

《药专业知识一》必考点 50 问

1. 药物分类

化学药：通过化学合成的方式得到的小分子的有机或无机化合物。包括从天然产物提取得到的有效单体化合物，通过发酵方式得到的抗生素以及半合成方式得到的天然产物和半合成抗生素。

中药：中医理论指导，植物药、动物药、矿物药及部分化学、生物制品类药物。

生物制品：指应用普通或以基因工程、细胞工程、蛋白质工程、发酵工程等生物技术获得的微生物、细胞及各种动物和人源的组织和液体等生物材料制备的，用于人类疾病预防、治疗和诊断的药品。

2. 剂型和制剂

剂型：不同的给药形式（片剂、胶囊剂、注射剂）

制剂：具有一定质量标准、规格的具体品种。制剂名=通用名+剂型名（维生素 C 注射液）

3. 剂型的分类

名称类型	内容
按 形态 分类	固体剂型、半固体剂型、液体剂型、气体剂型。
按 给药途径 分类	经胃肠道给药剂型、非经胃肠道给药剂型。
按 分散体系 分类	真溶液类、胶体溶液类、乳剂类、混悬液类、气体分散类、固体分散类、微粒类。
按 制法 分类	浸出制剂、无菌制剂。
按 时间 分类	速释、普通和缓控释制剂等。

4. 剂型的重要性和药用辅料的作用

剂型	辅料
可改变药物的 作用性质	赋型、使制备过程顺利进行
可调节药物的 作用速度	提高药物稳定性
可降低（或消除）药物的 不良反应	提高药物疗效
可产生 靶向作用	降低药物不良反应
可提高药物的 稳定性	调节药物作用
可影响 疗效	增加病人用药的顺应性

5. 药品的稳定性

名称类型	内容
化学 不稳定性（有新物质产生）	水解、氧化、还原、脱羧、光解、异构化、聚合。
物理 不稳定性（化学本质不变）	颗粒结块、结晶生长；乳剂分层、破裂；胶体制剂的老化；片剂崩解度、溶出速度的改变等。
生物 不稳定性	外因——微生物污染；内因——成分酶解。

6. 化学降解的途径

名称类型	内容
水解	酯类——盐酸普鲁卡因、毛果芸香碱、盐酸丁卡因，酰胺——青霉素类、头孢菌素类、利多卡因、对乙酰氨基酚。
氧化	易被氧化的结构：酚羟基（肾上腺素、吗啡）、烯醇基（维生素 C）、磺胺嘧啶钠、氨基比林、盐酸异丙嗪等。
聚合	氨苄西林钠、塞替派（以聚乙二醇 400 为溶剂，避免聚合）。

脱羧	对氨基水杨酸钠、普鲁卡因。
-----------	---------------

7. 影响药物制剂稳定性的因素

处方因素	外界因素
PH 的影响	控制温度、调节 PH
广义 酸碱催化 的影响	改变溶剂
溶剂 的影响	控制水分和湿度
离子强度 的影响	遮光、驱逐氧气
表面活性剂 的影响	加入抗氧剂或金属离子络合剂
处方中 基质或赋形剂 的影响	稳定化的其它方法

8. 药物稳定性试验方法

试验类别	试验方法
影响因素 试验	高温、高湿、强光照实验 高温 ($60^{\circ}\text{C} \pm 2^{\circ}\text{C}$)、高湿 (相对湿度 $95\% \pm 5\%$)、强光照实验 (照度 $4500\text{Lx} \pm 500\text{Lx}$)
加速 试验	采用化学动力学原理, 预测常温下的稳定性。温度 ($40^{\circ}\text{C} \pm 2^{\circ}\text{C}$)、相对湿度 ($75\% \pm 5\%$) 放置 6 个月。
长期 试验	实际贮存条件下, 样品的有效期。温度 ($25^{\circ}\text{C} \pm 2^{\circ}\text{C}$)、相对湿度 ($60\% \pm 10\%$) 放置 12 个月。

9. 血管紧张素转化酶抑制剂结构分类

含**巯基**的 ACE 抑制剂: 卡托普利。

含**磷酸基**的 ACE 抑制剂: 福辛普利。

含**二羧基**的 ACE 抑制剂: 赖诺普利、依那普利、雷米普利、贝那普利。

10. 青霉素类必须结构

β -内酰胺+四氢噻唑

11. 药物与作用靶标结合的化学本质

共价键结合	非共价键结合
不可逆结合, 例如烷化剂 类抗肿瘤药环磷酰胺。	范德华力 (最弱)
	氢键 (乙酰唑胺)
	疏水作用、静电引力 (乙酰胆碱)
	电荷转移复合物 (氯喹)
	加入抗氧剂或金属离子络合剂
	偶极相互作用力

