

《考前稳押600考点》

西药一

编号	预测题干	预测答案
1	可进行注册和专利保护	药品商品名
2	称为国际非专利药品名称【INN】	药品通用名
3	经典药物的母核结构	阿托伐他汀：【吡咯环】 地西洋：【苯二氮草环】 尼群地平：【1,4-二氢吡啶环】 环丙沙星：【喹啉酮环】 阿昔洛韦：【鸟嘌呤环】 氯丙嗪：【吩噻嗪环】 氢化可的松：【甾体】 格列本脲：【苯磺酰脲】
4	制剂名【如阿莫西林胶囊】	=药品通用名（阿莫西林）+剂型名（胶囊）
5	非胃肠道给药剂型	含片、舌下片、膜剂、漱口剂、栓剂、滴鼻剂、气雾剂、滴眼剂、注射剂等
6	药物进入血液前被肝脏代谢一部分	首过消除【也称首关消除】
7	完全避免或减少首过消除的剂型	注射剂、舌下片、气雾剂、含片、栓剂、透皮贴剂、鼻腔给药制剂等
8	药物剂型的重要性	1.改变药物作用性质 2.调节药物的作用速度 3.降低或消除不良反应 4.靶向作用 5.提高药物稳定性 6.影响疗效
9	硫酸镁给药途径不同，作用不同	【静脉注射】镇静、解痉、降低血压

		【口服给药】导泻作用
10	I类药品包装材料	直接接触药品的、直接使用的：塑料输液瓶/袋
11	II类药品包装材料	直接接触药品，便于清洗，可消毒灭菌：玻璃输液瓶、输液瓶胶塞
12	III类药品包装材料	铝盖、铝塑组合盖
13	热膨胀系数小，耐热冲击性能高，所以制作低温冻干粉针瓶比较理想	高硼硅玻璃
14	也称国际中性玻璃，国际上注射液一般都采用中性玻璃	中硼硅玻璃
15	容易熔制和加工、价廉，用于制作耐热性、化学稳定性要求不高的玻璃制品	钠钙玻璃
16	塑料药包材的缺点	耐热性和耐寒性和玻璃相比较差，高温容易变形，低温容易变脆、较玻璃容易透气、透湿、易老化、不易再生
17	大量用于片剂、胶囊剂的铝塑泡罩包装的泡罩材料	聚氯乙烯 (PVC)
18	目前塑料中最轻的一种，尤其是具有较好的刚性和抗弯曲性	聚丙烯 (PP)
19	易水解的结构	内酯结构【普鲁卡因】 酰胺结构【青霉素、头孢类、氯霉素、巴比妥类】
20	易氧化药物	肾上腺素、左旋多巴、吗啡、维生素C
21	异构化反应	维生素A易氧化，也发生几何异构化
22	聚合反应	氨苄西林钠、塞替派在水溶液中发生聚合
23	脱羧反应	对氨基水杨酸钠
24	影响制剂的【处方】因素	溶剂、pH、离子强度、赋形剂、金属离子络合剂
25	影响制剂的【非处方】因素	温度、光线、水分、空气、包装材料、金属离子
26	抗氧化剂	【适合偏酸性药】焦亚硫酸钠/亚硫酸氢钠 【适合偏碱性药】亚硫酸钠/硫代硫酸钠 【油性抗氧化剂】叔丁基对羟基茴香醚 (BHA)，2,6-二叔丁基对甲酚 (BHT)、维生素E
27	金属离子络合剂	依地酸二钠、枸橼酸、酒石酸
28	药物稳定性试验方法	影响因素试验、加速试验、长期试验
29	药品【有效期】计算公式	$t_{0.9}=0.1054/k$
30	药物【半衰期】计算公式	$t_{1/2}=0.693/k$
31	药典英文缩写	《中国药典》：ChP 《美国药典》：USP 《欧洲药典》：EP (Ph.Eur.)
32	《中国药典》第四部	收载通则、药用辅料
33	是对正文、通则与药品质量检定有关的共性问题的统一规定	凡例
34	对药品质量指标的检测方法或原则的统一规定，列于四部	通则

35	中国药典正文内容	品名, 结构式, 分子式, 分子量, 来源或化学名称, 含量或效价的规定, 处方, 制法, 性状, 鉴别, 检查, 含量或效价的测定, 类别, 规格, 贮藏、制剂及杂质信息
36	药品性状包括	1.外观与臭味 2.溶解度 3.物理常数
37	检查药品中杂质是否超过限量规定	限量检查法
38	采用适当的方法检查药品的固有理化性质是否发生改变以及发生改变的程度	特性检查法
39	崩解时限检查	普通片【15min】, 分散片、可溶片【3min】 舌下片/泡腾片【5min】, 薄膜衣片【30min】 糖衣片【60min】, 硬胶囊【30min】 软胶囊【60min】, 滴丸剂【30min】 口崩片【60s】
40	凡规定检查溶出度、释放度和分散均匀性的制剂	不再进行崩解时限检查
41	凡检查含量均匀度的制剂	一般不再检查重量差异
42	生物检查法	无菌检查法、异常毒性检查法、热原检查法、细菌内毒性检查法、过敏反应检查法
43	当含量限度未规定上限时, 系指	不超过101.0%
44	原料药含量测定首选	化学分析法
45	药物制剂, 尤其是复方制剂的含量测定, 首选	具有分离能力的色谱分析法, 在辅料不干扰测定时可选用光谱分析法
46	用于色谱法【鉴别-定性】的参数	保留时间 (tR)
47	用于色谱法【定量】的参数	峰面积 (A) 或峰高 (h)
48	用于生物检定或效价测定的标准物质	标准品
49	系指采用理化方法进行鉴别、检查或含量测定时所用的标准物质	对照品
50	密闭、密封、熔封或严封区别	密闭: 将容器密闭, 以防止尘土及异物进入 密封: 将容器密封以防止风化、吸潮、挥发或异物进入 熔封或严封: 将容器熔封或用适宜的材料严封, 以防止空气与水分的侵入并防止污染
51	密封	适用于有引湿性或遇湿气易水解的药品、具有挥发性或易风化的药品的包装 例如: 乙琥胺、阿司匹林、水合氯醛、氨茶碱
52	熔封或严封	主要用于注射剂、冲洗剂等无菌制剂的包装
53	阴凉处	温度不超过20℃
54	凉暗处	避光并温度不超过20℃
55	冷处	温度为2-10℃
56	常温	温度为10-30℃

57	重组人胰岛素要求	遮光、密闭、在-15℃以下保存
58	药物引湿性	极具引湿性：引湿增重不小于15% 有引湿性：引湿增重小于15%但不小于2% 略有引湿性：引湿增重小于2%但不小于0.2% 无或几乎无引湿性：引湿增重小于0.2%
59	静脉用注射剂，均应设细菌内毒素（或热原）检查项	化学药注射剂一般首选细菌内毒素检查项 中药注射剂一般首选热原检查项
60	将一定量的供试品溶液注入小鼠体内，规定时间内观察小鼠出现的死亡情况	异常毒性检查
61	利用鲎试剂（或家兔）测定供试品所含的细菌内毒素（或热原）的限量是否符合规定	细菌内毒素或热原检查
62	通过静脉注射限值剂量供试品，观察对麻醉猫的血压反应	降压物质检查
63	将一定浓度供试品和组胺对照品依次注入离体豚鼠回肠浴槽内，分别观察出现的收缩反应幅度并加以比较	组胺类物质检查
64	将一定量的供试品皮下或腹腔注射入豚鼠体内致敏，间隔一定时间后静脉注射供试品进行激发	过敏反应检查
65	将一定量供试品与2%兔红细胞混悬液混合，温育一定时间	溶血与凝聚检查
66	影响因素试验	高温试验、高湿度试验、强光照射试验
67	在接近药品的实际贮存条件下，为制定药品的有效期提供依据	长期试验【确定有效期】
68	通过加速药物制剂的化学或物理变化，探讨药物制剂的稳定性，为处方设计、工艺改进、质量研究、包装改进等提供必要资料	加速试验【预测稳定性】
69	在相似的试验条件下单次或多次给予相同剂量的试验药物后，受试制剂中药物的吸收速度和程度与参比制剂的差异在可接受范围内	生物等效性【有效性评价】
70	全血+抗凝剂离心后所得	血浆【抗凝剂：肝素、EDTA、草酸盐、枸橼酸盐等】
71	全血不加抗凝剂，离心后所得	血清
72	体内药物检测中最为常用的样本是	血液
73	体内样品的测定方法	免疫分析法【测定各种抗原、抗体等】 色谱分析法【适用于体内复杂样品中微量药物的专属】 准确定量：气相色谱法（GC），高效液相色谱法（HPLC）和色谱-质谱联用法（GC-MS、LC-MS）
74	他汀类药物母核结构	洛伐他汀、辛伐他汀【六氢萘环】 氟伐他汀【咪唑环】 阿托伐他汀【吡咯环】 瑞舒伐他汀【噻啉环】

