

高纲 3029

江苏省高等教育自学考试大纲

## **14550      药物化学（本）**

中国药科大学编（2024 年）

# I 课程性质与课程目标

## 一、课程性质和特点

药物化学是关于药物的发现、发展和确证，并在分子水平上研究药物作用方式的科学。《药物化学（本）》是江苏省高等教育自学考试药学（专升本）、药物制剂（专升本）专业的一门专业基础课。本课程的主要目的是通过传授各类常用药物的特性、发现和发展过程，使考生能掌握药物分子的性质、用途和结构的关系，了解各类药物现状及最新进展，训练解决药学实践问题的思维，培养药学家责任感和爱国精神，更好地为今后所从事的药学工作服务。

## 二、课程目标

通过本课程的学习，应达到知识和技能两方面的目标。

知识方面：通过本课程的学习，使考生掌握有关的基本概念、基本理论、基本知识，掌握常见药物的结构与用途，掌握重点药物的合成方法，为后续课程学习奠定坚实的基础。

具体包括：

1. 了解药物化学的发展概况、发展现状及未来发展趋势；
2. 掌握代表性药物的体内代谢过程；
3. 了解新药的研制和开发的相关知识；
4. 掌握常见药物的结构及理化性质；
5. 掌握常见药物的构效关系及结构修饰方法；
6. 掌握重要药物的合成方法及制备工艺。

技能方面：通过本课程的学习，使考生具备以下能力：

1. 熟悉进行药物化学的实训操作，进行性质的鉴别、稳定性的考察、药物合成等实训，培养考生的动手能力以及观察、分析和解决实际问题的能力；
2. 学会应用药物的理化性质解决药物的储存保管、制剂、分析检验及临床应用的能力。

## 三、课程的重点和难点

本课程的学习重点是常见药物的构效关系及理化性质；难点是代表性药物的合成方法。

## II 考核目标

本大纲在考核目标中，按照识记、领会、应用三个层次规定其应达到的能力层次要求。三个能力层次是递升的关系，后者必须建立在前者的基础上。各能力层次的含义是：

识记：要求能够识别和记忆有关知识点的主要内容（如概念、术语、药物名称及化学结构等），并能够根据考核的不同要求做出正确的表述、选择和判断。

领会：要求能够领悟和理解课程中规定的有关知识点的内涵与外延，熟悉其内容要点和它们之间的区别和相互关系，并能根据考核的不同要求，做出正确的解释、说明和论述。

应用：要求能够运用课程的知识点，解决药物合成及用药过程中的实际问题。

## III 课程内容与考核要求

### 第一章 绪论

#### 一、课程内容

介绍药物化学研究的内容和任务；药物化学的研究和发展历程；我国药物化学的发展历史；新药的研究与开发的过程和方法；我国创新药物研究的现状、成就与发展方向。

#### 二、考核知识点和考核要求

识记：①药物化学的研究与发展。

领会：①药物化学的研究内容和任务；②我国药物化学的发展；③新药研究与开发的过程和方法。

应用：①药物和药物化学的定义。

#### 三、本章重点和难点

本章重点和难点：①药物化学的主要任务；②新药研究与开发的阶段过程和方法。

### 第二章 药物结构与生物活性

#### 一、课程内容

介绍药物理化性质对药物活性的影响；药物的结构对药物活性的影响及药物

的结构对药物的转运及毒副作用的影响。

## 二、考核知识点和考核要求

识记：①类药性的“五规则”的概念；②熟悉药物与受体的结合方式及对药效的影响；③熟悉药物的立体异构体对药效的影响；④药物结构对药物转运的影响；⑤药物结构对药物毒副作用的影响。

领会：①药物的结构对药物活性的影响。

应用：①药物的理化性质对活性的影响。

## 三、本章重点和难点

本章重点和难点：①构性、构效、构代、构毒关系、药物类药性及溶解度的定义；②药物的各官能团对药效的关系；③类药性“五规则”；④药物与受体键合的方式；⑤立体异构对药效的影响。