12. 生物药剂学分类特点

分类	特征	代表药
I	高溶解度、高渗透性取决于溶出度	普萘洛尔、依那普利、地尔硫草
II	低溶解度、高渗透性取决于溶解度	双氯芬酸、卡马西平、匹罗昔康
III	高溶解度、低渗透性取决于渗透率	雷尼替丁、纳多洛尔、阿替洛尔
IV	低溶解度、低渗透性取决于难吸收	特非那定、酮洛芬、呋塞米

13. 颗粒剂分类

分类: 混悬颗粒、泡腾颗粒、肠溶颗粒、缓释颗粒、控释颗粒

14. 片剂的崩解时限

普通片剂的崩解时限是 **15 分钟**; 分散片、可溶片为 **3 分钟**; 舌下片、泡腾片为 **5 分钟**; 薄膜衣片为 **30 分钟**; 肠溶衣片盐酸溶液中 **2 小时不崩解**, 在 pH6.8 磷酸盐缓冲液中 **1 小时**内崩

解。

15. 药物结构与代谢

分类	内容
第 I 相生物转化	官能团反应 ，包括氧化、还原、水解、羟基化、脱卤素、N 脱烷基、S 脱烷基等反应，在药物分子中引入或使药物分子暴露出极性基团（羟基、羧基、巯基、氨基）。
第 II 相生物转化	结合反应 ，生成极性大、易溶于水、易排出体外的结合物，如与葡萄糖醛酸（吗啡、对乙酰氨基酚）、硫酸（沙丁胺醇）、氨基酸（羧酸）或谷胱甘肽（白消安）的结合反应；生成极性小，使外来物质去活化，如乙酰化（异烟肼、对氨基水杨酸）、甲基化（肾上腺素）反应。

16. 散剂的质量检查项目

- 外用散剂和用于烧伤或严重创伤的中药外用散剂通过七号筛的粉末重量不得少于 95%（最细粉）；
- 中药散剂中一般含水量不得过 9.0%。

17. 剂型与制剂因素对药物吸收的影响

剂型因素：一般口服剂型药物的生物利用度的顺序为：**溶液剂 > 混悬剂 > 胶囊剂 > 片剂 > 包衣片**。

制剂处方因素：①制剂中的药物和辅料的理化性质；②制剂制备工艺。

18. 抗抑郁药

分类	内容
去甲肾上腺素 (NE) 重摄取抑制剂	(1) 二苯并氮草类：丙米嗪、氯米帕明； (2) 二苯并庚二烯类：阿米替林； (3) 二苯并噁嗪类：多塞平。
5-羟色胺 (5-HT) 重摄取抑制剂	氟西汀及其代谢产物去甲氟西汀都选择性地抑制中枢神经系统对 5-HT 的再吸收，延长和增加 5-HT 的作用，为较强的抗抑郁药。 文拉法辛属于 5-羟色胺/去甲肾上腺素重摄取抑制剂，其小剂量时主要抑制 5-HT 的重摄取，大剂量时对 5-HT 和 NE 的重摄取均有抑制作用。（双重作用机制）

19. 镇痛药

分类	内容
天然生物碱及类似物	吗啡、可待因、纳洛酮； (1) 17 位 N 上引入烯丙基，得到阿片受体拮抗剂，用于吗啡类药物中毒的解救，如纳洛酮； (2) 3 位酚-OH 成甲醚 (-OCH ₃)，得到镇咳药可待因。可待因 6-羟基氧化成酮，为羟考酮，对脑脊髓阿片受体有亲和力，缓释片具有双向吸收模式，减少服药次数。
哌啶类	哌替啶、芬太尼； 哌啶类（吗啡结构保留 A、D 环）：属于 4-苯基哌啶结构（哌替啶）和 4-氨基哌啶结构。代表药物有哌替啶、芬太尼、阿芬太尼、舒芬太尼、瑞芬太尼等。
氨基酮类	美沙酮，二苯基庚酮类，1 个手性碳，药用外消旋体。但左旋体活性大于右旋体。成瘾性小，用于海洛因成瘾的替代疗法。
其他合成镇痛药	布桂嗪、曲马多

