



2 0 1 9 军 队 文 职 招 录 考 试

考前30分

30 Points Before The Examination

再看我一眼，多拿30分！

药

学

目录

第一章 药剂学专业知识	1
第一节 药剂学基础知识	1
第二节 散剂、颗粒剂	2
第三节 片 剂	3
第四节 液体制剂	7
第五节 灭菌制剂	11
第六节 其他制剂	14
第二章 药理学专业知识	17
第一节 药物的体内过程	17
第二节 药效学	19
第三节 药物的剂量与效应关系	19
第四节 药物的作用机制与受体	20
第五节 抗菌药	20
第六节 呼吸系统疾病用药	25
第七节 消化系统用药	26
第八节 内分泌系统用药	27

第九节 循环系统用药	31
第十节 镇静催眠药	33
第十一节 解热镇痛抗炎药	34
第三章 药物分析专业知识	36
第一节 药品标准	36
第二节 药物分析基础	38
第三节 药物的杂质检查	40
第四章 药物化学基础知识	43
第一节 药物的理化性质与药物的作用	43
第二节 药物的结构与药物的作用	44

军队文职药学专业一考前 30 分

第一章 药剂学专业知识

第一节 药剂学基础知识

一、药剂学专业知识

1. 药剂学的定义

药剂学是研究药物配制理论、生产技术以及质量控制合理利用等内容的综合性应用技术学科。

2. 剂型的分类

(1)形态：固、半固、液、气。

(2)给药途径：口服、注射、皮肤、口腔、鼻腔、眼部、肺部、直肠、阴道、尿道、呼吸道。

(3)分散系统：真溶液、胶体溶液、乳剂型、混悬剂、气体分散型、固体分散型、微粒分散型。

(4)制法：浸出制剂、无菌制剂等。

(5)作用时间：速释、普通、缓控释。

3. 剂型的重要性

(1)改变药物作用性质。如：硫酸镁口服用作泻下药；5%注射液静脉滴

注,具有镇静、解痉作用;外敷具有收敛杀菌作用。

(2)调节药物作用速度。

(3)可降低(或消除)药物的不良反应。如:氨茶碱制成栓剂可消除心悸等不良反应。

(4)可产生靶向作用。

(5)可提高药物稳定性。稳定性:固体制剂>液体制剂。

(6)可影响疗效。

4. 影响药物制剂稳定性的因素

(1)处方因素对药物制剂稳定性的影响:pH的影响;广义酸碱催化的影响;溶剂的影响;离子强度的影响;表面活性剂的影响;处方中基质或赋形剂的影响。

(2)外界因素对药物制剂稳定性的影响:温度的影响;光线的影响;空气(氧)的影响;金属离子的影响;湿度和水分的影响;包装材料的影响。

第二节 散剂、颗粒剂

一、固体制剂的分类、特点与一般质量要求

1. 固体制剂分为散剂、颗粒剂、胶囊剂和片剂。

2. 固体制剂的特点:

(1)物理、化学稳定性好,生产工艺稳定,生产成本低;

(2)制备过程前处理需经历相同的单元操作;

(3)药物在体内需先溶解后再被吸收进入血液循环;

(4)计量交易控制;

(5)贮存、运输、服用以及携带方便。

二、散剂的分类、特点和质量要求

散剂的质量要求

- (1)口服:细粉;局部:最细粉。
- (2)毒性、贵重、剂量小:配研法混匀并过筛。
- (3)多剂量散剂:附分剂量的用具。
- (4)含毒口服散剂:单剂量包装。
- (5)散剂中可含或不含辅料。
- (6)密闭、密封(挥发、易吸潮)。
- (7)其他检查项目:

外用散剂和用于烧伤或严重创伤的中药外用散剂通过七号筛的粉末重量不得少于95%;中药含水量不得超过9.0%;干燥失重量不得超过2.0%;用于烧伤、严重创伤或临床必需无菌的局部用散剂应符合无菌要求。

第三节 片 剂

一、片剂的分类、特点和质量要求

片剂:药物与适宜的辅料制成圆片状或异形片状的固体制剂,中药还有浸膏片、半浸膏片和全粉片等。

1. 优点

- (1)剂量准确,服用方便;
- (2)更稳定(散剂、颗粒剂);
- (3)生产机械化程度高,成本低;

- (4) 种类较多；
- (5) 运输、使用、携带方便。

2. 缺点

- (1) 幼儿及昏迷患者等不易吞服；
- (2) 制备工序较其他固体制剂多；
- (3) 某些含挥发性成分的片剂，贮存期内含量会下降。

3. 片剂的类型

类型	作用特点
含片	口腔中缓慢溶化，产生局部或全身作用
舌下片	舌下黏膜吸收，发挥全身作用，急症治疗
口腔贴片	粘贴于口腔黏膜，起局部或全身作用
咀嚼片	咀嚼后吞服，一般加入甘露醇、蔗糖等水溶性辅料；硬度适宜
可溶片	临用前溶解于水的片剂，可口服、外用、含漱
泡腾片	含有碳酸氢钠和有机酸，遇水产生气体呈泡腾状的片剂
阴道片 (泡腾片)	置于阴道内，溶化、崩解释放，主要起局部杀菌消炎或给予性激素类药物
肠溶片	肠溶材料包衣，防止药物在胃中被破坏；治疗结肠疾病的药物，可包结肠定位肠溶衣

4. 巧记黏合剂 & 崩解剂

- (1) XX 基纤维素——黏合剂(甲基纤维素、乙基纤维素、羟丙基纤维素、羟丙甲纤维素)。
- (2) 低取代 XX 纤维素——崩解剂(低取代羟丙基纤维素)。
- (3) 羧甲基纤维素钠——黏合剂。

- (4) 羧甲基淀粉钠——崩解剂。
- (5) 羧甲基纤维素钠、聚维酮——黏合剂。
- (6) 交联 XXX——崩解剂。

5. 片剂制备中常见问题

问题	原因
裂片	物料细粉太多,压缩时空气未能及时排出;物料塑性较差,结合力弱;工艺因素
松片	片剂硬度不够,黏性较差
崩解迟缓	片剂压力过大,影响水分渗入;黏合剂使片剂结合力过强;崩解剂性能较差
溶出超限	片剂不崩解、颗粒过硬或药物溶解度差等
含量不均匀	片重差异超限,药物混合度差,可溶性成分的迁移等,小剂量的更容易出现

6. 片剂的包衣目的

- (1) 掩盖药物的苦味或不良气味;
- (2) 防潮、避光,增加药物稳定性;
- (3) 用于隔离药物,避免药物配伍变化;
- (4) 改善片剂的外观,提高流动性和美观;
- (5) 控制药物在胃肠道的释药部位,胃溶、肠溶、缓控释等。

7. 包糖衣的流程

片芯→包隔离层→包粉衣层→包糖衣层→包有色糖衣层

8. 包薄膜衣的材料

类型	材 料
胃溶型	羟丙甲纤维素(HPMC)、羟丙基纤维素(HPC)、丙烯酸树脂 IV 号,聚维酮等
肠溶型	醋酸纤维素酞酸酯(CAP),丙烯酸树脂 I、II、III 号,羟丙甲纤维素酞酸酯(HPMCP)
水不溶型	乙基纤维素
增塑剂	水溶性:丙二醇、甘油、聚乙二醇等 水不溶性:甘油三醋酸酯、乙酰化甘油酸酯、邻苯二甲酸酯等
致孔剂	蔗糖、氯化钠、表面活性剂、PEG 等
遮光剂	二氧化钛(也可用于胶囊壳的遮光材料)

二、胶囊剂的分类、特点和质量要求

胶囊剂:原料药物与适宜辅料混合充填与空心胶囊或密封于软质囊材中的固体制剂。

1. 不宜制成胶囊剂的药物

- (1) 药物的水溶液或稀乙醇溶液;
- (2) 风化性药物;
- (3) 吸湿性很强的药物;
- (4) 易溶性的刺激性药物。

2. 胶囊剂的质量要求:崩解时限。

凡规定检查溶出度或释放度的胶囊剂,不在进行崩解时限的检查。(软硬兼施)

剂型分类	指 标
硬胶囊	30 分钟崩解
软胶囊	60 分钟崩解
肠溶胶囊	盐酸溶液 2 小时不崩解,pH6.8 磷酸盐缓冲液 1 小时崩解
结肠胶囊	人工胃液 2 小时不崩解;pH6.8 磷酸盐缓冲液 3 小时不崩解;pH7.8 磷酸盐缓冲液,1 小时崩解

第四节 液体制剂

一、液体制剂的溶剂和附加剂

1. 溶剂

(1)极性溶剂:水、甘油、二甲基亚砷。

(2)半极性溶剂:乙醇、丙二醇、聚乙二醇。

(3)非极性溶剂:脂肪油、液体石蜡、乙酸乙酯等。

2. 常用附加剂

①增溶剂——表面活性剂的增溶作用。

②助溶剂——与难溶性溶质发生化学反应生成可溶性分子间络合物或复盐,增加溶解度。

③潜溶剂——能形成氢键以增加难溶性药物溶解度的混合溶剂。

防腐剂

①苯甲酸、苯甲酸钠;

②对羟基苯甲酸酯(尼泊金类):有甲乙丙丁四种酯,混合使用具有协同作用,防腐作用强;与聚山梨酯类(吐温类)配伍,防腐作用降低;

③山梨酸与山梨酸钾;

- ④苯扎溴铵(新洁尔灭);
- ⑤其他防腐剂:苯酚、苯甲醇、硝酸苯汞、硫柳汞。

二、表面活性剂

1. 定义:具有很强表面活性,加入少量就能使液体表面张力显著下降的物质。

2. 表面活性剂的结构

(1)表面活性剂分子的结构特征:由具有极性的亲水基和非极性的亲油基组成,而且两部分分处两端;

(2)表面活性剂具有既亲水又亲油的两亲性质;

(3)具有两亲性的分子不一定是表面活性剂。

3. 分类

类别	代 表
阴离子型	硬脂酸钙、硬脂酸钠、十二烷基硫酸钠
阳离子型	苯扎溴铵、苯扎氯铵
两性离子型	卵磷脂、豆磷脂;氨基酸型、甜菜碱型
非离子型	聚山梨酯类(吐温)、脂肪酸山梨坦类(司盘)、泊洛沙姆