75	烷化剂抗肿瘤药物 β-内酰胺类抗生素药物 拉唑类抗溃疡药物	共价键【不可逆结合形式】
76	去甲肾上腺素与β ₂ 肾上腺素受体结合 氟贝胆碱与M胆碱受体相结合	离子键
77	【磺酰胺类利尿药】键合类型	氢键
78	镇痛药美沙酮分子中碳原子由于羰基极化作用形成偶极，与氨基氮原子的孤对电子形成离子-偶极作用	离子-偶极
79	【抗疟药氯喹】键合类型	电荷转移复合物
80	非共价键键合方式中最弱的	范德华力
81	药物的脂溶性用lgP表示	当药物脂溶性较低时，随着脂溶性增大，药物吸收性提高，当达到最大脂溶性后，药物吸收性降低，吸收性与脂溶性呈近抛物线的变化规律
82	第I类药物【高溶解度、高渗透性】	吸收取决于溶出度【普萘洛尔、依那普利】
83	第II类药物【低溶解度、高渗透性】	吸收取决于溶解度【卡马西平、双氯芬酸】
84	第III类药物【高溶解度、低渗透性】	吸收取决于渗透率【雷尼替丁、阿替洛尔】
85	第IV类药物【低溶解度、低渗透性】	吸收困难【吠塞米、特非那定、酮洛芬】
86	弱酸性药物的解离公式	$\lg \frac{[HA]}{[A]} = pK_a - pH$
87	弱碱性药物的解离公式	$\lg \frac{[B]}{[HB]} = pH - pK_a$
88	在胃中易吸收药物	弱酸性药物
89	在肠中易吸收药物	弱碱性药物
90	提高化合物的脂溶性，增加脂水分配系数，降低分子解离度，增加稳定性	烃基
91	属于吸电子基，影响药物分子间电荷分布和脂溶性及药物作用时间	卤素【氟奋乃静的安定作用比奋乃静强4-5倍】
92	羧酸成酯	增大脂溶性，易被吸收
93	增强与受体结合力，水溶性增加，改变活性	羟基
94	作为解毒的基团	巯基
95	易被氧化成亚砷或砷	硫醚
96	胺类生物活性比较	伯胺 > 仲胺 > 叔胺，季铵水溶性大，不易透过生物膜和血-脑屏障，口服吸收差，无中枢作用
97	增加水溶性的官能团	羟基、羧基、氨基
98	增加脂溶性的官能团	烃基、酯基、卤素
99	增加酸性的官能团	-COOH(羧基)，-SO ₃ H(磺酸基)
100	对映异构体产生相反的活性	哌西那朵、扎考必利、异丙肾上腺素
101	对映异构体产生不同类型活性	【奎宁-奎尼丁】【右丙氧芬-左丙氧芬】
102	对映异构体一个有活性，一个没活性	甲基多巴、氨基己酸
103	对映异构体之间具有等同的药理活性和强度	普罗帕酮、氟卡尼

104	一种对映体具有药理活性，另一对映体具有毒性	氯胺酮、乙胺丁醇、左旋多巴
105	对映异构体具有相同的药理活性，但强弱不同	萘普生、氧氟沙星、氯苯那敏
106	亦称为官能团化反应【I相代谢】	氧化、还原、水解、羟基化等
107	II相代谢中极性减小的反应	甲基化结合反应、乙酰化结合反应
108	芳环药物的氧化代谢	保泰松【体内代谢成羟布宗】
109	烯烃类药物代谢生成环氧化物	卡马西平I相代谢
110	含饱和碳原子药物的氧化代谢	丙戊酸钠【发生 ω 和 $\omega-1$ 氧化】
111	地西洋代谢生成奥沙西洋	N-脱甲基和 α -碳原子羟基化
112	氯霉素产生毒性的根源	二氯乙酰基侧链代谢氧化后生成酰氯，能与CYP450酶等中的脱辅基蛋白发生酰化
113	利多卡因的代谢反应	脱乙基反应
114	属前体药物，体外无效，进入体内后经还原代谢，生成硫醚类活性代谢物发挥作用	舒林酸
115	与葡萄糖醛酸发生结合反应	吗啡、氯霉素
116	与谷胱甘肽发生结合反应	白消安
117	与硫酸发生结合反应	沙丁胺醇
118	发生乙酰化结合反应	对氨基水杨酸
119	发生甲基化结合反应	肾上腺素
120	药物与非治疗部位靶标结合产生的副作用	氯丙嗪、氯普噻吨：引起锥体外系反应 罗非昔布/伐地昔布：引起心血管不良反应
121	罗非昔布引起血栓原因	破坏了TXA ₂ 与PGI ₂ 的平衡，从而增强了血小板聚集与血管收缩，引发血管栓塞事件
122	药物与非治疗靶标结合产生的副作用	氯氮平、利培酮：既阻断DA ₂ 受体，又阻断5-HT ₂ 受体 卡托普利、依那普利：同时阻断缓激肽分解 红霉素、罗红霉素：刺激胃动素的分泌
123	氯氮平、利培酮既阻断DA ₂ 受体，又阻断5-HT ₂ 受体	锥体外系反应降低
124	+抑制hERGK通道，出现心律失常	地高辛、依巴斯汀、氯雷他定、多潘立酮、特非那定、酮康唑、阿司咪唑等
125	对细胞色素P450的作用引发的毒副作用	对乙酰氨基酚与乙醇合用产生毒性
126	引起特质性硬化性腹膜炎，已撤市	普拉洛尔
127	临床III期表现出严重肝毒性	舒多昔康
128	因具有肝毒性，已停用或退市的	奈法唑酮、佐美酸、曲格列酮
129	地西洋经3位羟基化，代谢为替马西洋，再1位N-去甲基	代谢为奥沙西洋【1位N-去甲基，3位引入羟基】
130	苯二氮草类A环上7位的取代基的性质对生物活性影响大	7位引入吸电子取代基时，活性明显增强
131	苯二氮草类的1,2位联上三唑环【代表药物艾司唑仑、阿普唑仑】	增加1,2位的稳定性，代谢稳定，提高药物与受体亲和力，作用增强
132	非苯二氮草类药物	咪唑并吡啶结构药物【唑吡坦】

		吡咯酮药物【佐匹克隆】 吡唑并嘧啶【扎来普隆】
133	氯丙嗪光敏毒性的原因	遇光分解，生成自由基并与体内蛋白质作用，发生过敏反应
134	根据联合原理设计的药物	利培酮、齐拉西酮
135	利培酮的活性代谢产物	帕利哌酮
136	吩噻嗪类抗精神病药	氯丙嗪、奋乃静、氟奋乃静
137	硫杂蒴类抗精神病药	氯普噻吨、珠氯噻醇、氟哌噻吨
138	根据生物电子等排原理，用碳原子替换吩噻嗪母核上的10位氮原子，并通过双键与碱性侧链相连	硫杂蒴类
139	苯甲酰胺类【非三环类抗精神病药】	舒必利、硫必利、瑞莫必利
140	选择性5-羟色胺再摄取抑制剂	西酞普兰、氟伏沙明、氟西汀、去甲氟西汀、舍曲林、帕罗西汀
141	5-羟色胺与去甲肾上腺素再摄取抑制剂	文拉法辛、度洛西汀
142	单胺氧化酶抑制剂	吗氯贝胺、托洛沙酮
143	氟西汀口服吸收好，生物利用度100%，氟西汀在体内代谢生成	去甲氟西汀【半衰期为4-16天】
144	丙咪嗪的代谢产物	地昔帕明
145	抗抑郁药中不发生去甲基代谢的	帕罗西汀
146	抗抑郁药中发生O-去甲基代谢的	文拉法辛
147	抗抑郁药中发生N-去甲基代谢的	丙米嗪、氯米帕明、多塞平、阿米替林、氟西汀、西酞普兰
148	哌啶类镇痛药	哌替啶、芬太尼
149	吗啡3位羟基甲基化生成	可待因
150	吗啡3位，6位羟基同时酯化	海洛因
151	4-苯基哌啶类镇痛药	哌替啶
152	N-甲基被烯丙基取代的吗啡受体拮抗剂	纳洛酮、烯丙吗啡
153	吗啡光照后的产物	伪吗啡、N-氧化吗啡
154	吗啡脱水重排产物	阿扑吗啡（催吐）
155	阿片受体纯激动剂，镇痛作用无封顶效应	羟考酮【可待因6位氧化成酮，7，8位双键氢化】
156	临床上用于治疗海洛因依赖脱毒和替代维持治疗的药效作用。常作为依赖阿片病人的维持治疗药	美沙酮
157	氨基醚类抗过敏药	苯海拉明、茶海拉明、氯马斯汀、司他斯汀
158	丙胺类抗过敏药	氯苯那敏
159	三环类抗过敏药	异丙嗪、赛庚啶、酮替芬、氯雷他定
160	氯雷他定【第二代】的代谢产物	地氯雷他定【第三代】
161	西替利嗪【哌嗪类】特点	分子呈两性离子，不易穿透血-脑屏障，大大减少了镇静作用 属于第二代抗组胺药物 含有一个手性中心，具有旋光性，左旋体活性比右旋体活性更强，左西替利嗪对受体亲和力是右旋体的30倍 主要原型通过肾脏消除

