

昆明理工大学 2009 年硕士研究生招生入学考试试题(A 卷)

考试科目代码：613

考试科目名称：药物化学基础综合（包括有机化学、药物化学、天然药物化学）

试题适用招生专业：药物化学

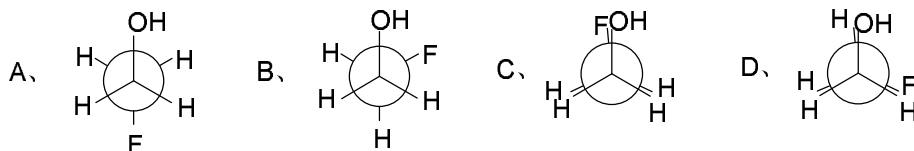
考生答题须知

1. 所有题目（包括填空、选择、图表等类型题目）答题答案必须做在考点发给的答题纸上，做在本试题册上无效。请考生务必在答题纸上写清题号。
2. 评卷时不评阅本试题册，答题如有做在本试题册上而影响成绩的，后果由考生自己负责。
3. 答题时一律使用蓝、黑色墨水笔或圆珠笔作答（画图可用铅笔），用其它笔答题不给分。
4. 答题时不准使用涂改液等具有明显标记的涂改用品。

有机化学

一、选择题（20 分，每小题 2 分）

1、下列构象最稳定的是（ ）



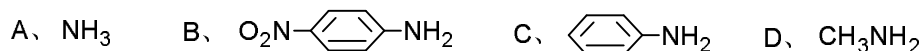
2、下列缩写代表四氢呋喃的是（ ）

- A、NBS B、DMF C、THF D、DMSO

3、下列化合物中最易发生亲电取代反应的是（ ）



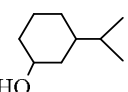
4、下列化合物按碱性由强到弱的顺序正确的是（ ）



- A、a>b>c>d B、d>c>b>a C、d>a>c>b D、c>d>b>a

5、酯的水解反应机理属于（ ）

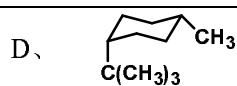
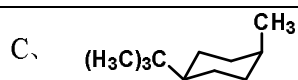
- A、亲电取代 B、亲核取代 C、游离基取代 D、亲核加成—消除

6、化合物可能  具有的旋光异构体的数目是（ ）

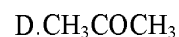
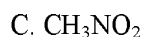
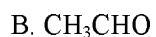
- A. 3 个 B. 4 个 C. 8 个 D. 16 个

7、1-甲基-4-叔丁基环己烷最稳定的构象为（ ）

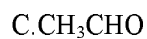
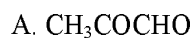




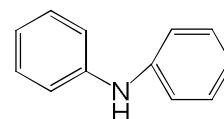
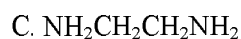
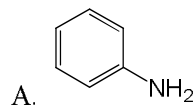
8、以下物质酸性最强的是 ()



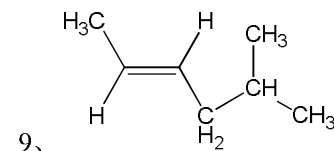
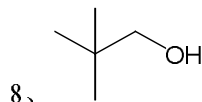
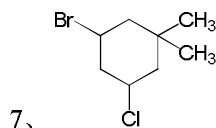
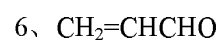
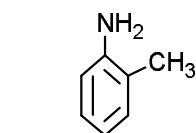
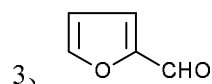
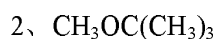
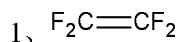
9、以下物质羰基活性最强的是 ()



10、以下物质碱性最强的是 ()

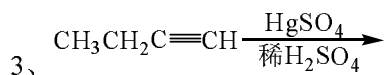
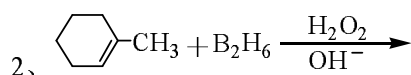
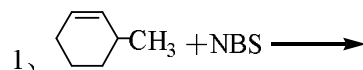


