

一、最佳选择题

1. 【正确答案】 C

【答案解析】 缓冲体系也就是 pH 值的影响属于处方因素。

2. 【正确答案】 A

【答案解析】 奎尼丁与地高辛同时给药时，地高辛的血药浓度明显升高，这是由于奎尼丁抑制了肾近端小管上皮细胞的转运体 P-糖蛋白（P-gp），使地高辛经 P-gp 的外排性分泌受到抑制，重吸收增加，因此导致地高辛的血药浓度明显升高。

3. 【正确答案】 C

【答案解析】 一般伯胺的活性较高，仲胺次之，叔胺最低。季铵易电离成稳定的铵离子，作用较强，但口服吸收不好。

4. 【正确答案】 D

【答案解析】 本题考查盐酸普鲁卡因与药物受体的作用方式。除 D 答案共价键外，均正确，故本题答案应选 D。

5. 【正确答案】 C

【答案解析】 酰胺也可被 N-氧化为羟胺，致癌毒性比较高。已淘汰的药物非那西汀的毒性就是由于产生 N-羟基化代谢产物所引起的。

6. 【正确答案】 B

【答案解析】 含芳环的药物主要发生氧化代谢，是在体内肝脏 CYP450 酶系催化下，首先将芳香化合物氧化成环氧化物，然后在质子的催化下发生重排生成酚，或被环氧化物水解酶水解生成二羟基化合物。

7. 【正确答案】 D

【答案解析】 将第 I 相中药物产生的极性基团与体内的内源性成分经共价键结合，生成极性大、易溶于水和易排出体外的结合物。

8. 【正确答案】 B

【答案解析】 润湿剂的最适 HLB 值通常为 7~9，并且要在合适的温度下才能够起到润湿作用。

9. 【正确答案】 E

【答案解析】 表面活性剂系指具有很强的表面活性、加入少量就能使液体的表面张力显著下降的物质。

10. 【正确答案】 E

【答案解析】 高分子溶液的黏度与其相对分子质量是有关的，可以通过特定的公式互相推导。

11. 【正确答案】 C

【答案解析】 助悬剂包括的种类很多，其中有低分子化合物、高分子化合物、甚至有些表面活性剂也可作助悬剂用。低分子助悬剂如甘油、糖浆剂等低分子化合物，可增加分散介质的黏度，也可增加微粒的亲水性。阿拉伯胶属于天然的高分子助悬剂；葡聚糖属于合成高分子助悬剂；触变胶也可用做助悬剂；而二甲基亚砷属于一种极性的溶剂；所以此题选择 C。

12. 【正确答案】 B

【答案解析】 如加入电解质后使 ζ 电位升高，阻碍微粒之间的碰撞聚集，这个过程称为反絮凝，能起反絮凝作用的电解质称为反絮凝剂。

13. 【正确答案】 E

【答案解析】 此题重点考查片剂包衣常用的物料。隔离层是在片芯外起隔离作用的衣层，以防止水分透入片芯。常用材料有玉米朊乙醇溶液、邻苯二甲酸醋酸纤维素乙醇溶液以及明胶浆等。

14. 【正确答案】 B

【答案解析】 散剂可单剂量包（分）装和多剂量包装，多剂量包装者应附分剂量的用具。含有毒性药的口服散剂应单剂量包装。

15. 【正确答案】 A

【答案解析】 服用散剂不宜过多饮水，以免药物过度稀释导致药效差。

16. 【正确答案】 A

【答案解析】 酞剂中药物浓度一般为 5%~20%，乙醇的浓度一般为 60%~90%。

17. 【正确答案】 E

【答案解析】 制成胶囊剂不会影响药物的疗效。

18. 【正确答案】 E

【答案解析】 根据它们所起作用的不同，常将辅料分成如下四大类：填充剂或稀释剂、黏合剂、崩解剂和润滑剂。

19. 【正确答案】 C

【答案解析】 热原的基本性质：水溶性、不挥发性、耐热性、过滤性、其他：能被强酸、强碱、强氧化剂以及超声破坏。

20. 【正确答案】 A

【答案解析】 通过与阴道或直肠接触而起全身治疗作用的栓剂，可利用非离子型表面活性剂、脂肪酸、脂肪醇和脂肪酸酯类、尿素、水杨酸钠、苯甲酸钠、羟甲基纤维素钠、环糊精类衍生物等作为药物的吸收促进剂，以增加药物的吸收。聚山梨酯 80 为非离子型表面活性剂。

