

第一篇

药专业知识（一）

分值比例及重点提示

速记导图

考点速记

独家记忆

第一章 药品与药品质量标准



听听老师怎么讲

分值比例及重点提示

本章预计分值：8~11分

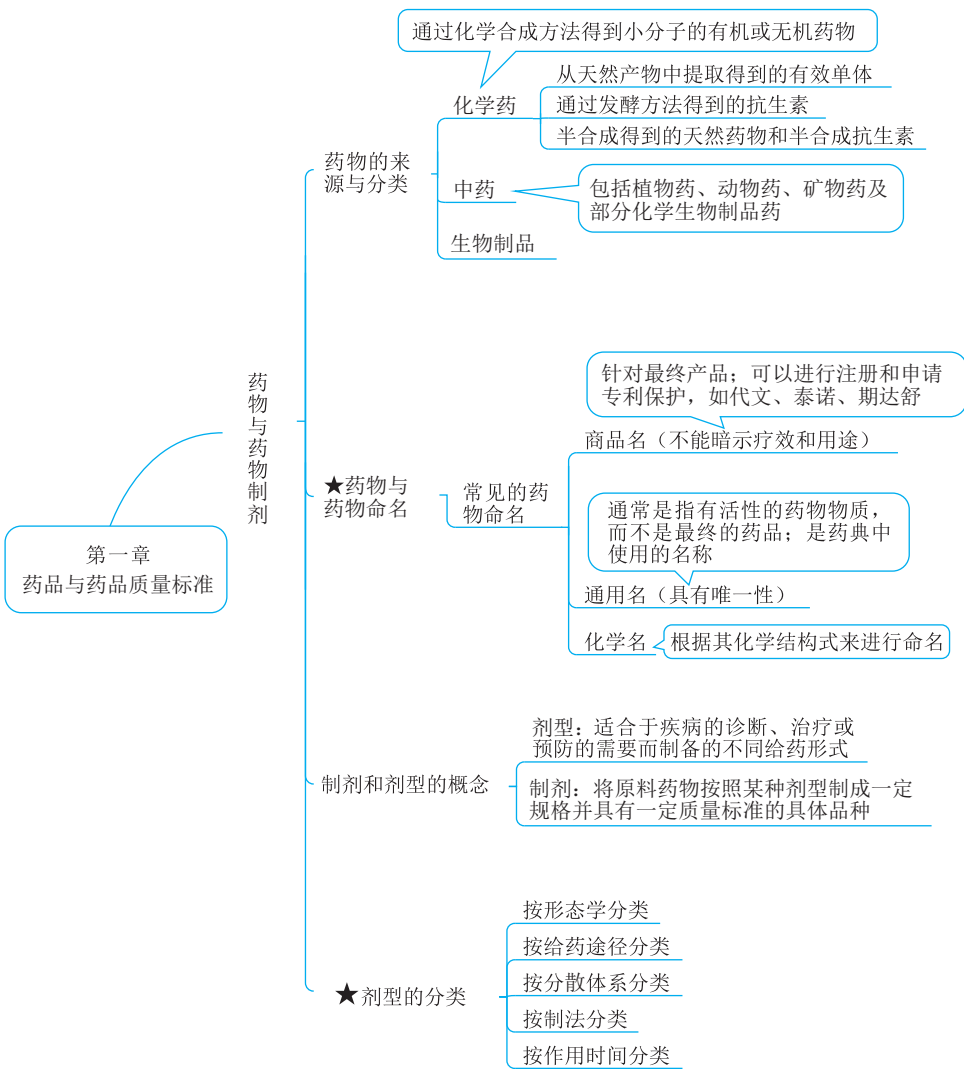
章节	预计分值	重点提示
第一节 药物与药物制剂	4~5	药物的来源与分类 药物的通用名、商品名和化学名的区别 药物剂型的分类方法 药用辅料与药品包装材料 药物的化学降解途径 影响药物稳定性的因素和提高药物稳定性的方法 药物稳定化试验方法
第二节 药物质量标准	2~3	《中国药典》的结构与内容 国际药典标准的基本内容与特点 我国药品标准体系的构成
第三节 药物质量保证	2~3	创新药质量研究 仿制药质量一致性评价 药品质量检验分类 生物样品种类与测定方法 药动学研究 with 参数测定

