

《药专业知识一》

模考试卷

医学教育网 著

《药学专业知识一》模考试卷

一、最佳选择题

1.下列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.高酸度试验
- D.长期试验
- E.高温试验

2.分子中含有酚羟基，化学性质不稳定，在光照下即能被空气氧化变质的是

- A.肾上腺素
- B.维生素 A
- C.盐酸普鲁卡因
- D.维生素 B₂
- E.维生素 C

3.下列关于《中国药典》对药品质量标准中检查的说法错误的是

- A.包括安全性、有效性、均一性和纯度检查
- B.溶出度属于有效性检查
- C.细菌内毒素属于安全性检查
- D.重量差异属于均一性检查
- E.药品生产中引入的砷盐属于特殊杂质

4.氨茶碱粉末易结块，在空气中会吸收二氧化碳，并分解成茶碱。根据氨茶碱的性状，其贮存的条件应满足

- A.遮光, 密闭, 常温保存
- B.遮光, 密封, 常温保存
- C.遮光, 密闭, 阴凉处保存
- D.遮光, 严封, 阴凉处保存
- E.遮光, 熔封, 冷处保存
- 5.临床上常用来进行治疗药物血药浓度监测的生物样品是
- A.全血
- B.血浆
- C.唾液
- D.尿液
- E.粪便
- 6.利多卡因在体内代谢发生的第 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
- 7.喹诺酮类抗菌药物的关键药效基团为
- A.3 位羧基, 4 位羰基
- B.3 位酮基, 4 位羧基
- C.4 位酮基, 6 位氟原子
- D.4 位氟原子, 6 位酮基

E.3 位羧基, 4 位氟原子

8.关于氯吡格雷的说法, 错误的是

A.为血小板二磷酸腺苷受体阻断药

B.有一个手性碳原子, 为 S-构型

C.为非前药, 口服后经 CYP450 酶系转化, 再经水解形成噻吩环开环的活性代谢物

D.经肝代谢, 主要代谢产物是其羧酸盐衍生物

E.临床主要用于预防缺血性脑卒中、心肌梗死及外周血管病

9.为了克服苯海拉明的嗜睡和中枢抑制作用, 苯海拉明与 8-氯茶碱结合而成的盐为

A.氯马斯汀

B.茶苯海明

C.氯苯那敏

D.特非那定

E.西替利嗪

10.又称为新诺明 (SMZ) 的抗菌药是

A.甲氧苄啶

B.磺胺嘧啶

C.磺胺

D.磺胺米隆

E.磺胺甲噁唑

11.短叶红豆杉的树皮中提取得到的一个具有紫杉烯环的二萜类化合物, 属于有丝分裂抑制剂或纺锤体毒素的抗肿瘤药是

A.紫杉醇

B.多西他赛

C.依托泊苷

D.羟喜树碱

E.长春新碱

12.在液体制剂中，薄荷挥发油属于

A.增溶剂

B.防腐剂

C.矫味剂

D.等渗调节剂

E.潜溶剂

13.关于口服乳剂的临床使用与注意事项，说法错误的是

A.口服乳剂生物利用度较高

B.O/W 型乳剂中的油相有很大的表面积，能提高油相中药物在胃肠道中的分配速度，有利于药物的溶解吸收

C.乳剂中含有的乳化剂，可以改变胃肠道黏膜的性能，亦可促进药物的吸收

D.乳剂可直接使用，无须摇匀

E.乳剂应放在低温避光的环境中保存

14.在口服混悬剂中加入适量的电解质，其作用为

A.使渗透压适当增加，起到等渗调节剂的作用

B.使电位适当降低，起到絮凝剂的作用

C.使黏度适当增加，起到助悬剂的作用

D.使 pH 适当增加，起到 pH 调节剂的作用

E.可络合金属离子，起到金属离子络合剂的作用

15.下列辅料中，可作为肠溶型包衣辅料的是

A.HPMCP

B.HPC

C.HPMC

D.聚乙烯缩乙醛二乙氨乙酸 (AEA)

E.聚乙烯吡咯烷酮 (PVP)

16.下列有关注射剂特点的叙述，哪项是错误的

A.注射剂均为澄明液体，必须热压灭菌

B.适用于不宜口服的药物

C.适用于不能口服药物的病人

D.疗效确切可靠，起效迅速

E.产生局部定位及靶向给药作用

17.最好选择哪种气体驱赶维生素 C 注射液中的氧气

A.环氧乙烷气

B.氮气

C.二氧化碳

D.氢气

E.氯气

18.关于注射用细胞色素 C 无菌冻干制剂的处方，说法错误的是

A.葡萄糖为填充剂

B.亚硫酸氢钠为增塑剂

C.氢氧化钠为 pH 调节剂

D.本品为细胞呼吸激活剂

E.亚硫酸钠为抗氧化剂

19.地西洋注射液与 5%葡萄糖注射液配伍时，易析出沉淀，其原因是

A.反应时间

B.盐析作用

C.离子作用

D.pH 的改变

E.溶剂组成改变

20.微球具有靶向性和缓释性的特点，但载药量较小，下列药物不宜制成微球的是

A.米诺环素

B.亮丙瑞林

C.地塞米松

D.生长激素

E.二甲双胍

21.下列有关滴眼剂的表述，正确的是

A.滴眼剂不得含有铜绿假单胞菌和金黄色葡萄球菌

B.滴眼剂通常要求进行热原检查

C.滴眼剂不得加尼泊金、三氯叔丁醇之类抑菌剂

D.黏度可适当减小，使药物在眼内停留时间延长

E.药物只能通过角膜吸收

22.吲哚美辛软膏的处方：吲哚美辛 10.0g、交联型聚丙烯酸钠（SDB-L400）10.0g、

PEG4000 80.0g、甘油 100.0g、苯扎溴铵 10.0ml、蒸馏水加至 1000g。处方中 PEG4000

是作为

- A.润湿剂
- B.水性凝胶基质
- C.透皮吸收促进剂
- D.保湿剂
- E.防腐剂

23.皮肤疾病急性期无渗液时，可使用

- A.洗剂或粉雾剂，有安抚、冷却、止痒及蒸发作用
- B.糊剂，增加局部的温度
- C.软膏剂，因为可阻滞水分蒸发
- D.溶液湿敷促使其炎症消退
- E.酊剂，既能保护滋润皮肤，还能软化附着物

