

考点 1 药物剂型的重要性

药物剂型的重要性	举例
改变性质	硫酸镁口服 - 泻下, 静脉滴注 - 镇静解痉
	依沙吖啶注射 - 引产, 局部涂敷 - 杀菌
改变速度	注射、吸入 - 急救, 丸剂、缓控释制剂 - 长效
减毒	氨茶碱治疗哮喘, 栓剂可消除心跳加快作用
	缓控释血药浓度平稳
靶向	静脉注射用脂质体 → 肝脾
提高稳定性	固体制剂 > 液体制剂
影响疗效	制备工艺、药物晶型、粒子大小

考点 2 药物制剂稳定性变化

类型	代表药
水解	酯类: 普鲁卡因、丁卡因、可卡因、阿托品、后马托品、溴丙胺太林等 内酯: 华法林钠、硝酸毛果芸香碱
	酰胺类: 青霉素类、头孢类、巴比妥类、氯霉素、利多卡因、阿糖胞苷、碘苷、对乙酰氨基酚、地西泮、V _B 族
氧化	酚类: 肾上腺素、吗啡、左旋多巴、水杨酸钠 烯醇类: V _C 双键类: V _A 、V _D 噻嗪类: 氯丙嗪
异构化	光学异构: 左肾上腺素 (外消旋化)、毛果芸香碱 (差向异构) 顺反异构: V _A (全反式 → 顺式, 失效)
聚合	氨苄西林 (聚合易过敏)、塞替派 (聚合失效, 用 PEG400 避免)
脱羧	对氨基水杨酸钠 (-COOH)

考点 3 药物稳定性试验方法

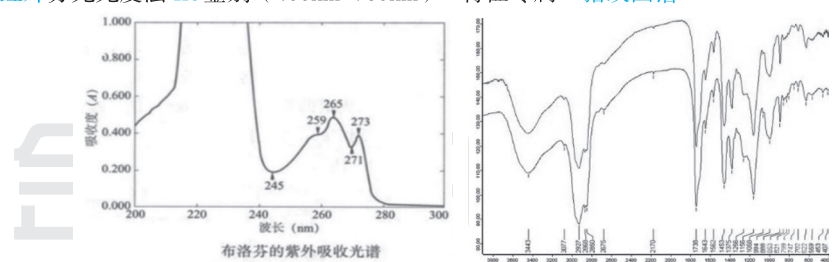
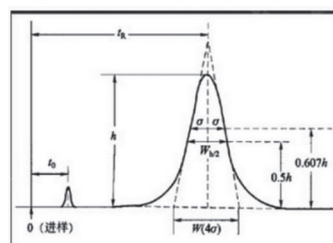
药物稳定性试验方法	试验条件
影响因素试验 (强化试验)	高温 (60℃ ± 2℃ 30 天)、高湿 (90% ± 5% 10 天)、强光 (4500Lx 10 天) - 剧烈条件 - 为工艺筛选、包材选择、贮存条件确定、加速和长期试验提供依据
加速试验 (超常试验条件)	预测常温下的稳定性 (40℃ ± 2℃ 75% ± 5% 6 个月)
长期试验 (留样观察法 实际贮存条件)	确定有效期 t _{0.9} (北方 25℃ ± 2℃ 60% ± 10% 12 个月, 南方 30℃ ± 2℃ 65% ± 5% 12 个月)
有效期 半衰期	t _{0.9} = 0.1054/k t _{1/2} = 0.693/k



考点4 《中国药典》基本要求

项目	要求
溶解度	①易溶: 1g 药物能在 1~10ml 溶剂中溶解; ②溶解: 1g 能在 10~30ml 中溶解; ③微溶: 1g 能在 100~1000ml 中溶解; ④几乎不溶: 1g 在 100000ml 中不能完全溶解 【易三姐微百千不过万 - 易溶 1, 溶解 10-30, 微溶 100-1000, 不溶 10000】
崩解时限	口崩片 -1min; 可溶片 -3min; 舌下片 -5min; 普通片 -15min; 薄膜衣片 -30min; 糖衣片 -1h; 肠溶片 - 碱中 1h 崩解, 酸中 2h 不崩解; 含片 -10min 不崩解; 硬胶囊 -30min; 软胶囊 -1h; 滴丸 -30min
贮藏	避光: 避免日光直射 遮光: 不透光包装
	密闭: 防止尘土/异物 密封: 防止风化、吸潮、挥发、异物进入 熔封/严封: 防止空气、水分、微生物 (注射剂/冲洗剂)
	阴凉处: 不超过 20℃ 凉暗处: 避光不超过 20℃ 冷处: 2℃ ~ 10℃ 常温: 10℃ ~ 30℃

考点5 鉴别试验/含量测定试验

要点	内容
化学鉴别法	颜色、沉淀、气体、焰色反应
光谱鉴别法	紫外-可见分光光度法 UV 鉴别 (200nm~400nm λ_{max} 、 λ_{min} 、肩峰)/含量测定 (吸光度 A) 红外分光光度法 IR 鉴别 (400nm~760nm) - 特征专属 - 指纹图谱  布洛芬的紫外吸收光谱
色谱鉴别法	薄层色谱法 TLC (比移值 R_f) - 鉴别 高效液相色谱法 HPLC - 保留时间 t_R - 鉴别 峰高 h 或峰面积 A - 含量测定  气相色谱法 (GC)
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

