

## 江苏大学 2009 年硕士研究生入学考试试题

科目代码: 621

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)

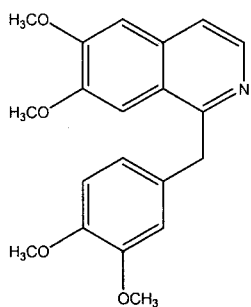
- 1、青蒿素 2、oleanolic acid 3、吗啡碱 4、taxol 5、rutin

二、按题目要求简要回答问题 (第 1、4 题每题 2 分, 第 2、3 题每题 8 分, 共 20 分)

- 1、含皂苷类成分的中药一般不用做注射剂, 其原因是什么?
- 2、在天然有机化合物分离及精制过程中, 固\_液吸附利用十分广泛, 简述固\_液吸附的分类, 并举例说明每种类型的特点?
- 3、黄酮类化合物的分离通常采用聚酰胺柱色谱或葡聚糖凝胶柱色谱, 试简述黄酮类化合物采用聚酰胺层析分离的洗脱规律?
- 4、写出实验室常用的有机溶剂, 并按极性大小顺序排列(至少八种)。

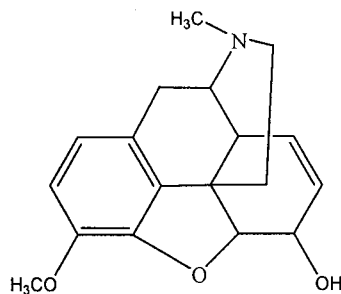
三、按题目要求比较或鉴别各组化合物 (每题 5 分, 共 20 分)

- 1、比较下列化合物的碱性大小, 指出各 pKa 值属于哪个化合物, 并简述理由。



A

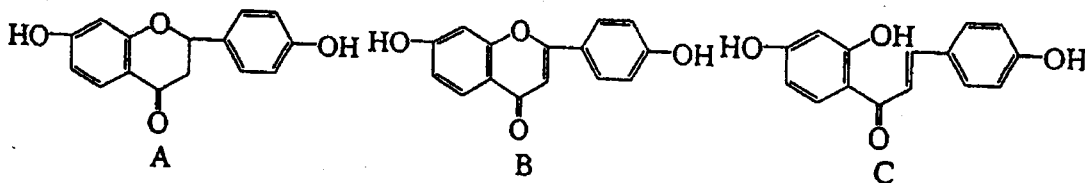
和



B

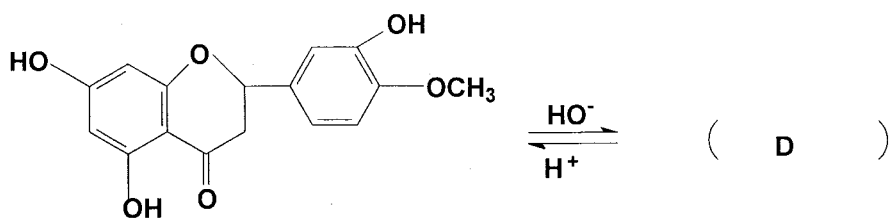
pKa 8.15 6.13

- 2、用 UV 光谱法区分下列化合物。

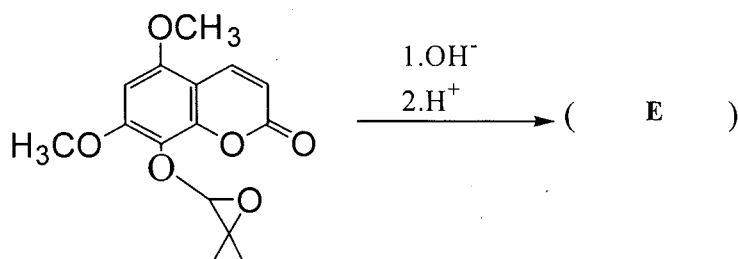




3、



4、



五、从某植物中分离得到一种新的化合物 A，其理化性质和波谱数据如下，请根据数据推导化合物 A 的化学结构，并写出推导过程。（10 分）

化合物 A 为黄色针晶， $\text{FeCl}_3$  反应：暗绿色； $\text{HCl-Mg}$  反应：紫红色。化合物 A 分子式为  $\text{C}_{21}\text{H}_{20}\text{O}_{11}$ 。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：