24.不作为栓剂质量检查的项目是

- A.熔点范围测定
- B.融变时限测定
- C.重量差异测定
- D.稠度检查
- E.药物溶出速度与吸收实验

25.用作栓剂水溶性基质的是

- A.混合脂肪酸甘油酯
- B.椰油酯

C.泊洛沙姆

D.棕榈酸酯

E.可可豆脂

26.细胞外的 K^+ 及细胞内的 Na^+ 可通过 Na^+, K^+ -ATP 酶逆浓度差跨膜转运, 这种过程称为

A.膜动转运

B.简单扩散

C.主动转运

D.滤过

E.易化扩散

27.维生素 B_2 在小肠上段的吸收属于

A.滤过

B.简单扩散

C.主动转运

D.易化扩散

E.膜动转运

28.大多数药物穿过生物膜的扩散速度

A.与药物的解离常数无关

B.与吸收部位浓度差成正比

C.取决于载体的作用

D.取决于给药途径

E.与药物的脂溶性无关

29.注射剂中药物释放速率最快的是

A.水溶液

B.油溶液

C.O/W 型乳剂

D.W/O 型乳剂

E.油混悬液

30.治疗药物监测 (TDM) 的临床意义不包括

A.指导临床合理用药

B.改变药物疗效

C.确定合并用药的原则

D.药物过量中毒的诊断

E.作为医疗差错或事故的鉴定依据

31.影响胃排空速率的因素不包括

A.食物

B.胃内容物的黏度、渗透压

C.循环系统转运

D.饮水量

E.药物

32.某些患者在应用治疗量的华法林抗凝时，会出现药效很不明显的情况，其用药剂量常需高达正常量的 20 倍方可见抗凝作用。下列描述正确的是

A.这些患者对华法林的代谢过快

B.这些患者对华法林的吸收过慢

C.这些患者是乙醛脱氢酶缺乏者

- D.这些患者对华法林的生物转化异常
- E.这些患者体内华法林与其靶点结合的能力低
- 33.对于乙酰化代谢者，下列说法中，错误的是
- A.应用胍苯哒嗪后，快代谢者易发生肝脏毒性
- B.应用普鲁卡因胺后，快代谢者可引起红斑狼疮
- C.应用异烟肼后，慢代谢者可引起多发性神经炎
- D.应用苯乙肼后，慢代谢者可引起镇静和恶心
- E.应用胍苯哒嗪后，慢代谢者可引起红斑狼疮
- 34.某结肠癌患者，基因检测为 KRAS 突变类型，FDA 和 CFDA 均批准应用过的药物是
- A.吉非替尼
- B.厄洛替尼
- C.曲妥珠单抗
- D.阿法替尼
- E.西妥昔单抗
- 35.质反应的特点是
- A.药理效应的强弱呈现量的变化
- B.可用数或百分率表示
- C.研究对象为单一生物个体
- D.药理效应性质的变化
- E.如血压、心率、血糖等的变化
- 36.表示药物安全性的治疗指数是
- A.毒-效曲线斜率

B.引起药理效应的阈浓度

C.量-效曲线斜率

D.LD₅₀与ED₅₀的比值

E.LD₅与ED₉₅之间的距离

37.关于用药与药物毒性，以下说法错误的是

A.药物的安全范围越小，越容易出现毒性作用

B.药物的毒性与剂量大小无关

C.治疗量与中毒量接近的药物，更易出现毒性作用

D.生物利用度高的药物相比于低的药物，更易出现毒性作用

E.同一药物注射给药相比于口服，更易出现毒性作用

38.阿米洛利利尿作用是通过

A.影响免疫功能

B.影响生理活性物质及其转运体

C.改变细胞周围环境的理化性质

D.影响酶的活性

E.影响细胞膜离子通道

39.丙磺舒用于痛风的作用机制

A.干扰核酸代谢

B.改变细胞周围环境的理化性质

C.补充体内物质

D.影响生理活性物质及其转运体

E.影响机体免疫功能

40.因药物作用选择性低，依照治疗目的不同，可以和药理效应转换的不良反应是

- A.后遗效应
- B.变态反应
- C.继发性反应
- D.特异质反应
- E.副作用

二、配伍选择题

- 1.A.异构化
- B.水解
- C.聚合
- D.脱羧
- E.氧化

- (1) 对氨基水杨酸钠转化为间氨基酚，发生的反应为
- (2) 阿糖胞苷在酸性溶液中转化成阿糖尿苷，发生的反应为
- (3) 维生素 A 转化为 2,6 位顺式异构体，发生的反应为
- (4) 维生素 C 转化为去氢抗坏血酸，发生的反应为
- (5) 塞替派在水溶液中失效，是因为发生了

- 2.A.环磷酰胺
- B.罗红霉素
- C.阿司咪唑
- D.罗非昔布
- E.地尔硫 (苻卓)

- (1) 因干扰心肌细胞 K^+ 通道，引发致死性尖端扭转型室性心动过速的药物是
- (2) 与非治疗部位靶标结合产生副作用的药物是
- (3) 与非治疗靶标结合产生副作用的药物是
- (4) 含有毒性基团的药物是

3.A.氯胺酮

B.氯苯那敏

C.丙氧酚

D.普罗帕酮

E.氨己烯酸

- (1) 对映异构体之间，具有等同的药理活性，但强弱不同的药物是
- (2) 对映异构体之间，一个有活性，另一个没活性的药物是
- (3) 对映异构体之间，具有等同的药理活性和强度的药物是
- (4) 对映异构体之间，产生不同类型生理活性的药物是
- (5) 对映异构体之间，一个有活性，另一个有毒性的药物是