162	第一个哌啶类H1受体阻断药	特非那定
163	特非那定活性代谢产物	非索非那定【第三代】
164	阿司咪唑活性代谢产物	诺阿司咪唑【第三代】
165	主要受儿茶酚胺-O-甲基转移酶【COMT】和单胺氧化酶【MAO】的催化	肾上腺素
166	属于前药，可用于治疗开角型青光眼，产生散瞳、降低眼内压作用	地匹福林
167	麻黄碱结构特点	含有2个手性碳原子，共有四个光学异构体，药用麻黄碱为(1R,2S)-赤藓糖型。临床上用的伪麻黄碱为(1S,2S)-苏阿糖型，广泛用于减鼻充血剂
168	属于前药、可用于妊娠高血压	甲基多巴
169	斑布特罗属于前药，代谢产物	特布他林
170	α 、 β 受体激动药	肾上腺素、地匹福林、多巴胺、麻黄碱
171	α 受体激动药	去氧肾上腺素、甲基多巴、可乐定
172	对乙酰氨基酚中毒解救药	谷胱甘肽、乙酰半胱氨酸
173	对乙酰氨基酚可代谢生成毒性代谢产物【乙酰亚胺醌】	引起肝毒性和肾毒性
174	贝诺酯体内水解	对乙酰氨基酚与阿司匹林
175	解热镇痛药中的前药	贝诺酯、舒林酸、萘丁美酮、洛索洛芬
176	甲基亚砷被还原为甲硫基起效	舒林酸
177	布洛芬临床用外消旋体	布洛芬在体内发生手性异构体间转化，R-异构体可转化为S-异构体
178	1,2-苯并噻嗪结构药物	美洛昔康
179	选择性COX-2抑制剂【塞来昔布】有心血管事件风险	阻断PGI ₂ 产生的同时，并不能抑制TXA ₂ 的生成，打破了正常情况下TXA ₂ 和PGI ₂ 处于平衡状态【罗非昔布因此而被主动召回】
180	我国药物化学家提出了“适度抑制”的理念研发的COX抑制剂	艾瑞昔布
181	西咪替丁组成三部分	【咪唑五元环】+【含硫醚的四原子链】+【氰基胍】
182	质子泵抑制剂组成三部分	【吡啶环】+【亚磺酰基】+【苯并咪唑】
183	奥美拉唑循环或前药循环	复活的生成的代谢物，经碱催化的Smiles重排得硫醚化合物，在肝脏可再被氧化成奥美拉唑
184	奥美拉唑特点	临床使用外消旋奥美拉唑时，在体内R-型和S-型异构体经前药循环生成相同的活性体，产生作用强度相同的抗酸分泌作用 但两种异构体在体内清除率不一样，清除率：R-异构体>S-异构体，S-异构体经体内循环更易重复循环，维持时间长，有更优良的药理性质
185	奥美拉唑的：S-(-)异构体	埃索美拉唑【代谢更慢，体内循环重复生成血药浓度更高，维持时间更长】
186	外周多巴胺D ₂ 受体拮抗剂	多潘立酮【基本没锥体外系反应】
187	中枢和外周性多巴胺D ₂ 受体拮抗剂	甲氧氯普胺【具有锥体外系反应】

188	选择性5-HT ₄ 受体激动剂	西沙必利、莫沙必利
189	阻断多巴胺D ₂ 受体和抑制乙酰胆碱酯酶活性	伊托必利
190	易引起干咳、粒细胞减少	卡托普利
191	唯一含巯基的ACEI类	卡托普利
192	含磷酰基的ACE抑制剂	福辛普利
193	卡托普利产生皮疹、味觉障碍原因	含有巯基
194	唯一两个非前药的ACEI类药物	卡托普利、赖诺普利
195	属于卡托普利的巯基乙酰化及羧基与苯甘氨酸的氨基成酰胺的前药	阿拉普利
196	结构中有1个游离羧基,1个成酯。代谢成XX普利拉起效	依那普利、贝那普利、群多普利、福辛普利、喹那普利、培哌普利、螺普利
197	血管紧张素II受体拮抗剂	氯沙坦、缬沙坦
198	氯沙坦分子结构	联苯+四氮唑+咪唑
199	分子结构中不含有咪唑	缬沙坦
200	【他汀类】中的两个前药	辛伐他汀、洛伐他汀
201	【贝特类】中的两个前药	非诺贝特、氯贝丁酯
202	他汀类药物的必需结构	3,5-二羟基戊酸
203	【第一个全合成】的他汀类药物	氟伐他汀
204	【天然或半合成】他汀类	辛伐他汀、洛伐他汀、普伐他汀
205	【洛伐他汀】的十氢萘环侧链上引入一个【甲基】	生成了【辛伐他汀】
206	他汀类典型副作用	横纹肌溶解【西立伐他汀因此而退市】
207	含有苯乙醇胺类结构,具有阻断β受体和延长心肌动作电位的双重作用	索他洛尔
208	选择性β ₁ 受体阻断药	美托洛尔、倍他洛尔、醋丁洛尔、阿替洛尔、艾司洛尔
209	α、β受体阻断药	卡维地洛、塞利洛尔、拉贝洛尔
210	属于苯乙醇胺类,妊娠高血压的首选降压药	拉贝洛尔
211	硝酸异山梨酯的代谢产物	5-单硝酸异山梨酯【半衰期长,不良反应小,已开发为临床用药】
212	钙通道阻滞剂分类	1,4-二氢吡啶类:硝苯地平、非洛地平、氨氯地平、尼莫地平 芳烷基胺类:维拉帕米 苯硫氮草类:地尔硫草
213	硝苯地平遇光不稳定,分子内部发生歧化反应,降解产物是	硝基苯吡啶衍生物和亚硝基苯吡啶衍生物
214	硝苯地平的必需药效团	1,4-二氢吡啶环
215	4位C非手性,3,5位酯基完全相同	只有【硝苯地平】
216	用于扩张脑血管钙通道阻滞剂	尼莫地平
217	2,6位不同,2位含有氨基醚苯环2'位Cl取代	氨氯地平
218	生物利用度接近100%,吸收不受食物影响,临床用	氨氯地平

	外消旋体和左旋体	
219	结构中含有一个手性碳，S-异构体的抗凝活性是R-异构体的4倍，药用其外消旋体	华法林钠
220	有一个手性碳原子，为S-构型，体外无活性，为前药，经CYP450酶系转化，再经水解形成噻吩环开环的活性代谢物	氯吡格雷
221	在可的松和氢化可的松的1位增加双键，增加了与受体的亲和力和改变了药动学性质，使其抗炎活性增大4倍，得到的药物是	泼尼松和氢化泼尼松
222	选择性雌激素受体调节剂	他莫昔芬【治疗雌激素依赖型的乳腺癌】 氯米芬【治疗不孕症】 雷洛昔芬【治疗女性绝经后骨质疏松】
223	芳构化酶抑制药	来曲唑、阿那曲唑
224	孕激素类药物	黄体酮、左炔诺孕酮
225	蛋白同化类激素	苯丙酸诺龙、司坦唑醇
226	将甲苯磺丁脲分子中脲上丁基以八氢环戊烷并[c]吡咯取代得到	格列齐特
227	噻唑烷二酮类增敏剂	罗格列酮、吡格列酮
228	餐时血糖调节剂	瑞格列奈、那格列奈
229	D-苯丙氨酸衍生物	那格列奈【D-苯丙氨酸衍生物】
230	磺酰脲类促胰岛素分泌药	格列本脲、格列美脲、格列齐特等
231	钠-葡萄糖协同转运蛋白2抑制剂	舍格列净、瑞格列净、卡格列净、恩格列净
232	含有金刚烷片段的甘氨酸胺衍生物	维达列汀
233	α -葡萄糖苷酶抑制剂	阿卡波糖、伏格列波糖
234	维生素D3的活性形式	阿法骨化醇、骨化三醇
235	维生素D3人体代谢过程	先在肝脏转化为骨化二醇，再经肾脏代谢为骨化三醇
236	阿仑膦酸钠的使用方法	为避免药物刺激上消化道，患者应在清晨、空腹时服药（早餐前至少30min），用足量水（至少200ml）整片吞服，然后站立或端坐30-60min，服药前后30min内不宜进食，饮用高钙浓度饮料及服用其他药物
237	具有双向作用，小剂量抑制骨吸收，大剂量时抑制骨形成	依替膦酸二钠
238	头孢菌素类抗菌活性药效团	β 内酰胺环+氢化噻嗪
239	青霉素类抗菌活性药效团	β 内酰胺+四氢噻唑
240	青霉素母核6位引入吸电子作用的【苯氧乙酰氨基】	非奈西林【耐酸，可口服】
241	青霉素母核6位引入【3-苯基-5-甲基异噻唑】	苯唑西林【耐青霉素酶】
242	青霉素母核6位引入【苯甘氨酸】	氨苄西林【口服、广谱】
243	抗铜绿假单胞菌的半合成青霉素	哌拉西林、羧苄西林、磺苄西林
244	广谱半合成青霉素	氨苄西林、阿莫西林

