

机密★启用前

## 江苏大学 2005 年硕士研究生入学考试试题

考试科目：药学综合

考生注意：答案必须写在答题纸上，写在试题及草稿纸上无效

### 药理学

#### 一、名词解释（每题 2 分，共 10 分）

1. side effect
2. 肾上腺素的翻转
3. resistance
4. 一级动力学
5. 二重感染

#### 二、填空题（每空 1 分，共 17 分）

1. NSAID<sub>s</sub> 是通过抑制\_\_\_\_\_酶，从而减少\_\_\_\_\_的合成。
2. 氨茶碱松弛平滑肌作用与下列因素有关：\_\_\_\_\_；\_\_\_\_\_；\_\_\_\_\_。
3. 肝素过量所致的出血应用\_\_\_\_\_防治；尿激酶所致的出血应用\_\_\_\_\_防治；鼻出血应用\_\_\_\_\_防治。
4. 硫脲类的作用机制为\_\_\_\_\_。
5. 氢氯噻嗪的药理作用为\_\_\_\_\_；\_\_\_\_\_；\_\_\_\_\_。
6. 利多卡因主要治疗\_\_\_\_\_心律失常，常采取\_\_\_\_\_方式给药。
7. 抗铜绿假单孢菌的药物有（写出药名）\_\_\_\_\_；\_\_\_\_\_；\_\_\_\_\_。

#### 三 选择题（单选题，每题 1 分，共计 16 分）

1. 以下关于小分子脂溶性药物的叙述，哪一项是错误的（ ）
  - A. 一般容易自消化道吸收
  - B. 较易透过血管壁
  - C. 容易自肾脏排出
  - D. 易储存于脂肪组织中
  - E. 与血浆蛋白结合后，药理活性暂时消失
2. 阿斯匹林易引发胃肠道不良反应(包括溃疡、出血等)，其主要原因（ ）
  - A. 通过释放组胺使胃酸分泌亢进
  - B. 通过其抗炎作用使结缔组织胶原间质合成受阻
  - C. 经环氧酶使 TXA<sub>2</sub> 和 PGI<sub>2</sub> 合成减少内皮受损
  - D. 抑制 COX-1，使 PGE<sub>2</sub> 减少而使而使粘液-重碳酸屏障受损
  - E. 兴奋迷走神经而增加酸和酶的分泌

3. 下列哪类药物可诱发或加重支气管哮喘( )  
A.  $\alpha$  受体激动剂      B.  $\alpha$  受体阻断剂      C.  $\beta$  受体激动剂  
D.  $\beta$  受体阻断剂      E. 以上都不是
4. 青霉素为弱酸性药物, 其  $pK_a=2.8$ , 在  $pH=4.8$  的环境下, [解离型]/[非解离型]之比应为: ( )  
A. 100/1      B. 10/1      C. 1/1  
D. 1/10      E. 1/100
5. 切除支配瞳孔括约肌的神经后, 哪种药滴眼可使瞳孔缩小( )  
A. 毒扁豆碱      B. 新斯的明      C. 阿托品      D. 毛果芸香碱      E. 以上都不对
6.  $\beta$  受体阻断药广泛用于治疗心血管系统疾病, 但不包括( )  
A. 阵发性室上性心动过速      B. 变异性心绞痛      C. 高血压  
D. 心力衰竭      E. 心房颤动
7. 地西泮的作用不包括( )  
A. 镇静      B. 催眠      C. 抗焦虑      D. 抗惊厥      E. 麻醉
8. 治疗乙胺嘧啶所致巨幼红细胞贫血的药物是: ( )  
A. 铁制剂      B. 叶酸      C. 维生素  $B_{12}$       D. 甲酰四氢叶酸钙      E. 叶酸 + 维生素  $B_{12}$
9. 局麻药过量中毒发生惊厥, 宜选用下列哪一药物( )  
A. 硫酸镁      B. 异戊巴比妥      C. 水合氯醛      D. 地西洋      E. 苯巴比妥
10. 治疗肺炎球菌性引起的大叶性肺炎的首选抗菌药物是: ( )  
A. 庆大霉素      B. 红霉素      C. 青霉素      D. SMZ      E. 四环素
11. 强心甙治疗心房纤颤与心房扑动主要是由于:  
A. 直接取消房颤、房扑      B. 缩短心房肌的有效不应期  
C. 减慢房室结的传导速度      D. 直接抑制窦房结, 降低自律性  
E. 降低蒲氏纤维自律性
12. 治疗量的硝酸甘油无下列哪种副作用( )  
A. 面部潮红      B. 心率减慢      C. 搏动性头痛  
D. 眩晕      E. 眼内压升高
13. 治疗深部真菌感染时最常选用下列哪一药物( )  
A. 制霉菌素      B. 两性霉素      C. 克霉唑      D. 灰黄霉素      E. 特比萘芬
14. 对氨水杨酸抗结核特点是  
A. 易渗透入结核病灶      B. 不易产生耐药菌

