



2026 年药专业知识一高频考点

【考点 1】药物来源 (26 年未改变)

植物来源的药物	天然产物	镇痛药吗啡、解痉药阿托品、抗疟药奎宁等
	天然产物的修饰物	水杨苷 → 阿司匹林 喜树碱 → 伊立替康
	天然产物的简化物	可卡因 → 普鲁卡因 双香豆素 → 华法林
动物来源药物	设计合成的 ACEI 类	
微生物的代谢产物	直接作为药物或作为先导化合物	青霉素、四环素、环孢菌素 A、阿霉素; 羟甲戊二酰辅酶 A (HMG-CoA) 还原酶抑制剂的先导化合物
天然配体	组胺 → 抗过敏药、**替丁 多巴胺、去甲肾上腺素、肾上腺素 → 甲基多巴、左旋多巴、多巴酚丁胺、β 受体拮抗剂	
现有药物改造	异烟肼 → 单胺氧化酶抑制剂吗氯贝胺; 异丙嗪 → 氯丙嗪 磺胺类 → 噻嗪类	
筛选得到的药物	实体筛选	拉帕替尼、达沙替尼、索拉非尼、舒尼替尼, 西格列汀, 马拉韦罗 (maraviroc)
	虚拟筛选	恩赛特韦
通过设计得到的药物	索磷布韦	
从代谢产物中发现	磺胺类药物、特非那定	
从药物合成的中间体中发现	安息他滨	

【考点 2】常见的药物命名 (26 年未改动)

(2015 年 A 型题, 1 分; 2017 年 A 型题, 1 分, 2017 年 B 型题, 2 分; 2019 年 B 型题, 2 分; 2021 年 A 型题, 1 分; 2023 年 X 型题, 1 分; 2024 年 A 型题, 1 分; 2025 年 A 型题, 1 分)

1. 商品名:

- (1) 通常是针对药物的最终产品, 剂型和剂量确定
- (2) 制药企业拥有专利权, 专利保护。其他企业不得冒用、顶替
- (3) 选用的商品名称不能暗示疗效和用途, 简单顺口
- (4) 含有相同药物活性成分的药品在不同的国家、不同的生产企业可能以不同的商品名称销售

2. 通用名:

- (1) 英文通用名称: 世界卫生组织 WHO, 国际非专有名称 (INN)
- (2) 中文通用名称: 国家药典委员会, 《中国药品通用名称 (CADN) 》
- (3) 通用名称用于识别药物物质或活性成分, 而非最终药品
- (4) 一个药物只有一个通用名称, 不受专利保护, 不能与已有名称相同, 不能与商品名近似

3. 化学名:

- (1) 依据: 国际纯化学和应用化学会 (IUPAC)、中国化学会、美国化学文献 (CA)。





(2) 原则: 选取特定部分作为母体, 规定母体位次编排法, 其他部分视为取代基, 手性化合物规定立体构型或几何构型

【考点 3】药物剂型的分类 (26 年微调)

(2015 年 A 型题, 1 分, 2015 年 B 型题, 2 分, 2015 年 X 型题, 1 分; 2016 年 X 型题, 1 分; 2021 年 X 型题, 1 分; 2023A 型题, 1 分)

1. 按形态学分类

- (1) 固体剂型: 散剂、颗粒剂、胶囊剂、片剂等;
- (2) 半固体剂型: 软膏剂、糊剂等;
- (3) 液体剂型: 溶液剂、混悬剂、注射剂等;
- (4) 气体剂型: 气雾剂、部分吸入剂等。

2. 按给药途径分类

(1) 经胃肠道给药剂型: 片剂、胶囊剂、颗粒剂、丸剂、口服溶液剂、散剂、糖浆剂等。易受胃肠道中酸或酶的破坏, 一般不能简单采用这类剂型。

(2) 非经胃肠道给药剂型:

- ①注射给药: 注射剂, 如静脉/肌肉/皮下/皮内注射;
- 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肺部给药: 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。

3. 按分散体系分类

①真溶液类: 如溶液剂、糖浆剂、甘油剂、溶液型注射剂等; ②胶体溶液类: 如溶胶剂、胶浆剂; ③乳剂类; ④混悬液类; ⑤气体分散类: 如气雾剂、喷雾剂等; ⑥固体分散类: 如散剂、丸剂、胶囊剂、片剂等普通剂型; ⑦微粒类: 粒径一般为微米级或纳米级。

4. 按释药速度与维持时间分类

速释, 普通和缓释、控释制剂

【考点 4】药物剂型的重要性 (26 年未改动)

(2016 年 B 型题, 2 分; 2019 年 A 型题, 1 分; 2020 年 A 型题, 1 分; 2022 年 A 型题, 1 分)

1. 改变药物的作用性质: 硫酸镁口服导泻, 5%注射液静脉滴注用于解痉。
2. 调节药物的作用速度: 注射剂作用速度快, 缓控释制剂药效慢。
3. 降低/消除药物的不良反应: 氨茶碱治疗哮喘病可引起心率加快, 改为栓剂则可消除此毒副作用。
4. 产生靶向作用: 静脉注射的脂质体可使药物在肝、脾等器官浓集性分布。
5. 提高药物的稳定性: 固体制剂的稳定性大于液体制剂。
6. 影响疗效: 固体制剂制备工艺不同会对药效产生显著影响; 药物晶型、粒子大小可影响药物的释放。

【考点 5】药物制剂的化学稳定性 (26 年未改动)

(2016 年 B 型题, 2 分; 2017 年 A 型题, 1 分; 2018 年 A 型题, 1 分。)

1. 水解

- (1) 酯或内酯: ①酯类药物: 盐酸普鲁卡因、盐酸丁卡因、盐酸可卡因、溴丙胺太林、乙酰水杨





酸、硫酸阿托品、氢溴酸后马托品；②内酯类药物：毛果芸香碱、华法林钠。

(2) 酰胺类：青霉素类、头孢菌素类、氯霉素、巴比妥类。

(3) 其他类：阿糖胞苷（酸性）、维生素 B、地西洋、碘苷等。

2. 氧化

(1) 酚类：肾上腺素、左旋多巴、吗啡、水杨酸钠等。

(2) 烯醇类：维生素 C。

(3) 芳胺类：磺胺嘧啶钠。

(4) 吡唑酮类：氨基比林、安乃近。

(5) 噻嗪类：盐酸氯丙嗪、盐酸异丙。

(6) 含有碳碳双键的药物：维生素 A 或维生素 D。

3. 异构化

(1) 光学异构：左旋肾上腺素（外消旋）；毛果芸香碱（差向异构）。

(2) 顺反异构：维生素 A（全反→顺式，活性↓）。

4. 聚合：氨苄西林、塞替派

5. 脱羧：对氨基水杨酸钠（—COOH）脱羧生成间氨基酚。

【考点 6】药物制剂稳定化的方法（26 年未改动）

（2015 年 X 型题，1 分；2018 年 A 型题，1 分；2022 年 X 型题，1 分；2022 年 B 型题，1 分）

1. **控制外界条件：调节 pH；控制水分及湿度；遮光；驱逐氧气。**

2. **改变溶剂：**在水中很不稳定的药物，可用乙醇、丙二醇、甘油等极性溶剂，或在水溶液中加入适量的非水溶剂可延缓药物的水解，减少药物的降解速度。

3. **加入抗氧化剂或金属离子络合剂**

(1) 水溶性抗氧化剂：亚硫酸钠、亚硫酸氢钠、焦亚硫酸钠、硫代硫酸钠、硫脲、维生素 C、半胱氨酸等。

(2) 油溶性抗氧化剂：叔丁基对羟基茴香醚（BHA）、2, 6-二叔丁基对甲酚（BHT）、维生素 E 等。

焦亚硫酸钠和亚硫酸氢钠适用于弱酸性溶液；亚硫酸钠常用于偏碱性药物溶液；硫代硫酸钠在酸性药物溶液中可析出硫细颗粒沉淀，故只能用于碱性药物溶液。

(3) **金属离子络合剂：EDTA-2Na、酒石酸、枸橼酸、磷酸。**

4. 稳定化的其他方法：

(1) 改进剂型或生产工艺：制成固体剂型（如青霉素粉针）；制成微囊或包合物；采用直接压片或包衣工艺。

(2) 制成稳定的衍生物：盐类、酯类、酰胺类、前体药物；

(3) 加入干燥剂及改善包装：二氧化硅作干燥剂可提高阿司匹林的稳定性。

【考点 7】药品标准体系（26 年微调）

（2019 年 A 型题，1 分；2020 年 B 型题，2 分。）

1. 《中国药典》

由一部、二部、三部、四部及其增补本组成。一部分三类收载中药，包括：药材和饮片；植物油脂和提取物；成方制剂和单味制剂。二部分两部分收载化学药品：第一部分收载化学药品、抗生素、生化药品及各类药物制剂（列于原料药之后）；第二部分收载放射性药物制剂。三部收载生物制品，包括：预防类、治疗类、体内诊断类和体外诊断类品种，同时还收载有生物制品通则、总论和通则。四部收载通则和药用辅料。





2. 药品注册标准

经核准的质量标准,生产该药品的药品生产企业应当执行药品注册标准。

3. 省级药品标准

省、自治区、直辖市省级药品监督管理部门制定的国家药品标准没有规定的中药材标准、中药饮片炮制规范和中药配方颗粒标准。

4. 企业药品标准 (非法定标准)

指标限度的要求应当等于或高于国家药品标准或药品注册标准。

【考点 8】《中国药典》基本要求: 鉴别 (26 年改动)

(2016 年 A 型题, 1 分; 2019 年 B 型题, 3 分; 2020 年 A 型题, 1 分; 2022 年 B 型题, 2 分; 2023 年 B 型题, 3 分; 2024 年 A 型题, 1 分; 2025 年 A 型题, 1 分)

➤ 化学鉴别法, 颜色变化或产生荧光、沉淀、气体等具有可检视的显著特征产物的化学反应。

盐酸麻黄碱	碱性条件下与硫酸铜形成蓝色配位化合物
吗啡	与甲醛-硫酸试液反应显紫堇色
盐酸氯丙嗪	与硝酸反应显红色, 渐变淡黄色
氢化可的松	在乙醇溶液中与硫酸苯肼加热显黄色
盐酸四环素	与硫酸反应显深紫色, 加入三氯化铁溶液变为红棕色
维生素 B1	碱性条件下与铁氰化钾反应生成具有蓝色荧光的硫色素
硫酸奎宁	在稀硫酸酸性条件下, 显蓝色荧光
维生素 C	可使二氯酚酚钠褪色
肾上腺素	与三氯化铁试液反应则显翠绿色

➤ 光学鉴别法, 包括光谱/非光谱法。

紫外-可见分光光度法 (UV-Vis)	190~800nm波长范围内测定物质吸收光谱或特定波长处的吸光度, 用于鉴别、杂质检查和定量测定
红外分光光度法 (IR)	4000~400波数 (cm ⁻¹) 范围。特征专属性, 《中国药典》及各国药典广泛采用标准物质对照法或标准图谱比较进行鉴别
高效液相色谱法 (HPLC)	保留时间 (t _R)
薄层色谱法 (TLC)	比移值 (R _f) 及大小和颜色

➤ 生物学鉴别方法

方法	适用范围
利用微生物学、分子生物学方法或动物试验进行鉴别	主要用于抗生素、生化药品





和生物制品的鉴别（三生）

【考点 9】《中国药典》基本要求：贮藏（26 年未改动）

（2015 年 A 型题，1 分；2017 年 X 型题，1 分；2018 年 A 型题，1 分；2019 年 A 型题，1 分；2022 年 A 型题，1 分；2024 年 B 型题，2 分；2025 年 B 型题，3 分）

1. 避光：系指避免日光直射。
2. 遮光：系指用不透光的容器包装。
3. 密闭：系指将容器密闭以防止尘土及异物进入。
4. 密封：系指将容器密封以防止风化、吸潮、挥发或异物进入。
5. 熔封或严封：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。
6. 阴凉处：系指不超过 20℃。
7. 凉暗处：系指避光并不超过 20℃。
8. 冷处：系指 2℃～10℃。
9. 常温：系指 10℃～30℃，注意与室温的区别。

【考点 10】药品稳定性试验（26 年未改动）

（2024 年 A 型题，1 分；2025 年 A 型题，1 分）

1. 影响因素试验

包括高温试验（温度高于加速试验 10℃ 以上，如 50℃ 或 60℃）、高湿试验（相对湿度 90%±5%）与强光照射试验（照度为 4500lx±500lx）。

影响因素试验法也适用于考察药物与药物、药物与辅料、药物与其直接接触的包装容器间的相容性试验。

2. 加速试验

温度 40℃±2℃、相对湿度 75%±5% 条件下放置 6 个月。中间条件试验 30℃±2℃、相对湿度为 65%±5%，建议考察时间为 12 个月。

对温度特别敏感、预计只能在冰箱（5℃±3℃）内保存使用的药品，可在温度 25℃±2℃、相对湿度 60%±5% 条件下进行，时间为 6 个月。

对拟冷冻贮藏的药品，在 5℃±3℃ 或 25℃±2℃ 条件下放置适当时间进行试验。

基本思路：加速条件比正常贮存条件略高一点。

3. 长期试验

市售包装，温度 25℃±2℃、相对湿度 60%±5% 条件（北方气候）放置 12 个月，或在温度 30℃±2℃、相对湿度 65%±5% 条件（南方气候）下放置。

每 3 个月取样一次，分别于 0、3、6、9、12、18、24、36 个月取样进行检测。将结果与 0 个月比较，一般按 95% 可信限进行统计分析，以确定药品的有效期。

【考点 11】蛋白质的分子结构（26 年未改动）

	定义	作用/形式
一级结构	多肽链中氨基酸残基的排列顺序	是蛋白质最基本的结构，一级结构相似的蛋白质，其基本构象及功能也相似
二级结构	多肽链主链中各原子在各局部的空间排布，即多肽链主链构象	折叠、盘曲成一定的空间结构 α-螺旋（右手螺旋）、β-折叠（伸展呈锯齿状）、β-转角（180° 的转折）和无





		规卷曲（规则性不强区段）等形式
三级结构	各个二级结构的空 间排布方式及有关侧链基 团之间的相互作用关系	疏水作用（维系蛋白质三级结构最主要的动力）、氢键、盐键（离子键）、范德瓦耳斯力和二硫键等
四级结构	两条以上具有独立三级结构的肽链通过非共价键相连聚合而成，各亚基在蛋白质分子内的空间排布及相互接触	

【考点 12】三羧酸循环（柠檬酸循环）的八步反应（26 年未改动）

	名称	催化酶	备注
1	乙酰 CoA 与草酰乙酸缩合成柠檬酸	柠檬酸合酶（第一限速酶）	1: 1
2	柠檬酸经顺乌头酸转变为异柠檬酸	顺乌头酸酶	
3	异柠檬酸氧化脱羧转变为 α -酮戊二酸	异柠檬酸脱氢酶（第二限速酶）	第一次脱羧
4	α -酮戊二酸氧化脱羧生成琥珀酰 CoA	α -酮戊二酸脱氢酶复合体（第三限速酶）	第二次脱羧
5	琥珀酰 CoA 合成酶催化底物水平磷酸化反应生成琥珀酸	琥珀酰 CoA 合成酶	可逆，直接生成高能磷酸键
6	琥珀酸脱氢生成延胡索酸	琥珀酸脱氢酶	
7	延胡索酸加水生成苹果酸	延胡索酸酶	
8	苹果酸脱氢生成草酰乙酸	苹果酸脱氢酶	

柠檬酸循环是三大营养物质分解产能的共同通路。

【考点 13】微生物分类及特征（26 年未改动）

非细胞型	病毒	形态最微小，含单一核酸（DNA/RNA）	细胞内寄生
原核细胞型	细菌	有细胞壁、细胞膜、原始核质、细胞质（有核糖体），无核仁、核膜；有荚膜、鞭毛、菌毛、芽孢特殊结构。球形、杆性、螺旋形	热原、毒素（内毒素为菌体死亡游离出来的细胞壁的脂多糖；外毒素为多数革兰阳性菌合成的）
	支原体	最小原核细胞型，多形态，无细胞壁	可过滤菌器
	衣原体	圆形或椭圆形	真核细胞寄生 细胞壁无肽聚糖，可过滤菌器
	立克次体		细胞内寄生
	螺旋体	有细胞壁，原始核质	细长、柔软、螺旋状、运动活泼
真核细胞型	真菌	细胞核，完整细胞器，比细菌大	细胞壁不含肽聚糖，细胞膜含固醇

【考点 14】超敏反应/变态反应分类（26 年未改动）

（24 年 A 型题，1 分）

I 型	速发型超敏反应	由抗体介导	IgE 抗体介导，肥大细胞、嗜	青霉素过敏、过敏性
-----	---------	-------	-----------------	-----------





			碱性粒细胞参与	哮喘、荨麻疹等
II 型	细胞溶解型超敏反应		IgG、IgM、补体介导，吞噬细胞、NK 细胞参与	输血反应、新生儿溶血、风湿性心肌炎等
III 型	免疫复合物型超敏反应		补体介导，中性粒细胞浸润	类风湿关节炎等
IV 型	迟发型超敏反应	由 T 细胞介导	单核细胞、淋巴细胞浸润，无个体差异	接触性皮炎等

【考点 15】脱水的分类 (26 年未改动)

分类	变化	特点	原因	防治
低渗性脱水	细胞外液减少合并低血钠	失钠多于失水，细胞内液增多，细胞肿胀，尿量无明显减少而尿比重降低	长期连续使用利尿剂，呕吐、腹泻、大量出汗后只补水或钠补充不足	适当补钠
高渗性脱水	细胞外液减少合并高血钠	失水多于失钠，细胞外液和细胞内液均减少，尿量减少而尿比重增高	水摄入减少或丢失过多	补水，适当补钠、钾
等渗性脱水	细胞外液减少而血钠正常	水、钠成比例丢失，血容量减少	单纯性的等渗性脱水临床上较少见。如不断丢失水分可转变为高渗性脱水；如补充水或给予过多低渗溶液则转变为低渗性脱水	

【考点 16】药物的跨膜转运 (26 年未改动)

(2015 年 B 型题，3 分；2016 年 B 型题，3 分；2017 年 B 型题，2 分；2018 年 B 型题，2 分；2019 年 B 型题，3 分；2021 年 A 型题，1 分；2021 年 B 型题，3 分；2022 年 B 型题，3 分；2023 年 B 型题，3 分)

1. 被动转运/非甾体转运：物质从高浓度区域向低浓度区域的转运。

(1) 滤过：细胞膜上存在膜孔，水溶性的小分子物质依靠膜两侧的流体静压或渗透压通过孔道，如药物通过肾小球膜的滤过过程。

(2) 单纯扩散：脂溶性药物溶解于细胞膜的脂质层，顺浓度差通过细胞膜，又称脂溶性扩散。扩散速度主要取决于膜两侧药物浓度梯度及药物的脂溶性。药物大多数以这种方式通过生物膜。

(3) 药物的极性和药物解离度对单纯扩散影响很大。药物解离程度取决于体液 pH 值和药物解离常数 (K_a)，弱酸性药物在 pH 值较低的胃液中解离度低，易吸收。相反，弱酸性药物在碱性尿液中不易被肾小管重吸收。

2. 载体转运：指细胞膜上的转运蛋白与药物结合，并载运药物到膜另一侧的过程。

① 主动转运 (逆水行舟)：药物逆浓度梯度或逆电化学梯度的跨细胞膜转运，即可从低浓度或低电位一侧向高浓度或高电位一侧的转运过程。其特点是：消耗能量，存在竞争性抑制和饱和现象。

