

试卷编号: B 卷

河南师范大学

二〇一〇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、氨基糖苷类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、下列哪个药物属于乙酰胆碱酯酶抑制剂 ()
- A. 盐酸多奈哌齐 B. 雷尼替丁 C. 环磷酰胺 D. 头孢氨苄 E. 硝苯地平
- 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pKa值越大, 未解离百分率越低, 显效越快。
B. 通常pKa值越大, 未解离百分率越高, 显效越快。
C. 通常pKa值越大, 未解离百分率越低, 显效越慢。
D. 通常 pKa 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 咪唑类 B 咪唑类 C 噻唑类 D 硝基 E 氨磺酰基
- 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 -内酰胺类抗生素的有 ()
- 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
- 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M A O 和C O M T 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. D N A 促旋酶 B. 二氢叶酸合成酶 C. R N A 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、目前临床上常用的两类抗高血压药为_____和_____。

2、先导化合物是指有_____且具有_____的化合物。在其结构的基础上，可以进行_____，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_____，延长其在体内的_____；干扰转运特点，使药物定向靶细胞，提高作用_____；消除药物的副作用或毒性及不适气味等。

4、药物作用的生物靶点主要有_____、_____、_____和_____。

5、巴比妥类药物 C-5 位取代基的_____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_____，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_____。

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）

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）

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）