



## 第一章 药品与药品质量标准

1. 通用名，也称国际非专利药品名称，是 WHO 推荐使用的名称，一个药物只有一个通用名。
2. 化学药物都有特定的化学结构，**化学名可以准确的表述药物的化学结构。**
3. 商品名（品牌名）针对最终产品，剂型、剂量确定；不同企业生产的药品具有不同的商品名，不得冒用，可注册和申请专利保护。
4. 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**剂型**。
5. **剂型的重要性：可改变药物的作用性质；可调节药物的作用速度；可降低药物的不良反应；可产生靶向作用；可提高药物的稳定性；可影响疗效。**
6. **药用辅料的应用原则：满足要求的最低用量原则、无不良影响原则。**
7. 按流通领域的作用药品包装可以分为内包装和外包装，内包装指直接与药品接触的包装，外包装指药品以外的包装。
8. 按使用方式药包材可分为 I（塑料）、II（玻璃、胶塞）和 III（盖）类。
9. **药物化学降解途径：水解、氧化、异构化、聚合、脱羧。**
10. **影响药物制剂稳定性的因素：①处方因素：pH、广义酸碱催化、溶剂、离子强度、表面活性剂、处方中基质或赋形剂。②外界因素：温度、光线、空气（氧）、金属离子、湿度和水分、包装材料。**
11. **药物制剂稳定化方法：控制温度、调节 Ph、改变溶剂、控制水分及湿度、遮光、驱逐氧气、加入抗氧化剂或金属离子络合剂等。**
12. **药物稳定性试验方法：①影响因素试验：高温、高湿、强光的剧烈条件下，考察影响稳定性的因素及降解途径。②加速试验：采用化学动力学原理，预测药品在常温下的稳定性。③长期试验：在实际贮存条件下，确定样品的有效期。**
13. 对于药物降解，通常用降解 10%所需的时间（称为十分之一衰期，记作  $t_{0.9}$ ）定义为有效期。恒温时， $t_{0.9} = 0.1054/k$ 。式中， $k$  为降解速度常数，单位  $h^{-1}$ 。
14. 中国药典，ChP；由一部、二部、三部、四部及其增补本组成。①一部分三类收载中药：药材和饮片；植物油脂和提取物；成方制剂和单味制剂。②二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。③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。④四部通则和药用辅料。
15. **药典的主要结构与内容：凡例、正文、通则。**
16. 《美国药典》+《美国国家处方集》，USP-NF。《欧洲药典》，Ph. Eur 或 EP。《日本药典》/《日本药局方》，JP。
17. 易溶指溶质 1g (ml) 能在溶剂 1~10ml 中溶解，几乎不溶或不溶指溶质 1g (ml) 在溶剂 1000ml 中不能完全溶解。
18. **崩解时限：薄膜衣片 30min；糖衣片 1h；肠溶片在盐酸中 2h 不崩解，在磷酸中 1h 应全部崩解；含片不应在 10min 内全部崩解；舌下片 5min；可溶片 3min；口崩片 60s；硬胶囊 30min；软胶囊 1h；滴丸剂 30min。**
19. 避光指避免日光直射；遮光指用不透光的容器包装；密闭指用可防止尘土及异物进入的容器包装。
20. 密封指用可防止风化、吸潮、挥发或异物进入的容器包装；熔封或严封指用可防止空气、水分的侵入与微生物污染的容器或适宜的材料包装。
21. **当含量限度未规定上限时，系指不超过 101.0%。**
22. **阴凉处指不超过 20℃；凉暗处指避光并不超过 20℃；冷处指 2℃~10℃；常温指 10℃~30℃。**



学习APP下载

世界上唯一只赚不赔的投资就是学习，学习让人生更为体面，考证让职业更具尊严。

23. 生物制品规定于  $2\sim 8^{\circ}\text{C}$  保存和运输。
24. 生物样品最常用的是血液。全血加抗凝剂离心后得到血浆，不加抗凝剂离心后得到血清；全血采集后置含有抗凝剂的试管中。
25. 生物药品测定法：免疫分析法（选择性很高、检出限低—临床用）、色谱分析法（专属性好、准确定量—复杂样品）。

## 第二章 药物的结构与作用

1. 共价键结合，键能较大，不可逆。如烷化剂类抗肿瘤药物与 DNA 中鸟嘌呤碱基键合形式。
2. 非共价键的键合类型（可逆）有离子键、氢键、离子—偶极和偶极—偶极相互作用、电荷转移复合物、疏水性相互作用、范德华力、金属离子络合物。
3. 氢键是最常见的非共价键形式，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治疗肌肉疼痛。
4. 离子键又称盐键，是所有键合键中键能最强的一种，如去甲肾上腺素体内成铵盐后与  $\beta_2$  肾上腺素受体形成离子键作用。
5. 生物药剂学分类：
  - ① I 类，高溶解度、高渗透性的两性分子药物，体内吸收取决于溶出度如普萘洛尔、马来酸依那普利。
  - ② II 类，低溶解度、高渗透性的亲脂性分子药物，体内吸收取决于溶解度如双氯芬酸、卡马西平。
  - ③ III 类，高溶解度、低渗透性的水溶性分子药物，体内吸收速率取决于药物渗透率如雷尼替丁、阿替洛尔。
  - ④ IV 类，低溶解度、低渗透性的疏水性分子药物，体内吸收比较困难如特非那定、呋塞米。
6. 弱酸性药物在酸性的胃液中非解离型多，吸收增多，在碱性的小肠中解离型增多，吸收减少。
7. 弱碱性药物在酸性的胃液中解离型多，吸收减少，在碱性的小肠中非解离型增多，吸收增多。
8. 使极性增加、水溶性增大的基团主要有羟基（ $-\text{OH}$ ）、巯基（ $-\text{SH}$ ）、磺酸（ $-\text{SO}_3\text{H}$ ）、羧酸（ $-\text{COOH}$ ）、季铵（ $-\text{N}^+$ ）等，不易通过生物膜；其他基团（卤素、硫、炔、烷、碳链等）多使脂溶性增大。
9. 羟基脱胎于  $\text{H}_2\text{O}$ ，水溶性强，脂溶性差，不易通过血脑屏障，易排泄，凡是羟基多的化合物，往往水溶性好，容易走肾走水，容易排出体外，毒性小，更安全。
10. 手性药物：
  - ① 对映异构体之间具有等同的药理活性和强度，如普罗帕酮和氟卡尼。
  - ② 药理活性相同但强弱不同，如氯苯那敏、萘普生。
  - ③ 一个有活性，一个没有；如甲基多巴、氨己烯酸。
  - ④ 产生相反的活性，如哌西那朵、扎考必利、依托唑啉。
  - ⑤ 产生不同药理活性，如丙氧酚、奎宁。
  - ⑥ 一个有活性，一个有毒性；如氯胺酮、丙胺卡因、乙胺丁醇。
11. I 相代谢是药物的官能团转化反应，主要是官能团在酶的催化下发生的氧化、还原、水解等生物转化反应。总体趋势是由极性小/水溶性差，变得极性大/水溶性好，走肾、走水，易于排泄，更安全。
12. II 相代谢包括葡萄糖醛酸、硫酸、氨基酸、谷胱甘肽、乙酰化、甲基化等结合反应。