UV  $\lambda_{\text{max}}$  nm:

MeOH	267	352		
NaOMe	275	326	402	↑
$\text{AlCl}_3$	274	301	352	398
$\text{AlCl}_3/\text{HCl}$	276	303	347	400
NaOAc	275	305(sh)	372	
NaOAc/ $\text{H}_3\text{BO}_3$	266	300(sh)	353	

KBr 压片，IR 吸收峰位置 ( $\text{cm}^{-1}$ ): 3401, 1655, 1606, 1504

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{DMSO-d}_6$ , TMS 内标)  $\delta$  (ppm):

3.2~3.9 (6H, m), 3.9~5.1 (4H, 加  $\text{D}_2\text{O}$  后均消失), 5.68 (1H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ),  
 6.12 (1H, d,  $J=2.0\text{Hz}$ ), 6.86 (2H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 6.42 (1H, d,  $J=2.0\text{Hz}$ ),  
 8.08 (2H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ )

## 药剂部分

一、解释下列名词并说明其在药剂学中的应用（共4题，每题5分）

- 1.特性溶解度
- 2.表面活性剂的临界胶束浓度和昙点
- 3.多晶型
- 4.休止角

二、选择题（共20题，每题1.5分）

- 1.我国历史上由官方颁布的第一部制剂规范( )  
A. 《太平惠民和剂局方》 B. 《本草纲目》 C. 《新修本草》 D. 《黄帝内经》
- 2.散剂制备的关键是 ( )  
A.过筛                      B.混合                      C.分剂量                      D.粉碎
- 3.注射用水应于制备后几小时内适用 ( )  
A.4小时                      B.8小时                      C.12小时                      D.16小时
- 4.在注射剂制备过程中，下列不属于防止主药氧化的附加剂是 ( )  
A. 抗氧剂                      B. 吐温-80                      C. N<sub>2</sub>                      D. CO<sub>2</sub>
- 5.下列哪种情况的药物适合制成胶囊剂( )  
A. 易溶性药物如氯化钠      B. 易风化药物      C. 吸湿性药物      D. 均不是
- 6.下列关于乙酰水杨酸片的制备中，表述错误的是( )  
A.乙酰水杨酸在湿热条件下不稳定，可筛选结晶直接压片。  
B.硬脂酸镁有良好的润滑作用，滑石粉有良好的助流作用，二者可联合选用作润滑剂。  
C.处方中三种主药应分别制粒。  
D.制备过程中禁用铁器。
- 7.可作水性凝胶的基质的是( )  
A.凡士林                      B.羊毛脂                      C.卡波普                      D.单硬脂酸甘油酯
- 8.从溶出速度考虑，稳定型一般( ) 亚稳定型。  
A.大于                      B.小于                      C.等于                      D.不一定
- 9.热原检查的法定方法是( )  
A.家兔法                      B.鲎试剂法                      C. A 和 B                      D. 超滤法
- 10.《中国药典》规定，糖浆中含蔗糖量应不低于( )  
A.50% (g/ml)      B.60% (g/ml)      C.65%(g/ml)      D.40%(g/ml)      E.75%(g/ml)

