

## 江苏大学 2008 年硕士研究生入学考试试题

科目代码： 608

科目名称： 药学综合二

考生注意：答案必须写在答题纸上，写在试卷、草稿纸上无效！

### 天然药物化学部分：

#### 一、写出下列各化合物的结构类型及主要生理活性（每题 4 分，共 20 分）

- 1、Rutin 2、Ferulic acid 3、芍药苷 4、大黄酸 5、青蒿素

#### 二、按题目要求简要回答问题(其余每题 10 分，共 30 分)

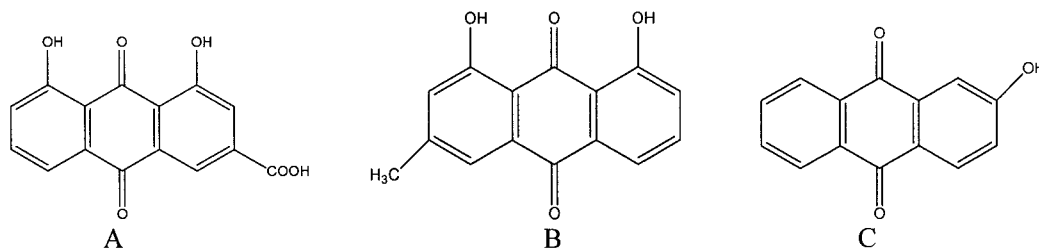
1、中草药有效成分分离精制过程中常常采用色谱法，试述色谱法的种类及其分离原理？并举说明。

2、对中药化学成分进行结构鉴定时，要求该成分达到一定的纯度，试述化合物纯度测定的方法有那些？请详细说明。

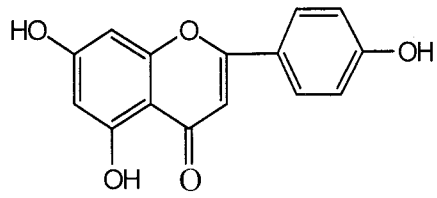
3、如何用  $^1\text{H-NMR}$  法区别葡萄糖苷的  $\alpha$ -苷键和  $\beta$  苷键？请简要说明。

#### 三、按题目要求比较或鉴别各组化合物（第 1 小题 4 分，其余每题 3 分，共 10 分）

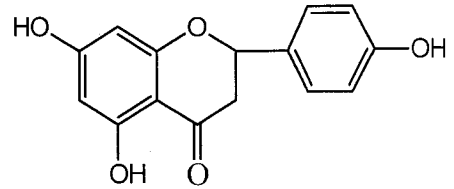
1、比较下列化合物的酸性大小，并说明采用何种方法可以将它们分离开来，请简要说明？



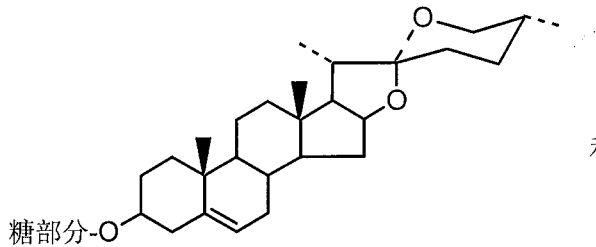
2、用化学方法或波谱方法分别鉴别下列化合物



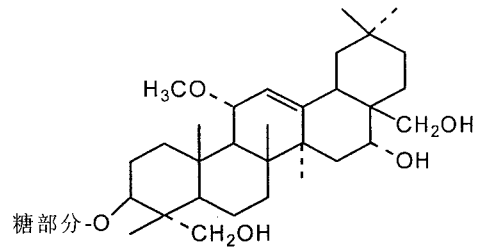
和



3、用化学方法鉴别下列化合物

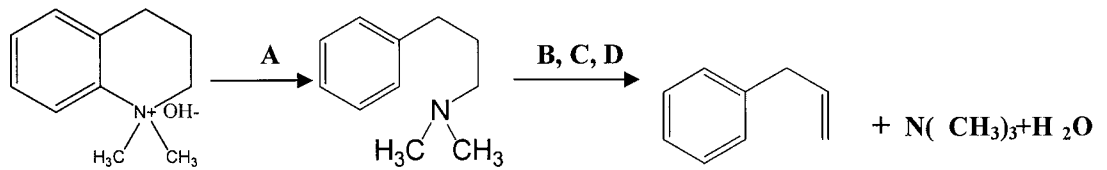


和

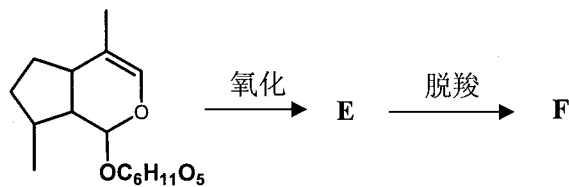


四、写出下列各反应条件 (A、B、C、D) 或各反应产物的结构式 (E、F) (每题 5 分, 共 10 分)