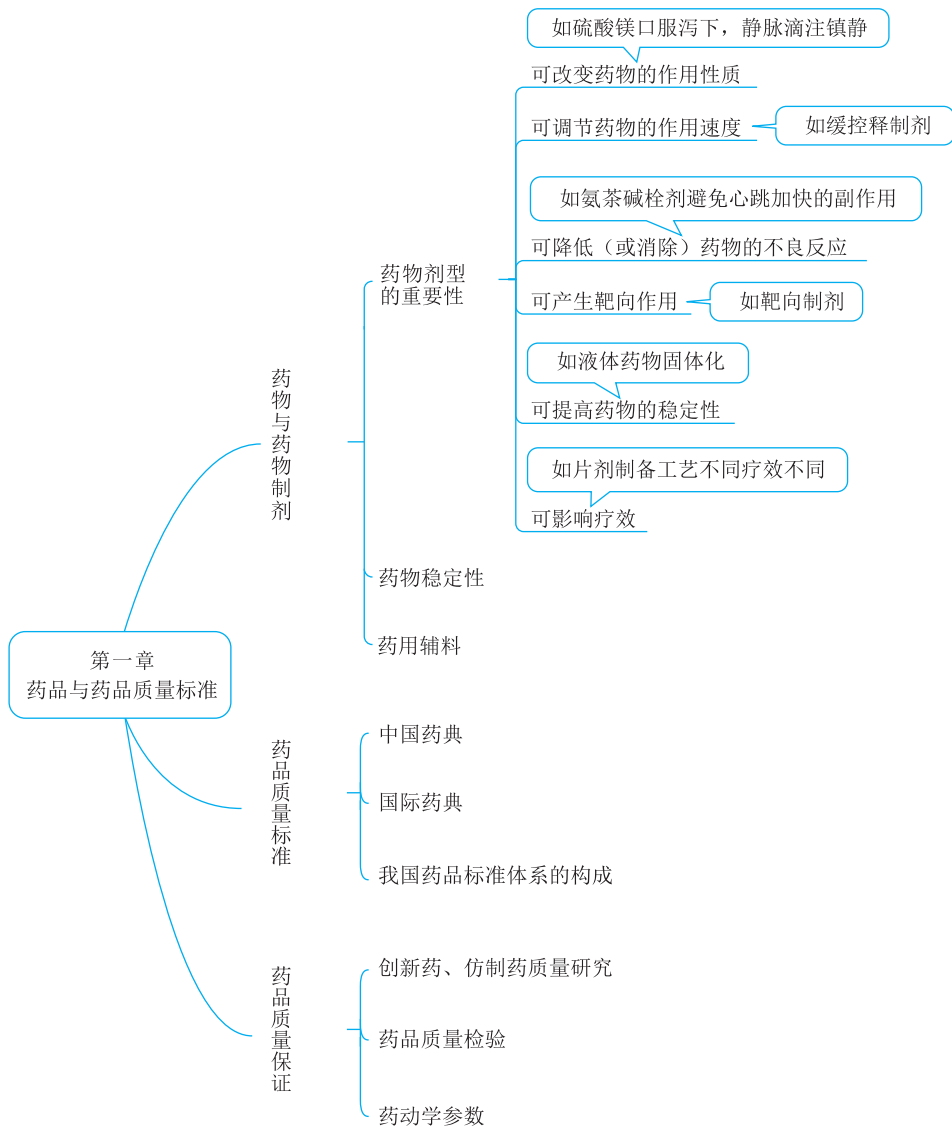
关于“听听老师怎么讲”，你需要知道——

亲爱的读者，本书中各章节均有赠送课程——听听老师怎么讲。下载并安装“医学教育网”APP，扫描对应二维码，即可观看学习（前10次试听免费）。

若想获取更多的视频课程，建议选购正保医学教育网上辅导课程，详情参见正保医学教育网（<http://www.med66.com>）招生方案。

速记导图





考点速记

1. 国际药品标准

名称	最新版本	发行频率	其他
《美国药典》	USP42-NF37	1 年	基本内容包括凡例、通则、标准正文
《欧洲药典》	EP10.0	3 年	分为 3 卷，不载化学药物制剂
《日本药典》 (名称是《日本药局方》)	JP17	5 年	收载有红外光谱集和紫外-可见光谱集

2. 药物剂型与制剂的区别

制剂名 = 药物通用名 + 剂型, 如维生素 C 片(制剂) = 维生素 C(药物通用名) + 片(剂型)。

3. 剂型的分类

分类方式	具体剂型
形态学	液体剂型、气体剂型、固体剂型、半固体剂型
给药途径	胃肠道给药剂型：散剂、片剂、颗粒剂、胶囊剂、溶液剂、糖浆剂 非经胃肠道给药剂型：注射剂、软膏剂、含片、滴鼻剂、气雾剂、滴眼剂、栓剂
分散系统	真溶液、乳剂、混悬液、气体分散、固体分散、微粒
制法	不常用，如浸出制剂、无菌制剂
作用时间	速释、普通和缓控释制剂

4. 药物制剂稳定性变化

稳定性变化	具体变化方式	具体药物
化学	水解	酯类和酰胺类药物(盐酸普鲁卡因、青霉素)
	氧化	酚类和烯醇类药物(吗啡、维生素 C)
化学	异构化	肾上腺素、毛果芸香碱
	聚合	氨苄西林、塞替派
	脱羧	对氨基水杨酸钠



续表

稳定性变化	具体变化方式	具体药物
物理	混悬剂颗粒结块、结晶生长，乳剂的分层、破裂，胶体制剂的老化，片剂崩解度、溶出速度的改变	
