



国家执业药师资格统一考试系列辅导用书

药学专业知识（一） 高频考题精析

决胜
2019

博学堂国家药考命题研究中心 组编

原第四军医大学出版社李军珂 主编



湖南科学技术出版社



国家执业药师资格统一考试系列辅导用书

药学专业知识（一） 高频考题精析

博学堂国家药考命题研究中心 组编

原第四军医大学出版社李军珂 主编

 湖南科学技术出版社

图书在版编目 (CIP) 数据

药学专业知识 (一) 高频考题精析 / 博学堂国家药考命题研究中心组编, 李军珂主编.
——长沙 : 湖南科学技术出版社, 2019. 1

国家执业药师资格统一考试系列辅导用书

ISBN 978-7-5710-0112-4

I. ①药… II. ①博… ②李… III. ①药学专一资格考试—题解 IV. ①R9. 44

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2019) 第 023490 号

YAOXUE ZHUANYE ZHISHI YI GAOPIN KAOTI JINGXI

药学专业知识 (一) 高频考题精析

组 编: 博学堂国家药考命题研究中心

主 编: 李军珂

责任编辑: 李 忠 姜 岚

出版发行: 湖南科学技术出版社

社 址: 长沙市湘雅路 276 号

网 址: <http://www.hnstp.com>

湖南科学技术出版社天猫旗舰店网址:

<http://hnkjcbstmall.com>

印 刷: 河南美轩印务有限公司

(印装质量问题请直接与本厂联系)

厂 址: 武陟县詹店镇印刷包装产业园 D 区

邮 编: 454971

版 次: 2019 年 1 月第 1 版

印 次: 2019 年 1 月第 1 次印刷

开 本: 787mm×1092mm 1/16

印 张: 11

书 号: ISBN 978-7-5710-0112-4

定 价: 50.00 元

(版权所有 • 翻印必究)

《药学专业知识（一）高频考题精析》编委会名单

组 编 博学堂国家药考命题研究中心

主 编 李军珂（原第四军医大学出版社主编）

副主编 张凤英 马东艳

编 委 陈胜楠 史 进 杜慧坤 马二军 张庆春

王九芝 李军珂 李倩倩 马 伸 谢冠生

张维群 魏志兵 焦小金 黎振超 孟小珂

王振杰 白蕙萍 李耀堂 王 伟 焦胜坤

雷 刚 安鹏飞 杨春明 任志鸿 张宝明

汪芳超 刘书彩 王素娜 马 康 马银锋

目 录

CONTENTS

第一章 药物与药学专业知识	1
高频考题	1
参考答案及专家精析	5
第二章 药物的结构与药物作用	10
第一节 药物理化性质与药物活性	10
高频考题	10
参考答案及专家精析	11
第二节 药物结构与药物活性	12
高频考题	12
参考答案及专家精析	14
第三节 药物化学结构与药物代谢	15
高频考题	15
参考答案及专家精析	18
第三章 药物固体制剂和液体制剂与临床应用	21
第一节 固体制剂	21
高频考题	21
参考答案及专家精析	25
第二节 液体制剂	29
高频考题	29
参考答案及专家精析	33
第四章 药物灭菌制剂和其他制剂与临床应用	37
第一节 灭菌制剂	37

高频考题	37
参考答案及专家精析	42
第二章 其他制剂	46
高频考题	46
参考答案及专家精析	48
第五章 药物递送系统与临床应用	50
第一节 快速释放制剂	50
高频考题	50
参考答案及专家精析	52
第二节 缓释、控释制剂	54
高频考题	54
参考答案及专家精析	56
第三节 靶向制剂	58
高频考题	58
参考答案及专家精析	59
第六章 生物药剂学	62
高频考题	62
参考答案及专家精析	66
第七章 药效学	69
高频考题	69
参考答案及专家精析	74
第八章 药品不良反应与药物滥用监控	77
高频考题	77

