

2020年《药学专业知识一》

密卷(一)

一、最佳选择题(共 40 小题,每题 1 分。题干在前,选项在后。每道题的备选选项中,只有一个最佳答案,多选、错选或不选均不得分)

1. 内源性胆固醇是由乙酸经 26 步生物合成步骤在肝细胞的细胞质中完成,主要合成步骤见反应式。

羟甲戊二酰辅酶A

胆固醇

其中 3-羟基-3-甲基戊二酰辅酶 A(简称羟甲戊二酰辅酶 A,HMG-CoA)还原酶是该合成过程中的限速酶,能催化 HMG-CoA 还原为甲羟戊酸,为内源性胆固醇合成中的关键一步,若抑制此酶,则内源性胆固醇合成减少。根据上述机理推测,下列结构药物可作为 HMG-CoA 还原酶抑制剂的是

$$A. \qquad \begin{array}{c} CH3 \\ CH3 \\$$

答案: E

Ε.

- 2. 有关药用辅料的作用,说法错误的是
 - A. 制备硝酸甘油片时,加入适量硬脂酸镁可使制备过程顺利进行
 - B. 制备奥美拉唑肠溶片时,采用丙烯酸树脂作为包衣材料,可以提高药物在胃酸中的稳定性
 - C. 制备维生素 C 注射液时,加入适量亚硫酸氢钠可以提高药物的稳定性
 - D. 制备西替利嗪咀嚼片时,加入适量羧甲淀粉钠可提高药物的崩解速率
 - E. 制备醋酸可的松滴眼液时,加入适量的硝酸苯汞可减少药物被细菌污染



答案: D

3. 二巯基丙醇可作为锑、砷、汞的解毒剂,其解毒机制是药物与金属之间可形成

A. 共价键

B. 金属络合物

C. 范德华力

D. 离子键

E. 氢键

答案: B

4. 对环丙沙星进行结构修饰, 5 位和 8 位分别引入氨基和氟原子,得到司帕沙星,其对金葡萄球菌的抑制活性比类似物环丙沙星强 16 倍。司帕沙星药效提高的主要影响因素是

A. 立体效应

B. 电荷效应

C. 空间位阻效应

D. 代谢

E. 解离

答案: B

5. 多数药物为弱酸或弱碱,在体液中部分解离。根据药物的解离常数(pKa)可以决定药物在胃和肠道中的吸收情况,改变药物的化学结构对药物的解离常数能产生较大的影响,从而影响药物的吸收和生物活性。巴比妥类药物的取代基变化与 pKa 之间的关系见下表:

结构通式	药名	R_1	R_2	R_3	рКа
O _{N 6} 1 R ₃	巴比妥酸	Н	Н	Н	4. 1
R_1 S	苯巴比妥		$-C_2H_5$	Н	7. 4
o'' 4 3	戊巴比妥	CH ₃ —C—CH ₂ CH ₂ CH ₃ H	—С ₂ Н ₅	Н	8.0
	异戊巴比妥	$\begin{array}{ccc} H_2 & CH_3 \\ -C & -CH_2CHCH_3 \end{array}$	$-C_2H_5$	Н	7.9
	海索比妥		—С ₂ Н ₅	−CH ₃	8. 4

根据上述信息,在生理 pH 环境中(pH7.35-7.45),分子形式占比最高、口服吸收最好、中枢作用最强的药物是

A. 巴比妥酸

B. 苯巴比妥

C. 戊巴比妥

D. 异戊巴比妥

E. 海索比妥

答案: E

6. 因抑制心脏快速延迟整流钾离子通道(hERG),导致心脏 Q-T 间期延长,引发致死性尖端扭转型室性心动过速,因此被美国 FDA 撤市的药物是

A. 阿司咪唑

B. 西替利嗪

C. 地氯雷他定

D. 咪唑斯汀

E. 苯海拉明



答案: A

- 7. 属于Ⅱ相生物转化反应的是
 - A. 吗啡 3 位酚羟基与葡萄糖醛酸结合生成弱的阿片受体拮抗剂,6 位醇羟基与葡萄糖醛酸结合则生成较强的阿片受体激动剂,产生药效
 - B. 苯妥英苯环对位羟基化后, 水溶性增强, 失去生物活性
 - C. 地西泮发生 1-去甲基、3-羟基化后,水溶性增强,药效降低,但副作用也降低
 - D. 舒林酸属于前药, 在体外不显示生物活性, 进入体内氧化为亚砜后产生活性, 进一步氧化为砜类后失活
 - E. 氯霉素结构中的二氯乙酰基经氧化生成酰氯后,能与 CYP450 酶等中的脱辅基蛋白发生酰化反应,是产生毒性的主要根源

