

2024年执业药师《药学专业知识(一)》考前十页纸

第一章 药品与药品质量标准

1. 通用名、化学名、商品名的区别

- ①通用名：**国际非专利药品名（INN）**，有活性的药物物质，非最终药品。**一药一个通用名**，不受专利保护，药典使用，《中国药品通用名称（CADN）》。
- ② 化学名：标明药品化学结构。**准确表述化学结构**。
- 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。

2. 剂型分类

- ①按**形态学**：固体（**栓剂**）、半固体、液体、气体。
- ②按**给药途径**：经胃肠道、非经胃肠道（注射、皮肤、口腔、肺部、眼部、直肠、阴道和尿道）。**有无肝脏首过效应**的主要判据。
- ③按**分散体系**：**真溶液（糖浆、甘油剂）**、胶体溶液、乳剂、混悬液、气体分散、固体分散、微粒等。
- ④按**制法**：**浸出制剂、无菌制剂**。
- ⑤按**作用时间**：速释、普通、缓控释。
- 3. **剂型**：适合疾病诊断、治疗或预防需要而制备的不同**给药形式**。如片剂、胶囊剂、注射剂等。“**剂型——形式**”。
- 4. **制剂**：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**。制剂名=药品通用名+剂型名，如维生素C片、阿莫西林胶囊、鱼肝油胶丸等。“**制剂——品种**”。

5. 剂型的重要性

- ①可**改变**药物的**作用性质**： $MgSO_4$ 口服和静滴；
- ②可**调节**药物的**作用速度**：缓、控释制剂，速释制剂；
- ③可**降低**药物的**不良反应**：包合、脂质体；氨茶碱；
- ④可产生**靶向**作用：脂质体、微球、微囊；
- ⑤可**提高**药物制剂的**稳定性**：包合；
- ⑥可**影响疗效**：制备工艺。

6. 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。

7. 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（依地酸二钠）等。**

8. 抗氧化剂

①**水溶性**抗氧化剂：亚硫酸**氢**钠（弱酸性）、**焦**亚硫酸钠（弱酸性）、亚硫酸钠（偏碱性）、硫代硫酸钠（碱性）、硫脲、维生素C、半胱氨酸等；**口诀：“青（氢）椒（焦）略酸”。**

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。

9. **有效期**：对于药物降解，通常用降解 10%所需的时间。 $t_{0.9} = 0.1054/k$ 。**口诀：“十佳五四青年”。**

10. **半衰期**：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。 $T_{1/2} = 0.693/K \approx 0.7/k$ 。

11. 《中国药典》的组成：**口诀：“一中、二西、三生、四辅”。**

药典组成	内容
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
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	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	通则和药用辅料

12. 主要的国际药品标准

- ①《美国药典》USP，原料药和制剂的标准；
- ②《美国国家处方集》NF，药用辅料和食品补充剂标准；
- ③《欧洲药典》Ph. Eur或EP。不载化学药物制剂（特殊）；
- ④《日本药典》/《日本药局方》，JP。

13. 贮藏条件汇总

遮光	用不透光容器包装，如棕色容器或黑纸包裹的无色透明、半透明容器。
避光	避免日光直射。
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。
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	不超过20℃。
凉暗处	避光并不超过20℃。
冷处	2℃～10℃。
常温	10℃～30℃。
室温	25℃±2℃

• 体内药物检测

- ①最常用生物样品种类：血液（全血、血浆和血清）。
- ②血浆、血清的区别：加抗凝剂（肝素、EDTA、草酸盐、枸橼酸盐）离心后得血浆；不加抗凝剂离心后得血清。

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、β-内酰胺类抗生素药、拉唑类抗溃疡药等。
2. 非共价键：可逆
 - ①离子键：盐键，正负离子，静电吸引力，键能最强，季铵。

- ②**氢键**：最常见，最基本键合形式。磺酰胺类利尿药与碳酸酐酶。
- ③**离子-偶极和偶极-偶极相互作用**：羰基（C=O）类化合物，如酰胺、酯、酰卤、酮等，如美沙酮。
- ④**电荷转移**复合物：抗疟药氯喹。
- ⑤**疏水性**相互作用：烷基、苯基等非极性（疏水）基团。
- ⑥**范德华力**：结合力最弱，普遍。
- ⑦**金属离子络合物**：铂金属络合剂、二巯基丙醇（锑砷汞解毒）。