② 易化扩散：与主动转运相似，亦具有饱和现象和竞争性抑制等，但易化扩散不能逆浓度梯度移动，也不耗能。易化扩散能加快药物转运速度。

在小肠上皮细胞、脂肪细胞、血-脑屏障血液侧的细胞膜中，单糖类、氨基酸、季铵盐类药物的转运属于易化扩散。





3. **膜动转运**: 是指大分子物质通过膜的运动而转运, 包括胞饮和胞吐。

①胞饮: 又称吞饮, 是指某些液态蛋白质或大分子物质通过细胞膜的内陷形成吞饮小泡而进入细胞内。如垂体后叶粉可采用鼻黏膜给药以胞饮方式吸收。

②胞吐: 又称外排或出胞, 是指胞质内的大分子物质以外泌囊泡形式排出细胞的过程。如腺体分泌及递质释放。

【考点 17】影响药物吸收的生理因素 (26 年未改动)

(2015 年 A 型题, 1 分; 2015 年 X 型题, 1 分; 2016 年 A 型题, 1 分; 2017 年 B 型题, 1 分; 2018 年 A 型题, 1 分; 2020 年 C 型题, 1 分。)

1. 胃肠液的成分和性质: pH; 胆盐; 黏膜蛋白。
2. 胃肠道运动: 胃肠道蠕动; 胃排空 (快或慢)。
3. 循环系统运动: 首过效应影响; 胃血流量; 淋巴系统转运 (油脂类、大分子药物, 无首过)。
4. P-糖蛋白作用: 通过减少药物的吸收来降低其效果。

【考点 18】食物对药物吸收的影响 (26 年未改动)

	吸收增多或有益	吸收减少或吸收延迟
高脂食物	异维 A 酸片, 泊沙康唑口服混悬液, 环孢素, 灰黄霉素等	非诺贝特
高蛋白	加巴喷丁, 阿司匹林	左旋多巴, 茶碱, 普萘洛尔
高膳食纤维	促进肠道益生菌生长	亲脂性药物吸收减少, 如依曲韦林; 洋车前子壳纤维抑制地高辛、华法林吸收
富含矿物质的食物		与四环素、喹诺酮类抗生素、利塞膦酸钠等形成不溶性络合物
高嘌呤食物	利巴韦林 (高嘌呤含量的食物包括动物内脏、扁豆、菠菜、蘑菇及海鲜等)	
高碳水化合物食物	吡喹酮; 他克莫司	
高酪胺饮食		与单胺氧化酶抑制药合用, 会发生高血压危险危及生命

【考点 19】生物药剂学分类 (26 年未改动)

(2015 年 B 型题, 2 分; 2018 年 A 型题, 1 分; 2020 年 B 型题, 2 分; 2022 年 B 型题, 3 分; 2023 年 A 型题, 1 分)

1. 第 I 类药物是**高水溶性**、**高渗透性**的两亲性药物, 药物吸收取决于溶出度, 如普萘洛尔、马来酸依那普利、盐酸地尔硫草。
2. 第 II 类药物是**低水溶性**、**高渗透性**的亲脂性药物, 药物吸收取决于溶解度, 如双氯芬酸、卡马西平、吡罗昔康。
3. 第 III 类药物是**高水溶性**、**低渗透性**的水溶性药物, 药物吸收取决于药物渗透率, 如雷尼替丁、纳多洛尔、阿替洛尔。
4. 第 IV 类药物是**低水溶性**、**低渗透性**的疏水性药物, 药物吸收困难, 如特非那定、酮洛芬、呋塞米。

【考点 20】药物的酸碱性、解离度和 pKa 对药效的影响 (26 年未改动)





(2015 年 A 型题, 1 分; 2016 年 A 型题, 1 分; 2017 年 A 型题, 1 分; 2018 年 A 型题, 1 分; 2019 年 C 型题, 1 分; 2021 年 B 型题, 2 分; 2023 年 A 型题, 1 分)

1. 药物通常以非解离的形式被吸收。在不同部位, pH 的情况不同, 影响药物的解离程度, 与药物解离常数 (pK_a) 和体液介质的 pH 有关。

酸性药物: $\lg [HA]/[A^-] = pK_a - pH$; 碱性药物: $\lg [B]/[HB^+] = pH - pK_a$

$[HA]$ 和 $[B]$: 非解离型酸/碱药物浓度; $[A^-]$ 和 $[HB^+]$: 解离型酸/碱药物浓度

酸性药物: $pK_a > pH$, 分子型比例高; $pK_a = pH$, 解离和非解离各一半。

2. 根据解离常数 (pK_a) 可以决定药物在胃肠道中的吸收情况:

(1) 弱酸性药物 (如水杨酸、巴比妥类), 胃液中 (pH 低) 呈非解离型, 易吸收。

(2) 弱碱性药物 (如奎宁、麻黄碱、氨苯矾、地西洋), 胃液中 (pH 低) 呈解离型, 难吸收; 肠液中 (pH 高) 呈非解离型, 易吸收。

(3) 碱性极弱的药物 (如咖啡因和茶碱), 在酸性介质中解离也很少, 在胃中易被吸收。

(4) 强碱性药物 (如胍乙啶), 胃肠道中多是离子化的, 吸收差。

(5) 完全离子化 (如季铵盐类、磺酸类药物), 胃肠道中多是离子化的, 消化道吸收很差。

(6) 在生理 pH 时, 苯巴比妥约有 50% 以分子形式存在。

【考点 21】影响药物分布的因素 (26 年未改动)

(2015 年 A 型题, 1 分; 2019 年 B 型题, 2 分。)

1. 器官血流量: 血流量相对较大的器官, 药物分布较快; 肌肉、皮肤等血流量相对较小的器官, 药物分布较慢。例如静脉注射脂溶性高的硫喷妥钠, 药物首先进入血流量大的脑组织而发挥麻醉作用, 而后再向血流量少的脂肪组织转移, 以致麻醉作用迅速消失。

2. 药物与血浆蛋白结合的能力: 药物疗效取决于游离型药物浓度; 药物与血浆蛋白结合可逆、有饱和、竞争和置换现象。例如磺胺嘧啶与血浆蛋白的结合率比磺胺噻唑低, 透入脑脊液相对较多, 故在防治流行性脑脊髓膜炎时宜选用磺胺嘧啶。

3. 体液 pH 值: 细胞内液 pH 值为 7.0, 细胞外液及血浆 pH 值为 7.4。弱酸性药物在细胞外液中解离型药物多, 不易进入细胞内, 其在细胞外液的浓度高于细胞内液。例如碳酸氢钠使血液碱化, 促进弱酸性药物巴比妥类由脑细胞向血浆转运, 且可碱化尿液, 减少巴比妥类在肾小管的重吸收, 促进药物随尿排出。因此, 碳酸氢钠可解救巴比妥类药物中毒。

4. 组织细胞结合: 药物与某些组织亲和力强是药物作用具有选择性的重要原因。例如氯喹在肝内浓度比血浆浓度高 700 倍, 适用于治疗阿米巴性肝脓肿。

【考点 22】影响药物代谢的因素 (26 年未改动)

(2015 年 C 型题, 1 分; 2016 年 B 型题, 1 分; 2017 年 C 型题, 1 分; 2018 年 A 型题, 2 分; 2019 年 A 型题, 3 分; 2020 年 A 型题, 2 分; 2020 年 B 型题, 1 分; 2023 年 B 型题, 1 分; 2024 年 A 型题, 1 分)

1. 遗传因素

2. 药物代谢酶的诱导与抑制

①酶诱导: 提高肝药酶活性, 增加自身或其他药物的代谢速率。②酶抑制: 抑制肝药酶活性, 减慢其他药物的代谢速率。

CYP	诱导剂	抑制剂
3A4	苯巴比妥	酮康唑
	苯妥英钠	孕二烯酮





	地塞米松	西咪替丁
	卡马西平	伊曲康唑
	醋竹桃霉素	红霉素
	利福平	
	克霉唑	
	磺胺二嘧啶	
2C9	苯巴比妥	磺胺苯吡唑
	利福平	
1A2	奥美拉唑	呋拉茶碱
	咖啡因	氟伏沙明
		环丙沙星
2C19	苯巴比妥	氟康唑
	利福平	氟伏沙明
2E1	乙醇	双硫仑
	异烟肼	
2A6	苯巴比妥	奎尼丁
	利福平	丁呋洛尔
		氟西汀
1A1	3-甲基胆蒽	7,8-苯并黄酮
		美替拉酮

3. 肝血流量的改变: 是决定肝脏药物清除率的重要因素。苯巴比妥增加肝血流量, 而普萘洛尔和吲哚美辛能降低肝血流量

4. 其他生理病理因素: 年龄、营养、重要脏器的功能状态、疾病等。

【考点 23】药物结构与第 I 相生物转化的规律 (26 年未改动)

(2015 年 A 型题, 1 分; 2017 年 B 型题, 3 分; 2018 年 A 型题, 1 分; 2020 年 B 型题, 4 分; 2023 年 X 型题, 1 分; 2024 年 B 型题, 3 分; 2025 年 B 型题, 1 分)

1. 氧化代谢

(1) 含芳环: 氧化生成酚的代谢产物为主, 如普萘洛尔、苯妥英钠、保泰松、华法林。

(2) 烯烃: 代谢生成环氧化物, 如抗惊厥药卡马西平、己烯雌酚。

(3) 炔烃: 最终成酮或羧基。

(4) 含饱和碳原子: 如抗癫痫药丙戊酸钠、降糖药甲苯磺丁脲。

(5) 脂环: 如四氢苯、降糖药醋磺己脲。

(6) 含卤素: 氧化脱卤素反应和还原脱卤素反应, 如氯霉素代谢生成酰氯, 能与 CYP450 酶中的脱辅基蛋白发生酰化, 产生毒性的主要根源。

(7) 胺类: N-脱烷基化和氧化脱氨反应, 如普萘洛尔、氯胺酮、丙咪嗪、利多卡因; N-氧化反应, 如吗啡、胍乙啶、氨苯砜。

(8) 醚类药物: O-脱烷基化反应, 生成醇或酚及羰基化合物, 如可待因、吲哚美辛、维拉帕米、多巴胺、非那西汀。





(9) 醇和醛: 脱氢氧化得到相应的羰基化合物。①伯醇→醛(不稳定)→羧酸; ②仲醇→酮。

(10) 酮类药物: 酶催化下生成仲醇, 易引入手性碳, 产生光学异构体。如镇痛药美沙酮。

(11) 硫醚: ①S-脱烷基, 氧化→硫醚和羰基化合物, 如 6-甲基硫嘌呤; ②S-氧化反应: 氧化生成亚砷→砷, 如阿苯达唑。

(12) 硫羰基药物: 碳-硫双键(C=S)和磷-硫双键(P=S)的化合物经氧化代谢后生成碳-氧双键(C=O)和磷-氧双键(P=O), 如硫喷妥经氧化脱硫生成戊巴比妥。

2. 还原代谢

(1) 硝基: 芳香族硝基可被还原生成芳香胺基, 如氯霉素还原生成对氨基苯化合物。

(2) 亚砷类: 氧化成砷或还原成硫醚。如前药舒林酸的代谢。

(3) 醛→醇; 酮→仲醇。

3. 水解代谢: 酯和酰胺类, 如羧酸酯、硝酸酯、磺酸酯、酰胺。如普鲁卡因、丙胺卡因。

【考点 24】药物结构与第 II 相生物转化的规律 (26 年未改动)

(2015 年 A 型题, 1 分, 2015 年 X 型题, 1 分; 2016 年 A 型题, 1 分, 2016 年 B 型题, 2 分; 2017 年 A 型题, 1 分; 2019 年 A 型题, 1 分; 2020 年 B 型题, 1 分; 2021 年 A 型题, 1 分; 2021 年 X 型题, 1 分; 2022 年 A 型题, 2 分; 2025 年 A 型题, 1 分)

1. 与葡萄糖醛酸的结合: 分为四种类型: O-, N-, S-和 C-的葡萄糖醛酸苷化。如氯霉素-灰婴综合征(婴儿体内缺乏这种酶, 无法代谢)。

2. 与硫酸的结合: 含(羟基、氨基和羟氨基)药物与硫酸基成酯; 形成硫酸酯的结合产物后水溶性增加, 毒性降低, 易排出体外。如支气管扩张药沙丁胺醇。

3. 与氨基酸的结合: 含羧基(芳香羧酸、芳乙酸、杂环羧酸)药物+氨基(来自氨基酸)→酰胺; 甘氨酸最常见; 如苯甲酸和水杨酸代谢。

4. 与谷胱甘肽的结合: 谷氨酸-半胱氨酸-甘氨酸组成的含硫醇基(巯基-SH)的三肽化合物。如抗肿瘤药白消安。谷胱甘肽与酰卤结合反应是解毒的。

5. 乙酰化结合: 结合对象——伯氨基(脂肪胺和芳香胺)、氨基酸、磺酰胺、肼、酰肼; 结合后极性减小, 去活化; 亲水性降低。如对氨基水杨酸乙酰化代谢。

6. 甲基化结合: 较少见; 结合对象——酚羟基、胺基、巯基; 结合后极性减小, 去活化; 亲水性降低。如酚羟基的甲基化反应主要对象是具儿茶酚胺结构的药物: 如肾上腺素去甲肾上腺素、多巴胺)。甲基化反应有区域选择性, 仅发生在 3 位酚羟基上。

【考点 25】药物排泄 (26 年未改动)

(2016 年 A 型题, 1 分, 2016 年 B 型题, 1 分; 2017 年 B 型题, 1 分; 2018 年 A 型题, 1 分, 2018 年 B 型题, 2 分; 2019 年 B 型题, 2 分; 2021 年 B 型题, 1 分; 2022 年 B 型题, 2 分)

1. 肾是药物排泄的主要器官, 其次是胆汁排泄。某些药物也可从肺、乳腺、唾液腺或汗腺排出。

2. 肾脏排泄: ①肾小球滤过(血浆蛋白结合型不滤过, 被动转运); ②肾小管分泌(主动转运, 血浆蛋白结合不影响); ③肾小管重吸收(被动为主); ④影响肾排泄的因素: 药物的脂溶性、尿液 pH、血浆蛋白结合率(影响肾小球滤过)、尿量、合并用药及疾病等影响肾排泄; ⑤肾清除率。

3. 胆汁排泄: 药物从血液向胆汁排泄时, 首先由血液进入肝细胞并继续向毛细胆管转运。胆汁排泄转运机制为被动扩散和主动转运。通常相对分子质量大于 0.5 kDa 的化合物可随胆汁排出, 但超过 5 kDa 的大分子化合物难从胆汁排出。

4. 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。洋地黄毒苷中毒时, 服用消胆胺可在肠道中与其结合, 阻断肠肝循环。





而加速其排泄。

5. 其他途径：唾液排泄、乳汁排泄、汗液排泄、肺排泄（吸入麻醉剂）等。

【考点 26】药动学参数（26 年微调）

（2015 年 A 型题，2 分；2016 年 B 型题，4 分；2017 年 A 型题，1 分，2017 年 C 型题，1 分；2019 年 A 型题，2 分；2020 年 A 型题，1 分；2020 年 C 型题，1 分；2021 年 A 型题，1 分；2021 年 C 型题，1 分；2022 年 B 型题，2 分；2023 年 A 型题，1 分；2024 年 X 型题，1 分；2025 年 A 型题，2 分）

1. 速率常数（ k ，单位： min^{-1} 或 h^{-1} ）：药物在体内的吸收、分布、代谢和排泄过程大多属于一级速率过程，即过程的速度与浓度成正比。速率常数用来描述这些过程速度与浓度的关系，是药动学的特征参数。 k 具有加和性。

2. 生物半衰期（ $t_{1/2}=0.693/k$ ）：生物半衰期指药物在体内的量或血药浓度降低一半所需要的时间。 $t_{1/2}$ 是药物的特征参数，不因药物剂型、给药途径或剂量而改变。除药物本身的特性外，生理及病理状况能够影响药物的半衰期，肾功能不全或肝功能受损者，均使半衰期延长。

3. 表观分布容积（ $V=X/C$ ，单位：“L”、“ml”或“L/kg”、“ml/kg”）：对于具体药物来说， V 是个确定的值。血液中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，表观分布容积较小；亲脂性药物在血液中浓度较低，表观分布容积通常较大，往往超过体液总体积。在多数情况下表观分布容积不涉及真正的容积。

4. 清除率（ $Cl=kV$ ，单位：“体积/时间”“L/min、ml/min、L/h”）：清除率是单位时间从体内消除的含药血浆体积，又称为体内总清除率（TBCL）。在临床上主要体现药物消除的快慢。 Cl 具有加和性。

5. 药-时间曲线下面积（AUC）：反映药物体内暴露的主要药动学参数。

【考点 27】单室模型给药（26 年未改动）

（2015 年 B 型题，2 分，2015 年 C 型题，1 分；2016 年 A 型题，1 分，2016 年 B 型题，1 分；2018 年 A 型题，1 分，2018 年 B 型题，3 分，2018 年 C 型题，2 分，2018 年 X 型题，1 分；2019 年 A 型题，2 分；2020 年 B 型题，1 分；2024 年 A 型题，2 分；2024 年 B 型题，2 分；2025 年 B 型题 2 分）

1. 单室模型静脉注射给药

（1）血药浓度与时间的关系： $X=X_0e^{-kt}$ ； $C=C_0e^{-kt}$ ； $\lg C=(-kt/2.303)+\lg C_0$

C_0 、 C ：分别表示药物初浓度与 t 时刻药物浓度。

（2）其他药动学参数求算

①半衰期： $t_{1/2}=0.693/k$

②表观分布容积： $V=X_0/C_0$ ， X_0 为静注剂量， C_0 为初始浓度。

③血药浓度-时间曲线下面积： $AUC=C_0/V=X_0/kV$

④清除率： $Cl=kV$

2. 单室模型静脉滴注给药

（1）血药浓度与时间的关系： $C=k_0(1-e^{-kt})/kV$

（2）稳态血药浓度与达稳分数： $f_{ss}=1-e^{-kt}$ ； $n=-3.32\lg(1-f_{ss})$

$n=1, C_{ss}\%=50$ ； $n=2, C_{ss}\%=75$ ； $n=3, C_{ss}\%=87.5$ ； $n=3.32, C_{ss}\%=90$ ； $n=4, C_{ss}\%=93.75$ ；

$n=5, C_{ss}\%=96.88$ ； $n=6, C_{ss}\%=98.44$ ； $n=6.64, C_{ss}\%=99$ ； $n=7, C_{ss}\%=99.22$ ； $n=8, C_{ss}\%=99.61$

（3）负荷剂量： $X_0^*=C_{ss}V$

3. 单室模型血管外给药

（1）血药浓度与时间的关系： $A=k_aFX_0/(k_a-k)V$ ； $C=[k_aFX_0(e^{-kt}-e^{-k_at})]/V(k_a-k)$





(2) 药动学参数计算:

①峰浓度: $T_{max} = (2.3031gk_a/k) / (k_a - k)$

②达峰时间: $C_{max} = FX_0 e^{-kT_{max}} / V$

(3) 血管外给药的药-时曲线下面积: $AUC = FX_0 / kV$

【考点 28】双室模型给药 (26 年未改动)

(2018 年 B 型题, 1 分; 2020 年 B 型题, 1 分。)

1. 静脉注射血药浓度与时间的关系: $C = Ae^{-\alpha t} + Be^{-\beta t}$

α : 分布速度常数

β : 消除速度常数

2. 血管外给药血药浓度与时间的关系: $C = Ne^{-\alpha t} + Le^{-\beta t} + Me^{-\gamma t}$

【考点 29】多剂量给药 (26 年未改动)

(2016 年 A 型题, 1 分; 2017 年 B 型题, 1 分; 2018 年 A 型题, 1 分, 2018 年 B 型题, 1 分; 2019 年 C 型题, 1 分; 2021 年 B 型题, 1 分; 2021 年 C 型题, 1 分; 2025 年 B 型题, 1 分)

$$C_n = \frac{X_0}{V} \left(\frac{1 - e^{-n\tau}}{1 - e^{-k\tau}} \right) e^{-kt}$$

