

参考答案与解析

模拟试卷(一)

一、最佳选择题

1.【参考答案】B

【解析】本题考查的是维生素C注射液的处方注解。维生素C是主药,显强酸性,由于注射时刺激性大,会产生疼痛,故加碳酸氢钠或碳酸钠,中和部分维生素C成钠盐,以避免疼痛;同时由于碳酸氢钠的加入调节了pH,可增强维生素C注射液的稳定性。维生素C容易被氧化,依地酸二钠是金属螯合剂,用来络合金属离子,防止药品被氧化。亚硫酸氢钠是还原剂(抗氧剂),可以防止药品被氧化。

2.【参考答案】D

【解析】本题考查的是药物结构中常见的化学结构和名称。

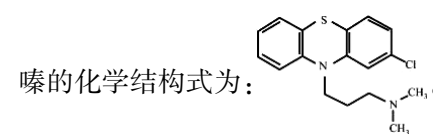
名称	化学结构及编号	名称	化学结构及编号
环己烷		萘	
呋喃		噻吩	
吡咯		吡啶	
咪唑		噁唑	
噻唑		三氮唑 (1,3,4-三氮唑)	
四氮唑(1,2,3,4-四氮唑)		哌啶	

续表

名称	化学结构及编号	名称	化学结构及编号
哌嗪		吡啶	
哒嗪		嘧啶	
吡嗪		茚	
吲哚		苯并咪唑	
喹啉		异喹啉	
苯并嘧啶		苯二氮草	
苯并噁唑		苯并噻唑	
吩噻嗪		尿嘧啶	
胸腺嘧啶		胞嘧啶	
腺嘌呤		鸟嘌呤	

3.【参考答案】C

【解析】本题考查的是抗精神病药物的基本结构。吩噻嗪类抗精神类药物的代表药物是氯丙嗪,临床上常用来治疗以兴奋症为主的精神病,主要副作用是锥体外系作用。氯丙



4.【参考答案】E

【解析】本题考查的是非甾体抗炎药。双氯芬酸、舒林酸、吲哚美辛属于芳基乙酸类的非甾体抗炎药，塞来昔布属于选择性 COX-2 抑制剂，芳基丙酸类有布洛芬、萘普生、萘丁美酮。

5.【参考答案】E

【解析】本题考查的是阿托品的药理作用。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；而当用于麻醉前给药时，其抑制腺体分泌作用可减少呼吸道分泌，则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，而减少腺体分泌产生的口干又成为副作用。由此可见，有时副作用和治疗作用之间是可以相互转变的。

6.【参考答案】D

【解析】本题考查的是均相液体制剂。均相液体制剂是溶液剂，药物以分子、离子或高分子状态分散。选项中只有磷酸可待因糖浆是低分子溶剂，故选 D。

7.【参考答案】D

【解析】本题考查的是非离子型表面活性剂。苯扎氯铵、苯扎溴铵是阳离子表面活性剂，此类表面活性剂由于其毒性较大，主要用于皮肤、黏膜和手术器材的消毒。

8.【参考答案】E

【解析】本题考查的是药物的名称。药物的名称包括药物的通用名、化学名和商品名。药物的通用名也是《中国药典》中使用的名称。

9.【参考答案】A

【解析】本题考查的是药物的稳定性。药物的氧化过程与化学结构有关，如酚类、烯醇类、芳胺类、吡唑酮类、噻嗪类药物较易氧化。选项中只有肾上腺素分子中含有酚羟基，故选 A。

10.【参考答案】D

【解析】本题考查的是药物警戒与药物不良反应监测。药物警戒工作不仅涉及不良反应监测，还涉及与药物相关的其他问题。药物的不良反应就是指合格药物的不良反应。

11.【参考答案】C

【解析】本题考查的是胶囊剂的质量要求。胶囊剂型对内容物具有一定的要求，一些药物不适宜制备成胶囊剂。例如：①会导致囊壁溶化的水溶液或稀乙醇溶液药物；②会导致囊壁软化的风化性药物；会导致囊壁脆裂的强吸湿性药物；③导致明胶变性的醛类药物；④会导致囊材软化或溶解的含有挥发性、小分子有机物的液体药物；⑤会导致囊壁变软的 O/W 型乳剂药物。

12.【参考答案】A

【解析】本题考查的是药物的物理学配伍变化。物理学的配伍变化属于外观变化，如果条件改变还可能恢复制剂的原来形式。如沉淀、潮解、液化、结块和粒径变化等。氯霉素注射液（含乙醇、甘油或丙二醇）加入 5% 葡萄糖注射液中析出氯霉素是由于溶解度的改变。属于物理学的配伍变化。

13.【参考答案】C

【解析】本题考查的是 β -内酰胺类抗菌药物的分类。①青霉素类，代表药物青霉素、阿莫西林、氨苄西林等；②头孢菌素类，代表药物头孢氨苄、头孢唑林等；③氧青霉烷类，代表药物克拉维酸；④青霉烷砜类，代表药物舒巴坦、他唑巴坦；⑤碳青霉烯类，代表药物亚胺培南、美罗培南；⑥单环 β -内酰胺类，代表药物氨基曲南。

14.【参考答案】B

【解析】本题考查的是剂型的分类。按给药途径可分为经胃肠道给药剂型，包括溶液剂、糖浆剂、颗粒剂、胶囊剂、散剂、丸剂、片剂。非经胃肠道给药剂型，包括：①注射给药：如注射剂等；②皮肤给药：如外用溶液剂等；③口腔给药：如含片等；④鼻腔给药：如滴鼻剂等；⑤肺部给药：如气雾剂等；⑥眼部给药：如滴眼剂等；⑦直肠、阴道和尿道给药：如灌肠剂、栓剂等。

15.【参考答案】B

【解析】本题考查的是药物解离常数对药效的影响。解离常数用 pK_a 表示，是药物的解离程度。当药物 pK_a 值 > 体液 pH 时分子型药物比例高；当药物 pK_a 值 = 体液 pH 时，分子型和离子型各占一半，如苯巴比妥，pH 变动一个单位，比例变动 10 倍。由于 $\lg[B]/[HB^+] = pH - pK_a$ ，代入数值得 -1，则比值为 10%，故选 B。

16.【参考答案】E

【解析】本题考查的是注射剂的质量要求。①pH：一般控制在 pH4~9 范围内；②渗透压：与血浆相同或略偏高；③稳定性：具有必要的物理和化学稳定性；④安全性：无毒、无刺激性；⑤澄明：不得含有可见的异物或不溶性微粒；⑥无菌；⑦无热原。

17.【参考答案】B

【解析】本题考查的是影响药物稳定性的因素。处方因素对药物制剂稳定性的影响：① pH 的影响；② 广义酸碱催化的影响；③ 溶剂的影响；④ 离子强度的影响；⑤ 表面活性剂的影响；⑥ 处方中基质或赋形剂的影响。环境因素对药物制剂稳定性的影响：① 温度的影响；② 光线的影响；③ 空气（氧）的影响；④ 金属离子的影响；⑤ 湿度和水分的影响；⑥ 包装材料的影响。

18.【参考答案】D

【解析】本题考查的是药物的主要结构骨架和药效团。羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶（HMG-CoA 还原酶）抑制剂：洛伐他汀、氟伐他汀、辛伐他汀、阿托伐他汀、瑞舒伐他汀。阿托伐他汀的必需药效团是 3,5-二羟基戊酸，故选 D。

19.【参考答案】B

【解析】本题考查的是埃索美拉唑的性质。埃索美拉唑是奥美拉唑的 S-(-)-光学异构体，比 R 异构体在体内的代谢更慢，并且经体内循环更易重复生成，导致血药浓度更高，维持时间更长。

20.【参考答案】E

【解析】本题考查的是精密称定的含义。药物分析实验室使用分析天平感量有 0.1 mg、

0.01 mg 和 0.001 mg 三种。为了保证称量的相对误差小于千分之一,当取样量大于 100 mg 时,选用感量为 0.1 mg 的分析天平;当取样量为 10~100 mg 时,选用感量为 0.01 mg 的分析天平;取样量小于 10 mg 时,选用感量为 0.001 mg 的分析天平。

21.【参考答案】C

【解析】本题考查的是药物的手性特征及其对药物作用的影响。对映异构体之间一个有药理活性,一个有毒性作用。如氯胺酮(-)-(R)-对映体有中枢兴奋的作用;乙胺丁醇 L 体活性小,毒性大,丙胺卡因(-)-(R)-有血液毒性。

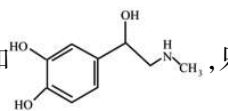
22.【参考答案】B

【解析】本题考查的是表面活性剂的分类。①阴离子表面活性剂:高级脂肪酸盐、硫酸化物、磺酸化物;②阳离子表面活性剂:苯扎氯铵、苯扎溴铵;③两性离子表面活性剂:卵磷脂、氨基酸型和甜菜碱型;④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、聚氧乙烯脂肪醇醚(苜泽)、聚氧乙烯-聚氧丙烯共聚物(泊洛沙姆/普朗尼克)。

23.【参考答案】C

【解析】本题考查的是药物稳定性试验方法。药物稳定性试验方法是在高温、高湿、强光的剧烈条件下考察影响药物稳定性的因素及可能的降解途径与降解产物,为制剂工艺的筛选、包装材料的选择、贮存条件的确定等提供依据。同时为加速试验和长期试验应采用的温度和湿度等条件提供依据。

24.【参考答案】D

【解析】本题考查的是甲基化结合反应。儿茶酚胺类药物是芳环上有两个羟基相邻的肾上腺素类药物。儿茶酚类药物结构如 , 只有 D 选项不含儿茶酚结构,故选 D。

25.【参考答案】A

【解析】本题考查的是苯妥英钠的性质。苯妥英钠主要被肝微粒体酶代谢,两个苯环只有一个被氧化,代谢产物与葡萄糖醛酸结合排出体外。约 20% 以原形由尿液排出体外。苯妥英钠具有“饱和代谢动力学”的特点,如果用量过大或短时间内反复用药,可使代谢酶饱和,代谢将显著减慢,并易产生毒性反应。

26.【参考答案】D

【解析】本题考查的是化学配伍变化的相关内容。化学的配伍变化系指药物之间发生了化学反应(氧化、还原、分解、水解、取代、聚合等)而导致药物成分的改变,产生沉淀、变色、产气、发生爆炸等现象,以致影响到药物制剂的外观、质量和疗效,或产生毒副作用。主要包括:浑浊或沉淀;变色;产气;发生爆炸;产生有毒物质;分解破坏,疗效下降。

27.【参考答案】C

【解析】本题考查的是胶囊剂的优点。胶囊剂的优点有:掩盖药物的不良臭味,药物的生物利用度高,液态药物固体化,可延缓药物的释放和定位释药,可提高药物的稳定性。故错误的选项为 C。

28.【参考答案】D

【解析】本题考查的是缓释、控释制剂的特点。

(1)减少半衰期短的或需要频繁使用的药物的给药次数,大大提高患者的用药顺应性,特别适用于需要长期用药的慢性病患者。

(2)血药浓度平稳,减少峰谷现象,有利于降低药物的毒副作用,减少耐药性的发生。

(3)减少用药的总剂量,发挥药物的最佳治疗效果。

(4)缓释、控释制剂也包括眼用、鼻腔、耳道、阴道、直肠、口腔或牙用、透皮或皮下、肌肉注射及皮下植入,使药物缓慢释放吸收,避免肝门系统的“首过效应”。

29.【参考答案】D

【解析】本题考查的是纯化水的定义及应用。纯化水为饮用水经蒸馏法、离子交换法、反渗透法或其他适宜方法制得的制药用水,不含任何附加剂。纯化水不得用于注射剂的配制与稀释。

30.【参考答案】B

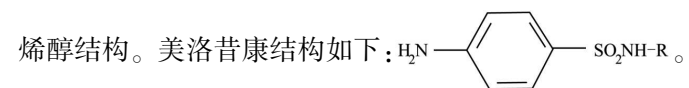
【解析】本题考查的是输液的质量要求。输液是指由静脉滴注输入体内的大剂量注射液(一般 ≥ 100 mL)。通常装于玻璃或塑料的输液瓶或袋中,不含防腐剂或抑菌剂。故错误选项为 B。

31.【参考答案】D

【解析】本题考查的是可生物降解的合成高分子囊材。可生物降解的合成高分子囊材包括聚碳酸酯、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(PLA-PEG)等,其特点是无毒、成膜性及成球性好、化学稳定性高,可用于注射。

32.【参考答案】B

【解析】本题考查的是药物的结构特性。含有 1,2-苯并噻嗪结构的抗炎药被称为昔康类,其分子含有烯醇结构药效团。此类药物多显酸性,其 pK_a 值在 4~6 之间,酸性来自于烯醇结构。美洛昔康结构如下:



33.【参考答案】B

【解析】本题考查的是气雾剂的附加剂。气雾剂系指原料药物或原料药和附加剂与适宜的抛射剂共同装封于具有特制阀门系统的耐压容器中,使用时借助抛射剂的压力内容物呈雾状物喷出,用于肺部吸入(全身作用)或直接喷至腔道黏膜、皮肤(局部作用)的制剂,故抛射剂需要。肾上腺素气雾剂中肾上腺素易氧化,故抗氧化剂需要。为增加难溶性药物溶解度需加潜溶剂,某些药物粉末本身没有粘性,故需加入润湿剂。则气雾剂中不需要使用

的附加剂为遮光剂。

34.【参考答案】A

【解析】本题考查的是药物配伍变化的类型。物理学的配伍变化:①溶解度改变;②吸湿、潮解、液化与结块;③粒径或分散状态的改变。化学的配伍变化:①浑浊或沉淀,例如酸性药物盐酸氯丙嗪注射液同碱性药物异戊巴比妥钠注射液混合,能发生沉淀反应;20%磺胺嘧啶钠注射液,与10%葡萄糖注射液混合后,由于溶液pH的明显改变可使磺胺嘧啶析出结晶;水杨酸钠或苯巴比妥钠水溶液因遇酸或酸性药物后,会析出水杨酸或巴比妥酸;大多数生物碱盐的溶液,当与鞣酸、碘、碘化钾、乌洛托品等相遇时能产生沉淀;黄连素和黄芩苷在溶液中能产生难溶性沉淀;硫酸镁遇可溶性的钙盐、碳酸氢钠或某些碱性较强的溶液时均产生沉淀;硝酸银遇含氯化物的水溶液,即产生沉淀;②变色,如维生素C与烟酰胺,即使是干燥粉末混合也会变色;多巴胺注射液与碳酸氢钠注射液配伍后会逐渐变成粉红色至紫色;氨茶碱或异烟肼与乳糖混合变成黄色;③产气,例如溴化铵、氯化铵或乌洛托品与强碱性药物配伍,溴化铵和利尿药配伍,产生氨气;乌洛托品与酸类或酸性药物配伍,产生甲醛;④发生爆炸,如氯化钾与硫,高锰酸钾与甘油,强氧化剂与蔗糖或葡萄糖等;⑤产生有毒物质,如含朱砂的中药制剂不宜与还原性药物如溴化钾、溴化钠、碘化钾、碘化钠、硫酸亚铁等配伍;⑥分解破坏,疗效下降,如维生素B₁₂和维生素C合用,维生素B₁₂的效价显著降低;乳酸环丙沙星与甲硝唑混合,甲硝唑的浓度下降;红霉素乳糖酸盐与葡萄糖氯化钠注射液配合,红霉素乳糖酸盐的效价降低。

35.【参考答案】C

【解析】本题考查的是栓剂的常用基质。油脂性基质:①可可豆脂;②半合成或全合成脂肪酸甘油酯:椰油酯、棕榈酸酯、混合脂肪酸甘油酯。水溶性基质:①甘油明胶;②聚乙二醇;③泊洛沙姆。

36.【参考答案】B

【解析】本题考查的是栓剂的常用基质。栓剂的水溶性基质有:甘油明胶、聚乙二醇、泊洛沙姆。选项中只有B选项是水溶性基质,其他皆为油脂性基质,故选B。

37.【参考答案】B

【解析】本题考查的是主动转运的特点。主动转运的特点:①逆浓度梯度转运;②需要消耗机体能量,能量的来源主要由细胞代谢产生的ATP提供;③转运速度与载体量有关,往往可出现饱和现象;④可与结构类似的物质发生竞争现象;⑤受抑制剂的影响;⑥具有结构特异性;⑦主动转运还具有部位特异性。

38.【参考答案】D

【解析】本题考查的是苯妥英钠所属的类别。乙内酰脲本身无抗癫痫作用,当5位两个氢被苯基取代后得到苯妥英,临床用其钠盐形式——苯妥英钠,抗惊厥作用强。

39.【参考答案】C

【解析】本题考查的是固体分散技术和包合技术的特点。固体分散技术和包合技术都类似于胶囊剂。可以掩盖不良气体,改善药物溶解度,液体药物固体化,提高药物稳定性。不同之处在于固体分散体不够稳定,久贮会发生老化现象。故选C。

40.【参考答案】D

【解析】本题考查的是硝酸异山梨酯的性质。硝酸酯类药物具有爆炸性,不宜以纯品形式放置和运输。硝酸酯类药物连续用药后会出现耐受性。硝酸异山梨酯为二硝酸酯,脂溶性大,易通过血脑屏障,有头痛的不良反应。硝酸异山梨酯进入人体后很快被代谢为2-硝酸异山梨酯和5-单硝酸异山梨酯,两者均具有抗心绞痛活性。

