

国家开放大学

期末考试考前复习资料

药物化学

伯仲教育出品

药物化学

一、填空题

- 1、巴比妥类药物结构中 5 位上的碳总数在哪个范围内活性最好 (4-8 个)
- 2、前临床治疗失眠和抗焦虑的首选药物是下列哪类药物 (苯并二氮卓类)
- 3、氯丙嗪呈 (碱性)
- 4、胃中水解的主要为 4.5 位开环，到肠道内又闭环成原药的是 (硝西泮)
- 5、水溶液不稳定、应用前配料，如发现沉淀，浑浊即不能应用的药物是 (苯妥英钠)
- 6、巴比妥类药物为 (弱酸性化合物)
- 7、地西洋的化学名 (1-甲基-5-苯基-7-氯-1,3-二氢-2H-1,4-苯并二氮杂卓-2-酮)
- 8、具有吩噻嗪环结构的药物是 (奋乃静)
- 9、与噻吨类抗精神病不相符合的是 (不存在几何异构体)
- 10、地西洋的活性代谢产物已开发成药物为 (奥沙西泮)
- 11、结构中含有苯并二氮卓环的是 (地西洋)
- 12、用于治疗内因性精神抑郁症的是 (阿米替林)
- 13、氟西汀是 (5-羟色胺重摄取抑制剂)
- 14、为口服抗抑郁药的是 (氟西汀)
- 15、结构中含有吩噻嗪环的是 (氯丙嗪)
- 16、以下哪一项叙述与艾司唑仑不相符 (结构中含有三氟甲基)
- 17、氟哌啶醇属于哪种结构类型的抗精神病药物 (丁酰苯类)
- 18、巴比妥类药物作用时间的长短主要受下列哪种因素的影响 (5-位取代基在体内的代谢难易)
- 19、结构中含有三唑环的是 (艾司唑仑)
- 20、地西洋化学结构中韵母核为 (1,4-苯并二氮卓环)
- 21、奋乃静(改为氯丙嗪) 在空气中或日光下放置渐变红色，分子中不稳定的结构部分为 (吩噻嗪环)
- 22、苯巴比妥钠注射剂制成粉针剂应用，这是因为 (水溶液不稳定，放置时易发生水解反应)
- 23、在 1,4-苯二氮卓类药物的 1,2 位并入三唑环，生物活性增强，原因是 (药物对代谢的稳定性及对受体的亲和力均增大)
- 24 苯妥英钠属于哪一类抗癫痫药 (乙内酰脲类)
- 25、可待因为吗啡的衍生物，可待因是 (3-甲基吗啡)
- 26、临床上用于海洛因成瘾的戒除治疗(脱瘾疗法)的药物是 (美沙酮)
- 27、成瘾性较小的药物是 (喷他佐辛)
- 28、在吗啡分子结构中引入哪一种基团可降低其成瘾性 (17-烯丙基)
- 29、在吗啡分子结构的 17 位上引入哪种基团可显著增强药物的镇痛作用 (苯乙基)
- 30、既显酸性又可呈碱性的两性药物是 (吗啡)
- 31、属于苯甲酸酯类的药物是 (丁卡因、普鲁卡因)
- 32、利多卡因属于 (酰胺类)
- 33、可发生重氮化-偶合反应生成猩红色偶氮

