

河南师范大学

二〇〇九年硕士研究生入学考试业务课试卷

科目代码： 611 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10分)

1、不符合四环素描述的是 ()

- A. 四环素在酸性条件下易发生脱水反应
- B. 碱性条件下易发生氧化反应。
- C. 目前四环素类作用时间最长的是多西环素

☒ D. 最简单的四环素类药物是山环素

2、下列哪个说法不正确 ()

- ☒ A. 镇静催眠药的lgP值越大，活性越强
- B. 具有相同基本结构的药物，它们的药理作用类型不一定相同
- C. 最合适的脂水分配系数，可使药物有最大活性
- D. 适度增加中枢神经系统药物的脂水分配系数，活性会有所提高
- E. 药物的脂水分配系数是影响药物活性的因素之一

3、氨曲南属于哪种结构类型的抗生素 ()

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

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、巴比妥类药物具有酸性，其解离常数与镇静催眠作用的显效快慢有关（ ）

- A. 通常 pK_a 值越大，未解离百分率越低，显效越快。
- B. 通常 pK_a 值越大，未解离百分率越高，显效越快。
- C. 通常 pK_a 值越大，未解离百分率越低，显效越慢。
- D. 通常 pK_a 值越大，未解离百分率越高，显效越慢。

6、硝苯地平的作用靶点为（ ）

- A. 受体
- B. 酶
- C. 离子通道
- D. 核酸
- E. 细胞壁

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、利多卡因比普鲁卡因作用时间长的主要原因是（ ）

- A. 普鲁卡因有芳香第一胺结构
- B. 普鲁卡因有酯基
- C. 利多卡因有酰胺结构
- D. 酰胺键比酯键不易水解

9、氯丙嗪作用于（ ）

- A. 阿片受体
- B. 多巴胺受体
- C. 磷酸二酯酶
- D. GABA受体

10、下列哪一个药物不具抗炎作用（ ）

- A. 阿司匹林
- B. 对乙酰氨基酚
- C. 布洛芬
- D. 吲哚美辛
- E. 地塞米松

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、抗溃疡药法莫替丁含有下列哪些结构部分（ ）

A 呋喃类 B 咪唑类 C 噻唑类 D 硝基 E 氨基磺酰基

2、镇痛药的化学结构中应有下列哪些特点 ()

A 分子中具有一个平坦的芳香环结构 ✓

B 有一个碱性中心，在生理 pH 下能大部分解离为阳离子 ✓

C 碱性中心和平坦的芳香环结构在同一个平面上

D 含有哌啶环或类似的结构

E 哌啶环与平坦的芳香环相连，芳香环处于哌啶环的竖键位置

3、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

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、下列属于 β -内酰胺抗生素的有 ()

A. 哌拉西林 ✓ B. 金霉素 C. 克拉维酸钾 ✓

D. 舒巴坦钠 ✓ E. 链霉素

6、四环素符合下列哪些性质 ()

A. 酸性条件下不稳定，易于发生消除反应 B. 为两性化合物

C. 结构中有五个羟基 D. 酸性条件下易发生差向异构化

E. 与多种金属离子形成络合物

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. 氨基糖苷类

8、下列药物中哪些属于镇痛药 ()

- A. ☒ 盐酸吗啡 B. 盐酸哌替啶 C. 盐酸美沙酮
D. 喷他佐辛 E. 纳布啡

9、下列哪些药物以酶为作用靶点 ()

- A. ☒ 卡托普利 B. ☒ 溴新斯的明 C. ☒ 降钙素
D. 吗啡 E. 青霉素

10、肾上腺素受体激动剂的化学不稳定性表现为 ()

- A. 饱和水溶液呈弱碱性 B. 易氧化变质
C. 受到MAO和COMT的代谢 D. 易水解 E. 易发生消旋化

11、喹诺酮抗菌药物的作用机制为其抑制细菌的 ()

- A. ☒ DNA促旋酶 B. 二氢叶酸合成酶 C. RNA聚合酶
D. ☒ 拓扑异构酶I V E. 二氢叶酸还原酶

12、前药的特征有 ()

- A. ☒ 原药与载体一般以共价键连接
B. ☒ 前药只在体内水解形成原药，为可逆性或生物可逆性药物
C. ☒ 前药应无活性或活性低于原药
D. 载体分子通常无活性
E. ☒ 前药在体内产生原药的速率应是快速动力学过程，以保障原药在作用部位有足够的药物浓度。

三、填空题 (每空3分，共45分)

1、药物作用的生物靶点主要有 受体、酶、核酸。

2、先导化合物是指有 独特结构 且具有 活性 的化合物。在其结构的基础上，可以进行 改造或修饰，符合治疗要求的新药。

3、应用前药原理设计新药，可以增加药物的代谢 活性，延长其在体内的 作用时间；干扰转运特点，使药物定向靶细胞，提高作用 药动学性质，消除

药物的副作用或毒性及不适气味等。

4、抗艾滋病药物按作用机理可分为_____和_____。

5、巴比妥类药物 C-5 位取代基的氧化反应是代谢的主要途径，C-5 位取代基为苯环时，不易被代谢，则药物在体内的作用时间长，若为不饱和烃基或支链烷烃时，易被代谢，则药物在体内的作用时间短。

四、名词解释并举例说明（每题 6 分，共 30 分）

- 1、构效关系
- 2、药物靶点
- 3、质子泵抑制剂
- 4、前药
- 5、化学治疗药

五、简答题（共 41 分）

- 1、氮芥类抗肿瘤药物的其结构是由哪两部分组成的？并简述各部分的主要作用。（8分）
氮芥化：抗肿瘤活性基团
载体：提高在体内活性
- 2、药物进入体内后，影响药效的因素主要有哪些，并进行简单阐述。（11分）
生物利用度
药物与血浆蛋白结合
- 3、如何运用软药原理设计药物并举例说明（10分）
- 4、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。（12分）