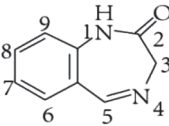
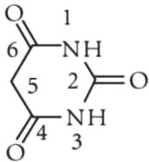
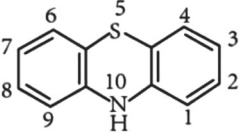
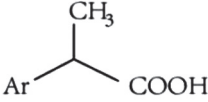
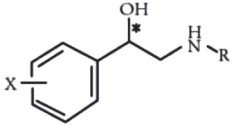
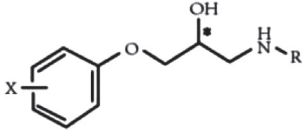
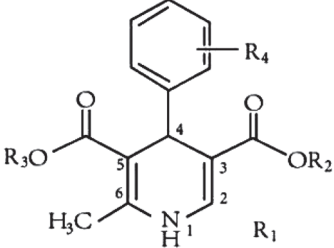
考点6 体内药物检验样品及测定方法

血浆	全血 + 抗凝剂 → 离心 → 上清液; 更可靠更常用, 占全血 50%~60% 抗凝剂 (肝素、EDTA、草酸盐、枸橼酸盐)
----	--

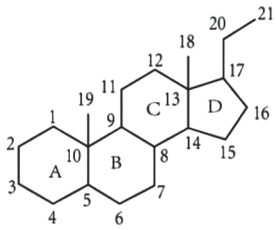
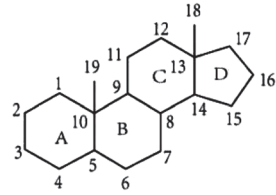
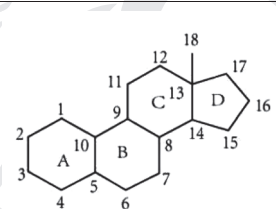
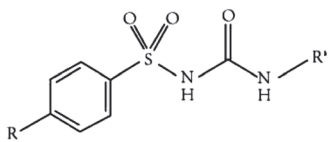
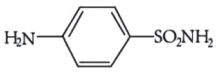
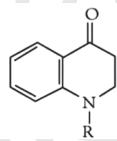


血清	全血→离心→上清液；占全血量 20~40%；无抗凝剂干扰
尿液	采集后立即测定；否则必须立即处置（低温保存 / 加防腐剂后冷藏保存） 防腐剂：二甲苯、氯仿、醋酸、盐酸等
测定法	免疫分析法：放射免疫法、非放射性免疫法（荧光免疫法、发光免疫法、酶免疫法、电化学免疫法） 色谱分析法：气相色谱法 GC、高效液相色谱法 HPLC、色谱-质谱联用（GC-MS、LC-MS）

考点 7 药物的结构和名称

药物的化学骨架名称	药物的化学骨架	药物类别
苯并二氮草		镇静催眠药
环丙二酰脲 (巴比妥类)		抗癫痫药
吩噻嗪		抗精神病药
芳基丙酸		非甾体抗炎药
苯乙醇胺		肾上腺素受体调控药
芳氧乙醇胺		β 受体阻断药
1,4-二氢吡啶		钙通道阻滞药



药物的化学骨架名称	药物的化学骨架	药物类别
孕甾烷		肾上腺糖皮质激素类药物、孕激素类药物
雄甾烷		雄性激素类药物、蛋白同化激素类药物
雌甾烷		雌激素类药物
磺酰脲		降血糖药
对氨基苯磺酰胺		磺胺类抗菌药
喹啉酮环		抗菌药

· 4 ·

考点 8 药物与作用靶标结合的化学本质

共价键	不可逆结合, 牢固	烷化剂 (环磷酰胺、美法仑)、β-内酰胺类、拉唑类	
非共价键	可逆结合	离子键	键能最强, 正负电荷, 去甲肾上腺素-铵盐、氯贝胆碱-季铵【案例】
		氢键	最常见, H原子, 碳酸/磺酰胺类利尿剂+碳酸酐酶、水杨酸甲酯【甲轻叹】
		离子偶极/偶极-偶极	乙酰胆碱、美沙酮【偶见美女】
		电荷转移复合物	氯喹【旅店】
		疏水作用	非极性链
		金属离子络合物	铂金属络合物、金属中毒解毒剂-二巯基丙醇
		范德华力	最弱, 普鲁卡因芳环部分【积阴德】



考点 9 生物药剂学分类

类别	药物分子特点	药物
第Ⅰ类	高溶解度、高渗透性的两亲性分子药物,其体内吸收取决于溶出度	普萘洛尔、马来酸依那普利、盐酸地尔硫革等【普洱普尔】
第Ⅱ类	低溶解度、高渗透性的亲脂性分子药物,其体内吸收量取决于溶解度	双氯芬酸、卡马西平、吡罗昔康等【双马匹】
第Ⅲ类	高溶解度、低渗透性的水溶性分子药物,其体内吸收速率取决于药物渗透率	雷尼替丁、纳多洛尔、阿替洛尔等【你拿啊】
第Ⅳ类	低溶解度、低渗透性的疏水性分子药物,其体内吸收比较困难	特非那定、酮洛芬、呋塞米等【特痛苦】

考点 10 药物的解离常数 (pKa)

类别	代表药物	吸收情况
弱酸性药物	如水杨酸和巴比妥类	在酸性的胃液中几乎不解离,呈分子型,易在胃中吸收。
弱碱性药物	如奎宁、麻黄碱、地西洋、氨苯砜	在胃中几乎全部呈解离形式,很难吸收;而在肠道中,由于pH较高,容易被吸收。
碱性极弱	茶碱和咖啡因	在酸性介质中解离也很少,在胃中易被吸收。
强碱性药物	如胍乙啶	在整个胃肠道中多是离子化的,以及完全离子化的磺酸类和季铵盐类药物,消化道吸收很差。

