

2015年执业药师药专业知识一真题

一、最佳选择题

1、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：本题考查的是药物的命名。

（1）药物的商品名

1) 商品名通常针对最终产品，剂型、剂量确定。2) 不同企业生产的药品具有不同的商品名，不得冒用。3) 商品名同商标一样可注册和申请专利保护。

（2）药品的通用名

1) 国际非专利药品名称（INN），WHO 推荐使用。2) INN 通常指有活性的药物物质，而非最终药品。3) 一个药物只有一个通用名，不受专利保护。药品通用名也是药典中使用的名称。

（3）药物的化学名

- 1) 表明药品化学结构的名称。
- 2) 依据国际纯化学和应用化学会、中国化学会、美国化学文献的原则。

2、不属于新药临床前研究内容的是

- A. 药效学研究
- B. 一般药理学研究
- C. 动物药动学研究
- D. 毒理学研究
- E. 人体安全性评价研究

答案：E

解析：本题考查新药研究。新药研究分为临床前和临床研究。临床前研究内容包括

主要药效学研究、一般药理学研究、药动学研究、毒理学研究；临床研究包括 I、II、III、IV 期临床试验。人体安全性评价研究属于 I 期临床试验。

3、属于非经胃肠道给药的制剂是

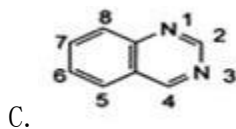
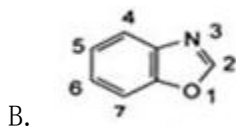
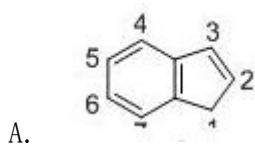
- A. 维生素 C 片
- B. 西地碘含片
- C. 盐酸环丙沙星胶囊
- D. 布洛芬混悬滴剂
- E. 氯雷他定糖浆

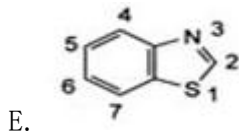
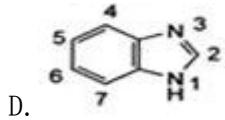
答案：B

解析：非经胃肠道给药剂型：指除口服给药以外的其他途径的给药剂型。

- (1) 注射给药：静脉注射、肌肉注射、皮下注射、皮内注射、脊椎腔内注射等。
- (2) 皮肤给药：外用溶液、洗剂、搽剂、硬膏剂、糊剂、贴剂等。
- (3) 口腔给药：漱口剂、含片、舌下片剂、膜剂等。
- (4) 鼻腔给药：滴鼻剂、喷雾剂、粉雾剂等。
- (5) 肺部给药：气雾剂、粉雾剂、吸入剂等。
- (6) 眼部给药：滴眼剂、眼膏剂、眼用凝胶、植入剂等。
- (7) 直肠、阴道、尿道等部位的给药：灌肠、栓剂给药。

4、苯并咪唑的化学结构和编号





答案：D

解析：本题考查药物结构中常见的化学骨架及名称。

A 茛，B 苯并恶唑，C 苯并嘧啶，D 苯并咪唑，E 苯并噻唑

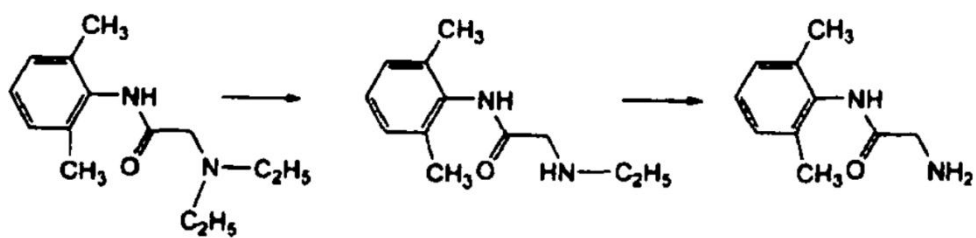
5、酸类药物成酯后，其理化性质变化是

- A. 脂溶性增大，易离子化
- B. 脂溶性增大，不易通过生物膜
- C. 脂溶性增大，刺激性增加
- D. 脂溶性增大，易吸收
- E. 脂溶性增大，与碱性药物作用强

