检验
- C.出厂检验系药品检验机构对药品生产企业要放行出厂的产品进行的质量检验
- D.复核检验系对抽验结果有异议时，由药品检验仲裁机构对有异议的药品进行再次抽检
- E.进口药品检验系对于未获得《进口药品注册证》或批件的进口药品进行的检验

113.患儿，男，2周岁，因普通感冒引起高热，哭闹不止，医师处方给予布洛芬口服混悬剂。相比固体剂型，在此病例中选用的布洛芬口服混悬剂的优势在于 **ACDE**

- A.小儿服用混悬剂更方便
- B.含量高，易于稀释，过量使用也不会造成严重的毒副作用
- C.混悬剂因颗粒分布均匀，对胃肠道刺激小
- D.适宜于分剂量给药
- E.含有**山梨糖**，味甜，顺应性高



正保医学教育
www.med66.com

五、混悬剂

1. 特点

- ①难溶性药物制成液体制剂
- ②服用方便
- ③掩盖药物的不良气味
- ④长效



114.盐酸异丙肾上腺素气雾剂处方如下

盐酸异丙肾上腺素 25g

维生素 C 1.0g

乙醇 296.5g

二氧二氟甲烷适量

共制成 1000g

于该处方中各辅料所起作用的说法，正确的有 **CD**

- A.乙醇是乳化剂
- B.维生素**
- C.二氧二氟甲烷是抛射剂
- D.乙醇是潜溶剂
- E.二氧二氟甲烷是金属离子络合剂

8. 实例：盐酸异丙肾上腺素气雾剂——注意附加剂

2017

二氯二氟甲烷 (F12)	抛射剂
乙醇	潜溶剂
维生素C	抗氧化剂



115. 与碳酸钙、氧化镁等制剂同服可形成络合物，影响其吸收的药物有 DE

- A. 卡那霉素
- B. 左氧氟沙星
- C. 红霉素
- D. 美他环素
- E. 多西环素

解析：含二价或三价金属离子（钙、镁、铁、铋、铝）的化合物能与四环素类抗生素形成难溶络合物，使抗生素在胃肠道的吸收受阻，在体内达不到有效抗菌浓度。例如，口服四环素、土霉素、美他环素、多西环素（强力霉素）时，如同服硫酸亚铁，会降低上述四种抗生素的血药浓度。因此，服用四环素类抗生素时，不宜与铁制剂或含钙、镁、铝离子的抗酸药如碳酸钙、氧化镁、氢氧化铝凝胶等同服。

www.med66.com

116. 可作为咀嚼片的填充剂和黏合剂的辅料有 BCE

- A. 丙烯酸树脂
- B. 甘露醇
- C. 蔗糖
- D. 山梨醇
- E. 乳糖

① 稀释剂——填充成型

- 淀粉：可压性差
 - 糊精：黏性高
 - 蔗糖：易引湿
 - 乳糖：优良、贵
- 配合使用
- 预胶化淀粉（可压性淀粉）
 - 微晶纤维素（MCC）：干黏合剂
 - 无机盐：磷酸氢钙、硫酸钙、碳酸钙
 - 甘露醇：贵，咀嚼



黏合剂

- 淀粉浆（8%~15%）
- 甲基纤维素（MC）
- 羟丙甲纤维素（HPMC）
- 羟丙纤维素（HPC）（低取代变崩解）
- 羧甲基纤维素钠（CMC-Na）
- 乙基纤维素（EC）——缓控
- 聚维酮（PVP）
- 聚乙二醇（PEG）
- 明胶：口含片



117. 由于影响药物代谢而产生的药物相互作用有 BCE

- A. 举巴比安使华法林的抗凝血作用减弱
- B. 异烟肼与卡马西平合用，肝毒性加重
- C. 保泰松使华法林的抗凝在作用增强
- D. 诺氧沙星与硫酸亚铁同时服用，抗菌作用减弱
- E. 酮康唑与特非那定合用导致心律失常

(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，黄指灰黄霉素，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



(三) 影响药物的代谢

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：西安两三楼硝烟，派在红梅倚坐。胺碘酮、丙米嗪、哌醋甲酯、甲硝唑、红霉素、咪康唑、氯丙嗪、氯霉素、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楼硝烟，派士兵在城墙的树下倚坐。西指西咪替丁，安指胺碘酮，两楼指氯霉素和氯丙嗪，三指三环类抗抑郁药，硝指甲硝唑，烟指异烟肼；派指哌醋甲酯，兵指丙米嗪，在指吩噻嗪类药物，红梅指红霉素，倚指咪康唑。



118. 同种药物的 A、B 两种制剂，口服相同剂量，具有相同的 AUC。其中制剂 A 达峰时间 0.5h，峰浓度为 116 ug/ml，制剂 B 达峰时间 3h，峰浓度 73ug/ml。关于 A、B 两种制剂的说法，正确的有

- A. 两种制剂吸收速度不同，但利用程度相当
- B. A 制剂相对 B 制剂的相对生物利用度为 100%
- C. B 制剂相对 A 制剂的绝对生物利用度为 100%
- D. 两种制剂具有生物等效性
- E. 两种制剂具有治疗等效性

119. 表观分布容积 V 反映了药物在体内的分布情况。地高辛的表观分布容积 V 通常高达 500L 左右，远大于人的体液的总体积，可能的原因有 AB

- A. 药物与组织大量结合，而与血浆蛋白结合较少
- B. 药物全部分布在血液中
- C. 药物与组织的亲和性强，组织对药物的摄取多
- D. 药物与组织几乎不发生任何结合
- E. 药物与血浆蛋白大量结合，面与组织结合较少

随堂
练习

A: 地高辛的表观分布容积为500L, 远大于人体体液容积, 原因可能是

- A. 药物全部分布在血液 ~~X~~
- B. 药物全部与血浆蛋白结合
- C. 大部分与血浆蛋白结合, 与组织蛋白结合少 ~~X~~
- D. 大部分与组织蛋白结合, 药物主要分布在组织
- E. 药物在组织和血浆分布



缺 120 题

医学教育网

www.med66.com