

科目代码: 705 科目名称: 药学综合(1) (共 5 页)

一、名词解释（每小题 5 分，共 60 分）

- 1、镇静催眠药
- 2、 β -内酰胺酶抑制剂
- 3、 β -受体阻滞剂
- 4、黄酮类化合物:
- 5、生物碱:
- 6、锆-枸橼酸反应:
- 7、杂质限量:
- 8、滴定度:
- 9、检测限:
- 10、乳析:
- 11、CRH:
- 12、长循环脂质体:

二、单选题（每小题 2 分，共计 40 分）

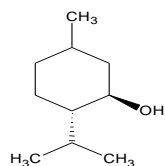
- 麻黄碱分子中有2个手性中心，四个异构体。临床上用构型是（ ）
 - (1R, 2R)
 - (1R, 2S)
 - (1S, 2R)
 - (1S, 2S)
- 头孢噻肟合成的一个主要原料（ ）
 - 6-APA
 - 6-ACA
 - 7-ACA
 - 7-ADCA
- 替丁类抗溃疡药物的硫醚四原子链上有支链则活性（ ）
 - 降低
 - 提高
 - 不变
 - 随支链长度降低
- 下面几个药物中属于消化系统药物的是（ ）
 - Indomethacin
 - Cimetidine

- A、对氨基苯甲酸 B、普鲁卡因胺 C、红霉素 D、水杨酸
- 15、片剂中的糖类对下列哪种测定方法有影响()
- A、氧化还原滴定法 B、非水滴定法
B、 C、双相滴定法 D、配位滴定法
- 16、制备散剂时，组分比例差异过大的处方，为混合均匀应采取的方法为()
- A. 加入表面活性剂，增加润湿性； B. 应用溶剂分散法
C. 等量递加混合法； D. 密度小的先加，密度大的后加
- 17、我国工业用标准筛号常用“目”表示，“目”系指()
- A. 以每 1 英寸长度上的筛孔数目表示
B. 以每 1 平方英寸面积上的筛孔数目表示
C. 以每 1 市寸长度上的筛孔数目表示
D. 以每 1 平方寸面积上的筛孔数目表示
- 18、粉末直接压片时，既可作稀释剂，又可作粘合剂，还兼有崩解作用的辅料是()
- A. 甲基纤维素； B. 微晶纤维素； C. 乙基纤维素； D. 羟丙甲基纤维素
- 19、粉体学中，用包括粉粒自身孔隙和粒子间孔隙在内的体积计算的密度称为()
- A. 堆密度； B. 粒密度； C. 真密度； D. 高压密度
- 20、下列关于冷冻干燥的正确表述()
- A、 冷冻干燥所出产品质地疏松，加水后迅速溶解
B、 冷冻干燥是在真空条件下进行，所出产品不利于长期储存
C、 冷冻干燥应在水的三相点以上的温度与压力下进行
D、 冷冻干燥过程是水分由固变液而后由液变汽的过程
E、 粘度大的样品较粘度小的样品容易进行冷冻干燥

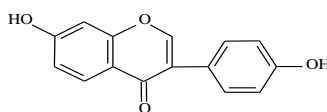
三、填空题（每空 2 分，共计 80 分）

1. 吗啡在体内代谢时，去甲基的一步发生在_____上。
2. 地高辛是通过抑制心肌细胞膜上_____的活性达到增强心肌收缩力的。
3. β -内酰胺酶类抗生素的作用机制是_____。

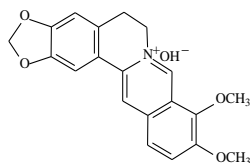
4. 维生素 D₃ 的活性代谢物是_____。
5. 生物烷化剂的结构类型有_____ (至少写三种)。
6. 喹诺酮类抗菌药的中枢毒性主要来源于_____取代基。
7. 盐酸普鲁卡因分子中甲氧羰基为活性必需结构为_____。
8. NO 供体药物在体内释放产生的 NO 分子首先激活_____的活性, 从而达到松弛血管平滑肌扩张血管的作用。
9. 甾体类激素的基本结构类型为_____。
10. 氯沙坦的作用靶点是_____。
11. 写出下列化合物的名称, 并指出属结构类型



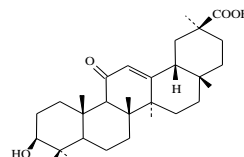
(1) 名称_____ 结构类型_____



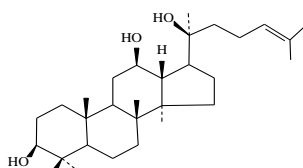
(2) 名称_____ 结构类型_____



(3) 名称_____ 结构类型_____



(4) 名称_____ 结构类型_____



(5) 名称_____ 结构类型_____

12. 利多卡因在酰胺基邻位存在两个甲基, 由于_____影响, 较_____水解, 故其盐的水溶液比较_____。
13. 巴比妥类药物的基本母核为_____, 为环状的_____结构。易发生_____, 在水溶液中发生_____级电离, 因此本类药物的水溶液显_____。
14. 麦芽酚反应是_____的特征反应。
15. 复方阿司匹林制剂中加入枸橼酸钠的目的是_____。
16. 一般说来, HLB 值在_____的表面活性剂可用作 O/W 型的乳化剂,

HLB 值在_____的表面活性剂可用作 W/O 型的乳化剂。

17、蛋白质或多肽类药物非注射给药的途径有_____、
_____、_____和
_____。

18、固体分散体的速效原理包括_____、_____和
_____等。

四、简答题（每题 10 分，共计 40 分）

1. 简述 β -受体阻滞剂普萘洛尔和美托洛尔的结构差异及作用。
2. 什么是植物二次代谢？包括哪些途径？
3. 古蔡氏法检查砷盐的原理是什么？操作中加入 KI 和 SnCl_2 的作用是什么？
4. 缓、控释制剂（一天给药 2 次）体外释放度试验至少取几个时间点？为什么？

五、论述题（每题 20 分，共计 80 分）

1. 奥美拉唑抑制 $\text{H}^+/\text{K}^+-\text{ATP}$ 酶的作用机制及特点
2. 从杜仲叶中用色谱方法分离得到一个黄色晶体，Molish 反应阳性，盐酸/镁粉反应呈紫红色，薄层水解检识出葡萄糖。

UV λ_{max} nm:

MeOH 266, 352; NaOMe 274, 400; AlCl_3 273, 344, 395; AlCl_3/HCl 273, 344, 395;
NaOAc 274, 383

^1H NMR $\text{DMSO}-d_6$ δ ppm :

8.0 (2H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 6.87(2H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 6.42(1H, d, $J=1.8\text{Hz}$), 6.19(1H, d, $J=1.8\text{Hz}$), 5.44(1H, d, $J=7.1\text{Hz}$)

试推断该化合物的结构并标示 ^1H NMR 各数据归属。

3. 说明溴量法测定司可巴比妥、盐酸去氧肾上腺素和异烟肼的原理，滴定剂与被测物的摩尔比，注意事项及异同点。
4. 测定溶出度有何意义？常用何法测定？哪些药物必须测定溶出度？