

江苏大学 2010 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)

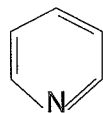
1、berberine 2、borneol 3、洋地黄毒苷 4、artemisinin 5、rutin

二、按题目要求简要回答问题(每题 5 分, 共 20 分)

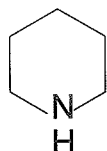
- 1、含皂苷类成分的中药一般不能静脉注射, 其原因是什么? 为什么含人参皂苷能作成注射剂?
- 2、如何用 $^1\text{H-NMR}$ 法区别葡萄糖苷的 α -苷键和 β 苷键? 请简要说明。
- 3、如何应用 pH 梯度萃取分离蒽醌类化合物?
- 4、“水提醇沉”和“醇提水沉”操作有何区别, 各除去什么杂质?

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, 并简述理由。

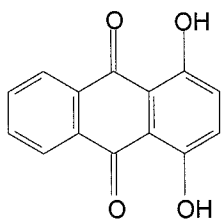


A

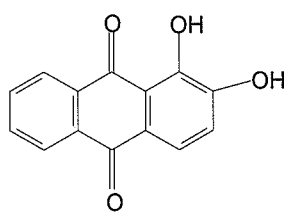


B

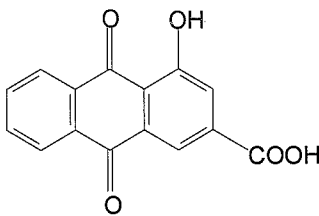
2、比较下列化合物酸性的大小, 并简述理由。



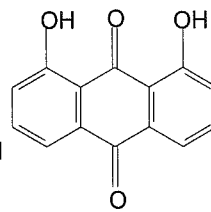
A



B

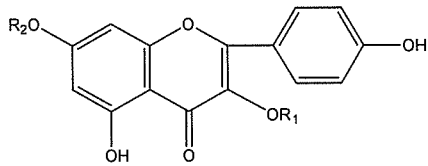


C



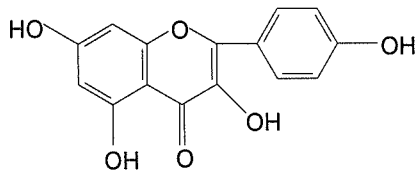
D

3、比较下列化合物在硅胶 TLC 中 R_f 值大小顺序 (条件 $\text{CHCl}_3-\text{MeOH}$: 1 展开), 并简述理由。

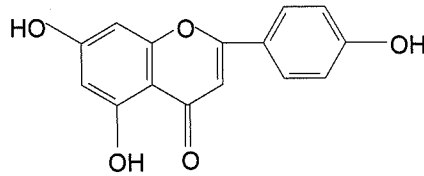


- A、 $R_1=R_2=H$
 B、 $R_1=H, R_2=Rham$
 C、 $R_1=Glc, R_2=Rham$

4、用化学方法鉴别下列化合物。



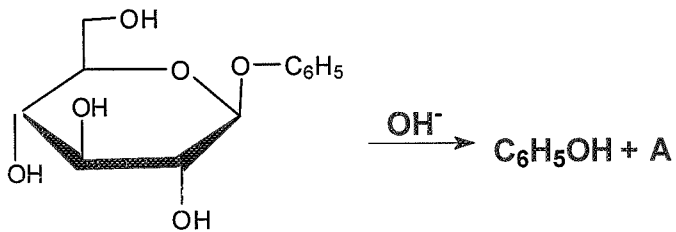
A



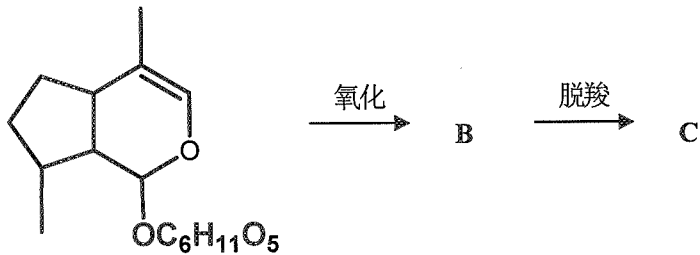
B

四、写出下列各反应产物的结构式 (每个反应产物 6 分, 共 30 分)