245	青霉素+丙磺舒	丙磺舒降低青霉素的排泄速率，增加疗效
246	第一代头孢菌素	头孢氨苄、头孢羟氨苄、头孢唑林
247	第二代头孢菌素	头孢克洛、头孢呋辛
248	第三代头孢菌素	头孢哌酮、头孢曲松
249	第四代头孢菌素【在第三代的基础上3位引入季铵基团】	头孢吡肟、头孢匹罗
250	【青霉素类】类抗生素	舒巴坦、他唑巴坦
251	【碳青霉烯】类抗生素	亚胺培南
252	【单环β内酰胺】类抗生素	氨曲南
253	【氧青霉烷】类抗生素	克拉维酸【β内酰胺酶不可逆抑制剂自杀性的酶抑制剂】
254	舒他西林【舒巴坦+氨苄西林】	舒巴坦为不可逆竞争性β内酰胺酶抑制剂
255	亚胺培南+西司他汀合用	减轻药物的【肾毒性】
256	头孢菌素3位取代基可明显改变抗菌活性和药动学性质	头孢菌素7位的酰胺基是抗菌谱的决定性基团
257	二氢叶酸还原酶抑制剂	甲氧苄啶、甲氨蝶呤
258	喹诺酮类的【必须】药效团	3-羧基4-羧基【与金属离子络合】
259	喹诺酮类的作用靶点	DNA螺旋酶和拓扑异构酶IV
260	【第一个引入F原子】的喹诺酮类	诺氟沙星
261	喹诺酮类具有最低抑菌浓度药物	环丙沙星
262	洛美沙星8位引入的氟原子	提高了生物利用度，但增加了光毒性
263	喹诺酮中毒性最小，活性好	左氧氟沙星
264	防治重度烧伤感染药物	磺胺嘧啶银
265	复方新诺明	磺胺甲噁唑（SMZ）:甲氧苄啶（TMP）（5:1）
266	体外无活性，但体内活性非常强，是治疗深部真菌病的首选药	氟康唑
267	多烯类抗真菌药	制霉菌素、两性霉素B
268	开环核苷类抗病毒药【抗非逆转录病毒药】	XX洛韦、替诺福韦酯、阿德福韦酯
269	6-脱氧阿昔洛韦属于前药，代谢为	阿昔洛韦【各种疱疹病毒感染的首选药】
270	更昔洛韦的生物电子等排衍生物	喷昔洛韦
271	泛昔洛韦属于前药，代谢为	喷昔洛韦
272	非核苷类抗病毒药【干扰病毒核酸复制的药物】	利巴韦林
273	核苷类逆转录酶抑制剂	齐多夫定、司他夫定、拉米夫定、恩曲他滨、扎西他滨、去羟肌苷
274	流感病毒神经氨酸酶抑制剂	奥司他韦
275	环磷酰胺+美司钠合用	减少【出血性膀胱炎】
276	叶酸拮抗剂包括	甲氨蝶呤、亚叶酸钙、培美曲塞
277	抑制蛋白质合成与功能药	长春碱、紫杉醇
278	甲氨蝶呤中毒解救药	亚叶酸钙
279	具有心脏毒性的药物	多柔比星、柔红霉素

280	小细胞性肺癌首选	依托泊苷
281	在体内转化为氟尿嘧啶	替加氟、卡莫氟
282	注射剂中加入了表面活性剂【聚环氧乙烷麻油】助溶剂容易引起变态反应	紫杉醇
283	具多靶点抑制作用的抗肿瘤药物	培美曲塞
284	酪氨酸激酶抑制剂【靶向抗肿瘤药】	伊马替尼
285	蒽醌类抗肿瘤抗生素【多柔比星、柔红霉素】的毒性主要是骨髓抑制和心脏毒性	可能是醌环被还原成半醌自由基，诱发了脂质过氧化反应，引起心肌损伤
286	由10-去乙酰基紫杉素半合成得到的又一个紫杉醇类抗肿瘤药物	多西他赛【水溶性比紫杉醇好，毒性较低，抗肿瘤谱更广】
287	脑瘤首选	替尼泊苷
288	拓扑异构酶I抑制剂	喜树碱、伊立替康
289	拓扑异构酶II抑制剂	依托泊苷、替尼泊苷
290	第一个选择性表皮生长因子受体酪氨酸激酶抑制剂，用于非小细胞肺癌治疗	吉非替尼
291	第一个上市的酪氨酸激酶抑制剂，在体内外均可在细胞水平上抑制“费城染色体”的Bcr-Abl阳性细胞系细胞	伊马替尼
292	5-HT ₃ 受体阻断剂	昂丹司琼、托烷司琼、格拉司琼
293	俗称“干黏合剂”	微晶纤维素 (MCC)
294	常用【黏合剂】	PVP、HPMC、CMC-Na
295	常用【崩解剂】	CMS-Na、L-HPC、CCMC-Na、PVPP
296	常用【润滑剂】	硬脂酸镁、微粉硅胶、滑石粉
297	物料细粉多、可塑性差	裂片
298	片剂压力大、崩解剂性能差、黏合剂过强	崩解迟缓
299	片剂不崩解、颗粒过硬	溶出超限
300	【水不溶型】高分子材料	乙基纤维素【EC】、醋酸纤维素【CA】
301	【肠溶型】高分子材料	丙烯酸树脂 (I、II、III)、CAP、HPMCP
302	【亲水性凝胶】骨架材料	羧甲基纤维素钠 (CMC-Na) 甲基纤维素 (MC) 羟丙基甲基纤维素 (HPMC) 聚维酮 (PVP)
303	【不溶性】骨架材料	乙基纤维素、聚乙烯、乙烯-醋酸乙烯共聚物
304	【生物溶蚀性】骨架材料	动物脂肪、蜂蜡、巴西棕榈蜡、氢化植物油、硬脂醇
305	不溶性高分子材料【包衣膜型释放调节剂】	EC
306	肠溶性高分子材料【包衣膜型释放调节剂】	醋酸纤维素酞酸酯 (CAP) 羟丙甲纤维素酞酸酯 (HPMCP)
307	薄膜衣中的【遮光剂】	二氧化钛
308	薄膜衣中的【致孔剂】	蔗糖、氯化钠、表面活性剂