# 第三章 药物结构与药物代谢

## 一、课程内容

介绍官能团化反应、结合反应、药物代谢研究在药物开发中的应用。

## 二、考核知识点和考核要求

识记：①药物代谢的相关酶系。

领会：①药物Ⅱ相生物转化反应（结合反应）的主要类型；②常见药物代谢的发生位点。

应用：①药物Ⅰ相生物转化反应（官能化反应）的主要类型；②药物代谢研究在药物开发中的应用。

## 三、本章重点和难点

本章重点和难点：①药物代谢；②Ⅰ相生物转化反应定义及实例；③Ⅱ相生物转化反应定义及实例；④首过效应；⑤拼合原理；⑥合理药物设计；⑦药物代谢在药物开发中的应用。

# 第四章 新药研究的基本原理和方法

## 一、课程内容

介绍药物的微观结构与宏观性质的概念；药物设计的概念；先导化合物发现的方法和途径；先导化合物优化的方法；定量构效关系及计算机辅助药物设计方

法。

## 二、考核知识点和考核要求

识记：①药物的微观结构与宏观性质的概念；②定量构效关系；③计算机辅助药物设计方法。

应用：①苗头化合物、先导化合物和候选药物的概念及其发现的方法和途径；②药物分子修饰和优化的目的和常用方法及其在优化先导化合物中的应用；③生物电子等排原理、前药原理目的和应用；④软药、硬药及孪药的概念和应用。

## 三、本章重点和难点

本章重点和难点：①药效团；②先导化合物；③前药；④软药；⑤硬药；⑥孪药；⑦ADME；⑧先导化合物发现的方法和途径；⑨先导化合物的优化方法；⑩前药修饰的目的及作用，虚拟筛选。

# 第五章 镇静催眠药和抗癫痫药

## 一、课程内容

介绍镇静催眠药和抗癫痫药的类型；介绍地西洋、奥沙西洋、替马西洋、硝西洋、艾司唑仑、咪达唑仑、三唑仑、酒石酸唑吡坦、佐匹克隆、扎来普隆、雷美替胺、苯巴比妥、异戊巴比妥、苯妥英钠、卡马西平、加巴喷丁、普瑞巴林、丙戊酸钠、拉莫三嗪和唑尼沙胺的结构、理化性质和临床用途；重点介绍地西洋的合成；巴比妥类药物和苯并氮杂䓬类药物的构效关系和体内代谢。

## 二、考核知识点和考核要求

识记：①“世界睡眠日”及其意义；②镇静催眠药和抗癫痫药的发展过程及作用机制；③褪黑素受体激动剂的作用机制及其合理性药物设计方法。

领会：①巴比妥类药物和苯并氮杂䓬类药物的构效关系和体内代谢；②奥沙西洋、替马西洋、硝西洋、三唑仑、扎来普隆、异戊巴比妥、加巴喷丁、丙戊酸钠、拉莫三嗪和唑尼沙胺的结构和临床用途。

应用：①镇静催眠药和抗癫痫药的结构类型；②地西洋、艾司唑仑、咪达唑仑、佐匹克隆、酒石酸唑吡坦、雷美替胺、苯巴比妥、苯妥英钠、卡马西平和普瑞巴林的结构、理化性质、体内代谢及临床用途；③地西洋的合成方法。

## 三、本章重点和难点

本章重点和难点：①抗癫痫药物的分类及代表药物；②镇静催眠药物的分类

及代表药物；③巴比妥类药物的构效关系；④苯二氮草类药物的构效关系；⑤地西洋的合成方法。

## 第六章 精神神经疾病治疗药

### 一、课程内容

介绍抗精神病药和抗抑郁药的类型；盐酸氯丙嗪、氟哌啶醇、舒必利、氯氮平、帕罗西汀、盐酸阿米替林、癸氟奋乃静、奋乃静、氯普噻吨、氟西汀、文拉法辛、米氮平的结构、理化性质、体内代谢及用途；抗精神失常药和抗抑郁药作用机制；盐酸氯丙嗪的合成方法。

### 二、考核知识点和考核要求

识记：①抗精神病药和抗抑郁药的发展过程及作用机制。

领会：①癸氟奋乃静、利培酮、奥氮平、吗氯贝胺、氟西汀、舍曲林、米氮平、盐酸文拉法辛和丁螺环酮的结构及临床用途；②吩噻嗪类药物的构效关系和体内代谢。

应用：①盐酸氯丙嗪、奋乃静、氯普噻吨、氟哌啶醇、舒必利、氨磺必利、氯氮平、盐酸阿米替林、帕罗西汀和草酸艾司西酞普兰的结构、理化性质、体内代谢及临床用途；②抗精神病药和抗抑郁药的类型；③盐酸氯丙嗪的合成方法。

### 三、本章重点和难点

本章重点和难点：①非典型精神病药物；②选择性 5-羟色胺重摄取抑制剂；③单胺氧化酶抑制剂；④吩噻嗪类药物的结构改造方法及构效关系；⑤抗精神病药物的分类及代表药物，氯丙嗪及奋乃静的结构稳定性；⑥氯丙嗪在体内的代谢过程，阿米替林的体内代谢过程，抗抑郁药的分类及代表药物；⑦氯丙嗪的合成方法。