参考答案及专家精析	88
第九章 药物的体内动力学过程	94
高频考题	94
参考答案及专家精析	99
第十章 药品质量与药品标准	103
第一节 药品标准与药典	103
高频考题	103
参考答案及专家精析	106
第二节 药品检验与体内药物检测	
	108
高频考题	108
参考答案及专家精析	115
第十一章 常用药物的结构与作用	119
第一节 精神与中枢神经系统疾病	
用药	119
高频考题	119
参考答案及专家精析	127
第二节 解热、镇痛、消炎药及抗痛	
风药	130
高频考题	130
参考答案及专家精析	131
第三节 呼吸系统疾病用药	133
高频考题	133
参考答案及专家精析	135
第四节 消化系统疾病用药	136
高频考题	136
参考答案及专家精析	138
第五节 循环系统疾病用药	140
高频考题	140
参考答案及专家精析	146
第六节 内分泌系统疾病用药	149
高频考题	149
参考答案及专家精析	152
第七节 抗菌药物	154
高频考题	154
参考答案及专家精析	160
第八节 抗病毒药	163
高频考题	163
参考答案及专家精析	165
第九节 抗肿瘤药	165
高频考题	165
参考答案及专家精析	168

第一章

药物与药学专业知识



高 频 考 题

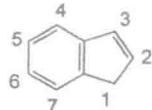
一、最佳选择题

1. 关于药物制剂稳定性的说法，错误的是
 - A. 运用化学动力学原理可以研究制剂中药物的降解速度
 - B. 药物制剂稳定性影响因素试验包括高温试验、高湿试验和强光照射试验
 - C. 药物制剂稳定性主要研究药物制剂的物理稳定性
 - D. 加速试验是在 (40 ± 2) °C、相对湿度 $(75\pm 5)\%$ 的条件下进行
 - E. 长期试验是在 (25 ± 2) °C、相对湿度 $(60\pm 10)\%$ 的条件下进行
2. 制剂中药物的化学降解途径不包括
 - A. 水解
 - B. 氧化
 - C. 异构化
 - D. 结晶
 - E. 脱羧
3. 下列药物中，吸湿性最大的是
 - A. 盐酸毛果芸香碱 (CRH=59%)
 - B. 柠檬酸 (CRH=70%)
 - C. 水杨酸钠 (CRH=78%)

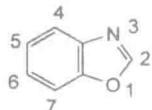
- D. 米格来宁 (CRH=86%)
- E. 抗坏血酸 (CRH=96%)
4. 适用于偏酸性药液的水溶性抗氧剂是
 - A. 对羟基茴香醚 (BHA)
 - B. 亚硫酸钠
 - C. 焦亚硫酸钠
 - D. 生育酚
 - E. 硫代硫酸钠
5. 不属于药物稳定性试验方法的是
 - A. 高湿试验
 - B. 加速试验
 - C. 随机试验
 - D. 长期试验
 - E. 高温试验
6. 影响因素试验包括
 - A. 高温试验、高湿度试验、强光照射试验
 - B. 高温试验、高压试验、高湿度试验
 - C. 高湿度试验、高酸度试验、强光照射试验
 - D. 高湿度试验、高碱度试验、强光照射试验
 - E. 高温度试验、高酸度试验、高湿度试验
7. 关于配伍变化的错误表述是

- A. 两种以上药物配合使用时，应该避免一切配伍变化
- B. 配伍禁忌系指可能引起治疗作用减弱甚至消失，或导致毒副作用增强的配伍变化
- C. 配伍变化包括物理的、化学的和药理的三方面配伍变化
- D. 药理的配伍变化又称为疗效的配伍变化
- E. 药物相互作用包括药动学的相互作用和药效学的相互作用
8. 常见药物制剂的化学配伍变化是
- 溶解度改变
 - 分散状态改变
 - 粒径变化
 - 颜色变化
 - 潮解
9. 混合易发生爆炸的是
- 维生素C和烟酰胺
 - 生物碱与鞣酸
 - 乳酸环丙沙星与甲硝唑
 - 碳酸氢钠与大黄酚
 - 高锰酸钾与甘油
10. 关于药品命名的说法，正确的是
- 药品不能申请商品名
 - 药品通用名可以申请专利和行政保护
 - 药品化学名是国际非专利药品名称
 - 制剂一般采用商品名加剂型名
 - 药典中使用的名称是通用名
11. 不属于新药临床前研究内容的是
- 药效学研究
 - 一般药理学研究
 - 动物药动学研究
 - 毒理学研究
 - 人体安全性评价研究

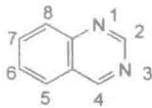
12. 苯并咪唑的化学结构和编号是
- A.