答案: A

- 8. 制备下列片剂时,不进行崩解时限检测的药品是
 - A. 维生素 C 钙泡腾片

C. 硝苯地平渗透泵片

E. 对乙酰氨基酚普通片

答案: C

B. 阿奇霉素分散片

D. 甲氧氯普胺口崩片

9. 有关胶囊剂的特点,说法错误的是

A. 可以提高药物稳定性

C. 帮助液态药物固体剂型化

E. 水溶液药物适宜制备成胶囊剂

答案: E

B. 可以掩盖药物的不良嗅味

D. 可实现定位、定速释放

10. 制备痤疮涂膜剂时,选用的成膜材料是

A. 羟丙甲基纤维素

B. 羧甲基纤维素钠

C. 鲸蜡醇

E. 凡士林

答案: D

D. PVA (聚乙烯醇)

11. 将原料药物用乙醇、油或适宜的溶剂制成溶液、乳状液或混悬液,供无破损皮肤揉擦用的液体制剂是

A. 搽剂

B. 涂剂

C. 洗剂

D. 甘油剂

E. 醑剂 答案: A

12. 热原的性质不包括

A. 荷电性

B. 水溶性

C. 挥发性

D. 耐热性

E. 过滤性

答案: C

13. 下列药物制备方法中,不能提高药物溶解度的是

A. 加入增溶剂

B. 微粉化技术

C. 包合技术

D. 制成共晶



E. 包衣 答案: E

- 14. 有关灭菌制剂特点的说法,错误的是
 - A. 供静脉注射的注射剂应具有与血浆相同或略偏高的渗透压
 - B. 对≥100ml 的静脉滴注用注射液应进行不溶性微粒检查
 - C. 对湿、热敏感的抗生素和生物制品适宜制备成注射用无菌粉末
 - D. 滴眼剂中不应加入抑菌剂
 - E. 混悬型眼用制剂不得检出超过 90 μ m 的粒子,大于 50 μ m 的粒子不得超过 2 个 答案: D
- 15. 水杨酸乳膏可用于治疗手、足癣及体、股癣等真菌感染性疾病,其处方如下:

水杨酸 50g 白凡士林 120g 硬脂酸甘油酯 70g 硬脂酸 100g

液状石蜡 100g

甘油 120g

十二烷基硫酸钠 10g

羟苯乙酯 1g

蒸馏水 480m1

有关该处方中辅料作用,说法正确的是

A. 硬脂酸是乳化剂

B. 硬脂酸甘油酯是保湿剂

C. 十二烷基磺酸钠是油相

D. 羟苯乙酯是抑菌剂

E. 白凡士林是抗氧剂

答案: D

- 16. 制备不溶性骨架片缓控释制剂的骨架材料是
 - A. β-环糊精

B. 磷脂和胆固醇

C. 乙基纤维素

D. 明胶

- E. 醋酸纤维素酞酸酯
- 答案: C
- 17. 属于均相液体制剂的是
 - A. 布洛芬口服混悬液

B. 鱼肝油乳剂

C. 胃蛋白酶合剂

D. 纳米银溶胶

- E. 复方硫磺洗剂
- 答案: C
- 18. 有关经皮给药制剂的特点,说法错误的是
 - A. 可产生全身治疗作用

B. 避免了肝首过效应

C. 缓慢释放药物

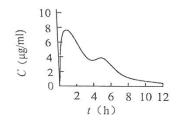
D. 存在皮肤的代谢与储库作用

- E. 血药浓度波动较大
- 答案: E
- 19. 有关脂质体的特点和质量要求, 说法错误的是
 - A. 通常要求脂质体的包封率不低于 80%
 - B. 将脂质体用 PEG (聚乙二醇) 修饰后,可延长药物在体内的循环时间
 - C. 将脂质吸附在氯化钠或山梨醇上后制备成前体脂质体, 适合包封脂溶性药物
 - D. 药物制备成脂质体可降低药物毒性、提高药物稳定性
 - E. 脂质体具有靶向、快速释药作用

答案: E



20. 某药厂委托当地一家三甲医院为其研究开发的一种新药做 I 期临床试验。医院选择了 32 名健康志愿者口服该药,在服药的 0、0.5、1.0、1.5、2.0、3.0、4.0、5.0、6.0、7.0、8.0、10.0、12.0h 分别采血,经高效液相法测定血浆药物浓度,并绘制血药浓度-时间曲线,如图:



研究者发现,药物在 1.2h 出现高峰,随后血药浓度开始下降,但在 5h 左右又出现一个小峰,即双峰现象。引起双峰现象的可能原因是

- A. 药物存在肝脏首过效应
- C. 药物存在肾小管分泌过程
- E. 药物存在酶诱导效应

答案: B

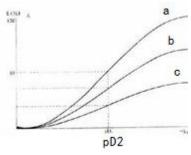
- B. 药物存在肠肝循环现象
- D. 药物存在肾小球滤过过程

- 21. 有关药物基本作用的说法,正确的是
 - A. 药物与受体结合具有结构特异性, 若药物进入体内与多种受体产生相互作用, 说明其选择性差
 - B. 若药物进入体内分布在多种组织、器官,药物作用范围广泛,说明其特异性差
 - C. 一个药物的选择性和特异性是平行的,即药物的选择性越高,其特异性也越强
 - D. 药物的选择性是相对的,有时与药物的剂量有关
 - E. 药物与机体生物大分子相互作用所引起的初始作用称为药理效应 答案: D
- 22. 通过非特异性机制产生药效的药物是
 - A. 氯化铵酸化尿液促进碱性毒物排泄
 - C. 氟尿嘧啶干扰肿瘤细胞核酸代谢
 - E. 尿激酶激活血浆纤溶酶原产生溶栓作用

答案: A

- B. 静脉注射甘露醇产生渗透压而利尿
- D. 胰岛素补充疗法治疗糖尿病

23. a、b、c 三个激动药的浓度-效应曲线图如下。根据图示,下列描述正确的是



- A. a、b、c 三个激动药的内在活性相等
- C. a、b、c 三个激动药的 ED₅₀大小顺序为 a>b>c
- E.a、b、c 三个激动药的治疗指数相等

答案: B

- B. a、b、c 三个激动药与受体的亲和力相等
- D. a、b、c 三个激动药的效能大小顺序为 a lb c

24. 属于生理性拮抗的药物相互作用是



A. 苯海拉明可拮抗组胺 H. 受体激动药的作 B. 普萘洛尔拮抗异丙肾上腺素的 β 受体激动作用 C. 肾上腺素抑制组胺作用治疗过敏性休克 D. 苯巴比妥使避孕药避孕失败 E. 肝素过量引起出血用静注鱼精蛋白注射液解救 答案: C 25. 经甲基戊二酰辅酶 A 还原酶抑制剂可抑制胆固醇的合成,药物效应也体现出相应的昼夜节律,效果好 的服药时间是 A. 睡前服用 B. 饭后服用 C. 晨起 08:00 服用 D. 饭前服用 E. 任意时间服用 答案: A 26. 抑制环氧酶导致前列腺素合成减少,从而造成白三烯合成增多,易引起哮喘的药物是 A. 卡托普利 B. 阿司匹林 C. 吗啡 D. 麻黄碱 E. 胺碘酮 答案: B 27. 异烟肼在不同人群中代谢速度不同,导致出现的毒副作用也有差异,造成异烟肼代谢差异的代谢酶是 A. CYP450 B. N-乙酰基转移酶 C. 假性胆碱酯酶 D. 水解酶 E. 还原酶 答案: B 28. 青霉素皮试的阳性率在白天低, 19:00~23:00 时最高, 原因是 A. 组织敏感性存在昼夜节律 B. 受体敏感性存在昼夜节律 C. 药物吸收存在昼夜节律 D. 受体数量存在昼夜敏感性 E. 药物代谢存在昼夜节律 答案: A 29. 影响线性药动学特征(一级动力学)药物生物半衰期的因素是 A. 给药途径 B. 代谢、排泄速度 C. 药物剂型 D. 给药剂量 E. 给药时间间隔 答案: B

30. 已知某药物的消除速率常数为 1. 39h⁻¹,静脉滴注该药物,达到稳态血药浓度 75%时,需要的给药时间 是

B. 2h

A. 1h

C. 3h D. 4h

E. 5h 答案: A

- 31. 有关药物表观分布容积(V)的描述,说法错误的是
 - A. V 值大说明药物体内分布广泛或者组织摄取量多
 - B. 一般水溶性或极性大的药物, 其 V 值较小



- C. 亲脂性药物的 V 值通常较大, 往往超过体液总体积
- D. 对于低白蛋白血症患者,血浆蛋白结合率高的药物 V 值减少
- E. 药物表观分布容积是药物在机体内的真实分布容积

