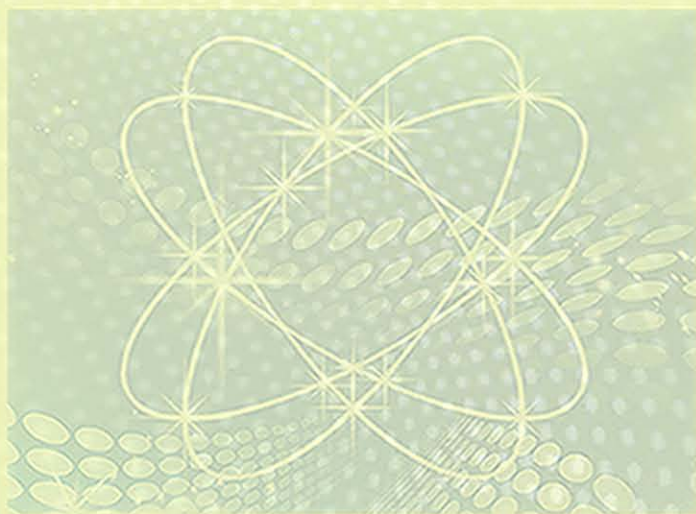


# 药学专业知识（二）

## 模拟试卷及解析

赵春杰 主编



人民军医出版社

国家执业药师资格考试（含部队）推荐辅导用书

# 药学专业知识（二）模拟试卷及解析

YAOXUE ZHUANYE ZHISHI (ER) MONI SHIJUAN JI JIEXI

国家执业药师资格考试（含部队）推荐辅导用书编委会



人民军医出版社

PEOPLE'S MILITARY MEDICAL PRESS

北 京

---

图书在版编目 (CIP) 数据

药专业知识 (二) 模拟试卷及解析 / 赵春杰主编. —3 版. —北京: 人民军医出版社, 2014.3

ISBN 978-7-5091-7391-6

I. ①药… II. ①赵… III. ①药理学—药剂人员—资格考试—题解 IV. ①R9-44

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2014) 第 042621 号

---

策划编辑: 于晓红 丁 震 文字编辑: 许泽平 黄维佳 责任审读: 王三荣

出版发行: 人民军医出版社 经销: 新华书店

通信地址: 北京市 100036 信箱 188 分箱 邮编: 100036

质量反馈电话: (010)51927290; (010)51927283

邮购电话: (010)51927252

策划编辑电话: (010)51927300—8062

网址: [www.pmmp.com.cn](http://www.pmmp.com.cn)

---

印刷: 三河市世纪兴源印刷有限公司 装订: 京兰装订有限公司

开本: 787mm×1092mm 1/16

印张: 7.25 字数: 148 千字

版、印次: 2014 年 3 月第 3 版第 1 次印刷

印数: 0001—5000

定价: 21.00 元

---

版权所有 侵权必究

购买本社图书, 凡有缺、倒、脱页者, 本社负责调换

# 国家执业药师资格考试（含部队）推荐辅导用书

## 编审委员会名单

主 编 赵春杰

编 委 （以姓氏笔画为序）

石 凯 朱晓明 刘 铮 杨 悦

宋少江 范晓文 周 蓓 赵春杰

袁久志 贾 嫻 贾健辉

## 《药学专业知识（二）模拟试卷及解析》分册编委名单

### 第一部分 药 剂 学

主 编 石 凯

副主编 丁平田

编 委 （以姓氏笔画为序）

丁平田 毛世瑞 石 凯 杨 丽

邹梅娟

### 第二部分 药物化学

主 编 贾 嫻

副主编 赵燕芳 赵 璇

编 委 （以姓氏笔画为序）

赵 璇 赵燕芳 郝希霖 贾 嫻

# 前 言

1994 年 3 月 15 日我国开始实施执业药师资格制度。执业药师资格考试属于职业准入性考试，经考试并成绩合格者，国家发给执业药师资格证书，表明具备执业药师的学识、技术和能力。本资格在全国范围内有效。

沈阳药科大学从 1996 年起开办执业药师资格考试考前培训，积累了丰富的考前培训经验，对考试内容、考试要求、考题特点等具有很好的把握和了解，考生通过培训极大地提高了考试一次通过率。

为了帮助广大参加执业药师资格考试的人员准确、全面地理解和掌握应试内容，顺利通过考试，沈阳药科大学在国内率先组织编写了执业药师资格考试考前辅导丛书和全真模拟试卷：①药事管理与法规（药学、中药学共用）；②药学专业知识的（一）；③药学专业知识的（二）；④药学综合知识与技能；⑤中药学专业知识的（一）；⑥中药学专业知识的（二）；⑦中药学综合知识与技能。

考前辅导丛书紧扣最新版执业药师资格考试大纲和国家食品药品监督管理局执业药师资格认证中心编写的《应试指南》，提炼考试要点，对教材内容予以高度的概括、浓缩，对重要知识点详细讲解，对难点、疑点辅以分析性的说明文字。指导考生抓住重点，帮助考生减少复习盲目性。在章节辅导的基础上，辅之章后练习题，帮助考生掌握考点，加深记忆。书后附上 1 套全真模拟试卷，帮助考生熟悉考试题型，了解考试过程。

全真模拟试卷系列是“考前辅导丛书”的配套练习卷，每个部分由 5 套卷组成，题型、题量及知识点的分配比例与真实考试相似，系统练习了大纲考点，对需要掌握的重点知识和关键考点起到增进记忆、熟练解答的作用，是考前冲刺的重要用书。

