

药物化学总复习题

第一 ~ 四章 总论

一、选择题

- 药物的亲脂性与药理活性的关系是（ D ）。
A. 降低亲脂性，有利于药物在血液中运行，活性增加
B. 降低亲脂性，使作用时间缩短，活性下降
C. 降低亲脂性，不利吸收，活性下降
D. 适度的亲脂性有最佳活性
- 用于测定药物分配系数 P 值的有机溶剂是（ D ）。
A. 氯仿 B. 乙酸乙酯 C. 乙醚 D. 正辛醇
- 药物在生物相中物质的量浓度与在水相中物质的量浓度之比，称为（ A ）。
A. 药物分配系数 B. 解离度 C. 亲和力 D. 内在活性
- 可使药物亲脂性增加的基团是（ A ）。
A. 烷基 B. 氨基 C. 羟基 D. 羧基
- 可使药物亲水性增加的基团是（ C ）。
A. 烷基 B. 苯基 C. 羟基 D. 酯基
- 药物的解离度与药理活性的关系是（ C ）。
A. 增加解离度，有利吸收，活性增加 B. 增加解离度，离子浓度上升，活性增强
C. 合适的解离度，有最大活性 D. 增加解离度，离子浓度下降，活性增强
- 作用于的中枢药物以（ B ）形式通过血脑屏障产生药理作用。
A. 离子 B. 分子 C. 盐 D. 络合物
- 药物分子以（ B ）形式通过消化道上皮细胞脂质膜而被吸收。
A. 离子 B. 分子 C. 盐 D. 离子对
- 由于药物与特定受体相互作用而产生某种药效的是（ A ）。
A. 结构特异性药物 B. 结构非特异性药物 C. 原药 D. 软药
- 产生某种药效并不是由于与特定的受体相互作用的药物是（ B ）。
A. 结构特异性药物 B. 结构非特异性药物 C. 原药 D. 软药
- 药物与受体结合的构象称为（ D ）。
A. 反式构象 B. 优势构象 C. 最低能量构象 D. 药效构象
- 经典的电子等排体是（ D ）。
A. 电子层数相同的 B. 理化性质相同
C. 电子总数相同的 D. 最外层电子数相同
- 生物电子等排体是指（ D ）的原子、离子或分子，可以产生相似或相反药理活性。
A. 电子层数相同的 B. 理化性质相同
C. 电子总数相同的 D. 最外层电子数相同
- 水解反应是（ C ）类药物在体内代谢的主要途径。
A. 醚 B. 胺 C. 酯 D. 羧酸
- 下列药物的体内代谢途径中属于第 I 相生物转化的是（ B ）。
A. 葡萄糖醛酸结合 B. 氧化反应 C. 硫酸酯化结合 D.

氨基酸轭合

19. 下列药物的体内代谢途径中属于第Ⅱ相生物转化的是（ B ）。
A. 水解反应 B. 葡萄糖醛酸轭合 C. 氧化反应 D. 还原反应
20. 下列药物的体内代谢途径中属于第Ⅱ相生物转化的是（ C ）。
A. 水解反应 B. 氧化反应 C. 硫酸酯化轭合 D. 还原反应
21. 先导化合物是指（ C ）
A. 理想的临床用药 B. 结构全新化合物
C. 具有某种生物活性的化学结构，可作为结构修饰和结构改造的化合物
D. 不具有生物活性的化合物
22. 下列优化先导化合物的途径是（ C ）。
A. 自天然产物中 B. 组合化学 C. 前药原理 D. 随机筛选
23. 下列优化先导化合物的途径是（ C ）。
A. 自天然产物中 B. 组合化学 C. 生物电子等排 D. 随机筛选
24. 下列发现先导化合物的途径是（ A ）。
A. 自天然产物中 B. 剖裂原理 C. 前药原理 D. 类似物
25. 下列发现先导化合物的途径是（ A ）。
A. 基于生物转化发现 B. 剖裂原理 C. 前药原理 D. 软药原理
26. 下列发现先导化合物的途径是（ A ）。
A. 组合化学 B. 剖裂原理 C. 前药原理 D. 软药原理
27. 我国发现的抗疟新药青蒿素，作为开发抗疟药的先导化合物发现的途径是（ C ）。
A. 从随机筛选中发现 B. 从生命基础研究发现
C. 从天然产物中发现 D. 经组合化学方法发现
28. 以生物化学为基础发现先导物的是（ B ）。
A. 青蒿素 B. 卡托普利 C. 长春碱 D. 红霉素
29. 基于生物转化发现先导物的是（ A ）。
A. 扑热息痛 B. 青蒿素 C. 红霉素 D. 红霉素
30. 药物的潜伏化是指（ A ）。
A. 指经化学结构修饰后，体外无活性或活性很低，在体内经酶或非酶作用能转化为原来药物发挥作用的化合物
B. 药物经化学结构修饰得到的化合物
C. 将有活性的药物，转变为无活性的化合物
D. 无活性或活性很低的化合物
31. 药物连接暂时转运基团，得到无活性或活性很低的化合物，在体内经在体内经酶或非酶作用又转变为原来的药物发挥药效，此化合物称为（ A ）。
A. 前药 B. 硬药 C. 孪药 D. 软药
32. 与前体药物设计的目的不符的是（ C ）。
A. 提高药物的化学稳定性 B. 消除不适宜的制剂性质
C. 提高药物的活性 D. 延长药物的作用时间