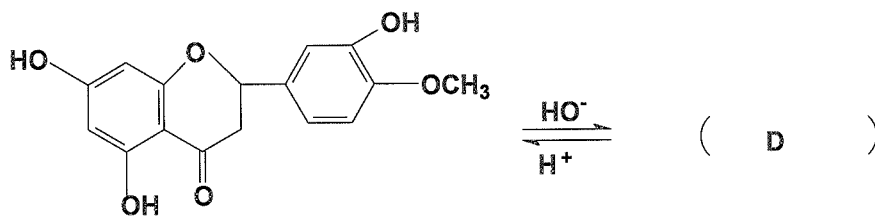
1、



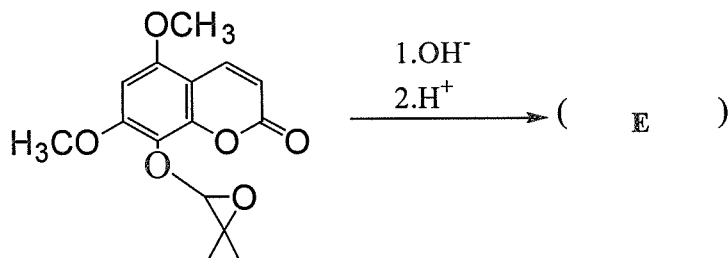
2、



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，写出推导过程，并将¹H-NMR信号归属。(10分)

化合物A为黄色针晶，m.p.:285~286°C (Me₂CO), FeCl₃反应(+), HCl-Mg反应(+), Molish反应(—), ZrOCl₂反应黄色，加枸橼酸黄色消退，SrCl₂反应(—)。EI-MS给出分子量为284。其光谱数据如下：

UV λ_{max}nm:

| | | | |
|--------------------------------------|-------------|--------|--------------|
| MeOH | 266.6, | 271.0, | 328.2 |
| NaOMe | 267.0 (sh), | 276.0, | 365.0 |
| NaOAc | 267.0 (sh), | 275.8, | 293.8, 362.6 |
| NaOAc/H ₃ BO ₃ | 266.6, | 271.6, | 331.0 |
| AlCl ₃ | 266.6, | 276.0, | 302.0, 340.0 |
| AlCl ₃ /HCl | 266.6, | 276.2, | 301.6, 337.8 |

¹H-NMR (DMSO-d₆, TMS内标) δ (ppm):

3.84 (3H, s), 6.19 (1H, d, J=1.8Hz), 6.47 (1H, d, J=1.8Hz), 6.86 (1H, s), 7.10 (2H, d, J=8.8Hz), 8.03 (2H, d, J=8.8Hz), 10.85 (1H, s, OH), 12.91 (1H, s, OH)

药理学部分:

一、名词解释 (每题 5 分, 共计 20 分)

- 1、受体:
- 2、治疗指数:
- 3、首关效应:
- 4、耐受性:

二、单选题 (每题 1 分, 共计 30 分)

- 1、具有抗细菌内毒素作用, 能减轻细菌内毒素引起的高热、昏迷的药物是 ()
A. 青霉素 B. 氢化可的松 C. 磺胺类 D. 甲氧苄啶 E. 甲硝唑
- 2、能升高血钾的利尿药是 ()
A. 氢氯噻嗪 B. 螺内酯 C. 呋喃苯胺酸 D. 依他尼酸 E. 氯丙嗪
- 3、最早用于治疗全身感染的人工合成的抗菌药是 ()
A. 青霉素 G B. 诺氟沙星 C. 磺胺类 D. 甲氧苄啶 E. 甲硝唑
- 4、药效学是研究 ()
A. 机体如何对药物进行处理 B. 药物如何影响机体
C. 药物发生动力学变化的原因 D. 合理用药的治疗方案
E. 药物的量效关系
- 5、atropine 对眼的作用是 ()
A. 瞳孔缩小, 眼压增高 B. 瞳孔缩小, 眼压降低
C. 瞳孔散大, 眼压降低 D. 瞳孔散大, 眼压增高
E. 以上都不是

