

西药一考前锦囊：50个核心必考点
【考点1】药物剂型的重要性

药物剂型的重要性	举例
改变性质	硫酸镁口服-泻下，静脉滴注-镇静解痉
	依沙吖啶注射-引产，局部涂敷-杀菌
改变速度	注射、吸入-急救，丸剂、缓控释制剂-长效
减毒	氨茶碱治疗哮喘，栓剂可消除心跳加快作用
	缓控释血药浓度平稳
靶向	静脉注射用脂质体→肝脾
提高稳定性	固体制剂 > 液体制剂
影响疗效	制备工艺、药物晶型、粒子大小

【考点2】药物制剂稳定性变化

类型	代表药
水解	酯类：普鲁卡因、丁卡因、可卡因、阿托品、后马托品、溴丙胺太林等 内酯：华法林钠、硝酸毛果芸香碱
	酰胺类：青霉素类、头孢类、巴比妥类、氯霉素、利多卡因、阿糖胞苷、碘苷、对乙酰氨基酚、地西洋、V _B 族
氧化	酚类：肾上腺素、吗啡、左旋多巴、水杨酸钠
	烯醇类：V _C 双键类：V _A 、V _D 噻嗪类：氯丙嗪
异构化	光学异构：左肾上腺素（外消旋化）、毛果芸香碱（差向异构）
	顺反异构：V _A （全反式→顺式，失效）
聚合	氨苄西林（聚合易过敏）、塞替派（聚合失效，用PEG400避免）
脱羧	对氨基水杨酸钠（-COOH）

【考点3】药物稳定性试验方法

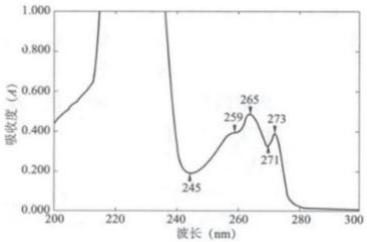
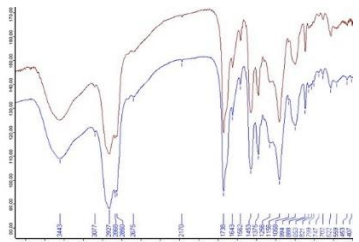
药物稳定性试验方法	试验条件
影响因素试验 (强化试验)	高温 (60°C±2°C 30天)、高湿 (90%±5% 10天)、强光 (4500Lx 10天) -剧烈条件-为工艺筛选、包材选择、贮存条件确定、加速和长期试验提供依据
加速试验 (超常试验条件)	预测常温下的稳定性 (40°C±2°C 75%±5% 6个月)
长期试验 (留样观察法 实际贮存条件)	确定有效期 t _{0.9} (北方 25°C±2°C 60%±10% 12个月, 南方 30°C±2°C 65%±5% 12个月)

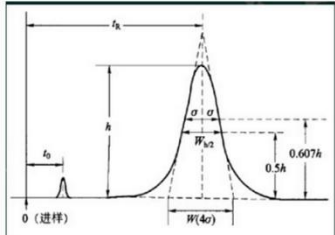
有效期	$t_{0.9}=0.1054/k$
半衰期	$t_{1/2}=0.693/k$

【考点4】《中国药典》基本要求

项目	要求
溶解度	①易溶：1g 药物能在 1~10ml 溶剂中溶解； ②溶解：1g 能在 10~30ml 中溶解； ③微溶：1g 能在 100~1000ml 中溶解； ④几乎不溶：1g 在 100000ml 中不能完全溶解 【易三姐微百千不过万-易溶 1，溶解 10-30，微溶 100-1000，不溶 10000】
崩解时限	口崩片-1min；可溶片-3min；舌下片-5min；普通片-15min；薄膜衣片-30min； 糖衣片-1h；肠溶片-碱中 1h 崩解，酸中 2h 不崩解；含片-10min 不崩解；硬胶囊-30min；软胶囊-1h；滴丸-30min
贮藏	避光：避免日光直射 遮光：不透光包装
	密闭：防止尘土/异物 密封：防止风化、吸潮、挥发、异物进入 熔封/严封：防止空气、水分、微生物（注射剂/冲洗剂）
	阴凉处：不超过 20°C 凉暗处：避光不超过 20°C
	冷处：2°C ~ 10°C 常温：10°C ~ 30°C

【考点5】鉴别试验/含量测定试验

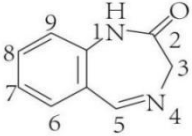
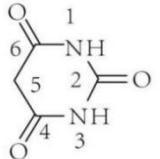
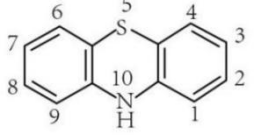
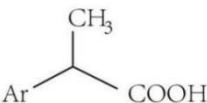
要点	内容
化学鉴别法	颜色、沉淀、气体、焰色反应
光谱鉴别法	紫外-可见分光光度法 UV 鉴别 (200nm~400nm λ_{max} 、 λ_{min} 、肩峰) /含量测定 (吸光度 A) 红外分光光度法 IR 鉴别 (400nm~760nm) -特征专属-指纹图谱  
	薄层色谱法 TLC (比移值 R_f) -鉴别 高效色谱法 HPLC-保留时间 t_R -鉴别 峰高 h 或峰面积 A-含量测定

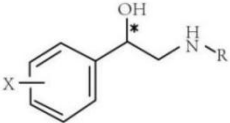
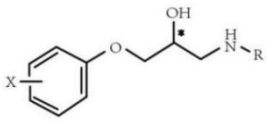
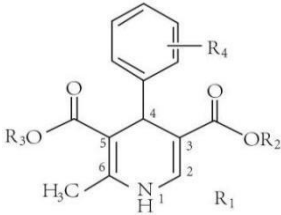
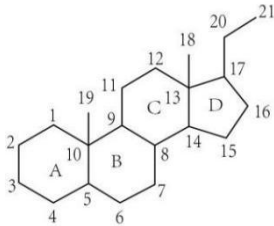
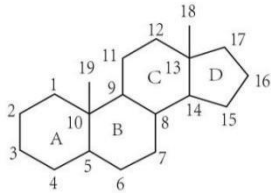
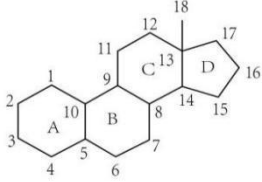
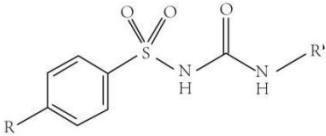
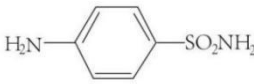
	 <p>气相色谱法 (GC)</p>
生物学方法	利用微生物或实验动物进行鉴别，主要用于抗生素和生化药品的鉴别