葡萄糖醛酸、硫酸、氨基酸、谷胱甘肽反应使极性变大，水溶性变大，从而容易排出体外；乙酰化、甲基化使极性变小，亲水性降低。

13. 药物与非靶标结合引发的毒副作用：

①经典抗精神病药，阻断通路1（中脑—边缘通路）和通路2（中脑—皮质通路）的多巴胺D2受体发挥药效，但同时也阻断通路3（结节—漏斗通路，主管垂体前叶的内分泌功能）和通路4（黑质—纹状体通路，属于锥体外系，协调运动功能），分别导致内分泌方面的改变和锥体外系副作用。

②选择性COX-2抑制剂，抑制COX-2而不抑制COX-1，导致前列腺素PGI<sub>2</sub>产生受阻，而血栓素TXA<sub>2</sub>合成不受影响，破坏了TXA<sub>2</sub>和PGI<sub>2</sub>的平衡，引发血管栓塞事件。

③非经典抗精神病药，既能阻断DA2受体，又能阻断5-HT<sub>2</sub>受体，可通过两个神经系统的相互作用降低锥体外系副作用。

④血管紧张素转换酶抑制剂，抑制血管紧张素转换酶，用于治疗高血压。但同时阻断了缓激肽的分解，导致干咳等不良反应。

⑤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的同时也刺激了胃动素的活性，增加了胃肠道蠕动，并引起恶心、呕吐等胃肠道副作用。但12元环和16元环内酯抗生素对胃动素的刺激活性很弱，胃肠道副反应就较低。

14. 乙醇是CYP2E1的诱导剂。服用对乙酰氨基酚或含有对乙酰氨基酚成分药品的患者，如同时大量饮酒就会诱导CYP2E1酶的活性，最终产生毒性。

15. 药物代谢产物的毒副作用：双氯芬酸、奈法唑酮、曲格列酮、佐美酸、舒多昔康（肝脏毒性）；普拉洛尔（特质性硬化性腹膜炎）；苯噻洛芬、芬氯酸和异丁芬酸（葡萄糖醛酸苷酯化代谢引发急性肝中毒和变态反应）；非尔氨酯（肝脏毒性和再生障碍性贫血）。

### 第三章 常用的药物结构与作用

1. 苯二氮草类药物，苯+二个氮的草。草是含杂原子（O、N、S）的七元环；A+B+C三个环，两个氮在1，4位。

2. 西洋类药是含有1，4-苯二氮草母核结构的苯二氮草类镇静催眠药。

3. 非苯二氮草类如唑吡坦、佐匹克隆。唑吡坦的母核结构为咪唑并吡啶。佐匹克隆为吡咯酮类，S构型右旋体有短效催眠作用。

4. 抗精神病药分为三环类（吩噻嗪类、硫杂蒯类又称噻吨类、二苯并氮草类）和非三环类。

5. 丙嗪/奋乃静类药物是含有硫氮杂蒯母核的吩噻嗪类抗精神病药。

6. 氯丙嗪，小剂量抑制多巴胺受体，大剂量抑制呕吐中枢，镇吐。主要副作用锥体外系反应、光毒性变态反应。

7. 氯氮平，二苯并二氮草类，第一个非典型抗精神病药。

8. 非三环类抗精神病药有

①丁酰苯类如氟哌啶醇、氟哌啶醇癸酸酯（前药）。

②苯甲酰胺类如舒必利、硫必利、瑞莫必利，可用于精神分裂症和顽固性呕吐的对症治疗。

③其他类如齐拉西酮、利培酮，是运用**拮合原理**设计的非经典抗精神病药。

9. 根据药物的作用机制，抗抑郁药可分为去甲肾上腺素再摄取抑制药、选择性5-羟色胺再摄取抑制药、单胺氧化酶抑制药、5-羟色胺与去甲肾上腺素再摄取抑制药等多种类型。