答案：D

解析：本题考查的是基团对药物活性的影响。羟基成酯既降低酸性，又增大脂溶性，易于吸收。

6. 利多卡因在体内代谢如下，其发生的第 I 相生物转化反应是



- A. O-脱烷基化
- B. N-脱烷基化
- C. N-氧化
- D. C-环氧化
- E. S-氧化

答案：B

解析：本题考查官能团的转化反应。从结构上可看出是N上乙基脱去。

7、不属于葡萄糖醛酸结合反应的类型是

- A. O-葡萄糖醛苷化
- B. C-葡萄糖醛苷化
- C. N-葡萄糖醛苷化
- D. S-葡萄糖醛苷化
- E. P-葡萄糖醛苷化

答案：E

解析：葡萄糖醛酸的结合反应共有四种类型：O、N、S和C的葡萄糖醛苷化。

8、有机药物多数为弱酸或弱碱，在体液中只能部分解离，以解离的形式非解离的形式同时存在于体液中，当 $pH=pK_a$ 时，分子型和离子型药物所占的比例分别为

- A. 90%和10%
- B. 10%和90%
- C. 50%和50%
- D. 33.3%和66.7%
- E. 66.7%和33.3%

答案：C

解析：当 $pK_a=pH$ 时，解离型和非解离型药物各一半。

9、关于散剂特点的说法，错误的是

- A. 粒径小、比表面积大
- B. 易分散、起效快
- C. 尤其适宜湿敏感药物
- D. 包装、贮存、运输、携带较方便
- E. 便于婴儿、老人服用

答案：C

解析：散剂的特点：粒径小、比表面积大

(1) 优点

①易分散、起效快；②外用覆盖面大，具保护、收敛作用；③制备工艺简单，剂量易控制；④包装、贮存、运输、携带方便；⑤便于特殊群体（婴幼儿、老人）服用。

(2) 缺点：对光、湿、热敏感的药物及刺激性强的药物不宜制成散剂。

10、不属于低分子溶液剂的是

- A. 碘甘油
- B. 复方薄荷脑酯
- C. 布洛芬混悬滴剂
- D. 复方磷酸可待因糖浆
- E. 对乙酰氨基酚口服溶液

答案：C

解析：低分子溶液剂，系指小分子药物以分子或离子状态分散在溶剂中形成的均匀的可供内服或外用的液体制剂。包括溶液剂、糖浆剂、芳香水剂、涂剂和酊剂等。

11、关于眼用制剂的说法，错误的是

- A. 滴眼液应与泪液等渗
- B. 混悬型滴眼液用前需充分混匀
- C. 增大滴眼液的黏度，有利于提高药效
- D. 用于手术后的眼用制剂必须保证无菌，应加入适量抑菌剂
- E. 为减小刺激性，滴眼液应使用缓冲液调节溶液的 pH，使其在生理耐受范围

答案：D

解析：用于眼外伤或手术后的眼用制剂必须满足无菌，成品需经严格的灭菌，并不加入抑菌剂，一般采用单剂量包装，一经使用后不能放置再用。

12、不要求进行无菌检查的剂型是

- A. 注射剂
- B. 吸入粉雾剂

- C. 植入剂
- D. 冲洗剂
- E. 眼部手术用软膏剂

答案：B

解析：本题考查无菌制剂的分类。

注射用制剂，如注射剂、输液、注射粉针等；

眼用制剂，如滴眼剂、眼用膜剂、软膏剂和凝胶剂等；

植入型制剂，如植入片等；

创面用制剂，如溃疡、烧伤及外伤用溶液、凝胶、软膏剂和气雾剂等；

手术用制剂，如冲洗剂、止血海绵剂和骨蜡等。

13、属于控释制剂的是

- A. 阿奇霉素分散片
- B. 硫酸沙丁胺醇口崩片
- C. 硫酸特布他林气雾剂
- D. 复方丹参滴丸
- E. 硝苯地平渗透泵片

答案：E

解析：本题考查缓控释制剂的分类。根据释药原理：缓释、控释制剂可分为溶出型、扩散型、溶蚀型、渗透泵型或离子交换型。分散片、口崩片、气雾剂、滴丸均属于速效制剂。

14、关于脂质体特点和质量要求的说法，正确的是

- A. 脂质体的药物包封率通常应在 10%以下
- B. 药物制备成脂质体，提高药物稳定性的同时增加了药物毒性
- C. 脂质体为被动靶向制剂，在其载体上结合抗体，糖脂等也可使其具有特异靶向性
- D. 脂质体形态为封闭多层囊状物，贮存稳定性好，不易产生渗透现象
- E. 脂质体是理想的靶向抗肿瘤药物载体，但只适用于亲脂性药物

答案：C

解析：本题考查脂质体的特点与要求。

脂质体的特点：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降低药物的毒性；⑤提高药物的稳定性。

脂质体指将药物包封于类脂质双分子层内而形成的微小囊泡。脂质体为被动靶向制剂，包封率应大于 80%。

15、关于药物经皮吸收及其影响因素的说法，错误的是

- A. 药物在皮肤内蓄积作用有利于皮肤疾病的治疗
- B. 汗液可使角质层水化从而增大角质层渗透性
- C. 皮肤给药只能发挥局部治疗作用
- D. 真皮上部存在毛细血管系统，药物到达真皮即可很快地被吸收
- E. 药物经皮肤附属器的吸收不是经皮吸收

答案：C

解析：本题考查经皮给药制剂的特点。经皮给药制剂属于缓控释制剂，经皮肤吸收起全身治疗作用，而乳膏、凝胶是在皮肤上起局部作用。

16、药物的剂型对药物的吸收有很大影响，下列剂型中，药物吸收最慢的是

- A. 溶液剂
- B. 散剂
- C. 胶囊剂
- D. 包衣片
- E. 混悬液

答案：D

解析：本题考查药物胃肠道吸收的影响因素。口服剂型药物的吸收顺序为：溶液剂>混悬剂>胶囊剂>片剂>包衣片。

17、高血浆蛋白结合率药物的特点是

- A. 吸收快
- B. 代谢快

- C. 排泄快
- D. 组织内药物浓度高
- E. 与高血浆蛋白结合率的药物合用易出现毒性反应

答案：E

解析：应用蛋白结合率高的药物时，当给药剂量增大使蛋白结合出现饱和，剂量上再有小小的改变就会使游离药物浓度产生很大的变化，或者同时给予另一种蛋白结合能力更强的药物后，由于竞争作用将其中一个蛋白结合能力较弱的药物置换下来，使游离药物浓度增大，从而引起药理作用显著增强，对于毒副作用较强的药物，易发生用药安全性问题。