化舍物的药物是（盐酸普鲁卡因）

34、不具有碱性的药物是（阿司匹林）

35、普鲁卡因变色的原因是（发生了氧化反应）

36、利多卡因比普鲁卡因作用时间长的原因是（酰胺键较脂不易水解）

37、普鲁卡因胺属于（抗心律失常药）

38、安乃近易溶于水是由于结构中具有下列哪一结构部分（磺酸钠）

39、非甾体抗炎药通过抑制前列腺素生物合成中哪种酶而产生抗炎作用（环氧化酶）

40、阿司匹林的主要不良反应是（胃肠道副作用）

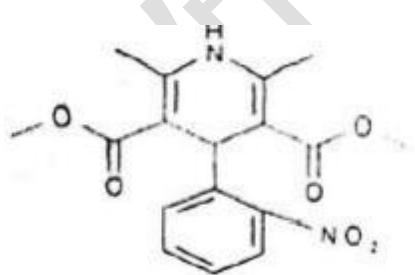
41、扑热息痛在治疗剂量下毒性小，但超剂量服用主要可引起（肝坏死）

42、阿司匹林的化学结构属于下列哪种结构类型（水杨酸类）

43、不具有抗炎作用的药物是（扑热息痛）

44、下列药物中，哪个是前体药物（扑炎痛(苯乐来、贝诺酯)）

46、2. 以下属于钙通道阻滞剂的药物是



47、洛伐他汀主要用于治疗（高胆固醇血症）

48、硝苯地平的作用靶点（离子通道）

49、下列药物属于 NO 供体药物的是（A）

50、下列属于选择性 β 受体阻滞剂的是（美托洛尔）

51、烷化剂类抗肿瘤药物的结构类型不包（硝基咪唑类）

52、下列哪个药物不是抗代谢药物（卡莫司汀）

53、用 F 原子置换尿嘧啶 5 位上的 H 原子，其设计思想是（生物电子等排置换）

54、环磷酰胺的毒性较小的原因是（在正常组织中、经酶代谢生成无毒的代谢物）

55、下列叙述哪条与氮芥类抗肿瘤药物不符（氮芥类药物的烷化基部分均为双（ β -氯乙基）氨基）

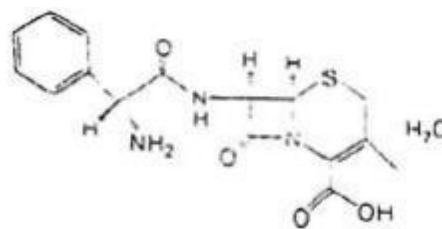
56、青霉素类药物结构中最不稳定的结构部分（ β -内酰胺环）

57. 青霉素的作用靶点是（粘肽转肽酶）

58、在天然苄青霉素的 6 位侧链的 α -碳上引入哪种基团可供口服（吸电子基）

59、临床可用于治疗伤寒但能引起再生障碍性贫血和造血系统损害的抗生素是（氯霉素）

60、化学结构如下的药物是（头孢氨苄）



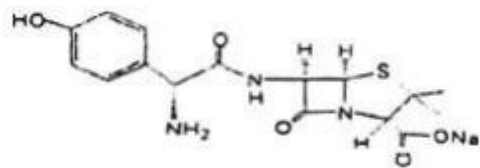
61、属于非经典 β -内酰胺酶抑制剂的药物是（克拉维酸）

62、半合成青霉素分子结构中对革兰氏阴性菌产生较强活性的重要基团是（斥电子基）

63、在苄青霉素的 6 位侧链的 α -碳上引入哪种基团后具耐酶活性（空间位阻大的基团）

64、红霉素属于哪种结构类型的抗生素（大环内酯类）

65、阿莫西林的结构式为 (C)



66、氯霉素的光学异构体中，仅 (1R, 2R) 构型有效

67、能引起骨髓造血系统的损伤，产生再生障碍性贫血的药物是 (氯霉素)

68、青霉素G 钠制成粉针剂的原因是 (易水失效)

69、糖皮质激素的主要副作用是 (引起水肿)

70、具有同化激素活性的药物是 (苯丙酸诺)

71、在雌二醇 17 α 位上引入乙炔基，其设计思想是 (阻碍代谢转化可以口服)

72、在糖皮质激素类药物结构中引入 Δ 后，可使药物抗炎活性 (增强)

73、在雌二醇的分子结构中引入 17 α -乙炔基后 (可以口服)

74、17 α -乙炔基睾丸素具有 (孕激素活性)

75、具有同化激素活性的药物是 (苯丙酸诺龙)

76、红霉素包括 A/B/C 三种成分，其中被视为杂质是 (B 和 C)

二、多项选择题：每题备选答案中有 2 个或 2 个以上正确答案，少选或多选均不得分

1、需制成粉针剂的药物是 (B. 苯妥因钠 D. 苯巴比妥)

2、属于苯并二氮卓类的药物有 (A、艾司唑仑 C. 安定 D. 奥沙西洋)

3、具有碱性的药物是 (A、氯丙嗪 B. 普鲁卡因 D. 利多卡因)

4、苯并二氮卓类药物的构效关系表明 (A、七员亚酰内酰胺 (B 环) 是产生药理作用的基本结构，C、7 位引入吸电子基、其活性明显增强，D、1,2 立并入杂环 (三唑环) 可增强活性)

5、地西洋结构中较不稳定的部位 (A、1,2 位的内酰胺结构，B、4,5 位的亚胺结构)

6、有关奥沙西洋哪些叙述是正确的 (A、是地西洋的活性代谢产物，B、具有旋光性、但右旋体的强于左旋体，C、在酸性溶液中加热水解后可发生重氮化-偶合反应，D、1 位上没有甲基取代，E、含有一个手性碳原子)

7、抗精神病药的化学结构类型有 (B、吩噻嗪类，C、噻吨类，D、二本环庚烷类，E、苯并二氮杂卓类)