二、配伍选择题

【41~42】

【参考答案】AC

【解析】本组题考查的是醋酸可的松滴眼液(混悬液)的处方。醋酸可的松滴眼液为混悬型,粒径应在5~20 μm,过粗易产生刺激性,降低疗效,甚至会损伤角膜。羧甲基纤维素钠为助悬剂,配液前需精制。本滴眼液中不能加入阳离子型表面活性剂,因与羧甲基纤维素钠有配伍禁忌;硼酸为pH与等渗调节剂,因氯化钠能使羧甲基纤维素钠黏度显著下降,促使结块沉降,故不能加入氯化钠。硝酸苯汞为本品的抑菌剂。

【43~44】

【参考答案】DE

【解析】本组题考查的是药物不良反应新分类。

G类反应(基因毒性反应):一些药物能损伤基因,出现致癌、致畸等不良反应。值得注意的是,有些是潜在的致癌物或遗传毒物,有些(并非全部)致畸物在胎儿期即可导致遗传物质受损。

H类反应(过敏反应):可能是继A类反应后最常见的不良反应,类别很多,它们不是药理学所能预测的,也与剂量无关,因此减少剂量通常不会改善症状,必须停药。

【45~46】

【参考答案】BA

【解析】本组题考查的是药物的名称。药品通用名也称国际非专利药品名,是世界卫生组织推荐使用的名称。商品名也称品牌名,通常针对药物的最终产品。它和商标一样可以进行注册和申请专利保护。这样药品的商品名只能由该药品的拥有者和制造者使用。

【47~48】

【参考答案】AB

【解析】本组题考查的是苯扎溴铵和液体石蜡的用途。阳离子表面活性剂特点:水溶性大,在酸性与碱性溶液中较稳定,具有良好的表面活性作用和杀菌、防腐作用,常用品种有苯扎溴铵和苯扎氯铵等。非极性溶剂:脂肪油、液体石蜡、油酸乙酯、乙酸乙酯等。

【49~51】

【参考答案】EBD

【解析】本组题考查的是莨菪生物碱类药物的结构特点。异丙托溴铵是将阿托品季铵化得到的盐,没有氧桥,难以通过血脑屏障,故不能进入中枢神经系统,不呈现中枢作用。东莨菪碱6,7位间有一个 β 取向的氧桥,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。丁溴东莨菪碱是东莨菪碱季铵化得到的药物,难以进入中枢,成为外周抗胆碱药。

【52~54】

【参考答案】BDA

【解析】本组题考查的是临床药理学研究。

(1) I期临床试验:人体安全性评价试验,一般选择20~30例健康成年志愿者,观察人体对受试药的耐受程度和人体药理学特征,为制定临床研究的给药方案提供依据。

(2) II期临床试验:初步药效学评价试验,采用随机、双盲、对照试验,完成例数大于100例,推荐临床给药剂量。

(3) III期临床试验:扩大的多中心临床试验,试验遵循随机、对照的原则,进一步评价受试药的有效性、安全性、利益与风险,完成例数大于300例,为受试药的新药注册申请提供依据。

(4) IV期临床试验:批准上市后的监测,也叫售后调研,是社会人群大范围内继续进行的安全性和有效性评价,该期对最终确定新药的临床价值有重要意义。

(5) 0期临床试验:完成临床前研究,但还未进入临床研究的探索性试验,先于I期临床试验,不以疗效评价为目的,目的是评价受试药物安全性和药动学特征,微剂量不大于100 μ g,受试者为6人左右。

【55~56】

【参考答案】BE

【解析】本组题考查的是联合用药的药理作用。磺胺甲噁唑与甲氧苄啶合用,其抗菌作用增强10倍;克林霉素与红霉素联用,红霉素可置换靶位上的克林霉素,或阻碍克林霉素与细菌核糖体50S亚基结合,从而产生拮抗作用。

【57~58】

【参考答案】BD

【解析】本组题考查的是国际药品标准。《美国药典》(USP);《英国药典》(BP);《欧洲药典》(Ph.Eur.或EP);《中国药典》(ChP);《日本药典》(JP)。

【59~60】

【参考答案】AC

【解析】本组题考查的是药物化学结构对转运体的影响。阿昔洛韦结构修饰用L-缬氨

酸酯化得到的伐昔洛韦,可使药物通过PEPT1的吸收增加3~5倍。抗过敏药特非那定对HERGK通道具有抑制作用,可诱发药源性心律失常。

【61~64】

【参考答案】CEDB

【解析】本组题考查的是循环系统疾病用药的重点药物。羟甲戊二酰辅酶A还原酶抑制剂,即他汀类,代表药物洛伐他汀、辛伐他汀、氟伐他汀、阿托伐他汀等。血管紧张素转换酶抑制剂(ACEI),代表药物包括卡托普利、依那普利、赖诺普利、贝那普利等。钙通道阻滞剂包括:①1,4-二氢吡啶类,代表药物有硝苯地平、尼群地平、氨氯地平、尼莫地平;②芳烷基胺类,代表药物有维拉帕米;③苯硫氮䓬类,代表药物有地尔硫䓬。美托洛尔,又名倍他洛克,临床应用的是其酒石酸盐,该药物具有4-甲氧乙基取代芳氧丙醇胺结构,为选择性的 β_1 受体拮抗剂。

【65~67】

【参考答案】ACB

【解析】本组题考查的是片剂制备中的常见问题及原因。

(1) 裂片:片剂发生裂开的现象叫作裂片,主要有顶裂和腰裂两种形式,裂开的位置分别发生在药片的顶部(或底部)和中间。产生裂片的处方因素有:①物料中细粉太多,压缩时空气不能及时排出,导致压片后气体膨胀而裂片;②物料的塑性较差,结合力弱。产生裂片的原因除处方因素外,还有工艺因素。

(2) 松片:片剂硬度不够,稍加触动即散碎的现象称为松片。主要原因是黏性差,压缩压力不足等。

(3) 崩解迟缓:崩解迟缓或崩解超限系指片剂崩解时间超过了药典规定的崩解时限。影响崩解的主要原因是:①片剂的压力过大,导致内部空隙小,影响水分渗入;②增塑性物料或黏合剂使片剂的结合力过强;③崩解剂性能较差。

(4) 溶出超限:溶出超限系指片剂在规定的时间内未能溶解出规定的药量。主要原因是:片剂不崩解,颗粒过硬,药物的溶解度差等。

(5) 含量不均匀:主要原因是片重差异超限、药物的混合度差、可溶性成分的迁移等。小剂量药物更易出现含量不均匀的问题。

【68~70】

【参考答案】ACD

【解析】本组题考查的是药物化学结构与药物代谢。保泰松的苯环氧化引入羟基生成活性大、毒性降低的羟布宗。烯炔类药物经代谢生成环氧化物后,可以被转化为二羟基化合物,或者是和体内生物大分子如蛋白质、核酸等进行烷基化反应,而产生毒性,导致组织坏死和致癌作用。如抗惊厥药物卡马西平,在体内代谢生成10,11-环氧化物,这一环氧化物是卡马西平产生抗惊厥作用的活性成分,是代谢活化产物,该环氧化物经进一步代

谢,被环氧化物水解酶立体选择性地水解产生 10S,11S-二羟基化合物,经由尿排出体外。N-脱烷基化和和氧化脱氨是氧化过程的两个不同方面,本质都是碳—氮键的断裂,条件是与氮原子相连的烷基碳上应有氢原子,该氢原子被氧化成羟基,生成的羟基胺是不稳定的中间体,会发生自动裂解。

【71~73】

【参考答案】CDE

【解析】本组题考查的是静脉注射脂肪乳、维生素 C 注射剂、醋酸可的松滴眼液的处方分析。维生素 C 注射剂中维生素 C 是主药,显强酸性,由于注射时刺激性大,会产生疼痛,故加碳酸氢钠或碳酸钠,中和部分维生素 C 成钠盐,以避免疼痛;同时由于碳酸氢钠的加入调节了 pH,可增强本品的稳定性。维生素 C 容易被氧化,依地酸二钠是金属螯合剂,用来络合金属离子,防止药品被氧化。亚硫酸氢钠是还原剂(抗氧剂),可以防止药品被氧化。静脉注射脂肪乳中精制大豆油是油相,也是主药,精制大豆磷脂是乳化剂,注射用甘油是等渗调节剂。醋酸可的松滴眼液中羧甲基纤维素钠为助悬剂,配液前需精制。本滴眼液中不能加入阳离子型表面活性剂,因与羧甲基纤维素钠有配伍禁忌。硼酸为 pH 与等渗调节剂,因氯化钠能使羧甲基纤维素钠黏度显著下降,促使结块沉降,改用 2% 的硼酸后,不仅改善降低黏度的缺点,且能减轻药液对眼黏膜的刺激性。

【74~76】

【参考答案】ABE

【解析】本组题考查的是 5-羟色胺(5-HT)重摄取抑制剂、非苯二氮草类药物、阿片类药物的依赖性治疗。氟西汀及其代谢产物去甲氟西汀都选择性地抑制中枢神经系统对 5-HT 的再吸收,延长和增加 5-HT 的作用,为较强的抗抑郁药。氟西汀口服吸收良好,生物利用度为 100%。佐匹克隆结构中含有一个手性中心,右旋异构体为艾司佐匹克隆,具有很好的短效催眠作用,而左旋体无活性且易引起毒副作用。美沙酮系合成的阿片类镇痛药,其作用维持时间长,成瘾潜力小,且口服吸收好,是目前用作阿片类药物如海洛因依赖性患者替代递减治疗的主要药物。

【77~78】

【参考答案】DA

【解析】本组题考查的是低分子液体制剂。搽剂:无破损皮肤揉擦用的液体制剂;涂膜剂:指药物溶解于含膜材料溶剂中,涂搽患处后形成薄膜的外用液体制剂。

【79~81】

【参考答案】DBA

【解析】本组题考查的是血药浓度与时间的关系、稳态血药浓度、一阶矩。血药浓度与时间的关系是 $C = \frac{k_0}{kV}(1 - e^{-kx})$; 稳态血药浓度 $C_{ss} = \frac{k_0}{kV}$; 药物在体内的平均滞留时间 $MRT = \frac{AUMC}{AUC}$ 。

【82~83】

【参考答案】EA

【解析】本组题考查的是药物制剂化学和物理稳定性变化。化学稳定性是指药物由于水解、氧化等因素发生化学降解,造成药物含量(或效价)下降、产生有毒或副作用的降解产物、色泽发生变化等。物理稳定性是指制剂的物理性质发生变化,如混悬剂的结块、结晶生长,乳剂的分层、破裂,片剂的崩解度、溶出速度改变等。

【84~86】

【参考答案】DCB

【解析】本组题考查的是布洛芬混悬液的附加剂。布洛芬口服混悬液中矫味剂是山梨醇,pH 调节剂是枸橼酸,甘油为润湿剂,羟丙甲纤维素为助悬剂。

【87~89】

【参考答案】BDC

【解析】本组题考查的是药物不良反应的分类。首剂效应是指一些患者在初服某种药物时,由于机体对药物作用尚未适应而引起不可耐受的强烈反应,例如哌唑嗪等按常规剂量开始治疗常可致血压骤降。后遗效应是指在停药后血药浓度已降至最低有效浓度以下时仍残存的药理效应。后遗效应可为短暂的或是持久的,如服用苯二氮草类镇静催眠药物后,在次晨仍有乏力、困倦等“宿醉”现象。副作用是指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,例如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。

【90~91】

【参考答案】CA

【解析】本组题考查的是注射剂的附加剂。

抗氧剂	焦亚硫酸钠、亚硫酸氢钠(用于酸性) 亚硫酸钠等、硫代硫酸钠(用于碱性)
金属离子螯合剂	乙二胺四乙酸二钠(EDTA·2Na)
缓冲剂	醋酸/醋酸钠、枸橼酸/枸橼酸钠、酒石酸/酒石酸钠、乳酸
助悬剂	CMC、明胶、果胶
稳定剂(了解)	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

【92~93】

【参考答案】CE

【解析】本组题考查的是注射剂的溶剂与附加剂。普通药物制剂溶剂主要用纯化水。灭菌注射用水:为注射用水按照注射剂生产工艺流程制备,不含任何添加剂。为注射用灭菌粉末的溶剂或注射剂的稀释剂。

【94~96】

【参考答案】DEA

【解析】本组题考查的是药物配伍变化的类型。物理学的配伍变化:①溶解度改变,例如氯霉素注射液(含乙醇、甘油或丙二醇等)加入5%葡萄糖注射液中时往往析出氯霉素;②吸湿、潮解、液化与结块;③粒径或分散状态的改变。化学的配伍变化:①浑浊或沉淀。②变色,如维生素C与烟酰胺,即使是干燥粉末混合也会变色;多巴胺注射液与碳酸氢钠注射液配伍后会逐渐变成粉红至紫色;氨茶碱或异烟肼与乳糖混合变成黄色;③产气;④发生爆炸;⑤产生有毒物质;⑥分解破坏、疗效下降。药理学的配伍变化:①协同作用;②拮抗作用;③增加毒副作用。

【97~98】

【参考答案】AB

【解析】本组题考查的是药物的溶解度、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具有水溶性。足够的亲水性能够保证药物分子溶于水相,适宜的亲脂性保障药物对细胞膜的渗透性。药物的溶解性和渗透性之间既对立又统一,生物药剂学分类系统根据药物溶解性和肠壁渗透性的不同组合将药物分为四类:第Ⅰ类是高水溶性、高渗透性的两亲性分子药物,其体内吸收取决于胃排空速率,如普萘洛尔、依那普利、地尔硫革等;第Ⅱ类是低水溶性、高渗透性的亲脂性分子药物,其体内吸收取决于溶解速率,如双氯芬酸、卡马西平、匹罗昔康等;第Ⅲ类是高水溶性、低渗透性的水溶性分子药物,其体内吸收受渗透效率影响,如雷尼替丁、纳多洛尔、阿替洛尔等;第Ⅳ类是低水溶性、低渗透性的疏水性分子药物,其体内吸收比较困难,如特非那定、酮洛芬、呋塞米等。

【99~100】

【参考答案】EC

【解析】本组题考查的是布洛芬和舒林酸的性质。舒林酸是前药,需要在体内经过肝脏代谢之后,甲基亚砷还原成甲硫基后才能产生生物活性。布洛芬和萘普生均属于芳基丙酸类非甾体抗炎药。

三、综合分析选择题

【101~102】

101.【参考答案】A

【解析】本题考查的是药物的转运方式。

被动转运 (大多数药物的 转运方式)	滤过	对象:水溶性的小分子物质 动力:流体静压或渗透压透过膜孔
	简单扩散	对象:解离度小,脂溶性大的易吸收 动力:膜两侧浓度差

续表

主动转运	生命必需物质(K^+ 、 Na^+ 、 I^- 、单糖、氨基酸、水溶性维生素)和有机酸、碱等弱电解质的离子型化合物
易化扩散	核苷类药物;单糖类、氨基酸类(小肠上皮细胞、脂肪细胞和血-脑屏障血液侧细胞膜中的)
膜动转运 (胞饮、吞噬、胞吐)	微粒或大分子物质(蛋白质、多肽)

102.【参考答案】C

【解析】本题考查的是主动转运特点。主动转运有如下特点:①逆浓度梯度转运;②需要消耗机体能量,能量的来源主要由细胞代谢产生的ATP提供;③转运速度与载体量有关,往往可出现饱和现象;④可与结构类似的物质发生竞争现象;⑤受抑制剂的影响,如抑制细胞代谢的二硝基苯酚、氟化物等物质可以抑制主动转运;⑥具有结构特异性,如单糖、氨基酸、嘧啶及某些维生素都有本身独立的主动转运特性;⑦主动转运还有部位特异性,例如胆酸和维生素 B_{12} 的主动转运只在小肠上段进行,维生素 B_{12} 在回肠末端部位吸收。一些生命必需物质(如 K^+ 、 Na^+ 、 I^- 、单糖、氨基酸、水溶性维生素)和有机酸、碱等弱电解质的离子型化合物等,能通过主动转运吸收。

【103~105】

103.【参考答案】C

【解析】本题考查的是奥美拉唑抑制胃酸分泌的作用机制。奥美拉唑分子具有较弱的碱性,可集中作用于弱酸性的壁细胞泌酸小管口,酸质子对苯并咪唑环上N原子进行攻击,通过发生重排、共价结合和解除结合等一系列反应。

104.【参考答案】B

【解析】本题考查的是肠溶片在肠道内的释药机制。肠溶片:指用肠溶性包衣材料进行包衣的片剂,通过包衣膜溶解使药物在肠道释放。

105.【参考答案】D

【解析】本题考查的是血药浓度的检测方法。由于血浆或血清中药物的浓度低,取样量又少,且有时患者体内会含有不止一种药物,故用于血药浓度测定的方法较体外药物测定的方法更复杂,要求也更高。常用高效液相色谱法、气相色谱法、液-质联用法、放射免疫法、荧光偏振免疫法、酶联免疫法等。

【106~108】

106.【参考答案】D

【解析】本题考查的是生物利用度的计算。绝对生物利用度 $F = AUC_T / AUC_{iv} \times 100\%$,代入数值为90%。

107.【参考答案】B

【解析】本题考查的是喹诺酮类抗菌药物的结构特点。在喹诺酮类抗菌药分子中的关键药效团是 3 位羧基和 4 位羰基,该药效团与 DNA 螺旋酶和拓扑异构酶 IV 结合起到至关重要的作用。

108. **【参考答案】**C

【解析】本题考查的是喹诺酮类抗菌药物。在喹诺酮类药物的 6 位和 8 位同时引入两个氟原子并在 7 位引入 3-甲基哌嗪得到洛美沙星,8 位氟原子取代基可提高口服生物利用度,可达到 95%~98%,口服吸收迅速、完全且稳定性强,口服后仅有 5% 的药物经生物转化后代谢,60%~80% 的药物以原形从尿液中排出,但 8 位氟原子取代可增加其光毒性。

