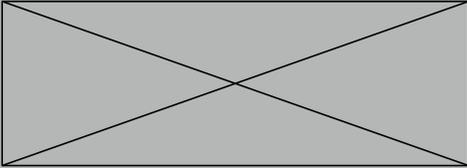
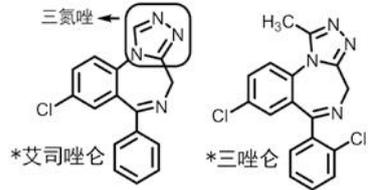
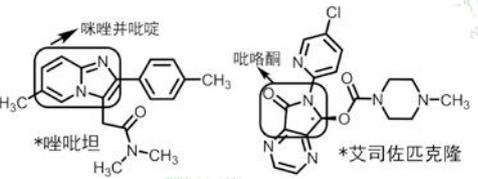
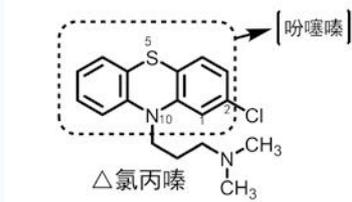
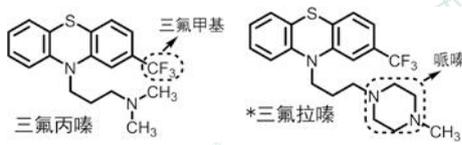
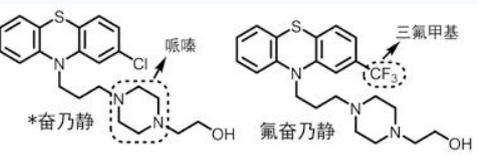


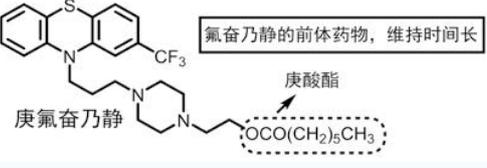
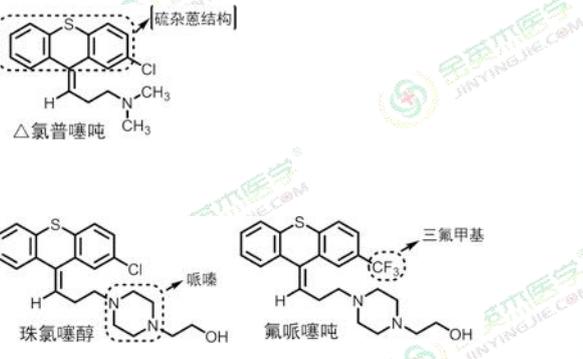
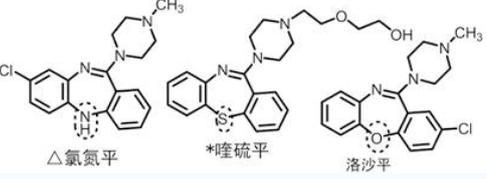
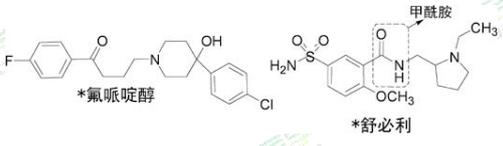
药专业知识一

考点一 镇静与催眠药

<p>1. 苯二氮草类: 地西洋★ (1) 3 位引入羟基 (-OH): 增加极性, 易于排泄; 保持活性, 降低毒性</p>	 <p>△地西洋 奥沙西洋 奥沙西洋是地西洋的活性代谢物</p>
<p>(2) 7 位引入吸电子基团: 脂溶性高、活性增强 $\text{NO}_2 > \text{Br} > \text{CF}_3 > \text{Cl}$</p>	
<p>(3) 1,2 位并上三氮唑: 代谢稳定性增加, 受体亲和力 / 脂溶性 / 活性增加 代表药: 艾司唑仑、三唑仑 (第一类精神药品) 等 XX 唑仑</p>	 <p>*艾司唑仑 *三唑仑</p>
<p>2. 非苯二氮草类 (1) 咪唑坦: 咪唑并吡啶 (2) 艾司佐匹克隆: 短效 (3) 扎来普隆: 吡啶并咪唑 (无精神依赖性和后遗效应)</p>	 <p>*咪唑坦 咪唑并吡啶 吡咯酮 *艾司佐匹克隆</p>