8、镇痛药的构效关系表明，其化学结构具有哪些共同结构特征 (A、一个平坦的芳环，B、一个碱性中心，C、平坦结构与碱性中心共平面，D、乙胺链凸出于平面的前方)

9、属于苯基哌啶类的药物有 (C、芬太尼，D、哌替啶)

10、下列药物属于酰胺类的有 (A、利多卡因，B、布比卡因)

11、局部麻醉药包括下列哪几种结构类型 (A、氨基酮类，B、酰胺类，C、苯甲酸酯类，D、氨基醚类)

12、普鲁卡因结构中不稳定的部位为 (B、酯结构，C、芳伯氨基)

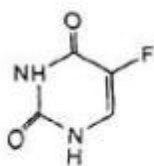
13、按结构分类，非甾类抗炎药有 (A、3,5-

吡唑烷二酮类，B、邻氨基苯甲酸类，C、吡啶乙酸类，D、芳基烷酸类)

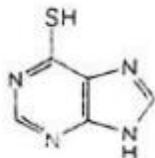
14、属于选择性 β_1 受体拮抗剂有 (A、阿替洛尔，B、美托洛尔，E、倍他洛尔)

15、下列抗肿瘤药物中属于抗代谢药物的有 (CDE)

C



D



16、属于 β -内酰胺酶抑制剂的药物有 (B、克拉维酸，C、舒巴坦，E、他巴坦)

17、下列叙述中，哪些与四环素类抗生素相符 (B、在碱性条件下、C环破裂失活，C、在酸性条件下，发生消除反应失活，D、在酸性条件下、发生差向异构化、抗菌活性减弱或消失、毒性也减小)

18、糖皮质激素类药物在临床上应用广泛，其药理作用有 (A、抗炎 B、抗毒素 C、抗休克 D、影响蛋白质的合成与代谢 E、影响脂肪的合成与代谢的药物)

19、可口服的激素药物有 (B、炔雌醇，C、甲睾酮，E、炔诺酮)

20、具有酸碱两性的药物有 (A、SD，B、氨基青霉素，C、四环素，E、环丙沙星)

21、影响药物-受体相互作用的立体化学的作用有 (A、几何异构，B、光学异构，C、构象异构)

22、四环素在酸性条件下不稳定，其原因是(A、

6位-OH发生反式消除反应，E、4位的二甲胺基发生差向异构化)

23、药物产生药效的两个主要的决定因素 (A、药物的理化性质，D、药物和受体的相互作用)

24、糖皮质激素在16位引入甲基的目的 (A、降低钠滞留副作用，D、增加了17位基团的稳定性，E、抗炎活性增强)

三、配伍选择题

1-5 A. 吡唑烷二酮类 B. 邻氨基苯甲酸类 C. 吡啶乙酸类 D. 芳基乙酸类 E. 芳基丙酸类

1、甲灭酸(B)，2、布洛芬(E)，3、二氯芬酸钠(D)，4、吡罗美辛(C)，5、保泰松(A)
6-10 A. 阿司匹林 B. 美沙酮 C. 尼可刹米 D. 山莨菪碱 E. 兰索拉唑

6、作用于M-胆碱受体(D)；7、作用于前列腺素合成酶(A)；8、作用于阿片受体(B)；9、作用于质子泵(E)；10、作用于延髓(C)
11-15

A. 盐酸普萘洛尔 B. 氯贝丁酯
C. 硝苯地平 D. 甲基多巴 E. 卡托普利

11、中枢性降压药(D)；12、ACE抑制剂类降压药(E)；13、 β 受体阻滞剂，可用于心律失常治疗(A)；14、二氢吡啶类钙拮抗剂，用于拉心绞痛(C)；15、苯氧乙酸类降血脂药(B)
16-20

A. 乙酰唑胺 398 B. 辛伐他汀 C. 拉贝洛尔 D. 卡托普利 E. 吉非罗齐

16、HMG-CoA类降脂血药(B)；17、苯氧烷酸类降血脂药(E)；18、ACEI类降压药(D)；

19、 β -受体阻滞剂类抗高血压药(C)；20、碳酸酐酶抑制剂类抗高血压药(A)

21-25

A. 泼尼松 B. 甲羟孕酮 C. 苯丙酸诺龙
D. 甲睾酮 E. 炔雌醇

21、雄激素类药物(D)；22、雌激素类药物(E)；23、蛋白同化激素类药物(C)；24、皮质激素类药物(A)；25、孕激素类药物(B)

26-30

A. 链霉素 B. 头孢噻肟钠 C. 氯霉素
D. 四环素 E. 克拉维酸

26. 抗结核杆菌作用强、但有较严重的耳毒性和肾毒性(A)