【109~110】

109. **【参考答案】**A

【解析】本题考查的是影响药物分布的因素。影响药物分布的方式可表现为相互竞争血浆蛋白结合部位,改变游离型药物的比例;或者改变药物在某些组织的分布量,从而影响它的消除。

110. **【参考答案】**B

【解析】本题考查的是药物与血浆蛋白的结合特性。结合型药物有以下特性:①不呈现药理活性;②不能通过血脑屏障;③不被肝脏代谢灭活;④不被肾排泄。只有游离型药物才能起作用。药物的血浆蛋白结合率各不相同。

四、多项选择题

111. **【参考答案】**ABCDE

【解析】本题考查的是非经胃肠道给药的剂型。非经胃肠道给药的剂型是指除胃肠道给药途径以外的其他所有剂型,包括:①注射给药:如注射剂,包括静脉注射、肌肉注射、皮下注射及皮内注射等;②皮肤给药:如外用溶液剂、洗剂、软膏剂、贴剂、凝胶剂等;③口腔黏膜给药:如漱口剂、含片、舌下片剂、膜剂等;④鼻腔给药:如滴鼻剂、喷雾剂、粉雾剂等;⑤吸入给药:如气雾剂、吸入剂、粉雾剂等;⑥眼部给药:如滴眼剂、眼膏剂、眼用凝胶、植入剂等;⑦直肠、阴道和尿道给药:如灌肠剂、栓剂等。

112. **【参考答案】**BCD

【解析】本题考查的是药物的量效关系。量效曲线斜率大的药物,药量微小的变化,会引起药物效应的明显改变;效价强度数值越小则药物的效价强度越大。

113. **【参考答案】**ABCDE

【解析】本题考查的是药物结构与性质的关系。 LD_{50} 、 ED_{50} 属于生物活性, pK_a 是解离常数,属于理化性质,旋光度属于理化性质,半衰期是体内过程。故 ABCDE 全选。

114. **【参考答案】**DE

【解析】本题考查的是药物消除的概念。药物的吸收、分布和排泄过程统称为转运,而分布、代谢和排泄过程称为处置,代谢与排泄过程合称为消除。

115. **【参考答案】**ABC

【解析】本题考查的是栓剂的常用基质。油脂性基质:①可可豆脂;②半合成或全合成脂肪酸甘油酯:椰油酯、棕榈酸酯、混合脂肪酸甘油酯。水溶性基质:①甘油明胶;②聚乙二醇;③泊洛沙姆。

116. **【参考答案】**ABCDE

【解析】本题考查的是片剂包衣的目的。片剂包衣的目的:控制药物释放部位(肠溶片);控制药物释放速度(缓、控释);增加药物稳定性;掩盖药物苦味或不良气味;防止药物配伍变化;改善片剂外观。

117. **【参考答案】**ABCDE

【解析】本题考查的是药物制剂稳定化方法。①制成固体制剂:凡在水溶液中不稳定的药物,制成固体制剂可显著改善其稳定性;②制成微囊或包合物:采用微囊化和包合技术,可防止药物因受环境中的氧气、湿度、水分、光线的影响而降解,或因挥发性药物挥发而造成损失,从而增加药物的稳定性;③采用直接压片或包衣工艺:包衣也可改善药物对光及湿热的稳定性;对不稳定的成分进行结构改造,如制成盐类、酯类、酰胺类或高熔点衍生物,可以提高制剂的稳定性。将有效成分制成前体药物,也是提高其稳定性的一种方法。

118. **【参考答案】**BCD

【解析】本题考查的是可制成胶囊的药物要求。胶囊剂型对内容物具有一定的要求,一些药物不适宜制备成胶囊剂。例如:①会导致囊壁溶化的水溶液或稀乙醇溶液药物;②会导致囊壁软化的风化性药物;③会导致囊壁脆裂的强吸湿性药物;④会导致明胶变性的醛类药物;⑤会导致囊材软化或溶解的含有挥发性、小分子有机物的液体药物;⑥会导致囊壁变软的 O/W 型乳剂药物。

119. **【参考答案】**ABE

【解析】本题考查的是聚山梨酯 80。聚山梨酯 80 可作为增溶剂、乳化剂、促吸收剂。

120. **【参考答案】**ABC

【解析】本题考查的是需进行血药浓度监测的情况。①个体差异大:三环类抗抑郁药;②非线性动力学特征:如苯妥英钠;③治疗指数小、毒性反应强:强心苷类药、茶碱、锂盐、普鲁卡因胺等;④毒性反应不易识别,用量不当或用量不足的临床反应难以识别的药物:地高辛;⑤特殊人群用药:如肾功能不全患者禁用氨基糖苷类;⑥常规剂量下没有疗效或出现毒性反应;⑦合并用药而出现的异常反应;⑧长期用药,血药浓度受各种因素影响而发生变化;⑨诊断和处理药物过量或中毒。

模拟试卷(二)

一、最佳选择题

1.【参考答案】E

【解析】本题考查的是药物的配伍变化。以下药物混合研磨时,可能发生爆炸:氯化钾与硫,高锰酸钾与甘油,强氧化剂与蔗糖或葡萄糖等。

2.【参考答案】E

【解析】本题考查的是缓释、控释制剂的分类。根据释药类型分:定时、定位、定速释药系统。定时:又称脉冲释放,是按生物时间节律特点设计,能定时定量脉冲释放有效剂量药物的剂型。按制备技术不同分为渗透泵脉冲释药系统、包衣脉冲释药系统和定时脉冲塞胶囊等。

3.【参考答案】E

【解析】本题考查的是成囊材料。常用天然高分子成囊材料有明胶、阿拉伯胶、海藻酸盐、壳聚糖。

4.【参考答案】B

【解析】本题考查的是氟尿嘧啶的作用机制。去氧氟尿苷是氟尿嘧啶类衍生物,在肿瘤组织中被高活性的嘧啶核苷磷酸化酶转化成5-FU,发挥其选择性抗肿瘤作用。在肿瘤组织中,嘧啶核苷磷酸化酶的活性较正常组织高,所以去氧氟尿苷在肿瘤细胞内转化为5-FU的速度快,而对肿瘤具有选择性作用。

5.【参考答案】E

【解析】本题考查的是微球的特点。微球具有靶向性,选项中只有二甲双胍是普通制剂,没有靶向性。

6.【参考答案】B

【解析】本题考查的是激动剂的定义。与受体结合既有亲和力,又有内在活性的药物称为激动药,它们能与受体结合并激活受体产生效应。

7.【参考答案】D

【解析】本题考查的是西咪替丁的化学结构组成。西咪替丁由咪唑五元环、含硫醚的四原子链和末端取代胍三部分构成。

8.【参考答案】D

【解析】本题考查的是单室模型静脉滴注给药。

$$n = -3.21 \lg(1 - f_{ss})$$

半衰期个数(n)	达坪浓度(C _{ss} %)	半衰期个数(n)	达坪浓度(C _{ss} %)
1	50.00	5	96.88
2	75.00	6	98.44
3	87.50	6.64	99.00
3.32	90.00	7	99.22
4	93.75	8	99.61

9.【参考答案】C

【解析】本题考查的是微囊技术。挥发油等制成微囊能够防止挥发,提高了制剂的物理稳定性,且微囊使液态药物固态化,便于制剂的生产、贮存和使用,如油类、香料和脂溶性维生素等。

10.【参考答案】C

【解析】本题考查的是喹诺酮类抗菌药的构效关系。喹诺酮类药物的构效关系中,8位与1位以氧烷基成环,使活性增强,但光毒性也增加。

11.【参考答案】D

【解析】本题考查的是表观分布容积。表观分布容积是体内药量与血药浓度间相互关系的一个比例常数,用“V”表示,V=X/C。分布容积大,甚至超过体液总体积,药物在血液中浓度较低,组织摄取量多。即药物主要分布在组织。

12.【参考答案】E

【解析】本题考查的是临床前药理毒理学研究。临床前药理毒理学研究包括药效学研究、一般药理学研究、药动学研究、毒理学研究四个方面。人体研究属于临床研究。

13.【参考答案】D

【解析】本题考查的是维生素C注射液处方的实例分析。维生素C分子中有烯二醇式结构,显强酸性,注射时刺激性大,产生疼痛,故加入碳酸氢钠,使维生素C部分中和成盐,以避免疼痛,同时碳酸氢钠起调节pH作用,以增强维生素C注射液的稳定性;维生素C还易受到空气中的氧、溶液的pH和金属离子(特别是铜离子)的影响,故加入抗氧化剂亚硫酸氢钠和金属离子络合剂依地酸二钠,增强其稳定性。注射用水作溶剂。

14.【参考答案】D

【解析】本题考查的是对因治疗。对因治疗:消除原发致病因子,治愈疾病的药物治疗。如使用抗生素杀灭病原微生物,控制感染性疾病;铁制剂治疗缺铁性贫血;补充体内营养或代谢物质不足等。对症治疗:用药后能改善患者疾病的症状。如应用解热镇痛药降低高热患者的体温,缓解疼痛。硝酸甘油缓解心绞痛;抗高血压药降低患者过高的血压等。

选项中只有 D 选项属于对因治疗,其他都属于对症治疗。

15.【参考答案】E

【解析】本题考查的是四环素类药物的结构特征。盐酸米诺环素为四环素脱去 C6 位甲基和 C6 位羟基,同时在 C7 位引入二甲氨基得到的衍生物,由于脱去 C6 位羟基,盐酸米诺环素对酸很稳定,不会发生脱水 and 重排而形成内酯环产物。

16.【参考答案】C

【解析】本题考查的是水溶性基团和脂溶性基团。亲水性基团有:羟(疏)基、羧基、磺酸基、氨基、季铵。亲脂性基团有:烃基、卤素、酯键、硫原子、烷氧基(醚键)、硝基。

17.【参考答案】D

【解析】本题考查的是药物的治疗指数。药物的安全性与 LD_{50} 大小成正比,与 ED_{50} 大小成反比,故常以药物 LD_{50} 与 ED_{50} 的比值,表示药物的安全性,称为治疗指数,此数值越大越安全。

18.【参考答案】D

【解析】本题考查的是絮凝的特点。混悬剂中如果加入适量的电解质,可使 ζ 电位降低到一定程度,即微粒间的排斥力稍低于吸引力,此时微粒成疏松的絮状聚集体,经振摇又可恢复成均匀的混悬剂,这个现象叫絮凝,所加入的电解质称为絮凝剂。为了保证混悬剂的稳定性,一般控制 ζ 电位在 20~25 mV,使其能发生絮凝。如加入电解质后使 ζ 电位升高,阻碍微粒之间的碰撞聚集,这个过程称为反絮凝,能起反絮凝作用的电解质称为反絮凝剂,适宜的反絮凝体系也有利于混悬剂的稳定性。同一电解质可因用量不同,在混悬剂中可以起絮凝作用(降低 ζ 电位)或起反絮凝剂作用(升高 ζ 电位)。如枸橼酸盐、枸橼酸氢盐、酒石酸盐、酒石酸氢盐、磷酸盐和一些氯化物(如三氯化铝)等,既可作絮凝剂,又可作反絮凝剂。通常阴离子的絮凝作用大于阳离子的,离子的价数越高,絮凝、反絮凝作用越强。

19.【参考答案】C

【解析】本题考查的是酸碱性、解离度和 pK_a 值对药效的影响。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,这种比例的变化与药物的解离常数(pK_a)和体液介质的 pH 有关,酸性药物的 pK_a 大于消化道体液 pH 时($pK_a > pH$),分子型药物所占比例高;当 $pK_a = pH$ 时,非解离型和解离型药物各占一半;当 pH 变动一个单位时,[非解离型药物/离子型药物]的比例也随即变动 10 倍。

20.【参考答案】E

【解析】本题考查的是效能和效价强度。效能和效价强度反应药物的不同性质,二者具有不同的临床意义,常用于评价同类药物中不同品种的作用特点。故效能值越大效价强度就越大的说法错误。

21.【参考答案】C

【解析】本题考查的是抗真菌药的分类。咪唑类抗真菌药物的代表药物为噻康唑、益康唑、酮康唑、咪康唑等。三氮唑类代表药物有氟康唑、伏立康唑和伊曲康唑等。

22.【参考答案】E

【解析】本题考查的是取样的原则。当一批样品的包装件数(N)不多于 100 时,抽样单元数(n)按下表确定:

N	n
1	1
2~5	2
6~10	3
11~20	4
21~30	5
31~40	6
41~50	7
51~70	8
71~90	9
91~100	10

23.【参考答案】B

【解析】本题考查的是受体的性质。选择性与特异性:多数药物在一定的剂量范围,对不同的组织和器官所引起的药理效应和强度不同,称作药物作用的选择性。药物对受体作用的特异性与药理效应的选择性不一定平行,选择性高的,特异性不一定高。如阿托品特异性阻断 M 胆碱受体,但对心脏、平滑肌、血管、腺体、中枢神经都有作用,特异性不高。

24.【参考答案】B

【解析】本题考查的是平喘药的分类。平喘药主要包括:① β_2 受体激动剂,代表药物有沙丁胺醇、沙美特罗、特布他林、班布特罗;②影响白三烯的平喘药,代表药物有孟鲁司特、扎鲁司特;③M 胆碱受体阻断剂,代表药物有噻托溴铵、异丙托溴铵;④糖皮质激素,代表药物有丙酸倍氯米松、丙酸氟替卡松、布地奈德;⑤磷酸二酯酶抑制剂,代表药物有茶碱。

25.【参考答案】E

【解析】本题考查的是药物代谢第 II 相反应。第 II 相生物结合反应共 6 种:与葡萄糖醛酸的结合反应、与氨基酸的结合反应、与硫酸的结合反应、乙酰化(乙酸化)结合反应、与谷胱甘肽的结合反应、甲基化结合反应。

26.【参考答案】D

【解析】本题考查的是受体作用的信号转导。第一信使作用于靶细胞后在细胞浆内产生的信息分子属于第二信使。如环磷酸腺苷(cAMP)、环磷酸鸟苷(cGMP)、二酰基甘油(DG)、三磷酸肌醇(IP3)、钙离子、碳烯酸、一氧化氮(NO)等。

27.【参考答案】B

【解析】本题考查的是栓剂的吸收促进剂。通过与阴道或直肠接触而起全身治疗作用的栓剂,可利用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、环糊精类衍生物等作为药物的吸收促进剂,以增加药物的吸收。

28.【参考答案】E

【解析】本题考查的是被动转运的特点。被动转运是物质从高浓度区域向低浓度区域的转运。转运速度与膜两侧的浓度差成正比,转运过程不需要载体,不消耗能量。膜对通过的物质无特殊选择性,不受共存其他物质的影响,即无饱和现象和竞争抑制现象,一般也无部位特异性。大多数药物以这种被动转运方式通过生物膜。

29.【参考答案】A

【解析】本题考查的是药动学方面的药物相互作用。竞争血浆蛋白结合部位:药物与血浆蛋白结合后表现为不呈现药理活性、不能通过血脑屏障、不被肝脏代谢灭活、不被肾脏排泄。阿司匹林、保泰松、吲哚美辛、氯贝丁酯、水合氯醛及磺胺药等都具有蛋白置换作用。

30.【参考答案】A

【解析】本题考查的是乙酰半胱氨酸用于对乙酰氨基酚中毒解救的作用机制。乙酰半胱氨酸可作为谷胱甘肽的类似物,用于对乙酰氨基酚中毒的解救,其作用机制是可以通过巯基与对乙酰氨基酚在肝内的毒性代谢物结合,使之失活,结合物易溶于水,通过肾脏排出。

31.【参考答案】D

【解析】本题考查的是药物的典型官能团对生物活性的影响。羧酸成酯可增大脂溶性,易被吸收。酯基易与受体的正电部分结合,其生物活性也较强。羧酸成酯后的生物活性与羧酸有很大区别。酯类化合物进入体内后,易在体内酶的作用下发生水解反应生成羧酸。利用这一性质,将羧基制成酯的前药,既可增加药物吸收,又降低药物的酸性,减少对胃肠道的刺激性作用。

32.【参考答案】D

【解析】本题考查的是肝药酶诱导剂。肝药酶是动物体内一种重要的代谢酶,进入血液循环的药物基本上是经肝药酶代谢的,所以对肝药酶有影响的药物,也会影响到药物的代谢,其中使肝药酶活性增强的药物称为肝药酶诱导剂,使肝药酶活性减弱的药物称为肝

药酶抑制剂;肝药酶诱导剂是指有些药物长期使用后能加速肝药酶的合成并增强其活性,这类药物就称为肝药酶诱导剂。苯巴比妥、苯妥英钠、卡马西平、利福平等都是肝药酶诱导剂。

33.【参考答案】B

【解析】本题考查的是药物结构与第 I 相生物转化的规律。第 I 相生物转化,也称为药物的官能团化反应,是体内的酶对药物分子进行的氧化、还原、水解、羟基化等反应,在药物分子中引入或使药物分子暴露出极性基团,如羟基、羧基、巯基、氨基等。利多卡因属于胺类化合物,胺类药物的氧化代谢主要发生在两个部位,一是在和氮原子相连接的碳原子上,发生 N-脱烷基化和脱氨反应,另一种是发生氧化反应。胺类药物的脱烷基代谢是这类药物主要且重要的代谢途径之一。胺类化合物 N-脱烷基化的基团通常是甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、烯丙基和苄基,以及其他具有 α -氢原子的基团。取代基的体积越小,越容易被脱去。对于叔胺和仲胺化合物,叔胺的脱烷基化反应速度比仲胺快,这与它们之间的脂溶性有关。如利多卡因的代谢,脱第一个乙基比脱第二个乙基容易。利多卡因在进入血脑屏障后产生的脱乙基化代谢产物会引起中枢神经系统的副作用。