①去甲肾上腺素再摄取抑制药又称三环类，丙米嗪（二苯并氮草类，代谢物地昔帕明）、氯米帕明、阿米替林（二苯并庚二烯，活性代谢物去甲替林）、多塞平（二苯并噻嗪类）。

②选择性5-羟色胺再摄取抑制药，氟西汀及去甲氟西汀（t<sub>1/2</sub>长，为4~16天）、舍曲林（使



用 S, S- 异构体)、氟伏沙明、西酞普兰(艾司西酞普兰 S-对映体)、帕罗西汀。

③单胺氧化酶抑制药, 吗氯贝胺和托洛沙酮。

④5-羟色胺与去甲肾上腺素再摄取双重抑制药, 文拉法辛小剂量主要抑制 5-HT 的再摄取, 大剂量对 5-HT 和 NE 的再摄取均有抑制作用。

10. **吗啡由 5 个环稠合而成**, 左旋吗啡有效, 吗啡具有苯酚结构, 在光照下能被空气氧化变质。在酸性溶液中加热, 可脱水并进行分子重排, 生成阿扑吗啡。**吗啡 3 位羟基甲基化可以得到可待因。**

11. 吗啡 N-甲基被烯丙基取代得到吗啡受体拮抗剂烯丙吗啡和纳洛酮。

12. 合成镇痛药, 盐酸哌替啶(4-苯基哌啶类镇痛药, 酯键的特殊性。非前药)、芬太尼(4-苯氨基哌啶类)、阿芬太尼、舒芬太尼、瑞芬太尼(不是前药)、美沙酮(治疗海洛因依赖脱毒和替代维持治疗)。

13. 其他合成镇痛药: 布桂嗪、曲马多。盐酸布桂嗪是阿片受体的激动-拮抗剂, 镇痛作用约为吗啡的 1/3, 显效速度快。**盐酸曲马多是微弱的  $\mu$  阿片受体激动剂**, 有两个手性中心, 临床用其外消旋体。

14. 组胺  $H_1$  受体阻断剂抗过敏药可分为氨基醚类、丙胺类、三环类、哌嗪类、哌啶类。

①氨基醚类, 苯海拉明、茶苯海明(苯海拉明+8-氯茶碱成盐。防治晕动症, 对肿瘤化疗引起的恶心、呕吐无效)。

②丙胺类, 氯苯那敏和溴苯那敏。S-优映体。

③三环类, 异丙嗪(最早, 一代)、氯雷他定(二代)、地氯雷他定(氯雷他定活性代谢物, 三代)。

④哌嗪类, 西替利嗪(二代, R-异构体左西替利嗪)。

⑤哌啶类, 特非那定和阿司咪唑(心脏不良反应撤市。活性代谢物非索非那定和诺阿司咪唑为第三代组胺  $H_1$  受体阻断药)、斯汀类。

15. 拟肾上腺素药:

① $\alpha$ 、 $\beta$  受体激动药, 肾上腺素(内源性神经递质, 含邻二酚羟基, COMT 甲基化代谢, 口服无效)、地匹福林(双特戊酯前药, 治疗开角型青光眼)、多巴胺、麻黄碱、伪麻黄碱。

② $\alpha$  受体激动药, 去甲肾上腺素(内源性物质,  $\alpha$ 、 $\beta$  受体激动药, 以  $\alpha_1$  受体作用为主)、盐酸可乐定( $\alpha$  受体激动药, 良好的中枢性降压药)、去氧肾上腺素(不被 COMT 所代谢, 可口服)、甲基多巴( $\alpha$ -甲基去甲肾上腺素的前体药)。

③ $\beta$  受体激动药, (1)**非选择性  $\beta$  受体激动药: 异丙肾上腺素用于治疗支气管哮喘发作。**(2)选择性  $\beta_1$  受体激动药: 多巴酚丁胺。含邻二酚羟基, 易代谢, 口服无效。(3)选择性  $\beta_2$  受体激动药: 沙丁胺醇、沙美特罗(长链亲脂性取代基, 长效  $\beta_2$  受体激动药)、特布他林(间二羟基)、班布特罗(特布他林前药)、富马酸福莫特罗(长效  $\beta_2$  受体激动药, R, R-异构体)、盐酸丙卡特罗。

16. **阿司匹林又称乙酰水杨酸, 含羧基(必要药效团)呈弱酸性。酯键水解产生水杨酸。环氧化酶(COX)不可逆抑制剂, 抑制血小板凝聚和防止血栓形成。**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。此反应可用于本品的鉴别。

17. 对乙酰氨基酚, 苯胺类。具酰胺键, 可水解产生对氨基酚(毒性大), 体内代谢成具肾毒性和肝毒性的乙酰亚胺酞。乙酰亚胺酞可耗竭谷胱甘肽, 引起肝坏死。解毒用含有游离巯基结构药物如谷胱甘肽或乙酰半胱氨酸。但硫醚(-S-)不能解毒。

18. 布洛芬, S-异构体活性比 R-异构体强 28 倍, 但因 R-异构体在体内可转为有效的 S-异构体, 故使用时不必拆分, 目前临床使用消旋体。

19. 非羧酸类是含潜在酸性药效团和作用于环氧酶-2 的药物:

①昔康类: **昔康类药是含有烯醇潜在酸性药效团和 1, 2-苯并噻嗪母核结构的非羧酸类非**



**甾体抗炎药。**吡罗昔康（第一个上市）、美洛昔康、依索昔康、替诺昔康、氯诺昔康。

②昔布类：COX-2 抑制剂。增大心血管事件风险。罗非昔布退市。塞来昔布、艾瑞昔布（适度抑制）。

20. **替丁类药是含有双药效团的组胺 H<sub>2</sub>受体阻断剂类抗溃疡药。**西咪替丁（咪唑环+含硫醚的四原子链+末端取代胍，肝药酶抑制剂）、雷尼替丁（咪唑环）和法莫替丁（噻唑环）、尼扎替丁及罗沙替丁乙酸酯（前药）。

21. **拉唑类药是含有苯并咪唑环母核的质子泵抑制剂类抗溃疡药。**奥美拉唑，S 和 R 两种光学异构体疗效一致，但代谢选择性却有所区别；S 比 R 在体内清除率低，经体内循环更易重复循环，维持时间更长，有更优良的药理性质。