考点 11 药物结构中的取代基对生物活性影响

基团	内容
羟基	提高化合物的脂溶性、增加脂水分配系数;降低分子的解离度;增加稳定性
卤素	有较强的电负性,增加分子的脂溶性
羟基和巯基	引入羟基,增强与受体的结合力,增加药物分子的水溶性,改变生物活性 引入巯基时,脂溶性比相应的醇高,更易于吸收。巯基还可用作解毒药
醚和硫醚	硫醚易被氧化成亚砷或砷
磺酸、羧酸和酯	①磺酸基的引入,使化合物的水溶性和解离度增加 ②羧酸解离度及水溶性均比磺酸小,羧酸成盐可增加水溶性 ③羧酸成酯后可以增大脂溶性,容易被吸收
含氮原子类	显示碱性;季铵水溶性大,不易通过生物膜和血-脑屏障,以致口服吸收不好,也无中枢作用

考点 12 手性结构对药物活性的影响

手性结构对药物活性的影响	代表药
等同活性和强度	普罗帕酮、氟卡尼
活性相同,强弱不同	氧氟沙星(左>右)、氯苯那敏(右>左)、萘普生(S>R,体内R可以转化为S)
一个有活性,一个没有活性	氯己烯酸(S)、L-甲基多巴、索他洛尔(苯乙醇胺类,R)、阿替洛尔(芳氧丙醇胺,S)
相反的活性(激动、拮抗)	扎考必利、依托唑啉、哌西那朵、异丙肾上腺素



手性结构对药物活性的影响	代表药
不同类型的活性	①右丙氧芬 (镇痛) 左丙氧芬 (镇咳) ②麻黄碱 (血管收缩、平喘) 伪麻黄碱 (支气管扩张) ③奎宁 (抗疟) 奎尼丁 (抗心律失常)
一种有活性, 另一个有毒性	氯胺酮、乙胺丁醇、丙胺卡因、青霉素、四咪唑、米安色林、左旋多巴

考点 13 药物结构与第 II 相生物转化的规律

结合反应	例子
与葡萄糖醛酸的结合反应	O、N、S 和 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 - “灰婴综合征”)
与硫酸的结合反应	沙丁胺醇
与氨基酸的结合反应	苯甲酸、水杨酸
与谷胱甘肽的结合反应	白消安
乙酰化结合反应	极性↓; 对氨基水杨酸
甲基化结合反应	极性↓; 儿茶酚胺结构药物 (去甲肾上腺素、肾上腺素、多巴胺等) (特例: 生成季铵盐, 水溶性↑)

考点 14 药物与非靶标结合引发的毒副作用

类型	代表药
与非治疗部位靶标结合	经典抗精神病药 - 氯丙嗪 - 阻断四条多巴胺通路 - 导致内分泌、锥体外系 选择性 COX-2 抑制剂 - 昔布 - 破坏 TXA ₂ 和 PGI ₂ 的平衡
与非治疗靶标结合	非经典抗精神病药 - 双重阻断 - 降低锥体外系 普利 - 抑制缓激肽分解 - 干咳 大环内酯类 - 刺激胃动素 - 胃肠道副作用
心脏快速延迟整流钾离子 (hERG)	特非那定 / 阿司咪唑 / 西沙比利 (撤市) 【心特细啊】

考点 15 中枢神经系统疾病用药

分类	代表药
苯二氮卓类	1,4- 苯并二氮卓环 (ABC 环) 西洋: 地西洋 → 奥沙西洋 (去甲基, 加 3-OH, 安全) 唑仑 (1,2 位并入三唑环): 艾司唑仑、三唑仑
非苯二氮卓类	唑吡坦 (咪唑并吡啶) 扎来普隆 (吡唑并咪啶, 无精神依赖性和后遗症) 佐匹克隆 (1 个 C*, 吡咯酮) - 艾司佐匹克隆 (右旋)

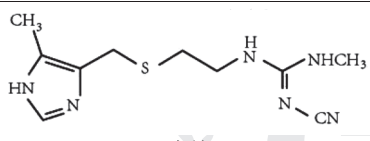
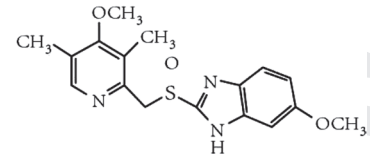
考点 16 抗抑郁药物

分类	代表药
NE 重摄取抑制剂	丙咪嗪 → 地昔帕明、氯米帕明 → 去甲帕明、阿米替林 → 去甲替林、多塞平 (E 型: Z 型 = 85:15 = NE: 5-HT)

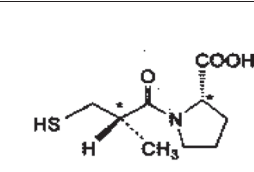
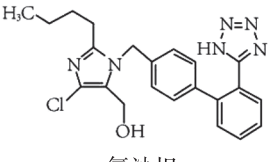


分类	代表药
选择性 5-HT 重摄取抑制剂	氟西汀 (1 个 C*) → 去甲氟西汀 舍曲林 (2 个 C*) → 去甲舍曲林 西酞普兰 (1 个 C*) → N- 去甲基西酞普兰 艾司西酞普兰 (S) 氟伏沙明、氯伏沙明、帕罗西汀 (2 个 C*)
单胺氧化酶抑制药	吗氯贝胺、托洛沙酮
5-HT 与 NE 再摄取抑制药	N- 去甲文拉法辛 ← 文拉法辛 → O- 去甲文拉法辛 (有活性) (小剂量: 5-HT, 大剂量: 5-HT 和 NE) 度洛西汀、米氮平