生物	药物的酶分解变质	

其中，药物降解的两个主要途径是水解和氧化。

5. 贮藏条件

贮藏条件	定义
遮光	用不透光的容器包装
避光	避免日光直射
密闭	将容器密闭，以防尘土及异物进入
密封	将容器密封以防止风化、吸潮、挥发和异物进入
熔封或严封	将容器熔封或用适宜的材料严封，以防止空气与水分的侵入并防止污染
阴凉处	贮藏处温度不超过 20℃
凉暗处	贮藏处避光并温度不超过 20℃
冷处	贮藏处温度为 2~10℃
常温	温度为 10~30℃ (除另有规定外，贮藏项下未规定贮藏温度的一般系指常温)

6. 药品质量研究的工作

主要分为三部分：结构确证、分析方法建立与验证、稳定性考察。

结构确证：确定药物分子结构式、分子量与分子式，是新药研发的基础工作。

包括一般项目：常用有机光谱分析法；手性药物：常用旋光度法、手性柱色谱法、单晶 X 射线衍射法；药物晶型；结晶溶剂：常用热分析法研究。

7. 杂质检查

药品中杂质分为一般杂质和特殊杂质。

(1) 一般杂质检查法：一般杂质包括氯化物(与硝酸银反应出现浑浊)、重金属(铅与硫代乙酰胺或硫化钠作用显色)、砷盐(古蔡氏法)、干燥失重(干燥至恒重)或水分(费休氏法)、炽灼残渣(与硫酸生成硫酸盐杂质)、残留溶剂(分四

我的学习笔记



类)等。

(2)特殊杂质检查法:包括合成起始物料及杂质、中间体、副产物、降解产物等。

例如阿司匹林中的“游离水杨酸”、对乙酰氨基酚中的“对氯苯乙酰胺”、盐酸普鲁卡因中的“对氨基苯甲酸”等。

8. 注射剂安全性检查项目

包括异常毒性、细菌内毒素(或热原)、降压物质(包括组胺类物质)、过敏反应、溶血与凝聚等项。其中细菌内毒素与热原检查项目间、降压物质与组胺类物质检查项目间,可以根据适用性研究结果相互替代,选择两者之一作为检查项。