答案: E

32. 因治疗指数低、毒性反应强,临床给药时需进行血药浓度监测的药物是

A. 苯妥英钠

B. 强心苷

C. 氨基糖苷类药物

D. 三环类抗抑郁药

E. 硝苯地平

答案: B

- 33. 中国药典对药品质量标准中含量(效价)限度的说法,错误的是
 - A. 原料药的含量限度是指有效物质所占的百分比
 - B. 制剂含量限度一般用含量占标示量的百分率表示
 - C. 制剂效价限度一般用效价占标示量的百分率表示
 - D. 抗生素效价限度一般用重量单位 (mg) 表示
 - E. 原料药含量测定的百分比一般是指重量的百分比 答案: D
- 34. 在药物的鉴别、含量测定时,常采用光谱法和色谱法。试验药品采用溴化钾压片后置于仪器中,所产生的吸收光谱具有人指纹一样的特征专属性,可用于药物鉴别的方法是

A. 紫外分光光度法

B. 红外分光光度法

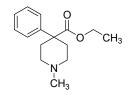
C. 高效液相色谱法

D. 色谱-质谱联用法

E. 荧光免疫法

答案: B

35. 哌替啶结构式如下,有关哌替啶的稳定性、代谢、应用事项,描述正确的是



- A. 酯基的邻位有苯环存在,空间位阻大,水溶液极易水解
- B. 酯基在血浆中可被酯酶水解生成哌替啶酸,水解产物的镇痛作用约为原药的 50%
- C. 在肝脏中可发生 N-去甲基代谢,生成去甲基哌替啶,该代谢物几乎无镇痛作用,且体内消除较慢,易蓄积中毒引发癫痫,故慢性疼痛患者不宜长期使用哌替啶止痛
- D. 发生 N-去甲基、酯基水解后生成去甲基哌替啶酸,该代谢物体内消除缓慢,易蓄积中毒引发癫痫
- E. 代谢物去甲基哌替啶镇痛作用强于哌替啶, 但半衰期短

答案: C

36. 喹诺酮类药物禁用于 18 岁以下儿童,原因是服用后可造成体内金属离子流失,引起这一副反应的主要结构基团是

A. 氟原子

B. 哌嗪环

C. 环丙基

D. 3 位羧酸和 4 位羰基

E. 氨基

答案: D



37. 结构中具有三氮唑环, 羟基化代谢物具有更强的活性, 药物药效由原药和代谢物共同完成, 该药是

A. 氟康唑

B. 伏立康唑

C. 酮康唑

D. 伊曲康唑

E. 咪康唑

答案: D

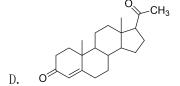
38. 属于芳构化酶抑制药,可与芳构化酶蛋白的血红素基的铁原子配位结合,显著降低体内雌激素水平, 用于治疗雌激素依赖型疾病的是

来曲唑

 CH_3 H₃C В.

他莫昔芬

雷洛昔芬



黄体酮

Ε.

Α.

己烯雌酚

答案: A

39. 将紫杉醇 10 位碳脱乙酰基,13 位的侧链上用特丁氧羰基取代苯甲酰基对3'氨基进行修饰得到的水溶 性比紫杉醇好,毒性较小,但抗肿瘤谱更广的药物是

A. 伊立替康

B. 依托泊苷

C. 多烯他赛

D. 培美曲塞

E. 吉西他滨

答案: C

$$CI$$
 N
 $COOC_2H_5$

40. 有关氯雷他定(

)的叙述,错误的是

- A. 属于三环类非镇静性抗组胺药
- B. 本身无活性, 经去乙氧羰基代谢生成地氯雷他定后产生 H1 受体阻断作用
- C. 代谢物无心脏毒性, 且起效快
- D. 口服吸收迅速,作用持续时间达 24h 以上
- E. 系第二代抗组胺药

答案: B

二、配伍选择题(共60题,每题1分。备选答案在前,试题在后。每组若干题。每组题均对应同一组备



选答案。每题只有一个正确答案,每个备选答案可重复选用,也可不选用)

[41-42]

