

考点一 药物的来源和分类

- 1、化学药：①化学合成方法，小分子药物 ②从天然产物中提取、发酵或半合成得到的有效单体、抗生素、天然药物或半成抗生素
- 2、中药：天然药极其加工品
- 3、生物制品：①以基因工程/细胞工程等生物技术制备 ②以维生素等生物材料制备

考点二 药品名称

1. 通用名：国际非专利药品名称；只有一个，不受专利和行政保护；药典中使用的名称；按照 WHO 原则命名，不能和已有的名称相同，也不能和商品名相似。
2. 商品名：可以进行注册和申请专利保护。
3. 化学名：名称中含有母核结构名称或者官能团名称。

考点三 药物剂型与制剂

按形态	按给药途径	按分散体系	按制法	按作用时间
固体、半固体、液体、气体	经胃肠道、非经胃肠道	①真溶液②胶体溶液 ③乳剂④混悬剂⑤气体分散类⑥固体分散类⑦微粒类	①浸出制剂 ②无菌制剂	普通、速释、缓控释

考点四 药品的包装材料

按使用方式分类	常用的药品包装材料
I类 ：药用塑料瓶/袋、塑料输液袋/瓶 II类 ：玻璃输液瓶、输液瓶胶塞 III类 ：输液瓶铝盖、铝塑组合盖	①玻璃②塑料 ：聚乙烯（PE）、聚丙烯（PP）、聚氯乙烯（PVC）、聚偏二氯乙烯（PVDC）、聚酯（PET） ③金属④复合材料

考点五 药物稳定性及有效期

- 1、药物的化学降解途径：水解、氧化、异构化、聚合、脱羧
- 2、影响药物稳定性的因素：处方因素、外界因素
- 3、药物稳定性试验方法：影响因素试验、加速试验、长期试验
- 4、药品有效期和半衰期： $t_{0.9}=0.1054/k$ ， $t_{1/2}=0.693/k$

考点六 我国药品标准体系构成

中国药典主要内容：一部（中）、二部（化）、三部（生）、四部（通则、辅料）

考点七 《中国药典》基本要求之性状

溶解度：1、易溶：1g 药物能在 1~10ml 溶剂中溶解；2、溶解：1g 药物能在 10~30ml 溶剂中溶解；3、微溶：1g 药物能在 100~1000ml 溶剂中溶解；4、几乎不溶




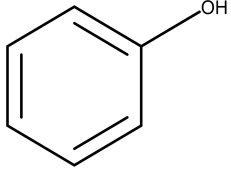
考点八 《中国药典》基本要求之检查

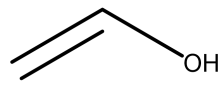
崩解时限检查法：口崩片--1 分钟、可溶片--3 分钟、舌下片--5 分钟、薄膜衣片--30 分钟、糖衣片--1 小时、肠溶片--酸中 2 小时不崩解，碱中 1 小时全部崩解、含片--10 分钟不崩解、硬胶囊--30 分钟、软胶囊--1 小时、滴丸--30 分钟

考点九 体内药物检验

- 1、全血：通常采静脉血，采集后置于含有抗凝剂的试管中，混合均匀既得
- 2、血浆：全血+抗凝剂→离心→上清液
- 3、血清：全血→离心→上清液

考点十 结构中常见的官能团

常见官能团	甲基/乙基/丙基	—CH_3  CH_3  CH_3
	烯/双键	 $\text{R}_1\text{C}=\text{CR}_2$
	炔/叁键	$\text{—}\equiv\text{—}$ $\text{R}_1\text{C}\equiv\text{CR}_2$
	卤素	—F/Cl/Br/I
	醇羟基	R-OH (R非芳香烃)
	酚羟基	Ar-OH (Ar芳香烃) 

	甲氧基	$R-OCH_3$
	烯醇	$H_2C=C-H-OH$ 
	巯基	$R-SH$
	醚/硫醚	R_1-O-R_2 R_1-S-R_2

考点十一 药物与作用靶标结合的化学本质（键合）

- 1、共价键：不可逆，结合牢固
- 2、非共价键：可逆：离子键、氢键、离子-偶极和偶极=偶极、电荷转移复合物、疏水性相互作用、范德华力、金属离子络合物

考点十二 药物的结构、理化性质与药物活性

药物的渗透性对药效影响

第 I 类	高水溶性、高渗透性	溶出度	普萘洛尔、依那普利、地尔硫草
第 II 类	低水溶性、高渗透性的	溶解速率	双氯芬酸、卡马西平、吡罗昔康
第 III 类	高水溶性、低渗透性	渗透效率	雷尼替丁、纳多洛尔、阿替洛尔
第 IV 类	低水溶性、低渗透性	吸收困难	特非那定、酮洛芬、呋塞米

考点十三 药物在胃肠道的吸收

分类	吸收特点	举例
1. 弱酸性药物	胃液中（pH 低）几乎不解离型，呈分子型，胃中易吸收	水杨酸、巴比妥
2. 弱碱性药物	胃液中（pH 低）几乎全部解离型，难吸收	奎宁、麻黄碱、氨苯砜、地西洋
	肠液中（pH 高）呈非解离型，易吸收	
3. 极弱碱性药物	酸性中解离少，易吸收	咖啡因和茶碱
4. 强碱性或完全离子化	肠胃中多离子化，吸收差	（1）胍乙啶 （2）季铵、磺酸

考点十四 药物分子的电荷分布对药效的影响

喹诺酮类抗菌药：作用靶点是 DNA 螺旋酶，其中 4 位的酮基是药效团，当羰基的氧电荷密

度增加时，有利于和 DNA 螺旋酶的电性相互结合。

麻醉作用比较：普鲁卡因 > 苯甲酸乙酯 > 对硝基苯甲酸乙酯

考点十五 药物结构与药物代谢

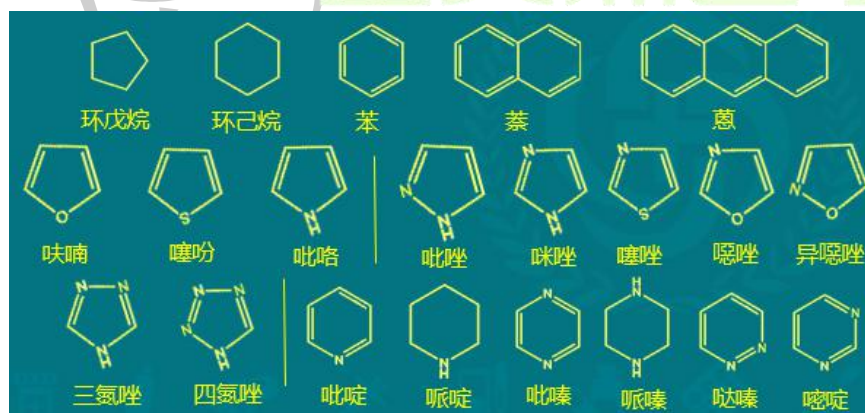
第 I 相生物转化

氧化	芳环、烯烃、饱和碳→加羟基（保泰松、苯妥因钠、卡马西平、地西洋） 醚、硫醚、卤素、氨基→脱掉-烷基/卤素/胺基
	氯霉素、利多卡因；(C=S)→(C=O)（硫喷妥） 醇→醛或酮；醛→酸；硫醚→亚砷→砷（舒林酸-甲基亚砷）
还原	醛→醇；酮→仲醇（美沙酮）；硝基→氨基（氯霉素）
水解	酯、酰胺→酸+醇/胺
羟基化	饱和碳；脂环