34.【参考答案】A

【解析】本题考查的是需要测定比旋度的药品实例。《中国药典》要求测定比旋度的药物很多,如肾上腺素、硫酸奎宁、葡萄糖、阿莫西林、氢化可的松、蔗糖、乳糖等。

35.【参考答案】B

【解析】本题考查的是生理性拮抗。生理性拮抗:两种激动药分别作用于生理作用相反的两个特异性受体。如组胺和肾上腺素合用,治疗过敏性休克,拟肾上腺素药和三环类抗抑郁药与去甲肾上腺素重摄取抑制剂合用,引起高血压危象。

36.【参考答案】B

【解析】本题考查的是注射剂的特点。混悬型注射剂一般仅供肌内注射;肌内注射可以是溶液剂、混悬剂或乳剂。

37.【参考答案】D

【解析】本题考查的是二氢吡啶类的钙通道阻滞剂的结构特点。苯磺酸氨氯地平与其他二氢吡啶类钙通道阻滞剂不同,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,导致 3,5 位羧酸酯的结构不同,因而 4 位碳原子具有手性,可产生两个光学异构体,临床用外消旋体和左旋体。

38.【参考答案】B

【解析】本题考查的是出现不良反应时的患者教育。当患者用药后出现不良反应时,或既往有不良反应史,药师应主动向患者提供咨询。故选 B。

39.【参考答案】E

【解析】本题考查的是与葡萄糖醛酸的结合反应。与葡萄糖醛酸的结合反应是药物代谢中最普遍的结合反应,生成的结合产物含有可离解的羧基(pK_a 3.2)和多个羟基,无生物活性,易溶于水和排出体外。葡萄糖醛酸的结合反应共有四种类型:O-葡萄糖醛苷化、N-葡萄糖醛苷化、S-葡萄糖醛苷化和C-葡萄糖醛苷化。

40. **【参考答案】**C

【解析】本题考查的是散剂的特点。由于散剂的分散度较大,往往对制剂的吸湿性、化学活性、气味、刺激性、挥发性等性质影响较大,故对光、湿、热敏感的药物一般不宜制成散剂。

二、配伍选择题

【41~43】

【参考答案】DAB

【解析】本组题考查的是药物的转运方式。被动靶向制剂是利用药物载体被生理过程自然吞噬而实现靶向的制剂(属于自然靶向)。如脂质体、微乳、微囊、微球、纳米粒等。缓控释制剂按存在状态分为骨架型:骨架片(丸)、缓、控释颗粒(微囊)压制片、胃内滞留片、生物黏附片等;膜控型:微孔膜包衣片、膜控释片、肠溶膜控释片、膜控释小丸。口服速释制剂包括口崩片、分散片。

【44~46】

【参考答案】CAD

【解析】本组题考查的是乳膏剂中常用的辅料。以水杨酸乳膏为例,常用的保湿剂有甘油、丙二醇和山梨醇等;常用的乳化剂有皂类、月桂醇硫酸钠等;常用的防腐剂有羟苯乙酯、氯甲酚等。

【47~49】

【参考答案】CAE

【解析】本组题考查的是经皮给药制剂。控释膜材料:乙烯-醋酸乙烯共聚物、聚硅氧烷、聚丙烯。背衬材料:常用多层复合铝箔(铝箔、聚乙烯或聚丙烯)、PET、高密度PE、聚苯乙烯等。药物储库层是有厚为0.01~0.7 mm的聚乙烯醇或聚醋酸乙烯酯或其他高分子材料制成的一层膜。

【50~52】

【参考答案】BAC

【解析】本组题考查的是静脉注射用脂肪乳的处方注解。精制大豆油是油相,也是主药,精制大豆磷脂是乳化剂,注射用甘油是等渗调节剂。

【53~55】

【参考答案】CAB

【解析】本组题考查的是非共价键的键合类型。离子-偶极、偶极-偶极相互作用通常见于羰基化合物,如乙酰胆碱和受体的结合。共价键键合类型多发生在化学治疗药物的作用机制上,例如烷化剂类抗肿瘤药物,与DNA中鸟嘌呤碱基形成共价结合键,产生细胞毒活性。碳酸和碳酸酐酶的结合,形成的主要键合类型是氢键。

【56~57】

【参考答案】CE

【解析】本组题考查的是药物转运方式的特点。主动转运需要载体,有饱和现象、有竞争、抑制现象,具有结构特异性、部位特异性。细胞通过膜动转运摄取液体称为胞饮,摄取的是微粒或大分子物质称为吞噬,大分子物质从细胞内转运到细胞外称为胞吐。

【58~60】

【参考答案】DAE

【解析】本组题考查的是解热、镇痛及抗炎药的结构特点及性质。贝诺酯为对乙酰氨基酚与阿司匹林形成的酯,是前药,相对胃肠道反应小,在体内水解成原药,具有解热、镇痛及抗炎作用。双氯芬酸是芳基乙酸类药物中具有标志性的代表药物,抗炎、镇痛和解热作用很强,不良反应少,且在非甾体药物中剂量最小,双氯芬酸分子中两个间位氯原子迫使苯胺中的苯环与苯乙酸中的苯环非共平面,此种结构有利于非甾体抗炎药与环氧酶的活性部分结合。尽管布洛芬(S)异构体的活性比(R)异构体强28倍,但布洛芬通常以外消旋体上市,因为布洛芬在体内会发生转化,无效的(R)异构体可转化为有效的(S)异构体。

【61~63】

【参考答案】DAB

【解析】本组题考查的是片剂包衣材料的分类。薄膜包衣可用高分子包衣材料,包括胃溶型(普通型)、肠溶型和水不溶型三大类:①胃溶型系指在水或胃液中可以溶解的材料,主要有羟丙甲纤维素(HPMC)、羟丙纤维素(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)等;②肠溶型系指在胃中不溶,但可在pH较高的水及肠液中溶解的成膜材料,主要有虫胶、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);③水不溶型系指在水中不溶解的高分子薄膜材料,主要有乙基纤维素(EC)、醋酸纤维素等。

【64~66】

【参考答案】ACB

【解析】本组题考查的是药物的分布、代谢及排泄。首过效应:口服药物在尚未吸收进入血液循环之前,在肠黏膜和肝脏被代谢而使进入血液循环的原形药量减少的现象,称为“首过效应”。首过效应使药物生物利用度降低,首过效应大的药物宜改变给药途径。血液与脑组织之间存在屏障,脑组织对外来物质有选择性摄取的能力称为血脑屏障。血脑屏

障的作用在于保护中枢神经系统,使其具有稳定的化学环境。肠肝循环:是指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,重新进入血液循环的现象,有肠肝循环的药物在体内能停留较长时间。

【67~68】

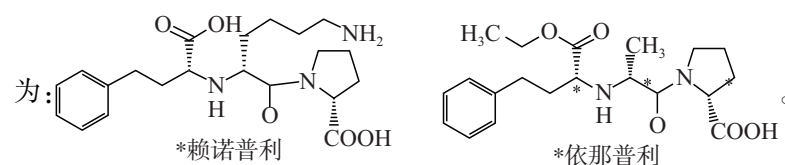
【参考答案】CE

【解析】本组题考查的是萘丁美酮和舒林酸的结构特点。萘丁美酮为非酸性的前体药物,其本身无环氧酶抑制活性。小肠吸收后,经肝脏首过效应代谢为活性代谢物,即原药6-甲氧基-2-萘乙酸起作用。舒林酸有几何异构现象,药用顺式体(Z),可保证亚磺酰基与萘的苯环在同侧。舒林酸属于前体药物,它在体外无效,在体内经肝代谢,甲基亚砜基被还原为甲硫基化合物而显示生物活性。

【69~70】

【参考答案】AB

【解析】本组题考查的是ACE抑制剂的结构特点。赖诺普利、依那普利的结构分别为:



【71~73】

【参考答案】CAE

【解析】本组题考查的是片剂的辅料。崩解剂:使片剂在胃肠液中迅速碎成细小颗粒。表面活性剂是指具有很强的表面活性,加入少量就能使液体的表面张力显著下降的物质。黏合剂是指依靠本身所具有的黏性赋予无黏性或黏性不足的物料以适宜黏性的辅料,使用过量,可能导致片剂崩解迟缓。

【74~77】

【参考答案】BADC

【解析】本组题考查的是滴眼剂中各成分的作用。pH的缓冲液剂有磷酸盐缓冲液、硼酸盐缓冲液。渗透压调节剂有氯化钠、葡萄糖、硼酸、硼砂。抑菌防腐有氯化钠、苯扎溴铵、甲酯、山梨酸等。常用来调整黏度的附加剂有甲基纤维素、聚乙二醇、聚维酮、聚乙烯醇等。

【78~80】

【参考答案】CBD

【解析】本组题考查的是片剂易出现的问题。颗粒不够干燥或物料易于吸湿、润滑剂选用不当或用量不足以及冲头表面锈蚀或刻字粗糙不光等,都会造成黏冲。片剂硬度不够,稍加触动即散碎的现象称为松片。原、辅料颜色有差别,制粒前未充分混匀压片时会产

生色斑。

【81~83】

【参考答案】EBA

【解析】本组题考查的是高血压的作用机制。氨氯地平是钙通道阻滞剂,阻滞钙离子跨膜进入心肌和血管平滑肌细胞。氨氯地平抗高血压作用的机制是直接松弛血管平滑肌。氟尿嘧啶是胸腺核苷合成酶抑制剂,作用机制是影响核酸合成。依那普利是血管紧张素转换酶抑制剂,作用机制是抑制血管紧张素转化酶的活性。

【84~85】

【参考答案】BB

【解析】本组题考查的是片剂的崩解时限。普通片剂的崩解时限是15 min;分散片、可溶片为3 min;舌下片、泡腾片为5 min;薄膜衣片为30 min;肠溶衣片要求在盐酸溶液中2 h内不得有裂缝、崩解或软化现象,在pH 6.8磷酸盐缓冲液中1 h内全部溶解并通过筛网等。

【86~87】

【参考答案】DC

【解析】本组题考查的是影响药物治疗作用的机体因素。机体因素包括:①生理因素(年龄、体重与体型、性别);②精神因素;③疾病因素(心脏疾病、肝脏疾病、肾脏疾病、胃肠疾病、营养不良、酸碱平衡失调、电解质紊乱、发热);④遗传因素(种族差异、特异质反应、个体差异、种属差异);⑤时辰因素;⑥生活习惯与环境。

【88~90】

【参考答案】BAC

【解析】本组题考查的是药物的适宜给药时间。①糖皮质激素——上午7~8点时一次服用;②消化药——饭时;③催眠药——睡前。

【91~93】

【参考答案】ECA

【解析】本组题考查乳剂不稳定现象的原因。乳剂类型有O/W型和W/O型,转相是由O/W乳剂转变为W/O或由W/O转变为O/W型,主要是受各种因素的影响使乳化剂的性质改变所引起的;酸败是指乳剂中的油,含有不饱和脂肪酸,极易被空气中的氧氧化,或由微生物、光、热破坏而引起酸败;絮凝是指乳剂具有双电层结构,即具有Zeta电位,当Zeta电位降至20~25 mV时,引起乳剂粒子发生絮凝。

【94~95】

【参考答案】DC

【解析】本组题考查的是抗痛风药的来源与作用机制。秋水仙碱为一种天然产物,为百合科植物丽江山慈菇的球茎中得到的一种生物碱,略有引湿性。遇光颜色变深,需

避光密闭保存。能抑制细胞菌丝分裂,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,长期用药可产生骨髓抑制,胃肠道反应是严重中毒的前兆,症状出现应立即停药。别嘌醇是通过抑制黄嘌呤氧化酶来抑制尿酸生成的药物,临床上适用于原发性和继发性高尿酸血症、反复发作或慢性痛风者、痛风石、尿酸性肾结石和尿酸性肾病,以及伴有肾功能不全的高尿酸血症。苯溴马隆属于苯并咪唑衍生物,为促尿酸排泄药,作用机制主要是通过抑制肾小管对尿酸的重吸收,从而降低血中尿酸浓度。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。

【96~97】

【参考答案】DE

【解析】本组题考查的是药物不良反应的新分类。撤药反应只发生在停止给药或剂量突然减小后,该药再次使用时可使症状得到改善,反映的可能性更多与给药时程有关,而不是与剂量有关。

【98~100】

【参考答案】ABB

【解析】本组题考查的是用于样品组分定性的色谱参数。保留时间(t_R)主要用于组分的鉴别;半峰高宽($W_{1/2}$)或峰宽(W)主要用于色谱柱柱效的评价;峰高(h)或峰面积(A)主要用于组分的含量测定。

三、综合分析选择题

【101~103】

101.【参考答案】B

【解析】本题考查的是药物储存要求。储存药品相对湿度要求为35%~75%。

102.【参考答案】C

【解析】本题考查的是药物储存要求。按质量状态实行色标管理:合格药品为绿色,不合格药品为红色,待确定药品为黄色。

103.【参考答案】C

【解析】本题考查的是药物储存要求。按要求拆除外包装的零货药品应当集中存放。

【104~106】

104.【参考答案】C

【解析】本题考查的是表观分布容积。负荷剂量即初始给药剂量 X ,要达到血药浓度 $C=0.1\text{ g}$,表观分布容积 $V=0.5\text{ L/kg}\times 60\text{ kg}=30\text{ L}$;根据表观分布容积 $V=X/C$,得出 $X=VC=30\text{ L}\times 0.1\text{ g/L}=3\text{ g}$,即需要美洛西林 3 g ,需要美洛西林/舒巴坦 3.75 g 。

105.【参考答案】C

【解析】本题考查的是美洛西林钠与舒巴坦的性质。克拉维酸是由 β -内酰胺环和氢化异唑环联合而成,张力比青霉素要大得多,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,所以克拉维酸是一种“自杀性”的酶抑制剂,而不是美洛西林。舒巴坦属于青霉素类,碳青霉烯类抗菌药物的代表药物为亚胺培南、美罗培南。

106.【参考答案】E

【解析】本题考查的是注射剂的质量要求。注射用美洛西林钠/舒巴坦为注射用无菌粉末,临用前稀释,所以质量要求不包括等渗。

【107~110】

107.【参考答案】B

【解析】本题考查的是曲马多的药理作用特点。曲马多是弱阿片受体激动剂,镇痛作用为吗啡的 $1/35$,具有一定程度的耐受性和依赖性。

108.【参考答案】E

【解析】本题考查的是曲马多的结构特性。曲马多分子中有2个手性中心,临床用其外消旋体,(+)抑制5-羟色胺,(-)去甲肾上腺素重摄取抑制剂,消旋体来自于二者的协同,强于吗啡。

109.【参考答案】A

【解析】本题考查的是曲马多的代谢途径。曲马多在体内经肝脏CYP2D6酶代谢生成O-脱甲基曲马多。

110.【参考答案】D

【解析】本题考查的是缓释片的溶出度。缓释片:指在水中或规定的介质中缓慢地非恒速释放药物的片剂。故符合盐酸曲马多缓释片溶出度的曲线为D选项。

四、多项选择题

111.【参考答案】ADE

【解析】本题考查的是药物制剂物理学的配伍变化。物理学的配伍变化:①溶解度改变,析出沉淀;②吸湿、潮解、液化和结块;③分散状态或粒径变化。化学的配伍变化:①浑浊或沉淀;②变色;③产气;④发生爆炸;⑤产生有毒物质;⑥分解破坏,疗效下降。

112.【参考答案】ABCE

【解析】本题考查的是吸入粉雾剂的特点。①无胃肠道降解作用;②无肝脏首过效应;③药物吸收迅速,给药后起效快;④大分子药物的生物利用度可以通过吸收促进剂或其他方法的应用来提高;⑤药物吸收后直接进入体循环,达到全身治疗的目的;⑥小分子药物尤其适用于呼吸道直接吸入或喷入给药;⑦可用于胃肠道难以吸收水溶性大的药物;⑧顺应

性好,特别适用于原需进行长期注射治疗的患者;⑨起局部作用的药物,给药剂量明显降低,毒副作用小。

113.【参考答案】ABD

【解析】本题考查的是转运的概念。药物的吸收、分布和排泄过程统称为转运,而分布、代谢和排泄过程称为处置,代谢与排泄过程合称为消除。

114.【参考答案】ABCD

【解析】本题考查的是吗啡的性质。有效的吗啡构型是左旋吗啡,右旋吗啡则完全没有镇痛及其他生理活性。吗啡及其盐类的化学性质不稳定,在光照下即能被空气氧化变质,这与吗啡具有苯酚结构有关。氧化可生成伪吗啡和 N-氧化吗啡。伪吗啡亦称双吗啡,是吗啡的二聚物,毒性增大。故本品应避光、密封保存。吗啡结构的 3 位是具有弱酸性的酚羟基,17 位是碱性的 N-甲基叔胺,因此,吗啡具有酸碱两性。通常将吗啡的碱性基团与酸如盐酸、硫酸等成盐后供药用,在我国临床上用吗啡的盐酸盐。

115.【参考答案】BD

【解析】本题考查的是药物的量效曲线。由图可见,a、b、c 三条曲线所达最终高度相同,则内在活性相等。相同条件下,lgC 越小,亲和力越大。

116.【参考答案】ABCE

【解析】本题考查的是包合技术的特点。包合技术的特点:包合物可使药物溶解度增大,稳定性提高;将液体药物粉末化;可防止挥发性成分挥发;掩盖药物的不良气味或味道,降低药物的刺激性与毒副作用;调节释药速率;提高药物的生物利用度等。