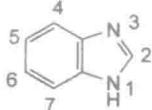
B.



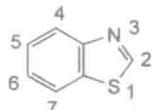
C.



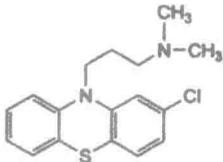
D.



E.



13. 氯丙嗪化学结构名



- A. 2-氯-N,N-二甲基-10H-苯并哌唑-10-丙胺
- B. 2-氯-N,N-二甲基-10H-苯并噻唑-10-丙胺
- C. 2-氯-N,N-二甲基-10H-吩噻嗪-10-丙胺
- D. 2-氯-N,N-二甲基-10H-噻嗪-10-丙胺
- E. 2-氯-N,N-二甲基-10H-哌嗪-10-丙胺

14. 属于均相液体制剂的是

- 纳米银溶液
- 复方硫黄洗剂
- 鱼肝油乳剂

- D. 磷酸可待因糖浆
E. 石灰搽剂
15. 分子中含有酚羟基，遇光易氧化变质，需避光保存的药物是
A. 肾上腺素
B. 维生素 A
C. 苯巴比妥钠
D. 维生素 B₂
E. 叶酸
16. 下列药物配伍或联用时，发生的现象属于物理配伍变化的是
A. 氯霉素注射液加入 5% 葡萄糖注射液中析出沉淀
B. 多巴胺注射液与碳酸氢钠注射液配伍后，溶液逐渐变成粉红至紫色
C. 阿莫西林与克拉维酸钾制成复方制剂时疗效最强
D. 维生素 B₁₂ 注射液与维生素 C 注射液配伍时效价最低
E. 甲氧苄啶与磺胺类药物制成复方制剂时疗效最强

[3~5]

- A. 变色
B. 沉淀
C. 产气
D. 结块
E. 爆炸

3. 离锰酸钾与甘油混合研磨时，易发生
4. 生物碱与鞣酸溶液配伍，易发生
5. 水杨酸与铁盐配伍，易发生

[6~7]

- A. 改变尿液 pH，有利于药物代谢
B. 产生协同作用，增强药效
C. 减少或延缓耐药性的产生
D. 形成可溶性复合物，有利于吸收
E. 利用药物的拮抗作用，克服某些毒副作用

说明以下药物配伍使用的目的

6. 乙酰水杨酸与对乙酰氨基酚、咖啡因联合使用
7. 吗啡与阿托品联合使用

[8~10]

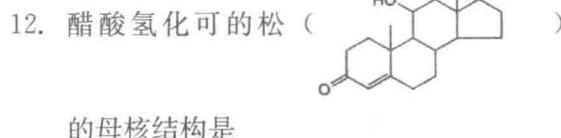
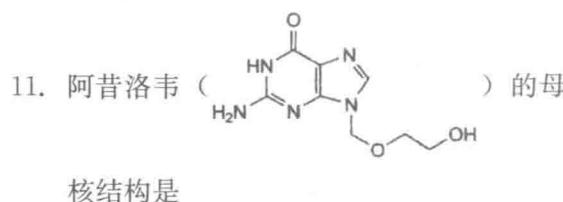
- A. pH 值改变
B. 离子作用
C. 溶剂组成改变
D. 盐析作用
E. 直接反应

8. 诺氟沙星注射液与氨苄青霉素钠注射液混合析出沉淀，其原因是
9. 安定注射液（含 40% 丙二醇和 10% 乙醇）与 5% 葡萄糖注射液配伍析出沉淀，其原因是
10. 两性霉素 B 注射液遇氯化钠输液析出沉淀，其原因是

[11~12]

- A. 筛体
B. 吻噻嗪环

- C. 二氢吡啶环
D. 鸟嘌呤环
E. 噻吩酮环



[13~15]