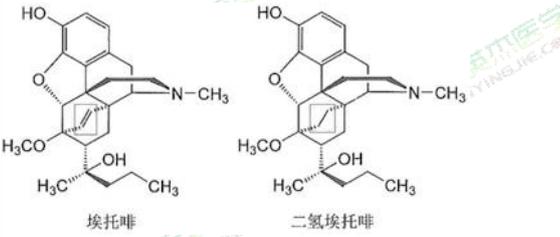
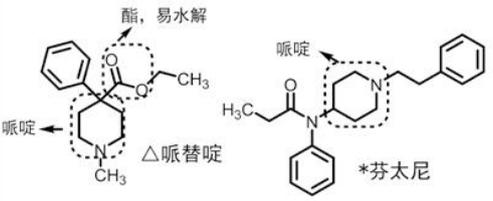
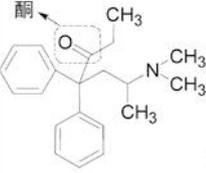
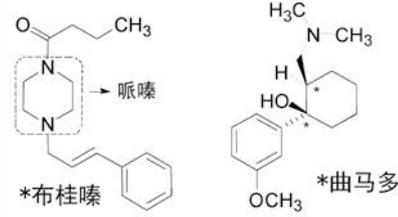
考点二 抗精神病药

<p>1. 吩噻嗪类: 氯丙嗪 (锥体外系、光毒性、吩噻嗪母核易氧化) ★</p>	 <p>△氯丙嗪</p>
<p>(1) 2 位取代基: 引入吸电子基团, 增强活性 $\text{CF}_3 > \text{Cl} > \text{COCH}_3 > \text{H} > \text{OH}$</p>	 <p>三氟丙嗪 三氟甲基 *三氟拉嗪 哌嗪</p>
<p>(2) 10 位: 哌嗪取代的侧链作用最强代表</p>	 <p>*奋乃静 哌嗪 三氟甲基 氟奋乃静</p>

<p>药：奋乃静、氟奋乃静、庚氟奋乃静（前药），氟奋乃静癸酸酯（前药）</p>	
<p>2. 硫杂蒽类（噻吨） 顺式（Z 型）> 反式（E 型）； 活性：氟哌噻吨 > 珠氯噻醇 > 氯普噻吨</p>	
<p>3. 二苯并二氮草类（氯氮平、奥氮平） 4. 二苯并硫氮草类（喹硫平） 5. 二苯并氧氮草类（洛沙平、阿莫沙平）</p>	
<p>6. 非经典抗精神病药★ 拼合原理设计</p>	<p>齐拉西酮、利培酮（活性代谢物 - 帕利哌酮）</p>
<p>7. 非三环类</p>	<p>(1) 丁酰苯类药物：抗精神病作用强，氟哌啶醇、三氟哌多、氟哌利多 (2) 苯甲酰胺类药物：作用强副作用小；舒必利、硫必利、瑞莫必利</p>
	

考点三 抗抑郁药（代谢和分类总结）

<p>1. 大部分：N- 去甲基，代谢物有活性★</p>	<p>NE 重摄取抑制剂：丙米嗪、氯米帕明、阿米替林、多塞平 选择性 5-HT 重摄取抑制剂：氟西汀、西酞普兰、舍曲林 双重：度洛西汀、米氮平、文拉法辛（N-去甲基~没活性）</p>
<p>2.O- 去甲基</p>	<p>文拉法辛（O- 去甲文拉法辛也有双重机制） 氟伏沙明（O- 去甲基代谢物没有活性）</p>
<p>3. 不发生去烷基代谢★</p>	<p>帕罗西汀（5-HT 重摄取抑制剂） 吗氯贝胺、托洛沙酮（单胺氧化酶 MAO 抑制剂）</p>

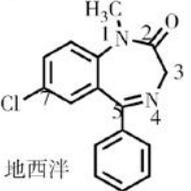
<p>痛</p>	 <p>埃托啡 二氢埃托啡</p>
<p>2. 哌啶类合成镇痛药 (4- 苯基哌啶)</p> <p>(1) 哌替啶: 体内被酯酶水解→哌替啶酸 (失活)</p> <p>(2) 芬太尼、阿芬太尼、舒芬太尼、瑞芬太尼 (前药)</p>	 <p>哌啶 哌啶 酯, 易水解 哌啶 哌替啶 *芬太尼</p>
<p>3. 氨基酮类: 美沙酮</p> <p>成瘾性小, 戒断症状轻, 是戒除海洛因成瘾的替代治疗的药物</p>	 <p>△美沙酮</p>
<p>4. 其他镇痛药</p> <p>(1) 布桂嗪 (阿片受体激动 - 拮抗剂)</p> <p>(2) 曲马多 (弱的 μ 阿片受体激动剂; NE 和 5-HT 双重重摄取抑制作用; 结构/机制类似文拉法辛)</p>	 <p>酮 哌啶 哌啶 *布桂嗪 *曲马多</p>