(1)静脉用注射剂:细菌内毒素(或热原)。化学药品注射剂首选细菌内毒素检查项,中药注射剂首选热原检查项。中药注射剂应考虑设立溶血与凝聚检查项。

(2)肌内注射用注射剂:根据情况考虑设立异常毒性检查项、过敏反应检查项、细菌内毒素检查项。

(3)特殊途径的注射剂:应符合静脉注射用注射剂要求,必要时增加刺激性检查、细胞毒性检查。

9. 药品质量检验

药品检验工作的基本程序包括抽样、检验、出具检验报告等。

(1)抽样:检验工作的开始。

(2)检验:对每一批样品,鉴别或限度试验通常取一份供试品进行试验;含量测定取两份供试品;当测定法精密度较差时,适当增加平行测定次数,旋光度测定时,每次供试品溶液应连续读取三次数据,取平均值,采用费休氏法测定水分时,应取三份供试品平行测定。

(3)报告:记载的内容包括品名、规格、批号、数量、包装、有效期、生产单位、检验依据、取样/收检日期、报告日期、检验项目、标准规定、检验结果、检验结论。



第二章 药物的结构与作用



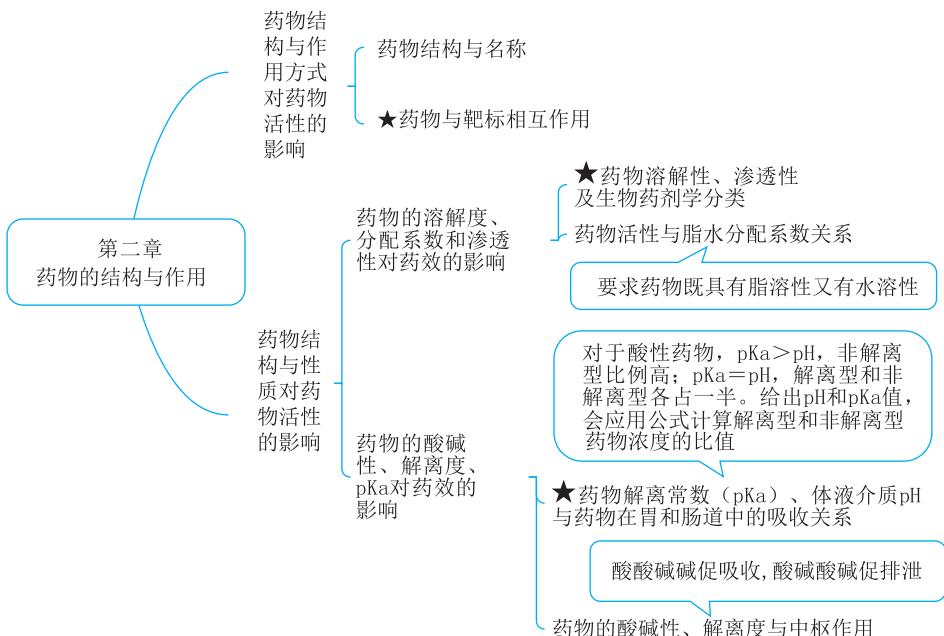
听听老师怎么讲

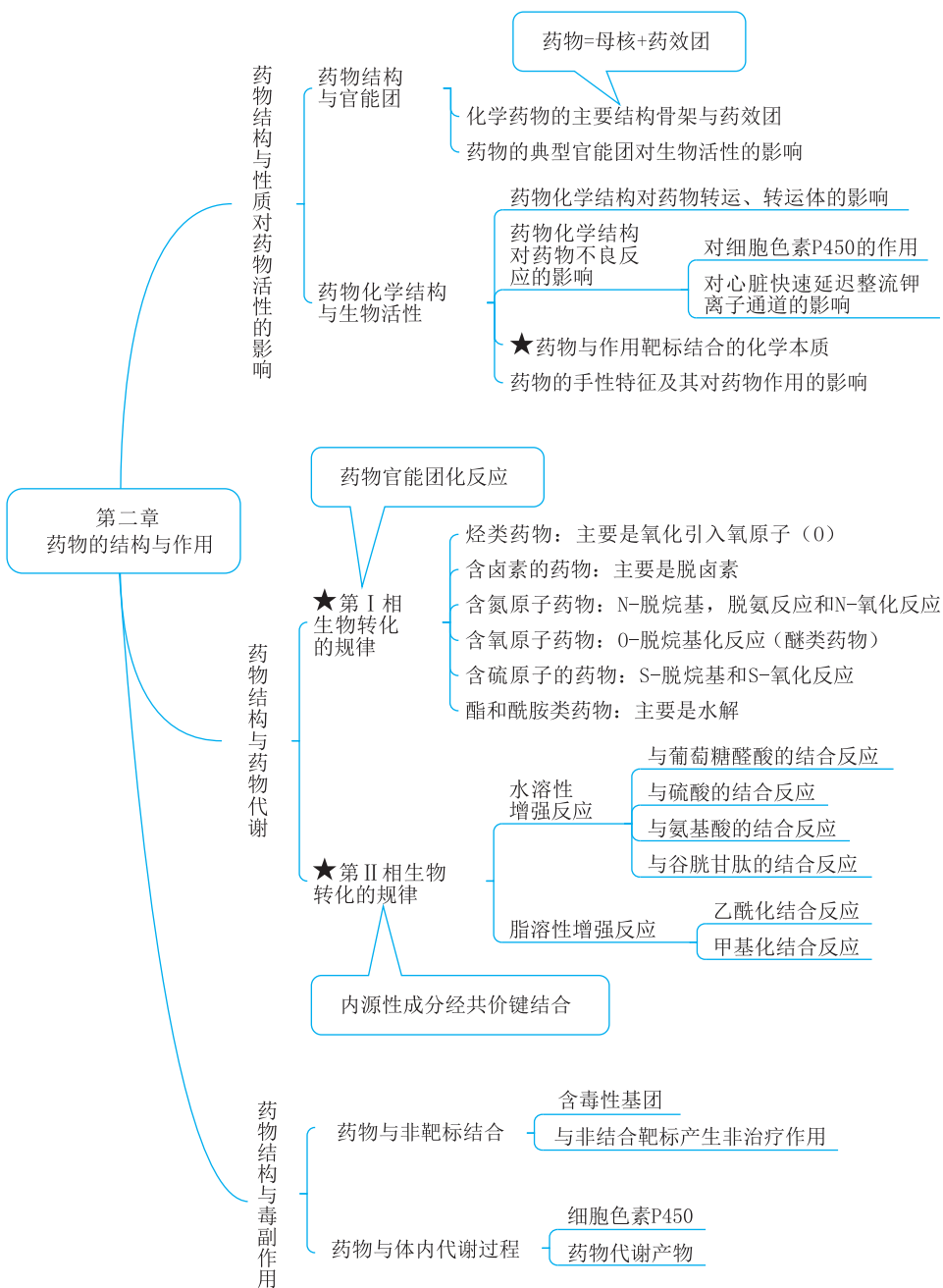
分值比例及重点提示

本章预计分值：11~14分

章节	预计分值	重点提示
第一节 药物结构与作用方式对药物活性的影响	3~5	药物与作用靶标结合的化学本质
第二节 药物结构与性质对药物活性的影响	2~3	药物的生物药剂学分类 药物的酸碱性、解离度和 pK_a 对药效的影响
第三节 药物结构与药物代谢	2~3	药物第 I 相生物转化和第 II 相生物转化规律
第四节 药物结构与毒副作用	2~3	药物与非靶标结合引起的毒副作用