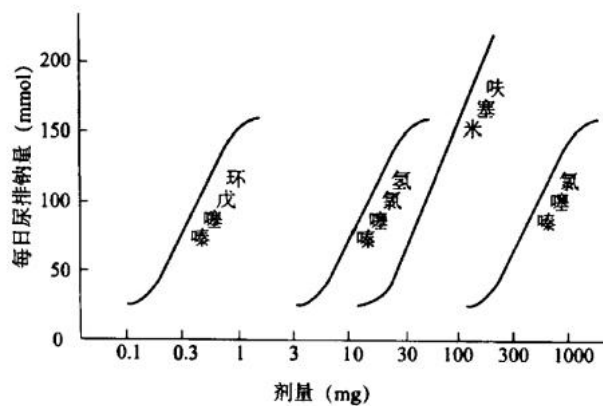
18、药物在体内代谢的主要部位是

- A. 胃
- B. 肠道
- C. 胰腺
- D. 肝脏
- E. 肾脏

答案：D

解析：药物代谢的主要部位是在肝脏。

19、环戊噻嗪、氢氯噻嗪、呋塞米、氯噻嗪的效价强度与效能的比较见下图，对这四种利尿药效能和效价强度的分析，正确的是



- A. 效能最强的是呋塞米
- B. 效价强度最小的是呋塞米
- C. 效价强度最大的是氯噻嗪
- D. 氢氯噻嗪效能大于环戊噻嗪，小于氯噻嗪
- E. 环戊噻嗪、氢氯噻嗪和氯噻嗪的效价强度相同

答案：A

解析：本题考查最大效应（效能）和效价强度的含义。

最大效应（Emax）或效能：在一定范围内，增加药物剂量或浓度，其效应强度随之增加，但效应增至最大时，继续增加剂量或浓度，效应不能再上升，此效应为一极限，称为最大效应，也称效能。效能反映药物的内在活性；质反应的阳性率达 100%。

效价强度：用于作用性质相同的药物之间的等效剂量或浓度的比较，指能引起等效反应（一般采用 50%效应量）的相对剂量或浓度，值越小则强度越大。

效能最大的是呋塞米，效价强度最大的是环戊噻嗪。

20、属于对因治疗的药物作用方式是

- A. 胰岛素降低糖尿病患者的血糖
- B. 阿司匹林治疗感冒引起的发热
- C. 硝苯地平降低高血压患者的血压
- D. 硝酸甘油缓解心绞痛的发作
- E. 青霉素治疗脑膜炎奈瑟菌引起的流行性脑脊髓膜炎

答案：E

解析：药物的治疗作用：患者用药后引起的符合用药目的，达到防治疾病的作用。根据治疗效果，分对因治疗和对症治疗。

（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，达到控制感染性疾病；铁制剂治疗缺铁性贫血等属于对因治疗。注：补充体内营养或代谢物质不足，称为补充疗法（替代疗法），也属对因治疗。

（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的体温，缓解疼痛；硝酸甘油缓解心绞痛；抗高血压药降低患者过高的血压等属于对症治疗。

21、根据药物作用机制分析，下列药物作用属于非特异性作用机制的是

- A. 阿托品阻断 M 受体而缓解胃肠平滑肌痉挛
- B. 阿司匹林抑制环氧酶而解热镇痛
- C. 硝苯地平阻断 Ca^{2+} 通道而降血压
- D. 氢氯噻嗪抑制肾小管 Na^+-Cl 转运体产生利尿作用
- E. 碳酸氢钠碱化尿液而促进弱酸性药物的排泄