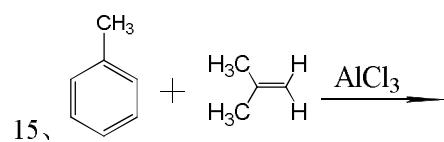
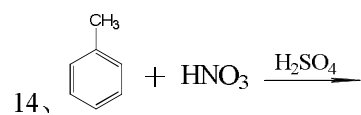
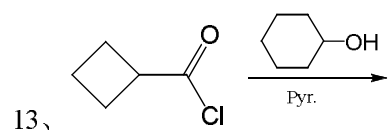
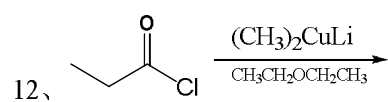
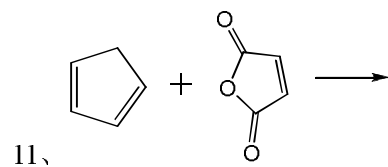
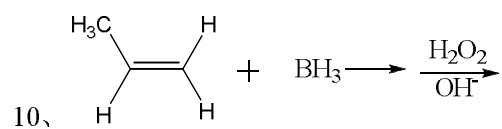
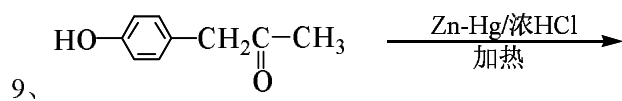
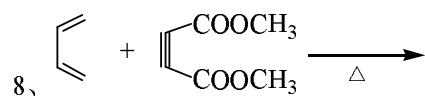
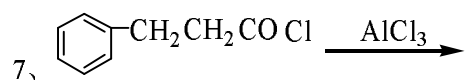
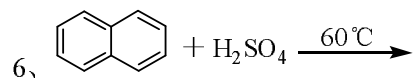
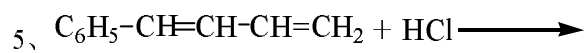
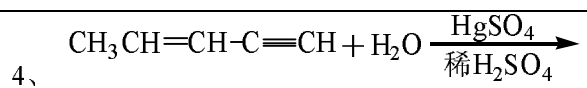
二、命名下列化合物或画结构 (20 分, 每小题 2 分)



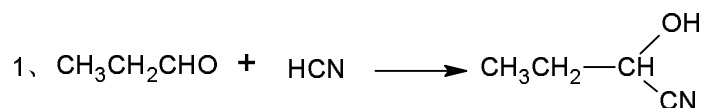
10、用纽曼式表示椅式环己烷

三、完成下列反应式 (30 分, 每小题 2 分)





四、为下列反应写出合理的反应机理（10 分）

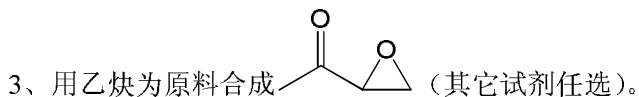
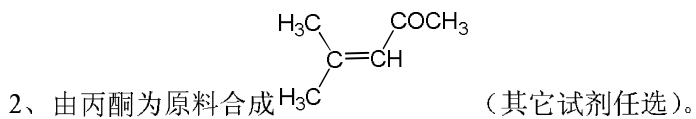


五、推导结构（10 分）

化合物 A，分子式为 $\text{C}_8\text{H}_9\text{Br}$ ，在它的核磁共振图谱中，在 $\delta=2.0$ 处有一个二重峰（3H）；在 $\delta=5.15$ 处有一个四重峰（1H）；在 $\delta=7.35$ 处有一个多重峰（5H），给出它的结构并简单分析。

六、按要求合成指定化合物（30 分，每小题 10 分）

1、由苯为原料合成间溴苯酚（其它试剂任选）。



药物化学

一、名词解释（将下列专业英文名词翻译成中文，然后进行简明解释。每个名词 5 分，共 10 分）

- 1、Bioalkylating agents:
- 2、H₂-receptor Antagonists:

二、填空题（每空 3 分，共 30 分）

- 1、巴比妥类药物属于结构非特异性药物，其药物作用强弱、快慢与作用时间长短主要与药物分子的_____有关。
- 2、沙丁胺醇的化学结构式为：_____，其化学名为：_____，其主要药理作用与效应是：_____。
- 3、氯霉素的主要毒副作用是_____。
- 4、胆固醇在人体内的生物合成是利用_____作为起始原料的，所以利用_____衍生物可以干扰胆固醇的体内合成而达到降低体内胆固醇的作用。氯贝丁酯即是通过该机制作用的临床常用降胆固醇药物，其化学结构式为：_____。
- 5、喹诺酮类抗菌药的 3 位_____和 4 位_____是活性必要基团。

三、简答题（每题 15 分，共 30 分）

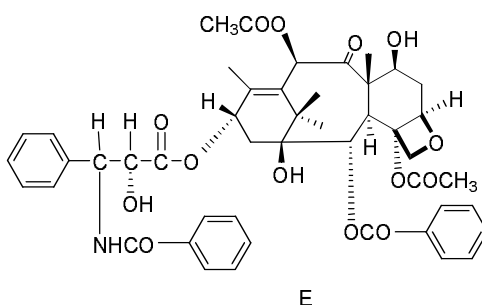
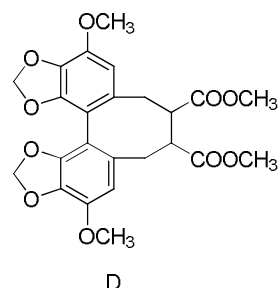
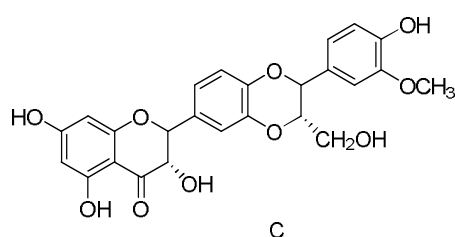
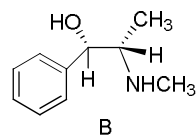
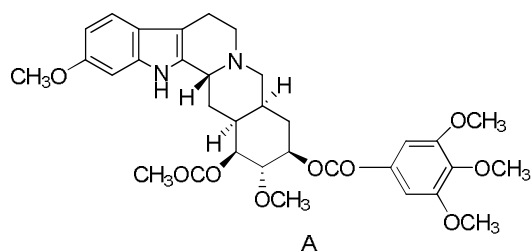
- 1、试写出药物贝诺酯的合成路线。
- 2、试写出二氢吡啶类钙拮抗剂类药物的构效关系。

