

执业药师——药专业知识（二）

华图医疗卫生考试官网：<http://ylws.huatu.com/>

华图执业药师 QQ 群：426392798

华图医疗卫生微信号：huatuyiliao



一、单项选择

1. 基于升华原理的干燥方法是

- A. 红外干燥
- B. 消化床干燥
- C. 冷冻干燥
- D. 喷雾干燥
- E. 微波干燥

2. 某片剂主药含量应为 0.33g，如果测得颗粒中主药含量为 66%，那么片重应为

- A. 0.1g
- B. 0.2g
- C. 0.3g
- D. 0.4g
- E. 0.5g

3. 不适合粉末直接压片的辅料是

- A. 微粉硅胶

- B. 可压性淀粉
- C. 微晶纤维素
- D. 蔗糖
- E. 乳糖

4. 为了防止片剂的崩解迟缓，制备时宜选用的润滑剂为

- A. A 辅料（接触角=36 度）
- B. B 辅料（接触角=91 度）
- C. C 辅料（接触角=98 度）
- D. D 辅料（接触角=104 度）
- E. E 辅料（接触角=121 度）

5. 在胶囊剂的空胶囊壳中可加入少量的二氧化钛作为

- A. 抗氧化剂
- B. 防腐剂
- C. 遮光剂
- D. 增塑剂
- E. 保湿剂

6. 适合制备难溶性药物灰黄霉素滴丸的基质是

- A. MCC
- B. EC
- C. HPMCP
- D. CAP
- E. PEG

7. 《中国药典》2010 版规定平均重量在 1.0-3.0g 的栓剂，其重量差异限度为

- A. $\pm 5.0\%$

- B. $\pm 7.5\%$
- C. $\pm 10\%$
- D. $\pm 12.5\%$
- E. $\pm 15\%$

8. 关于眼膏剂的说法，错误的是

- A. 是供眼用的无菌制剂
- B. 用于眼部手术的眼膏剂不得加入抑菌剂
- C. 常用 1:1:8 的黄凡士林、液体石蜡和羊毛脂的混合物作为基质
- D. 难溶性药物制备眼膏剂时，应先研成极细粉末并通过九号筛选
- E. 眼膏剂的缺点是有油腻感并使视力模糊

9. 关于膜剂的说法，错误的是

- A. 可供口服，口含，舌下或黏膜给药
- B. 可制成单层膜、多层膜和夹心膜
- C. 载药量高
- D. 起效快
- E. 重量差异不易控制

10. 关于纯化水的说法，错误的是

- A. 可作为制备中药注射剂时所用饮片的提取溶剂
- B. 可作为制备中药滴眼剂时所用饮片的提取溶剂
- C. 可作为配制口服制剂的溶剂
- D. 可作为配制外用的溶剂
- E. 可作为配制注射剂的溶剂

11. 关于热原性质的说法，错误的是

- A. 具有不耐热性



- B. 具有过滤性
- C. 具有水溶性
- D. 具有不挥发性
- E. 具有被氧化性
12. 不能除去热原的方法是
- A. 高温法
- B. 酸碱法
- C. 冷冻干燥法
- D. 吸附法
- E. 反渗透性
13. 关于液体药剂特点的说法，错误的是
- A. 分散度大，吸收快
- B. 给药途径广泛，可内服也可外用
- C. 易引起药物的化学降解
- D. 携带、运输方便
- E. 易霉变、常需加入防腐剂
14. 属于非极性溶剂的是
- A. 甘油
- B. 乙醇
- C. 丙二醇
- D. 液体石蜡
- E. 聚乙二醇
15. 属于非离子表面活性剂的是
- A. 硬脂酸钾



B. 泊洛沙姆

C. 十二烷基硫酸钠

D. 十二烷基苯磺酸钠

E. 苯扎氯铵

16. 对于易水解的药物制剂生产中原料的水分一般控制在

A. 0.5%以下

B. 1.0%以下

C. 2.0%以下

D. 3.0%以下

E. 4.0%以下

17. 不属于药物稳定性试验方法的是

A. 高湿试验

B. 加速试验

C. 随机试验

D. 长期试验

E. 高温试验

18. 不属于包合物制备方法的是

A. 熔融法

B. 饱和水溶液法

C. 研磨法

D. 冷冻干燥法

E. 喷雾干燥法

19. 不属于经皮给药制剂类型的是

A. 充填封闭型



- B. 复合膜型
- C. 中空分散型
- D. 聚合物骨架型
- E. 微储库型

20. 关于药物经皮吸收的说法，正确的是

- A. 吸收的主要途径是汗腺、毛囊等皮肤附属器
- B. 吸收的速率与分子量成正比
- C. 分子型药物增多，不利于药物的经皮吸收
- D. 低熔点的药物容易渗透通过皮肤
- E. 药物与基质的亲和力越大，释放越快

21. 不属于物理化学靶向制剂的是

- A. 磁性靶向制剂
- B. 栓塞靶向制剂
- C. 热敏靶向制剂
- D. 免疫靶向制剂
- E. PH 敏感靶向制剂

22. 有肝脏首过效应的吸收途径是

- A. 胃粘膜吸收
- B. 肺粘膜吸收
- C. 鼻粘膜吸收
- D. 口腔黏膜吸收
- E. 阴道粘膜吸收

23. 某药的稳态血药浓度为 3mg/L，表现分布容积为 2.0L/kg，若患者体重为 60kg，静脉滴注该药到达稳态时，体内的稳态药量是



- A. 30mg
- B. 60mg
- C. 120mg
- D. 180mg
- E. 360 mg

24. 关于蛋白多肽类药物的说法正确是

- A. 口服吸收好
- B. 副作用少
- C. 稳定性好
- D. 作用时间长
- E. 活性降低

二、配伍选择

【25-27】

- A. 11.0
- B. 17.4
- C. 34.8
- D. 58.2
- E. 69.6

25. A 和 B 两种药物的 CRH 分别为 71.0%和 82.0%，两者等量混合后 CRH (%) 值是

26. A 和 B 两种抛射剂的蒸汽压分别为 12.5 和 22.3，两者等量混合后的蒸汽压是

27. A 和 B 两种表面活性剂的 HLB 值分别为 16.6 和 18.2 两者混合后的 HLB 值是

【28-29】

- A. 可溶性颗粒
- B. 混悬颗粒
- C. 泡腾颗粒

D. 肠溶颗粒

E. 控释颗粒

28. 以碳酸氢钠和有机酸为主要辅料制备的颗粒剂是

29. 能够恒速释放药物的颗粒剂是

【30-31】

A. 肠溶片

B. 分散片

C. 泡腾片

D. 舌下片

E. 缓释片

30. 能够避免药物受胃肠及酶的破坏而迅速起效的片剂是

31. 规定在 20℃左右在水中 3 分钟内崩解的片剂是

【32-33】

A. 乙基纤维素

B. 醋酸纤维素

C. 羟丙基纤维素

D. 低取代羟丙基纤维素

E. 微晶纤维素

32. 既可以作湿法制粒粘合剂，也可以作为粉末直接压片黏合剂的是

33. 既可以作片剂的填充剂（稀释剂），也可作为粉末直接压片黏合剂的是

【34-36】

A. 羟丙基纤维素

B. 甲基纤维素

C. 醋酸纤维素

D. 微晶纤维素

E. 邻苯二甲醋酸纤维素

34. 属于肠溶型包衣材料的是

35. 属于胃溶型包衣材料的是

36. 属于水不溶型包衣材料的是

【37-38】

A. 15min

B. 30 min

C. 45 min

D. 60 min

E. 120 min

37. 脂肪性基质的栓剂的融变时限规定是

38. 水溶性基质的栓剂的融变时限规定

【39-41】

A. 白蜡

B. 聚山梨酯 80

C. 叔丁基对甲酚

D. 单硬脂酸甘油酯

E. 凡士林

39. 可作为栓剂吸收促进剂的是

40. 可作为栓剂抗氧化剂的是

41. 即可作为栓剂增稠剂，又可作为 O/W 软膏剂基质稳定剂的是

【42-45】

A. 十八醇

B. 月桂醇硫酸钠

C. 司盘 80

D. 甘油

E. 羟苯乙酯

42. 属于软膏剂基质的是

43. 属于 O/W 软膏剂基质乳化剂的是

44. 属于软膏保湿剂的是

45. 属于软膏剂防腐剂的是

【46-48】

A. 硫柳汞

B. 氯化钠

C. 羧甲基纤维素

D. 聚山梨酯 80

E. 注射用水

46. 在醋酸可的松注射液中作为抑菌剂的是

47. 在醋酸可的松注射液中作为助悬剂的是

48. 在醋酸可的松注射液中作为渗透压调节剂的是

【49-52】

A. 依地酸二钠

B. 碳酸氢钠

C. 亚硫酸氢钠

D. 注射用水

E. 甘油

49. 在维生素 C 注射液中作为抗氧剂的是

50. 在维生素 C 注射液中作为金属离子络合剂的是

51. 在维生素 C 注射液中作为 pH 调节剂的是

52. 在维生素 C 注射液中作为溶剂的是

【53-54】

- A. 低温间歇灭菌法
- B. 干热空气灭菌法
- C. 辐射灭菌法
- D. 紫外线灭菌法
- E. 微波灭菌法

53. 不升高灭菌产品的温度，穿透性强，适用于不耐热药物灭菌的方法是

54. 可穿透到介质的深部，通常可使介质表里一致的加热，适用于水性注射液灭菌的方法是

【55-56】

- A. 大豆油
- B. 大豆磷脂
- C. 甘油
- D. 羟苯乙酯
- E. 注射用水

55. 属于静脉注射脂肪乳剂中乳化剂的是

56. 属于静脉注射脂肪乳剂中渗透压调节剂的是

【57-60】

- A. 羟苯乙酯
- B. 聚山梨酯
- C. 苯扎溴铵
- D. 硬脂酸钙
- E. 卵磷脂

57. 属于阳离子表面活性剂的是

58. 属于阴离子表面活性剂的是

59. 属于两性离子表面活性剂的是

60. 属于非离子表面活性剂的是

【61-63】

- A. 在 60℃温度下放置 10 天
 - B. 在 25℃和相对湿度 (90±5)%条件下放置 10 天
 - C. 在 65℃稳定下放置 10 天
 - D. 在 (4500±5000)lx 的条件下放置 10 天
 - E. 在 (8000±800)lx 的条件下放置 10 天
61. 属于药物稳定性高温试验条件的是
62. 属于药物稳定性高湿试验条件的是
63. 属于药物稳定性光照试验条件的是

【64-67】

- A. 复凝聚法
 - B. 喷雾冻凝法
 - C. 单凝聚法
 - D. 液中干燥法
 - E. 多孔离心法
64. 带相反电荷的高分子材料相互交联且与囊芯物凝聚成囊的方法是
65. 在 高分子溶液中加入凝聚液而凝聚成囊的方法是
66. 从乳浊液中除去分散相挥发性溶剂以制备微囊的方法是
67. 使囊芯物高速穿过囊材的液态膜进入固化浴固化成囊的方法是

【68-69】

- A. 酶诱导作用
- B. 膜动转运
- C. 血脑屏障
- D. 肠肝循环
- E. 蓄积效应

68. 某些药物促进自身或其他合用药物代谢的现象属于

69. 通过细胞膜主动变形将药物摄入细胞内部释放到细胞外的过程

【70-72】

70. 表示双室模型静脉注射给药血药浓度-时间关系式的方程式是

71. 表示多剂量（重复）血管外给药首剂量与维持剂量关系的公式是

72. 表示以尿中排泄药物计算相对生物利用度的公式是

A. $C = Ae^{-\alpha t} + Be^{-\beta t}$

B. $X_0^* = X_0 \frac{1}{(1 - e^{-k\tau})(1 - e^{-k_s\tau})}$

B.