4.A.取决于药物渗透率

B.取决于溶解度

C.取决于溶出度

D.取决于酸碱度

E.难吸收

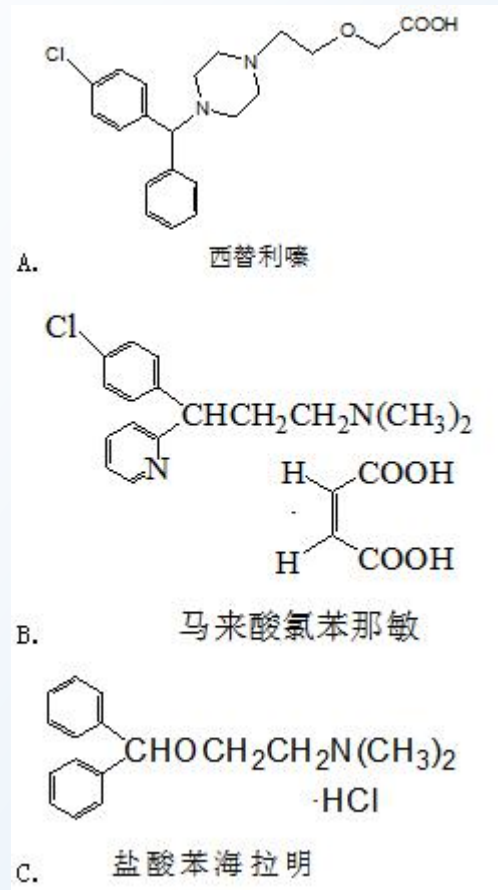
生物药剂学分类系统，根据溶解度和渗透性的不同组合，将药物分为四类

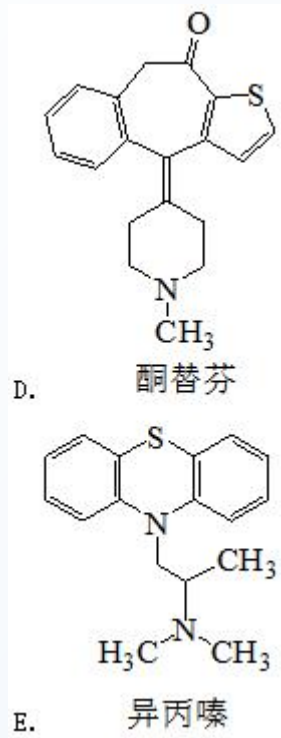
- (1) 雷尼替丁属于第Ⅲ类，在体内吸收的特点是
- (2) 双氯芬酸属于第Ⅱ类，在体内吸收的特点是

(3) 呋塞米属于第IV类，在体内吸收的特点是

(4) 普萘洛尔属于第I类，在体内吸收的特点是

5.





(1) 最早发现的吩噻嗪结构的三环类抗组胺药，能竞争性阻断组胺 H₁ 受体而产生抗组胺作用

(2) 丙胺类，作用持久，对中枢抑制较弱，嗜睡副作用小，适用于日间服用，治疗荨麻疹、过敏性鼻炎、结膜炎等，该药物是

6.A.卡莫司汀

B.卡铂

C.巯嘌呤

D.亚叶酸钙

E.甲氨蝶呤

(1) 为二氢叶酸还原酶的抑制剂，阻断二氢叶酸转变为四氢叶酸的抗肿瘤药是

(2) 属于第二代铂配合物的抗肿瘤药是

(3) 含有β-氯乙基亚硝基脲结构的抗肿瘤药是

7.A.雷尼替丁

B.西咪替丁

C.罗沙替丁乙酸酯

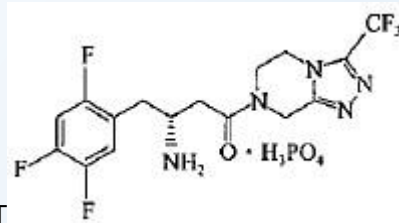
D.兰索拉唑

E.艾司奥美拉唑

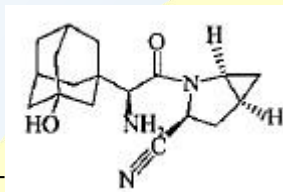
(1) 为奥美拉唑的 S-异构体，是第一个上市的光学活性质子泵抑制剂是

(2) 结构中含有含氧四原子链的 H₂受体拮抗剂为

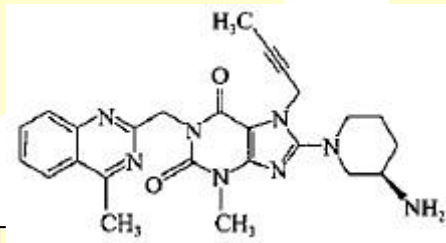
(3) 结构中含有咪唑环的 H₂受体拮抗剂为



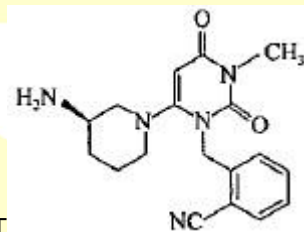
8.A.磷酸西格列汀



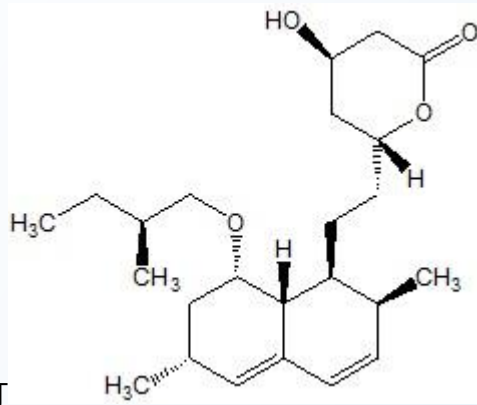
B.沙格列汀



C.利格列汀



D.阿格列汀



E.洛伐他汀

- (1) 含有黄嘌呤结构的二肽基肽酶-4 抑制药是
- (2) 含有羟基金刚烷的氨基酰胺结构的二肽基肽酶-4 抑制药是
- (3) 含有嘧啶二酮结构的二肽基肽酶-4 抑制药是