- C. 抗菌作用强 D. 无不良反应
- E. 饭前服用疗效增强
15. 以下那种药物可以防止疟疾复发 ( )
- A. 乙氨嘧啶 B. 伯氨喹 C. 氯喹 D. 青蒿素 E. 奎宁
16. 长期口服氯丙嗪最常见的不良反应为
- A 体位性低血压 B 内分泌紊乱 C 锥体外系症状
- D 肝功能受损 E 以上都不是

四 问答题：（每题 8 分，共 32 分）

- 1 列举解除各种疼痛代表药物的名称并解释作用机制。
- 2 简述胆碱受体的分类、分布及效应。
- 3 简述糖皮质激素的抗炎作用的特点和机制。
- 4 简述临床常用的抗菌药类别及其抗菌机制。

药物化学

### 一、单项选择题（每题 1 分，共 20 分）

- 1、下列药物中，( ) 主要用作抗真菌药。  
A、阿昔洛韦      B、氟康唑      C、长春碱      D、氧氟沙星
- 2、氨基糖甙类抗生素产生耐药性的主要原因是由于细菌产生了钝化酶。这些钝化酶中不包括( )  
A、 $\beta$ -内酰胺酶      B、磷酸转移酶      C、核苷转移酶      D、乙酰转移酶
- 3、下列哪种药物不溶于碳酸氢钠溶液( )  
A、扑热息痛      B、吲哚美辛      C、布洛芬      D、萘普生
- 4、抗组胺药物苯海拉明，其化学结构属于哪一类( )  
A、氨基醚      B、乙二胺      C、哌嗪      D、三环类
- 5、甲氧苄啶的作用机制为( )  
A、抑制二氢叶酸合成酶      B、抑制二氢叶酸还原酶  
C、参入 DNA 的合成      D、抑制  $\beta$ -内酰胺酶
- 6、下列利尿药中，( ) 具有甾体结构。  
A、依他尼酸      B、螺内酯      C、呋塞米      D、氢氯噻嗪
- 7、下列药物中，( ) 不易被空气氧化。

- A、肾上腺素      B、去甲肾上腺素      C、多巴胺      D、麻黄碱
- 8、用氟原子置换尿嘧啶 5 位上的氢原子，其设计思想是（ ）
- A、生物电子等排置换      B、起生物烷化剂作用
- C、立体位阻增大      D、改变药物的理化性质，有利于进入肿瘤细胞
- 9、适当增加化合物的亲脂性不可以（ ）
- A、改善药物在体内的吸收      B、有利于通过血脑屏障
- C、使药物在体内易于排泄      D、使药物易于穿透生物膜
- 10、在喹诺酮类抗菌药的构效关系中，这类药物的必要基团是下列哪点（ ）
- A、1 位氮原子无取代      B、5 位有氨基
- C、3 位上有羧基和 4 位是羰基      D、8 位氟原子取代
- 11、含芳环的药物主要发生以下哪种代谢（ ）
- A、还原代谢      B、氧化代谢
- C、脱羟基代谢      D、开环代谢
- 12、盐酸普鲁卡因是通过下面哪个天然药物的结构进行简化得到的（ ）
- A、吗啡      B、阿托品      C、奎宁      D、可卡因
- 13、在具有较强抗炎作用的甾体药物的化学结构中，哪个位置上具有双键可使抗炎作用增加，副作用减少（ ）
- A、5 位      B、7 位      C、11 位      D、1 位
- 14、巴比妥类药物为（ ）
- A、两性化合物      B、中性化合物      C、弱酸性化合物      D、弱碱性化合物
- 15、在 1, 4-苯二氮卓类结构的 1, 2 位并入三唑环，生物活性明显增强，原因是（ ）
- A、药物对代谢的稳定性增加      B、药物对受体的亲和力增加
- C、药物的极性增加      D、药物对代谢的稳定性及对受体的亲和力均增加
- 16、贝诺酯是由哪两种药物拼合而成的（ ）
- A、阿司匹林和丙磺舒      B、阿司匹林和对乙酰氨基酚
- C、水杨酸和阿司匹林      D、水杨酸和对乙酰氨基酚
- 17、经红霉素衍改造得到的第一个环内含氮的 15 元环的大环内酯抗生素是（ ）
- A、克拉霉素      B、阿齐霉素      C、罗红霉素      D、螺旋霉素
- 18、丙酸睾酮是对睾酮进行结构修饰而得到的药物，其结构修饰的目的是（ ）
- A、提高药物的选择性      B、提高药物的稳定性
- C、降低药物的毒副作用      D、延长药物的作用时间