4. 表面活性剂的基本性质

(1)形成胶束

临界胶束浓度:表面活性剂分子缔合形成胶束的最低浓度即为临界胶束浓度(CMC)。

(2)亲水亲油平衡值(HLB)

每一种表面活性剂都有一定的亲水基团具有亲水能力,并对亲油基团的

亲油能力具有一定的平衡关系,这种关系称亲水亲油平衡值,即 HLB 值,是个相对值。

HLB 值应用:

3~6 W/O 型乳化剂;13~18 增溶剂;

7~9 润湿剂与铺展剂;0.8~3 消泡剂;

8~18 O/W 型乳化剂;13~16 去污剂。

5. 表面活性剂的毒性

(1) 阳离子 > 阴离子 > 非离子;

(2) 两性离子毒性和刺激性均小于阳离子;

(3) 口服非离子型表面活性剂一般认为是无毒性的;

(4) 静脉给药毒性大于口服;

(5) 能够静脉使用的表面活性剂有:泊洛沙姆、卵磷脂、豆磷脂。

三、高分子溶液剂与溶胶剂

1. 高分子溶液剂

(1) 定义:高分子化合物(胃蛋白酶、聚维酮、羧甲基纤维素钠等)以单分子形式分散于介质中形成的均相体,属于热力学稳定体系。

2. 溶胶剂

(1) 定义:固体药物以多分子聚集体的形式分散在水中形成的非均相液体制剂,热力学不稳定体系,动力学稳定体系。

(2) 溶胶剂的特点

① 胶粒间带有同种电荷,使胶粒不容易聚结;

② 胶粒做“布朗运动”,在重力场中不会沉降,动力学稳定;胶粒碰撞变

大,布朗运动减弱,动力学稳定性降低,导致聚沉;

③光学性质——丁达尔效应(Tyndall 效应);

④双电层结构。

四、混悬剂

1. 混悬剂的特点

(1)有助于难溶性药物制成液体制剂,提高药物的稳定性。

(2)相比于固体制剂便于服用;粗分散体,掩盖不良气味。

(3)产生长效作用。

2. 混悬剂常用稳定剂

(1)润湿剂

(2)助悬剂

(3)絮凝剂与反絮凝剂

五、乳剂

1. 乳剂组成:油相(Oil),水相(Water)和乳化剂是构成乳剂的基本成分,为了增加乳剂的稳定性,乳剂中还可加入辅助乳化剂与防腐剂、抗氧剂等附加剂。

2. 乳剂的分类

(1)按分散系统的组成分类

单乳:水包油型(O/W)和油包水型(W/O);

复乳:水包油包水 W/O/W,油包水包油 O/W/O。

3. 乳化剂

乳化剂的作用:有效地降低界面张力,有利于形成乳滴并使液滴荷电形

成双电层,使乳剂保持一定的分散度和稳定性。

4. 乳化的稳定性

乳剂属于热力学不稳定的非均相分散体系,放置过程中会出现分层、合并、破裂、絮凝、转相、酸败等不稳定现象。

分层	乳剂放置后在重力的作用下,分散相粒子上浮或下沉的现象,与密度差有关。	可逆
絮凝	分散相乳滴电荷减少, ζ 电位降低,出现的可逆性聚集现象。	可逆
合并	乳化膜部分破裂导致液滴合并变大的现象。	
破裂	液滴合并进一步发展,最后使乳剂变成油相和水相两相的过程。	不可逆
转相	乳化剂性质改变,由 O/W 转变成 W/O 或发生相反的变化。	可逆
酸败	外界因素或微生物影响,油、乳化剂发生变质的现象(防腐剂、抗氧化剂)。	不可逆

第五节 灭菌制剂

一、注射剂的溶剂与附加剂

1. 注射用水

制药用水	制备方法	用途
纯化水	饮用水经蒸馏法、离子交换法、反渗透法制得,不含任何附加剂	口服或外用液体制剂的溶剂
注射用水	纯化水经蒸馏所得	注射剂、滴眼剂等溶剂的稀释剂及容器的清洗剂
灭菌注射用水	注射用水按照注射剂生产工艺制备所得,不含任何添加剂	

2. 注射用油

大豆油、茶油、麻油等植物油。

3. 注射剂的附加剂

类型	附加剂
抗氧化剂	亚硫酸氢钠、焦亚硫酸钠、硫代硫酸钠
金属离子螯合剂	依地酸二钠(EDTA-2Na)
缓冲剂(pH 调节剂)	碳酸氢钠、碳酸钠;醋酸、醋酸钠;磷酸氢二钠、磷酸二氢钠
助悬剂	羧甲基纤维素
增溶剂、润湿剂或乳化剂	聚山梨酯类、泊洛沙姆、卵磷脂
抑菌剂	苯酚、三氯叔丁醇、硝酸苯汞、尼泊金类
渗透压调节剂	氯化钠、葡萄糖、甘油

二、热原

指微生物产生的一种内毒素,能引起恒温动物体温异常升高的物质,大多数细菌,霉菌甚至部分病毒都可能产生热原,制热能力最强的是革兰阴性杆菌。

热原的性质

(1)水溶性——磷脂结构连接多糖,能溶解于水。

(2)不挥发性——蒸馏时随水蒸气进入蒸馏水中,故蒸馏器应有完好的隔沫装置,以防止热原污染。

(3)耐热性——一般注射剂灭菌条件下,热原不能完全被破坏,但高温可以除热原,比如容器、器皿。

(4)滤过性——体积小,一般滤器可通过,活性炭可吸附热原。

(5)其他性质——能被强酸、强碱、强氧化剂如高锰酸钾、过氧化氢一级超声波破坏,也可被某些离子交换树脂吸附。

三、注射剂的临床应用

- (1)患者存在口服或吞咽障碍;
- (2)口服生物利用度低的药物;
- (3)患者病情严重,需要快速起效;
- (4)没有合适的口服剂型。

四、输液

静脉滴注输入体内的大剂量注射液,也称大容量注射液,通常包装与玻璃或塑料输液瓶或袋中,不含防腐剂或抑菌剂。

1. 分类及临床用途

电解质输液	补充水分,纠正电解质、酸碱平衡,如氯化钠等
营养输液	用于不能口服吸收营养的患者,补充能量、蛋白质和人体必需脂肪酸等;如葡萄糖注射液、复方氨基酸输液
胶体输液	与血液等渗的胶体溶液,增加血容量和维持血压的作用,如右旋糖酐、明胶、聚维酮等
含药输液	治疗疾病的含药输液(大多数),如氧氟沙星葡萄糖注射液

2. 输液的质量要求——比注射液更严格,不得添加抑菌剂。

五、注射用无菌粉末

又称粉针,指药物制成的供临用前用适宜溶液配制成注射液的无菌粉末或无菌块状物。适用于水中不稳定的药物尤其是对湿热敏感的水溶性药物,如:抗生素和生物制品。

六、眼用制剂

1. 质量要求

(1)滴眼剂、洗眼剂和眼内注射剂应与泪液等渗。

(2)用于眼外伤或术后的眼用制剂必须满足无菌,不能加入抑菌剂,一般单剂量包装;无外伤的滴眼剂,要求无致病菌,不得检测出铜绿假单胞菌和金葡菌。

(3)适当增加滴眼剂的黏度可延长药物在眼内的停留时间,增强疗效。

(4)眼用制剂贮存应密封避光,启用后最多可用4周。

2. 眼用液体制剂的附加剂

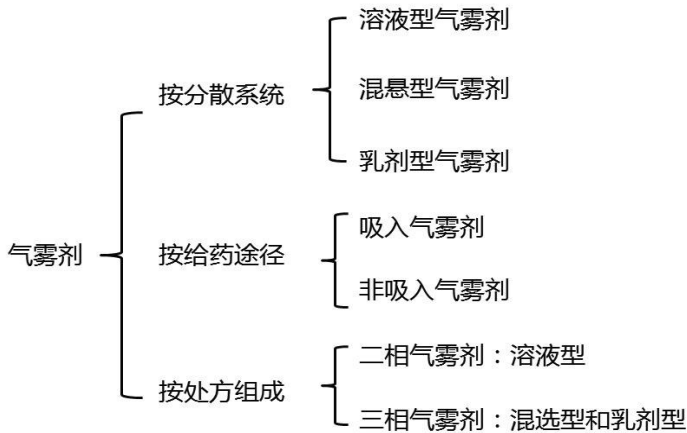
作用	附加剂
pH 调节剂(缓冲剂)	磷酸盐缓冲液、硼酸缓冲液、硼酸盐缓冲液
渗透压调节剂	氯化钠、葡萄糖、硼砂
抑菌剂	尼泊金类、硝酸苯汞、硫柳汞
调整黏度的附加剂	甲基纤维素、聚维酮等
增溶剂、抗氧剂、助溶剂等	

第六节 其他制剂

一、气雾剂

原料药物或原料药和附加剂与适宜的抛射剂共同装封于具有特制阀门系统的耐压容器中,使用时借助抛射剂的压力将内容物呈雾状物喷出,用于肺部吸入或直接喷至腔道黏膜、皮肤的制剂。

1. 气雾剂的分类



2. 气雾剂的抛射剂与附加剂

(1) 抛射剂

① 氟氯烷烃——氟利昂；

② 氢氟烷烃——HFA-134a(四氟乙烷)、HFA-227(七氟丙烷)等(最常用)；

③ 碳氢化合物——丙烷、正丁烷、异丁烷等；

④ 压缩气体——二氧化碳、氮气等。

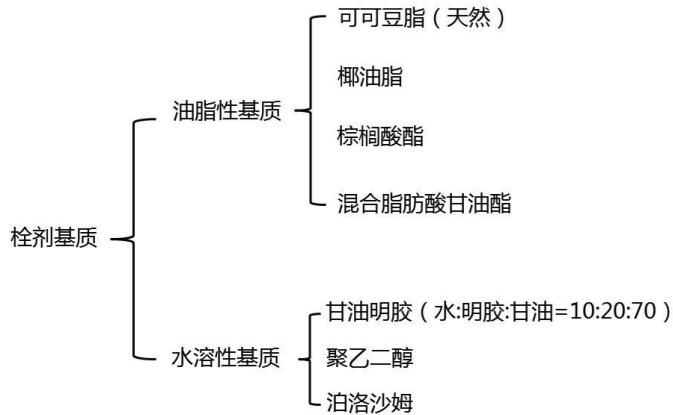
(2) 潜溶剂：乙醇、丙二醇、甘油、聚乙二醇常与水形成潜溶剂。

(3) 润湿剂常为表面活性剂。

二、栓剂

药物与适宜基质制成的具有一定形状供腔道给药的固体外用制剂，目前常用的有直肠栓、阴道栓和尿道栓等。

1. 基质的分类



2. 常用附加剂

栓剂常用附加剂	作用	代表
抗氧化剂	防止药物被氧化	叔丁基羟基茴香醚(BHA)、叔丁基对甲酚(BHT)
防腐剂		对羟基苯甲酸酯
硬化剂	避免过软	白蜡、硬脂酸、巴西棕榈蜡
增稠剂		氢化蓖麻油、单硬脂酸甘油酯、硬脂酸铝
吸收促进剂	促进药物吸收,起全身治疗作用	表面活性剂、脂肪酸、脂肪酸酯类、羟甲基纤维素钠