20. 组胺 H₁ 受体阻断剂抗过敏药

分类	代表药物	特点
氨基醚类	苯海拉明、茶苯海明、氯马斯汀、司	苯海拉明竞争性阻断组胺 H ₁ 受体。

	他斯汀	
丙胺类	马来酸氯苯那敏	又称扑尔敏，口服吸收快且完全，经肝代谢。
三环类	异丙嗪、赛庚啶、酮替芬	赛庚啶结构改造成阿扎他定，阿扎他定苯环引入氯原子并结构改造为第二代氯雷他定，无抗胆碱和中枢神经抑制作用，氯雷他定代谢产物为第三代地氯雷他定。
哌嗪类	氯环利嗪、西替利嗪	西替利嗪的左旋体，左旋西替利嗪活性大于右旋体 30 倍，是西替利嗪 2 倍。
哌啶类	特非那定、非索非那定、依巴斯汀、卡瑞斯汀、阿司咪唑、诺阿司咪唑、咪唑斯汀、左卡巴斯汀、依美斯汀、氮卓斯汀	唯有司他斯汀为氨基醚类，其他都为哌啶类。

21. 拟肾上腺素药

分类	内容
α、β 受体激动药	(1) 肾上腺素：分子中含有邻二酚羟基，水中不稳定，故口服无效，受 COMT（羟基甲基转移酶）和 MAO（单胺氧化酶）催化； (2) 多巴胺：为体内合成的去甲肾上腺素及肾上腺素的前体，不能透过血脑屏障，可直接兴奋 α、β 受体对 β ₂ 作用弱，作为抗休克药，常用于急性心肌梗死、创伤、肾功衰竭及心脏手术等引起的休克，口服无效； (3) 盐酸麻黄碱：兴奋 α、β 两种受体，临床上用伪麻黄碱减轻鼻充血。
α 受体激动药	(1) 重酒石酸去甲肾上腺素：激动 α ₁ 和 α ₂ 受体均有激动作用，以 α ₁ 为主； (2) 盐酸可乐定：α 受体激动药，直接激动脑内 α ₂ 受体，兴奋 α ₁ ； (3) 去氧肾上腺素：去掉去甲肾上腺素一个羟基，不被 COMT 所代谢； (4) 甲基多巴：可用于肾性高血压和妊娠高血压，为前药体。
β 受体激动药	(1) 非选择性的为异丙肾上腺素：能激动 β ₁ 和 β ₂ 受体，外消旋体用来治疗支气管哮喘； (2) 选择性 β ₁ 受体激动药盐酸多巴酚丁胺：为选择性心脏 β ₁ 受体激动药。

22. 他汀类共同点

1. 主要降低胆固醇（HMG-CoA 是胆固醇合成限速酶）
2. 典型副作用：肌肉疼痛或横纹肌溶解
3. 必需结构：3, 5-二羟基羧酸（内酯结构必须水解才能生效）
4. 作用：高胆固醇血症、高脂血症、冠心病、脑卒中

23. 竞争性拮抗药、非竞争性拮抗

竞争性拮抗药，量效曲线平行右移，最大效应不变（个头不变）。非竞争性拮抗药，量效曲线的最大效应降低（个头变矮）

24. 解痉药

分类	内容
【莨菪生物碱类】 ——阿托品、东莨菪碱、山莨菪碱、丁溴东莨菪碱、后马托品	(1) 均为酯结构，易水解，阿托品由托品醇和托品酸成酯； (2) 均显莨菪酸（托品酸）的特征反应； (3) 有手性碳，阿托品含 4 个手性碳、山莨菪碱含 5 个手性碳、东莨菪碱含 6 个手性碳，药用消旋体。天然莨菪酸为左旋体； (4) 均有叔胺碱性中心，水溶液近中性； (5) 中枢作用：东莨菪碱>阿托品>山莨菪碱>丁溴东莨菪碱（季铵盐）；

	<p>(6) 阿托品 6、7 位无氧桥、无羟基；山莨菪碱 6、7 位无氧桥、有羟基；东莨菪碱 6、7 位有氧桥、无羟基。他们结构中，无论任何位置有羟基存在，中枢作用减弱；</p> <p>(7) 作用：解痉药，扩瞳，有机磷农药中毒解救等。</p>
--	--