1. 单室模型静脉注射多剂量给药血药浓度:

X_0 : 每次给药剂量

n : 给药次数

τ : 给药间隔

k : 消除速率常数

$$C_{ss} = \frac{X_0}{V} \left(\frac{1}{1 - e^{-k\tau}} \right) e^{-kt}$$

2. 多剂量给药稳态血药浓度:

3. 平均稳态血药浓度

单室静脉注射多次给药: $C_{av} = X_0 / kV \tau = X_0 / Cl \tau$

血管外: $C_{av} = FX_0 / kV \tau = FX_0 / Cl \tau$

4. 多剂量给药的波动度: $DF = [(C_{max}^{ss} - C_{min}^{ss}) / C_{av}] \times 100\% = k \tau \times 100\%$

5. 多剂量给药体内药量的蓄积: $R = C_{min}^{ss} / (C_1)_{min} = 1 / (1 - e^{-k\tau})$

【考点 30】药物生物利用度 (26 年微调)

(2015 年 A 型题, 1 分, 2015 年 C 型题, 1 分, 2015 年 X 型题, 1 分; 2016 年 B 型题, 1 分; 2017 年 A 型题, 2 分, 2017 年 C 型题, 1 分; 2018 年 B 型题, 1 分; 2019 年 B 型题, 2 分; 2019 年 C 型题, 1 分; 2022 年 B 型题, 2 分; 2022 年 C 型题, 1 分; 2024 年 A 型题, 1 分)

1. 生物利用度定义

生物利用度 (BA) 是指药物被吸收进入血液循环的速度与程度。

生物利用度包括药物吸收速度与药物吸收程度两个方面。吸收速度, 即药物进入血液循环的快慢, 常用血药浓度-时间曲线的达峰时间 (T_{max}) 比较制剂间的吸收快慢, 达峰时间短, 药物吸收快。吸收程度, 即药物进入血液循环的多少, 用血药浓度-时间曲线下的面积表示, 它与药物吸收总量成正比。

药物的疗效不但与吸收量有关, 而且也与吸收速度有关。制剂生物等效性评价的三个主要参数是峰浓度 C_{max} 、达峰时间 T_{max} 和血药浓度-时间曲线下面积 AUC。

2. 生物利用度的研究方法有血药浓度法 (最常用)、尿药数据法和药理效应法等。





3. 生物利用度的影响因素有：药物的理化性质、药物制剂因素、生理因素、药物在胃肠道内的代谢分解、肝脏的首关效应。

4. 生物利用度分为相对生物利用度 (F_r) 和绝对生物利用度 (F)。是以静脉制剂为参比制剂获得的药物活性成分吸收进入血液循环的相对量，通常用于原料药和新制剂的研究；**相对生物利用度是以其他非静脉途径给药的制剂为参比制剂获得的药物活性成分吸收进入血液循环的相对量，用于剂型之间或同种剂型不同制剂之间的比较。**

绝对生物利用度： $F = [AUC_{(po)} / Dose_{(po)}] / [AUC_{(iv)} / Dose_{(iv)}] \times 100\%$ ；以口服制剂为例， $AUC_{(po)}$ 为口服血药浓度-时间曲线下面积， $AUC_{(iv)}$ 为静脉注射血药浓度-时间曲线下的面积， $Dose_{(po)}$ 为口服剂量， $Dose_{(iv)}$ 为静脉注射剂量。

相对生物利用度： $F_r = [AUC_{(T)} / Dose_{(T)}] / [AUC_{(R)} / Dose_{(R)}] \times 100\%$ ； $AUC_{(T)}$ 为试验制剂药-时曲线下面积， $Dose_{(T)}$ 为试验制剂剂量， $AUC_{(R)}$ 为参比制剂的药-时曲线下面积， $Dose_{(R)}$ 为参比制剂的剂量。

【考点 31】非线性药动学 (26 年未改动)

(2016 年 A 型题，1 分；2018 年 C 型题，1 分；2020 年 A 型题，1 分；2020 年 B 型题，1 分；2022 年 A 型题，1 分；2023 年 A 型题，1 分；2024 年 B 型题，1 分)

1. 米氏方程：非线性药动学过程常用米氏方程来表征。

米氏方程： $-dC/dt = V_m C / (K_m + C)$

$-dC/dt$ ：药物浓度在 t 时间的下降速度；

V_m ：药物消除过程的理论最大速度；

K_m ：米氏常数，指药物消除速度为 V_m 一半时的血药浓度。

2. 非线性药动学的特点

- (1) 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；
- (2) 剂量增加，消除半衰期延长；
- (3) AUC 和平均稳态血药浓度与剂量不成正比；
- (4) 原药与代谢产物的组成比例随剂量改变而变化；
- (5) 其他可能竞争酶或载体系统的药物，影响其动力学过程。

【考点 32】生物等效性 (26 年未变动)

(2018 年 X 型题，1 分；2020 年 X 型题，1 分；2021 年 B 型题，2 分；2025 年 X 型题，1 分)

1. 生物等效性 (BE) 是指在相似的试验条件下单次或多次给予相同剂量的试验药物后，受试制剂中药物的吸收速度和吸收程度与参比制剂的差异在可接受范围内，反映其吸收程度和速度的主要药动学参数无统计学差异。

2. ①年龄在 18 周岁以上 (含 18 周岁)；②应涵盖一般人群的特征，包括年龄、性别等；③如果研究药物拟用于两种性别的人群，研究入选的受试者应有适当的性别比例；④如果研究药物主要拟用于老年人群，应尽可能多地入选 60 岁以上的受试者；⑤入选受试者的例数应使生物等效性评价具有足够的统计学效力。

3. 血药浓度法的评价参数是 AUC、 C_{max} 、 T_{max} 。

4. 生物等效性研究方法按照研究方法评价效力，其优先顺序为药物动力学研究、药效动力学研究、临床研究和体外研究。这里主要说明药动学研究，它是最常用的生物等效性研究方法。

5. 仿制药生物等效性试验应尽可能选择原研产品作为参比制剂

6. 生物等效的接受标准为：受试制剂和参比制剂的 PK 参数 (AUC 和 C_{max}) 的几何均值比值 (GMR) 的 90% 置信区间数值均应不低于 80.00%，且不超过 125.00%，即均在 80%~125% 范围内。对于窄治疗窗





药物,应根据药物的特性适当缩小 90%置信区间范围。对于高变异药物,可根据参比制剂的个体内变异,将等效性评价标准作适当比例的调整,但调整应有充分的依据。

【考点 33】统计矩模型 (26 年未改动)

(2015 年 B 型题, 1 分; 2016 年 B 型题, 1 分; 2017 年 A 型题, 1 分, 2017 年 B 型题, 1 分; 2018 年 B 型题, 1 分; 2020 年 B 型题, 2 分; 2021 年 B 型题, 2 分; 2024 年 A 型题, 1 分)

1. 零阶矩 (AUC): 血药浓度-时间曲线下面积定义为药时曲线的零阶矩。代表药物的血药浓度随时间的变化过程。

2. 一阶矩 (AUMC): 药-时曲线的一阶矩定义为时间与血药浓度的乘积-时间曲线下的面积 (AUMC), 即以 $t \cdot C$ 对 t 作图, 所得的曲线下面积。一阶矩 (MRT) 是在药物临床应用中非常重要的一个参数, 代表了药物在体内的滞留情况, 与其作用时间等许多性质有关。

3. 平均滞留时间: 平均滞留时间是指所有药物分子在体内滞留的平均时间, 即单次给药后所有药物分子在体内滞留时间的平均值, 经过数学推导, 药物在体内的 MRT 等于其一阶矩和零阶矩的比值, 即: $MRT = AUMC / AUC$ 。

【考点 34】需进行治疗药物监测的情况 (26 年未改动)

(2017 年 X 型题, 1 分; 2018 年 C 型题, 1 分; 2021 年 X 型题, 1 分; 2022 年 X 型题, 1 分; 2023 年 A 型题, 1 分)

1. 个体差异很大的药物, 即患者间有较大的药动学差异——三环类抗抑郁药。
2. 具非线性动力学特征的药物——苯妥英钠。
3. 治疗指数小、毒性反应强的药物——强心苷类药、茶碱、锂盐、普鲁卡因胺等。
4. 毒性反应不易识别, 用量不当或不足的临床反应难以识别的药物——地高辛。
5. 特殊人群用药, 患心、肝、肾、胃肠道疾病者、婴幼儿、老年人——肾功能不全的患者禁用氨基糖苷类抗生素。
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。

【考点 35】药物的治疗作用 (26 年未改动)

(2015 年 A 型题, 1 分; 2016 年 A 型题, 1 分; 2017 年 A 型题, 1 分; 2022 年 A 型题, 1 分)

1. 对因治疗: 用药后能消除原发致病因子, 治愈疾病的药物治疗。

如使用抗生素杀灭病原微生物, 达到控制感染性疾病。

2. 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体温并缓解疼痛; 硝酸甘油缓解心绞痛; 抗高血压药降低患者过高的血压等。

3. 补充/替代疗法: 指补充体内营养或代谢物质不足, 又称替代疗法。

如, 补充铁制剂治疗缺铁性贫血; 补充胰岛素治疗糖尿病。补充疗法也可以纠正发病原因, 但引起缺乏症的原发病因并未去除, 因此严格讲与对因治疗并不相同。

临床实践应遵循“急则治其标, 缓则治其本”的原则, 有时应“标本兼治”。

对因治疗比对症治疗重要, 但对症治疗虽然不能根除病因, 但对疾病的治疗不可缺少。

【考点 36】药物的不良反应 (26 年未改动)

(2015 年 B 型题, 3 分; 2016 年 A 型题, 1 分; 2017 年 X 型题, 1 分; 2018 年 A 型题, 1 分; 2019





年 A 型题, 2 分; 2019 年 B 型题, 3 分; 2020 年 A 型题, 1 分; 2020 年 B 型题, 3 分; 2021 年 B 型题, 3 分; 2023 年 A 型题, 2 分; 2024 年 A 型题, 1 分; 2024 年 C 型题, 1 分; 2025 年 A 型题, 2 分; 2025 年 B 型题, 1 分)

1. 副作用(副反应): 在药物按正常用法用量使用时, 出现的与治疗目的无关的不适反应。难以避免。举例: 阿托品: 解痉一口干、心悸、便秘; 抑制腺体分泌-口干。

2. 毒性作用: 在药物剂量过大或体内蓄积过多时发生的危害机体的反应, 较为严重。可预期。药理学毒性, 如巴比妥类药物过量; 病理学毒性, 如对乙酰氨基酚引起的肝脏损害; 基因毒性, 如氮芥细胞毒性作用引起的机体损伤。致癌、致畸、致突变也属于慢性毒性范畴。

3. 后遗效应: 在停药后血药浓度已降低至最低有效浓度以下时仍残存的药理效应。举例: 短暂, 苯二氮草类→宿醉; 持久, 长期用肾上腺皮质激素, 可引起肾上腺皮质萎缩。

4. 继发性反应(治疗矛盾): 由药物的治疗作用所引起的不良后果。举例: 长期应用广谱抗生素→继发性感染, 此称二重感染。

5. 变态反应(过敏反应): 机体受药物刺激所发生异常的免疫反应, 引起机体生理功能障碍或组织损伤。变态反应的发生与药物的剂量无关或关系甚少; 常仅见于过敏体质的患者, 且不易预知。

6. 特异质反应(特异性反应): 因先天性遗传异常, 少数病人用药后发生与药物本身药理作用无关的有害反应。该反应和遗传有关, 与药理作用无关。

举例: 假性胆碱酯酶缺乏者用琥珀胆碱后, 常出现呼吸暂停反应。

7. 依赖性: 反复用药所引起的人体心理上或生理上或两者兼有的对药物的依赖状态, 表现出强迫性的要连续或定期用药的行为和其他反应。

(1) 精神依赖性: 为得到欣快感而不得不定期或连续使用某种药物。

(2) 身体依赖性: 停药后产生戒断症状, 使人非常痛苦, 甚至危及生命。

例如: 阿片类和催眠镇静药在反复用药过程中, 先产生精神依赖性, 后产生身体依赖性。

8. 停药反应(反跳反应): 长期服用某药, 突然停药, 使疾病原有症状重现以及加剧的现象。这类药物如需停药, 应逐步减量。举例: 普萘洛尔、可乐定(突然停药, 血压升高)。

【考点 37】药物的靶标作用机制(26 年未变动)

(2015 年 A 型题, 1 分; 2016 年 A 型题, 1 分, 2016 年 B 型题, 2 分; 2017 年 B 型题, 3 分; 2018 年 A 型题, 1 分; 2020 年 B 型题, 2 分; 2022 年 A 型题, 1 分; 2024 年 B 型题, 1 分)

1. 受体: 胰岛素(激活胰岛素受体)、阿托品(阻断 M)、肾上腺素(激动 α 、 β)。

2. 酶: ①抑制酶活性: 依那普利(抑制 ACE)、地高辛(抑制 Na^+ 、 K^+ -ATP 酶)、阿司匹林(抑制 COX)。②激活酶活性: 尿激酶(激活血浆纤溶酶原)、碘解磷定(激活胆碱酯酶)。③影响代谢酶: 肝药酶诱导剂、肝药酶抑制剂。④我就是酶: 胃蛋白酶、胰蛋白酶。

3. 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)。

4. 核酸作为药物靶标: 抗肿瘤药(氟尿嘧啶)、抗病毒药(齐多夫定)、抗菌药(磺胺药、喹诺酮类)。

【考点 38】药物的非靶标作用机制(26 年未改动)

1. 补充体内物质: 铁剂治疗缺铁性贫血、胰岛素治疗糖尿病。

2. 改变细胞周围环境的理化性质: 氢氧化铝(抗酸)、甘露醇(脱水)、二巯基丁二酸钠(重金属解毒)、硫酸镁(泻药)、右旋糖酐(血容量扩张剂)。

3. 影响生理活性物质及其转运体: 解热镇痛药(影响前列腺素)、噻嗪类利尿药(抑制 Na^+ - Cl^- 转





运体)、丙磺舒(竞争肾小管分泌转运体)。

4. 影响免疫功能: 免疫抑制药(环孢素)、免疫调节药(左旋咪唑)、本身就是抗体/抗原(丙种球蛋白/疫苗)。

5. 非特异性作用: 消毒防腐药、蛋白沉淀剂、调节酸碱药、维生素等。

【考点 39】受体的特性 (26 年未改动)

(2015 年 B 型题, 2 分; 2017 年 A 型题, 1 分; 2019 年 A 型题, 1 分; 2024 年 X 型题, 1 分)

1. 饱和性: 受体数量有限, 能结合的配体量也有限, 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。

2. 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。

3. 可逆性: 配体与受体的结合是化学性的, 既要求两者的构象互补, 还需要两者间有相互吸引力。绝大多数是可逆的, 少数是通过共价键结合难以逆转。配体与受体复合物解离后可得到原来的配体, 而非代谢物。

4. 灵敏性: 受体能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, 例如 $5 \times 10^{-19} \text{mol/L}$ 的乙酰胆碱溶液就能对蛙心产生明显的抑制作用。

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, 受体密度不同。受体多样性是受体亚型分类的基础, 受体受生理、病理和药理因素调节, 处于动态变化之中。

【考点 40】受体的类型 (26 年未改动)

(2015 年 X 型题, 1 分; 2016 年 C 型题, 1 分; 2020 年 A 型题, 1 分; 2021 年 A 型题, 1 分; 2022 年 B 型题, 3 分; 2023 年 B 型题, 3 分; 2024 年 A 型题, 1 分)

1. G-蛋白偶联受体: M 胆碱受体、**肾上腺素受体**、多巴胺受体、5-HT 受体、前列腺素受体。

2. 配体门控离子通道受体: 配体门控及电压门控型, 包括 **N 型乙酰胆碱受体**、 γ -氨基丁酸 (GABA) 受体。

3. 酶联膜受体: ①酪氨酸蛋白激酶受体: 胰岛素、生长因子。②丝氨酸-苏氨酸蛋白激酶受体。③自身无酶结构但可招募细胞内酶发挥作用的膜受体: 包括细胞因子受体 JAK-STAT 信号通路、Toll 样受体 (TLR) IRAK/NF- κ B 信号通路、肿瘤坏死因子- α (TNF- α) 受体 NF- κ B 信号通路等。

4. 细胞内受体: 甾体激素受体、**甲状腺激素受体**、细胞核激素受体、维生素 A、维生素 D。

5. 鸟苷酸环化酶受体: 鸟苷酸环化酶 (GC)。

【考点 41】受体作用的信号转导 (26 年未改动)

(2015 年 A 型题, 1 分; 2016 年 X 型题, 1 分; 2017 年 A 型题, 1 分; 2020 年 B 型题, 2 分; 2022 年 A 型题, 1 分)

1. 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。

2. 第二信使: 第一信使作用于靶细胞后在胞浆内产生的信息分子。

包括环磷酸腺苷 (cAMP, 最早发现); 环磷酸鸟苷 (cGMP); 二酰基甘油 (DAG) 和三磷酸肌醇 (IP_3); 钙离子; 廿碳烯酸类 (花生四烯酸); 一氧化氮 (NO , 既有第一信使特征, 又有第二信使特征)。

3. 第三信使: 负责细胞核内外信息传递的物质, 包括生长因子、转化因子等。

【考点 42】作用于受体的药物分类: 激动药 (26 年未改动)

(2015 年 B 型题, 2 分; 2016 年 B 型题, 2 分; 2018 年 B 型题, 3 分; 2019 年 A 型题, 1 分;)

激动药: 与受体既有亲和力又有内在活性的药物, 能与受体结合并激活受体而产生效应。

1. 完全激动药: 对受体有很高的亲和力和内在活性 ($\alpha=1$), 如吗啡。





2. 部分激动药: 对受体有很高的亲和力, 但内在活性不强 ($\alpha < 1$), 如喷他佐辛。

3. 反向激动药: 有些药物 (如苯二氮䓬类) 对失活态的受体亲和力大于活化态, 药物与受体结合后引起与激动药相反的效应。

如完全激动药吗啡 ($\alpha = 1$) 和部分激动药喷他佐辛 ($\alpha = 0.25$) 合用时, 当喷他佐辛和吗啡都在低浓度时, 产生两药作用相加效果; 当喷他佐辛和吗啡的用量达到一个临界点时, 吗啡产生的效应相当于喷他佐辛的最大效应, 此时随着喷他佐辛浓度增加发生对吗啡的竞争性拮抗。喷他佐辛小剂量产生激动作用, 大剂量产生拮抗作用。

【考点 43】作用于受体的药物分类: 拮抗药 (26 年未改动)

(2015 年 B 型题, 1 分; 2016 年 B 型题, 1 分; 2017 年 X 型题, 1 分; 2020 年 X 型题, 1 分; 2021 年 A 型题, 1 分; 2023 年 A 型题, 1 分; 2025 年 A 型题, 1 分)

拮抗药: 具有较强的亲和力, 但缺乏内在活性 ($\alpha = 0$), 故不能产生效应; 但由于占据一定数量受体, 反而可拮抗激动药的作用。如纳洛酮为阿片受体拮抗药, 普萘洛尔是 β 肾上腺素受体拮抗药。

1. 部分拮抗药: 有些药物以拮抗作用为主, 但还有一定的激动受体的效应。如氨烯洛尔是 β 肾上腺素受体部分拮抗药。

2. 拮抗药分竞争性拮抗药和非竞争性拮抗药。

激动药与受体的结合可逆, 竞争性拮抗药可与激动药互相竞争与相同受体结合, 产生竞争性抑制作用; 增加激动药的浓度使其效应恢复到原先单用激动药时的水平, 使激动药的量效曲线平行右移, 但其最大效应不变, 这是竞争性抑制的重要特征。如阿托品是乙酰胆碱的竞争性拮抗药, 可使乙酰胆碱的量效曲线平行右移, 但不影响乙酰胆碱的效能。