第二章 药理学专业知识

第一节 药物的体内过程

一、药物代谢动力学

(一)药物的吸收:从给药部位进入血液循环的过程叫做吸收。

包括:消化道给药、注射给药、呼吸道给药和皮肤黏膜给药。

(二)药物的分布及影响因素

药物进入血液后,随血液运至机体各组织的过程称为药物的分布。

(三)药物的代谢

1. 代谢过程:药物代谢过程分为 2 个时相。

(1)Ⅰ相:包括氧化、还原、水解,使药物分子结构中引入极性基团,如羟基、羧基、巯基、氨基等。

(2)Ⅱ相:为结合反应,将药物分子结构中的极性基团与体内的葡萄糖醛酸、甘氨酸、谷胱甘肽等,经共价键结合,生成极性大、易溶于水的结合物排出体外。

2. 酶诱导剂:长期使用某些药物能使酶活性增强的药物。如苯巴比妥、苯妥英钠、利福平、卡马西平、灰黄霉素和地塞米松等。药物能诱导 P450 酶的活性,加速自身或其他药物的代谢,使药物效应减弱。

3. 酶抑制剂:能使酶活性减弱的药物。如氯霉素、别嘌醇、酮康唑、异烟肼、西咪替丁、吩噻嗪类等药物能抑制 P450 酶的活性,降低其他药物的代谢,使药物效应增强。

(四)药物的排泄

1. 肾脏排泄:主要排泄途径。

2. 胆汁排泄:某些药物经胆汁排入十二指肠后,部分药物可再经小肠上皮细胞重吸收,经门静脉重新进入体循环,这种现象称为肝肠循环。

二、药物代谢动力学重要参数

1. 半衰期

定义:药物的血浆半衰期($t_{1/2}$)是指血浆药物浓度下降一半所需要的时间,是临床确定给药间隔长短的重要参数之一。 $t_{1/2}$ 反映药物消除快慢的程度及机体消除药物的能力。经过5—6个 $t_{1/2}$ 达到稳态血药浓度,可基本消除干净。

2. 表观分布容积(V_d)

定义:表观分布容积(V_d)是指体内药物按血中同样浓度分布所需体液的总容积。

3. 清除率(CL)

定义:单位时间内,机体能将多少容积血浆中药物从体内被清除,是反映药物从体内消除的一个重要参数。

4. 生物利用度(F)

(1)定义:生物利用度是指药物经血管外给药后,药物被吸收进入血液循环的速度和程度,是评价药物制剂优劣的重要参数。

5. 稳态血药浓度(坪值)

定义:按一级动力学消除的药物,随给药次数增加,血药浓度递增速率逐渐减慢。当给药量等于消除量时(5个 $t_{1/2}$),血药浓度呈锯齿状波动,直到稳态浓度——坪值。

第二节 药效学

一、药物的不良反应

1. **副反应(副作用)**:是药物在治疗剂量时出现的与治疗目的无关的不适的反应。副作用是药物本身固有的反应,是由于药物的选择性低、作用广泛引起的,一般反应较为轻微,可以避免。随治疗目的不同可以转化。

2. **毒性反应**:是指在药物剂量过大或体内蓄积过多时发生的危害机体的反应,一般较为严重,毒性反应是可以预知的。

3. **变态反应(过敏反应)**:是指机体受药物刺激所发生的异常免疫反应,引起机体生理功能障碍和组织损伤。

4. **后遗效应**:停药后血药浓度已降至最低浓度以下时,仍残存的药理效应。

5. **继发反应**:由于药物治疗作用引起的不良后果。

6. **停药反应**:患者长期用药,突然停药后原有疾病加剧。

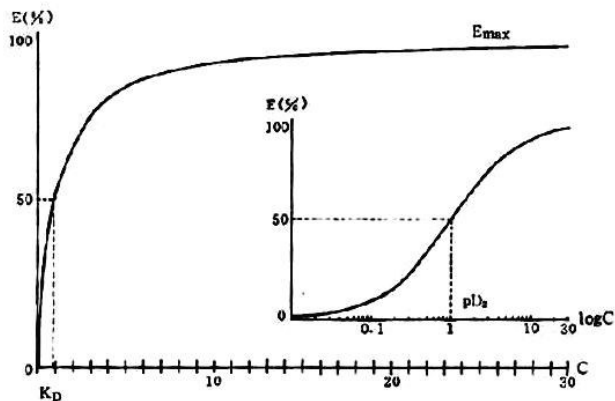
7. **特异质反应**:指某些药物可使少数病人出现特异性的不良反应,反应性质与常人不同。

第三节 药物的剂量与效应关系

一、量效关系

在一定剂量范围内,药物的剂量(或浓度)增加或减少时,其效应随之增强或减弱,两者间的相关性。

表现形式:量—效关系曲线或浓度—效应曲线



几个重要概念：

- (1) 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。
- (2) 半数致死量(LD_{50})：指能引起 50% 死亡时的浓度和剂量。
- (3) 治疗指数： $(TI) = LD_{50} / ED_{50}$ ，用以表示药物的安全性。
- (4) 安全范围： ED_{95} 和 LD_5 之间的距离。

第四节 药物的作用机制与受体

一、激动药与拮抗药

1. **激动药**：与受体既有亲和力又有内在活性的药物，分为完全激动药和部分激动药。
2. **拮抗药**：具有较强亲和力，但缺乏内在活性($\alpha=0$)，故不能产生效应。

第五节 抗菌药

一、青霉素类抗菌药物

1. 药理作用与临床评价

(1)作用机制:干扰敏感细菌细胞壁黏肽的合成,使细菌细胞壁缺损,菌体失去渗透保护屏障导致细菌肿胀、变形,死亡。

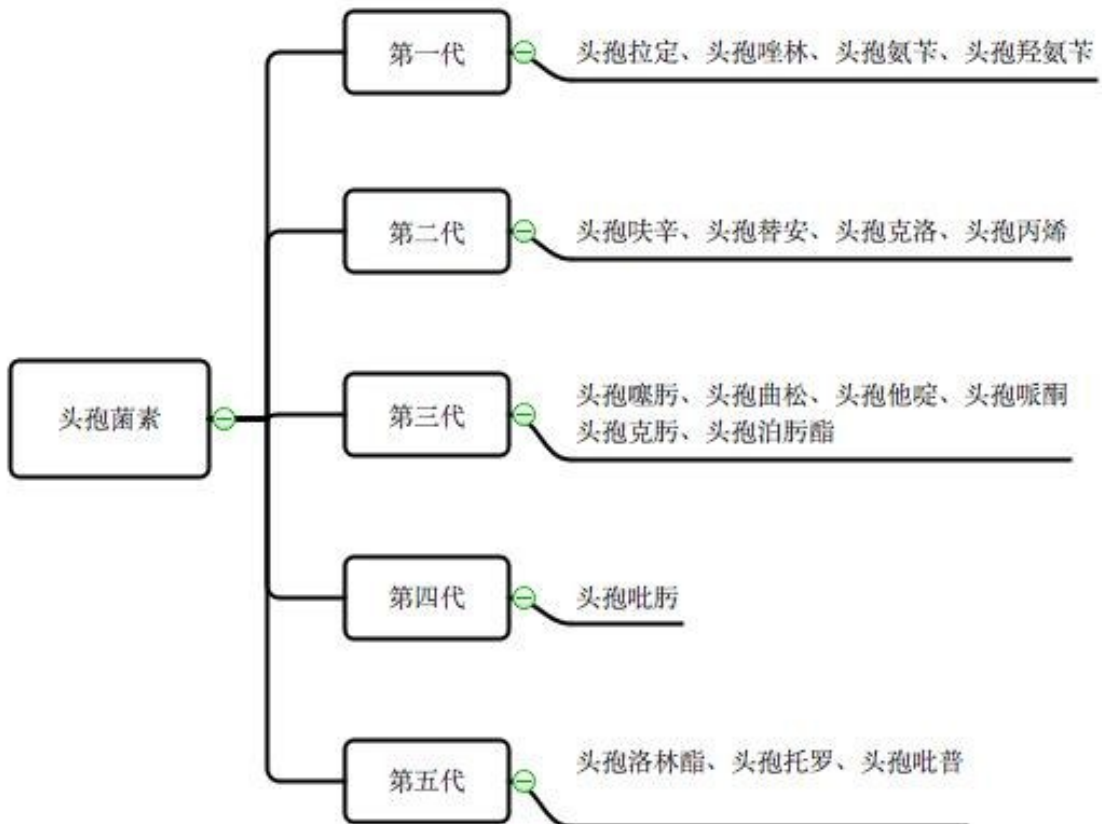
(2)抗菌谱:主要用于革兰阳性、革兰阴性球菌感染,某些革兰阳性杆菌引起的感染,对多数革兰阴性杆菌无效。