309	薄膜衣中的【增塑剂】	丙二醇、甘油、聚乙二醇、邻苯二甲酸酯
310	【水不溶型】高分子材料	乙基纤维素【EC】、醋酸纤维素【CA】
311	【肠溶型】高分子材料	丙烯酸树脂 (I、II、III)、CAP、HPMCP
312	【胃溶型】高分子材料	PVP、HPMC、丙烯酸树脂IV号
313	对光、湿、热敏感的藥物一般不宜制成	散剂
314	含有碳酸氢钠和有机酸,遇水放出大量气体呈泡腾状颗粒	泡腾颗粒
315	在规定介质中缓慢非恒速释放药物	缓释颗粒
316	在规定介质中缓慢恒速释放药物	控释颗粒
317	指临用前能溶解于水的非包衣片或薄膜包衣片剂	可溶片
318	指在水中能迅速崩解并均匀分散的片剂	分散片
319	指在口腔内不需要用水即能迅速崩解或溶解的片剂	口腔崩解片
320	不适合制备成胶囊的藥物	强吸湿性、易风化、导致囊壁溶化的水溶液或稀乙醇溶液、导致明胶变性的醛类药物、导致囊壁软化的挥发性、小分子有机物的液体药物、导致囊壁变软的O/W型乳剂药物
321	滴丸常用【脂溶性基质】	氢化植物油、硬脂酸、单硬脂酸甘油酯
322	滴丸常用【水溶性基质】	甘油明胶、泊洛沙姆、聚乙二醇
323	适用于液体药物,及主药体积小或有刺激性的药物	滴丸
324	指药物溶解或均匀分散于成膜材料中加工成的薄膜制剂	口服膜剂
325	膜剂缺点	载药量小,只适合于小剂量的药物,膜剂的重量差异不易控制,收率不高
326	非均相液体制剂	溶胶剂、乳剂、混悬剂等
327	均相液体制剂	低分子溶液剂、高分子溶液剂
328	表面活性剂增加药物溶解度【聚山梨酯】	增溶剂
329	加入第三种物质与药物络合等【苯甲酸、碘化钾】	助溶剂
330	加入混合溶剂【乙醇、丙二醇、甘油等】	潜溶剂
331	液体制剂常用溶剂分类	极性溶剂【水、甘油、二甲基亚砷】 半极性溶剂【乙醇、丙二醇、聚乙二醇】 非极性溶剂【脂肪油、液体石蜡、乙酸乙酯】
332	常用防腐剂	苯甲酸类、对羟基苯甲酸酯类【尼泊金类】 山梨酸类、苯扎溴铵【阳离子型表面活性剂】
333	【阴离子】表面活性剂	高级脂肪酸盐、硫酸化物、磺酸化物
334	【阳离子】表面活性剂	苯扎溴铵、苯扎氯铵
335	【两性离子】表面活性剂	卵磷脂
336	【非离子型】表面活性剂	司盘、吐温、泊洛沙姆
337	表面活性剂毒性大小	阳离子型>阴离子型>非离子型
338	乳化剂HLB值区间	W/O型乳化剂HLB值: 3-8 O/W型乳化剂HLB值: 8-16

		润湿剂HLB值：7-9
339	目前制备注射用乳剂的主要乳化剂	卵磷脂
340	芳香挥发性药物（多为挥发油）的饱和或近饱和水溶液	芳香水剂
341	挥发性药物的浓乙醇溶液	醋剂
342	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	酊剂
343	药物溶解于稀醇中，形成澄明香甜的口服溶液剂	酏剂
344	含有药物的浓蔗糖水溶液，供口服使用	糖浆剂
345	沉降物容积与沉降前混悬液的容积之比	沉降容积比【F】，F值在0~1，F值越大，混悬剂就越稳定
346	混悬液常用【稳定剂】	润湿剂、助悬剂、絮凝剂与反絮凝剂
347	常用【助悬剂】包括	甘油、阿拉伯胶、海藻酸钠、羧甲基纤维素钠、PVP、HPMC等
348	乳剂常用的【絮凝剂与反絮凝剂】	枸橼酸盐、枸橼酸氢盐、酒石酸盐等
349	乳剂分散相与分散介质之间密度差造成	分层
350	乳剂的 ζ -电位降低引起	絮凝
351	乳剂的微生物影响引起	酸败
352	乳剂的乳化剂性质改变引起	转相
353	微生物污染、乳化剂性质变化、温度过高或过低	合并与破裂
354	混悬剂特点	有助于难溶性药物制成液体制剂 便于服用 粗分散体，掩盖不良气味 产生长效作用
355	生物制品一般不宜制成	注射用浓溶液
356	注射剂的质量要求	pH和血液相等或相近、渗透压与血浆相同或略高渗、无菌、无热原、澄明（溶液型）、安全稳定
357	系指原料药物或与适宜辅料制成的供临用前用无菌溶液配制成注射液的无菌粉末或无菌块状物	注射用无菌粉末
358	可用作注射剂、滴眼剂等的溶剂或稀释剂及容器的清洗溶剂	注射用水【纯化水经蒸馏所得的水】
359	注射用灭菌粉末的溶剂或注射剂的稀释剂	灭菌注射用水
360	饮用水经蒸馏法、离子交换法、反渗透法或其他适宜方法制得的制药用水	纯化水【作为配制普通药物制剂的溶剂或试验用水得用于注射的配制与稀释】
361	注射剂常用【抗氧化剂】	硫代硫酸钠、焦亚硫酸钠、亚硫酸氢钠
362	注射剂常用【抑菌剂】	三氯叔丁醇、尼泊金类、硝酸苯汞
363	注射剂【等渗调节剂】	氯化钠、葡萄糖、甘油
364	注射剂【增溶剂或乳化剂】	吐温、卵磷脂、普朗尼克
365	注射剂【助悬剂】	CMC、明胶、果胶
366	热原性质	水溶性、耐热性、不挥发性、过滤性、被强酸强碱破坏

367	除去药液或溶剂中热原的方法	吸附法、离子交换法、凝胶滤过法、超滤法、反渗透法
368	增加药物溶解度的方法	加入增溶剂、加入助溶剂、使用混合溶剂、制成盐类、制成共晶等
369	地西洋注射液+5%葡萄糖/0.9%氯化钠【析出沉淀】	溶剂组成改变
370	【pH改变】引起沉淀	诺氟沙星+氨苄西林【产生沉淀】
371	乳酸根离子会加速氨苄西林钠和青霉素G的水解	离子作用
372	两性霉素B注射液+NaCl溶液【析出沉淀】	盐析作用
373	安瓿的玻璃材质	中性玻璃：适用近中性或弱酸性注射液 含钡玻璃：碱性较强的注射液 含铅玻璃：耐酸、碱
374	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	注射用无菌粉末特点
375	输液的质量要求	不得添加任何抑菌剂
376	【电解质】输液	氯化钠注射液
377	【营养】输液	氨基酸输液、脂肪乳剂、葡萄糖注射液
378	【胶体】输液	右旋糖酐输液
379	【PEG修饰】增加脂质体柔顺性和亲水性	【长循环】脂质体
380	表面联接抗体，对靶细胞进行识别	【免疫】脂质体
381	利用肿瘤间质的pH比周围正常细胞的pH低	【pH敏感性】脂质体
382	将脂质吸附在极细的水溶性载体如氯化钠、山梨醇等聚合糖类制成	【前体】脂质体
383	利用在相变温度时，脂质体的类脂质双分子层膜从胶态过渡到液晶态，脂质体通透性增加释放药物	【热敏】脂质体
384	脂质体特点	靶向性、缓释、组织相容性、降低毒性、提高稳定性
385	脂质体主要组成成分	磷脂和胆固醇
386	丝裂霉素脂质体上结合抗胃癌细胞表面抗原的单克隆抗体，对胃癌细胞M85杀伤作用比游离丝裂霉素提高4倍	【免疫】脂质体
387	二棕榈酸磷脂（DPPC）和二硬脂酸磷脂（DSPC）按一定比例混合，制成的甲氨蝶呤脂质体	【热敏】脂质体
388	脂质体【物理稳定性】	渗漏率
389	脂质体【化学稳定性】	磷脂氧化程度
390	脂质体的质量要求	形态、粒径及其分布，包封率【80%以上】，载药量，脂质体的稳定性
391	注射于癌变部位的动脉血管内，随血流可以阻滞在瘤体周围的毛细血管内，甚至可使小动脉暂时栓塞	栓塞性微球
392	需进行有机溶剂残留检查	微球
393	天然的高分子囊材	明胶、海藻酸盐、壳聚糖、阿拉伯胶
394	半合成高分子囊材	CMC-Na, CAP, EC, HPMC等
395	被FDA批准的可降解高分子囊材	聚乳酸【PLA】、PLGA