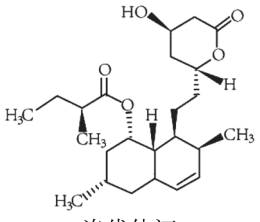
考点 17 消化系统疾病用药

分类	代表药物	内容
H ₂ 受体 阻断药	 西咪替丁	基本结构: 芳环基团 + 四原子链 + 脒基团 ①西咪替丁: 咪唑环 + 含硫醚的四原子链 + 胍基 ②雷尼替丁: 咪唑环, 二氨基硝基乙烯, 反式体 ③尼扎替丁 (反式)、法莫替丁: 噻唑环 ④罗沙替丁: 无芳杂环, 哌啶甲苯环
质子泵 抑制药	 奥美拉唑	基本结构: 苯并咪唑 + 亚磺酰基 (亚砷) + 吡啶环 ①奥美拉唑: 前药循环; 清除率异构体 R > S (埃索美拉唑) ②同类: 兰索拉唑 (肠溶)、右兰索拉唑 [R 异构体, 其控释胶囊是首个设计提供分 2 次释药的双重控释 (DDR)]
促胃肠动 力药	中枢性和外周性多巴胺 D ₂ 受体拮抗剂	甲氧氯普胺 - 苯甲酰胺类 - 锥体外系症状
	外周性多巴胺 D ₂ 受体拮抗剂	多潘立酮 - 双苯并咪唑结构
	阻断多巴胺 D ₂ 受体活性和抑制乙酰胆碱酯酶活性	伊托必利 - 不产生甲氧氯普胺的锥体外系症状, 无西沙比利的致室性心律失常及其他严重的药物不良反应, 安全性更高
	选择性 5-HT ₄ 受体激动药	莫沙必利 - 新型, 强效 - 无心脏副作用

考点 18 循环系统疾病用药

分类	代表药物	内容
血管紧张 素转换酶 抑制剂	 卡托普利	(1) 卡托普利 (1 个游离羧基、巯基, 脯氨酸药效基团, 非前药, 皮疹和味觉障碍)、阿拉普利 (前药) (2) 2 个游离羧基、赖氨酸: 赖诺普利 (非前药) 1 个游离羧基, 1 个成酯: 依那普利 (→ 依那普利拉, 有活性)、贝那普利 (→ 贝那普利拉) (3) 福辛普利 (含磷酸基, 1 个游离羧基, 1 个成酯, → 福辛普利拉)
血管紧张 素 II 受体 阻断药	 氯沙坦	(1) 四氮唑基、咪唑、联苯: 氯沙坦、厄贝沙坦 (螺环)、坎地沙坦酯 (前药) (2) 缬沙坦: 不含“咪唑” (3) 替米沙坦: 不含四氮唑, 而含羧酸基



分类	代表药物	内容
羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑制剂	 洛伐他汀	(1) 副作用: 肌肉疼痛或横纹肌溶解 (西立伐他汀由于引起横纹肌溶解, 导致病人死亡的副作用而撤出市场) (2) 必需结构: 3,5-二羟基羧酸 (内酯水解生效) (3) 前药 (内酯环水解): 洛伐他汀、辛伐他汀 (4) 结构总结: ①天然及半合成改造药物: 洛伐他汀(天然)、辛伐他汀(-CH ₃)、普伐他汀钠(-OH) ②人工全合成药物: 氟伐他汀钠(咪唑环, 第一个)、阿托伐他汀钙(吡咯环)、瑞舒伐他汀钠(噻啉环)

考点 19 口服降糖药

分类	代表药
促胰岛素分泌药	磺酰脲类 苯磺酰脲结构 格列齐特、格列本脲(环己基)、格列吡嗪、格列美脲(甲基环己基, 高效长效)
	非磺酰脲类 氨基酸结构, 餐时血糖调节剂 瑞格列奈(S 异构体)、那格列奈(D- 苯丙氨酸衍生物, R 异构体)、米格列奈(强快短)
胰岛素增敏剂	双胍类 二甲双胍(强碱性, 肾功能损害者禁用)
	噻唑烷二酮类 罗格列酮、吡格列酮
α-葡萄糖苷酶抑制剂	阿卡波糖(-OH)、米格列醇、伏格列波糖
二肽基肽酶-4 抑制药	列汀
钠-葡萄糖协同转运蛋白 2 抑制药	列净【二太太停牌四次, 净胡二钠】