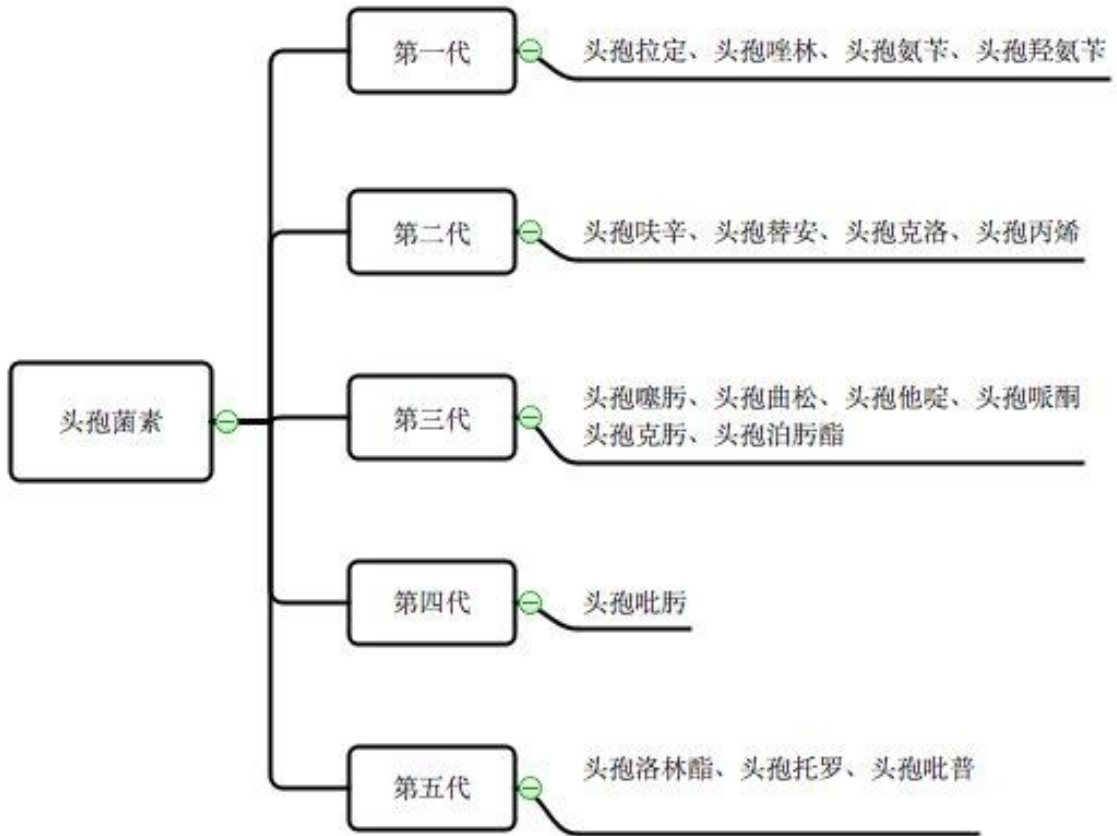
(3)典型不良反应 :过敏反应;

2. 用药监护:用药前必须询问过敏史,应用前(口服、注射)必须做青霉素皮肤敏感试验。

二、头孢菌素类

1. 主要药品





警惕双硫仑样反应:使用含有甲硫四氮唑或甲硫三嗪侧链的头孢菌素类药物期间或之后 5—7 日内饮酒、服用含有乙醇药物或食物,可导致乙醛在体内蓄积,引起双硫仑样反应。

三、氨基糖苷类抗菌药物

1. 不良反应

- (1)耳毒性
- (2)肾毒性
- (3)神经肌肉阻滞
- (4)过敏反应

四、大环内酯类抗菌药物

代表药物:红霉素

1. 药理作用与临床评价

(1)作用机制:与细菌核糖体 50S 亚基结合,抑制细菌蛋白质的合成。

2. 典型不良反应

(1)主要不良反应为胃肠道反应,呕吐、腹胀、腹痛、腹泻、抗生素相关性腹泻等。

(2)红霉素、依托红霉素可出现肝毒性。

(4)静脉滴注速度过快可发生心脏毒性,表现为心电图复极异常、心律失常、Q-T 间期延长及尖端扭转型室性心动过速,甚至可发生晕厥或猝死。

五、四环素类抗菌药物

典型不良反应

1. 四环素牙:与钙离子形成的螯合物在体内呈黄色,沉积于牙齿和骨中,造成牙齿黄染,影响胎儿、新生儿和婴幼儿骨骼的正常发育。

2. 可致道菌群失调,轻者引起维生素缺乏,严重时二重感染,亦可发生腹泻。

3. 光敏现象。

4. 大剂量或长期使用均可能发生肝毒性。

六、氟喹诺酮类抗菌药物

1. 药理作用与临床评价

(1)作用机制:主要作用靶位在细菌的 DNA 拓扑异构酶 II 和 IV,从而影响 DNA 的合成而致细菌死亡。

(2)典型不良反应

①肌痛、骨关节病损、跟腱炎症和跟腱断裂。

②血糖紊乱,尤其是加替沙星可致严重的、致死性、双相性血糖紊乱——低血糖或高血糖。

③光敏反应:如司帕沙星。(回忆:四环素)。

④精神和中枢神经系统:头痛、疲倦、昏厥、失眠、耳鸣或嗜睡。严重者包括抑郁、兴奋亢进、幻觉、幻视、疑虑、癫痫发作、精神失常、双相情感障碍等,甚至自杀和伤人,发生率极低,且可逆。

(4)禁忌症

①不宜用于骨骼系统未发育完全的 18 岁以下的儿童(包括外用制剂)。

②患有中枢神经系统病变或以往有神经、精神病史,尤其是癫痫病史者。

③妊娠及哺乳期妇女。

七、抗真菌药考点

类别	代表药
多烯类	两性霉素 B(深为主)、制霉菌素(浅)
唑类	咪唑类(酮康唑)、三唑类(伊曲康唑)
丙烯胺类	特比萘芬(浅为主)
棘白菌素	卡泊芬净(深)
嘧啶类	氟胞嘧啶(深)
其他	灰黄霉素(浅)

第六节 呼吸系统疾病用药

一、镇咳药

1. 用药监护

(1)对白日咳嗽为主者宜选用苯丙哌林；

(2)对夜间咳嗽宜选用右美沙芬，以保证睡眠。

(3)对频繁、剧烈、无痰干咳及刺激性咳嗽，可考虑应用可待因，尤其适用于胸膜炎伴胸痛的咳嗽患者。

二、平喘药

1. 哮喘药物分类

(1)支气管扩张药：肾上腺素受体激动剂、磷酸二酯酶抑制剂、M胆碱受体阻断剂。

(2)抗炎平喘药：白三烯受体阻断剂、糖皮质激素(防治)。

(3)抗过敏药物：色甘酸钠。

2. 代表药

(1)肾上腺素 β_2 受体激动药——短效：沙丁胺醇、特布他林；长效：沙美特罗、班布特罗。

(2)磷酸二酯酶抑制剂——茶碱、氨茶碱、多索茶碱。

(3)M胆碱受体阻断剂——代表药物：短效：异丙托溴铵；长效：噻托溴铵。

(4)糖皮质激素。

第七节 消化系统用药

一、抗酸药

1. 药理作用与临床评价

(1) 分类

吸收抗酸剂	碳酸氢钠	口服后,在胃内中和胃酸,易被肠道吸收,可用于消化性溃疡和碱化尿液。
非吸收性抗酸剂	铝碳酸镁 氢氧化铝 三硅酸镁	含难吸收的阳离子,口服后只能直接中和胃酸而不被胃肠道吸收。

二、组胺 H₂ 受体阻断剂

1. 作用特点

(1) 阻断组胺 H₂ 受体,可逆性竞争壁细胞基底膜上的 H₂ 受体,显著抑制胃酸分泌。

(2) 抑酸作用强度(不如 PPI):法莫替丁 > 尼扎替丁 > 雷尼替丁 > 西咪替丁

(3) 用于胃及十二指肠溃疡、功能性消化不良、胃食管反流病、消化性溃疡并发出血,防治应激性溃疡。

三、质子泵抑制剂

质子泵抑制剂(PPI)是抑制胃酸分泌和防治消化性溃疡的最有效药物。

1. 作用特点

(1) PPI 与 H⁺, K⁺ - ATP 酶(又称质子泵)结合形成复合物,抑制 H⁺, K⁺ - ATP 酶的活性,从而抑制胃酸生成的终末环节。

2. 常用药物

抑酸速度:雷贝拉唑>兰索拉唑>奥美拉唑>泮托拉唑

3. 典型不良反应

(1)长期或高剂量使用——患者髌骨、腕骨、脊椎骨骨折。

(2)连续使用3个月以上——低镁血症。

四、胃粘膜保护剂

1. 作用特点

(1)铋剂:枸橼酸铋钾、胶体果胶铋

(2)铝剂:硫糖铝

2. 典型不良反应

(1)铋剂——便秘,口中氨味,舌、大便变黑,牙齿短暂变色。

(2)硫糖铝——服后吸收较少,故不良反应较少,可能出现腹胀、腹泻等胃肠道反应。

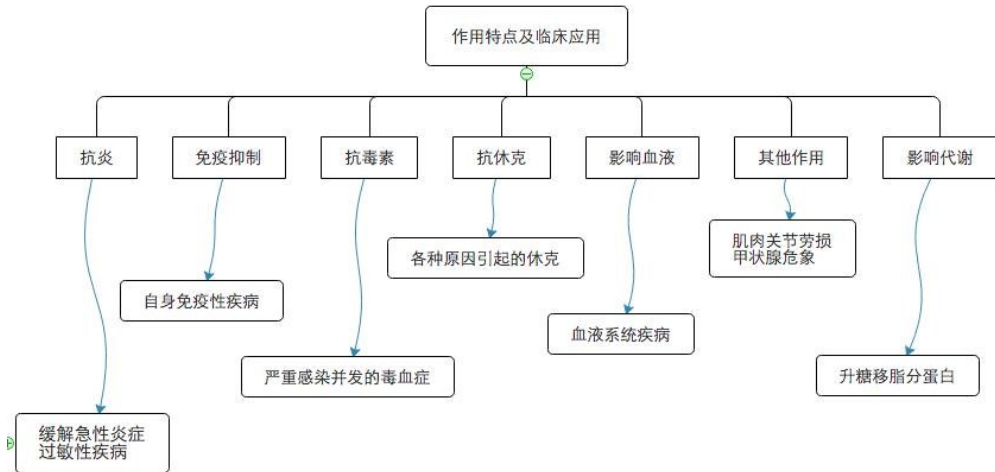
第八节 内分泌系统用药

一、肾上腺糖皮质激素

1. 糖皮质激素分类

分类	主要药物
短效	可的松、氢化可的松
中效	泼尼松、泼尼松龙、甲泼尼龙、曲安西龙
长效	地塞米松、倍他米松

2. 糖皮质激素作用特点



3. 不良反应、禁忌症

升糖、移脂、分蛋白质；保钠、潴水、排钾钙磷

机制	不良反应	禁忌症
升糖	血糖升高、糖尿病倾向	严重糖尿病
移脂	血胆固醇升高、血脂肪酸升高	
分蛋白质	创面或伤口愈合不良	新近胃肠吻合术者、创伤恢复期、角膜溃疡
保钠潴水	水钠潴留, 高血压	严重高血压
排钾钙磷	血钾降低、血钙降低, 骨质疏松症, 病理性骨折	骨折患者
生理需要	长期大剂量应用, 引起库欣综合征, 表现为满月脸、向心性肥胖、紫纹、皮肤变薄、痤疮	肾上腺皮质功能亢进者、妊娠早期
降低抵抗力	诱发感染, 致真菌与病毒感染、结核病加重	抗菌药物不能控制的感染如水痘、真菌感染者
兴奋	诱发或加重消化道溃疡、溃疡穿孔	活动性消化性溃疡病 严重精神病或癫痫病史者

二、胰岛素

1. 根据胰岛素作用时间分类(重点)

分类	代表药物
超短效胰岛素	门冬胰岛素、赖脯胰岛素
短效胰岛素	常规胰岛素
中效胰岛素	低精蛋白锌胰岛素
长效胰岛素	精蛋白锌胰岛素
超长效胰岛素	甘精胰岛素、地特胰岛素
预混胰岛素	双时相胰岛素,如 30R,50R

记忆方法:超短赖门,超长地甘,短效普通,精长记忆!