二、名词解释

1. 构效关系（SAR）：研究药物的化学结构和药效之间的关系。

药物动力相：药物从用药部位经吸收、分布和消除，到达最终作用部位的过程。

2. 药效相：药物和受体在靶组织相互作用的过程。
3. 首过效应：药物自小肠吸收进入血液循环，首先进入肝脏。肝脏对一部分（甚至全部）药物分子进行代谢，使药物活性降低，这种过程称为首过效应。
4. 消除：药物经口服途径进行肝代谢，经肾和胆汁进行排泄，这些过程总称为消除。
5. 生物利用度：表征药物进入血液循环中药量的份额和吸收的速率。
6. 药物分配系数（ P 值）：药物在生物相中物质的量浓度与在水相中物质的量浓度之比。
7. 疏水常数（ π 值）：指分子被基团 X 取代后的 $\lg P_X$ 与母体化合物的 $\lg P_H$ 之差，表达药物取代基的疏水性。
8. 结构特异性药物：能与特定受体结合产生药效的药物。
9. 结构非特异性药物：产生某种药效并不是由于与特定的受体相互作用，而是取决于药物的物理化学性质的药物。
10. 亲和力：药物-受体复合物的缔合速度常数除以复合物解离速度常数，表示药物-受体结合的能力。
11. 药效团：指在药物在与受体相互作用生成复合物过程中，能为受体识别并与之结合的药物分子的三维结构的组合。
12. 生物电子等排体：指具有相似的理化性质，可以产生相似或相反药理活性的分子或基团。
13. QSAR（定量构效关系）：将药物的化学结构、理化性质与生物活性之间的关系用数学方程式 $\phi = F(C)$ 定量表示出来。
14. 药物代谢：在酶的作用下将药物转变成极性分子，再通过人体的排泄系统排出体外。
15. 第一相生物转化（Phase I 生物转化）：在酶的催化下，在药物分子中引入或暴露极性基团。
16. 第二相生物转化（Phase II 生物转化，轭合反应）：极性药物或 I 相代谢产物在酶的催化下与内源性小分子如葡萄糖醛酸、硫酸等结合，生成极性大或易溶于水的结合物。
17. ω 氧化：含长碳链的烷烃化合物在倒数第一个碳原子上进行的氧化。
18. $\omega-1$ 氧化：含长碳链的烷烃化合物在倒数第二个碳原子上进行的氧化。
19. 葡萄糖醛酸轭合：极性药物或 I 相代谢产物在酶的催化下与葡萄糖醛酸结合，生成易溶于水的结合物。
20. 硫酸酯化轭合：极性药物或 I 相代谢产物在酶的催化下与内源性硫酸结合，生成易溶于水的结合物。
21. 先导物（先导化合物）：是通过各种途径或方法得到的具有某种生物活性，但又存在一些缺陷的化合物。
22. 组合化学：基于一系列组建模块可能发生不同的组合方式，快速合成数目巨大的化学实体，构建化合物库。
23. 反义寡核苷酸：根据碱基配对的原则，基于 DNA 或 mRNA 的结构设计药物分子的一种方法。
24. 割裂物：对结构比较复杂的天然产物作分子剪切所得的化合物。
25. 类似物：对先导物结构作局部变换或修饰所得的化合物。

26. 同系物：分子间的差异只有亚甲基的数目不同的化合物。

27. 插烯物：在分子中引入双键形成的化合物。
28. 药物的潜伏化：将有活性的原药转变成无活性的化合物，后者在体内经酶或化学作用，生成原药，发挥药理作用。
29. 前药：指用化学方法将有活性的原药连接转运基团，转变为无活性的药物，此药在体内经酶或非酶解作用释放出原药而发挥疗效。
30. 软药：指本身具有活性的药物，在体内产生药理作用后可按预知方式和可控速率经代谢转化成无活性的产物。
31. 硬药：指含有药理活性所必需的基团，但不易被代谢或化学方法进行转化的药物。

三、简答题

1. 药物的第 I 相生物转化的主要目的是什么？第 II 相生物转化的主要途径有哪一种？

答：第一相生物转化的主要目的是增加药物的极性，使之容易排泄。

第 II 相生物转化有如下几种途径：①葡萄糖醛酸结合；②硫酸结合；③氨基酸结合；④谷光甘肽或巯基尿酸结合；⑤甲基化反应；⑥乙酰化反应。

2. 简述发现先导物的主要途径。

答：(1) 由天然有效成分获得，包括植物、微生物和内源性活性物质；

(2) 反义核苷酸；

(3) 基于生物大分子结构和作用机理设计；

4 组合化学；

(5) 基于生物转化发现。

3. 叙述前药与软药设计的区别。

答：(1) 前药是指用化学方法由有活性原药转变的无活性衍生物，后者在体内经酶或非酶解作用释放出原药而发挥疗效。(2) 软药系本身具有活性，在体内产生药理作用后可按预知方式和可控速率经进一步代谢转化成无活性产物的药物。