22. 促胃肠动力药：

①中枢和外周多巴胺 D<sub>2</sub>受体阻断药甲氧氯普胺，是第一个用于临床的促动力药，有锥体外系症状，常见嗜睡和倦怠。

②外周性多巴胺 D<sub>2</sub>受体阻断药多潘立酮，极性较大，不能透过血—脑屏障。

③阻断多巴胺 D<sub>2</sub>受体并抑制乙酰胆碱活性药伊托必利。

④选择性 5-HT<sub>4</sub>受体激动药莫沙必利，西沙必利（因心脏副作用被撤市）。

23. **普利类药是含巯基（1 卡托）、二羧基（若干）和磷酸基（1 福辛）结构的血管紧张素转换酶抑制剂类抗高血压药。**赖诺普利和卡托普利是非前药的 ACE 抑制剂。

24. 血管紧张素 II 受体阻断药，含酸性基团的联苯（两个苯环手拉手）结构，酸性基团为四氮唑环或羧基。**沙坦类药是含联苯结构的血管紧张素 II 受体阻断药类抗高血压药。**

25. **他汀类药是含十氢化萘环母核结构和 3，5-二羟基羧酸药效团的羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑制剂类调节血脂药。**氟伐他汀是第一个通过全合成得到的他汀类药物。普伐他汀不是前药。

26. 抗心律失常药按其药理作用机制分为四类：① I 类，钠通道阻滞药；② II 类，β 受体阻断药，③ III 类，延长动作电位时程药物，通常指钾通道阻滞药；④ IV 类，钙通道阻滞药。其中 I、III、IV 类统称为作用于离子通道的抗心律失常药。

27. 钾通道阻滞药胺碘酮，含有碘原子，易在体内积蓄，长期用药导致心律失常，影响甲状腺素代谢。

28. β 受体阻断药，侧链上均含有带羟基的手性中心，是关键药效团。**洛尔类药是芳氧丙醇胺/苯乙醇胺结构的 β 受体阻断药类抗心律失常药。**

29. 拉贝洛尔，α、β 受体阻断药；副作用较少，为妊娠高血压的首选降压药物。

30. **地平类药是含 1，4-二氢吡啶母核结构的二氢吡啶类钙通道阻滞药类抗心绞痛药。**

31. 芳烷基胺类钙通道阻滞药维拉帕米。苯硫氮草类钙通道阻滞药地尔硫草，2 个手性碳，首过效应强，生物利用度低。

32. 甾体芳构化酶抑制药的代表药物有依西美坦和福美司坦。非甾体芳构化酶抑制药有阿那曲唑和来曲唑。

33. **格列类药是含有磺酰脲结构的促胰岛素分泌药类降血糖药。**

34. **列奈类药是被称为“餐时血糖调节剂”的非磺酰脲结构的促胰岛素分泌药类降血糖药。**

35. **列汀类药是二肽基肽酶-4 抑制剂类降血糖药。**列净类药是钠-葡萄糖协同转运蛋白 2 抑制剂类降糖药。

36. **维生素 D3 须在肝脏和肾脏两次羟基化，先在肝脏转化为骨化二醇，再经肾脏代谢为骨化三醇，才具活性。**老年人肾中 1α-羟化酶活性几乎消失，无法将维生素 D3 活化。故老年人应使用骨化三醇。

37. **青霉素抗菌药物：四元 β-内酰胺环与四氢噻唑环联合。**杂质蛋白及青霉噻唑高聚物是其过敏源。易发生交叉过敏反应。



- ①耐酸青霉素：非奈西林（6位侧链苯氧乙酰氨基）、阿度西林（6位侧链叠氮）。
- ②耐酶青霉素：耐 $\beta$ -内酰胺酶。甲氧西林（第一个用于临床，但对酸不稳定）、苯唑西林（对酸稳定，可口服）。
- ③广谱抗生素：氨苄西林（苯甘氨酸，可口服，生物利用度低）、阿莫西林（羟氨苄西林，提高口服生物利用度）、哌拉西林、羧苄西林、磺苄西林。
38. 沙星类药是含有3位羧基和4位羰基药效团的喹诺酮类合成抗菌药。
39. 磺胺类抗菌药基本结构为对氨基苯磺酰胺。靶点是细菌的二氢叶酸合成酶。
40. 洛韦类药是开环核苷类抗病毒药。
41. 青蒿素是屠呦呦从菊科植物黄花蒿中提取分离得到的具有过氧键的倍半萜内酯抗疟药。
42. 烷化剂类抗肿瘤药可分为氮芥类、亚硝基脲类及金属铂类。
- ①氮芥类：环磷酰胺（体外对肿瘤细胞无效）、异环磷酰胺（骨髓抑制、出血性膀胱炎、尿道出血等，须和尿路保护剂美司纳合用）
- ②亚硝基脲类：卡莫司汀、洛莫司汀、司莫司汀。
- ③金属铂配合物：顺铂（水溶性差且仅能注射给药）、卡铂、奥沙利铂（第一个对结肠癌有效的铂类烷化剂）。
43. 天然产物类抗肿瘤药有紫杉烷类、喜树碱类、鬼臼毒素类
- ①紫杉烷类紫杉醇：水溶性小，其注射剂通常加入表面活性剂，治疗难治性卵巢癌及乳腺癌的有效药物之一。多西他赛（水溶性好，毒性较小）：结构上与紫杉醇有两点不同：一是10位碳上的取代基，二是3'位上的侧链。卡巴他赛（多西他赛双甲基化产物）：用于治疗激素难治性前列腺癌。
- ②喜树碱类，作用靶点：拓扑异构酶I。羟喜树碱（不溶于水，毒性比较大，主要为尿频、尿痛和尿血等）、伊立替康、拓扑替康。
- ③鬼臼毒素类，作用靶点：拓扑异构酶II。依托泊苷（小细胞肺癌化疗首选药物）、替尼泊苷（脂溶性高，脑瘤首选）。
44. 叶酸类抗代谢抗肿瘤药有甲氨蝶呤、亚叶酸钙、培美曲塞。
45. 靶向抗肿瘤药多为酪氨酸激酶抑制剂，伊马替尼是第一个上市的蛋白酪氨酸激酶抑制剂。
46. 司琼类药是5-HT<sub>3</sub>受体拮抗剂类止吐药。