3. 生物药剂学分类：

分类	特征	归属	决定因素	代表药
第Ⅰ类	高溶解度 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
第Ⅱ类	低溶解度 高渗透性	亲脂性	溶解度	双氯芬酸、卡马西平、吡罗昔康
第Ⅲ类	高溶解度 低渗透性	水溶性	渗透率	雷尼替丁、纳多洛尔、阿替洛尔
第Ⅳ类	低溶解度 低渗透性	疏水性	难吸收	特非那定、酮洛芬、呋塞米。 <u>口诀：“特洛夫斯基”</u>

4. 药物酸碱性对药物的影响：①**酸性**药物在**酸性**环境（pH低的胃）中解离少，**易吸收**；②**碱性**药物在**碱性**环境（pH高的小肠）中解离少，**易吸收**。口诀：“酸酸碱碱促吸收，酸碱碱酸促排泄”。

5. 使**极性增加**、**水溶性增大**的基团主要有**羟基**（-OH）、**巯基**（-SH）、**磺酸**（-SO₃H）、**羧酸**（-COOH）、**季铵**（-N⁺）等，不易通过生物膜。

6. 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**、**氨基烯酸**。
- ④产生相反的活性，如**哌西那多**、**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**。

7. **I**相代谢是药物的**官能团**反应，包括：**氧化**、**还原**（硝基）、**水解**（酯/酰胺）等。

8. **II**相代谢/生物转化，**结合反应**，包括：**葡萄糖醛酸**、**硫酸**、**氨基酸**、**谷胱甘肽**（酸，极性大）、**乙酰化**、**甲基化**（基团小，极性小、水溶性小）。口诀：“四大两小”。

9. 药物的毒副作用

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），分别导致锥体外系副作用和内分泌方面的改变。口诀：“勾三搭四”。

②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，导致前列腺素PGI₂产生受阻，而血栓素TXA₂合成不受影响，破坏了TXA₂和PGI₂的平衡，引发血管栓塞事件。**被迫撤市**。口诀：“大吹法螺（伐、罗）”。

③**非经典抗精神病药**氯氮平、利培酮、喹硫平、阿立哌唑、奥氮平、齐拉西酮等**既能阻断D₂受体，又能阻断**

5-HT₂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。口诀：“一箭双雕”。

第三章 常用的药物结构与作用

1. 西洋类：含有 **1, 4-苯二氮草**母核结构的苯二氮草类镇静催眠药。
2. **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（艾司佐匹克隆）有短效催眠作用。
3. **丙嗪/奋乃静**类药是含有**硫氮杂蒽**母核的**吩噻嗪类**抗精神病药。
4. **氯氮平**，二苯并二氮草类，**第一个非典型抗精神病药**。
5. 齐拉西酮、利培酮，是运用**联合原理设计**的**非经典抗精神病药**。
6. **吗啡**：具有**菲环**结构，由**5个环**稠合而成，左旋吗啡有效，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**。
7. 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**。
8. 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），体内代谢成具有肾毒性和肝毒性的**乙酰亚胺醌**。
9. 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**。
10. **普利类药**是含**巯基（1卡托）、二羧基（若干）和磷酰基（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。
11. **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**。
12. **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 1 α -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。
13. 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 β -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。
14. 沙星类药：是含有**3位羧基**和**4位羰基药效团**的喹啉酮结构的喹诺酮类合成抗菌药。靶点：**DNA螺旋酶和拓扑异构酶IV**。
15. **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。

第四章 口服制剂与临床应用

1. 口服制剂的常用辅料

稀释剂	常用的有淀粉、乳糖、糊精、蔗糖、预胶化淀粉、 微晶纤维素（MCC，“干黏合剂”之称） 、无机盐类（如硫酸钙、碳酸钙等）、甘露醇（兼有矫味作用）。
润湿剂	水（首选）和乙醇。
黏合剂	淀粉浆（最常用） 、甲基纤维素（MC）、羟丙基纤维素（HPC）、羟丙基甲基纤维素（HPMC）、羧甲基纤维素钠（CMC-Na）、乙基纤维素（EC，不溶于水）、聚维酮（PVP）、明胶、聚乙二醇（PEG）等。
崩解剂	干淀粉 （适于水不溶性或微溶性药物）、羧甲基淀粉钠（CMS-Na，高效崩解剂）、低取代羟丙基纤维素（L-HPC，吸水迅速膨胀）、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，也可以用柠檬酸、富马酸与碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钾）等。
润滑剂	硬脂酸镁（MS） 、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。