## 第七章 神经退行性疾病治疗药物

### 一、课程内容

介绍盐酸罗匹尼罗、盐酸普拉克索、左旋多巴、盐酸多奈哌齐、重酒石酸卡巴拉汀、盐酸美金刚、吡贝地尔、他利克索、卡比多巴、雷沙吉兰、托卡朋和石杉碱甲的结构、理化性质、体内代谢及临床用途；抗帕金森病药和抗阿尔茨海默病药的类型；盐酸多奈哌齐的合成方法。

## 二、考核知识点和考核要求

识记：①抗帕金森病药和抗阿尔茨海默病药的发展过程及作用机制。

领会：①吡贝地尔、他利克索、卡比多巴、雷沙吉兰、托卡硼和石杉碱甲的结构及临床用途；②抗帕金森病药和抗阿尔茨海默病药的类型。

应用：①盐酸罗匹尼罗、盐酸普拉克索、左旋多巴、盐酸多奈哌齐、重酒石酸卡巴拉汀和盐酸美金刚的结构、理化性质、体内代谢及临床用途；②盐酸多奈哌齐的合成方法。

## 三、本章重点和难点

本章重点和难点：①抗帕金森病药物的分类及代表药物；②多巴胺缺失补偿的5种机制，抗阿尔茨海默病药的分类及代表药物；③左旋多巴的性质、作用及用途；④盐酸多奈哌齐的合成方法。

# 第八章 镇痛药

## 一、课程内容

介绍掌握镇痛药物的类型；吗啡的理化性质；掌握盐酸吗啡、盐酸哌替啶、枸橼酸芬太尼、盐酸美沙酮、喷他佐辛和曲马朵的化学结构、理化性质、体内代谢及临床用途；熟悉可待因、海洛因、纳诺酮、布托啡诺、阿芬太尼的化学结构和临床用途；掌握盐酸派替啶的合成。

## 二、考核知识点和考核要求

领会：①可待因、海洛因、纳诺酮、布托啡诺的化学结构及临床用途；②吗啡的构效关系及镇痛药物的发展过程。

应用：①镇痛药物的结构类型；②盐酸吗啡、盐酸哌替啶、枸橼酸芬太尼、盐酸美沙酮和喷他佐辛和曲马朵的化学结构、理化性质、体内代谢及临床用途；③盐酸哌替啶的合成方法。

## 三、本章重点和难点

本章重点和难点：①吗啡的结构特点、结构改造方法及相应衍生物的特点；②合成镇痛药的分类及代表性药物；③美沙酮在体内的代谢过程及产生阵痛的机制；④盐酸哌替啶的合成路线。

# 第九章 非甾体抗炎药

## 一、课程内容

介绍解热镇痛药和非甾体抗炎药的结构类型、作用机理；掌握阿司匹林、对乙酰氨基酚、吲哚美辛、双氯芬酸钠、布洛芬、萘普生、吡罗昔康、艾瑞昔布和别嘌醇的结构、理化性质、体内代谢及临床用途；熟悉贝诺酯、舒林酸、萘丁美酮、酮洛芬、美洛昔康、替诺昔康、塞来昔布、来司诺雷钠和非布司他的结构和临床用途以及花生四烯酸的两条主要代谢途径；掌握双氯芬酸钠、布洛芬的合成方法。

## 二、考核知识点和考核要求

领会：①芳基丙酸类和 1, 2-苯并噻嗪类药物的构效关系；②贝诺酯、舒林酸、萘丁美酮、酮洛芬、美洛昔康、替诺昔康、塞来昔布、来司诺雷钠和非布司他的结构及临床用途；③痛风治疗药物的类型。

应用：①解热镇痛药和非甾体抗炎药的结构类型及作用机理；②对乙酰氨基酚、阿司匹林、吲哚美辛、双氯芬酸钠、布洛芬、萘普生、吡罗昔康、艾瑞昔布和别嘌醇的结构、理化性质、体内代谢及临床用途；③双氯芬酸钠的合成方法。

## 三、本章重点和难点

本章重点和难点：①非甾体抗炎药；②选择性 COX-2 抑制剂；③非甾体抗炎药物的分类及代表性药物；④痛风药物的类型及代表性药物；⑤芳基丙酸类和 1, 2-苯并噻嗪类药物的构效关系；⑥双氯芬酸钠的抗炎机制及其合成方法。