答案：E

解析：非特异性作用是由药物的理化性质引起的。

22、既有第一信使特征，也有第二信使特征的信使分子是

- A. 钙离子
- B. 神经递质
- C. 环磷酸腺苷
- D. 一氧化氮
- E. 生长因子

答案：D

解析：NO：既有第一信使特征，也有第二信使特征。

23、不同企业生产一种药物不同制剂，处方和生产工艺可能不同，欲评价不同制剂间吸收速度和程度是否相同，应采用评价方法是

- A. 生物等效性试验
- B. 微生物限度检查法
- C. 血浆蛋白结合率测定法
- D. 平均滞留时间比较法
- E. 制剂稳定性试验

答案：A

解析：本题考查生物等效性的概念。评价不同制剂吸收速率和程度，可采用的评价方法是生物等效性。

24、属于肝药酶抑制剂的药物是

- A. 苯巴比妥
- B. 螺内酯
- C. 苯妥英钠
- D. 西咪替丁
- E. 卡马西平

答案：D

解析：常见的肝药酶抑制剂：吩噻嗪类（氯丙嗪）、西咪替丁、环丙沙星、甲硝唑、保泰松、异烟肼、氯霉素、别嘌醇、酮康唑。

25、由于竞争性占据酸性转运系统，阻碍青霉素肾小管分泌，进而延长青霉素作用的药是

- A. 阿米卡星
- B. 克拉维酸
- C. 头孢哌酮
- D. 丙磺舒
- E. 丙戊酸钠

答案：D

解析：丙磺舒抑制青霉素的肾小管分泌，延长作用时间。P179

26、下列联合用药产生拮抗作用的是

- A. 磺胺甲噁唑合用甲氧苄
- B. 华法林合用维生素 K
- C. 克拉霉素合用奥美拉唑
- D. 普鲁卡因合用肾上腺素
- E. 哌替啶合用氯丙嗪

答案：B

解析：本题考查药效学方面的药物相互作用。

药效学相互作用：联合用药后发生的药物效应变化。

有两种情况：一是联合用药后出现药效增强，或毒副作用减轻，这是联合用药的目的；二是联合用药后出现药效减弱或毒副作用增强，对治疗不利，应该尽量避免之。

药效学相互作用：协同作用和拮抗作用。

维生素 K 治疗出血症，华法林与之合用抗凝作用下降。

27、药物警戒与不良反应监测共同关注

- A. 药品与食物不良相互作用
- B. 药物误用
- C. 药物滥用
- D. 合格药品的不良反应
- E. 药品用于无充分科学依据并未经核准的适应症

答案：D

解析：药品不良反应监测质量合格的药品。药物警戒涉及除质量合格药品之外的其他药品，如低于法定标准的药品、药物与化合物、药物及食物的相互作用等。所以二者共同关注合格药品的不良反应。

28、药源性疾病是因药品不良反应发生程度较严重才持续时间过长引起，下列关于药源性疾病的防治，不恰当的是

- A. 依据病情的药物适应症，正确选用
- B. 根据对象个体差异，建立合理给药方案
- C. 监督患者用药行为，及时调整给药方案和处理不良反应
- D. 慎重使用新药，实体个性化给药
- E. 尽量联合用药

答案：E

解析：临床上不合理用药引起药源性疾病的主要因素之一，应尽量减少联合用药，避免不良的药物相互作用。

29、药物流行病学是临床药学与流行病学两个学科相互渗透、延伸发展起来的新的

医学研究领域，主要任务不包括

- A. 新药临床实验前药效学研究的设计
- B. 药品上市前临床试验的设计
- C. 上市后药品有效性再评价
- D. 上市后药品不良反应或非预期作用的监测
- E. 国家基本药物的遴选

答案：A

解析：药物流行病学的主要任务：1. 药品上市前临床试验的设计和上市后药品有效性再评价 2. 上市后药品不良反应或非预期作用的监测 3. 国家基本药物的遴选 4. 药物利用情况的调查研究 5. 药物经济学研究。