全书内容丰富，重点突出，能帮助考生更好地理解、掌握、记忆教材内容，使应试者在有限的时间内有的放矢，抓住重点，明确要点和考点。

希望本套系列用书能为目前执业药师应试者复习节省时间，提高考试通过率。

编 者

# 药学专业知识（二）模拟试卷

## 答案与解析



人民军医出版社

PEOPLE'S MILITARY MEDICAL PRESS

北 京

## 模拟试卷一答案与解析

## 药剂学部分

1. E。泡腾片含有碳酸氢钠和有机酸，以蔗糖为包衣材料的是糖衣片，专用于舌下的片剂为舌下片。

2. D。粉碎后密度增加。

3. A。在物料的降速干燥阶段，物料内部的水分不能及时补充到物料的表面。

4. D。复方阿司匹林片采用 15% 的淀粉浆作为黏合剂。

5. D。《中国药典》中的九号筛的孔径小于一号筛的孔径。

6. C。直肠吸收比口服吸收的干扰因素少。

7. D。一般的栓剂应贮存于 30℃ 以下。

8. C。每 100g 可可豆脂可吸收 20~30g 的水分。

9. D。眼膏剂常用基质中可以使用羊毛脂。

10. C。涂膜剂的处方由药物、成膜材料和挥发性有机溶剂组成。

11. D。注射于真皮与肌肉之间软组织内的给药途径为皮下注射。

12. D。影响药物溶解度的因素包括药物的极性、溶剂、温度、第三种物质、晶型等。

13. A。BHA 或 BHT 是油溶性抗氧化剂。

14. D。温度会影响滤液的黏度，滤液的黏度越大，则滤过速度越慢。

15. E。混悬剂是指难溶性固体药物以 0.5μm 以上微粒分散在液体分散介质中形成的多相液态制剂。

16. B。非离子表面活性剂溶血作用轻微，吐温类的溶血作用最小，其顺序为吐温 20>吐温 60>吐温 40>吐温 80。

17. C。光线为影响药物制剂稳定性的

环境因素。

18. D。β-CD 包合物不具有靶向性。

19. C。复凝聚法系使用两种带相反电荷的高分子材料作为复合囊材，阿拉伯胶带负电，明胶带正电。

20. C。缓释、控释制剂的体外释放度至少应测 3 个取样点。

21. C。月桂氮草酮（Azone）的透皮促进作用很强，常用作经皮吸收促进剂。

22. E。<100nm 的纳米囊和纳米球可缓慢积聚于骨髓。

23. A。促进扩散转运的速率大大超过被动扩散，主动转运需消耗能量，被动扩散无饱和现象，胞饮作用是蛋白质大分子吸收的主要方式。

24. B。地西洋注射液与 5% 葡萄糖注射液配伍时，析出沉淀的原因是溶剂组成改变。

25. C。润湿性大小用接触角评价。

26. D。电感应法测定粉体体积径。

27. E。微粉硅胶可作为粉末直接压片的助流剂。

28. A。滑石粉作为抗黏剂，可将颗粒表面的凹陷填满补平改善颗粒流动性。

29. C。将物料中的水分加热汽化而达到干燥的是辐射干燥。

30. B。以热气体传递热量，使物料中的水分汽化并被气流带走的干燥方法是对流干燥。

31. D。颗粒的流动性较差易导致片重差异超限。

32. A。弹性复原率高是发生裂片的根本原因。

33. A。凡已规定检查含量均匀度的片剂，不必进行片重差异检查。

34. C。凡已规定检查溶出度的片剂，

不必进行崩解度检查。

35. B. 药物与适当基质加热熔化后，在冷凝液中收缩冷凝而制成的小丸状制剂称为滴丸。

36. D. 微丸是指药物与辅料构成的直径 $<2.5\text{mm}$ 的实心球状制剂。

37. C. 栓剂是指药物与适宜基质制成一定形状的供人体腔道给药的固体制剂。

38. E. 流通蒸汽灭菌适于对热不稳定的药品及 $1\sim 2\text{ml}$ 小容量注射剂。

39. B. 热压灭菌适用于能耐受高压蒸汽的制剂（如输液、注射液、眼药水、合剂等）。

40. A. 干热空气灭菌法适用于耐高温的玻璃、金属器皿等。

41. C. 紫外线灭菌法适用于物体表面、无菌室的空气及蒸馏水的灭菌。

42. A. 滴眼液的渗透压调节剂常用氯化钠、硼酸盐缓冲液等。

43. B. 滴眼液的抑菌剂常用硝酸苯汞、硫柳汞、羟苯酯类等。

44. B. 滴眼液的抑菌剂常用硝酸苯汞、硫柳汞、羟苯酯类等。

45. A. 极性溶剂包括水、甘油、二甲亚砷。

46. E. 半极性溶剂包括乙醇、丙二醇、聚乙二醇。

47. B. 非极性溶剂包括脂肪油、液状石蜡、乙酸乙酯。

48. C. 常用的防腐剂包括羟苯酯类、苯甲酸及其盐、山梨酸。

49. A. 泻下灌肠剂是以清除粪便、降低肠压、使肠道恢复正常功能为目的使用的液体制剂。

50. C. 涂剂是供无破损皮肤揉搽用的液体制剂。

51. D. 灌洗剂主要是指清洗阴道、尿道的液体制剂。

52. A. 巴比妥钠注射剂中加有 $60\%$ 丙二醇的目的是降低介电常数使注射液稳定。

53. B. 硼酸是无机酸，在水中会部分电离，离子强度相对增大，硫酸锌滴眼剂中，常加入少量的硼酸使溶液呈弱酸性，其作用是防止硫酸锌水解。

54. B. 青霉素钾制成粉针剂的目的是防止青霉素水解。

55. C. 维生素 A 容易氧化，制成胶囊提高药物的稳定性。

56. C. 聚乳酸为生物可降解性合成高分子囊材。

57. B. 乙基纤维素为水不溶性半合成高分子囊材。

58. A. 制备环糊精包合物的方法有重结晶或共沉淀法、研磨法、冷冻干燥法。

59. E. 验证是否形成包合物的方法有 X 线衍射法、红外光谱法、磁共振法、热分析法、荧光光谱法、紫外分光光度法、溶出度法等。