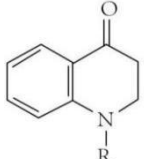
【考点6】体内药物检验样品及测定方法

血浆	全血 + 抗凝剂 → 离心 → 上清液；更可靠更常用，占全血 50%-60% 抗凝剂（肝素、EDTA、草酸盐、枸橼酸盐）
血清	全血 → 离心 → 上清液；占全血量 20~40%；无抗凝剂干扰
尿液	采集后立即测定；否则必须立即处置（低温保存/加防腐剂后冷藏保存） 防腐剂：二甲苯、氯仿、醋酸、盐酸等
测定法	免疫分析法：放射免疫法、非放射性免疫法（荧光免疫法、发光免疫法、酶免疫法、电化学免疫法） 色谱分析法：气相色谱法 GC、高效液相色谱法 HPLC、色谱-质谱联用（GC-MS、LC-MS）

【考点7】药物的结构和名称

药物的化学骨架名称	药物的化学骨架	药物类别
苯并二氮䓬		镇静催眠药
环丙二酰脲 (巴比妥类)		抗癫痫药
吩噻嗪		抗精神病药
芳基丙酸		非甾体抗炎药

<p>苯乙醇胺</p>		<p>肾上腺素受体调控药</p>
<p>芳氧丙醇胺</p>		<p>β受体阻断药</p>
<p>1,4-二氢吡啶</p>		<p>钙通道阻滞药</p>
<p>孕甾烷</p>		<p>肾上腺糖皮质激素类药物、孕激素类药物</p>
<p>雄甾烷</p>		<p>雄性激素类药物、蛋白同化激素类药物</p>
<p>雌甾烷</p>		<p>雌激素类药物</p>
<p>磺酰脲</p>		<p>降血糖药</p>
<p>对氨基苯磺酰胺</p>		<p>磺胺类抗菌药</p>

喹啉酮环		抗菌药
-------------	---	-----

【考点 8】药物与作用靶标结合的化学本质

共价键	不可逆结合, 牢固	烷化剂 (环磷酰胺、美法仑)、β-内酰胺类、拉唑类	
非共价键	可逆结合	离子键	键能最强, 正负电荷, 去甲肾上腺素-铵盐、氯贝胆碱-季铵【案例】
		氢键	最常见, H 原子, 碳酸/磺酰胺类利尿剂+碳酸酐酶、水杨酸甲酯【甲轻叹】
		离子偶极/偶极-偶极	乙酰胆碱、美沙酮【偶见美女】
		电荷转移复合物	氯喹【旅店】
		疏水作用	非极性链
		金属离子络合物	铂金属络合物、金属中毒解毒剂-二巯基丙醇
		范德华力	最弱, 普鲁卡因芳环部分【积阴德】

【考点 9】生物药剂学分类

类别	药物分子特点	药物
第 I 类	高溶解度、高渗透性的两亲性分子药物, 其体内吸收取决于溶出度	普萘洛尔、马来酸依那普利、盐酸地尔硫草等【普洱普洱】
第 II 类	低溶解度、高渗透性的亲脂性分子药物, 其体内吸收量取决于溶解度	双氯芬酸、卡马西平、吡罗昔康等【双马匹】
第 III 类	高溶解度、低渗透性的水溶性分子药物, 其体内吸收速率取决于药物渗透率	雷尼替丁、纳多洛尔、阿替洛尔等【你拿啊】
第 IV 类	低溶解度、低渗透性的疏水性分子药物, 其体内吸收比较困难	特非那定、酮洛芬、呋塞米等【特痛苦】

【考点 10】药物的解离常数 (pKa)

类别	代表药物	吸收情况
弱酸性药物	如水杨酸和巴比妥类	在酸性的胃液中几乎不解离, 呈分子型, 易在胃中吸收。
弱碱性药物	如奎宁、麻黄碱、地西泮、氨苯砞	在胃中几乎全部呈解离形式, 很难吸收;而在肠道中, 由于 pH 较高, 容易被吸收。
碱性极弱	茶碱和咖啡因	在酸性介质中解离也很少, 在胃中易被吸收。
强碱性药物	如胍乙啶	在整个胃肠道中多是离子化的, 以及完全离子化的磺酸类和季铵盐类药物, 消化道吸收很差。

【考点 11】药物结构中的取代基对生物活性影响

基团	内容
烃基	提高化合物的脂溶性、增加脂水分配系数; 降低分子的解离度;增加稳定性
卤素	有较强的电负性, 增加分子的脂溶性

羟基和巯基	引入羟基，增强与受体的结合力，增加药物分子的 水溶性 ，改变生物活性 引入巯基时，脂溶性比相应的醇高， 更易于吸收 。巯基还可用作 解毒药
醚和硫醚	硫醚易被氧化成 亚砷或砷
磺酸、羧酸和酯	①磺酸基的引入，使化合物的 水溶性和解离度增加 ②羧酸解离度及水溶性均比磺酸小，羧酸成盐可 增加水溶性 ③羧酸成酯后可以 增大脂溶性 ， 容易被吸收
含氮原子类	显示碱性； 季铵 水溶性大 ，不易通过生物膜和血-脑屏障，以致口服吸收不好，也 无中枢作用

