

## 《药专业知识一》考点及历年考题举例

### 药物的名称

药物的名称包括药物的通用名、化学名和商品名。

(1) **通用名**：也称为国际非专利药品名称 (INN)。通常是指有活性的药物物质，而不是最终的药品，一个药物只有一个通用名 (唯一性)。药典使用药品通用名。

(2) **化学名**：根据药物的化学结构式，参照国际纯化学和应用化学会 (IUPAC) 和中国化学会的有关原则命名，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。

例如：

通用名	化学名	母核结构
氨苄西林	6-[D-(-) 2-氨基-本乙酰氨基]青霉烷酸三水合物	$\beta$ 内酰胺环
盐酸环丙沙星	1-环丙基-6-氟-1,4-二氢-4-氧代-7-(1-哌嗪基)-3-喹啉羧酸盐一水合物	喹啉酮环
地西洋	1-甲基-5-苯基-7-氯-1,3-二氢-2H-1,4-苯并二氮杂(卅卓)-2-酮	苯并二氮(卅卓)环
尼群地平	2,6-二甲基-4-(3-硝苯基)-1,4-二氢-3,5-吡啶二甲酸甲乙酯	1,4-二氢吡啶环

(3) **商品名 (品牌名)**：通常是针对药物的最终产品，剂型和剂量确定，制药企业拥有专利权，不得冒用、顶替。选用的商品名不能暗示疗效和用途，最好简单顺口。

### 历年考题举例

关于药品命名的说法，正确的是

- A. 药品不能申请商品名
- B. 药品通用药名可以申请专利和行政保护
- C. 药品化学名是国际非专利药品名称
- D. 制剂一般采用商品名加剂型名

E. 药典中使用的名称是通用名

【答案】E

【解析】药品可以申请商品名；药品通用名不可以申请专利和行政保护；

药品通用名是国际非专利药品名称；制剂一般采用通用名加剂型名。

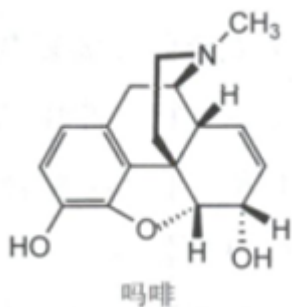
### 药物制剂的稳定性变化

稳定性变化	具体变化方式	具体药物
化学不稳定	水解	酯类：盐酸普鲁卡因
		酰胺类药物：青霉素、头孢、氯霉素、巴比妥类
	氧化	酚类：肾上腺素、左旋多巴、吗啡、水杨酸钠
		烯醇类：维生素 C
	异构化	肾上腺素、毛果芸香碱
	聚合	氨苄西林、塞替派
脱羧	对氨基水杨酸钠	
物理不稳定	混悬剂药物颗粒结块、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	
生物不稳定	微生物污染引起药物酶败分解变质	