60. B. 制备固体分散体的方法有熔融法、溶剂法、溶剂-熔融法、溶剂-喷雾（冷冻）干燥法、研磨法。

61. C. 制备脂质体的方法有注入法、薄膜分散法、超声波分散法、高压乳匀法等。

62. A. 渗透泵常用的半透膜材料有醋酸纤维素、乙烯-醋酸乙烯共聚物、乙基纤维素等。

63. C. 聚氧化乙烯（PEO）在这种制剂中所起的作用是促渗聚合物，其吸水溶解后的体积膨胀，产生推动力，驱动药物最大限度地从小孔中释放出来。

64. D. 渗透压活性物质常用乳糖、果糖、葡萄糖、甘露糖、氯化钠等。

65. D. 鞘内注射可克服血、脑屏障，使药物向脑内分布。

66. E. 腹腔注射注射后药物经门静脉进入肝，可能影响药物的生物利用度。

67. C. 皮内注射注射吸收差，只适用于诊断与过敏试验。

68. E.

69. C。

70. D。68—70 题主要考查单室模型静脉注射给药的药动学方程、静脉滴注和静脉注射联合用量的负荷剂量。

71. C。麦角胺生物碱与咖啡因同时口服形成可溶性复合物，有利于吸收。

72. B。阿莫西林与克拉维酸联合使用能够减少或延缓耐药性的发生。

73. ADE。药剂学是研究药物制剂的处方设计、基本理论、制备工艺和合理应用的综合性技术科学。

74. ABDE。粉体一般情况下真密度 $\geq$ 粒密度 $>$ 松密度。

75. CD。表面活性剂添加过多，会使药物滞留在基质中释放变慢，吸收降低；当基质的溶解特性正好与药物相反时，有利于药物的释放与吸收。

76. ABDE。应选用对药物溶解度小的抛射剂。

77. ABDE。注射剂质量要求没有无色。

78. ABCE。热原具有水溶性。

79. CD。安瓿通入的气体常用为氮气和二氧化碳。

80. BCE。D 值是微生物的耐热系数，系指一定温度下，将微生物杀灭 90%（即使之下降一个对数单位）所需要的时间。D 值越大，说明该微生物的耐热性越强。

81. ABDE。剧毒药或剂量小的药物不应制成混悬剂。

82. CDE。用于制备乳剂的方法有两相交替加入法、油中乳化法、水中乳化法。

83. ABDE。分子胶囊指包合物。

84. ABDE。影响药物透皮吸收的因素有药物的分子量、基质的特性与亲和力、透皮吸收促进剂、生理状态等。

### 药物化学部分

85. D。异烟肼在体内经乙酰化代谢，并导致生成活性乙酰基自由基而产生肝毒

性。对乙酰化速度较快的患者需要调节使用剂量。其他代谢物为异烟酸和肼。

86. E。卡莫司汀具有广谱抗肿瘤活性，其结构中含有的吡唑酮类  $\beta$ -氯乙基具有较强的亲脂性，易通过血-脑屏障进入脑脊液，因此适用于脑瘤、转移性脑瘤、其他中枢神经系统肿瘤及恶性淋巴瘤等的治疗。但有迟发性和累积性骨髓抑制的不良反应。

87. E。安乃近为吡唑酮类解热镇痛消炎药，结构以吡唑酮为母体，1、5 位有甲基取代，2 位有苯基取代，3 位为酮，4 位氨基上有甲基和亚甲基磺酸钠取代，是氨基比林与亚硫酸钠结合的化合物，因含有亚甲基磺酸钠结构和 1 分子结晶水，水溶性好；本品的解热镇痛作用比较强，可用于高热时的解热。本品亦有较强的抗风湿作用。因不良反应严重，临床已少用。

88. C。哌替啶结构中含有哌啶环和苯环，无吡啶环。

89. C。抗心力衰竭药为可以加强心肌收缩力的药物，又称正性肌力药，主要为强心苷类药。代表药物有地高辛、去乙酰毛花苷等。氯沙坦为血管紧张素受体 II 拮抗药，硝苯地平为钙通道阻滞药，两者皆为降压药；甲基多巴为作用于中枢的抗高血压药，美西律为治疗心律失常的药物。

90. C。肌肉松弛药的结构特点是两个季铵结构相差十几个碳原子的位置，题干给出结构符合该特点，选项中泮库溴铵和阿曲库铵皆为肌肉松弛药，泮库溴铵含有雄甾烷结构，所以选项为 C。其他选项苯丙酸诺龙为蛋白同化激素，米非司酮为抗早孕药物，氢化可的松为糖皮质激素类用药。

91. B。降血脂药物中，含有 3，5-二羟基羧酸结构片段的是 HMG-CoA 还原酶抑制药中的合成类药物，只有阿托伐他汀（B）符合，洛伐他汀为天然产物，结构中含有内酯结构，体内代谢后才形成 3，5-二羟基羧酸结构。

92. A。给出结构为  $H_2$  受体拮抗药的结构特征(①碱性芳杂环或者具有碱性取代基的芳杂环;②含氮原子的平面极性基团;③易弯曲的4个原子链,将芳杂环与平面极性基团相连接),故本题答案为西咪替丁。

93. C。与阿托品比较,山莨菪碱在脱品环的6位有羟基,极性增大;东莨菪碱在6,7位有环氧环,极性增大;因此,极性大小的顺序为山莨菪碱>阿托品>东莨菪碱;中枢作用强弱的顺序与其极性的顺序相反。

94. D。氟康唑属于三氮唑类抗真菌药物,结构中含有2个弱碱性的三氮唑环和1个亲脂性的2,4-二氟苯基,由于结构的对称性,不含有手性中心。口服吸收良好,是治疗深部真菌感染的首选药物,不受食物、抗酸药、组胺  $H_2$  受体拮抗药类抗溃疡药的影响。也可用于表皮真菌感染的治疗。

95. E。磺胺甲噁唑又称磺胺甲基异噁唑、新诺明(SMZ)。抗菌谱广,抗菌作用强。主治大肠埃希菌和变形杆菌引起的急性、慢性尿路感染及预防脑膜炎球菌所致流行性脑脊髓膜炎。本品多与甲氧苄啶合用(称为复方新诺明),起到对二氢叶酸合成酶和二氢叶酸还原酶双重阻断效果,用于泌尿道和呼吸道感染、外伤及软组织感染、伤寒、布氏菌病等。