- 11.不具有靶向性的制剂是( )
- A 静脉乳剂      B 毫微粒注射液      C 脂质体注射液      D 口服芳香水剂
- 12.鼻部吸收药物粒子的大小为( )。
- A.大于 50 $\mu\text{m}$       B.2-20 $\mu\text{m}$       C.小于 10 $\mu\text{m}$       D.20-50 $\mu\text{m}$
- 13.红霉素的生物有效性可因下列哪种因素而明显增加( )。
- A.缓释片      B.肠溶片      C.薄膜包衣片      D.使用红霉素硬脂酸盐
- 14.下列那组中全部为片剂中常用的崩解剂( )
- A.淀粉、L-HPC、CMC-Na      B. HPMC、PVP、L-HPC  
C. PVPP、HPC、CMS-Na      D. CCNa、PVPP、CMS-Na
- 15.湿法制粒压片工艺的目的在于改善主药的( )
- A.可压性和流动性      B.崩解性和溶出性  
C.防潮性和稳定性      D.润滑性和抗粘着性
- 16.无菌区对洁净度的要求是( )
- A.10 万级      B.1 万级      C.100 级      D.1000 级
- 17.下列叙述不是包衣目的的是( )
- A.改善外观      B.防止药物配伍变化      C.控制药物释放速度  
D.药物进入体内分散程度大, 增加吸收, 提高生物利用度      E.增加药物稳定性  
F.控制药物在胃肠道的释放部位
- 18.浸膏剂是指药材用适宜的方法浸出有效成分, 调整浓度至规定标准。通常为( )
- A.1g 相当于原药材的 2-5g      B.1ml 相当于原药材的 1g  
C.1g 相当于原药材的 5g      D.1ml 相当于原药材的 2-5g
- 19.以下表面活性剂毒性最强的是( )
- A.吐温 80      B.肥皂      C.司盘 20      D.平平加 O      E.氯苄烷铵
- 20.关于片剂等制剂成品的质量检查, 下列叙述错误的是( )
- A 糖衣片应在包衣后检查片剂的重量差异  
B 栓剂应进行融变时限检查  
C 凡检查含量均匀度的制剂,不再检查重量差异  
D 凡检查溶出度的制剂,不再进行崩解时限检查  
E 对一些遇胃液易破坏或需要在肠内释放的药物,制成片剂后应包肠溶衣

三、简答题（共三题，计 25 分）

1. 某一弱酸性易氧化的药物，若制备成注射剂，请简要回答以下问题（10 分）

(1) 注射剂制备过程中哪些生产环节需要在洁净区完成，洁净区洁净度级别一般规定为多少级？

(2) 应采用何种玻璃的容器？

(3) 制备过程中应采取哪些措施防止药物氧化？

2. 影响吸入气雾剂药物在呼吸系统分布的因素有哪些？（7 分）

3. 简述复凝聚法制备微囊的原理，试以明胶—阿拉伯胶为囊材加以说明。（8 分）

四、综合分析题（共 2 题计 25 分）

1. (15 分) [处方]

银杏叶 助流剂 9% 硬脂酸镁 1%

欲将上述处方设计为全浸膏糖衣片，设计制备工艺全过程，及体内外质量控制方法。

2. (10 分) [处方]

硝酸甘油	0.26 g(10%乙醇溶液 2.95ml)
十六醇	6.6 g
硬脂酸	6.0g
聚维酮 (PVP)	3.1 g
微晶纤维素	5.88 g
微粉硅胶	0.54 g
乳糖	4.98 g
滑石粉	2.49 g
硬脂酸镁	0.15 g

制法：

将 PVP 溶于硝酸甘油乙醇液中，加微粉硅胶混匀，加硬脂酸与十六醇，水浴加热到 60℃，使溶。将微晶纤维素、乳糖、滑石粉的均匀混合物加入上述熔化的系统中，搅拌 1 小时。将上述粘稠的混合物摊于盘中，室温放置 20 分钟，待成团块时，用 16 目筛制粒。30℃干燥，整粒，加入硬脂酸镁，压片。

分析回答：

a. 处方各成分的作用。b. PVP 在该处方中加入的目的。c. 简述该缓释片的释药机理。

药理部分;

一、单选题 (每题1分, 共40 分):