21. 【正确答案】 A

【答案解析】 按给药途径分类分为直肠用、阴道用、尿道用栓剂等，如直肠栓、阴道栓、尿道栓等；按制备工艺与释药特点分类分为双层栓、中空栓、缓控释栓。

22. 【正确答案】 C

【答案解析】 注射剂的特点：（1）药效迅速、剂量准确、作用可靠。（2）可适用于不宜口服给药的患者和不宜口服的药物。（3）可发挥局部定位作用。但注射给药不方便，注射时易引起疼痛。（4）易发生交叉污染、安全性不及口服制剂。（5）制造过程复杂，对生产的环境及设备要求高，生产费用较大，价格较高。

23. 【正确答案】 A

【答案解析】 动靶向制剂经静脉注射后在体内的分布首先取决于其粒径的大小，通常粒径在 $2.5\sim 10\mu\text{m}$ 时，大部分积集于巨噬细胞；小于 $7\mu\text{m}$ 时一般被肝、脾中的巨噬细胞摄取； $200\sim 400\text{nm}$ 的纳米粒集中于肝后迅速被肝清除；小于 10nm 的纳米粒则缓慢积集于骨髓；大于 $7\mu\text{m}$ 的微粒通常被肺的最小毛细血管床以机械滤过方式截留，被单核白细胞摄取进入肺组织或肺气泡。

24. 【正确答案】 E

【答案解析】 由于药物的释放受溶出速度的限制，溶出速度慢的药物显示出缓释的性质。可采用制成溶解度小的盐或酯、与高分子化合物生成难溶性盐、控制粒子大小等方法和技术。

25. 【正确答案】 D

【答案解析】 口服缓(控)释制剂与普通口服制剂相比其主要特点是：

(1)对于半衰期短的或需要频繁给药的药物，可以减少给药次数，方便使用，从而大大提高患者的顺应性，特别适用于需要长期服药的慢性病患者。

(2)血药浓度平稳，避免或减小峰谷现象，有利于降低药物的不良反应。

(3)减少用药的总剂量，因此可用最小剂量达到最大药效。

但口服缓控制剂并不能避免肝脏的首过效应，所以此题选 D。

26. 【正确答案】 A

【答案解析】 本题考查药物的吸收。吸收是指药物从给药部位到达全身循环的过程。因此腹腔注射、肌肉注射、口服给药、肺部给药都有吸收过程，静脉注射则没有。故本题答案应选 A。

27. 【正确答案】 E

【答案解析】 生物利用度即指由给药部位进入循环的药物相对量，影响到药物作用的快慢和强弱。药物的作用机制着重探讨药物如何引起机体作用。改变药物的生物利用度不属于药物的作用机制。

28. 【正确答案】 B

【答案解析】 考查重点是药物相互作用的结果。

29. 【正确答案】 E

【答案解析】 药物被吸收入血后，有一部分与血浆蛋白发生可逆性结合，称为结合型，结合型药物有以下特性：不呈现药理活性、不能透过血脑屏障、不被肝脏代谢灭活、不被肾排泄。

30. 【正确答案】 E

【答案解析】 世界卫生组织关于药品不良反应的分类包括：副反应、不良反应、不良事件、严重不良事件、非预期不良反应和信号。

31. 【正确答案】 C

【答案解析】 不论何种药物，达稳态相同分数所需半衰期的个数相同，经过 3 个半衰期后，血药浓度达到稳态血药浓度的 88%。

32. 【正确答案】 A

【答案解析】 乙琥胺应采用非水酸量法测定含量。

33. 【正确答案】 B

【答案解析】 青霉素在生物合成中产生的杂质蛋白，以及生产、贮存过程中产生的杂质青霉噻唑高聚物是引起其过敏反应的根源。由于青霉噻唑基是青霉素类药物所特有的结构，因此青霉素类药物这种过敏反应是交叉过敏反应。

34. 【正确答案】 B

【答案解析】 维生素 D₃ 须在肝脏和肾脏两次羟基化，转化为 1, 25-二羟基维生素 D₃ 后，才具有活性。由于老年人肾中 1 α -羟化酶活性几乎消失，无法将维生素 D₃ 活化，于是开发了阿法骨化醇。