8

考点 20 口服固体制剂的常用辅料

分类	常用种类	
稀释剂(填充剂)	乳糖、蔗糖、糊精、淀粉、预胶化淀粉、微晶纤维素(MCC)、甘露醇和无机盐类等	
润湿剂和黏合剂	常用的润湿剂有乙醇和蒸馏水, 其中首选的润湿剂是蒸馏水 常用的黏合剂有甲基纤维素(MC)、淀粉浆、羟丙基甲基纤维素(HPMC)、羟丙基纤维素(HPC)、羧甲基纤维素钠(CMC-Na)、乙基纤维素(EC)、聚维酮(PVP)、聚乙二醇(PEG)、明胶等	
崩解剂	羧甲基淀粉钠(CMS-Na)、干淀粉、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)和泡腾崩解剂等	
润滑剂	微粉硅胶、硬脂酸镁(MS)、氢化植物油、滑石粉、十二烷基硫酸钠、聚乙二醇类等	
释放调节剂	常用的释放调节剂主要分为骨架型、包衣膜型缓控释放高分子和增稠剂等	
	骨架型释放调节剂	亲水性凝胶骨架材料 甲基纤维素(MC)、羧甲基纤维素钠(CMC-Na)、羟丙基甲基纤维素(HPMC)、聚维酮(PVP)、海藻酸盐、卡波姆、脱乙酰壳多糖(壳聚糖)等
		不溶性骨架材料 乙基纤维素(EC)、聚甲基丙烯酸酯、聚乙烯、乙烯-醋酸乙烯共聚物、无毒聚氯乙烯、硅橡胶等
		生物溶蚀性骨架材料 巴西棕榈蜡、动物脂肪、氢化植物油、蜂蜡、硬脂醇、单硬脂酸甘油酯等
	包衣膜型释放调节剂	不溶性高分子材料 如不溶性骨架材料 EC 等
肠溶性高分子材料 如醋酸纤维素酞酸酯(CAP)、丙烯酸树脂 L 和 S 型、羟丙基甲基纤维素酞酸酯(HPMCP) 和醋酸羟丙基甲基纤维素琥珀酸酯(HPMCAS) 等		



考点 21 薄膜包衣

要点	内容
胃溶型	羟丙基甲基纤维素 (HPMC)、羟丙基纤维素 (HPC)、丙烯酸树脂 IV 号、聚乙烯缩乙醛二乙氨乙酸 (AEA) 和聚乙烯吡咯烷酮 (PVP) 等
肠溶型	醋酸纤维素酞酸酯 (CAP)、虫胶、羟丙基甲基纤维素酞酸酯 (HPMCP)、丙烯酸树脂类 (I、II、III 号) 等
水不溶型	醋酸纤维素、乙基纤维素 (EC) 等
增塑剂	水溶性增塑剂 (如甘油、丙二醇、聚乙二醇等) 和非水溶性增塑剂 (如乙酰化甘油酸酯、甘油三醋酸酯、邻苯二甲酸酯等)
致孔剂	蔗糖、氯化钠、表面活性剂和 PEG 等
遮光剂	二氧化钛等

考点 22 口服散剂的特点

分类	优点	缺点
散剂	①粒径小、易分散、起效快；②制备工艺简单，特殊群体可口服；③较方便；④完整保存中药材药性	分散度较大，稳定性差，对光湿热敏感不宜
颗粒剂	①分散性、附着性、团聚性、引湿性等较小；②服用方便，可加入添加剂 (着色剂/矫味剂)，提高服药顺应性；③包衣可使颗粒具有防潮性、缓释性、肠溶性等；④制粒可防止复方散剂各组分由于粒度或密度差异而产生离析	
片剂	①准确、服方便；②性质稳定；③成本低，售价低；④种类多，应用广；⑤方便	①不易吞服；②含挥发性成分的含量下降；③工序多，难度高
胶囊剂	①掩味，提高稳定性；②起效快、生物利用度高；③液态药物固体化；④药物缓释、控释和定位释放	①胶囊壳受温度和湿度影响较大；②成本高；③特殊群体 (婴幼儿、老人) 口服困难；④一些药物不宜制成胶囊剂

考点 23 口服膜剂

要点	内容
特点	吸收快、方便、不同释药速度、载药量小
成膜材料	聚乙烯醇 (PVA)、丙烯酸树脂类、纤维素类等

考点 24 口服液体制剂的分类

分类	类型	特征
均相	低分子溶液剂	真溶液；热力学稳定体系；扩散快，能透过滤纸和半透膜。
	高分子溶液剂	真溶液；热力学稳定体系；扩散慢，不能透过半透膜。
非均相	溶胶剂	胶体 胶态分散形成多相体系；有界面，热力学不稳定体系。
	混悬剂	固体微粒分散形成，动力学和热力学均不稳定体系；有界面。
	乳剂	液体微粒分散形成，动力学和热力学均不稳定体系；有界面。水相 - 油相 - 乳化剂



考点 25 表面活性剂的分类及应用

分类	应用	
阴离子型	有刺激性, 一般外用, 很少用于口服 高级脂肪酸盐 (硬脂酸钠 / 钾 / 钙、三乙醇胺)、硫酸化物 (十二烷基硫酸钠)、磺酸化物 (十二烷基苯磺酸钠)	
阳离子型	苯扎氯铵 (洁尔灭) 苯扎溴铵 (新洁尔灭)	毒性大, 主要用于皮肤、黏膜、手术器械消毒
两性离子型	天然: 卵磷脂、豆磷脂	注射用乳剂的乳化剂; 脂质体主要原材料
非离子型	司盘、吐温、卖泽、苜泽、泊洛沙姆 / 普朗尼克 (静脉注射用乳剂的乳化剂)	
毒性	阳 > 阴 > 非 (口服无毒)	

考点 26 低分子溶液剂

要点	内容
溶液剂	(不挥发性) 化学药物 + 水 / 醇 / 油
芳香水剂	芳香挥发性药物 + 水 (水蒸气蒸馏法 - 露剂) (澄明, 不易久贮)
酊剂	挥发性药物 + 浓乙醇溶液 (含醇 60%~90%, 不易久贮)
酏剂	药物 + 乙醇 (含剧毒酏剂浓度 ≤ 10%, 其他酏剂 ≤ 20%; 最低乙醇含量为 30%)
酞剂	不良味道药物 + 稀醇 (含醇 5%~40%, + 芳香剂 / 甜味剂)
糖浆剂	药物 + 浓蔗糖水溶液 [含蔗糖量不低于 45% (g/ml)]。