【83-85】

- A. 过敏反应
- B. 首剂效应
- C. 副作用
- D. 后遗效应
- E. 特异质反应

83、患者在初次服用哌唑嗪时，由于机体对药物作用尚未适应而引起不可耐受的强烈反应，该反应是

84、服用地西洋催眠次晨出现乏力，倦怠等“宿醉”现象，该不良反应是

85、服用阿托品治疗胃肠绞痛出现口干等症状，该不良反应是

答案：BDC

解析：副作用（副反应）：药物按正常用法用量使用，出现与治疗目的无关的不适反应。

后遗效应：在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。后遗效应可短暂或持久。

首剂效应：一些患者在初服某种药物时，由于机体对药物作用尚未适应而引起不可耐受的强烈反应。例如哌唑嗪等按常规剂量开始治疗常可致血压骤降。

变态反应（过敏反应）：机体受药物刺激所发生异常的免疫反应，引起机体生理功能障碍或组织损伤。

特异质反应（特异性反应）：和先天性遗传异常有关，与药理作用无关。大多是由于机体缺乏某种酶，药物在体内代谢受阻所致反应。

【86-88】

A. $MRT=AUMC/AUC$

B. $C_{ss}=k_0/kV$

C. $f_{ss}=1-e^{-kt}$

D. $C = \frac{k_0}{kV} (1 - e^{-kt})$

E. $\frac{dX_u}{dt} = -k_e \cdot X_0 e^{-kt}$

86、单室模型静脉滴注给药过程中，血药浓度与时间的计算公式是

87、单室模型静脉滴注给药过程中，稳态血药浓度的计算公式是

88、药物在体内的平均滞留时间计算公式是

答案：DBA

解析：单室模型静脉滴注给药过程中，血药浓度与时间的计算公式是

$$C = \frac{k_0}{kV} (1 - e^{-kt})$$

稳态血药浓度的计算公式是 $C_{ss}=k_0/kV$ ；

药物在体内的平均滞留时间计算公式是 $MRT=AUMC/AUC$

【89-90】

A. BP

B. USP

C. ChP

D. EP

E. LP

89、美国药典的缩写是

90、英国药典的缩写是

答案：BD

解析：美国药典：USP；英国药典：BP；日本药局方：JP；欧洲药典：Ph. Eur 或 EP

【91-93】

- A. 氟西汀
- B. 艾司佐匹克隆
- C. 艾司唑仑
- D. 齐拉西酮
- E. 美沙酮

91、口服吸收好，生物利用度高，属于 5-羟色胺摄取抑制剂的抗抑郁药是

92、因左旋体引起不良反应，而右旋体已上市，具有短效催眠作用的药物是

93、可用于阿片类成瘾替代治疗的氨基酮类药物是

答案：ABE

解析：氟西汀是 5-羟色胺摄取抑制剂的抗抑郁药，艾司佐匹克隆是佐匹克隆的右旋体，美沙酮可用于阿片类成瘾替代治疗。

【94-95】

- A. 氨曲南
- B. 克拉维酸
- C. 哌拉西林
- D. 亚胺培南
- E. 他唑巴坦

94、属于青霉素类抗生素的是

95、属于碳青霉烯类抗生素的是

答案：ED

解析：舒巴坦、他唑巴坦等巴坦类药物属于青霉素类；培南类属于碳青霉烯类。

【96-98】

- A. 完全激动药
- B. 竞争性拮抗剂
- C. 部分激动药
- D. 非竞争性拮抗药
- E. 负性拮抗药

96、与受体具有很高亲和力和内在活性 ($\alpha = 1$) 的药物是

97、与受体有很高亲和力，但内在活性不强 ($\alpha < 1$) 的药物是

98、与受体有很高亲和力，但缺乏内在活性 ($\alpha = 0$)，与激动药合用，在增强激动药的剂量或浓度时，激动药的量-效曲线平行右移，但最大效应不变的药物是

答案：ACB

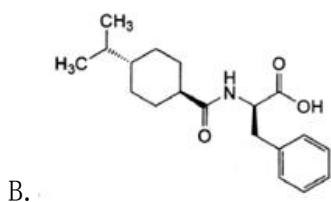
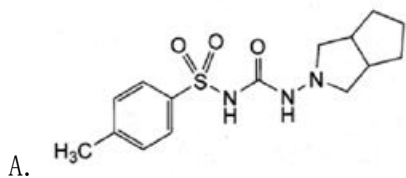
解析：根据亲和力和内在活性，分完全激动药和部分激动药。

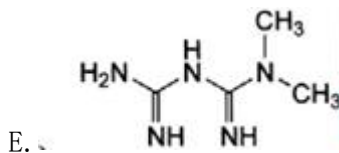
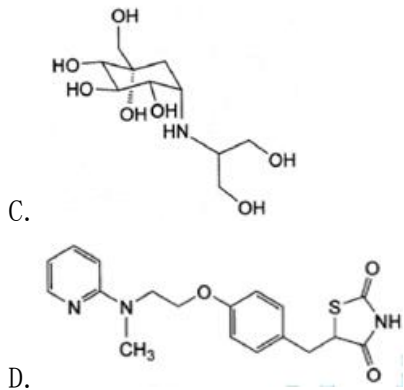
完全激动药：对受体有高亲和力和内在活性 ($\alpha = 1$)，

部分激动药：对受体有高亲和力，但内在活性不强 ($\alpha < 1$)。

拮抗药：虽具有较强的亲和力，但缺乏内在活性 ($\alpha = 0$)，故不能产生效应；由于占据一定数量受体，反而可拮抗激动药的作用。激动药与受体的结合可逆，竞争性拮抗药可与激动药互相竞争与相同受体结合，产生竞争性抑制作用。增加激动药的浓度使其效应恢复到原先单用激动药时的水平，使激动药的量效曲线平行右移，但其最大效应不变，这是竞争性抑制的重要特征。

【99-100】





99、为 D-苯丙氨酸衍生物，被称为“餐时血糖调节剂”的药物是

100、含双胍类结构母核，属于胰岛素增敏剂的口服降糖药物是

答案：BE

解析：D-苯丙氨酸衍生物，被称为“餐时血糖调节剂”的药物是那格列奈；含双胍类结构母核，属于胰岛素增敏剂的口服降糖药物是二甲双胍。

三、综合分析题

【101-103】

注射用美洛西林/舒巴坦、规格 1.25（美洛西林 1.0g，舒巴坦 0.25g）。成人静脉符合单室模型。美洛西林表观分布容积 $V=0.5L/Kg$ 。

101、体重 60Kg 患者用此药进行呼吸系统感染治疗，希望美洛西林/舒巴坦可达到 0.5g/L，需给美洛西林/舒巴坦的负荷剂量为

- A. 1.25g（1 瓶）
- B. 2.5g（2 瓶）
- C. 3.75g（3 瓶）
- D. 5.0g（4 瓶）
- E. 6.25g（5 瓶）

答案：C

解析：负荷剂量 $X_0 = C_{ss}V = 0.1\text{g/L} \times 0.5\text{L/Kg} \times 60\text{Kg} = 3.0\text{g}$

102、关于复方制剂美洛西林钠与舒巴坦的说法，正确的是

- A. 美洛西林为“自杀性” β -内酰胺酶抑制剂
- B. 舒巴坦是氨苄西林经改造而来，抗菌作用强
- C. 舒巴坦可增强美洛西林对 β -内酰胺酶稳定性
- D. 美洛西林具有甲氧脲基，对 β -内酰胺酶具高稳定作用
- E. 舒巴坦属于碳青霉烯类抗生素