35. 【正确答案】 B

【答案解析】 名称提示结构，对乙酰氨基酚中含有互成对位的乙酰氨基和酚羟基。

36. 【正确答案】 B

【答案解析】 结构中含有硫，所以该化合物为抗癫痫药硫喷妥。

37. 【正确答案】 E

【答案解析】 盐酸胺碘酮属于钾通道阻滞剂；ABCD 属于钠通道阻滞剂；所以此题选 E。

38. 【正确答案】 E

【答案解析】 米诺环素为四环素脱去 C-6 位甲基和 C-6 位羟基，同时在 C-7 位引入二甲氨基得到的衍生物，由于脱去 C-6 位羟基，米诺环素对酸很稳定，不会发生脱水 and 重排而形成内酯环的产物。

39. 【正确答案】 B

【答案解析】 本题考查大环内酯类抗生素。大环内酯类抗生素有红霉素及其衍生物琥乙红霉素、罗红霉素、阿奇霉素、克拉霉素还有乙酰螺旋霉素及麦迪霉素等，克拉维酸和头孢克洛属于 β -内酰胺类，阿米卡星属于氨基糖苷类，盐酸林可霉素属于其他类抗生素。故本题答案应选 B。

40. 【正确答案】 C

【答案解析】 哌啶类镇痛药代表药物有哌替啶、芬太尼。

二、配伍选择题

[41~44]

【正确答案】 E、A、B、C

【答案解析】 抗氧化剂可提高易氧化药物的化学稳定性等。将胰酶制成肠溶衣片，不仅可使其免受胃酸破坏，还可保证其在肠中充分发挥作用从而提高疗效。以硬脂酸钠和虫蜡为基质制成的芸香草油肠溶滴丸，既可掩盖药物的不良臭味，也可避免对胃的刺激降低毒副作用。口服液体制剂中加入矫味剂，可改善药物的不良口味，提高患者用药顺应性。

[45~48]

【正确答案】 A、B、D、C

【答案解析】 弱酸性药物如水杨酸和巴比妥类药物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、氨苯砞、地西洋在胃中几乎全部呈解离形式，很难被吸收；而在肠道中，由于 pH 比较高，容易被吸收。碱性极弱的咖啡因和茶碱，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，以及完全离子化的季铵盐类和磺酸类药物，消化道吸收很差。

[49~52]

【正确答案】 B、A、C、D

【答案解析】 本题考查各类表面活性剂的分类及归属，二甲基亚砷常作为经皮吸收促进剂。

[53~56]

【正确答案】 A、C、D、B

【答案解析】 本题考查各种注射剂的适用对象，注意掌握。

[57~59]

【正确答案】 D、B、A

【答案解析】 本题考查缓释、控释制剂常用的辅料和作用。骨架片包括亲水凝胶型骨架片、不溶性骨架片、生物溶蚀性骨架片。亲水性凝胶骨架材料常用羧甲基纤维素钠、甲基纤维素、羟丙甲纤维素、羟丙基纤维素、聚维酮等；不溶性骨架材料如常用乙基纤维素、聚乙烯、无毒聚氯乙烯、硅橡胶等；生物溶蚀性骨架材料常用动物脂肪、蜂蜡、巴西棕榈蜡、氢化植物油、硬脂醇、硬脂酸、单硬脂

酸甘油酯等。大豆磷脂和胆固醇是脂质体形成不可缺的辅料。故本题答案应选择 DBA。

[60~63]

【正确答案】 A、B、C、D

【答案解析】 胃排空速率快对药物吸收可能产生的影响：①主要在胃吸收的药物吸收会减少，例如水杨酸盐；②主要在肠道吸收的药物吸收会加快或增多，如阿司匹林、地西洋、左旋多巴等；③在胃内易破坏的药物破坏减少，吸收增加，如红霉素、左旋多巴；④作用点在胃的药物，作用时间会缩短，疗效可能下降，如氢氧化铝凝胶、三硅酸镁、胃蛋白酶、硫糖铝等；⑤需要胃内溶解的药物和某些难以溶解的药物吸收会减少，例如螺内酯、氢氯噻嗪等。

[64~67]