1. 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. 去甲肾上腺素; C. 多巴胺; D. 5-羟色胺; E. 乙酰胆碱
2. 促进儿茶酚胺类药物代谢的主要酶系统是  
A. 单胺氧化酶 B. 细胞色素P450酶系统 C. 辅酶II D. 葡萄糖醛酸转移酶 E. 水解酶
3. 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药强度是B药的100倍 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药作用持续时间比B药短
4. 某药半衰期为9小时, 一日3次给药, 达到稳态血药浓度的时间约需  
A. 0.5-1 d B. 1.5-2 d C. 3-4 d D. 4-5 d E. 5-6 d
5. 雷尼替丁抑制胃酸分泌的机制是  
A. 阻断M1受体; B. 阻断H1受体; C. 阻断H2受体; D. 促进PGE2合成; E. 干扰胃壁细胞内质子泵的功能
6. 硝酸甘油通过下列哪个作用产生抗心绞痛效应  
A. 心肌收缩力减弱; B. 心率减慢, 心脏舒张期相对延长; C. 扩张小动脉, 小静脉和较大的冠状血管; D. 扩张小静脉, 外周阻力降低; E. 扩张小动脉, 回心血量减低, 心室容积减少, 心肌耗氧量降低。
7. 硫酰脲类降糖药的作用机制是  
A. 加速胰岛素合成; B. 抑制胰岛素降解; C. 提高胰岛 细胞功能; D. 刺激胰岛细胞释放胰岛素; E. 促进胰岛素与受体结合
8. 镇痛强度与吗啡相近, 但成瘾性发生慢, 戒断症状相对减轻的药物是  
A. 哌替啶; B. 喷他佐辛; C. 美沙酮; D. 吲哚美辛; E. 纳洛酮
9. 细菌对氨基糖苷类抗生素产生耐药性的主要原因是  
A. 细菌产生了水解酶 B.细菌膜通透性改变 C.细菌产生了钝化酶 D.细菌的代谢途径改变  
E.细菌产生了大量的PABA
10. 由酪氨酸合成去甲肾上腺素的限速酶是  
A. 多巴脱羟酶 B. 单胺氧化酶 C. 酪氨酸羟化酶 D. 儿茶酚氧位甲基转移酶 E. 多巴胺羟化酶

11. 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
12. 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
13. 塞米昔布抗炎作用机制是  
A. 非选择性阻断COX B. 选择性阻断COX1 C. 选择性阻断MAO D. 选择性阻断COX2 E. 阻断PLA<sub>2</sub>
14. 属于胆碱酯酶复活药的是:  
A. 吡啶斯的明 B. 加兰他敏 C. 氯磷定 D. 乐果 E. 安贝氯铵
15. 解热镇痛药的抗炎作用机制是:  
A. 促进炎症消散 B. 抑制炎症时PG的合成 C. 抑制黄嘌呤氧化酶 D. 促进PG从肾脏排泄 E. 激活黄嘌呤氧化酶
16.  $\beta$ -内酰胺类抗生素主要抑制  
A. 转肽酶 B. 羟化酶 C. 合成酶 D. 回旋酶 E. 端粒酶
17. 一线抗结核病药不包括:  
A. 异烟肼 B. 乙硫异烟肼 C. 利福平 D. 乙胺丁醇 E. 吡嗪酰胺
18. 可对抗肿瘤化疗引起的呕吐的是:  
A. 阿托品 B. 枸橼酸铋钾 C. 昂丹司琼 D. 乳果糖 E. 西沙必利
19. 能竞争性拮抗磺胺类药物抗菌作用的化学物质是:  
A. 乙酰水杨酸 B. 对氨基苯甲酸 C. 对氨基水杨酸 D. 叶酸 E. 维甲酸
20. 抗心律失常药的基本电生理作用不包括哪一项:  
A. 降低异位节律点的自律性 B. 加快传导而取消折返 C. 延长或相对延长ERP而取消折返 D. 抑制后去极及触发活动 E. 延长APD和ERP
21. 羧甲基纤维素可以治疗:  
A. 功能性便秘 B. 习惯性便秘 C. X线检查前排空结肠内容物 D. 急性便秘 E. 慢性便秘
22. ACEI的降压作用机制中, 不正确的是  
A. 抑制ACE, 使AT II和醛固酮生成减少 B. 激活激肽酶II, 促进缓激肽的合成 C. 促水钠排泄, 减轻水钠潴留 D. 抑制肾素的释放, ATII和醛固酮生成减少 E. 减弱ATII对交感神经

末梢突触前膜AT受体的作用，降低交感神经活性

23. 有降血糖及抗利尿作用的药物是：

- A. 甲苯磺丁脲 B. 氯磺丙脲 C. 格列本脲 D. 甲福明 E. 苯乙福明

24. 对可待因的描述，正确的是：

- A. 吗啡的去甲基衍生物 B. 兼有中枢和外周作用的镇咳药 C. 非成瘾性镇咳药 D. 外周性镇咳药 E. 兼有镇痛作用的镇咳药

25. 利尿药物分子中能抑制碳酸酐酶的结构是

- A. 羧基 B. 氨基磺酰基 C. 咪唑氨基 D. 羟基 E. 甲氧基

26. 沙丁胺醇的作用机制是选择性：

- A. 阻断 $\beta_1$ 受体 B. 激动 $\beta_1$ 受体 C. 阻断 $\beta_2$ 受体 D. 激动 $\beta_2$ 受体 E. 以上都不是

