

药物化学（二）

(课程代码 01759)

注意事项：

1. 本试卷分为两部分，第一部分为选择题，第二部分为非选择题。
2. 应考者必须按试题顺序在答题卡（纸）指定位置上作答，答在试卷上无效。
3. 涂写部分、画图部分必须使用 2B 铅笔，书写部分必须使用黑色字迹签字笔。

第一部分 选择题

一、单项选择题：本大题共 30 小题，每小题 1 分，共 30 分。在每小题列出的备选项中只有一项是最符合题目要求的，请将其选出。

1. 盐酸吗啡注射剂放置过久颜色变深，是因为发生了
 - A. 氧化反应
 - B. 水解反应
 - C. 还原反应
 - D. 结合反应
2. 我国自主研发，别名“654-2”的 M 受体拮抗剂是
 - A. 东莨菪碱
 - B. 消旋山莨菪碱
 - C. 阿托品
 - D. 樟柳碱
3. 麻黄碱比肾上腺素稳定是因为
 - A. 麻黄碱没有醇羟基
 - B. 麻黄碱没有儿茶酚结构
 - C. 麻黄碱没有手性碳
 - D. 麻黄碱比肾上腺素多一个叔胺基
4. 西替利嗪无中枢抑制作用，主要是因为
 - A. 对中枢 H₁受体选择性低
 - B. 结构中含有羧基，易离子化
 - C. 含有三环结构片段
 - D. 结构中含有双键
5. 沙丁胺醇对 β₂受体有选择性激动作用，主要是
 - A. 与 β-苯乙醇胺结构母核有关
 - B. 与邻苯二酚结构有关
 - C. 与侧链 N 原子上的叔丁基有关
 - D. 与手性碳上的羟基有关
6. 硫酸阿托品的水解产物是
 - A. 莨菪醇和莨菪酸
 - B. 对氨基苯甲酸和二乙胺基乙醇
 - C. 托烷和托品酸
 - D. 对氨基苯磺酸和托品

