

《药专业知识一》

模拟试题

医学教育网 著

《药学专业知识一》模拟试题

2022：药物制剂稳定性变化

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

其中，水解和氧化是药物降解的两个主要途径。

1.（单选题）容易发生氧化降解反应的药物是

- A. 维生素 C
- B. 普鲁卡因
- C. 青霉素
- D. 氯霉素
- E. 氨苄西林

【正确答案】A

【答案解析】普鲁卡因，青霉素和氯霉素容易发生水解降解反应，而氨苄西林容易发生聚合降解和水解反应，所以此题选 A。

2.（单选题）三种现象均属于药物制剂物理稳定性变化的是

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

【正确答案】A

【答案解析】乳剂分层、混悬剂结晶生长、片剂溶出速度改变均属于药物制剂物理稳定性变化。

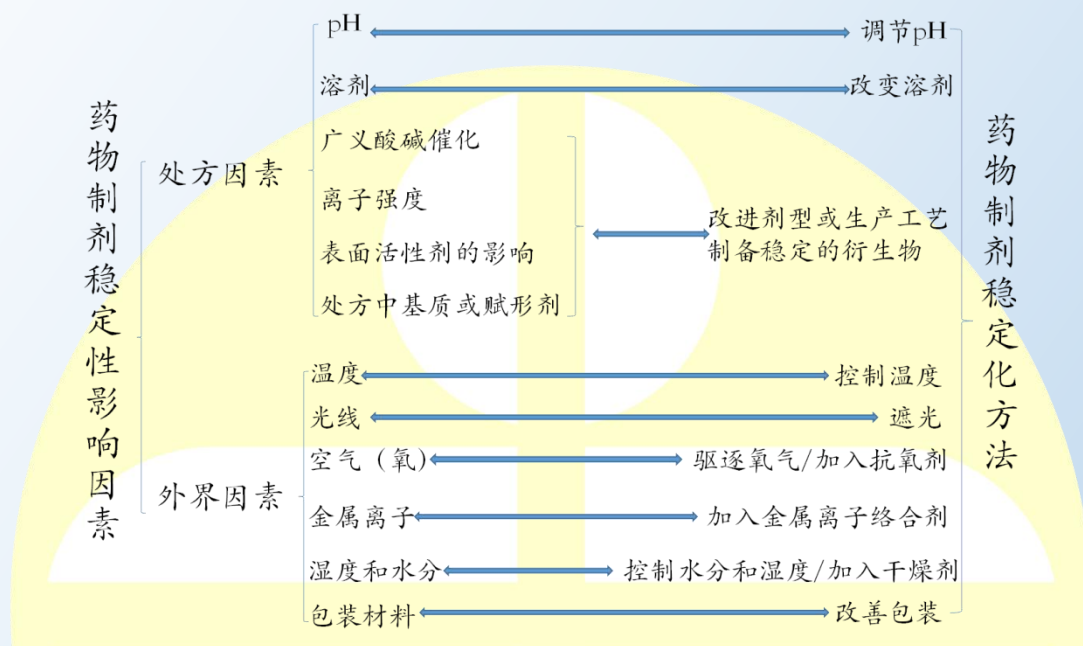
3. (单选题) 易发生水解的药物为

- A. 酚类药物
- B. 烯醇类药物
- C. 杂环类药物
- D. 磺胺类药物
- E. 酯类与内酯类药物

【正确答案】 E

【答案解析】 酯类和酰胺易水解。

2022: 影响药物制剂稳定性的因素及药物制剂稳定化方法



1. (单选题) 影响药物制剂稳定性的处方因素不包括

- A. pH
- B. 广义酸碱催化
- C. 光线
- D. 溶剂
- E. 离子强度

【正确答案】 C

【答案解析】 光线属于环境因素。

2. (单选题) 下列药物制剂稳定化的方法中不属于改进剂型与生产工艺的是

- A. 制成固体制剂
- B. 制成微囊
- C. 直接压片
- D. 加入干燥剂
- E. 制成包合物

【正确答案】 D

【答案解析】 D选项涉及不到剂型和工艺的改进不属于改进剂型的稳定性方法。

3. (多选题) 影响药物制剂稳定性的环境因素不包括

- A. 温度
- B. 溶剂
- C. pH值
- D. 表面活性剂
- E. 辅料

【正确答案】 BCDE

【答案解析】 影响药物制剂稳定性的环境因素包括：温度、光线、氧气、金属离子、湿度和水分、包装材料。

2022：体内药物检测

(一) 生物样品的种类

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

1. 血样的分类和特点

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

这里注意血清是不加抗凝剂的！

2. 尿液：主要用于药物尿液累积排泄量、尿清除率或生物利用度的研究。

（二）生物样品的测定法

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

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

1.（单选题）灵敏度最高的分析方法是

- A. 放射免疫法
- B. 荧光免疫法
- C. 酶免疫法
- D. 电化学免疫法
- E. 发光免疫法

【正确答案】A

【答案解析】放射免疫法的灵敏度最高，是在生物样品中加入理化性质、免疫学特性与待测物相同的经放射性同位素标记的待测物。将该待测物与特异性抗体结合，用测量放射性的方法，测量并计算结合部分与游离部分的比值，从而确定待测物的量。

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

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

【正确答案】A

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

3.（单选题）临床治疗药物检测的前提是体内药物浓度的准确测定，在体内药物浓度测定中，如果抗凝剂、防腐剂可能与被测的药物发生作用，并对药物浓度的测定产生干扰，检测样品宜选择

- A. 汗液
- B. 尿液

- C. 全血
- D. 血浆
- E. 血清

【正确答案】E

【答案解析】本题考点是体内药物浓度测定宜选用的样本。本题说明“抗凝剂、防腐剂可能与被测的药物发生作用，并对药物浓度的测定产生干扰”，因此不宜选用需要添加抗凝剂的样本，所以只能选择血清。故本题选E。