【考点 12】手性结构对药物活性的影响

手性结构对药物活性的影响	代表药
等同 活性和强度	普罗帕酮、氟卡尼
活性相同， 强弱 不同	氧氟沙星（左>右）、氯苯那敏（右>左）、萘普生（S>R，体内 R 可以转化为 S）
一个 有 活性，一个 没有 活性	氯己烯酸（S）、L-甲基多巴、索他洛尔（苯乙醇胺类，R）、阿替洛尔（芳氧丙醇胺，S）
相反 的活性（激动、拮抗）	扎考必利、依托唑啉、哌西那朵、异丙肾上腺素
不同 类型的 活性	①右丙氧芬（镇痛）左丙氧芬（镇咳） ②麻黄碱（血管收缩、平喘）伪麻黄碱（支气管扩张） ③奎宁（抗疟）奎尼丁（抗心律失常）
一种有活性，另一个有 毒性	氯胺酮、乙胺丁醇、丙胺卡因、青霉胺、四咪唑、米安色林、左旋多巴

【考点 13】药物结构与第Ⅱ相生物转化的规律

结合反应	例子
与 葡萄糖醛酸 的结合反应	O、N、S 和 C 的葡萄糖醛苷化和 O、N、S 的葡萄糖醛酸酯化、酰胺化（ 吗啡 、 氯霉素 -“灰婴综合征”）
与 硫酸 的结合反应	沙丁胺醇
与 氨基酸 的结合反应	苯甲酸 、 水杨酸
与 谷胱甘肽 的结合反应	白消安
乙酰化 结合反应	极性↓；对 氨基水杨酸
甲基化 结合反应	极性↓； 儿茶酚胺结构 药物（去甲肾上腺素、肾上腺素、多巴胺等） （特例：生成 季铵盐 ，水溶性↑）

【考点 14】药物与非靶标结合引发的毒副作用

类型	代表药
与 非治疗部位靶标	经典 抗精神病药 -氯丙嗪-阻断四条多巴胺通路-导致内分泌、锥体外系

结合	选择性 COX-2 抑制剂-昔布-破坏 TXA ₂ 和 PGI ₂ 的平衡
与非治疗靶标结合	非经典抗精神病药-双重阻断-降低锥体外系 普利-抑制缓激肽分解-干咳 大环内酯类-刺激胃动素-胃肠道副作用
心脏快速延迟整流钾离子 (hERG)	特非那定/阿司咪唑/西沙比利 (撤市) 【心特细啊】

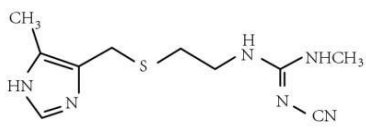
【考点 15】中枢神经系统疾病用药

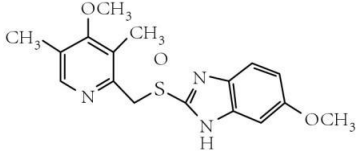
分类	代表药
苯二氮卓类	1,4-苯并二氮卓环 (ABC 环) 西泮: 地西泮→奥沙西泮 (去甲基, 加 3-OH, 安全) 唑仑 (1,2 位并入三唑环): 艾司唑仑、三唑仑
非苯二氮卓类	唑吡坦 (咪唑并吡啶) 扎来普隆 (吡唑并嘧啶, 无精神依赖性和后遗效应) 佐匹克隆 (1 个 C*, 吡咯酮) -艾司佐匹克隆 (右旋)

【考点 16】抗抑郁药物

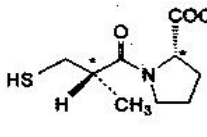
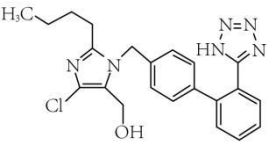
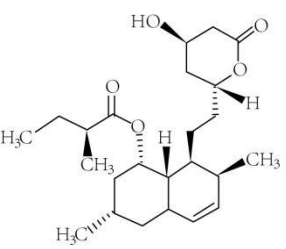
分类	代表药
NE 重摄取抑制剂	丙咪嗪→地昔帕明、氯米帕明→去甲帕明、阿米替林→去甲替林、多塞平 (E 型: Z 型=85:15=NE: 5-HT)
选择性 5-HT 重摄取抑制剂	氟西汀 (1 个 C*) →去甲氟西汀 舍曲林 (2 个 C*) →去甲舍曲林 西酞普兰 (1 个 C*) →N-去甲基西酞普兰 艾司西酞普兰 (S) 氟伏沙明、氯伏沙明、帕罗西汀 (2 个 C*)
单胺氧化酶抑制剂	吗氯贝胺、托洛沙酮
5-HT 与 NE 再摄取抑制剂	N-去甲文拉法辛←文拉法辛→O-去甲文拉法辛 (有活性) (小剂量: 5-HT, 大剂量: 5-HT 和 NE) 度洛西汀、米氮平

【考点 17】消化系统疾病用药

分类	代表药物	内容
H ₂ 受体阻断药	 西咪替丁	基本结构: 芳环基团 + 四原子链 + 胍基 ①西咪替丁: 咪唑环 + 含硫醚的四原子链 + 胍基 ②雷尼替丁: 咪唑环, 二氨基硝基乙烯, 反式体 ③尼扎替丁 (反式)、法莫替丁: 噻唑环 ④罗沙替丁: 无芳杂环, 哌啶甲苯环

质子泵抑制药	 <p>奥美拉唑</p>	<p>基本结构:苯并咪唑 + 亚磺酰基(亚砷) + 吡啶环</p> <p>①奥美拉唑:前药循环;清除率异构体 R > S (埃索美拉唑)</p> <p>②同类:兰索拉唑(肠溶)、右兰索拉唑【R 异构体, 其控释胶囊是首个设计提供分 2 次释药的双重控释(DDR)】</p>
促胃肠动力药	中枢性和外周性多巴胺 D2 受体拮抗剂	甲氧氯普胺-苯甲酰胺类-锥体外系症状
	外周性多巴胺 D2 受体拮抗剂	多潘立酮-双苯并咪唑结构
	阻断多巴胺 D2 受体活性和抑制乙酰胆碱酯酶活性	伊托必利-不产生甲氧氯普胺的锥体外系症状, 无西沙比利的致室性心律失常及其他严重的药物不良反应, 安全性更高
	选择性 5-HT4 受体激动药	莫沙必利-新型, 强效-无心脏副作用