答案：C

解析：舒巴坦为 β -内酰胺酶抑制剂，增加青霉素类药物对 β -内酰胺酶稳定性。

103、注射用美洛西林钠/舒巴坦的质量要求不包括

- A. 无异物
- B. 无菌
- C. 无热原、细菌内毒素
- D. 粉末细度与结晶度适宜
- E. 等渗或略偏高渗

答案：E

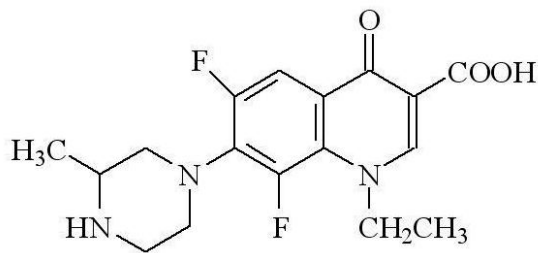
【解析】美洛西林易水解，应制成注射用无菌粉末。

注射用无菌粉末的质量要求

注射用无菌粉末质量应符合以下规定：(1)粉末无异物，配成溶液后可见异物检查合格。(2)粉末细度或结晶度需适宜，便于分装。(3)无菌、无热原或细菌内毒素。(4)冻干制品是完整块状物或海绵状物。(5)外形饱满，色泽均一，多孔性好，水溶解后能快速恢复冻干前状态。(6)不溶性微粒、装量差异、含量均匀度等检查符合规定。

【104-106】

洛美沙星结构如下：



对该药进行人体生物利用度研究，采用静脉注射与口服给药方式，给药剂量均为400mg，静脉注射和口服给药的AUC分别为40ug·h/ml和36ug·h/ml。

104、基于上述信息分析，洛美沙星生物利用度计算正确的是

- A. 相对生物利用度为 55%
- B. 绝对生物利用度为 55%
- C. 相对生物利用度为 90%
- D. 绝对生物利用度为 90%
- E. 绝对生物利用度为 50%

答案：D

解析：。当参比制剂是静脉注射剂时，则得到的比率称绝对生物利用度，因静脉注射给药药物全部进入血液循环。

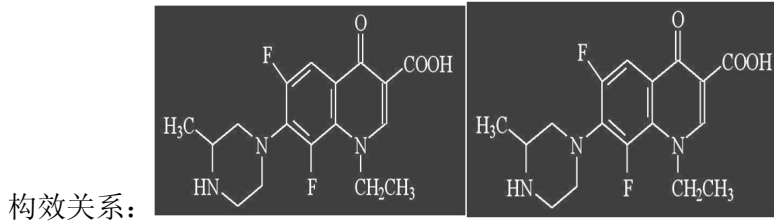
$$\text{绝对生物利用度 } F = \frac{AUC_T}{AUC_{iv}} \times 100\% = 36/40 \times 100\% = 90\%$$

105、根据喹诺酮类抗菌药构效关系，洛美沙星关键药效基团是

- A. 1-乙基 3-羧基
- B. 3-羧基 4-酮基
- C. 3-羧基 6-氟
- D. 6-氟 7-甲基哌嗪
- E. 6、8-二氟代

答案：B

【解析】



吡啶酮酸的 A 环是抗菌作用必需的基本药效基团。B 环可以是苯环、吡啶环、嘧啶环等。

(1) 1 位取代基为烃基或环烃基活性较佳，其中以乙基或与乙基相近的氟乙基或环丙基取代活性较好。

(2) 3 位 -COOH、4 位 C=O 与 DNA 促旋酶和拓扑异构酶 IV 结合，为抗菌活性必须部分。

(3) 5 位引入 -NH₂ 可提高吸收能力或组织分布选择性。

(4) 6 位引入 F，可使抗菌活性增大。

(5) 7 位引入五元或六杂环、抗菌活性增加，以哌嗪基最好。

(6) 8 位以 F，-OCH₃ 取代或与 1 位以氧烷苯成环，活性增加。

106、洛美沙星是喹诺酮母核 8 位引入氟，构效分析，8 位引入氟后，使洛美沙星

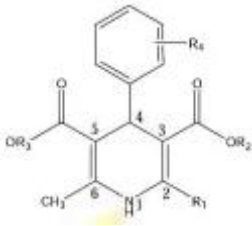
- A. 与靶酶 DNA 聚合酶作用增强，抗菌活性减弱
- B. 药物光毒性减少
- C. 口服利用度增加
- D. 消除半衰期 3-4 小时，需一日多次给药
- E. 水溶性增加，更易制成注射液