396	皮肤给药制剂的特点	<p>直接作用疾病部位，发挥局部治疗作用</p> <p>避免肝脏首关效应和胃肠因素的干扰</p> <p>避免药物对胃肠道的副作用</p> <p>长时间维持恒定的血药浓度，避免峰-谷现象，降低药物的不良反应</p> <p>减少给药次数，患者可自主用药，特别适合于儿童、老人及不宜口服给药的患者，提高患者的用药依从性</p> <p>发现副作用时可随时中断给药</p>
397	无渗液时，用洗剂或粉雾剂	不能使用糊剂及软膏剂
398	有大量渗液时	用溶液湿敷促使炎症消退，如3%硼酸洗剂有散热、消炎、清洁作用
399	软膏剂油脂性基质	凡士林、石蜡、液状石蜡
400	软膏剂水溶性基质	聚乙二醇、卡波姆、甘油、明胶
401	贴剂【皮肤给药制剂】缺点	<p>由于起效慢，不适合要求起效快的药物</p> <p>大面积给药，可能会对皮肤产生刺激性和过敏性</p> <p>存在皮肤的代谢与贮库作用</p> <p>药物吸收的个体差异和给药部位的差异较大</p>
402	贴剂的处方材料	<p>骨架材料：聚乙烯醇</p> <p>控释膜材料：乙烯-醋酸乙烯共聚物</p> <p>压敏胶：聚异丁烯类、硅橡胶压敏胶</p> <p>背衬材料：多层复合铝箔、聚苯乙烯</p> <p>防黏材料：聚乙烯、聚苯乙烯</p> <p>药库材料：卡波姆、聚乙烯醇、HPMC</p>
403	具有一定的渗透性，利用其渗透性和膜的厚度可以控制药物的释放速率	控释膜
404	指原料药用乙醇、油或适宜的溶剂制成的溶液、乳状液或混悬液，供无破损皮肤揉擦用的液体制剂	搽剂
405	供临用前用消毒纱布或棉球等柔软物料蘸取涂于皮肤或口腔与喉部黏膜的液体制剂	涂剂
406	指原料药溶解或分散于含有膜材料溶剂中，涂搽患处后形成薄膜的外用液体制剂	涂膜剂
407	具有特制阀门系统、借助抛射剂作为动力	气雾剂
408	目前最有应用前景的一类氟氯烷烃替代品	HFA-134a【氢氟烷烃】
409	不含抛射剂、借动手动泵压力	喷雾剂
410	三相气雾剂	混悬型、乳剂型气雾剂
411	眼用液体制剂的附加剂	<p>pH调节剂：磷酸盐缓冲盐、硼酸缓冲液</p> <p>渗透压调节剂：氯化钠、葡萄糖、硼酸、硼砂</p> <p>抑菌剂：三氯叔丁醇、尼泊金类（羟苯酯类）、硫柳汞</p> <p>黏度调节剂：甲基纤维素、PVP、PEG</p>
412	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化剂或不适当的附加剂，且应采用一次性使用包装

413	【油脂性】栓剂基质	可可豆脂、椰油酯、棕榈酸酯
414	【水溶性】栓剂基质	甘油明胶、聚乙二醇、泊洛沙姆
415	栓剂常用【硬化剂】	白蜡、鲸蜡醇、硬脂酸
416	栓剂常用【抗氧化剂】	叔丁基羟基茴香醚、2,6-二叔丁基对甲酚
417	栓剂常用【防腐剂】	对羟基苯甲酸酯
418	栓剂常用【增稠剂】	氢化蓖麻油、单硬脂酸甘油酯
419	栓剂常用【吸收促进剂】	非离子型表面活性剂、硬脂酸等
420	聚乙二醇对黏膜产生刺激性	可以加入20%的水润湿或在栓剂表面涂鲸蜡醇、使用硬脂醇薄膜可减轻刺激
421	药物从给药部位进入体循环	吸收
422	药物从体循环到各个组织、器官	分布
423	药物经体内酶系统的作用	代谢【生物转化】
424	药物及其代谢产物排出体外	排泄
425	药物在体内的量或血药浓度降低一半所需要的时间	生物半衰期【 $t_{1/2}=0.693/k$ 】
426	表观分布容积计算	$V=X_0/C$ 【表观分布容积的单位通常以“L”或“L/kg”表示】
427	单位时间内从体内消除的含药血浆体积	清除率 (Cl)【 $Cl=kV$ 】
428	清除率具有加和性	$Cl = Cl_h + Cl_r$
429	表观分布容积特点	<p>1.V没有生理学与解剖学上的意义，不代表生理空间，仅仅是反映药物在体内分布程度的一项比例常数</p> <p>2.当药物的V远大于体液总体积时，表示其血中药物浓度很小，说明分布到组织中的药物多，提示药物在某些组织或器官可能存在蓄积</p> <p>3.一般水溶性或极性大的药物，不易进入细胞内或脂肪组织中，血药浓度较高，表观分布容积较小</p> <p>4.亲脂性药物在血液中浓度较低，表观分布容积通常较大，往往超过体液总体积</p> <p>5.肥胖者脂肪多，亲脂性药物在其中分布亦多，血药浓度降低，V值增大</p> <p>6.血浆蛋白结合率高的药物，在白蛋白血症患者的血中药物浓度升高，则V值减少</p>
430	水溶性小分子物质依靠膜两侧的流体静压或渗透压通过孔道	滤过
431	不需能量和载体、顺浓度梯度【高到低】	被动转运
432	需能量和载体、逆浓度梯度【低到高】	主动转运【胆酸和维生素B2在小肠上段进行转运，维生素B12在回肠末端吸收】
433	不需能量、需载体、顺浓度梯度【高到低】	易化扩散【核苷类药物水溶性大，主要靠转运蛋白跨膜转运】
434	扩散速度取决于膜两侧药物浓度、脂水分配系数、在膜内的扩散速度	简单扩散【大多数药物以这种方式通过生物膜】
435	生物膜通过主动变形，膜凹陷吞没液滴或微粒，将某些物质摄入细胞内或从细胞内释放到细胞外	膜动转运【蛋白质和多肽重要吸收方式】

436	主要的代谢器官	肝脏
437	主要的排泄器官	肾脏
438	用于某些肿瘤治疗,可提高疗效和降低毒性的注射给药方式	动脉内注射
439	需要载体转运的	具有饱和现象、竞争抑制、结构特异性
440	胃排空速率快对药物吸收影响	胃内吸收药物减少: 水杨酸盐 肠内吸收会增多或加快: 阿司匹林、地西洋、左旋多巴 疗效降低的: 氢氧化铝凝胶、三硅酸镁、硫糖铝
441	多晶型溶解度大小	无定型>亚稳定型>稳定型
442	溶剂化物溶解度大小	水合物<无水物<有机溶剂化物
443	剂型吸收快慢	溶液剂>混悬剂>胶囊剂>片剂>包衣片
444	II型药物溶解度低	通过增加溶解度和溶出速度,改善药物吸收
445	III型药物有较低的渗透性	通过增加药物的脂溶性,改善药物的渗透性
446	IV型药物的溶解度和渗透性较低	采用微粒给药系统靶向给药,或制备前体药物
447	无吸收过程,生物利用度100%	静脉注射
448	用于诊断和过敏试验,注射量0.2ml以内	皮内注射
449	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,可用溶液剂、混悬剂或乳剂	肌肉注射
450	容易透过皮肤的药物	脂溶性大、分子型、低熔点
451	各种注射液中药物释放速度排序	水溶液>水混悬液>油溶液>O/W型乳剂>W/O型乳剂>油混悬剂
452	某些大分子、水溶性或解离型药物	难以进入脑组织
453	鼻黏膜给药	可避开首关消除,吸收程度和速度有时可与静脉注射相当
454	能够迅速从直肠吸收	脂溶性好、非解离型的药物
455	栓剂中药物吸收的限速过程	是基质中药物释放到体液的速度,而不是药物在体液中的溶解度
456	眼部药物吸收途径	角膜渗透【局部作用】、结膜渗透【全身作用】
457	容易经过角膜渗透吸收	脂溶性药物
458	主要通过结膜途径吸收	亲水性药物及多肽蛋白质类药物
459	药物与蛋白质结合后	不能通过血管壁向组织转运,不能由肾小球滤过,也不能经肝脏代谢
460	肝脏疾病或由于体内蛋白总浓度降低,会导致药物蛋白结合率改变	蛋白结合率高的药物,在血浆中的游离浓度小,结合率低的在血浆中的游离药物浓度高
461	药物透过血-脑屏障的决定因素	药物的亲脂性【大分子、水溶性或解离型药物难于进入脑组织】
462	酶诱导剂	卡马西平、苯妥英钠、苯巴比妥、利福平、水合氯醛、乙醇、保泰松
463	酶抑制剂	胺碘酮、红霉素、酮康唑、西咪替丁、异烟肼、甲苯磺丁脲
464	口服抗凝血药双香豆素加服苯巴比妥,双香豆素血药浓度下降	属于酶的诱导作用
465	口服甲苯磺丁脲加服氯霉素,出现低血糖	属于酶的抑制作用

