

《药专业知识一》考前密卷（二）答案与解析

一、最佳选择题

1.

【正确答案】E

【答案解析】药物的名称有通用名（也称为国际非专利药品名称）、化学名、商品名三大类型。

2.

【正确答案】C

【答案解析】其余选项都属于按照形态分类的剂型分类。

3.

【正确答案】D

【答案解析】输液瓶铝盖、铝塑组合盖属于Ⅲ类药包材。

4.

【正确答案】C

【答案解析】可溶片：水温为 $20^{\circ}\text{C} \pm 5^{\circ}\text{C}$ ，应在 3 分钟内全部崩解并溶化。如有 1 片不能完全崩解或溶化，应另取 6 片复试，均应符合规定。

5.

【正确答案】E

【答案解析】稳定性试验包括影响因素试验、加速试验与长期试验。影响因素试验又包括：高温试验、高湿度试验、强光照射试验。

6.

【正确答案】C

【答案解析】化学合成药物中的有机药物、天然药物及其半合成药物都是有机化合物，这些药物都是由一个核心的主要骨架结构（又称母核）和与之相连接的基团或片段（又称为药效团）组成。

7.

【正确答案】E

【答案解析】抗肿瘤药物白消安与谷胱甘肽的结合，由于甲磺酸酯是较好的离去基团，先和巯基生成硫醚的结合物，然后生成的硫醚和分子中的另一个甲磺酸酯基团作用环合形成氢化噻吩。

8.

【正确答案】B

【答案解析】作用于神经系统的药物，需通过血脑屏障，应具有较大的脂溶性。

9.

【正确答案】A

【答案解析】脂水分配系数可以反应药物的水溶性和脂溶性。药物的吸收、分布、

排泄过程是在水相和脂相间经多次分配实现的，因此要求药物既具有脂溶性又有水溶性。

10.

【正确答案】C

【答案解析】当外界环境的 $\text{pH}=\text{pK}_a$ 时，分子型和离子型分别占 50%。

11.

【正确答案】D

【答案解析】AB 属于含芳环的氧化代谢，C 选项卡马西平含有双键经代谢生成环氧化合物，E 选项为酯类的水解，均属于第 I 相生物转化。D 选项是与氨基酸的结合反应属于第 II 相生物转化。

12.

【正确答案】E

【答案解析】参与药物代谢的细胞色素亚型主要有：CYP1A2 (4%)，CYP2A6 (2%)，CYP2C9 (10%)，CYP2C19 (2%)，CYP2D6 (30%)，CYP2E1 (2%)，CYP3A4 (50%)。

13.

【正确答案】D

【答案解析】血管紧张素转换酶抑制药类药物用于治疗高血压、充血性心力衰竭 (CHF) 等心血管疾病。但同时也阻断了缓激肽的分解，增加呼吸道平滑肌分泌前列腺素、慢反应物质以及神经激肽 A 等，导致血压过低、血钾过多、咳嗽、皮疹、味觉障碍等不良反应，特别是干咳是其发生率较高的不良反应。

14.

【正确答案】D

【答案解析】萘普生和布洛芬是芳基丙酸类非甾体抗炎药的典型代表药物。

15.

【正确答案】D

【答案解析】吡罗昔康属于 1, 2-苯并噻嗪类非甾体抗炎药；布洛芬和萘普生属于芳基丙酸类非甾体抗炎药；吲哚美辛和舒林酸属于芳基乙酸类非甾体抗炎药。

16.

【正确答案】D

【答案解析】培美曲塞是具有多靶点抑制作用的抗肿瘤药物，能够抑制胸苷酸合成酶、二氢叶酸还原酶和甘氨酸酰胺核苷酸甲酰转移酶、氨基咪唑甲酰胺核苷酸甲酰基转移酶等的活性，影响了叶酸代谢途径，使嘧啶和嘌呤合成受阻。培美曲塞临床上主要用于非小细胞肺癌和耐药性间皮瘤的治疗。

17.