4. 前药的主要特征是什么？

答：(1) 原药与暂时转运基团以共价键连接，并且在体内可断裂，形成原药；

(2) 前药无活性或活性低于原药；

(3) 前药与暂时转运基团无毒性；

(4) 前药在体内产生原药的速率是快速的，以保障原药在作用部位有足够的药物浓度，并且应尽量减低前药的直接代谢。

5. 先导化合物进行前药修饰的目的是什么？

答：(1) 增加脂溶性以提高吸收性能；(2) 部位特异性；(3) 增加药物的化学稳定性；(4) 消除不适宜的制剂性质；(5) 延长作用时间。

第五章 镇静催眠、抗癫痫和抗精神失常药

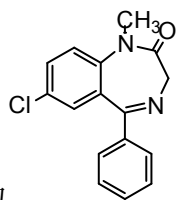
1. 苯二氮卓类镇静催眠药的化学结构中含有 (B) 母核。

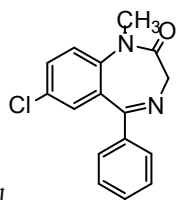
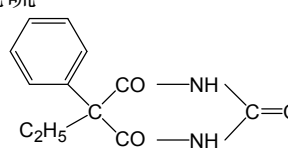
A. 5-苯基-1, 3-苯并二氮卓

B. 5-苯基-1, 4-苯并二氮卓

C. 5-苯基-1, 5-苯并二氮卓

D. 2-苯基-1, 3-苯并二氮卓



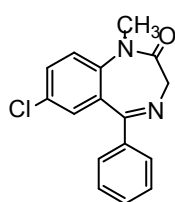
2. 化学结构为  药物是 (A)。
 - A. 地西洋
 - B. 奥沙西洋
 - C. 苯巴比妥
 - D. 苯妥英钠
3. 地西洋化学结构中的母核是 (A)。
 - A. 5-苯基-1, 4-苯二氮卓环
 - B. 5-苯基-1, 4-二氮卓环
 - C. 5-苯基-1, 5-苯二氮卓环
 - D. 5-苯基-1, 3-苯二氮卓环
4. 巴比妥类药物的具有内酰胺-内酰亚胺互变异构, 故它们呈现 (A)。
 - A. 酸性
 - B. 中性
 - C. 碱性
 - D. 两性
5. 具有二酰亚胺结构的药物是 (D)。
 - A. 地西洋
 - B. 奋乃静
 - C. 水合氯醛
 - D. 苯巴比妥
6. 以下主要与巴比妥类药物药效无关的因素是 (B)。
 - A. 酸性解离常数
 - B. 取代基的立体因素
 - C. 药物的油水分布系数
 - D. 药物的代谢
7. 以下主要与巴比妥类药物药效无关的因素是 (C)。
 - A. 酸性解离常数
 - B. 药物的油水分布系数
 - C. 药物的稳定性
 - D. 药物的代谢
8. 巴比妥类药物 $\lg P$ 值一般在 (B) 左右。
 - A. 4
 - B. 2
 - C. 0
 - D. -2
9. 巴比妥类药物若 2 位碳上的氧原子以其电子等排体硫取代, 解离度和脂溶性增大, 故起效快, 为 (D) 时间作用巴比妥类药物。
 - A. 长
 - B. 中
 - C. 短
 - D. 超短
10. 巴比妥类药物的主要代谢途径是 (B)。
 - A. 水解开环
 - B. 5 位取代基的氧化
 - C. 氮上脱烷基
 - D. 脱硫
11. 化学结构为  的药物为 (D)。
 - A. 海索比妥
 - B. 司可巴比妥
 - C. 硫喷妥钠
 - D. 苯巴比妥
12. 可鉴别苯巴比妥和戊巴比妥的试剂是 (D)。
 - A. 硝酸银
 - B. 硝酸汞
 - C. 吡啶和硫酸铜
 - D. 甲醛与硫酸
13. 不是用来鉴别苯巴比妥和苯妥英钠的试剂是 (D)。
 - A. 硝酸银
 - B. 硝酸汞
 - C. 吡啶和硫酸铜
 - D. 甲醛与硫酸
14. 下列叙述与苯妥英钠不相符的是 (B)。
 - A. 水溶液呈碱性
 - B. 水溶液与硝酸汞试液反应生成白色沉淀溶于氨试液
 - C. 与硫酸铜试液反应显蓝色
 - D. 抗癫痫药
15. 下列与吩噻嗪类抗精神失常药构效关系不符的是 (D)。
 - A. 2 位吸电子基取代, 活性增强
 - B. 氯丙嗪的 2-氯原子用三氟甲基取代, 活性增强
 - C. 侧链上的二甲氨基用碱性杂环取代, 活性增强
 - D. 吩噻嗪母核与侧链上碱性氨基之间相隔 2 个碳原子距离最佳
16. 盐酸氯丙嗪具有 (C)