【正确答案】 C、B、D、E

【答案解析】 半数有效量 (ED_{50}) 是指引起 50% 阳性反应 (质反应) 或 50% 最大效应 (量反应) 的浓度或剂量。

效能是指在一定范围内，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。

效价强度用于作用性质相同的药物之间的等效剂量的比较，是指能引起等效反应的相对剂量或浓度。

最小有效浓度是指引起药物效应的最低药物浓度，亦称阈浓度。

[68~71]

【正确答案】 B、E、D、C

【答案解析】 以药物 LD_{50} 与 ED_{50} 的比值表示药物的安全性，称为治疗指数，此数值越大越安全。较好的药物安全指标是 LD_5 与 ED_{95} 或 LD_1 与 ED_{99} 之间的距离，称为药物安全范围，其值越大越安全。 ED_{50} 是半数有效量， LD_{50} 是半数致死量。

[72~75]

【正确答案】 E、A、B、D

【答案解析】 此题考查的是药动学的一般概念，注意区别掌握。单室模型药物在体内各组织器官中迅速分布并迅速达到动态分布平衡。药物随胆汁进入小肠后

被小肠重新吸收的现象是肠肝循环。主药到达体循环的相对数量和相对速度是生物利用度。体内药量 X 与血药浓度 C 的比值是表观分布容积。药物在体内衰减一半所用的时间是半衰期。

[76~79]

【正确答案】 A、E、D、B

【答案解析】 评价指标“稳态血药浓度”的英文缩写为 C_{ss} 。

评价指标“药时曲线下面积”英文为 area under the curve, 简称 AUC。

评价指标“清除率”的英文为 clear, 简写为 Cl。

[80~83]

【正确答案】 A、C、D、E

【答案解析】 肌酐清除率是判断肾小球滤过功能的指标。肾功能正常的成年男性肌酐清除率为 100~120ml/min, 轻度肾功能减退者为 50~80ml/min, 中度肾功能减退者肌酐清除率可降至 10~50 ml/min, 严重肾功能减退者

[84~86]

【正确答案】 A、C、E

【答案解析】 《美国药典》, 英文缩写为 USP-NF。目前 USP-NF 每年发行 1 版, 最新版本为 USP (39) -NF (34), 于 2016 年 5 月 1 日生效。

《欧洲药典》目前出版周期为 3 年, 每年发行 3 个增补本。

《中国药典》每 5 年出版 1 版, 《中国药典》的版次以出版的年份表示。

[87~90]

【正确答案】 A、E、B、D

【答案解析】 本题考查储存条件的温度和区别。阴凉处系指不超过 20℃; 凉暗处系指避光并不超过 20℃; 冷处系指 2~10℃; 常温系指 10~30℃。除另有规定外, 贮藏项下未规定贮藏温度的一般系指常温。

[91~93]

【正确答案】 A、E、D

【答案解析】 哌拉西林为氨苄西林的衍生物, 在 α -氨基上引入极性较大的基团后, 改变其抗菌谱, 具有抗假单胞菌活性。

β -内酰胺酶抑制剂：

①氧青霉素类：克拉维酸

②青霉素类：舒巴坦

[94~97]

94. 【正确答案】 B

【答案解析】 头孢克洛——是头孢氨苄的 C-3 位以卤素替代甲基得到的。由于氯原子的亲脂性比甲基强，口服吸收优于氨苄西林。

95. 【正确答案】 E

【答案解析】 头孢曲松——C-3 位上引入酸性较强的杂环（1, 2, 4-三嗪-5, 6-二酮），可广泛分布全身组织和体液，可以通过脑膜，在脑脊液中达到治疗浓度。

96. 【正确答案】 D

【答案解析】 硫酸头孢匹罗——为 C-3 位甲基上引入含有正电荷季铵基团的药物，能迅速穿透细菌的细胞壁，与细菌细胞 1 个或多个青霉素结合蛋白（PBPs）结合，发挥作用。

97. 【正确答案】 C

【答案解析】 头孢呋辛含有氨基甲酸酯基团。

[98~100]

98. 【正确答案】 A

【答案解析】 药名提示结构，结构中含有苯的是苯巴比妥。

99. 【正确答案】 D

【答案解析】 结构中含有异丙烯基的是司可巴比妥。

100. 【正确答案】 E

【答案解析】 药名提示结构，结构中含有 S 的是硫喷妥钠。

三、综合分析选择题

[101~102]