9.A.矫味剂

B.遮光剂

C.防腐剂

D.增塑剂

E.致孔剂

- (1) 在包制薄膜衣的过程中，加入的邻苯二甲酸酯是
- (2) 在包制薄膜衣的过程中，加入的二氧化钛是
- (3) 在包制薄膜衣的过程中，加入的表面活性剂是

10.A.渗透压调节剂

B.增溶剂

C.抑菌剂

D.抗氧化剂

E.缓冲剂

- (1) 注射剂的处方中，枸橼酸、枸橼酸钠的作用是

(2) 注射剂的处方中，焦亚硫酸钠的作用是

(3) 注射剂的处方中，甘油的作用是

11.A.稳定剂

B.渗透压调节剂

C.助悬剂

D.螯合剂

E.pH 调节剂

罗替戈汀长效混悬型注射剂处方组成：罗替戈汀、吐温 20、PEG4000、磷酸二氢钠、甘露醇、柠檬酸、注射用水。

(1) 在处方组成中，磷酸二氢钠是作为

(2) 在处方组成中，PEG4000 是作为

(3) 在处方组成中，吐温 20 是作为

(4) 在处方组成中，柠檬酸是作为

(5) 在处方组成中，甘露醇是作为

12.A.凡士林

B.十二烷基硫酸钠

C.甘油

D.羟苯乙酯

E.硼酸

(1) 软膏剂中常用的油脂性基质是

(2) 可与纤维素衍生物类等构成水性凝胶基质的是

(3) 乳膏剂中常用的防腐剂是

(4) 乳膏剂中常用的 O/W 型乳化剂是

13.A. K_m, V_m

B. MRT

C. k_a

D. Cl

E. β

在不同药物动力学模型中，计算血药浓度与时间关系会涉及不同参数

(1) 双室模型中，慢配置速度常数是

(2) 非房室分析中，平均滞留时间是

14.A. 脂溶性

B. 制剂包衣

C. 多晶型

D. 胃肠道运动

E. 药物稳定性

(1) 影响药物吸收的生理因素

(2) 影响药物的脂水分配系数的因素

(3) 影响药物吸收的剂型与制剂因素

15.A. 血浆蛋白结合率

B. 血-脑屏障

C. 肠-肝循环

D. 淋巴循环

E. 胎盘屏障

- (1) 母体与胎儿间的体内物质和药物交换起着十分重要的作用是
- (2) 影响脂肪、蛋白质等大分子物质转运，使药物避免肝脏首关效应而影响药物分布因素是
- (3) 决定药物游离型和结合型浓度比例，可影响药物分布也能影响药物代谢和排泄的因素是
- (4) 对外来物质有选择摄取的能力，以致许多中枢神经系统疾病都得不到良好的治疗，是由于

16.A.遗传因素

B.病理状态

C.种族差异

D.年龄

E.药物的结构和理化性质

- (1) 快代谢人群服用异烟肼易出现肝毒性，而慢代谢者易出现周围神经炎，属于
- (2) 加入卤素后可使药物更易与酶系统结合而增加毒性，属于
- (3) G-6-PD 缺乏者应用伯氨喹啉、磺胺药、氨苯砞等药物易发生溶血反应，属于
- (4) 新生儿应用氯霉素可导致灰婴综合征，属于

17.A.肺纤维化

B.肺水肿

C.哮喘

D.呼吸抑制

E.肺脂质沉积

- (1) 筒箭毒碱类药物可引起

(2) 卡托普利可引起

(3) 胺碘酮可引起

三、综合分析选择题

1.患者，男，60岁。因骨折手术后需要使用镇痛药解除疼痛，医生建议使用羟考酮。查询羟考酮说明书和相关药理学资料：羟考酮为阿片受体纯激动剂，药理作用及作用机制与吗啡相似，主要通过激动中枢神经系统内的阿片受体而起镇痛作用，镇痛效力中等。本药也可通过直接作用于延髓的咳嗽中枢而起镇咳作用，还具有抗焦虑、镇静作用。此外，羟考酮的控释片具有双相吸收模式，主要经过肝 CYP3A 家族和 CYP2D6 代谢。

(1) 下列有关羟考酮的说法错误的是

- A.口服生物利用度为 60% ~ 87%
- B.无极量限制，镇痛作用无封顶效应
- C.根据背景资料，羟考酮具有镇咳、镇痛、抗焦虑和镇静作用
- D.在调整体重的基础上，女性血浆羟考酮平均浓度比男性高 25%
- E.羟考酮控释片具有双相吸收模式，增加了患者的服药次数，不利于疼痛的控制

(2) 羟考酮经 CYP2D6 代谢生成羟吗啡酮后经肾排泄，其代谢途径为

- A.O-脱甲基
- B.N-脱甲基
- C.乙酰化
- D.苯环羟基化
- E.环己烷羟基化

2.有一癌症晚期患者，近日疼痛难忍，使用中等程度的镇痛药无效，为了减轻或消除患者的痛苦更换药物治疗。

(1) 根据病情，可选用的治疗药物是

- A.地塞米松
- B.曲马多
- C.美沙酮
- D.对乙酰氨基酚
- E.可待因

(2) 上题选用的治疗药物属于

- A.孕甾烷
- B.天然生物碱类似物
- C.合成镇痛药
- D.水杨酸类药物
- E.苯胺类药物

(3) 该药还可用于

- A.解救吗啡中毒
- B.海洛因依赖脱毒和替代维持治疗
- C.抗炎
- D.镇咳
- E.治疗感冒发烧

3.患者在使用盐酸异丙肾上腺素气雾剂时，对气雾剂阀门揿压与吸入协调性不足，阀门的揿压与吸气不同步，结果药物大部分停留在咽喉部。

(1) 基于上述情况，下列说法中不正确的是

- A.药物粒子到达的部位不影响疗效

B.使用喷雾给药时，患者的呼吸量、给药频率和药物类型与气雾剂粒子到达呼吸道的部位相

关

C.一般快而短的吸气使药物粒子停留在气管部位

D.细而长的吸气可使药物到达深部，如肺泡等

E.支气管扩张剂和皮质激素类药物治疗哮喘的药物，要求到达下呼吸道

(2) 有关气雾剂的叙述，正确的是

A.借助抛射剂的压力将内容物呈雾状物喷出

B.抛射剂仅使用氯氟烷烃类

C.借手动泵的压力或其他方法将内容物呈雾状物释出

D.用于呼吸系统局部性疾病

E.患者主动吸入雾化药物至肺部的制剂

(3) 盐酸异丙肾上腺素气雾剂，其粒径应该控制在

A.2~10 μ m

B.1~3 μ m

C.10~20 μ m

D.20~50 μ m

E.无需控制

4.临床上采用阿托品特异性阻断 M 胆碱受体，但对其心脏、血管、平滑肌、腺体及中枢神经功能都有影响，而且有的兴奋，有的抑制。

(1) 阿托品对心脏、血管、平滑肌、腺体及中枢神经功能都有影响的原因是

A.药物选择性低

B.给药剂量过大

- C.给药途径不当
- D.药物副作用太大
- E.患者对药物敏感性过高

(2) 药物作用的选择性取决于

- A.药物的剂量
- B.药物的脂溶性
- C.药物的水溶性
- D.药物的生物利用度
- E.药物与组织的亲和力及细胞对药物的反应性

四、多项选择题

1.影响药物制剂稳定性的外界因素有

- A.pH
- B.温度
- C.包装材料
- D.金属离子
- E.表面活性剂

2.下列属于药物代谢产物产生的毒副作用的特点的是

- A.一般与药理作用同时发生
- B.剂量-效应关系不明显
- C.产生的后果通常比副作用严重
- D.并非与药理作用同时发生，一般呈滞后效应
- E.剂量-效应关系明显，一般可以预测