7. 有抗精神病作用的吩噻嗪类药物是

- A. 氟西汀
- B. 氟哌啶醇

- C. 氯丙嗪
- D. 喹替啶

8. 属于二氢吡啶类钙通道阻滞剂的药物是

- A. 氟桂利嗪
- B. 维拉帕米

- C. 胺碘酮
- D. 硝苯地平

9. 奥美拉唑属于

- A. 钙离子通道阻滞剂
- B. 质子泵抑制剂

- C. H₂受体拮抗剂
- D. DNA 融合酶抑制剂

10. 属于 5-HT₃受体拮抗剂的药物是

- A. 甲氧氯普胺
- B. 雷贝拉唑

- C. 多潘立酮
- D. 昂丹司琼

11. 通过选择性抑制 COX-2 发挥作用的非甾体抗炎药物是

- A. 阿司匹林
- B. 对乙酰氨基酚

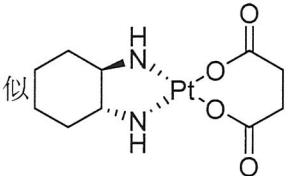
- C. 塞来昔布
- D. 布洛芬

12. 双氯芬酸钠的作用靶点是

- A. 环氧化酶和脂氧合酶
- B. 环氧化酶

- C. 质子泵
- D. 钙离子通道

13. 具有右边结构的化合物，与下列哪种药物的临床用途相似



- A. 阿霉素
- B. 四环素

- C. 氯霉素
- D. 氯雷他定

14. 下列属于抗肿瘤植物药物或其衍生物的是

- A. 环磷酰胺
- B. 氟尿嘧啶

- C. 多西他赛
- D. 米托蒽醌

15. 结构中含有氨基糖苷键的抗生素是

- A. 头孢氨苄
- B. 阿莫西林

- C. 四环素
- D. 庆大霉素

16. 下列属于碳青霉烯类 β-内酰胺抗生素的是

- A. 亚胺培南
- B. 克拉维酸钾

- C. 派拉西林
- D. 舒巴坦

17. 头孢菌素类抗生素比青霉素类稳定，主要是因为
 A. 头孢菌素类不含 β -内酰胺环 B. 头孢菌素类侧链没有酰胺键
 C. 头孢菌素类结构中有共轭体系 D. 头孢菌素类为四元环骈五元环体系
18. 关于四环素的叙述，正确的是
 A. 酸性条件下会发生差向异构化 B. 碱性条件下较稳定
 C. 用药后不会影响骨骼发育 D. 其酸性主要来自于结构中的羧基
19. 常用作 β -内酰胺酶抑制剂的药物是
 A. 头孢哌酮钠 B. 氨曲南
 C. 克拉维酸钾 D. 卡那霉素
20. 喹诺酮类抗菌药的光毒性主要与
 A. 8位氟取代基有关 B. 1位环丙基有关
 C. 7位哌嗪基有关 D. 5位氨基有关
21. 喹诺酮类药物的作用靶点是
 A. DNA 回旋酶和拓扑异构酶 IV B. β -内酰胺酶
 C. HIV 蛋白酶 D. DNA 多聚酶
22. 磺胺类抗菌药的基本母核是
 A. 对氨基苯甲酸 B. 对氨基苯磺酰胺
 C. 苯甲酸酯 D. 对氨基苯磺酸
23. 下列有抗病毒作用的药物是
 A. 氟康唑 B. 阿昔洛韦
 C. 青蒿素 D. 吡喹酮
24. 异烟肼的化学结构是
- A.
- B.
- C.
- D.
25. 含有酰脲结构的降血糖药物是
 A. 甲苯磺丁脲 B. 吡格列酮
 C. 二甲双胍 D. 阿卡波糖

26. 二甲双胍的化学结构是
- A.
- B.
- C.
- D.

27. 结构母核为环戊烷并多氢菲，有较强抗炎作用的药物是
 A. 布洛芬 B. 地塞米松
 C. 塞来昔布 D. 齐多夫定
28. 有抗氧化作用的脂溶性维生素是
 A. 维生素 K B. 维生素 C
 C. 维生素 A D. 维生素 B₂
29. 下列与-NH-是生物电子等排体的是
 A. 羟基 B. 硫基
 C. 卤素 D. 硫
30. 药物第 I 相生物转化的作用是
 A. 引入或暴露出极性官能团 B. 使药物失去活性
 C. 代谢产生活性 D. 将药物代谢为无毒物

二、多项选择题：本大题共 5 小题，每小题 2 分，共 10 分。在每小题列出的备选项中至少有两项是符合题目要求的，请将其选出，错选、多选或少选均无分。

31. 关于肾上腺素的叙述，正确的有
 A. 具有邻苯二酚结构 B. 具有 β -苯乙胺的结构骨架
 C. 容易被氧化成肾上腺素红 D. 比麻黄碱更易透过血脑屏障进入中枢
 E. 含一个手性碳原子
32. 关于普萘洛尔的叙述，正确的有
 A. 具有苯乙胺基本结构 B. 属于选择性 β_1 受体拮抗剂
 C. 含手性碳原子，药用外消旋体 D. 以麻黄碱为先导化合物结构改造得到
 E. 可用于心绞痛和高血压病的治疗

33. 关于 H₂受体拮抗剂的叙述，正确的有

 - A. 西咪替丁是以组胺为先导物结构改造得到
 - B. 该类药物的结构由芳环基团、四原子链和脒脲基
 - C. 雷尼替丁用呋喃环替换了西咪替丁的咪唑环
 - D. 雷尼替丁含硫原子，显硫化物鉴别反应
 - E. 法莫替丁以胍基噻唑基替代西咪替丁的咪唑基得

34. 结构中含有羧基的非甾体抗炎药物有

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

35. 下列属于大环内酯类抗生素的药物有

- A. 红霉素
 - B. 罗红霉素
 - C. 克拉霉素
 - D. 阿奇霉素
 - E. 庆大霉素

第二部分 非选择题

三、名词解释题：本大题共 5 小题，每小题 3 分，共 15 分。

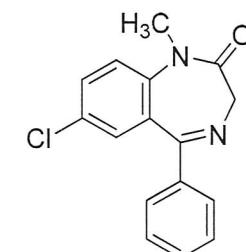
- 36. 先导化合物
 - 37. 脂水分配系数
 - 38. 构效关系
 - 39. 药物代谢
 - 40. 药物化学

四、简答题：本大题共 5 小题，每小题 5 分，共 25 分。

41. 简述巴比妥类药物共同的结构特点和化学性质。
 42. 简述普鲁卡因的结构与化学性质的关系。
 43. 简述为什么青霉素类药物常制成钠盐和粉针剂？
 44. 简述环磷酰胺的设计思路。
 45. 结合化学结构，说明为什么喹诺酮类药物不宜和含钙、铁等食物和药品同时服用？

五、论述题：本大题共 2 小题，每小题 10 分，共 20 分。

46. 地西泮的结构如下图所示, 请问该药在酸性条件下会发生什么变化? 如何对其进行结构改造, 以提高镇静催眠活性?



47. 卡托普利的作用靶点是什么？为什么用药后会产生咳嗽和味觉迟钝的副作用？如何进行改造才能克服这些副作用？