四、论述题（20 分）

写出苄青霉素、苯唑青霉素、氨苄青霉素的化学结构，试阐述其结构变化对其抗菌谱的影响。

天然药物化学部分

一、写出下列化合物的中文或英文名称，并说明其结构类型、生物来源及主要生理活性（每题 4 分，共 20 分）



二、选择题（每题 2 分，共 20 分）

- 从药材中依次提取不同极性的成分，应采取的溶剂顺序是（ ）
 - 石油醚、醋酸乙酯、乙酸、乙醇
 - 乙醇、醋酸乙酯、乙醚、石油醚
 - 乙醇、石油醚、乙醚、醋酸乙酯
 - 石油醚、乙醚、醋酸乙酯、乙醇
- 醌类化合物结构中只具有对醌形式的是（ ）
 - 苯醌
 - 萘醌
 - 蒽醌
 - 菲醌
- 生物碱薄层层析中常用的显色剂是（ ）
 - 硅钨酸
 - 碘化铋钾
 - 改良碘化铋钾
 - 碘-碘化钾
- 化合物在进行薄层色谱时，常碰到两边斑点 R_f 值大，中间 R_f 值小，其原因是（ ）
 - 点样量不一
 - 色谱板铺的不均匀
 - 边缘效应
 - 色谱缸底部不平整
- 环烯醚萜类多以哪种形式存在（ ）

A. 酯 B. 游离 C. 苷 D. 萜源功能基

6. 生物碱在自然界分布最多的是 ()

A. 单子叶植物 B. 裸子植物 C. 双子叶植物 D. 菌类

7. 人参中的主要成分属于 ()

A. 五环三萜皂苷 B. 四环三萜皂苷
C. 环烯醚萜苷 D. 甾体皂苷

8. 活性皂苷化合物一般不做成针剂, 这是因为 ()

A. 不能溶于水 B. 产生泡沫
C. 有溶血作用 D. 久置产生沉淀

9. 在天然产物中得到的第一个碱性成分是 ()

A. 阿托品 B. 可待因 C. 金鸡纳碱 D. 吗啡

10. 对水及其它溶剂溶解度都小, 且苷键难于被酸所裂解的苷是 ()

A. N-苷 B. C-苷 C. S-苷 D. O-苷

三、填空题 (每空 1 分, 共 15 分)

1. 天然化合物的主要生物合成途径有: 乙酸-丙二酸途径, _____, _____, _____和复合途径。

2. 香豆素及其苷的分子中具有_____结构, 在_____溶液中水解生成顺邻羟基桂皮酸盐而溶于水, 该水溶液一经_____, 即闭环恢复为内酯。

3. 黄酮类化合物的基本骨架类型为_____。

4. 三萜是由_____个碳原子组成的萜类化合物, 根据异戊二烯规则, 多数三萜被认为是由_____个异戊二烯缩合而成。

5. 青蒿素来源于植物_____, 其药理作用主要表现为_____; 香菇多糖的主要作用与用途是_____; 银杏制剂的主要有效成分为_____和_____, 其主要活性是_____。

四、简答题 (20 分)

1. 分别以生物碱、萜类、多酚类衍生物 (酚、醌、苯丙素、黄酮)、甾体四大类型中的任意一个具有药用活性的化合物为论述对象, 对自己选定的四个化合物的中英文名称、主要来源、活性、毒性、药用前景等方面展开论述 (12 分)。

2. 从天然药物中分离生物活性物质的方法主要有哪些? 各有什么利弊? 请举例说明 (8 分)。

五、结构解析 (15 分)

从某植物根中分得一黄酮类化合物, 白色针晶, mp. 178-180℃, 可溶于热 NaOH 溶液, 呈黄色, Mg-HCl 反应黄色, 元素分析实测值 (%): C 71.10, H 5.22, O 23.68

EI-MS (70 eV): m/z 270 [M^+], 255, 242, 166 (100%), 104。

UV (MeOH) λ_{\max} 210, 259, 325 nm;

IR (KBr) ν_{\max} : 3400 (br), 1670, 1640 cm^{-1} ;

^1H NMR (DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.97 (1H, s, D_2O 交换后消失), 7.45 (5H, brs), 6.28 (1H, d, $J = 2.2$ Hz), 6.04 (1H, d, $J = 2.2$ Hz), 3.91 (3H, s), 5.45 (1H, dd), 3.06~3.88 (2H, m);

试根据以上数据计算其分子式、不饱和度, 推测可能的结构, 并说明判断依据, 解释和归属其主要光谱和波谱数据。