27. 血管扩张药治疗心衰的药理依据主要是

- A. 扩张冠脉，增加心肌供氧量 B. 减少心肌耗氧量 C. 减轻心脏的前、后负荷 D. 降低血压 E. 降低心输出量

28. 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

29. 骨骼肌细胞膜上的乙酰胆碱受体是

- A. M1受体； B. M2受体； C. M3受体； D. N2受体； E. N1受体

30. 普萘洛尔治疗心绞痛的主要药理作用是

- A. 扩张冠状动脉； B. 降低心脏前负荷； C. 阻断 $\beta$ 受体，减慢心率，抑制心肌收缩力； D. 降低左心室壁张力； E. 以上都不是

31. 长期使用利尿药的降压机制是

- A. 排 $\text{Na}^+$ 、利尿、血容量减少 B. 降低血浆肾素活性 C. 增加血浆肾素活性  
D. 减少血管平滑肌细胞内 $\text{Na}^+$  E. 抑制醛固酮的分泌

32. 色苷酸钠预防哮喘发作的机制是

- A. 直接松弛支气管平滑肌 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. 稳定肥大细胞膜，抑制过敏介质释放

33. 血管紧张转化酶抑制剂治疗心衰和抗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

34.吗啡镇痛作用原理是

B. 激动中枢阿片受体, 使P物质增多 B. 阻断中枢阿片受体, 使P物质减少 C. 阻断中枢阿片受体, 使P物质增多 D. 激动中枢阿片受体, 使P物质减少 E. 以上均不是

35.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. 激素能促使病原微生物生成繁殖; D. 激素降低了机体对病原微生物的抵抗力; E. 使用激素时, 未用足量、有效的抗菌药

36. 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. 大剂量抑制TXA<sub>2</sub> C. 小剂量抑制COX D. 小剂量抑制TXA<sub>2</sub>生成 E. 以上都不是

37. 在抗肿瘤药物研发过程中, 只能用于in vivo 阳性对照的药物是:

A. 甲氨蝶呤 B. 5-氟尿嘧啶 C. 巯嘌呤 D. 顺铂 E. 环磷酰胺

38. 甲氨蝶呤抗肿瘤的主要作用机制是

A. 抑制肿瘤细胞的蛋白质合成; B. 抑制二氢叶酸还原酶; C. 阻碍肿瘤细胞的嘌呤合成代谢; D. 干扰肿瘤细胞的RNA转录; E. 阻止转录细胞的DNA复制

39. 可用于尿崩症的降血糖药

A. 甲苯磺丁脲; B. 二甲双胍; C. 格列本脲; D. 氯磺丙脲; E. 格列吡嗪

40. 普萘洛尔抗甲状腺作用的机制是

A. 抑制碘的摄取; B. 抑制甲状腺激素的合成; C. 阻断受体, 抑制5-脱碘酶, 减少T<sub>3</sub>生成; D. 拮抗促甲状腺激素的作用; E. 以上都不是

二、名词解释 (每题5分, 共20分)

1. 表观分布容积 2. pA<sub>2</sub> 3. ED<sub>50</sub> 4. PAE

三、简答题 (每题5分, 共20分)

1. 什么是PD? 目前治疗PD的较理想的药物是什么?
2. 简述奥美拉唑抑制胃酸分泌的主要机制。
3. 简述苯二氮卓类药物镇静催眠作用的主要机制。
4. 如何用实验鉴别肾上腺素、异丙肾上腺素和去甲肾上腺素?

四、问答题 (每题10分, 共20分)

1. 抗高血压药按其作用机制的不同主要分为几类?
2. 抗肿瘤药物抗肿瘤作用的生化机制和产生耐药性的耐药机制分别有哪些? 简介抗肿瘤药研发的趋势?