25. 促胃动力药

分类	内容
甲氧氯普胺	中枢和外周多巴胺 D ₂ 受体拮抗剂，第一个用于临床的促动力药。中枢神经系统副作用(锥体外系症状)。
多潘立酮	外周性多巴胺 D ₂ 受体拮抗剂，极性较大，不能透过血脑屏障，故较少中枢神经系统副作用(锥体外系症状)，会导致心脏 Q-T 间歇延长，具有心脏毒性。
莫沙必利	5-HT ₄ 受体激动剂，与多巴胺 D ₂ 受体、肾上腺素受体和胆碱受体无亲和力，不良反应少，无锥体外系和催乳素分泌增多副作用。克服了西沙比利的副作用。中枢作用小。代谢物作用于 5-HT ₃ 受体。

26. 抗高血压药

分类	内容
血管紧张素转化酶 (ACE) 抑制剂	<p>——卡托普利、赖诺普利、依那普利、贝那普利、雷米普利、福辛普利。</p> <p>1. 结构分类：含巯基、二羧基、磷酸基三种 ACE 抑制剂</p> <p>①含巯基的 ACE 抑制剂：卡托普利；</p> <p>②含磷酸基的 ACE 抑制剂：福辛普利；</p> <p>③含二羧基的 ACE 抑制剂：赖诺普利、依那普利、雷米普利、贝那普利。</p> <p>2. 临床作用：充血性心力衰竭、左心室功能紊乱或糖尿病的高血压</p> <p>3. 副作用：主要是干咳、粒细胞减少</p> <p>卡托普利特殊副作用：斑丘疹、味觉障碍(巯基)</p>
血管紧张素 II 受体拮抗剂	<p>(1) 血管紧张素 II 受体拮抗剂是含有酸性基团的联苯结构，酸性基团是四氮唑环或羧基，还含有咪唑环或咪唑开环结构；</p> <p>(2) 良好的抗高血压、抗心衰和利尿作用，无 ACE 抑制剂的干咳副作用；</p> <p>(3) 缬沙坦是第一个不含咪唑环的 A II 受体拮抗剂；厄贝沙坦为缺乏氯沙坦中羟基的螺环化合物；替米沙坦是第一个分子中不含四氮唑基的 A II 受体拮抗剂；坎地沙坦酯和替米沙坦均含有苯并咪唑环的 A II 受体拮抗剂，坎地沙坦酯为前药。</p>

27. 调血脂药

分类	内容
羟甲戊二酰辅酶 A (HMG-CoA) 还原酶抑制剂	<p>洛伐他汀、辛伐他汀、普伐他汀、氟伐他汀、阿托伐他汀、瑞舒伐他汀。</p> <p>1. 主要降低胆固醇 (HMG-CoA 是胆固醇合成限速酶)；</p> <p>2. 典型副作用：肌肉疼痛或横纹肌溶解；</p> <p>3. 必需结构：3, 5-二羟基羧酸(内酯结构必须水解才能生效)；</p> <p>4. 前药：洛伐他汀、辛伐他汀；</p> <p>5. 作用：高胆固醇血症、高脂血症、冠心病、脑卒中。</p>
苯氧乙酸类调血脂药	非诺贝特、苯扎贝特、吉非罗齐

28. 抗心律失常药

分类	内容
I 类：钠通道阻滞剂	<p>I A：适度阻滞钠通道——奎尼丁；</p> <p>I B：轻度阻滞钠通道——美西律(以醚键代替利多卡因的酰胺键，更稳定。用药需测定尿 pH 值，血药浓度监测 TDM)；</p>

	I C: 强度阻滞钠通道——普罗帕酮。
II 类: 钾通道阻滞剂	胺碘酮 (光毒性。含碘, 代谢较困难, 易积蓄, 长期用药致心律失常。结构与甲状腺素类似, 影响其代谢)。
III 类: β 受体拮抗剂	芳氧丙醇胺类——普萘洛尔、美托洛尔、倍他洛尔等; 苯乙醇胺类——拉贝洛尔、索他洛尔。
IV 类: 钙离子通道阻滞剂	非二氢吡啶类: 维拉帕米、地尔硫卓。

