

世

球

二〇〇八年硕士研究生入学考试业务课试卷

科目代码: 811 名称: 药物化学 适用专业或方向: 药物化学专业

(必须在答题纸上答题, 在试卷上答题无效, 答题纸可向监考老师索要)

一、单选题 (请把正确的答案填在括号内, 每题1分, 共15分)

- 1、下列哪一项不能用药物的化学修饰方法来解决 ()
 - A. 提高药物的选择性
 - B. 提高药物的稳定性
 - C. 改善药物的吸收
 - D. 改变药物的作用类型
 - E. 延长药物的作用时间
- 2、下列有关手性药物的描述不正确的是 ()
 - A. 甲氨蝶呤主要经被动扩散而吸收, 所以其 L-和 D-异构体吸收的速率和数量是相同的。
 - B. 血浆主要结合蛋白为白蛋白和 α_1 酸性糖蛋白。前者主要与酸性药物结合, 而后者主要与碱性药物结合。
 - C. 若手性药物的手性中心距离代谢反应位点较远, 则代谢转化的立体选择性较低。
 - D. 2-芳基丙酸类非甾体抗炎药 S 和 R 型异构体对环氧合酶的体外抑制活性差别很大, 但在体内的活性差异却很小。这是因为在体内发生了单向的手性代谢转化, 由低活性的 R 构型转变成 S 构型。
- 3、下列概念正确的是 ()
 - A. 先导化合物是具有某种生物活性的合成前体。
 - B. 将两个相同的或不同的先导物或药物组合成新的分子, 称作孪药。
 - C. 外围电子数目相同或排列相似, 具有相同生物活性或拮抗生物活性的原子、基团或部分结构, 即为经典生物电子等排体。
 - D. 软药是指一类本身有治疗效用或生物活性的化学实体, 当在体内起作用后, 转变成无活性和无毒性的化合物。
- 4、有机磷杀虫剂中毒是由于 ()
 - A. 使乙酰胆碱酯酶老化
 - B. 使乙酰胆碱水解

C. 使乙酰胆碱磷酸化 D. 使乙酰胆碱酯酶磷酸化

5、维生素C有酸性,是因为其化学结构上有()

A. 羰基 B. 无机酸根 C. 酸羟基 D. 共轭系统 E. 连二烯醇

6、磺胺类药物的抑菌作用,是由于它能与细菌生长所必须的()产生竞争作用,干扰了细菌的正常生长

A. 苯甲酸 B. 苯甲醛 C. 邻苯基苯甲酸
D. 对硝基苯甲酸 E. 对氨基苯甲酸

7、以下哪个不符合异烟肼的描述()

A. 是抗结核药
B. 是用3-甲基吡啶为起始原料合成的
C. 易和金属离子形成络合物
D. 在酸性和碱性条件下均易水解,失去活性

8、以下哪个是阿片类镇痛药中毒的解救药()

A. 芬太尼 B. 埃托啡 C. 纳曲酮 D. 哌替啶

9、抗高血压药福辛普利(Fosinopril)前药的特点是()

A. 磷酸化物 B. 磷化物 C. 增加水溶性 D. 磷酸酯

10、雷洛昔芬是()

A. 雌激素 B. SERMs C. H_2 受体拮抗剂 D. 抗过敏药

11、抗肿瘤药物卡莫司汀属于()

A. 亚硝基脲类烷化剂 B. 氮芥类烷化剂 C. 嘧啶类抗代谢物
D. 嘌呤类抗代谢物 E. 叶酸类抗代谢物

12、奥美拉唑的临床应用是()

A. 解热镇痛 B. 抗癫痫 C. 降血脂 D. 止吐 E. 抗溃疡

13、四环素在碱性溶液中会发生哪种变化()

A. 分解为三环化合物 B. C环芳构化 C. 生成表四环素
D. C环破裂, 成内酯 E. B环脱水

14、头孢噻肟合成的一个主要原料是()

A. 6APA B. 6ACA C. 7ACA D. 双烯 E. 7ADCA

15、哪一个药物使用的是前药()

A. 西咪替丁 B. 布洛芬 C. 氨苄西林 D. 奥美拉唑 E. 利多卡因

二、多项选择题(在每小题的五个备选答案中,选出二至五个正确的答案,并将正确答案的序号分别填在题干的括号内,多选、少选、错选均不得分。每小题2分,共24分)

1、从药物化学角度,新药设计主要包括()