# 第十章 拟胆碱药和抗胆碱药

## 一、课程内容

介绍拟胆碱药、抗胆碱药的结构类型和作用机理；硝酸毛果云香碱、溴新斯的明、硫酸阿托品、盐酸苯海索、溴丙胺太林、氢溴酸东莨菪碱、氢溴酸山莨菪碱、樟柳碱、苯磺酸阿曲库铵和氯化琥珀胆碱的结构、理化性质及用途；拟胆碱药、抗胆碱药的构效关系；盐酸苯海索的合成方法。

## 二、考核知识点和考核要求

识记：①乙酰胆碱受体的分类及乙酰胆碱的生理作用、胆碱受体激动剂和 M 胆碱受体拮抗剂的构效关系。

领会：①拟胆碱药和抗胆碱药的类型和作用机理；②氢溴酸东莨菪碱、氢溴酸山莨菪碱、樟柳碱、苯磺酸阿曲库铵和氯琥珀胆碱的结构及临床用途。

应用：①硝酸毛果云香碱、溴新斯的明、硫酸阿托品、盐酸苯海索和溴丙胺太林的结构、理化性质及临床用途；②盐酸苯海索的合成方法。

### 三、本章重点和难点

本章重点和难点：①抗胆碱药物的分类及临床用途；②胆碱受体激动剂的构效关系；③乙酰胆碱酯酶抑制剂的作用、分类及代表药物（有机磷酸酯类杀虫剂及药物的抗胆碱酯酶作用）；④盐酸苯海索的合成方法。

## 第十一章 抗变态反应药物

### 一、课程内容

介绍变态反应的发生机制；组胺受体的分类和组胺的生理作用； $H_1$ 受体拮抗剂的结构类型和构效关系；马来酸氯苯那敏、盐酸赛庚啶、盐酸西替利嗪、氯雷他定、盐酸非索非那定的结构、理化性质、体内代谢和临床用途；盐酸苯海拉明、阿伐斯汀、阿司咪唑、曲尼司特和孟鲁司特钠的结构和临床用途；马来酸氯苯那敏的合成方法。

### 二、考核知识点和考核要求

识记：①变态反应的发生机制、组胺受体的分类和组胺的生理作用；②了解 $H_1$ 受体拮抗剂的发展过程。

领会：①盐酸苯海拉明、阿伐斯汀、阿司咪唑、曲尼司特和孟鲁司特钠的结构和临床用途。

应用：① $H_1$ 受体拮抗剂的结构类型及其构效关系；②马来酸氯苯那敏、盐酸赛庚啶、盐酸西替利嗪、氯雷他定和盐酸非索非那定的结构、理化性质、体内代谢和临床用途；③马来酸氯苯那敏的合成方法。

### 三、本章重点和难点

本章重点和难点：① $H_1$ 受体拮抗剂的结构分类及代表性药物；②经典 $H_1$ 受体拮抗剂的构效关系；③马来酸氯苯那敏的合成方法。

## 第十二章 消化系统药物

### 一、课程内容

介绍胃壁细胞的泌酸过程及抗溃疡药物的作用机理； $H_2$ 受体拮抗剂的发展、结构类型和构效关系；质子泵抑制剂的发展及构效关系；5-HT<sub>3</sub>受体拮抗剂

的构效关系；西咪替丁、盐酸雷尼替丁、奥美拉唑、盐酸伊托必利和盐酸昂丹司琼的结构、理化性质、体内代谢和临床用途；法莫替丁、罗沙替丁、兰索拉唑、甲氧氯普胺、多潘立酮、枸橼酸莫沙必利、盐酸托烷司琼、盐酸帕洛诺司琼、阿瑞匹坦的结构和临床用途；盐酸雷尼替丁的合成方法。

## 二、考核知识点和考核要求

识记：①胃壁细胞的泌酸过程及抗溃疡药物的作用机理；②H<sub>2</sub>受体拮抗剂西咪替丁的发现过程及其对新药研究的意义；③质子泵抑制剂的发展过程及其构效关系。

领会：①H<sub>2</sub>受体拮抗剂的构效关系；②H<sub>2</sub>受体拮抗剂西咪替丁的发现过程及其对新药研究的意义；③5-HT<sub>3</sub>受体拮抗剂的构效关系；④法莫替丁、兰索拉唑、枸橼酸莫沙必利、盐酸托烷司琼、盐酸帕洛诺司琼和阿瑞匹坦的结构和临床用途。

应用：①H<sub>2</sub>受体拮抗剂的结构类型；②西咪替丁、盐酸雷尼替丁、奥美拉唑、多潘立酮、盐酸伊托必利和盐酸昂丹司琼的结构、理化性质、体内代谢和临床用途；③盐酸雷尼替丁的合成方法。