6、NA 治疗上消化道出血的给药方法是 ()

- A. 口服 B. 静脉注射 C. 腹腔注射 D. 肌肉注射 E. 皮下注射

7、毛果芸香碱滴眼后会产生那些症状 ()

- A. 缩瞳、降眼压, 调节痉挛 B. 扩瞳、升眼压, 调节麻痹
C. 缩瞳、升眼压, 调节痉挛 D. 扩瞳、降眼压, 调节痉挛
E. 缩瞳、升眼压, 调节麻痹

8、反映药物毒性的指标是 ()

- A. $T_{1/2}$ B. LD_{50} C. ED_{50} D. PH E. P_{ka}

9、用于脑水肿最安全有效的药物是 ()

- A. 山梨醇 B. 甘露醇 C. 乙醇 D. 乙胺丁醇 E. 丙三醇

10、呼吸功能不全、颅内压升高、产妇临产时麻醉前用药应禁用的药物是 ()

- A. Aspirin B. chlorpromazine C. Morphine D. Atropine E. Anisodamine (654-2)

11、静脉注射胍乙啶初期血压上升, 心率加快的原因是 ()

- A. 将 NA 排挤释放之故 B. 抑制了迷走神经的活动
C. 直接兴奋心脏, 心输出量增加 D. 胍乙啶有部分拟肾上腺素活性
E. 以上都不是

12、下列药物属于抗肿瘤药物的是 ()

- A. 土霉素 B. 氯霉素 C. 红霉素 D. 青霉素 E. 阿霉素

13、下列抗心律失常药物中哪一个是钙通道阻滞药 ()

- A. 利多卡因 B. 苯妥英钠 C. 维拉帕米 D. 奎尼丁 E. 心得安

14、肾功能减退时应慎用的抗菌药是 ()

- A. 青霉素 B. 链霉素 C. 红霉素 D. 甲硝唑 E. 诺氟沙星

15、地西洋与苯巴比妥比较，前者没有哪一项作用（ ）

- A. 镇静、催眠 B. 抗焦虑 C. 麻醉作用
D. 抗惊厥 E. 抗癫痫作用

16、氢氯噻嗪的主要作用部位（ ）

- A. 近曲小管 B. 集合管 C. 髓袢升枝
D. 髓袢升枝粗段 E. 远曲小管的近段

17、有机磷酸酯类农药急性中毒的机制为（ ）

- A. 难逆性胆碱酯酶抑制作用 B. N样作用 C. M样作用
D. 中枢中毒症状 E. 加速药物在体内的分布

18、下列抗结核药中属于广谱抗生素的是（ ）

- A. 异烟肼 B. 对氨水杨酸 C. 链霉素
D. 乙胺丁醇 E. 利福平

19、使用胰岛素的常用给药途径是（ ）

- A. 口服 B. 静脉注射 C. 肌肉注射
D. 皮下注射 E. B和D

20、硝酸甘油抗心绞痛的药理学基础是（ ）

- A. 增强心肌收缩力 B. 降低心肌耗氧量 C. 松弛血管平滑肌
D. 改善心肌供血 E. 以上说法均不对

21、奥美拉唑治疗十二指肠溃疡的机制为（ ）

- A. 中和过多的胃酸 B. 抑制H⁺泵的作用，减少胃酸分泌
C. 阻断胃腺壁细胞上组胺H₁受体，抑制胃酸分泌
D. 阻断胃腺壁细胞上组胺H₂受体，抑制胃酸分泌 E. 以上都不是

22、有关糖皮质激素药理作用的叙述, 错误的是 ()