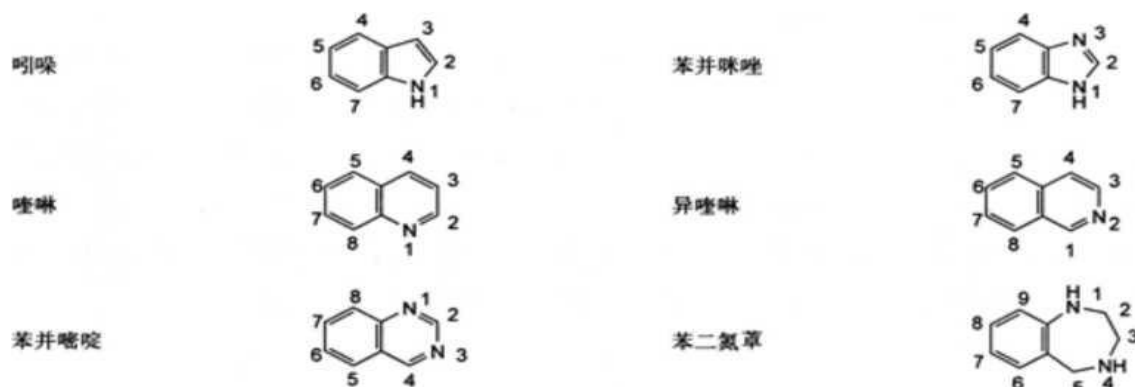
考点十六 药物对细胞色素 P450 的作用（诱导或抑制）

类型	作用	代表药
1. 可逆性抑制剂	含氮杂环，如咪唑，吡啶等，可以和血红素中的铁离子螯合，形成可逆作用	酮康唑
2. 不可逆性抑制剂	烯烃、炔烃、咪唑、肼类	异烟肼
3. 类不可逆抑制剂	最终结果是不可逆的抑制作用，但是起效时间比较缓慢	胺类：地尔硫草、丙米嗪、尼卡地平
4. 诱导剂	举例：诱导剂-乙醇、底物-对乙酰氨基酚 大量饮酒（乙醇）诱导 CYP2E1 活性，促进对乙酰氨基酚代谢产生的 氢醌 增加，代谢物 耗竭谷胱甘肽 ，同时与体内蛋白等结合产生毒性	

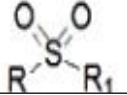
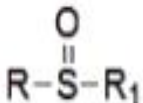
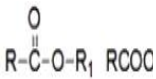
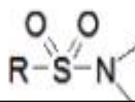
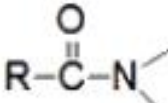
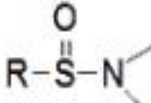
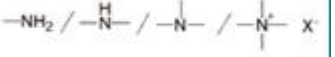
考点十七 官能团



考点十八 稠合杂环



考点十九 主要官能团

类别	名称	结构	名称	结构
烃基	烷烃	CH ₃ -CH ₃	烯烃	—C=C—
	炔烃	—C≡C—	卤代烃	R-X (X=↑, Cl, Br, I)
含 O、S 官能团	醇羟基	R-OH (R 非芳香烃)	酚羟基	Ar-OH (Ar 芳香烃)
	甲氧基	R-O-CH ₃	巯基	R-SH
	醚键	R ₁ -O-R ₂	硫醚键	R ₁ -S-R ₂
	醛基	R-CHO	磺羟基	R-S-OH R-SO ₃ H
	酮基	R-C-R	磺酰基 (磺)	
	羧基	R-C-OH R-COOH	亚磺酰基 (亚磺)	
	酯键	 RCOC	磺酰胺	
	酰胺		亚磺酰胺	
含 N 官能团	硝基/亚硝基	—NO ₂ / —NO	仲叔季	

考点二十 苯二氮卓类的构效关系及同类药

1、7 位引入吸电子基团：脂溶性高、活性强 ($\text{NO}_2 > \text{Br} > \text{CF}_3 > \text{Cl}$)

代表药：硝西洋、氯硝西洋

2、3 位引入羟基 (-OH)：增加极性，易于排泄；保持活性，降低毒性 **代表药：**奥沙西洋

3、5 位苯环的 2' 位：引入吸电子基团 (F、Cl)，活性增强 **代表药：**氟西洋、氟地西洋

4、1,2 位并上三氮唑：代谢稳定性增加，受体亲和力增加，脂溶性增加，活性增加

代表药：艾司唑仑、三唑仑、阿普唑仑、咪达唑仑、依替唑仑

考点二十一 吩噻嗪类构效关系和同类药

1、2 位取代基 (必需基团)：引入吸电子基团，增强活性： $\text{CF}_3 > \text{Cl} > \text{COCH}_3 > \text{H} > \text{OH}$

代表药：三氟丙嗪、三氟拉嗪

2、10 位：哌嗪取代的侧链作用最强

代表药：奋乃静、氟奋乃静、庚氟奋乃静 (前药，活性 > 氯丙嗪)

考点二十二 抗抑郁物的分类和代谢

(1) 大部分：N-去甲基，代谢物有活性	<p>NE 重摄取抑制剂：丙米嗪、氯米帕明、阿米替林、多塞平</p> <p>选择性 5-HT 重摄取抑制剂：氟西汀、西酞普兰、舍曲林</p> <p>双重：度洛西汀、米氮平、文拉法辛 (N-去甲基代谢物没活性)</p>
(2) O-去甲基	<p>文拉法辛 (O-去甲文拉法辛也有双重机制)</p> <p>氟伏沙明 (O-去甲基代谢物没有活性)</p>
(3) 不发生脱烷基代谢	帕罗西汀、吗氯贝胺、托洛沙酮

考点二十三 天然生物碱及类似物

- (1) **可待因：**吗啡 3 位羟基甲基化 (镇痛 ↓, 镇咳 ↑)
- (2) **纳洛酮、烯丙吗啡：**17 位 N-甲基被烯丙基取代，吗啡受体拮抗剂
- (3) **海洛因：**吗啡 3 位、6 位羟基同时酯化 (二乙酰化前药)
- (4) **羟考酮：**阿片受体纯激动剂，镇痛无封顶效应；羟考酮控释片，用于中/重度疼痛，双相吸收模式
- (5) **埃托啡：**镇痛活性是吗啡的 10000 倍，透过血脑屏障是吗啡的 300 倍，