## 第四章 口服制剂与临床应用

1. 凡主药剂量小于50mg时需加稀释剂/填充剂，常用稀释剂有淀粉、乳糖、糊精、蔗糖、预胶化淀粉、微晶纤维素、无机盐类和甘露醇。
2. 常用的润湿剂有蒸馏水和乙醇。
3. 常用的黏合剂有淀粉浆、甲基纤维素、羟丙基纤维素、羟丙基甲基纤维素、羧甲基纤维素钠、乙基纤维素、聚维酮、明胶、聚乙二醇等。
4. 常用的崩解有干淀粉、羧甲基淀粉钠、低取代羟丙基纤维素、交联羧甲基纤维素钠、交联聚维酮和泡腾崩解剂等。
5. 常用的润滑剂有硬脂酸镁、微粉硅胶、滑石粉、氢化植物油、聚乙二醇类、十二烷基硫酸钠等。
6. 制备含有毒性药、贵重药或药物剂量小的散剂时，应采用配研法混匀并过筛。含有毒性药的口服散剂应单剂量包装。
7. 化学药和中药散剂一般含水量分别不得过2.0%和9.0%。



学习APP下载

世界上唯一只赚不赔的投资就是学习，学习让人生更为体面，考证让职业更具尊严。

8. **剧毒散剂如九分散；液体散剂如蛇胆川贝散；共熔组分散剂如白避瘟散。**
9. 除另有规定外，散剂应密闭贮存，含挥发性原料药或易吸湿性原料药的散剂应密封贮存。
10. **对光、湿、热敏感的药物一般不宜制成散剂。**
11. **颗粒剂不能过一号筛与能过五号筛颗粒总和 $\leq 15\%$ 。**
12. **化学药和中药颗粒剂一般含水量分别不得过 2.0%和 8.0%。**
13. **中药颗粒剂不宜用铁制或铝制容器冲服。**除另有规定外，颗粒剂应密封，置于干燥处贮存，防止受潮。
14. 泡腾颗粒剂 5min 内颗粒均应完全分散或溶解在水中。
15. 片剂制备中的常见问题：
  - ①**裂片**，物料中细粉太多，压缩时空气不能及时排出，导致压片后气体膨胀而裂片；物料的塑性较差，结合力弱；工艺因素。
  - ②**松片**，黏性力差或压缩压力不足。
  - ③**崩解迟缓**，压力过大，导致内部空隙小，影响水分渗入；增塑性物料或黏合剂使片剂的结合力过强；崩解剂性能较差。
  - ④**溶出超限**，不崩解、颗粒过硬、物溶解度差等。
  - ⑤**含量不均匀**，片重差异超限、药物的混合度差、可溶性成分的迁移等。
16. **中药硬胶囊水分含量不得过 9.0%。**
17. 口服滴丸的水溶性基质常用的有聚乙二醇类、硬脂酸钠、甘油明胶、泊洛沙姆、聚氧乙烯单硬脂酸酯等。脂溶性基质有硬脂酸、单硬脂酸甘油酯、氢化植物油、虫蜡、蜂蜡等。
18. 口服膜剂，药物溶解或均匀分散于成膜材料中加工成的薄膜制剂。常用成膜材料有聚乙烯醇、丙烯酸树脂类、纤维素类等；膜剂工艺简单，药物吸收快，体积小，质量轻，方便。载药量小，只适合于小剂量的药物；应密封贮存。
19. 液体制剂：
  - ①**低分子溶液剂**， $< 1\text{nm}$ ，分子/离子，均相，澄明，热力学稳定，扩散快，能透过滤纸和某些半透膜。
  - ②**胶体**：(1)高分子溶液剂， $1\sim 100\text{nm}$ ，分子，均相，澄明，热力学稳定，扩散慢，能透过滤纸，不能透过半透膜。(2)溶胶剂， $1\sim 100\text{nm}$ ，胶粒，非均相，热力学不稳定，能透过滤纸，不能透过半透膜。
  - ③**乳剂**， $> 100\text{nm}$ ，小液滴，非均相，热力学/动力学不稳定，扩散很慢或不扩散，显微镜下可见。
  - ④**混悬液**， $> 500\text{nm}$ ，固体微粒，非均相，热力学/动力学不稳定，扩散很慢或不扩散，显微镜下可见。
20. **增溶剂的最适亲水亲油平衡值为 15~18，常用增溶剂为聚山梨酯类、聚氧乙烯脂肪酸酯类等。**
21. **乳化剂：HLB 值在 3~8 的表面活性剂适用作 W/O 型乳化剂；HLB 值在 8~16 的表面活性剂可用作 O/W 型乳化剂。**
22. 阳离子型表面活性剂由于其毒性和刺激性比较大，不做内服乳剂的乳化剂用，主要用于皮肤、黏膜和手术器材的消毒；阴离子型表面活性剂一般作为外用制剂的乳化剂；
23. **阳离子表面活性剂常用品种有苯扎氯铵、苯扎溴铵。阴离子表面活性剂如高级脂肪酸盐、硫酸化物、磺酸化物等。**
24. 两性离子型表面活性剂，如琼脂、阿拉伯胶等可用作内服制剂的乳化剂；
25. 非离子型表面活性剂毒性低，相容性好，不易发生配伍变化，对 pH 的改变以及电解质均不敏感，可用于内服制剂。
26. **润湿剂：最适 HLB 值通常为 7~9，并且要在合适的温度下才能够起到润湿作用。**