2022：药物理化性质与药物活性

1. 药物的溶解度、分配系数和渗透性对药效的影响

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

2. 药物的酸碱性、解离度和 pK_a 对药效的影响

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

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

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

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

1. (单选题)评价药物亲水性或亲脂性大小的标准是药物的脂水分配系数P，关于P的说法正确的是
- A. P值越大，水溶性越大，药物越容易吸收
 - B. P值越大，脂溶性越大，药物越容易吸收
 - C. P值越小，水溶性越大，药物越容易吸收
 - D. P值越小，脂溶性越大，药物越容易吸收
 - E. P值越小，脂溶性越小，P值适宜吸收才最佳

【正确答案】E

【答案解析】P值越大脂溶性越大，P值越小脂溶性越小，脂溶性适宜的药物吸收最佳，不

是越大越好。

2. (单选题) 有机药物多数为弱酸或弱碱, 在体液中只能部分解离, 以解离的形式和非解离的形式同时存在于体液中, 当 $pH=pK_a$ 时, 分子型和离子型药物所占比例分别为

- A. 90%和 10%
- B. 10%和 90%
- C. 50%和 50%
- D. 33.3%和 66.7%
- E. 66.7%和 33.3%

【正确答案】 C

【答案解析】 当外界环境的 $pH=pK_a$ 时, 分子型和离子型分别占 50%。

3. (单选题) 下面药物中最易在肠道吸收的是

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

【正确答案】 A

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

2022: 药物与作用靶标结合的化学本质

键合类型		举例
共价键 (不可逆)		烷化剂类抗肿瘤药物与 DNA 中鸟嘌呤碱基键合形式 β 内酰胺类抗生素药物、拉唑类抗溃疡药物
非共价键 (可逆)	离子键 (盐键, 键能最强)	去甲肾上腺素体内成铵盐后与 β ₂ 肾上腺素受体作用
	氢键 (最常见的非共价键形式)	磺酰胺类利尿药通过氢键和碳酸酐酶结合; 水杨酸甲酯形成分子内氢键治疗肌肉疼痛
	离子-偶极和偶极-偶极	羰基化合物, 如美沙酮和阿片受体的作用

电荷转移复合物	抗疟药氯喹可以插入到疟原虫的 DNA 碱基对之间的作用
疏水性相互作用	药物非极性部分与生物大分子非极性部分相互作用
范德华引力	非极性分子中的暂时不对称电荷分布
金属离子络合物	铂金属络合物；二巯基丙醇作为锑、砷、汞的螯合解毒剂

1. (单选题) 水杨酸甲酯与对羟基苯甲酸甲酯的生物活性不同是因为前者可以形成

- A. 范德华力
- B. 疏水性相互作用
- C. 电荷转移复合物
- D. 分子内氢键
- E. 离子-偶极作用

【正确答案】D

【答案解析】水杨酸甲酯，由于形成分子内氢键，用于肌肉疼痛的治疗；而对羟基苯甲酸甲酯的酚羟基则无法形成这种分子内氢键，对细菌生长具有抑制作用。

2. (单选题) 盐酸普鲁卡因与药物受体的作用方式不包括

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

【正确答案】D

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

3. (单选题) 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. 环磷酰胺
- B. 美洛昔康

- C. 雌二醇
 D. 乙胺丁醇
 E. 芬太尼

【正确答案】A

【答案解析】共价键合是一种不可逆的结合形式，与发生的有机合成反应相类似。共价键键合类型多发生在化学治疗药物的作用机制上，如烷化剂类抗肿瘤药物，与 DNA 种鸟嘌呤碱基形成共价结合键，产生细胞毒活性。环磷酰胺是烷化剂的一种。

2022：药物结构与第 I 相生物转化的规律

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
	N-脱烷基和氧化脱氨反应	普萘洛尔、氯胺酮、丙咪嗪、苯丙胺
胺类药物	N-氧化反应	吗啡、胍乙啶、氨苯砜
	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 → 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

1. (单选题) 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. 烯炔氧化
- D. N-脱烷基氧化
- E. 乙酰化

【正确答案】A

【答案解析】保泰松羟基化生成羟布宗。

2. (单选题) 含芳环的药物在体内主要发生

- A. 还原代谢
- B. 氧化代谢
- C. 水解代谢
- D. 开环代谢
- E. 甲基化代谢

【正确答案】B

【答案解析】含芳环的药物主要发生氧化代谢, 是在体内肝脏 CYP450 酶系催化下, 首先将芳香化合物氧化成环氧化物, 然后在质子的催化下发生重排生成酚, 或被环氧化物水解酶水解生成二羟基化合物。

3. (单选题) 含硝基的药物在体内主要发生

- A. 还原代谢

- B. 氧化代谢
- C. 甲基化代谢
- D. 开环代谢
- E. 水解代谢

【正确答案】A

【答案解析】芳香族硝基在代谢还原过程中可被 CYP450 酶系消化道细菌硝基还原酶等酶催化，还原生成芳香胺基。

2022：药物结构与第Ⅱ相生物转化的规律

药物第Ⅱ相生物转化规律如下表所示：

类型	反应	参与反应的药物类型及代表药物
极性和水溶性增强	与葡萄糖醛酸的结合反应	O、N、S、C 的葡萄糖醛苷化和 O、N、S 的葡萄糖醛酸酯化、酰胺化（吗啡、氯霉素）
	与硫酸的结合反应	羟基、氨基、羟氨基（沙丁胺醇）
	与氨基酸的结合反应	羧酸类（苯甲酸、水杨酸）
	与谷胱甘肽的结合反应	白消安
极性和水溶性降低	乙酰化结合反应	伯氨基、氨基酸、磺酰胺、肼、酰肼（对氨基水杨酸）
	甲基化结合反应	酚羟基、胺基、巯基（肾上腺素、褪黑激素）