C. $\bar{C} = \frac{\int_0^{\tau} (C_{ss}) dt}{\tau} = \frac{X_0}{Vk\tau}$

C.

D. $F_{Rel} = \frac{AUC_{试验}/X_{0(试验)}}{AUC_{参比}/X_{0(参比)}} \times 100\%$

D.

E. $F_{Ab} = \frac{AUC_{po}/X_{0(po)}}{AUC_{iv}/X_{0(iv)}} \times 100\%$

E.

三、多项选择题

73. 以非均匀分散体系构成的剂型包括

A. 溶液型

B. 高分子溶液型

C. 乳浊型



- D. 混悬型
- E. 固体分散型

74. 胶囊剂包括

- A. 硬胶囊
- B. 软胶囊
- C. 缓释胶囊
- D. 控释胶囊
- E. 肠溶胶囊

75. 甘油在膜剂处方中可作

- A. 着色剂
- B. 脱膜剂
- C. 增塑剂
- D. 表面活性剂
- E. 填充剂

76. 可以静脉给药的剂型有

- A. 水溶液型注射剂
- B. 油溶液性注射剂
- C. O/W 型乳剂型注射剂
- D. 油混悬液型注射剂
- E. 水混悬液型注射剂

77. 常使用药物水溶液，注射剂量可以超过 5ml 的给药途径有

- A. 静脉注射
- B. 脊椎腔注射
- C. 肌内注射

D. 皮下注射

E. 皮内注射

78. 关于注射剂质量要求的说法，正确的有

A. 无菌

B. 无热原

C. 无可见异物

D. 渗透压与血浆相等或接近

E. PH 值与血液相等或接近

79. 需要加入抑菌剂的有

A. 低温灭菌的注射剂

B. 滤过除菌的注射剂

C. 无菌操作制备的注射剂

D. 多剂量的注射剂

E. 静脉给药的注射剂

80. 属于半极性溶剂的有

A. 聚乙二醇

B. 丙二醇

C. 脂肪油

D. 二甲基亚砷

E. 醋酸乙酯

81. 关于固体分散物的说法，正确的有

A. 药物以分子、胶态、微晶或无定性状分散在载体材料中

B. 载体材料包括水溶性、难溶性和肠溶性三类

C. 可使液体药物固体化

- D. 药物的分散状态好，稳定性高，易于久贮
- E. 固体分散物不能进一步制成注射液

82. 关于缓（控）释制剂的说法，正确的有

- A. 缓（控）释制剂可以避免或减少血药浓度的峰谷现象
- B. 可以用聚氯乙烯、聚乙烯等制成不溶性骨架片达到缓（控）释效果
- C. 可以用羟丙甲纤维素等制成亲水性凝胶骨架片达到缓（控）释效果
- D. 可以用巴西棕榈蜡等制成溶油性骨架片达到缓（控）释效果
- E. 可以用微晶纤维包衣制成渗透泵片达到缓（控）释效果

83. 不影响药物溶出速度的有

- A. 粒子大小
- B. 颜色
- C. 晶型
- D. 旋光度
- E. 溶剂化物

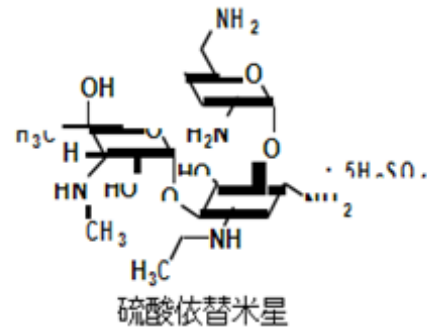
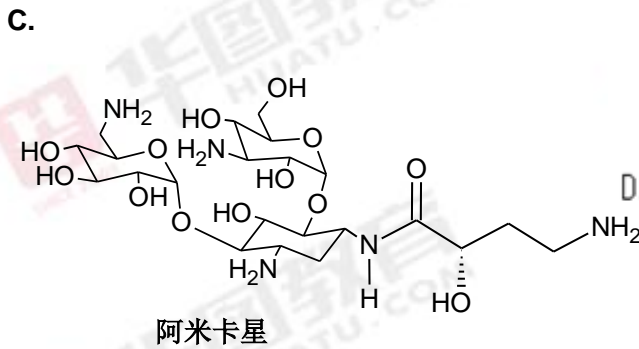
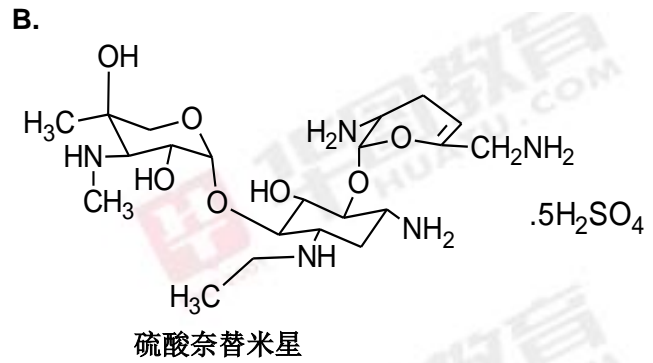
84. 属于药物制剂的物理配伍变化的有

- A. 结块
- B. 变色
- C. 产气
- D. 潮解
- E. 液化

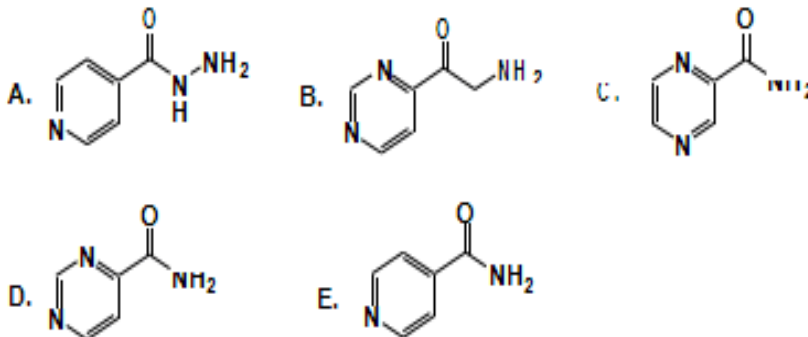
药物化学部分

一、单项选择

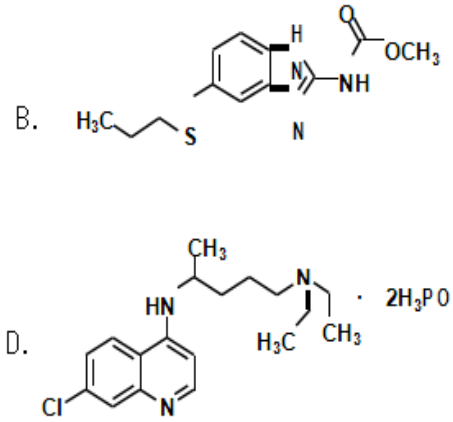
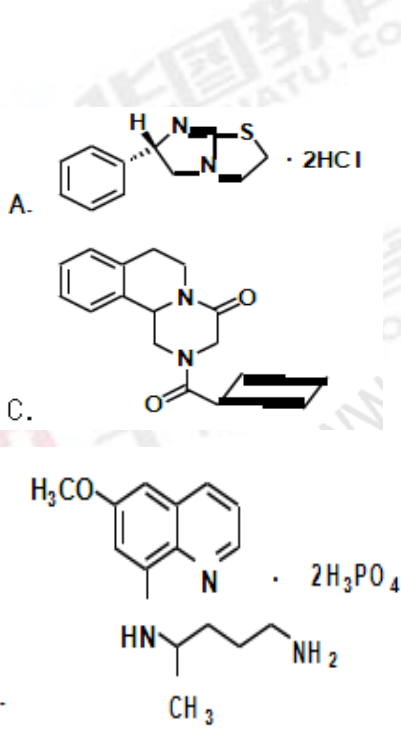
85. 在卡那霉素的分子中引入 L-(-) 氨基羟丁酰基侧链，所得到的药物对耐卡那霉素的金黄色葡萄球菌等细菌有显著的抑制作用。该药物是



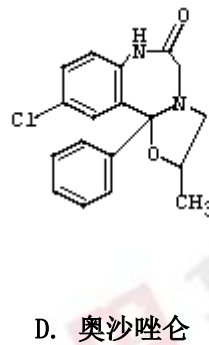
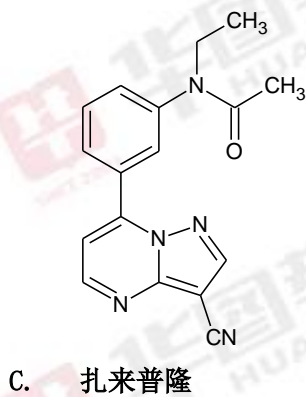
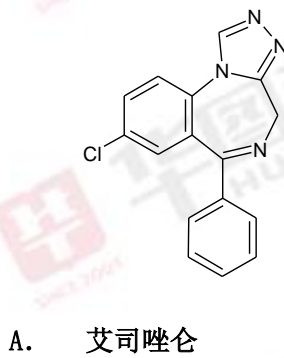
86. 抗结核药吡嗪酰胺是烟酰胺的抗代谢物，在体内水解为吡嗪羧酸而发挥作用，吡嗪酰胺的结构是

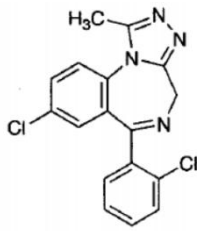


87. 分子中存在 S-氨基喹啉结构片段，在体内转化为具有较强氧化性的喹啉醌衍生物，用作防止抗疟疾药物是



88. 脂溶性大，易进入中枢，起效快，半衰期短，按第一类精神药品管理的镇静药是



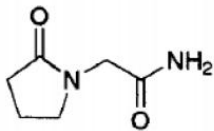


E. 三唑仑

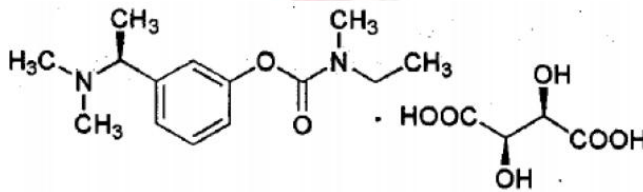
89. 精神病患者在服用盐酸氯丙嗪后，若在日光强烈照射下易发生光过敏反应。产生光过敏反应的原因是

- A. 氯丙嗪分子中的噻嗪环遇光被氧化后，与体内蛋白质发生反应
- B. 氯丙嗪分子中的硫原子遇光被氧化成亚砷，与体内蛋白质发生反应
- C. 氯丙嗪分子中的酮—氯键遇光分解产生自由基，与体内蛋白质发生反应
- D. 氯丙嗪分子中的侧链碳原子遇光被氧化成羰基，与体内蛋白质发生反应
- E. 氯丙嗪分子中的侧链氮原子遇光被氧化成 N 氧化物，与体内蛋白质发生反应