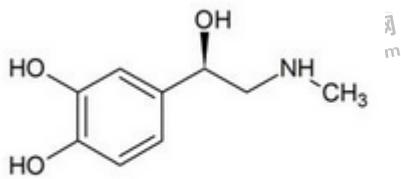
### 历年考题举例

易发生水解降解反应的药物是

A. 吗啡

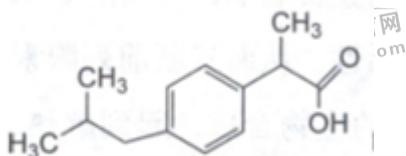


B. 肾上腺素



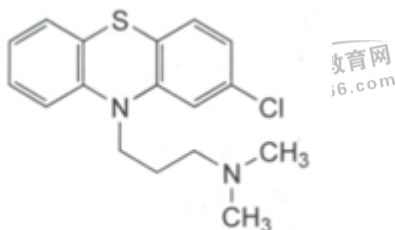
肾上腺素

C. 布洛芬



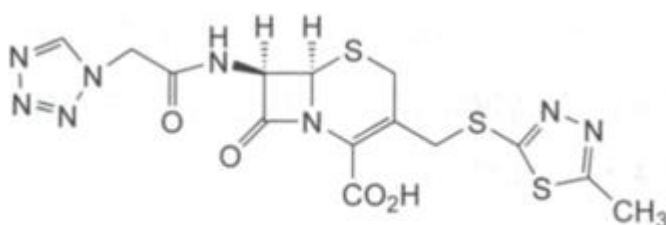
布洛芬

D. 盐酸氯丙嗪



氯丙嗪

E. 头孢唑林



头孢唑林

【答案】E

### 影响药物制剂稳定性的因素及稳定化方法

#### 1. 影响药物制剂稳定性的因素

影响因素	具体内容
处方因素	pH、溶剂、广义酸碱催化、离子强度、表面活性剂、基质或赋形剂
外界因素	温度、光线、空气（氧）、金属离子、湿度和水分、包装材料

## 2. 提高药物制剂稳定化方法

稳定化方法	具体内容	
控制温度	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	
调节 pH	固体制剂和半固体制剂中的药物若对 pH 较敏感，在选择赋形剂或基质时应注意	
改变溶剂	在水中很不稳定的药物，可采用乙醇、丙二醇、甘油等极性溶剂，或加入适量非水溶剂，延缓水解	
控制水分及湿度	采用干法制粒、流化喷雾制粒代替湿法制粒，可提高易水解药物片剂的稳定性	
遮光	光敏感的药物，采用棕色玻璃瓶包装或在包装容器内衬垫黑纸等	
驱逐氧气	通入惰性气体，如二氧化碳或氮气	
加入抗氧化剂或金属离子络合	水溶性抗氧化剂	焦亚硫酸钠、亚硫酸氢钠（适用于弱酸性溶液）
		亚硫酸钠、硫代硫酸钠（适用于偏碱性药物溶液）
		硫脲、维生素 C、半胱氨酸
	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
	金属离子络合剂	依地酸二钠（EDTA-2Na）、枸橼酸、酒石酸
稳定化的其他方法	改进剂型或生产工艺	①在水溶液中不稳定的药物，制成固体制剂（青霉素：制成无菌粉针；硝酸甘油制成膜剂）； ②制成微囊或包合物（维生素 A、维生素 C、硫酸亚铁制成微囊；盐酸异丙嗪、苯佐卡因制成包合物）； ③采用直接压片或包衣工艺（遇湿热不稳定的

	药物)
制备稳定的衍生物	将有效成分制成前体药物
加入干燥剂及改善包装	如用 3% 二氧化硅作干燥剂可提高阿司匹林的稳定性

### 历年考题举例

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. 为防止药物因受环境中的氧气、光线影响，制成微囊包合物
- 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

【答案】ABCDE

### 常用抗氧剂或金属离子络合剂

抗氧剂/金属离子络合剂	名称
水溶性抗氧剂	焦亚硫酸钠、亚硫酸氢钠（适用于弱酸性溶液）
	亚硫酸钠、硫代硫酸钠（适用于偏碱性药物溶液）
	硫脲、维生素 C、半胱氨酸
油溶性抗氧剂	叔丁基对羟基茴香醚（BHA）、2,6-二叔丁基对甲酚（BHT）、维生素 E
金属离子络合剂	依地酸二钠（EDTA-2Na）、枸橼酸、酒石酸

### 历年考题举例

- A. 酒石酸
- B. 硫代硫酸钠
- C. 焦亚硫酸钠
- D. 依地酸二钠



E. 维生素 E

1. 用于弱酸性药物液体制剂的常用抗氧化剂是
2. 用于油性液体制剂的常用抗氧化剂是
3. 用于碱性药物液体制剂的常用抗氧化剂是

【答案】CEB

药品有效期

药品有效期考点	内容
概念	对于药物降解，常用降解 10%所需的时间，称为十分之一衰期，记作 $t_{0.9}$
公式	$t_{0.9} = 0.1054/k$
有效期标注原则	若标注到日，应当为起算日期对应年月日的前一天 若标注到月，应当为起算月份对应年月的前一月
标注格式	①有效期至 XXXX 年 XX 月或者有效期至 XXXX 年 XX 月 XX 日 ②有效期至 XXXX.XX. 或者有效期至 XXXX/XX/XX

历年考题举例

关于药品有效期的说法，正确的是

- A. 有效期可用加速试验预测，用长期试验确定
- B. 根据化学动力学原理，用高温试验按照药物降解 1%所需的时间计算确定

有效期

- C. 有效期按照药物降解 50%所需时间进行推算
- D. 有效期按照  $t_{0.1} = 0.1054/k$  公式进行推算，用影响因素试验确定
- E. 有效期按照  $t_{0.9} = 0.693/k$  公式进行推算，用影响因素试验确定