1.（单选题）以下哪种药物的代谢是与 GSH 结合

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

【正确答案】E

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

2.（单选题）不属于第Ⅱ相生物结合代谢的反应有

- A. 葡萄糖醛酸的结合
- B. 与硫酸的结合
- C. 与甘氨酸的结合
- D. 与蛋白质的结合
- E. 乙酰化结合

【正确答案】D

【答案解析】第Ⅱ相生物结合，是将第Ⅰ相中药物产生的极性基团与体内的内源性成分，如葡萄糖醛酸、硫酸、甘氨酸或谷胱甘肽，经共价键结合，生成极性大、易溶于水和易排出体外的结合物。

3. (单选题) 以下哪种反应会使亲水性减小

- A. 与葡萄糖醛酸结合反应
- B. 与硫酸的结合反应
- C. 与氨基酸的结合反应
- D. 与谷胱甘肽的结合反应
- E. 乙酰化结合反应

【正确答案】E

【答案解析】ABCD 四个选项中的结合反应都是使亲水性增加，极性增加，而乙酰化反应是将体内亲水性的氨基结合形成水溶性小的酰胺。

2022：组胺 H₁ 受体阻断剂抗过敏药

抗过敏药分为乙二胺类、氨基醚类、丙胺类、三环类、哌嗪类和哌啶类。

1. 氨基醚类

盐酸苯海拉明：临床用于皮肤、黏膜变态反应性疾病。

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

2. 丙胺类

氯苯那敏和溴苯那敏。H₁ 受体优映体均为 S-(+)-体。临床使用氯苯那敏外消旋体的马来酸盐（扑尔敏）。

马来酸氯苯那敏对组胺 H₁ 受体的竞争性阻断作用甚强，且作用持久。对中枢抑制作用较弱，嗜睡副作用较小，抗胆碱作用也较弱，适用于日间服用，治疗荨麻疹、过敏性鼻炎、

结膜炎等。

3. 三环类

异丙嗪是最早的吩噻嗪结构的三环类抗组胺药。

第二代抗组胺药氯雷他定为阿扎他定的结构改造物。

地氯雷他定：氯雷他定的活性代谢物，第三代 H_1 受体阻断药。

4. 哌嗪类

第二代抗组胺药西替利嗪，用于治疗季节性过敏性鼻炎（花粉症）。

5. 哌啶类

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

卡瑞斯汀：依巴斯汀的活性代谢物，抗组胺作用比依巴斯汀更强。

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

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

【正确答案】B

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

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

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

【正确答案】E

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

3. (多选题) 组胺 H_1 受体阻断药包括下列类别

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

【正确答案】ABCDE

【答案解析】本题考点是组胺 H_1 受体阻断药的结构分类，包括氨基醚类、丙胺类、三环类、哌嗪类、哌啶类等。故本题选 ABCDE。

2022: 抗血栓药

(一) 抗凝血药

1. 香豆素类

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

2. 凝血酶抑制药

达比加群酯：以原药和前药两种形式进入门静脉，在肝脏中完全转化为达比加群。

阿加曲班：结构中包含精氨酸、哌啶和四氢喹啉的三脚架结构。

3. 凝血因子 X_a 抑制药

直接作用于凝血因子 X_a 的抗凝血药有良好的抑制初期血栓形成的疗效。

代表药：阿哌沙班和利伐沙班。

(二) 血小板二磷酸腺苷受体阻断药

氯吡格雷、噻氯匹定、普拉格雷、坎格雷洛和替卡格雷等。

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

(三) 糖蛋白GP II b/IIIa受体阻断药

阿昔单抗和依替巴肽、替罗非班

1. (单选题) 属于凝血酶抑制药的是

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

【正确答案】B

【答案解析】凝血酶抑制药包括达比加群酯、阿加曲班。

2. (单选题) 属于糖蛋白 GP II_b/III_a受体阻断药的是

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

【正确答案】C

【答案解析】糖蛋白 GP II_b/III_a受体阻断药主要分为肽类和小分子非肽类阻断药，用于临床的肽类药物主要包括单克隆抗体阿昔单抗和依替巴肽；小分子非肽类药物有替罗非班。

3. (单选题) 属于血小板二磷酸腺苷受体阻断药的是

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

【正确答案】E

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

2022：雄激素及蛋白同化激素

(1) 雄激素

天然雄激素：睾酮、雄烯二酮

丙酸睾酮：睾酮的 17-OH 进行丙酸酯化的前药，作用时间延长。

甲睾酮：睾酮 17 α 位引入甲基，可口服。

(2) 蛋白同化激素

苯丙酸诺龙：去除睾酮 19 位甲基，可显著降低雄性激素作用，提高蛋白同化作用

美雄酮：甲睾酮的 1 位去氢衍生物，蛋白同化作用增强，临床用口服片剂治疗贫血或严重体重丢失。

司坦唑醇：在睾酮的 A 环并上吡唑环，17 α 位引入甲基得到；蛋白同化作用增强，雄激素活性降低。

1. (单选题) 在睾酮的 17 α 位引入甲基而得到甲睾酮，其主要目的是

- A. 可以口服
- B. 增强雄激素的作用
- C. 增强蛋白同化的作用
- D. 增强脂溶性，使作用时间延长
- E. 降低雄激素的作用

【正确答案】A

【答案解析】在睾酮的 17 α 位引入甲基，增大 17 位的代谢位阻，得到可口服的甲睾酮。

2. (单选题) 甲睾酮的 1 位去氢衍生物，蛋白同化作用与丙睾丸素相同，临床用口服片剂治疗贫血或严重体重丢失的是

- A. 苯丙酸诺龙
- B. 美雄酮
- C. 氯司替勃
- D. 羟甲烯龙
- E. 司坦唑醇

【正确答案】B

【答案解析】美雄酮为在甲睾酮的 1 位去氢衍生物，蛋白同化作用与丙睾丸素相同，雄激素活性约为丙睾丸素的 1/100，蛋白同化作用增强，临床用口服片剂治疗贫血或严重体重丢失。