【考点 44】药物与靶标相互作用对药理活性的影响 (26 年未改动)

(2015 年 B 型题, 3 分; 2016 年 A 型题, 1 分; 2018 年 A 型题, 2 分; 2020 年 A 型题, 1 分; 2020 年 B 型题, 2 分; 2021 年 A 型题, 1 分; 2022 年 A 型题, 1 分; 2023 年 B 型题, 3 分; 2024 年 A 型题, 1 分)

1. 共价键 (不可逆), 多见于化学治疗药, 如烷化剂类抗肿瘤药 (环磷酰胺、美法仑), 与 DNA 中鸟嘌呤碱基形成共价结合键, 产生细胞毒活性。

2. 非共价键键合: 可逆。

(1) 离子键: 又称盐键, 键能最强。如去甲肾上腺素与 β_2 肾上腺素受体; 拟胆碱药氯贝胆碱与 M 胆碱受体相结合。

(2) 氢键: 最常见、最基本的化学键合形式。如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。

(3) 离子-偶极/偶极-偶极相互作用: 比静电作用弱很多; 常见于羰基类化合物 ($C=O$), 如乙酰胆碱与受体。

(4) 电荷转移复合物: 实质是分子间偶极-偶极作用。如抗疟药氯喹插入疟原虫。

(5) 疏水性相互作用: 多数药物分子中的烷基、苯基等非极性基团均易与作用靶点形成疏水键。

(6) 范德瓦耳斯力相互作用: 非共价键中键能最弱, 但非常普遍。

(7) 金属离子螯合物: 如抗肿瘤药物中, 常见的有铂金属络合物。金属络合物还可用作金属中毒时的解毒剂, 如二巯基丙醇可作为锑、砷、汞的螯合解毒剂。

【考点 45】药物的量-效关系 (26 年未改动)

(2015 年 A 型题, 2 分; 2016 年 A 型题, 2 分; 2017 年 A 型题, 3 分; 2017 年 X 型题, 1 分; 2018 年 A 型题, 1 分; 2019 年 A 型题, 1 分; 2019 年 B 型题, 4 分; 2020 年 A 型题, 1 分; 2021 年 A 型题,





1 分; 2025 年 A 型题, 2 分)

1. 斜率: 斜率在一定程度上反映用药的剂量安全范围。

2. 最小有效量 (阈剂量): 引起药理效应的最小药量。

最小有效浓度 (阈浓度): 引起药理效应的最低药物浓度。

3. 最大效应 (E_{max}) 或效能: 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, 此效应为极限, 即最大效应, 也称效能。效能反映药物的内在活性; 质反应阳性率达 100%。

4. 效价强度: 用于作用性质相同的药物之间的等效剂量或浓度的比较, 指能引起等效反应 (一般采用 50% 效应量) 的相对剂量或浓度, 值越小则强度越大。

5. 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, 分别用半数有效量 (ED_{50}) 及半数有效浓度 (EC_{50}) 表示。如效应指标为惊厥或死亡, 则分别称为半数惊厥量或半数致死量 (LD_{50})。

6. 治疗指数 (TI): 药物的安全性一般与其 LD_{50} 的大小成正比, 与 ED_{50} 成反比。故常以药物 LD_{50} 与 ED_{50} 的比值表示药物的安全性, 此数值越大越安全。 $TI = LD_{50} / ED_{50}$ 。

注: 治疗指数大的药物不一定安全, 因为量效曲线与毒效曲线的首尾仍可能出现重叠, 即 ED_{95} 可能大于 5% 的中毒死亡量 (LD_5)。

7. 药物安全范围: 药物安全指标, 是 ED_{95} 和 LD_5 之间的距离, 其值越大越安全。

安全指数: LD_5 / ED_{95} ; 安全界限: LD_1 / ED_{99} 。

【考点 46】药效动力学方面的相互作用 (26 年未改动)

(2015 年 B 型题, 1 分; 2016 年 X 型题, 1 分; 2017 年 B 型题, 1 分; 2018 年 B 型题, 2 分; 2019 年 A 型题, 1 分; 2021 年 A 型题, 1 分; 2022 年 B 型题, 2 分; 2023 年 X 型题, 1 分; 2024 年 B 型题, 2 分)

1. 作用于同一部位或受体的协同作用和拮抗作用

α 受体拮抗药酚妥拉明与去甲肾上腺素合用, 目的是对抗去甲肾上腺素的 α 型作用, 保留其 β 型作用, 使血管收缩作用不致过分剧烈, 而又保持其加强心肌收缩力和增大脉压的作用, 从而改善休克时微循环血液灌注不足和有效血容量下降的症状。

氯丙嗪可增强麻醉药、镇静催眠药、镇痛药及乙醇的作用; 氨基糖苷类抗生素的耳毒性, 应避免与高效利尿药或其他耳毒性药物合用。磺胺 (二氢蝶酸合酶) + 甲氧苄啶 (二氢叶酸还原酶) 可使细菌的叶酸代谢遭到双重阻断, 增强抑菌作用, 甚至出现杀菌作用。

单胺氧化酶抑制药和三环类抗抑郁药可互相增强毒性作用。

2. 作用于不同部位的协同作用和拮抗作用

有水钠潴留作用的药物 (保泰松、吲哚美辛、糖皮质激素类) 可拮抗利尿药和抗高血压药的降压作用; 但利尿药可与抗高血压药米诺地尔或肼屈嗪合用, 减轻其水钠潴留的不良反应, 产生协同降压作用; 噻嗪类利尿药或高效利尿药 (如呋塞米、依他尼酸) 与强心苷合用时, 必须注意补钾。

3. 对作用部位的增敏作用: 氟烷使 β 受体敏感性增强; 甲状腺素使抗凝药与受体部位的亲和力增加, 从而使抗凝作用增强。

【考点 47】药动学差异 (26 年未改动)

(2016 年 A 型题, 1 分; 2018 年 A 型题, 1 分, 2018 年 B 型题, 2 分; 2021 年 A 型题, 2 分; 2022 年 B 型题, 1 分; 2023 年 B 型题, 1 分; 2024 年 B 型题, 1 分; 2025 年 B 型题, 1 分)

1. 乙酰化作用: 人体通过 N-乙酰基转移酶将异烟肼转变为乙酰化异烟肼而灭活。人群分为快代谢





者和慢代谢者。慢代谢者（白种人）易发生多发性神经炎，快代谢者（黄种人）易发生肝炎。

2. 水解作用：血浆假性胆碱酯酶缺乏的人（约 1: 1500）对琥珀胆碱水解灭活能力减弱，常规剂量应用时可以引起呼吸肌麻痹时间延长。

3. 氧化作用：①异喹肼氧化多态性：CYP2D6。②S-美芬妥英代谢多态性：CYP2C19。

4. G-6-PD 缺乏：溶血性贫血的遗传病，一般无症状，但食用蚕豆或服用伯氨喹啉类药物后可出现血红蛋白尿、黄疸、贫血等急性溶血反应。

5. 乙醛脱氢酶与乙醇脱氢酶异常：①乙醛脱氢酶是乙醇代谢的关键酶，约 50% 的亚洲人缺乏。乙醛脱氢酶缺乏者饮酒后出现面部潮红、心率增快、出汗、肌无力等不良反应。②乙醇脱氢酶缺乏者饮酒后，引起血管扩张、面部潮红及代偿性心动过速。

【考点 48】时辰药理学（26 年未改动）

（2017 年 B 型题，1 分；2020 年 A 型题，1 分；2021 年 B 型题，2 分；2023 年 B 型题，2 分；2024 年 A 型题，1 分；2025 年 B 型题，1 分）

1. 他汀类降脂药推荐临睡前给药，降低血清胆固醇的作用更强。

2. 铁剂的服用选择在 19:00 比较合理。

3. 呼吸道对组胺反应 0:00~02:00 敏感性最高。哮喘患者易在凌晨发作。皮肤对组胺或过敏原在 19:00~23:00 敏感性最高，赛庚啶的抗组胺作用在 07:00 时给药疗效可持续 15-17 小时，而 19:00 时给药则只能维持 6-8 小时。

4. 吗啡 21:00 时给药的镇痛作用最强，15:00 时给药的镇痛作用最弱。

5. β_2 受体激动药可采取剂量晨低夜高的给药方法，有利于药物在清晨呼吸道阻力增加时达到较高血浓度。

6. 茶碱类药物白天吸收快，晚上吸收较慢，可采取日低夜高的给药剂量。

7. 糖皮质激素可采用每日清晨一次给药法或隔日清晨给药法。

【考点 49】药物与非靶标结合引发的毒副作用（26 年未改动）

（2017 年 B 型题，2 分；2018 年 A 型题，1 分；2019 年 A 型题，1 分；2020 年 A 型题，1 分；2021 年 A 型题，1 分；2022 年 A 型题，1 分；2022 年 B 型题，1 分；2024 年 A 型题，1 分；2024 年 B 型题，1 分；2025 年 B 型题，2 分）

1. 药物与非治疗部位靶标结合产生副作用

抗精神病药（氯丙嗪、氯普噻吨、奋乃静、洛沙平等）有锥体外系副作用。

长春碱、长春新碱、紫杉醇、多西他赛等抑制微管蛋白的聚合或解聚，从而抑制肿瘤的生长。但这类同时也抑制神经细胞的微管，产生较为严重的神经炎副作用。而长春瑞滨对神经的微管蛋白作用较弱，其神经毒性比长春碱和长春新碱低。

2. 药物与非治疗靶标结合产生副作用

（1）抗精神病药氯氮平、利培酮、奥氮平、齐拉西酮等可阻断 DA_2 受体和 $5-HT_2$ 受体，降低了锥体外系副作用。

（2）大环内酯类抗生素类药物，14 元环内酯化合物在产生抗菌作用，同时增加了胃肠道蠕动，并引起恶心、呕吐等胃肠道副作用。

3. 对心脏快速延迟整流钾离子通道（hERG）的影响：某些抗心律失常药、抗心绞痛药和强心药阻断 hERG K^+ 通道，引起 QT 间期延长，诱发 TdP，产生心脏不良反应。如**特非那定和阿司咪唑**，引发致死性尖端扭转型室性心动过速，导致药源性心律失常被撤市。

4. 含有毒性基团的药物作用





抗肿瘤的烷化剂类药物，如氮芥类药物、磺酸酯类药物、氮丙啶类药物、含有醌类结构的药物等。

5. 药物“一靶多能”引起的毒副作用

**普利用于治疗高血压、充血性心力衰竭(CHF)等心血管疾病。但 ACE 抑制剂也同时阻断了缓激肽的分解，增加呼吸道平滑肌分泌前列腺素、慢反应物质及神经激肽 A 等，导致血压过低、血钾过多、咳嗽、皮疹、味觉障碍等不良反应，特别是引起干咳是其发生率较高的不良反应。

6. 药物选择性差异引起的毒副作用

选择性 COX-2 抑制剂罗非昔布、伐地昔布抑制 COX-2 而不抑制 COX-1，前列腺素 PGI₂ 产生受阻，血栓素 TXA₂ 合成不受影响，TXA₂ 和 PGI₂ 的平衡被破坏，引发血管栓塞事件，导致药物撤回。

7. 光照引起的药物毒副作用

四环素类药物（多西环素>金霉素>四环素）；吩噻嗪类药物；喹诺酮类（司帕沙星>洛美沙星>氟罗沙星>托氟沙星>环丙沙星>依诺沙星>诺氟沙星>氧氟沙星>左氧氟沙星>加替沙星和莫西沙星）

【考点 50】药物代谢产物产生的毒副作用（26 年未改动）

（2024 年 B 型题，2 分）

1. 含有苯胺、苯酚等结构药物的代谢

药物结构中常含有苯胺(包括 N-苯基哌啶和 N-苯基哌嗪)、苯酚(包括苯氧烷基)、p-胺基酚和 p-胺苯甲基等片段，可能被 CYP 氧化成具有较强亲电性的 p-或 o-醌、亚胺-醌或次甲基-醌等结构，具有产生毒性或引发特质性反应的潜在风险。

①双氯芬酸的结构中含有二苯胺，代谢生成强亲电性亚胺-醌，可与体内蛋白或谷胱甘肽发生亲核取代，引发肝脏毒性。

②奈法唑酮结构中含有苯基哌嗪片段，代谢为具有亲电性的亚胺-醌，以及 N-去芳基化生成氯代对醌，从而产生肝脏毒性反应，2003 年撤市。

③β 受体拮抗剂普拉洛尔代谢生成亚胺-醌式结构化合物，导致特质性硬化性腹膜炎，由此而被撤出市场。

④过氧化酶体增殖激活 γ 受体激动药曲格列酮是由色满酮母核和噻唑烷二酮相连接，在肝药酶的作用下形成强亲电试剂 o-次甲基-醌和 p-醌，因严重的肝脏毒性被停止使用。

2. 含有杂环结构的药物代谢

舒多昔康因出严重的肝脏毒性而被终止开发，舒多昔康的噻唑环开环，生成乙二醛和强亲电性酰基硫脲，进而产生毒性。

3. 含有芳烷酸药物的代谢

①非甾体抗炎药佐美酸的代谢产物为芳乙酸酰化的葡萄糖醛酸，可与肝脏的蛋白分子共价结合从而引发肝脏毒性，故佐美酸已被终止使用。

②苯噻洛芬的代谢产物为酰基葡萄糖醛化合物，可产生特质性毒性反应，已被停止使用。

③芬氯酸和异丁芬酸也因与葡萄糖醛酸发生反应，引发急性肝中毒和过敏反应，被停用。

4. 钠通道阻滞剂非尔氨酯具有镇静催眠和抗癫痫作用，曾因可引起肝脏毒性和再生障碍性贫血而被限制使用（代谢为强亲电性的 2-苯基丙烯醛）。该药物首先在体内被酯酶水解并被醛脱氢酶催化下生成醛基氨甲酸酯，

【考点 51】药物对机体各系统的毒性作用（26 年未改动）

（2020 年 A 型题，2 分；2020 年 B 型题，2 分；2021 年 X 型题，1 分；2024 年 A 型题，1 分；2025 年 B 型题，1 分；2025 年 A 型题，1 分）





1. 药物对肾脏的毒性作用及常见药物

(1) 急性肾小管损伤/坏死: 氨基糖苷类(最常见)、头孢菌素、两性霉素 B、万古霉素、造影剂、重金属、顺铂、阿昔洛韦等。

(2) 急性间质性肾炎: 抗生素、非甾体抗炎药、头孢菌素、卡托普利、青霉胺、利福平、西咪替丁、别嘌呤醇、喹诺酮类等。

(3) 慢性间质性肾炎: 非甾体类抗炎药、顺铂、锂、铅、汞、镉、环孢素、甲氨蝶呤等。

(4) 肾小球肾炎: 非甾体抗炎药、海洛因、青霉胺、血管紧张素转化酶抑制药等。

(6) 慢性肾衰竭: 非甾体抗炎药、锂盐、环孢素、抗生素等。

(7) 肾血管损害: 环孢素、氟尿嘧啶、丝裂霉素、环孢素等。

(8) 肾结石: 柳氮磺吡啶、头孢曲松、呋喃妥因、茛地那韦、替诺福韦、钙剂、碳酸酐酶抑制药、托吡酯、苯溴马隆等

(9) 狼疮样综合征: 肼屈嗪、普鲁卡因胺、苯妥英钠、丙硫氧嘧啶等。

(10) 巴比妥类、苯妥英钠、长春新碱和某些麻醉药等可致抗利尿激素过多综合征, 远曲小管水重吸收过多引起水肿、低钠血症等; 环磷酰胺大剂量易诱发出血性膀胱炎。

2. 药物对肝脏的毒性作用及常见药物

(1) 肝细胞损伤

急性肝细胞损伤: 异烟肼、对乙酰氨基酚、洛伐他汀、呋喃妥因、氟烷、磺胺、苯妥英钠、酮康唑、特比萘芬、双氯芬酸、阿司匹林

慢性肝细胞损伤/肝纤维化: 呋喃妥因、甲基多巴、双氯芬酸、米诺环素、对乙酰氨基酚、异烟肼、甲氨蝶呤、高剂量维生素 A

(2) 胆汁淤积

例如氨苄西林、卡马西平、氯丙嗪、红霉素、雌激素、氟哌啶醇、苯妥英等。有些药物可产生原发性胆汁淤积同时伴有肝坏死, 如氯丙嗪、红霉素; 还有一些药物引起胆汁淤积却几乎不伴有肝细胞损伤, 如类固醇激素。

(3) 肝血管损伤

致病药物包括含吡咯双烷生物碱的草药(土三七)、某些化疗药、同化激素、避孕药、免疫抑制药及抗逆转录病毒药物等。

(4) 脂肪肝

包括甲氨蝶呤、重金属类化合物、雌激素、糖皮质激素等。

(5) 肝纤维化

含砷的药物和甲氨蝶呤可引起肝纤维化; 另有一些药物如甲基多巴、呋喃妥因、异烟肼、双氯芬酸等可引起慢性活动性肝炎, 如果不及时停药, 也可导致肝纤维化。

3. 药物对心血管系统的毒性作用及典型药物

损伤类型	代表药物
心力衰竭	钙通道阻滞药如维拉帕米、地尔硫草, β 受体拮抗药如普萘洛尔
心律失常—窦性心动过速	灰黄霉素、丙米嗪、阿米替林、哌替啶、洛贝林、阿托品、肾上腺素、氯丙嗪、奋乃静、沙丁胺醇等
心律失常—心室颤动	两性霉素 B、克霉唑、阿托品等
心律失常—室性期前收缩	克霉唑、依米丁、阿托品等





心律失常—室性心动过速	克霉唑、咖啡因、麻黄碱等
心律失常—窦性心动过缓	美沙酮、去甲肾上腺素、奥美拉唑等
心律失常—传导阻滞	卡马西平、乌头碱、三环类抗抑郁药、抗精神病药物、抗组胺药、抗惊厥药、右丙氧芬、抗疟疾药(氯喹、奎宁)、钙通道阻滞药、普萘洛尔、美托洛尔、索他洛尔等
心肌炎—超敏性心肌炎	青霉素、磺胺类、甲基多巴等
心肌炎—中毒性心肌炎	环磷酰胺、某些抗精神病类药、抗寄生虫药等
心肌病	多柔比星、柔红霉素、氯丙嗪、奋乃静、氯米帕明、依米丁、儿茶酚胺类等
心包炎	多柔比星、柔红霉素、青霉素、普鲁卡因胺、异烟肼等
高血压	环孢素、非甾体抗炎药、皮质醇等
低血压	α 受体拮抗药、ACEI、血管扩张药等
血管炎	磺胺类、环丙沙星、丙硫氧嘧啶、环磷酰胺、吡啶洛尔、麦角胺等

4. 药物对神经系统的毒副作用及典型药物

损伤类型	代表药物
神经元损伤	链霉素、紫杉醇类、奎宁
轴突损害	有机磷酸酯类、异烟肼、硼替佐米
髓鞘损害	胺碘酮、哌克昔林、呋喃妥因
神经递质毒性	可卡因、氯丙嗪、利血平

5. 药物对血液系统的毒副作用及典型药物

代表药物	血液系统损害的表现
氯霉素	可逆性全血细胞减少、再生障碍性贫血
卡马西平	白细胞减少、白细胞增加、叶酸缺乏、粒细胞缺乏、再生障碍性贫血、全血细胞减少、溶血性贫血等
氯氮平	粒细胞缺乏、白细胞减少等
磺胺类	白细胞减少、先天缺乏葡萄糖 6-磷酸脱氢酶患者发生溶血性贫血、粒细胞缺乏、再生障碍性贫血、血小板减少等
头孢菌素类	溶血性贫血、凝血功能异常、白细胞减少、血小板减少、粒细胞缺乏等
四环素类	溶血性贫血、再生障碍性贫血等
紫杉醇	骨髓抑制、中性粒细胞减少、血小板减少等
环磷酰胺	骨髓抑制、白细胞减少、血小板减少、药源性白血病等
阿司匹林	缺铁性贫血、溶血性贫血、巨幼细胞贫血、凝血障碍、药源性血小板功能障碍等