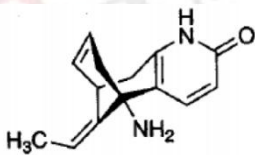
90. 分子中含有氨基甲酸酯结构，为选择性乙酰胆碱酯酶抑制的药物是



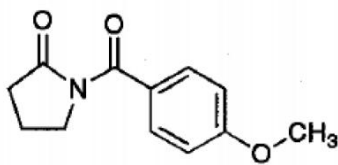
A. 吡拉西坦



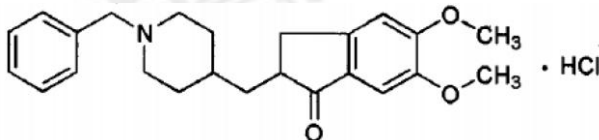
B. 酒石酸利斯的明



C. 石杉碱甲



D. 茴拉西坦



E. 盐酸多奈哌齐

91. 为莨菪碱类药物，天然品为左旋体（称 654-1），合成品为外消旋体（称 654-2） 药物是

- A. 硫酸阿托品 B. 氢溴酸山莨菪碱 C. 丁溴东莨菪碱 D. 氢溴酸东莨菪碱 E. 溴丙胺太林

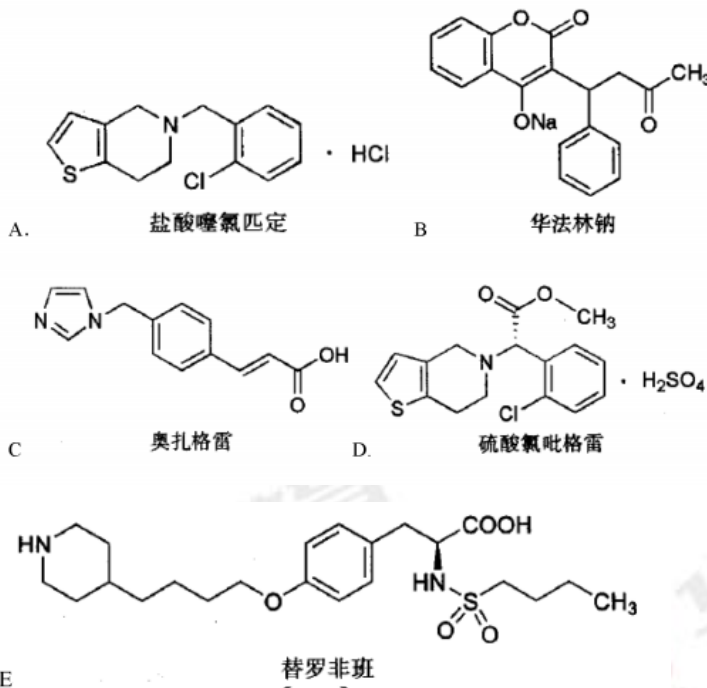
92. 分子中含有巯基，对血管紧张素转换酶（ACE）产生较强抑制作用的抗高血压药物是

- A. 卡托普利 B. 马来酸依那普利 C. 福辛普利 D. 赖诺普利 E. 雷米普利

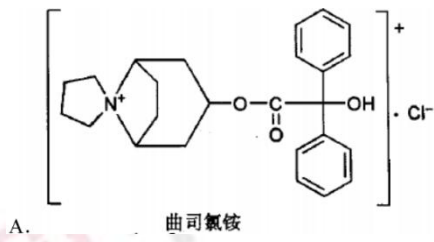
93. 关于硝酸甘油性质和作用的说法，错误的是

- A. 常温下为液体，有挥发性
B. 在遇热或撞击下易发生爆炸
C. 在碱性条件下迅速水解
D. 在体内不经代谢而排出
E. 口腔黏膜吸收迅速，心绞痛发作时，可在舌下含服

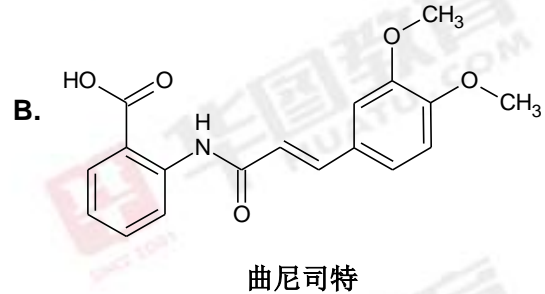
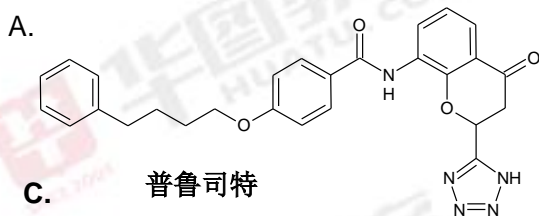
94. 分子中含有香豆素的内酯结构，易多种药物发生相互作用而影响安全性的抗凝药物是

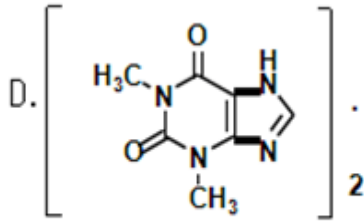


95. 属于 M 受体拮抗剂，因分子内含有季铵基团，不能通过血脑屏障，而没有中枢神经系统副作用的抗尿失禁药物是

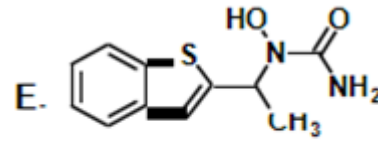
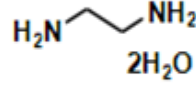


96. 含有苯并吡喃的双色酮结构，在肺部的吸收为 8%，在肠道为 1%，常以气雾剂使用的抗哮喘药是





氨茶碱



齐留通

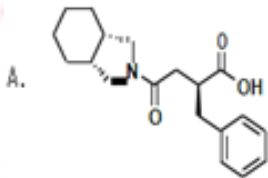
97. 为 S-(-)-光学异构体，体内代谢慢，维持时间长的抗溃疡药物是

- A. 奥美拉唑 B. 埃索美拉唑 C. 兰索拉唑
D. 泮托拉唑 E. 雷贝拉唑钠

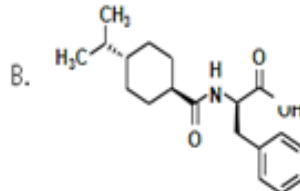
98. 既能抑制环氧合酶，又能抑制脂氧合酶的芳基乙酸类非甾体抗炎药物是

- A. 双氯芬酸钠 B. 萘丁美酮 C. 布洛芬 D. 美洛昔康 E. 塞来昔布

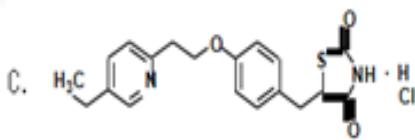
99. 为取代苯甲酸衍生物，分子中含有一个手性碳，S-异构体的活性大于 R-异构体，在体内代谢迅速，作为餐时血糖调节剂的降血糖药是



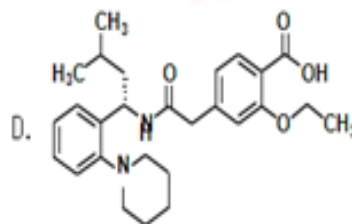
米格列奈



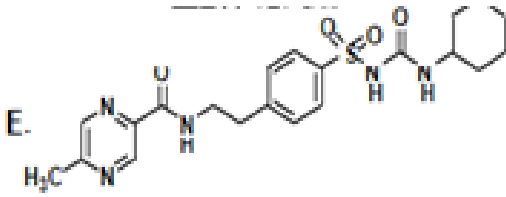
那格列奈



盐酸吡格列酮



瑞格列奈



格列吡嗪

100. 含有甲基萘醌结构，可用于新生儿出血的维生素药物是

- A. 维生素 A
- B. 维生素 D
- C. 维生素 D3
- D. 维生素 E
- E. 维生素 K1

二、配伍选择题

[101-104]

- A. 丙磺舒 B. 克拉维酸 C. 舒巴坦钠 D. 他唑巴坦 E. 甲氧苄啶

101. 天然来源的β-内酰胺酶抑制剂，临床上常与阿莫西林组成复方制剂的药物是

102. 因口服吸收差，可与氨苄西林以 1:1 的形式以次甲基相连，得到舒他西林的药物是

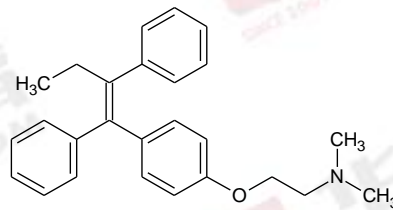
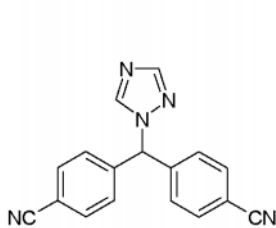
103. 与青霉素合用，可降低青霉素的排泄速度，从而增强青霉素抗菌活性的药物是

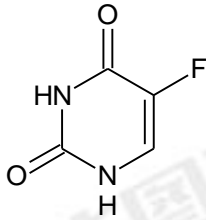
104. 本身具有广谱抗菌作用，与磺胺类药物合用可显著增强抗菌作用的药物是

[105-107]

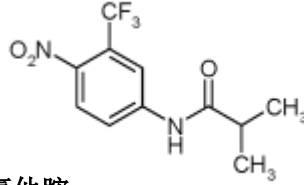
A. 来曲唑

B. 枸橼酸他莫昔芬

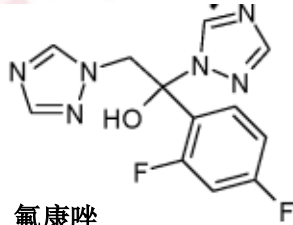




C. 氟尿嘧啶



D. 氟他胺



E. 氟康唑

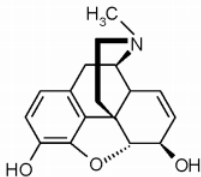
105. 含有三苯乙烯结构，通过拮抗雌激素受体，用于乳腺癌治疗的药物是

106. 含有三氮唑结构，通过抑制芳香酶，用于乳腺癌治疗的药物是

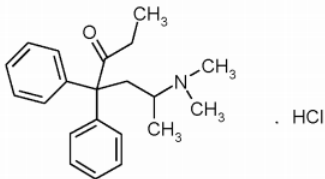
107. 含有酰胺结构，通过拮抗雌激素受体，用于前列腺癌治疗的药物是

[108-110]

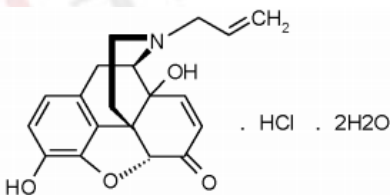
A. 吗啡



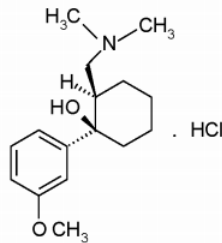
C. 盐酸美沙酮



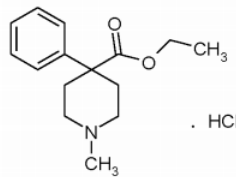
E. 盐酸纳洛酮



B. 盐酸曲马多



D. 盐酸哌替啶



108. 分子中含有氨基酮结构，戒断症状较轻，常用作戒毒药的药物是

109. 分子中含有烯丙基结构，及有阿片受体拮抗作用的药物是

110. 分子中含有哌啶结构，具有 μ 受体激动作用的药物是

[111-113]

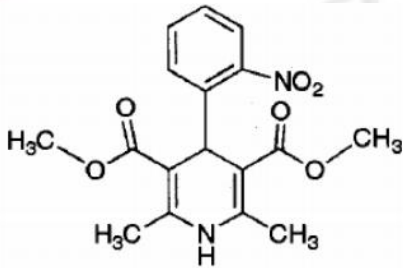
- A. 肾上腺素 B. 酒石酸间羟胺 C. 沙丁胺醇
D. 沙美特罗 E. 盐酸麻黄碱

111. 含有儿茶酚胺结构，易被氧化变质的肾上腺素能药物是

112. 含有叔丁氨基结构，选择行激动 β_2 受体的肾上腺能药物是

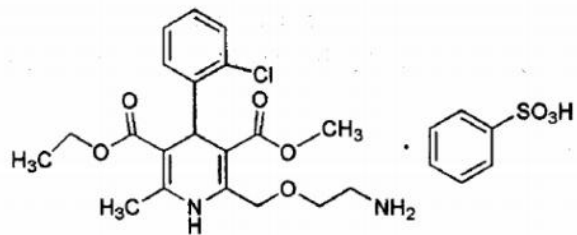
113. 结构中不含有酚羟基，易通过血脑屏障，产生较强中枢兴奋副作用的肾上腺素能药物是

[114-117]



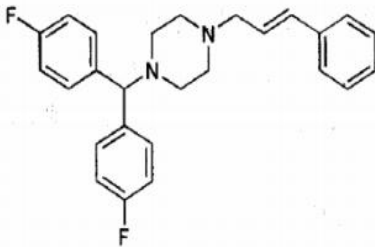
A.

