

《药学专业知识（一）》高频考点

知识点 1: 药物的名称

药物的名称包括药物的通用名、化学名和商品名。

(1) 通用名: 也称为国际非专利药品名称 (INN)。通常是指有活性的药物物质, 而不是最终的药品, 一个药物只有一个通用名 (唯一性)。药典使用药品通用名。

(2) 化学名: 根据药物的化学结构式, 参照国际纯化学和应用化学会 (IUPAC) 和中国化学会的有关原则命名, 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。

例如:

通用名	化学名	母核结构
氨苄西林	6-[D- (-) 2-氨基-本乙酰氨基]青霉烷酸 三水合物	β 内酰胺环
盐酸环丙沙星	1-环丙基-6-氟-1,4-二氢-4-氧代-7-(1-哌嗪基)-3-喹啉羧酸盐一水合物	喹啉酮环
地西洋	1-甲基-5-苯基-7-氯-1,3-二氢-2H-1,4-苯并二氮杂 (2,1-卓) -2-酮	苯并二氮 (2,1-卓) 环
尼群地平	2,6-二甲基-4-(3-硝苯基)-1,4-二氢-3,5-吡啶二甲酸甲乙酯	1,4-二氢吡啶环

(3) 商品名 (品牌名): 通常是针对药物的最终产品, 剂型和剂量确定, 制药企业拥有专利权, 不得冒用、顶替。选用的商品名不能暗示疗效和用途, 最

好简单顺口。

知识点 2: 药物制剂的稳定性变化

稳定性变化	具体变化方式	具体药物
化学不稳定	水解	酯类: 盐酸普鲁卡因
		酰胺类药物: 青霉素、头孢、氯霉素、巴比妥类
	氧化	酚类: 肾上腺素、左旋多巴、吗啡、水杨酸钠
		烯醇类: 维生素 C
	异构化	肾上腺素、毛果芸香碱
	聚合	氨苄西林、塞替派
脱羧	对氨基水杨酸钠	
物理不稳定	混悬剂药物颗粒结块、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	
生物不稳定	微生物污染引起药物酶败分解变质	

知识点 3: 影响药物制剂稳定性的因素及稳定化方法

1. 影响药物制剂稳定性的因素

影响因素	具体内容
处方因素	pH、溶剂、广义酸碱催化、离子强度、表面活性剂、基质或赋形剂
外界因素	温度、光线、空气(氧)、金属离子、湿度和水分、包装材料



2.提高药物制剂稳定化方法

稳定化方法	具体内容	
控制温度	热特别敏感的药物, 如某些抗生素、生物制品, 则采用无菌操作及冷冻干燥	
调节 pH	固体制剂和半固体制剂中的药物若对 pH 较敏感, 在选择赋形剂或基质时应注意	
改变溶剂	在水中很不稳定的药物, 可采用乙醇、丙二醇、甘油等极性溶剂, 或加入适量非水溶剂, 延缓水解	
控制水分及湿度	采用干法制粒、流化喷雾制粒代替湿法制粒, 可提高易水解药物片剂的稳定性	
遮光	光敏感的药物, 采用棕色玻璃瓶包装或在包装容器内衬垫黑纸等	
驱逐氧气	通入惰性气体, 如二氧化碳或氮气	
加入抗氧化剂或金属离子络合	水溶性抗氧化剂	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
	油溶性抗氧化剂	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	

稳定化的其他方法	改进剂型或生产工艺	①在水溶液中不稳定的药物, 制成固体制剂 (青霉素: 制成无菌粉针; 硝酸甘油制成膜剂); ②制成微囊或包合物 (维生素 A、维生素 C、硫酸亚铁制成微囊; 盐酸异丙嗪、苯佐卡因制成包合物); ③采用直接压片或包衣工艺 (遇湿热不稳定的药物)
	制备稳定的衍生物	将有效成分制成前体药物
	加入干燥剂及改善包装	如用 3% 二氧化硅作干燥剂可提高阿司匹林的稳定性

知识点 4: 常用抗氧化剂或金属离子络合剂

抗氧化剂/金属离子络合剂	名称
水溶性抗氧化剂	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
油溶性抗氧化剂	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