6. 药物对内分泌系统的毒副作用及典型药物

(1) 引起甲状腺功能紊乱

胺碘酮、聚维酮碘、锂剂、干扰素 α 、抗甲状腺药，硝普钠、磺脲类药物也可导致甲状腺功能减退症。

(2) 引起药源性高血糖症





抗肿瘤药门冬酰胺酶、二氮嗪、噻嗪类利尿药、 β 受体拮抗药；抗精神病药(如氯氮平和奥氮平)、糖皮质激素类药物(如氢化可的松和泼尼松)、噻嗪类利尿药和 β 受体拮抗药； β 受体拟交感神经药。

(3) 引起药源性低血糖症

胰岛素、磺酰脲类、双胍类降糖药、水杨酸类药物、磺胺类抗菌药、丙吡胺、喷他咪、 β 受体拟交感神经药；血管紧张素转化酶抑制药； β 受体拮抗药；奎宁、奎尼丁、色氨酸、单胺氧化酶抑制药、环丙沙星、对乙酰氨基酚。

7. 药物对呼吸系统的毒副作用及典型药物

损伤类型	代表药物
鼻塞	抗高血压药(如哌唑嗪、普萘洛尔)、非甾体抗炎药和激素类药物等
咳嗽	胺碘酮、博来霉素、青霉素类、红霉素类、呋喃妥因及甲氨蝶呤、氯丙嗪、ACEI
哮喘	青霉素、阿司匹林、普萘洛尔等
呼吸抑制	中枢抑制药(如巴比妥类、吗啡、哌替啶、硝西泮、芬太尼、美沙酮和喷他佐辛等药物)引起；呼吸肌麻痹(氨基糖苷类、多黏菌素、琥珀胆碱类、筒箭毒碱类)
肺炎及肺纤维化	博来霉素、紫杉烷类、环磷酰胺、抗肿瘤药物(如多柔比星、厄洛替尼、依托泊苷)和免疫检查点抑制药； 肺变态反应性炎症(青霉素类、头孢菌素类、磺胺类等抗菌药物，以及氯丙嗪、对氨基水杨酸钠、干扰素、甲氨蝶呤、阿糖胞苷、利巴韦林、氟尿嘧啶、吲达帕胺、呋喃妥因、胍屈嗪、普鲁卡因胺等)
非心源性肺水肿	变态反应多由青霉素、链霉素、磺胺类、丝裂霉素、吉西他滨、白介素-2、胺碘酮、噻嗪类等引起； 中毒反应多由镇痛药、镇静催眠药、麻醉药、平喘药、链激酶、美沙酮、碘类造影剂等引起。
肺泡出血	抗肿瘤药如全反式维甲酸、贝伐珠单抗、依托泊苷、吉西他滨等，以及硝基呋喃妥因、两性霉素B、D-青霉胺、丙基硫氧嘧啶等
肺动脉高压	阿米雷司、氟苯丙胺、右芬氟拉明、选择性5-羟色胺再摄取抑制药、安非他命
肺静脉闭塞病	博来霉素、丝裂霉素、卡莫司汀、顺铂、长春新碱、环磷酰胺等抗肿瘤药
肺栓塞	环磷酰胺、甲氨蝶呤、丝裂霉素等化疗药物；口服避孕药炔雌醇环丙孕酮片、肾上腺皮质激素；吩噻嗪类、氯氮平等抗精神病药
类风湿性肺结节	甲氨蝶呤、来氟米特、硫唑嘌呤等

【考点 52】药物取代基对生物活性影响 (26 年未改变)

(2015 年 A 型题, 1 分; 2016 年 B 型题, 3 分; 2018 年 B 型题, 3 分; 2020 年 A 型题, 1 分; 2022 年 B 型题, 3 分; 2025 年 B 型题, 1 分)

1. 烃基: 脂溶性 $\uparrow$, 位阻 $\uparrow$, 稳定性 $\uparrow$ 。如环己巴比妥引入甲基 $\rightarrow$ 海索比妥, 不易解离。

2. 卤素: 强吸电子基, 脂溶性 $\uparrow$ 。如氟奋乃静的安定作用比奋乃静强。

3. 羟基($-\text{OH}$): 水溶性 $\uparrow$, 受体结合力 $\uparrow$ 。①脂肪链上: 活性和毒性 $\downarrow$; ②芳环上: 酸性、活性和毒性 $\uparrow$; ③酰化/酯化/成醚: 活性 $\downarrow$ 。

4. 巯基: 形成氢键能力比羟基低, 但脂溶性高。①解药: 与重金属形成不溶性硫醇盐, 可作解药, 如二巯基丙醇; ②加成反应、与酶的吡啶环结合。

5. 醚和硫醚: 脂溶性 $\uparrow$, 易通过生物膜。硫醚类易氧化成亚砷或砷, 砷为对称结构, 分子极性 $\downarrow$, 脂溶性 $\uparrow$; 亚砷为较稳定的棱锥形结构, 硫氧键使其极性和水溶性 $\uparrow$ 。如广谱驱虫药阿苯达唑。





6. 磺酸: 仅有磺酸基的化合物一般无活性, 引入磺酸基, 水溶性↑。如抗肿瘤药巯嘌呤。

7. 羧酸: 羧酸水溶性解离度较磺酸小; 对一些易透过血-脑屏障, 会产生中枢副作用的药物, 引入羧基可减少药物副作用。如抗组胺药羟嗪, 其结构中的羟基换成羧基得到西替利嗪, 脂溶性↑。

8. 酯: 羧酸成酯后酸性↓, 脂溶性↑, 减少刺激, 易吸收。如头孢呋辛羧基酯化得到头孢呋辛酯, 脂溶性↑。

9. 酰胺: 易与生物大分子形成氢键与受体的结合能力强。

10. 胺类: 碱性、氢键接受体(与多种受体结合) ①活性: 伯胺>仲胺>叔胺。季铵易电离成稳定的铵离子, 作用强, 水溶性大, 难透过生物膜。如双氯芬酸、对乙酰氨基酚。

【考点 53】药物的手性结构对药物活性的影响 (26 年未改动)

(2016 年 X 型题, 1 分; 2017 年 A 型题, 1 分; 2019 年 B 型题, 3 分; 2021 年 B 型题, 1 分; 2023 年 B 型题, 3 分)

1. 作用相同, 强度相同: 静态手性类药物, 手性与活性无关; 如普罗帕酮、氟卡尼。

2. **作用相同, 强弱不同**: 如抗菌药氧氟沙星其[S-(-)>R-(+)]对映异构体; 组胺类抗过敏药氯苯那敏(右旋>左旋)、非甾体抗炎药萘普生[(S)-(+)>(R)-(-)]。

3. **一个有活性, 一个无活性**: 如抗高血压药 L-甲基多巴有效、(S)-氨基己烯酸是 GABA 转氨酶抑制剂。

4. 产生相反的活性

异丙肾上腺素: R-β 受体激动作用; S-β 受体阻断作用。

哌西那多: (+)阿片受体激动药, 镇痛作用; (-)阿片受体阻断作用。

扎考必利: (R)5-HT₃拮抗剂, 抗精神病; (S)5-HT₃激动剂。

依托唑啉: (-)利尿; (+)抗利尿。

5. 产生不同类型作用 右丙氧芬(镇痛)-左丙氧芬(镇咳)、麻黄碱(血管收缩药和平喘药)-伪麻黄碱(支气管扩张药)、奎宁(抗疟)-奎尼丁(抗心律失常)。

6. **一个有活性, 一个有毒性**

氯胺酮: S-对映体, 中枢兴奋; R-对映体, 安眠镇痛

乙胺丁醇: D-对映体的活性强、毒性小; L-对映体则相反

丙胺卡因: (R)-(-)-对映体在体内水解生成邻甲苯胺, 有血液毒性

青霉胺: S-(-)-对映体, 免疫抑制, 抗风湿; R-(+)-对映体, 致癌

四咪唑: (S)-对映体, 广谱驱虫药; (R)-对映体, 呕吐

米安色林: (S)-对映体, 抗忧郁; (R)-对映体, 细胞毒性

左旋多巴: (S)-对映体, 抗震颤麻痹; (R)-对映体, 竞争性拮抗

【考点 54】镇静与催眠药 (26 年未改动)

(2015 年 B 型题, 1 分; 2016 年 A 型题, 1 分; 2017 年 A 型题, 1 分; 2019 年 A 型题; 2021 年 B 型题, 2 分; 2023 年 B 型题, 1 分; 2024 年 A 型题, 1 分; 2025 年 A 型题, 1 分)

1. 苯二氮䓬类药物---XX 西泮、XX 唑仑

(1) 构效关系

①A 环: 7 位引入吸电子取代基, 活性增强, 吸电子越强, 作用越强, 其次序为 NO₂>Br>CF₃>Cl。

②B 环: 地西泮体内代谢时在 3 位上引入羟基可以增加其分子的极性, 易与葡萄糖醛酸结合排出体外。3 位羟基衍生物可保持原有药物的活性, 临床上较原药物更安全, 如奥沙西泮。

③C 环: 5 位上的苯环取代是产生药效的重要基团之一, 无苯基取代的化合物没有镇静催眠活性。5 位苯环的 2' 位引入体积小的吸电子基团如 F、Cl 可使活性增强。如氟西泮(二乙氨基侧链)和氟地





西洋等。

④1, 4-苯二氮草的 1, 2 位并上三氮唑环, 代谢稳定性和脂溶性增加, 活性显著增加。如艾司唑仑、阿普唑仑、三唑仑(甲基提高了脂溶性)、咪达唑仑和依替唑仑, 活性比地西洋强。

(2) 稳定性: 1, 2 位酰胺键和 4, 5 位亚胺键在酸性条件下及受热时易发生 1, 2 位或 4, 5 位开环。

(3) 体内代谢: 主要在肝脏进行, 代谢途径相似, 主要有 1 位 N-去甲基、3 位羟基化、苯环羟基化、1, 2 位开环等, 这些代谢产物活性降低。

2. 非苯二氮草类

(1) 酒石酸唑吡坦: 咪唑并吡啶类催眠药。代谢物无药理活性, 体内无蓄积。

(2) 艾司佐匹克隆: 佐匹克隆的右旋体, 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。连续多次给药无蓄积作用。

(3) 扎来普隆: 吡唑并嘧啶的衍生物。口服吸收迅速且完全。适用于入睡困难的失眠症短期治疗。

【考点 55】抗精神病药 (26 年未改动)

(2016 年 A 型题, 1 分; 2018 年 A 型题, 1 分; 2020 年 A 型题, 1 分。)

1. 三环类抗精神病药

(1) 吩噻嗪类药物:

①代表药: 氯丙嗪, 治疗以兴奋症为主的精神病, 主要副作用是锥体外系作用。

②共性: 光毒性变态反应(避免日光照射)。

③构效关系: 2 位吸电子基团, 活性增强: 三氟丙嗪(以 $-CF_3$ 取代 Cl); 10 位侧链氮杂环(哌嗪最强): (氟)奋乃静; 长链脂肪酸酯类前药: 氟奋乃静庚酸酯、氟奋乃静癸酸酯(作用时间延长)。

(2) 硫杂蒯类: 氯普噻吨(顺式异构体为有效异构体)、珠氯噻醇(老人更适用)、氟哌噻吨、替沃噻吨。

(3) 二苯并氮草类及其他药物:

①氯氮平: 第一个非典型抗精神病药。有首过效应, 主要代谢产物为去甲基氯氮平和氯氮平-N-氧化物。

②其他药物: 喹硫平(二苯并硫氮草)、奥氮平(噻吩并硫氮草)、洛沙平(氯噻平“S” $\rightarrow$ “O”)、阿莫沙平(洛沙平去甲基代谢物)。

2. 非三环类抗精神病药

(1) 丁酰苯类药物: 氟哌啶醇(避光稳定, 光照颜色加深)、三氟哌多(较氟哌啶醇迅速)、氟哌利多(代谢快, 维持时间短)。

(2) 苯甲酰胺类药物: 舒必利、硫必利、瑞莫必利。

(3) 其他类药物: 利培酮(拼合原理)、帕利哌酮(利培酮活性代谢物, $t_{1/2}$ 更长)、齐拉西酮(拼合原理)。

【考点 56】抗抑郁药: 去甲肾上腺素(NE)再摄取抑制剂 (26 年微调)

(2019 年 X 型题, 1 分。)

1. 丙米嗪(生物电子等排原理): 二苯并氮草类、NE 和 5-HT 双重重摄取抑制剂。

2. 地昔帕明: 丙米嗪的活性代谢物。

3. 氯米帕明: 起效快, 抗焦虑。本品在肝脏代谢生成活性的代谢产物去甲氯米帕明。

4. 阿米替林(生物电子等排原理): 二苯并环庚二烯类。对日光敏感, 易氧化, 需避光保存。活性代谢产物去甲替林。

5. 多塞平: 以 85:15 的 E 型和 Z 型的异构体混合物, Z 异构体抑制 5-HT 重摄取, E 异构体抑制 NE





重摄取。

【考点 57】抗抑郁药：5-羟色胺（5-HT）再摄取抑制剂（26 年未改动）

（2015 年 B 型题，1 分；2017 年 A 型题，1 分；2019 年 X 型题，2 分；2021 年 C 型题，1 分；2025 年 B 型题，1 分；2025 年 C 型题，1 分）

1. 氟西汀：选择性 5-HT 重摄取抑制剂；生物利用度 100%；含有手性碳，使用外消旋体。
2. 去甲氟西汀：氟西汀的代谢产物，半衰期更长。
3. 西酞普兰：苯并呋喃，有 1 个手性碳，药用外消旋体。艾司西酞普兰是西酞普兰的 S 对映体。
4. 氟伏沙明：非三环类抗抑郁药。仅 E-异构体有活性。需避光保存。
5. 帕罗西汀：2 个手性中心，用（3S，4R）-（-）-异构体，具饱和性，非线性药动力学特征。
6. 舍曲林：2 个手性中心，目前用 S，S-（+）-异构体。代谢产物是 N-去甲基舍曲林。

【考点 58】抗抑郁药：5-羟色胺与去甲肾上腺素再摄取抑制剂（26 年微调）

（2017 年 A 型题，1 分；2019 年 X 型题，1 分；2025 年 B 型题，1 分）

1. 文拉法辛：5-HT/NE 重摄取抑制剂，小剂量抑制 5-HT 重摄取，大剂量抑制 5-HT 和 NE 重摄取。代谢物为 O-去甲文拉法辛。
2. 度洛西汀：强效的选择性 5-HT 和 NE 重摄取抑制剂。有手性碳，药用右旋体。
3. 米氮平：2 种光学异构体。R-异构体对 5-HT₃ 受体的抑制强。主要代谢方式为 N-脱甲基及氧化反应，脱甲基后代谢产物仍有活性。

【考点 59】天然生物碱及类似物（26 年微调）

（2017 年 B 型题，1 分；2019 年 A 型题，1 分；2021 年 A 型题，1 分；2022 年 A 型题，1 分；2023 年 A 型题，1 分）

1. 吗啡

（1）结构：具有菲环结构的生物碱，由 5 个环稠合而成，含 5 个手性中心，左旋吗啡为有效构型，右旋吗啡无活性。镇痛作用和 T 型骨架构象有关。

（2）性质：①酸碱两性：3 位酚羟基具弱酸性，17 位 N-甲基叔胺具碱性；②易氧化：光照氧化变质→伪吗啡（毒性大）；③吗啡在酸性溶液中加热，可脱水和分子重排，生成阿扑吗啡（多巴胺激动剂，作催吐剂）。

（3）代谢：口服生物利用度低，故一般制成注射剂或缓释片。

2. 可待因：吗啡 3 位羟基甲基化。镇痛活性弱，是吗啡的 1/10，有较强的镇咳作用。
3. 海洛因：吗啡 3、6 位羟基同时酯化（二乙酰化前药）。脂溶性强，更易进入血-脑屏障，增强了镇痛作用和成瘾性。
4. 纳洛酮：吗啡 17 位 N-甲基被烯丙基取代后所得。吗啡受体拮抗剂，用于吗啡过量的解毒剂、戒毒剂。

5. 纳曲酮：吗啡 17 位环丙基甲基取代后所得，活性比纳洛酮强 8 倍。

6. 羟考酮：阿片受体纯激动剂，镇痛无封顶效应。具有双向吸收模式。

7. 埃托啡：镇痛活性是吗啡的 10000 倍，透过血脑屏障的速度是吗啡的 200 倍。

8. 二氢埃托啡：镇痛活性强于埃托啡，戒断症状及精神依赖性明显轻于吗啡，但易于导致成瘾性。

【考点 60】合成镇痛药物（26 年微调）

（2015 年 B 型题，1 分；2017 年 C 型题，1 分；2020 年 A 型题，1 分；2023 年 B 型题，2 分；2024 年 A 型题，1 分）

1. 盐酸哌替啶：4-苯基哌啶类结构的镇痛药。体内代谢生成哌替啶酸、去甲基哌替啶和去甲基哌





替啶酸。去甲基哌替啶体内消除很慢，易蓄积产生中枢毒性，引发癫痫，不用于慢性疼痛的治疗。

2. 枸橼酸芬太尼：亲脂性高，易通过血脑屏障，起效快，作用强，镇痛作用比吗啡强，作用时间短。同类药物：阿芬太尼（乙基四氮唑）、舒芬太尼（噻吩）、瑞芬太尼（羧酸酯）

3. 美沙酮：氨基酮类。美沙酮的左旋体镇痛作用强，右旋体作用极弱，药用其外消旋体。常用作海洛因等成瘾造成的戒断症状治疗（戒毒药）。

4. 布桂嗪：哌嗪为母体，2个N原子上分别连有苯丙烯和丁酰基。阿片受体的激动-拮抗剂（混合型）。可致耐受和成瘾，故不可滥用（麻醉品）。

5. 曲马多：2个手性碳，临床用外消旋体。几无成瘾性。代谢生成O-去甲基曲马多。用于中重度、急慢性疼痛的止痛。

①1R, 2R-(+)-曲马多抑制5-HT重摄取，为弱 μ 受体激动剂，对 μ 受体亲和性为吗啡的1/3800；

②1S, 2S-(-)-曲马多是去甲肾上腺素重摄取抑制剂和肾上腺素能 α_2 受体激动剂；

③(±)-曲马多的镇痛作用得益于两者的协同性和互补性作用， ED_{50} 比吗啡大9倍。

【考点61】解热镇痛药物（26年未改动）

（2015年A型题，1分；2017年B型题，1分；2018年A型题，1分，2018年B型题，1分；2019年B型题，1分，2019年C型题，1分；2022年A型题，1分）

1. 水杨酸类药物

（1）阿司匹林

【结构】水杨酸类，活性必需基团：羧酸。

【鉴别】阿司匹林水解生成的水杨酸与三氯化铁试液反应，呈紫堇色。

【性质】在生产中带入水杨酸或在贮存中水解产生水杨酸，不仅有一定的毒副作用，还可在空气中逐渐被氧化成一系列淡黄、红棕甚至深棕色的醌类有色物质。本品变色后不可使用。

（2）贝诺酯：阿司匹林和对乙酰氨基酚的酯，是前药。

（3）二氟尼柳：水杨酸的5位上引入2,4-二氟苯基衍生物。口服吸收好。用于轻、中毒镇痛。

2. 苯胺类药物

对乙酰氨基酚（扑热息痛）

【结构】乙酰苯胺类。

【性质】具有酰胺键，贮藏不当可发生水解，产生对氨基酚，酸性及碱性均能促进水解反应。

【代谢】毒性代谢产物乙酰亚胺醌（具肾毒性和肝毒性）。

【中毒解救】误使用过量对乙酰氨基酚，应用含有巯基结构药物如谷胱甘肽或乙酰半胱氨酸解毒。

【考点62】羧酸类非甾体抗炎药（26年未改动）

（2016年B型题，1分；2018年B型题，1分；2019年B型题，1分；2020年B型题，1分；2021年A型题，1分；2024年A型题，1分；2024年B型题，1分；2025年A型题，1分）