三、口服降糖药

	药物类别	代表药
降糖药	磺酰脲类和非磺酰脲类	格列本脲、格列齐特 瑞格列奈、那格列奈
	双胍类	二甲双胍、苯乙双胍
	α 葡萄糖苷酶抑制剂	阿卡波糖
	胰岛素增敏剂	罗格列酮、吡格列酮
	胰高血糖素样肽-1 受体激动剂(GLP-1)	艾塞那肽、利拉鲁肽
	二肽基肽酶-4 抑制剂(DPP-4)	西格列汀、维格列汀

注意辨证用药:

病情	选药
空腹血糖较高(齐美)	选用长效的格列齐特、格列美脲

续表

病 情	选 药
餐后血糖升高(别亏)	选用短效的格列吡嗪、格列喹酮
既往发生心肌梗死或存在心血管疾病高危因素	格列美脲、格列吡嗪 (别美)
急性心肌梗死者	急性期可使用胰岛素,急性期后再选择磺酰脲类药
轻、中度肾功能不全者	选用格列喹酮
严重肾功能不全	用胰岛素治疗
应激状态如发热、昏迷、感染和外科手术	必须换胰岛素治疗

四、甲状腺激素和抗甲状腺药

1. 甲状腺激素

(1)药理作用——也是其生理作用。

维持正常生长发育,影响脑和长骨的生长发育。

甲状腺功能不足,小儿可致呆小病(克汀病);成人引起黏液性水肿。

(2)临床应用——用于甲低的替代补充治疗。

①呆小病。

②黏液性水肿。

③单纯性甲状腺肿。

2. 抗甲状腺药:甲硫咪唑、丙硫氧嘧啶——硫脲类。

临床应用

甲亢——轻症,或不宜手术和放射性碘治疗的中、重度病人。

甲状腺手术前准备——使甲状腺功能控制到正常或接近正常水平。

第九节 循环系统用药

一、抗心力衰竭药

1. 强心苷类正性肌力药

(1)作用机制:

①抑制衰竭的心肌细胞膜上 Na^+ , K^+ -ATP酶,使细胞内 Na^+ 水平升高。

②促进 Na^+ - Ca^{2+} 交换,提高细胞内 Ca^{2+} 水平,心肌收缩加强。

(2)常用药物

①地高辛②甲地高辛③去乙酰毛花苷(西地兰 D)④毛花苷丙(西地兰 C)⑤洋地黄毒苷⑥毒毛花苷 K

(3)临床应用

强心苷类药物适用于已经使用利尿剂、ACEI(或 ARB)和 β 受体阻断剂治疗而仍持续有症状的慢性收缩性心力衰竭或合并心室率快的心房颤动患者。

(4)典型不良反应

①胃肠道症状②心血管系统——心律失常③神经系统④感官系统——色觉异常(红—绿、蓝—黄辨认异常)。

二、抗心律失常药

1. 抗心律失常药的分类及代表药物

类别	代表药物		主要作用	记忆口诀
I类钠通道阻滞药	I A类	奎尼丁、普鲁卡因胺	适度阻滞钠通道	普通卡车装水泥
	I B类	利多卡因、苯妥英钠、美西律	轻度阻滞钠通道	一本万利,多美啊
	I C类	普罗帕酮、氟卡胺	重度阻滞钠通道	普通罗汉都怕佛
II类 β 受体阻断药	普萘洛尔		阻断 β 受体	
III类延长APD药	胺碘酮		延长动作电位时程	
IV类钙通道阻滞药	维拉帕米		抑制钙内流	
V类其他类	腺苷		激活钾通道	

3. 典型不良反应和禁忌症

不良反应——心律失常	禁忌症
缓慢性心律失常 (β 受体阻断剂、钙通道阻滞剂或洋地黄制剂)	严重心动过缓及病窦综合征者;II或III度房室传导阻滞者;严重充血性心力衰竭、心源性休克、严重低血压者。
折返性心律失常加重(IC类药的风险最高)	
尖端扭转型室性心动过速 (IA类药奎尼丁、普鲁卡因胺;III类药索他洛尔最为常见)	
血流动力学障碍,心律失常	

三、抗高血压药

一线降压药(5大类)

①利尿剂——氢氯噻嗪等)

② β 受体阻断剂——XX洛尔

③钙通道阻滞剂——XX地平

④血管紧张素转换酶抑制剂(ACEI)——XX普利

⑤血管紧张素 II 受体阻断剂(ARB)——XX 沙坦

第十节 镇静催眠药

一、苯二氮 类(地西洋)

1. 地西洋——癫痫持续状态的首选药。用于子痫、小儿高热、破伤风等所致惊厥。

2. 作用机制

GABA(γ -氨基丁酸)是中枢神经系统抑制性递质,作用于 GABA_A 受体——Cl⁻通道开放——抑制效应。

3. 不良反应

(1)后遗效应:可头昏、嗜睡和乏力等,大剂量可致共济失调。

(2)长期应用可有耐受性和依赖性,久服突然停药可出现戒断症状,如焦虑、失眠比巴比妥类的戒断症状轻。

(3)急性中毒:大剂量偶致共济失调、运动功能障碍、语言含糊不清,甚至昏迷。

二、巴比妥类(苯巴比妥)

1. 药理作用:小剂量镇静,中等剂量催眠,大剂量抗惊厥、抗癫痫,中毒量麻痹延脑而死亡。

2. 机制:促进 GABA 与 GABA 受体结合,但不是增加 Cl⁻通道的开放频率,而是延长 Cl⁻通道的开放时间。

3. 临床应用:

(1)抗惊厥。

(2) 静脉麻醉——小手术或内窥镜检查时麻醉。

第十一节 解热镇痛抗炎药

一、共同作用

1. 解热作用; 2. 镇痛作用; 3. 抗炎。

二、分类

1. 水杨酸类: 阿司匹林

(1) 临床应用

具有较强的解热、镇痛和消炎抗风湿作用。

临床上用于: 感冒发烧、头痛、牙痛、神经痛、肌肉痛和痛经等风湿热及活动型风湿性关节炎的首选药物抑制血小板聚集, 预防和治疗血栓形成和心肌梗死有促进尿酸排泄作用, 可用于治疗痛风, $\text{PGI}_2 \downarrow$ 可促进凝血和血栓形成。

(2) 不良反应

① **凝血障碍**: 有出血倾向、肝功能障碍、血友病、低凝血酶原血症、VK 缺乏者禁用。

② **过敏反应**: 偶见皮疹、荨麻疹、血管神经性水肿、过敏性休克。

③ **“阿斯匹林哮喘”**某些哮喘患者服用后可产生。

④ **水杨酸反应**。

⑤ **瑞夷(Reye)综合征**。

2. 乙酰苯胺类——对乙酰氨基酚

(1) 临床应用:

是临床常用的解热镇痛药, 口服吸收迅速, 可用于发热、疼痛, 其解热镇

痛作用与阿司匹林相同,但无抗炎抗风湿作用,正常使用剂量下对肝肾无损害,毒副作用下,尤其适用于胃溃疡及儿童因病毒感染引起的发热、头痛。本药不能单独用于抗炎或抗风湿。

第三章 药物分析专业知识

第一节 药品标准

一、药品标准及制定原则

1. 国家药品标准

是国家为保证药品质量所制定的关于药品的质量指标、检验方法以及生产工艺的技术要求,是药品生产、经营、使用、检验和监督管理部门共同遵循的法定依据。

2. 国家药品标准组成

包括:《中华人民共和国药典》、《药品标准》和药品注册标准。由国家药典委员会负责制定和修订。

二、国家药品标准

《中国药典》由一部、二部、三部及其增补本组成,内容分别包括凡例、正文和附录。

1. 凡例:把与正文品种、附录及质量检定有关的共性问题加以规定,避免在全书中重复说明。

(1)关于精确度的规定

①**称定**:准确至所取重量的百分之一。

②**精密称定**:准确至所取重量的千分之一。

③**精密量取**:量取体积的准确度应符合国家标准中对该体积移液管的精度要求。

④约:取用量不得超过规定量 $\pm 10\%$ 。

2. 正文

品名,结构式,分子式与分子量,来源或化学名称,含量限度,处方,制法,性状,鉴别,检查,含量测定,类别,规格,贮藏,制剂。

3. 附录

制剂通则;生物制剂通则;

通用检测方法;生物检测法;

试药和试纸;溶液配制;原子量表;

制剂通则有:片剂;注射剂等 21 种,均有规定检查项目。

4. 索引

中文索引:按汉语拼音顺序排列

英文索引:按英文字母顺序排列

三、主要国外药典

美国药典 [USP]

美国国家处方集 [NF]

欧洲药典 [Ph Eup]

国际药典 [Ph Int]

英国药典 [BP]

日本药局方 [JP]