27. 在 pH 2~6 条件下易发生差向异构化(D)

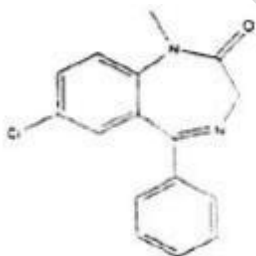
28. 在光照条件下，顺式异构体向反式异构体转化(B)

29. 1R, 2R(-) 体供药用(C)

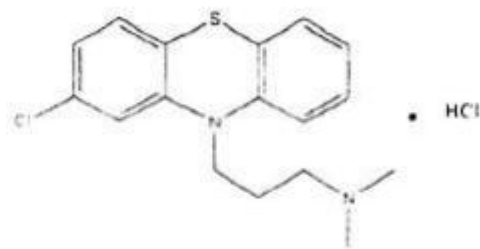
30. 为第一个用于临床的 β -内酰胺酶抑制剂(E)

四、写出下列结构式对应的药物通用名称及其临床用途。

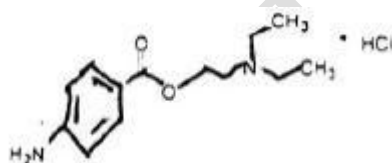
1、通用名称：地西洋；临床用途：(失眠、抗焦虑、抗癫痫、神经官能团证)



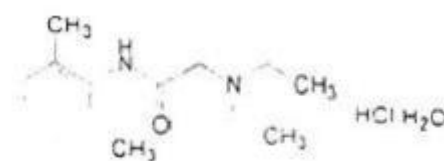
2、通用名称：盐酸氯丙嗪；临床用途：(精神分裂症、躁狂症、镇吐、人工冬眠)



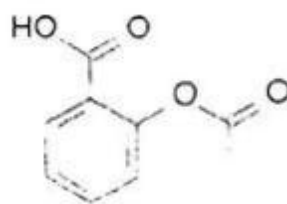
3、通用名称：盐酸普鲁卡因；临床用途：(局部浸润麻醉，蛛网膜下腔麻醉，腰麻、表面麻醉)写“局部麻醉”即可



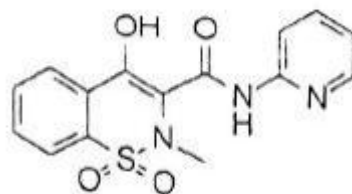
4、通用名称：盐酸利多卡因；临床用途：(浸润麻醉、硬膜外麻醉。表面麻醉、室性早搏、室性心动过速)



5、通用名称：阿司匹林；临床用途：(感冒、发热、头痛、牙痛、神经痛)

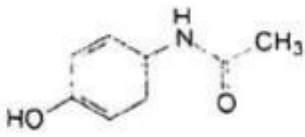


6、通用名称：吡罗昔康；临床用途：治疗分实行和类风湿性关节炎

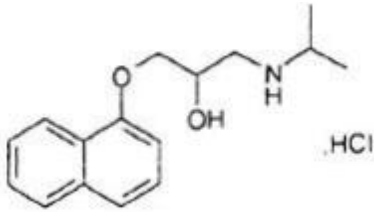


7、通用名称：对乙酰氨基酚；临床用途(发

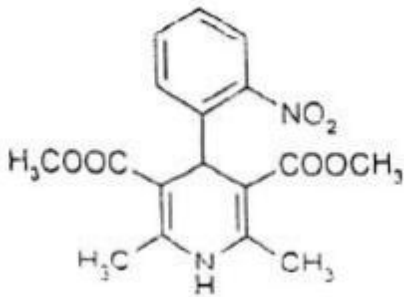
热、头痛、风湿痛、神经痛、痛经)