27. 毒性顺序，阳离子型>阴离子型>非离子型。
28. 常用的防腐剂有苯甲酸与苯甲酸钠、对羟基苯甲酸酯类、山梨酸与山梨酸钾等。
29. 低分子溶液剂有溶液剂、芳香水剂、酊剂、酞剂、酞剂、糖浆剂。
30. 高分子溶液剂，高分子化合物（胃蛋白酶、聚维酮、羧甲基纤维素钠等）以单分子形式分散于介质中形成的均相体系，热力学稳定体系。
31. 溶胶剂，固体药物以多分子聚集体形式分散在水中形成的非均相液体制剂，也称为疏水胶体，药物微粒在1~100nm之间，胶粒是多分子聚集体，分散度极大，属热力学不稳定体系。稳定性受双电层结构 $\zeta$ -电位和水化膜厚度的影响。
32. 溶胶剂胶粒间相互聚结，结构不稳定；但具有静电稳定性。胶粒有布朗运动，具有动力学稳定性。具有Tyndall效应。双电层离子在胶粒周围形成水化膜， $\zeta$ -电位越高，扩散层越厚，水化膜越厚在一定程度上增大了胶粒的稳定性。
33. 糖浆剂含糖量不低于45%，山梨酸和苯甲酸用量不得过0.3%，羟苯酯类不得过0.05%。
34. 混悬剂特点：有助于难溶性药物制成液体制剂；相对于固体制剂，服用更方便；粗分散体系，可掩盖药物的不良气味；药物溶出慢，可长效。
35. 混悬剂贮存后再振摇，沉淀物应可很快重新分散，保证服用时的均匀性、分剂量的准确性；沉降容积比F，值越大稳定（0~1）。
36.  $\zeta$ 电位降低产生絮凝现象；升高产生反絮凝。
37. 溶血作用顺序，聚氧乙烯烷基醚>聚氧乙烯芳基醚>聚氧乙烯脂肪酸酯>吐温20>吐温60>吐温40>吐温80。
38. 口服乳剂的特点：
- ①乳剂中液滴的分散度很大，药物吸收快、药效发挥快及生物利用度高；
  - ②O/W型乳剂可掩盖药物的不良气味并可以加入矫味剂；
  - ③减少药物的刺激性及毒副作用；
  - ④可增加难溶性药物的溶解度，如纳米乳，提高药物的稳定性，如对水敏感的药物；
  - ⑤油性药物制成乳剂后，其分剂量准确，使用方便。
39. 乳剂的乳化剂：
- ①高分子化合物乳化剂：常用于O/W型乳剂。阿拉伯胶、西黄蓍胶、明胶、杏树胶、卵黄、果胶等。
  - ②表面活性剂类乳化剂：乳化能力强。但稳定性不如高分子化合物乳化剂，故通常使用混合乳化剂。
  - ③固体粉末乳化剂：不溶性细微的固体粉末，常用硅皂土、氢氧化镁、氢氧化铝、二氧化硅、白陶土等，能被水更多润湿，可用于制备O/W型乳剂；而氢氧化钙、氢氧化锌、硬脂酸镁等，能被油更多润湿可用于制备W/O型乳剂。
40. 乳剂的不稳定现象有分层、絮凝、合并与破裂、转相、酸败等。





学习APP下载

世界上唯一一只赚不赔的投资就是学习，学习让人生更为体面，考证让职业更具尊严。

## 第五章 注射剂与临床应用

1. 注射剂给药，药效迅速、剂量准确、作用可靠；适用于不宜口服给药的患者和不宜口服的药物；可发挥局部定位作用。但给药不方便，注射易引起疼痛；易发生交叉污染，安全性不及口服制剂；制造过程复杂，对生产的环境及设备要求高，生产费用较大，价格较高。
2. 饮用水可用于非灭菌制剂饮片提取。纯化水可用于普通制剂溶剂、稀释剂、中药注射剂饮片提取。注射用水可用于注射、滴眼的溶剂、稀释剂及容器精洗。灭菌注射用水用于注射用灭菌粉末溶剂、注射剂的稀释剂。
3. 注射用油常用的有大豆油、茶油、麻油等植物油。
4. 注射剂常用的抗氧化剂有亚硫酸钠、硫代硫酸钠、亚硫酸氢钠、焦亚硫酸钠等。
5. 注射剂常用的金属离子螯合剂为乙二胺四乙酸二钠（EDTA·2Na）。
6. 注射剂常用的缓冲剂有醋酸—醋酸钠、枸橼酸—枸橼酸钠、酒石酸—酒石酸钠等。
7. 注射剂常用的助悬剂有 CMC、明胶、果胶等。等渗调节剂有氯化钠、葡萄糖、甘油。
8. 注射剂常用的局麻剂/止痛剂有盐酸普鲁卡因、利多卡因。
9. 注射剂的 pH 一般在 4~9，同一品种 pH 差异范围不超过 ±1.0；渗透压与血浆相同或略偏高。溶液型注射液应澄明，不得含可见异物或不溶性微粒；无菌无热原及其他符合要求。
10. 静脉用乳状液型注射液中 90% 的乳滴粒径应在 1μm 以下，不得有大于 5μm 的乳滴。
11. 热原是微生物产生的一种内毒素，可引起恒温动物体温异常升高；大多数细菌都能产生热原，霉菌、病毒也能产生热原。致热能力最强的是革兰阴性杆菌。
12. 热原具有水溶性、不挥发性、耐热性、过滤性及其他性质如能被强酸、强碱等破坏。
13. 除去药液或溶剂中热原的方法：①吸附法：活性炭是常用的吸附剂。②离子交换法。③凝胶滤过法。④超滤法。⑤反渗透法。⑥其他方法：两次以上湿热灭菌法，或适当提高灭菌温度和时间，微波也可破坏热原。
14. 除去容器或用具上热原的方法：高温法、酸碱法。
15. 增加药物溶解度方法有加入增溶剂、加入助溶剂、制成盐类、使用混合溶剂、制成共晶。
16. 输液的分类：①电解质输液如氯化钠、乳酸钠。②营养输液如葡萄糖、氨基酸。③胶体输液如右旋糖酐、聚维酮。④含药输液如氧氟沙星。
17. 输液存在的问题：染菌问题、热源问题、可见异物与不溶性微粒的问题。
18. 药物的溶解度：稳定型 < 亚稳定型 < 无定型，水合物 < 无水物 < 有机溶剂化物。
19. 难溶性药物的溶解度随粒径减小而增加。
20. 注射用无菌粉末/粉针，临用前需经灭菌注射用水或生理盐水溶解；主要适用于水中不稳定药物，尤其是对湿热敏感的抗生素和生物制品。
21. 冻干制剂常见问题有含水量偏高、喷瓶、产品外观不饱满或萎缩。
22. 脂质体的质量要求是形态、粒径及其分布；包封率；载药量。脂质体存在的问题是靶向性和稳定性。
23. 微球分为普通注射微球、栓塞性微球、磁性微球、生物靶向性微球。
24. 微球的特点有缓释性、靶向性、降低毒副作用。
25. 微球需检查粒子大小与粒度分布、载药量、有机溶剂残留和体外释放度。
26. 微囊的质量要求是微囊的囊形、粒径、载药量与包封率及微囊中药物释放速率。
27. 其他微粒制剂：纳米乳（大多 < 100nm）、亚微乳（100~1000nm）、纳米粒（10~100nm）。



