

中山大学

二00六年攻读硕士学位研究生入学考试试题

科目代码: 810

科目名称: 药物化学

考试时间: 1月15日下午

考生须知

全部答案一律写在答题纸上,
答在试题纸上的不得分! 请用
蓝、黑色墨水笔或圆珠笔作答。
答题要写清题号, 不必抄题。

一、单选题 (每题1分, 共30分)

- 下列哪条内容与前药设计目的不符
A. 延长药物的作用时间 B. 提高药物的活性 C. 提高药物的脂溶性
D. 降低药物的毒副作用 E. 提高药物的组织选择性
- 吗啡、合成镇痛药及脑啡肽均具有镇痛作用, 因为
A. 化学结构具有很大的相似性 B. 具有相似的疏水性 C. 具有相同的构型
D. 具有相同的基本结构 E. 具有相似的药效构象
- 下列哪条性质与 Procaine Hydrochloride 不符
A. 在水中易溶, 在乙醇中略溶, 在氯仿中微溶
B. 经重氮化反应后与碱性β-萘酚偶合生成猩红色沉淀
C. 水溶液中加入碘化汞钾试液可产生沉淀
D. 水溶液经 Na_2CO_3 中和后加入苦味酸试液可产生沉淀
E. 其水溶液在酸性中稳定, 在碱性中易水解
- 洛伐他汀主要用于治疗
A. 高甘油三酯症 B. 高胆固醇血症 C. 心绞痛
D. 高磷脂血症 E. 心率失常
- 下列不属于抗代谢抗肿瘤药物的是
A. 四氢叶酸 B. 5-氟尿嘧啶 C. 甲氨蝶呤 D. 巯嘌呤 E. 阿糖胞苷
- 用F原子置换尿嘧啶5位上的H原子, 其设计思想是
A. 生物电子等排置换 B. 供电子效应 C. 改变空间位阻
D. 增加反应活性 E. 改变药物的理化性质, 有利于进入肿瘤细胞
- 芳基丙酸类药物最主要的临床作用是
A. 中枢兴奋 B. 抗癫痫 C. 降血脂 D. 抗病毒 E. 消炎镇痛
- 将 Testosterone 的17位羟基丙酸酯化得到丙酸睾酮, 其设计的主要目的是
A. 提高药物的生物利用度 B. 增加药物的稳定性 C. 减少毒副作用
D. 使药物具有长效 E. 掩蔽药物的不适味道

