

药学专业知识（一）

内部讲义



执业药师考试研究中心◎编著

中公教育医药卫生考试研究院◎审定

本书特色

★ **名师**总结 大纲精华

★ **透彻**讲解 突出重点

★ **权威**解读 把握趋势

★ **讲练**结合 轻松过关

offcn 中公教育 | 严格依据国家执业药师资格考试新大纲编写

2015 / 新大纲

国家执业药师资格考试辅导用书

药学专业知识的(一) 内部讲义

执业药师考试研究中心◎编著
中公教育医药卫生考试研究院◎审定

世界图书出版公司

上海·西安·北京·广州

图书在版编目 (CIP) 数据

药学专业知识 (一) · 内部讲义 / 执业药师考试研究中心编著. — 上海: 上海世界图书出版公司, 2015. 7
ISBN 978-7-5100-9800-0

I. ①药… II. ①执… III. ①药理学—药剂师—资格考试—自学参考资料 IV. ①R9

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2015) 第 134187 号

责任编辑: 孙妍捷

总 策 划: 中公教育

封面设计: 中公教育图书设计中心

药学专业知识 (一) · 内部讲义

执业药师考试研究中心 编著

中公教育医药卫生考试研究院 审定

上海世界图书出版公司 出版发行

上海市广中路 88 号

邮政编码 200083

大厂回族自治县彩虹印刷有限公司

如有质量或印装问题, 请拨打售后服务电话 010-82838515

各地新华书店经销

开本: 850×1168 1/16 印张: 21 字数: 537 600

2015 年 7 月第 1 版 2015 年 7 月第 1 次印刷

ISBN 978-7-5100-9800-0/R·341

定价: 48.00 元

<http://www.wpcsh.com.cn>

<http://www.wpcsh.com>

本书编委会

刘姗姗 张 彪 王文赛

成 磊 杨佳妹 宋 新

李 直 王琳丽 唐琳俐

杨俊利 雷诚世 刘美玉

翟文君

前言

《2015执业药师资格考试新版考试大纲》对大纲结构、内容和具体能力要求方面都做了较大的修订。新大纲中,不仅使各专业知识科目的综合性大大增强,而且在具体的考试内容和要求上,加大综合知识与技能的分值比重,降低专业基础知识的比重。

同时根据《2015新大纲》的调整,执业药师具体的题型题量也做了调整,如下表。

考试科目	题量	题型	计分方式
药事管理与法规 药专业知识(一) 药专业知识(二) 药综合知识与技能 中药专业知识(一) 中药专业知识(二) 中药综合知识与技能	120题(较上版规定少20题)	A型题(最佳选择题) B型题(配伍选择题) C型题(综合分析选择题) X型题(多项选择题)	各个考试科目单独考试,单独计分,每题均为1分,满分为120分

2014年全国执业药师资格考试合格率为19.52%,2013年合格率为15.21%,五六个人参加考试只有一个人才达到合格分数线,考试难度极大。

在考试难度极高、通过率极低、考试大纲变动很大的情况下,中公教育国家执业药师考试研究中心组织众多辅导名师,根据新考试大纲和历年考试真实情况,总结考试规律和技巧,把握考试重点和难点,精准预测考试趋势,编写了这套切合考试实情、易于理解记忆、重点要点突出、包含经典习题、讲练结合快速提分的精品教材。

本书精心研发,经典权威,帮助考生学习专业知识,顺利通过考试。本书具有以下特点:

针对大纲,系统全面

中公教育执业药师考试研究中心以新考试大纲为根本依据,深入研究大纲变化和近年真题,完全覆盖考试要点。每个章节之前有知识框架或大纲要求,内容全面系统,精准预测考试趋势,使考生理解有思路,作答有依据。

双色印刷,层次分明

本书针对广大执业药师资格考试考生需求,版面设计活泼,采用双色印刷,提高阅读效果,同时彩色标注重要知识点,便于考生把握重点。内容层次分明,条理清晰,重点突出,便于考生复习,使考生记忆有方案。