3. (单选题) 结构为去甲睾酮的衍生物，具有蛋白同化激素样作用的药物是

- A. 苯丙酸诺龙
- B. 雌二醇

- C. 炔雌醇
- D. 丙酸睾酮
- E. 炔诺酮

【正确答案】A

【答案解析】将睾酮 19 位甲基去除，得到苯丙酸诺龙，可显著降低雄激素作用，提高蛋白同化作用。

2022：喹诺酮类抗菌药、磺胺类抗菌药

1. 喹诺酮类抗菌药

特征结构：1,4-二氢-4-氧代喹啉(或氮杂喹啉)-3-羧酸。作用靶点：DNA 螺旋酶和拓扑异构酶 IV。关键药效团是 3 位羧基和 4 位羰基，3 位羧基和 4 位羰基还极易和钙、镁、铁、锌等金属离子螯合，不仅降低了药物的抗菌活性，也是造成因体内的金属离子流失引起妇女、老人和儿童缺钙、贫血、缺锌等副作用主要原因。

典型药物有诺氟沙星（首个引入氟原子），环丙沙星，左氧氟沙星（药用左旋体，活性高；水溶性好，毒副作用为喹诺酮类抗菌药已上市中的最小者）、洛美沙星、加替沙星、莫西沙星、依诺沙星。

2. 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。

- 1.（单选题）含手性中心，左旋体活性大于右旋体的药物是
- A. 磺胺甲噁唑
 - B. 诺氟沙星
 - C. 环丙沙星
 - D. 左氧氟沙星
 - E. 吡嗪酰胺

【正确答案】D

【答案解析】将喹诺酮 1 位和 8 位成环得左氧氟沙星，此环含有手性碳原子，药用为左旋体，这源于其对 DNA 螺旋酶的抑制作用大于右旋体，左旋体的抗菌作用大于右旋异构体 8~128 倍。

- 2.（单选题）磺胺甲噁唑的作用机制为

- A. 抑制二氢叶酸还原酶
- B. 抑制二氢叶酸合成酶
- C. 抑制细菌蛋白质的合成
- D. 掺入 DNA 的合成
- E. 抑制 β -内酰胺酶

【正确答案】 B

【答案解析】 磺胺类药物作用的靶点是细菌的二氢叶酸合成酶（DHFS）使其不能充分利用对氨基苯甲酸合成叶酸。

3.（多选题）喹诺酮类药物极易和钙、镁、铁、锌等形成螯合物使抗菌活性降低，是由于结构中含有

- A. 6 位氟原子
- B. 7 位哌嗪环
- C. 3 位羧基
- D. 4 位酮羰基
- E. 5 位氨基

【正确答案】 CD

【答案解析】 考查喹诺酮类药物的副作用及构效关系。3 位羧基和 4 位酮羰基易和钙、镁、铁、锌等形成螯合物。故本题答案应选 CD。

2022：抗真菌药

（1）多烯类抗真菌药

主要用于深部真菌感染，损伤细胞膜的通透性。主要代表药物有制霉菌素 A1、那他霉素、两性霉素 B、哈霉素和曲古霉素

（2）唑类抗真菌药

主要有咪唑类和三氮唑类，咪唑类代表药物有噻康唑、益康唑、酮康唑等；三氮唑类药物有伏立康唑、氟康唑（深部真菌感染首选）、伊曲康唑、泊沙康唑。

（3）其他抗真菌药

烯丙胺类：特比萘芬

苯甲胺类：布替萘芬

棘白菌素类：卡泊芬净

嘧啶类：氟胞嘧啶

1. (单选题) 属于多烯类抗真菌药的是

- A. 制霉菌素 A1
- B. 布替萘芬
- C. 伏立康唑
- D. 特比萘芬
- E. 卡泊芬净

【正确答案】 A

【答案解析】 多烯类抗真菌药代表药物有制霉菌素 A1、那他霉素、两性霉素 B、哈霉素和曲古霉素。

2. (单选题) 属于棘白菌素类抗真菌药的是

- A. 制霉菌素 A1
- B. 布替萘芬
- C. 伏立康唑
- D. 特比萘芬
- E. 卡泊芬净

【正确答案】 E

【答案解析】 棘白菌素类，如卡泊芬净、米卡芬净、阿尼芬净。

3. (单选题) 主要用于深部真菌感染，与真菌细胞膜上的甾醇结合，损伤膜的通透性，导致真菌细胞内钾离子、核苷酸、氨基酸等外漏，破坏正常代谢而起抑菌作用

- A. 多烯类抗真菌药
- B. 唑类抗真菌药
- C. 烯丙胺类抗真菌药
- D. 棘白菌素类抗真菌药
- E. 苯甲胺类抗真菌药

【正确答案】 A

【答案解析】 多烯类抗真菌药主要用于深部真菌感染，此类药物与真菌细胞膜上的甾醇结合，损伤膜的通透性，导致真菌细胞内钾离子、核苷酸、氨基酸等外漏，破坏正常代谢而起抑菌作用。

2022：口服固体制剂的常用辅料（稀释剂、润湿剂、黏合剂、崩解剂、润滑剂）

用途	举例
稀释剂/填充剂（主药剂量小于 50mg 时加入）	淀粉、乳糖、糊精、蔗糖、预胶化淀粉、微晶纤维素（MCC，干黏合剂）、无机盐类、甘露醇
润湿剂	蒸馏水、乙醇
黏合剂	淀粉浆、甲基纤维素（MC）、羟丙纤维素（HPC，可用于粉末直接压片）、羟丙甲纤维素（HPMC）、羧甲基纤维素钠（CMC-Na）、乙基纤维素（EC）、聚维酮（PVP）、明胶、聚乙二醇（PEG）
崩解剂（缓控释片、口含片、咀嚼片、舌下片不加）	干淀粉、羧甲基淀粉钠（CMS-Na）、低取代羟丙基纤维素（L-HPC）、交联羧甲基纤维素钠（CCMC-Na）、交联聚维酮（PVPP）、泡腾崩解剂（碳酸盐/碳酸氢盐+酸类）
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