3.通过阻滞钙离子通道发挥药理作用的药物是

- A.维拉帕米
- B.地尔硫（ ++ 卓）
- C.非洛地平
- D.胺碘酮
- E.普罗帕酮

4.血管紧张素 II 受体阻断药的药效结构有

- A.联苯结构
- B.酸性基团四氮唑或羧基
- C.缬氨酸片段
- D.咪唑环或视为咪唑环的开环衍生物
- E.螺环结构

5.具有磺酰脲结构的胰岛素分泌促进剂有

- A.格列本脲
- B.格列齐特
- C.瑞格列奈
- D.那格列奈
- E.格列喹酮

6.下列关于阿仑膦酸钠的服药方法的说法，正确的是

- A.患者应在清晨、空腹时服药
- B.患者应在早餐前至少 30min 服药
- C.应用足量的水（至少 200ml）整片吞服

- D.身体保持立位（站立或端坐）30~60min
- E.服药前后30min内不宜进食、饮用高钙浓度饮料及服用其他药物
- 7.下列不适合制成软胶囊的药物或物质是
- A.维生素E和维生素D
- B.含有5%水的中药提取物
- C.乙醇、乙酸乙酯、醋酸
- D.pH为8.0的液态药物
- E.药物的稀乙醇溶液
- 8.下述关于注射剂质量要求的表述，正确的有
- A.pH与血液的pH接近
- B.可见异物检查合格
- C.无色
- D.无热原
- E.无菌
- 9.下列说法中，与药物时-效关系不符的是
- A.时-效关系是指用药后随时间推移，由于体内药量的变化，药物效应随时间变化的过程
- B.时-量曲线和时-效曲线可以互相取代
- C.在前次给药的作用残留时间内进行再次给药不会产生蓄积
- D.药物的时-量曲线和时-效曲线的变化一致
- E.起效时间代表药物发生疗效以前的潜伏期
- 10.关于药物对心血管系统的毒性作用机制，叙述正确的有
- A.苯妥英钠主要通过阻滞心肌细胞膜 K^+ 通道发挥作用

- B.利多卡因主要通过阻滞心肌细胞膜 K^+ 通道发挥作用
- C.三环类抗抑郁药主要对 Na^+ 通道有阻滞作用
- D.胺碘酮主要阻断与复极化过程有关的 K^+ 通道
- E.维拉帕米主要通过阻滞 Ca^{2+} 通道发挥作用



答案部分

一、最佳选择题

1.【正确答案】C

【答案解析】药物稳定性试验方法包括：高温试验、高湿试验、强光照射试验、加速试验、长期试验。

2.【正确答案】A

【答案解析】易氧化的药物有酚类、烯醇类、芳胺类、吡唑酮类、噻嗪类、碳碳双键类等，选项中只有A含有酚羟基，属于酚类药物。

3.【正确答案】E

【答案解析】砷盐属于一般杂质。

4.【正确答案】B

【答案解析】除另有规定外，贮存项下未规定贮存温度的一般系指常温，氨茶碱易结块，应密封防止风化、吸潮、挥发或异物进入。

5.【正确答案】B

【答案解析】血浆是治疗药物血药浓度监测常用的生物样品。

6.【正确答案】B

【答案解析】在胺类药物的氧化代谢中，胺类化合物N-脱烷基化的基团通常是甲基、乙基、丙基、异丁基等。利多卡因第一次脱掉一个乙基，第二次脱掉另一个乙基，因此是N-脱烷基化。

7.【正确答案】A

【答案解析】喹诺酮类抗菌药物的关键药效基团为3位羧基，4位羰基。

8.【正确答案】C

【答案解析】氯吡格雷体外无活性，为前药，口服后经 CYP450 酶系转化，再经水解形成噻吩环开环的活性代谢物。

9.【正确答案】B

【答案解析】茶苯海明为苯海拉明与具有中枢兴奋作用的 8-氯茶碱结合而成的盐，克服了苯海拉明的嗜睡和中枢抑制作用。

10.【正确答案】E

【答案解析】磺胺甲噁唑又名新诺明、磺胺甲基异噁唑 (SMZ)。

11.【正确答案】A

【答案解析】短叶红豆杉的树皮中提取得到的一个具有紫杉烯环的二萜类化合物是紫杉醇，是有丝分裂抑制剂或纺锤体毒素，临床用于乳腺癌治疗。

12.【正确答案】C

【答案解析】薄荷挥发油属于矫味剂中的芳香剂。

13.【正确答案】D

【答案解析】口服乳剂服用前需要摇匀，不可仅服上清液，保证每次服用的有效药物相当。

14.【正确答案】B

【答案解析】制备混悬剂时加入适量的电解质可使混悬液中微粒电位降低到一定程度，使得微粒间吸引力稍大于排斥力，从而形成疏松的絮状聚集体，经振摇又可重新分散均匀，所加入的电解质称为絮凝剂。

15.【正确答案】A

【答案解析】羟丙甲纤维素酞酸酯 (HPMCP) 可作为肠溶型包衣材料。

16.【正确答案】A

【答案解析】本题考查的是注射剂的特点。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。

17. 【正确答案】 C

【答案解析】维生素 C 注射液为酸性溶液，在酸性溶剂中稳定，加入二氧化碳后，二氧化碳可以与水生成碳酸，使维生素 C 更稳定。且维生素 C 注射液中抗氧化剂碳酸氢钠或碳酸钠与维生素 C 可生成二氧化碳。

18. 【正确答案】 B

【答案解析】在注射用细胞色素 C 无菌冻干制剂的处方，亚硫酸钠、亚硫酸氢钠为抗氧化剂。

19. 【正确答案】 E

【答案解析】地西洋注射液与 5%葡萄糖注射液配伍时，由于溶剂的改变使药物析出沉淀。

20. 【正确答案】 E

【答案解析】微球载药量有限，对用药量大的药物不易制成微球注射剂。二甲双胍用药量大故不宜制成微球注射剂。

21. 【正确答案】 A

【答案解析】滴眼剂不需要进行热原检查，眼用液体制剂属多剂量型，要保证在使用过程中始终保持无菌，可添加适当的抑菌剂。适当增大滴眼剂的黏度可延长药物在眼内的停留时间，从而增强药物作用。眼部给药主要有两条途径：角膜渗透和结膜渗透。