) 结构, 易氧化, 在空气或日光中放置, 渐变为红棕色。

- A. 酚羟基 B. 氨基 C. 吩塞嗪 D. 氯原子

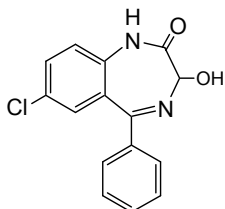
二、写出下列药物的结构或名称及主要药理作用

1. 地西洋



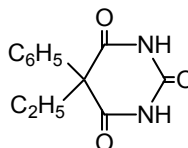
镇静催眠

2. 奥沙西洋



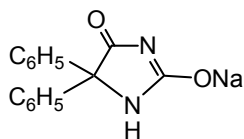
镇静催眠

3. 苯巴比妥



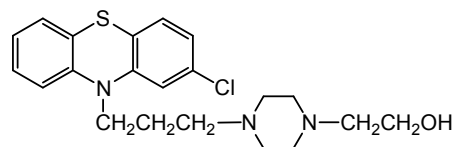
镇静催眠

4. 苯妥英钠



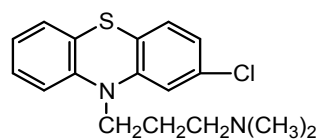
抗癫痫

5. 氯丙嗪



抗精神失常药

6. 奋乃静



抗精神失常药

三、合成题

1. 以 $\text{H}_2\text{C}(\text{COOC}_2\text{H}_5)_2$ 为原料合成 。

答: 丙二酸二乙酯与相应的卤烃在醇钠的催化下引入 2, 2 二取代基, 再与脲在醇钠催化下缩合而成。

2. 以 $\text{C}_6\text{H}_5\text{-CH}_2\text{COOC}_2\text{H}_5$ 为原料合成

答: 苯乙酸乙酯为原料, 在醇钠催化下与草酸二乙酯进行缩合后, 加热脱羧基, 制得 2-苯基丙二酸二乙酯, 再进行乙基化, 最后与脲缩合而得苯巴比妥。

四、简答题

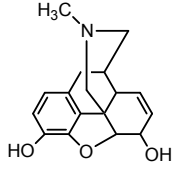
1. 简述巴比妥类药物的构效关系。

答: 巴比妥类药物属于非特异性药物, 作用强度、快慢、作用时间长短主要取决于药物的理化性质。

① 酸性解离常数影响药效。5, 5-二取代巴比妥类分子与巴比妥酸及 5-单取代巴比妥相比, 酸性减弱, 在生理条件下具有相当比例的分子态, 可使药物口服吸收并易进入大脑而发挥作用。

- ② **油水分配系数对药效影响**。 C_5 上二个取代基，其碳原子总数必须在 6-10 之间，使油水分配系数保持一定比值，才有良好镇静催眠作用。氮原子上引入甲基，降低了解离度而增加了脂溶性，因而起效快，作用时间短。2 位碳上的氧原子以硫取代，解离度和脂溶性增加，故起效快，持续时间很短。
- ③ **C_5 上的取代基氧化，是巴比妥类药物代谢最主要途径**。如是苯环，往往在其对位氧化成酚羟基，由于其不易被代谢而易被从吸收，因而作用时间长。
2. 巴比妥类药物的钠盐为何制成粉针剂？
- 答: **巴比妥类药物钠盐呈弱碱性**，为环酰脲类化合物，不稳定，易发生水解开环反应，水解速度及产物与 pH 及温度有关。此类钠盐水溶液放置时，一般水解开环生成酰脲类化合物而失效，在加热灭菌时更不稳定。所以常制成粉针剂供药用。
3. 如何区分苯巴比妥的钠盐及苯妥英钠？
- 答: (1) 苯巴比妥的钠盐水溶液与硝酸银或硝酸汞试液作用，生成白色沉淀，可溶于碳酸钠或氨试液；与吡啶和硫酸铜溶液作用生成**紫红色**。(2) 苯妥英钠水溶液与硝酸银或硝酸汞试液反应，均生成白色沉淀，但不溶于氨试液中；与吡啶硫酸铜试液反应呈**蓝色**。
4. 简述氯丙嗪的不稳定性及通常采取保护措施。
- 答: 氯丙嗪结构中具有吩噻嗪环，易被氧化不稳定，无论其固体或水溶液，在空气和日光中均易氧化变红色或棕色。其溶液可加对氢醌、连二亚硫酸钠、亚硫酸氢钠或维生素 C 等抗氧化剂，均可阻止其变色。应盛于避光容器，密闭保存。