1. 芳基乙酸类药物：

（1）吲哚美辛：抗炎活性强度与乙酸基的酸性强度成正相关；5位取代基有效防止体内代谢；本品对光敏感；可被强酸或强碱水解。

（2）舒林酸：利用电子等排原理，将吲哚环上的-N-换成-CH-得到的茚类衍生物，舒林酸是前药。药用顺式体（Z）。本品需在体内经肝脏代谢后产生活性。起效慢，作用持久，副作用小、耐受性好、长期服用不易引起肾坏死。

（3）双氯芬酸钠：标志性代表药物。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。





2. 芳基丙酸类药物:

(1) 布洛芬: 市售外消旋体, (S)-异构体的活性强, 无效的(R)-异构体在体内转化为有效的(S)-异构体。

(2) 萘普生: S-异构体活性强。口服吸收迅速而完全。

(3) 萘丁美酮: 非酸性前药。本身无活性, 经肝脏首关代谢为活性代谢物。

(4) 依托度酸、氟比洛芬、酮洛芬、洛索洛芬、非诺洛芬。

【考点 63】非羧酸类非甾体抗炎药 (26 年微调)

(2016 年 B 型题, 1 分; 2018 年 B 型题, 1 分; 2019 年 A 型题, 1 分; 2023 年 A 型题, 1 分; 2024 年 B 型题, 1 分)

1. 昔康类:

(1) 吡罗昔康: 分子含有烯醇结构药效团, 是第一个上市的昔康类药物。

(2) 美洛昔康: 结构中有噻唑环, 代谢产物没有活性。

(3) 依索昔康: 将美洛昔康的噻唑环用异噻唑替代产物。

(4) 替诺昔康: 将吡罗昔康中的苯环以噻吩替代得到替诺昔康。

(5) 氯诺昔康: 替诺昔康的 7-氯代物。

2. 昔布类:

(1) 塞来昔布: 有三环结构, 含有氨磺酰基、三氟甲基结构。磺酰基体积大, 不易与 COX-1 结合。该类药物有增大心血管事件的风险。

(2) 罗非昔布: 有三环结构, 含有甲磺酰基, 因心血管风险, 已被召回。

(3) 艾瑞昔布: 结构中有不饱和吡咯烷酮, 甲磺酰基, 甲基苯, 成为治疗关节疼痛、骨性关节炎的一线治疗药。

【考点 64】平喘药-β 肾上腺受体激动剂 (26 年未改动)

(2024 年 A 型题, 1 分)

(1) 非选择性 β 肾上腺受体激动剂

异丙肾上腺素: 兴奋 β_1 和 β_2 受体, 松弛支气管平滑肌, 同时可兴奋心脏而加快心率, 产生心悸、心动过速等**心脏副作用**。**口服**经肝肠循环而**失效**。

(2) 选择性 β_2 受体激动剂

沙丁胺醇: R-左旋体对 β_2 受体的亲和力较大, S-右旋体代谢较慢。沙丁胺醇**口服有效**。二相代谢, 硫酸结合。

沙美特罗: 沙丁胺醇侧链氮原子上的叔丁基用**长链亲脂性取代基**取代, 获得**长效** β_2 受体激动剂, 作用时间长达 12 小时。(长链延长时间)

特布他林: 将异丙肾上腺素的**邻二羟基**改为**间二羟基**, 不易被 COMT、MAO 或硫酸酯酶代谢, 稳定性提高, 可口服。

班布特罗: 特布他林两个酚羟基酯化制成**双二甲氨基甲酸酯前药**, 在体内经肝脏代谢为有活性的**特布他林**发挥作用。

特布他林(原药)——**班布特罗**(前药)

富马酸**福莫特罗**: **长效** β_2 受体激动剂。**R, R-异构体**对 β_2 受体的亲和力是 S, S-异构体的 1000 倍。

盐酸**丙卡特罗**: 对支气管 β_2 受体具有高度选择性, 扩张支气管作用为沙丁胺醇的 3~10 倍, 用药量少, 作用持久。同时还有祛痰和镇咳作用。

克仑特罗(**瘦肉精**): 强效的选择性 β_2 受体激动剂, 分子结构稳定, **不易代谢**, 且**脂溶性大**, **易于沉积在机体中**。

氯丙那林: 对 β_2 受体的选择性低于沙丁胺醇。





【考点 65】抗溃疡药 (26 年为改动)

(2017 年 A 型题, 1 分; 2017 年 C 型题, 1 分; 2019 年 A 型题, 1 分; 2020 年 B 型题, 2 分; 2021 年 A 型题, 2 分; 2022 年 C 型题, 2 分; 2023 年 A 型题, 1 分; 2024 年 A 型题, 1 分; 2025 年 A 型题, 1 分)

1. H_2 受体阻断药

(1) 西咪替丁: 含咪唑环、含硫醚的四原子链和末端取代胍结构。本品为肝药酶抑制剂, 有首关效应。

(2) 雷尼替丁: 含呋喃核。极性药效团为二氨基硝基乙烯。有首关效应, 代谢产物为 N-氧化、S-氧化和去甲基雷尼替丁。

(3) 法莫替丁: 含胍基, 药效团为 N-氨基磺酰基脒。

(4) 尼扎替丁: 噻唑环替换雷尼替丁的呋喃环得到。强效组胺 H_2 受体拮抗剂。

(5) 罗沙替丁: 本品为选择性、竞争性的组胺 H_2 受体拮抗剂。

(6) 罗沙替丁乙酸酯: 罗沙替丁的羟基乙酰化得到。前药。

2. 不可逆质子泵抑制剂 (抑制 H^+ , K^+ -ATP 酶)

(1) 奥美拉唑 (前药)

【性质】具酸碱两性, 水中不稳定, 对强酸不稳定, 需低温避光保存; 制剂为有肠溶衣的胶囊。

【作用机制】奥美拉唑循环或前药循环。

【代谢】奥美拉唑的两种光学异构体疗效一致, 代谢选择性不同。体内清除率: R-异构体 > S-异构体。

(2) 艾司奥美拉唑: 奥美拉唑 S-异构体。

(3) 兰索拉唑: 苯并咪唑环无取代基, 吡啶环 4 位引入三氟乙氧基。

(4) 右兰索拉唑: 兰索拉唑的 R- (+) -异构体。药-时曲线有 2 个峰值。

(5) 泮托拉唑: 有 2 个手性异构体, 右旋体可向左旋体转化。有立体选择性。

(6) 雷贝拉唑钠: 兰索拉唑吡啶环 4 位侧链延长。

3. 可逆性质子泵抑制剂 (钾离子竞争性酸阻滞剂)

不需要进行转化激活, 可与质子泵的钾离子区域进行离子化的竞争性结合, 从而阻断胃酸分泌。对 H^+ , K^+ -ATP 酶的抑制是可逆的, 既能调节性减少胃酸的分泌, 又不会造成过度抑制, 因此能避免不可逆性质子泵抑制剂造成的胃酸缺乏症, 减少相应的副作用。

代表药物: 伏诺拉生 (针对反流性食管炎) 和瑞普拉生

【考点 66】促胃肠动力药 (26 年未改动)

(2017 年 A 型题, 1 分; 2019 年 A 型题, 1 分; 2020 年 A 型题, 1 分; 2022 年 A 型题, 1 分; 2025 年 A 型题, 1 分)

1. 甲氧氯普胺: 苯甲酰胺类似物。本品为中枢和外周多巴胺 D_2 受体拮抗剂, 是第一个临床应用的促动力药。副作用有锥体外系症状。

2. 多潘立酮: 较强的外周性多巴胺 D_2 受体拮抗剂, 极性较大, 不能透过血-脑屏障, 锥体外系副作用较甲氧氯普胺小。

3. 伊托必利: 阻断多巴胺 D_2 受体, 抑制乙酰胆碱酯酶活性; 无 Q-T 间期延长和室性心律失常副作用 (西沙必利有)。选择性高、不良反应少、安全性高。

4. 莫沙必利: 强效, 选择性 $5-HT_4$ 受体激动剂; 无 Q-T 间期延长和室性心律失常副作用。

【考点 67】抗高血压药: 血管紧张素转换酶 (ACE) 抑制剂 (26 年未改动)





(2016 年 A 型题, 1 分; 2018 年 A 型题, 1 分; 2019 年 A 型题, 1 分; 2020 年 B 型题, 3 分; 2022 年 A 型题, 1 分)

1. 卡托普利: 非前药, 含**巯基-药效团**, **易氧化**、易发生皮疹和味觉障碍。含巯基的 ACE 抑制剂的唯一代表。

2. 赖诺普利: 非前药, 2 个游离羧基, 含赖氨酸。

3. 依那普利: 双羧基 ACE 抑制剂药物的代表, 分子中含三个手性中心, 均为 S 构型。

4. 贝那普利: 七元环; 含双羧基的 ACE 抑制剂, 前药。

5. 福辛普利: 含磷酰基的 ACE 抑制剂。体内代谢生成福辛普利拉而发挥作用, 是前药。

6. 螺普利: 长期应用要防止低血钾。

7. 群多普利: 口服后在肝脏水解成群多普利拉。

8. 培哚普利: 口服后在肝脏水解成培哚普利拉。

9. 喹那普利: 口服后在肝脏水解成喹那普利拉。

10. 依那普利: 双羧基 ACE 抑制剂药物的代表, 分子中含三个手性中心, 均为 S 构型。依那普利是前药, 口服给药后在体内水解代谢为依那普利拉。

【考点 68】抗高血压药: 血管紧张素 II 受体拮抗剂 (26 年未改动)

(2017 年 X 型题, 1 分; 2019 年 B 型题, 1 分; 2022 年 B 型题, 3 分; 2023 年 B 型题, 2 分; 2025 年 A 型题, 1 分)

1. 氯沙坦

(1) 结构: 分子中含四氮唑取代联苯和咪唑环结构。

(2) 性质: ①四氮唑结构呈酸性, 可成钾盐; ②代谢产物羧甲基氧化成甲酸, 活性更强。

(3) 作用: 第一个血管紧张素 II 受体拮抗剂, 无干咳副作用。

2. 缬沙坦: 不含咪唑环的 A II 受体拮抗剂。尤其适用于 ACE 抑制剂不耐受的患者。

3. 厄贝沙坦: 缺乏氯沙坦中羟基的**螺环化合物**。治疗原发性高血压, 合并高血压的 2 型糖尿病肾病的治疗。

4. 替米沙坦: 分子中不含四氮唑基的 A II 受体拮抗剂, **酸性基团为羧酸**。

5. 坎地沙坦酯: 与替米沙坦均为含苯并咪唑环。前药, 在体内迅速、完全代谢成活性化合物坎地沙坦。

6. 依普罗沙坦: **含有噻吩丙烯酸结构, 不经 CPY450 代谢, 基本以原型药物形式排泄, 耐受性好**。

【考点 69】调节血脂药 (26 年未改动)

(2015 年 A 型题, 1 分; 2017 年 A 型题, 1 分; 2018 年 B 型题, 5 分; 2019 年 C 型题, 3 分; 2021 年 B 型题, 3 分; 2022 年 A 型题, 1 分; 2024 年 A 型题, 1 分)

1. 他汀类共性: ①主要降低胆固醇 (TC); ②副作用: 肌肉疼痛或横纹肌溶解, 特别是西立伐他汀; ③必需结构: **3, 5-二羟基羧酸** (内酯必须水解生效)。

2. 天然及半合成改造药物

(1) 洛伐他汀: 由于分子内存在内酯结构, 体外无 HMG-CoA 还原酶抑制作用, 需进入体内后水解为 3, 5-二羟基戊酸 (关键药效团) 才有活性。

(2) 辛伐他汀: 比洛伐他汀六氢萘环侧链多一个甲基取代基, 亲脂性 ↑, 活性比洛伐他汀高。

(3) 普伐他汀钠: 洛伐他汀内酯环开环成 3, 5-二羟基戊酸并与钠成盐, 六氢萘环 2 位羟基取代甲基所得。普伐他汀比洛伐他汀亲水性好, 对肝组织选择性更好, 减少了洛伐他汀的副作用。

3. 人工全合成药物





(1) 氟伐他汀钠: 第一个全合成他汀类药物。水溶性好, 口服吸收迅速而完全, 蛋白结合率较高。

(2) 阿托伐他汀钙: 用于各型高胆固醇血症和混合型高脂血症; 也可用于冠心病和脑卒中的防治。本品可降低心血管病的总死亡率, 亦适用于心肌梗死后不稳定型心绞痛及血管重建术后。

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

【考点 70】抗心绞痛药: 1, 4-二氢吡啶类钙通道阻滞剂 (26 年未改动)

(2015 年 C 型题, 2 分; 2018 年 A 型题, 1 分, 2018 年 B 型题, 3 分; 2023 年 B 型题, 1 分; 2024 年 A 型题, 1 分)

1. 此类共性: ①光催化歧化反应→硝基苯吡啶/亚硝基苯吡啶(有毒); ②相互作用: 不宜与柚子汁同服(影响地平代谢); ③有首过效应(除尼索地平外)。

2. 硝苯地平: 对称结构的二氢吡啶类药物, 4 位无手性碳。用于治疗冠心病, 缓解心绞痛。硝苯地平适用于各种类型的高血压。

3. 尼群地平: 4 位碳原子具手性。临床用外消旋体。本品为选择性作用于血管平滑肌的钙通道阻滞剂, 对冠状动脉选择性更强, 降压作用温和持久。

4. 非洛地平: 选择性钙离子拮抗药。不引起体位性低血压; 对心肌亦无明显抑制作用。临床用于治疗高血压, 可单用或与其他降压药合用。

5. 氨氯地平: 4 位碳原子具手性, 产生两个光学异构体, 临床用外消旋体和左旋体。生物利用度接近 100%, 吸收不受食物影响, 血药浓度稳定。

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

7. 依拉地平: 4 位为 2, 1, 3-苯并氧杂二唑。对血管的选择性高, 能舒张外周血管, 可使血压下降, 持续时间较长, 但起效较慢(2~4 周)。

【考点 71】抗心绞痛药: 其他钙通道阻滞剂 (26 年未改动)

(2016 年 A 型题, 1 分; 2018 年 A 型题, 1 分; 2019 年 X 型题, 1 分; 2023 年 A 型题, 1 分; 2025 年 B 型题, 2 分)

1. 芳烷基胺类——维拉帕米

(1) 结构: 含手性碳原子, 右旋体作用强, 现用外消旋体。

(2) 性质: 本品呈碱性, 化学稳定性好, 甲醇溶液不稳定。

(3) 代谢: 活性代谢物为 N-脱甲基化物。

2. 苯硫氮草类——地尔硫草

(1) 结构: 2 个手性, 4 个立体异构体, D-顺式异构体(2S、3S 异构体)活性最高。

(2) 代谢: 地尔硫草经肝肠循环, 主要代谢途径为脱乙酰基、N-脱甲基和 O-脱甲基化。

(3) 作用: 本品是高选择性钙离子通道阻滞剂, 具有扩张血管作用。

【考点 72】口服降糖药 (26 年未改动)

(2015 年 B 型题, 2 分; 2016 年 A 型题, 1 分; 2019 年 B 型题, 2 分; 2020 年 C 型题, 2 分; 2021 年 B 型题, 2 分; 2024 年 B 型题, 2 分; 2024 年 C 型题, 1 分; 2025 年 B 型题, 3 分)

1. 促胰岛素分泌药:

(1) 磺酰脲类: 甲苯磺丁脲(最早, 药物相互作用多, 有低血糖反应; 格列本脲(甲苯磺丁脲中脲上丁基被环己基取代, 苯环上的甲基被苯甲酰胺乙基取代; 格列吡嗪(格列本脲的苯甲酰胺基被吡嗪甲酰基取代, 降糖作用强); 格列齐特(甲苯磺丁脲中脲上丁基被八氢环戊烷并[c]吡咯环取代); 格列美脲(高效、长效)。





(2) 非磺酰脲类(餐时血糖调节剂): 瑞格列奈(氨甲酰甲基苯甲酸衍生物, 有手性碳, 临床用S-异构体, 活性强); 那格列奈(D-苯丙氨酸衍生物, 有手性, R-异构体活性强); 米格列奈(主要用于降低餐后高血糖)。

2. 胰岛素增敏剂:

(1) 双胍类: 盐酸二甲双胍(几乎全部以原型由尿排出, 肾功能损害者禁用)

(2) 噻唑烷二酮类(苯丙氨酸衍生物): 马来酸罗格列酮、盐酸吡格列酮, 其作用靶点为细胞核的过氧化物酶增殖体激活受体。

3. α -葡萄糖苷酶抑制剂: 阿卡波糖(由不饱和环己多醇, 氨基糖及2个分子右旋葡萄糖组成); 伏格列波糖(氨基糖类似物, 对小肠上皮绒毛膜刷状缘上的双糖水解酶抑制作用强); 米格列醇(α -葡萄糖苷酶强效抑制药, 葡萄糖类似物, 可显著降低HbA1c, 餐后及空腹血糖水平)。

4. 二肽基肽酶-4抑制药: 磷酸西他列汀(芳香 β -氨基酰胺衍生物); 维格列汀(含金刚烷胺片段的甘氨酸衍生物); 沙格列汀(与二甲双胍合用); 阿格列汀(生物利用度100%); 利格列汀(含黄嘌呤)。

5. 钠-葡萄糖协同转运蛋白2抑制药: 根皮苷、(第一个SGLT抑制药); 舍格列净(O-糖苷类); 瑞格列净(O-糖苷类); 达格列净(C-糖苷类); 卡格列净(C-糖苷类); 恩格列净(C-糖苷类)和伊格列净(C-糖苷类)等。

【考点73】青霉素类抗生素(26年未改动)

(2017年B型题, 1分; 2019年A型题, 1分; 2020年B型题, 2分; 2022年B型题, 1分)

1. 天然青霉素: 青霉素G/苄基青霉素——第一个临床使用的, 临床用其钠盐或钾盐。

【结构特征】含有四元的 β -内酰胺环与四氢噻唑环并合的结构, 分子张力较大; 酸或碱性条件下, β -内酰胺环发生裂解, 故青霉素不能和碱性药物(如氨基糖苷类抗生素)合用; 易水解(钠盐/钾盐粉针剂)。

【相互作用】合用丙磺舒, 青霉素增效。排泄速度降低。

【过敏反应】交叉过敏反应: 共同抗原决定簇——青霉噻唑高聚物。

【三大缺点】不耐酸(不能口服)、不耐酶、抗菌谱窄。

2. 耐酸青霉素(半合成): 非奈西林(6位侧链苯氧乙酰氨基的甲基碳上引入甲基)、阿度西林(侧链引入叠氮)。

3. 耐酶青霉素(半合成)

(1) 甲氧西林: 侧链引入二甲氧基苯, 对酸不稳定。第一个用于临床的耐酶青霉素。成人不宜口服给药。

(2) 苯唑西林: 侧链引入3-苯基-5-甲基异噁唑。耐酸, 耐酶, 可口服。

4. 广谱青霉素(半合成)

(1) 氨苄西林: 青霉素6位酰胺侧链引入苯甘氨酸, 侧链氨基有聚合反应。

(2) 阿莫西林: 氨苄西林中苯甘氨酸的苯环4位引入羟基, 口服生物利用度提高。

(3) 羧苄西林: 氨苄西林侧链氨基被羧基取代。不可口服。

(4) 磺苄西林: 氨苄西林侧链氨基被磺酸基取代。

(5) 哌拉西林: 氨苄西林侧链氨基引入哌嗪酮酸基团。

【考点74】头孢菌素类抗菌药物(26年未改动)