受体结合力是吗啡的 200 倍，但治疗指数低

考点二十四 组胺 H1 受体拮抗剂抗过敏药（分类）

【氨基醚类】

盐酸苯海拉明（肝药酶诱导剂）

茶苯海明（苯海拉明氨茶碱盐，中枢抑制作用降低）、氯马斯汀、司他斯汀

【丙胺类】

马来酸氯苯那敏，又称扑尔敏，阻断 H1 作用强，中枢作用弱；代谢：N-去甲基，N 氧化

【哌嗪类】

西替利嗪，呈两性离子，不易透过血脑屏障，左西替利嗪

【三环类】

1. 异丙嗪：吩噻嗪结构 2. 赛庚啉、酮替芬（强效） 3. 氯雷他定 4. 地氯雷他定

【哌啶类】（非镇静抗组胺药，外周 H1 高选择性，无中枢和抗胆碱作用）

1. 特非那定、阿司咪唑 2. 非索非那定、诺阿司咪唑

3. XX 斯汀：依巴斯汀、卡瑞斯汀（依巴斯汀活性代谢物）、咪唑斯汀等

考点二十五 拟肾上腺素药分类总结

α 、 β 受体激动药	肾上腺素、多巴胺、麻黄碱
α 受体激动药	去甲肾上腺素（ $\alpha 1$ ）、盐酸可乐定（ $\alpha 2$ ）、去氧肾上腺素、甲基多巴、莫索尼定、利美尼定
非选择性 β 激动剂	异丙肾上腺素
选择性 $\beta 1$ 激动剂	多巴酚丁胺
选择性 $\beta 2$ 激动剂	沙丁胺醇、沙美特罗、特布他林（前药-班布特罗）、福莫特罗、丙卡特罗

考点二十六 解热镇痛药

（一）水杨酸类：阿司匹林（酯键可水解--乙酰+水杨酸）

（二）乙酰苯胺类：对乙酰氨基酚（结构中含有酰胺键，相对稳定， $t_{1/2}=21.8$ 年）

（三）贝诺酯：对乙酰氨基酚（酚羟基）+阿司匹林（羧基）形成的酯类前药；体内水解成以上两原药

考点二十七 非羧酸类抗炎药（昔康、昔布）

1、1,2-苯并噻嗪类 或 昔康类

①此类共性：烯醇（药效团，酸性）；N-CH₃（活性最强）

②美洛昔康：选择性作用于 COX-2，无胃肠道副作用

③活性：美洛昔康 > 吡罗昔康；④同类：依索昔康、替诺昔康、氯诺昔康

2、昔布类

①塞来昔布：选择性 COX-2 抑制剂；磺酰基体积大不易与 COX-1 结合，所以避免了胃肠道副作用，但有心血管事件风险

②同类：罗非昔布（被召回）、艾瑞昔布（我国研发，适度抑制 COX-2）

考点二十八 组胺 H2 受体阻断剂类抗溃疡药

【此类基本结构】碱性芳环+杂原子链+平面极性基团

- 1、西咪替丁：极性大、口服好、有首过；A型晶效果最好；
代谢——硫的氧化物，咪唑羟甲基化合物；强肝药酶抑制剂
- 2、同类：雷尼替丁（药效团-二氨基硝基乙烯；反式有效）、法莫替丁（选择性最高，作用最强）、尼扎替丁、罗沙替丁乙酸酯（前药）

考点二十九 质子泵抑制剂类抗溃疡药

【此类基本结构】苯并咪唑（活性必需）+亚磺酰基（亚砷）+吡啶环

- 1、奥美拉唑：前药循环；清除率：R-(+)异构体>S-(-)异构体；
代谢：甲氧基去甲基，甲基羟基化，亚砷→砷或硫醚
- 2、埃索美拉唑：奥美拉唑S异构体，钠盐注射镁盐口服
- 3、同类：兰索拉唑（常制成肠溶制剂，右兰索拉唑控释胶囊）、雷贝拉唑、泮托拉唑（二氟甲氧基）

考点三十 血管紧张素转化酶抑制剂（ACEI类） ACEI类共同结构：脯氨酸

- 1、卡托普利（非前药）——1个游离羧基，含巯基
赖诺普利（非前药）——2个游离羧基，含赖氨酸
- 2、其他普利（前药）——1个游离羧基，1个成酯，代谢成XX普利拉（酯水解）起效
依那普利（3个S手性碳）、贝那普利（七元环）、福辛普利（含磷酰基）

【依那普利改造的前药】喹那普利（脯氨酸→异喹啉羧酸）

培哚普利（苯丁酸→戊酸；脯氨酸→吡啶羧酸）

群多普利（脯氨酸→吡啶羧酸）；螺普利（脯氨酸→螺环羧酸）

考点三十一 调血脂药物

【他汀类共性】

1. 主要降低内源性胆固醇（TC）；也可用于冠心病和脑卒中的防治。
2. 副作用：肌肉疼痛或横纹肌溶解（西立伐他汀毒性最大，临床有死亡病例，已撤出市场）；肝毒性；
3. 必需药效基团：3,5-二羟基戊酸（内酯则必须水解生效）

考点三十二 抗心律失常药归类

I类：钠通道阻滞剂

IA：适度阻滞钠通道——奎尼丁

IB：轻度阻滞钠通道——美西律、利多卡因

IC：强度阻滞钠通道——普罗帕酮

II类：β受体阻滞剂——XX洛尔

III类：钾通道阻滞剂——胺碘酮、伊布利特、多非利特

IV类：钙通道阻滞剂——维拉帕米、地尔硫草

考点三十三 1,4-二氢吡啶类 - 钙拮抗剂

【此类共性】

- 1、构效：1,4-二氢吡啶（药效团）；3,5位羧酸酯（药效团）；注意4位
- 2、光催化歧化反应→硝基/亚硝基苯吡啶（有毒）
- 3、不宜与柚子汁同服（抑制酶，代谢减少）

4、有**首过效应**（除尼索地平外）

考点三十四 抗血栓药物

【抗凝血药】

1. 香豆素类：共性：**口服有效**、体外无抗凝作用；
代表药：双香豆素、醋硝香豆素、**华法林钠**
2. 凝血酶抑制药：**达比加群酯**（前药）、**阿加曲班**
3. 凝血因子 Xa 抑制药：**阿哌沙班**（口服预防血栓）、**利伐沙班**（高度选择性，竞争性拮抗 Xa 因子）

【血小板二磷酸腺苷（ADP）受体阻断药】

1. 临床应用：预防缺血性脑卒中、心肌梗死及外周血管病等。
2. 代表药：**氯吡格雷**（前药，抑制血小板聚集）、噻氯匹定、普拉格雷、坎格雷洛、替卡格雷

【糖蛋白 GP IIb/IIIa 受体阻断药】

1. 肽类药物单克隆抗体：**阿昔单抗**、**依替巴肽**
2. 小分子非肽类药物：**替罗非班**（可逆性抑制，停药后血小板聚集功能恢复）。

考点三十五 降血糖药分类归属

1. 胰岛素及其类似物

2. 胰岛素分泌促进剂

- a. 磺酰脲类：格列本脲/格列吡嗪/甲苯磺丁脲/格列美脲/格列齐特
 - b. 非磺酰脲类：瑞格列奈、那格列奈、米格列奈
3. **胰岛素增敏剂**：a. 双胍类：二甲双胍；b. 噻唑烷二酮类：吡格列酮、罗格列酮
 4. **α -葡萄糖苷酶抑制剂**：阿卡波糖、伏格列波糖、米格列醇
 5. **二肽基肽酶-4 抑制药**：XX 列汀
 6. **钠-葡萄糖协同转运蛋白 2 抑制药**：XX 列净