答案：A

药品标准体系

1. 《中国药典》分部介绍

分部	刊载内容
----	------

《中国药典》一部	中药
《中国药典》二部	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；第二部分收载放射性药物制剂）
《中国药典》三部	生物制品
《中国药典》四部	通则和药用辅料

## 2. 《中国药典》的主要结构与内容

主要结构	作用	内容
凡例	对共性问题的统一规定	①总则；②正文；③通则；④名称与编排；⑤项目与要求；⑥检验方法和限度；⑦标准品与对照品；⑧计量；⑨精确度；⑩试药、试液、指示剂；⑪动物试验；⑫说明书、包装和标签
正文	标准的主体内容	①品名；②有机药物的结构式；③分子式；④分子量；⑤来源或有机药物的化学名称；⑥含量或效价限度；⑦处方；⑧制法；⑨性状；⑩鉴别；⑪检查；⑫含量测定；⑬类别；⑭规格；⑮贮藏；⑯杂质信息
通则	对药品质量指标的检测方法或原则的统一规定	①制剂通则与其他通则；②通用分析与检测方法；③指导原则

## 3. 国际药品标准

国际药品标准	缩写
《美国药典》	USP
《美国国家处方集》	NF
《欧洲药典》	Ph. Eur. 或 EP
《日本药典》	JP

## 历年考题举例

药品标准正文内容，除收载有名称、结构式、分子式、分子量与性状外，还载有

- A. 鉴别
- B. 检查
- C. 含量测定
- D. 药动学参数
- E. 不良反应

【答案】ABC

### 常用的鉴别方法

鉴别方法	内容
化学鉴别法	<p>①盐酸麻黄碱在碱性条件下与硫酸铜形成蓝色配位化合物；</p> <p>②吗啡与甲醛-硫酸试液反应显紫堇色；</p> <p>③氢化可的松在乙醇溶液中与硫酸苯肼加热显黄色；</p> <p>④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；</p> <p>⑤维生素 B<sub>1</sub> 在碱性条件下与铁氰化钾反应生成具有蓝色荧光的硫色素；</p> <p>⑥维生素 C 可使二氯靛酚钠褪色；</p> <p>⑦肾上腺素与三氯化铁试液反应则显翠绿色；</p> <p>⑧葡萄糖溶液遇碱性酒石酸铜试液，即生成红色氧化亚铜（Cu<sub>2</sub>O）沉淀；</p> <p>⑨尼可刹米与氢氧化钠试液加热，即发生二乙胺臭气，能使湿润的红色石蕊试纸变蓝色</p>
光谱鉴别法	<p>紫外-可见分光光度法</p> <p>①盐酸氯丙嗪用盐酸溶液（9→1000）制成每 1ml 含 5μg 的溶液，在 254nm 与 306nm 的波长处有最大吸收，在 254nm 的波长处吸光度约为 0.4；</p> <p>②布洛芬的 0.4% 氢氧化钠溶液，在 265nm 与 273nm 的波长处有最大吸收，在 245nm 与 271nm 的波长处有最小吸收，在 259nm 的波长处有一</p>