A. 吐温 80

B. 卵磷脂

C. 泊洛沙姆

D. 聚乙二醇

E. 苯扎氯铵

41. 属于两性离子表面活性剂,主要作为乳剂的乳化剂,也作为制备脂质体的主要原料的是

42. 属于非离子表面活性剂,但增溶作用较弱,主要作为润湿剂的是

答案: BC

【43-45】

A. 饮用水

B. 注射用水

C. 灭菌注射用水

D. 纯化水

E. 天然水

43. 无特殊说明时, 提取中药饮片使用的制药用水是

44. 实行批准文号管理的制药用水是

45. 生产滴眼剂时,用作溶剂的制药用水是

答案: ACB

【46-47】

A. 甘油明胶

B. 香果脂

C. 巴西棕榈蜡

D. 叔丁基羟基茴香醚 (BHA)

E. 氢化蓖麻油

46. 制备栓剂的水溶性基质是

47. 制备栓剂的油溶性基质是

答案: AB

【48-50】

A. 简单扩散

B. 主动转运

C. 易化扩散

D. 膜动转运

E. 滤过

药物在体内转运时存在跨膜过程,不同药物的跨膜转运机制不同

- 48. 解离度小、强脂溶性药物的主要跨膜转运方式是
- 49. 维生素 B12 在回肠末端部位吸收的主要跨膜转运方式是
- 50. 蛋白质、多肽类药物体内吸收的主要跨膜转运方式是

答案: ABD

【51-53】

A. 肝药酶活性

B. 胃肠液 pH

C. 胃排空速率

D. 肾小管重吸收

E. 血脑屏障

药物在体内存在吸收、分布、代谢、排泄过程,这些过程受到很多药物因素、生理因素的影响,有时一种因素也会影响多个体内过程。

- 51. 主要影响药物体内分布的药物或生理因素是
- 52. 主要影响药物体内代谢的药物或生理因素是
- 53. 主要影响药物体内排泄的药物或生理因素是

答案: EAD



【54-56】

A. Emax

B. ED₅₀

С. α

D. $t_{1/2}$

E. AUC

- 54. 药物的效应强度随给药剂量增加而增加,当剂量达到一定程度后,效应不再升高,此效应为一极限, 称为最大效应,可表示为
- 55. 拮抗剂与受体之间具有较强的亲和力,但缺乏内在活性。内在活性可表示为
- 56. 引起 50%阳性反应或 50%最大效应的剂量可表示为

答案: ACB

【57-58】

A. 干扰素受体

B. 胰岛素受体

C. γ-氨基丁酸受体

D. 肾上腺皮质激素受体

- E.M 胆碱受体
- 57. G 蛋白偶联受体是指与鸟苷酸结合调节蛋白(G 蛋白)相偶连的受体,属于 G 蛋白偶联受体的是
- 58. 配体门控的离子通道受体是指药物与受体结合后,受体构象改变使离子通道开放或关闭,属于配体门控的离子通道受体的是

答案: EC

(59-61**)**

A. 钙离子

B. 乙酰胆碱

C. 环磷酸腺苷

D. 一氧化氮

- E. 生长因子
- 59. 既有第一信使特征,也有第二信使特征的药物分子是
- 60. 最早发现的第二信使是
- 61. 属于内源性配体的是

答案: DCB

【62-64】

A. 中毒性表皮坏死

B. 肝损伤

C. 血管神经性水肿

D. 听力障碍

- E. 心动过缓
- 62. 福辛普利引起的典型药源性疾病是
- 63. 强心苷(地高辛)引起的典型药源性疾病是
- 64. 阿米卡星引起的典型药源性疾病是

答案: CED

【65-66】

A. 1R, 2R-苏阿糖型左旋体

B. 1S, 2S-苏阿糖型右旋体

C. 1R, 2S-赤藓糖型左旋体

D. 1S, 2R-赤藓糖型右旋体

- E. 1R, 2S-赤藓糖型右旋体
- 65. 临床上使用的盐酸伪麻黄碱的构型是
- 66. 临床上使用的盐酸麻黄碱的构型是

答案: BC

[67-69]



A. tmax B. t1/2

C. Ke D. Cmax

E. AUC

67. 进行药物生物等效性研究时,描述药物吸收速度的药动学参数是

68. 进行药物生物等效性研究时,描述药物吸收总量的药动学参数是

69. 进行药物生物等效性研究时,与药物吸收速度、吸收程度均有关的药动学参数是答案: AED

【70-71】

A. 避光 B. 防潮

C. 密闭 D. 密封

E. 熔封或严封

70. 为防止尘土及异物进入,需要的保管方式是

71. 为防止药品风化、吸潮、挥发或异物进入,需要的保管方式为答案: CD

【72-74】

A. 哌拉西林 B. 头孢曲松

C. 舒巴坦 D. 法罗培南

E. 氨曲南

72. 具有β内酰胺环并氢化噻唑环,对铜绿假单胞菌有效的抗生素是

73. 具有 β 内酰胺环并部分氢化噻嗪环,产生独特非线性的剂量依赖性药动学性质的抗生素是

74. 不可逆 β 内酰胺酶抑制剂,结构中的 S 原子氧化成砜,极性增强,口服吸收差的药物是答案: ABC

[75-77]