96. E。齐多夫定为胸苷的类似物,在其脱氧核糖部分的3位上以叠氮基取代。

97. D。本题要掌握药物的结构特点,头孢羟氨苄含有头孢烷酸结构母核,含有对羟基苄基,且苄基上有氨基取代。

98. B。氟西汀含三氟苯氧基和N-甲基苯丙氨结构。含有手性中心,S-异构体是R-异构体的100倍,而R-异构体是长效抑制药。口服在肝内代谢,主要为活性代谢物N-去甲氟西汀,半衰期更长(盐酸氟西汀2~3d,代谢物半衰期7~9d),通过肾排泄。选择性抑制中枢神经5-HT的重摄取。口服抗抑郁药。主要不良反应为肠胃道刺激和神经失调。

99. E。本题考查药物的结构特点,选项中只有己烯雌酚不含有甾体环母核,为二苯乙烯类化合物。

100. A。本考题考查维生素的用途,维生素D类药物可促进钙吸收,可用于佝偻病和软骨病、肾性骨病、骨质疏松症和甲状旁腺功能减退症;维生素E是 $\alpha$ -生育酚酯类化合物,用于习惯性流产、不孕症、进行性肌营养不良等,亦可用于心血管疾病的辅助治疗;维生素K用于缺乏维生素K引起的出血,如梗阻性黄疸、胆瘘、慢性腹泻等所致出血,香豆素类、水杨酸钠等所致的低凝血酶原血症,新生儿出血及长期应用广谱抗生素所致的体内维生素K缺乏;维生素C用于坏血病的预防及治疗,预防冠心病、尿的酸化、各种贫血等。

101. B。本题题干有两个线索,治疗心律失常的药物只有“洛尔”类药物,而索他洛尔刚好符合题干中结构要求。

102. A。哌唑嗪结构中含有喹唑啉基团,且为抗高血压药物,也用于治疗良性前列腺增生症。

103. E。含有苯丙醇胺基团的药物应该属于拟肾上腺素类药物,麻黄碱和伪麻黄碱都是易制毒品,属于我国管制药物。

104. C。多巴酚丁胺结构中含有儿茶酚胺基团,为选择性 $\beta_1$ 受体激动药,临床主要用于抗心力衰竭。

105. B。本题考查药物的结构特点,地西洋以1,4-苯并二氮杂草为母体结构,1位带有甲基,7位有氯取代。

106. E。本题考查药物的结构特点,是地西洋的活性代谢物,是地西洋1-脱甲基、4-羟基化产物。

107. A。本题考查药物的结构特点,唑仑类药物结构中因1、2位并合三唑环,不能发生水解。因此,唑仑类比西洋类更稳定,活性更强,毒性反应和副作用小,治疗安全范围大。艾司唑仑三氮唑环上没有甲基。

108. C. 本题考查药物的结构特点, 阿普唑仑结构在艾司唑仑结构中的三氮唑环上带上 1 个甲基。

109. D. 本题考查解热镇痛消炎药物的结构分类。解热镇痛药按照化学结构将该类药物分为水杨酸类、乙酰苯胺类、吡唑酮类。乙酰氨基酚属于乙酰苯胺类。

110. A. 本题考查解热镇痛消炎药物的结构分类。非甾体消炎药按照化学结构可将非甾体消炎药分为芳基乙酸类、芳基丙酸类、1,2-苯并噻嗪类及选择性 COX-2 抑制药等。萘丁美酮结构中虽然不含有乙酸结构, 但为一个非酸性前药, 在体内经过代谢形成萘乙酸衍生物而起作用, 所以仍然被归类为芳基乙酸类。

111. B. 本题考查解热镇痛消炎药物的结构分类。非甾体消炎药按照化学结构可将非甾体消炎药分为芳基乙酸类、芳基丙酸类、1,2-苯并噻嗪类及选择性 COX-2 抑制药等。萘普生属于芳基丙酸类。

112. C. 本题考查解热镇痛消炎药物的结构分类。非甾体消炎药按照化学结构可将非甾体消炎药分为芳基乙酸类、芳基丙酸类、1,2-苯并噻嗪类及选择性 COX-2 抑制药等。吡罗西康以 1,2-苯并噻嗪为母体, 1 位硫氧化为砒, 2 位氮上连有甲基, 3 位连有甲酰胺, 4 位连有烯醇式羟基。虽然分子中无羧基, 但结构中的烯醇羟基存在互变异构现象, 使本类药物显酸性。1,2-苯并噻嗪类药物为选择性 COX-2 抑制药。