- A. 抗炎、抗休克作用 B. 免疫增强作用
C. 抗毒素作用和中枢兴奋作用 D. 能使中性白细胞增多 E. 能够提高食欲

23、茶碱类药的主要平喘原理是 ()

- A. 激动效应器官, 使 cAMP 增加 B. 激活磷酸二酯酶, 使细胞内 cAMP 增加
C. 抑制磷酸二酯酶, 使细胞内 cAMP 增加 D. 激活腺苷酸环化酶, 使细胞内 cAMP 增加
E. 以上都不是

24、注射硫酸镁不具备的作用是 ()

- A. 抗惊厥作用 B. 降压作用 C. 中枢抑制作用
D. 导泻、利胆作用 E. 松弛骨骼肌

25、治疗厌氧菌感染的首选药是

- A. 青霉素 B. 巴龙霉素 C. 红霉素 D. 喹碘仿 E. 甲硝唑

26、急性骨髓炎宜选用 ()

- A. 红霉素 B. 四环素 C. 庆大霉素 D. 卡那霉素 E. 林可霉素

27、治疗“流脑”应首选 ()

- A. ST B. SD C. SIZ D. SA E. SML

28、硫脲类作用机理是抑制以下何种酶活性

- A. 胆碱酯酶 B. 环加氧酶 C. MAO D. 过氧化物酶 E. 转肽酶

29、易引起灰婴综合征的抗生素是 ()

- A. 氯霉素 B. 四环素 C. 二性霉素 D. 多粘菌素 E. 卡那霉素

30、能增加氨基糖苷类抗生素耳毒作用的药物是 ()

- A. 速尿 B. 氢氯噻嗪 C. 氨基青霉素 D. 多粘菌素 E. 醋氨酚

三、简答题（每题 10 分，共计 30 分）

- 1、什么是药物的副作用。
- 2、细菌对抗菌药物产生耐药的机制有哪些。
- 3、影响药物效应的机体方面因素有哪些。

四、问答题（每题 20 分，选做其中 1 题，共计 20 分）

- 1、propranolol 的药理作用有哪些。
- 2、在新药研究与开发中药理学的研究内容有哪些。

药剂学部分

一、请解释下列名词并说明其在药剂学中的应用（共5题，每题4分，计20分）

1. hydrophile-lipophile balance
2. 临界胶束浓度
3. FO 值
4. 前期药物
5. 冷冻干燥

二、选择题（共20题，每题1分，计20分）

1. 下列哪一项是表示分子极性大小的一种量度（ ）
A 溶解度参数 B 溶出速度常数 C 扩散系数 D 离子强度
2. 混合粉碎适用的情况是（ ）。
A 处方中各组分软硬程度相似 B 含有粘性差异较大的药物
C 处方中含有贵重药物 D 含有产生低共熔药物
3. 最适于作疏水性药物的润湿剂 HLB 值是（ ）
A. HLB 值在 5~20 之间 B. HLB 值在 7~9 之间
C. HLB 值在 8~16 之间 D. HLB 值在 7~13 之间
4. W/O 乳剂的性质有（ ）。
A 乳白色状 B 可被亚甲蓝染色 C 粒子大小在 100nm 以上 D 可导电
5. 我国目前法定制备注射用水的方法是（ ）
A 离子交换法 B 电渗析法 C 反渗透法 D 蒸馏法
6. 以下哪一项与片剂润滑剂无关（ ）。
A 增加颗粒流动性 B 防止颗粒粘在冲模上

C 促进片剂在胃中的润湿

D 减少冲头和冲模的磨损

7. 用凡士林作软膏的基质时, 通常需要加入适量的 ()。

A 液体石蜡

B 石蜡

C 羊毛脂

D 植物油

8. 下列中只有 () 属物理性配伍变化。

A 液化

B 沉淀

C 产生气体

D 变色

9. 一般注射液的 pH 值应为 ()。

A 3~8

B 3~10

C 4~9

D 5~10

10. 为提高浸出效率, 常采取一些措施, 下列哪一项措施是错误的 ()。

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. 下列属于非离子表面活性剂的是 ()