硝苯地平



B/

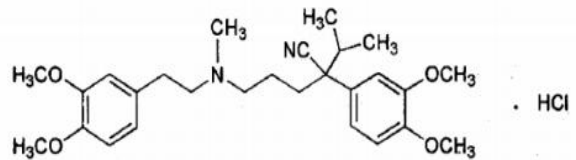
苯磺酸氨氯地平



C.

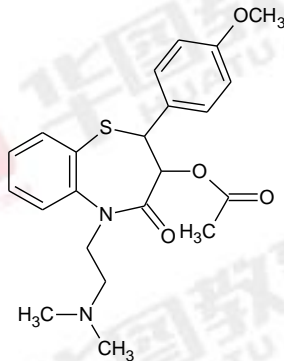
盐酸氟桂利嗪

. 2HCl



D.

盐酸维拉帕米



E. 盐酸地尔硫卓

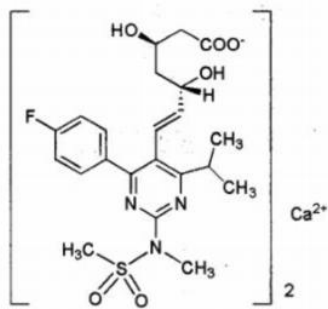
114. 含有 1 个手性碳的二氢吡啶类钙通道阻滞剂，用于高血压治疗的药物是

115. 含有 1 个手性碳的芳烷基胺类钙通道阻滞剂，用于室上性心动过速治疗的药物是

116. 含有 2 个手性碳的苯硫氮类钙通道阻滞剂，用于冠心病治疗的药物是

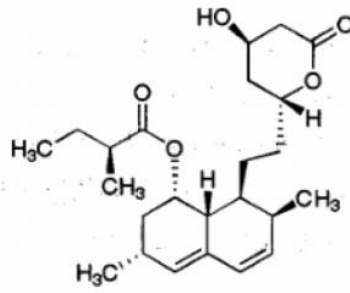
117. 不含有手性碳的三苯哌嗪类钙通道阻滞剂，用于脑供血不足治疗的药物是

[118-121]



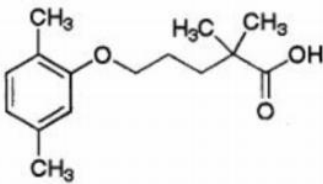
A.

瑞舒伐他汀钙



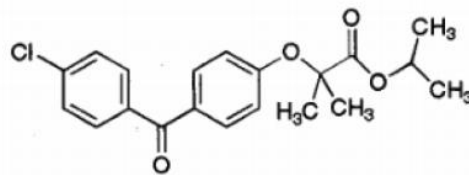
B.

洛伐他汀



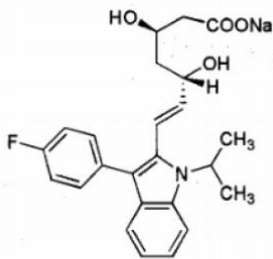
C.

吉非罗齐



D.

非诺贝特



E.

氟伐他汀钠

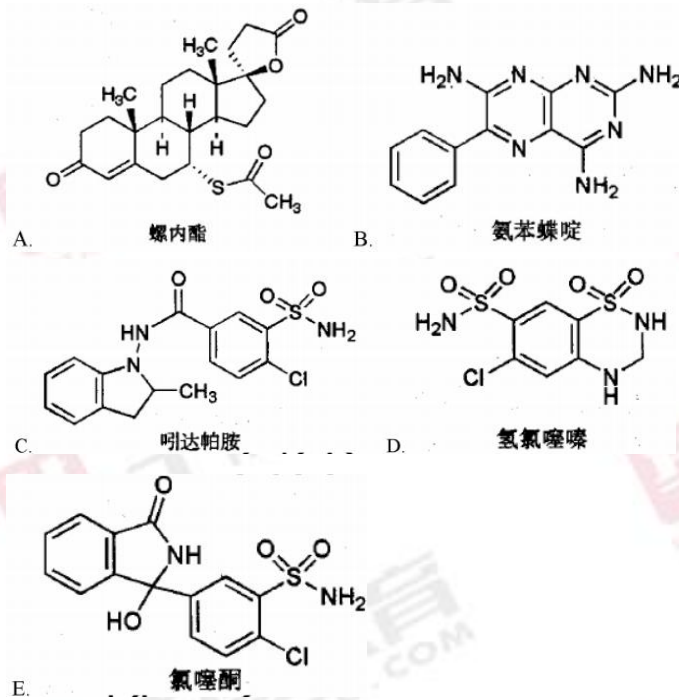
118. 含有羟基内酯结构和氢化萘环骨架的 HMG-CoA 还原酶抑制剂的调血脂药是

119. 含有 3,5-二羟基羧酸活性结构和嘧啶环骨架的 HMG-CoA 还原酶抑制剂的调血脂药是

120. 还有芳氧羧酸结构的调血脂药是

121. 为前药，在体内代谢后产生活性苯氧羧酸的调血脂药是

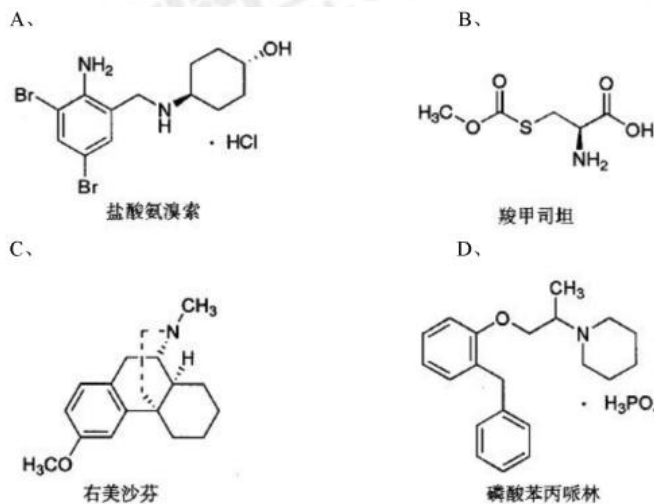
[122-123]



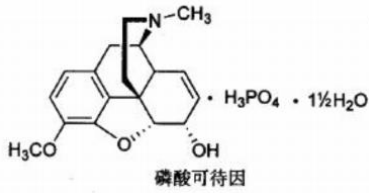
122. 分子中含有双磺酰胺结构，碱性溶液中易失活，不宜与碱性药物配伍的利尿药是

123. 分子中含有甾体结构，体内代谢生成坎利酮的利尿药物是

[124-125]



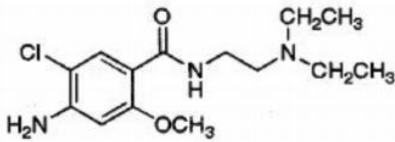
E、



124. 含有半胱氨酸结构，可降低痰液粘滞性的祛痰药物是

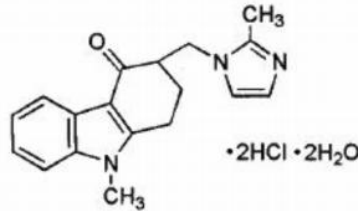
125. 在体内有部分药物可代谢产生吗啡，被列入我国麻醉药品品种目录的镇咳药物

[126-127]



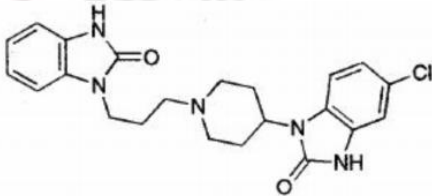
A.

甲氧氯普胺



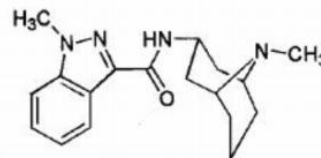
B.

盐酸昂丹司琼



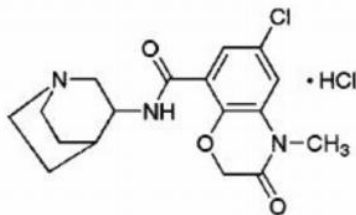
C.

多潘立酮



D.

格拉司琼



E.

盐酸阿扎司琼

126. 分子中含有苯甲酰胺结构，拮抗多巴胺 D2 受体，具有促胃动力和止吐作用的药物是

127. 分子中含有咪唑环结构，通过拮抗 5-羟色胺受体而产生止吐作用的药物是

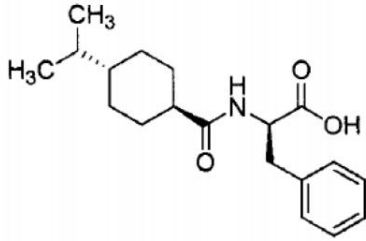
[128-129]

A. 丙磺舒 B. 苯溴马隆 C. 别嘌醇 D. 秋水仙碱 E. 盐酸赛庚啶

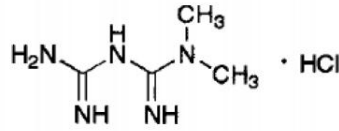
128. 来源于天然植物，长期使用会产生脊髓抑制毒副作用的抗痛风药物是

129. 在体内通过抑制嘌呤氧化物，减少尿酸的生物合成，降低血中尿酸浓度的抗痛风药物是

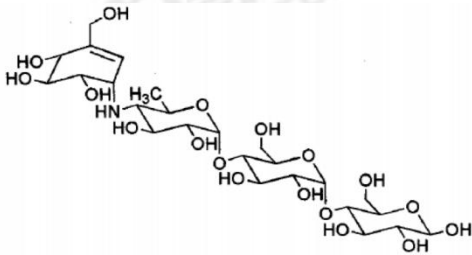
[130-132]