## 第六章 皮肤和黏膜给药途径制剂与临床应用

1. 软膏剂的油脂性基质：凡士林、石蜡、液状石蜡、硅油、蜂蜡、硬脂酸、羊毛脂等。
2. 软膏剂的水溶性基质：聚乙二醇、卡波姆、甘油、明胶等。
3. 乳膏剂的油相基质有硬脂酸、石蜡、蜂蜡、高级脂肪醇、凡士林、液状石蜡、植物油等。
4. 贴剂的基本结构：背衬层、药物贮库层、控释膜、胶黏膜、保护层。
5. 贴膏剂包括凝胶贴膏和橡胶膏剂。
6. 气雾剂按分散系统分为溶液型、混悬型和乳剂型；按给药途径分为吸入气雾剂、非吸入气雾剂；按处方组成为二相、三相气雾剂；按定量与否分为定量与非定量气雾剂。
7. 气雾剂的抛射剂为其专属赋形剂，为适宜的低沸点液体如①氢氟烷烃：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。③压缩气体：主要有二氧化碳、氮气、一氧化氮等。
8. 气雾剂：原料药+附加剂+抛射剂+特制阀门系统。
9. 喷雾剂：原料药+附加剂+手动泵。
10. 吸入粉雾剂：微粉化药物+吸入装置+需要患者主动吸入。
11. 喷雾剂，对肺的局部作用，其雾化粒子以3~10um大小为宜，若要迅速吸收发挥全身作用，其雾化粒径最好为1~5um大小。
12. 吸入粉雾剂药物粒度大小应控制在10um以下，其中大多数应在5um以下。
13. 吸入喷雾剂和吸入液体制剂应为无菌制剂。
14. 眼用制剂的附加剂：①调整pH，磷酸盐缓冲液、硼酸缓冲液、硼酸盐缓冲液②调节渗透压，氯化钠、葡萄糖、硼酸、硼砂③抑菌剂，三氯叔丁醇、对羟基苯甲酸甲酯与丙酯混合物、氯化苯甲羟胺、硝酸苯汞、硫柳汞、苯乙醇。
15. 眼用制剂单剂量包装不得加入抑菌剂，多剂量包装需加入抑菌剂。滴眼剂每个容器装量≤10ml；洗眼剂每个容器装量≤200ml。启用后最多使用4周。
16. 栓剂油脂性基质有可可豆脂及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。
17. 栓剂水溶性基质有甘油明胶、聚乙二醇、泊洛沙姆。
18. 栓剂常用的硬化剂有白蜡、鲸蜡醇硬脂酸、巴西棕榈蜡等。
19. 鼻用制剂，装量应不超过10ml或5g。多剂量包装的鼻用制剂在开启后使用期一般不超过4周。
20. 耳用制剂，装量应不超过10ml或5g。用于伤口或手术前使用的耳用制剂应无菌，应不含抑菌剂，并以单剂量供应。多剂量包装的耳用制剂在开启后使用期最多不超过4周。

## 第七章 生物药剂学与药代动力学

1. 药物在体内会经历吸收、分布、代谢、排泄等过程。
2. 速率常数K，描述体内各过程的快慢，药动学的特征参数。
3. 生物半衰期 $T_{1/2}$ 体内药量或血药浓度降低一半所需要的时间。表示药物从体内消除的快慢。 $T_{1/2}=0.693/K$
4. 表观分布容积V， $V=X/C$ ，X为体内药量，C为血药浓度。没有生理学与解剖学上的意义，不代表生理空间。
5. 清除率Cl，清除率与消除速率常数和表观分布容积的关系 $Cl=kV$ 。
6. 被动转运包括滤过和简单扩散。顺浓度梯度，从高浓度向低浓度转运；不消耗能量，不