目 录

第一章 药物与药专业知识	1
第一节 药物与药物命名	1
第二节 药物剂型与制剂	6
第三节 药专业知识	22
第二章 药物的结构与药物作用	28
第一节 物理化性质与药物活性	28
第二节 药物结构与药物活性	30
第三节 药物化学结构与药物代谢	42
第三章 药物固体制剂和液体制剂与临床应用	50
第一节 固体制剂	50
第二节 液体制剂	63
第四章 药物灭菌制剂和其他制剂与临床应用	83
第一节 灭菌制剂	83
第二节 其他制剂	100
第五章 药物递送系统(DDS)与临床应用	112
第一节 快速释放制剂	112
第二节 缓释、控释制剂	119
第三节 靶向制剂	125
第六章 生物药剂学	136
第一节 药物体内过程基础知识	136
第二节 药物的胃肠道吸收	138
第三节 药物的非胃肠道吸收	142
第四节 药物的分布、代谢和排泄	148
第七章 药效学	154
第一节 药物的基本作用	154
第二节 药物的剂量与效应关系	155
第三节 药物的作用机制与受体	158
第四节 影响药物作用的因素	164
第五节 药物相互作用	166

第八章 药品不良反应与药物滥用监控	174
第一节 药品不良反应的定义和分类	174
第二节 药品不良反应因果关系评定依据及评定方法	181
第三节 药物警戒	184
第四节 药源性疾病	186
第五节 药物流行病学在药品不良反应监测中的作用	192
第六节 药物滥用与药物依赖性	194
第九章 药物的体内动力学过程	201
第一节 药动学参数及其临床意义	201
第二节 单室模型静脉注射给药	203
第三节 单室模型静脉滴注给药	205
第四节 单室模型血管外给药	206
第五节 双室模型给药	207
第六节 多剂量给药	209
第七节 非线性药动学	211
第八节 统计矩分析在药动学中的应用	213
第九节 给药方案设计与个体化给药	214
第十节 生物利用度与生物等效性	217
第十章 药品质量与药品标准	221
第一节 药品标准与药典	221
第二节 药品质量检验与体内药物检测	230
第十一章 常用药物的结构特征与作用	245
第一节 精神与中枢神经系统疾病用药	245
第二节 解热、镇痛、抗炎药及抗痛风药	254
第三节 呼吸系统疾病用药	258
第四节 消化系统疾病用药	262
第五节 循环系统疾病用药	265
第六节 内分泌系统疾病用药	277
第七节 抗菌药物	285
第八节 抗病毒药	297
第九节 抗肿瘤药	299
中国医考网 2015 年执业药师考试辅导课程简章	309
中公教育·全国分校一览表	314

第一章

药物与药理学专业知识

知识框架



第一节 药物与药物命名

一、药物的来源与分类

药物是指可以改变或查明机体的生理功能及病理状态,用以预防、治疗和诊断疾病的物质。我们通常说的药品,是指用于预防、治疗、诊断人的疾病,有目的地调节人的生理功能并规定有适应证或者功能主治、用法和用量的物质,包括中药材、中药饮片、中成药、化学原料及其制剂、抗生素、生化药品、放射性药品、血清、疫苗、血液制品和诊断药品等。

(一) 化学合成药物

化学合成药物是指通过化学合成方法得到的小分子的有机或无机药物。这些药物都具有确定的化学结构和明确的药物作用和机制。

(二) 来源于天然产物的药物

来源于天然产物的药物是指从天然产物中提取得到的有效单体、通过发酵方法得到的抗生素

以及半合成得到的天然药物和半合成抗生素。这些药物中,有些是直接从天然的植物,如草、叶、根、茎、皮等中提取得到的天然活性物质;有的是通过生物发酵得到的抗生素;但有很大一部分是以天然活性物质或抗生素为原料通过化学半合成或生物合成的方法得到的半合成天然药物或半合成抗生素。