19、下列哪种说法与前药的概念相符合( )

- A、用酯化方法做出的药物是前药
- B、用酰胺化方法做出的药物是前药
- C、在体内经简单代谢而失活的药物是前药
- D、前药是药效潜伏化的药物

20、先导化合物的发现途径不包括( )

- A、从植物中发现和分离有效成分
- B、从活性内源性物质中发现
- C、应用前药原理
- D、研究药物体内的代谢途径

二、多项选择题(每题 1 分, 共 20 分)

1、下列可用于成酯和成酰氨修饰的药物是( )

- A、具氨基的药物
- B、具卤素的药物
- C、具羧基的药物
- D、具羟基的药物
- E、具双键的药物

2、青霉素钠具有下列哪些理化性质( )

- A、有吸湿性需在干燥条件下保存
- B、水溶液在室温下稳定
- C、可以口服给药
- D、在碱性条件下稳定
- E、在酸性条件下不稳定

3、下列哪些属于抗病毒药物( )

- A、齐多夫定
- B、磺胺嘧啶
- C、利巴韦林
- D、阿昔洛韦
- E、阿苯达唑

4、药物结构修饰的目的是( )

- A、减低药物的毒副作用
- B、延长药物的作用时间
- C、提高药物的稳定性
- D、发现新结构类型的药物
- E、开发新药

5、中枢兴奋药按药物的作用部位可分为( )



- A. 大脑皮层兴奋药  
B. 脊髓兴奋药  
C. 生物碱类中枢兴奋药  
D. 促进大脑功能恢复的药物  
E. 苯乙胺类中枢兴奋药
- 6、下列哪些叙述与盐酸麻黄碱相符 ( )  
A. 结构中没有酚羟基  
B. 具有旋光性  
C. 能被高锰酸钾氧化为苯甲醛及甲胺  
D. 作用比肾上腺素强，中枢副作用小  
E. 分子中含有一个手性碳原子
- 7、吗啡的化学结构中 ( )  
A. 含有 N-甲基哌啶环  
B. 含有酚羟基  
C. 含有甲氧基  
D. 含有环氧基  
E. 含有两个苯环
- 8、下列哪些药物是前体药物 ( )  
A. 氯霉素棕榈酸酯  
B. 睾丸素-17-丙酸酯  
C. 螺内酯  
D. 盐酸甲氯芬酯  
E. 环磷酰胺
- 9、影响药物生物活性的立体因素包括 ( )  
A. 立体异构  
B. 旋光异构  
C. 顺反异构  
D. 构象异构  
E. 互变异构
- 10、药物与受体结合一般是通过 ( )  
A. 氢键  
B. 疏水键  
C. 共轭作用

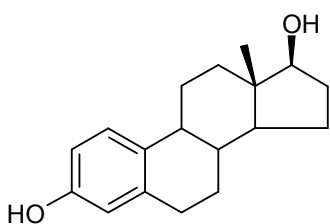
- D、电荷转移复合物                      E、静电引力
- 11、提高肾上腺皮质激素的抗炎作用一般通过（ ）
- A、C1(2)位引入双键                      B、9 $\alpha$ -位引入氟原子
- C、C16 $\alpha$ -位引入甲基                      D、C10-位去甲基
- E、C16 $\beta$ -位引入甲基
- 12、如何延长拟肾上腺素药物的作用时间（ ）
- A. 延长苯环与氨基间的碳链
- B. 去掉苯环上的酚羟基
- C. 在 $\alpha$ -碳上引入甲基
- D. 在氨基上以较大的烷基取代
- E. 成盐
- 13、下列药物中属于水溶性维生素的有（ ）
- A、维生素 C
- B、维生素 B<sub>6</sub>
- C、维生素 K
- D、维生素 B<sub>2</sub>
- E、维生素 E
- 14、下列叙述与盐酸哌替啶相符的是（ ）
- A、是从吗啡结构简化而来的                      B、镇痛作用比吗啡强
- C、连续应用可成瘾                      D、在酸催化下易水解
- E、又名度冷丁
- 15、下列哪几项是硫酸阿托品的性质（ ）
- A、易溶于乙醇                      B、不易被水解
- C、水溶液呈中性                      D、呈旋光性，供药用的为其左旋体
- E、具有中枢副作用
- 16、下列关于磺胺类药物的叙述中正确的是（ ）
- A. 苯环上的氨基与磺酰胺必须处在对位
- B. 苯环被其他取代则抑菌作用消失
- C. N<sup>1</sup>的一个氢被杂环取代时有较好的疗效
- D. 为二氢叶酸还原酶抑制剂
- E. 抑菌作用与化合物的 pKa 有密切的关系