知识点 5: 药品有效期



药品有效期考点	内容
概念	对于药物降解, 常用降解 10%所需的时间, 称为十分之一衰期, 记作 $t_{0.9}$
公式	$t_{0.9} = 0.1054/k$
有效期标注原则	若标注到日, 应当为起算日期对应年月日的前一天
	若标注到月, 应当为起算月份对应年月的前一月
标注格式	①有效期至 XXXX 年 XX 月或者有效期至 XXXX 年 XX 月 XX 日 ②有效期至 XXXX.XX.或者有效期至 XXXX/XX/XX

知识点 6: 药品标准体系

《中国药典》分部介绍

分部	收载内容
《中国药典》一部	中药
《中国药典》二部	化学药品 (第一部分收载化学药品、抗生素、生化药品及各类药物制剂; 第二部分收载放射性药物制剂)
《中国药典》三部	生物制品
《中国药典》四部	通则和药用辅料

《中国药典》的主要结构与内容

主要结构	作用	内容
凡例	对共性问题的统一规定	①总则; ②正文; ③通则; ④名称与编排; ⑤项目与要求; ⑥检验方法和限度; ⑦标准



		品与对照品; ⑧计量; ⑨精确度; ⑩试药、试液、指示剂; ⑪动物试验; ⑫说明书、包装和标签
正文	标准的主体内容	①品名; ②有机药物的结构式; ③分子式; ④分子量; ⑤来源或有机药物的化学名称; ⑥含量或效价限度; ⑦处方; ⑧制法; ⑨性状; ⑩鉴别; ⑪检查: ⑫含量测定; ⑬类别; ⑭规格; ⑮贮藏; ⑯杂质信息
通则	对药品质量指标的检测方法或原则的统规定	①制剂通则与其他通则; ②通用分析与检测方法; ③指导原则

国际药品标准

国际药品标准	缩写
《美国药典》	USP
《美国国家处方集》	NF
《欧洲药典》	Ph.Eur.或 EP
《日本药典》	JP

知识点 7: 常用的鉴别方法

鉴别方法	内容
化学鉴别法	①盐酸麻黄碱在碱性条件下与硫酸铜形成蓝色配位化合物; ②吗啡与甲醛-硫酸试液反应显紫堇色;

	<p>③ 氯化可的松在乙醇溶液中与硫酸苯肼加热显黄色;</p> <p>④ 盐酸四环素与硫酸反应显深紫色, 加入三氯化铁溶液变为红棕色;</p> <p>⑤ 维生素 B₁ 在碱性条件下与铁氰化钾反应生成具有蓝色荧光的硫色素;</p> <p>⑥ 维生素 C 可使二氯靛酚钠褪色;</p> <p>⑦ 肾上腺素与三氯化铁试液反应则显翠绿色;</p> <p>⑧ 葡萄糖溶液遇碱性酒石酸铜试液, 即生成红色氧化亚铜 (Cu₂O) 沉淀;</p> <p>⑨ 尼可刹米与氢氧化钠试液加热, 即发生二乙胺臭气, 能使湿润的红色石蕊试纸变蓝色</p>
<p>光谱鉴别法</p>	<p>紫外 - 可见分光光度法</p> <p>① 盐酸氯丙嗪用盐酸溶液 (9→1000) 制成每 1ml 含 5μg 的溶液, 在 254nm 与 306nm 的波长处有最大吸收, 在 254nm 的波长处吸光度约为 0.4;</p> <p>② 布洛芬的 0.4% 氢氧化钠溶液, 在 265nm 与 273nm 的波长处有最大吸收, 在 245nm 与 271nm 的波长处有最小吸收, 在 259nm 的波长处有一肩峰;</p> <p>③ 硝西泮的无水乙醇溶液, 在 220nm、260nm 与 310nm 的波长处有最大吸收, 260nm 与 310nm 波长处的吸光度的比值应为 1.45 ~</p>