第七章 镇痛药

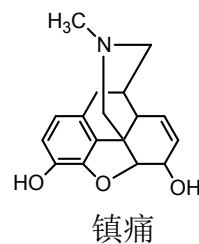
1. 镇痛药通过与体内的 (C) 受体作用而呈现药理作用。
A. 肾上腺素能受体 B. H 受体 C. **阿片受体** D. 多巴胺受体
2. 合成镇痛药按化学结构可分为 (A)。
A. **哌啶类、氨基酮类、吗啡喃类、苯吗喃类、其他类**
B. 哌啶类、氨基酮类、苯吗喃类、其他类
C. 吗啡类、哌啶类、氨基酮类、吗啡喃类、苯吗喃类
D. 吗啡类、氨基酮类、吗啡喃类、其他类
3. 以下与吗啡的化学结构不符的是 (C)
A. 酚羟基 B. 哌啶环 C. **含有四个环状结构** D. 含有 5 个手性中心
4. 下列属于哌啶类的合成镇痛药的是 (C)
A. 曲马朵 B. 喷他佐辛 C. **哌替啶** D. 美沙酮
5. 化学结构为  的药物是 (C)。

- A. 哌替啶 B. 芬太尼 C. **吗啡** D. 美沙酮
6. 下列药物中，为合成镇痛药，化学结构属哌啶类，镇痛作用弱于吗啡，有成瘾性的是 (C)。
A. 曲马朵 B. 喷他佐辛 C. **哌替啶** D. 美沙酮

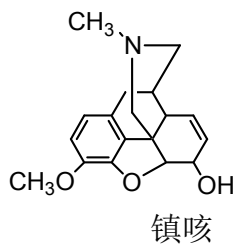
7. 下列药物中, 为合成镇痛药, 化学结构属哌啶类, 镇痛作用强于吗啡的是 (A)。
A. 芬太尼 B. 喷他佐辛 C. 地左辛 D. 美沙酮
8. 下列药物中为阿片受体拮抗剂, 临床用于吗啡等引起的呼吸抑制的解救的是 (A)。
A. 纳洛酮 B. 喷他佐辛 C. 哌替啶 D. 美沙酮
9. 以下与吗啡和合成镇痛药化学结构特点不相符的是 (B)。
A. 一个碱性中心, 并在生理 pH 下能电离为阳离子
B. 碱性中心和平坦的芳环结构不在一个平面上
C. 烃基链部分凸出于平面前方
D. 分子中具有一个平坦的芳环结构
10. 吗啡、人工合成镇痛药及脑啡肽均具有镇痛作用, 是因为 (C)。
A. 具有相同的优势构象 B. 具有相似的基本结构
C. 具有共同的药效构象 D. 化学结构具有很大的相似性
11. 吗啡易被氧化变色是因为分子中含有 (B)。
A. 醚基 B. 酚羟基 C. 哌啶基 D. 醇羟基
12. 盐酸吗啡注射液放置过久, 颜色变深, 这是发生了 (A)。
A. 氧化反应 B. 还原反应 C. 聚合反应 D. 水解反应
13. 吗啡及其盐在光的催化下可被空气中的氧化, 生成毒性大的 (A)。
A. 双吗啡 B. 阿扑吗啡 C. 可待因 D. N-氧化吗啡
14. 吗啡在盐酸或磷酸存在下加热, 发生脱水及分子重排反应生成的化合物是 (C)。
A. N-氧化吗啡 B. 可待因 C. 阿扑吗啡 D. 双吗啡
15. 下列药物中为天然生物碱, 镇痛作用强, 成瘾性大的是 (B)。
A. 芬太尼 B. 吗啡 C. 可待因 D. 美沙酮
16. 将吗啡分子中 3 位酚羟基甲基化所得药物是 (B)。
A. 美沙酮 B. 可待因 C. 哌替啶 D. 喷他佐辛

二、写出下列药物的结构或名称及主要药理作用

1. 吗啡



2. 可待因



3. 哌替啶



三、简答题

1. 吗啡在盐酸或磷酸存在下加热会生成何物质? 药典中如何检查吗啡中此副产物?

答: 吗啡在盐酸或磷酸存在下加热生成**阿扑吗啡**。阿扑吗啡在碳酸氢钠水溶液中加入碘溶液被氧化, 在水及醚存在时, 水层为棕色, 醚层为红色, 利用这个反应可以检查吗啡中是否有阿扑吗啡。

2. 可待因由何种原料制备而成? 如何检查可待因中混入微量原料?

答：可待因由吗啡甲基化制备而成。**吗啡与亚硝酸反应**，能生成 2-亚硝基吗啡，加入氨水至碱性时显黄棕色。应用此反应可检查可待因中混入的微量吗啡。

3. 简述吗啡及合成镇痛药的立体结构特征。

答：(1)分子中具有一个平坦的芳环结构，与受体的平坦区通过范德华力结合；
(2)有一个叔氮原子的碱性中心，在生理 pH 条件下，大部分电离为阳离子正电中心，与受体表面的阴离子部位缔合；
(3)联结它们两者之间的烃链部分突出于平面的前方，正好与受体的凹槽相适应。