第二节 药物分析基础

一、药物的鉴别

1. 化学鉴别法

(1) 颜色反应

阿司匹林(酚类)	水解后加三氯化铁呈紫堇色
磺胺甲恶唑(芳香伯氨类)	与亚硝酸钠反应生成重氮盐,与β萘酚缩合生成橙黄色至猩红色的偶氮化合物
盐酸麻黄碱(氨基醇)	双缩脲反应(碱性条件下与硫酸铜形成蓝色配合物)
阿托品(莨菪碱)	Vitali 反应,与硝酸共热后在醇制氢氧化钾溶液中显深紫色
吗啡(异喹啉类生物碱)	与甲醛硫酸试液反应(Marquis 反应)显紫堇色
维生素 B ₁	碱性条件下与铁氰化钾反应生成具有蓝色荧光的硫色素

(2) 沉淀反应

苯巴比妥,加入碳酸钠试液水解后,滴加硝酸银试液生成白色沉淀,振荡,沉淀即溶解;继续滴加过量硝酸银溶液,沉淀不再溶解。

(3) 气体生成反应

尼可刹米鉴定方法:本品 10 滴,加氢氧化钠试液 3ml,加热,即发生二乙胺臭气,能使湿润的红色石蕊试纸变蓝。

(4) 焰色反应

焰色反应利用供试品在无色火焰中燃烧所显现的特征颜色鉴别药物中金属离子。本法适用于含钠、钾、钙、钡、锂等金属离子盐类药物的鉴别。

钠黄钾紫钙砖红,钡黄绿,锂紫红

光谱鉴别法———紫外—可见分光光度法

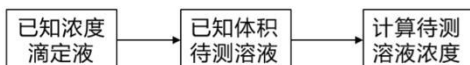
仪器：紫外分光光度计波长范围 200nm—760nm。

紫外—可见分光光度法应用

2、滴定分析法

1. 滴定分析法

——原料药含量测定的首选方法



包括：酸碱滴定法、非水溶液滴定法、氧化还原滴定法等

(1) 酸碱滴定法，滴定原理：酸碱中和反应、终点指示剂

酸性指示剂	甲基橙、甲基红、溴酚蓝、溴百里酚蓝
碱性指示剂	酚酞、百里酚酞

(2) 非水溶液滴定法

滴定原理：非水溶液中的酸碱中和反应，在非水溶剂中药物的相对酸碱性提高，反应灵敏度提高。

(3) 氧化还原滴定法

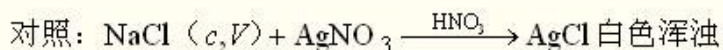
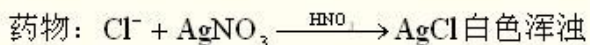
滴定方法	滴定剂	指示剂	应用
直接碘量法	碘	淀粉	强还原性药物(维生素 C)
置换碘量法	硫代硫酸钠	淀粉	氧化性药物
剩余碘量法	硫代硫酸钠	淀粉	弱还原性药物(对乙酰氨基酚)
铈量法	硫酸铈	邻二氮菲	金属低价化合物或还原性药物(硫酸亚铁)
亚硝酸钠滴定法	亚硝酸钠	电位法、永停法	含有芳伯氨基药物(盐酸普鲁卡因)

第三节 药物的杂质检查

一、一般杂质检查

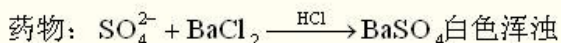
1. 氯化物检查法

原理:利用氯化物在硝酸酸性溶液中与硝酸银试液作用,生成氯化物的白色混浊比较。



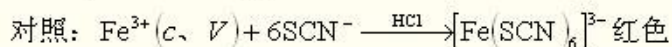
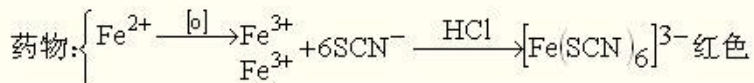
2. 硫酸盐检查法

原理:利用 SO_4^{2-} 与氯化钡在盐酸酸性溶液中生成硫酸钡的白色混浊液,比较。



3. 铁盐检查法

原理:铁盐在盐酸酸性溶液中与硫氰酸铵生成红色可溶性硫氰酸铁配位离子,与对照比较。



4. 重金属检查法

检查重金属:银、铅、汞、铜、镉、锡、铋等能与硫代乙酰胺或硫化钠作用显色的金属。

《中国药典》重金属检查法一共收载有四法,以Pb 为代表。

(1)第一法:硫代乙酰胺法

适用范围:适用于在实验条件下供试液澄清、无色,对检查无干扰或经处理后对检查无干扰的药物。

(2)第二法:炽灼后的硫代乙酰胺法

适用范围:用于在水中难溶,或能与重金属离子形成配位化合物而影响检查的有机药物。

原理:500~600℃炽灼后的残渣,经处理后,依一法检查。

(3)第三法:硫化钠法

适用范围:适用于溶于碱而不溶于稀酸或在稀酸中生成沉淀的药物。如磺胺类、巴比妥类。

原理:

5. 砷盐检查法

《中国药典》采用古蔡法和二乙基二硫代氨基甲酸银法检查药物中微量的砷盐。

6. 干燥失重测定法

干燥失重是指药物在规定条件下经干燥后所减失的重量,根据所减失的重量和取样量计算供试品干燥失重的百分率。主要检查药物中的水分,也包括其他挥发性物质如残留的有机溶剂等。

7. 炽灼残渣检查法

检查有机药物中混入的各种无机杂质(如金属的氧化物或盐等)。

二、特殊检查项目与限度

特殊杂质检查的目的:控制不同药物在生产和贮藏过程中可能引入的特有杂质。

第四章 药物化学基础知识

第一节 药物的理化性质与药物的作用

一、药物的溶解度、分配系数和渗透性对药效的影响

1. 分子中官能团形成氢键的能力和官能团的离子化程度较大时, 药物的水溶性增大。
2. 分子结构中含有较大烃基、卤素原子、脂环等非极性结构, 药物的脂溶性增大。

类别	代表药物	特点
第 I 类	普萘洛尔、依那普利、地尔硫	高水溶性、高渗透性的两性分子药物, 在体内的吸收取决于胃排空速率
第 II 类	双氯芬酸、卡马西平、吡罗昔康	低水溶性、高渗透性的脂溶性药物, 在体内吸收取决于溶解速率
第 III 类	雷尼替丁、那多洛尔、阿替洛尔	水溶性高、渗透性低的水溶性药物, 在体内吸收取决于渗透效率
第 IV 类	特非那定、酮洛芬、呋塞米	低水溶性、低渗透性的疏水性分子药物, 在体内吸收比较困难

二、药物的酸碱性、解离度和 pK_a 对药效的影响

$$\text{酸性药物: } \lg \frac{[HA]}{[A^-]} = pK_a - pH$$

$$\text{碱性药物: } \lg \frac{[B]}{[HB^+]} = pH - pK_a$$

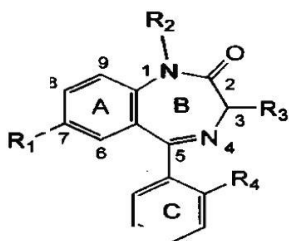
重要结论: 弱酸性或弱碱性药物, 当 $pH = pK_a$ 时, 非解离型和解离型药

物各占一半。

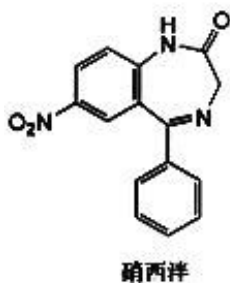
第二节 药物的结构与药物的作用

一、镇静与催眠药

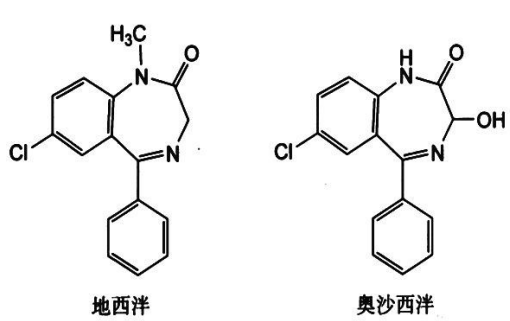
1. 苯二氮 类药物



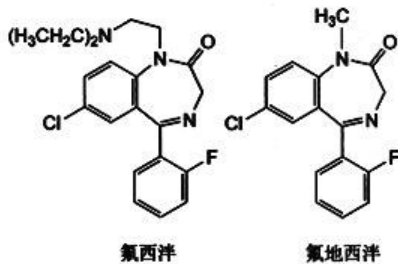
(1)A 环:7 一位的取代基的性质对生物活性 11 影响较大。当 7 位引入吸电子取代基时,药物活性明显地增强,吸电子越强,作用越强。



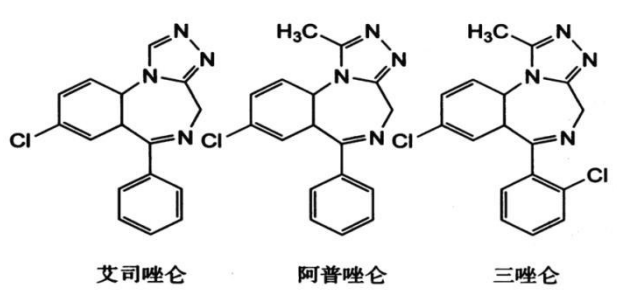
(2)B 环:3 位上引入羟基可以增加其分子的极性,易于与葡萄糖醛酸结合排出体外。临床上较原药物更加安全,3 位羟基的药物如奥沙西洋。



(3)C环:5位苯环的2位引入体积小的吸电子基团如F、Cl可使活性增强。如氟西洋和氟地西洋等。



(4)在1,4-苯二氮 的1,2位并上三唑环,不仅可使代谢稳定性增加,而且提高了与受体的亲和力,活性显著增加。如艾司唑仑、阿普唑仑和三唑仑,活性均比地西洋强几十倍。

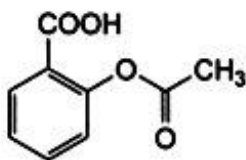


二、解热镇痛抗炎药与抗痛风药

1. 解热镇痛药

水杨酸类:阿司匹林——乙酰水杨酸

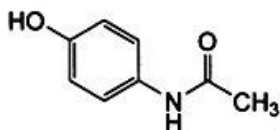
- (1)含有羧基,呈弱酸性。
- (2)羧基是必要结构,羧基和羟基于邻位。
- (3)不可逆地抑制环氧酶,阻断前列腺素等内源性致热物质的合成。
- (3)减少血栓素 A₂ 的生成,抑制血小板聚集和防止血栓生成。