考点三十六 调节骨代谢与形成药物

【双膦酸盐类-抗骨吸收药（阿仑膦酸钠）】

- A、常见不良反应：**消化道症状**（容易与食物结合，口服吸收差）
- B、**用药注意**：清晨、空腹、站立、多水、30min 内不宜进食/高钙饮料/其他药
- 双向作用**：
小剂量-抑制骨吸收，防治骨质疏松、高钙血症
大剂量-抑制骨矿化和骨形成，防治异位骨化

【促进钙吸收药物（维生素 D3）】

- 1、**代谢后活化**：肝脏代谢（加 25 位羟基）→骨化二醇→肾脏代谢（加 1 α 位羟基）→骨化三醇
- 2、老年人 1 α -羟化酶活性几乎消失，无法活化 VD3，所以开发出：**阿法骨化醇和骨化三醇**
阿法骨化醇稳定性好体内进一步转化为**骨化三醇**

考点三十七 β -内酰胺类 之 青霉素类（青霉素）

【青霉素类母核】

β -内酰胺+**四氢噻唑**；改造位置：**氨基侧链**

- 1、 β -内酰胺环——**张力大**，**酸碱下易裂解**，忌与**氨基糖苷类等碱性药合用**；**易水解**（钠盐

/钾盐粉针剂)

- 2、合用丙磺舒，青霉素增效（排泄↓）
- 3、交叉过敏反应：共同抗原决定簇——青霉噻唑高聚物
- 4、三大缺点：不耐酸（不能口服）、不耐酶、抗菌谱窄

【半合成青霉素构效关系】

- 1、耐酸青霉素：非奈西林（侧链苯氧基，可口服）、阿度西林（侧链叠氮）
- 2、耐酶青霉素：苯唑西林（侧链苯异噁唑）、甲氧西林（二甲氧基苯）
- 3、广谱青霉素：氨苄西林/阿莫西林（侧链游离氨基有聚合反应）
- 4、抗铜绿青霉素：哌拉西林（侧链胺基酰化）、羧苄西林（侧链羧基取代氨基）、磺苄西林（侧链磺酸基取代氨基）

考点三十八 β-内酰胺类之头孢菌素类

【头孢类母核】β-内酰胺+氢化噻嗪改造位置（3位，侧链）

- 1、第一代头孢代表药：头孢氨苄、头孢羟氨苄、头孢唑林、头孢拉定
- 2、第二代头孢代表药：头孢克洛、头孢呋辛、头孢呋辛酯、氯碳头孢
- 3、第三代头孢代表药：头孢哌酮、拉氧头孢 含“肟”结构的三代头孢：头孢曲松、头孢噻肟、头孢他啶、头孢克肟、头孢泊肟酯（前药，吸收好）
- 4、第四代头孢代表药：头孢匹罗、头孢吡肟、头孢噻利

考点三十九 喹诺酮类抗菌药

【喹诺酮类共性】

- 1、母核：1,4-二氢-4-氧代喹啉-3-羧酸
- 2、药效团：3-羧基，4-酮基（必需）
- 3、靶点：DNA螺旋酶和拓扑异构酶IV
- 4、副作用：①3羧4酮-金属离子络合；②8位F-光毒性

【喹诺酮类代表药】

环丙沙星、左氧氟沙星、洛美沙星、莫西沙星、依诺沙星、司帕沙星、加替沙星

考点四十 抗真菌药分类

- ①多烯类抗真菌药：制菌霉素 A1，那他霉素，两性霉素 B，哈霉素，曲古霉素；
- ②唑类抗真菌药：XX 康唑；
- ③其他类抗真菌药：萘替芬、特比萘芬、布替萘芬。

考点四十一 抗病毒药物

【抗非逆转录病毒药】

1. 干扰病毒核酸复制的药物

- (1) 核苷类抗病毒药
- (2) 开环核苷类抗病毒药

代表药：阿昔洛韦（抗疱疹病毒首选药）、伐昔洛韦（阿昔洛韦前药）、更昔洛韦（对巨细胞病毒作用强）、喷昔洛韦、泛昔洛韦（喷昔洛韦前药）、6-脱氧阿昔洛韦（阿昔洛韦前药）、替诺福韦酯（替诺福韦磷酸酯前药）、阿德福韦酯（阿德福韦磷酸酯前药）

- (3) 非核苷类抗病毒药：代表药利巴韦林

2. 干扰病毒进入宿主细胞和病毒释放的药物

- (1) 金刚烷胺类
- (2) 金刚乙胺
- (3) 干扰素
- (4) 奥司他韦

【抗逆转录病毒药】

1. 逆转录酶抑制药

(1) **核苷类逆转录酶抑制药** 代表药：齐多夫定（首选）、司他夫定、拉米夫定、恩曲他滨、扎西他滨、去羟肌苷。

- (2) **非核苷类逆转录酶抑制药** 代表药：奈韦拉平、依法韦伦、地拉韦定

2. **HIV 蛋白酶抑制药** 代表药：沙奎那韦、利托那韦

考点四十二 抗疟药

1. **青蒿素类抗疟药**：青蒿素是我国发现的第一个被国际公认的天然药物，起效最快，但口服活性低、溶解度小、复发率高、半衰期短

2. **青蒿素衍生物**：双氢青蒿素（C10 羰基还原得到）、蒿甲醚（双氢青蒿素甲醚后得到）、青蒿琥酯（双氢青蒿素与琥珀酸形成的单酯）

考点四十三 烷化剂类抗肿瘤药

【氮芥类-烷化剂】

β -氯乙胺（烷基化药效团）+ 载体（药动学）

【亚硝基脲类-烷化剂】

β 氯乙基（烷基化基团）+ N-亚硝基脲（易分解成 N_2/CO_2 ）；

代表药物：卡莫司汀（脂溶性高，可透过血脑屏障，适用于脑瘤）、洛莫司汀、司莫司汀【金属配合物抗肿瘤药物】

顺铂：顺式体（反式无效），缺点-水溶性差，胃肠道、神经毒性、耳/肾毒性

卡铂、奥沙利铂（草酸根合铂 + 环己二胺；第一个对结肠癌有效的铂类）

考点四十四 抗代谢抗肿瘤药分类

1. 尿嘧啶类抗代谢药：氟尿嘧啶、替加氟、卡莫氟
2. 胞嘧啶类抗代谢药：阿糖胞苷、吉西他滨、卡培他滨
3. 嘌呤拮抗剂：巯嘌呤、巯鸟嘌呤
4. 叶酸类：甲氨蝶呤、亚叶酸钙、培美曲塞

