药学综合A卷答案

1. 选择题

DDBBC

BCBCB

BCDAB

CDBAC

1. 名词解释
2. Molisch反应：糖在浓硫酸或浓盐酸的作用下脱水形成糠醛及其衍生物与α-萘酚作用形成紫红色复合物，在糖液和浓H2SO4的液面间形成紫环，因此又称紫环反应。
3. 药物剂型：适合于疾病的诊断、治疗或预防的需要而制备的不同给药形式，简称剂型。
4. 聚合物胶束：系由两亲性嵌段共聚物在水中自组装形成的一种热力学稳定的胶体溶液。
5. 药物分析：利用分析测定手段，发展药物的分析方法研究药物的质量规律，对药物进行全面检验与控制的科学。
6. 标示量：即制剂的规格，系指每一片、支或其他每一个单位制剂中含有主药的重量（或效价）或含量％或装量。
7. 先导化合物：简称先导物，是通过各种途径和手段得到的具有某种生物活性和化学结构的化合物，用于进一步的结构改造和修饰，是现代新药研究的出发点。
8. 脂水分布系数：化合物在有机相和水相中分配达到平衡时的比值，通常用lg P表示，用于表示药物脂溶性和水溶性的相对大小。
9. 基源鉴定:应用植物、动物或矿物的形态学和分类学知识,对生药的来源进行鉴定,确定其正确的动植物学名、矿物名称,以保证应用品种准确无误的一种方法。
10. 简答

1、天然药物有效成分提取方法有几种？采用这些方法提取的依据是什么？

答：①溶剂提取法：利用溶剂把天然药物中所需要的成分溶解出来，而对其它成分不溶解或少溶解。②水蒸气蒸馏法：利用某些化学成分具有挥发性，能随水蒸气蒸馏而不被破坏的性质。③升华法：利用某些化合物具有升华的性质。

2、那类物质具有“起昙” 现象？并简述其产生的原因。

答：吐温类，卖泽类，苄泽类等含聚氧乙烯基团的表面活性剂，在水中其亲水基团（聚氧乙烯基）与水发生氢键络合而呈溶解状态。当温度上升到一定程度时，聚氧乙烯链可发生强烈的脱水和收缩，使增溶空间减少，增溶能力下降，因而产生混浊、分层、沉淀等现象，即“起昙”。一般情况下，当温度下降后，聚氧乙烯基和水之间的氢键可恢复，溶液又会成为澄清溶液。

1. 简述湿法制粒的工艺过程。

答：制软材→制粒→干燥→整粒与分级→质量检查与分剂量。

1. 抑制胃酸分泌药分为哪几类？写出各类代表药。

答：（1）H2受体阻断药，西咪替丁、雷尼替丁。（2）M胆碱受体阻断药，哌仑西平。（3）胃泌素受体阻断药，丙谷胺。（4）胃壁细胞H+泵（Na+-K+-ATP酶）抑制剂，奥美拉唑。

1. 简述一线抗高血压的分类，代表药及主要降压机制。

答：1）利尿药：氢氯噻嗪——利尿，降低血容量及血管阻力；（2）钙拮抗药：硝苯地平——扩血管降低血管阻力等；（3）β受体阻断药：普萘洛尔——抑制交感活性等；（4）血管紧张素I转化酶抑制药：卡托普利——抑制ACE，扩血管，抗病理性重构等；（5）AT1受体阻断药：氯沙坦——阻断AT1受体，扩血管，抗病理性重构。

6、简述HPLC用于杂质检查的方法与条件。

答：外标法（杂质对照品法），适用于有杂质对照品，而且进样量能够精确控制（以定量环或自动进样器进样）的情况。加校正因子的主成分自身对照测定法，适用于已知杂质的控制。不加校正因子的主成分自身对照测定法，适用于没有杂质对照品的情况。峰面积规一划法，使用粗略测量供试品中的杂质含量。

7、注射液中抗氧剂的存在如何影响定量？如何排除？

答:具有还原性药物的注射剂，常需加人抗氧剂以增加药物的稳定性。常用的抗氧剂有亚硫酸钠、亚硫酸氢钠、焦亚硫酸钠、硫代硫酸钠以及维生素C等。这些物质均具有较强的还原性,当用氧化还原滴定法测定药物含量时便会产生干扰。排除干扰的方法有以下几种:①加人掩蔽剂；②加酸分解；③加人弱氧化剂氧化；④利用主药与抗氧剂紫外吸收光谱的差异进行测定。

8、将阿司匹林制成钙盐，是否能降低胃肠道的副作用？原因何在？

答：不能。因为阿司匹林的作用靶点为环氧酶，其钙盐不改变其作用靶点，只能改变其溶解度，副作用产生的本质是抑制胃壁的前列腺素合成。

1. 抗代谢抗肿瘤药物是如何设计出来的？试举例说明。

答：抗代谢抗肿瘤药物是根据代谢拮抗原理设计出来的，其结构与体内正常代谢物很相似，多是将代谢物的结构作细微的改变而得。例如利用生物电子等排原理，以F或CH3代替H，S或CH2代替O、NH2或SH代替OH等。

10、如何确定生药适宜采收期？不同药用部位的生药一般采收原则？

答：必须把有效成分的积累动态与植物生长发育阶段这两个指标结合考虑。当有效成分含量高峰期与药用部分产量高峰期不一致时，要考虑有效成分的总含量。当有效成分含量有显著的高峰期而药用部分产量变化不显著，则含量高峰期即为适宜采收期。