A. 华法林钠 B. 达比加群酯

C. 阿加曲班 D. 氯吡格雷

E. 替罗非班

75. 属于香豆素结构,与维生素 K 相似,能拮抗维生素 K 的生理作用的抗凝血药是

76. 属于前药,经胃肠道吸收后部分水解转化为原药,进入门静脉后可经肝脏全部代谢为原药的凝血酶抑制药是

77. 属于前药,经水解、开环后,暴露出的巯基与靶点血小板 ADP 受体结合,产生抑制血小板聚集的药物是

答案: ABD

【78-79】

A. 紫杉醇



В.

С.

D.

Ε.

- 78. 具有过氧键的倍半萜内酯结构的药物是
- 79. 属于二萜类化合物的药物是

答案: CA

【80-82】

A. 格列美脲

B. 瑞格列奈

C. 二甲双胍

D. 吡格列酮

E. 伏格列波糖

- 80. 属于非磺酰脲类胰岛素分泌促进剂,对 K⁺-ATP 通道具有"快开"和"快闭"作用,起效迅速,作用时间短,被称为"餐时血糖调节剂"的降糖药
- 81. 属于噻唑烷二酮类胰岛素增敏剂,可使胰岛素对受体靶组织的敏感性增加,减少肝糖原产生的降糖药是
- 82. 具有强碱性,几乎全部以原形由尿排泄,故肾功能减退时,易造成蓄积引起高乳酸血症或乳酸性酸中毒的降糖药是

答案: BDC

【83-84】

A. 吩噻嗪环

B. 苯二氮草环

C. 喹啉酮环

D. β-内酰胺环

E. 鸟嘌呤环

83. 镇静催眠药地西泮(

) 的母核结构是



CH₃)的母核结构是

84. 抗精神病药氯丙嗪(

答案: BA

[85-87]

- A. 氯霉素注射液加入 5%葡萄糖注射液中时析出沉淀
- B. 盐酸氯丙嗪注射液同异戊巴比妥钠注射液混合后产生沉淀
- C. 两性霉素 B 注射液遇氯化钠输液析出沉淀
- D. 四环素与含钙盐的输液在中性或碱性下产生不溶性螯合物
- E. 磺胺嘧啶钠注射液与葡萄糖输液混合后约在 2h 左右出现沉淀
- 85. 因反应时间原因引起药物配伍禁忌的是
- 86. 因盐析作用改变引起药物配伍禁忌的是
- 87. 因直接作用改变引起药物配伍禁忌的是 答案: ECD

【88-89】

$$O \longrightarrow OH$$
 NH_2
 NH_2
 $O \longrightarrow OH$
 $O \longrightarrow OH$

H O O OH

$$H_3C$$
 OH $N=N$ NH NH

- 88. 分子中的巯基可与 ACE 的锌离子产生结合,增强药物活性,但也易被氧化生成二巯聚合物的是
- 89. 磷酰基衍生物,ACE 的锌离子能与次磷酸产生相互作用。结构中的酰氧基烷基能增强药物脂溶性,口服生物利用度高,进入体内代谢后产生活性

答案: AE

【90-92】

- A. 本身有活性,代谢后失活
- C. 本身有活性,代谢物活性降低
- E. 本身及代谢物均无活性
- 90. 苯妥英在体内代谢生成羟基苯妥英,代谢特点是
- 91. 保泰松在体内代谢生成羟布宗, 代谢特点是
- 92. 舒林酸代谢生成硫醚产物,代谢特点是答案: ABD

- B. 本身有活性, 代谢物活性增强
- D. 本身无活性, 代谢后产生活性



[93-95]

A. 叔胺

B. 酰胺

C. 硝基

D. 巯基

E. 芳环

93. 可发生水解代谢的药物结构是

94. 可发生 N-脱烷基代谢的药物结构是

95. 可发生氧化反应生成二硫键的药物结构是

答案: BAD

[96-98]