2. 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。

3. 化学药、中药颗粒剂、中药散剂、中药硬胶囊一般含水量分别不得过2.0%、8.0%、9.0%、9.0%。

4. **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。**

5. 糖包衣

①**隔离层**：隔离片芯，防止水分透入。常用玉米朊乙醇溶液、邻苯二甲酸醋酸纤维素乙醇溶液以及明胶浆等。

②**粉衣层**：消除片芯边缘棱角的衣层，常用材料包括滑石粉、蔗糖粉、明胶、阿拉伯胶或蔗糖的水溶液等。

③**糖衣层**：在粉衣层外包上蔗糖衣膜，使其表面光滑、细腻，用料主要是适宜浓度的蔗糖水溶液。

④**有色糖衣层**：在蔗糖水溶液中加入适宜适量的色素。

6. **对光、湿、热敏感的药物一般不宜制成散剂。**

7. **颗粒剂不能过一号筛与能过五号筛颗粒总和 $\leq 15\%$ 。 口诀：“一五十五”。**

8. 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**，片剂硬度不够，稍加触动即散碎。黏性力差，压缩压力不足等。

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。

9. 崩解度或溶出度的要求：**分散片、可溶片3分钟；舌下片、泡腾片5分钟；普通片剂15分钟；薄膜衣片30分钟；糖衣片、肠溶衣片为60分钟。 口诀：“舌泡五分普一刻。三三十分刻（可）薄，六十定位常趟（糖）河”。**

10. 不适宜胶囊剂型（水性液体等）：**①水溶液或稀乙醇溶液；②风化性药物；③强吸湿性药物；④醛类药物；⑤挥发性、小分子有机物液体药物；⑥O/W型乳剂药物。**

11. **均相**分散系统中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。**非均相**分散系统中药物以微粒、小液滴、胶粒分散，如溶胶剂、乳剂、混悬剂。

12. 口服液体制剂的常用溶剂

①**极性**：水、甘油、二甲基亚砷。**“风（砷）干（甘）水”。**

②**半极性**：乙醇、丙二醇、聚乙二醇。**“醇”。**

③**非极性**：脂肪油、液状石蜡、油酸乙酯、乙酸乙酯。**“油、脂/酯、蜡”。**

13. 口服液体制剂的附加剂

①**增溶剂**：**表面活性剂**，最适亲水亲油平衡值（HLB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。

②**助溶剂**：**小分子的第三种物质**，形成可溶性分子间络合物、缔合物或复盐等，苯甲酸、碘化钾、酰胺或乙二胺，PVP。

③**潜溶剂**：**混合溶剂**。**水+醇**，乙醇、丙二醇、甘油、聚乙二醇等。

④**防腐剂/抑菌剂**：**苯甲酸与苯甲酸钠、山梨酸与山梨酸钾**、对羟基苯甲酸酯类（**尼泊金类**，甲、乙、丙、丁四种）；其他防腐剂（乙醇、甲酸、苯甲醇、甘油、三氯甲烷、桉油、桂皮油、薄荷油等）。

14. **阳离子表面活性剂**：**苯扎氯铵（洁尔灭）、苯扎溴铵（新洁尔灭）**。**阴离子表面活性剂**：**高级脂肪酸盐、硫酸化物、磺酸化物**等。

15. **两性离子型表面活性剂**：**天然（卵磷脂类）、人工合成（氨基酸型和甜菜碱型）**。

16. **非离子型表面活性剂**：**脂肪酸山梨坦类（司盘）、聚山梨酯（吐温）、蔗糖脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚类**等。

17. **乳化剂**：亲水亲油平衡值（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。**润湿剂**：最适 HLB 值通常为 7~9（11），并且要在合适的温度下才能够起到润湿作用。

18. 表面活性剂毒性顺序，**阳离子型>阴离子型>非离子型**。

19. **酊剂**：药物用规定浓度的乙醇浸出或溶解而制成的液体制剂，也可用流浸膏稀释制得。**含剧毒药品的酊剂每100ml相当于原药物10g，其他酊剂每100ml相当于原药物20g。酊剂中乙醇的最低含量为30%。**

20. **糖浆剂含蔗糖量不低于 45%（g/ml），山梨酸和苯甲酸用量不得过 0.3%，羟苯酯类不得过 0.05%。糖浆剂应澄清。药材提取物糖浆剂允许有少量摇之易散的沉淀。**