【正确答案】E

【答案解析】度洛西汀为一种强效的选择性 5-HT 和 NE 再摄取抑制药；对两者都

有高度亲和力，用于治疗重度抑郁症，糖尿病周围神经痛，女性中至重度应激性尿失禁。

18.

【正确答案】A

【答案解析】利用前药原理，将肾上腺素苯环上的两个羟基酯化，获得双特戊酯药物地匹福林，该药物可改善透膜吸收，并延长作用时间。用于治疗开角型青光眼，在眼内角膜酯酶的作用下，迅速水解为肾上腺素而发挥作用，产生散瞳、降眼压作用。

19.

【正确答案】C

【答案解析】ABD 属于磺酰脲类胰岛素分泌促进剂，氟尿嘧啶不是降血糖药物。

20.

【正确答案】B

【答案解析】本题考查西咪替丁的结构类型及特点。西咪替丁的结构中含有咪唑环，故本题答案应选 B。

21.

【正确答案】A

【答案解析】血管紧张素 II 受体拮抗剂的名称为 XX 沙坦。

22.

【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。

23.

【正确答案】E

【答案解析】纯化水为饮用水经蒸馏法、离子交换法、反渗透法或其他适宜方法制得的制药用水，不含任何附加剂。可作为配制普通药物制剂的溶剂或试验用水，口服、外用制剂配制用溶剂或稀释剂。纯化水不得用于注射剂的配制与稀释。

24.

【正确答案】C

【答案解析】注射剂应具有与血浆相同的或略偏高的渗透压。

25.

【正确答案】E

【答案解析】口腔黏膜给药制剂即可治疗局部病变，又可发挥全身治疗作用。

26.

【正确答案】C

【答案解析】聚乙二醇类对黏膜产生刺激性，加入约 20% 的水润湿或在栓剂表面涂鲸蜡醇、使用硬脂醇薄膜可减轻刺激。

27.

【正确答案】E

【答案解析】栓剂系指药物与适宜基质制成供腔道给药的固体制剂。它只能外用不能口服，要检查融变时限，不用检查溶化性，中空栓可达到快速释药目的。

28.

【正确答案】C

【答案解析】搽剂系指原料药物用乙醇、油或适宜的溶剂制成的溶液、乳状液或混悬液，供无破损皮肤揉擦用的液体制剂。

29.

【正确答案】E

【答案解析】血浆蛋白结合率高的药物，在白蛋白血症患者的血中药物浓度升高，则 V 值减少。

30.

【正确答案】B

【答案解析】根据公式 $V=X_0/C_0$ ，其中 V 是表观分布容积， X_0 为静脉剂量， C_0 为初始浓度。所以 $V=80\text{mg}/20\ \mu\text{g/ml}=4\text{L}$ 。

31.

【正确答案】C

【答案解析】代谢和排泄过程合称为消除。

32.

【正确答案】A

【答案解析】促胃动力药多潘立酮可以促进胃排空，因此在胃内易破坏的红霉素在胃内的停留时间缩短，破坏减少，吸收增加。

33.

【正确答案】D

【答案解析】药物的分子量大小影响药物肺部吸收。小分子药物吸收快，大分子药物吸收相对较慢。

34.

【正确答案】A

【答案解析】眼部药物的吸收途径主要是角膜渗透和结膜渗透。角膜渗透是眼局部用药的有效吸收途径。

35.

【正确答案】B

【答案解析】副作用指在药物治疗剂量时，出现的与治疗目的无关的不适反应。副作用是由于药物的选择性低、作用广泛引起的，一般反应较轻微，多数可以恢复。

36.

【正确答案】A

【答案解析】第一信使是指多肽类激素、神经递质、细胞因子及药物等细胞外信使物质。环磷酸腺苷、环磷酸鸟苷、钙离子和二酰基甘油都是第二信使。

37.

【正确答案】D

【答案解析】继发反应是继发于药物治疗作用之后的不良反应，是治疗剂量下治疗作用本身带来的间接结果。例如，长期应用广谱抗生素，使敏感菌被杀灭，而非敏感菌（如厌氧菌、真菌）大量繁殖，造成二重感染。

38.