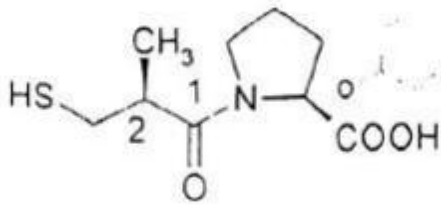
8、通用名称：盐酸普萘洛尔；临床用途：心绞痛、窦性



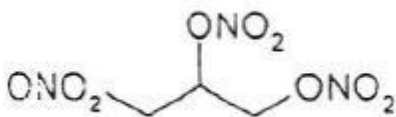
9、通用名称：硝苯地平；临床用途：高血压、心绞痛



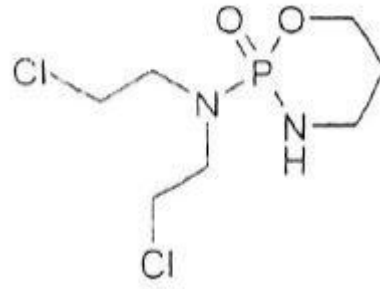
10、通用名称：卡托普利；临床用途：高血压、心里衰退、心肌梗死后的心功能不全



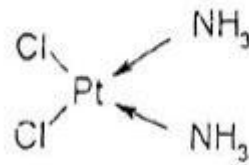
11、通用名称：硝酸甘油；临床用途：治疗冠心病心绞痛、充血性心力衰退



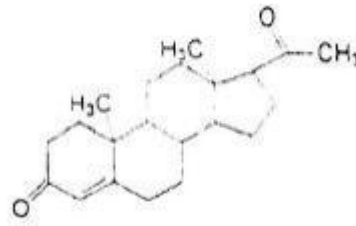
12、通用名称：环磷酰胺；临床用途：恶性淋巴瘤、急性淋巴细胞白血病



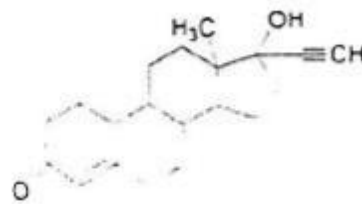
13、通用名称：顺铂；临床用途：睾丸癌、卵巢癌、肺癌、恶性淋巴瘤和白血病



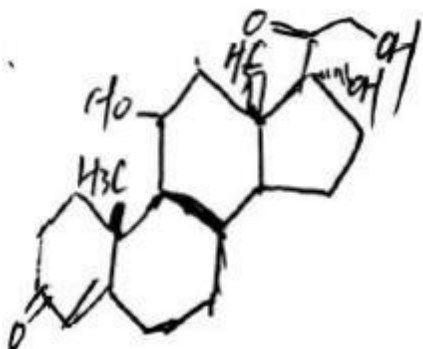
14、通用名称：黄体酮；临床用途：先兆流产和习惯性流产、月经不调



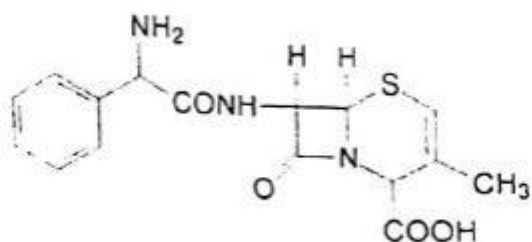
15、通用名称：炔若酮；临床用途：子宫功能性出血、子宫内膜异位、痛经



16、通用名称：氢化可的松；临床用途：过敏性皮炎、湿疹、脂溢性皮炎、瘙痒症

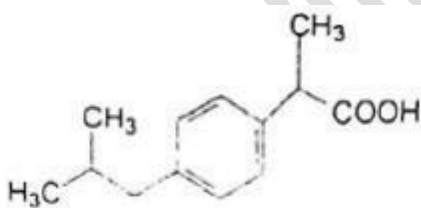


17、通用名称：头孢氨苄；临床用途：呼吸道、泌尿道、皮肤和软组织

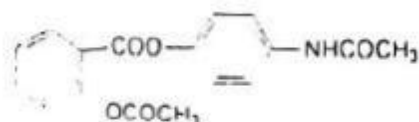


18、通用名称：青霉素 G；临床用途：气性坏疽、梅毒、鼠咬热的首选药；草绿色链球菌心内膜炎的首选药；放线菌病、钩端螺旋体病

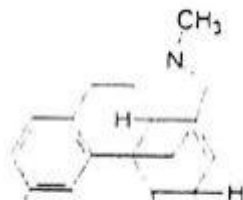
19、通用名称：布洛芬；临床用途：风湿性关节炎、类风湿性关节炎



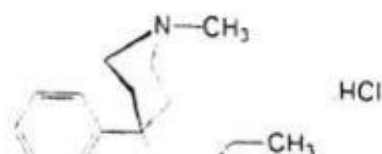
20、通用名称：扑炎痛（贝诺酯）；临床用途：感冒、发热、牙痛、头痛、神经痛



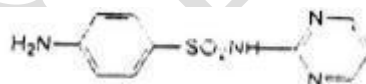
21、通用名称：吗啡；临床用途：用于抑制剧烈的疼痛、亦用于麻醉前给药



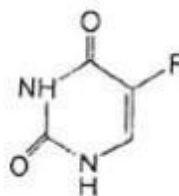
22、通用名称：哌替啶；临床用途：常用于分娩痛的止痛，还具有解痉作用



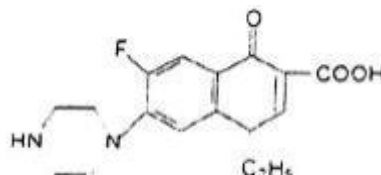
23、通用名称：SD；临床用途：脑膜炎双球菌、肺炎球菌、淋球菌感染的治疗，治疗流行性脑膜炎的首选药