第十章 肾上腺素能药物

1. 肾上腺素能药物作用的受体是 (A)。

A. **α 受体或 β 受体** B. 阿片受体 C. H 受体 D. 多巴胺受体

2. 下列哪种性质与去甲肾上腺素相符 (B)。

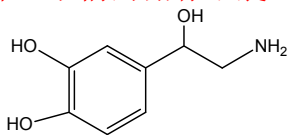
A. 在酸性或碱性条件下均易水解 B. **在空气中放置可被氧化，颜色逐渐变黄至深棕色**

C. 易溶于水而不溶于氢氧化钠溶液 D. 不具有旋光性

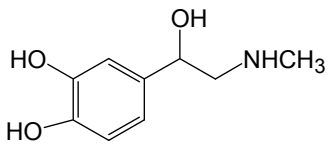
3. 绝大部分排入间隙的去甲肾上腺素的归宿是 (C)。

A. 与肾上腺素能受体起反应产生生理作用 B. 被酶代谢失活

C. 被重摄入神经末梢而储存于囊泡中 D. 被排泄

4. 化学结构为  的药物是 (B)。

A. 肾上腺素 B. **去甲肾上腺素** C. 沙丁胺醇 D. 氯丙那林

5. 下面结构  的药物名称是 (D)。

A. 麻黄碱 B. 多巴胺 C. 去甲肾上腺素 D. **肾上腺素**

6. 肾上腺素作用于 (C) 受体。

A. α 受体 B. β 受体 **C. α 受体和 β 受体** D. β_2 受体

7. 去甲肾上腺素为 (A)。

A. 左旋体 B. 右旋体 C. 外消旋体 D. 内消旋体

8. 重酒石酸去甲肾上腺素在 pH6.5 的缓冲液中加碘液，氧化生成去甲肾上腺素红，用硫代硫酸钠使碘色消退，溶液显 (B)。

A. 绿色 **B. 红色** C. 蓝色 D. 黑色

9. 肾上腺素能药物的基本结构是 (B)。

A. 苯胺 **B. 苯乙胺** C. 苯丙胺 D. 苄胺

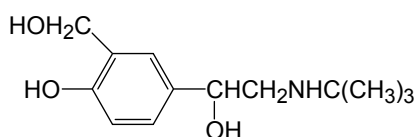
10. 增强肾上腺素能药物的 β 受体激动作用采取的办法是 (D)。

A. 去掉侧链上的羟基 B. 去掉苯环上的酚羟基
C. 在 α -碳上引入甲基 **D. 在氨基上以异丙基或叔丁基取代**

11. 盐酸克仑特罗临床用于 (D)。

A. 支气管哮喘性心搏骤停 B. 抗休克

- C. 升血压 D. 防治支气管哮喘和喘息型支气管炎
 12. 下列结构的药物名称是 (A)。

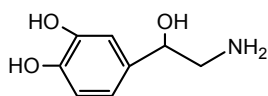


- A. 沙丁胺醇 B. 麻黄碱 C. 克仑特罗 D. 去甲肾上腺素
 13. 具有儿茶酚胺结构的肾上腺素能激动剂，苯环上电子密度高，极易发生 (A) 反应。
 A. 氧化 B. 还原 C. 水解 D. 缩合
 14. 具有儿茶酚胺结构的肾上腺素能激动剂，苯环上电子密度高，极易发生 (A)。
 A. 自动氧化 B. 自动还原 C. 自动水解 D. 自动分解
 15. 在碱性介质中，酚类药物的苯氧负离子增多使自动氧化 (B)。
 A. 减慢 B. 加快 C. 速度不变 D. 不确定
 16. 长效类 α 受体阻断剂与 α 受体亲核基团发生烷基化反应，生成稳定的 (C) 化合物，不能被肾上腺素逆转，所以作用较持久。
 A. 氢键 B. 离子键 C. 共价键 D. 偶极键
 17. β 受体阻断剂侧链氨基上的取代基常为仲胺结构，其中，以 (C) 取代效果较好。
 A. 甲基 B. 乙基 C. 异丙基或叔丁基 D. 苄基