113. D. 本题考查药物的结构特点。奥美拉唑含有苯并咪唑环、亚磺酰基和吡啶环, 亚磺酰基有手性。

114. E. 本题考查药物的结构特点。西咪替丁分子中含有咪唑环、含硫醚的四原子链、末端取代胍。

115. C. 本题考查药物的结构特点。雷尼替丁属于咪唑类  $H_2$  受体拮抗药, 分子结构中含有硝基乙烯二胺。

116. B. 本题考查药物的结构特点。酮替芬的结构中将赛庚啉的 1 个苯环用噻吩环替换, 再将环庚三烯连接 2 个苯环的烯键饱和, 并在与噻吩相邻的碳上引入羰基。

117. A. 本题考查药物的结构特点。氯雷他定的结构中将盐酸赛庚啉的 1 个苯环用吡啶环置换, 将环庚三烯连接 3 个苯环的烯键饱和, 即为本品的母核。

118. C. 本题考查药物的结构特点。酮替芬的结构中将赛庚啉的三环结构中的 1 个苯环用噻吩环替换, 再将环庚三烯连接 3 个苯环的烯键饱和, 并在与噻吩相邻的碳上引入羰基。

119. A. 质子泵抑制药的名称中都有“拉唑”的后缀。

120. B. 本题考查药物的结构特点。盐酸赛庚啉的结构中以二苯并环庚三烯为母体。

121. A. 质子泵抑制药的名称中都有“拉唑”的后缀。该类药物的结构特点是: 含有苯并咪唑环、亚磺酰基和吡啶环, 亚磺酰基有手性。

122. D. 西咪替丁是咪唑类  $H_2$  受体拮抗药, 分子中含有咪唑环、含硫醚的四原子链、末端取代胍。

123. C. 耐酶半合成青霉素的结构特点为在侧链上引入吸电子基团, 降低侧链羰基氧原子上的电子云密度, 使其作为亲核试剂进攻  $\beta$ -内酰胺环的能力减弱, 如非奈西林和丙匹西林。

124. D. 耐酶半合成青霉素的结构特点为在侧链酰胺上引入体积较大的基团, 阻止药物分子与  $\beta$ -内酰胺酶活性中心相互作用, 如苯唑西林类药物。

125. E. 广谱半合成青霉素的结构特点为在侧链酰胺上引入极性基团, 增加对革兰阴性菌的活性。

126. A. 6-氨基青霉烷酸 (6-APA) 既是青霉素药物的基本结构母核, 也是半合成

青霉素的合成基本原料。

127. B。7-氨基头孢烷酸(7-ACA)既是头孢菌素类药物的基本结构母核,也是半合成头孢菌素的合成基本原料。

128. C。司坦唑醇是甲睾酮A环改造的产物,在A环上并和上一个吡唑环,为蛋白同化激素。

129. D。地塞米松与氢化可的松相比,结构中有1-烯、9 $\alpha$ -氟、16 $\alpha$ -甲基。

130. A。己烯雌酚为二苯乙烯类化合物,苯环的对位有羟基,双键上连有2个乙基。本品立体构型与雌二醇相似,有几何异构体,反式构型活性高,临床用反式己烯雌酚。

131. B。醋酸甲地孕酮在黄体酮结构基础上,引入了6 $\alpha$ -甲基、17 $\alpha$ -乙酰氧基,在6位上有双键。

132. E。氢化可的松结构特点:以孕甾烷为母核,3-羰基,4位双键,11 $\beta$ -羟基,17 $\alpha$ -羟基。如果在A环1、2位引入双键,则得到泼尼松龙,消炎活性增大,钠潴留作用不变。

133. ABCD。本题考查选项中哪些是前体药物。奥美拉唑,体外无活性,进入胃壁细胞后,经氢离子对咪唑环上N原子的催化,发生重排形成活性形式次磺酸和次磺酰胺,从而发挥H<sup>+</sup>, K<sup>+</sup>-ATP酶抑制作用。奥美拉唑是前体药物,其代谢物经碱催化的Smiles重排得到硫醚化合物,可经肝再被氧化成奥美拉唑重新发挥作用,这种体内循环称为前药循环。贝诺酯,口服后以原型吸收,代谢过程中水解为阿司匹林和对乙酰氨基酚而发挥解热、镇痛、消炎作用。阿司匹林和对乙酰氨基酚产生协同治疗作用,作用时间长。舒林酸为前药,在肝将甲基亚砷还原为甲硫基后产生活性,甲硫基代谢物在肾内排泄较慢,因此本品具有起效慢、作用持久的特点。维生素D类需在肝中经25-羟化酶系统催化代谢为骨化二醇、然后再经肾经1-羟化酶系统催化代谢为骨化三醇,才具有调整钙、磷代谢的活性。

134. ABDE。巴比妥类药物的构效关系:

①C<sub>5</sub>上2个取代基总数在4~8个时,脂水分配系数保持一定值,药效最佳;>9个时作用下降,甚至出现惊厥。②5,5-二取代,N-甲基产物,由于脂溶性增大,起效快、作用时间短,易被代谢,但两个氮原子上都引入甲基,会导致惊厥。③2位S取代O,脂溶性增大,起效快,持续时间短。巴比妥类药物属于结构非特异性药物,起作用强弱、显效快慢、作用时间长短主要取决于药物的理化性质,与药物的酸性解离常数、脂/水分配系数和代谢失活过程有关。当环状酰胺结构5位上的R<sub>1</sub>和R<sub>2</sub>均为氢时(巴比妥酸),酸性较强,生理条件下完全解离,不能通过血-脑屏障,无生理活性。当5位的两个氢同时被取代时,增加了分子的脂溶性,降低了整个分子的酸性,在生理条件下,部分化合物以分子形式存在,部分化合物以离子形式存在。此时药物可以分子形式进入中枢神经系统,产生生物活性。

135. CE。抗抑郁药按照作用机制可分为去甲肾上腺素再摄取抑制药、5-羟色胺再摄取抑制药和单胺氧化酶抑制药。代表药物有多塞平、盐酸阿米替林、盐酸氟西汀、盐酸帕罗西汀、度洛西汀、瑞波西汀、文拉法辛、舍曲林、吗氯贝胺、米氮平、艾司西酞普兰(西酞普兰)、氟伏沙明、丙米嗪。苯妥英钠和卡马西平是抗癫痫药,舒必利为一新型抗精神病药,除有较强的抗精神分裂症作用外,还有很强的止吐作用和一定的抗抑郁作用,锥体外系等不良反应较轻。

136. AE。蔡丁美酮为非酸性前药,口服后在十二指肠吸收,经肝代谢为6-甲氧基-2-萘乙酸后产生活性,对COX-2有选择性抑制作用,对胃肠道COX-1无作用,无一般非甾体消炎药的胃肠道不良反应。芬布芬本品为酮酸类前药,体内代谢为联苯乙酸后产生活性。

137. ABCD。盐酸美沙酮为氨基庚酮类,

可以看作是仅仅保留了吗啡结构中的 A 环。盐酸美沙酮含有 1 个手性中心，左旋体活性大于右旋体，临床使用外消旋体；其水溶液不稳定，在光照下可变色。在体内主要代谢途径是 N-氧化、N-去甲基化、苯环羟化及羰基还原等。代谢产物仍具镇痛作用，且作用时间较长。盐酸美沙酮镇痛作用强于盐酸哌替啶和吗啡，适用于各种剧烈疼痛的镇痛，并有一定镇咳作用；成瘾性小，临床上用于戒除海洛因成瘾的替代疗法；为阿片  $\mu$  受体激动药。