9. 红霉素属于哪一类抗生素

- A. β -内酰胺类 B. 氨基糖苷类 C. 大环内酯类 D. 四环素类 E. 其它类

10. 诺氟沙星属于哪一种结构类型

- A. 萘啶羧酸类 B. 喹啉羧酸类 C. 吡啶并嘧啶羧酸类
D. 喹啉羧酸类 E. 苯氧羧酸类

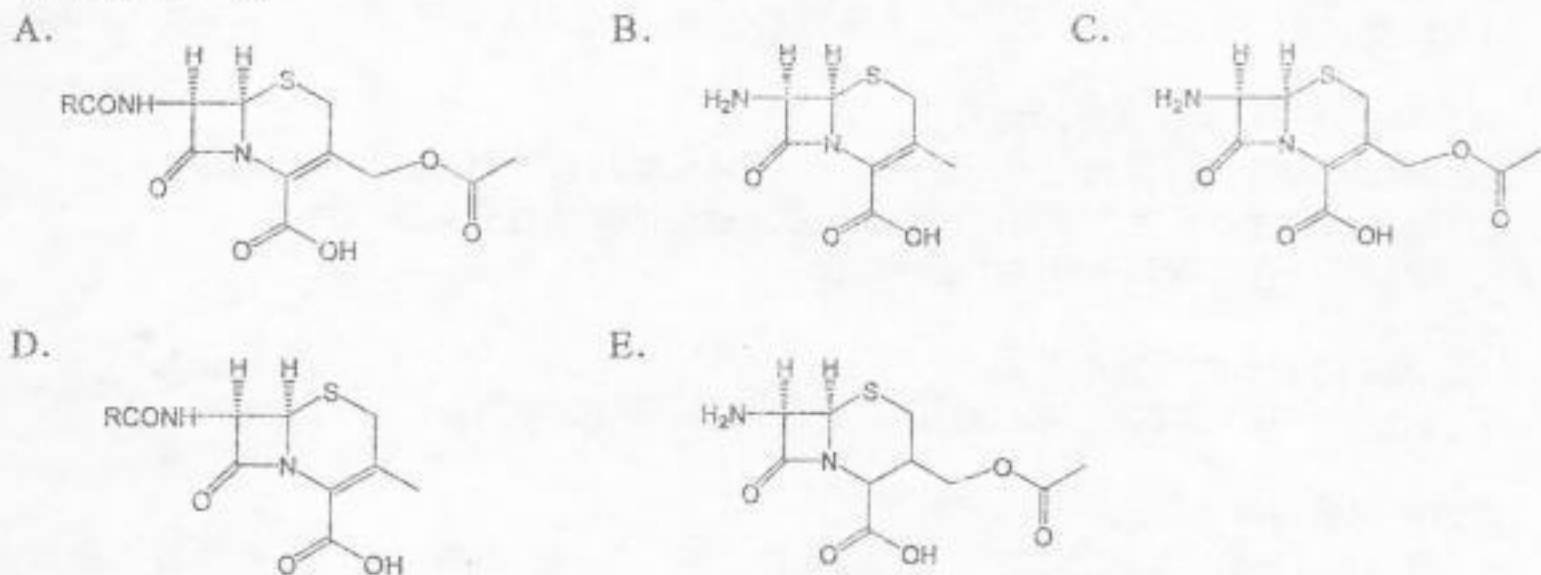
11. 盐酸雷尼替丁的结构中含有

- A. 呋喃环 B. 咪唑环 C. 噻唑环 D. 嘧啶环 E. 吡啶环

12. 下列药物中, 不是环氧化酶抑制剂的是

- A. 吲哚美辛 B. 吡罗昔康 C. 萘替芬 D. 布洛芬 E. 萘普生

13. 7-ACA 的结构是



14. 维生素 C 的哪一个光学异构体活性最高

- A. D-(+)-抗坏血酸 B. D-(-)-抗坏血酸 C. L-(-)-抗坏血酸
D. L-(+)-抗坏血酸 E. DL-抗坏血酸

15. 下列哪一种药物为抗孕激素

- A. 黄体酮 B. 丙酸睾酮 C. 炔诺酮 D. 米非司酮 E. 醛固酮

16. 下列有关磺酰脲类口服降糖药的叙述, 不正确的是

- A. 可水解生成磺酰胺类 B. 结构中的磺酰脲具有酸性
C. 第一代与第二代的体内代谢方式相同 D. 第二代苯环上磺酰基引入了较大结构的侧链
E. 第二代较第一代降糖作用更好, 副作用更小, 因而用量更少

17. 下列可用于治疗心力衰竭的药物是

- A. 奎尼丁 B. 地高辛 C. 普鲁卡因胺 D. 胍乙啶 E. 硝苯地平

18. 以下属于核苷类抗艾滋病药地是

- A. 阿昔洛韦 B. 盐酸金刚烷胺 C. 利巴韦林 D. 磷甲酸钠 E. 齐多夫定

19. 属于 Ang II 受体拮抗剂地是

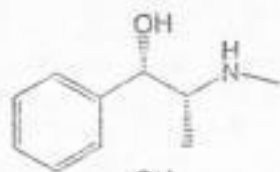
- A. 氯贝丁酯 B. 洛伐他汀 C. 夫塞米 D. 硝酸甘油 E. 氯沙坦

20. Neostigmine Bromide 是根据哪一个天然物的结构简化设计出来的

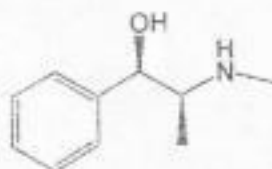
- A. 毒蕈碱 B. 毒扁豆碱 C. 茶碱 D. 毛果芸香碱 E. 筒箭毒碱

21. 临床用药(-)-麻黄碱的结构为

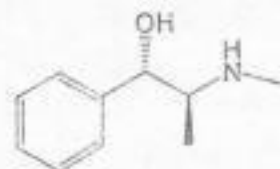
A.



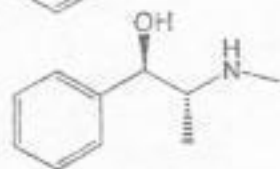
B.



C.



D.



E. 上述四种的混合物

22. 盐酸氯丙嗪在体内代谢中一般不进行的反应类型为

- A. N-氧化 B. S-氧化 C. 苯环羟基化 D. 脱氯原子 E. 侧链去 N-甲基

23. 药物的亲脂性与生物活性的关系是

- A. 降低亲脂性, 可使作用时间延长 B. 降低亲脂性, 可使作用时间缩短
C. 增加亲脂性, 可使作用时间缩短 D. 适当的亲脂性有最佳活性
E. 增加亲脂性, 有利于吸收, 活性增加

24. 可使药物的亲水性增加的基团是

- A. 卤素 B. 苯基 C. 羟基 D. 酯基 E. 烷基

25. 通过研究药物体内代谢产物得到的新药是

- A. 紫杉醇 B. 氨卞西林 C. 西咪替丁 D. 奥沙西洋 E. 异丙肾上腺素

26. 下列哪个不是 QSAR 常用的参数

- A. 原子参数 B. 结构参数 C. 立体参数 D. 疏水性参数 E. 电性参数

27. 下列哪个说法不正确

- A. 弱酸性药物在胃中易被吸收 B. 弱碱性药物在肠中易被吸收
C. 离子状态的药物易透过生物膜 D. 分子状态的药物易透过生物膜
E. 口服药物的吸收情况与所处的介质的 pH 有关