## 三、本章重点和难点

本章重点和难点：①常用抗溃疡药物的分类；②H<sub>2</sub>受体拮抗剂的分类及代表性药物；③H<sub>2</sub>受体拮抗剂的构效关系；④质子泵抑制剂的代表性药物及作用机制；⑤盐酸雷尼替丁的合成方法。

# 第十三章 降血糖药和骨质疏松治疗药

## 一、课程内容

介绍降血糖药物和骨质疏松治疗药物的发展、作用机制；降血糖药物和骨质疏松治疗药物的类型；格列吡嗪、瑞格列奈、盐酸二甲双胍、马来酸罗格列酮、磷酸西格列汀和阿仑膦酸钠的结构、理化性质和临床用途；胰岛素、格列本脲、格列美脲、恩格列净、帕立骨化醇、依普黄酮和利塞膦酸钠的结构和临床用途；马来酸罗格列酮的合成方法。

## 二、考核知识点和考核要求

识记：①降血糖药物和骨质疏松治疗药物的发展、作用机制。

领会：①降血糖药物和骨质疏松治疗药物的类型；②格列本脲、格列美脲、

恩格列净、帕立骨化醇、依普黄酮和利塞膦酸钠的结构和临床用途。

应用：①格列吡嗪、瑞格列奈、盐酸二甲双胍、马来酸罗格列酮、磷酸西格列汀和阿仑膦酸钠的结构、理化性质和临床用途；②马来酸罗格列酮的合成。

### 三、本章重点和难点

本章重点和难点：①口服降糖药按机理进行分类及代表性药物；②骨质疏松药物的分类及代表性药物；③马来酸罗格列酮的合成。

## 第十四章 作用于肾上腺素受体的药物

### 一、课程内容

介绍肾上腺素受体的分类、分布及相应的生理效应；儿茶酚胺递质的生物合成及代谢途径；拟肾上腺素药物和抗肾上腺素药物的发展及构效关系；肾上腺素、盐酸麻黄碱、盐酸可乐定、盐酸多巴酚丁胺、硫酸沙丁胺醇、盐酸哌唑嗪、盐酸普萘洛尔和酒石酸美托洛尔的结构、理化性质、体内代谢及临床用途；去甲肾上腺素、甲基多巴、莫索尼定、盐酸异丙肾上腺素、克仑特罗、特布他林、米拉贝隆、特拉唑嗪和艾司洛尔的结构和临床用途；盐酸普萘洛尔的合成方法。

### 二、考核知识点和考核要求

识记：①肾上腺素受体的分类、分布及相应的生理效应；②内源性的儿茶酚胺递质的生物合成途径及代谢途径；③拟肾上腺素药物和抗肾上腺素药物的发展及构效关系。

领会：①去甲肾上腺素、甲基多巴、莫索尼定、盐酸异丙肾上腺素、克仑特罗、特布他林、米拉贝隆、特拉唑嗪和艾司洛尔的结构和临床用途。

应用：①肾上腺素、盐酸麻黄碱、盐酸可乐定、盐酸多巴酚丁胺、硫酸沙丁胺醇、盐酸哌唑嗪、盐酸普萘洛尔和酒石酸美托洛尔的结构、理化性质、体内代谢及临床用途；②盐酸普萘洛尔的合成方法。

### 三、本章重点和难点

本章重点和难点：①拟肾上腺素药物的结构通式及构效关系；② $\beta$ -受体拮抗剂的结构通式及构效关系；③盐酸普萘洛尔的合成方法。

## 第十五章 抗高血压药和利尿药

### 一、课程内容

介绍高血压病病因的过程，由此过程熟悉抗高血压药物的作用靶点；抗高血压药的发展及分类；吡那地尔、卡托普利、氯沙坦、硝苯地平、氨氯地平、地尔硫草、盐酸维拉帕米、氢氯噻嗪和呋塞米的结构、理化性质、体内代谢及临床应用；利血平、米诺地尔、马来酸依那普利、福辛普利、厄贝沙坦、氟桂利嗪、尼群地平、卡普地尔及螺内酯的结构及临床用途；ACE 抑制剂、AII 受体拮抗剂、1, 4-二氢吡啶类钙离子通道阻滞剂的构效关系；卡托普利的合成方法。

## 二、考核知识点和考核要求

识记：①抗高血压药物的最新进展；②肾素—血管紧张素—醛固酮系统中 ACE 抑制剂和 AII 受体拮抗剂的发现和发展过程。

领会：①利血平、米诺地尔、马来酸依那普利、福辛普利、厄贝沙坦、氟桂利嗪、尼群地平、卡普地尔及螺内酯的结构及临床用途；②地尔硫草的体内代谢；③1, 4-二氢吡啶类钙离子通道拮抗剂的构效关系。