138. AB。拟肾上腺素类药物因结构中含有儿茶酚和苯乙胺结构，体内代谢主要被

两种酶代谢失活，即儿茶酚-O-甲基转移酶（COMT）和单胺氧化酶（MAO）。

139. ABDE。盐酸克林霉素，又称氯洁霉素。为林可霉素的 7 位羟基（R）被氯（S）取代的半合成抗生素。化学稳定性好，对光稳定，水溶液中 pH 为 3.0~5.0 时最稳定。抗菌作用比盐酸林可霉素强 4~8 倍。用于骨髓炎、厌氧菌引起的感染、呼吸系统感染、胆道感染、心内膜炎、中耳炎、皮肤软组织感染及败血症等。克林霉素是金黄色葡萄球菌性骨髓炎的首选治疗药物。进食不影响其吸收。结构最小的抗生素不是克林霉素。

140. AD。

## 模拟试卷二答案与解析

### 药剂学部分

1. B。CMS-Na 是羧甲基淀粉钠，为常用崩解剂。CMC-Na 是羧甲基纤维素钠，PVP 是聚乙烯吡咯烷酮，HPC 是羟丙基纤维素，都是黏合剂；PEG 4000 为润滑剂。

2. D。影响片剂成型的主要因素有药物/辅料的可压性、药物的熔点及结晶形态、黏合剂和润滑剂的用量、水分、压力。

3. E。提高空气温度或降低空气中湿度可以加快干燥速率。

4. C。薄膜衣片的崩解时限是 60min。

5. A。常用硬胶囊的容积以 0 号为最大，5 号为最小。

6. B。栓剂的重量与基质的密度关系密切。

7. C。栓剂基质用量公式： $X = (G - W/f) \times n$ ，其中  $G$ 、 $W$ 、 $f$ 、 $n$  分别为空白栓、每枚含药栓的含药质量、置换价及栓剂枚数。

8. E。混悬型软膏剂除另有规定外，不得检出  $>180\mu\text{m}$  的粒子。

9. E。不溶性药物应先研成细粉并通过

9 号筛，再制成混悬型眼膏剂。

10. A。膜剂外用能用于皮肤创伤、烧伤或炎症表面的覆盖。

11. B。致热能力最强的是革兰阴性杆菌产生的热原。

12. D。活性炭在酸溶液中吸附作用较强，在碱性溶液中有时出现“胶溶”或脱吸附作用。

13. B。冰点下降法计算等渗调节剂用量： $a(\text{g}/100\text{ml}) = (0.52 - a)/0.58$ ，其中  $a$  为药物溶液冰点降低值。

14. B。大多数阳离子表面活性剂和两性离子表面活性剂可用作溶液杀菌剂。

15. C。制备乳剂的方法有油中乳化剂法、水中乳化剂法、两相交替换加法、新生皂法、机械法。

16. C。 $t_{0.9} = 0.1054/k$ 。

17. A。原料药需进行影响因素试验、加速试验和长期试验。长期试验温度为  $(25 \pm 2)^\circ\text{C}$ ，湿度为  $60\% \pm 10\%$ ，影响因素试验只需一批供试品，加速试验和长期试验需用 3 批。

18. D. 采用难溶性载体材料可达到缓释作用，水溶性载体无此效果。

19. D. 化学法制备微囊的方法有辐射交联法和界面缩聚法。

20. C. 主要在胃、小肠吸收的药物，服用间隔设计为 12h；若在大肠也有一定吸收，间隔设计为 24h。

21. D. TTS 的不足之处为存在皮肤的代谢与储库作用。

22. B. 化学交联固化法不是脂质体的制备方法。

23. B. 大多数药物穿过生物膜的扩散转运是被动扩散，故与吸收部位浓度差成正比。

24. E. 测定药动学参数是体内行为的测定，不是物理化学的方法。

25. B. 舌下片剂的给药途径属于黏膜给药。

26. B. 滴眼剂的给药途径属于黏膜给药。

27. B. 微晶纤维素可作为粉末直接压片“干黏合剂”使用的辅料。

28. D. 糖粉黏合力强、可用于增加片剂的硬度，但吸湿性较强。

29. B. 湿物料中的水分不断气化并向热空气中移动的过程属于传质过程。

30. C. 利用热能除去湿物料中水分或其他溶剂的过程属于干燥过程。

31. A. 普通压制片崩解时限为 15min。

32. C. 糖衣片崩解时限为 60min。

33. E. 胶体磨为湿法粉碎机，物料在对接在一起的定子和转子间的缝隙中受剪切力作用而被粉碎。常用于混悬剂与乳剂等分散系的粉碎。

34. B. 气流式粉碎机具有焦耳-汤姆逊冷却效应，适用于热敏性物料的粉碎。

35. B. 颗粒剂需进行溶化性检查。

36. C. 片剂、胶囊剂须进行崩解时限检查。

37. B. 颗粒剂干燥失重不超过 2.0%。

38. C. 软膏基质的保湿剂常用甘油、丙二醇、山梨醇。

39. A. 软膏基质的乳化剂常用有机皂类、月桂醇硫酸钠、聚山梨酯类等。

40. D. 软膏基质的防腐剂常用尼泊金类、山梨酸。

41. B. 硫柳汞为抑菌剂。

42. A. 氯化钠为渗透调节剂。

43. D. 聚山梨酯 80 为混悬型注射液的润湿剂。

44. C. 羧甲基纤维素钠为混悬型注射液的助悬剂。

45. B. 溶胶剂是固体药物以 1~100nm 微细粒子分散在水中形成的非均匀液体分散体系。

46. C. 芳香水剂是芳香挥发性药物的饱和或近饱和的水溶液。

47. A. 糖浆剂是药物或芳香物质的浓蔗糖水溶液。

48. E. 溶液剂是低分子药物溶解于溶剂中所形成的澄明液体制剂。

49. C. 洗剂是专供涂抹、敷于皮肤的外用液体制剂。

50. E. 涂剂是用纱布、棉花蘸取后涂搽皮肤或口、喉部黏膜的液体制剂。

51. D. 搽剂是专供揉搽皮肤表面用的液体制剂。

52. B. 溶剂介电常数对药物降解反应的影响方程式： $\log k = \log k_{\infty} - kZ_A Z_B / \epsilon$ 。

53. C. 专属酸催化对降解速度常数影响的方程式： $\log k = \log k_H^+ - pH$ 。