1.（单选题）不适宜用作固体制剂黏合剂的物质是

- A. 淀粉浆
- B. 甲基纤维素
- C. 微粉硅胶
- D. 羟丙甲纤维素
- E. 聚乙二醇

【正确答案】 C

【答案解析】 微粉硅胶是润滑剂，其余均可作固体制剂黏合剂。

2.（单选题）可作片剂的崩解剂的是

- A. 交联聚维酮
- B. 预胶化淀粉
- C. 聚乙二醇
- D. 聚乙烯吡咯烷酮
- E. 甘露醇

【正确答案】 A

【答案解析】 预胶化淀粉和甘露醇是填充剂，聚乙二醇是润滑剂，聚乙烯吡咯烷酮是黏合剂。

3. (单选题) 作片剂填充剂的是

- A. HPMC
- B. 羧甲淀粉钠
- C. 聚乙二醇
- D. 微晶纤维素
- E. 低取代羟丙基纤维素

【正确答案】D

【答案解析】AC 为黏合剂，BE 为崩解剂。

2022：口服固体制剂的薄膜包衣材料

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 (如丙二醇、甘油、聚乙二醇等) 和非水溶性增塑剂 (如甘油三醋酸酯、乙酰化甘油酸酯、邻苯二甲酸酯等)
	致孔剂 (释放调节剂)	蔗糖、氯化钠、表面活性剂和 PEG
	遮光剂	二氧化钛

1. (单选题) 胃溶型的薄膜衣材料是

- A. 丙烯酸树脂 II 号
- B. 丙烯酸树脂 III 号
- C. CAP
- D. HPMCP
- E. HPMC

【正确答案】E

【答案解析】本题考查胃溶性的薄膜衣材料。胃溶性的薄膜衣材料是指在胃里能够溶解的高分子材料，主要有：羟丙基甲基纤维素 HPMC、羟丙基纤维素 HPC、聚乙烯吡咯烷酮 PVP、丙

烯酸树脂IV号。故本题答案应选 E。

2. (单选题) 以下为肠溶型薄膜衣材料的是

- A. 醋酸纤维素
- B. 乙基纤维素
- C. EudragitE
- D. 醋酸纤维素酞酸酯
- E. 羟丙基纤维素

【正确答案】 D

【答案解析】 AB 是不溶型包衣材料，CE 是胃溶性包衣材料。

3. (单选题) 常用的致孔剂是

- A. 丙二醇
- B. 聚乙烯吡咯烷酮
- C. 醋酸纤维素
- D. 蔗糖
- E. 乙基纤维素

【正确答案】 D

【答案解析】 释放调节剂也称致孔剂，致孔剂一般为水溶性物质，用于改善水不溶性薄膜衣的释药速度。常见的致孔剂有蔗糖、氯化钠、表面活性剂和 PEG 等。

2022：胶囊剂

1. 特点

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

2. 质量要求

项目	质量要求
水分（中药）	≤9.0%
装量差异限度	平均装量<0.30g，装量差异限度±10%； 平均装量≥0.30g，装量差异限度±7.5%（中药±10%）
崩解时限	硬胶囊 30min；软胶囊、肠溶胶囊 1h

1.（单选题）关于胶囊剂的说法中不正确的是

- A. 中药硬胶囊水分含量不得过 9.0%
- B. 硬胶囊内容物为液体或半固体者不检查水分
- C. 每粒装量与平均装量相比较，超出装量差异限度的不得多于 2 粒，且不得有 1 粒超出限度 1 倍
- D. 硬胶囊崩解时限为 1 小时
- E. 肠溶胶囊在人工肠液中进行检查，1 小时内应全部崩解

【正确答案】 D

【答案解析】 硬胶囊崩解时限是 30 分钟。

2.（单选题）某胶囊剂的平均装量为 0.2g，它的装量差异限度为

- A. ±10%
- B. ±8%
- C. ±7.5%
- D. ±5%
- E. ±3%

【正确答案】 A

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

3.（单选题）关于将药物制成胶囊剂的目的或优点的说法错误的是

- A. 可以实现液体药物固体化
- B. 可以掩盖药物的不良嗅味
- C. 可以用于强吸湿性药物
- D. 可以控制药物的释放

E. 可以提高药物的稳定性

【正确答案】C

【答案解析】胶囊壳多以明胶为原料制备，受温度和湿度影响较大。强吸湿性药物会导致囊壁脆裂，所以不适宜制成胶囊剂。

2022：口服液体制剂的溶剂和附加剂

项目	具体品种
溶剂	极性溶剂：水、甘油、二甲基亚砷
	半极性溶剂：乙醇、丙二醇、聚乙二醇
	非极性溶剂：脂肪油、液状石蜡、油酸乙酯、乙酸乙酯
增溶剂	聚山梨酯、聚氧乙烯脂肪酸酯
助溶剂	苯甲酸钠、碘化钾、聚乙烯吡咯烷酮
潜溶剂	乙醇、丙二醇、甘油、聚乙二醇
防腐剂	苯甲酸（钠）、山梨酸（钾）、对羟基苯甲酸酯（尼泊金）、乙醇
矫味剂	甜味剂：蔗糖、山梨醇、甘露醇、甜菊苷、阿司帕坦
	芳香剂：柠檬、薄荷水、桂皮水、香精
	胶浆剂：阿拉伯胶、琼脂、纤维素类
	泡腾剂：有机酸+碳酸氢钠
着色剂	焦糖、胡萝卜素、姜黄、胭脂红、苏木、柠檬黄