21. 乳剂的稳定性。

①**分层/乳析**：分散相粒子上浮或下沉的现象。**密度差**。

②**絮凝**：乳剂中分散相的乳滴荷电减少，**ζ-电位降低**，出现可逆性的聚集现象。

③**合并与破裂**：液滴合并变大，**不可逆过程**。

④**转相/转型**：**改变乳剂类型**的现象。乳化剂性质发生改变，或加入相反类型的乳化剂。

⑤**酸败**：受外界因素及微生物的影响，使其中的油、乳化剂等发生变质的现象，可加入抗氧化剂与防腐剂等防止或延缓酸败的发生。

第五章 注射剂与临床应用

1. 制药用水

①**饮用水**：可用于非灭菌制剂饮片提取。

②**纯化水**：饮用水经纯化制得。可作为配制普通药剂的溶剂或试验用水，口服、外用制剂配制用溶剂或稀释剂。纯化水不得用于注射剂的配制与稀释。

③**注射用水**：纯化水经蒸馏所得的水，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。

④**灭菌注射用水**：一般按药品批准文号管理，用于注射用灭菌粉末的溶剂或注射剂的稀释剂。

2. 热原是微生物产生的一种内毒素，能引起恒温动物体温异常升高的致热物质，“热原反应”。大多数细菌、霉菌、病毒都能产生热原。**致热能力最强的是革兰阴性杆菌**。主要污染途径来自溶剂带入。

3. 热原的性质：**水溶性、不挥发性、耐热性、过滤性、其他性质如能被强酸、强碱等破坏**。

4. 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。

5. 除去容器或用具上热原的方法：**高温法（180℃2h/250℃30min）、酸碱法**。

6. 增加药物溶解度方法：**加入增溶剂、加入助溶剂、制成盐类、使用混合溶剂、制成共晶**。

7. **输液pH与血液相近；渗透压应为等渗或偏高渗；不得添加任何防腐剂或抑菌剂**。

8. 新型靶向脂质体

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。

②**长循环**脂质体：**PEG修饰**可延长循环时间。

③**免疫**脂质体：表面联接**抗体**，提高脂质体的靶向性。

④**热敏**脂质体：相变**温度**时，类脂质双分子层膜从胶态过渡到液晶态，脂质膜通透性增加，药物释放速度增大。

⑤**pH敏感性**脂质体：选用对pH敏感类脂材料，如二棕榈酸磷脂或十七烷酸磷脂为膜材制备成载药脂质体。

9. 脂质体的质量要求是形态、**粒径**及其分布；**包封率**；**载药量**。

10. 微球静脉注射给药，通过控制微球的粒径实现被动靶。粒径**大于3 μm**的微球将被**肺**有效截获；**3 μm**以下的微球会被**肝、脾**的巨噬细胞摄取。

11. 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**。

第六章 皮肤和黏膜给药途径制剂与临床应用

1. 贴剂的处方材料

材料	具体种类
骨架 材料	疏水性的聚硅氧烷与亲水性的聚乙烯醇。
控释膜 材料	均质膜材料主要有乙烯-醋酸乙烯共聚物和聚硅氧烷等。微孔膜有聚丙烯拉伸微孔膜等。
压敏胶	聚异丁烯 类、聚丙烯酸类和硅橡胶类。
背衬 材料	常用多层复合铝箔，聚对苯二甲酸二乙酯、高密度聚乙烯、聚苯乙烯等。
防黏 材料	聚乙烯、聚苯乙烯、聚丙烯、聚碳酸酯等高聚物膜材。
药库 材料	卡波姆、羟丙基甲基纤维素、聚乙烯醇等。

2. 皮肤给药的部分液体制剂：①**搽剂**：原料药用乙醇、油或适宜溶剂制成的溶液、乳状液或混悬液，**供无破损皮肤揉擦用的液体制剂**。②**洗剂**：含原料药的溶液、乳状液、混悬液，**供清洗或涂抹无破损皮肤或腔道用的液体制剂**。③**冲洗剂**：冲洗**开放性伤口**或腔体的无菌溶液。

3. 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（气-液）**、**三相气雾剂（气-液-固，气-液-液）**；按定量与否分为定量与非定量气雾剂。

4. **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。

5. ①**气雾剂**：原料药+附加剂+**抛射剂**+特制阀门系统；②**喷雾剂**：原料药+附加剂+手动泵；③**吸入粉雾剂**：微粉化药物+吸入装置+需要患者主动吸入。