		1.65
	红外分光光度法	化合物的红外吸收光谱具有人指纹一样的特征专属性, 几乎没有两个化合物具有相同的红外光谱
色谱鉴别法	优点	具有高灵敏度、高选择性、高效能、应用范围广等优点, 是分析混合物的最有效手段
	鉴别	高效液相色谱法 (HPLC) ; 保留时间 (t_R) 作为鉴别依据
生物学方法	利用微生物或实验动物进行鉴别, 主要用于抗生素和生化药品的鉴别	

知识点 8: 贮藏条件的定义

贮藏条件	定义	药物举例
避光	避免日光直射	-
遮光	用不透光的容器包装, 例如棕色容器或黑纸包裹的无色透明、半透明容器	二氢吡啶类、维生素 A、盐酸异丙嗪、异烟肼、盐酸四环素
密闭	用可防止尘土及异物进入的容器包装	-
密封	用可防止风化、吸潮、挥发或异物进入的容器包装	乙琥胺、阿司匹林、水合氯醛、氨茶碱
熔封或严封	用可防止空气、水分的侵入与微生物污染的容器或适宜的	-

材料包装		
阴凉处	贮藏处温度不超过 20℃	锭剂、丙酸倍氯米松乳膏、如头孢地尼
凉暗处	贮藏处避光并温度不超过 20℃	丙酸倍氯米松吸入气雾剂、阿法骨化醇软胶囊、头孢他啶
冷处	贮藏处温度为 2~10℃	阿法骨化醇、门冬酰胺酶
	《中国药典》规定于 2℃~8℃保存和运输	重组人胰岛素、重组人生长激素
常温	10~30℃	-

知识点 9: 药物与生物大分子的结合形式

键合类型	举例
共价键 (不可逆)	烷化剂类抗肿瘤药、β内酰胺类抗生素药物、拉唑类抗溃疡药物
非共价键 (可逆)	离子型 去甲肾上腺素结构中的氨基在体内质子化成铵盐后, 与β ₂ 肾上腺素受体形成离子键作用; 拟胆碱药物氯贝胆碱通过与M胆碱受体相结合产生激动作用
	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 羰基化合物乙酰胆碱和受体的作用

电荷转移复合物	抗疟药氯喹与疟原虫的 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
范德华力	非极性分子中的暂时不对称电荷分布
金属离子络合物	抗肿瘤药: 铂金属络合物; 金属中毒解毒剂: 二巯基丙醇

知识点 10: 生物药剂学分类

分类	特征	归属	体内吸收决定因素	代表药
I	高水溶性、高渗透性	两亲性	溶出度	普萘洛尔、马来酸依那普利、盐酸地尔硫草
II	低水溶性、高渗透性	亲脂性	溶解度	双氯芬酸、卡马西平、吡罗昔康
III	高水溶性、低渗透性	水溶性	渗透率	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

独家记忆:

脂水分配系数, 脂前水后, 所以是脂相除以水相 (脂上水下); P 值越大, 脂相中浓度相对越高, 脂溶性越高。水溶性代表药物水溶性 (药物先要溶解于以

水为主体的体液中)；渗透性代表药物脂溶性（药物转运要能穿透若干层以磷脂双分子层为主的细胞膜）；哪种性质差，就是限速步骤，体内吸收的快慢就取决于该性质。生物药剂学分类系统的排序先是两亲，再是单一亲脂、单一亲水（脂水分配系数，脂先水后），最后是疏水（两不亲，不光不亲脂，还疏水）。

知识点 11：药物的酸碱性、解离度和 pKa 对药效的影响

有机药物多数为弱酸或弱碱，体内不同部位 pH 不同，影响药物的解离，解离型和非解离型药物的比例关系如下：

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

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

举例：对于酸性药物， $pK_a > \text{pH}$ ，非解离型（分子型）比例高； $pK_a = \text{pH}$ ，解离型和未解离型各占一半。给出 pH 和 pK_a 值，应用上述公式计算解离型和非解离型药物浓度的比值。

药物的吸收情况

分类	吸收特点	举例
弱酸性药物	胃液中 (pH 低) 呈非解离型， 易吸收	水杨酸、巴比妥类
弱碱性药物	胃液中 (pH 低) 呈解离型，难 吸收	奎宁、麻黄碱、氨苯砜、 地西洋
	肠液中 (pH 高) 呈非解离型， 易吸收	
碱性极弱药	胃中解离少，易吸收	咖啡因和茶碱