28. β -内酰胺类抗生素的作用机制是

- A. 干扰核酸的复制和转录 B. 影响细胞膜的渗透性
C. 为二氢叶酸还原酶抑制剂 D. 干扰细菌蛋白质的合成
E. 抑制粘肽转肽酶的活性, 阻止细胞壁的合成

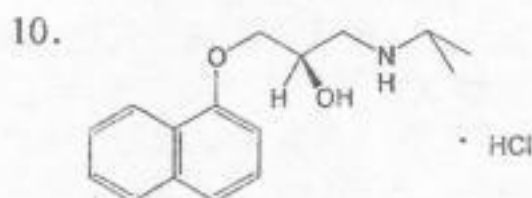
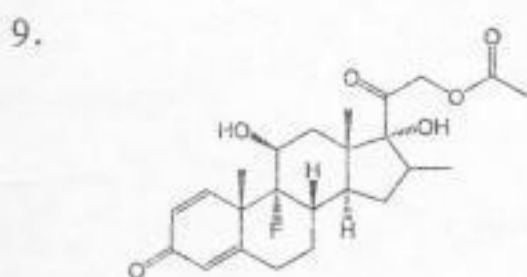
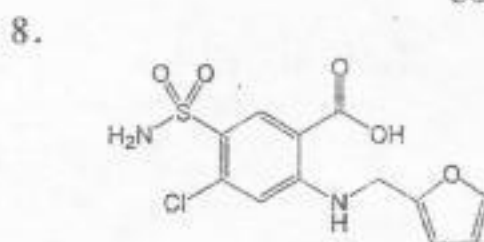
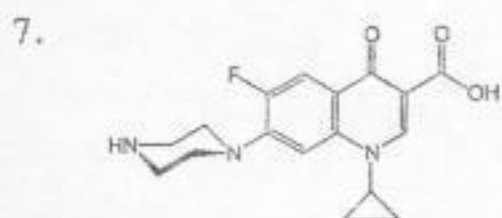
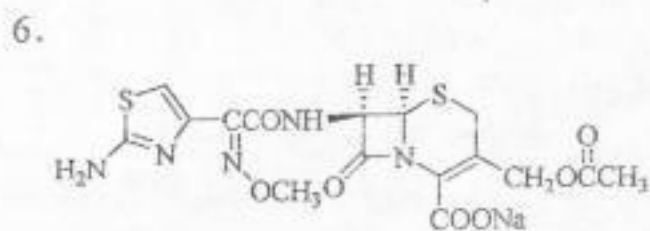
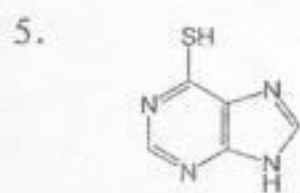
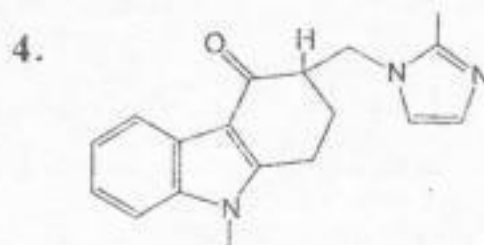
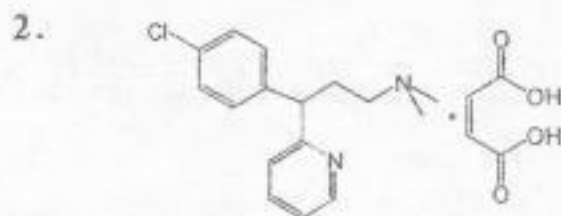
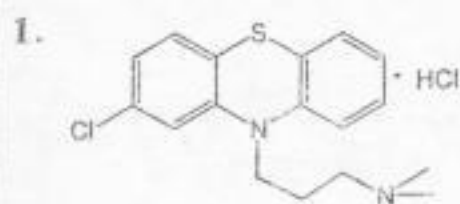
29. 下列哪一条不能用于鉴别吗啡

- A. 其水溶液加三氯化铁试液显蓝色 B. 其水溶液加甲醛硫酸试液显蓝紫色
C. 其水溶液加钼酸铵硫酸试液显紫色, 继变蓝色, 最后变为棕色
D. 其稀硫酸溶液加入碘化钾试液显棕色, 再加氨水, 则颜色转深, 几至黑色
E. 其水溶液加硫酸铜试液有蓝灰色沉淀生成