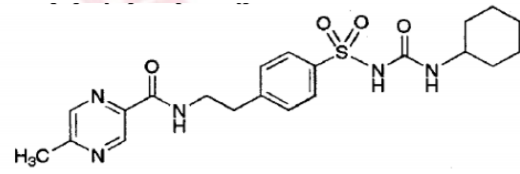
A. 那格列奈



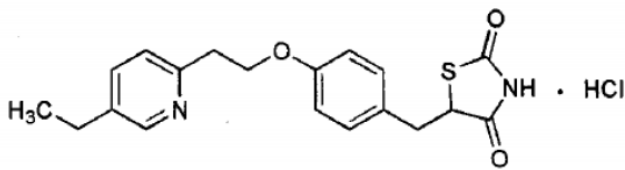
B. 盐酸二甲双胍



C. 阿卡波糖



D. 格列吡嗪



E. 盐酸吡格列酮

130. 属于磺酰脲类胰岛素分泌促进剂的降血糖药物是

131. 属于非磺酰脲类胰岛素分泌促进剂的降血糖药物是

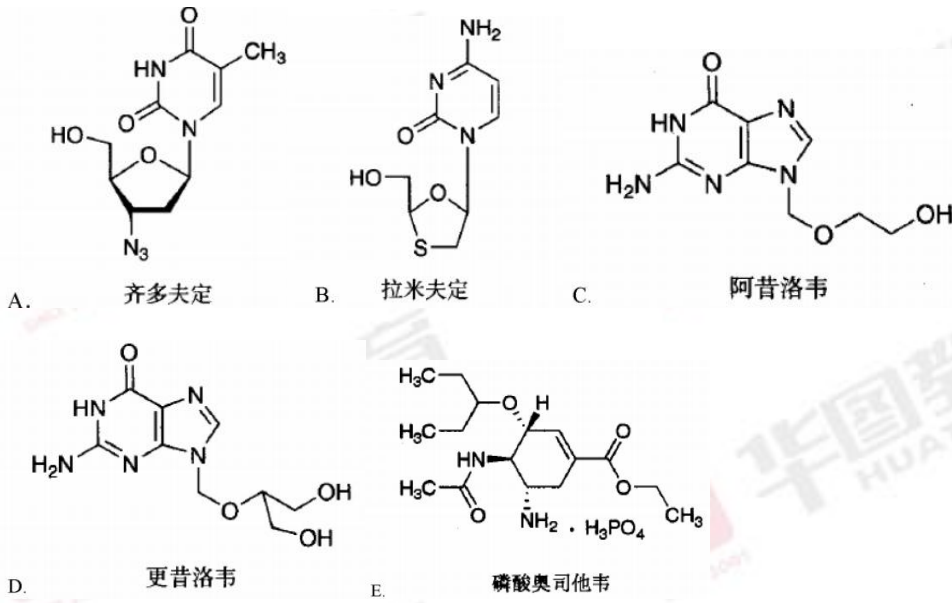
132. 属于噻唑烷二酮类胰岛素增敏剂的降血糖药物是

三、多项选择题

133. 含有大环内酰胺结构的抗结核药物是

A. 盐酸乙胺丁醇 B. 硫酸链霉素 C. 利福喷丁 D. 利福平 E. 利福布汀

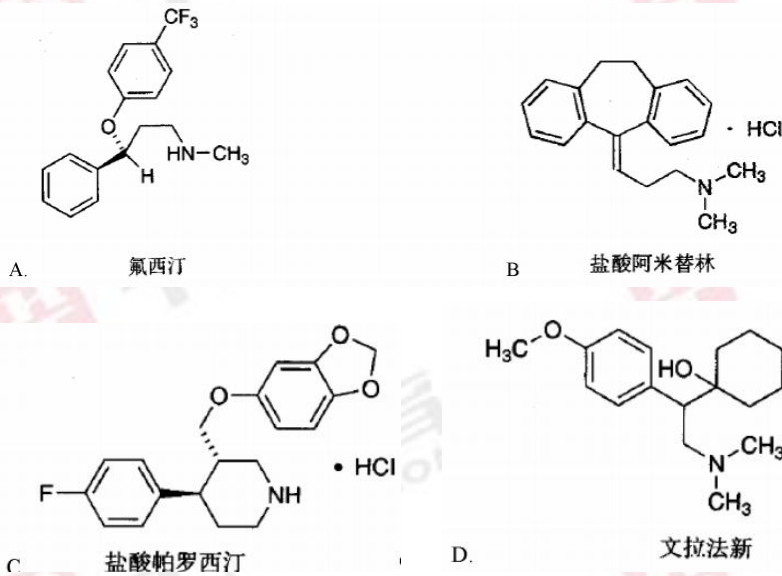
134. 属于核苷类的抗病毒药物有

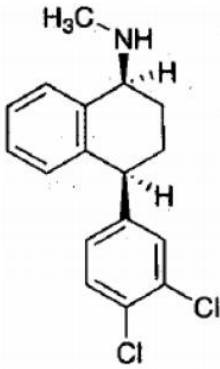


135. 从天然产物中发现的抗菌药物有

- A. 盐酸小檗碱 B. 盐酸林可霉素 C. 甲硝唑 D. 磷霉素 E. 利奈唑胺

136. 在体内可发生脱甲基代谢，其代谢产物仍保持抗抑郁活性的药物有





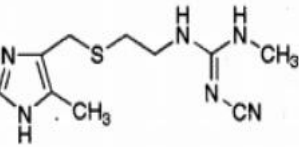
E. 舍曲林

137. 结构中含有糖基的抗心力衰竭药物有

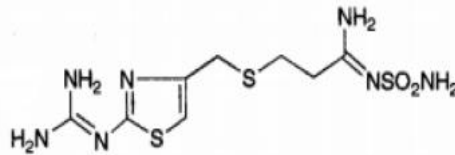
- A. 盐酸美西律 B. 去乙酰毛花苷 C. 华法林 D. 地高辛 E. 阿司匹林

138. 结构中含有硫原子连接链 H₂ 受体拮抗剂的抗溃疡药物有

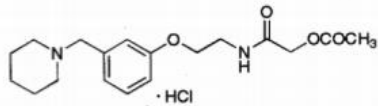
- A. 西米替丁 B. 法莫替丁



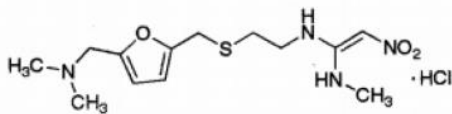
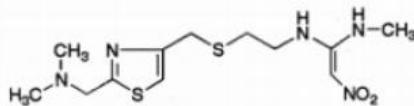
C. 罗沙替丁乙酸酯盐酸盐



D. 尼扎替丁



E. 盐酸雷尼替丁



139. 从代谢产物中发现的 H₁ 受体拮抗剂药物有

- A. 马来酸氯苯那敏 B. 阿斯咪唑 C. 盐酸赛庚啶 D. 地氯雷他定 E. 非索非那定

140. 对骨质疏松症有治疗作用的药物是

- A. 盐酸雷洛昔芬 B. 阿法骨化醇 C. 阿伦膦酸钠
D. 利赛膦酸钠 E. 依替膦酸二钠

答案与解析

药剂部分

一、单项选择题

1、C。【解析】干燥的方法包括：常压箱式干燥、流化床干燥、喷雾干燥、红外干燥、微波干燥、冷冻干燥。其中，冷冻干燥是利用固体冰升华去除水分的干燥方法。

2、E。【解析】片重=每片含主药量（标示量）/颗粒中主药的百分含量（实测值），片剂主药含量为 0.33g，颗粒中主药含量为 66%，片重=0.33/66% =0.5

3、D。【解析】可用于粉末直接压片的药用辅料包括：微晶纤维素、喷雾干燥乳糖、磷酸二氢钙二水合物、可压性淀粉、微粉硅胶。

4、A。【解析】润滑剂的润湿性差，是造成片剂崩解迟缓的主要原因。接触角小，粉体的润湿性越好。

5、C。【解析】明胶是空胶囊的主要成囊材料，且会在胶囊中加入增塑剂如甘油、山梨醇、CMC-Na、HPC；加入增稠剂琼脂；对光敏感药物要加入遮光剂二氧化钛；加入防腐剂尼泊金类。

6、E。【解析】滴丸滴丸剂中除主工以外的赋形剂均称为基质，常用的有水溶性和脂溶性两大类。1. 水溶性基质常用的有 PEG 类，如 PEG6000、PEG4000、及肥皂类如硬脂酸钠和甘油明胶等。2. 脂溶性基质常用的有硬脂酸、单硬脂酸甘油酯、十六醇、十八醇、虫蜡、氢化植物油等。在实际应用中常采用水溶性和脂溶性基质的混合物作滴丸的基质。难溶性药物灰黄霉素选择水溶性基质 PEG 类。

7、B。【解析】平均重量小于等于 1.0g 时，其重量差异限度为±10.0%；平均重量在 1.0-3.0g 的栓剂，其重量差异限度为±7.5%；平均重量大于 3.0g 时，其重量差异限度为±5.0%。

8、C。【解析】眼膏剂常用黄凡士林、液体石蜡和羊毛脂的混合物作为基质，其用量比例为 8:1:1，可根据气温适当增减液体石蜡的用量。

9、C。【解析】膜剂可制成单层膜、多层膜和夹心膜，供口服，口含，舌下或黏膜给药。稳定性好，起效快。的缺点是载药量少，仅适用于剂量小的药物，重量差异不易控制，吸收率不高。

10、E。【解析】纯化水为饮用水经蒸馏法、离子交换法或其他适宜方法制得的制药用水，可作为制备中药注射剂时所用饮片的提取溶剂；可作为制备中药滴眼剂时所用饮片的提取溶剂；可作为配制口服制剂的溶剂；可作为配制外用的溶剂；但纯化水不得用于注射剂的配置和稀释。

11、A。【解析】热原的性质包括：耐热性、滤过性、水溶性、不挥发性、被强氧化剂氧化性。

12、C。【解析】热原的除去方法包括：高温法、酸碱法、吸附法、离子交换法、超滤法、凝胶滤过法、反渗透法。

13、D。【解析】液体制剂分散度大，吸收快；给药途径广泛，可内服也可外用；易引起药

物的化学降解，使药效降低；但液体制剂体积较大，携带、运输贮存都不方便；液体制剂易霉变、常需加入防腐剂。

14、D。【解析】极性溶剂包括：水、甘油、二甲基亚砷；半极性溶剂包括：乙醇、丙二醇、聚乙二醇；非极性溶剂包括：脂肪油、液体石蜡、醋酸乙酯。

15、B。【解析】根据极性基团的解离性质，将表面活性剂分为 1、阴离子表面活性剂：①肥皂类如硬脂酸钠、三乙醇胺。②硫酸化物如十二烷基硫酸钠。③磺酸化物如十二烷基苯磺酸钠。2、阳离子表面活性剂：苯扎氯铵、苯扎溴铵。3、两性离子表面活性剂：卵磷脂、氨基酸和甜菜碱。4、非离子表面活性剂：脂肪酸甘油酯、蔗糖脂肪酸酯、脂肪酸山梨坦（司盘）、聚山梨酯（吐温）、聚氧乙烯脂肪酸酯（卖泽）、聚氧乙烯脂肪醇醚（苜泽）、泊洛沙姆。

16、B。【解析】微量的水分会加速可加速药物的降解，对于易水解的药物制剂生产中原料的水分一般控制在 1.0% 以下。水分含量越高，药物降解速度越快。

17、C。【解析】稳定性试验包括影响因素试验、加速试验与长期试验。其中影响因素试验包括高温、高湿、强光照射试验。

18、A。【解析】常用的饱和方法包括：饱和水溶液法、研磨法、冷冻干燥法、喷雾干燥法。

19、C。【解析】经皮给药制剂制剂的类型目前普遍应用的有：充填封闭型、复合膜型、黏胶分散型、聚合物骨架型、微储库型。

20、D。【解析】药物经皮吸收的主要途径为表皮途径，非主要途径是皮肤附属器途径；药物吸收速率与分子量成反比，经皮给药宜选用分子量小、药理作用强的小剂量药物；低熔点药物容易渗透通过皮肤；水溶性基质中，药物与基质亲和力越大，越难释放，因而吸收也越差；药物分子型增多，越有利于药物的经皮吸收。