【考点 18】循环系统疾病用药

分类	代表药物	内容
血管紧张素转换酶抑制剂	 <p>卡托普利</p>	<p>(1) 卡托普利(1 个游离羧基、巯基, 脯氨酸药效基团, 非前药, 皮疹和味觉障碍)、阿拉普利(前药)</p> <p>(2) 2 个游离羧基、赖氨酸: 赖诺普利(非前药)</p> <p>1 个游离羧基, 1 个成酯: 依那普利(→依那普利拉, 有活性)、贝那普利(→贝那普利拉)</p> <p>(3) 福辛普利(含磷酰基, 1 个游离羧基, 1 个成酯, →福辛普利拉)</p>
血管紧张素 II 受体阻断药	 <p>氯沙坦</p>	<p>(1) 四氮唑基、咪唑、联苯: 氯沙坦、厄贝沙坦(螺环)、坎地沙坦酯(前药)</p> <p>(2) 缬沙坦: 不含“咪唑”</p> <p>(3) 替米沙坦: 不含四氮唑, 而含羧酸基</p>
羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑制药	 <p>洛伐他汀</p>	<p>(1) 副作用: 肌肉疼痛或横纹肌溶解(西立伐他汀由于引起横纹肌溶解, 导致病人死亡的副作用而撤出市场)</p> <p>(2) 必需结构: 3,5-二羟基羧酸(内酯水解生效)</p> <p>(3) 前药(内酯环水解): 洛伐他汀、辛伐他汀</p> <p>(4) 结构总结: ①天然及半合成改造药物: 洛伐他汀(天然)、辛伐他汀(-CH₃)、普伐他汀钠(-OH)</p> <p>②人工全合成药物: 氟伐他汀钠(吡啶环, 第一个)、阿托伐他汀钙(吡咯环)、瑞舒伐他汀钠(咪啉环)</p>

【考点 19】口服降糖药

分类	代表药
促胰岛素分泌药	<p>磺酰脲类</p> <p>苯磺酰脲结构</p> <p>格列齐特、格列本脲(环己基)、格列吡嗪、格列美脲(甲基环己基, 高效长效)</p>
	<p>非磺酰脲类</p> <p>氨基酸结构, 餐时血糖调节剂</p>

		瑞格列奈 (S 异构体)、那格列奈 (D-苯丙氨酸衍生物, R 异构体)、米格列奈 (强快短)
胰岛素增敏剂	双胍类	二甲双胍 (强碱性, 肾功能损害者禁用)
	噻唑烷二酮类	罗格列酮、吡格列酮
α-葡萄糖苷酶抑制剂		阿卡波糖 (-OH)、米格列醇、伏格列波糖
二肽基肽酶-4 抑制药		列汀
钠-葡萄糖协同转运蛋白 2 抑制药		列净【二太太停牌四次, 净胡二钠】

【考点 20】口服固体制剂的常用辅料

分类	常用种类		
稀释剂 (填充剂)	乳糖、蔗糖、糊精、淀粉、预胶化淀粉、微晶纤维素 (MCC)、甘露醇和无机盐类等		
润湿剂和黏合剂	常用的润湿剂有乙醇和蒸馏水, 其中首选的润湿剂是蒸馏水 常用的黏合剂有甲基纤维素 (MC)、淀粉浆、羟丙基甲基纤维素 (HPMC)、羟丙基纤维素 (HPC)、羧甲基纤维素钠 (CMC-Na)、乙基纤维素 (EC)、聚维酮 (PVP)、聚乙二醇 (PEG)、明胶等		
崩解剂	羧甲基淀粉钠 (CMS-Na)、干淀粉、低取代羟丙基纤维素 (L-HPC)、交联羧甲基纤维素钠 (CCMC-Na)、交联聚维酮 (PVPP) 和泡腾崩解剂等		
润滑剂	微粉硅胶、硬脂酸镁 (MS)、氢化植物油、滑石粉、十二烷基硫酸钠、聚乙二醇类等		
释放调节剂	常用的释放调节剂主要分为骨架型、包衣膜型缓控释放高分子和增稠剂等		
	骨架型释放调节剂	亲水性凝胶骨架材料	甲基纤维素 (MC)、羧甲基纤维素钠 (CMC-Na)、羟丙基甲基纤维素 (HPMC)、聚维酮 (PVP)、海藻酸盐、卡波姆、脱乙酰壳多糖 (壳聚糖) 等
		不溶性骨架材料	乙基纤维素 (EC)、聚甲基丙烯酸酯、聚乙烯、乙烯-醋酸乙烯共聚物、无毒聚氯乙烯、硅橡胶等
		生物溶蚀性骨架材料	巴西棕榈蜡、动物脂肪、氢化植物油、蜂蜡、硬脂醇、单硬脂酸甘油酯等
	包衣膜型释放调节剂	不溶性高分子材料	如不溶性骨架材料 EC 等
肠溶性高分子材料		如醋酸纤维素酞酸酯 (CAP)、丙烯酸树脂 L 和 S 型、羟丙基甲基纤维素酞酸酯 (HPMCP) 和醋酸羟丙基甲基纤维素琥珀酸酯 (HPMCAS) 等	

【考点 21】薄膜包衣

要点	内容
胃溶型	羟丙基甲基纤维素 (HPMC)、羟丙基纤维素 (HPC)、丙烯酸树脂 IV 号、聚乙烯缩乙醛二乙氨乙酸 (AEA) 和聚乙烯吡咯烷酮 (PVP) 等
肠溶型	醋酸纤维素酞酸酯 (CAP)、虫胶、羟丙基甲基纤维素酞酸酯 (HPMCP)、丙烯酸树脂类 (I、II、III 号) 等
水不溶型	醋酸纤维素、乙基纤维素 (EC) 等

增塑剂	水溶性增塑剂（如甘油、丙二醇、聚乙二醇等）和非水溶性增塑剂（如乙酰化甘油酸酯、甘油三醋酸酯、邻苯二甲酸酯等）
致孔剂	蔗糖、氯化钠、表面活性剂和 PEG 等
遮光剂	二氧化钛等