1、



2、

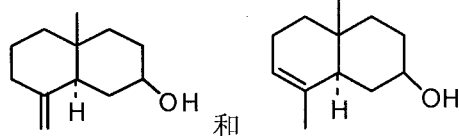


五、分离下列各对中药成分，应选用哪一类层析系统（自甲、乙、丙、丁、戊五种层析系统中选择），并比较二者 Rf 值的大小。（10 分）

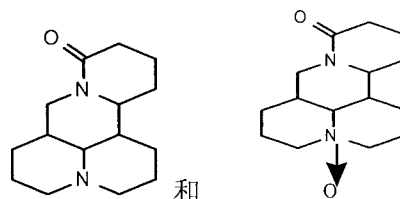
层析系统：甲：PC  
 乙：SiO<sub>2</sub> (TLC)  
 丙：Al<sub>2</sub>O<sub>3</sub> (TLC)  
 丁：SiO<sub>2</sub>-AgNO<sub>3</sub> (TLC)  
 戊：聚酰胺 (TLC)

n-BuOH : HAc : H<sub>2</sub>O (4 : 1 : 5)  
 石油醚 : 乙酸乙酯 (7 : 3)  
 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> : MeOH (19 : 1)  
 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> : 乙酸乙酯 (10 : 2)  
 50%乙醇

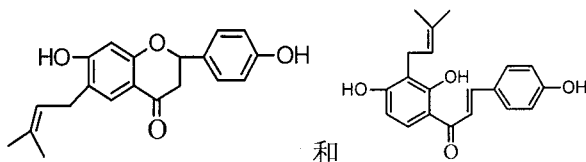
1.



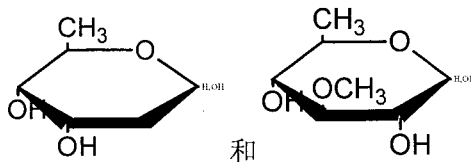
2.



3.



4.



六、从某植物中分离得到一化合物单体 A，其理化性质和波谱数据如下，请依据数据推导化合物 A 的化学结构，并写出推导过程（20 分）

化合物 A 为黄色针晶，FeCl<sub>3</sub> 反应：暗绿色；HCl-Mg 反应：紫红色。化合物 A 分子式为 C<sub>21</sub>H<sub>20</sub>O<sub>11</sub>。化合物 A 用酸水解，得水解产物 B 和母液，母液经 PC 鉴定为葡萄糖，化合物 B 重结晶后，二氯氧锆反应呈黄色，加枸橼酸后黄色不褪。经光谱测定，数据如下：

UVλ<sub>max</sub>nm:

MeOH	267	352		
NaOMe	275	326	402 ↑	
AlCl <sub>3</sub>	274	301	352	398
AlCl <sub>3</sub> /HCl	276	303	347	400
NaOAc	275	305(sh)	272	
NaOAc/H <sub>3</sub> BO <sub>3</sub>	266	300(sh)	353	

IR<sub>γ</sub><sup>KBr</sup> max cm<sup>-1</sup>: 3401, 1655, 1606, 1504

<sup>1</sup>HNMR(DMSO-d<sub>6</sub>, TMS内标) δ (ppm):

3.2~3.9 (6H, m), 3.9~5.1 (4H, 加D<sub>2</sub>O后均消失), 5.68 (1H, d, J=8.0Hz)

6.12 (1H, d, J=2.0Hz), 6.86 (2H, d, J=9.0Hz), 6.42 (1H, d, J=2.0Hz), 8.08 (2H, d, J=9.0Hz)