22. 【正确答案】 C

【答案解析】在吲哚美辛软膏处方中，PEG4000 用作透皮吸收促进剂。

23. 【正确答案】 A

【答案解析】皮肤疾病急性期表现为红斑丘疹、红肿和水疱为主，可伴有不同程度的水肿和渗出。无渗液时，用洗剂或粉雾剂，有安抚、冷却、止痒及蒸发作用，可改善皮肤的血液循环，消除患处的肿胀与炎症。不能使用糊剂及软膏剂，因为会阻滞水分蒸发，增加局部的温度，使皮疹加剧。

24. 【正确答案】 D

【答案解析】栓剂为固体制剂，无需稠度检查，只有半固体制剂需要进行。栓剂检查的项目为重量差异、融变时限、熔点范围的测定、药物溶出速率与吸收实验。

25. 【正确答案】 C

【答案解析】栓剂的水溶性基质包括：甘油明胶、聚乙二醇和泊洛沙姆。

26. 【正确答案】 C

【答案解析】一些生命必需物质（如 K^+ 、 Na^+ 、 I^- ，单糖、氨基酸、水溶性维生素）等通过主动转运吸收。

27. 【正确答案】 C

【答案解析】胆酸和维生素 B_2 的吸收属于主动转运，而且只在小肠上段进行。

28. 【正确答案】 B

【答案解析】大多数药物都是以简单扩散的方式通过生物膜进行转运的，扩散速度取决于膜两侧药物的浓度梯度、药物的脂水分配系数及药物在膜内的扩散速度。

29. 【正确答案】 A

【答案解析】各种注射剂中药物的释放速率按以下次序排列：水溶液 > 水混悬液 > 油溶液 > O/W 型乳剂 > W/O 型乳剂 > 油混悬液。

30. 【正确答案】 B

【答案解析】治疗药物监测，对于深入研究患者用药后药物的体内过程、明确血药浓度与临

床疗效的关系、提高药物疗效、保证临床用药的安全性和有效性等具有重要意义。其临床意义简单归纳如下：(1) 指导临床合理用药、提高治疗水平。(2) 确定合并用药的原则。临床上合并用药引起药源性疾病或导致药物中毒的报道不少，开展 TDM 研究药物的相互作用，对确定合并用药原则具有重要意义。(3) 用于药物过量中毒的诊断。开展 TDM 对防止药物过量中毒和药物急性过量中毒的诊断具有重要意义。(4) 作为医疗差错或事故的鉴定依据及评价患者用药依从性的手段。

31. 【正确答案】 C

【答案解析】循环系统转运和胃排空同样属于影响药物吸收的生理因素，但循环系统转运不影响胃排空。

32. 【正确答案】 E

【答案解析】某些个体在应用治疗量的华法林后表现出非常低的抗凝血活性，要产生期望的药理效应，剂量需高达正常量的 20 倍，这种低活性可能与遗传因素有关，是华法林和其受体相结合的亲和力降低所致，这属于遗传因素导致的患者之间药效学差异范畴。而吸收、代谢（生物转化）都属于药动学范畴。

33. 【正确答案】 B

【答案解析】乙酰化慢代谢者，在服用胍苯吡嗪和普鲁卡因胺时可引起红斑狼疮。

34. 【正确答案】 E

【答案解析】本题考查的是临床常用分子靶向抗肿瘤药物的基因检测。FDA 和 CFDA 均批准西妥昔单抗应用于 KRAS 突变类型的直肠癌患者。

35. 【正确答案】 D

【答案解析】质反应是指药理效应不是随着药物剂量或浓度的增减呈连续性量的变化，而为反应的性质变化，一般以阳性或阴性、全或无的方式表示。例如死亡与存活、惊厥与不惊厥，

睡眠与否等，研究对象为一个群体。

36.【正确答案】D

【答案解析】以药物半数致死量 (LD_{50}) 与半数有效量 (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。

37.【正确答案】B

【答案解析】药物在治疗量时，主要表现为治疗作用，当达到或超过最小中毒量时，就会引起毒性反应，且随剂量的增加而加强。安全范围小的药物，治疗剂量与中毒剂量非常接近，易出现毒性作用。口服剂量用于注射，则可能会导致毒性反应。药物的剂型和给药途径不同，起效速度和作用维持时间不同，产生的治疗作用和毒性作用强度不同。

38.【正确答案】E

【答案解析】阿米洛利利尿作用是通过阻滞肾小管 Na^+ 通道而利尿。

39.【正确答案】D

【答案解析】丙磺舒竞争性抑制肾小管对弱酸性代谢物的转运体，抑制原尿中尿酸再吸收，可用于痛风的治疗。

40.【正确答案】E

【答案解析】副作用是药物固有的药理作用所产生的，由于药物作用的选择性低，药理效应涉及多个器官，当某一效应用作为治疗目的时，其他效应就成为副作用。药物的副作用随用药目的的变化而变化，在一定条件下，依照用药目的不同，两者是可以互相转化的。

二、配伍选择题

1. (1)【正确答案】D

【答案解析】对氨基水杨酸钠在光、热、水分存在的条件下很易发生脱羧反应，生成间氨基酚。

(2)【正确答案】B

【答案解析】阿糖胞苷在酸性溶液中，脱氨水解为阿糖尿苷。

(3)【正确答案】A

【答案解析】维生素A除了易氧化外，还可能发生几何异构化，其活性形式是全反式，若转化为2,6位顺式异构体，其生理活性会降低。

(4)【正确答案】E

【答案解析】维生素C在有氧条件下可氧化成去氢抗坏血酸。

(5)【正确答案】C

【答案解析】塞替派在水溶液中易聚合失效，以聚乙二醇400为溶剂制成注射液可避免聚合。

2. (1)【正确答案】C

【答案解析】抗过敏药特非那定、阿司咪唑因干扰心肌细胞 K^+ 通道，引发致死性尖端扭转型室性心动过速，导致药源性心律失常。

(2)【正确答案】D

【答案解析】与非治疗部位靶标结合产生副作用的药物有氯丙嗪、奋乃静、罗非昔布、伐地昔布等。

(3)【正确答案】B

【答案解析】与非治疗靶标结合产生副作用的药物有普利类药物、红霉素类抗生素等。

(4)【正确答案】A

【答案解析】含有毒性基团的药物主要是一些抗肿瘤的化疗药物，尤其是抗肿瘤烷化剂，如氮芥类。

3. (1)【正确答案】B

(2) 【正确答案】 E

(3) 【正确答案】 D

(4) 【正确答案】 C

【答案解析】对映异构体之间具有等同的药理活性和强度，代表药物有：普罗帕酮、氟卡尼。
对映异构体之间具有等同的药理活性，但强弱不同，代表药物有氯苯那敏、萘普生。对映异构体之间一个有活性，另一个没活性，代表药物有：甲基多巴、氨己烯酸。对映异构体之间一个有活性，另一个有毒性，代表药物有：氯胺酮、乙胺丁醇。对映异构体之间产生不同类型生理活性，代表药物有：丙氧酚、奎尼丁。