【考点 22】口服散剂的特点

分类	优点	缺点
散剂	①粒径小、易分散、起效快 ②制备工艺简单，特殊群体可口服 ③较方便 ④完整保存中药材药性	分散度较大，稳定性差，对光湿热敏感不宜
颗粒剂	①分散性、附着性、团聚性、引湿性等较小 ②服用方便，可加入添加剂（着色剂/矫味剂），提高服药顺应性 ③包衣可使颗粒具有防潮性、缓释性、肠溶性等； ④制粒可防止复方散剂各组分由于粒度或密度差异而产生离析	
片剂	①准确、服方便 ②性质稳定 ③成本低，售价低 ④种类多，应用广⑤方便	①不易吞服 ②含挥发性成分的含量下降 ③工序多，难度高
胶囊剂	①掩味，提高稳定性 ②起效快、生物利用度高 ③液态药物固体化 ④药物缓释、控释和定位释放	①胶囊壳受温度和湿度影响较大 ②成本高 ③特殊群体(婴幼儿、老人)口服困难④一些药物不宜制成胶囊剂

【考点 23】口服膜剂

要点	内容
特点	吸收快、方便、不同释药速度、载药量小
成膜材料	聚乙烯醇 (PVA)、丙烯酸树脂类、纤维素类等

【考点 24】口服液体制剂的分类

分类	类型	特征
均相	低分子溶液剂	真溶液；热力学稳定体系；扩散快，能透过滤纸和半透膜。
	高分子溶液剂	真溶液；热力学稳定体系；扩散慢，不能透过半透膜。
非均相	溶胶剂	胶体 胶态分散形成多相体系；有界面，热力学不稳定体系。
	混悬剂	固体微粒分散形成，动力学和热力学均不稳定体系；有界面。
	乳剂	液体微粒分散形成，动力学和热力学均不稳定体系；有界面。 水相-油相-乳化剂

【考点 25】表面活性剂的分类及应用

分类	应用
阴离子型	有刺激性，一般外用，很少用于口服 高级脂肪酸盐（硬脂酸钠/钾/钙、三乙醇胺皂）、硫酸化物（十二烷基硫酸钠）、

	磺酸化物（十二烷基苯磺酸钠）	
阳离子型	苯扎氯铵（洁尔灭） 苯扎溴铵（新洁尔灭）	毒性大，主要用于皮肤、黏膜、手术器械消毒
两性离子型	天然：卵磷脂、豆磷脂	注射用乳剂的乳化剂；脂质体主要原材料
非离子型	司盘、吐温、卖泽、苜泽、泊洛沙姆/普朗尼克（静脉注射用乳剂的乳化剂）	
毒性	阳 > 阴 > 非（口服无毒）	

【考点 26】低分子溶液剂

要点	内容
溶液剂	（不挥发性）化学药物+水/醇/油
芳香水剂	芳香挥发性药物+水（水蒸气蒸馏法-露剂）（澄明，不易久贮）
酞剂	挥发性药物+浓乙醇溶液（含醇 60%-90%，不易久贮）
酞剂	药物+乙醇（含剧毒酞剂浓度≤10%，其他酞剂≤20%；最低乙醇含量为 30%）
酞剂	不良味道药物+稀醇（含醇 5%-40%，+芳香剂/甜味剂）
糖浆剂	药物+浓蔗糖水溶液[含蔗糖量不低于 45% (g/ml)]。

【考点 27】乳剂的稳定性

要点	内容
分层	可逆，分散相和分散介质之间存在密度差
絮凝	可逆，乳滴荷电减少， ζ 电位↓→可逆性聚集
转相	乳化剂性质变化→乳剂类型变化
合并	乳滴周围乳化膜部分破裂→液滴合并变大
破裂	不可逆，液滴进一步合并→形成水相两相
酸败	不可逆，可加入防腐剂/抗氧化剂

【考点 28】注射剂的质量要求

要点	内容
pH	注射剂的 pH 应和血液 pH 相等或相近。一般控制在 4~9 的范围内
渗透压	与血浆相同的或略偏高
稳定性	物理稳定性和化学稳定性
安全性	对机体无毒性、无刺激性，降压物质符合规定
澄明	溶液型注射液应澄明，不得含有可见的异物或不溶性微粒
无菌	不应含有任何活的微生物

无热原	<p>内毒素（G⁻菌致热能力最强）</p> <p>热原的性质:水溶性、不挥发性、耐热性、过滤性(活性炭)、能被强碱、强酸、强氧化剂、超声波破坏,被离子交换树脂吸附</p> <p>除去方法:①除去药液/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;②除去容器/用具上热原的方法:高温法/酸碱法。</p>
------------	---

【考点 29】注射剂常用的附加剂

附加剂种类	附加剂名称
抗氧化剂	焦亚硫酸钠、亚硫酸氢钠、亚硫酸钠、硫代硫酸钠
金属螯合剂	乙二胺四乙酸二钠(EDTA·2Na)
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、聚山梨酯 20 (吐温 20)、聚山梨酯 40 (吐温 40)、聚山梨酯 80 (吐温 80)、聚维酮、聚乙二醇-40-蓖麻油、卵磷脂、脱氧胆酸钠、普朗尼克 F-68 (泊洛沙姆 188)
抑菌剂	苯酚、甲酚、氯甲酚、苯甲醇、三氯叔丁醇、硝酸苯汞、尼泊金类
等渗调节剂	氯化钠、葡萄糖、甘油
填充剂	乳糖、甘露醇、甘氨酸

【考点 30】制药用水

饮用水	制药用水 原水 , 饮片提取溶剂
纯化水	不得用于注射剂 ; 可用于 口服、外用制剂
注射用水	注射剂、滴眼剂 等的溶剂或稀释剂及容器的清洗溶剂
灭菌注射用水	不含附加剂; 注射用灭菌粉末 的溶剂或 注射剂的稀释剂