117.【参考答案】BDE

【解析】本题考查的是剂型对药物吸收的影响。舌下片适用于需要立即起效或避免肝脏首过效应的情况下使用,例如心血管系统疾病。经皮给药制剂避免了口服给药可能发生的肝首过效应及胃肠灭活效应。注射剂无吸收过程,可以避免首过效应。

118.【参考答案】ABCD

【解析】本题考查的是影响药物作用的因素。遗传因素:种族差异、特异质反应(个体对药物不同于常人的反应,与遗传缺陷有关)、个体差异(用药条件相同,多数人药效学和药动学相似,但一些人对同一药物反应不同)、种属差异、遗传多态性。

119.【参考答案】BD

【解析】本题考查的是靶向制剂的分类。

被动靶向制剂(巨噬细胞吞噬)	脂质体、微乳、微球、微囊、纳米粒
主动靶向制剂(修饰载体定向运送)	修饰的药物载体、前体药物
物理化学靶向制剂(理化方法定向)	磁性靶向(微球、纳米囊)、热敏感靶向、pH 敏感、栓塞性制剂(阻断血供营养)

120.【参考答案】BCD

【解析】本题考查的是常用的抗氧化剂。

(1)水溶性抗氧化剂:①用于酸性(焦亚硫酸钠、亚硫酸氢钠);②用于碱性(亚硫酸钠等、硫代硫酸钠);③维生素 C;④氨基酸。

(2)油溶性抗氧化剂:叔丁基对羟基茴香醚(BHA)、二丁甲苯酚(BHT)、维生素 E。

模拟试卷(三)

一、最佳选择题

1.【参考答案】B

【解析】本题考查的是药品的不良反应监测。药品不良反应监测的关注对象是合格药品,工作内容是上市后药品的监测。

2.【参考答案】E

【解析】本题考查的是沙利度胺的不良反应。沙利度胺具有致畸作用,产生海豹儿。

3.【参考答案】C

【解析】本题考查的是热原的性质。热原的性质:①耐热性;②滤过性;③水溶性;④不挥发性;⑤能被强酸、强碱所破坏,也能被强氧化剂如高锰酸钾或过氧化氢所破坏,超声波也能破坏热原。

4.【参考答案】A

【解析】本题考查的是他汀类药物的不良反应。他汀类药物的典型不良反应包括肌毒性(肌痛、肌病、横纹肌溶解症)、肝毒性(肝脏转氨酶 AST 及 ALT 升高)、胰腺炎、史蒂文斯-约翰综合征、多形性红斑、大疱型表皮坏死松解症。故选 A。

5.【参考答案】E

【解析】本题考查的是药物作用机制中的非特异性作用。有些药物并无特异性作用机制,而主要与理化性质有关。如消毒防腐药对蛋白质有变性作用,因此只能用于体外杀菌或防腐,不能内服。另外,还有酚类、醇类、醛类和重金属盐类等蛋白沉淀剂。有些药物利用自身酸碱性,产生中和反应或调节血液酸碱平衡,如碳酸氢钠、氯化铵等,还有些药物补充机体缺乏的物质,如维生素、多种微量元素等。

6.【参考答案】B

【解析】本题考查的是片剂的润滑剂。常用的润滑剂(广义)有硬脂酸镁(MS)、微粉硅胶、滑石粉、氢化植物油、聚乙二醇类、十二烷基硫酸钠等。而微晶纤维素(MCC)具有较强的结合力与良好的可压性,亦有“干黏合剂”之称,常用作片剂的填充剂。

7.【参考答案】A

【解析】本题考查的是药物流行病学的主要任务。药物流行病学的主要任务有:药品上市前临床试验的设计和上市后药品有效性再评价;上市后药品不良反应或非预期作用的监测;国家基本药物的遴选;药物利用情况的调查研究;药物经济学研究。不包括 A 选项。

8.【参考答案】C

【解析】本题考查的是《中国药典》的组成。《中国药典》由一部、二部、三部、四部及增

补本组成。其中,一部分类收载药材和饮片、植物油脂和提取物、成药制剂和单味制剂;二部分为两部分,第一部分收载化学药、抗生素、生化药品及各类药物制剂(列于原料药之后),第二部分收载放射性药制剂;三部收载生物制品;四部收载通则和药用辅料。《中国药典》标准体系构成包括凡例与正文及其引用的通则三部分。正文是用以检测药品质量是否达到用药要求并衡量其质量是否稳定均一的技术规定。

9.【参考答案】E

【解析】本题考查的是辛伐他汀的结构特点。辛伐他汀是在洛伐他汀十氢萘环的侧链上改造得到的药物,分子中有内酯结构,所以体外无 HMG-CoA 还原酶抑制作用,需进入体内后分子中的羟基内酯结构水解为 3,5-二羟基戊酸才表现出活性。

10.【参考答案】D

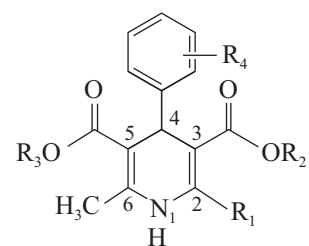
【解析】本题考查的是药动学参数。表观分布容积是体内药量与血药浓度间相互关系的一个比例常数,表观分布容积较小,一般为水溶性或极性大的药物,不易进入细胞内或脂肪组织中,血药浓度较高。故 D 选项错误。

11.【参考答案】B

【解析】本题考查的是滴丸剂的常用基质。滴丸剂水溶性基质:聚乙二醇类(如聚乙二醇 6 000、聚乙二醇 4 000 等)、硬脂酸钠、泊洛沙姆、甘油明胶、聚氧乙烯单硬脂酸酯等。滴丸剂非水溶性基质:硬脂酸、单硬脂酸甘油酯、氢化植物油、虫蜡、蜂蜡等。

12.【参考答案】C

【解析】本题考查的是氨氯地平的结构特征。1,4-二氢吡啶类基本结构如下:



,尼莫地平、尼群地平、硝苯地平、非洛地平的 2 位取代基都是甲

基,氨氯地平的 2 位取代基为 2-氨基乙氧基甲基。

13.【参考答案】C

【解析】本题考查的是药动学特征。注射给药适合于口服不吸收、在胃肠道降解、首过效应大、胃肠道刺激性大的药物。注射给药药物半衰期不变,生物利用度增加。

14.【参考答案】B

【解析】本题考查的是缓控释制剂释药的原理。利用溶出原理达到缓释作用的方法有制成溶解度小的盐或酯、与高分子化合物生成难溶性盐、控制颗粒的大小等。

15.【参考答案】E

【解析】本题考查的是常用崩解剂。常用崩解剂包括干淀粉(适用于水不溶性或微溶

性药物)、羧甲基淀粉钠(CMS-Na, 高效崩解剂)、低取代羟丙基纤维素(L-HPC, 吸水迅速膨胀)、交联羧甲基纤维素钠(CCMC-Na)、交联聚维酮(PVPP)和泡腾崩解剂(碳酸氢钠和枸橼酸组成的混合物, 也可以用柠檬酸、富马酸与碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钾)等。

16.【参考答案】D

【解析】本题考查的是肠肝循环。肠肝循环是指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, 重新进入血液循环的现象。有肠肝循环的药物在体内能停留较长时间。

17.【参考答案】B

【解析】本题考查的是山莨菪碱的性质及临床应用。氢溴酸山莨菪碱是山莨菪碱与托品酸结合的酯, 其氢溴酸盐代号为654, 天然品具左旋性, 称为654-1; 合成品为外消旋体, 称为654-2, 副作用较天然品略大。临床用于抢救感染、中毒性休克、治疗血栓、各种神经痛及平滑肌痉挛等疾病。

18.【参考答案】B

【解析】本题考查的是药物效应的拮抗作用。

受影响药物	影响药物	相互作用结果
华法林	维生素 K	抗凝作用下降
甘珀酸	螺内酯	妨碍溃疡愈合
降糖药	糖皮质激素	影响降糖作用
催眠药	咖啡因	阻碍催眠
左旋多巴	抗精神病药(有震颤麻痹不良反应)	抗震颤麻痹作用下降

19.【参考答案】C

【解析】本题考查的是药动学特征。制剂 A 吸收快, 达峰时间短, 峰浓度大, 已超过最小中毒浓度, 可能会出现中毒反应。制剂 B 达峰比制剂 A 稍慢, 血药浓度有较长时间落在最小中毒浓度与最小有效浓度之间, 因此可以得到较好的疗效。制剂 C 的血药浓度一直在最小有效浓度以下, 在临床上可能无效。

20.【参考答案】C

【解析】本题考查的是磺胺类抗菌药物的作用机制。磺胺类药物作用的靶点是细菌的二氢叶酸合成酶, 使其不能充分利用对氨基苯甲酸合成叶酸。抗菌增效剂甲氧苄啶是二氢叶酸还原酶可逆性抑制剂, 阻碍二氢叶酸还原为四氢叶酸, 影响辅酶 F 的形成, 从而影响微生物 DNA、RNA 及蛋白质的合成, 抑制了其生长繁殖。

21.【参考答案】C

【解析】本题考查的是单室模型给药。将所给数值代入公式 $C = C_0 e^{-kt}$ 、 $\lg C = -\frac{k}{2.303}t +$

$\lg C_0$ 中, 可求出 2 小时后体内血药浓度是 $20 \mu\text{g/mL}$ 。

22.【参考答案】D

【解析】本题考查的是《中国药典》的组成。通则: 明确通则所载的内容及其效力。故选 D。

23.【参考答案】C

【解析】本题考查的是包衣的目的。包衣的目的: ①掩盖药物的苦味或不良气味, 改善用药顺应性, 方便服用; ②防潮、避光, 以增加药物的稳定性; ③可用于隔离药物, 避免药物间的配伍变化; ④改善片剂的外观, 提高流动性和美观度; ⑤控制药物在胃肠道的释放部位, 实现胃溶、肠溶或缓控释等目的。

24.【参考答案】C

【解析】本题考查的是体内药物检测样品的种类。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研究, 以及药物代谢物及其代谢途径、类型和速率等的研究。

25.【参考答案】A

【解析】本题考查的是体内药物检测样品的种类。在体内药物分析中最常用的样本是血液, 它能够较为准确地反映药物在体内的状况。血样包括全血、血浆和血清, 血浆药物浓度可作为体内药物浓度的可靠指标。

26.【参考答案】A

【解析】本题考查的是药品质量标准中各项目包含的内容。在药品质量标准中, 性状项下记载药品的外观、嗅、味、溶解度以及物理常数; 鉴别项下仅规定了药品的试验方法; 检查项下包括反映药品的安全性与有效性的试验方法和限度、均一性与纯度等制备工艺要求等内容; 含量测定项下规定了测定原料和制剂中有效成分的含量的化学、仪器和生物测定方法; 类别系按药品的主要作用和主要用途或学科的归属划分。

27.【参考答案】D

【解析】本题考查的是被动扩散的特点。被动扩散的特点: 从高浓度区域(吸收部位)向低浓度区域(血液)顺浓度梯度转运, 转运速度与膜两侧的浓度差成正比, 呈现表现一级速度过程。扩散过程不需要载体, 也不消耗能量, 故又称单纯扩散。膜对通过的物质无特殊选择性, 不受共存的类似物的影响, 即无饱和现象和竞争抑制现象, 一般也无部位特异性, 药物大多数以这种方式吸收。

28.【参考答案】C

【解析】本题考查的是药物代谢。文拉法辛代谢为去甲文拉法辛后, 代谢产物有活性。故 C 选项错误。

29.【参考答案】C

【解析】本题考查的是用亚叶酸钙解救甲氨蝶呤中毒的作用机制。亚叶酸钙是四氢叶酸钙甲酰衍生物的钙盐, 系叶酸在体内的活化形式, 由于甲氨蝶呤是二氢叶酸还原酶的抑

制剂,阻断二氢叶酸转变为四氢叶酸,当使用甲氨蝶呤剂量过大引起中毒时,可用亚叶酸钙解救。亚叶酸钙在体内可转变为四氢叶酸,能有效地对抗甲氨蝶呤引起的毒性反应,与甲氨蝶呤合用可降低毒性,不降低肿瘤活性。

30.【参考答案】B

【解析】本题考查的是片剂包衣材料的分类。薄膜包衣可用高分子包衣材料,包括胃溶型(普通型)、肠溶型和水不溶型三大类:①胃溶型系指在水或胃液中可以溶解的材料,主要有羟丙甲纤维素(HPMC)、羟丙纤维素(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)等;②肠溶型系指在胃中不溶,但可在pH较高的水及肠液中溶解的成膜材料,主要有虫胶、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);③水不溶型系指在水中不溶解的高分子薄膜材料,主要有乙基纤维素(EC)、醋酸纤维素等。

31.【参考答案】B

【解析】本题考查的是地西洋的活性代谢。地西洋在羟基的 α 碳原子氧化引入羟基,生成替马西洋,进一步脱甲基代谢生成奥沙西洋。故选B。

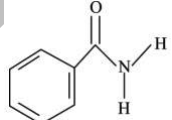
32.【参考答案】D

【解析】本题考查的是剂型对药物吸收的影响。除静脉给药外,药物的剂型因素对药物的吸收有很大的影响。剂型不同,药物的用药部位及吸收途径可能不一样。有些剂型给药后必须经过肝脏吸收,其中一部分药物在肝中经代谢后,再进入体循环系统。有些剂型给药后药物不经肝脏直接进入体循环系统吸收。不同口服剂型,药物从制剂中的释放速度不同,其吸收的速度和程度也往往相差很大。一般认为口服剂型药物的生物利用度的顺序为:溶液剂>混悬剂>胶囊剂>片剂>包衣片。

33.【参考答案】B

【解析】本题考查的是均相固体分散体。固态溶液:药物溶解于熔融的载体中,呈分子状态分散,为均相体系。

34.【参考答案】B

【解析】本题考查的是苯甲酰胺的结构。苯甲酰胺的结构式为:,选项中

只有B选项多潘立酮不含苯甲酰结构。

35.【参考答案】D

【解析】本题考查的是阿司匹林用三氯化铁鉴别的原理。阿司匹林分子结构中无游离的酚羟基,不能直接与三氯化铁试液反应,酯键受热水解后生成水杨酸。水杨酸含有游离酚羟基,可在中性或弱酸性条件下,与三氯化铁试液反应,生成紫堇色配位化合物。

36.【参考答案】C

【解析】本题考查的是静脉注射用脂肪乳的处方注解。精制大豆油是油相,也是主药,精制大豆磷脂是乳化剂,注射用甘油是等渗调节剂。

37.【参考答案】C

【解析】本题考查的是促进钙吸收的药物。维生素D₃类药物必须在肝脏和肾脏经过两次羟基化代谢才能产生活性。故此题选C。

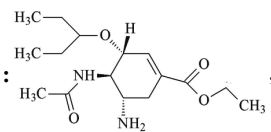
38.【参考答案】D

【解析】本题考查的是凉暗处的含义。阴凉处指不超过20℃;凉暗处指避光并且不超过20℃;冷处指2~10℃;常温指10~30℃。

39.【参考答案】C

【解析】本题考查的是表观分布容积。 $15\mu\text{g/mL} = 15\text{mg/L}$, $V = X/C = 60/15 = 4\text{L}$ 。

40.【参考答案】D

【解析】本题考查的是神经氨酸酶抑制剂。奥司他韦是神经氨酸酶抑制剂,为前药,对禽流感病毒有效。奥司他韦的结构式为:,故选D。

二、配伍选择题

【41~42】

【参考答案】BE

【解析】本组题考查的是片剂薄膜包衣材料。增塑剂系指用来改变高分子薄膜的物理机械性质,使其更柔顺,增加可塑性的物质。主要有水溶性增塑剂(如丙二醇、甘油、聚乙二醇等)和非水溶性增塑剂(如甘油三醋酸酯、乙酰化甘油酸酯、邻苯二甲酸酯等)。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。还可应用着色剂和遮光剂,应用着色剂的目的是增加片剂的识别性,改善片剂的外观,常用的材料有水溶性色素、水不溶性色素和色淀等。加入遮光剂的目的是增加药物对光的稳定性,常用材料为二氧化钛等。

薄膜包衣可用高分子包衣材料,包括胃溶型(普通型)、肠溶型和水不溶型三大类。

(1)胃溶型:系指在水或胃液中可以溶解的材料,主要有羟丙甲纤维素(HPMC)、羟丙纤维素(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)等。

(2)肠溶型:系指在胃中不溶,但可在较高的水及肠液中溶解的成膜材料,主要有虫胶、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)。

(3)水不溶型:系指在水中不溶解的高分子薄膜材料,主要有乙基纤维素(EC)、醋酸纤维素等。

【43~44】

【参考答案】AE

【解析】本组题考查的是药效学方面的药物相互作用。增强作用:两药合用时的作用大于单用时的作用之和,1+1>2。降压药联用硝酸酯类药物引起直立性低血压是增强作用。肝素过量出血,用鱼精蛋白注射液解救,强大阳电荷与肝素形成复合物,使肝素的抗凝血作用迅速消失,称为化学性拮抗。

【45~46】

【参考答案】CB

【解析】本组题考查的是剂型的分类。药物口服后的主要吸收部位是小肠。随胆汁排入十二指肠的药物或其代谢物重新进入血液循环的现象是肠-肝循环。

【47~48】

【参考答案】DA

【解析】本组题考查的是片剂薄膜包衣材料。增塑剂系指用来改变高分子薄膜的物理机械性质,使其更柔顺,增加可塑性的物质。主要有水溶性增塑剂(如丙二醇、甘油、聚乙二醇等)和非水溶性增塑剂(如甘油三醋酸酯、乙酰化甘油酸酯、邻苯二甲酸酯等)。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。