药剂学部分：

一、名词解释（共5题，每题4分，计20分）

1. 生物半衰期
2. HLB
3. 前体药物
4. 靶向制剂
5. Critical micelle concentration

二、选择题（共20题，每题1分，计20分）

1. 关于药剂学的叙述哪项内容是正确的（            ）。  
A 药剂学研究的对象是药物制剂  
B 研究药物制剂的基本理论、处方设计制备工艺和合理应用的综合性技术科学  
C 研究药物制剂的处方设计制备工艺  
D 研究药物制剂的基本理论和合理应用
2. 对含有毒药品、贵重药品或各组分混合比例相差悬殊的情况应采用（            ）。  
A 搅拌混合                                    B 研磨混合  
C 过筛混合                                    D “等量递增”的原则进行混合
3. 肥皂是（            ）表面活性剂。  
A 阴离子            B 阳离子                                    C 非离子                                    D 两性离子
4. 适宜制备 W/O 乳剂的表面活性剂的 HLB 值范围为（            ）。  
A 7-11            B 8-16                                    C 3-8                                    D 15-18
5. CRH 为评价散剂哪项性质的指标（            ）。  
A 流动性            B 吸湿性                                    C 粘着性                                    D 风化性                                    E 聚集性
6. 不做片剂崩解剂的是（            ）。  
A 微粉硅胶                                    B 干淀粉  
C 交联羧甲基纤维素钠                                    D 交联聚乙烯吡咯烷酮
7. 下列不属于油脂性基质的是（            ）。  
A 聚乙二醇                                    B 石蜡                                    C 羊毛脂                                    D 凡士林

8. 混悬性气雾剂的组成中不包括 ( )。
- A 抛射剂      B 润湿剂      C 助溶剂      D 分散剂
9. 在某注射液中加入焦亚硫酸钠, 其作用为 ( )。
- A 抑菌剂      B 抗氧化剂      C 止痛剂      D 络合剂
10. 下列哪一项措施不能提高浸出效率 ( )。
- A 选择适宜的溶剂      B 恰当地升高温度  
C 加大浓度差      D 将药材粉碎得越细越好      K 加表面活性剂
11. 噻孢霉素钠的氯化钠等渗当量为 0.24, 配制 2% 滴眼剂 100ml 需加 ( ) 克氯化钠。
- A 0.42g      B 0.61g      C 0.36g      D 1.42g      E 1.36g
12. 下列关于增加药物的溶解度方法的错误表述是 ( )。
- A 加入助溶剂      B 使用增溶剂      C 制成可溶性盐类  
D 加强搅拌      E 使用混合溶剂
13. 口服剂型在胃肠道中吸收快慢的顺序一般认为是 ( )
- A 混悬剂 > 溶液剂 > 胶囊剂 > 片剂 > 包衣片  
B 胶囊剂 > 混悬剂 > 溶液剂 > 片剂 > 包衣片  
C 片剂 > 包衣片 > 胶囊剂 > 混悬剂 > 溶液剂  
D 溶液剂 > 混悬剂 > 胶囊剂 > 片剂 > 包衣片  
E 包衣片 > 片剂 > 胶囊剂 > 混悬剂 > 溶液剂
14. 不属于固体分散技术的方法是 ( )。
- A 熔融法      B 研磨法      C 凝聚法      D 溶剂-熔融法      E 溶剂法
15. 吸入粉雾剂中的药物微粒, 大多数应在 ( )  $\mu\text{m}$  以下。
- A 10 $\mu\text{m}$       B 15 $\mu\text{m}$       C 5 $\mu\text{m}$       D 2 $\mu\text{m}$       E 3 $\mu\text{m}$
16. 下列高分子材料中主要用于肠溶衣的是 ( )。
- A 羟丙甲纤维素      B 甲基纤维素      C 丙烯酸树脂 II      D 聚乙二醇      E 川蜡
17. 以下哪项检查最能反映栓剂的生物利用度 ( )。
- A 体外溶出实验      B 融变时限      C 重量差异      D 体内吸收实验      E 硬度测定

18. 属于主动靶向制剂的为( )。

- A 固体分散体制剂                      B 微型胶囊制剂  
C 前体靶向制剂                        E 动脉栓塞制剂  
D 环糊精包合物制剂