需要载体；无饱和现象和竞争抑制现象，无部位特异性。

7. 载体转运包括主动转运和易化扩散，有饱和现象和竞争现象，有特异性。主动转运是逆浓度梯度，耗能。易化扩散是顺浓度梯度，不耗能。

8. 膜动转运胞饮、吞噬、胞吐。蛋白质和多肽的重要吸收方式。

9. 小肠的 pH 通常为 5~7，有利于弱碱性药物的吸收。大肠黏膜分泌的肠液的 pH 更高为 8.3~8.4。

10. 影响药物吸收的物理化学因素有脂溶性和解离度、溶出速度、药物胃肠道稳定性。

11. 口服剂型生物利用度：溶液剂>混悬剂>胶囊剂>片剂>包衣片。

12. 药物与血浆蛋白的结合：是可逆过程，有饱和现象，游离型和结合型之间存在着动态平衡关系。

13. 结合型药物的特性：不呈现药理活性；不能通过血-脑屏障分布；不被肝脏代谢灭活；不被肾排泄。

14. 某些化学物质能提高肝药酶活性，增加自身或其他药物代谢速率的现象；药效减弱。常见酶诱导剂：苯妥英钠、苯巴比妥、利福平。

15. 能抑制肝药酶活性，减慢其他药物的代谢速率；药效增强。常见酶抑制剂：华法林、西咪替丁、氯霉素。

16. 肾脏是人体排泄药物最重要的器官，肾排泄包括肾小球滤过、肾小管分泌及肾小管重吸收。

17. 药物经过 3.32 个半衰期，达坪浓度为 90%；药物经过 6.64 个半衰期，达坪浓度为 99%。

18. 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，是反映药物及其制剂临床治疗效果内在质量的重要指标，包括药物吸收速度与药物吸收程度。

19. 峰浓度  $C_{max}$ 、达峰时间  $t_{max}$  和血药浓度-时间曲线下面积 AUC 三个指标是生物等效性评价的三个主要参数。

20. 绝对生物利用度是以静脉制剂为参比制剂，相对生物利用度是以非静脉制剂为参比制剂。

## 第八章 药物对机体的作用

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从而控制感染性疾病。

2. 对症治疗：用药后能改善患者疾病的症状。如解热镇痛药降低高热患者体温、缓解疼痛；硝酸甘油缓解心绞痛；抗高血压药降压。

3. 补充疗法：补充体内物质营养或代谢物质不足。如补充铁剂治疗缺铁性贫血；补充胰岛素治疗糖尿病。

4. 药物的不良反应包括副作用、毒性反应、后遗效应、停药效应、继发反应、变态反应、特异质反应、依赖性。

5. 最小有效量/阈剂量：引起药理效应的最小药物剂量。

6. 最低有效浓度/阈浓度：引起药理效应的最低药物浓度。

7. 最大效应 ( $E_{max}$ ) 或效能：阿片类镇痛药效能高，能解除剧痛；阿司匹林类镇痛效能低，只用于一般轻、中度疼痛。

8. 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，值越小则强度越大。



学习APP下载

世界上唯一一只赚不赔的投资就是学习，学习让人生更为体面，考证让职业更具尊严。

9.  $ED_{50}$ 为半数有效量， $LD_{50}$ 为半数致死量；治疗指数为 $LD_{50}/ED_{50}$ ，表示药物的安全性，数值越大越安全。
10. 受体具有饱和性、特异性、可逆性、灵敏性、多样性。
11. 受体三大信使：①第一信使：多肽类激素、神经递质、细胞因子及药物等。②第二信使：环磷酸腺苷（cAMP，最早发现）、环磷酸鸟苷（cGMP）、二酰基甘油（DAG）、三磷酸肌醇（IP<sub>3</sub>）、前列腺素（PGs）、Ca<sup>2+</sup>、廿碳烯酸类（花生四烯酸）和一氧化氮（NO，兼具第一和第二信使特征）等。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。
12. 激动药：与受体既有亲和力，又有内在活性（ $\alpha > 0$ ）。
13. 完全激动药：亲和力高，内在活性很强（ $\alpha = 1$ ）。
14. 部分激动药：亲和力高，内在活性不强（ $0 < \alpha < 1$ ）。
15. 反向 / 负性激动药：如苯二氮草类对失活态的受体亲和力大于活化态。
16. 拮抗药：具有较强亲和力，但缺乏内在活性（ $\alpha = 0$ ）。
17. 受体脱敏指长期使用一种激动药，组织或细胞受体对激动药敏感性和反应性下降的现象，分同源脱敏和异源脱敏。
18. 受体增敏指因长期应用拮抗药，造成受体数量或敏感性提高。
19. 药物效应的相加作用，如阿司匹林+对乙酰氨基酚使解热镇痛作用增强。
20. 药物效应的增强作用，如磺胺甲恶唑与甲氧苄啶合用，抗菌作用增加 10 倍。
21. 药物效应的增敏作用，如钙增敏药作用于心肌收缩蛋白，增加肌钙蛋白对 Ca<sup>2+</sup>的亲和力。
22. 药动学差异：①乙酰化作用，如对异烟肼灭活的快慢；②水解作用，如血浆假性胆碱酯酶缺乏的人对琥珀胆碱水解灭活能力减弱；③氧化作用，如葡萄糖—6—磷酸脱氢酶缺乏、乙醛脱氢酶与乙醇脱氢酶异常等。
23. 药效学差异：华法林活性降低、胰岛素耐受性、ACEI 疗效降低等。
24. 他汀类降脂药推荐临睡前给药。
25. 铁剂 19: 00 服用较 07: 00 服用的吸收率增加一倍。
26. 茶碱 5: 00 给药比 22: 00 给药 C<sub>max</sub> 明显升高。
27.  $\beta_2$ 受体激动剂平喘药可采取剂量晨低夜高给药方法。
28. 晚间临睡前口服沙丁胺醇缓释片 16mg，可获较好疗效。
29. 茶碱类药物白天吸收快，而晚间吸收较慢，采取日低夜高的给药剂量。
30. 糖皮质激素 08: 00 时 1 次予以全天剂量比 1 天多次给药效果好，不良反应也少。