【49~51】

【参考答案】ABD

【解析】本组题考查的是药源性疾病。①非甾体抗炎药、血管紧张素转换酶抑制剂、环孢素等易引起急性肾衰竭;②辛伐他汀有引起横纹肌溶解的风险;③强心苷、普鲁卡因胺、胺碘酮、钾盐等易引起心律失常。

【52~53】

【参考答案】BE

【解析】本组题考查的是可待因和乙酰半胱氨酸的作用特点。磷酸可待因口服后迅速吸收,体内代谢在肝脏进行。约有8%的可待因代谢后生成吗啡,可产生成瘾性,仍需对它的使用加强管理。乙酰半胱氨酸为巯基化合物,易被氧化,可与金属离子络合。乙酰半胱氨酸可作为谷胱甘肽的类似物,用于对乙酰氨基酚中毒的解救。

【54~56】

【参考答案】CDA

【解析】本组题考查的是药物滥用与药物依赖性。药物滥用:非医疗目的地使用具有致依赖性潜能的精神活性物质的行为。药物耐受性:重复用药条件下,人体对药物反应性逐渐减弱的状态,耐受性具有可逆性,也具有交叉耐受性。身体依赖性:又称生理依赖性,

是指药物滥用造成机体对所滥用药物的适应状态。

【57~58】

【参考答案】BD

【解析】本组题考查的是抗病毒药中的前体药物。伐昔洛韦是阿昔洛韦与缬氨酸形成的酯类前体药物,口服后吸收迅速并在体内很快转化为阿昔洛韦。泛昔洛韦口服后在肠壁吸收后迅速去乙酰化和氧化为有活性的喷昔洛韦。

【59~60】

【参考答案】CB

【解析】本组题考查的是单室模型血管外给药和单室模型静脉滴注给药的血药浓度与时间的关系。单室单剂量血管外给药 C-t 关系式: $C = \frac{k_a F X_0}{V(k_a - K)}(e^{-kt} - e^{-k_a t})$; 单室单剂量静

脉滴注给药 C-t 关系式: $C = \frac{k_0}{kV}(1 - e^{-kt})$ 。

【61~62】

【参考答案】AC

【解析】本组题考查的是气雾剂和片剂的辅料。只有气雾剂中含有氢氟烷烃抛射剂。碳酸氢钠和有机酸是常用的泡腾崩解剂,是泡腾片中的常见辅料。

【63~64】

【参考答案】ED

【解析】本组题考查的是专业名词的缩写。平均稳态血药浓度是 C_{ss} 。一阶矩(MRT): 药物在体内的平均滞留时间。

【65~68】

【参考答案】BCAD

【解析】本组题考查的是主动转运、促进扩散、被动扩散和膜动转运的概念。主动转运:必须借助载体或酶系统,从膜的低浓度一侧向高浓度一侧的转运。促进扩散: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扩散或转运的过程。被动扩散:又称被动转运,大多数药物通过这种方式透过生物膜,由高浓度一侧向低浓度转动的过程。膜动转运:通过细胞膜的主动变形将药物摄入细胞内或从细胞内释放到细胞外的过程。膜动转运可分为胞饮和吞噬,摄取的药物为溶解物或液体称为胞饮,摄取的物质为大分子或颗粒状物称为吞噬作用。

【69~70】

【参考答案】BE

【解析】本组题考查的是非磺酰脲类胰岛素分泌促进剂、双胍类降糖药的结构特点。

那格列奈为 D-苯丙氨酸衍生物,其降糖作用是其前体 D-苯丙氨酸的 50 倍,由于其基本结构为氨基酸,决定了该药的毒性很低,降糖作用良好。双胍类口服降糖药的化学结构均由一个双胍母核连接不同侧链而构成,本类药物的代表药物是二甲双胍,具有高于一般脂肪胺的强碱性,吸收快,半衰期短。

【71~72】

【参考答案】BD

【解析】本组题考查的是光谱鉴别法。紫外-可见分光光度法(UA):波长范围为 200~760 nm,用于药物鉴别的波长范围为 200~400 nm。近红外光谱的波长范围是 760~2 500 nm。

【73~76】

【参考答案】BADE

【解析】本组题考查的是血管紧张素转化酶抑制剂的结构特点。福辛普利为含磷酰基的血管紧张素转化酶抑制剂,以磷酰基与血管紧张素转化酶的锌离子结合,福辛普利在体内能经肝或肾所谓双通道代谢生成福辛普利拉而发挥作用。赖诺普利结构中含有碱性的赖氨酸基团取代了经典的丙氨酸基团,且具有两个没有被酯化的羧基。雷米普利含有骈合双环结构。卡托普利除了血管紧张素转化酶抑制剂的一般副作用外,还有两个特殊副作用,即皮疹和味觉障碍,这与其分子中含有巯基有关。

【77~80】

【参考答案】CDBE

【解析】本组题考查的是常见辅料的英文简称。羟丙甲纤维素(HPMC)、微晶纤维素(MCC)、邻苯二甲酸醋酸纤维素(CAP)、羟丙基纤维素(HPC)、乙基纤维素(EC)。

【81~82】

【参考答案】AE

【解析】本组题考查的是降糖药的分类及基本结构特点。A 是格列齐特;B 是那格列奈;C 是伏格列波糖;D 是罗格列酮,E 是二甲双胍。磺酰脲类胰岛素分泌促进剂是格列XX,二甲双胍是双胍类降血糖药。

【83~85】

【参考答案】ABE

【解析】本组题考查的是药物效应的协同作用。氨氯地平是钙离子拮抗剂降压药,氢氯噻嗪是利尿药的降压药,两者合用会使降压作用增强。甲氨蝶呤合用复方磺胺甲噁唑会导致巨幼红细胞症。髓祥利尿药可增加庆大霉素等肾毒性药物的肾内浓度,使肾毒性增加。

【86~87】

【参考答案】DE

【解析】本组题考查的是平喘药的结构特点。培美曲塞是具有多靶点抑制作用的抗肿瘤药物,能够抑制胸苷酸合成酶、二氢叶酸还原酶和甘氨酸酰胺核苷酸甲酰转移酶、氨基咪唑甲酰胺核苷酸甲酰基转移酶等的活性。他莫昔芬为三苯乙烯类抗雌激素药物,存在顺反几何异构体。

【88~89】

【参考答案】ED

【解析】本组题考查的是头孢菌素类药物的结构式。E 选项是头孢曲松的结构式,为第三代头孢菌素。D 选项是头孢匹罗的结构式,为第四代头孢菌素。

【90~92】

【参考答案】DBA

【解析】本组题考查的是片剂的常用辅料。片剂常用黏合剂和润湿剂:蒸馏水、乙醇、淀粉浆、羧甲基纤维素钠、羟丙基纤维素、甲基纤维素、乙基纤维素、羟丙甲纤维素和其他黏合剂。常用崩解剂:干淀粉、羧甲基淀粉钠、低取代羟丙基纤维素、交联聚乙烯吡咯烷酮、交联羧甲基纤维素钠、泡腾崩解剂。常用润滑剂:硬脂酸镁、微粉硅胶、滑石粉、氢化植物油、聚乙二醇类、十二烷基硫酸钠等。

【93~94】

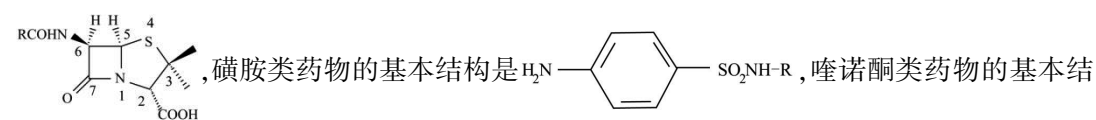
【参考答案】AB

【解析】本组题考查的是乳膏剂。乳膏剂常用的油相基质有:硬脂酸、石蜡、蜂蜡、高级脂肪醇、凡士林、液状石蜡、植物油等。乳膏剂常用的乳化剂可分为水包油型和油包水型。水包油型乳化剂有钠皂、三乙醇胺皂类、脂肪醇硫酸(酯)钠类(十二烷基硫酸钠)和聚山梨酯类;油包水型乳化剂有钙皂、羊毛脂、单甘油酯、脂肪醇等。十二烷基硫酸钠也叫做月桂醇硫酸钠。

【95~97】

【参考答案】AEC

【解析】本组题考查的是抗菌类药物的基本结构。青霉素类药物的基本结构是



【98~100】

【参考答案】BDA

【解析】本组题考查的是缓(控)释制剂的骨架材料。①亲水性凝胶骨架材料:常用的有羧甲基纤维素钠(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)等;②不溶性骨架材料:常用的有聚甲基丙烯酸酯、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;③生物溶蚀性骨架材料:常用的有动物脂肪、蜂蜡、巴西棕榈蜡、氢化植物油、硬脂醇、单硬脂酸甘油酯等。

三、综合分析选择题

【101~103】

101.【参考答案】C

【解析】本题考查的是注射剂的质量要求。注射剂给药不方便,注射易引起疼痛,易发生交叉污染,安全性不及口服制剂。

102.【参考答案】D

【解析】本题考查的是山莨菪碱的结构。具有托品烷结构的只有C和D,题目提示山莨菪碱在托品醇的6位增加了一个羟基取代,所以应该选D。A是西咪替丁,B是兰索拉唑,C是阿托品,E是甲氧氯普胺。

103.【参考答案】B

【解析】本题考查的是山莨菪碱的结构特点。山莨菪碱天然品称为654-1,具有左旋性;合成品称为654-2,具有消旋性。

【104~105】

104.【参考答案】C

【解析】本题考查的是1,4-二氢吡啶类的药物结构特点。尼群地平1,4-二氢吡啶环上所连接的两个羧酸酯的结构不同,使其4位碳原子具有手性。

105.【参考答案】D

【解析】本题考查的是氨氯地平的结构特点及性质。氨氯地平与其他二氢吡啶类钙通道阻滞剂不同,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位碳原子具有手性,可产生两个光学异构体,临床用外消旋体和左旋体。

【106~108】

106.【参考答案】C

【解析】本题考查的是清除率的计算。清除率是指单位时间内从体内消除的含药血浆体积,又称体内总清除率,常以“Cl”表示,单位:体积/时间。 $Cl=kV$ 。由计算得总清除率为10 L/h,肾排泄占20%,则肝代谢占80%,故选C。

107.【参考答案】A

【解析】本题考查的是绝对生物利用度的计算。绝对生物利用度计算公式: $F = \frac{AUC_{ir}}{AUC_{iv}} \times$

100%。静脉注射200 mg的AUC是 $20 \mu\text{g} \cdot \text{h/mL}$,口服1000 mg的AUC是 $10 \mu\text{g} \cdot \text{h/mL}$,则相同剂量下,代入数值为10%。

108.【参考答案】C

【解析】本题考查的是可避免首过效应的剂型。剂型按给药途径分为经胃肠道给药即口服给药都有首过效应,不经胃肠道即非口服给药无首过效应(栓剂纳入直肠较深处除外)。

【109~110】

109.【参考答案】D

【解析】本题考查的是卡托普利的特点。卡托普利结构中含有的是游离羧酸结构,不是前药。

110.【参考答案】B

【解析】本题考查的是卡托普利的特点。在该处方中乳糖的作用是稀释剂不是抗氧化剂。

四、多项选择题

111.【参考答案】DE

【解析】本题考查的是药品不良反应。B型药品不良反应指与药物常规药理作用无关的异常反应。与剂量无关,难预测,发生率低,死亡率高。又分为遗传药理学不良反应(特异质反应)和药物变态反应(过敏反应)。

112.【参考答案】ABC

【解析】本题考查的是栓剂的常用基质。油脂性基质:①可可豆脂;②半合成或全合成脂肪酸甘油酯;椰油酯、棕榈酸酯、混合脂肪酸甘油酯。水溶性基质:①甘油明胶;②聚乙二醇;③泊洛沙姆。

113.【参考答案】ABCDE

【解析】本题考查的是注射剂的质量要求。①pH:注射剂的pH应和血液pH相等或相近。一般控制在4~9的范围内;②渗透压:对用量大、供静脉注射的注射剂应具有与血浆相同的或略偏高的渗透压;③稳定性:注射剂要具有必要的物理稳定性和化学稳定性,以确保产品在贮存期内安全、有效;④安全性:注射剂必须对机体无毒性、无刺激性,降压物质必须符合规定,确保安全;⑤澄明:溶液型注射液应澄明,不得含有可见的异物或不溶性微粒;⑥无菌:注射剂内不应含有任何活的微生物;⑦无热原:注射剂内不应含热原,热原检查必须符合规定。

114.【参考答案】ACDE

【解析】本题考查的是血药浓度监测。给药方案设计的目的是使药物在靶部位达到最佳治疗浓度,产生最佳的治疗作用和最小的副作用。安全范围广的药物不需要严格的给药方案。如青霉素、头孢菌素类维持最低有效血药浓度即可。治疗指数小的药物,要求血药浓度的波动范围在最低中毒浓度与最小有效浓度之间。非线性动力学特征的药物,剂量的微小改变,可能会导致治疗效果的显著差异,甚至会产生严重毒副作用,需要制定个体化给药方案。给药方案设计和调整,常常需要进行血药浓度监测。

115. **【参考答案】**BCD

【解析】本题考查的是常用囊材的分类。硝苯地平的作用机制是阻滞钙离子通道,氢氯噻嗪的作用机制是抑制肾小管 Na^+-Cl^- 转运体。磺胺嘧啶、齐多夫定和氟尿嘧啶都是属于干扰核酸代谢的药物。

116. **【参考答案】**BCD

【解析】本题考查的是非共价键的键合类型。共价键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,例如烷化剂类抗肿瘤药物,与 DNA 中鸟嘌呤碱基形成共价结合键,产生细胞毒活性。非共价键键合是可逆的结合形式,其键合的形式有:范德华力、氢键、疏水键、静电引力、电荷转移复合物、偶极相互作用力等。

117. **【参考答案】**ABCDE

【解析】本题考查的是《中国药典》规定的药物储存条件。贮藏:避光;不透光,棕色或黑色纸包裹容器;密闭:防尘土进入;密封:防风化、防潮及挥发或异物进入;熔(严)封:防

空气水分进入,防污染;阴凉处:温度 $\leq 20\text{ }^\circ\text{C}$;凉暗处:避光,温度 $\leq 20\text{ }^\circ\text{C}$;冷处:温度为 $2\sim 10\text{ }^\circ\text{C}$;常温:温度为 $10\sim 30\text{ }^\circ\text{C}$ 。

118. **【参考答案】**ABC

【解析】本题考查的是四环素类的不良反应。由于四环素类药物能和钙离子形成螯合物,在体内该螯合物呈黄色,可沉积在骨骼和牙齿上,儿童服用会使牙齿变黄,孕妇服用后其产儿可能发生牙齿变色、骨骼生长受到抑制。

119. **【参考答案】**ADE

【解析】本题考查的是第 II 相生物结合代谢所发生的反应。第 II 相生物转化的结合反应有葡萄糖醛酸的结合反应、硫酸酯化结合反应、氨基酸结合反应、谷胱甘肽结合反应、乙酰化结合反应、甲基化结合反应等。

120. **【参考答案】**ABCE

【解析】本题考查的是坎地沙坦酯。坎地沙坦酯与替米沙坦均为含有苯并咪唑环的 AII 受体拮抗剂,坎地沙坦酯是一个前药,在体内迅速并完全地代谢成活性化合物坎地沙坦,而坎地沙坦不属于前药。坎地沙坦口服生物利用度为 14%,故坎地沙坦不宜口服,而坎地沙坦酯可口服且仅可口服。由于过度降压,有可能使肾功能恶化,因此 1 日 1 次,从 2 mg 开始服用,有严重肾功能障碍的患者慎用。由于坎地沙坦酯有可能使肝功能恶化,并且,据推测活性代谢物坎地沙坦的清除率降低,因此应从小剂量开始服用,有肝功能障碍的患者慎用。

模拟试卷(四)

一、最佳选择题

1.【参考答案】B

【解析】本题考查的是片剂包衣材料的分类。薄膜包衣可用高分子包衣材料,包括胃溶型(普通型)、肠溶型和水不溶型三大类:①胃溶型系指在水或胃液中可以溶解的材料,主要有羟丙甲纤维素(HPMC)、羟丙纤维素(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)等;②肠溶型系指在胃中不溶,但可在pH较高的水及肠液中溶解的成膜材料,主要有虫胶、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);③水不溶型系指在水中不溶解的高分子薄膜材料,主要有乙基纤维素(EC)、醋酸纤维素等。

2.【参考答案】D

【解析】本题考查的是影响药物胃肠道吸收的生理因素。影响药物胃肠道吸收的生理因素包括胃肠液成分与性质、胃排空与胃肠道蠕动、循环系统的影响、食物的影响、胃肠道代谢的作用、疾病因素。

3.【参考答案】D

【解析】本题考查的是提高药物溶出速度的方法。提高难溶性药物固体制剂的溶出速度具有重要意义,除了粉末纳米化、使用表面活性剂外,还可采取制成盐或亲水性前体药物、固体分散体、环糊精包合物、磷脂复合物等方法提高溶出速度。

4.【参考答案】D

【解析】本题考查的是输液的概念及其质量要求。输液是指由静脉滴注输入体内的大剂量(除另有规定外,一般不小于100 mL)注射液。它是注射液的一种给药形式,故也称大容量注射液,通常包装于玻璃或塑料的输液瓶或袋中,不含防腐剂或抑菌剂。输液的质量要求与注射剂基本上是一致的。但由于输液的注射量大,直接注入血液循环,因而质量要求更严格。无菌、无热原或细菌内毒素、不溶性微粒等项目,必须符合规定;pH尽可能与血液相近;渗透压应为等渗或偏高渗;不得添加任何抑菌剂,并在储存过程中质量稳定;使用安全,不引起血液一般检测或血液常规检测的任何变化,不引起过敏反应,不损害肝、肾功能。