54. D. 离子强度对药物降解反应影响的方程式： $\log k = \log k_0 + 1.02 Z_A Z_B \mu^{1/2}$ 。

55. A. 温度对药物降解反应影响的方程式： $k = Ae^{-E/RT}$ 。

56. C. 常见环糊精有  $\alpha$ -环糊精、 $\beta$ -环糊精和  $\gamma$ -环糊精，分别由 6、7、8 个葡萄糖分子形成的环状低聚糖化合物。

57. E.  $\beta$ -环糊精最常用, 已被《中国药典》收载。

58. D. 疏水性环糊精衍生物有乙基- $\beta$ -环糊精衍生物。

59. B. 水溶性环糊精衍生物有甲基- $\beta$ -环糊精。

60. A. 常用水溶性载体材料有聚乙二醇(PEG)类、聚维酮(PVP)类、表面活性剂类、有机酸类、糖类与醇类。

61. C. 肠溶性载体材料包括纤维素类(如 CAP、HPMCP、CMC)、聚丙烯酸树脂(国产的 II 号和 III 号, Eudragit L 型、S 型)类。

62. B. 缓控释制剂的亲水凝胶型骨架材料常用羟丙甲纤维素、海藻酸钠、羧甲基纤维素钠等。

63. A. 缓控释制剂的溶蚀性骨架材料常用硬脂酸、硬脂醇、单硬脂酸甘油酯等。

64. C. 缓控释制剂的不溶性骨架材料常用聚乙烯、聚氯乙烯、乙基纤维素等。

65. D. 吸收是药物从给药部位向循环系统转运的过程。

66. A. 肠肝循环指在胆汁中排出的药物或代谢物, 在小肠中转运期间重新吸收返回门静脉的现象。

67. E. 分布是药物从循环系统运送至体内各脏器组织中的过程。

68. D.

69. A.

70. C. 单室模型常用药物动力学公式。

71. E. 给予碳酸氢钠可抑制巴比妥的重吸收, 有利于排泄。

72. A. 吗啡与阿托品联合使用是利用药物间的拮抗作用, 克服药物的不良反应。

73. DE. HPC、HPMC、PVP 均为黏合剂。

74. BCD. 硬胶囊壳主要组成为明胶, 不宜装吸湿性强的药物、易溶性的刺激性药物、药物水溶液或乙醇溶液。

75. BCDE. 栓剂塞入距肛门 2cm 处吸收最好, 可有 50%~75% 的药物不经肝门系统而避免首关作用。

76. ABCE. 膜剂成膜材料用量小。

77. BCDE. 热原可由注射用水、原辅料、容器与设备、制备过程及生产环境带入。

78. ACD. 静脉注射脂肪乳的乳化剂要求较高, 目前常用的有豆磷脂, 卵磷脂和普朗尼克 F68。

79. ADE. D 值系指一定温度下, 将微生物杀灭 90% 所需的时间, D 值大, 说明该微生物耐热性强。

80. CDE. 粒径、搅拌速度是影响溶出速度的因素。

81. BDE. 混悬剂中稳定剂有助悬剂、润湿剂和絮凝剂和反絮凝剂。

82. ABCE. 无限溶胀过程, 常需加以搅拌或加热等步骤才能完成。

83. ABC. 相分离-凝聚法为制备微囊的方法之一; 重结晶法为制备包合物的方法之一。

84. ACD. 微粉硅胶、乳糖可作为片剂的填充剂。

## 药物化学部分

85. B. 硫喷妥钠为异戊巴比妥 2 位氧原子以硫替换得到的药物, 由于硫原子的引入使得药物脂溶性增大, 易通过血-脑屏障, 作用快。但硫易被代谢, 失效也快, 为超短时作用的巴比妥类药物。

86. A. 胺碘酮为甲状腺素类似物, 其结构如下。



87. D. 选项中的手性药物只有 2 个,

氧氟沙星有效的对映体为左旋, 萘普生结构中羧基  $\alpha$  位为手性碳, 临床使用 S- (+) 体, 即右旋体。

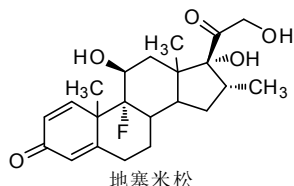
88. D. 镇痛药中氨基酮类及其类似物的代表性药物大纲只要求了 2 个药物, 即盐酸美沙酮、右丙氧芬。

89. B. 乙酰半胱氨酸是半胱氨酸的氨基乙酰化衍生物, 临床有两种重要用途, 即黏液溶解药及用于对乙酰氨基酚过量的解毒。

90. B. 他汀类药物属于羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑制药类降血脂药, 结构中重要的结构特点为含有 3,5-二羟基羧酸片段, 或者其形成内酯的结构片段。题干中给出的为洛伐他汀, 分子中含有氢化萘环和六元  $\delta$ -内酯环, 可竞争性抑制 HMG-CoA 还原酶。

91. B.

92. C. 醋酸地塞米松的结构式如下。



93. E. 题干给出的结构式中含有亚硝基脒结构, 属于亚硝基脒类抗肿瘤药物, 故正确选项为卡莫司汀。

94. E. 在生理 pH=7.4 时, 苯巴比妥离子态药物为 56.30%。

95. A. 异烟酸的结构为羧基处在吡啶氮原子的对位, 异烟肼与异烟酸结构相对应。所以正确选项应当是 A。

96. E. 大纲中涉及的质子泵抑制药中的手性药物只有埃索美拉唑, 为奥美拉唑的 S-构型, 已经以单一光学异构体上市。

97. B. 甲氧苄啶为磺胺类药物的增效剂, 本身不含有对氨基苯磺酰胺结构。

98. E. 在氨苄西林的侧链氨基上引入极性较大的哌嗪酮酸基团得到哌拉西林。哌拉西林对酸不稳定, 口服给药时易被胃酸破

坏且不能从胃肠道吸收。临床上用其钠盐注射给药。抗菌谱扩大, 尤其具有抗铜绿假单胞菌活性, 对铜绿假单胞菌、肺炎杆菌、变形杆菌等有较强作用。

99. B.

100. C. 维生素 C 母体为  $\gamma$ -丁内酯, 2 位有双键, 2、3、5、6 位连有 4 个羟基, 是含有 6 个碳原子的酸性多羟基化合物, 分子中有 2 个手性碳原子, 因而有 4 个光学异构体, 其中以 L- (+) -抗坏血酸活性最强。