- A. 药理学的配伍变化
B. 给药途径的变化
C. 适应证的变化
D. 物理学的配伍变化
E. 化学的配伍变化
13. 将氯霉素注射液加入 5% 葡萄糖注射液中，氯霉素从溶液中析出
14. 多巴胺注射液加入 5% 碳酸氢钠溶液中逐渐变成粉红色
15. 异烟肼合用香豆素类药物抗凝血作用增强属于什么变化

[16~17]

- A. < 200nm
B. 200~400nm
C. 400~760nm
D. 760~25000nm
E. 2.5μm~25μm
16. 药物测量紫外分光光度的范围是
17. 药物近红外光谱的范围是

[18~19]

- A. 商品名
B. 通用名

- C. 化学名
D. 别名
E. 药品代码

18. 国际非专利药品名称是
19. 只有名称拥有者、制造者才能无偿使用的药品是

[20~22]

- A. 一期临床试验
B. 二期临床试验
C. 三期临床试验
D. 四期临床试验
E. 0 期临床试验
20. 可采用试验、对照、双盲试验，对受试药的有效性和安全性做出初步药效学评价，推荐给药剂量的新药研究阶段是
21. 新药上市后在社会人群大范围内继续进行的安全性和有效性评价，在广泛、长期使用的条件下考察其疗效和不良反应的新药研究阶段是
22. 一般选 20~30 例健康成年志愿者，观察人体对于受试药的耐受程度和人体药动学特征，为制定后续临床试验的给药方案提供依据的新药研究阶段是

三、多项选择题

1. 属于固体剂型的有
A. 散剂
B. 膜剂
C. 合剂
D. 栓剂
E. 酊剂
2. 药物剂型的重要性主要表现在
A. 可改变药物的作用性质
B. 可改变药物的作用速度
C. 可降低药物的毒副作用
D. 不影响疗效

- E. 可产生靶向作用
3. 影响药物制剂稳定性的处方因素有
 A. pH 值
 B. 抗氧剂
 C. 温度
 D. 金属离子络合剂
 E. 光线
4. 提高药物制剂稳定性的方法有
 A. 制备稳定衍生物
 B. 制备难溶性盐类
 C. 制备固体剂型
 D. 制备微囊
 E. 制备包合物
5. 属于药物制剂的物理配伍变化的有
 A. 结块
 B. 变色
 C. 产气
 D. 潮解
 E. 液化
6. 下列变化中属于物理配伍变化的有
 A. 在含较多黏液质和蛋白质的水溶液中加入大量的醇后产生沉淀
 B. 散剂、颗粒剂在吸湿后又逐渐干燥而结块
 C. 混悬剂因久贮而发生颗粒粒径变大
 D. 维生素 C 与烟酰胺混合后产生橙红色固体
 E. 溴化铵与强碱性药物配伍时产生氯气
7. 在有可能发生药物的物理或化学配伍变化时采取的处理方法有
 A. 改变溶剂
 B. 改变调配顺序
 C. 添加助溶剂
 D. 改变溶液的 pH 值
- E. 改变有效成分或剂型
8. 药剂学的研究内容主要包括
 A. 药剂学的基本理论的研究
 B. 新剂型的研究
 C. 新辅料的研究
 D. 制剂新机械的研究
 E. 医药新技术的研究
9. 提高药物稳定性的方法有
 A. 对水溶液不稳定的药物，制成固体制剂
 B. 对防止药物因受环境中的氧气、光线等影响，制成微囊或包合物
 C. 对遇湿不稳定的药物，制成包衣制剂
 D. 对不稳定的有效成分，制成前体药物
 E. 对生物制品，制成冻干粉制剂



参考答案及专家精析

一、最佳选择题

1. C 本题考查的是药物制剂的稳定性。

药物制剂稳定性主要包括化学和物理两个方面。如降解速度等化学稳定性可用化学动力学的原理进行评价。稳定性的试验方法包括：①影响因素试验、高湿度试验、强光照射试验；②加速试验，即在温度（40±2）℃、相对湿度（75±5）%的条件下放置 6 个月；③长期试验，即在温度（25±2）℃、相对湿度（60±10）%的条件下放置 12 个月；④经典恒温法。