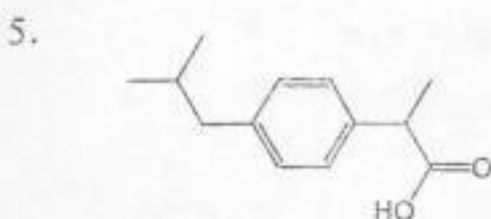
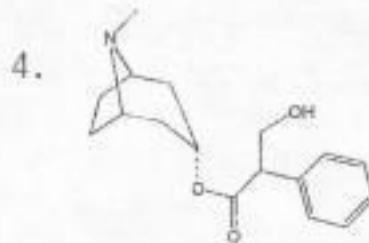
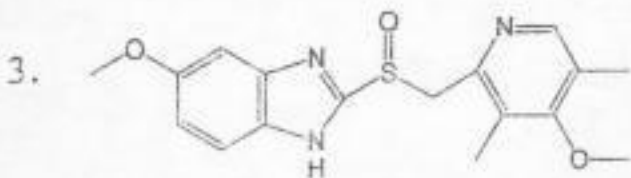
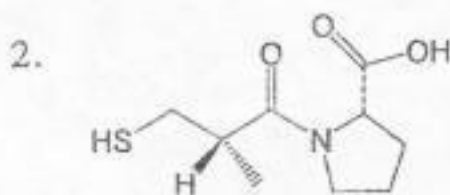
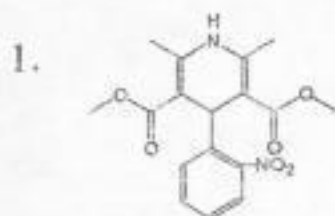
30. 奎尼丁具有抗疟疾活性, 还为

- A. 抗血吸虫药 B. 抗心律不齐药 C. 抗心绞痛药 D. 强心药 E. 抗高血压药

二、写出下列药物的通用名（中英文均可），并指出其主要用途（每题 3 分，共 30 分）

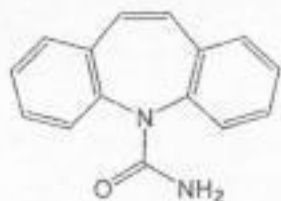


三、指出下列药物的作用靶点（每题 2 分，共 10 分）

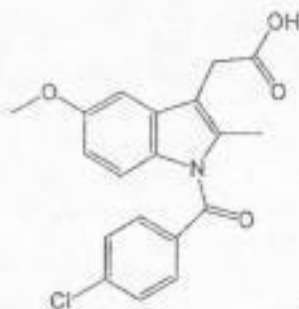


四、写出下列药物的化学名（中英文均可）（每题 5 分，共 20 分）

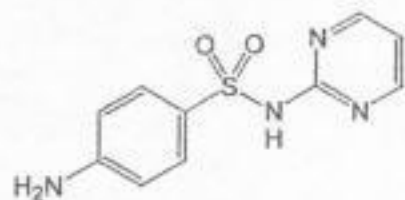
1.



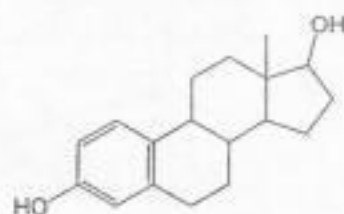
2.



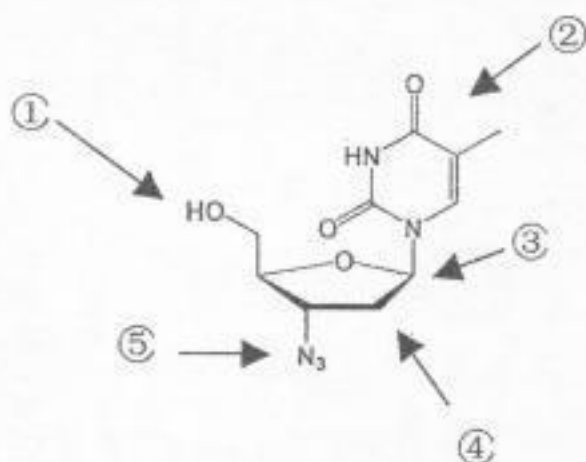
3.



4.



五、试指出以 Zidovudine 为代表的核苷类逆转录酶抑制剂（NRTIs）分子结构中箭头所指基团的结构与抗 HIV 病毒活性的关系（20 分）



六、问答题（每题 8 分，共 40 分）

1. 什么是前药？举例说明前药设计的目的与方法（3 例以上）。
2. 从药物的候选化合物到新药上市需经过哪几个阶段，主要需进行哪些研究工作？你认为在新药开发工作中应注意哪些问题？
3. 耐酶青霉素为什么能耐酶？
4. 欲提高氮芥的选择性和疗效，降低毒性，可采取哪些途径？
5. 药物与内源性物质结合是指什么？