466	一些结核病患者对治疗结核病的药物异烟肼的反应不一样,有“快乙酰化”和“慢乙酰化”,慢乙酰化患者出现肢端疼痛、麻刺感 硫嘌呤甲基转移酶缺陷的患者服用常规剂量的硫基嘌呤或硫唑嘌呤会产生有生命危险的严重造血毒性	属于基因多态性
467	胎儿及新生儿的药物代谢酶活性比成年人低的多,所以新生儿用药时,不仅药效强,毒性也高	属于生理因素
468	青霉素+丙磺舒	减慢排泄,药效增强
469	脂溶性大、非解离型药物【分子型】	肾小管重吸收大
470	随胆汁排入十二指肠的药物或其代谢物,在肠道中重新被吸收,经门静脉返回肝脏,重新进入血液循环	肠-肝循环【一些药物因有肠-肝循环在血药浓度-时间曲线上出现第二个峰,即双峰现象】
471	当药物进入体循环后,能够迅速分布到全身各处,并很快在血液与各组织脏器之间达到动态平衡,并通过排泄或代谢进行消除	单室模型
472	药物进入体循环后,能很快地分布在整个中央室并迅速达到平衡,同时药物在中央室和周边室之间进行可逆转运;一定时间后,中央室和周边室的药物才达到动态平衡	双室模型
473	稳态血药浓度表示	C _{ss}
474	经过几个半衰期达到90%和99%的达坪浓度分数	3.32个和6.64个
475	单室模型静脉注射给药【一级消除】	$\lg C = -\frac{k}{2.303}t + \lg C_0$
476	【单室模型静脉注射】关键字母	X ₀ 或C ₀
477	【单室模型静脉滴注】关键字母	k ₀
478	【单室模型血管外给药】关键字母	K _a
479	【双室模型静脉注射】关键字母 $C = Ae^{-\alpha t} + Be^{-\beta t}$	A与B分成两项书写 α 称为分布速度常数【快配置速度常数】 β 称为消除速度常数【慢配置速度常数】
480	【多剂量给药】关键字母	给药次数n与给药间隔时间(τ)
481	米氏方程【非线性药动学】关键字母	V _m 、K _m
482	非线性药动学的特点	药物的消除不呈现一级动力学特征,即消除动力学是非线性的 当剂量增加时,消除半衰期延长 AUC和平均稳态血药浓度与剂量不成正比 其他可能竞争酶或载体系统的药物,影响其动力学过程
483	线性药动学的特点	药物的消除符合一级动力学特征 当剂量增加时,药物的消除速率常数、半衰期和清除率保持不变 AUC和平均稳态血药浓度与剂量成正比 剂量改变时,原药与代谢产物的组成比例不会发生变化
484	药-时曲线的【零阶矩】定义	血药浓度-时间曲线下面积

485	药-时曲线的【一阶矩】定义	时间与血药浓度的乘积-时间曲线下的面积【AUMC】
486	MRT: 平均滞留时间	一阶矩AUMC与零阶矩AUC的比值得到MRT, MRT代表了药物在体内的平均滞留时间的长短, 是一个反映速度的函数
487	药物进入血液循环的速度和程度	生物利用度
488	药物吸收速度	常用血药浓度-时间曲线的达峰时间T _{max} 来表示, 达峰时间短, 则药物吸收快
489	药物吸收程度	即药物进入血液循环的多少, 可用血药浓度-时间曲线下面积AUC来表示, 它与药物吸收总量成正比
490	生物等效性评价参数	C _{max} 、t _{max} 、AUC
491	试验制剂口服与静脉注射的AUC比值	绝对生物利用度
492	试验制剂与参比制剂口服AUC比值	相对生物利用度
493	在相似的试验条件下单次或多次给予相同剂量的试验药物后, 受试制剂中药物的吸收速度和吸收程度与参比制剂的差异在可接受范围内, 反映其吸收程度和速度的主要药动学参数无统计学差异	生物等效性
494	指药物对机体的初始作用	药物作用
495	药物初始作用引起的机体原有生理、生化等功能或形态的变化, 是药物作用的结果	药物效应
496	指在一定剂量下, 药物对不同的组织器官作用的差异性	选择性
497	抗生素杀灭病原微生物	属于对因治疗
498	解热镇痛药降低体温 硝酸甘油缓解心绞痛 抗高血压药物降低血压	属于对症治疗
499	补充铁剂治疗缺铁性贫血 补充胰岛素治疗糖尿病	属于补充治疗
500	药物按正常剂量使用, 出现与治疗目的无关的不适反应	副作用【阿托品引起口干、心悸、便秘等】
501	药物剂量过大或体内蓄积过多时发生的危害机体的反应	毒性作用【氨基糖苷类引起耳毒性】
502	停药后血药浓度已降低至最低有效浓度以下时, 仍残存的药理效应	后遗效应【苯二氮草类引起宿醉现象, 长期用激素引起肾上腺皮质萎缩, 一旦停药, 肾上腺皮质功能低下】
503	药物的治疗作用引起的不良反应, 是治疗剂量下治疗作用本身带来的间接结果	继发性反应【四环素导致二重感染】
504	长期服用某药, 产生适应性, 若突然停药或减量过快发生功能紊乱, 导致病情加重或反跳回升现象, 又称“反跳反应”或“回跃反应”	停药反应【普萘洛尔停药引起心跳加快】
505	因先天性遗传异常引起	特异质反应【如假性胆碱酯酶缺乏者, 应用琥珀胆碱后, 由于延长了肌肉松弛作用而常出现呼吸暂停反应】

506	先天性葡萄糖-6-磷酸脱氢酶【G-6-PD】缺乏的疟疾患者服用伯氨喹后，容易发生急性溶血性贫血和高铁血红蛋白血症	特异质反应
507	指机体受药物刺激所发生的异常免疫反应，引起机体生理功能障碍或组织损伤，也称为过敏反应	变态反应
508	中枢神经系统对长期使用的药物所产生的一种身体适应状态，一旦停药，将发生一系列生理功能紊乱称为戒断综合征	生理依赖性
509	多次用药后使人产生欣快感，导致用药者在精神上对所用药物有一种渴求连续不断使用的强烈欲望，继而引发强迫用药行为，也称为成瘾性	精神依赖性
510	血压、心律、尿量、血糖浓度	量反应
511	存活与死亡、睡眠与否、惊厥与不惊厥	质反应
512	量效关系中，以药理效应强度为纵坐标，药物剂量或浓度为横坐标，得到直方双曲线	将药物浓度或剂量改用对数值作图，呈现典型的S形曲线，即量-效曲线
513	引起药理效应的最小药量	最小有效量【阈剂量】
514	药物所能达到的最大效应【Emax】	效能【反应了药物的内在活性】
515	引起等效反应的相对剂量或浓度	效价强度【其值越小，强度越大】
516	引起50%阳性反应的剂量	半数有效量【ED50】
517	引起50%动物死亡量	半数致死量【LD50】
518	LD50/ED50	治疗指数【越大越安全】
519	ED95与LD5的距离	安全范围【越大越安全】
520	给药至时-效曲线与有效效应线首次相交点的时间，代表药物发生疗效以前的潜伏期	起效时间
521	从起效时间开始到到-效曲线下降到与有效效应线再次相交点之间时间	疗效维持时间
522	曲线从降到有效效应线以下到作用完全消失之间的时间	作用残留时间
523	MTC	最小中毒浓度
524	MEC	最小有效浓度
525	阿托品、肾上腺素作用机制	作用于【受体】
526	卡托普利、阿司匹林、地高辛作用机制	影响【酶活性】
527	利多卡因、硝苯地平、阿米洛利、米诺地尔的作用机制	影响【细胞膜离子通道】
528	磺胺类、喹诺酮类、齐多夫定作用机制	干扰【核酸代谢】
529	氢氯噻嗪作用机制	影响【生理活性物质及其转运体】
530	氢氧化铝抗酸药、甘露醇脱水、二巯基丁二酸钠作用机制	改变细胞周围环境起作用
531	铁剂治疗贫血、胰岛素治疗糖尿病	补充体内物质