【正确答案】D

【答案解析】有些药物对机体的代谢过程可产生多种影响，破坏其动态平衡，使相应的生理功能受损，这是药物呈现毒性作用较常见的方式。如四环素通过干扰肝细胞的代谢过程，抑制三酰甘油从肝内析出，抑制脂肪受体蛋白的合成而导致肝内脂肪堆积形成脂肪肝。

39.

【正确答案】B

【答案解析】质反应中药物的 LD_{50} 引起半数实验动物死亡的剂量称半数致死量。其数值越大证明毒性越小。

40.

【正确答案】C

【答案解析】慢代谢者有 80% 发生多发性神经炎，而快代谢者仅 20% 有此不良反应。这是由于异烟肼在体内可与维生素 B_6 反应，使后者失活，从而导致维生素 B_6 缺乏性神经损害，故一般服异烟肼需同时服用维生素 B_6 以减轻此不良反应。

二、配伍选择题

[41~42]

【正确答案】A、C

【答案解析】化学药是通过化学合成的方式得到的小分子的有机或无机药物。生物制品不同于一般医用药品，它是通过刺激机体免疫系统，产生免疫物质（如抗体）才发挥其功效，在人体内出现体液免疫、细胞免疫或细胞介导免疫。

[43~45]

43.

【正确答案】C

【答案解析】离子-偶极，偶极-偶极相互作用通常见于羰基类化合物，如酰胺、酯、酰卤、酮等。

44.

【正确答案】A

【答案解析】共价键键合类型多发生在化学治疗药物的作用机制上，例如烷化剂类抗肿瘤药物，与 DNA 中鸟嘌呤碱基形成共价结合键，产生细胞毒活性。

45.

【正确答案】B

【答案解析】药物与生物大分子通过氢键相结合的例子在药物的作用中比比皆是，如磺酰胺类利尿药通过氢键和碳酸酐酶结合，其结合位点与碳酸和碳酸酐酶的结合位点相同。

[46~48]

46.

【正确答案】B

【答案解析】酸酸碱碱促吸收，弱酸性药物在酸性的胃中解离少，分子型的多，吸收增加。

47.

【正确答案】B

【答案解析】弱碱性药物在碱性的小肠中解离少，分子型多，吸收增加。

48.

【正确答案】C

【答案解析】弱酸性药物在碱性的肠道中解离多，分子型的少，吸收减少。

[49~51]

49.

【正确答案】D

【答案解析】缬沙坦可和氨氯地平组成复方用于治疗原发性高血压，特别是单药治疗不能充分控制血压的患者，结构中含有四氮唑基团。

50.

【正确答案】B

【答案解析】舒林酸属前体药物，它在体外无效，在体内经肝代谢，甲基亚砷基被还原为甲硫基化合物而显示生物活性。

51.

【正确答案】A

【答案解析】对乙酰氨基酚主要在肝脏代谢，其主要代谢物是与葡萄糖醛酸或硫酸结合产物；极少部分可由 CYP450 氧化酶系统转化成毒性代谢产物 N-羟基衍生物和 N-乙酰亚胺醌。

[52~54]

【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。

[55~56]

55.

【正确答案】C

【答案解析】丙烯酸树脂、羟丙甲纤维素为薄膜衣材料。

56.

【正确答案】D

【答案解析】泡腾崩解剂是一种专用于泡腾片的特殊崩解剂，最常用的是由碳酸氢钠与枸橼酸组成的混合物。

[57~59]

57.

【正确答案】B

【答案解析】增溶是指难溶性药物在表面活性剂的作用下，在溶剂中增加溶解度并形成溶液的过程。具增溶能力的表面活性剂称为增溶剂。

58.