6. **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。

7. 眼用制剂的质量要求

①滴眼剂、洗眼剂和眼内注射溶液应**与泪液等渗**。

②**多剂量**眼用制剂一般应加入适宜的**抑菌剂**。

③不溶性药物应预先制成极细粉。

④**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。

⑤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。

⑥眼用制剂贮存应密封避光，启用后最多可用4周。

8. 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。

9. 栓剂**水溶性基质**有甘油明胶、聚乙二醇、泊洛沙姆。

10. 栓剂常用的硬化剂有白蜡、鲸蜡醇硬脂酸、巴西棕榈蜡等。

11. 多剂量包装的**鼻用制剂**在开启后使用期一般不超过4周。

12. 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. 药物的体内过程

①**吸收**：药物从给药部位进入体循环，速度与量。

②**分布**：药物进入体循环后向各组织、器官或体液转运。

③**代谢**：药物受体内酶系统作用，结构发生转变。

④**排泄**：药物及其代谢产物排出体外的过程。

⑤**转运**：吸收+分布+排泄。代谢不运动，排除。

⑥**处置**：分布+代谢+排泄。吸收进体循环前，排除。

⑦**消除**：肝代谢+肾排泄。药量减少的过程。

2. **被动转运**（“**顺水游泳**”）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。

3. **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（“**逆水行舟**”）是**逆**浓度梯度，耗能。易化扩散（“**顺水行舟**”）是**顺**浓度梯度，**不**耗能。

4. 注射给药

①**静脉注射和静脉滴注**：直接进入血液循环，**无**吸收过程，生物利用度为100%。

②**肌肉注射**：有吸收过程，药物经**结缔组织**扩散，再由毛细血管和淋巴吸收进入血液循环。容量一般为2~5ml。

③**皮下注射**：吸收较慢，如胰岛素，植入剂常植入皮下。

④**皮内注射**：真皮，**诊断与过敏试验**，**注射量0.2ml以内**。

⑤**动脉内注射**：抗肿瘤药经动脉作区域性滴注。

6. 影响药物吸收的排序

①多晶型溶出排序：**无定型>亚稳定型>稳定型**。

②溶剂化物溶出排序：有机溶剂化物>无水物>水合物。

③口服剂型生物利用度排序：**溶液剂>混悬剂>胶囊剂>片剂>包衣片**。

④注射剂释放速率排序：水溶液>水混悬液>油溶液>O/W型乳剂>W/O型乳剂>油混悬液。

7. 静脉滴注半衰期个数与达坪浓度分数的关系

半衰期个数 (n)	达坪浓度 (C _{ss} %)	半衰期个数 (n)	达坪浓度 (C _{ss} %)
1	50.00	5	96.88
2	75.00	6	98.44
3	87.50	6.64	99.00
3.32	90.00	7	99.22
4	93.75	8	99.61

8. **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。
9. **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。
10. ①**绝对**生物利用度是以**静脉**制剂为参比制剂，常用于原料药和新剂型研究；②**相对**生物利用度是以**非静脉**制剂为参比制剂，用于剂型之间或同种剂型不同制剂之间的比较。

第八章 药物对机体的作用

1. 药物的治疗作用分类

- ①**对因**治疗：消除原发致病因子治愈疾病。**抗生素杀灭病原微生物**。
- ②**对症**治疗：改善症状。**应用解热镇痛药降低高热患者体温；硝酸甘油缓解心绞痛；抗高血压药降低患者过高的血压；吗啡镇痛等**。
- ③**补充/替代**疗法：补充体内营养或代谢物质不足，**补充铁制剂治疗缺铁性贫血（可治愈）；补充胰岛素治疗糖尿病（治不愈）**。

2. 药品不良反应 (ADR) 的分类

副作用	药物固有药理作用所产生，药物作用选择性低导致。一般反应较轻微并可预料，多数可以恢复。 阿托品用于解除胃肠痉挛时，引起口干、心悸、便秘等副作用。
毒性反应	剂量过大或蓄积过多导致。通常比较严重，一般可预知，应避免发生。包括急性毒性反应和慢性毒性反应（包括 致癌、致畸胎和致突变反应 ）。
后遗效应	服用催眠药次晨出现 “宿醉” 现象；长期应用肾上腺皮质激素， 停药后数月难以恢复 。
停药反应	长期应用某种药物突然停药后出现原有疾病加剧的现象，又称 回跃反应或反跳 。 抗高血压药普萘洛尔和可乐定常见 。逐步减量停药。
继发反应	长期应用广谱抗生素，使敏感细菌被杀灭，而非敏感菌（如厌氧菌、真菌）大量繁殖，造成 二重感染 。
变态反应	异常免疫反应， 过敏反应 。常见于过敏体质患者。致敏物质：药物本身，代谢物和杂质（青霉素）。
特异质反应	先天遗传异常。 葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏者 （急性溶血性贫血和高铁血红蛋白血症）； 假性胆碱酯酶缺乏者 （应用琥珀胆碱出现呼吸暂停反应）。