(三) 生物技术药物

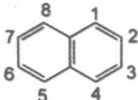
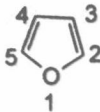
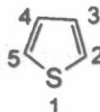
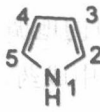
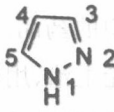
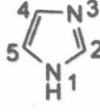
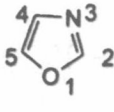
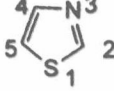
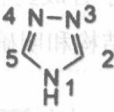
生物技术药物是指所有以生物物质为原料的各种生物活性物质及其人工合成类似物,以及通过现代生物技术制得的药物。包括细胞因子、重组蛋白质药物、抗体、疫苗和寡核苷酸药物等。

二、药物的结构与命名

(一) 药物常见的化学结构及名称

化学药物大都是有机化合物,在其结构中存在基本骨架和化学官能团。其基本骨架主要包括两类:一类是只含有碳氢原子的脂肪烃环、芳烃环,另一类是除含有碳氢原子外,还含有氮、氧、硫等杂原子的杂环。药物结构中常见的化学骨架及名称见表1-1。

表 1-1 药物结构中常见的化学骨架及名称

名称	化学结构及编号	名称	化学结构及编号
环戊烷		环己烷	
苯		萘	
呋喃		噻吩	
吡咯		吡唑	
咪唑		噁唑	
噻唑		三氮唑 (1, 3, 4-三氮唑)	

续表

名称	化学结构及编号	名称	化学结构及编号
四氮唑 (1, 2, 3, 4, 四氮唑)		哌啶	
哌嗪		吡啶	
哒嗪		嘧啶	
吡嗪		茛	
吡啶		茛	
喹啉		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	

续表

名称	化学结构及编号	名称	化学结构及编号
胸腺嘧啶		胞嘧啶	
腺嘌呤		鸟嘌呤	
雌甾烷		雄甾烷	
孕甾烷			

(二)常见的药物命名

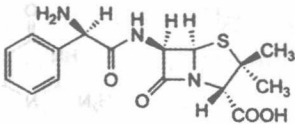
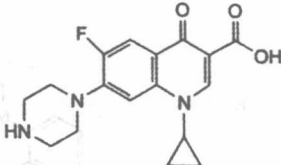
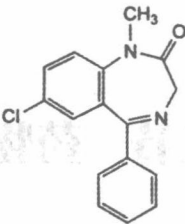
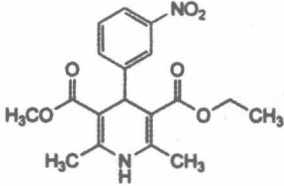
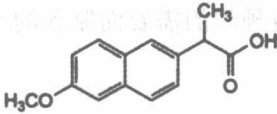
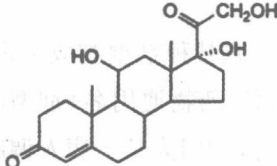
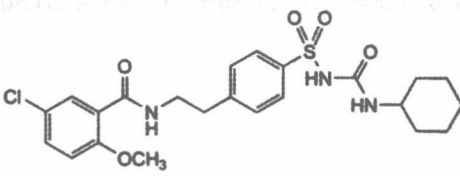
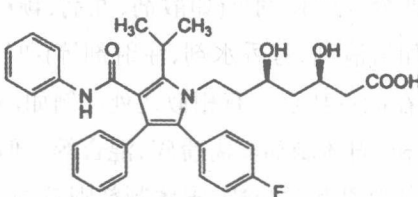
药物的名称包括药物的通用名,化学名和商品名。

表 1-2 药物名称的概念、性质、特点

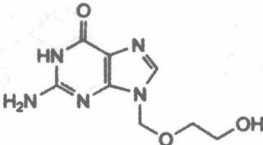
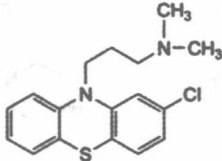
名称	定义	性质	特点
商品名	通常是针对药物的最终产品,即剂量和剂型已确定的含有一种或多种药物活性成分的药物	由制药企业自己进行选择	可以进行注册和申请专利保护;不能暗示药物的疗效和用途;应简易顺口
通用名	国际非专利药品名称,指有活性的药物物质,而不是最终的药品	是药学研究人员和医务人员使用的共同名称;一个药物只有一个药品通用名	不受专利和行政保护;通用名的确定应遵循WHO的原则,且不能和已有的名称相同,也不能和商品名相似;是药典中使用的名称
化学名	准确的表述药物的化学结构所采用的名称	根据其化学结构式来进行命名的,以一个母体为基本结构,然后将其他取代基的位置和名称标出	参考国际纯化学和应用化学会(IUPAC)公布的有机化合物命名原则及中国化学会公布的“有机化学物质系统命名原则”进行命名