物		
强碱性药物	胃肠中多离子化, 吸收差	胍乙啶
完全离子化	胃肠中多离子化, 吸收差	季铵、磺酸

独家记忆: 酸酸碱碱促吸收, 酸碱尖酸促排泄。

知识点 12: 药物结构中的取代基对生物活性的影响

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 (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-水交界处定向排布, 易通过生物膜	硫醚类可氧化成亚砷或砷, 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,	活性: 伯胺 > 仲胺 > 叔胺

	显碱性, 易与受体形成氢键	(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

知识点 13: 药物的立体结构对药物作用的影响

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

知识点 14: 药物结构与第 I 相生物转化规律

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



物		
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、引哚美辛
醇类	氧化成羰基化合物	伯醇 → 醛 → 酸 仲醇 → 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

知识点 15: 抗抑郁药

分类		考点
去甲肾上腺素 (NE)	代表药物	丙米嗪、氯米帕明、地昔帕明、阿



重摄取抑制剂		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再摄取抑制剂	代表药物	度洛西汀、文拉法辛、米氮平
<p>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药包括:</p> <p>丙米嗪——地西帕明</p> <p>氯米帕明——去甲氯米帕明</p> <p>阿米替林——去甲替林</p> <p>氟西汀——去甲氟西汀</p>		



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

知识点 16: 镇痛药

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
合成镇痛药	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
	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
其他合成镇痛药	美沙酮	R 旋体镇痛作用强, S 旋体作用弱, 药用其外消旋体
	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

知识点 17: 组胺 H₁ 受体阻断剂抗过敏药



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啉的苯环上引入被原子, 并将碱性氮甲基部分换以中性的氮甲酸乙酯得到; 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

知识点 18: 非甾体抗炎药

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, 体内代谢产生甲磺基化合物产生活性, 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)
--	---

知识点 19: 抗溃疡药

分类	考点
组胺 H ₂ 受体 阻断剂 (**替 丁)	<p>雷尼替丁、西咪替丁、法莫替丁、尼扎替丁、罗沙替丁</p> <p>①H₂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</p>
质子泵抑制剂 (**拉唑)	<p>奥美拉唑、埃索美拉唑、兰索拉唑、泮托拉唑、雷贝拉唑</p> <p>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</p>



正保医学教育网 www.med66.com	胞色素酶代谢
--------------------------	--------

知识点 20: 调节血脂药

分类	药物	考点
羟甲戊二	构效关系	构效基团: 3,5-二羟基羧酸
酰辅酶 A (HMG- CoA) 还	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
原酶抑制 剂	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

知识点 21: 抗心绞痛药

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°C 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	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;



吡啶类		该类药物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

知识点 22: 口服降血糖药

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

知识点 23: 调节骨代谢与形成药物

分类	药物	考点
双磷酸盐类	依替磷酸二钠	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
	阿伦磷酸钠	为氨基双磷酸盐, 其抗骨吸收作用较依替磷酸钠强, 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 1 α -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

		<p>醇;</p> <p>阿法骨化醇稳定性较好,在体内进一步转化为骨化三醇</p>
--	--	---

知识点 24: β -内酰胺类抗菌药物

药物	考点
青霉素	<p>含有四元的β-内酰胺环与五元的四氢噻唑环并合的结构, 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;</p> <p>临床上常用青霉素钠或青霉素钾, 不耐酸 (不能口服)、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并合得到, 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>
<p>头孢氨苄 (第一代)</p>	<p>侧链为苯甘氨酸</p>
<p>头孢唑林 (第一代)</p>	<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>
<p>头孢克洛 (第二代)</p>	<p>头孢氨苄的 C-3 位甲基以卤素替代得到;</p> <p>可口服</p>
<p>头孢呋辛 (第二代)</p>	<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,</p> <p>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>
<p>头孢哌酮 (第三代)</p>	<p>在头孢羟氨苄的 C-7 位氨基上引入乙基哌嗪二酮侧链, 抗菌活性增强, 对铜绿假单胞菌的作用较强;</p> <p>C-3 位甲基上引入硫代甲基四氮唑杂环</p>
<p>头孢曲松 (第三代)</p>	<p>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);</p> <p>钠盐的形式注射给药</p>
<p>头孢匹罗 (第四代)</p>	<p>含有正电荷的季铵基团, 穿透力强, 对β-内酰胺酶稳定,</p> <p>对大多数细菌有高度活性</p>