(2017年B型题, 2分; 2021年C型题, 1分; 2025年C型题, 1分)

1. 共性: β -内酰胺环+氢化噻嗪(3位和侧链取代基不同)





2. 结构特点: 比青霉素稳定; 对酸稳定、可口服、毒性小、与青霉素很少交叉过敏。

3. 第一代头孢: 耐青霉素酶, 不耐 β -内酰胺酶; 抗菌谱——敏感 G^+ 菌, 某些 G^- 球菌。

头孢氨苄 (苯甘氨酸侧链)、头孢唑林 (噻二唑、四氮唑)、头孢拉定

4. 第二代头孢: 对 β -内酰胺酶稳定; 抗菌谱更广——对 G^- 菌作用 >1 代, 对 G^+ 菌作用 <1 代。

头孢克洛 (C1)、头孢呋辛 (氨基甲酸酯、甲氧肟)、头孢呋辛酯 (前药)、氯碳头孢

5. 第三代头孢: 对 β -内酰胺酶高度稳定; 抗菌谱更广, 对 G^- 活性强, 对 $G^+ <1$ 代, 部分抗铜绿作用强, 用于脑膜炎。

头孢哌酮 (四氮唑、哌嗪酮酸)、头孢曲松 (三嗪、氨基噻唑、甲氧肟)、头孢泊肟酯 (前药)、头孢噻肟、头孢他啶 (乙酰氧基)、头孢克肟 (乙酸基)、拉氧头孢

6. 第四代头孢: 对 β -内酰胺酶 (尤其超广谱质粒酶及染色体酶) 稳定; 抗菌谱——对 G^+ , G^- 菌高度活性。

头孢匹罗、头孢吡肟 (季铵、氨基噻唑、甲氧肟)、头孢噻利

【考点 75】其他 β -内酰胺类抗生素 (26 年未改动)

(2015 年 B 型题, 2 分, 2015 年 C 型题, 1 分; 2019 年 A 型题, 2 分; 2021 年 B 型题, 1 分; 2023 年 B 型题, 1 分)

1. 氧青霉烷类——克拉维酸: β 内酰胺酶不可逆抑制剂 (自杀机制); 与阿莫西林配伍使增效

2. 青霉烷砜类——舒巴坦、他唑巴坦: 不可逆竞争性 β 内酰胺酶抑制剂; 舒他西林 (舒巴坦: 氨苄西林=1: 1; 可口服, 双酯前药)

3. 碳青霉烯类:

(1) 亚胺培南: 合用西司他丁钠-肾肽酶抑制剂。

(2) 美罗培南: 对肾肽酶稳定, 作用强。

(3) 其他: 比阿培南、厄他培南

4. 单环 β -内酰胺类——氨曲南: 全合成, 单环不稳定

【考点 76】合成抗菌药 (26 年未改动)

(2015 年 C 型题, 1 分; 2017 年 B 型题, 2 分; 2018 年 A 型题, 1 分; 2021 年 B 型题, 2 分; 2023 年 B 型题, 1 分; 2024 年 A 型题, 1 分; 2024 年 X 型题, 1 分)

1. 喹诺酮类抗菌药

(1) 1 位-乙基: 诺氟沙星 (第一个引入 F-6 位)、洛美沙星、依诺沙星 (8 位 N)。

(2) 1 位-环丙基: 环丙沙星、莫西沙星 (8-甲氧基喹诺酮类抗菌药)、司帕沙星、加替沙星。

(3) 5-氨基: 司帕沙星。

(4) 8-甲氧基: 莫西沙星、加替沙星。

(5) 8-F 原子: 洛美沙星、司帕沙星。

(6) 1, 8 位噁嗪环: 左氧氟沙星 (水溶性好, 毒性最小)。

2. 磺胺类抗菌药 (作用机制: 抑制细菌的二氢蝶酸合成酶)

(1) 磺胺甲噁唑: 新诺明 (SMZ), 复方新诺明 SMZ: TMP=5: 1。

(2) 磺胺嘧啶: 流脑首选, 磺胺嘧啶银可防治重度烧伤感染。

(3) 甲氧苄啶: TMP, 二氢叶酸还原酶抑制剂, 抗菌增效剂。

3. 抗真菌药

(1) 多烯类: 制霉菌素 A1、那他霉素、两性霉素 B (氨基和羧基, 酸碱两性; 最常用)、哈霉素、曲古霉素





(2) 唑类(咪唑或三氮唑): 酮康唑(乙酰哌嗪和缩酮)、伏立康唑(广谱; 代谢有饱和性; 非线性药动学口服生物利用度高)、硝酸咪康唑(含 2, 4-二氯苯基; 弱碱性)、噻康唑(广谱; 栓剂和软膏剂)、氟康唑(含 2 个弱碱性的三氮唑环和亲脂性的 2, 4-二氯苯基; 深部真菌首选)、伊曲康唑(含 1, 2, 4-三氮唑和 1, 3, 4-三氮唑)、泊沙康唑

(3) 其他: ①烯丙胺类(特异性抑制角鲨烯环氧化酶): 萘替芬(高广谱抗菌活性)、特比萘芬(乙炔基); ②苯甲胺类(抑制角鲨烯环氧化酶): 布替萘芬(抗菌谱广; 滞留时间长; 安全有效); ③棘白菌素类(天然/半合成脂肽): 卡泊芬净、米卡芬净、阿尼芬净; 嘧啶类: 氟胞嘧啶

【考点 77】抗病毒药的分类 (26 年未改动)

(2015 年 B 型题, 1 分, 2015 年 X 型题, 1 分; 2016 年 B 型题, 2 分; 2017 年 A 型题, 1 分; 2018 年 A 型题, 2 分; 2022 年 A 型题, 1 分; 2023 年 B 型题, 1 分; 2023 年 C 型题, 1 分; 2024 年 B 型题, 1 分; 2025 年 A 型题, 1 分)

1. 抗非逆转录病毒药

(1) 干扰病毒核酸复制药

①开环核苷类抗病毒药物: 阿昔洛韦(开环鸟苷类似物)、更昔洛韦(比阿昔洛韦多 1 个羟甲基)、喷昔洛韦(更昔洛韦的生物电子等排衍生物)、泛昔洛韦(喷昔洛韦的前药)、伐昔洛韦(阿昔洛韦的前药; 体内分解成 L-缬氨酸和阿昔洛韦)、6-脱氧阿昔洛韦(阿昔洛韦前药)、替诺福韦酯(替诺福韦的磷酸酯类前药)、阿德福韦酯(阿德福韦的磷酸酯类前药)。

②非核苷类抗病毒药: 利巴韦林(广谱抗病毒药)。

(2) 干扰病毒进入宿主细胞和病毒释放的药物

①金刚烷胺类药: 盐酸金刚烷胺(对称的包含三环癸烷; M_2 蛋白抑制药)、盐酸金刚乙胺(抗 A 型流感病毒活性强; 中枢神经副作用低)。

②干扰素: α -干扰素(人白细胞干扰素)、 β -干扰素(人成纤维母细胞干扰素)

③奥司他韦(流感病毒的神经氨酸酶抑制药)。

2. 抗逆转录病毒药

(1) 核苷类逆转录酶抑制药: 齐夫多定(叠氮胸苷; 抗逆转录酶病毒药)、司他夫定(不饱和的胸苷衍生物; 对酸稳定, 口服吸收好)、拉米夫定(双脱氧硫代胞苷化合物)、恩曲他滨、扎西他滨、去羟肌苷(嘌呤核苷类衍生物)。

(2) 非核苷类逆转录酶抑制药: 奈韦拉平(专一性 HIV-1 非核苷类逆转录酶抑制药)、依法韦伦(非竞争性抑制 HIV-1 逆转录酶)、地拉韦定(双芳杂环取代的哌嗪类化合物)。

(3) HIV 蛋白酶抑制药: 沙奎那韦(第一个上市)、利托那韦。

【考点 78】烷化剂类抗肿瘤药 (26 年未改动)

(2017 年 B 型题, 1 分; 2018 年 X 型题, 1 分; 2021 年 A 型题, 1 分。)

1. 氮芥类: 环磷酰胺(氮芥的氮上连有吸电子的环状磷酰胺内酯)、异环磷酰胺(前药, 与尿路保护剂美司钠合用)

环磷酰胺的作用: ①是前药, 磷酰基强吸电子, 烷基化能力降低, 因而毒性降低; ②体外无效, 进入体内在肝脏被氧化代谢活化; ③在正常组织, 酶促氧化, 成无毒羧酸物。在肿瘤细胞缺乏正常组织的酶, 非酶促反应, 生成丙烯醛和磷酰氮芥, 后者生成去甲氮芥, 均是强烷化剂。

2. 亚硝基脲类: 卡莫司汀(β -氯乙基亚硝基脲; 周期非特异性药, 无完全交叉耐药; 脂溶性高, 可透过血-脑屏障)、洛莫司汀(环己烷)、司莫司汀(抗肿瘤疗效优于卡莫司汀和洛莫司汀, 毒性较低)





3. 金属铂配合物：顺铂（二氯二氨合铂，是顺式体，反式无效；顺铂的水溶性差，仅注射给药；有严重的肾脏、胃肠道毒性、耳毒性及神经毒性）、卡铂（含环丁烷二羧酸；第二代铂配合物）、奥沙利铂（草酸根（1R, 2R-环己二胺）合铂，手性铂配合物；第一个显现对结肠癌有效的铂类烷化剂）。

【考点 79】天然产物类抗肿瘤药（26 年未改动）

（2016 年 C 型题，1 分；2018 年 C 型题，2 分；2019 年 A 型题，1 分；2021 年 A 型题，1 分；2025 年 A 型题，2 分；2025 年 B 型题，1 分）

1. 紫杉烷类：

（1）紫杉醇：从红豆杉树皮提取得到的一个具有紫杉烯环的二萜类化合物，属有丝分裂抑制剂或纺锤体毒素。紫杉醇由于水溶性小，其注射剂通常加入表面活性剂。如聚环氧化蓖麻油等助溶，常会引起血管舒张，血压降低及过敏反应等副作用。本品为广谱抗肿瘤药物，主要用于治疗卵巢癌、乳腺癌及非小细胞肺癌，是治疗难治性卵巢癌及乳腺癌的有效药物之一。

（2）多西他赛：由 10-去乙酰基紫杉素进行半合成得到的紫杉烷类抗肿瘤药物。水溶性比紫杉醇好，毒性较小，但抗肿瘤谱更广。

（3）卡巴他赛：多烯他赛结构的 C10 位和 C7 位进行双甲基化得到的药物。用于治疗激素难治性前列腺癌。卡巴他赛的活性脱甲基衍生物、多西紫杉醇。主要用于前列腺癌。

2. 喜树碱类

（1）喜树碱：从中国特有珙桐科植物喜树中分离得到含五个稠和环的内酯生物碱。不溶于水，也几乎不溶于有机溶剂。有较强的细胞毒性，对消化道肿瘤（如胃癌、结肠直肠癌）、肝癌、膀胱癌和白血病等恶性肿瘤有较好的疗效。但毒性比较大，主要为尿频、尿痛和尿血等。

（2）羟基喜树碱：不溶于水，微溶于有机溶剂。

（3）伊立替康：前药。主要副作用是中性白细胞减少和腹泻。

（4）拓扑替康：主要用于转移性卵巢癌的治疗。

3. 鬼臼毒素类：依托泊苷（细胞周期特异性抗肿瘤药物；水溶性差，毒性较低；小细胞肺癌化疗首选药物）、依托泊苷磷酸酯（前药）、替尼泊苷（脂溶性高，可透过血-脑屏障，为脑瘤首选药）。

4. 抗肿瘤抗生素类

多柔比星（阿霉素）：蒽环糖苷抗生素。临床用其盐酸盐。由于共轭蒽醌结构，为桔红色针状结晶。易溶于水，水溶液稳定，在碱性条件下易迅速分解。本品为广谱的抗肿瘤药物。不良反应主要为骨髓抑制和心脏毒性。

【考点 80】靶向抗肿瘤药和放疗与化疗的止吐药（26 年未改动）

（2019 年 A 型题，1 分；2020 年 A 型题，1 分；2020 年 B 型题，3 分；2020 年 X 型题，1 分；2022 年 A 型题，1 分；2024 年 A 型题，1 分；2025 年 B 型题，1 分）

1. 靶向抗肿瘤药（酪氨酸激酶抑制剂）：甲磺酸伊马替尼（第一个上市）尼洛替尼、达沙替尼、吉非替尼（第一个选择性表皮生长因子受体酪氨酸激酶抑制剂）、厄洛替尼、奥希替尼（第三代口服、不可逆的选择性 EGFR 突变抑制剂）、舒尼替尼、索拉非尼（口服的、作用于多个激酶靶点的抗肿瘤药）、阿帕替尼（晚期胃癌治疗）、克唑替尼（ALK 阳性的转移性非小细胞肺癌的治疗）、埃克替尼（局部晚期或转移非小细胞肺癌治疗）。

2. 放疗与化疗的止吐药：盐酸昂丹司琼：（含吡唑酮+2-甲基咪唑；无锥体外系副作用，毒副作用极小；临床用外消旋体）；格拉司琼（含咪唑环+含氮双环；剂量小，半衰期较长，每日仅注射一次）；盐酸托烷司琼（含咪唑环+托品醇；高效预防癌症化疗的呕吐）；盐酸帕洛诺司琼（含苯异喹啉+手性氮杂双环；止吐作用强、作用时间长、用量小、不良反应少）；盐酸阿扎司琼（含 1,4-苯丙噁嗪+氮杂





双环；与碱性注射液或依托泊苷注射液配伍发生浑浊或结晶析出）。

【考点 81】四环素类抗生素（26 年未改动）

四环素类抗生素是由放线菌产生以氢化并四苯为基本骨架的一类广谱抗生素。天然的四环素类药有金霉素、土霉素和四环素。

四环素类抗生素能与细菌 70S 核糖体中的 30S 亚单位上的 A 位特异结合，阻止氨基酰基 tRNA 进入该位而阻断蛋白质合成；同时可使细菌细胞膜通透性增大，导致细胞内容物外漏，使之生存受到抑制。

四环素类抗生素结构中都含有酸性的酚羟基和烯醇羟基及碱性的二甲氨基。在酸性及碱性条件均不稳定，可生成脱水产物、差向异构体、内酯结构异构体的抗菌活性均减弱或消失。

四环素类药能与多种金属离子形成不溶性螯合物。和钙离子形成的螯合物呈黄色，可沉积在骨骼和牙齿上，儿童服用会发生牙齿变黄，妊娠期妇女服用后其产儿可能发生牙齿变色、骨骼生长抑制。

代表药物：盐酸多西环素、盐酸美他环素、盐酸米诺环素。

【考点 82】口服固体制剂的常用辅料（26 年微调）

（2015 年 B 型题，2 分；2016 年 A 型题，1 分；2017 年 B 型题，1 分；2018 年 X 型题，1 分；2019 年 B 型题，1 分；2020 年 A 型题，1 分；2020 年 B 型题，1 分；2021 年 B 型题，3 分；2022 年 B 型题，2 分；2024 年 X 型题，1 分）

1. 稀释剂（填充剂）：淀粉（玉米淀粉最常用）、乳糖（性能优良）、糊精（多与淀粉、蔗糖等合用）、蔗糖（吸湿性强）、预胶化淀粉（可压性淀粉）、微晶纤维素（MCC，干粘合剂）、无机盐类（磷酸氢钙、碳酸钙、硫酸钙）、甘露醇（兼有矫味作用）等。

2. 润湿剂：纯化水、乙醇及不同比例的纯化水乙醇混合溶剂。

3. 黏合剂：淀粉浆（最常用）、甲基纤维素（MC，水溶性好）、羟丙纤维素（HPC，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，适于可压性较差的药）、乙基纤维素（EC，不溶于水但溶于乙醇）、聚维酮（PVP，吸湿性强）、明胶（用于口含片）、聚乙二醇（PEG）等。

4. 崩解剂：干淀粉（水不溶性或微溶性药）、羧甲淀粉钠（CMS-Na，高效崩解剂）、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（碳酸氢钠和枸橼酸组成的混合物）等。缓释片、控释片、口含片、咀嚼片、舌下片不需加入崩解剂。

5. 润滑剂：①疏水性润滑剂：硬脂酸镁（MS）：量大影响崩解或裂片。②水溶性润滑剂：聚乙二醇类与十二烷基硫酸钠。③助流剂：微粉硅胶（粉末直接压片的助流剂）、滑石粉（抗黏剂）、氢化植物油（润滑性能良好的润滑剂）。

6. 其他辅料：①着色剂：主要用于改善片剂的外观，使其便于识别。常用色素应符合药用规格。

②芳香剂包括各种芳香油、香精等。③甜味剂包括阿司帕坦、蔗糖等。

【考点 83】口服片剂的分类（26 年微调）

（2019 年 C 型题，2 分；2017 年 C 型题，1 分；2015 年 B 型题，1 分；2020 年 A 型题，1 分；2023 年 B 型题，1 分，2023 年 C 型题，1 分）

1. 普通片：即普通压制片，是指将药物与辅料混合压制而成，一般用水吞服，应用最广。一般未包衣的片剂多属此类。

2. 口崩片：系指在口腔内不需要用水即能迅速崩解或溶解的片剂。一般由直接压片和冷冻干燥法制备，由冷冻干燥法制备的口腔崩解片称口服冻干片。

3. 分散片：系指在水中能迅速崩解并均匀分散的片剂，分散片中的药物应是难溶性的，分散片可





加水分散后口服，也可将分散片含于口中吮服或吞服。

4. 泡腾片：系指含有碳酸氢钠和有机酸，遇水可产生气体而呈泡腾状的片剂。泡腾片中的药物应是易溶性的，加水产生气泡后应能溶解。有机酸一般用枸橼酸、酒石酸、富马酸等。

5. 可溶片：系指临用前能溶解于水的非包衣片或薄膜包衣片剂。可溶片应溶解于水中。溶液可呈轻微乳光。

6. 咀嚼片：系指于口腔中咀嚼后吞服的片剂。咀嚼片一般应选择甘露醇、山梨醇、蔗糖等水溶性辅料作填充剂和黏合剂。咀嚼片的硬度应适宜。

7. 多层片：由两层或多层（配方或色泽不同）组成的片剂，制成多层片的目的是避免各层药物的接触，减少配伍变化，调节各层药物释放、作用时间等，也有改善外观的作用。上下分层或里外分层。

8. 肠溶片：指用肠溶性包衣材料进行包衣的片剂。为防止药物在胃内分解失效、对胃的刺激或控制药物在肠道内定位释放，可对片剂包肠溶衣；为治疗结肠部位疾病等，可对片剂包结肠定位肠溶衣。

9. 缓释片：系指在规定的释放介质中缓慢地非恒速释放药物的片剂。与相应的普通片剂相比，具有服药次数少、作用时间长、不良反应少的特点。

10. 控释片：系指在规定的释放介质中缓慢地恒速释放药物的片剂。与相应的缓释片相比，血药浓度更加平稳。

【考点 84】片剂的质量要求（26 年微调）

（2016 年 B 型题，3 分；2018 年 B 型题，2 分；2022 年 B 型题，2 分；2023 年 B 型题，3 分）

1. 硬度适中，一般认为普通片剂的硬度在 50N 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。（1）平均重量 $< 0.30\text{g}$ ，其差异限度为 $\pm 7.5\%$ 。（2）平均重量 $\geq 0.30\text{g}$ ，其差异限度为 $\pm 5.0\%$ 。
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 分钟；分散片、可溶片为 3 分钟；舌下片、泡腾片为 5 分钟；含片为 10 分钟；糖衣片为 60 分钟；咀嚼片不进行崩解时限检查；薄膜衣片为 30 分钟；肠溶片要求在盐酸溶液中 2 小时内不得有裂缝、崩解或软化现象，在 pH6~8 磷酸盐缓冲液中 1 小时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。