【考点 31】注射剂的溶解度

影响溶解度的因素	①药物结构与溶剂极性（相似相溶） ②温度 ③药物的晶型： 无定型 > 亚稳定型 > 稳定型有机溶剂化物 > 无水物 > 水合物 ④粒子大小： 溶解度随粒径减小而增加 ⑤加入第三种物质： 助溶剂、增溶剂
增加溶解度的方法	①加入增溶剂（ 表面活性剂 ） ②加入助溶剂（ 苯甲酸钠、水杨酸钠、碘化钾 ） ③制成可溶性盐类 ④使用混合溶剂（ 潜溶剂，醇 + 水 ） ⑤制成共晶 ⑥提高温度，改变 pH，微粉化、 包合技术

【考点 32】注射剂配伍变化的主要原因及实例

主要原因	实例
溶剂组成改变	如 地西洋 注射液与 0.9%氯化钠、5%葡萄糖或 0.167mol/L 乳酸钠注射液配伍时,易析出沉淀
pH 的改变	如 5%葡萄糖与 新生霉素 , 氨苄西林 与诺氟沙星配伍会发生沉淀,磺胺嘧啶钠,谷氨酸钠(钾)、氨茶碱等碱性药物可使肾上腺素变色
缓冲容量	如 5% 硫喷妥钠 10ml 加入含乳酸盐的葡萄糖注射液会析出沉淀

离子作用	如 乳酸根离子 会加速青霉素 G 和氨苄西林钠的水解
直接反应	如 四环素 与含钙盐的输液在碱性或中性下, 会产生不溶性螯合物
盐析作用	如 两性霉素 B 注射液, 只能加入 5%葡萄糖注射液中静脉滴注。若在大量电解质的输液中则能被电解质盐析出来
配合量	如重酒石酸间羟胺注射液与氯化可的松琥珀酸钠注射液
混合顺序	氨茶碱与烟酸配伍
反应时间	如葡萄糖输液与磺胺嘧啶钠注射液混合后, 约在 2 小时 出现沉淀
氧与二氧化碳的影响	如苯妥英钠、硫喷妥钠注射剂因吸收二氧化碳导致 pH 下降, 也有可能析出沉淀
光敏感性	如磺胺嘧啶钠、两性霉素 B、四环素、维生素 B ₂ 、雌性激素等
成分的纯度	如氯化钠原料中含有微量的 钙盐 , 当与 25%枸橼酸钠注射液配伍时往往产生枸橼酸钙的悬浮微粒而浑浊

【考点 33】溶液型注射剂的临床应用

- ①患者存在吞咽困难或明显的吸收障碍;
- ②口服生物利用度低的药物;
- ③患者疾病严重、病情进展迅速的紧急情况下;
- ④没有合适的口服剂型的药物。

【考点 34】脂质体

要点	内容
成膜材料	① 磷脂 : 天然的卵磷脂、豆磷脂以及合成磷脂 ② 胆固醇 (两亲, 调节流动性)
特点	靶向性 (肿瘤)、淋巴定向性、缓释长效、 细胞亲和性和组织相容性 、降低药物毒性
理化性质	相变温度、荷电性
新型靶向	前体 (+水溶性载体, 适合包封脂质性药物)、长循环 (PEG 修饰)、免疫 (+抗体)、热敏 (相变温度)、pH 敏感性 (肿瘤间质 pH 低)
质量要求	包封率 > 80% ; 载药量;
	物理稳定性: 渗漏率; 化学稳定性: 磷脂氧化指数, 磷脂量的测定

【考点 35】生物技术药物注射剂

要点	内容
特点	①分子量大: 多肽类、抗体类、重组病毒、细胞等 ②几乎都必须采用 注射 给药方式: 难以透过体内屏障 ③对温度、pH、离子强度及酶等条件极为 敏感 , 易被降解或失活 ④结构非常 复杂 : 分析方法独特
注意事项	①稳定剂 - 蔗糖 , 抗氧化剂 - EDTA 等螯合剂 ②表面活性剂: 可防止蛋白的变性 (少量 吐温 80)

【考点 36】贴剂的处方材料

处方材料	常用材料
骨架材料	亲水性的聚乙烯醇与疏水性的聚硅氧烷
控释膜材料	微孔膜:聚丙烯拉伸微孔膜等 均质膜:聚硅氧烷和乙烯-醋酸乙烯共聚物等
压敏胶	硅橡胶类、聚丙烯酸类和聚异丁烯(PIB)类
背衬材料	常用多层复合铝箔,其他可使用的背衬材料还有聚苯乙烯、高密度聚乙烯、聚对苯二甲酸二乙酯等
防黏材料	聚苯乙烯、聚乙烯、聚碳酸酯、聚丙烯等
药库材料	聚乙烯醇、羟丙基甲基纤维素、卡波姆等均较常用,各种骨架膜材和压敏胶也同时可以是药库材料

【考点 37】皮肤给药制剂的选用原则

分期	应用
皮肤病急性期	① 无渗液 :洗剂/粉雾剂; 禁用 糊剂/软膏剂(阻滞水分蒸发) ② 大量渗液 :溶液湿敷(3%硼酸 洗剂)
皮肤病亚急性期	①皮肤糜烂, 少量渗液 :外用 糊剂 ②丘疹或小片增厚 无渗液 :乳膏剂/洗剂/软膏剂 ③ 有痂皮 :先软膏剂(软化),再外用药(易吸收)
皮肤病慢性期	浸润增厚为主:乳膏剂、软膏剂; 苔藓样变为主:软膏剂、酊剂

【考点 38】栓剂的基质

种类	常用品种
油脂性基质	可可豆脂 、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)
水溶性基质	甘油明胶 、 聚乙二醇 、 泊洛沙姆

【考点 39】药物的转运方式的特点

分类		特点	转运物质
被动转运	滤过	流体静压/渗透压透过膜孔	水溶性、小分子药物
	简单扩散	无需载体、 顺浓度差(不耗能)	解离度小,脂溶性大
载体转运	主动转运	载体(饱和性/竞争性/特异性)逆浓度差(耗能)	生命必需物质 (K^+ 、 Na^+ 、 I^- 、单糖、氨基酸、水溶性维生素)和有 机酸、碱等弱电解质的离子型化合物
	易化扩散	载体(饱和性/竞争性/特异性)顺浓度差(不耗能)	核苷类、单糖类、氨基酸等 高级性物质
膜动		胞饮、吞噬、胞吐	