2. D 本题考查的是药物的化学降解途径。

药物由于化学结构不同，其降解反应途径也不尽相同。水解和氧化是药物降解的两个主要途径，其他如异构化、聚合、脱羧等反应，在某些药物中也有发生，有时一种药物可能同时产生两种或两种以上的降解反应。

结晶属于物理变化。

3. A 本题考查的是粉体的临界相对湿度(CRH)。

具有水溶性的药物粉末在相对湿度较低环境时一般吸湿量较小，但当相对湿度提高到某一定值时，吸湿量急剧增加，此时的相对湿度被称为临界相对湿度，该值可以通过作图法求得。CRH是水溶性药物的固有特征，是药物吸湿性大小的衡量指标。CRH越小则越易吸湿，反之则不易吸湿。CRH值的测定通常采用饱和溶液法。

4. C 本题考查的是抗氧剂的相关知识。

适用于偏酸性药液的水溶性抗氧剂是焦亚硫酸钠、亚硫酸氢钠，亚硫酸钠与硫代硫酸钠用于偏碱性溶液。

5. C 本题考查的是稳定性试验的方法。

稳定性试验包括影响因素试验、加速试验与长期试验。影响因素试验又称强化试验，需要在比加速试验更激烈的条件下进行，包括高温试验、高湿度试验、强光照射试验。

6. A 本题考查的是影响因素试验。

影响因素试验又称强化试验，需要在比加速试验更激烈的条件下进行，包括高温试验、高湿度试验、强光照射试验。

7. A 本题考查的是配伍变化的相关知识。

配伍变化包括物理的、化学的和药理的3个方面。药理的配伍变化又称疗效的配伍变化；药物相互作用包括药动学的相互作用和药效学的相互作用；配伍禁忌系指可能引起治疗作用减弱甚至消失，或导致毒副作用增强的配伍变化。药物配合使用应避免药效出现不符合临床要求的配伍变化。但根据药物作用机制，可以有目的地对药物进行联合使用，以加强临床效果。例如，丙磺舒与青霉素合用，可减低青霉素排泌，从而提高青霉素效果。

8. D 本题考查的是药物制剂的配伍变化。

A、B、C、E四项都属于物理变化。化学配伍变化包括变色、混浊和沉淀、产气等。

9. E 本题考查的是药物的配伍变化。

配伍变化可分为物理的、化学的和药理的3个方面，其中化学的配伍变化包括：①变色。例如，维生素C与烟酰胺混合产生橙红色，碳酸氢钠使大黄粉末变为粉红色；②混浊或沉淀。pH改变产生沉淀；水解产生沉淀；生物碱盐溶液的沉淀，生物碱与鞣酸相遇产生沉淀。③产气。④分解破坏、疗效下降。例如，乳酸环丙沙星与甲硝唑混合，甲硝唑浓度降为90%。⑤发生爆炸。例如，高锰酸钾与甘油混合研磨发生爆炸。

10. E 本题考查的是药物名称的命名。

①药品可以申请商品名。药品的商品名是由制药企业自己进行选择的，和商标一样可以进行注册和申请专利保护。②药品通用名又称国际非专利药品名称，不受专利和行政保护。③化学名是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。④制剂一般采用通用名十剂型名。

11. E 本题考查的是新药临床前研究的内容。

临床前药理病理学研究包括主要药效学研究、一般药理学研究、药动学研究、毒理学研究，故选E。

12. D

13. C 氯丙嗪化学名：N,N-二甲基-2-氯-10H-吩噻嗪-10-丙胺。

14. D 液体制剂包括溶液剂、芳香水剂、注射剂等。

15. A 肾上腺素分子中具有酚羟基，遇光易氧化变质。

16. A 物理学的配伍变化是指药物配伍时发生了分散状态或其他物理性质的改变，如发生沉淀、潮解、液化、结块和粒径变化等而造成药物制剂不符合质量和医疗要求。

二、配伍选择题

1~2. EA 本组题考查的是药物制剂稳

定性变化。

制剂中药物的化学降解有水解、氧化、异构化、聚合、脱羧等。制剂中药物的物理稳定性变化有混悬剂的结块、结晶生长，乳剂的分层、破裂，片剂的崩解度、溶出速度的改变。

3~5. EBA 本组题考查的是配伍变化。

爆炸大多数由强氧化剂与强还原剂配伍使用引起。例如，氯化钾与硫、高锰酸钾与甘油、强氧化剂与蔗糖或葡萄糖等药物混合研磨时可能发生爆炸。生物碱盐的溶液与鞣酸、碘等相遇时，能产生沉淀。含酚羟基的药物如水杨酸与铁盐相遇，颜色将变深。