第三章 常用药物的结构与作用

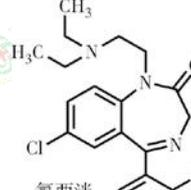
第一节 中枢神经系统疾病用药

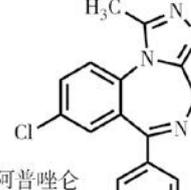
一、最佳选择题

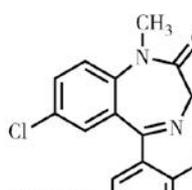
- 下列属于吡咯烷酮类药物, 且其主要镇静催眠作用来自其右旋体的是
A. 佐匹克隆 B. 唑吡坦 C. 三唑仑
D. 扎来普隆 E. 丁螺环酮
- 在苯二氮䓬结构的 1, 2 位骈合三氮唑结构, 其脂溶性增加, 易通过血脑屏障, 产生较强的镇静催眠作用的药物是

A.  地西洋

B.  奥沙西洋

C.  氟西洋

D.  阿普唑仑

E.  氟地西洋

3. 地西洋与奥沙西洋的化学结构比较，奥沙西洋的极性明显大于地西洋的原因在于

- A. 奥沙西洋的分子中存在酰胺基团
- B. 奥沙西洋的分子中存在烃基
- C. 奥沙西洋的分子中存在氟原子
- D. 奥沙西洋的分子中存在羟基
- E. 奥沙西洋的分子中存在氨基

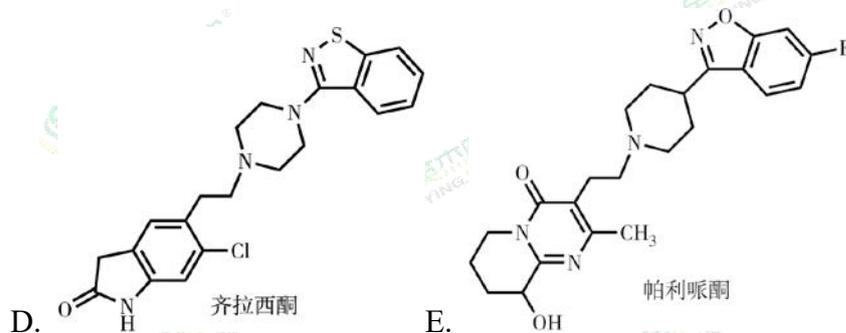
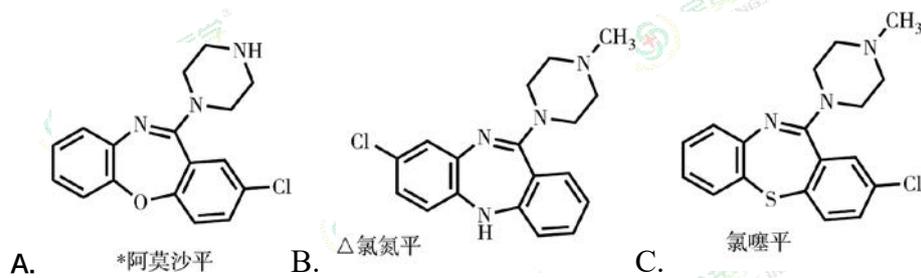
4. 地西洋的结构特征的是

- A. 吩噻嗪 B. 三环 C. 1, 4- 苯并二氮草
- D. 巴比妥 E. 二苯并氮杂萘类

5. 地西洋的活性代谢产物是



6. 抗精神病药利培酮的活性代谢产物是



7. 在 1, 4- 苯二氮草类结构的 1, 2 位上并入三唑环，生物活性明显增强，原因是

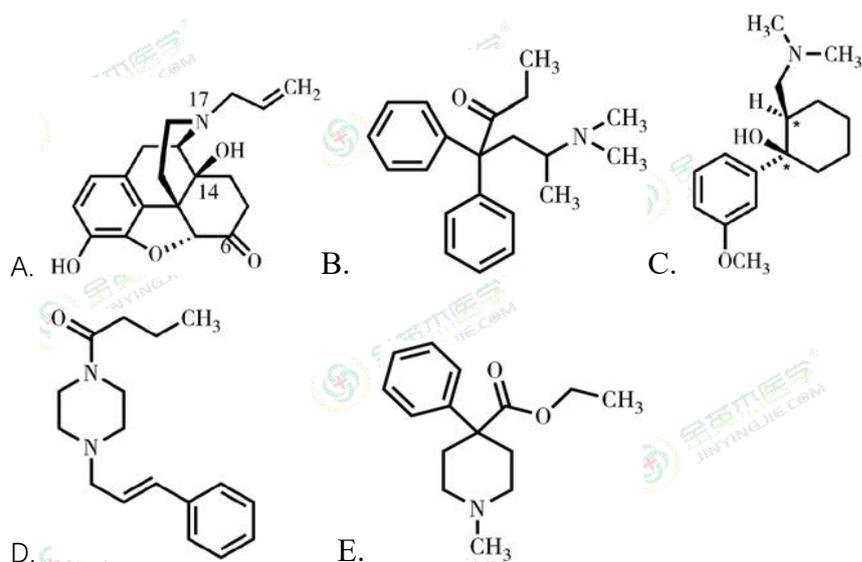
- A. 药物对代谢的稳定性增加
- B. 药物与受体的亲和力增加
- C. 药物的极性增大