1.（单选题）制备复方碘溶液时，加入的碘化钾的作用是

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

【正确答案】B

【答案解析】难溶性药物与加入的第三种物质在溶剂中形成可溶性分子间的络合物、缔合物或复盐等，以增加药物在溶剂中的溶解度。这第三种物质称为助溶剂。助溶剂多为某些有机酸及其盐类如苯甲酸、碘化钾等，酰胺或胺类化合物如乙二胺等，一些水溶性高分子化合物如聚乙烯吡咯烷酮等。

2. (单选题) 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. 丙二醇
- C. 胆固醇
- D. 聚乙二醇
- E. 甘油

【正确答案】 C

【答案解析】 常与水形成潜溶剂的有乙醇、丙二醇、甘油和聚乙二醇等。

3. (多选题) 属于非极性溶剂的有

- A. 聚乙二醇
- B. 丙二醇
- C. 脂肪油
- D. 二甲基亚砷
- E. 醋酸乙酯

【正确答案】 CE

【答案解析】 极性溶剂 (如水、甘油、二甲基亚砷等)、半极性溶剂 (如乙醇、丙二醇、聚乙二醇等)、非极性溶剂 (脂肪油、液状石蜡、油酸乙酯、乙酸乙酯等)。

2022: 注射剂的附加剂

注射剂的附加剂	举例
抗氧化剂	亚硫酸钠、硫代硫酸钠: 用于弱碱性溶液; 亚硫酸氢钠、焦亚硫酸钠: 用于弱酸性溶液
金属离子螯合剂	乙二胺四乙酸二钠/依地酸二钠 (EDTA-2Na)
缓冲剂 (调节 pH)	醋酸-醋酸钠、枸橼酸-枸橼酸钠、酒石酸-酒石酸钠、乳酸
助悬剂	羧甲基纤维素、明胶、果胶
稳定剂	肌酐、甘氨酸、烟酰胺、辛酸钠
增溶/润湿/乳化剂	吐温、PVP、卵磷脂、普朗尼克、脱氧胆酸钠
抑菌剂	三氯叔丁醇、苯甲醇、苯酚、甲酚、尼泊金

局麻剂（止痛）	盐酸普鲁卡因、利多卡因
等渗调节剂	氯化钠、葡萄糖、甘油
填充剂	乳糖、甘露醇、甘氨酸
保护剂	乳糖、蔗糖、麦芽糖、人血红蛋白

1.（单选题）制备易氧化药物注射剂应加入的抗氧剂是

- A. 碳酸氢钠
- B. 焦亚硫酸钠
- C. 氯化钠
- D. 醋酸钠
- E. 枸橼酸钠

【正确答案】B

【答案解析】焦亚硫酸钠是抗氧剂，其他都不是。

2.（单选题）常用作注射剂的等渗调节的是

- A. 氢氧化钠
- B. NaCl
- C. HCl
- D. 硼砂
- E. NaHCO_3

【正确答案】B

【答案解析】本题考点为注射剂的等渗调节剂，常用氯化钠和葡萄糖。

3.（单选题）用于注射剂中的抑菌剂

- A. 甲基纤维素
- B. 盐酸
- C. 三氯叔丁醇
- D. 氯化钠
- E. 焦亚硫酸钠

【正确答案】C

【答案解析】常用的抑菌剂有：苯甲醇，三氯叔丁醇等。

2022：注射用无菌粉末

1. 特点

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

2. 常见问题及产生原因

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

1. (单选题) 对于易溶于水，但在水溶液中不稳定的药物适合制成

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

【正确答案】 E

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

2. (单选题) 装入液层过厚会导致

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

【正确答案】 A

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

3. (单选题) 局部过热可出现

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

【正确答案】B

【答案解析】喷瓶的原因：预冻温度过高或时间太短、产品冻结不实、升华供热过快、局部过热等。

2022：眼用制剂附加剂

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

1. (单选题) 适当增加滴眼剂的黏度，既可延长药物与作用部位的接触时间，又能降低药物对眼的刺激性，有助于药物发挥作用，用作滴眼剂黏度调节剂的辅料是

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

【正确答案】D

【答案解析】适当增加滴眼剂的黏度，既可延长药物与作用部位的接触时间，又能降低药物对眼的刺激性，有助于药物发挥作用。常用的包括甲基纤维素、聚乙二醇、聚维酮、聚乙烯醇等。