6~7. BE 本组题考查的是药物配伍使用的相关知识。

乙酰水杨酸与对乙酰氨基酚、咖啡因联合使用的目的是产生协同作用，增强药效；吗啡与阿托品联合使用的目的是利用药物的拮抗作用，克服某些毒副作用。

8~10. ACD 本组题考查的是注射液配伍变化的主要原因。

注射液配伍变化的主要原因包括：①pH 改变，如诺氟沙星注射液与氨苄青霉素钠注射液混合产生沉淀。②溶剂组成改变，如地西泮（安定）注射液与 5% 葡萄糖注射液配伍析出沉淀。③盐析作用，如两性霉素 B 注射液遇氯化钠输液析出沉淀。④其他原因还有离子作用、缓冲容量、直接反应、配合量、混合的顺序、反应时间、氧与二氧化碳的影响、光敏感性、成分的纯度等。

11~12. DA 本组题考查的是药物的结构和命名。

13~15. DEA 本组题考查的是药物配伍变化的类型。

溶解度改变为物理学的配伍变化，如氯霉素注射液（含乙醇、甘油或丙二醇等）加入 5% 葡萄糖注射液中时往往析出氯霉素。但当输液中氯霉素的浓度低于 0.25% 则不会析出沉淀。

16~17. BD 药物测量紫外分光光度的范围是 200~400nm。药物近红外光谱的范围是 760~2500nm。

18~19. BA 通用名指国际非专利药品名称，指有活性的物质，而不是最终药品。商品名通常是针对药物的最终产品，即剂量和剂型已经确定的含有一种或多种药物活性成分的药物，由制药企业自行选择，可以进行注册和申请专利保护，名称拥有者、制造者才能无偿使用。

20~22. BDA 本组题考查的是临床试验分期的内容。

Ⅱ期临床试验：为初步药效学评价试验，采用随机、双盲、对照试验，完成粒数大于 100 粒，对试药的有效性和安全性做出初步评价，推荐临床给药剂量。

Ⅳ期临床试验：为批准上市后的监测，是受试新药上市后在社会人群大范围内继续进行的安全性和有效性评价，在广泛、长期使用的条件下考察其疗效和不良反应，该期对最终确立新药的临床价值有重要意义。

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

三、多项选择题

1. AB 本题考查的是药物固体剂型的类别。

属于固体剂型的有散剂、膜剂、丸剂、片剂；属于液体剂型有溶液剂（含醑剂、酊剂），注射剂，合剂，洗剂等；属于半固体剂型的有软膏剂、栓剂。

2. ABCE 本题考查的是药物剂型的重要性相关知识。

药物剂型的重要性包括：①剂型可改变药物的作用性质；②剂型能改变药物的作用速度；③改变剂型可降低（或消除）药物的毒副作用；④剂型可产生靶向作用；⑤剂型可影响疗效。

3. ABD 本题考查的是影响药物制剂稳定性的处方因素。

影响药物制剂稳定性的因素有：①处方因素，如 pH、广义酸碱催化、溶剂、离子强度、表面活性剂、处方中辅料等；②环境因素，如温度、光线、空气（氧）、金属离子、湿度和水分、包装材料等。

4. ABCDE 本题考查的是药物制剂稳定化的提高方法。

药物制剂稳定性的提高方法如下。

(1) 改进剂型与生产工艺：①制成固体剂型。在水溶液中不稳定的药物，制成固体剂型可提高其稳定性。如注射用灭菌粉针剂，是目前青霉素类、头孢菌素类抗生素的基本剂型。其他药物还可制成片剂、胶囊剂、颗粒剂、膜剂等。②制成微囊或包合物。某些药物制成微囊后可增加药物的稳定性，如 β -胡萝卜素、维生素 C 硫酸亚铁制成微囊后，稳定性都较原药提高。包合物也可增加药物的稳定性，如见光易分解的维生素 A 制成 β -环糊精包合物后，稳定性明显提高。③采用直接压片或包衣工艺。对一些遇湿热不稳定的药物压片时，为避免高温和水分对药物稳定性的影响，可采用直接压片或干法制粒压片等工艺。包衣也可改善药物对光、湿、热的稳定性，是解决片剂稳定性的常规方法之一。