532	环孢素、左旋咪唑、丙种球蛋白作用机制	影响机体免疫功能
533	消毒防腐药用于体外杀菌或防腐的作用机制	非特异性作用
534	受体的性质	饱和性、特异性、可逆性、灵敏性、多样性
535	当药物达到一定浓度,其效应不会随浓度增加而增加	饱和性
536	特定的配体只能与特定受体结合	特异性
537	受体能识别周围环境中微量的配体	灵敏性【例如 5×10^{-19} mol/L的乙酰胆碱溶液就能对蛙心产生明显的抑制作用】
538	受体与配体形成的复合物可以解离,也可以被另一种配体置换	可逆性
539	药理效应与被占领受体数量成正比	占领学说
540	M胆碱受体、肾上腺素受体、5-HT受体属于	G蛋白偶联受体
541	N胆碱受体、兴奋性氨基酸受体、GABA受体	配体门控的离子通道受体
542	肾上腺皮质激素、甲状腺激素、维A酸等在细胞核上有相应受体	细胞核激素受体
543	第一信使	多肽类激素、神经递质、细胞因子
544	第二信使	cAMP、cGMP、DAG、IP ₃ 、钙离子、NO
545	第三信使	生长因子、转化因子
546	既是第一信使,又是第二信使	NO
547	亲和力较强、内在活性较强【 $\alpha=1$ 】	完全激动药【吗啡】
548	亲和力较强、内在活性不强【 $\alpha < 1$ 】	部分激动药【喷他佐辛】
549	亲和力较强、无内在活性【 $\alpha=0$ 】	拮抗药
550	拮抗参数pA ₂ 定义	在拮抗药存在时,若2倍浓度的激动药所产生的效应恰好等于未加入拮抗药时激动药效应,则加入的拮抗药的摩尔浓度的负对数称为pA ₂
551	E _{max} 不变、量-效曲线平行右移	竞争性拮抗药
552	E _{max} 下降	非竞争性拮抗药
553	长期使用一种激动药后,组织和细胞的受体对激动药敏感性下降	受体脱敏【长期用异丙肾肾上腺素治疗哮喘,引起异丙肾肾上腺素疗效逐渐变弱】
554	只对一种类型受体的激动药反应性下降,对其他类型受体激动药反应性不变	同源脱敏
555	受体对一种类型激动药脱敏,对其他类型受体的激动药也不敏感	异源脱敏
556	长期应用拮抗药,造成受体数量或敏感性提高	受体增敏【高血压患者长期用 β 受体拮抗药普萘洛尔时,突然停药可以由于 β 受体敏感性增高而引起反跳现象】
557	药物效应的协同作用	相加、增强、增敏作用
558	阿司匹林+对乙酰氨基酚 阿替洛尔+氢氯噻嗪	相加作用
559	磺胺甲噁唑+甲氧苄啶 普鲁卡因+肾上腺素	增强作用
560	两个激动药分别作用于生理作用相反的两个特异性	生理性拮抗【组胺-肾上腺素】

	受体	
561	当一种药物与特异性受体结合后,阻止激动药与其结合,从而降低药效	药理性拮抗【β受体阻断药阻断异丙肾上腺素的β受体激动作用】
562	两药联合用药时一个药物通过诱导生化反应而使另外一个药物的药效降低	生化性拮抗【苯巴比妥诱导肝药酶活性,使避孕药代谢加速,效应降低】
563	两药联合用药时一个药物通过诱导化学反应形成合用药物的无活性复合物而使另外一个药物的药效降低	化学性拮抗【肝素-鱼精蛋白(鱼精蛋白带正电,肝素带负电,两者合用使肝素的抗凝作用消失)】
564	慢代谢者多发性神经炎,这是由于异烟肼在体内可与维生素B6反应,使后者失活,从而导致维生素B6缺乏性神经损害。发生肝损害者中86%是快代谢者	药动学差异【乙酰化作用】
565	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,常规剂量应用时可以引起呼吸肌麻痹时间延长	药动学差异【水解作用】
566	葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏吃蚕豆或服用伯氨喹啉类药物后可出现血红蛋白尿、黄疸、贫血等急性溶血反应	药动学差异【氧化作用】
567	某些个体在应用治疗量的华法林后表现出非常低的抗凝血活性,要产生期望的药理效应,剂量需高达正常量的20倍	药效学差异
568	研究机体对药物效应呈现的周期性节律变化规律的学科,分别以有效性或毒性作为研究重点	时辰药理学和时辰毒理学
569	研究药物在体内过程中的节律变化	时辰药动学
570	许多药物疗效及毒效的昼夜节律并不一定完全取决于药动学的昼夜节律的差异,而可能是取决于药物的组织敏感性的昼夜差异【组织敏感性机制】	呼吸道对组胺反应敏感性在0:00~02:00最高,因此,哮喘易在凌晨发作皮肤对组胺或过敏原在19:00-23:00敏感性最高,赛庚啶的抗组胺作用在07:00时给药疗效可持续15~17小时,而19:00时给药则只能维持6~8小时
571	硝苯地平对心绞痛发作的疗效存在一定的昼夜节律	几乎可完全取消通常于上午6~12时发生的心肌缺血高峰,对下午21~24时的心肌缺血保护作用强度明显不如前者
572	β2受体激动药可采取剂量晨低夜高的给药方法,有利于药物在清晨呼吸道阻力增加时达到较高血浓度	例如,特布他林08:00时口服5mg,20:00时服10mg,可使该药的血药浓度昼夜保持相对稳定,有效控制哮喘发作
573	茶碱类药物白天吸收快,而晚间吸收较慢	根据这特点,也可采取日低夜高的给药剂量
574	糖皮质激素类药物是时辰应用	应用糖皮质激素治疗疾病时,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
575	年龄【影响药物毒性因素】	新生儿用氯霉素引起灰婴综合征
576	营养条件【影响药物毒性因素】	机体血浆白蛋白水平减少,肝药酶活性降低,游离药物浓度明显升高,药物的治疗作用与毒性作用均会增强
577	遗传因素【影响药物毒性因素】	异烟肼的快代谢型与慢代谢型G-6-PD缺乏者应用伯氨喹、磺胺药等药物易发生溶血反应
578	种族差异【影响药物毒性因素】	异烟肼的乙酰化代谢在不同种族人不一样

579	病理状态【影响药物毒性因素】	小肠或胰腺疾病或心力衰竭等导致小肠黏膜水肿时可导致药物吸收不完全肝肾功能不全时，导致药物半衰期延长
580	非甾体抗炎药阿司匹林、吲哚美辛 双氯芬酸【消化系统毒性】	引起消化性溃疡、出血
581	林可霉素、克林霉素、四环素、头孢菌素、红霉素【消化系统毒性】	引起假膜性肠炎
582	肾毒性药物	非甾体抗炎药 抗菌药物：氨基糖苷类、头孢菌素类、两性霉素B、万古霉素、磺胺类 抗肿瘤药：甲氨蝶呤、环磷酰胺、氟尿嘧啶 免疫抑制药：环孢素 含马兜铃酸的中药
583	心血管系统毒性	罗红霉素、多柔比星、干扰离子通道和钙稳定药物【如胺碘酮、奎尼丁、强心苷等】
584	遗传性G-6-PD酶缺陷人群使用造成红细胞膜破裂溶血	伯氨喹、奎宁、磺胺类药物、维生素K、呋喃妥因
585	引起高铁血红蛋白血症	非那西丁、硝酸甘油
586	引起再生障碍性贫血	氯霉素、保泰松、苯妥英钠
587	免疫系统毒性药物	环磷酰胺、糖皮质激素、环孢素、齐多夫定
588	引起脂肪肝药物	乙醇、丙戊酸钠、甲氨蝶呤、四环素、胺碘酮
589	引起肝坏死药物	乙醇、对乙酰氨基酚、异烟肼
590	对神经元损害	多柔比星引起周围神经系统神经元损伤 氨基糖苷类引起前庭神经和耳蜗神经损伤
591	变应原再次进入机体时，可与致敏细胞表面的IgE或IgG结合，诱导肥大细胞脱颗粒，释放炎症介质，诱发变态反应【如青霉素过敏】	I型变态反应【IgE介导的速发性变态反应】
592	刺激机体产生IgG或IgM抗体，抗体可特异性地结合到位于细胞表面的抗原上，活化补体、溶解靶细胞、诱导粒细胞浸润及吞噬作用，引起组织损伤【如非那西丁引起溶血】	II型变态反应【溶细胞型反应】
593	抗原抗体免疫复合物形成【血清病、结缔组织病】	III型变态反应【免疫复合物型或血管炎型反应】
594	没有抗体和补体参与，需预先与药物接触及T细胞敏感化，故发生较为缓慢【如结核菌素试验】	IV型变态反应【迟发型变态反应】
595	引起间质性肺炎和肺纤维化	博来霉素、甲氨蝶呤、苯丙酸氮芥、胺碘酮、他莫昔芬
596	引起哮喘	阿司匹林、氯胺酮、普鲁卡因、利多卡因、卡托普利、青霉素、头孢菌素、磺胺类、喹诺酮类
597	引起光毒性反应	胺碘酮、喹诺酮类【莫西沙星和加替沙星不存在光毒性】，四环素类、磺胺类
598	引起荨麻疹	青霉素、链霉素、头孢菌素、利福平、水杨酸类药物

599	引起痤疮	雄激素、促肾上腺皮质激素
600	引起肺脂质沉积的药物	胺碘酮