

添加学霸君微信号“ks233wx7”, 拉你进 2020 年执业药师药师备考交流群。

通过 233 网校 APP—我的资料包, 下载更多执业药师学习资料, 最新章节习题, 模拟试题, 历年真题在线免费做!

[点击领取 >> 执业药师新人大礼包\(购课优惠券+精讲班免费视频+精华资料\)>>](#)

## 2020 年执业药师《药学专业知识一》新增考点解析:

### 药物与毒副作用

尽管新药在研究开发过程中, 对药物的毒副作用进行了极其严格的研究, 但在药物上市后的使用过程中, 仍会产生一些不良反应和副作用, 这是不可避免的。如果药物使用不当, 或配伍错误, 甚至会产生严重的不良反应, 从而导致患者死亡。

#### 一、新增考点

药物与非靶标结合引发的毒副作用	抗肿瘤的烷化剂, 如氮芥类、磺酸酯类、含有氮丙啶结构的药物、含有醌类结构的药物等含有毒性基团, 表现为毒性、致癌性或致突变性
	抗精神病药物产生的锥体外系副作用, 主要症状是帕金森综合征, 表现为运动障碍, 如坐立不安, 不停的动作、震颤、僵硬等
	选择性 COX-2 抑制剂的非甾体抗炎药物罗非昔布、伐地昔布等所产生心血管不良反应
	选择性的 COX-2 抑制剂罗非昔布、伐地昔布等强力抑制 COX-2, 增强血小板聚集和血管收缩, 引发了血管栓塞
	血管紧张素转换酶抑制药类药物卡托普利、依那普利、赖诺普利、培哚普利、喹那普利、雷米普利、福辛普利等治疗心血管疾病, 导致血压过低、血钾过多、咳嗽、皮疹、味觉障碍等不良反应
	大环内酯类抗生素红霉素类药物, 如红霉素、罗红霉素、克拉霉素等 14 元环的内酯化合物抗菌的同时也刺激了胃动素的活性, 引起恶心、呕吐等胃肠道副作用
	抗心律失常药、抗心绞痛药和强心药, 抗高血压药、抗精神失常药、抗抑郁药等药抑制 hERG K <sup>+</sup> 通道, 诱发尖端扭转型室性心动过速
	抗过敏药物特非那定、阿司咪唑因干扰心肌细胞 K <sup>+</sup> 通道, 引发致死性尖端扭转型室性心动过速, 导致药源性心律失常
药物与体内代谢过程引发的毒副作用	含氮杂环, 如咪唑、吡啶等可以和血红素中的铁离子整合, 对 CYP 具有可逆抑制作用
	抗真菌药物酮康唑对 CYP51 和 CYP3A4 产生可逆性抑制作用
	胺类化合物如地尔硫草、丙米嗪、尼卡地平等可转化为亚硝基代谢中间体, 与血红素的铁离子整合产生抑制作用
	服用对乙酰氨基酚或含有对乙酰氨基酚成分药品的患者, 再同时大量饮酒就会大量消耗体内的谷胱甘肽, 与体内的蛋白等生物大分子作用产生毒性



考证就上233网校APP

报考指导、学习视频、免费题库一手掌握

含苯胺、苯酚等结构药物的代谢产物可能被 CYP450 氧化代谢生成醌、亚胺醌和次甲基醌的结构, 有产生毒性或引发特质性反应的潜在风险
非甾体抗炎药双氯芬酸的结构中含有二苯胺, 可被 CYP3A4 或 MPO 催化代谢氧化, 生成与蛋白的加成产物, 引发肝脏毒性
非三环类抗抑郁药奈法唑酮含有苯基哌嗪片段, 代谢产物可氧化为具有亲电性的亚胺一醌以及 N-去芳基化生成氯代对醌, 从而产生肝毒性
$\beta$ 受体阻断药普洛洛尔在体内的代谢活化产物可与蛋白发生不可逆结合生成产物, 导致临床上发生特质性硬化性腹膜炎
曲格列酮母核在 CYP2C8 和 CYP3A4 的作用下形成强亲电试剂 o-次甲基-醌和 p-醌, 进而与蛋白质以共价键结合; 曲格列酮的噻唑烷二酮的代谢活化也会产生毒性
舒多昔康的噻唑环被 CYP450 开环, 生成乙二醛和强亲电性酰基硫脲, 后者可与蛋白质的亲核基团发生共价结合而产生毒性
非甾体抗炎药佐美酸的代谢产物葡糖醛酸苷酯, 可与肝脏的蛋白分子共价结合从而引发肝脏毒性
另一抗炎药苯唔洛芬的代谢产物为葡糖醛酸苷酯化合物, 其可与血浆蛋白的 159 位赖氨酸以共价键结合, 进而产生特质性毒性反应
抗炎药芬氟酸和异丁芬酸也因可发生葡糖醛酸苷酯化反应, 进而引发急性肝中毒和变态反应
钠通道阻滞药非尔氨酯在体内的代谢产物易与蛋白的亲核基团发生迈克尔加成, 产生特质性毒性

## 二、考情分析

药物的毒副作用属于考点, 特别是有毒副作用的药物示例, 其中包括药物在体内的代谢反应, 生成的产物等, 考试中都有可能考查到。预计考试分数 1 分左右。

【例题】关于药物毒副作用的说法, 错误的是 ( )

- A. 服用对乙酰氨基酚, 再同时大量饮酒就会大量消耗体内的谷胱甘肽
- B. 曲格列酮的噻唑烷二酮的代谢活化会产生毒性
- C. 舒多昔康代谢生成强亲电性酰基硫脲, 可与蛋白质发生共价结合而产生毒性
- D. 选择性的 COX-2 抑制剂罗非昔布、伐地昔布等强力抑制 COX-2, 可增强血小板聚集和血管收缩
- E. 含氮杂环, 如咪唑、吡啶等可以和血红素中的铁离子整合, 对 CYP 具有诱导作用

参考答案: E

参考解析: 含氮杂环, 如咪唑、吡啶等可以和血红素中的铁离子整合, 对 CYP 具有可逆抑制作用。

**执业药师刷题:** 每日一练、章节练习、模拟考场、历年真题在线题库, 配备老师视频解析掌上刷, 另有做题记录、错题集、收藏试题、积分下载试题离线刷, 以及个性化做题习惯设置, 移动学习更方便! 更有答题闯关, 知识点打卡、模考大赛等活动边刷题边赢奖品! 伴你备考路上丰富多彩!

手机应用市场搜索“233 网校”或识别下图二维码, 点击下载 233 网校 APP



考证就上233网校APP

报考指导、学习视频、免费题库一手掌握



考证就上233网校APP

报考指导、学习视频、免费题库一手掌握