3. 效能与效价强度的联系和区别

①最大效应 (E_{max}) 或效能 (个头, 纵坐标): 阿片类镇痛药效能高, 能解除剧痛; 阿司匹林镇痛效能低, 用于一般轻、中度疼痛。 “效能比个头”。

②效价强度 (靠左靠右): 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。 “效价强度比左右”。

4. ①治疗指数: LD_{50} (半数致死量) / ED_{50} (半数有效量), 表示药物的安全性, 数值越大越安全。 ②安全范围: ED_{95} 到 LD_5 之间的范围。

5. 药物的作用机制

①作用于受体: 胰岛素激活胰岛素受体; 阿托品阻断M胆碱受体。

②影响酶的活性: 抑制/激活酶活性产生治疗作用。

③影响细胞膜离子通道: 抗心律失常药可影响 Na^+ 、 K^+ 或 Ca^{2+} 通道。

④干扰核酸代谢: 抗代谢药伪品掺入。氟尿嘧啶抗肿瘤; 磺胺类抗菌。

⑤补充体内物质: 补充铁剂; 补充胰岛素; 补充维生素、微量元素等。

⑥改变细胞周围环境的理化性质: 抗酸药中和胃酸; 静注甘露醇利尿; 二巯基丁二酸钠解毒。

⑦影响生理活性物质及其转运体: 噻嗪类利尿药抑制肾小管 Na^+-Cl^- 转运体发挥排钠利尿作用; 丙磺舒竞争性抑制肾小管对弱酸性代谢物的转运体, 抑制原尿中尿酸再吸收, 可用于痛风的治疗。

⑧影响机体免疫功能: 免疫抑制药环孢素用于器官移植的排斥反应; 免疫增强药左旋咪唑治疗免疫缺陷性疾病。

⑨非特异性作用: 消毒防腐药体外杀菌或防腐。碳酸氢钠、氯化铵调节血液酸碱平衡等。

6. 受体具有饱和性、特异性、可逆性、灵敏性、多样性。 口诀: “多吃灵芝可以特别饱”。

7. 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 (IP₃)、前列腺素 (PGs)、 Ca^{2+} 、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。 口诀: “细胞膜前盖一二三四环”。

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。

8. 基于内在活性 (α) 的药物分类

①激动药: 与受体既有亲和力, 又有内在活性 ($\alpha > 0$)。

②完全激动药: 亲和力高, 内在活性很强 ($\alpha = 1$);

③部分激动药: 亲和力高, 内在活性不强 ($0 < \alpha < 1$);

④拮抗药: 具有较强亲和力, 但缺乏内在活性 ($\alpha = 0$)。

9. 受体的调节, 脱敏和增敏

①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。

②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。

10. 药效学方面的药物相互作用

①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。 “1+1=2”。

②药物效应的增强作用, 如磺胺甲噁唑与甲氧苄啶合用, 抗菌作用增加10倍。 “1+1>2; 1+0>1”。 ③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^{2+} 的亲和力。

④拮抗作用: 生理性 (组胺+肾上腺素)、生化性 (苯巴比妥+避孕药)、化学性 (肝素+鱼精蛋白) 和药理性 (苯海拉明+异丙肾上腺素)。

11. 女性特殊生理期用药需注意药物毒性作用

- ①月经期不宜服用泻药和抗凝药，以免盆腔充血、月经增多；
- ②妊娠期要注意药物可能对胎儿产生的不利影响，禁用已知的致畸药如碳酸锂、华法林、苯妥英及性激素等；
- ③胎儿期要注意药物对胎儿中枢及器官的影响，如孕妇应用氨基糖苷类抗生素可使婴儿听力丧失，抗甲状腺药可致。
- ④新生儿甲状腺功能减退，妊娠晚期应用氯霉素可致灰婴综合征；
- ⑤临产前禁用吗啡等可抑制胎儿呼吸的镇痛药；
- ⑥哺乳期，能通过乳汁分泌的药物对婴儿可能造成损害，如氯霉素、吩噻嗪类及苯巴比妥等。