考点四十五 天然产物类抗肿瘤药

【紫杉烷类】

代表药：①紫杉醇，难治性卵巢癌及乳腺癌的有效药物之一②多西他赛：水溶性好，毒性更小，抗癌谱更广，对除肾癌、结、直肠癌以外的其他实体肿瘤都有效

【喜树碱类】

代表药：喜树碱、羟基喜树碱（活性↑，毒性↓）、伊立替康、拓扑替康

【鬼臼生物碱类】

代表药：依托泊苷、替尼泊苷

【抗肿瘤抗生素】

代表药：多柔比星、表柔比星（多柔比星差向异构体，毒性↓）；柔红霉素（用于白血病）

考点四十六 靶向抗肿瘤药

1. 伊马替尼：第一代酪氨酸激酶抑制剂，已显耐药性；
2. 吉非替尼：治疗非小细胞肺癌，第一个选择性表皮生长因子酪氨酸激酶抑制剂；
3. 索拉非尼：多靶点酪氨酸激酶抑制剂；
4. 尼洛替尼、达沙替尼、厄洛替尼、奥希替尼、舒尼替尼、阿帕替尼（国内研发）、克唑替尼（国内研发）、埃克替尼

考点四十七 固体制剂的常用辅料

- 1、稀释剂/填充剂：主药剂量 < 50mg 时加入，增加片重与体积
- 2、润湿剂与粘合剂
- 3、崩解剂：不加崩解剂的情况：缓/控释、口含、舌下、咀嚼片
- 4、润滑剂

5、释放调节剂：（1）骨架型【亲水性凝胶骨架材料、不溶性骨架材料、生物溶蚀性骨架材料】（2）包衣模型【不溶性高分子材料、肠溶性高分子材料】

考点四十八 薄膜包衣

1. 薄膜包衣材料

①胃溶型	羟丙甲纤维素（HPMC）、羟丙基纤维素（HPC） 聚乙烯吡咯烷酮（PVP） 丙烯酸树脂IV号、聚乙烯缩乙醛二乙氨乙酸（AEA）
②肠溶型	虫胶、醋酸纤维素酞酸酯（CAP）、羟丙甲纤维素酞酸酯（HPMCP）、丙烯酸树脂类（I、II、III号）
③水不溶型	乙基纤维素（EC）、醋酸纤维素

2. 薄膜包衣辅助材料

(1) 增塑剂	①水溶性（如丙二醇、甘油、聚乙二醇等）
	②非水溶性（如甘油三醋酸酯、乙酰化甘油酸酯、邻苯二甲酸酯等）
(2) 释放调节剂	又称致孔剂（水溶性）：蔗糖、氯化钠、表面活性剂、PEG（聚乙二醇）
(3) 遮光剂	二氧化钛

考点四十九 口服散剂

（一）口服散剂的特点

优点：易分散、起效快、外用覆盖面大、剂量易控适用老幼、五方便

缺点：对光、湿、热敏感

（二）口服散剂的质量要求

1. 口服——细粉

2. 毒、贵、剂量小：配研法

3. 多剂量散：附分剂量的用具

4. 含毒口服散剂：单剂量包装

5. 干燥失重：≤2.0%（105℃）；水分：≤9.0%（中药）

（三）口服散剂注意事项：温胃止痛直接吞服（不用水）

考点五十 口服片剂

片剂制备中的常见问题及原因

裂片（顶、腰）	细粉太多→压后空气膨胀 塑性差→结合力弱
松片	黏性差、压力不足
崩解迟缓	压力大、结合力强、崩解剂差
溶出超限	不崩解、颗粒硬、溶解度差（崩解迟缓）

含量不均匀	片重差异超限、药物混合度差、可溶成分迁移
质量要求： 外观均匀度、硬度、脆碎度、崩解时限、含量均匀度、片重差异	
平均重量 (g)	差异限度 (%)
<0.30	±7.5
≥0.30	±5.0

考点五十一 胶囊剂

优点：掩味、提高稳定性；利用度高（>片/丸）、液态药物固体化、缓控释、定位
缺点：湿度影响大、老幼服用难、生产成本低、不宜制胶囊药物（含水/醇、醛、风化、吸湿、挥发、O/W 乳剂）

考点五十二 口服滴丸剂

口服滴丸剂的分类：

- ①速释高效滴丸（固体分散技术）；
- ②缓释/控释滴丸（如氯霉素控释滴丸）；
- ③溶液滴丸（水溶性基质，如氯己定滴丸可用于饮用水消毒）；
- ④硬胶囊滴丸（如联苯双酯的硬胶囊滴丸）；
- ⑤包衣滴丸（如联苯双酯滴丸）；
- ⑥脂质体滴丸（脂质体+PEG4000 基质）；
- ⑦肠溶衣滴丸（肠溶基质）；
- ⑧干压包衣滴丸

滴丸剂的基质和冷凝液(类栓剂)

- ①水溶性基质：聚乙二醇（PEG4000/6000）、甘油明胶、泊洛沙姆、硬脂酸钠
 对应冷凝液：液状石蜡、植物油、甲基硅油
- ②脂溶性基质：硬脂酸、单硬脂酸甘油酯、氢化植物油、虫蜡、蜂蜡
 对应冷凝液：水

考点五十三 口服膜剂

口服膜剂的质量要求

- ①成膜材料（无毒、无刺激性、稳定）：聚乙烯醇、丙烯酸树脂类、纤维素类等。
- ②水溶性药物，应与成膜材料制成具一定黏度的溶液；不溶性药物，应粉碎成极细粉，与成膜材料混合均匀。 ③多剂量的膜剂，能按压痕撕开。

考点五十四 口服液体制剂的基本要求

一、口服液体制剂的特点

优点：分散度高吸收快、给药途径广泛、易分剂量、服用方便
缺点：易分解、稳定性差、易霉变（防腐剂）、携带运输不便

二、口服液体制剂质量要求

- ①均相液体制剂（澄明） ②非均相液体制剂（粒子分散均匀）
- ③口服液体制剂（外观良好、口感适宜） ④保存和使用（不霉变）

考点五十五 口服液体制剂的常用溶剂

- ①、**极性**：水、甘油、二甲基亚砷（DMSO）【水风干】
 ②、**半极性**：乙醇、丙二醇、PEG300~600（聚乙二醇）
 ③、**非极性**：脂肪油、液体石蜡（口服、搽剂）、油酸乙酯、乙酸乙酯

考点五十六 口服液体制剂的常用附加剂

增溶剂	表面活性剂 （HLB15-18）：聚山梨酯（吐温）、聚氧乙烯脂肪酸酯类（卖泽）
助溶剂	多溶于水，第三种物质 （与药物络合/成盐增溶）如： 苯甲酸 （帮助咖啡因溶解）、 碘化钾 （帮助碘的溶解）、乙二胺、聚乙烯吡咯烷酮（PVP）
潜溶剂	混合溶剂 →水+乙醇/丙二醇/甘油/PEG