18. 化学结构为 的药物是 (C)。
 A. 地尔硫卓 B. 美西律 C. 普萘洛尔 D. 维拉帕米

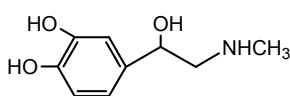
二、写出下列药物的结构或名称及主要药理作用

1. 去甲肾上腺素



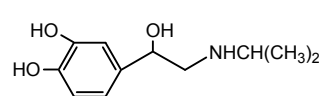
肾上腺素能受体激动剂

2. 肾上腺素



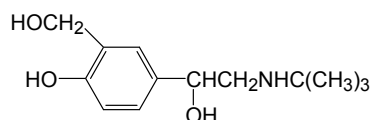
肾上腺素能受体激动剂

3. 异丙肾上腺素



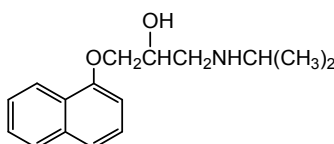
β 受体激动剂

4. 沙丁胺醇



β_2 受体激动剂

5. 普萘洛尔



β 受体拮抗剂

三、简答题

1. 简述儿茶酚胺类肾上腺素药的化学不稳定性。

答：①结构中有两个邻位酚羟基，苯环上电子云密度高，极易自动氧化而呈色。

特别是在碱性介质中，由于苯氧负离子增多使自动氧化加快。金属离子可催化该氧化反应。

②如果肾上腺素能激动剂的β碳原子具手性中心，其水溶液室温放置后发生消旋化而降低效价，在加热或酸性条件下，消旋化速度更快。

2. 简述苯乙胺类肾上腺素能激动剂的构效关系。

答：(1) 具有苯乙胺的母体结构。

(2) 苯环上羟基可显著地增强拟肾上腺素作用，3, 4-二羟基化合物比含一个羟基的化合物活性大。

(3) 侧链的β羟基是与受体复合时形成氢键的有利条件。与β羟基相连碳原子的立体构型与活性有关，R构型具有较大的活性。

(4)侧链氨基上被非极性烷基取代时，基团的大小对受体的选择性有密切关系。在一定范围内，取代基愈大，对β受体选择性也愈大。但氨基上必须保留一个氢未被取代。

(5) 在侧链的α碳原子上引入甲基，阻碍单胺氧化酶对其代谢，可延长作用时间。

3. 举例说明侧链氨基的取代对拟肾上腺素药构效关系的影响。

答：侧链氨基上被非极性烷基取代时，基团的大小对受体的选择性有密切关系。在一定范围内，取代基愈大，对β受体选择性也愈大。但氨基上必须保留一个氢未被取代，N-双烷基取代可使活性下降，毒性增大。例如，无取代的去甲肾上腺素主要为α受体激动剂，肾上腺素的N-甲基取代，为α和β受体激动剂，当N-取代为异丙基，如异丙肾上腺素，主要为β受体激动剂。

第十二章 心血管药物

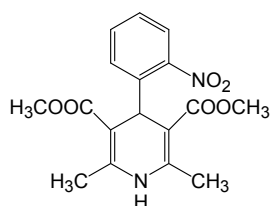
1. 地高辛属于（ A ）强心药。

A. 强心苷类 B. 磷酸二酯酶抑制剂 C. β受体激动剂 D. 钙敏化药

2. 磷酸二酯酶抑制剂对于PDE的抑制使（ C ）水平增高导致强心作用。

A. ATP B. AMP C. cAMP D. PDE

3. 化学结构 为 的药物是（ A ）。

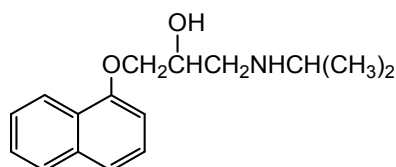


A. 硝苯地平 B. 维拉帕米 C. 地尔硫卓 D. 普萘洛尔

4. 下列药物中属于二氢吡啶类钙拮抗剂，用于抗心绞痛的是（ B ）。

A. 维拉帕米 B. 硝苯地平 C. 盐酸普萘洛尔 D. 卡托普利

5. 下面化学结构 的药物是（ A ）。



A. 普萘洛尔 B. 美西律 C. 地尔硫卓 D. 维拉帕米

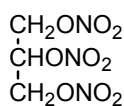
6. 下列药物中含有芳烷基胺结构的是（ A ）。

A. 维拉帕米 B. 硝苯地平 C. 地尔硫卓 D. 甲基多巴

7. 抗心律失常按作用机理分为 (A) 两大类。
 A. 离子通道阻断剂和 β 受体阻断剂 B. 钠通道阻断剂和 β 受体阻断剂
 C. 钙拮抗剂和钠通道阻断剂 D. 钾通道阻断剂和钙拮抗剂
8. 下列可用于抗心律失常的药物是 (A)。
 A. 喹尼丁 B. 辛伐他汀 C. 氯贝丁酯 D. 卡托普利
9. 利舍平分子中有两个酯键, 其在酸、碱催化下水溶液可发生 (A), 生成利舍平酸。
 A. 水解 B. 氧化 C. 聚合 D. 差向异构化
10. 甲基多巴由于分子中有两个相邻的酚羟基, 易 (A) 变色, 因此, 制剂中常加入亚硫酸氢钠或维生素 C 等以增加其稳定性, 同时应避光保存。
 A. 氧化 B. 水解 C. 还原 D. 分解
11. 血管紧张素转化酶 (ACE) 抑制剂可以 (A)。
 A. 抑制血管紧张素 II 的生成 B. 阻断钙离子通道
 C. 抑制体内胆固醇的生物合成 D. 阻断 β 受体
12. 降压药卡托普利属于 (C)。
 A. 血管紧张素 II 受体拮抗剂 B. 钙敏化剂
 C. 血管紧张素转化酶抑制剂 D. HMG-CoA 还原酶抑制剂
13. 氯贝丁酯在体内迅速水解为活性产物 (A), 约 95% 与血浆蛋白结合。
 A. 氯贝酸 B. 乙醇 C. 双贝特 D. 烟酸
14. 下列不具有抗高血压作用的药物是 (B)。
 A. 卡托普利 B. 氯贝丁酯 C. 盐酸普萘洛尔
 D. 利血平
15. 羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑制剂可以 (B)。
 A. 抑制血管紧张素 I 向血管紧张素 II 的转化
 B. 抑制胆固醇合成过程中的限速酶 HMG-CoA 还原酶
 C. 降低血中甘油三酯的含量
 D. 促进胆固醇的排泄
16. 下列用于降血脂的药物是 (B)。
 A. 地尔硫卓 B. 辛伐他汀 C. 维拉帕米 D. 硝苯地平
17. 辛伐他汀降低胆固醇的作用是通过 (C), 并且与增加 LDL 受体有关。
 A. 帮助胆固醇转运、代谢及排泄 B. 促使胆酸排泄
 C. 抑制 HMG-CoA 还原酶 D. 降低血中甘油三酯的含量
18. 洛伐他汀属于 (D)。
 A. NO 供体药物 B. 血管紧张素转化酶抑制剂
 C. 血管紧张素 II 受体拮抗剂 D. HMG-CoA 还原酶抑制剂