应用：①抗高血压药物的分类、作用靶点；②吡那地尔、卡托普利、氯沙坦、硝苯地平、氨氯地平、地尔硫草、盐酸维拉帕米、氢氯噻嗪和呋塞米的结构、理化性质、体内代谢及临床应用；③卡托普利的合成方法。

## 三、本章重点和难点

本章重点和难点：①抗高血压药物的分类及代表性药物；②钙离子通道阻滞剂的分类及代表性药物；③利尿药的分类及代表性药物；④1, 4-二氢吡啶类钙离子通道拮抗剂的构效关系；⑤ACE 抑制剂、AII 受体拮抗剂；⑥卡托普利的合成方法。

# 第十六章 心脏疾病药物和血脂调节药

## 一、课程内容

介绍心力衰竭、心绞痛、心律失常以及高血脂的病因，由此介绍各类药物的作用机制以及分类；介绍高血脂尤其是他汀类高胆固醇血症治疗药物的发现过程及构效关系；介绍扎莫特罗、米力农、匹莫苯丹、奎尼丁、普鲁卡因胺、美西律、莫雷西嗪、氯贝丁酯和非洛贝特的结构和临床用途；介绍普罗帕酮、索他洛尔、盐酸胺碘酮、硝酸甘油、硝酸异山梨酯、洛伐他汀、氟伐他汀钠和吉非罗齐的结构、理化性质、体内代谢和临床用途；介绍吉非罗齐的合成方法。

## 二、考核知识点和考核要求

识记：①强心药的分类和作用机理；②抗心绞痛药物的分类；③血脂的化学和生物化学知识。

领会：①氯贝丁酯、米力农、奎尼丁、普鲁卡因胺、胺碘酮、洛伐他汀、氟伐他汀的结构、性质和用途；②降血脂药物的分类；③他汀药物的发现、构效关系及其研究进展。

应用：①抗心律失常药的分类和作用机理；②吉非贝齐、美西律、普罗帕酮、索他洛尔、硝酸甘油、硝酸异山梨酯的结构、性质及用途；③吉非贝齐的合成。

### 三、本章重点和难点

本章重点和难点：①血脂调节药物的结构分类及代表性药物；②抗心律失常药物的分类、代表性药物及作用机制；③NO 供体药物及其用途；④硝酸酯类药物使用的注意事项；⑤吉非贝齐药物的合成路线。

## 第十七章 甾体激素类药物

### 一、课程内容

介绍甾体激素类药物的发展历程及作用机制，介绍各类甾体激素的结构特点、命名及分类；介绍各类甾体激素类药物的结构改造思路；介绍雌二醇、己烯雌酚、福美司坦、丙酸睾酮、苯丙酸诺龙、炔诺酮、醋酸甲地孕酮、米非司酮和醋酸地塞米松的结构、理化性质和临床用途；介绍炔雌醇、他莫昔芬、黄体酮、非那雄胺、阿帕他胺、左炔诺孕酮、来曲唑、醋酸氢化泼尼松和丙酸氟替卡松的结构和临床用途；介绍己烯雌酚的合成方法。

### 二、考核知识点和考核要求

识记：①甾体激素类药物的发展历程及作用机制；②抗雌激素、抗雄激素及抗孕激素类药物的发展及临床用途。

领会：①各类甾体激素类药物的结构改造方法及糖皮质激素类药物的构效关系；②炔雌醇、他莫昔芬、黄体酮、非那雄胺、阿帕他胺、左炔诺孕酮、来曲唑、醋酸氢化泼尼松和丙酸氟替卡松的结构和临床用途。

应用：①甾体激素类药物的结构特点及分类；雌二醇、己烯雌酚、福美司坦、丙酸睾酮、苯丙酸诺龙、炔诺酮、醋酸甲地孕酮、米非司酮和醋酸地塞米松的结构、理化性质和临床用途；②己烯雌酚的合成方法。

### 三、本章重点和难点

本章重点和难点：①雌激素、雄激素、糖皮质激素及孕激素的结构特征；②顺反式己烯雌酚结构与活性的关系；③肾上腺皮质激素的构效关系及改造方法；④己烯雌酚的合成方法。

## 第十八章 抗生素

### 一、课程内容

介绍抗生素类药物的类别； $\beta$ -内酰胺类抗生素的发展、构效关系、作用机制及耐药机制；寻找耐酸、耐酶、广谱青霉素的研究途径；青霉素、氨苄西林、阿莫西林、头孢氨苄、头孢噻肟、头孢克肟、克拉维酸、舒巴坦、盐酸多西环素和氯霉素的结构、理化性质和临床用途；苯唑西林、哌拉西林、头孢他啶、头孢曲松、亚胺培南、氨曲南、四环素、阿米卡星、红霉素、阿奇霉素和克拉霉素的结构和临床用途；四环素类、氨基糖苷类和大环内酯类抗生素的结构特点、理化性质、毒副作用、耐药机制及临床用途；半合成红霉素衍生物的结构改造方法；半合成青霉素和头孢菌素衍生物的合成方法。