29. 抗心绞痛药

分类	内容
硝酸酯类	硝酸甘油、硝酸异山梨酯、单硝酸异山梨酯。硝酸甘油: 舌下片通过口腔黏膜迅速吸收, 避免首过效应, 1~2 分钟起效。谷胱甘肽的消耗可导致对本品的快速耐受性。给予硫化物还原剂 (1, 4-二巯基-3, 3-丁二醇) 能迅速反转耐受性。硝酸酯类化合物挥发性, 爆炸性, 不宜以纯品形式放置和运输。
钙通道阻滞剂	硝苯地平、非洛地平、氨氯地平、尼莫地平、维拉帕米、地尔硫卓。(1) 1, 4-二氢吡啶类: 1, 4-二氢吡啶环是必需药效团, 遇光不稳定, 除尼索地平, 所有二氢吡啶类药均经历肝首过效应;(2) 芳烷基胺类: 维拉帕米;(3) 苯硫氮草类: 地尔硫卓, 2 个手性碳, 具 4 个立体异构体, 临床仅用 2S, 3S-异构体。首过效应强, 生物利用度低。

30. 抗凝血药

分类	内容
香豆素类	华法林、双香豆素、醋硝香豆素。华法林: 口服完全吸收, 生物利用度接近 100% 化学结构与 Vk 相似, 12~18 小时起效, 24~36 小时作用达到高峰。
凝血酶抑制剂	达比加群酯、阿加曲班。达比加群酯: 口服给药经胃肠道吸收后, 部分转化为原药, 以原药和前药两种形式计进入门静脉, 在肝脏中完全转化为达比加群。 阿加曲班: 化学结构中包括精氨酸、哌啶和四氢喹啉的三脚架结构。阻止凝血酶在血栓形成过程中发挥作用。
凝血因子 Xa 抑制药	阿哌沙班、利伐沙班。利伐沙班: 可高度选择性、竞争性的直接拮抗游离和结合的 Xa 因子以及凝血酶原活性, 以剂量依赖方式延长活化部分凝血酶时间 (APTT) 和凝血酶原时间 (PT)。
血小板二磷酸腺苷受体阻断药	氯吡格雷、噻氯匹定。氯吡格雷: 为前药, 口服经 P450 酶转化, 在经水解成噻吩开环的活性代谢物。可与血小板 ADP 受体中半胱氨酸残基形成二硫键, 拮抗血小板 ADP 受体, 导致纤维蛋白原无法与受体发生粘连而抑制血小板聚集。

31. 抗代谢抗肿瘤药

- 嘌呤类:** 巯嘌呤、巯鸟嘌呤。
- 嘧啶类:** 尿嘧啶 (治疗实体肿瘤首选的氟尿嘧啶) 和胞嘧啶 (阿糖胞苷、吉西他滨 (双氟取代的胞嘧啶核苷衍生物, 体内磷酸化生成活性代谢物三磷酸类似物)、卡培他滨 (5-FU 前体药))。
- 叶酸类:** 甲氨蝶呤 (二氢叶酸还原酶抑制剂, 中毒用亚叶酸钙解毒)、亚叶酸钙 (叶酸在体内的活化形式, 与甲氨蝶呤合用可降低毒性, 不降低抗肿瘤活性) 和培美曲塞 (非小细胞肺癌和耐药性间皮瘤)。

32. 药物转运方式比较

跨膜转运方式	浓度梯度	机体能量	饱和现象	竞争现象	特异性	代谢抑制剂作用
被动转运 (顺水游泳)	顺	不需要	无	无	无	无

载体转运	易化扩散	顺	不需要	有	有	有	—
	主动转运	逆	需要	有	有	有	有
膜动转运		—	—	—	—	有一定	—

33. 抗病毒药物分类

核苷类：非开环核苷类：齐多夫定、司他夫定、拉米夫定

开环核苷类：阿昔洛韦、更昔洛韦、喷昔洛韦、泛昔洛韦

非核苷类：利巴韦林、金刚烷胺、金刚乙胺、膦甲酸钠、奥司他韦

34. 联合用药意义

①提高疗效；②减少或降低不良反应；③延缓机体耐受性或病原体产生耐药性，缩短疗程；④治疗并发症

35. 稀释剂（填充剂）

种类	特点
淀粉	性质稳定、吸湿性小，但可压性较差。玉米淀粉最为常用
乳糖	性能优良，可压性、流动性好（贵）。
糊精	较少单独使用，多与淀粉、蔗糖等合用。
蔗糖	吸湿性强。
预胶化淀粉	又称可压性淀粉，具有良好的可压性、流动性和自身润滑性。
微晶纤维素（MCC）	具有较强的结合力与良好的可压性，亦有“干黏合剂”之称。
无机盐类（磷酸氢钙、硫酸钙、碳酸钙）	性质稳定。
甘露醇	价格较贵，常用于咀嚼片中，兼有矫味作用。