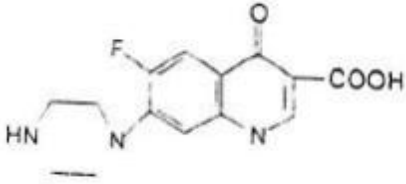
24、通用名称：氟尿嘧啶；临床用途：对绒毛上皮癌及恶性葡萄胎疗效显著，对结肠癌、直肠癌有效，是治疗实体瘤的首选药



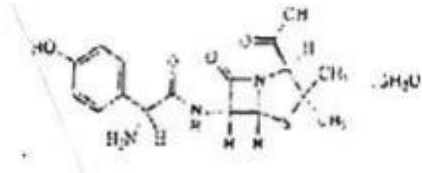
25、通用名称：诺氟沙星；临床用途：敏感菌所致的泌尿道、肠道及耳道感染



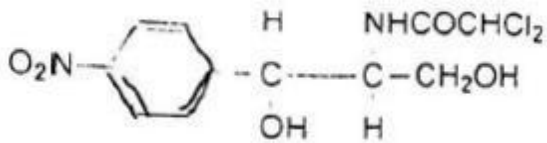
26、通用名称：环丙沙星；临床用途：胃肠道、泌尿道、呼吸道、骨关节、皮肤和软组织感染



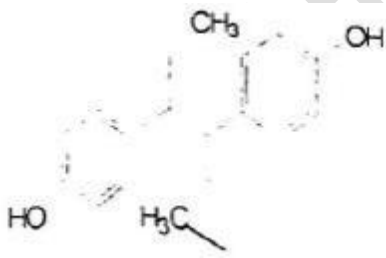
27、通用名称：阿莫西林；临床用途：呼吸系统、泌尿系统、胆道系统



28、通用名称：氯霉素；临床用途：治疗伤寒、副伤寒、斑疹伤寒



29、通用名称：乙烯雌酚；临床用途：萎缩性阴道炎、女性性腺发育不良、绝经期综合症、阴道炎



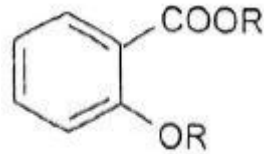
30、通用名称：地塞米松；临床用途：用于活动性、风湿性关节炎、红斑狼疮等自身免疫性疾病