### 二、考核知识点和考核要求

识记：① $\beta$ -内酰胺类抗生素的发展、构效关系、作用机制及耐药机制；②耐酸、耐酶、广谱青霉素的研究途径；③四环素类、氨基糖苷类和大环内酯类抗生素的结构特点、理化性质、毒副作用、耐药机制及临床用途；④半合成红霉素衍生物的结构改造方法；⑤半合成青霉素和头孢菌素衍生物的合成方法。

领会：①苯唑西林、哌拉西林、头孢他啶、头孢曲松、亚胺培南、氨曲南、四环素、阿米卡星、红霉素、阿奇霉素和克拉霉素的结构和临床用途。

应用：①抗生素类药物的类别和青霉素的不稳定性；②青霉素、氨苄西林、阿莫西林、头孢氨苄、头孢噻肟、头孢克肟、克拉维酸、舒巴坦、盐酸多西环素和氯霉素的结构、理化性质和临床用途。

### 三、本章重点和难点

本章重点和难点：① $\beta$ -内酰胺类抗生素的构效关系、作用机制及耐药机制；②青霉素的不稳定性特征；③四环素类、氨基糖苷类和大环内酯类抗生素的结构特点；④头孢类药物的结构特征及理化性质。

## 第十九章 合成抗菌药

### 一、课程内容

介绍喹诺酮类药物、抗结核药物和抗真菌药物的发展过程和作用机理；磺胺类药物及抗菌增效剂的作用机理；喹诺酮类药物和磺胺类药物的构效关系；磺胺甲噁唑、甲氧苄啶、诺氟沙星、环丙沙星、左氧氟沙星、利奈唑胺、异烟肼、氟康唑和特比萘芬的结构、理化性质和临床用途；磺胺醋酰、磺胺嘧啶、洛美沙星、莫西沙星、盐酸乙胺丁醇、利福平、克霉唑、酮康唑和布替萘酚的结构和临床用途；诺氟沙星的合成方法。

### 二、考核知识点和考核要求

识记：①磺胺类药物、喹诺酮类药物、抗结核药物和抗真菌药物的发展过程；②喹诺酮类药物和抗真菌药物的作用机制。

领会：①喹诺酮类药物和磺胺类药物的构效关系；②磺胺醋酰、磺胺嘧啶、洛美沙星、莫西沙星、盐酸乙胺丁醇、利福平、克霉唑、酮康唑和布替萘酚的结构和临床用途。

应用：①磺胺类药物及抗菌增效剂的作用机理；②代谢拮抗和致死合成的概念；③磺胺甲噁唑、甲氧苄啶、诺氟沙星、环丙沙星、左氧氟沙星、利奈唑胺、异烟肼、氟康唑和特比萘芬的结构、理化性质和临床用途；④诺氟沙星的合成方法。

### 三、本章重点和难点

本章重点和难点：①抗生素的四种作用机制，磺胺类药物的构效关系及作用机制，抗菌增效剂如甲氧苄啶（TMP）的增效原理，喹诺酮类药物的构效关系及作用机理（包括代表性药物）；②抗结核药物的作用机制、分类及代表性药物；③诺氟沙星的合成方法。

## 第二十章 抗病毒药

### 一、课程内容

介绍抗病毒药物的发展及新进展；HIV 酶抑制剂的研究概况和最新进展；代谢拮抗原理在核苷类抗病毒药物设计中的应用；磷酸奥司他韦、碘苷、索磷布韦、阿昔洛韦、利巴韦林、齐多夫定、奈韦拉平和利匹韦林的结构、理化性质和临床用途；盐酸金刚烷胺、阿糖胞苷、更昔洛韦、玛巴洛沙韦、司他夫定、沙奎那韦、

茆地那韦和艾维雷韦的结构和临床用途；利巴韦林的合成方法。

## 二、考核知识点和考核要求

识记：①抗病毒药物的发展及新进展；②HIV 酶抑制剂的研究概况和最新进展。

领会：①抗病毒药物的作用机制和分类；②代谢拮抗原理在核苷类抗病毒药物设计中的应用；③盐酸金刚烷胺、阿糖胞苷、更昔洛韦、玛巴洛沙韦、司他夫定、沙奎那韦、茆地那韦和艾维雷韦的结构和临床用途。