A. 月桂酸

B. 卵磷脂

C. 吐温 80

D. 苯扎氯铵

12. 下述哪种方法不能增加药物的溶解度 ()。

A 加入助溶剂

B 加入非离子表面活性剂

C 制成盐类

D 应用潜溶剂

E 加入助悬剂

13. 关于热原叙述错误的是 ()

A 热原是微生物的代谢产物

B 热原致热活性中心是脂多糖

C 一般滤器能截留热原

D 蒸馏法制备注射用水主要是依据热原的不挥发性

14. 片剂辅料中既可做填充剂又可做粘合剂与崩解剂的物质是()。

- A 糊精 B 微晶纤维素 C 羧甲基纤维素钠 D 微粉硅胶 E 甘露醇

15. 吸入粉雾剂中的药物微粒, 大多数应在() μm 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. 下届哪一种基质不是水溶性软膏基质()。

- A 聚乙二醇 B 甘油明胶 C 羊毛脂 D 纤维素衍生物 E 卡波普

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. 以下制备注射用水的流程哪个最合理?()

- A. 自来水→滤过→电渗析→蒸馏→离子交换→注射用水
B. 自来水→滤过→离子交换→电渗析→蒸馏→注射用水
C. 自来水→滤过→电渗析→离子交换→蒸馏→注射用水
D. 自来水→离子交换→滤过→电渗析→蒸馏→注射用水

19. 关于包合物的叙述错误的是()

- A 包合物是一种分子被包藏在另一种分子的空穴结构内的复合物
B 包合物是一种药物被包裹在聚合物材料中形成的囊状物
C 包合物能增加药物稳定性
D 包合物能使液态药物粉末化

20. 能保持稳定的净化气流使微粒不沉降、不蓄积的方法称为()

- A. 高效滤过技术 B. 空调法
C. 层流净化技术 D. 旋风分离技术

三、简答题（共5题，计30分）

1. 根据极性基团的解离性质及所带电荷，表面活性剂有哪些类型？各举一例。
2. 简述透皮给药系统比之其他常用的药物制剂有哪些优缺点？
3. 什么是固体分散技术，试简述固体分散体的速释与缓释原理。
4. 什么是口服定时释药系统，按照制备技术可将口服定时释药系统分为哪几类？
5. 为什么要在维生素C注射液的处方中加入依地酸二钠、碳酸氢钠和亚硫酸氢钠？而且在制备过程中要充CO₂气体？

四、处方设计综合题（共2题，计30分）

1. 硝酸甘油缓释片处方分析

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 ()

2. 处方

丸芯：克拉霉素 250g

微晶纤维素 70g

糖粉 40g

3%羟丙基甲基纤维素水溶液适量

每 500g 含药丸芯，包衣材料用量处方：

乙基纤维素水分散体（含乙基纤维素 6%） 100mL

滑石粉（1250 目） 28g

聚乙二醇 6000 0.85g

十二烷基硫酸钠 0.21g

[制法]含药丸芯的制备称取克拉霉素、微晶纤维素、糖粉，置离心包衣造粒机内，调整合适的主机转速、喷浆、加料速度进行层积，待含药粉末加完后，继续转动机器，抛光 6 分钟，取出，置 60℃烘干，筛取 20~24 目含药丸芯。

包衣工艺 称取 500g 上述含药丸芯，置离心包衣造粒机内；另取包衣液适量，调整合适的主机转速、喷浆速度等参数，待包衣液喷完时停止，取出后于 40℃烘箱中老化 24 小时即可。

回答下列问题：

- 1) 上述处方及工艺过程制备的是何种剂型。
- 2) 分析处方中各组分的作用。
- 3) 此种剂型的质量评价中释放度的测定是一重要评价指标，溶剂的选择是该类制剂体外释放度测定方法成败的关键步骤，应如何考虑？