

试卷编号：A 卷试题

## 河南师范大学

## 2012 年硕士研究生入学考试业务课试卷

科目代码： 621 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2分，共20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、下面哪个药物的作用与受体无关（ ）  
 A. 氯沙坦      B. 奥美拉唑      C. 盐酸麻黄碱      D. 苯磺阿曲库铵      E. 氯贝胆碱
- 3、盐酸普萘洛尔是（ ）  
 A.  $\beta$ -受体阻滞剂      B. H1受体拮抗剂      C. 胆碱酯酶抑制剂      D. 肾上腺素受体激动剂。
- 4、卡托普利是（ ）而发挥抗高血压作用  
 A. 羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑制剂      B. H2 受体拮抗剂  
 C. 血管紧张素转化酶(ACE)抑制剂      D. H1 受体拮抗剂
- 5、下列哪个说法不正确（ ）  
 A. 具有相同基本结构的药物，它们的药理作用不一定相同  
 B. 最合适的脂水分配系数，可使药物有最大活性  
 C. 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  
 D. 药物的脂水分配系数是影响药物活性的因素之一  
 E. 镇静催眠药的 lgP 值越大，活性越强
- 6、 $\beta$ -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. 抑制粘肽转肽酶的活性，阻止细胞壁的合成      D. 二氢叶酸还原酶抑制剂
- 7、半合成青霉素是以（ ）和相应的侧链酸进行缩合得到的  
 A. 7-ACA      B. 6-APA      C. 7-ADCA      D. 7-ADCA三氯乙酯
- 8、最早用于临床的抗肿瘤药物是（ ）  
 A. 嘧啶类抗代谢药物      B. 生物烷化剂      C. 抗肿瘤抗生素      D. 嘌呤类抗代谢药物
- 9、苯磺阿曲库铵是用哪个药物设计原理设计的（ ）  
 A. 软药原理      B. 前药原理      C. 合理药物设计      D. 抗代谢原理
- 10、有机膦杀虫剂中毒是由于（ ）

- 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

**二、多项选择题(在每小题的备选答案中,选出二个以上正确的答案,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3分,共30分)**

- 1、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,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
- 2、下列属于β-内酰胺抗生素的有( )  
 A. 哌拉西林    B. 克拉维酸钾    C. 舒巴坦钠    D. 链霉素
- 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
- 4、直接作用于 DNA 的抗肿瘤药物有( )  
 A. 环磷酰胺    B. 卡铂    C. 卡莫司汀    D. 盐酸阿糖胞苷
- 5、下列哪些说明是正确的( )  
 A. 抗代谢药物是最早用于临床的抗肿瘤药物    B. 芳香氮芥比脂肪氮芥的毒性小  
 C. 氮甲属于烷化剂类抗肿瘤药物    D. 顺铂的水溶液不稳定,会发生水解和聚合
- 6、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. 对革兰氏阳性菌和革兰氏阴性菌都有效
- 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. 氨曲南
- 8、先导化合物可来源于( )  
 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
- 9、以下哪些药物是用代谢拮抗原理设计的( )  
 A. 苯碘阿曲库铵    B. 5-氟尿嘧啶    C. 对氨基水杨酸钠    D. 磺胺嘧啶
- 10、下列哪些药物具有抗炎作用( )  
 A. 阿司匹林    B. 对乙酰氨基酚    C. 羟布宗    D. 呋喃美辛

**三、填空题(每空3分,共30分)**

- 1、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,是利用\_\_\_\_\_原理设计的新药。
- 2、最早发现的磺胺类抗菌药是\_\_\_\_\_。

- 3、喹诺酮抗菌药物的作用机制为抑制细菌的DNA旋转酶和\_\_\_\_\_。
- 4、巴比妥类药物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\_\_\_\_\_。
- 5、药物作用的生物靶点主要有\_\_\_\_\_、\_\_\_\_\_、\_\_\_\_\_和核酸。
- 6、苯磺阿曲库铵利用\_\_\_\_\_原理设计的新药。

**四、名词解释并举例说明（每题6分，共30分）**

- 1、生物电子等排体
- 2、软药
- 3、合理药物设计
- 4、化学治疗药
- 5、先导化合物

**五、简答题（共40分）**

- 1、简单阐述药物进入体内后，影响药效的主要因素。（10分）
- 2、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。（15分）
- 3、谈谈手性药物研究的重要意义。（15分）