答案：C

解析：洛美沙星：8 位氟原子取代基可提高口服生物利用度，但是 8 位氟原子取代可增加其光毒性。

【107-110】

二氢吡啶类钙通道阻滞剂的基本结构如下图（硝苯地平的结构式）



二氢吡啶是该类药物的必须有效团之一，二氢吡啶类钙通道阻滞剂代谢酶通常为CYP3A4，影响该酶活性的药物可产生各药物相互作用，钙通道阻滞剂的代表药物是硝苯地平。

107、本类药物的两个羧酸酯结构不同时，可产生手性异构体且手性异构体的活性也有差异，其手性中心的碳原子编号是

- A. 2
- B. 3
- C. 4
- D. 5
- E. 6

答案：C

解析：二氢吡啶类母核是1,4-二氢吡啶类，具有不对称结构4位为手性碳。

108、本类药物通常以消旋体上市，但有一药物分别以外消旋体和左旋体先后上市，且左旋体活性较优，该药物是

- A. 尼群地平
- B. 硝苯地平
- C. 非洛地平
- D. 氨氯地平
- E. 尼莫地平

答案：D

解析：氨氯地平临床用外消旋体和左旋体。

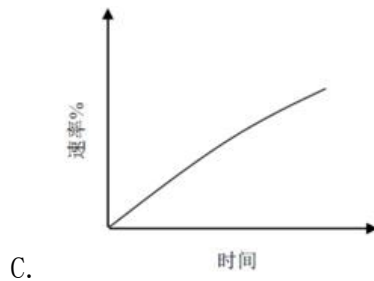
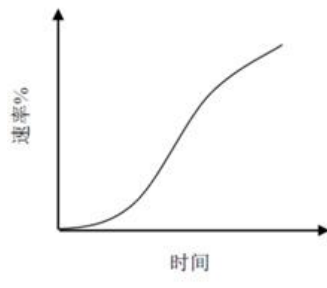
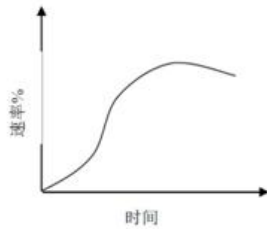
109、西咪替丁与硝苯地平合用，可以影响硝苯地平的代谢，使硝苯地平的代谢速度

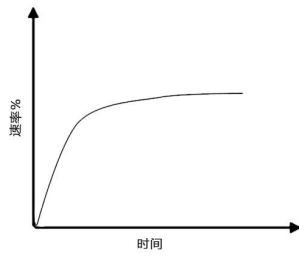
- A. 代谢速度不变
- B. 代谢速度减慢
- C. 代谢速度加快
- D. 代谢速度先加快后减慢
- E. 代谢速度先减慢后加快

答案：B

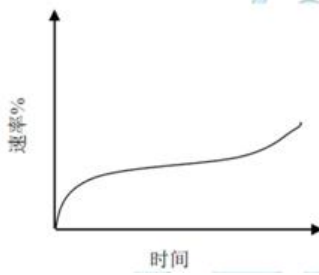
解析：肝药酶抑制剂抑制肝药酶活性，会使和它合用的药物代谢减慢。

110、控释片要求缓慢地恒速释放药物，并在规定时间内以零级或接近零级速度释放，下列由五个药厂通过的硝苯地平控释片的释放曲线，符合硝苯地平控释片释放的是





D.



E.

答案：D

【解析】

D图符合控释片的释放曲线。控释制剂系指在规定释放介质中，按要求缓慢地恒速释放药物，与相应的普通制剂比较，给药频率比普通制剂有所减少，血药浓度比缓释制剂更加平稳，且能显著增加患者的依从性的制剂。

控释制剂广义上包括控制释药的速度、方向和时间，靶向制剂、透皮吸收制剂等都属于控释制剂的范畴。而控释制剂狭义上是指在预定时间内以零级或接近零级速度释放药物的制剂。

四、多项选择题

111、提高药物稳定性的方法是

- 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、光线等的影响，制成微囊或包含物
- 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

解析：药物制剂稳定化方法 1. 控制温度 2. 调节 pH 3. 改变溶剂 4. 控制水分及湿度 5. 遮光 6. 驱逐氧气 7. 加入抗氧化剂或金属离子络合剂 8. 稳定化的其他方法（1）改进剂型或生产工艺：①制成固体制剂②制成微囊或包含物③采用直接压片或包衣工艺（2）制备稳定的衍生物（3）加入干燥剂及改善包装

112、属于第 II 相生物转化的反应有

- A. 对乙酰氨基酚和葡萄糖醛酸的结合反应
- B. 沙丁胺醇和硫酸的结合反应
- C. 白消安和谷胱甘肽的结合反应
- D. 对氨基水杨酸的乙酰化结合反应
- E. 肾上腺素的甲基化结合反应

答案：ABCDE

解析：第 II 相生物结合：与葡萄糖醛酸的结合反应；与硫酸的结合反应；与氨基酸的结合反应；与谷胱甘肽的结合反应；乙酰化结合反应；甲基化结合反应。

113、下列属于非均相液体药剂的是

- A. 低分子液体药剂

- B. 高分子液体药剂
- C. 溶胶剂
- D. 混悬剂
- E. 乳剂

答案：CDE

解析：液体制剂按分散系统分类：根据药物的分散状态，液体制剂可分为均相分散系统、非均相分散系统。在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；在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。