五、 写出下列药物的结构通式

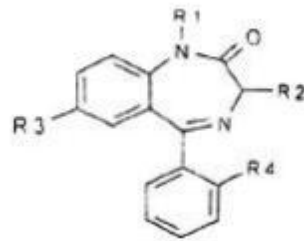
1、青霉素类抗生素

2、水杨酸类解热镇痛抗炎药

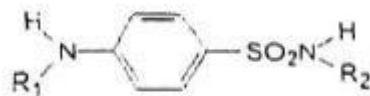


3、头孢霉素类抗生素

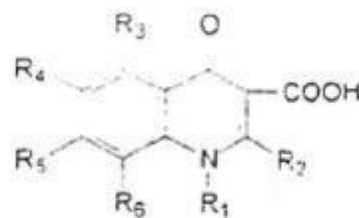
4、苯二氮卓类催眠镇静药



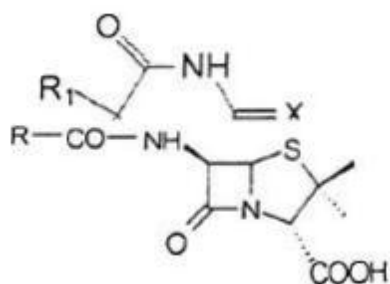
5、磺胺类抗菌药



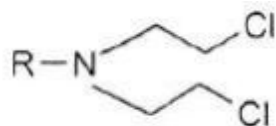
6、唑啉羧酸类抗菌药物



7、巴比妥类催眠镇静药



8、氨基类抗肿瘤药



六 排序题（根据下列题目要求排序，可用“>”符号表示

抗癫痫活性：苯妥因钠>苯巴比妥>异戊巴比妥

抗炎活性：地塞米松>氢化泼尼松>氢化可的松>可的松

镇痛作用：海洛因>吗啡>镇痛新>可待因

2、药物毒副作用的大小：成瘾性：海洛因>吗啡>镇痛新>可待因

3、药物酸性或碱性的大小：酸性：无机酸>有机酸（羟基）>苯酚

（两性中的酸性比较） SA>SD>SMZ>SN

碱性：脂肪胺>芳香胺>

酰胺（磺酰胺：酸性）

4、药物稳定性的大小 7 α -甲氧基头孢>头孢>青霉素

1. A 苯巴比妥 B 戊巴比妥 C. 苯妥因钠
抗癫痫活性强弱： C>A>B

2. A 奥沙西泮 B. 氯丙嗪 C 奋乃静
安定作用强弱： C>B>A

3. A 阿司匹林 B 扑炎痛（苯乐来） C
扑热息痛 酸性强弱： A>C>B

4. A 扑炎繁 B. 水杨酸 C 阿司匹林
副作用大小： B>C>A

5. A 羧酸类化合物 B 无机酸 C 酚类化合物
酸性强弱： B>A>C

6. A 镇痛新 B. 杜冷丁 C. 吗啡
成瘾性大小： C>B>A

7. A 喷他佐辛 B 可待因 C 呱替定
镇痛作用强弱： A>C>B

8. A. SN B SD C SA
酸性强弱： C>B>A

9. A 诺氟沙星 B 氧氟沙星 C. 吡哌酸
抗节作用强弱： B>A> C

10. A 青霉素 B 头孢菌素 C 7 α -头孢菌素
稳定性大小： C>B>A

11. A. 四环素 B 米诺环素 C. 土霉素
抗苦活性大小： B>C>A

12. A. 地塞米松 B. 氢化可的松 C 氢化泼尼松
抗炎作用强弱： A>C>B

七、简答题

1. 简述苯巴比妥钠在制针剂时须制成粉针剂原因。

答：因其钠盐不稳定，易吸收空气二氧化碳析出沉淀，且具水解性，易水解开环失效，水解的速度随温度和PH值的升高而加快，为避免水解失效故苯巴比妥制成粉针剂使用

2、 吗啡空间构象特点。

答：(1) 分子中具有一个平坦的芳环结构 (2) 有一个叔碳原子的碱性中心，能在生理的PH条件下大部分电离为阳离子，碱性中心和平坦结构在同一平面；(3) 含有哌啶环，

哌啶环的烃基部分，突出由芳环构成的平面上方。

3、简述利多卡因比普鲁卡因稳定性的原因。

答：(1) 利多卡因具有酰胺机构、而普鲁卡因结构中含有酯键，酰胺键比酯键稳定，(2) 利多卡因酰胺键的邻位也有两个甲基，由于空间位阻，使利多卡因更稳定，这就是利多卡因比普鲁卡因稳定的原因。

4、简述非甾体抗炎药的抗炎镇痛作用机理。

答：前列腺素是一类介导发热、疼痛的炎症介质，该类物质抑制了前列腺素合成过程中

氧酶 COX 的活性，从而使前列腺素合成受阻，产生减轻疼痛和缓解炎症的作用，临床上用来治疗关节炎及风湿性关节炎等症。

5、简述引起非甾体抗炎药胃肠道毒作用的主要原因。

答：该类物质大都具有酸性，药物的酸性对胃有刺激作用，可引起胃肠道不良反应，(2) 药物选择性差，在抑制 COX-2 产生抗炎作用的同时，胃肠组织中的 COX-1 也被抑制，使对胃肠组织有保护作用的前列腺素水平下降，导致胃肠道的副作用。

6、简述他汀类降血脂药物作用原理。

答：羟甲戊二酸单酰辅酶 A (HMG-CoA) 还原酶催化作用于内源性胆固醇合成的早期，是胆固醇合成限速酶，抑制 HMG-CoA 还原酶则减少内源性胆固醇的合成。他汀类药物是 HMG-CoA 还原酶的竞争性抑制剂，是目前治疗血脂障碍最有效的药物

7、简要说明 ACEI 类抗高血压药的作用机制

答：血管紧张素原经肾素作用后裂解释放出无活性多肽 AngI，再经血管紧张素转化酶 (ACE) 酶解成具有强升血压活性的 AngII，导致血压升高。ACEI 药物抑制了 ACE 的活性，是 AngI 转化为 AngII 受阻，从而产生降血压作用。

8、简述 β -内酰胺类抗生素的作用机理及 β -内酰胺类抗生素具有较高选择性的原因。

答：(1) 作用机理：抑制细菌胞壁黏肽合成酶的活性，从而阻碍细菌细胞壁的活性，使细菌细胞壁缺损，外环境水分渗入菌体膨胀裂解而死，若还具有触发细菌自溶酶的活性，则可杀死细菌，(2) 具有较高选择性的原因，细胞壁是细菌细胞所特有的，而哺乳动物细胞无细胞壁，因而 β -内酰胺类抗生素对哺乳动物无影响，其作用具有较高的选择性。