表1-3列出了一些药物的结构和命名。

表 1-3 药物的结构和命名举例

通用名	化学名	化学结构	母核结构	主要用途
氨苄西林 Ampicillin	6-[D-(-) 2-氨基-苯乙酰氨基]青霉烷酸		β -内酰胺环	抗生素抗菌药物
环丙沙星 Ciprofloxacin	1-环丙基-6-氟-1, 4-二氢-4-氧代-7-(1-哌嗪基)-3-喹啉羧酸		喹啉酮环	合成抗菌药物
地西洋Diazepam	1-甲基-5-苯基-7-氯-1, 3-二氢-2H-1, 4-苯并二氮杂卓-2-酮		苯二氮卓环	中枢镇静药
尼群地平 Nitrendipine	2, 6-二甲基-4-(3-硝基苯基)-1, 4-二氢-3, 5-吡啶二甲酸甲乙酯		1, 4-二氢吡啶环	降压药
萘普生Naproxen	(+)- α -甲基-6-甲氧基-2-萘乙酸		萘环	非甾体抗炎药
氢化可的松 Hydrocortisone	11 β , 17 α , 21-三羟基孕甾-4-烯-3, 20-二酮		甾体	肾上腺皮质激素类抗炎药
格列本脲 Glibenclamide	N-[2-[4-[[[(环己氨基)羰基]氨基]磺酰基]苯基]乙基]-2-甲氧基-5-氯苯甲酰胺		苯环	降糖药
阿托伐他汀 Atorvastatin	7-[2-(4-氟苯基)-3-苯基-4-(苯氨基羰基)-5-(2-异丙基)-1-吡咯基]-3, 5-二羟基庚酸		吡咯烷环	降血脂药

续表

通用名	化学名	化学结构	母核结构	主要用途
阿昔洛韦 Acyclovir	9-(2-羟乙氧甲基) 鸟嘌呤		鸟嘌呤环	抗病毒药物
氯丙嗪 Chlorpromazine	N, N-二甲基-2- 氯-10H-吩噻嗪-10- 丙胺		吩噻嗪环	抗精神病药

第二节 药物剂型与制剂

一、药物剂型与辅料

(一) 制剂和剂型的概念

1. 剂型的概念

适合于疾病的诊断、治疗或预防的需要而制备的不同给药形式,称为药物剂型,简称剂型,如片剂、胶囊剂、注射剂等。

2. 制剂的概念

药物制剂系指将原料药物按照某种剂型制成一定规格并具有一定质量标准的具体品种,简称制剂。根据制剂命名原则,制剂名=药物通用名+剂型名,如维生素C片、阿莫西林胶囊、鱼肝油胶丸等。应当说明的是,凡按医师处方,专门为某一病人调制的并确切指明具体用法、用量的药剂称为方剂,方剂一般是在医院药房中调配制备的,研究方剂的调制理论、技术和应用科学称为调剂学。

(二) 剂型的分类

1. 按形态学分类

根据物质形态分类,即分为固体剂型(如散剂、丸剂、颗粒剂、胶囊剂、片剂等)、半固体剂型(如软膏剂、糊剂等)、液体剂型(如溶液剂、芳香水剂、注射剂等)和气体剂型(如气雾剂、部分吸入剂等)。一般而言,形态相同的剂型,在制备特点上有相似之处。例如,液体制剂制备时多需溶解、分散等操作,半固体制剂多需熔化和研和,固体制剂多需粉碎、混合等。但剂型的形态不同,药物作用的速度也不同,如同样是口服给药,液体制剂起效最快,固体制剂则较慢。