转运	① 适用对象： 微粒/大分子物质 （蛋白质、多肽）②有部位特异性
----	---

【考点 40】影响药物吸收的因素

要点	内容	
生理因素	①胃肠液的成分和性质 ②胃肠道运动 ③循环系统转运 ④食物 ⑤胃肠道酶代谢 ⑥疾病因素 ⑦特殊人群	
剂型（广义）因素	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
	剂型与制剂因素	① 剂型 ②制剂处方 ③制剂制备工艺

【考点 41】药物的分布

要点	内容
影响分布的因素	①药物与组织的亲和力:亲脂性药物容易从水性血浆环境中分布进入脂肪组织 ②血液循环系统 ③药物与血浆蛋白结合的能力:药物与血浆蛋白结合是 可逆 过程,有 饱和现象 ,包括游离药物与结合药物,但 药物的疗效 取决于其 游离型浓度 ④微粒给药系统 (靶向 < 7 μ m 肝、脾; > 7 μ m 肺截流)
淋巴系统转运	可使药物 避免肝脏的首关效应 ; 脂肪和蛋白质等大分子物质 的转运
脑内分布/胎儿内分布	血脑屏障和胎盘屏障 (亲脂性/非解离易通过 ; 大分子、水溶性/解离型难通过)

【考点 42】药物排泄

要点	内容	
肾小管重吸收	肾小球滤过	血浆蛋白 结合型不能滤过
	肾小管分泌	主动转运 , 竞争性抑制; 血浆蛋白结合率不影响肾小管分泌
	肾小管重吸收	必备物质 葡萄糖主动重吸收 药物被动重吸收 【酸碱碱酸促排泄】
肠-肝循环	是指随胆汁排入十二指肠的药物或其代谢物,在肠道中被重新吸收,经门静脉返回肝脏,重新进入血液循环的现象(在体内能停留较长时间)。药-时曲线双峰现象(氯霉素、螺内酯、己烯雌酚、卡马西平、吲哚美辛等药物)	

【考点 43】药动学参数及临床意义

参数	名称	意义	公式	单位
k	速率常数	药物消除速度的快慢	肝代谢+肾排泄 $k = k_b + k_e$ 特征参数	时间 ⁻¹ min ⁻¹
t_{1/2}	生物	药物在体内的量/	t_{1/2} = 0.693/k 特征参数, 不因药物剂型、给	时间

	半衰期	血药浓度降低一半所需要的时间	药途径或剂量而改变	min
V	表观分布容积	不涉及真正的容积	$V=X/C$ 常数 C高, 亲水性药物, V小; C低, 亲脂性药物, V大, 可超过体液总体积	体积 L L/kg
Cl	清除率	药物消除的快慢	肝清除率+肾清除率 $Cl=kV$ 常数	体积/时间 L/min

【考点 44】非线性药动学

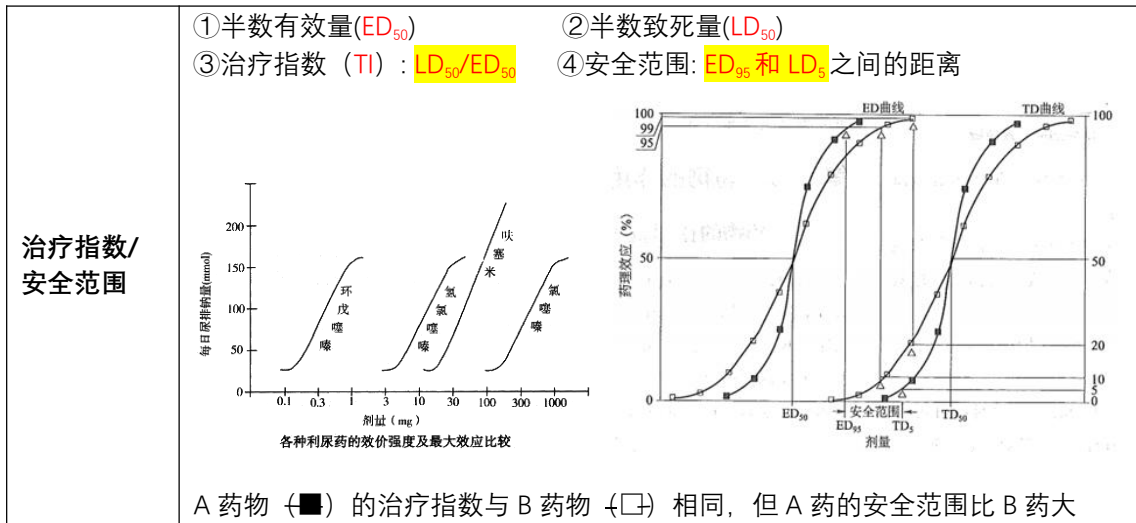
区分	线性特点	非线性特点 (可能竞争酶/载体系统)
一级动力学特征	符合	不呈现, 米氏方程
剂量增加, k 、 $t_{1/2}$ 、Cl	不变	k 、Cl 变小, $t_{1/2}$ 延长
AUC、 C_{av} 与剂量	成正比 $C_{av}=X_0/Vkt$	不成正比
剂量改变, 原药与代谢产物的组成比例	不变	改变

【考点 45】生物利用度与生物等效性

生物利用度的研究方法	绝对生物利用度 (参比制剂-静脉)	$F = \frac{AUC_{(po)} / Dose_{(po)}}{AUC_{(iv)} / Dose_{(iv)}} \times 100\%$
	相对生物利用度	$F_r = \frac{AUC_{(T)} / Dose_{(T)}}{AUC_{(R)} / Dose_{(R)}} \times 100\%$
生物等效性研究	药物动力学研究 (最常用) > 药效动力学研究 > 临床研究 > 体外研究	
	药动学终点评价指标: C_{max} 、 t_{max} 、AUC (血难测→换尿) C_{max} 、AUC 的 90%置信区间均在 80%~125%	