(2) 制成稳定衍生物：对不稳定的药物进行结构改造，如制成难溶性盐、酯类、酰胺类或高熔点衍生物，可以提高其稳定性。一般水溶性越小，稳定性越好。

(3) 加入干燥剂及改善包装：易水解药物可与某些吸水性较强的物质混合压片，这些物质起到干燥剂的作用，能够吸走药物所吸附的水分，提高药物稳定性。

5. ADE 本题考查的是药物物理配伍变化的类型。

配伍变化可分为物理的、化学的和药理的 3 个方面。物理的配伍变化有：溶解度改

变，潮解、液化和结块，分散状态或粒径变化。化学的配伍变化有：变色，混浊和沉淀，产气，分解破坏，疗效下降，发生爆炸。

6. ABC 本题考查的是药物的物理配伍变化。

药物配伍变化可分为物理的、化学的和药理的 3 个方面。物理配伍变化有：①溶解度的改变。例如，含黏液质、蛋白质的水溶液若加入大量的醇，能产生沉淀。②潮解、液化和结块。例如，散剂、颗粒剂由于药物吸湿后又逐渐干燥而结块。③分散状态与粒径的变化。例如，乳剂、混悬剂因久贮而粒径变粗，或分散相聚结或凝聚而分层或析出。

7. ABCDE 本题考查的是药物配伍变化。

配伍变化处理办法有改变储存条件、改变调配次序、改变溶剂或添加助溶剂、调整溶液的 pH、改变有效成分或改变剂型。

8. ABCDE 本题考查的是药剂学研究内容。

药剂学的主要任务可以从科研、生产、临床等若干方面归纳如下：①基本理论的研究；②新剂型的研究与开发；③新辅料的研究与开发；④制剂新机械和新设备的研究与开发；⑤中药新剂型的研究与开发；⑥生物技术药物制剂的研究与开发；⑦医药新技术的研究与开发。

9. ABCDE 本题考查的是提高药物稳定性的方法。

稳定化的方法如下。

(1) 改进制剂和工艺：①制成固体制剂。凡在水中不稳定的药物，制成固体制剂可显著改善其稳定性。②制成微囊或包合物。采用微囊化和包合技术，可防止药物因受环境中的氧气、湿度、水分、光线的影响而降解，或因挥发性药物挥发而造成损失，从而加强药物稳定性。③采用直接压片或包衣工艺。对一些遇湿热不稳定的药物压片时，可采用粉末直接压片、结晶药物压片或干法制粒压

片等工艺。

(2) 制备稳定的衍生物。对不稳定的成分进行结构改造,如制成盐类、酯类、酰胺类或高熔点衍生物,可以提高制剂稳定性。将有效成分制成前药也是提高稳定性的一种方法。

(3) 加入干燥剂及改善包装。易水解的药物可与某些吸水性较强的物质混合压片,这些物质起到干燥剂的作用,吸收药物所吸附的水分,从而提高了药物稳定性。那些对热特别敏感的药物,如某些抗生素、生物制品,则采用无菌操作及冷冻干燥。

第二章

药物的结构与药物作用

第一节

药物理化性质与药物活性



高 频 考 题

一、最佳选择题

1. 巴比妥类药物解离度与药物的 pK_a 和环境 pH 有关。在生理 pH=7.4 时, 分子态形式和离子态形式比例接近的巴比妥类药物是

- A. 异戊巴比妥 (pK_a 7.9)
- B. 司可巴比妥 (pK_a 7.9)
- C. 戊巴比妥 (pK_a 8.0)
- D. 海索比妥 (pK_a 8.4)
- E. 苯巴比妥 (pK_a 7.3)