(5) 【正确答案】 A

4. (1) 【正确答案】 A

【答案解析】第Ⅲ类为水溶性分子药物，其体内吸收取决于药物渗透率。

(2) 【正确答案】 B

【答案解析】第Ⅱ类为亲脂性分子药物，体内吸收取决于溶解度。

(3) 【正确答案】 E

【答案解析】第Ⅳ类属于疏水性分子药物，体内吸收比较困难。

(4) 【正确答案】 C

【答案解析】第Ⅰ类为两亲性分子药物，其体内吸收取决于溶出度。

5. (1) 【正确答案】 E

【答案解析】异丙嗪是最早发现的吩噻嗪结构的三环类抗组胺药，能竞争性阻断组胺 H₁ 受体而产生抗组胺作用，通过吩噻嗪结构可选出 E。

(2) 【正确答案】 B

【答案解析】马来酸氯苯那敏属于丙胺类组胺 H₁ 受体阻断剂。

6. (1) 【正确答案】 E

【答案解析】 甲氨蝶呤是二氢叶酸还原酶的抑制剂，阻断二氢叶酸转变为四氢叶酸。

(2) 【正确答案】 B

【答案解析】 卡铂是第二代铂配合物。

(3) 【正确答案】 A

【答案解析】 卡莫司汀分子中含有 β -氯乙基亚硝基脲结构。

7. (1) 【正确答案】 E

【答案解析】 奥美拉唑具有 S 和 R 两种光学异构体，(-) - (S) -异构体称为艾司奥美拉唑，是第一个上市的光学活性质子泵抑制药，在体内代谢慢，疗效和作用时间都优于奥美拉唑。

(2) 【正确答案】 C

【答案解析】 罗沙替丁乙酸酯是用哌啶甲苯代替五元碱性芳杂环，以含氧四原子链代替含硫四原子链。

(3) 【正确答案】 B

【答案解析】 西咪替丁由咪唑五元环、含硫醚的四原子链和末端取代胍三部分构成。

8. (1) 【正确答案】 C

【答案解析】 利格列汀分子中含有黄嘌呤环结构。

(2) 【正确答案】 B

【答案解析】 沙格列汀分子中含有羟基金刚烷的 α -氨基酰胺结构。

(3) 【正确答案】 D

【答案解析】 阿格列汀分子中含有嘧啶二酮结构。

9. (1) 【正确答案】 D

【答案解析】 在包制薄膜衣的过程中，加入的邻苯二甲酸酯是增塑剂。

(2)【正确答案】B

【答案解析】在包制薄膜衣的过程中，加入的二氧化钛是遮光剂。

(3)【正确答案】E

【答案解析】在包制薄膜衣的过程中，加入的表面活性剂是致孔剂。

10. (1)【正确答案】E

【答案解析】注射剂的处方中，甘油的作用是渗透压调节剂，焦亚硫酸钠的作用是抗氧化剂，枸橼酸、枸橼酸钠的作用是缓冲剂。

(2)【正确答案】D

(3)【正确答案】A

11. (1)【正确答案】E

(2)【正确答案】C

(3)【正确答案】A

(4)【正确答案】D

【答案解析】在罗替戈汀长效混悬型注射剂处方中，罗替戈汀为主药，吐温 20 为表面稳定剂，PEG4000 为助悬剂，磷酸二氢钠为 pH 调节剂，甘露醇为渗透压调节剂，柠檬酸为螯合剂。

(5)【正确答案】B

12. (1)【正确答案】A

【答案解析】软膏剂中常用的油脂性基质有凡士林、石蜡、液状石蜡、硅油、蜂蜡、硬脂酸、羊毛脂等。

(2)【正确答案】C

【答案解析】水性凝胶基质一般由水、甘油或丙二醇与纤维素衍生物、卡波姆和海藻酸盐、

西黄蓍胶、明胶、淀粉等构成。

(3) 【正确答案】 D

【答案解析】 对羟基苯甲酸酯类（羟苯乙酯）常用作防腐剂。

(4) 【正确答案】 B

【答案解析】 乳膏剂中常用的 O/W 型乳化剂有钠皂、三乙醇胺皂类、脂肪醇硫酸（酯）钠类（十二烷基硫酸钠）、聚山梨酯类等。

13. (1) 【正确答案】 E

【答案解析】 α 称为分布速度常数或快配置速度常数； β 称为消除速度常数或称为慢配置速度常数。

(2) 【正确答案】 B

【答案解析】 药物在体内的平均滞留时间（MRT）。

14. (1) 【正确答案】 D

【答案解析】 影响药物吸收的生理因素有胃肠液的成分和性质、胃肠道蠕动、循环系统转运、食物、胃肠道代谢作用、疾病因素。

(2) 【正确答案】 A

【答案解析】 药物的脂溶性和水溶性决定了药物的脂水分配系数。

(3) 【正确答案】 B

【答案解析】 制剂包衣是制剂处方对药物吸收的影响，属于制剂因素。

15. (1) 【正确答案】 E

【答案解析】 在母体循环系统与胎儿循环系统之间存在着胎盘屏障。胎盘屏障对母体与胎儿间的体内物质和药物交换起着十分重要的作用。

(2) 【正确答案】 D

【答案解析】淋巴循环可使药物不通过肝脏从而避免首过效应；脂肪和蛋白质等大分子物质转运依赖淋巴系统；传染病、炎症、癌转移等使淋巴系统成为靶组织时，药物需向淋巴系统转运。

(3) 【正确答案】 A

【答案解析】药物与血浆蛋白结合的能力：血液中的药物一部分呈非结合的游离型存在，一部分与血浆蛋白成为结合型药物。药物的疗效取决于其游离型浓度。药物的蛋白结合不仅影响药物的体内分布，也影响药物的代谢和排泄。