【正确答案】E

【答案解析】难溶性药物与加入的第三种物质在溶剂中形成可溶性分子间的络合物、缔合物或复盐等，以增加药物在溶剂中的溶解度。这第三种物质称为助溶剂。助溶剂多为某些有机酸及其盐类如苯甲酸、碘化钾等，酰胺或胺类化合物如乙二胺等，一些水溶性高分子化合物如聚乙烯吡咯烷酮等。

59.

【正确答案】A

【答案解析】潜溶剂系指能形成氢键以增加难溶性药物溶解度的混合溶剂。能与水形成潜溶剂的有乙醇、丙二醇、甘油、聚乙二醇等。

[60~62]

【正确答案】E、C、A

【答案解析】混悬型注射剂中常用的助悬剂有：甲基纤维素，羧甲基纤维素钠，

明胶等；常用的抑菌剂有：苯甲醇，三氯叔丁醇等；而氯化钠是调节渗透压；盐酸调节 pH；焦亚硫酸钠是抗氧化剂。

[63~66]

【正确答案】D、C、B、A

【答案解析】前体脂质体是将脂质吸附在极细的水溶性载体；长循环脂质体是用 PEG 修饰可增加脂质体的柔顺性和亲水性，从而降低与单核巨噬细胞的亲和力，前体脂质体是将脂质吸附在极细的水溶性载体；长循环脂质体是用 PEG 修饰可增加脂质体的柔顺性和亲水性，从而降低与单核巨噬细胞的亲和力，延长循环时间；免疫脂质体表面联接抗体，对靶细胞进行识别，提高脂质体的靶向性；利用在相变温度时，脂质体的类脂质双分子层膜从胶态过渡到液晶态，脂质膜的通透性增加，药物释放速度增大的原理制成热敏脂质体。

[67~69]

【正确答案】C、B、A

【答案解析】本题考查药物微囊化材料。合成高分子囊材有非生物降解的和生物降解的两类。前者有聚酰胺、聚乙烯醇、硅胶等。后者有聚乳酸、聚碳酸酯、聚氨基酸、乙交酯丙交酯共聚物、聚乳酸-聚乙二醇嵌段共聚物等。半合成高分子囊材有羧甲基纤维素盐、醋酸纤维素酞酸酯、羟丙甲基纤维素、甲基纤维素、乙基纤维素等，其中乙基纤维素不溶于水。明胶属于天然的高分子材料。枸橼酸是有机酸，不是高分子材料。 β -CYD 属于环糊精，是包合材料。故本题答案应选 CBA。

[70~73]

70.

【正确答案】D

【答案解析】选项中只有维生素 C 可以作为抗氧化剂使用。

71.

【正确答案】B

【答案解析】常用的抛射剂有氢氟烷烃、碳氢化合物及压缩气体。七氟丙烷属于氢氟烷烃。

72.

【正确答案】C

【答案解析】选项中只有聚山梨酯-80 是表面活性剂。

73.

【正确答案】A

【答案解析】常用的潜溶剂是醇类和甘油。

[74~75]

74.

【正确答案】C

【答案解析】 t_{max} 是达峰时间，达峰时间最长的是 C。

75.

【正确答案】A

【答案解析】 C_{max} 是峰浓度， C_{max} 最大的是 A。

[76~77]

76.

【正确答案】A

【答案解析】达坪分数用 f_{ss} 表示，所以选 A。

77.

【正确答案】C

【答案解析】血药浓度用 C 表示，所以在选项 CE 中选择，单室模型血管外给药公式中含有吸收系数 F ，所以选 C。E 是单室模型静脉滴注给药血药浓度公式。

[78~80]

78.

【正确答案】C

【答案解析】时辰药效学和时辰毒理学是研究机体对药物效应呈现的周期性节律变化规律的学科，分别以有效性或毒性作为研究重点。

79.

【正确答案】E

【答案解析】时辰药动学是研究药物在体内过程中的节律变化。

80.