2. (单选题) 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

【正确答案】 D

【答案解析】 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。

3. (多选题) 不可作为氯霉素滴眼剂 pH 调节剂的是

- A. 10%HCl
- B. 硼砂
- C. 尼泊金甲酯
- D. 硼酸
- E. 硫柳汞

【正确答案】 ACE

【答案解析】 盐酸不能用作滴眼剂的 pH 调节剂，尼泊金类和硫柳汞是抑菌剂。

2022：气雾剂

1. 特点

(1) 优点

便携、耐用、方便；

比雾化器容易准备，治疗时间短；

剂量均一性良好；

气溶胶形成与病人的吸入行为无关；

所有 MDIs 的操作和吸入方法相似；

高压下的内容物可防止病原体侵入。

(2) 缺点

可能会造成患者肺部剂量较低和（或）不均一；

通常肺部沉积量较低；

无法递送大剂量药物；

大多数现有的 MDIs 没有剂量计数器。

2. 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

1. (单选题) 下列有关气雾剂特点的叙述错误的是

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

【正确答案】D

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

2. (单选题) 可作为气雾剂抛射剂的是

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

【正确答案】B

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

3. (单选题) 可作为气雾剂抗氧剂的是

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

E. 液状石蜡

【正确答案】D

【答案解析】选项中只有维生素C可以作为抗氧剂使用。

2022：口服滴丸剂的定义及特点

1. 定义

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

2. 特点

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

(2) 可使液态药物固化。

(3) 用固体分散技术制备的滴丸具有吸收迅速、生物利用度高的特点。

(4) 发展了耳、眼科用药的新剂型，可起到延效作用。

1. (单选题) 药物与基质加热熔融混匀后，滴入不相混溶、互不作用的冷凝液中收缩成球形的制剂

A. 胶丸

B. 滴丸剂

C. 脂质体

D. 靶向乳剂

E. 微球

【正确答案】B

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

2. (单选题) 以水溶性基质制备滴丸时应选用的冷凝液是

A. 水与醇的混合液

B. 乙醇水溶液

C. 液体石蜡

D. 乙醇与甘油的混合液

E. 以上都不行

【正确答案】C

【答案解析】水溶性基质选用的冷凝液应是脂溶性的。

3. (单选题) 从滴丸剂组成及制法看, 关于滴丸剂的特点, 说法错误的是

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

【正确答案】A

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

2022: 口服固体制剂的常用辅料-释放调节剂

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

1. (单选题) 下列辅料中不用于骨架型缓释材料的是

- A. 聚乙烯

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

【正确答案】B

【答案解析】羟丙基纤维素酞酸酯为包衣膜型材料。

2. (单选题) 属于亲水凝胶骨架材料是
- A. 乙基纤维素
 - B. 硬脂酸
 - C. 巴西棕榈蜡
 - D. 羟丙甲纤维素
 - E. 聚乙烯

【正确答案】D

【答案解析】羟丙甲纤维素属于亲水性凝胶骨架材料。此题选项中聚乙烯、乙基纤维素属于不溶性骨架材料，硬脂酸、巴西棕榈蜡属于生物溶蚀性骨架材料。

3. (单选题) 下列属于生物溶蚀性骨架材料的是
- A. 乙基纤维素
 - B. 聚维酮 (PVP)
 - C. 羟丙甲纤维素酞酸酯 (HPMCP)
 - D. 羟丙甲纤维素 (HPMC)
 - E. 蜂蜡

【正确答案】E

【答案解析】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。

2022：微囊

1. 特点

- (1) 提高药物的稳定性。
- (2) 掩盖药物的不良臭味。
- (3) 防止药物在胃内失活，减少药物对胃的刺激性。

- (4) 控制药物的释放。
- (5) 使液态药物固态化。
- (6) 减少药物的配伍变化。
- (7) 使药物浓集于靶区，提高疗效，降低毒副作用。

2. 微囊化材料

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

1. (单选题) 以下关于药物微囊化的特点不正确的是

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

【正确答案】 E

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

2. (单选题) 下列辅料中，可生物降解的合成高分子囊材是

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

【正确答案】 D

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

3. (单选题) 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

【正确答案】E

【答案解析】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。

2022：药物的转运方式

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

1. (单选题) 细胞膜可以主动变形而将某些物质摄入细胞内，此种方式是

- A. 限制扩散
- B. 主动转运
- C. 易化扩散
- D. 膜动转运
- E. 溶解扩散

【正确答案】D

【答案解析】细胞膜主动变形将某些物质摄入细胞内称为膜动转运，膜动转运可分为胞饮和吞噬作用。

2. (单选题) 有关易化扩散的特征错误的是

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

【正确答案】E

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

3. (单选题) 下列转运方式为逆浓度转运的是

- A. 被动转运
- B. 易化扩散
- C. 简单扩散
- D. 主动转运
- E. 促进扩散

【正确答案】D

【答案解析】主动转运是从膜的低浓度一侧向高浓度一侧转运（逆浓度转运），需要消耗能量，其他选项均是从膜的高浓度一侧向低浓度一侧转运，不消耗能量。

2022：注射给药

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

1. (单选题) 不存在吸收过程的给药途径是

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

【正确答案】 A

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

2. (单选题) 将药物注射到真皮中，一般用于诊断和过敏试验的是

- A. 静脉注射
- B. 肌内注射
- C. 皮内注射
- D. 皮下注射
- E. 动脉注射

【正确答案】 C

【答案解析】 皮内注射是将药物注射到真皮中，此部位血管稀且小，吸收差，只用于诊断与过敏试验，注射量在 0.2ml 以内。

3. (单选题) 若想延长胰岛素的作用时间可采用

- A. 静脉注射
- B. 肌内注射
- C. 皮下注射
- D. 皮内注射
- E. 动脉注射

【正确答案】 C

【答案解析】 皮下注射吸收较肌内注射慢，一些需要延长作用时间的药物可采用皮下注射。如治疗糖尿病的胰岛素。

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

1.（单选题）药物达到一定效应时所需要的剂量是

- A. 效价强度
- B. 效能
- C. 治疗指数
- D. 最大效应
- E. 安全指数

【正确答案】A

【答案解析】效价强度用于作用性质相同的药物之间的等效剂量的比较，是指能引起等效反应（一般采用50%效应量）的相对剂量或浓度。一般反映药物与受体的亲和力，其值越小则强度越大，即用药量越大者效价强度越小。

2.（单选题）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=B>A

【正确答案】B

【答案解析】治疗指数（TI）=LD₅₀/ED₅₀。表示药物的安全性。

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

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

【正确答案】 B

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

2022: 药物的作用机制

类型	特点	举例
作用于受体	大多数药物作用机制	胰岛素、阿托品 (M 受体)、肾上腺素 (α 、 β 受体)
影响酶活性	抑制酶活性	依那普利 (ACE)、阿司匹林 (COX)、地高辛 (Na^+ - K^+ -ATP 酶)
	激活酶活性	尿激酶、碘解磷定 (复活胆碱酯酶)
	影响代谢酶	苯巴比妥 (诱导肝药酶)、氯霉素 (抑制肝药酶)
影响离子通道	利多卡因 (Na^+)、硝苯地平 (Ca^{2+})	
干扰核酸代谢	氟尿嘧啶 (掺入肿瘤细胞 DNA、RNA 中)、磺胺药 (抑制叶酸代谢干扰核酸合成)、喹诺酮类 (抑制 DNA 螺旋酶和拓扑异构酶 IV)	
补充体内物质	铁剂治疗缺铁性贫血、胰岛素治疗糖尿病; 补充维生素、多种微量元素	
改变细胞周围环境的理化性质	氢氧化铝 (抗酸药中和胃酸)、甘露醇 (利尿)、硫酸镁 (渗透性泻药)	
影响生理活性物质及其转运体	噻嗪类利尿药 (抑制 Na^+ - Cl^- 转运体)	