· 10 ·

考点 27 乳剂的稳定性

要点	内容
分层	可逆, 分散相和分散介质之间存在密度差
絮凝	可逆, 乳滴荷电减少, ζ 电位 ↓ → 可逆性聚集
转相	乳化剂性质变化 → 乳剂类型变化
合并	乳滴周围乳化膜部分破裂 → 液滴合并变大
破裂	不可逆, 液滴进一步合并 → 形成水相两相
酸败	不可逆, 可加入防腐剂 / 抗氧化剂

考点 28 注射剂的质量要求

要点	内容
pH	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
渗透压	与血浆相同的或略偏高
稳定性	物理稳定性和化学稳定性
安全性	对机体无毒性、无刺激性, 降压物质符合规定
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
无菌	不应含有任何活的微生物



要点	内容
无热原	<p>内毒素 (G⁻菌致热能力最强)</p> <p>热原的性质: 水溶性、不挥发性、耐热性、过滤性 (活性炭)、能被强碱、强酸、强氧化剂、超声波破坏, 被离子交换树脂吸附</p> <p>除去方法: ①除去药液/溶剂中热原的方法: 吸附法/离子交换法/凝胶滤过法/超滤法/反渗透法; ②除去容器/用具上热原的方法: 高温法/酸碱法。</p>

考点 29 注射剂常用的附加剂

附加剂种类	附加剂名称
抗氧化剂	焦亚硫酸钠、亚硫酸氢钠、亚硫酸钠、硫代硫酸钠
金属螯合剂	乙二胺四乙酸二钠 (EDTA · 2Na)
助悬剂	羧甲基纤维素、明胶、果胶
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)
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
等渗调节剂	氯化钠、葡萄糖、甘油
填充剂	乳糖、甘露醇、甘氨酸

考点 30 制药用水

饮用水	制药用水原水, 饮片提取溶剂
纯化水	不得用于注射剂; 可用于口服、外用制剂
注射用水	注射剂、滴眼剂等溶剂或稀释剂及容器的清洗溶剂
灭菌注射用水	不含附加剂; 注射用灭菌粉末的溶剂或注射剂的稀释剂

考点 31 注射剂的溶解度

影响溶解度的因素	<p>①药物结构与溶剂极性 (相似相溶) ②温度</p> <p>③药物的晶型: 无定型 > 亚稳定型 > 稳定型 有机溶剂化物 > 无水物 > 水合物</p> <p>④粒子大小: 溶解度随粒径减小而增加 ⑤加入第三种物质: 助溶剂、增溶剂</p>
增加溶解度的方法	<p>①加入增溶剂 (表面活性剂) ②加入助溶剂 (苯甲酸钠、水杨酸钠、碘化钾)</p> <p>③制成可溶性盐类 ④使用混合溶剂 (潜溶剂, 醇+水)</p> <p>⑤制成共晶 ⑥提高温度, 改变 pH, 微粉化、包合技术</p>

考点 32 注射剂配伍变化的主要原因及实例

主要原因	实例
溶剂组成改变	如地西洋注射液与 0.9% 氯化钠、5% 葡萄糖或 0.167mol/L 乳酸钠注射液配伍时, 易析出沉淀
pH 的改变	如 5% 葡萄糖与新生霉素, 氨苄西林与诺氟沙星配伍会发生沉淀, 磺胺嘧啶钠, 谷氨酸钠 (钾)、氨茶碱等碱性药物可使肾上腺素变色
缓冲容量	如 5% 硫喷妥钠 10ml 加入含乳酸盐的葡萄糖注射液会析出沉淀
离子作用	如乳酸根离子会加速青霉素 G 和氨苄西林钠的水解



主要原因	实例
直接反应	如四环素与含钙盐的输液在碱性或中性下,会产生不溶性螯合物
盐析作用	如两性霉素 B 注射液,只能加入 5% 葡萄糖注射液中静脉滴注。若在大量电解质的输液中则能被电解质盐析出来

考点 33 药物对机体各系统的毒性作用

药物对肾脏的毒性作用:急性肾小管损伤或坏死、急性间质性肾炎、慢性间质性肾炎、肾小球肾炎、梗阻性急性肾功能衰竭、肾血管损害

药物对肝脏的毒性作用:肝坏死、胆汁淤积、纤维化及肝硬化、慢性坏死性肝炎

考点 34 溶液型注射剂的临床应用

- ①患者存在吞咽困难或明显的吸收障碍;
- ②口服生物利用度低的药物;
- ③患者疾病严重、病情进展迅速的紧急情况下;
- ④没有合适的口服剂型的药物。

考点 35 脂质体

要点	内容
成膜材料	①磷脂:天然的卵磷脂、豆磷脂以及合成磷脂 ②胆固醇(两亲,调节流动性)
特点	靶向性(肿瘤)、淋巴定向性、缓释长效、细胞亲和性和组织相容性、降低药物毒性
理化性质	相变温度、荷电性
新型靶向	前体(+水溶性载体,适合包封脂质性药物)、长循环(PEG 修饰)、免疫(+抗体)、热敏(相变温度)、pH 敏感性(肿瘤间质 pH 低)
质量要求	包封率 > 80%;载药量; 物理稳定性:渗漏率;化学稳定性:磷脂氧化指数,磷脂量的测定