【正确答案】B

【答案解析】时间生物学是一门以研究生物节律，即生命活动的周期规律及其产生机制与应用的新兴交叉性生命学科。

时辰药理学研究药物与生物的内源性周期节律变化的关系，是在对药物治疗效果进行研究的基础上，根据机体生物节律，选择合理药物用药时间的药理学分支学科。

[81~82]

【正确答案】C、B

【答案解析】本题考点是药物与受体结合的特点，5 项，口诀：多吃灵芝可以特别饱。受体具有饱和性、特异性、可逆性、灵敏性和多样性等。依据字面意思理解和解题。故本组题选 C、B。

[83~85]

83.

【正确答案】A

【答案解析】受体脱敏是指在长期使用一种激动药后，组织或细胞的受体对激动药的敏感性和反应性下降的现象。

84.

【正确答案】C

【答案解析】受体增敏是与受体脱敏相反的一种现象，可因长期应用拮抗药或激动药水平降低，造成受体数量或敏感性提高。

85.

【正确答案】E

【答案解析】同源脱敏是指只对一种类型受体的激动药的反应下降，而对其他类型受体激动药的反应性不变。

[86~88]

86. 【正确答案】A

【答案解析】普鲁卡因胺可致狼疮样综合征。

87.

【正确答案】B

【答案解析】异烟肼可诱发慢性坏死性肝炎。

88.

【正确答案】C

【答案解析】造影剂可导致梗阻性急性肾功能衰竭。

[89~93]

【正确答案】A、C、D、E、B

【答案解析】本题考察不良反应的定义和分类，注意掌握。

[94~96]

94.

【正确答案】A

【答案解析】有些药物并无特异性作用机制，而主要与理化性质有关。如消毒防腐药对蛋白质有变性作用，因此只能用于体外杀菌或防腐，不能内服。

95.

【正确答案】C

【答案解析】解热镇痛抗炎药阿司匹林通过抑制环氧酶（COX）发挥作用。

96.

【正确答案】D

【答案解析】有些药物通过补充生命代谢物质，治疗相应的缺乏症，如铁剂治疗

缺铁性贫血；胰岛素治疗糖尿病；补充维生素、多种微量元素。

[97~100]

97.

【正确答案】A

【答案解析】服用异烟肼患者慢代谢者有 80% 发生多发性神经炎，发生肝损害者中 86% 是快代谢者。

98.

【正确答案】B

【答案解析】服用异烟肼患者慢代谢者有 80% 发生多发性神经炎，发生肝损害者中 86% 是快代谢者。

99.

【正确答案】C

【答案解析】血浆假性胆碱酯酶缺乏的人对琥珀胆碱水解灭活能力减弱，常规剂量应用时可引起呼吸麻痹时间延长。

100.

【正确答案】E

【答案解析】乙醛脱氢酶缺乏者饮酒后血中乙醛水平明显升高，导致儿茶酚胺介导的血管扩张以及营养障碍症状，出现面部潮红、心率增快、出汗、肌无力等不良反应。

三、综合分析选择题

[101~104]

101.

【正确答案】B

【答案解析】舒巴坦是青霉素类抗生素，亚胺培南是碳青霉烯类。

102.

【正确答案】D

【答案解析】注射用无菌粉末在使用前应该使用灭菌注射用水进行稀释，不能用注射用水，因为注射用水没有经过灭菌。

103.

【正确答案】E

【答案解析】释放度是缓控释制剂的检查项目，不是注射用无菌粉末的质量检查项目。

104.

【正确答案】C

【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。

[105~107]

105.

【正确答案】A

【答案解析】洛伐他汀是天然的他汀类药物，但由于分子中存在内酯结构，所以体外无 HMG-CoA 还原酶抑制作用，需进入体内后分子中的羟基内酯结构水解为 3, 5-二羟基戊酸才表现出活性。临床上用于治疗高胆固醇血症和混合型高脂血症，也可用于缺血性脑卒中的防治。

106.

【正确答案】A

【答案解析】氟伐他汀是第一个通过全合成得到的他汀类药物。水溶性好，口服吸收迅速而完全，与蛋白结合率较高。除具强效降血脂作用外，还有抗动脉硬化的潜在功能，降低冠心病发病率及死亡率。

107.