速记导图





考点速记

我的学习笔记 

1. 药物的生物药剂学分类系统

	分类	体内吸收 决定因素	代表药
第Ⅰ类	高水溶性、高渗透性的两亲性分子药物	溶出度	普萘洛尔、依那普利、地尔硫草
第Ⅱ类	低水溶性、高渗透性的亲脂性分子药物	溶解度	双氯芬酸、卡马西平、吡罗昔康
第Ⅲ类	高水溶性、低渗透性的水溶性分子药物	渗透率	雷尼替丁、纳多洛尔、阿替洛尔
第Ⅳ类	低水溶性、低渗透性的疏水性分子药物	难吸收	特非那定、酮洛芬、吠塞米

2. 药物的酸碱性、解离度和 pK_a 对药效的影响

有机药物多数显弱酸性或弱碱性，**弱酸性药物在酸性的胃液中非解离型多，吸收增多**，在碱性的小肠中解离型增多，吸收减少；**弱碱性药物在酸性的胃液中解离型多，吸收减少**，在碱性的小肠中非解离型增多，吸收增多。

3. 药物典型官能团对生物活性的影响

官能团	对生物活性影响
烃基	改变溶解度、解离度、分配系数，位阻增加，稳定性增加。如环己巴比妥引入甲基→海索比妥，不易解离
卤素	影响电荷分布、脂溶性及作用时间。如：安定作用：氟奋乃静>奋乃静
羟基	增强与受体结合力，水溶性增大，改变活性
巯基	形成氢键能力比羟基低，但脂溶性高，更易吸收。如解毒药：与重金属形成不溶性硫醇盐
醚和硫醚	醚类在脂-水交界处定向排布，易通过生物膜。如硫醚类可氧化成 亚砜或砜 ，极性↑
磺酸	水溶性和解离度增加，不易吸收，仅有磺酸基一般无活性
羧酸	水溶性解离度增加，但较磺酸小，成酯后脂溶性增加
酰胺	增强与受体的结合能力



续表

官能团	对生物活性影响
胺类	N上未共用电子;碱性、氢键接受体(与多种受体结合)表现出多样的生物活性。如 活性:伯胺>仲胺>叔胺(伯仲叔按年龄排序,大哥活性强)

4. 药物与作用靶标结合的化学本质

键合类型		举例
共价键(不可逆)		烷化剂类抗肿瘤药物与 DNA 中鸟嘌呤碱基键合形式
非共价键(可逆)	氢键(最常见的非共价键形式)	磺酰胺类利尿药碳酸酐酶结合形式
	离子-偶极和偶极-偶极	羰基化合物,乙酰胆碱和受体的作用
	电荷转移复合物	抗疟药氯喹插入到疟原虫的 DNA 碱基对之间的作用
	疏水性相互作用	药物非极性部分与生物大分子非极性部分的相互作用
	范德华引力	非极性分子中的暂时不对称电荷分布

独家记忆

6种结合反应,分为**四大**(与**酸**结合,极性和水溶性增大)和**两小**(**乙酰化和甲基化**,极性和水溶性变小)。

注解:酸指的是葡萄糖醛酸、硫酸、氨基酸、谷胱甘肽,谷胱甘肽是氨基酸组成的三肽化合物。

5. 药物与非靶标结合引发的毒副作用

(1) 含有毒性基团的药物作用

抗肿瘤烷化剂,如氮芥类、磺酸酯类、醌类、含氮丙啶类结构的药物有亲电性的毒性基团,与核酸、蛋白质等发生烷基化或氧化反应,产生毒性、致癌性或致突变性。

(2) 药物作用在非结合靶标产生非治疗作用

药物与非治疗部位靶标结合:抗精神病药物产生锥体外系反应(氯丙嗪、氯普噍吨、氟哌啶醇、奋乃静、洛沙平等);选择性 COX-2 抑制剂的非甾体抗炎药产生心血管不良反应