- D. 药物的亲水性增大
 E. 药物对代谢的稳定性及对受体的亲和力均增大
 8. 具有咪唑并吡啶结构的药物是
 A. 地西洋 B. 异戊巴比妥 C. 唑吡坦
 D. 佐匹克隆 E. 氯丙嗪
 9. 氯丙嗪化学结构名 (选项是结构名称)
 A. 2-氯-N,N-二甲基-10H-苯并咪唑-10-丙胺
 B. 2-氯-N,N-二甲基-10H-苯并噻唑-10-丙胺
 C. 2-氯-N,N-二甲基-10H-吩噻嗪-10-丙胺
 D. 2-氯-N,N-二甲基-10H-噻嗪-10-丙胺
 E. 2-氯-N,N-二甲基-10H-哌嗪-10-丙胺
 10. 芬太尼是强效镇痛药, 其结构的特征是
 A. 含有 4- 苯基哌啶结构 B. 含有 4- 苯氨基哌啶结构 C. 含有苯吗喃结构
 D. 含有吗啡喃结构 E. 含有氨基酮结构
 11. 精神病患者在服用盐酸氯丙嗪后, 若在日光强烈照射下易发生光过敏反应, 产生光过敏反应的原因是
 A. 氯丙嗪分子中的吩噻嗪环遇光被氧化后, 与体内蛋白质发生反应
 B. 氯丙嗪分子中的硫原子遇光被氧化成亚硫, 与体内蛋白质发生反应
 C. 氯丙嗪分子中的碳-氯键遇光会分解产生自由基, 与体内蛋白质发生反应
 D. 氯丙嗪分子中的侧链碳原子遇光被氧化成羰基, 与体内蛋白质发生反应
 E. 氯丙嗪分子中的侧链氮原子遇光被氧化成 N 氧化物, 与体内蛋白质发生反应
 12. 下列哪项构效关系与吩噻嗪类抗精神失常药不符
 A. 氯丙嗪的 2- 位氯用乙酰基取代, 作用增强, 毒性降低
 B. 以三氟甲基取代氯丙嗪的 2- 位氯, 抗精神失常作用增强
 C. 侧链的二甲胺基用碱性杂环取代, 以哌嗪衍生物最好
 D. 氯丙嗪的吩噻嗪母核中的氮原子以碳原子置换再通过双键与侧链相连镇静作用增强
 E. 以乙撑基置换吩噻嗪母核中的硫原子仍有抗精神失常作用
 13. 下列关于药物代谢, 说法错误的是
 A. 舍曲林含两个手性中心, 目前使用的是 S, S- (+) 构型异构体
 B. 氟西汀在体内代谢生成去甲氟西汀, 去甲氟西汀的 $t_{1/2}$ 为 330 小时
 C. 文拉法辛代谢为去甲基文拉法辛, 代谢产物没有活性
 D. 艾司西酞普兰的抗抑郁活性为西酞普兰的 2 倍, 是 R 对映体活性的至少 27 倍
 E. 帕罗西汀包含两个手性中心, 目前使用的是 (3S, 4R) - (-) - 异构体
 14. 下列不属于选择性 5- 羟色胺重摄取抑制剂的是
 A. 氟西汀 B. 阿米替林 C. 舍曲林
 D. 帕罗西汀 E. 西酞普兰
 15. 阿米替林的结构属于



- A. 二苯并氮茛类
 D. 二苯并哌嗪类 B. 苯二氮茛类

- E. 二苯并 嗪类 C. 二苯并庚二烯类
16. 吗啡易被氧化变色是由于分子结构中含有以下哪种基团
 A. 醇羟基 B. 双键 C. 醚键
 D. 哌啶环 E. 酚羟基
17. 纳洛酮结构中 17 位氮原子上的取代基是
 A. 甲基 B. 乙基 C. 烯丙基
 D. 环丙基 E. 乙烯基
18. 属于哌啶类合成镇痛药的是



19. 下列药物中属于氨基酮类的合成镇痛药是
 A. 纳曲酮 B. 美沙酮 C. 氢吗啡酮
 D. 纳洛酮 E. 羟吗啡酮
20. 奋乃静在空气中或日光下放置渐变红色，分子中不稳定的结构部分为
 A. 羟基 B. 哌嗪环 C. 侧链部分
 D. 苯环 E. 吩噻嗪环

【参考答案】

1	2	3	4	5	6	7	8	9	10
A	D	D	C	B	E	E	C	C	B
11	12	13	14	15	16	17	18	19	20
C	A	C	B	C	E	C	E	B	E