114、某药物首过效应大，适应的制剂有

- A. 肠溶片
- B. 舌下片
- C. 泡腾片
- D. 经皮制剂
- E. 注射剂

答案：BDE

解析：为避免首过效应，常采用注射、舌下、鼻腔、肺部、直肠下部给药或经皮给药，药物吸收过程不经肝脏，直接进入体循环，从而减少首过效应的损失。

115、多数药物作用于受体发挥药效，受体的主要类型有

- A. G 蛋白偶联受体
- B. 配体门控离子通道受体
- C. 酶活性受体
- D. 电压依赖性钙离子通道
- E. 细胞核激素受体

答案：ABCE

解析：受体的类型：G 蛋白偶联受体、配体门控的离子通道受体、酶活性受体、细胞核激素受体

116、药物的物理化学因素和患者的生理因素均影响药物吸收，属于影响药物吸收的物理化学因素有

- A. 溶出速度
- B. 脂溶性
- C. 胃排空速率
- D. 在胃肠道中的稳定性
- E. 解离度

答案：ABDE

解析：影响药物吸收的物理化学因素

- (1) 脂溶性和解离度
- (2) 溶出速度
- (3) 药物在胃肠道中的稳定性

胃排空速率是生理因素。

117、引起药源性心血管系统损害的药物是

- A. 地高辛
- B. 胺碘酮
- C. 新斯的明
- D. 奎尼丁
- E. 利多卡因

答案：ABCDE

解析：药源性心血管系统损害：

能引起心律失常的药物有强心苷、胺碘酮、普鲁卡因胺、钾盐等。

肾上腺素可引起室性期前收缩。

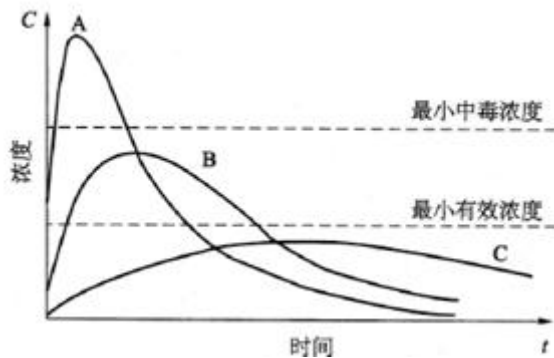
新斯的明可引起心动过缓、血压下降或休克。

胍屈嗪可引起窦性心动过速或心绞痛。

麻黄碱、多巴胺、去氧肾上腺素、苯丙胺、酚妥拉明、异丙肾上腺素可引起心动过速。

奎尼丁、利多卡因、美心律、恩卡因、氟卡胺、胺碘酮、安搏律定、溴苄胺、硝苯地平、洋地黄类、异丙肾上腺素、氯丙嗪、异丙嗪、阿米替林及一些新型的 H1 受体阻断药（如阿司咪唑）可引起尖端扭转性室性心动过速。

118、三种药物的血药浓度时间曲线如下图，对 ABC 三种药物的临床应用和生物利用度分析，正确的是



- A. 制剂 A 的吸收速度最慢
- B. 制剂 A 的达峰时间最短
- C. 制剂 A 可能引起中毒
- D. 制剂 C 可能无治疗作用
- E. 制剂 B 为较理想的药品

答案：BCDE

解析：图中 A、B、C 三种制剂具有相同的 AUC，但制剂 A 吸收快，达峰时间短，峰浓度大，已超过最小中毒浓度，因此临床上应用可能会出现中毒反应。制剂 B 达峰比制剂 A 稍慢，血药浓度有较长时间落在最小中毒浓度与最小有效浓度之间，因此可以得到较好的疗效。制剂 C 的血药浓度一直在最小有效浓度以下，所以在临床上可能无效。

119、以下为左氧氟沙星的部分报告书

检验项目	标准	检验结果
液相色谱		
紫外光谱	应在 226nm、294nm 波长处有最大吸收	226nm、294nm 波长处有最大吸收
	在 263nm 波长处有最小吸收	在 263nm 波长处有最小吸收

杂质 A	≤0.3%	0.3%
其他杂质	≤0.3%	0.2%
其他总杂	≤0.7%	0.8%
含量测定	标示量为 90.0-110.0%	110.1%

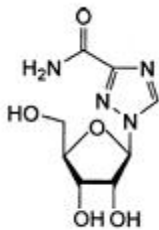
以下合格的项目有

- A. 紫外光谱
- B. 杂质 A
- C. 其他杂质
- D. 其他总杂
- E. 含量测定

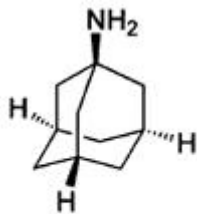
答案：ABC

解析：根据检验报告，紫外光谱、杂质 A、其他杂质都符合规定。

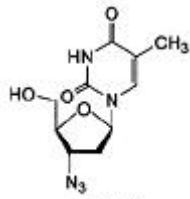
120、属于非核苷类的抗病毒药



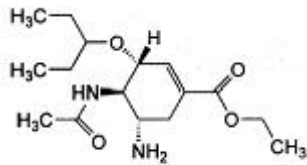
A. 利巴韦林



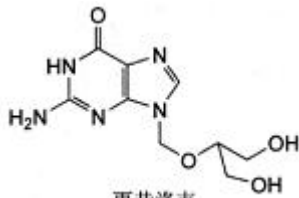
B. 金刚烷胺



C. 齐多夫定 |



D. 奥司他韦



E. 更昔洛韦

答案：ABD

解析：非核苷类的抗病毒药：利巴韦林（广谱抗病毒药）、金刚烷胺（对称的三环状胺）、金刚乙胺（金刚烷胺衍生物）、膦甲酸钠（疱疹病毒）、奥司他韦（流感病毒）。夫定类和洛韦类属于核苷类的抗病毒药。