101. 【正确答案】 B

【答案解析】 氨苄西林的化学名称为 6-[D-(-)-2-氨基-苯乙酰氨基]青霉素，其它选项均不符合要求。

102. 【正确答案】 A

【答案解析】 从化学名称上就可以推测出该药物为 β -内酰胺类抗生素，所以其母核结构为 β -内酰胺环。

[103~104]

103. 【正确答案】 B

【答案解析】 第 I 相生物转化，也称为药物的官能团化反应，是体内的酶对药物分子进行的氧化、还原、水解、羟基化等反应，在药物分子中引入或使药物分子暴露出极性基团，如羟基、羧基、巯基、氨基等。

104. 【正确答案】 D

【答案解析】 第 II 相生物结合，是将第 I 相中药物产生的极性基团与体内的内源性成分，如葡萄糖醛酸、硫酸、甘氨酸或谷胱甘肽，经共价键结合，生成极性大、易溶于水和易排出体外的结合物。

[105~107]

105. 【正确答案】 B

【答案解析】 胃蛋白酶为主药，单糖浆、橙皮酊为矫味剂，5%羟苯乙酯为防腐剂，稀盐酸为 pH 调节剂，纯化水为溶剂。

106. 【正确答案】 B

【答案解析】 胃蛋白酶为主药，单糖浆、橙皮酊为矫味剂，5%羟苯乙酯为防腐剂，稀盐酸为 pH 调节剂，纯化水为溶剂。

107. 【正确答案】 C

【答案解析】 本品一般不宜过滤，因为胃蛋白酶带正电荷，而润湿的滤纸或棉花带负电荷，过滤时易吸附胃蛋白酶。

[108~110]

108. 【正确答案】 D

【答案解析】 沉降硫、硫酸锌、氯霉素、樟脑酯为主药，甘油为润湿剂，PVA 为成膜材料，乙醇、蒸馏水为溶剂。

109. 【正确答案】 B

【答案解析】 沉降硫、硫酸锌、氯霉素、樟脑酯为主药，甘油为润湿剂，PVA 为成膜材料，乙醇、蒸馏水为溶剂。

110. 【正确答案】 A

【答案解析】 涂膜剂属于液体剂型，该药品是外用液体制剂。

四、多项选择题

111. 【正确答案】 ABC

【答案解析】 药物名称包括药物的通用名、化学名和商品名。

112. 【正确答案】 ABCDE

【答案解析】 生物技术药物包括细胞因子、重组蛋白质药物、抗体、疫苗和寡核苷酸药物等。

113. 【正确答案】 BCE

【答案解析】 影响药物制剂降解的因素

处方因素：pH 值、广义酸碱催化、溶剂、离子强度、表面活性剂、辅料

环境因素：温度、光线、空气(氧)、金属离子、湿度和水分、包装材料。

114. 【正确答案】 ABDE

【答案解析】 水杨酸盐与碱性药物配伍变色属于化学的配伍变化。

115. 【正确答案】 ABCDE

【答案解析】 非共价键键合是可逆的结合形式，其键合的形式有：范德华力、氢键、疏水键、静电引力、电荷转移复合物、偶极相互作用力等。

116. 【正确答案】 BC

【答案解析】 乙酰化反应是含伯氨基（包括脂肪胺和芳香胺）、氨基酸、磺酰胺、肼和酰肼等基团药物或代谢物的一条重要的代谢途径。布洛芬和氯贝丁酯结构中不含有这些基团，所以不能发生乙酰化反应。

117. 【正确答案】 ABCD

【答案解析】 E 是胃溶型包衣材料。

118. 【正确答案】 ABCDE

【答案解析】 依据胶囊剂的溶解与释放特性，可分为硬胶囊(通称为胶囊)、软胶囊(胶丸)、缓释胶囊、控释胶囊和肠溶胶囊，主要供口服用。

119. 【正确答案】 ABCD

【答案解析】 氢氧化钙、氢氧化锌、硬脂酸镁等，能被油更多润湿，可用于制备 W/O 型乳剂。

120. 【正确答案】 ABDE

【答案解析】 胶囊型、泡囊型吸入粉雾剂应标明：①每粒胶囊或泡囊中药物含量；②胶囊应置于吸入装置中吸入，而非吞服；③有效期；④贮藏条件。