【正确答案】C

【答案解析】他汀类药物会引起肌肉疼痛或横纹肌溶解的副作用，特别是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后，更加引起人们的关注。

[108~110]

108.

【正确答案】E

【答案解析】肾上腺素经儿茶酚-O-甲基转移酶 (COMT) 快速甲基化后生成 3-O-甲基肾上腺素，活性降低。

109.

【正确答案】D

【答案解析】将异丙肾上腺素苯核 3 位的酚羟基用羟甲基取代，N 原子上的异丙基用叔丁基取代，得到沙丁胺醇，其化学稳定性增加，不易被消化道内的硫酸酯酶和组织中的儿茶酚氧位甲基转移酶破坏，故口服有效。其他选项药物结构中均含有邻二酚羟基，易于在体内代谢，口服无效。

110.

【正确答案】C

【答案解析】将异丙肾上腺素分子中的邻二羟基改为间二羟基得到硫酸特布他林，对气管 β_2 受体选择性较高，对心脏 β_1 受体的作用仅为异丙肾上腺素的 1/100。且不易被 COMT、MAO 或硫酸酯酶代谢，化学稳定性提高，可口服，作用持久。将特布他林苯环上两个酚羟基酯化制成的双二甲氨基甲酸酯前药为盐酸班布特罗，吸收后在体内经肝脏代谢成为有活性的特布他林而发挥作用。

四、多项选择题

111.

【正确答案】ABCD

【答案解析】为适应治疗或预防的需要而制成的药物应用形式，称为药物剂型，

简称剂型。

在各种剂型中都包含有许多不同的具体品种，我们将其称为药物制剂，亦即：根据药典或药政管理部门批准的标准、为适应治疗或预防的需要而制成的药物应用形式的具体品种，称为药物制剂，简称制剂。

112.

【正确答案】 ABD

【答案解析】 本题考查药物的结合反应。产生水溶性代谢物的有：与葡萄糖醛酸的结合反应、与硫酸的结合反应、与氨基酸的结合反应、与谷胱甘肽的结合反应。C、E 使代谢物水溶性降低。故本题答案应选 ABD。

113.

【正确答案】 ACD

【答案解析】 BE 选项为第 II 相反应，其余都是第 I 相反应。

114.

【正确答案】 ABCDE

【答案解析】 用于骨质疏松治疗的药物主要有两类：双膦酸盐类和促进钙吸收药物。前者主要包括依替膦酸二钠、阿仑膦酸钠和利塞膦酸钠、唑来膦酸钠、米诺膦酸钠。后者主要包括维生素 D₃、阿法骨化醇和骨化三醇。

115.

【正确答案】 CD

【答案解析】 盐酸吡格列酮和罗格列酮都属于噻唑烷二酮类的降糖药，含有噻唑烷二酮的结构。

116.

【正确答案】 ABC

【答案解析】 表面活性剂没有氧化、还原作用。

117.

【正确答案】 ABCDE

【答案解析】 脂质体的质量评价包括：形态、粒径及其分布；包封率和载药量测定；突释效应或渗漏率的检查；靶向制剂评价；脂质体的稳定性的检查。

118.

【正确答案】 AE

【答案解析】 BCD 属于营养输液，不是血浆代用液。

119.

【正确答案】 ABE

【答案解析】 贴剂的优点

(1) 避免了口服给药可能发生的肝首关效应及胃肠灭活，药物可长时间持续扩散进入血液循环，提高了治疗效果。

- (2) 维持恒定有效的血药浓度，增强治疗效果，减少胃肠给药的副作用。
- (3) 延长作用时间，减少用药次数，改善患者用药顺应性。
- (4) 患者可以自行用药，适用于婴幼儿、老人和不宜口服给药及需长期用药的患者。

(5) 发现副作用可随时中断给药。

CD 是贴剂的局限性。

120.

【正确答案】AD

【答案解析】载体转运有主动转运和易化扩散两种方式。