考点 36 生物技术药物注射剂

要点	内容
特点	①分子量大:多肽类、抗体类、重组病毒、细胞等;②几乎都必须采用注射给药方式:难以透过体内屏障;③对温度、pH、离子强度及酶等条件极为敏感,易被降解或失活;④结构非常复杂:分析方法独特
注意事项	①稳定剂-蔗糖,抗氧化剂-EDTA 等螯合剂 ②表面活性剂:可防止蛋白的变性(少量吐温 80)

考点 37 贴剂的处方材料

处方材料	常用材料
骨架材料	亲水性的聚乙烯醇与疏水性的聚硅氧烷



处方材料	常用材料
控释膜材料	微孔膜:聚丙烯拉伸微孔膜等 均质膜:聚硅氧烷和乙烯-醋酸乙烯共聚物等
压敏胶	硅橡胶类、聚丙烯酸类和聚异丁烯(PIB)类
背衬材料	常用多层复合铝箔,其他可使用的背衬材料还有聚苯乙烯、高密度聚乙烯、聚对苯二甲酸二乙酯等
防黏材料	聚苯乙烯、聚乙烯、聚碳酸酯、聚丙烯等
药库材料	聚乙烯醇、羟丙基甲基纤维素、卡波姆等均较常用,各种骨架膜材和压敏胶也同时可以是药库材料

考点 38 皮肤给药制剂的选用原则

分期	应用
皮肤病急性期	①无渗液:洗剂/粉雾剂;禁用糊剂/软膏剂(阻滞水分蒸发) ②大量渗液:溶液湿敷(3%硼酸洗剂)
皮肤病亚急性期	①皮肤糜烂,少量渗液:外用糊剂 ②丘疹或小片增厚无渗液:乳膏剂/洗剂/软膏剂 ③有痂皮:先软膏剂(软化),再外用药(易吸收)
皮肤病慢性期	浸润增厚为主:乳膏剂、软膏剂;苔藓样变为主:软膏剂、酊剂

考点 39 栓剂的基质

种类	常用品种
油脂性基质	可可豆脂、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	甘油明胶、聚乙二醇、泊洛沙姆

考点 40 药物的转运方式的特点

分类	特点	转运物质
被动转运	滤过	流体静压/渗透压透过膜孔
	简单扩散	无需载体、顺浓度差(不耗能)
载体转运	主动转运	载体(饱和性/竞争性/特异性)、逆浓度差(耗能)
	易化扩散	载体(饱和性/竞争性/特异性)、顺浓度差(不耗能)
膜动转运	胞饮、吞噬、胞吐 适用对象:微粒/大分子物质(蛋白质、多肽)②有部位特异性	水溶性、小分子药物 解离度小,脂溶性大 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 核苷类、单糖类、氨基酸等高极性物质

考点 41 影响药物吸收的因素

要点	内容
生理因素	①胃肠液的成分和性质 ②胃肠道运动 ③循环系统转运 ④食物 ⑤胃肠道酶代谢 ⑥疾病因素 ⑦特殊人群



要点	内容	
剂型(广义)因素	物理化学因素	①脂溶性和解离度; ②溶出速度; ③药物在胃肠道中的稳定性
	剂型与制剂因素	①剂型; ②制剂处方; ③制剂制备工艺

考点 42 药物的分布

要点	内容
影响分布的因素	①药物与组织的亲和力: 亲脂性药物容易从水性血浆环境中分布进入脂肪组织 ②血液循环系统 ③药物与血浆蛋白结合的能力: 药物与血浆蛋白结合是可逆过程, 有饱和现象, 包括游离药物与结合药物, 但药物的疗效取决于其游离型浓度 ④微粒给药系统(靶向 $7\mu\text{m}$ 肝、脾; > <math>7\mu\text{m}< math>="" td="" 肺截流)<=""> </math>7\mu\text{m}<>
淋巴系统转运	可使药物避免肝脏的首关效应; 脂肪和蛋白质等大分子物质的转运
脑内分布/胎儿内分布	血脑屏障和胎盘屏障(亲脂性/非解离易通过; 大分子、水溶性/解离型难通过)

考点 43 药物排泄

要点	内容	
肾小管重吸收	肾小球滤过	血浆蛋白结合型不能滤过
	肾小管分泌	主动转运, 竞争性抑制; 血浆蛋白结合率不影响肾小管分泌
	肾小管重吸收	必备物质葡萄糖主动重吸收 药物被动重吸收【酸碱碱酸促排泄】
肠-肝循环	是指随胆汁排入十二指肠的药物或其代谢物, 在肠道中被重新吸收, 经门静脉返回肝脏, 重新进入血液循环的现象(在体内能停留较长时间)。药-时曲线双峰现象(氯霉素、螺内酯、己烯雌酚、卡马西平、吲哚美辛等药物)	

考点 44 药动学参数及临床意义

参数	名称	意义	公式	单位
k	速率常数	药物消除速度的快慢	肝代谢 + 肾排泄 $k = k_b + k_e$ 特征参数	时间 ⁻¹ min ⁻¹
$t_{1/2}$	生物半衰期	药物在体内的量/血药浓度降低一半所需要的时间	$t_{1/2} = 0.693/k$ 特征参数, 不因药物剂型、给药途径或剂量而改变	时间 min
V	表观分布容积	不涉及真正的容积	$V = X/C$ 常数 C 高, 亲水性药物, V 小; C 低, 亲脂性药物, V 大, 可超过体液总体积	体积 L L/kg
Cl	清除率	药物消除的快慢	肝清除率 + 肾清除率 $Cl = kV$ 常数	体积/时间 L/min