36. 润湿剂和粘合剂

种类	特点
淀粉浆	最常用黏合剂之一，常用浓度 8%~15%，价廉、性能较好。
甲基纤维素（MC）	水溶性较好。
羟丙纤维素（HPC）	可作粉末直接压片黏合剂。
羟丙甲纤维素（HPMC）	可溶于冷水。
羧甲基纤维素钠（CMC-Na）	适用于可压性较差的药物。
乙基纤维素（EC）	不溶于水，但溶于乙醇。
聚维酮（PVP）	吸湿性强，可溶于水和乙醇。
明胶	可用于口含片。
聚乙二醇（PEG）	可溶于水，用于水溶性片剂。

37. 片剂的包衣

种类	特点
胃溶型	羟丙甲纤维素（HPMC）、羟丙纤维素（HPC）、丙烯酸树脂 IV 号、聚维酮（PVP）
肠溶型	醋酸纤维素酞酸酯（CAP）、丙烯酸树脂类（I、II、III 类）、羟丙甲纤维素酞酸酯（HPMCP）
水不溶型	乙基纤维素（EC）
致孔剂	蔗糖、氯化钠、表面活性剂和 PEG
遮光剂	二氧化钛

38. 固体分散技术

项目	内容
分类	①低共熔混合物；②固态溶液；③共沉淀物。
优点	①延缓水解和氧化，掩盖不良气味和刺激性，液态药物固体化； ②难溶性药物以分子状态分散在水溶性载体中，可加快药物的溶出，提高生物利用度； ③采用难溶性载体可达到缓释作用； ④采用肠溶性载体可以控制药物仅在肠中释放； ⑤固体分散体不稳定，久贮会发生老化现象。
速释原理	药物以分子态、胶体状态、亚稳定态、微晶态与无定形分散于载体材料中，分散度高，溶出速度快。 溶出速度：分子态>无定形>微晶态

39. 缓控释制剂的特点

项目	内容
优点	1. 减少给药次数，提高患者的用药顺应性； 2. 血药浓度平稳，减少峰谷现象，降低药物毒副作用； 3. 减少用药的总剂量。
不足	1. 剂量调节的灵活性降低； 2. 价格昂贵； 3. 易产生体内药物的蓄积，对于首过效应大的药物制成缓释、控释制剂时生物利用度可能比普通制剂低。

40. 缓控释制剂常用辅料

类型	种类	常见品种
骨架型	亲水性凝胶骨架片	羧甲基纤维素钠 (CMC-Na)、甲基纤维素 (MC)、羟丙甲纤维素 (HPMC)、聚维酮 (PVP)、卡波姆、海藻酸盐、脱乙酰壳多糖
	不溶性骨架片	聚甲基丙烯酸酯 (EudragitRS, EiragitRL)、乙基纤维素 (EC)、聚乙烯、无毒聚氯乙烯、乙烯-醋酸乙烯共聚物、硅橡胶等
	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、单硬脂酸甘油酯
包衣膜型	不溶性高分子材料	乙基纤维素 (EC)
	肠溶性高分子材料	丙烯酸树脂 L 和 S 型、醋酸纤维素酞酸酯 (CAP)、醋酸羟丙甲纤维素琥珀酸酯 (HPMCAS) 和羟丙甲纤维素酞酸酯 (HPMCP)
增粘作用	增稠剂	明胶、PVP、CMC、PVA、右旋糖酐等
微孔膜包衣片	衣膜材料	乙基纤维素、醋酸纤维素、乙烯-醋酸乙烯共聚物、聚丙烯酸树脂
	致孔剂	PEG 类、PVA、PVP、十二烷基硫酸钠、糖和盐等水溶性的物质
渗透泵型控释片	半透膜材料	醋酸纤维素、乙基纤维素
	渗透压活性物质	氯化钠、乳糖、果糖、葡萄糖、甘露醇的不同混合物
	推动剂	聚羟甲基丙烯酸烷基酯 (3 万~500 万)、PVP (1 万~36 万)、聚氧乙烯 (20 万~500 万)