(4) 【正确答案】 B

【答案解析】血-脑屏障（BBB）是血液与脑组织之间存在屏障，脑组织对外来物质有选择地摄取的能力。血-脑屏障的作用在于保护中枢神经系统，使其具有稳定的化学环境。

16. (1) 【正确答案】 A

【答案解析】药物代谢酶的遗传多态性可导致药物代谢异常。如异烟肼在不同人群体内的乙酰化代谢呈多态性，快代谢型人群可快速使药物灭活，易出现肝毒性；慢代谢型人群使药物灭活缓慢，易出现周围神经炎。

(2) 【正确答案】 E

【答案解析】同一类药物结构不同，毒性作用不同。如在药物结构中增加卤素会使分子的极化程度增加，更易与酶系统结合使毒性增加。如甲烷无致癌作用，而碘甲烷、溴甲烷均有致癌作用。

(3) 【正确答案】 A

【答案解析】一些遗传缺陷或遗传病与药物毒性作用易感性密切相关，如 G-6-PD 缺乏者应用伯氨喹啉、磺胺药、氨苯砞等药物易发生溶血反应。

(4) 【正确答案】 D

【答案解析】新生儿肝葡萄糖醛酸结合能力尚未发育，应用氯霉素可导致灰婴综合征，属于年龄因素。

17. (1) 【正确答案】 D

【答案解析】筒箭毒碱类药物可阻断膈神经支配的呼吸肌神经肌肉接头的 N_M 受体，引起呼吸肌麻痹，导致呼吸抑制。

(2) 【正确答案】 B

【答案解析】可引起肺水肿的药物包括镇痛药（美沙酮、可待因等）、镇静催眠药（地西洋）、降压药与利尿药（卡托普利、肼屈嗪等）、钙通道阻滞药（硝苯地平等）、抗肿瘤药（甲氨蝶呤、多柔比星、丝裂霉素等）等。

(3) 【正确答案】 A

【答案解析】延长动作电位时程类抗心律失常药胺碘酮，长期应用约有 10% 的患者发生肺纤维化，甚至致死。

三、综合分析选择题

1. (1) 【正确答案】 E

【答案解析】羟考酮控释片具有双相吸收模式，能减少服药次数，不必因频繁服药中断睡眠。

(2) 【正确答案】 A

【答案解析】羟考酮在体内经 CYP2D6 酶系发生 O-脱甲基代谢。

2. (1) 【正确答案】 C

【答案解析】美沙酮为强效镇痛药。

(2) 【正确答案】 C

【答案解析】美沙酮为合成镇痛药。

(3) 【正确答案】 B

【答案解析】临床上美沙酮被用于治疗海洛因依赖脱毒和替代维持治疗的药效作用。常作为依赖阿片病人的维持治疗药。

3. (1) 【正确答案】 A

【答案解析】 药物粒径大小不同，到达肺黏膜的部位不同，对疗效影响显著。

(2) 【正确答案】 A

【答案解析】 气雾剂是借助抛射剂压力将内容物呈雾状物喷出。

(3) 【正确答案】 B

【答案解析】 粒径在 $1 \sim 3\mu\text{m}$ 的药物，易滞留在肺泡发挥作用。

4. (1) 【正确答案】 A

【答案解析】 多数药物在一定的剂量范围，对不同的组织和器官所引起的药理效应和强度不同，称作药物作用的选择性。阿托品特异性阻断 M 胆碱受体，但其选择性作用并不高。

(2) 【正确答案】 E

【答案解析】 药物作用的选择性取决于药物与组织的亲和力及细胞对药物的反应性。选择性高的药物与组织亲和力大，组织细胞对其反应性高，药物作用范围窄，只影响机体的一种或几种功能。选择性差的药物作用广泛，可影响机体多种功能。

四、多项选择题

1. 【正确答案】 BCD

【答案解析】 影响药物稳定性的外界因素包括：温度、光线、空气（氧）、金属离子、湿度和水分、包装材料。

2. 【正确答案】 BCD

【答案解析】 药物在体内发生代谢生成有反应活性的物质，引发毒性作用，这类毒性被称作特质性药物毒性。特点在于：并非与药理作用同时发生，一般呈滞后效应。剂量-效应关系

不明显。产生的后果通常比副作用严重。

3.【正确答案】ABC

【答案解析】阻滞钙离子通道发挥药理作用的药物有：1，4-二氢吡啶类如非洛地平、芳烷基胺类如维拉帕米、苯硫氮（⁺⁺卓）类如地尔硫（⁺⁺卓）。

4.【正确答案】ABD

【答案解析】血管紧张素Ⅱ受体阻断药基本结构是联苯骨架，临床主要用于高血压的治疗。连有酸性的四氮唑或羧基，在联苯的一端有咪唑环或咪唑开环的衍生物，均为活性药效基团。

5.【正确答案】ABE

【答案解析】磺酰脲类胰岛素分泌促进剂的降血糖药物有：格列本脲、格列吡嗪、格列喹酮、格列齐特、格列美脲等。

6.【正确答案】ABCDE

【答案解析】服用阿仑膦酸钠应在清晨、空腹时服用（早餐前至少 30min），用足量水整片吞服，然后身体保持立位（站立或端坐）30~60min，服药前后 30min 内不宜进食、饮用高钙浓度饮料及服用其他药物。

7.【正确答案】BCDE

【答案解析】由于软胶囊的囊材以明胶为主，因此对蛋白质性质无影响的药物和附加剂才能填充，而且填充物多为液体，如各种油类。液体药物若含 5%水或为水溶性、挥发性、小分子有机物，如乙醇、酮、酸、酯等，能使囊材软化或溶解，这些均不宜制成软胶囊。

8.【正确答案】ABDE

【答案解析】“无色”错误，有些注射剂是有色的。

9.【正确答案】BCD

【答案解析】量反应作用残留时间是指曲线从降到有效效应线以下到作用完全消失之间的时

间，若在此阶段内再次给药，因前次用药的残留作用，可能会发生蓄积。有些药物必须在体内生物转化后才呈现活性，类似过程需要时间，因此时-量曲线和时-效曲线的变化在时间上可能不一致。时-量曲线和时-效曲线可以互相参考而不能互相取代。

10. 【正确答案】 DE

【答案解析】 苯妥英钠和利多卡因通过阻滞心肌细胞膜 Na^+ 通道发挥作用，故选项 A 和 B 错误；三环类抗抑郁药对 Cl^- 通道有阻滞作用，故选项 C 错误。