9、试述头孢霉素比青霉素稳定的原因。

答：头孢菌素是四元的 β -内酰胺环与六元环的氢化噻嗪酮合而成，而青霉素类是四元的 β -内酰胺环与五元的氢化噻唑酮合而成，前者比后者环张力小，头孢菌素环上的 N 原子的孤对电子与邻位的双键发生了共轭，不易被亲核亲电试剂进攻，故较稳定。

10、天然青霉素 G 有哪些缺点？试述半合成青霉素的结构改造方法，并举一药物实例说明

答：天然青霉素 G 的缺点是不耐酸口服无效，抗菌谱窄只对革兰阳性菌作用较强，对革兰阴性菌无效，不耐酶而已耐药。改造方法：在 6-酰胺侧链上引入吸电子基团，如苯唑西林、可以耐酸，获得合成的口服青霉素，

在侧链上都具有大位阻基团，如三苯甲基青霉素，具有耐酶活性，不易产生耐药性，在侧链上引入极性取代基（氨基、羧基、磺酸基）如氨苄青霉素、磺苄西林、对革兰氏阴性菌也有效，可研发出广谱青霉素。

11、药物作用的靶点有哪几种类型？各类分别列举出一药物实例

答：（1）以受体作为药物的作用靶点；如阿替洛尔拮抗肾上腺素能受体 β_1 受体，用于心律失常的治疗，（2）以酶作为药物的作用靶点；如卡托普利，抑制ACE，用于降低血压。（3）以离子通道作为药物的作用靶点，如二氢吡啶类化合物硝苯地平，作用钙通道，用于降压。（4）以核酸作为药物的作用靶点，如抗肿瘤药和抗病毒药。

12、试列举例先导化合物发现的三条途径，并各举一药物实例(多记几条)。

答：（1）从天然产物得到先导化合物；如青蒿素是从青蒿中分离出的抗疟有效成分，新型结构的倍半萜过氧化物；（2）以现有药物为先导化合物，从药物的代谢物中寻找新的药物也是常用的发现新药的方法，例如由地西泮的代谢物中发现毒副作用更小的奥沙西泮，由保泰松的代谢物发现羟布宗等；（3）用内源性活性物质为先导化合物；如以炎症介质5-羟色胺为先导化合物研发了抗炎药吲哚美辛。

13、①试述磺胺抗菌药的作用机制

②以及磺胺类抗菌药与甲氧苄啶配伍的理论依据。

答：细菌不能直接利用其生长环境中的叶酸，

而是利用环境中的对氯苯甲酸(PABA)和二氢氢喋啶，谷氨酸在菌体内的二氢叶酸合成酶催化下合成二氢叶酸。二氢叶酸在二氢叶酸还原酶的作用下形成四氢叶酸，四氢叶酸作为一碳单位转移酶的辅酶，参与核酸前体物（嘌呤、嘧啶）的合成。而核酸是细胞生长繁殖所必须的成分。磺胺药的化学结构与PABA类似，能与PABA抑制二氢叶酸合成酶，影响了二氢叶酸的合成，因而使细菌生长和繁殖收到抑制。

②通过双重阻断机制阻断细菌四氢叶酸合成路径来发挥协同抗菌作用（SMZ抑制二氢叶酸合成酶，TMP抑制二氢叶酸合成酶）比单用的抗菌活性提高几十倍甚至具有部分杀菌作用。

八、名词解释

1、先导化合物：是通过各种途径和手段得到的具有某种生物活性和化学结构的化合物，用于进一步的结构改造和修饰，是现代新药的出发点。

2、前体药物：是指药物经过化学结构修饰后得到的在体外无活性或活性较小，在体内经酶或非酶的转化释放出活性药物而发挥药效的化合物。

3、拼合原理：主要是指将两种具有生物活性的化合物通过共价键连接起来，进入体内分解成两个有效成分，以期减小两种药物的毒副作用，求得二者作用的联合效应。

4、构效关系：指的是药物或其他生理活性物质的化学结构域其生理活性之间的关系，是

药物化学的主要研究内容之一。 马

- 6、ACA：7-氨基头孢烷酸。
- 7、ACEI：血管紧张素转化酶抑制剂。
- 8、基本结构：同类药物中化学结构相同的部分
9. 6-APA：6-氨基青霉烷酸
- 10、化学结构修饰：保持药物的基本结构不变，仅在某些官能团上作一定的活性结构改变的方法
11. 7-ACA：7-头孢烷酸