考点五十七 表面活性剂的应用

- ①增溶剂：增加难溶性药物在水中的溶解度，比如：难溶性维生素、甾体激素、挥发油等。
 ②乳化剂：**W/O型乳化剂**（HLB值3~8）；**O/W型乳化剂**（HLB值8~16）；阳离子型和阴离子型表面活性剂-外用制剂的乳化剂；**两性离子型和非离子型表面活性剂-内服制剂的乳化剂**。
 ③润湿剂：最适HLB值7~9。

考点五十八 高分子溶液剂

单分子分散，**均相体**，热力学稳定，亲水/非水性

- ①荷电性：**电泳现象**（正电荷或负电荷）
 ②**渗透压**（与浓度有关）、**黏稠性**（与分子量有关）
 ③**聚结特性**：大量亲水基+水→水化膜→阻碍高分子凝聚；电解质、脱水剂（乙醇）破坏水化膜→凝结沉淀↓
 ④**胶凝性**：温热黏稠液，降温成凝胶（胶凝）
 ⑤**陈化现象**：放置中自发聚集沉淀（光、热、盐、pH、絮凝剂等）

考点五十九 口服混悬剂常用稳定剂

润湿剂	表面活性(HLB 7~11)	磷脂类、吐温、司盘（W/O型）、泊洛沙姆
助悬剂	低分子	糖浆（内用）、甘油（外用）
	天然高分子	胶类、琼脂、海藻酸钠
	合成高分子	MC（甲基纤维素）、CMC-Na、HPMC、PVP（聚维酮）、PVA（聚乙烯醇）
	硅皂土（>pH7效果好，多外用）、触变胶	
絮凝剂	$\zeta \downarrow$ ，疏松絮状聚集，絮凝	【最佳ζ：20~25mv】
反絮凝剂	$\zeta \uparrow$ ，阻碍聚集，反絮凝	枸橼酸（氢）盐，酒石酸（氢）盐，磷酸盐，AlCl ₃

注意事项：用前摇匀、低温避光

考点六十 口服乳剂

乳剂组成、分类、特点

组成三者缺一不可：**油相（O）+水相（W）+乳化剂**

*其他附加剂：辅助乳化剂、防腐剂、抗氧化剂等

乳剂的分类：1. 分散系 2. 乳滴大小

乳化剂的分类：高分子化合物、表面活性剂、固体粉末

考点六十一 注射剂的质量要求

1. pH: **4~9**（血液 pH≈7.4），同品种允许误差±1.0
2. 渗透压：**用量大及静注**应与**血浆等渗或偏高渗**
3. 无菌、无热原；**稳定、安全**
4. **溶液型注射液**应：澄明、无可见异物或不溶性微粒

考点六十二 注射剂常见的溶剂与附加剂

一、注射剂的常用溶剂：1. 饮用水 2. 纯化水 3. **注射用水** 4. 灭菌注射用水 5. 注射用油 6. 其他注射溶剂

二、注射剂的常用附加剂：1. 抗氧化剂 2. 金属离子螯合剂 3. pH 缓冲剂 4. 助悬剂 5. 增溶/润湿/乳化剂 6. 抑菌剂（防腐）7. 等渗调节剂

考点六十三 热原

热原性质	除去热原方法
1. 水溶性	蒸馏法制备注射用水（蒸馏水器上需附隔沫装置）
2. 不挥发性	
3. 耐热性	高温法/湿热法除去热原 180~200℃（2h）；250℃（30~45min）；650℃（1min）
4. 过滤性	体积小（1~5nm）；凝胶滤过（分子筛）/超滤法（3~15nm 超滤膜）/反渗透法（三醋酸纤维素膜或聚酰胺膜）
5. 可吸附性	活性炭/离子交换树脂吸附法
6. 其他	热原能被强酸、强碱、强氧化剂（高锰酸钾、过氧化氢）以及超声波破坏

考点六十四 注射剂的溶解度与溶出速度

【增加药物溶解度和溶出速度的方法】

1. 加入**增溶剂**：**表面活性剂**
2. **助溶剂**：碘→**碘化钾**、咖啡因→**苯甲酸钠**
3. 制成**盐类**
4. 使用混合溶剂：**潜溶剂**（乙醇/丙二醇/甘油/聚乙二醇 + 水）
5. 制成**共晶**、**升温**，**改变 pH**，**微粉化**、**包合技术**
6. **增加溶出速度**：粒径越小、温度越高、溶液中药物浓度越低，溶出速度越快

考点六十五 注射液的配伍禁忌

配伍变化的主要原因：①**溶剂组成改变**②pH 改变③缓冲剂④离子作用⑤盐析作用⑥**直接反应**⑦配合量⑧混合顺序⑨反应时间⑩O₂ 与 CO₂ 的影响⑪**光敏感性**⑫成分纯度

考点六十六 注射液的包装与贮存

注射剂包装的水处理

1. 纯化水一般用于注射剂容器的初期冲洗；
2. 注射用水主要用于注射液的配制和注射剂容器的最后清洗。

注射剂容器的分类：1. 安瓿 2. 玻璃瓶（最传统的输液容器） 3. 塑料瓶 4. 塑料袋 5. 橡胶塞

考点六十七 溶液型注射剂的临床应用

1. 不宜口服的患者——吞咽/吸收障碍（呕吐、腹泻、胃肠道病变、术后不能进食）
2. 不宜口服的药物——如：庆大霉素（口服生物利用度低）
3. 没有合适口服剂型——如：氨基酸类、胰岛素
4. 紧急情况——注射剂能较快地发挥药效

考点六十八 乳状液型注射剂的临床应用与注意事项

1. 易出现分层、破乳或酸败等现象；
2. 与其他药物配伍有可能引起粒径增大，或产生破乳；
3. 不得有相分离现象，不得用于椎管注射。

考点六十九 混悬型注射剂的特点

1. 微粉化可减小粒径，增加溶出速度；
2. 长效混悬型注射剂给药后可在局部形成贮库，缓慢释放药物；
3. 适用：无适当溶媒的不溶性固体药物，需制成长效/高含量制剂

考点七十 注射用无菌粉末

一、注射用无菌粉末的分类

- ①注射用无菌粉末直接分装制品
——喷雾干燥法/灭菌溶剂法：抗生素（青霉素）
- ②注射用冻干无菌粉末制品
——灌装 → 冷冻干燥：生物制品（酶、血浆）

二、注射用无菌粉末的特点

- A、临用前溶解（灭菌注射用水、生理盐水）
- B、适用于水中不稳定药物（即：对湿热敏感的药物）

考点七十一 注射用浓溶液

一、注射用浓溶液的特点

- ①适用于水溶液中不稳定和溶解度低的药物；
 - ②可解决水的引入导致的药物异构化或有关物质增多的问题；
 - ③可以扩大药物在临床上的适用范围。
- 二、质量要求：注射用浓溶液稀释后应符合注射液的要求。

考点七十二 输液（输液速度、提倡临用前配制）

- ①静滴氧氟沙星注射液速度宜慢，否则易产生低血压
- ②复方氨基酸滴注过快可致恶心呕吐

③林可霉素滴注时间维持 1h 以上

考点七十三 微粒制剂的一般要求

微粒分散体系：直径在 $10^{-4} \sim 10^{-9} \text{m}$ ($1 \text{nm} \sim 100 \mu\text{m}$) 范围