考点 45 非线性药动学

区分	线性特点	非线性特点 (可能竞争酶 / 载体系统)
一级动力学特征	符合	不呈现, 米氏方程
剂量增加, k 、 $t_{1/2}$ 、 Cl	不变	k 、 Cl 变小, $t_{1/2}$ 延长
AUC 、 C_{av} 与剂量	成正比 $C_{av} = X_0 / Vkt$	不成正比
剂量改变, 原药与代谢产物的组成比例	不变	改变

考点 46 生物利用度与生物等效性

生物利用度的研究方法	绝对生物利用度 (参比制剂 - 静脉)	$F = \frac{AUC_{(po)} / Dose_{(po)}}{AUC_{(iv)} / Dose_{(iv)}} \times 100\%$
	相对生物利用度	$F_r = \frac{AUC_{(T)} / Dose_{(T)}}{AUC_{(R)} / Dose_{(R)}} \times 100\%$
生物等效性研究	药物动力学研究 (最常用) > 药效动力学研究 > 临床研究 > 体外研究	
	药动学终点评价指标: C_{max} 、 t_{max} 、 AUC (血难测 → 换尿)	
	C_{max} 、 AUC 的 90% 置信区间均在 80%~125%	

考点 47 药物的量 - 效关系

要点	内容
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 (药物的内在活性)
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
治疗指数 / 安全范围	<p>①半数有效量 (ED_{50}) ②半数致死量 (LD_{50}) ③治疗指数 (TI): LD_{50} / ED_{50} ④安全范围: ED_{95} 和 LD_5 之间的距离</p> <p>A 药物 (■) 的治疗指数与 B 药物 (□) 相同, 但 A 药的安全范围比 B 药大</p>

考点 48 药物的作用机制

作用机制	代表药物
作用于受体	胰岛素, 阿托品, 肾上腺素 (激活 α 、 β 受体) 等
影响酶的活性	①抑制酶活性: 依那普利 (抑制血管紧张素 I 转化酶)、阿司匹林、地高辛 ②激活酶活性: 尿激酶、碘解磷定 (激活胆碱酯酶) ③影响代谢酶: 苯巴比妥 (诱导肝药酶)、氯霉素 (抑制肝药酶) ④本身是酶: 胃蛋白酶、胰蛋白酶等



作用机制	代表药物
影响细胞膜离子通道	利多卡因 (抑制 Na ⁺ 通道); 硝苯地平 (阻滞 Ca ²⁺ 通道); 阿米洛利 (阻滞肾小管 Na ⁺ 通道); 米诺地尔 (激活血管平滑肌 ATP 敏感的 K ⁺ 通道等)
干扰核酸代谢	①抗肿瘤药 (氟尿嘧啶结构与尿嘧啶相似, 掺入肿瘤细胞后发挥抗肿瘤作用) ②抗菌药 (磺胺类、喹诺酮类) ③抗人类免疫缺陷病毒药 (齐多夫定)
补充体内物质	补充铁剂治疗缺铁性贫血; 补充胰岛素治疗糖尿病; 补充维生素、多种微量元素等
改变细胞周围环境的理化性质	甘露醇 (利尿); 氢氧化铝、三硅酸铁 (抗酸药); 二巯基丁二酸钠 (解毒); 硫酸镁 (泻药); 右旋糖酐 (血容量扩张药)
影响生理活性物质及其转运体	噻嗪类利尿药 (抑制肾小管 Na ⁺ -Cl ⁻ 转运体); 丙磺舒 (竞争性抑制肾小管对弱酸性代谢物的转运体)
影响机体免疫功能	免疫抑制药 (环孢素)、免疫增强药 (左旋咪唑)
非特异性作用	消毒防腐药、蛋白沉淀剂、调节血液酸碱平衡 (碳酸氢钠、氯化铵) 等

考点 49 受体的激动药和拮抗药

	亲和力	内在活性	分类	特点
激动药	高	有	完全激动药	内在活性强 ($\alpha=1$) (吗啡)
			部分激动药	内在活性弱 ($\alpha < 1$ E _{max} 较低) (喷他佐辛 小剂量激动, 大剂量拮抗)
			反向激动药	(苯二氮卓类) 结合后引起与激动药相反的效应
拮抗药	高	无 ($\alpha=0$)	竞争性拮抗药	可与激动剂竞争相同受体, 可逆 (E _{max} 不变、曲线平行右移)
			非竞争性拮抗药	与受体结合牢固 / 不可逆 (E _{max} 下降)
竞争性拮抗药				

考点 50 药物效应的协同作用和拮抗作用

药理学相互作用		代表药物
协同作用	相加作用	阿司匹林 + 对乙酰氨基酚; 阿替洛尔 + 氢氯噻嗪
	增强作用	磺胺甲噁唑 + 甲氧苄啶 (SMZ+TMP); 普鲁卡因注射液 + 肾上腺素
	增敏作用	钙增敏药
拮抗作用	生理性拮抗	组胺 + 肾上腺素
	生化性拮抗	苯巴比妥使避孕药效应降低, 避孕失败
	化学性拮抗	肝素 + 鱼精蛋白
	药理性拮抗	苯海拉明 + 组胺 H ₁ 受体激动药; β 受体阻断药 + 异丙肾上腺素