41. 液体制剂常用附加剂

种类	常用品种	备注
增溶剂	聚山梨酯类、聚氧乙烯脂肪酸酯类等	HLB 值:15~18
助溶剂	无机化合物：碘化钾等	多为低分子化合物，形成的组合物多为大

(加入第三种物质)	有机酸及其盐类：苯甲酸等 酰胺或胺类化合物：乙二胺等 水溶性高分子化合物：聚乙烯吡咯烷酮	分子
潜溶剂	乙醇、丙二醇、甘油、聚乙二醇等	如甲硝唑用水-乙醇混合溶剂

42. 表面活性剂

种类	特点
阳离子型	季胺类化合物，新旧洁尔灭，毒性大
阴离子型	十二烷基硫酸钠，SDS
两性离子型	豆磷脂、卵磷脂，无毒
非离子型	吐温、司盘、卖泽、泊洛沙姆（普朗尼克 F68）

43. 表面活性剂的毒性顺序

阳离子型>阴离子型>非离子型。两性离子表面活性剂一般认为无毒，可用于静脉注射。

44. 注射剂附加剂

变化	典型例子
抗氧化剂	焦亚硫酸钠、亚硫酸氢钠（酸性）
	亚硫酸钠、硫代硫酸钠（碱性）
金属螯合剂	乙二胺四乙酸二钠（EDTA·2Na）
缓冲剂	XX 酸-XX 酸钠、乳酸
助悬剂	羧甲基纤维素、明胶、果胶
增溶剂、润湿剂或乳化剂	聚氧乙烯蓖麻油、吐温 80、卵磷脂、普朗尼克（泊洛沙姆）、聚维酮
抑菌剂	三氯叔丁醇、苯甲醇、苯酚、羟苯丁酯（丙酯）、尼泊金类
局麻剂（止痛剂）	盐酸普鲁卡因、利多卡因
等渗调节剂	氯化钠、葡萄糖、甘油
填充剂	乳糖、甘露醇、甘氨酸

45. 脂质体特点和性质

项目	内容
特点	①靶向性和淋巴定向性；②缓释性和长效性；③细胞亲和性和组织相容性；④降低毒性；⑤提高药物稳定性。
组成与结构	①膜材料主要由磷脂与胆固醇构成； ②极性基团向外侧的水相、非极性烃基彼此面对面形成板层状或球状双分子层结构。

46. 新型靶向脂质体

种类	特点
前体脂质体	将脂质吸附在水溶性载体如氯化钠、山梨醇等聚合糖类制成前体脂质体。
长循环脂质体	PEG 修饰的脂质体，既可保持长循环，又可保持对靶点的识别。
免疫脂质体	脂质体表面联接抗体，对靶细胞进行识别，提高脂质体的靶向性。如丝裂霉素（MMC）制成免疫脂质体。
热敏感脂质体	利用在相变温度时，脂质体的脂质膜的通透性增加，药物释放速度增大的原理制成热敏脂质体。
pH 敏感性脂质体	由于肿瘤间质的 pH 比周围正常组织细胞的 pH 低，选用对 pH 敏感的一类脂材料，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。

47. 脂质体的性质和质量要求

项目	内容
性质	① 相变温度 ：温度升高，脂质体双分子层疏水链可从有序排列变为无序排列，该温度称相变温度，取决于磷脂种类； ② 荷电性 。
质量要求	1. 包封率 （应大于 80%）和 载药量 ； 2. 脂质体的稳定性 ：①物理稳定性：渗漏率；②化学稳定性：磷脂氧化。

48. 乳膏剂常用辅料

种类	常用基质
油相基质	硬脂酸、石蜡、蜂蜡、高级脂肪醇、凡士林、液状石蜡、植物油
水包油型乳化剂	钠皂、三乙醇胺皂类、脂肪醇硫酸（酯）钠类（十二烷基硫酸钠）和聚山梨酯类
油包水型乳化剂	钙皂、羊毛脂、单甘油酯、脂肪醇

49. 量效关系重要概念

- 斜率**：16%~84%。斜率大，曲线陡，药量微小的变化，即可引起效应的明显改变
- 最小有效量（阈剂量）**：引起效应的最小药量（浓度）
- 最大效应（Emax）/效能**：增加剂量，所能达到的最大效应

50. 影响药物吸收的生理因素

胃肠液的成分和性质；胃肠道运动；循环系统转运；食物；胃肠道代谢作用；疾病因素和特殊人群。