1. 粗(微米)分散体系 MDDS：粒径在 $1 \sim 500 \mu\text{m}$ ，主要包括微囊、微球、亚微乳等。
2. 纳米分散体系的 MDDS：粒径 $< 1000 \text{nm}$ ($1 \mu\text{m}$)，主要包括脂质体、纳米乳、纳米粒、聚合物胶束。

考点七十四 脂质体 (人工生物膜)

脂质体的组成膜材料：①磷脂：天然的卵磷脂、脑磷脂、豆磷脂以及合成磷脂。②胆固醇（两亲，调节流动性）

脂质体的性质：①相变温度——温度升高，脂质体双分子层从有序排列→无序排列，膜厚度减小，膜流动性增加 ②荷电性

脂质体的特点：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（靶向），提高药物稳定性

考点七十五 微球

一、微球的分类

1. 普通注射微球
2. 栓塞性微球
3. 磁性微球
4. 生物靶向性微球

二、微球的特点

①缓释性；②靶向性③降低毒副作用。

考点七十六 药物微囊化的特点

1. 提高药物的稳定性；
2. 掩盖药物的不良臭味；
3. 防止药物胃内失活，减少对胃的刺激性；
4. 缓释控释的微囊材料；
5. 使液态药物固态化；
6. 减少药物的配伍变化；
7. 浓集于靶区，提高疗效，降低毒副作用：如抗肿瘤药。

考点七十七 一、软膏剂、乳膏剂与糊剂的分类

1. 软膏剂	①溶液型软膏剂：原料药溶解（或共熔）于基质
	②混悬型软膏剂：原料药细粉均匀分散于基质
2. 乳膏剂	水包油型（O/W 型）乳膏剂
	油包水型（W/O 型）乳膏剂
3. 糊剂	原料药固体粉末（ $\geq 25\%$ ）均匀分散在适宜基质中
	①含水凝胶性糊剂；②脂肪糊剂

考点七十八 凝胶剂质量要求、临床应用与注意事项

1. 均匀、细腻、保持胶状、不干涸或液化
2. 一般应检查 pH

3. 应避光、密闭贮存、**并应防冻**
4. 常用于**无渗出**的急、慢性皮肤损害。
5. 皮肤**破损处不宜用**。避免接触眼睛、黏膜；

考点七十九 贴剂

贴剂的质量要求

- ①**残留溶剂**含量测定
- ②**黏附力**测定——初黏力、持黏力及剥离强度
- ③**释放度**测定、**含量均匀度**测定

贴剂的分类：黏胶分散型、周边黏胶骨架型、储库型贴剂

考点八十 贴膏剂

1. **凝胶贴膏**(原巴布膏剂或凝胶膏剂)：原料药 + **亲水性基质**
常用基质(亲水)：聚丙烯酸钠、羧甲基纤维素钠、明胶、甘油和微粉硅胶等。
2. **橡胶膏剂**：原料药 + **橡胶**等基质；
常用基质：橡胶、热可塑性橡胶、松香及其衍生物、凡士林、羊毛脂和氧化锌等。

考点八十一 气雾剂

优点：方便、操作方法类似、高压下防止病原体侵入
缺点：肺部**沉积量低**、无法递送大剂量药物、无剂量计数器
气雾剂的注意事项

- ①用前摇匀；首次或间隔1周，**空中试喷**
- ②吸入后清水漱口，如使用**激素类**应刷牙
- ③贮存：避光、避热、避冷冻、避摔碰
- ④即使药品已用完的小罐也**不可弄破、刺穿或燃烧**

考点八十二 喷雾剂的临床应用、注意事项

1. 既可作**局部**用药，亦可治疗**全身性**疾病。
2. 肺的局部作用-雾化粒径 $3-10\mu\text{m}$ ；迅速吸收发挥全身作用-雾化粒径 $1-0.5\mu\text{m}$ 。
3. 多为**临时配制**，保存时间不宜过久，否则容易变质。

考点八十三 粉雾剂的分类

1. **吸入粉雾剂**：微粉化药物+载体→**胶囊、泡囊或多剂量贮库**，特制的干粉吸入装置，由患者**主动吸入**雾化药物至肺部。
一般不含防腐剂(减少刺激)、**给药剂量大**(适用多肽和蛋白质类药物)
2. **非吸入粉雾剂**：微粉化药物+载体→**胶囊、泡囊或多剂量贮库**，特制的干粉给药装置，将雾化药物**喷至**腔道黏膜的制剂
3. **外用粉雾剂**

考点八十四 用液体制剂的附加剂

- ①pH 缓冲液②渗透压调节剂③**抑菌剂**④调节**黏度**⑤其他：增溶剂、助溶剂、抗氧化剂

考点八十五 栓剂的附加剂

- ①表面活性剂②抗氧化剂③防腐剂④硬化剂⑤增稠剂⑥吸收促进剂

考点八十六 口腔黏膜给药制剂的质量要求

1. 无毒和无刺激性，不刺激唾液的分泌。
2. 崩解时限：含片（不应在 10min 内全部崩解或溶化），舌下片（5min 内全部崩解）。
3. 口腔贴片（膜）：应进行释放度检查。

考点八十七 鼻用制剂的特点

1. 优点：吸收迅速/起效快；避免肝首关效应；避免胃肠道的刺激，适于急救、自救；部分药物可经嗅觉神经绕过血-脑屏障直接进入脑组织，有利于中枢统疾病治疗。
2. 缺点：鼻黏膜刺激。鼻腔给药体积小。

考点八十八 耳用制剂的质量要求

1. 多剂量水性耳用制剂：应含适宜抑菌剂
2. 伤口或术前用的耳用制剂：无菌，不含抑菌剂，单剂量
3. 手术、耳部伤口或耳膜穿孔的滴耳剂与洗耳剂：须为灭菌制剂
4. 多剂量包装容器：装量应不超过 10ml 或 5g。
5. 贮存：密闭；开启后使用最多不超过 4 周。

考点八十九 药物体内的基本过程

- 1: 吸收——药物从给药部分进入体循环的过程，非血管内给药（口服、肌注、吸入、透皮等）都存在吸收过程，吸收是药物起效先决条件
- 2: 分布——药物进入体循环后向各组织、器官或体液转运的过程
- 3: 代谢——药物在体内结构发生变化的过程
- 4: 排泄——药物及其代谢物排出体外的过程

考点九十 药动学基本参数

- 1、速率常数 (h^{-1} 、 min^{-1})——代表体内过程快慢；加和性，例如消除（代谢+排泄+胆汁排泄） $k=k_b+k_e+k_{bi}+\dots$
- 2、生物半衰期 ($t_{1/2}$)： $t_{1/2}=0.693/k$ ——消除快慢
- 3、表观分布容积 (V)： $V=X/C$ ——亲脂性药物组织分布广； V 与 C 成反比，比如水溶性药物，血药浓度高，则 V 值小；
- 4、清除率 (Cl ，体积/时间)： $Cl=kV$ ——消除快慢（有加和性， $Cl=Cl_h+Cl_r$ ）