101. C. 去甲肾上腺素重摄取抑制剂主要包括 4 种药物, 即丙米嗪、多塞平、盐酸阿米替林、瑞波西汀。其中前三个药物具有三环结构。

102. A. 氯丙嗪结构中含有吩噻嗪母核, 母核上 10 位连有二甲氨基丙基、2 位有氯原子。

103. E. 吗氯贝胺结构结构中对氯苯甲酰胺的氮原子连有乙基吗啉环。选择性和可逆性的单胺氧化酶 A (MAO-A) 抑制药。抗抑郁作用持续时间和具有可逆性。不良反应轻, 代谢快, 因此, 开始使用时需要较大剂量。

104. B. 5-羟色胺重摄取抑制药主要有盐酸氟西汀、盐酸帕罗西汀、文拉法辛、舍曲林、西酞普兰、艾司西酞普兰、氟伏沙明等。

105. B. 痛风又称“高尿酸血症”, 是由于体内嘌呤代谢紊乱或尿酸排泄减少而引起的一类疾病。根据作用机制可将抗痛风药分为: ①控制尿酸盐对关节造成的炎症的药物, 如秋水仙碱; ②增加尿酸排泄速率的药物, 如丙磺舒、苯溴马隆; ③通过抑制黄嘌呤氧化酶来抑制尿酸生成的药物, 如别嘌醇、非布索坦。

106. C. 选择性 COX-2 抑制药能避免对胃肠道的刺激, 降低药物不良反应。代表药物有塞来昔布、帕瑞昔布。

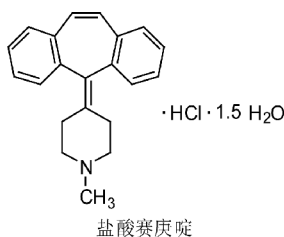
107. D. 布洛芬结构中的羧基  $\alpha$  位为手

性碳, S- (+) 异构体有活性, R- (-) 异构体无活性。由于在体内 R- (-) 可转化为 S- (+) 异构体, 因此不必拆分, 临床使用外消旋体。

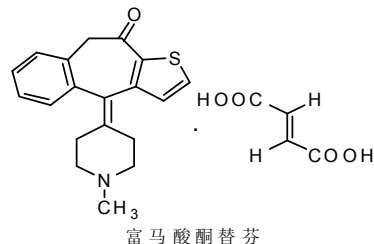
108. E. 蔡丁美酮为非酸性前药, 口服后在十二指肠吸收, 经肝代谢为 6-甲氧基-2-蔡乙酸后产生活性, 对 COX-2 有选择性抑制作用, 对胃肠道 COX-1 无作用, 无一般非甾体消炎药的胃肠道不良反应。

109. D.  $H^+$ ,  $K^+$ -ATP 酶抑制药的药名都含有“拉唑”的后缀。

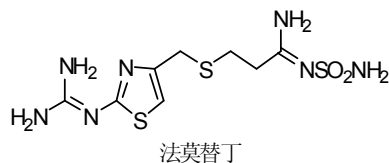
110. A. 赛庚啶结构如下。



111. B. 富马酸酮替芬的结构如下。



112. E. 法莫替丁的结构如下。



113. C. 马来酸氯苯那敏(又称扑尔敏), 适用于皮肤过敏症, 如荨麻疹、湿疹、皮炎、药疹、皮肤瘙痒症、神经性皮炎、虫咬症、日光性皮炎, 也可用于过敏性鼻炎、血管舒缩性鼻炎、药物及食物过敏。

114. B. 本题考查非经典的  $\beta$ -内酰胺类抗生素的分类及代表药物。

115. D.  $\beta$ -内酰胺酶抑制剂的结构类型有青霉烷类(代表药物克拉维酸钾); 青霉烷砜类(代表药物有舒巴坦钠、他唑巴坦)。

116. C.  $\beta$ -内酰胺酶抑制药的结构类型有青霉烷类(代表药物克拉维酸钾); 青霉烷砜类(代表药物有舒巴坦钠、他唑巴坦)。

117. A. 左氧氟沙星结构中含有 1 个手性中心, 其中其左旋体的活性要好于右旋体。

118. B. 盐酸乙胺丁醇含有 2 个手性碳, 由于分子有对称性, 实际仅有 3 个对映异构体, 药用为 R, R 构型的右旋体。

119. D. 呋塞米结构中含有呋喃环。呋塞米具有酸性, 可形成钠盐溶于水。呋塞米可促进氯化钠的排泄作用, 作用时间较短, 具有温和的降压作用。

120. B. 氢氯噻嗪的分子中含有苯并噻嗪母核、2 个磺酰胺基本品固体状态时, 在室温下稳定; 水溶液时可发生水解反应, 生成开环的 4-氯-6-氨基-1,3-苯二磺酰胺和甲醛。本品母核 1 位磺酰基的强吸电作用使 2 位氮原子上的氢具酸性, 因此, 本品可形成钠盐。本品在碱性条件下易水解失活, 故不宜与碱性药物配伍。口服吸收良好, 在体内不代谢降解, 以原型排泄。本品可用于治疗水肿性疾病、高血压、中枢性或肾性尿崩症、肾石症, 主要用于预防含钙盐成分形成的结石。长期大量使用本品时, 应注意补钾。

121. E. 螺内酯分子中含有甾体母环、乙酰巯基、内酯环。本品在肝内脱去乙酰巯基, 代谢为有活性的坎利酮, 可进一步代谢为无活性的坎利酮酸。螺内酯为醛固酮拮抗药。可用于: ①水肿性疾病, 常与其他利尿药合用, 如与氢氯噻嗪合用(螺内酯作用慢、弱、持久, 氢氯噻嗪作用较快、较强; 螺内酯有保钾作用, 氢氯噻嗪有缺钾的不良反应; 两者合用能够增加疗效, 降低不良反应)。②高血压治疗的辅助用药。③原发性醛固酮增多症。④低钾血症的预防。

122. E.