阿司匹林

乙酰苯胺类——对乙酰氨基酚又名扑热息痛

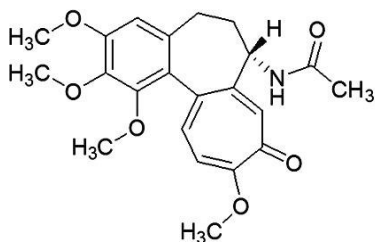
- (1) 含有酰胺键，相对稳定。
- (2) 贮藏不当会产生或生产过程中会引入对氨基酚杂质，毒性较大。
- (3) 过量对乙酰氨基酚会耗竭肝内储存的谷胱甘肽，引起肝坏死，应用谷胱甘肽或乙酰半胱氨酸解毒。



对乙酰氨基酚

2. 抗痛风药

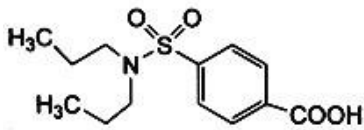
(1) **秋水仙碱**，一种天然生物碱，有一定抗肿瘤作用，主要可以抑制尿酸盐对关节造成的炎症，在痛风急症时使用。



(2) **丙磺舒**☆

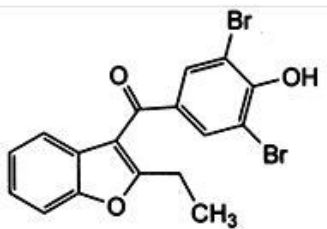
作用机理：抑制尿酸近曲小管的主动重吸收，促进尿酸的排泄。

临床应用：用于慢性痛风。



丙磺舒

(3) 苯溴马隆, 苯并呋喃衍生物, 抑制肾小管对尿酸的重吸收, 促进尿酸排泄。



苯溴马隆

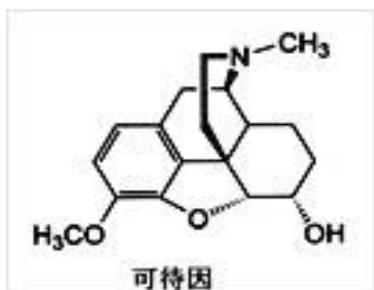
三、呼吸系统用药

1. 镇咳药

中枢性镇咳药

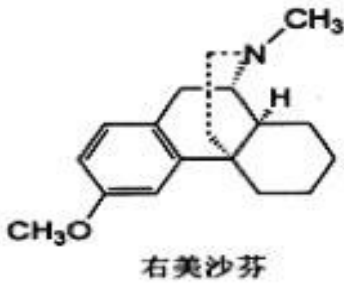
(1) 多为吗啡类似物, 作用于阿片受体, 具有成瘾性, 属于特殊管理药品。

可待因:



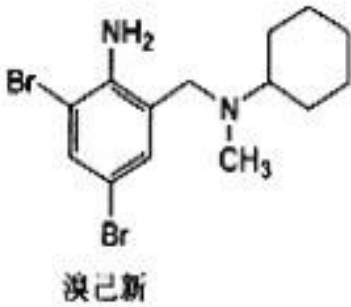
可待因

(2) 右美沙芬: 苯吗喃结构, 有旋光性, 右旋镇咳、左旋镇痛。



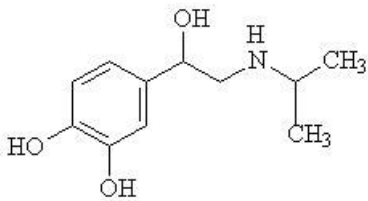
2. 祛痰药

(1) 溴己新: 降低痰液黏稠性, 用于支气管炎和呼吸道疾病。

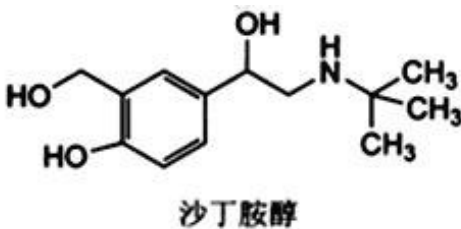


3. 平喘药

β -羟基苯乙胺基本结构; 选择性 β_2 受体激动剂 R-左旋体效果好, 市售外消旋体。



异丙肾上腺素



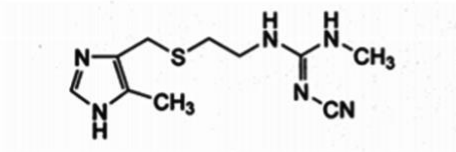
四、消化系统用药

1. 组胺 H₂ 受体阻断剂——XX 替丁

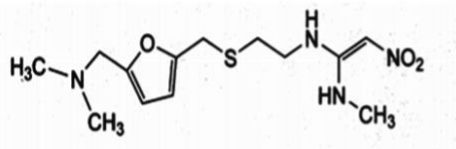
基本结构



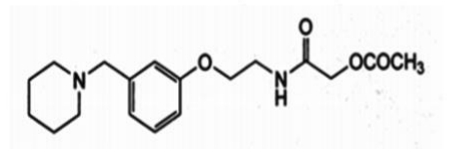
(1)具碱性的芳环结构和平面的极性基团。碱性的芳环与受体上谷氨酸残基阴离子结合,而平面极性基团可能与受体发生氢键键合的相互作用。



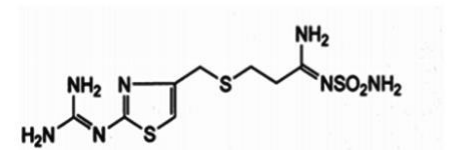
西咪替丁



雷尼替丁

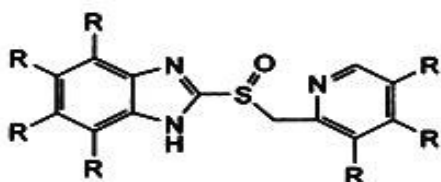


罗沙替丁乙酸酯



法莫替丁

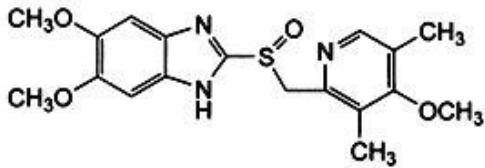
2. 质子泵抑制剂



奥美拉唑:弱酸性和弱碱性,稳定性差,需低温避光保存。

奥美拉唑循环(前药循环):咪唑-N 上重排、共价结合和解除结合。

埃索美拉唑

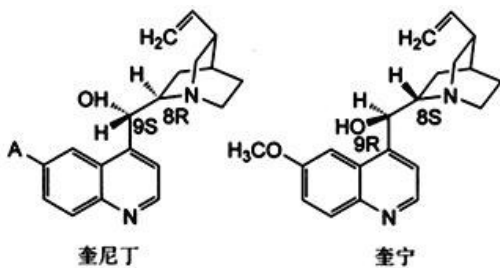


奥美拉唑

五、循环系统用药

1. 抗心律失常药

(1)奎尼丁 Ia 类抗心律失常药,适度阻滞钠通道。是抗疟药奎宁的立体异构体;具有金鸡纳反应。

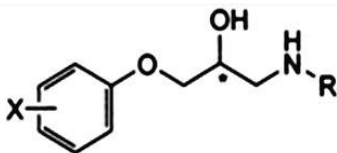


奎尼丁

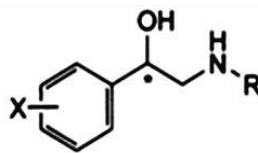
奎宁

(2) β 受体拮抗剂

结构特点:芳氧丙醇胺类、苯乙醇胺类。



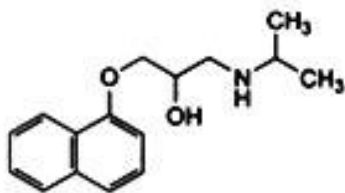
芳氧丙醇胺类



苯乙醇胺类

含有羟基的手性中心,该羟基是关键药效基团(氢键)。

普萘洛尔



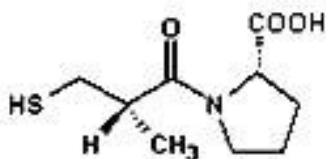
普萘洛尔

2. 抗高血压药

(1) 血管紧张素转化酶抑制剂(ACEI)

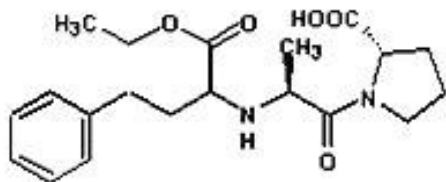
① 含巯基的 ACEI

卡托普利: 巯基可以和酶中锌离子结合, 是关键药效团; 脯氨酸片段也是关键基团; 易被氧化, 能发生二聚反应生成二硫键。



② 含双羧基的 ACEI

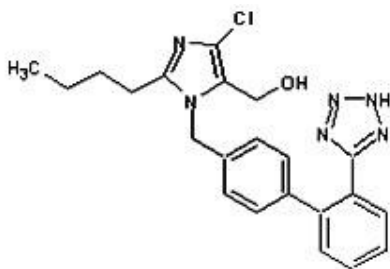
依那普利: 3 个手性中心, 均为 S 构型; 属于前体药物, 体内水解代谢为依那普利拉——长效的血管紧张素转化酶抑制剂; 单独使用降压或者与利尿剂合用、



(2) ARB 类

基本结构——含有酸性基团的联苯结构，酸性基团可以为四氮唑环也可以是羧基。

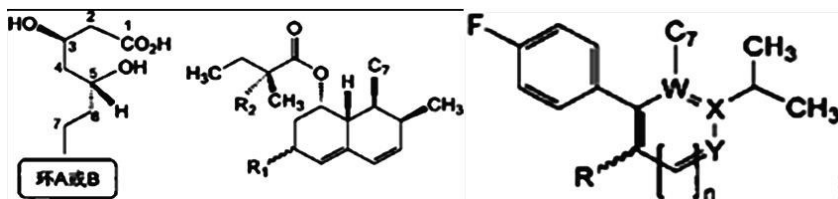
氯沙坦，2-位丁基保证必要的脂溶性和疏水性；5-位羟甲基代谢氧化成甲酸衍生物，活性比氯沙坦强 10—40 倍，比如缬沙坦。