考点九十一 药物的跨膜转运

1. 被动转运	①滤过	流体静压 或 渗透压透过膜孔	水溶性、小分子
	②简单扩散 (被动转运)	无需载体、顺浓度差（不耗能）	解离度小，脂溶性大的药物
2. 载体转运	③主动转运	载体(饱和性、竞争性、特异性)、逆浓度差（耗能）	生命必须物质 (K^+ 、 Na^+ 、 I^- 、单糖、氨基酸、水溶性维生素) 等离子型化合物
	④易化扩散	载体(饱和性、竞争性、特异性)、顺浓度差（不耗能）	
3. 膜动转运		胞饮、吞噬、胞吐	微粒 或 大分子物质（蛋白质、多

肽)

考点九十二 影响药物吸收的生理因素

1、胃肠液 pH 2、胃肠道运动 3、循环系统运动 4、食物 5、胃肠道代谢作用 6、疾病因素

考点九十三 影响药物吸收的剂型与制剂影响

剂型	生物利用度顺序：溶液剂>混悬剂（乳剂）>散剂>胶囊剂>片剂>包衣片【越稀越碎易吸收】
制剂处方	<p>①液体制剂中的辅料：增黏剂（黏度与溶出度和扩散速度成反比）、络合物（吸收↓）、吸附剂（影响吸收）、表面活性剂（增溶）</p> <p>②固体制剂：药物颗粒大小（微粉化促进难溶药物吸收）、辅料（一般无活性）、包衣（材料种类及厚度，胃肠 pH）</p> <p>③制剂工艺：原辅料混合方法、制粒、压片</p>

考点九十四 影响注射给药吸收的因素

- 1、注射部位血流状态：三角肌>大腿外侧>臀部
 - 2、药物理化性质：分子量大难吸收，溶解度的影响
 - 3、与蛋白质的吸附和结合：影响药物的扩散
 - 4、油溶剂易形成储库
 - 5、混悬剂药物结晶状态，黏度
- 【释放速率】水溶液>水混悬液>油溶液>O/W型乳剂>W/O型乳剂>油混悬液【水>油，稀>稠】

考点九十五 药物的代谢

- 一、首关效应：胃肠道给药进入血液循环之前，在肠黏膜和肝脏被代谢而使进入血液循环的原形药量减少
- 二、药物代谢酶系统
 - (1) 微粒体酶系
 - (2) 非微粒体酶系
- 三、代谢类型：第 I 相反应：氧化、还原、水解、异构化；第 II 相反应：结合（4 酸 1 肽 1 甲基）

考点九十六 给药方案设计

1、根据半衰期设计给药方案：

①给药间隔 $\tau = t_{1/2}$ （5~7 个 $t_{1/2}$ 达稳态） 注： $\tau > t_{1/2}$ 血药浓度波动大， $\tau < t_{1/2}$ 药物可能有较大积累

②负荷剂量：首剂加倍（迅速达到稳态） $X_0^* = 2X_0$

2、根据平均稳态血药浓度设计给药方案

$$C_{av} = \frac{FX_0}{kV\tau} \quad \tau = \frac{FX_0}{C_{av} \times kV}$$

①给药间隔越长，血药浓度波动越大

②治疗窗窄，治疗指数小：小剂量多次或静滴；控制稳态最大血药浓度和稳态最小血药浓度在一定范围内。

3、**静脉滴注给药方案设计**（适用 $t_{1/2}$ 短，治疗指数小的药物）

$$C_{ss} = \frac{K_0}{KV}$$

先静注负荷剂量—— $X_0 = C_{ss}V = K_0/K$

考点九十七 治疗药物监测

需进行血药浓度监测的情况（举例）

- ①个体差异大：**三环类抗抑郁药**
- ②非线性动力学特征：如**苯妥英钠**
- ③治疗指数小、毒性反应强：**强心苷类药、茶碱、锂盐、普鲁卡因胺**等。
- ④毒性反应不易识别，用量不当或用量不足的临床反应难以识别的药物：**地高辛**
- ⑤特殊人群用药：如肾功能不全患者禁用**氨基糖苷类**
- ⑥**常规剂量**下没有疗效或出现毒性反应
- ⑦**合并用药**而出现的异常反应
- ⑧长期用药，血药浓度受各种因素影响而发生变化
- ⑨诊断和处理药物**过量或中毒**

考点九十八 生物利用度的研究方法

$$\text{绝对生物利用度: } F = \frac{AUC_{(po)} / Dose_{(po)}}{AUC_{(iv)} / Dose_{(iv)}} \times 100\%$$

$$\text{相对生物利用度: } F_r = \frac{AUC_{(T)} / Dose_{(T)}}{AUC_{(R)} / Dose_{(R)}} \times 100\%$$

口服制剂 (po)、静脉注射 (iv)、血药浓度时间曲线面积 (AUC)、给药剂量 (Dose) ; 试验制剂 (T)、参比制剂 (R)

考点九十九 药物的治疗作用

1. 对因治疗	消除致病因子	抗生素杀灭病原微生物
2. 对症治疗	改善症状	①解热镇痛药降低体温 ②硝酸甘油缓解心绞痛 ③抗高血压药降压
3. 补充疗法	又称替代疗法; 补充体内营养或代谢物质不足	①铁剂治疗缺铁性贫血 ②胰岛素治疗糖尿病

考点一百 药物的作用机制

1、受体	大多数药物作用机制	阿托品 (阻断 M)、肾上腺素 (激动 α 、 β)
2、酶	①抑制酶活性	依那普利 (抑制 ACE)、阿司匹林 (抑制 COX)
	②激活酶活性	尿激酶 (激活血浆纤溶酶原) 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我就是酶	胃蛋白酶、胰蛋白酶
3、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 ⁺)、米诺地尔 (激活血管平滑肌 K ⁺ 通道)	
4、干扰核酸代谢	①抗肿瘤药 (氟尿嘧啶-抗代谢药) ②抗病毒药 (齐多夫定-抑制核苷逆转录酶) ③抗菌药 (磺胺药-二氢蝶酸合酶抑制剂、喹诺酮-DNA 回旋酶和拓扑异构酶IV)	
5、补充体内物质	铁剂治疗缺铁性贫血、胰岛素治疗糖尿病、补充维生素/微量元素	

6、改变细胞周围环境的理化性质	氢氧化铝（抗酸）、甘露醇（脱水）、二巯基丁二酸钠（重金属解毒）、硫酸镁（泻药）、右旋糖酐（容量扩张）
7、影响生理活性物质及其转运体	解热镇痛药（影响前列腺素）、噻嗪类利尿药（抑制 Na^+-Cl^- 转运体）、丙磺舒（竞争肾小管分泌转运体）
8、影响免疫功能	免疫抑制药（环孢素）、免疫调节药（左旋咪唑）、本身就是抗体/抗原（丙种球蛋白/疫苗）
9、非特异性作用	主要与理化性质有关：消毒防腐药、蛋白沉淀剂、调节酸碱药