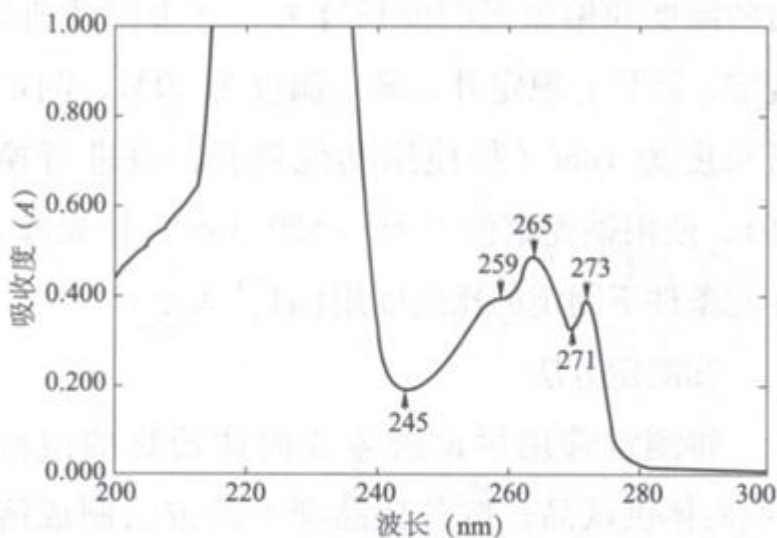


		肩峰； ③硝西洋的无水乙醇溶液，在 220nm、260nm 与 310nm 的波长处有最大吸收，260nm 与 310nm 波长处的吸光度的比值应为 1.45~1.65
	红外分光光度法	化合物的红外吸收光谱具有人指纹一样的特征专属性，几乎没有两个化合物具有相同的红外光谱
色谱鉴别法	优点	具有高灵敏度、高选择性、高效能、应用范围广等优点，是分析混合物的最有效手段
	鉴别	高效液相色谱法（HPLC）； 保留时间（ $t_R$ ）作为鉴别依据
生物学方法	利用微生物或实验动物进行鉴别，主要用于抗生素和生化药品的鉴别	

历年考题举例

- A. 265nm
- B. 273nm
- C. 271nm
- D. 245nm
- E. 259nm

布洛芬的 0.4% 氢氧化钠溶液的紫外吸收光谱如下图所示



布洛芬的紫外吸收光谱

溶剂：0.4% 氢氧化钠溶液；

浓度：每 1ml 中含布洛芬 0.25mg

1. 在布洛芬溶液的紫外吸收光谱中，除 273nm 外，最大吸收波长是
2. 在布洛芬溶液的紫外吸收光谱中，肩峰的波长是
3. 在布洛芬溶液的紫外吸收光谱中，除 245nm 外，最小吸收波长是

【答案】AEC

### 贮藏条件的定义

贮藏条件	定义	药物举例
避光	避免日光直射	-
遮光	用不透光的容器包装，例如棕色容器或黑纸包裹的无色透明、半透明容器	二氢吡啶类、维生素 A、盐酸异丙嗪、异烟肼、盐酸四环素
密闭	用可防止尘土及异物进入的容器包装	-
密封	用可防止风化、吸潮、挥发或异物进入的容器包装	乙琥胺、阿司匹林、水合氯醛、氨茶碱
熔封或严封	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	
阴凉处	贮藏处温度不超过 20℃	锭剂、丙酸倍氯米松乳膏、如头孢地尼
凉暗处	贮藏处避光并温度不超过 20℃	丙酸倍氯米松吸入气雾剂、阿法骨化醇软胶囊、头孢他啶
冷处	贮藏处温度为 2~10℃	阿法骨化醇、门冬酰胺酶
	《中国药典》规定于 2℃~8℃保存和运输	重组人胰岛素、重组人生长激素
常温	10~30℃	-

### 历年考题举例

中国药典“凡例”规定，用不透光的容器包装，需采用的贮藏条件是

- A. 避光
- B. 熔封
- C. 遮光
- D. 密闭
- E. 密封

【答案】C

### 药物与生物大分子的结合形式

键合类型		举例
共价键（不可逆）		烷化剂类抗肿瘤药、β 内酰胺类抗生素药物、拉唑类抗溃疡药物
非共价键（可逆）	离子型	去甲肾上腺素结构中的氨基在体内质子化成铵盐后，与β <sub>2</sub> 肾上腺素受体形成离子键作用；拟胆碱药物氯贝胆碱通过与 M 胆碱受体相结合产生激动作用
	氢键（最常见的非共价键形式）	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
	离子-偶极和偶	羰基化合物乙酰胆碱和受体的作用

	极-偶极	
	电荷转移复合物	抗癌药氯喹与疟原虫的 DNA 碱基对之间的作用
	疏水性相互作用	药物非极性部分与生物大分子非极性部分相互作用
	范德华力	非极性分子中的暂时不对称电荷分布
	金属离子络合物	抗肿瘤药：铂金属络合物； 金属中毒解毒剂：二巯基丙醇