21、D。【解析】物理化学靶向制剂包括磁性靶向制剂、栓塞靶向制剂、热敏感靶向制剂、PH 敏感靶向制剂。

22、A。【解析】药物经胃肠道吸收存在首过效应。药物的非胃肠道吸收包括：注射部位吸收、肺部吸收、鼻粘膜吸收、口腔黏膜吸收、阴道粘膜吸收。

23、E。【解析】表观分布容积计算公式 $Vd=X_{ss}/C_{ss}$ ， X_{ss} 为稳态体内药量、稳态药物浓度 C_{ss} ，且患者体重为 60kg，所以题中计算所得：

$$X_{ss}=C_{ss} \times Vd \times 60kg = 3mg/L \times 2.0L/kg \times 60kg = 360 \text{ mg}$$

24、B。【解析】蛋白质或多肽类药物临床使用剂量小，药理活性高，副作用少；但这类药物稳定性差，极易失活；吸收很少，不能口服给药；此类药物生物半衰期较短，在体内作用时间短。

二、配伍选择

25、D。

26、C。

27、B。

【解析】混合物的 CRH (%) 值约等于各药物 CRH 的乘积，即 $CRH_{AB}=CRH_A \times CRH_B$ ，而与各组分比例无关；混合抛射剂的蒸汽压可用拉乌尔定律计算， $P=P_A+P_B$ ；非表面活性剂的 HLB 值具有加和性， $HLB = (HLB_A \times W_A + HLB_B \times W_B) / W_A + W_B$

28、C。

29、E。

【解析】混悬颗粒是指难溶性固体药物与适宜辅料制成一定粒度的干燥颗粒剂；泡腾颗粒是指含有碳酸氢钠和有机酸，遇水可放出大量气体而呈泡腾状的颗粒剂；肠溶颗粒是指肠溶材料包裹颗粒或其他适宜方法制成的颗粒剂；控释颗粒是指在规定的释放介质中缓慢地恒速释

放药物的颗粒剂。

30、D。

31、B。

【解析】舌下片指置于舌下能迅速溶化，药物经舌下黏膜吸收发挥全身作用的片剂。由于舌下片的药物未经过胃肠道，所以可以避免药物受胃肠液酸碱性的影响以及酶的破坏，同时也避免了肝脏对药物的破坏作用；分散片是指在水中能迅速崩解并均匀分散的片剂（在 $21^{\circ}\text{C} \pm 1^{\circ}\text{C}$ 的水中 3 分钟即可崩解分散并通过 $180\ \mu\text{m}$ 孔径的筛网）。

32、C。

33、E。

【解析】微晶纤维素既可以作片剂的填充剂（稀释剂），也可作为粉末直接压片的“干黏合剂”使用；羟丙基纤维素既可以作湿法制粒粘合剂，也可以作为粉末直接压片黏合剂。

34、E。

35、A。

36、C。

【解析】胃溶型包衣材料包括：羟丙基甲基纤维素 HPMC、羟丙基纤维素 HPC、丙烯酸树脂 VI 号、聚乙烯吡咯烷酮 PVP；肠溶型包衣材料包括：邻苯二甲酸醋酸纤维素 CAP、邻苯二甲酸羟丙基甲基纤维素 HPMCP、邻苯二甲酸聚乙烯醇酯 PVAP、苯乙烯马来酸共聚物、丙烯酸树脂 I、II、III；水不溶型包衣材料包括：乙基纤维素、醋酸纤维素。

37、B。

38、D。

【解析】油脂性基质栓 30min 内全部融化、软化，或触压无硬心；水溶性基质栓 60min 内全部溶解。

39、B。

40、C。

41、D。

【解析】栓剂中往往加入一些附加剂。抗氧化剂如叔丁基羟基茴香醚、叔丁基对甲酚；增稠剂如氢化蓖麻油、单硬脂酸甘油酯、硬脂酸铝；吸收促进剂如非离子表面活性剂、脂肪酸、脂肪醇和脂肪酸酯类。

42、A。

43、B。

44、D。

45、E。

【解析】常用的软膏剂基质分为 1、油脂性基质包括烃类、油脂类、类脂类、硅酮；2、乳状型基质如肥皂类、高级脂肪醇、脂肪醇硫酸酯类、多元醇酯类、聚氧乙烯醚类；3、水溶性基质如甘油明胶、纤维素衍生物类、聚乙二醇类。由于 O/W 型乳状基质易蒸发失去水分，故常常加入保湿剂如甘油、丙二醇、山梨醇；O/W 型乳状基质在贮存过程可能霉变，需加入防腐剂如羟苯酯类、氯甲酚、三氯叔丁醇醇。

46、A。

47、C。

48、B。

【解析】注射剂的附加剂包括：1. 增溶剂、润湿剂或乳化剂：吐温、聚乙烯吡咯烷酮、卵磷脂、普郎尼克等 2. 缓冲剂：醋酸-醋酸钠、枸橼酸-枸橼酸钠、乳酸、酒石酸-酒石酸钠 3. 助悬剂：甲基纤维素、羧甲基纤维素钠、明胶 4. 螯合剂：EDTA-2Na 5. 抗氧化剂：亚硫酸钠、亚硫酸氢钠、焦亚硫酸钠、硫脲等 6. 抑菌剂：三氯叔丁醇、苯甲醇、羟苯丁酯、羟苯丙酯、苯酚 7. 局麻剂：盐酸普鲁卡因、利多卡因 8. 渗透压调剂：氯化钠、葡萄糖。硫柳汞属于汞类防腐剂。

49、C。

50、A。

51、B

52、D

【解析】维生素 C 注射剂中，注射用水为溶剂；加入碳酸氢钠调节 PH，增强注射液稳定性；维生素 C 易自动氧化，需加入亚硫酸氢钠作为抗氧化剂，依地酸二钠为金属离子络合剂。

53、C。

54、E。

【解析】低温间歇灭菌法首先温度 60~80℃ 水或流通蒸汽灭菌 1 小时，再室温或 37℃ 下放置 24 小时，最后反复操作 3~5 次；干热空气灭菌法适用于耐高温的玻璃制品、金属制品以及不允许湿气穿透的油脂类和耐高温的粉末化学药品等；辐射灭菌法如 γ 射线杀菌，特点：不升高灭菌产品的温度，穿透性强，适用于耐热但对光稳定的药品如：维生素、抗生素、激素、包装材料、器具、机械等；紫外线灭菌法，适用于空气、表面—即环境灭菌或器具灭菌；微波灭菌法，利用微波产生的热杀灭微生物适用于水性注射液的灭菌。

55、B。

56、C。

【解析】静脉注射脂肪乳剂：是一种浓缩的高能量肠外营养液，是以植物油脂为主要成分，加乳化剂与注射用水而制成的水包油型乳剂。乳化剂：常用的有卵磷脂、豆磷脂及普朗尼克 F-68 等，甘油用作渗透压调节剂。

57、C。

58、D。

59、E。

60、B。

【解析】表面活性剂分为阳离子、阴离子、两性离子表面活性剂及非离子表面活性剂。阳离子型表面活性剂包括：苯扎氯胺（洁尔灭）、苯扎溴胺（新洁尔灭）；阴离子型表面活性剂包括：（1）高级脂肪酸盐（肥皂类）（2）硫酸化物分类：①硫酸化油 ②高级脂肪醇硫酸酯 ③磺酸化物；非离子表面活性剂包括：① 脂肪山梨坦 ②聚山梨酯—吐温 ③脂肪酸甘

油脂 ④聚氧乙烯脂肪酸酯-卖泽 ⑤聚氧乙烯脂肪醇醚-苜泽 ⑥聚氧乙烯-聚氧丙烯共聚物即泊洛沙姆。

61、A。

62、B。

63、D。

【解析】影响因素试验包括 1. 高温试验:60℃温度下放置 10 天,于第五、十天取样;2. 高湿度试验:供试品开口置恒湿密闭容器中,在 25℃分别于相对湿度(90±5)%条件下放置 10 天,于第五、十天取样检测;3. 强光照射试验:供试品开口放置在光照仪器内,于照度为(4500±500) lx 的条件下放置 10 天,于第五、十天取样检测。

64、A。

65、C。

66、D。

67、E。

【解析】单凝聚法:在 高分子囊材溶液中加入凝聚剂,使囊材溶解度降低而凝聚并包裹药物成囊的方法;复凝聚法:系使用两种带相反电荷的高分子材料作为复合囊材,在一定条件下,两种囊材在溶液中将发生正负电的结合而凝聚成囊;液中干燥法:从乳浊液中除去分散相挥发性溶剂以制备微囊的方法;利用离心力使囊芯物高速穿过囊材的液态膜进入固化浴固化成囊的方法为多孔离心法。

68、A。

69、B。

【解析】酶诱导作用指某些药物促进自身或其他合用药物代谢的现象;通过细胞膜的主动变形将药物摄入细胞内或从细胞内释放到细胞外的过程是膜动转运,可分为胞饮和吞噬作用;血脑屏障是脑毛细血管阻止某些物质(多半是有害的)进入脑循环血的结构;肠肝循环是指经胆汁或部分经胆汁排入肠道的药物,在肠道中又重新被吸收,经门静脉又返回肝脏的现象;

蓄积效应是毒物逐次进入生物体，而在靶器官内积和/或毒物对生物体所致效应的累加现象

70、A。

71、B。

72、D。

【解析】双室模型静脉注射给药血药浓度-时间关系式的方程式是 $C = Ae^{-\alpha t} + Be^{-\beta t}$ ；

$$X_0^* = X_0 \frac{1}{(1 - e^{-kr})(1 - e^{-k_r r})}$$

多剂量(重复)血管外给药首剂量与维持剂量关系的公式是

$$F_{\text{Rel}} = \frac{AUC_{\text{试验}}/X_{0(\text{试验})}}{AUC_{\text{参比}}/X_{0(\text{参比})}} \times 100\%$$

示以尿中排泄药物计算相对生物利用度的公式是

三、多项选择

73、CD。【解析】溶液型、胶体溶液型是药物以分子或高分子形式分散于分散介质中形成的均匀分散体系；乳油型、混悬型是非均匀分散体系；固体分散型是固体药物以聚集状态存在的分散体系，如片剂、散剂、颗粒剂。

74、ABCDE。【解析】胶囊剂根据溶解和释放特性分为：硬胶囊、软胶囊、缓释胶囊、控释胶囊、肠溶胶囊。

75、BC。【解析】甘油在膜剂和涂膜剂中作增塑剂、脱模剂

76、AC。【解析】静脉注射多为水溶液，非水溶液、混悬注射液一般不做静脉注射。

77、AB。【解析】椎管（脊椎腔）注射——注射不超过 10ml；肌内注射——一次剂量一般为 1~5ml；皮下注射——注射剂量一般为 1~2ml；皮内注射——一次剂量在 0.2ml 以下；静脉推注——注射剂量为 5~50ml。

78、ABCDE。【解析】注射剂质量要求：1. 无菌：不得含有任何活的微生物；2. 无热原：注射剂的重要指标，用量大的静脉注射及脊椎腔用注射剂应进行热原检查，应符合规定；3. 可见异物（澄明度）：在规定的条件下检查，不得有肉眼可见的混浊或异物；4. 安全性；5. 渗透压：输液与血浆体液等渗或稍高，脊椎腔注射液必须与血浆等渗；6. pH：最好为约 7.4，可允许值为 4~9；7. 稳定性 8. 降压物质；9. 澄清度：检查药品溶液的浑浊程度；10. 不溶性微粒。