这种分类方式具有直观、明确的特点,且对药物制剂的设计、生产、储存和应用都有一定的指导意义。不足之处是没有考虑制剂的内在特点和给药途径。

2.按给药途径分类

将同一给药途径的剂型分为一类,紧密联系临床,能反映给药途径对剂型制备的要求。

(1)经胃肠道给药剂型:此类剂型是指给药后药物经胃肠道吸收后发挥疗效。如溶液剂、糖浆剂、颗粒剂、胶囊剂、散剂、丸剂、片剂等。口服给药虽然简单方便,但有些药物易受胃酸破坏或被肝脏代谢,引起生物利用度的问题,有些药物对胃肠道有刺激性。

(2)非经胃肠道给药剂型

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。

此分类方法的缺点是会产生同一种剂型由于给药途径的不同而出现于不同类别。如喷雾剂,既可以通过口腔给药,也可以通过鼻腔、皮肤或肺部给药。又如临床上的氯化钠生理盐水,可以是注射剂,也可以是滴眼剂、滴鼻剂、灌肠剂等。所以此种分类方法无法体现具体剂型的内在特点。

3.按分散体系分类

按剂型的分散特性,即根据分散介质中存在状态的不同以及分散相在分散介质中存在的状态特征不同进行分类,利用物理化学等理论对有关问题进行研究,基本上可以反映出剂型的均匀性、稳定性以及制法的要求。

(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:如口服乳剂、静脉乳剂、乳膏剂等。

(4)混悬液类:如混悬型洗剂、口服混悬剂、部分软膏剂等。

(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。这类制剂在药物制剂中占有很大的比例。

(7)微粒类:药物通常以不同大小的微粒呈液体或固体状态分散,主要特点是粒径一般为微米级(如微囊、微球、脂质体等)或纳米级(如纳米囊、纳米粒、纳米脂质体等),这类剂型能改变药物在体内的吸收、分布等方面特征,是近年来大力研发的药物靶向剂型。

按该法进行分类的缺点在于不能反映剂型的用药特点,可能会出现同一种剂型由于辅料和制法不同而属于不同的分散系统,如注射剂可以是溶液型,也可以是乳状液型、混悬型或微粒型等。

4.按制法分类

根据制备方法进行分类,与制剂生产技术相关。例如,浸出制剂是用浸出方法制成的剂型(如流浸膏剂、酊剂等);无菌制剂是用灭菌方法或无菌技术制成的剂型(如注射剂、滴眼剂等)。但这种分类方法不能包含全部剂型,故不常用。

5.按作用时间分类

根据剂型作用快慢,分为速释、普通和缓控释制剂等。这种分类方法能直接反映用药后药物起效的快慢和作用持续时间的长短,因而有利于合理用药。但该法无法区分剂型之间的固有属性。如注射剂和片剂都可以设计成速释和缓释产品,但两种剂型的制备工艺截然不同。

(三)药物剂型的重要性

1.药物剂型与给药途径

药物制成制剂应用于人体,在人体部位中有20余种给药途径,即口腔、舌下、颊部、胃肠道、直肠、子宫、阴道、尿道、耳道、鼻腔、咽喉、支气管、肺部、皮内、皮下、肌肉、静脉、动脉、皮肤、眼等。药物剂型必须根据这些给药途径的特点来制备。如眼黏膜用药途径是以液体、半固体剂型最为方便,舌下给药则应以速释制剂为主。总之,药物剂型必须与给药途径相适应。

2.药物剂型的重要性

(1)可改变药物的作用性质:如硫酸镁口服剂型用作泻下药,但5%注射液静脉滴注,能抑制大脑中枢神经,具有镇静、解痉作用;又如依沙吖啶1%注射液用于中期引产,但0.1%~0.2%溶液局部涂敷有杀菌作用。

(2)可调节药物的作用速度:如注射剂、吸入气雾剂等,发挥药效很快,常用于急救;丸剂、缓控释制剂、植入剂等属长效制剂。医生可按疾病治疗的需要选用不同作用速度的剂型。

(3)可降低(或消除)药物的不良反应:如氨茶碱治疗哮喘病效果很好,但有引起心跳加快的毒副作用,若改成栓剂则可消除这种不良反应;缓释与控释制剂能保持血药浓度平稳,从而在一定程度上降低某些药物的不良反应。