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

知识点 25: 核苷类抗病毒药

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衍生物
	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-脱氧胞苷脱氨酶有拮抗作用
	恩曲他滨	拉米夫定胞嘧啶碱基的5位以氟取代得到

知识点 26: 靶向抗肿瘤药

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

知识点 27: 口服固体制剂的常用辅料

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	<p>骨架型释放调节剂</p> <p>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)</p> <p>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</p> <p>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</p>

	酯
	包衣膜型
释放调节剂	不溶性高分子材料: 不溶性骨架材料 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

知识点 28: 口服固体制剂——薄膜包衣材料

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)	蔗糖、氯化钠、表面活性剂和 PEG

调节剂)	
遮光剂	二氧化钛
着色剂	柠檬黄、胭脂红

知识点 29: 口服片剂的特点

优点	<ul style="list-style-type: none"> 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	<ul style="list-style-type: none"> 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

知识点 30: 片剂制备中的常见问题及原因

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

知识点 31: 口服固体制剂重量/装量差异

剂型	平均片重/装量	差异限度
片剂 (重量)	< 0.30g	±7.5%
	≥0.30g	±5.0%
胶囊剂 (装量)	< 0.30g	±10%
	≥0.30g	±7.5% (中药±10%)

知识点 32: 口服液体制剂的特点

优点	<p>①药物以分子或微粒状态分散在介质中, 分散程度高, 吸收快, 作用较迅速;</p> <p>②给药途径广泛, 可以内服、外用;</p> <p>③易于分剂量, 使用方便, 尤其适用于婴幼儿和老年患者;</p> <p>④药物分散于溶剂中, 能减少某些药物的刺激性, 通过调节液体制剂的浓度, 避免固体药物(溴化物、碘化物等)口服后由于局部浓度过高引起胃肠道刺激作用</p>
缺点	<p>①药物分散度较大, 易引起药物的化学降解, 从而导致失效;</p> <p>②液体制剂体积较大, 携带运输不方便;</p> <p>③非均相液体制剂的药物分散度大, 分散粒子具有很大的比表面积, 易产生一系列物理稳定性问题;</p> <p>④水性液体制剂容易霉变, 需加入防腐剂</p>

知识点 33: 口服液体制剂的附加剂

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。

知识点 34：表面活性剂的分类

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(苜泽)、聚氧乙烯-聚氧丙烯共聚物(泊洛沙姆、普朗尼克)

知识点 35: 混悬剂的附加剂

(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。

知识点 36: 注射剂的特点

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

知识点 37: 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、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	聚氧乙烯蓖麻油、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

知识点 38: 热原的性质和除去方法

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

知识点 39: 脂质体质量要求

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
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

知识点 40: 微囊的囊材

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 不受 pH 影响: 聚酰胺、硅橡胶;

解	可在一定 pH 条件下溶解: 聚丙烯酸树脂、聚乙烯醇
---	----------------------------

知识点 41: 乳膏剂的基质和附加剂

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

知识点 42: 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); 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

知识点 43: 眼用制剂的附加剂

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、抗氧化剂

知识点 44: 栓剂

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	-

知识点 45: 药动学参数定义、公式及临床意义

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
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

知识点 46: 食物对药物吸收的影响

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

知识点 47: 常见的药物代谢酶抑制剂

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

知识点 48: 药物的不良反应

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。

	<p>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;</p> <p>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。</p>
<p>停药反应</p>	<p>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。</p> <p>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;</p> <p>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</p>
<p>继发反应</p>	<p>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</p> <p>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</p>
<p>变态反应</p>	<p>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</p>
<p>特异质反应</p>	<p>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</p> <p>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;</p>

	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”

知识点 49: 药理学基本概念

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(效能)	在一定范围内, 增加药物剂量或浓度, 所能达到的最大效应是效能。
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。

知识点 50: 受体的特性

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