19. 大多数药物的吸收机理是( )。

- A 被动扩散      B 主动转运      C 促进扩散      D 膜孔转运      E 胞饮和吞噬

20. 已知某药口服肝首过效应很大, 改用肌肉注射后( )。

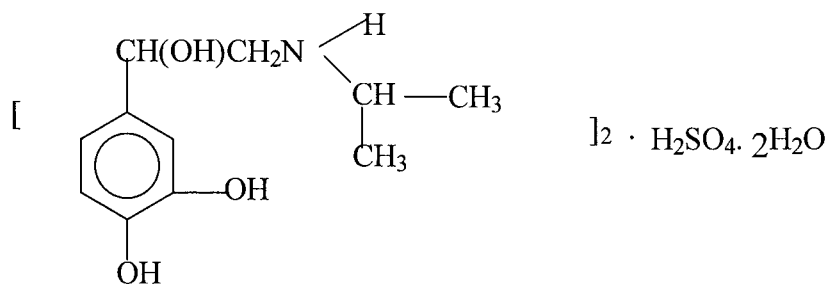
- A  $t_{1/2}$  不变, 生物利用度增加  
B  $t_{1/2}$  不变, 生物利用度减少  
C  $t_{1/2}$  增加, 生物利用度也增加  
D  $t_{1/2}$  减少, 生物利用度也减少  
E  $t_{1/2}$  和生物利用度都不变化

### 三、简答题 (共 4 题, 计 40 分)

1. 影响固体药物制剂中药物溶出速度的因素有哪些？。
2. 试述润滑剂、助流剂在压片过程中对流动性和均匀性的作用和原理。
3. 何为 TDDS? 有何特点?
4. 试述渗透泵片剂的组成及控释原理。

### 四、处方设计综合题 (共 1 题, 计 20 分)

设计下列处方某药物其化学结构如下:



为白色、无嗅、带苦味的结晶性粉末, 可溶于水, 几乎不溶于苯和氯仿, 主要用于支气管哮喘、抗休克和心脏传导阻滞等的治疗和急救。临床推荐剂量为每次 1mg。请根据以上条件设计一合理的剂型, 并写出完整处方及详细制备工艺, 并说明处方中辅料选择的依据。

药理学部分：

一、单项选择题（每题一分，共20分）

1. 能引起调节麻痹的药物是  
A. 肾上腺素 B. 酚妥拉明 C. 筒箭毒碱 D. 阿托品 E. 匹鲁卡品
2. 药物的 Pka 值是指其  
A. 50%解离时的 pH 值 B. 99%解离时的 pH 值 C. 90%解离时的 pH 值  
D. 不解离时的 pH 值 E. 全部解离时的 pH 值
3. 同一坐标上两药的 S 型量效曲线，B 药在 A 药的左侧且高出 A 药 20%，下述那种评价是正确的  
A. A 药的强度和最大效能均较大 B. A 药的强度较大而最大效能较小  
C. A 药的强度较小而最大效能较大 D. A 药的强度和最大效能均较小  
E. A 药和 B 药强度和最大效能相等
4. A 药和 B 药作用机制相同，达同一效应 A 药剂量是 5 mg，B 药是 500 mg，下述那种说法正确  
A. B 药疗效比 A 药差 B. A 药作用持续时间比 B 药短  
C. A 药毒性比 B 药小 D. 需要达最大效能时 A 药优于 B 药  
E. A 药强度是 B 药的 100 倍
5. 塞来昔布抗炎作用机制是  
A. 非选择性阻断 COX B. 选择性阻断 COX<sub>1</sub> C. 选择性阻断 MAO  
D. 选择性阻断 COX<sub>2</sub> E. 阻断 PLA<sub>2</sub>
6. 某药 t<sub>1/2</sub> 为 12 小时，每天给药两次，每次固定剂量，几天后血药浓度即大于稳态的 98%  
A. 1 天 B. 2 天 C. 3 天 D. 4 天 E. 7 天
7. 吗啡镇痛作用原理是  
A. 激动中枢阿片受体，使 P 物质增多 B. 激动中枢阿片受体，使 P 物质减少  
C. 阻断中枢阿片受体，使 P 物质增多 D. 阻断中枢阿片受体，使 P 物质减少  
E. 以上均不是
8. 阿司匹林预防血栓生成是由于  
A. 小剂量抑制 PGI<sub>2</sub> 生成 B. 小剂量抑制 TXA<sub>2</sub> 生成 C. 小剂量抑制 COX  
D. 大剂量抑制 TXA<sub>2</sub> E. 以上都不是