【考点 85】薄膜包衣材料（26 年未改动）

（2015 年 B 型题，2 分；2020 年 B 型题，1 分。）

1. 薄膜包衣材料：

- （1）胃溶型：HPMC、HPC、PVP、丙烯酸树脂 IV 号、AEA。
- （2）肠溶型：丙烯酸树脂类（I、II、III 类）、CAP、HPMCP、虫胶。
- （3）水不溶型：EC、醋酸纤维素。

2. 增塑剂：

- （1）水溶性：丙二醇、甘油（丙三醇）、聚乙二醇。
- （2）非水溶性：甘油三醋酸酯、邻苯二甲酸酯、乙酰化甘油酸酯。

3. 致孔剂：蔗糖、NaCl、PEG、表面活性剂。

4. 着色剂：水溶性/水不溶性色素、色淀。

5. 遮光剂：二氧化钛。





【考点 86】口服液体制剂的分类 (26 年未改动)

(2015 年 X 型题, 1 分; 2017 年 A 型题, 1 分; 2023 年 A 型题, 1 分)

1. 均相分散系统: 药物以分子或离子状态分散, 如低分子溶液剂、高分子溶液剂。
2. 非均相分散系统: 药物以微粒、小液滴、胶粒分散, 如溶胶剂、乳剂、混悬剂。

【考点 87】口服液体制剂的附加剂 (26 年未改动)

(2015 年 B 型题, 3 分; 2016 年 A 型题, 1 分, 2016 年 B 型题, 3 分; 2018 年 A 型题, 1 分; 2019 年 B 型题, 3 分; 2021 年 A 型题, 1 分; 2021 年 B 型题, 1 分; 2022 年 C 型题, 1 分; 2023 年 B 型题, 3 分; 2024 年 B 型题, 3 分; 2025 年 A 型题, 1 分)

1. 增溶剂: 增溶是指难溶性药物在表面活性剂的作用下, 在溶剂中增加溶解度并形成溶液的过程。以水为溶剂的液体制剂, 增溶剂的最适 HLB 值为 15-18, 常用增溶剂为聚山梨酯类、聚氧乙烯脂肪酯类等。

2. 助溶剂: 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。

3. 潜溶剂: 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。

4. 防腐剂: 常见的有苯甲酸与苯甲酸钠、**羟苯酯类** (尼泊金类)、山梨酸与山梨酸钾、苯扎溴铵 (新洁而灭) 等。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。

5. 矫味剂: ①甜味剂 (合成甜味剂糖精钠、阿司帕坦); ②芳香剂; ③胶浆剂, 如阿拉伯胶; ④泡腾剂。

6. 着色剂: ①天然色素: 常用的有植物性和矿物性色素。植物性色素有: 甜菜红、胡萝卜素焦糖 (棕色)、氧化铁 (棕红色) 等。②合成色素有: 苋菜红、柠檬黄、胭脂红、胭脂蓝和日落黄等。

【考点 88】表面活性剂的毒性 (26 年未改动)

(2017 年 X 型题, 1 分; 2019 年 B 型题, 2 分; 2023 年 A 型题, 1 分; 2024 年 A 型题, 1 分)

1. 毒性顺序: 阳 > 阴 > 非离子表面活性剂。毒性和刺激性: 两性 < 阳离子表面活性剂。

2. 溶血作用顺序: 聚氧乙烯烷基醚 > 聚氧乙烯芳基醚 > 聚氧乙烯脂肪酯 > 吐温 20 > 吐温 60 > 吐温 40 > 吐温 80。

【考点 89】表面活性剂的应用 (26 年未改动)

(2020 年 A 型题, 1 分。)

1. 增溶剂: 难溶性维生素、甾体激素、挥发油加表面活性剂 (HLB 15~18), 提高药物的溶解度。
2. 乳化剂: HLB 3~8 作 W/O 型乳化剂; HLB 8~16 作 O/W 型乳化剂。
3. 润湿剂: 最适 HLB 7~9。

【考点 90】混悬剂常用稳定剂 (26 年未改动)

(2017 年 B 型题, 3 分; 2018 年 X 型题, 1 分; 2020 年 B 型题, 1 分; 2021 年 A 型题, 1 分; 2022 年 A 型题, 1 分; 2023 年 B 型题, 2 分; 2024 年 X 型题, 1 分)

1. 润湿剂: 指能增加疏水性药物微粒被水润湿能力的附加剂。常用润湿剂是 HLB 值在 7-11 之间的表面活性剂, 如泊洛沙姆、磷脂类、聚山梨酯类、脂肪酸山梨坦类。

2. 助悬剂: 指能增加混悬剂中分散介质的黏度, 降低药物微粒的沉降速度或增加微粒亲水性的附加剂。





(1) 低分子助悬剂: 甘油、糖浆等。

(2) 高分子助悬剂: ①天然高分子: 琼脂、果胶、白芨胶、西黄蓍胶、阿拉伯胶、海藻酸钠等。

②合成或半合成高分子: 纤维素类, 如甲基纤维素、羟丙基甲基纤维素、羧甲基纤维素钠、聚乙烯醇、聚维酮等。

3. 絮凝剂与反絮凝剂: 酒石酸盐、酒石酸氢盐、枸橼酸盐、枸橼酸氢盐、磷酸盐和氯化物(如三氯化铝)等, 既可作絮凝剂亦可作反絮凝剂。通常阴离子的絮凝作用大于阳离子, 离子的价数越高, 絮凝、反絮凝作用越强。

【考点 91】乳剂的不稳定表现 (26 年未改动)

(2016 年 B 型题, 2 分; 2020 年 X 型题, 1 分; 2022 年 A 型题, 1 分)

1. 分层(乳析): 指乳剂放置后出现分散相粒子上浮或下沉的现象。分层的乳剂经振摇可重新分散。

原因: 分散相和分散介质之间的密度差引起的。

2. 絮凝: 乳剂中的乳滴由于某些因素的作用使其荷电减少, ζ 电位降低, 发生可逆的聚集称为絮凝。絮凝状态有利于乳剂的稳定, 是可逆的。

原因: 电解质、离子型乳化剂, 黏度、相体积比及流变性。

3. 转相: 由于某些条件的变化而改变乳剂类型的现象。由 O/W 型转变成 W/O 型或发生相反的变化。

原因: 乳化剂性质的改变或添加了相反类型乳化剂。

4. 合并与破裂: 乳剂中乳滴周围的乳化膜破坏导致乳滴合并变大, 称为合并; 乳滴合并进而产生油、水分离的现象, 为乳剂的破裂(不可逆)。

破裂的原因: ①微生物的污染; ②温度过高或过低, 如温度高于 70℃, 或降至冷冻温度, 许多乳剂可能会破裂; ③加入可与乳化剂发生作用的物质, 引起乳化剂性质变化。

5. 酸败: 受外界因素及微生物的影响使油相或乳化剂变质的现象。措施: 加入抗氧化剂与防腐剂。

【考点 92】注射剂的溶剂 (26 年未改动)

(2016 年 B 型题, 3 分; 2017 年 B 型题, 2 分; 2019 年 B 型题, 2 分; 2021 年 A 型题, 1 分; 2024 年 B 型题, 1 分)

1. 制药用水

《中国药典》所收载的制药用水分为饮用水、纯化水、注射用水和灭菌注射用水。制药用水的原水通常为饮用水(天然水经净化处理所得的水, 除另有规定, 可作为饮片的提取溶剂)。

(1) 纯化水: 纯化水为饮用水经蒸馏法、离子交换法、反渗透法或其他方法制得的制药用水, 不含任何附加剂。可作为配制普通药物制剂的溶剂或试验用水, 口服、外用制剂配制用溶剂或稀释剂。

(2) 注射用水: 为纯化水经蒸馏所得的水, 是最常用的注射用溶剂。注射用水可作为注射剂、滴眼剂等的溶剂或稀释剂及容器的清洗溶剂。

(3) 灭菌注射用水: 为注射用水按照注射剂生产工艺制备所得, 不含任何添加剂。主要用于注射用灭菌粉末的溶剂或注射剂的稀释剂。

注射用水的质量要求: 除一般蒸馏水的检查项目, 如 pH、氯化物、氨、硫酸盐与钙盐、硝酸盐与亚硝酸盐、易氧化物、二氧化碳、不挥发物及重金属应符合规定外, 还必须通过细菌内毒素(热原)检查 and 无菌检查。

2. 注射用油: 常用大豆油、茶油、麻油等植物油。

3. 其他注射用溶剂: ①乙醇: 可供肌内与静脉注射, 浓度不超过 10%; ②丙二醇(PG): 可供肌内与静脉注射, 常与水制成复合溶剂, 常用浓度为 10%~60%; ③聚乙二醇(PEG): PEG300、PEG400 均





可用作注射用溶剂；④甘油：可供肌内与静脉注射，浓度一般为 1%~50%。不单独作注射剂溶剂用。

【考点 93】注射剂的附加剂（26 年未改动）

（2015 年 B 型题，2 分；2016 年 B 型题，3 分；2017 年 B 型题，2 分；2018 年 B 型题，3 分；2020 年 A 型题，1 分；2021 年 A 型题，1 分；2024 年 A 型题，1 分）

1. 缓冲剂：醋酸-醋酸钠、酒石酸-酒石酸钠、枸橼酸-枸橼酸钠、乳酸。
2. 增溶剂、润湿剂、乳化剂：聚山梨酯类 80（吐温 80）、聚乙烯吡咯烷酮（聚维酮 PVP）、泊洛沙姆（普朗尼克）、卵磷脂、脱氧胆酸钠等。泊洛沙姆、卵磷脂用于静脉注射。
3. 助悬剂：羧甲基纤维素（CMC）、明胶、甲基纤维素等。
4. 金属螯合剂：乙二胺四乙酸二钠（EDTA·2Na）。
5. 抗氧化剂：亚硫酸氢钠、焦亚硫酸钠（用于酸性）；亚硫酸钠、硫代硫酸钠（用于碱性）。
6. 抑菌剂：三氯叔丁醇、尼泊金、硝酸苯汞、苯酚、甲酚、氯甲酚。
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。

【考点 94】热原（内毒素=热原=脂多糖，G 杆菌热原致热力最强）（26 年未改动）

（2019 年 A 型题，1 分；2020 年 X 型题，1 分；2025 年 A 型题，1 分）

1. 性质：①水溶性；②不挥发性：蒸馏水器上需附隔沫装置；③耐热性：180~200℃（2h）、250℃（30~45min）、650℃（1min）；④过滤性：体积 1~5nm 可滤过；⑤被强酸、强碱、强氧化剂、超声波破坏；可被活性炭、离子交换树脂吸附。
2. 污染途径：溶剂带入（主要途径）；原辅料带入；容器或用具带入；制备过程带入；使用过程带入。
3. 热原的除去方法：（1）除去药液或溶剂中热原的方法：①吸附法（活性炭）；②离子交换法；③凝胶滤过法（分子筛滤过法）；④超滤法（3~15nm 超滤膜）；⑤反渗透法（三醋酸纤维膜、聚酰胺膜）；⑥其他方法：采用两次以上湿热灭菌法，或提高灭菌温度和时间。（2）除去容器或用具上热原的方法：①高温法（180℃2h 或 250℃30min）；②酸碱法：重铬酸钾硫酸洗液、稀 NaOH。

【考点 95】常见新型脂质体（26 年微调）

（2016 年 B 型题，2 分，2016 年 C 型题，1 分；2018 年 A 型题，1 分；2022 年 B 型题，3 分；2024 年 A 型题，1 分；2025 年 A 型题，1 分）

1. **前体脂质体**：将脂质吸附在极细的水溶性载体如氯化钠、山梨醇等聚合糖类（增加脂质分散面积）制成前体脂质体，遇水时脂质溶胀，载体溶解形成多层脂质体。
2. **长循环脂质体**：PEG 修饰可增加脂质体的柔顺性和亲水性，从而降低与单核巨噬细胞的亲和力，延长循环时间。
3. **免疫脂质体**：脂质体表面联接抗体，对靶细胞进行识别，提高脂质体的靶向性。
4. **热敏脂质体**：利用在相变温度时，脂质体的类脂质双分子层膜从胶态过渡到晶态，脂质膜的通透性增加，药物释放速度增大的原理制成热敏脂质体。
5. **pH 敏感性脂质体**：由于肿瘤间质的 pH 比周围正常组织细胞的 pH 值低，选用对 pH 敏感的一类脂材料为膜材制备成载药脂质体。

【考点 96】脂质体的特点与质量要求（26 年未改动）

（2015 年 A 型题，1 分，2015 年 B 型题，3 分；2016 年 C 型题，1 分；2019 年 A 型题，1 分；2020





年 X 型题, 1 分; 2022 年 A 型题, 1 分)

1. 脂质体的特点: 靶向性和淋巴定向性、细胞亲和性和组织相容性、降低药物的毒性。

2. 脂质体的质量要求:

(1) 形态、粒径及其分布: 注射给药脂质体的粒径应小于 200nm, 且分布均匀, 呈正态性, 跨距宜小。

(2) **包封率**=[脂质体中的药量/(介质中的药量+脂质体中的药量)]×100%, 不得低于 80%。

(3) **载药量**的大小直接影响到药物的临床应用剂量, 故载药量愈大, 愈易满足临床需要。载药量与药物的性质有关, 通常亲脂性药物或亲水性药物较易制成脂质体。载药量=[脂质体中药物量/(脂质体中的药量+载体总量)]×100%。

(4) 脂质体的稳定性:

1) 物理稳定性: 主要用渗漏率表示, 即在贮存期间脂质体的包封率变化情况。

渗漏率=(贮存后渗漏到介质中的药量/贮存前包封的药量)×100%

2) 化学稳定性: ①磷脂氧化指数: 氧化指数= $A_{233\text{nm}}/A_{215\text{nm}}$, 一般规定磷脂氧化指数应小于 0.2; ②磷脂量的测定: 基于每个磷脂分子中仅含 1 个磷元素, 采用化学法将样品中磷脂转变为无机磷后测定磷摩尔量(或重量), 即可推算出磷脂量; ③防止氧化的措施: 充入氮气, 添加抗氧剂, 采用氢化饱和磷脂。

【考点 97】气雾剂的特点与质量要求 (26 年未改动)

(2018 年 A 型题, 1 分; 2020 年 A 型题, 1 分; 2021 年 A 型题, 1 分; 2025 年 C 型题, 1 分)

1. 特点:

(1) 优点: ①简洁、便携、耐用、方便、多剂量; ②比雾化器容易准备, 治疗时间短, 吸收迅速, 无首过消除; ③良好的剂量均一性; ④气溶胶形成与患者的吸入行为无关; ⑤所有 MDIs 的操作和吸入方法相似; ⑥高压下的内容物可防止病原体侵入。

(2) 缺点: ①若患者无法正确使用, 就会造成肺部剂量较低和/或不均一; ②通常不是呼吸触动, 即使吸入技术良好, 肺部沉积量通常较低; ③阀门系统对药物剂量有所限制, 无法递送大剂量药物; ④大多数现有的 MDIs 没有剂量计数器。

2. 质量要求:

(1) 无毒性、无刺激性。

(2) 抛射剂为适宜的低沸点液体。

(3) 定量气雾剂释出的主药含量应准确、均一, 喷出的雾滴(粒)应均匀。

(4) 制成的气雾剂应进行泄漏检查, 确保使用安全。

(5) 烧伤、创伤、溃疡用气雾剂应无菌。若为非无菌制剂的, 应在标签上标明“非无菌制剂”; 产品说明书中应注明“本品为非无菌制剂”, 同时在适应证下应明确“用于程度较轻的烧伤(I°或浅II°)”; 注意事项下规定“应遵医嘱使用”。

(6) 定量气雾剂应标明: 每罐总揿次及每揿主药含量或递送剂量。

(7) 气雾剂应置凉暗处保存, 并避免暴晒、受热、敲打、撞击。

【考点 98】气雾剂的抛射剂与附加剂 (26 年未改动)

(2015 年 B 型题, 1 分; 2016 年 A 型题, 1 分; 2017 年 A 型题, 1 分; 2018 年 X 型题, 2 分; 2019 年 B 型题, 1 分; 2022 年 B 型题, 3 分; 2024 年 A 型题, 1 分; 2025 年 C 型题, 1 分)

1. 抛射剂: 是喷射药物的动力, 有时兼作药物的溶剂。

(1) 氢氟烷烃: 是目前最有应用前景的一类氯氟烷烃的替代品, 主要为 HFA-134a(四氟乙烷)和





HFA-227（七氟丙烷）。

(2) 碳氢化合物：丙烷、**正丁烷**和异丁烷。易燃、易爆，不宜单独应用，常与其他抛射剂合用。

(3) 压缩气体：二氧化碳、氮气、一氧化氮等。

2. 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。

3. 润湿剂：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**湿润剂为表面活性剂**。

【考点 99】气雾剂的临床应用与注意事项（26 年未变动）

（2015 年 B 型题，1 分；2016 年 C 型题，1 分；2018 年 A 型题，1 分。）

1. 临床应用：可用于呼吸道吸入给药，或直接喷至腔道黏膜、皮肤给药，也可用于空间消毒。

2. 注意事项

(1) 使用前应充分摇匀储药罐，使罐中药物和抛射剂充分混合。首次使用前或距上次使用超过 1 周时，先向空中试喷一次。

(2) 患者吸药前需张口、头略后仰、缓慢地呼气，直到不再有空气可以从肺中呼出。垂直握住雾化吸入器，用嘴唇包绕住吸入器口开始深而缓慢吸气并按动气阀，尽量使药物随气流方向进入支气管深部，然后闭口并屏气 10 秒钟后用鼻慢慢呼气。如需多次吸入，休息 1 分钟后重复操作。

(3) 吸入结束后用清水漱口，以清除口腔残留的药物。如使用激素类药物应刷牙，避免药物对口腔黏膜和牙齿的损伤。

(4) 气雾剂药物使用耐压容器、阀门系统，有一定的内压。抛射剂多为液化气体，在常压沸点低于室温，常温下蒸气压高于大气压。气雾剂药物遇热和受撞击有可能发生爆炸，贮存时应注意避光、避热、避冷冻、避摔碰，即使药品已用完的小罐也不可弄破、刺穿或燃烧。

【考点 100】眼用制剂的质量要求（26 年微调）

（2015 年 A 型题，1 分；2018 年 A 型题，1 分。）

1. 滴眼液中可加入调节渗透压、pH 值、黏度及增加药物溶解度和制剂稳定的辅料，所用辅料不应降低药效或产生局部刺激。

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**。混悬型滴眼剂的沉降物不应结块或聚集，经振摇应易再分散，并应检查沉降体积比。

3. 多剂量眼用制剂一般应加入适宜的抑菌剂，尽量选用安全风险小的抑菌剂，产品标签应标明抑菌剂种类和标示量。除另有规定外，在制剂确定处方时，该处方的抑菌效力应符合抑菌效力检查法。

4. 眼用半固体制剂的基质应**过滤灭菌**，不溶性药物应预先制成极细粉。眼膏剂、眼用软膏剂、眼用凝胶剂应均匀、细腻、无刺激性，并易涂抹于眼部，便于原料药物分散和吸收。除另有规定外，每个容器的装量应**不超过 5g**。

5. 眼内注射溶液、眼内插入剂、供外科手术用和急救用的眼用制剂，均不得加入抑菌剂或抗氧剂或不适当的附加剂，且应采用一次性使用包装。

6. 除另有规定外，滴眼剂每个容器的装量不得超过 10ml；洗眼剂每个容器的装量应不得超过 200ml。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遮光，启用后最多可用 **4 周**。

更多执业药师资料请添加助教老师咨询



扫码关注执业药师考试公众号



环球网校移动课堂 APP



环球网校 侵权必究



助教 1



助教 2



助教 3