【考点 46】药物的量-效关系

要点	内容
效能	在一定范围内, 增加药物剂量或浓度, 所能达到的最大效应 (药物的内在活性)
效价强度	引起等效反应 (一般采用 50%效应量) 的相对剂量或浓度

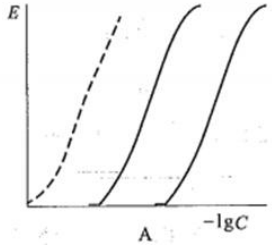
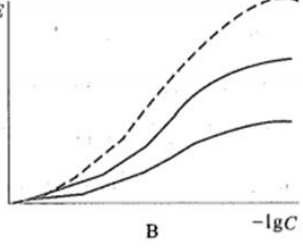


【考点 47】药物的作用机制

作用机制	代表药物
作用于受体	胰岛素, 阿托品, 肾上腺素(激活 α 、 β 受体)等
影响酶的活性	①抑制酶活性:依那普利(抑制血管紧张素 I 转化酶)、阿司匹林、地高辛 ②激活酶活性:尿激酶、碘解磷定(激活胆碱酯酶) ③影响代谢酶:苯巴比妥(诱导肝药酶)、氯霉素(抑制肝药酶) ④本身是酶:胃蛋白酶、胰蛋白酶等
影响细胞膜离子通道	利多卡因(抑制 Na^+ 通道);硝苯地平(阻滞 Ca^{2+} 通道);阿米洛利(阻滞肾小管 Na^+ 通道);米诺地尔(激活血管平滑肌 ATP 敏感的 K^+ 通道等)
干扰核酸代谢	①抗肿瘤药(氟尿嘧啶结构与尿嘧啶相似, 掺入肿瘤细胞后发挥抗肿瘤作用) ②抗菌药(磺胺类、喹诺酮类) ③抗人类免疫缺陷病毒药(齐多夫定)
补充体内物质	补充铁剂治疗缺铁性贫血; 补充胰岛素治疗糖尿病;补充维生素、多种微量元素等
改变细胞周围环境的理化性质	甘露醇(利尿);氢氧化铝、三硅酸铁(抗酸药);二巯基丁二酸钠(解毒);硫酸镁(泻药); 右旋糖酐(血容量扩张药)
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);丙磺舒(竞争性抑制肾小管对弱酸性代谢物的转运体)
影响机体免疫功能	免疫抑制药(环孢素)、免疫增强药(左旋咪唑)
非特异性作用	消毒防腐药、蛋白沉淀剂、调节血液酸碱平衡(碳酸氢钠、氯化铵)等

【考点 48】受体的激动药和拮抗药

	亲和力	内在活性	分类	特点
激动药	高	有	完全激动药	内在活性强 ($\alpha=1$) (吗啡)
			部分激动药	内在活性弱 ($\alpha < 1$) E_{max} 较低 (喷他佐辛 小剂量激动, 大剂量拮抗)
			反向激动药	(苯二氮卓类) 结合后引起与激动药相反的效应

拮抗药	高	无 ($\alpha=0$)	竞争性拮抗药	可与激动剂竞争相同受体, 可逆 (E_{max} 不变、曲线平行右移)	
			非竞争性拮抗药	与受体结合牢固/不可逆 (E_{max} 下降)	
		竞争性拮抗药		非竞争性拮抗药	

【考点 49】药物效应的协同作用和拮抗作用

药效学相互作用		代表药物
协同作用	相加作用	阿司匹林+对乙酰氨基酚; 阿替洛尔+氢氯噻嗪
	增强作用	磺胺甲噁唑+甲氧苄啶(SMZ+TMP); 普鲁卡因注射液+肾上腺素
	增敏作用	钙增敏药
拮抗作用	生理性拮抗	组胺+肾上腺素
	生化性拮抗	苯巴比妥使避孕药效应降低, 避孕失败
	化学性拮抗	肝素+鱼精蛋白
	药理性拮抗	苯海拉明+组胺 H1 受体激动药; β 受体阻断药+异丙肾上腺素

【考点 50】药物对机体各系统的毒性作用

药物对肾脏的毒性作用	常见药物
急性肾小管损伤或坏死	氨基糖苷类、头孢菌素、两性霉素 B、万古霉素、造影剂、重金属(汞、铅等)、顺铂、阿昔洛韦等
急性间质性肾炎	抗生素、非甾体抗炎药、半合成青霉素、头孢菌素、卡托普利、青霉胺、利福平、西咪替丁、别嘌呤醇、喹诺酮类等
慢性间质性肾炎	非甾体类抗炎药、某些金属制剂(顺铂、锂、铅、汞、镉等)、环孢素、甲氨蝶呤等;含马兜铃酸的中药如关木通、马兜铃
肾小球肾炎	非甾体抗炎药、海洛因、青霉胺、血管紧张素转化酶抑制剂等
梗阻性急性肾功能衰竭	磺胺类、甲氨蝶呤、阿昔洛韦、造影剂、二甲麦角胺新碱等
慢性肾功能衰竭	非甾体抗炎药、锂盐、环孢素、抗生素等
肾血管损害	氟尿嘧啶、丝裂霉素、环孢素

药物对肝脏的毒性作用	常见药物
脂肪肝	乙醇、丙戊酸钠、甲氨蝶呤、四环素、 α -甲基多巴、胺碘酮
肝坏死	乙醇、对乙酰氨基酚、抗代谢药、烷化剂、异烟肼、苯妥英钠、丙基硫氧嘧啶、氟烷、维拉帕米、摇头丸等
胆汁淤积	氯丙嗪、环孢素、同化类固醇、甲基睾丸素、红霉素脂化剂、复方新诺明等
纤维化及肝硬化	乙醇、维生素 A、吩噻嗪类、甲磺丁脲、同化类固醇等
慢性坏死性肝炎	氟烷、左旋多巴、异烟肼、磺胺药、氯丙嗪、呋喃妥因等