- A. 先导化合物的发现和设计
- B. 先导化合物的结构优化
- C. 先导化合物的结构修饰
- D. 计算机辅助分子设计
- E. 剂型与剂量的设计

2、下列药物中,哪些药物是半合成红霉素衍生物()

- A. 阿齐霉素
- B. 克拉霉素
- C. 甲砒霉素
- D. 泰利霉素
- E. 柔红霉素

3、下列药物中,哪些可以口服给药()

- A. 琥乙红霉素
- B. 阿米卡星
- C. 阿莫西林
- D. 头孢噻肟
- E. 头孢克洛

4、下述性质中哪些符合阿莫西林()

- A. 为广谱的半合成抗生素
- B. 口服吸收良好
- C. 对 β -内酰胺酶稳定
- D. 易溶于水,临床用其注射剂
- E. 室温放置会发生分子间的聚合反应

5、青霉素钠具有下列哪些性质()

- A. 遇碱 β -内酰胺环破裂
- B. 有严重的过敏反应
- C. 在酸性介质中稳定
- D. 6位上具有 α -氨基苄基侧链
- E. 对革兰氏阳性菌和革兰氏阴性菌都有效

6、红霉素符合下列哪些性质()

- A. 为大环内酯类抗生素
- B. 为两性化合物
- C. 结构中有五个羟基
- D. 在水中的溶解度较大
- E. 对耐药的金黄色葡萄球菌有效

7、下列哪些药物是通过抑制细菌细胞壁的合成而产生抗菌活性的()

- A. 青霉素钠
- B. 氯霉素
- C. 头孢羟氨苄
- D. 泰利霉素
- E. 氨基糖苷

8、氯霉素具有下列哪些性质()

- A. 化学结构中含有两个手性碳原子,临床用1R,2S(+)型异构体
- B. 对热稳定,在强酸、强碱条件下可发生水解
- C. 结构中含有甲磺酰基
- D. 主要用于伤寒,斑疹伤寒,副伤寒等
- E. 长期多次应用可引起骨髓造血系统损伤,产生再生障碍性贫血

9、模型化合物的发掘方法有()

- A. 意外获得 B. 由天然产物中获得 C. 在生命基础过程研究中发现
D. 在药物代谢中发现 E. 由受体模式推测

10、常用于结构修饰的方法有 ()

- A. 成盐 B. 成酰胺 C. 加氢 D. 氨甲基化 E. 成几何异构体

11、下列抗生素属于 β -内酰胺类抗生素的有 ()

- A. 青霉素类 B. 氯霉素类 C. 氨基糖甙类
D. 头孢菌素类 E. 四环素类

12、用于心血管系统疾病的药物有 ()

- A. 降血脂药 B. 强心药 C. 解痉药 D. 抗组胺药 E. 抗高血压药

三、填空题 (每空2分, 共32分)

1、机体吸收药物的过程除受许多生理因素影响之外, 药物的____、____、____、____和____等均对其有显著影响。

2、药物的官能团与____相结合的反应, 称为药物结合反应。

3、抗肿瘤药物按作用机制可分为____, _____和____三类。

4、药物及其代谢产物主要由____排泄, 还可由____等排泄。

5、新药研发的四要素: _____、____、____、_____。

四、名词解释并举例说明 (每题 6 分, 共 24 分)

1、构效关系

2、药物靶点

3、前药

4、质子泵抑制剂

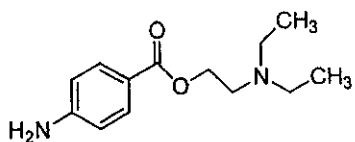
五、简答题 (共 55 分)

1、什么是药物化学? 药物化学研究的主要内容是什么? (8 分)

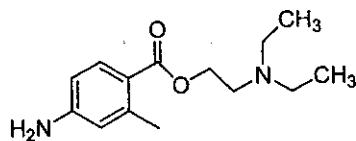
2、试述抗肿瘤药的分类和作用机制, 各举一典型药物。 (10 分)

3、什么是计算机辅助药物设计? (9 分)

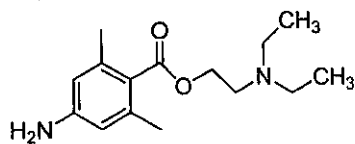
4、比较下列普鲁卡因同系物的水解反应速度及麻醉作用时间长短(以>, =和<表示), 并说明原因: (9 分)



普鲁卡因



甲基普鲁卡因



二甲基普鲁卡因

5、简述手性药物研究的重要意义。(9分)

6、根据自己所掌握的知识，谈谈目前药物化学中新药研究与开发的热点和前沿。

(10分)