9. 硫 酰 脲 类 降 糖 药 的 作 用 机 制 是
- A. 加 速 胰 岛 素 合 成; B. 刺 激 胰 岛  $\beta$  细 胞 释 放 胰 岛 素; C. 提 高 胰 岛  $\beta$  细 胞 功 能; D. 抑 制 胰 岛 素 降 解; E. 促 进 胰 岛 素 与 受 体 结 合
10. 雷 尼 替 丁 抑 制 胃 酸 分 泌 的 机 制 是
- A. 阻 断  $M_1$  受 体; B. 阻 断  $H_2$  受 体; C. 阻 断  $H_1$  受 体; D. 促 进  $PGE_2$  合 成; E. 干 扰 胃 壁 细 胞 内 质 子 泵 的 功 能
11. 在 抗 肿 瘤 药 物 研 发 过 程 中, 只 能 用 于 在 体 (*in vivo*) 研 究 阳 性 对 照 的 药 物 是:
- A. 甲 氨 蝶 呤 B. 环 磷 酰 胺 C. 巯 嘌 呤 D. 顺 铂 E. 5-氟 尿 嘧 啶
12. 骨 骼 肌 细 胞 膜 上 的 乙 酰 胆 碱 受 体 是
- A.  $M_1$  受 体; B.  $M_2$  受 体; C.  $M_3$  受 体; D.  $N_2$  受 体; E.  $N_1$  受 体
13. 磺 胺 类 药 物 的 抗 菌 机 制 是
- A. 抑 制 敏 感 菌 二 氢 叶 酸 还 原 酶; B. 抑 制 敏 感 菌 二 氢 叶 酸 合 成 酶; C. 破 坏 细 菌 细 胞 壁; D. 增 强 机 体 免 疫 机 能; E. 改 变 细 菌 细 胞 膜 通 透 性
14. 肾 上 腺 素 能 神 经 兴 奋 时, 其 末 梢 释 放 的 递 质 是
- A. 肾 上 腺 素; B. 5-羟 色 胺; C. 多 巴 胺; D. 去 甲 肾 上 腺 素; E. 乙 酰 胆 碱
15. 色 苷 酸 钠 预 防 哮 喘 发 作 的 机 制 是
- A. 稳 定 肥 大 细 胞 膜, 抑 制 过 敏 介 质 释 放 B. 有 较 强 的 抗 炎 作 用 C. 有 较 强 的 抗 过 敏 作 用 D. 阻 止 抗 原 与 抗 体 结 合 E. 直 接 松 弛 支 气 管 平 滑 肌
16. 血 管 紧 张 转 化 酶 抑 制 剂 治 疗 心 衰 和 高 血 压 的 作 用 机 制 不 包 括
- A. 抑 制 激 肽 酶 II, 增 加 缓 激 肽 的 降 解 B. 抑 制 局 部 组 织 中 的 血 管 紧 张 素 转 化 酶 C. 抑 制 激 肽 酶 II, 减 少 缓 激 肽 的 降 解 D. 抑 制 血 管 的 构 型 重 建 E. 抑 制 心 室 的 构 型 重 建
17. 第 三 代 头 孢 菌 素 的 特 点 是
- A. 广 谱 及 对 绿 脓, 厌 氧 菌 有 效 B. 对 肾 脏 基 本 无 毒 性 C. 耐 药 性 产 生 快 D. A+B E. A+C
18. 细 菌 对 氨 基 糖 苷 类 抗 生 素 产 生 耐 药 性 的 主 要 原 因 是
- A. 细 菌 产 生 了 钝 化 酶 B. 细 菌 膜 通 透 性 改 变 C. 细 菌 产 生 了 水 解 酶 D. 细 菌 的 代 谢 途 径 改 变 E. 细 菌 产 生 了 大 量 的 PABA

19. 促进药物生物转化的主要酶系统是

- A. 单胺氧化酶                      B. 辅酶 II                      C. 细胞色素 P450 酶系统  
D. 葡萄糖醛酸转移酶              E. 水解酶

20. 糖皮质激素诱发和加重感染的主要原因为

- A. 病人对激素不敏感；                      B. 激素用量不足；  
C. 激素降低了机体对病原微生物的抵抗力；      D. 激素能促使病原微生物生成繁殖；  
E. 使用激素时，未用足量、有效的抗菌药

二. 名词解释（每题 5 分，共 30 分）

1. ED<sub>50</sub>
2. PA<sub>2</sub>
3. 生物利用度
4. 化疗指数
5. 首过效应
6. 药物作用的选择性

三. 简答题（每题 10 分，共 20 分）

1. 简述奥美拉唑抑制胃酸分泌的主要机制。
2. β-内酰胺类抗生素的作用靶点是什么？主要耐药机制是什么？

四. 问答题（每题 15 分，共 30 分）

1. 为什么左旋多巴可以治疗帕金森氏病（PD）？为什么美多巴可以取代左旋多巴用于治疗帕金森氏病（PD）？
2. 抗肿瘤药物抗肿瘤作用的生化机制有哪些？主要不良反应有哪些？简介抗肿瘤药物研发方向。