根和根茎类：宜在植物生长停止、花叶萎谢的休眠期或在初春发芽前采集。

叶和全草类：宜在植物生长最旺盛时，或花蕾将开放时，或花盛开而果实种子尚未成熟时采收。

树皮和根皮：树皮多在春夏之交来采收，根皮多在秋季采收。

花类：一般在花刚开放时采收。

果实类：果实应在已成熟或将成熟时采收，少数用未成熟的果实，如枳实。

种子类: 应在完全成熟后采收。

1. 论述及案例

1、硝苯地平是钙拮抗剂中的一种，是治疗变异型心绞痛和高血压首选钙离子拮抗剂，宜于长期使用。目前已研制出胶囊剂、普通片剂、膜剂、气雾剂、缓释片、透皮制剂、栓剂、控释片等。规格：片剂：每片10mg；胶囊剂：每胶囊5mg；喷雾剂：每瓶100mg。用法及用量：口服：1次5~10mg，每日3次，急用时可舌下含服，对慢性心力衰竭，每6小时20mg；咽部喷药：每次1.5~2mg (约喷3~4下)。问题:（1）分析硝苯地平各种剂型的吸收特点。（2）如何根据临床需要，选择适宜的硝苯地平剂型?

答：（1）胶囊剂的吸收特点：由于胶囊剂制备时不需加压力，服用后在胃中崩解快，囊壳破裂后，药物颗粒可迅速分散，故药物的吸收快，吸收较好。

普通片剂的吸收特点：片剂在胃肠道中经历着崩解、分散和溶出的全过程。片剂充分崩解，分散成包含辅料的细颗粒，细颗粒进一步分散，药物溶解后才能被机体吸收。

膜剂的吸收特点：药物的溶出速度和吸收快。

气雾剂的吸收特点：鼻腔给药。①鼻粘膜内血管丰富，鼻粘膜渗透性高，有利于全身吸收；②可避开肝首过作用、消化道内代谢和药物在胃肠液中的降解；③吸收程度和速度有时可与静脉注射相当；

缓、控释片的吸收特点：①释药徐缓,时血药浓度平稳，避免峰谷现象，有利于降低药物的毒副作用,减少耐药性的发生；②某些缓、控制剂可以按要求定时、定位释放，更加适合疾病的治疗。

透皮制剂的吸收特点：皮肤给药，经皮下毛细血管吸收，吸收慢。①避免肝脏首过作用和肠胃道的酶降解；②避免对胃肠道的刺激性；③维持恒定的血药浓度，具缓释长效作用；④使用方便、安全，如有副作用可随时中断给药。

栓剂的吸收特点：①药物可以避免胃肠pH和酶的影响和破坏；②对胃有刺激的药物可采用直肠给药；③作用时间一般比口服片剂长；④可作为多肽蛋白质类药物的吸收部位。

1. 急用时，可选择吸收快的给药途径，如舌下含服片剂。而对于慢性疾病，可用其他相对吸收比较慢的剂型，如胶囊剂、缓控释片等。

2、某男，农民，8月的某日于田间喷洒农药，劳作结束数小时后开始出现不适，随即就医。患者出现的症状有恶心、呕吐、腹痛、腹泻、尿频，胸闷、视力模糊、无力，临床检查可见意识清楚、步态蹒跚、肌纤维颤动、瞳孔明显缩小、流涎等。实验室检查：胆碱酯酶活力仅为33%。医生立即给予患者静脉注射阿托品和肌内注射解磷定进行治疗，同时敦促家属和护理人员帮助患者沐浴，清理指甲，更换清洁衣物。后续，患者病情好转。问题：（1） 患者为何种毒物中毒？简述其中毒机制。（2）医生为什么要求患者沐浴、更衣，清理指甲？（3）医生所使用的两种药物解毒机制何在？分别能解除该患者的哪些中毒表现？

答：（1）患者为有机磷酸酯类农药中毒。中毒机制为：难逆性抑制胆碱酯酶，导致乙酰胆碱灭活减少，在体内堆积，导致体内胆碱受体被过度激动而出现多器官功能改变，因此中毒。（2）患者在使用农药时中毒，吸入、通过皮肤吸收是农药入血的主要路径。入院后，空气中不再含有农药，吸入路径切断。但是患者身体上、毛发指甲缝中、衣服上都还沾有农药，因此可能进一步被透皮吸收而导致体内毒物增加，毒性无法缓解。所以患者沐浴、更衣、清理指甲可以阻止毒物的吸收，减轻毒物的危害。（3）解毒药物机制和解除的中毒表现如下：A阿托品作用机制：阻断M受体，解除有机磷酸酯类农药中毒后对M受体的过度兴奋。解除的中毒表现：主要是M样症状，包括恶心、呕吐、腹痛、腹泻、尿频，胸闷、视力模糊，瞳孔明显缩小、流涎。B解磷定作用机制：复活胆碱酯酶，恢复其对乙酰胆碱的灭活；与有机磷酸酯类农药结合，使之成为无毒化合物而排出体外，从而解毒。解除的中毒表现：主要解除N样症状，包括无力步态蹒跚、肌纤维颤动。

1. 试述非水滴定法。

答：要点（1）适用于弱酸或弱碱性药物的定量 （2）四种非水溶剂 （3）一般方法 （4）常见问题讨论。

1. 阿昔洛韦为无环核苷类抗病毒药物的典型代表，但其目前的市场地位受到了盐酸万乃洛韦（阿昔洛韦左缬氨酸酯盐酸盐）的强势挑战（注：均为口服给药片剂），请从药物化学、药剂学角度分析其原因何在。

答：紧扣前药原理，从药物溶出、跨膜的改变，得出口服生物利用度提高的结果，