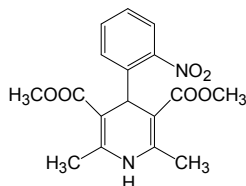
二、写出下列药物的结构或名称及主要药理作用

1. 硝酸甘油



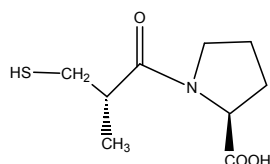
抗心绞痛

2. 硝苯地平



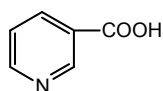
钙拮抗剂

3. 卡托普利



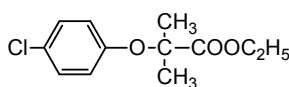
降血压

4. 烟酸



降血脂

5. 氯贝丁酯



降血脂

三、简答题

1. 简述抗心绞痛药的分类及其作用机理。

答：(1) 硝酸酯及亚硝酸酯类，在平滑肌细胞及血管内皮细胞中产生 NO 而舒张血管；

(2) 钙拮抗剂，抑制细胞外钙离子内流，使心肌和血管平滑肌细胞缺乏足够的钙离子，导致心肌的收缩力减弱，心率减慢，同时，血管松弛，血压下降，因而减少心肌作功量和耗氧量；

(3) β 受体阻断剂，阻断儿茶酚胺，减慢心率，减弱心肌收缩力，从而减少耗氧量，缓解心绞痛。

2. 简述二氢吡啶类钙拮抗剂的构效关系。

答：(1) 1, 4-二氢吡啶环为必要基团，如氧化为吡啶，作用消失。

(2) 二氢吡啶的氮原子上不宜有取代基。

(3) 二氢吡啶的 2, 6 位以低级烃为最适宜的取代基。

(4) C3, 5-位取代基为酯基是必要的，如换为乙酰基或氰基则活性大为降低。

(5) C4 为手性时有立体选择作用。

(6) 4 位的苯基的取代基以邻、间位取代为宜。

3. 抗心律失常药按 Vaughan-Williams 可分为哪几类？每类列举一代表药。

答：(1) I 类（钠离子通道阻断剂），这类药可进一步细分成 I_A，I_B，I_C 三类。

I_A 类如奎尼丁，I_B 类如利多卡因，I_C 类如氟卡尼。

(2) II 类（ β 受体阻断剂），其代表药物为普萘洛尔。

(3) III 类（钾离子通道阻断剂），如胺碘酮。

(4) IV 类为钙拮抗剂，如维拉帕米。

第十三章 非甾体抗炎药

1. 非甾体抗炎药的作用机理是（ C ）。

A. 抑制二氢叶酸合成酶

B. 抑制 β -内酰胺酶

C. 抑制花生四烯酸环氧合酶

D. DNA 拓扑异构酶 II

2. 以下仅具有解热和镇痛作用，不具有消炎抗风湿作用的药物是（ D ）。

A. 布洛芬

B. 阿司匹林

C. 双氯芬酸

D. 扑热息痛

3. 扑热息痛在空气中甚为稳定，水溶液中的稳定性与溶液的 pH 值有关，在（ B ）时最稳定。

A. pH3

B. pH6

C. pH8

D. pH10

4. 扑热息痛在体内代谢时 55%~75% 与（ B ）结合，其它结合及转化较少。

A. 硫酸

B. 葡萄糖醛酸

C. 氨基酸

D. 谷胱甘肽

5. 非甾体抗炎药中抗炎药按化学结构可分为（ D ）。

A. 吡唑乙酸类，芳基烷酸类，水杨酸类

B. 吡唑酮类，吡唑乙酸类，芳基烷酸类

以上内容仅为本文档的试下载部分，为可阅读页数的一半内容。

如要下载或阅读全文，请访问：

<https://d.book118.com/865201204313011311>