17、从药物化学角度，新药设计主要包括（ ）

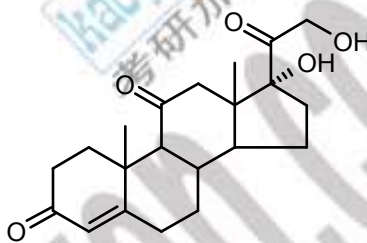
- A. 药物剂型的设计
- B. 剂量范围的确定
- C. 先导化合物的发掘和设计
- D. 先导化合物的结构修饰
- E. 先导化合物的结构改造

18、下列药物哪些具有甾体结构母核（ ）

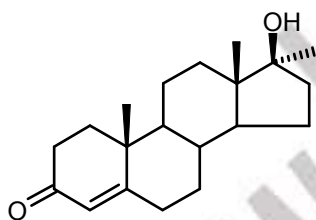
A、



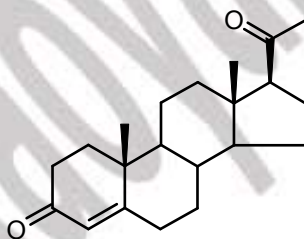
B、



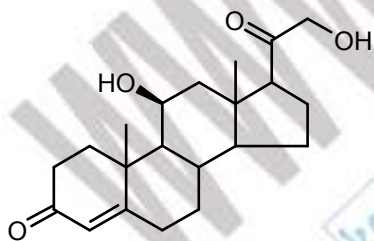
C、



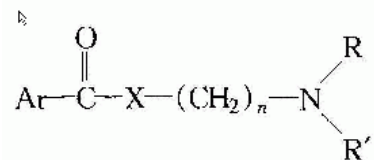
D、



E、



19、苯甲酸酯局麻药具有



结构，下列叙述中哪些是正确的（ ）



- A. 当 x 为—S—, —O—, —CH<sub>2</sub>—, —NH—时局麻作用依次降低
- B. n=2—3, 碳链增长毒性增加
- C. 氨基一般是叔胺
- D. R 和 R' 一般分别为 C1—C4, R 的碳链增长, 毒性增加
- E. Ar 中在酯键的邻位有取代基时, 局麻作用减弱

20、合成镇痛药化学结构应有下列哪些特点( )

- A. 分子中具有一个平坦的芳环结构
- B. 有一个碱性中心, 在生理 pH 下能大部分电离成阳离子
- C. 碱性中心和平坦的芳环结构不在同一平面
- D. 含有哌啶或类似哌啶的结构
- E. 连在哌啶或类似哌啶环上的烃基(如苯基)突出于环平面

### 三、填空题(每空 1 分, 共 10 分)

- 1、从药物设计的角度看海洛因是吗啡的\_\_\_\_, 这归于海洛因的\_\_\_\_大于吗啡, 因而较易进入中枢组织。
- 2、我国科学家发现的天然抗疟药物是\_\_\_\_\_。
- 3、羟布宗是\_\_\_\_\_在体内的活性代谢产物, 临床主要用作\_\_\_\_\_药。
- 4、咖啡因、可可碱、茶碱均为\_\_\_\_\_类中枢兴奋药, 三者的中枢兴奋作用大小顺序为\_\_\_\_\_。
- 5、维生素药物多具有结构的\_\_\_\_\_, 对其进行结构改造基本无效。
- 6、诺氟沙星的母核为\_\_\_\_\_, 临床用作\_\_\_\_\_药。

### 四、简答题(每题 5 分, 共 10 分)

- 1、举例说明如何对红霉素进行结构改造, 以增加对酸的稳定性和水溶性。
- 2、氮芥类抗肿瘤药物的结构是由哪两部分组成? 各自发挥什么作用?

### 五、合成题(每题 5 分, 共 15 分)

- 1、以甲苯为原料合成布洛芬。
- 2、以氯乙酸乙酯为原料合成 5-FU。
- 3、以邻氯苯甲酸和间氯苯胺为原料合成氯丙嗪。