5.【参考答案】A

【解析】本题考查的是生物等效性的概念。生物等效性是指一种药物的不同制剂在相同试验条件下,给予相同剂量。不同企业生产同种药物制剂由于制剂工艺不同,药物的吸收和药效也不同,为保证药物的吸收和药效发挥一致作用,要用生物等效性试验作为比较的标准对上述药物给予评价。

6.【参考答案】D

【解析】本题考查的是靶向制剂的分类。靶向制剂可分为被动靶向制剂、主动靶向制剂和物理化学靶向制剂三大类。其中物理化学靶向制剂包括磁性靶向制剂、热敏靶向制剂、pH敏感靶向制剂和栓塞靶向制剂。

7.【参考答案】A

【解析】本题考查的是抗心律失常药普罗帕酮的药理作用。普罗帕酮为Ic类抗心律失常药,具有钠通道阻滞作用,本品结构与β受体拮抗剂相似,也具有轻度β受体的拮抗作用,临床用于治疗阵发性室性心动过速、阵发性室上性心动过速及预激综合征伴室上性心动过速、心房扑动或心房颤动,也可用于各种早搏的治疗。

8.【参考答案】D

【解析】本题考查的是微晶纤维素的用途。微晶纤维素(MCC)可作为粉末直接压片的“干黏合剂”使用,另外,片剂中含20%微晶纤维素时崩解效果较好。

9.【参考答案】C

【解析】本题考查的是热原的除去方法。根据热原的基本性质和可能被污染的途径,除去药液中的热原可从以下两方面着手。

(1)除去药液或溶剂中热原的方法:①吸附法:活性炭是常用的吸附剂;②离子交换法:热原分子上含有磷酸根与羧酸根,带有负电荷,因而可以被弱酸性阳离子交换树脂吸附;③凝胶滤过法:也称分子筛滤过法;④超滤法:一般用3~15 nm超滤膜除去热原;⑤反渗透法:通过三醋酸纤维素膜或聚酰胺膜除去热原;⑥其他方法:采用两次以上湿热灭菌法,或适当提高灭菌温度和时间,微波也可破坏热原。

(2)除去容器或用具上热原的方法:①高温法:对于耐高温的容器或用具,如注射用针筒及其他玻璃器皿,在洗涤干燥后,经180℃加热2 h或250℃加热30 h,可以破坏热原;②酸碱法:常用的酸碱液为重铬酸钾硫酸洗液、硝酸硫酸洗液或稀氢氧化钠溶液。

10.【参考答案】D

【解析】本题考查的是联合用药与药物相互作用。丙磺舒与青霉素二者均为酸性药,同用时可产生相互作用,青霉素主要以原形从肾脏排出,其中有90%通过肾小管主动分泌到肾小管腔,若同时应用丙磺舒,后者竞争性占据酸性转运系统,阻碍青霉素经肾小管的分泌,因而延缓青霉素的排泄使其发挥较持久的效果。

11.【参考答案】A

【解析】本题考查的是红霉素与多潘立酮的联用。促胃动力药多潘立酮可以促进胃排空,因此在胃内易破坏的红霉素在胃内的停留时间缩短,吸收增加。

12.【参考答案】C

【解析】本题考查的是肠肝循环。有肠肝循环的药物在体内能停留较长时间。己烯雌酚、卡马西平、氯霉素、吡哌美辛、螺内酯等药物口服后都存在肠肝循环。一些药物会因肠

肝循环在血药浓度-时间曲线上出现第二个峰,即产生双峰现象。

13.【参考答案】C

【解析】本题考查的是片剂的质量要求。①硬度适中,一般认为普通片剂的硬度在 50 N 以上为宜;②脆碎度反映片剂的抗磨损和抗振动能力,小于 1%为合格片剂;③符合片重差异的要求,含量准确;④色泽均匀,外观光洁;⑤符合崩解度或溶出度的要求,普通片剂的崩解时限是 15 min;分散片、可溶片为 3 min;舌下片、泡腾片为 5 min;薄膜衣片为 30 min;肠溶衣片要求在盐酸溶液中 2 h 内不得有裂缝、崩解或软化现象,在 pH 6.8 磷酸盐缓冲液中 1 h 内全部溶解并通过筛网等;⑥小剂量的药物或作用比较剧烈的药物,应符合含量均匀度的要求;⑦符合有关卫生学的要求。

14.【参考答案】C

【解析】本题考查的是亚硝酸钠滴定法测定普鲁卡因的机制。盐酸普鲁卡因具有芳伯氨基,在盐酸介质中与亚硝酸钠作用,生成重氮盐,重氮盐进一步与 β -萘酚偶合,生成有色的偶氮化合物。

15.【参考答案】D

【解析】本题考查的是脂质体的包封率。包封率 = [脂质体中的药量 / (介质中的药量 + 脂质体中的药量)] × 100%,通常要求脂质体的药物包封率达 80% 以上。

16.【参考答案】A

【解析】本题考查的是属于极性溶剂的药物。液体剂剂常用溶剂按介电常数大小分为极性溶剂、半极性溶剂和非极性溶剂。极性溶剂常用的有水、甘油、二甲基亚砜等;半极性溶剂常用乙醇、丙二醇和聚乙二醇;非极性溶剂常用的有脂肪油、液体石蜡等。

17.【参考答案】D

【解析】本题考查的是氧氟沙星的结构特点。将喹诺酮 1 位和 8 位成环得到左氧氟沙星,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的。

18.【参考答案】C

【解析】本题考查的是胶囊的成囊材料。胶囊壳多以明胶为原料制备,受温度和湿度影响较大。

19.【参考答案】E

【解析】本题考查的是眼用制剂的质量要求。眼用制剂的质量要求:①眼用溶液剂的 pH 应兼顾药物的溶解度、稳定性和刺激性的要求,同时亦应考虑 pH 对药物吸收和药效的影响;②除另有规定外,滴眼剂、洗眼剂和眼内注射溶液应与泪液等渗;③用于眼外伤或术后的眼用制剂必须满足无菌,成品须经严格的灭菌,并不加入抑菌剂,一般采用单剂量包装,一经使用后不能放置再用;而用于无外伤的滴眼剂,要求无致病菌,不得检测出铜绿假单胞菌和金黄色葡萄球菌;滴眼剂是多剂量剂型,患者在多次使用后易染菌,因此可适当加

入抑菌剂于下次再用前恢复无菌;④适当增大滴眼剂的黏度可延长药物在眼内停留时间,从而增强药物作用;增大黏度后在减少刺激的同时亦能增加药效;⑤混悬型眼用制剂大于 50 μm 的粒子不超过 2 个,且不得检出超过 90 μm 的粒子;沉降体积比 ≥ 0.9 ;⑥除另有规定外,滴眼剂每个容器的装量不得超过 10 mL;洗眼剂每个容器的装量应不得超过 200 mL;包装容器应无菌、不易破裂,其透明度应不影响对可见异物的检查;⑦眼用制剂贮存应密封避光,启用后最多可用 4 周。

20.【参考答案】B

【解析】本题考查的是药品贮存的常用术语。避光是指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。密闭是指容器密闭,以防止尘土及异物进入。密封系指将容器密封以防止风化、吸潮、挥发或异物进入。熔封或严封是指将容器熔封或用适宜的材料严封,以防止空气与水分的侵入并防止污染。

21.【参考答案】A

【解析】本题考查的是最大效应(效能)和效价强度的含义。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,称为最大效应,也称效能。效价强度是指用于作用性质相同的药物之间的等效剂量或浓度的比较,是指能引起等效反应的相对剂量或浓度,其值越小则强度越大。效能和效价强度反映药物的不同性质,二者具有不同的临床意义,常用于评价同类药物中不同品种的作用特点。例如,利尿药以每日排钠量为效应指标进行比较,环戊噻嗪的效价强度约为氢氯噻嗪的 30 倍,但二者效能相同,而二者无论剂量如何增加,都不能达到呋塞米所产生的效能(利尿效果)。

22.【参考答案】D

【解析】本题考查的是埃索美拉唑的特性。埃索美拉唑是奥美拉唑的 S-(-)-异构体,现已上市,其疗效和作用时间都优于奥美拉唑。

23.【参考答案】C

【解析】本题考查的是片剂包衣材料的分类。薄膜包衣可用高分子包衣材料,包括胃溶型(普通型)、肠溶型和水不溶型三大类:①胃溶型系指在水或胃液中可以溶解的材料,主要有羟丙甲纤维素(HPMC)、羟丙纤维素(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)等;②肠溶型系指在胃中不溶,但可在 pH 较高的水及肠液中溶解的成膜材料,主要有虫胶、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);③水不溶型系指在水中不溶解的高分子薄膜材料,主要有乙基纤维素(EC)、醋酸纤维素等。

24.【参考答案】C

【解析】本题考查的是脂质体的特点和质要求。通常要求脂质体的药物包封率应达到 80% 以上。脂质体特点包括:①靶向性和淋巴定向性;②缓释和长效性;③细胞亲和性与

组织相容性;④降低药物毒性;⑤提高药物稳定性。脂质体存在贮存稳定性差,静注给药后因血中蛋白、酶等因素作用造成其破裂及包封药物的快速渗漏等不足,使其临床应用受到极大限制。脂质体作为一种具有多种功能的药物载体,可包封水溶性和脂溶性两种类型的药物。

25.【参考答案】E

【解析】本题考查的是胶囊剂辅料的作用。二氧化钛常用作遮光剂和着色剂。

26.【参考答案】E

【解析】本题考查的是分散片的质量要求。分散片应达到一般片剂规定的要求,如含量测定、有关物质测定、重量差异等符合规定,与普通片剂的要求相比增加了溶出度、分散均匀性检查。

27.【参考答案】E

【解析】本题考查的是药源性疾病的防治。药源性疾病的防治包括:①加强认识,慎重用药;②加强管理;③加强临床药学服务;④坚持合理用药;a.要明确诊断,依据病情和药物适应证,正确选用药物;b.根据治疗对象的个体差异、生理特点及药学知识,研究给药方案是否合理,有无药物相互作用及配伍禁忌;c.监督患者的用药行为,观察药物疗效和不良反应,及时调整治疗方案和处理不良反应;d.要慎重使用新药,实行个体化用药;e.根据病情缓急、用药目的及药物性质,确定给药剂量、给药时间、给药方法及疗程;f.尽量减少联合用药;g.发放药物应做到“三查七对”;⑤加强医药科普教育;⑥加强药品不良反应监测报告制度。

28.【参考答案】D

【解析】本题考查的是液体制剂的常用溶剂按极性分类。液体制剂的常用溶剂按极性大小分为极性溶剂(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)。

29.【参考答案】C

【解析】本题考查的是紫外-可见分光光度法的波长范围。利用紫外-可见吸收光谱进行鉴别的方法,称为紫外-可见分光光度法。紫外-可见吸收光谱包括紫外光区与可见光区,波长范围为200~760 nm,用于药物鉴别的通常为紫外吸收光谱(200~400 nm)。

30.【参考答案】D

【解析】本题考查的是眼用制剂的质量要求。眼用制剂的质量要求:①眼用溶液剂的pH应兼顾药物的溶解度、稳定性和刺激性的要求,同时亦应考虑pH对药物吸收和药效的影响;②除另有规定外,滴眼剂、洗眼剂和眼内注射溶液应与泪液等渗;③用于眼外伤或术后的眼用制剂必须满足无菌,成品需经严格的灭菌,并不加入抑菌剂,一般采用单剂量包装,一经使用后不能放置再用;而用于无外伤的滴眼剂,要求无致病菌,不得检测出铜绿假单胞菌和金黄色葡萄球菌;滴眼剂是多剂量剂型,患者在多次使用后易染菌,因此可适当加

入抑菌剂于下次再用前恢复无菌;④适当增大滴眼剂的黏度可延长药物在眼内停留时间,从而增强药物作用;增大黏度后在减少刺激的同时亦能增加药效;⑤混悬型眼用制剂大于50 μm的粒子不超过2个,且不得检出超过90 μm的粒子;沉降体积比≥0.9;⑥除另有规定外,滴眼剂每个容器的装量不得超过10 mL;洗眼剂每个容器的装量应不得超过200 mL;包装容器应无菌、不易破裂,其透明度应不影响对可见异物的检查;⑦眼用制剂贮存应密封避光,启用后最多可用4周。

31.【参考答案】A

【解析】本题考查的是热原的性质。

(1)水溶性:由于磷脂结构上连接有多糖,所以热原能溶于水。

(2)不挥发性:热原本身没有挥发性,但因溶于水,在蒸馏时,可随水蒸气雾滴进入蒸馏水中,故蒸馏水器均应有完好的隔沫装置,以防止热原污染。

(3)耐热性:热原的耐热性较强,一般经60℃加热1小时不受影响,100℃也不会发生热解,但在120℃下加热4小时能破坏98%左右,在180~200℃干热2小时或250℃,30~45分钟或650℃,1分钟可使热原彻底破坏。由此可见,在通常采用的注射剂灭菌条件下,热原不能被完全破坏。

(4)过滤性:热原体积较小,约在1~5 nm之间,一般滤器均可通过,不能被截留去除,但活性炭可吸附热原,纸浆滤饼对热原也有一定的吸附作用。

(5)其他性质:热原能被强酸、强碱、强氧化剂如高锰酸钾、过氧化氢以及超声波破坏。热原在水溶液中带有电荷,也可被某些离子交换树脂所吸附。

32.【参考答案】A

【解析】本题考查的是卡托普利的结构特点。卡托普利是含巯基的ACE抑制剂的唯一代表,分子中的巯基可有效地与酶中的锌离子结合,为关键药效团,但会产生皮疹和味觉障碍;由于巯基的存在,卡托普利易被氧化,能够发生二聚反应而形成二硫键,体内代谢有40%~50%的药物以原药形式排泄,剩下的以二硫聚合物或卡托普利-半胱氨酸二硫化物形式排泄。

33.【参考答案】C

【解析】本题考查的是经皮给药制剂的特点。将药物应用于皮肤上,药物穿过角质层,进入真皮和皮下脂肪以达到局部治疗目的,或由毛细血管和淋巴管吸收进入体循环,产生全身治疗作用的过程称为经皮给药。广义的经皮给药制剂包括软膏剂、硬膏剂、贴剂,还可以是涂剂和气雾剂等。狭义的经皮给药制剂一般是指贴剂,通常起全身治疗作用,也称经皮给药系统(简称TDDS)。TDDS发展很快,我国现有东莨菪碱、硝酸甘油、可乐定、雌二醇、芬太尼、尼古丁等经皮给药制剂。

34.【参考答案】A

【解析】本题考查的是常用抗凝剂。全血采集后常使用的抗凝剂有:肝素、EDTA、草酸

盐、枸橼酸盐等。

35.【参考答案】C

【解析】本题考查的是氯丙嗪的理化性质。氯丙嗪等吩噻嗪类抗精神病药物,遇光会分解,产生自由基并与体内一些蛋白质作用,发生过敏反应。故一些患者在服用药物后,在日光照射下皮肤会产生红疹,称为光毒化过敏反应。这是氯丙嗪及其他吩噻嗪药物的毒副作用之一。服用氯丙嗪等药物后应尽量减少户外活动,避免日光照射。

36.【参考答案】E

【解析】本题考查的是药物的治疗指数和安全范围。A药与B药的 ED_{50} 与 TD_{50} 都重合,故两者的治疗指数相同。A药在95%和99%有效量时(ED_{95} 和 ED_{99})没有动物死亡,而B药在 ED_{95} 和 ED_{99} 时则分别有10%或20%死亡,说明A药比B药安全。

37.【参考答案】C

【解析】本题考查的是液体制剂的常用防腐剂。常用的防腐剂有:①苯甲酸与苯甲酸钠;②对羟基苯甲酸酯类;③山梨酸与山梨酸钾;④苯扎溴铵;⑤其他防腐剂,如乙醇、苯酚、甲酸、三氯叔丁醇、苯甲醇、硝酸苯汞、硫柳汞、甘油、氯仿、桉油、桂皮油、薄荷油等均可作防腐剂使用。

38.【参考答案】B

【解析】本题考查的是药物流行病学研究方法。药物流行病学研究方法包括描述性研究、分析性研究和实验性研究。分析性研究包括队列研究和病例对照研究。

39.【参考答案】B

【解析】本题考查的是氟西汀的性质。氟西汀及其代谢产物去甲氟西汀都选择性地抑制中枢神经系统对5-HT的再吸收,延长和增加5-HT的作用,为较强的抗抑郁药。氟西汀的口服吸收良好,生物利用度为100%。由于去甲氟西汀的半衰期很长,会产生药物积蓄及排泄缓慢的现象。因此肝病和肾病患者需要考虑氟西汀的用药安全问题。氟西汀含有手性碳,但使用外消旋混合物。其两个对映体对人体5-羟色胺重吸收转运蛋白都显示了相似的亲和力。

40.【参考答案】D

【解析】本题考查的是适合制成胶囊剂的药物要求。填充风化性药物,可使囊壁软化;填充吸湿性很强的药物,可使囊壁脆裂;填充的药物是水溶液或稀乙醇溶液,会使囊壁溶化;易溶性的刺激性药物也不宜制成胶囊剂。