影响免疫功能	环孢素（抑制免疫）、左旋咪唑（免疫增强药）
非特异性作用	消毒防腐药、调节血液酸碱平衡药

1.（单选题）铁剂治疗缺铁性贫血的作用机制是

- A. 影响酶的活性
- B. 影响核酸代谢
- C. 补充体内物质
- D. 影响机体免疫功能
- E. 影响细胞环境

【正确答案】C

【答案解析】本题考点是铁剂治疗缺铁性贫血的作用机制，即补充体内物质。故本题选C。

2.（单选题）碘解磷定解救有机磷中毒的机制是

- A. 作用于M受体
- B. 影响酶的活性
- C. 影响Na⁺通道
- D. 干扰核酸代谢
- E. 补充体内物质

【正确答案】B

【答案解析】碘解磷定使有机磷抑制的胆碱酯酶复活，因此碘解磷定的解毒机制是影响酶活性。

3.（单选题）磺胺类药物的作用机制

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

【正确答案】D

【答案解析】磺胺类抗菌药通过抑制敏感细菌体内叶酸的代谢而干扰核酸的合成。

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

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

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

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

(5) 多样性：同一受体可广泛分布于不同组织或同一组织不同区域。

1. (单选题) 关于受体所具有的性质，不正确的是

- A. 灵敏性
- B. 可逆性
- C. 特异性
- D. 饱和性
- E. 持久性

【正确答案】 E

【答案解析】 受体的性质：多样性、灵敏性、可逆性、特异性、饱和性。

2. (单选题) 阿托品阻断 M 胆碱受体而不阻断 N 受体，体现了受体的性质是

- A. 饱和性
- B. 特异性
- C. 可逆性
- D. 灵敏性
- E. 多样性

【正确答案】 B

【答案解析】 本题考点是药物与受体结合的特点，5 项，受体具有饱和性、特异性、可逆性、灵敏性和多样性等。阿托品阻断 M 胆碱受体而不阻断 N 受体，体现了受体的特异性。依据字面意思理解和解题。故本题选 B。

3. (单选题) 阿托品的作用存在最大效应，当药物达到一定浓度后，其效应不会随浓度而增加体现受体的性质是

- A. 饱和性
- B. 特异性
- C. 可逆性
- D. 灵敏性
- E. 多样性

【正确答案】A

【答案解析】受体数量是有限的，其能结合的配体量也是有限的，因此受体具有饱和性，在药物的作用上反映为最大效应。当药物达到一定浓度后，其效应不会随其浓度增加而继续增加。

2022：受体的信号转导

（1）第一信使

细胞外信使物质，多肽类物质、神经递质、细胞因子及药物属于第一信使

（2）第二信使

胞浆内信使物质，包括环磷酸腺苷（cAMP）、环磷酸鸟苷（cGMP）、二酰基甘油（DAG）、三磷酸肌醇（IP₃）、钙离子（Ca²⁺）、甘油二酯类、一氧化氮（NO，同时具有第一信使和第二信使特征）

（3）第三信使

细胞核内信使，生长因子、转化因子

1.（单选题）可作为第一信使的是

- A. cAMP
- B. 5-HT
- C. cGMP
- D. DAG
- E. Ca²⁺

【正确答案】B

【答案解析】第一信使指多肽类激素、神经递质、细胞因子及药物等细胞外信使物质。5-HT是神经递质。其他选项都是第二信使。

2.（单选题）已确定的第二信使不包括

- A. cAMP

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

【正确答案】 E

【答案解析】 G 蛋白偶联受体介导来自这些配体的信号通过第二信使（cAMP、cGMP、IP₃、DAG、Ca²⁺）转导至效应器，从而产生生物效应。DAG 就是甘油二酯。

3.（单选题）既有第一信使特征，也有第二信使特征的药物分子是

- A. 钙离子
- B. 神经递质
- C. 环磷酸腺苷
- D. 一氧化氮
- E. 生长因子

【正确答案】 D

【答案解析】 本题考点是第二信使的类型，包括最早发现的第二信使环磷酸腺苷（cAMP）、环磷酸鸟苷（cGMP）、二酰基甘油（DAG）和三磷酸肌醇（IP₃）及前列腺素（PGs）、Ca²⁺、廿碳烯酸和一氧化氮（NO）等。其中一氧化氮（NO）既有第一信使特征，也有第二信使特征。故本题选 D。

2022：药动学参数及临床意义

药动学参数及临床意义如下表：

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	$V=X/C$	水溶性或极性大的药物表观分布容积较小；亲脂性药物表观分布容积较

			大
清除率 (Cl)	单位时间从体内消除的含药血浆体积	$Cl=kV$	肝脏或肾脏功能出现障碍时, Cl 变小

1. (单选题) 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
- 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
- D. 大部分药物主要分布在组织
- E. 药物在组织和血浆分布

【正确答案】D

【答案解析】当药物的 V 远大于体液总体积时, 表示其血中药物浓度很小, 说明分布到组织中的药物多, 提示药物在某些组织或器官可能存在蓄积, 一般排泄较慢, 在体内能保持较长时间。

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

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

【正确答案】D

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

3. (单选题) 静脉注射某药, $X_0=60mg$, 若初始血药浓度为 $15\mu g/ml$, 其表观分布容积 V 是

- A. 0.25L
- B. 4L
- C. 0.4L
- D. 0.9L
- E. 9L

【正确答案】B

【答案解析】根据公式 $V=X_0/C_0$ ，其中 V 是表观分布容积， X_0 为静脉剂量， C_0 为初始浓度。所以 $V=60\text{mg}/15\ \mu\text{g}/\text{ml}=4\text{L}$ 。