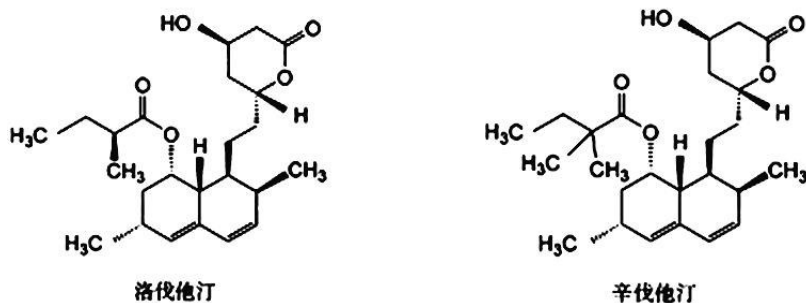
氯沙坦

3. 调节血脂药

(1) 羟甲基戊二酰辅酶 A 还原酶抑制剂：必须药效基团：3,5-二羟基羧酸，5 位羟基可能与羧基成酯，制成前药。



洛伐他汀和辛伐他汀：天然 HMG—CoA 还原酶抑制剂，具有内酯结构，体内水解发挥作用。



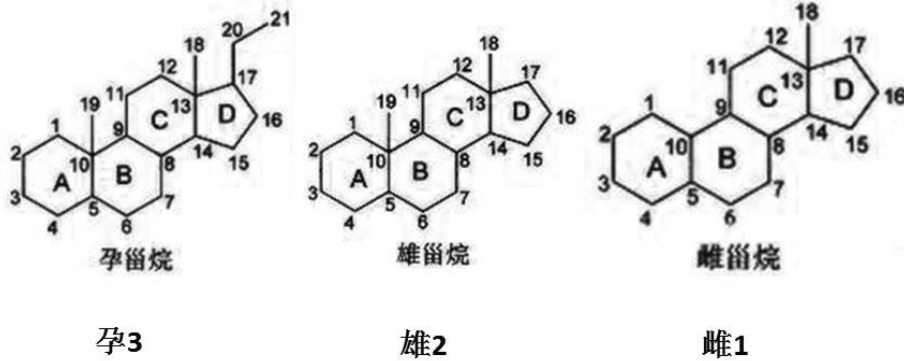
洛伐他汀

辛伐他汀

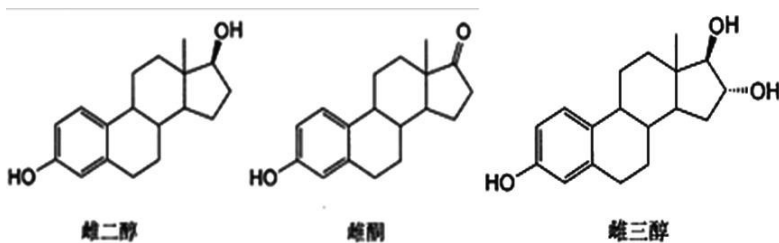
六、内分泌系统疾病用药

1. 甾体激素类

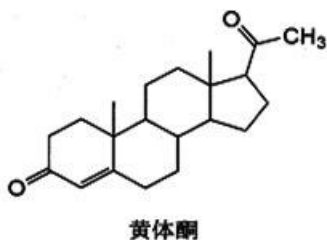
甾体激素类药物的母核有：孕甾烷、雄甾烷和雌甾烷。



(1) 雌激素结构特点：A 环为芳香环，无 19 位甲基，含有 3 位羟基，17 位带有羟基或羰基；在肝脏迅速代谢，作用时间短，不可口服。



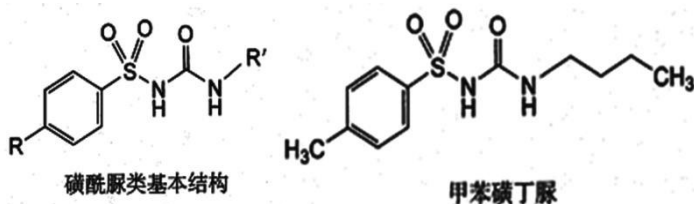
(2) 孕激素基本结构：4-双键-3,20-二酮孕甾烷；口服迅速代谢失活，黄体酮只能肌肉注射油剂或栓剂。



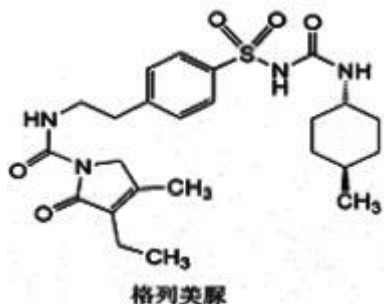
2. 口服降糖药

磺酰脲类胰岛素分泌促进剂

(1) 甲苯磺丁脲 甲苯磺丁脲, 最早的磺酰脲类胰岛素, 结构特点。

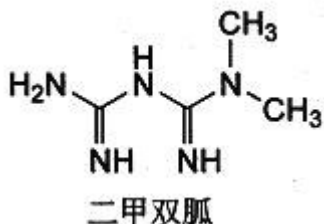


(2) 格列美脲: 环己烷上连有甲基, 甲基处于平伏键, 阻碍了环己烷上的羟基化作用, 具有高效、长效降血糖作用。



双胍类胰岛素增敏剂

二甲双胍强碱性, 临床应用盐酸盐; 二甲双胍吸收快, 几乎全部以原型由尿排出, 肾功能损害者禁用。

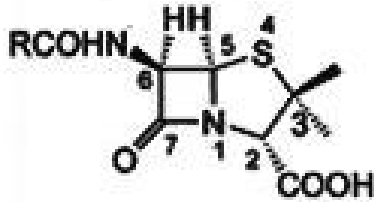


七、抗菌药物

1. 抗生素类抗菌药

(1) 青霉素类: 酸性或碱性条件, β -内酰胺环均会发生裂解, 生成青霉

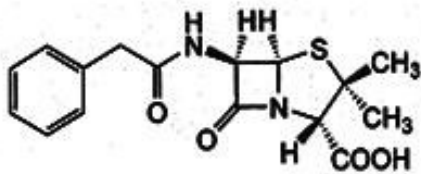
酸、青霉醛和青霉胺,青霉素不能和氨基糖苷类碱性药物置于同一容器配伍合用。



青霉素类

青霉素(青霉素 G)

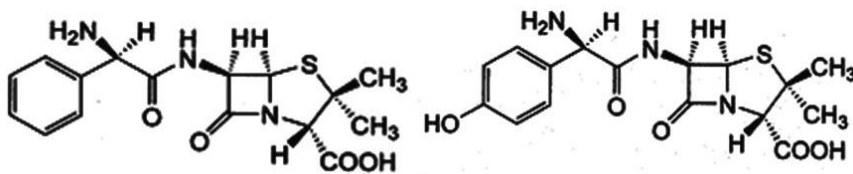
常用钠盐和钾盐,水溶液在室温下不稳定,常用其粉针剂;青霉素与丙磺舒合用可以降低青霉素排泄速度,延长作用时间;过敏反应,生产过程中产生的杂质蛋白和青霉噻唑高聚物是过敏源,具有交叉过敏反应



青霉素

氨苄西林 & 阿莫西林

针对青霉素不耐酸、不能口服、抗菌谱窄、不耐酶的特点,对青霉素母核6-氨基青霉烷酸进行化学改造,合成耐酸、耐酶、可口服、广谱的青霉素。

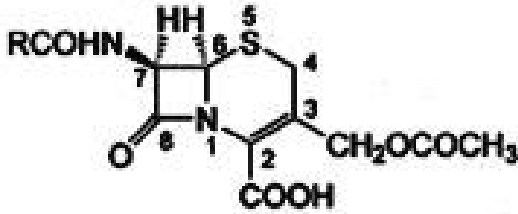


氨苄西林

阿莫西林

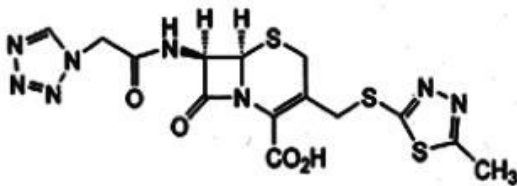
(2) 头孢菌素类

四元环并六元环稳定性提好,本类药物多耐酸,耐青霉素酶。



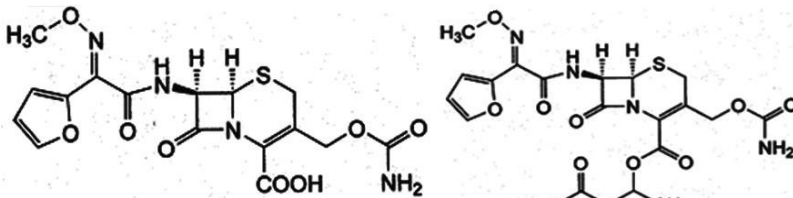
头孢菌素类

第一代头孢菌素:借氨苄西林成功案例,苯环苄位引入氨基,可以口服;苯环 4 为引入羟基增加口服生物利用度。



头孢唑林

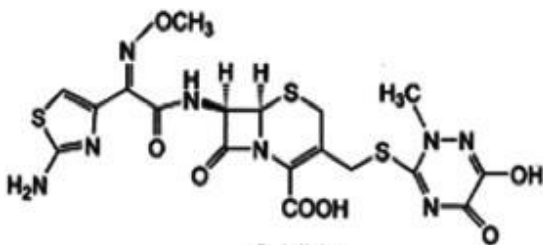
第二代头孢菌素:对多数 β -内酰胺酶稳定。头孢呋辛



头孢呋辛

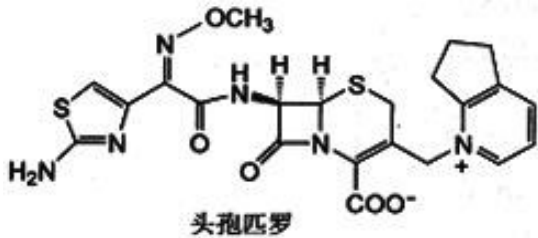
头孢呋辛酯

第三代头孢菌素:对多数 β 内酰胺酶高度稳定,抗菌谱更广,对 G^- 菌活性强,但对 G^+ 菌活性比第一代差。



头孢曲松

第四代头孢菌素:3位引入季铵基团,含有正电荷的季铵基团能使头孢菌素类药物迅速穿透细菌的细胞壁,对大多数的革兰阳性菌产生高度活性。



头孢代次歌:

君且安(氨苄)坐(唑林),听我一言;
小女克(克洛)夫(呋辛),二嫁状元;
派(哌酮)往边关,曲(曲松)终人散;
四十从痞(匹罗),谁比我(吡肟)惨。

2019军队文职招录考试

考前30分



扫码听解析,估分对答案