2. 药物的亲脂性与生物活性的关系是

- A. 增强亲脂性, 有利于吸收, 活性增强
- B. 降低亲脂性, 不利于吸收, 活性下降
- C. 增强亲脂性, 使作用时间缩短
- D. 降低亲脂性, 使作用时间延长
- E. 适度的亲脂性有最佳活性

3. 弱碱性药物

- A. 在酸性环境中易跨膜转运
- B. 在胃中易于吸收
- C. 酸化尿液时易被重吸收

- D. 酸化尿液可加速其排泄
- E. 碱化尿液可加速其排泄

4. 酸性药物在体液中的解离程度可用公式

$$\lg \frac{[HA]}{[A^-]} = pK_a - pH$$

来计算。已知苯巴比妥的 pK_a 约为 7.4, 在生理 pH 为 7.4 的情况下, 其以分子形式存在的比例是

- A. 30%
- B. 40%
- C. 50%
- D. 75%
- E. 90%

5. 关于药物的分配系数对药效的影响叙述正确的是

- A. 分配系数越小, 药效越好
- B. 分配系数越大, 药效越好
- C. 分配系数越小, 药效越低
- D. 分配系数越大, 药效越低
- E. 分配系数适当, 药效为好

6. 关于药物的解离度对药效的影响, 叙述正确的是

- A. 解离度越小, 活性越好
- B. 解离度越大, 活性越好
- C. 解离度越小, 活性越低
- D. 解离度越大, 活性越低
- E. 解离度适当, 活性为好

参考答案及专家精析

二、配伍选择题

[1~2]

- A. 解离度
B. 分配系数
C. 立体构型
D. 空间构象
E. 电子云密度分布

1. 影响手性药物对映体之间活性差异的因素是
2. 影响结构非特异性全身麻醉药活性的因素是

[3~5]

- A. 弱酸性药物
B. 弱碱性药物
C. 强碱性药物
D. 两性药物
E. 中性药物
3. 在胃中易吸收的药物是
4. 在肠道易吸收的药物是
5. 在消化道难吸收的药物是

三、多项选择题

1. 影响结构非特异性药物活性的因素有
A. 溶解度
B. 分配系数
C. 几何异构体
D. 光学异构体
E. 解离度
2. 可能影响药效的因素有
A. 药物的脂水分配系数
B. 药物的解离度
C. 药物形成氢键的能力
D. 药物与受体的亲和力
E. 药物的电子密度分布

一、最佳选择题

1. E 本题考查的是药物解离度。

巴比妥类药在 pH 7.4 时的解离与 pK_a 的关系见下表：

巴比妥类药的解离度 (pH 7.4)

名称	pK_a 药物 (%)	分子态 (%)	离子态药物 (%)	作用时间	用途
巴比妥酸	4.12	0.05	99.95		无药理作用
5-苯基巴比妥酸	3.75	0.02	99.98		无药理作用
苯巴比妥	7.3	43.70	56.30	长	镇静催眠、抗癫痫
异戊巴比妥	7.9	75.97		中	镇静催眠、麻醉前给药
环己巴比妥	7.5			中	镇静催眠
司可巴比妥	7.9	75.97		短	催眠、麻醉前给药
戊巴比妥	8.0	79.9		短	催眠、麻醉前给药
海索比妥	8.4	90.91	9.09	超短	催眠、静脉麻醉药
硫喷妥钠	7.6			超短	催眠、静脉麻醉药

2. E

3. D 本题考查的是药物的体内过程。

弱酸性或弱碱性药物在肾小管内可通过简单扩散重吸收，尿液的 pH 可影响它们的解离度。酸化尿液可增加弱碱性药物解离度，减少肾小管的重吸收，加速其排泄。

4. C 本题考查的是药物的解离度。

酸性药物在体内的解离程度依据公式 $\lg \frac{[\text{HA}]}{[\text{A}^-]} = pK_a - \text{pH}$ ，带入已知条件可算出以分子形式存在的比例是 50%，故本题答案应选 C。

5. E

6. E

二、配伍选择题

1~2. CB 本组题考查的是药物的物理性质与活性的关系。

非特异性全身麻醉药活性与分配系数有关；手性药物对映体之间活性与立体构型有