**历年考题举例：**

以共价键方式结合的抗肿瘤药是

- A. 尼群地平
- B. 乙酰胆碱
- C. 氯喹
- D. 环磷酰胺
- E. 普鲁卡因

**【答案】D**

**【解析】**药物与靶标产生共价键键合的药物主要有烷化剂类抗肿瘤药物、 $\beta$ -内酰胺类抗生素药物、拉唑类抗溃疡药物等。

**生物药剂学分类**

分类	特征	归属	体内吸收决定因素	代表药
I	高水溶性、高渗透性	两亲性	溶出度	普萘洛尔、马来酸依那普利、盐酸地尔硫草
II	低水溶性、高渗透性	亲脂性	溶解度	双氯芬酸、卡马西平、吡罗昔康
III	高水溶性、低渗透性	水溶性	渗透率	雷尼替丁、纳多洛尔、阿替洛尔
IV	低水溶性、低渗透性	疏水性	难吸收	特非那定、酮洛

				芬、吠塞米
--	--	--	--	-------

**独家记忆：**

脂水分配系数，脂前水后，所以是脂相除以水相（脂上水下）；P 值越大，脂相中浓度相对越高，脂溶性越高。水溶性代表药物水溶性（药物先要溶解于以水为主体的体液中）；渗透性代表药物脂溶性（药物转运要能穿透若干层以磷脂双分子层为主的细胞膜）；哪种性质差，就是限速步骤，体内吸收的快慢就取决于该性质。生物药剂学分类系统的排序先是两亲，再是单一亲脂、单一亲水（脂水分配系数，脂先水后），最后是疏水（两不亲，不光不亲脂，还疏水）。

**历年考题举例**

生物药剂学分类系统根据药物溶解性和肠壁渗透性的不同组合将药物分为四类卡马西平属于第 II 类，是低水溶性、高渗透性的亲脂性分子药物，其体内吸收取决于

- A. 渗透率
- B. 溶解度
- C. 胃排空速度
- D. 解离度
- E. 酸碱度

【答案】B

【解析】第 II 类是低水溶性、高渗透性的亲脂性分子药物，其体内吸收取决于溶解度，如双氯芬酸、卡马西平、匹罗昔康等。

**药物的酸碱性、解离度和 pKa 对药效的影响**

有机药物多数为弱酸或弱碱，体内不同部位 pH 不同，影响药物的解离，解离型和非解离型药物的比例关系如下：

$$\text{酸性药物: } \lg \frac{[HA]}{[A^-]} = pK_a - pH$$

$$\text{碱性药物: } \lg \frac{[B]}{[HB^+]} = pH - pK_a$$



举例：对于酸性药物， $pK_a > pH$ ，非解离型（分子型）比例高； $pK_a = pH$ ，解离型和未解离型各占一半。给出  $pH$  和  $pK_a$  值，应用上述公式计算解离型和非解离型药物浓度的比值。

药物的吸收情况

分类	吸收特点	举例
弱酸性药物	胃液中（pH 低）呈非解离型，易吸收	水杨酸、巴比妥类
弱碱性药物	胃液中（pH 低）呈解离型，难吸收	奎宁、麻黄碱、氨苯砞、地西洋
	肠液中（pH 高）呈非解离型，易吸收	
碱性极弱药物	胃中解离少，易吸收	咖啡因和茶碱
强碱性药物	胃肠中多离子化，吸收差	胍乙啶
完全离子化	胃肠中多离子化，吸收差	季铵、磺酸

**独家记忆：酸酸碱碱促吸收，酸碱尖酸促排泄。**

**历年考题举例：**

药物的解离常数可以影响药物在胃和肠道中的吸收。根据上述信息，在  $pH$  为 1.49 的胃液中的阿司匹林吸收情况是

- A. 在胃液中几乎不解离，分子型和离子型的比例约为 100:1，在胃中易吸收
- B. 在胃液中不易解离，分子型和离子型的比例约为 1:1，在胃中不易吸收
- C. 在胃液中易解离，分子型和离子型的比例约为 10:1，在胃中不易吸收
- D. 在胃液中几乎全部呈解离型，分子型和离子型的比例约为 1:100，在胃中不易吸收
- E. 在胃液中几乎全部不易解离，分子型和离子型的比例约为 10:1，在胃中不易吸收

**【答案】A**

酸性药物： $\lg \frac{[HA]}{[A^-]} = pK_a - pH$

【解析】

pH为1.49， $pK_a=3.49$

带入公式得  $\lg [HA]/[A^-]=pK_a-pH=2$ ，所以  $[HA]/[A^-]=100$ 。另外可以直接根据酸酸碱碱促吸收，酸性药物在酸性环境中易吸收，所以选A。