(4)可产生靶向作用:如静脉注射用脂质体是具有微粒结构的剂型,在体内能被网状内皮系统的巨噬细胞所吞噬,使药物在肝、脾等器官浓集性分布,即在肝、脾等器官发挥疗效的药物剂型。

(5)可提高药物的稳定性:同种主药制成固体制剂的稳定性高于液体制剂,对于主药易发生降解的,可以考虑制成固体制剂。

(6)可影响疗效:固体制型如片剂、颗粒剂、丸剂的制备工艺不同会对药效产生显著的影响,药物晶型、药物粒子大小的不同,也可直接影响药物的释放,从而影响药物的治疗效果。

(四)药用辅料

药用辅料系指生产药品和调配处方时所用的赋形剂和附加剂,是除了活性成分以外,包含在药物制剂中的在安全性方面已进行了合理评估的物质。药用辅料是指在制剂处方设计时,为解决制剂成型性、有效性、稳定性及安全性而加入处方中的除主药以外的一切药用物料的统称。

1.药用辅料的作用与应用原则

(1)药用辅料的作用:

①赋型。

②使制备过程顺利进行。

③提高药物稳定性。

④提高药物疗效。

⑤降低药物毒副作用。

⑥调节药物作用。

⑦增加病人用药的顺应性。

(2)药用辅料的应用原则:

①满足制剂成型、有效、稳定、安全、方便要求的最低用量原则。

②无不良影响原则。即不降低药物疗效,不产生毒副作用,不干扰制剂质量监控。

2. 药用辅料的分类

药用辅料种类繁多,在不同剂型中作用不同,可按来源、作用和用途、给药途径等进行分类。

(1)按来源分类:依据来源不同,药用辅料可分为天然物质、半合成物质和全合成物质。

(2)按作用与用途分类:药用辅料在制剂中有60余种,包括溶剂、增溶剂、助溶剂、防腐剂、矫味剂、着色剂、助悬剂、乳化剂、润湿剂、发泡剂、消泡剂、填充剂、吸收剂、稀释剂、黏合剂、崩解剂、润滑剂、助流剂、包衣材料、增塑剂、pH调节剂、抗氧剂、渗透压调节剂、螯合剂、渗透促进剂、增稠剂、保湿剂、抛射剂、缓控释材料等。

(3)按给药途径分类,药用辅料可分为口服用、注射用、黏膜用、经皮或局部给药用、经鼻或口腔吸入给药用和眼部给药用等。同一辅料可用于不同给药途径的药物制剂,且有不同的作用和用途。

3. 药用辅料的一般质量要求

(1)药用辅料必须符合药用要求,供注射剂用的应符合注射用质量要求。

(2)药用辅料应通过安全性评估,对人体无毒害作用,化学性质稳定,不与主药及其他辅料发生作用,不影响制剂的质量检验。

(3)药用辅料的安全性以及影响制剂生产、质量、安全性和有效性的性质应符合要求。

(4)根据不同的生产工艺及用途,药用辅料的残留溶剂、微生物限度或无菌应符合要求;注射用药用辅料的热原或细菌内毒素、无菌等应符合要求。

二、药物稳定性及药品有效期

药物稳定性是指原料药及制剂保持其物理、化学、生物学和微生物学性质的能力。通过稳定性试验,考察药物不同环境条件(如温度、湿度、光线等)下制剂特性随时间变化的规律,以认识和预测制剂的稳定趋势,为制剂生产、包装、贮存、运输条件的确定和有效期的建立提供科学依据。

药物制剂稳定性变化一般包括化学、物理和生物学三个方面。

(1)化学不稳定性 是指药物由于水解、氧化、还原、光解、异构化、聚合、脱羧,以及药物相互作用产生的化学反应,使药物含量(或效价)、色泽产生变化。

(2)物理不稳定性 是指制剂的物理性能发生变化,如混悬剂中药物颗粒结块、结晶生长,乳剂的分层、破裂,胶体制剂的老化,片剂崩解度、溶出速度的改变等。

(3)生物不稳定性 是指由于微生物污染滋长,引起药物的酶败分解变质。可由内在和外部两方