79、ABCD。【解析】一般注射剂不需要加入抑菌剂，凡采用低温灭菌、滤过除菌或无菌操作制备的注射剂、多剂量的注射剂，应加入适宜抑菌剂，以确保用药安全。供静脉或椎管用注射剂，一般均不得加入抑菌剂。

80、AB。【解析】极性溶剂包括水、甘油、二甲基亚砷（DMSO）；半极性溶剂包括乙醇、丙二醇、聚乙二醇类；非极性溶剂包括脂肪油、液体石蜡、醋酸乙酯。

81、ABC。【解析】固体分散是固体药物以分子、胶态、微晶或无定形态分散于另一种水溶性、难溶性或肠溶性固体载体中所制成的高度分散体系。可进一步制成各种剂型如颗粒、片剂、胶囊剂、注射剂等。固体分散物的特点：1. 可延缓药物的水解和氧化；2. 掩盖药物的不良气味和刺激性；3. 使液态药物固体化；4. 缺点：药物处于高度分散状态，久贮后不稳定。

82、ABCD。【解析】控缓释制剂对半衰期短或需频繁给药的药物，可以减少服药次数，提高病人顺应性，使用方便；使血液浓度平稳，避免峰谷现象，有利于降低药物的毒副作用；减少用药的总剂量，因此可用最小剂量达到最大药效。控缓释制剂中起控缓释作用的辅料包括阻滞剂、骨架材料、增黏剂。1) 阻滞剂包括 ①疏水物质：脂肪、蜂蜡、巴西棕榈蜡、氢化植物油、硬脂醇。②肠衣材料：CAP、Eudragit L、S 型、HPMCP。2) 骨架材料包括①亲水性骨架材料：MC、CMC-Na、HPMC、PVP、卡波普、海藻酸盐、壳聚糖等。②不溶性骨架材料：EC、聚甲基丙烯酸酯、聚氯乙烯、聚乙烯、EVA、硅橡胶等。③溶蚀性骨架材料。3) 增黏剂包括 CMC-Na、PVA、PVP。

83、BD。【解析】影响药物的溶出速度（1）粒径越小，溶出速率越大，越有利于吸收，因此可采用微粉化。（2）多晶型：多晶型中有稳定型、亚稳定型和不稳定型。稳定型溶解度最小。不稳定型则相反。亚稳定型介于二者之间，为有效晶型。（3）无定形：无定形药物溶解不需要克服晶格能，所以溶解速度比结晶形快。（4）溶剂化物：（药物与溶剂缔合形成的结晶）有机溶剂化物>无水物>水合物。（5）成盐：其溶出速率增大。

84、ADE。【解析】物理配伍变化包括 1. 溶解度改变：某些溶剂性质不同的制剂相互配合使用时，常因药物在混合后的溶液体系中的溶解度较小而析出沉淀。2. 潮解、液化和结块：①混合物的临界相对湿度下降而吸湿 ②形成低共熔混合物。3. 分散状态或粒径变化乳剂、混悬剂中分散相的粒径变粗，或聚结或凝聚而分层或析出。

药化部分

一、单项选择

85、C。【解析】阿米卡星是卡那霉素引入 α -羟基丁酰胺基，含手性碳，构型为 L-（-）型，有立体位阻，突出优点是对各种转移酶都稳定，不易形成耐药。

86、C。【解析】吡嗪酰胺可能为药物的活性形式或为部分前体药物。敏感的生物体可产生吡嗪酰胺水解酶，将吡嗪酰胺水解为吡嗪羧酸，羧酸可降低其周边环境的 pH，使结核杆菌不能生长。吡嗪酰胺结构的突出特点是含有吡嗪环。

87、E。【解析】磷酸伯氨喹为 8-氨基喹啉类药物，结构：6-甲氧基-8-氨基喹啉，端头伯氨基，在体内转化为具有较强氧化性能的喹啉醌衍生物，作用是防止疟疾复发和传播。

88、E。【解析】三唑仑的分子中三唑环与苯并二氮卓环并和，使其脂溶性加大，易进入中枢神经系统，故本品为短效镇静催眠药。但其致眠作用强、起效快、已按一类麻醉药管理。

89、C。【解析】服用盐酸氯丙嗪后，在日光强烈照射下，氯丙嗪遇光分解，生成自由基，并进一步发生各种氧化反应，自由基与体内一些蛋白质作用时产生光过敏反应。这是吩噻嗪类特有的毒副反应。

90、B。【解析】新斯的明由三部分组成，季铵阳离子部分（极易溶于水）、芳环部分及氨基甲酸酯部分（在碱性水液中可水解）。新斯的明为可逆性胆碱酯酶抑制剂，治疗重症肌无力、术后腹胀及尿潴留。

91、B。【解析】氢溴酸山莨菪碱是山莨菪醇和托品酸结合的酯，天然品为左旋体，称 654-1。合成品为外消旋体，称 654-2，副作用较天然品略大。

92、A。【解析】基于化学结构可将 ACE 抑制剂分成三类：含巯基的 ACE 抑制剂、含二羧基的 ACE 抑制剂和含磷酸基的 ACE 抑制剂。含巯基的 ACE 抑制剂代表药物为卡托普利，有巯基，易被氧化，发生二聚反应形成二硫键。

93、D。【解析】硝酸甘油结构是 1, 2, 3-丙三醇三硝酸酯。为黄色油状液体，吸收空气的水成塑胶状；遇热或撞击易爆炸，为了便于运输，常以乙醇溶液的形式保存；碱性条件迅速水解，生成甘油和恶臭丙烯醛；代谢产物是 1, 2（和 1, 3）甘油二硝酸酯，甘油单硝酸酯和甘油，这些代谢物均可经尿和胆汁排出体外；本品经口腔黏膜吸收迅速，起效快，作用时间也短，心绞痛发作时将其片剂在舌下含化。

94、B。【解析】华法林钠是钠盐，极易溶解于水，因有内酯结构，易水解。含有一个手性碳，有两个光学异构体。多种药物可增强或减弱华法林的抗凝疗效，同时影响其应用的安全性。临床使用时应密切注意用药安全。

95、A。【解析】曲司氯铵为阿托品类的抗胆碱药物，具有拮抗 M 受体的作用，从而拮抗乙酰胆碱对膀胱平滑肌的收缩效应，有效降低膀胱平滑肌的紧张度，解除痉挛状态。临床上用于治疗膀胱过度活动症、尿频、夜尿症。本品起效快、长期使用疗效优良。因分子结构中含

有季铵基团，水溶性大，生物利用度低，不能通过血脑屏障，没有中枢神经系统毒性，但有抗胆碱药物的外周常见不良反应，如口干、便秘等

96、C。【解析】色甘酸钠的结构为苯并吡喃的双色酮结构，两个色酮对于活性来说是必需的，且必须保持共平面；作用机制为抑制组胺、5-羟色胺、慢反应物质等过敏反应介质的释放；在肺部的吸收约为 8%，口服仅能吸收 1%，是采用气雾剂的原因。

97、B。【解析】埃索美拉唑是奥美拉唑的 S-（-）异构体。比 R 异构体在体内的代谢更慢，并且经体内循环更易重复生成，导致血药浓度更高，维持时间更长。疗效和作用时间都优于奥美拉唑。

98、A。【解析】双氯芬酸钠的结构为芳基乙酸，其抗炎、解热和镇痛作用都很强。除了能够抑制 COX，减少前列腺素的生物合成和血小板的生成，还能抑制脂氧合酶，减少白三烯的生成，这种双重的抑制作用能够避免由于单纯抑制 COX 而导致脂氧合酶活性突增而引起的不良反应。此外，双氯芬酸钠还能抑制花生四烯酸的释放，并刺激其再摄取。

99、D。【解析】瑞格列奈结构为氨甲酰甲基苯甲酸的衍生物；含有一手性碳原子，S-（+）-异构体的活性是 R-（-）-异构体的 100 倍，临床上使用其 S-（+）-异构体；构象分析其优势构象呈 U 型，其中疏水性支链处于 U 型的顶部，U 型的底部是酰胺键，无活性的类似物不呈现此构象；在肝内快速代谢为非活性物，大部分随胆汁排泄；作为餐时血糖调节剂，在餐前 15min 服用，用于 II 型糖尿病、老年糖尿病患者

100、E。【解析】维生素 K1 的基本结构是 2-甲基-1,4-萘醌，C-3 上有侧链；为黄色至橙色透明的黏稠液体，遇光易分解；有两个手性中心，C7 和 C11，且有顺反异构体；用于防治因维生素 K 缺乏所致的出血症，如新生儿出血、长期口服抗生素所致的出血症。

二、配伍选择题

101、B。

102、C。

103、A。

104、E。

【解析】克拉维酸是天然来源的第一个 β -内酰胺酶抑制剂，单独使用无效，与 β -内酰胺类抗生素联合使用，临床上常与阿莫西林组成复方制剂；舒巴坦钠因口服吸收差，为了改变其口服吸收能力，将舒巴坦与氨苄西林以 1:1 的形式以次甲基相连，形成双酯结构的前体药物，称为舒他西林。体内水解，给出较高血清浓度的氨苄西林和舒巴坦；青霉素约有 10% 系由肾小球分泌，90% 由肾小管分泌而排出，抗痛风药丙磺舒也由肾小管分泌，二者排泄部位相同，故合用时可产生竞争，使青霉素在肾小管中的分泌减少，从而增加了青霉素在血中的浓度；甲氧苄啶本身具有广谱抗菌作用，与磺胺类药物体内的半衰期接近，联用有协同抑菌和杀菌作用，两者分别作用于二氢叶酸合成酶和还原酶，双重阻断细菌叶酸合成的第一步和第二步，从而干扰了细菌蛋白质的合成。

105、B。

106、A。

107、D。

【解析】枸橼酸他莫昔芬为三苯乙烯类抗雌激素药物，分子中具有二苯乙烯的基本结构。药用他莫昔芬为顺式几何异构体。脱甲基化得到主要的代谢物 N-脱甲基他莫昔芬，再进一步代谢生成代谢物 Y，两者均有抗雌激素活性，次要的代谢物 4-羟基他莫昔芬，对人体乳腺癌细胞的生长抑制作用是他莫昔芬的 100 倍。作用为抗雌激素，治疗雌激素依赖性乳腺癌，治疗绝经后晚期乳腺癌的一线药物；来曲唑是新一代芳香化酶抑制剂，为人工合成的苯三唑类衍生物，来曲唑通过抑制芳香化酶，使雌激素水平下降，从而消除雌激素对肿瘤生长的刺激作用。用于乳腺癌化疗和放疗；氟他胺属于非甾体类抗雄激素药物。除抗雄激素作用外，本品无任何激素的作用，能在靶组织内与雄激素受体结合，阻断二氢睾酮(雄激素的活性形式)与雄激素受体结合，抑制靶组织摄取睾酮，从而起到抗雄激素作用。

108、C。

109、E。

110、D。

【解析】盐酸美沙酮为 μ 阿片受体激动剂，含有氨基酮结构，药效与吗啡类似，具有镇痛作用，但与吗啡相比，作用时间较长、不易产生耐受性、药物依赖性低，用于治疗海洛因依赖脱毒和替代维持治疗；纳洛酮化学名称为:17-烯丙基-4,5a-环氧基-3,14-二羟基吗啡喃-6-酮盐酸盐二水合物，含有烯丙基，为纯粹的阿片受体拮抗药,本身无内在活性.但能竞争性拮抗各类阿片受体,对 μ 受体有很强的亲和力；哌替啶为哌啶甲酸乙酯，与一般酯键不同，空间位阻大，水溶液短时间煮沸不至于被水解。遇光变质，避光保存，为阿片受体激动剂，是目前最常用的人工合成强效镇痛药。