A. 稀释剂

B. 黏合剂

C. 润滑剂

D. pH 调节剂

E. 崩解剂

96. 制备克拉霉素胶囊时,加入的低取代羟丙基纤维素(L-HPC)是

97. 制备对乙酰氨基酚口服液时,加入的枸橼酸是

98. 制备硝酸甘油片时,加入的硬脂酸镁是

答案: EDC

【99-100】

A. 分层

B. 絮凝

C. 合并与破裂

D. 转相

E. 酸败

99. 由于分散相和分散介质之间的密度差可造成乳剂出现的不稳定现象是

100. 由于 5 电位降低可导致乳剂出现的不稳定现象是

答案: AB

三、综合分析题 (共 10 题,每题 1 分;每个题干下有 2-5 题,每题的备选答案中只有一个最佳答案,多选、错选或不选均不得分)

【101-104】

20 世纪 40 年代,在大量应用磺胺类药物磺胺异丙基噻二唑治疗斑疹伤寒时出现了很多不明原因的死亡病例。进一步研究发现,这是由于磺胺异丙基噻二唑可刺激胰腺释放胰岛素,引起患者低血糖所致。1955年发现具有抗菌活性的氨苯磺丁脲具有更强的降血糖作用,是第一个应用于临床的磺酰脲类降糖药,但因骨髓毒性大,后被停用。氨苯磺丁脲的发现,促进了磺酰脲类降糖药的研究,磺酰脲类降糖药结构通式及常用药物如下。

磺酰脲类降糖药结构通式

		INCHARACIO CI I PA PARA I A CONT				
=药名	R	R ₁ 半衰期	作	用	肾清除	
		(h)	持	续	率 (%)	
			时	间		
				(h)		
甲苯磺丁脲	H ₃ C—	CH 4. 5-6. 5	6-1	12	100	



氯磺丙脲	CI—	∕CH ₃	36	>60	80-90
格列本脲	CI N H OCH3		1.5-3.0	>24	50
格列齐特	H ₃ C—	-N	10-12	>24	60-70
格列吡嗪	H ₃ C N H	\bigcirc	4	>24	68
格列美脲	H ₃ C N H	CH ₃	2-3	>24	40

101. 根据题干信息, 磺酰脲类降糖药的作用机制是

A. 胰岛素增敏剂

B. α -葡萄糖苷酶抑制剂

C. 胰岛素分泌促进剂

D. 二肽基肽酶-IV抑制剂

E. 胰高糖素样肽-1 受体激动剂

答案: C

102. 相比氯磺丙脲,甲苯磺丁脲代谢速度快,且代谢产物失活,因而半衰期短,作用时间短。甲苯磺丁脲 体内发生的主要 I 相代谢反应是

A. 脱甲基代谢

B. 甲基氧化为羧酸

C. 芳环羟化

D. 烯烃氧化

E. 酯基水解

答案: B

103. 当 R_1 为甲基环己基时,甲基处在环己烷的平伏键上,阻碍了环己烷的羟基化反应,因此具有高效、长效降血糖作用,具有上述特征的药物是

A. 氯磺丙脲

B. 格列本脲

C. 格列齐特

D. 格列吡嗪

E. 格列美脲

答案: E

104. 该类药物与其他弱酸性药物一样能与血浆蛋白牢固结合,因此与阿司匹林、保泰松或磺胺药等弱酸性药物合用时,可竞争血浆蛋白结合位点,导致该类药物

- A. 游离型药物增多,降血糖作用增强,引起低血糖
- B. 结合型药物增多, 降血糖作用下降
- C. 游离性药物增多,降糖作用下降
- D. 结合型药物增多,降糖作用增强
- E. 游离型药物和结合型药物均增多,降糖作用不变

答案: A

【105-108】



茶碱属于磷酸二酯酶抑制剂类平喘药,供临床使用的剂型包括普通片、缓释片、栓剂、注射剂等。制备 茶碱微孔膜缓释小片处方如下:

片芯: 茶碱、5%CMC 浆液适量、硬脂酸镁

包衣液: 乙基纤维素、聚山梨酯 20、EudragitRL100、EudragitRS100

105. 处方中聚山梨酯 20 的作用是

A. 致孔剂

B. 润滑剂

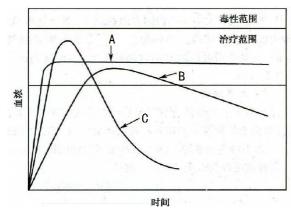
C. 增溶剂

D. 润湿剂

E. 崩解剂

答案: A

106. 缓释制剂应检查药物释放速度,图中A、B和C三条曲线,符合茶碱缓释片质量要求的是



A. A 曲线和 B 曲线均符合

B. A 曲线和 C 曲线均符合

C. 仅 A 曲线符合

D. 仅 B 曲线符合

E. 仅 C 曲线符合

答案: D

- 107. 临床应用茶碱时,应进行血药浓度监测,将血药浓度控制在 5-10 μ g/ml,原因是
 - A. 具有非线性药动学特征

B. 治疗指数小,安全范围窄,毒性反应强

C. 毒性反应不易识别

D. 属特殊人群用药

E. 药物易蓄积中毒

答案: B

- 108. 用药期间为防止血药浓度波动,建议患者避免合用的药物是
 - A. 丙酸倍氯米松

B. 沙丁胺醇

C. 异丙托溴铵

D. 普萘洛尔

E. 西咪替丁

答案: E

【109-110】

患者,女,21岁,因支气管哮喘购药,药师推荐舒利迭气雾剂(含沙美特罗、氟替卡松)。 109. 药师对患者的交代事项不包括

A. 应贮存在凉暗处

B. 用完的小罐不可刺破

C. 使用前应充分摇匀

D. 吸入结束后避免漱口

E. 给药后应缓慢呼气

答案: D



- 110. 该药为复方平喘药,两个药物的作用是
 - A. 沙美特罗是 a 2 受体激动剂, 氟替卡松是磷酸二酯酶抑制剂
 - B. 沙美特罗是 β 2 受体激动剂, 氟替卡松是糖皮质激素类药物
 - C. 沙美特罗是抗胆碱药, 氟替卡松是白三烯受体阻断剂
 - D. 沙美特罗是糖皮质激素类药物, 氟替卡松是 B 2 受体激动剂
 - E. 沙美特罗是肥大细胞膜稳定剂, 氟替卡松是糖皮质激素类药物

答案: B

四、多项选择题(共10题,每题1分。每题的备选答案中有2个或2个以上正确,少选或多选均不得分)

111. 影响药效的因素包括

A. 剂型

B. 理化性质

C. 半衰期

D. 内在活性

E. 联合用药

答案: ABCDE

112. 制备液体制剂的极性溶剂有

A. 水

B. 乙酸乙酯

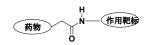
C. 甘油

D. 乙醇

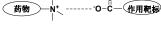
E. 二甲基亚砜

答案: ACE

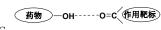
113. 下列药物与靶标之间的键合形式,属于非共价键结合的有



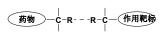
В.



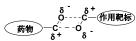
A.



D.



С.



Ε.

答案: BCDE

- 114. 可避免首关效应的制剂有
 - A. 丙酸倍氯米松气雾剂
 - C. 茶碱缓释片
 - E. 西替利嗪舌下片

答案: ABDE

- B. 吲哚美辛透皮贴剂
- D. 维生素 C 注射剂

- 115. 属于药效学参数的是
 - A. 亲和力
 - C. 达峰时间
 - E. 半数有效量

答案: ABE

- B. 内在活性
- D. 血药浓度-时间曲线下面积



116. 属于开环核苷类抗病毒药物的有

答案: ABD

- 117. 关于非线性药动学, 叙述正确的有
 - A. 在低剂量时, 药物消除表现为线性动力学特征
 - B. 在较大剂量时, 药物消除不呈现一级动力学特征
 - C. 给药剂量增大, 药物的消除速度减慢
 - D. 对于非线性动力学特征的药物无须进行血药浓度监测
 - E. 药物呈现非线性动力学与体内转运载体或代谢酶饱和等因素有关

答案: ABCE

- 118. 临床常用的血药浓度测定方法有
 - A. 气相色谱-质谱联用法(GC-MS)
 - C. 酶联免疫法(ELISA)
 - E. 液相色谱-质谱联用法(LG-MS)

答案: ACDE

- B. 薄层色谱法(HLC)
- D. 高相液相色谱法 (HPLC)

119. 芳基丙酸类 NSAID 是在芳基乙酸的 α -碳原子上引入甲基得到的,甲基的引入限制了羧基的自由旋转,使其保持适合与受体或酶结合的构象,提高抗炎活性,且毒性也有所下降,引入甲基后使得 α -碳原子成为手性碳原子,该类药物的对映异构体之间在生理活性、毒性、体内分布及代谢方面均有差异,具有上述特征的药物有

СООН



答案: CD

120. 环磷酰胺在肿瘤细胞中代谢产生的活性代谢物有

D.
$$H_2C$$