二、配伍选择题

【41~42】

【参考答案】AD

【解析】本组题考查的是药物依赖性的概念。精神依赖性是由于滥用致依赖性药物对脑内奖赏系统产生反复的非生理性刺激所致的一种特殊精神状态。身体依赖性又称生理

依赖性,是指药物滥用造成机体对所滥用药物的适应状态。在这种特殊身体状态下,一旦突然停止使用或减少用药剂量,导致机体已经形成的适应状态发生改变,用药者会相继出现一系列以中枢神经系统反应为主的严重症状和体征,呈现极为痛苦的感受及明显的生理功能紊乱,甚至可能危及生命,此即药物戒断综合征。身体依赖性是一种药理学反应。可以产生身体依赖性的药物有阿片类(如阿片、吗啡、海洛因等)、镇静催眠药(巴比妥类、苯二氮草类)和酒精等。

【43~44】

【参考答案】DC

【解析】本组题考查的是抗肿瘤药的药物结构。塞替派结构中氮杂环丙基团可与腺嘌呤的3-N和7-N进行烷基化,生成塞替派-DNA的烷基化产物,为细胞周期特异性产物。奥沙利铂为草酸根(1R,2R-环己二胺)合铂,奥沙利铂结构中的手性1,2-环己二胺配体通过嵌入在DNA大沟中,可用于对顺铂和卡铂耐药的肿瘤株。

【45~47】

【参考答案】ACE

【解析】本组题考查的是受体的调节。受体脱敏是指在长期使用一种激动药后,组织或细胞的受体对激动药的敏感性和反应性下降的现象。受体增敏是与受体脱敏相反的一种现象,可因长期应用拮抗药或激动药水平降低,造成受体数量或敏感性提高。同源脱敏是指只对一种类型受体的激动药的反应下降,而对其他类型受体激动药的反应性不变。

【48~50】

【参考答案】DEB

【解析】本组题考查的是抗心律失常药物的结构特点和分类。普罗帕酮有R异构体和S异构体两个异构体,它们的药效和药代动力学性质存在明显的差异,二者均具有钠通道阻滞作用。胺碘酮的结构与甲状腺素类似,含有碘原子,可影响甲状腺素代谢。奎尼丁是金鸡纳树皮生物碱的成分之一,是抗疟药奎宁的非对映异构体。

【51~52】

【参考答案】DC

【解析】本组题考查的是抛射剂和冷凝剂。七氟丙烷属于氢氟烷烃类的抛射剂。单硬脂酸甘油酯属于油性基质,可用水作为冷凝液。

【53~55】

【参考答案】EAC

【解析】本组题考查的是抗菌药的结构特点。克拉霉素是对红霉素C-6羟基甲基化后得到的衍生物。多西环素属于四环素类抗生素,会导致四环素牙即牙齿变黄。阿米卡星是在卡那霉素分子的链霉胺部分引入氨基羟丁酰基侧链得到的半合成抗生素,又称丁胺卡那霉素。

【56~57】

【参考答案】AC

【解析】本组题考查的是不同体系中药物的分散状态。①溶液型是药物以分子或离子状态分散于分散介质中所构成的均匀分散体系;②胶体溶液型是药物以高分子形式分散在分散介质中所形成的均匀分散体系;③乳剂型是油类药物或药物油溶性溶液以液滴状态分散在分散介质中所形成的非均匀分散体系;④混悬型是固体药物以微粒状态分散在分散介质中所形成的非均匀分散体系;⑤固体分散型是固体药物以聚集状态存在的分散体系。

【58~61】

【参考答案】DECB

【解析】本组题考查的是注射剂的常用附加剂。

(1) 抗氧化剂:焦亚硫酸钠、亚硫酸氢钠、亚硫酸钠、硫代硫酸钠。

(2) 金属螯合剂:乙二胺四乙酸二钠(EDTA·2Na)、醋酸、醋酸钠、枸橼酸、枸橼酸钠、乳酸、酒石酸、酒石酸钠。

(3) 助悬剂:甲基纤维素、羧甲基纤维素、明胶、果胶。

(4) 稳定剂:肌酐、甘氨酸、烟酰胺、辛酸钠。

(5) 增溶剂、润湿剂或乳化剂:聚氧乙烯蓖麻油、聚山梨酯 20(吐温 20)、聚山梨酯 40(吐温 40)、聚山梨酯 80(吐温 80)、聚维酮、聚乙二醇-40-蓖麻油、卵磷脂、脱氧胆酸钠、普朗尼克 F-68(泊洛沙姆 188)。

(6) 抑菌剂:苯酚、甲酚、氯甲酚、苯甲醇、三氯叔丁醇、硝酸苯汞、尼泊金类。

(7) 局麻剂(止痛剂):盐酸普鲁卡因、利多卡因。

(8) 等渗调节剂:氯化钠、葡萄糖、甘油。

(9) 填充剂:乳糖、甘露醇、甘氨酸。

(10) 保护剂:乳糖、蔗糖、麦芽糖、人血红蛋白。

【62~64】

【参考答案】ACB

【解析】本组题考查的是钙通道阻滞剂的结构特点。与其他二氢吡啶类钙通道阻滞剂不同,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,临床用外消旋体和左旋体。硝苯地平为对称结构的二氢吡啶类药物,3,5 位取代基均为甲酸甲酯。非洛地平苯环 2' 和 3' 位各有一个氯原子取代基。

【65~68】

【参考答案】DCBA

【解析】本组题考查的是潜溶、增溶、助溶、絮凝的概念。潜溶是指当混合溶剂中各溶剂达某一比例时,药物的溶解度比在各单纯溶剂中溶解度出现极大值的现象。碘酊加碘化

钾可形成络合物,增加碘在水中的溶解度。硬脂酸钠为表面活性剂,在水中加入表面活性剂可增加难溶性药物的溶解度,这种现象称为增溶。助溶是指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。混悬微粒形成疏松状聚集体的过程称为絮凝,加入的电解质称为絮凝剂。

【69~72】

【参考答案】EBAC

【解析】本组题考查的是国际药品标准。《美国药典》(USP);《英国药典》(BP);《欧洲药典》(Ph.Eur.或 EP);《中国药典》(ChP);《日本药典》(JP)。

【73~75】

【参考答案】ADB

【解析】本组题考查的是缓(控)释制剂的骨架材料。①亲水性凝胶骨架材料:常用的有羧甲基纤维素钠(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)等;②不溶性骨架材料:常用的有聚甲基丙烯酸酯、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;③生物溶蚀性骨架材料:常用的有动物脂肪、蜂蜡、巴西棕榈蜡、氢化植物油、硬脂醇、单硬脂酸甘油酯等。

【76~77】

【参考答案】CB

【解析】本组题考查的是镇静催眠药的结构特点。唑吡坦为咪唑并吡啶类镇静催眠药。阿普唑仑结构中含有三氮唑的结构。

【78~80】

【参考答案】BEA

【解析】本组题考查的是表面活性剂的应用、液体制剂常用的附加剂。甾体激素等难溶性药物可利用表面活性剂的增溶作用提高药物的溶解度。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。潜溶剂系指能形成氢键以增加难溶性药物溶解度的混合溶剂。能与水形成潜溶剂的有乙醇、丙二醇、甘油、聚乙二醇等。

【81~84】

【参考答案】BEDC

【解析】本组题考查的是头孢类抗菌药物的结构特点。头孢克洛是头孢氨苄的 C-3 位以卤素替代甲基得到可口服的半合成头孢菌素药物。由于氯原子的亲脂性比甲基强,口服吸收优于氨苄西林。头孢曲松的 C-3 位引入酸性较强的杂环,6-羟基-1,2,4-三嗪-5-酮,产生独特的非线性的剂量依赖性药动学性质。第四代头孢菌素是在第三代的基础上 3 位引入季铵基团,例如头孢匹罗和头孢吡肟。头孢呋辛的 C-7 位的氨基上连有顺式的甲

氧脞基酰基侧链,该甲氧脞基对 β -内酰胺酶有高度稳定作用。

【85~88】

【参考答案】BDAC

【解析】本组题考查的是溶液剂的常用附加剂。渗透压调节剂有氯化钠、葡萄糖。助悬剂有甲基纤维、羧甲基纤维钠、明胶。润湿剂常用吐温80(聚山梨酯80)。常用防腐剂的分类:①酸碱及其盐类:苯酚、山梨醇及其盐类;②中性化合物类:三氯叔丁醇、聚维酮碘等;③汞化合物类:硫柳汞、硝酸苯汞等;④季铵化合物:苯扎溴铵、度米芬等。

【89~91】

【参考答案】CCA

【解析】本组题考查的是气雾剂的附加剂。潜溶剂为提高难溶性药物的溶解度常使用的混合溶剂,在混合溶剂中各溶剂达到一定比例时,药物的溶解度出现极大值,这种现象称为潜溶,这种混合溶剂称为潜溶剂,常与水形成潜溶剂的有乙醇、丙二醇、甘油和聚乙二醇等。抛射剂分为三类:氢氟烷烃、碳氢化合物和压缩气体。某些药物粉末本身没有黏性,通过加入适当的液体诱发物料黏性,此时加入的液体叫作润湿剂,常用的润湿剂有蒸馏水和乙醇。

【92~93】

【参考答案】CB

【解析】本组题考查的是受体的性质。特异性:受体对它的配体有高度识别能力,对配体的化学结构与立体结构具有很高的专一性,特定的受体只能与其特定的配体结合,产生特定的生理效应。饱和性: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。

【94~97】

【参考答案】BACD

【解析】本组题考查的是表面活性剂的分类。①阴离子表面活性剂:高级脂肪酸盐、硫酸化物、磺酸化物;②阳离子表面活性剂:苯扎氯铵、苯扎溴铵;③两性离子表面活性剂:卵磷脂、氨基酸型和甜菜碱型;④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、聚氧乙烯脂肪酸醚(苜泽)、聚氧乙烯-聚氧丙烯共聚物(泊洛沙姆/普朗尼克)。

【98~100】

【参考答案】BAA

【解析】本组题考查的是药物的排泄。在肾小管中,弱酸性药物在酸性尿中的特点是解离少、重吸收多、排泄慢;在肾小管中,弱酸性药物在碱性尿中的特点是解离多、重吸收少、排泄快;在肾小管中,弱碱性药物在酸性尿中的特点是解离多、重吸收少、排泄快。

三、综合分析选择题

【101~103】

【参考答案】DBA

【解析】本组题考查的是阿仑膦酸钠的用药指导。为避免阿仑膦酸钠刺激上消化道,患者应在清晨、空腹时服药(早餐前至少30分钟),用足量水(至少200 mL)整片吞服,然后身体保持立位(站立或端坐)30~60分钟。服药前后30分钟内不宜进食、饮用高钙浓度饮料及服用其他药物。

维生素D₃须在肝脏和肾脏两次羟基化,先在肝脏转化为骨化二醇,然后再经肾脏代谢为骨化三醇,才具有活性。

按使用方式,药包材可分为I、II、III三类。I类药包材指直接接触药品且直接使用的药品包装用材料、容器(如塑料输液瓶或袋、固体或液体药用塑料瓶等)。

【104~106】

【参考答案】BAD

【解析】本组题考查的是水杨酸乳膏的用药指导和辅料。

(1)已经糜烂或继发性感染部位不可以使用O/W型软膏剂。

(2)十二烷基硫酸钠为O/W型乳化剂。

(3)羟苯酯类均为防腐剂。

【107~108】

【参考答案】EB

【解析】本组题考查的是临床药理学研究的分期。

(1)0期临床试验是在完成临床前研究,但还未进入正式的临床试验之前进行的探索性研究,目的是评价受试药物的安全性和药动学特征,不以药物疗效评价为目的。

(2)I期临床试验为人体安全性评价试验,一般选20~30例健康成年志愿者,观察人体对于受试药的耐受程度和人体药动学特征,为制定临床研究的给药方案提供依据。

【109~110】

【参考答案】DB

【解析】本组题考查的是普萘洛尔的不良反应和分类。

(1)若突然停药或减量过快易使机体的调节功能失调而发生功能紊乱,导致原有病情加重或临床症状上的一系列反跳回升现象,称为反跳现象。

(2)普萘洛尔对 β_1 和 β_2 受体均有阻断作用,属于非选择性 β 受体阻断药。

四、多项选择题

111.【参考答案】ABCDE

【解析】本题考查的是阿司匹林的性质。阿司匹林分子中含有羧基而呈弱酸性,可以在NaOH或Na₂CO₃溶液中溶解。分子中具有酯键可水解,产生水杨酸,其分子中由于含有

酚羟基,在空气中久置,易被氧化成一系列淡黄、红棕甚至深棕色的醌型有色物质,而使阿司匹林成品变色。阿司匹林为环氧化酶(COX)的不可逆抑制剂,可以使COX发生乙酰化反应而失去活性,从而阻断前列腺素等内源性致热致炎物质的生物合成,起到解热、镇痛、抗炎的作用。

112.【参考答案】ABCE

【解析】本题考查的是受体的类型。受体的类型可分为:G蛋白偶联受体、配体门控离子通道受体、酶活性受体、细胞核激素受体。

113.【参考答案】AB

【解析】本题考查的是非线性药动学的特点。非线性药动学的特点:药物的消除不呈现一级动力学特征,即消除动力学是非线性的;当剂量增加时,消除半衰期延长;AUC和平均稳态血药浓度与剂量不成正比;其他可能竞争酶或载体系统的药物,影响其动力学过程。非线性药动学的识别:以剂量对相应的血药浓度进行归一化,以单位剂量下血药浓度对时间作图,所得的曲线如明显不重叠,则可能存在非线性过程。

114.【参考答案】ABCDE

【解析】本题考查的是影响微囊中药物释放速率的因素。①药物的理化性质:囊材相同时,药物在介质中的溶解度越小,释放越慢;②囊材的类型及组成:不同的囊材形成的囊壁具有不同的孔隙率和降解性能,常用囊材形成的囊壁释药速率依次为:明胶>乙基纤维素>苯乙烯-马来酸酐共聚物>聚酰胺;③微囊的粒径:囊膜材料和厚度相同时,微囊粒径越小表面积越大,释药越快;④囊壁的厚度:囊材相同时,囊壁越厚释药越慢;⑤工艺条件:不同工艺条件制得的微囊,其释药速率也不相同;⑥释放介质:释放介质的pH或离子强度通常会影响到囊壁的溶解或降解速度,因而会影响释药速率。

115.【参考答案】ABCD

【解析】本题考查的是抗病毒药物的分类。核苷类抗病毒药物有非开环核苷类(齐多夫定、司他夫定、拉米夫定、扎西他滨)和开环核苷类(阿昔洛韦、伐昔洛韦、更昔洛韦等)。

116.【参考答案】ABCDE

【解析】本题考查的是缓、控释制剂的释药原理。

原理	方法
溶出原理	释放受溶出速度限制——制成溶解度小的盐或酯、与高分子化合物生成难溶性盐、控制粒子大小
扩散原理	释放受扩散速度限制——增加黏度以减小扩散速度、包衣、制微囊、不溶性骨架片、植入剂、乳剂
溶蚀与溶出、扩散结合原理	生物溶蚀型骨架系统:不仅药物可从骨架中扩散出来,而且骨架本身也存在溶蚀的过程

续表

原理	方法
渗透压驱动原理	渗透压为动力,零级释药,释药不受pH影响,比如渗透泵片(原理:水溶性片芯用水不溶性的聚合物包衣,包衣壳用激光打一细孔;水通过包衣半透膜渗入片芯,使药物溶解成饱和溶液,加之高渗透压辅料的溶解,形成膜内外的渗透压差,药物的饱和溶液由细孔持续流出)
离子交换作用	离子交换药物树脂

117.【参考答案】ABD

【解析】本题考查的是营养输液的种类。营养液的种类包括复方氨基酸输液、静脉注射用脂肪乳、维生素和微量元素。右旋糖酐输液为代血浆输液,氧氟沙星葡萄糖输液为含药输液。

118.【参考答案】ABD

【解析】本题考查的是抗病毒药物的分类。①非开环核苷类抗病毒药物,代表药物有齐多夫定、司他夫定、拉米夫定;②开环核苷类抗病毒药物,代表药物有阿昔洛韦、更昔洛韦、喷昔洛韦、泛昔洛韦;③非核苷类抗病毒药物,代表药物有利巴韦林、金刚烷胺、金刚乙胺、膦甲酸钠、奥司他韦。

119.【参考答案】ABC

【解析】本题考查的是缓(控)释制剂的特点。优点:①减少半衰期短的或需要频繁使用的药物的给药次数,大大提高患者的用药顺应性,特别适用于需要长期用药的慢性病患者;②血药浓度平稳,减少峰谷现象,有利于降低药物的毒副作用,减少耐药性的发生;③减少用药的总剂量,发挥药物的最佳治疗效果;④缓释、控释制剂也包括眼用、鼻腔、耳道、阴道、直肠、口腔或牙用、透皮或皮下、肌肉注射及皮下植入,使药物缓慢释放吸收,避免肝门系统的“首过效应”。缓释、控释制剂也有不足:①在临床应用中剂量调节的灵活性降低;②价格昂贵;③易产生体内药物的蓄积,对于“首过效应”大的药物如普萘洛尔等制成缓释、控释制剂时生物利用度可能比普通制剂低。

120.【参考答案】ABD

【解析】本题考查的是片剂常用黏合剂。黏合剂系指依靠本身所具有的黏性赋予无黏性或黏性不足的物料以适宜黏性的辅料,常用的黏合剂有淀粉浆(最常用黏合剂之一,常用浓度8%~15%,价廉、性能较好)、甲基纤维素(MC,水溶性较好)、羟丙纤维素(HPC,可作粉末直接压片黏合剂)、羟丙甲纤维素(HPMC,溶于冷水)、羧甲基纤维素钠(CMC-Na,适用于可压性较差的药物)、乙基纤维素(EC,不溶于水,但溶于乙醇)、聚维酮(PVP,吸湿性强,可溶于水和乙醇)、明胶(可用于口含片)、聚乙二醇(PEG)等。