111、A。

112、C。

113、E。

【解析】肾上腺素是含有邻苯二酚基本结构的儿茶酚胺类药物，邻苯二酚基不稳定，易氧化，使得肾上腺素易氧化变质；沙丁胺醇结构为 α -[(叔丁基胺)甲基]-4-羟基-m-二甲苯- α, α' -二醇，结构中含有叔丁氨基结构，为选择性 β_2 受体激动剂，能有效地抑制组胺等致过敏性物质的释放，防止支气管痉挛；麻黄碱化学名为(1R,2S)-2-甲氨基-苯丙烷-1-醇，存在多种立体异构体，是从中药麻黄中提出，其作用与肾上腺素相似，但该药易通过血脑屏障，中枢兴奋作用较肾上腺素为强。

114、B。

115、D。

116、E。

117、C。

【解析】氨氯地平为钙离子拮抗药，可用于治疗各种类型高血压和心绞痛，化学名为 3-乙基-5-甲基-2-(2-氨乙氧甲基)-4-(2-氯苯基)-1,4-二氢-6-甲基-3,5-吡啶二羧酸酯苯磺酸盐，其中 1,4-二氢吡啶环的 2 位甲基被 2-氨乙氧甲基取代，且 3,5 位羧酸酯结构不同，因而 4 位碳原子具有手性；芳烷基胺类代表药维拉帕米为钙通道阻滞剂，分子中含有 1 个手性碳原子，右旋体比左旋体作用强的多，维拉帕米为治疗室上性心动过速的首选药物；地尔硫卓是

苯硫氮卓类钙通道阻滞剂代表药物，分子结构中含有 2 个手性碳原子，具有 4 个光学异构体，地尔硫卓由于能改善左室舒张功能，可用于治疗冠心病；三苯哌嗪类钙通道阻滞剂药物氟桂利嗪为桂利嗪的二氟化衍生物，无手性碳原子，为选择性 Ca^{2+} 拮抗剂，可阻止过量 Ca^{2+} 进入血管平滑肌细胞，引起血管扩张，对脑血管的选择性较好，用于脑供血不足治疗。

118、B。

119、A。

120、C。

121、D。

【解析】他汀类药物抑制 HMG-Co A 还原酶，可有效地降低胆固醇的水平，对原发性高胆固醇血症的疗效确切。洛伐他汀结构中含 多氢萘和六元内酯，有 8 个手性中心，药用右旋（+）体；瑞舒伐他汀是选择性 HMG-CoA 还原酶抑制剂，为全合成的他汀类药物，含 3,5-二羟基羧酸活性结构，其刚性部分改成了多取代的嘧啶环；吉非罗齐为非卤代的苯氧戊酸衍生物，显著降低甘油三酯和总胆固醇；由于分子中羧基的存在，非诺贝特酸在肠道的碱性环境中成离子态，限制其吸收，因此非诺贝特酸是以非诺贝特酸异丙酯（非诺贝特）的形式应用。非诺贝特在体内经酯酶的作用，迅速代谢成非诺贝特酸而起降血脂作用，具有明显的降低血清胆固醇，甘油三酯和升高高密度脂蛋白的作用。

122、D。

123、A。

【解析】氢氯噻嗪结构含两个磺酰胺，连接在磺酰氨基氮上的氢原子具弱酸性。在碱性溶液中易水解失活，可生成 4-氯-6-氨基间二苯磺酰胺（3,4 位处开环），不宜与碱性药物配伍。大剂量或长期使用时，应与氯化钾同服，以避免血钾过低。体内不经代谢，以原型排泄；螺内酯含甾体结构，体内代谢过程为：脱乙酰巯基，生成坎利酮（活性代谢物）和坎利酮酸（无活性，但可内酯化为坎利酮），螺内酯保钾利尿，高血钾者忌用，可引起阳痿和男性雌性化。

124、B。

125、E。

【解析】羧甲司坦为乙酰半胱氨酸的类似物，是酯类化合物，用作黏痰调节剂，使痰液的黏滞性降低，易于咳出；磷酸可待因结构是吗啡的 3 位甲醚衍生物，对延髓的咳嗽中枢有直接抑制作用，作用强而迅速，体内代谢约有 8%生成吗啡，可产生成瘾性，需对其的使用加强管理（麻醉药品），副作用比吗啡小，但过量使用可产生兴奋和惊厥，也具有成瘾性。

126、A。

127、B。

【解析】甲氧氯普胺为苯甲酰胺类似物，为中枢性和外周性多巴胺 D₂ 受体拮抗剂，具促动力和止吐作用。是第一个用于临床的促动力药；昂丹司琼结构含咪唑环。咪唑环上的 3 位手性碳，R 异构体的活性较大，使用外消旋体，作用特点：为强效、高选择性的 5-HT₃ 受体拮抗剂，对其它受体无拮抗作用，无锥体外系的副作用，毒副作用极小。

128、D。

129、C。

【解析】秋水仙碱为植物来源的生物碱，具有酰胺结构，双庚环及四个甲氧基，用于急性痛风、消炎，对一般性疼痛、炎症及慢性痛风无效。能抑制细胞有丝分裂，有抗肿瘤作用。毒性大，不良反应与剂量有明显的相关性，口服比注射安全性高。不良反应主要有胃肠道症状，肌肉和周围神经的病变，骨髓抑制作用，致畸等；别嘌醇抑制黄嘌呤氧化酶，减少尿酸合成。临床用于原发性和继发性高尿酸血症、反复发作或慢性痛风。

130、D。

131、A。

132、E。

【解析】格列吡嗪为磺酰脲结构，苯环上磺酰基对位有吡嗪环，脲基末端带有环己烷。除能促进胰岛 β 细胞分泌胰岛素，还能刺激胰岛 α 细胞使胰高血糖素分泌受抑制，降低餐后血糖作用明显；阿卡波糖是 α-葡萄糖苷酶抑制剂代表药物，属于单糖或多糖类类似物，能抑制 α-葡萄糖苷酶的活性，减慢糖类水解产生葡萄糖的速度及吸收，降低餐后血糖，但并不增加胰岛素分泌；吡格列酮结构中含噻唑烷二酮和吡啶，通过提高胰岛素敏感性而控制血糖水平。

还可以改善血管内膜功能和降低心脑血管危险因素，有助于降低心脑血管疾病发生的危险。

三、多项选择题

133、CDE。【解析】抗结核药物根据化学结构分为合成抗结核药和抗结核抗生素。合成抗结核药主要包括异烟肼、对氨基水杨酸钠、乙胺丁醇，不含大环内酰胺结构。抗结核抗生素主要有氨基糖苷类的链霉素、卡那霉素、利福霉素、环丝氨酸、紫霉素、卷曲霉素等。利福霉素是用链丝菌发酵产生的抗生素，其化学结构为大环内酰胺，天然的利福霉素抗菌作用弱，口服吸收差。目前临床上使用的利福霉素类药物是其半合成衍生物，如利福平、利福定、利福喷丁、利福布汀。

134、ABCD。【解析】抗病毒药物分为分四类：核苷、非核苷类、蛋白酶抑制剂及其他类。其中核苷由碱基和糖两部分组成。由五种天然碱基（尿嘧啶、胞嘧啶、胸腺嘧啶、鸟嘌呤、腺嘌呤）中的一种与核糖或脱氧核糖所形成的核苷称天然核苷。核苷类抗病毒药物包括两类：一是非开环核苷类抗病毒药物，例如齐多夫定、司多夫定、拉米夫定；二是开环核苷类抗病毒药物，例如阿昔洛韦、更昔洛韦、喷昔洛韦、泛昔洛韦、阿德福韦酯。

135、ABD。【解析】毛茛科植物黄连中的抗菌成分黄连素（又名小檗碱），对痢疾杆菌、大肠杆菌、金葡菌等引起的肠道感染疗效确切；土壤中分离得到的林可霉素链霉菌产生林可霉素，用于骨髓炎治疗；磷霉素从放线菌的培养滤液中分离得到，主要用于敏感的革兰阴性菌引起的尿路、皮肤及软组织、肠道等部位感染；甲硝唑属于硝基咪唑类合成抗菌药，主要用于厌氧菌感染的治疗；利奈唑胺属于人工合成的唑烷酮类抗生素，用于治疗革兰阳性(G+)球菌引起的感染如院内获得性肺炎、社区获得性肺炎、复杂性皮肤或皮肤软组织感染。

136、ABDE。【解析】5-羟色胺(5-HT)重摄取抑制剂代表药物氟西汀，代谢为两个异构体，其中N去甲氟西汀有活性，但S-(-)-去甲氟西汀活性比R-(+)-代谢产物强；选择性抑制5-HT药物舍曲林，其代谢产物为N去甲舍曲林，有抗抑郁活性但作用减弱；5-HT重摄取抑制剂药物文拉法辛，其初级代谢产物O-去甲文拉法辛，活性和功能和文拉法辛等价，且文拉法辛和它的活性代谢物O-去甲文拉法辛都有双重的作用机制（优先对5-HT重摄取

的亲和对 NE 及多巴胺重摄取的微弱抑制)；抗抑郁药阿米替林为选择性去甲肾上腺素重摄取抑制剂，代谢物为去甲替林，其活性与阿米替林相同，毒性略低；盐酸帕罗西汀有首过效应，但代谢产物无活性。

137、BD。【解析】盐酸美西律、去乙酰毛花苷、地高辛属于抗心力衰竭药物。美西律为钠通道阻滞剂，化学名为 1-(2,6-二甲基苯氧基)-2-丙胺盐酸盐，结构中不含糖基。去乙酰毛花苷、地高辛均为强心苷类，强心苷是一类有机化合物，其分子由一个醇基或醇样基团结合于数量不等的糖分子而构成。若配基中含甾核，其 17 位碳原子连以一个不饱和内酯环，其 3 位碳原子与糖分子相连。强心苷主要用以治疗慢性心功能不全。

138、ABDE。【解析】抗溃疡药物按作用机制分三类：1. 组胺 H₂ 受体拮抗剂（抑制胃酸分泌）2. H⁺/K⁺-ATP 酶（质子泵）抑制剂（抑制胃酸分泌）3. 胃黏膜保护剂（前列腺素类）。其中组胺 H₂ 受体拮抗剂结构由三部分构成：咪唑环、含硫醚的四原子链和末端取代氨基胍，代表药物西咪替丁、雷尼替丁、法莫替丁、尼扎替丁。

139、DE。【解析】H₁ 受体拮抗剂代表药物包括：马来酸氯苯那敏、阿斯咪唑、盐酸赛庚啶、西替利嗪、氯雷他定、地氯雷他定、非索非那定。其中地氯雷他定为氯雷他定的主要代谢产物，非索非那定是特非那定的活性代谢产物。

140、ABCDE。【解析】骨质疏松症是全身性代谢性骨病，其特征为骨量降低，骨组织细微结构破坏，骨脆性增加，易发生骨折。依照作用机制的不同，治疗骨质疏松症的药物分为两类。一是抑制骨吸收，包括盐酸雷洛昔芬、阿法骨化醇、骨化三醇；二是促进骨形成，包括阿伦磷酸钠、利赛膦酸钠、帕米膦酸二钠、依替膦酸二钠。