应用：①磷酸奥司他韦、碘苷、索磷布韦、阿昔洛韦、利巴韦林、齐多夫定、奈韦拉平和利匹韦林的结构、理化性质和临床用途；②利巴韦林的合成方法。

## 三、本章重点和难点

本章重点和难点：①抗病毒药物的分类及代表性药物；②利巴韦林的合成方法。

# 第二十一章 抗肿瘤药物

## 一、课程内容

介绍各类抗肿瘤药物的结构类型、构效关系和作用机理；代谢拮抗原理在抗肿瘤药物设计中的应用；抗肿瘤药物的发展历程、新靶点和发展方向；环磷酰胺、卡莫司汀、顺铂、米托蒽醌、氟尿嘧啶、盐酸阿糖胞苷和甲磺酸伊马替尼的结构、理化性质和临床用途；盐酸氮芥、美法仑、氮甲、异环磷酰胺、盐酸多柔比星、白消安、塞替派、洛莫司汀、喜树碱、拓扑替康、卡莫氟、磺巯嘌呤钠、甲氨蝶呤和吉非替尼的结构和临床用途；环磷酰胺、甲磺酸伊马替尼的合成方法。

## 二、考核知识点和考核要求

识记：①抗肿瘤药物的发展历程、新靶点和发展方向。

领会：①各类抗肿瘤药物的结构类型、构效关系和作用机理；②盐酸氮芥、氮甲、白消安、塞替派、洛莫司汀、喜树碱、伊立替康、吉非替尼、硼替佐米、伏立诺他和西达本胺的结构和临床用途。

应用：①代谢拮抗原理在抗肿瘤药物设计中的应用；②环磷酰胺、卡莫司汀、顺铂、米托蒽醌、甲氨蝶呤、5-氟尿嘧啶、盐酸阿糖胞苷、巯嘌呤、甲磺酸伊马替尼的结构、理化性质和临床用途；③甲磺酸伊马替尼的合成方法。

## 三、本章重点和难点

本章重点和难点：①抗肿瘤药物的分类及代表性药物；②烷基化试剂的作用机制；③环磷酰胺的内代谢途径及毒性低的原因；④抗代谢抗肿瘤药物分类及代表性药物；⑤甲磺酸伊马替尼的合成方法。

## IV 有关说明与实施要求

### 一、课程自学考试大纲的目的和作用

本课程自学考试大纲是根据专业考试计划的要求，结合自学考试的特点而确定的。目的是对个人自学、社会助学和课程考试命题进行指导和规定。

课程自学考试大纲明确了课程学习的内容以及深度、广度，规定了课程自学考试的范围和标准。因此，它是编写自学考试教材和辅导书的依据，是社会助学组织进行自学辅导的依据，是考生学习教材、掌握课程内容的依据，也是进行自学考试命题的依据。

### 二、课程自学考试大纲与教材的关系

课程自学考试大纲是进行学习和考核的依据，教材是学习掌握课程知识的基本内容与范围，教材的内容是大纲所规定的课程知识和内容的拓展与发挥。课程内容在教材中可以体现一定的深度或难度，但在大纲中对考核的要求一定要适当。

大纲与教材所体现的课程内容应基本一致；大纲里面的课程内容和考核知识点，教材里一般也要有。反过来教材里有的内容，大纲里就不一定体现。

### 三、关于自学教材

1. 本课程使用教材为：药物化学（第四版），尤启冬，化学工业出版社，2021年。

2. 参考书：

[1] Foye's Principles of Medicinal Chemistry, edited by Tomas L. Lemke, David A. Williams, et al. 7th Edition, (Lippincott Williams and Wilkins, Philadelphia), 2013.

[2] Burger's Medicinal Chemistry and Drug Discovery, edited by Abraham, 6th edition (Wiley, New York), 2003. RS 403.B8 2003.

[3] 药物化学总论（第三版），郭宗儒，科学出版社，2016年。

### 四、关于自学要求和自学方法的指导

本大纲的课程基本要求是依据专业考试计划和专业培养目标而确定的。课程基本要求明确了课程的基本内容，以及对基本内容掌握的程度。基本要求中的知

识点构成了课程内容的主体部分。因此，课程基本内容掌握程度、课程考核知识点是高等教育自学考试考核的主要内容。

为有效地指导个人自学和社会助学，本大纲已指明了课程的重点和难点，在章节的基本要求中一般也指明了章节内容的重点和难点。自考生必须保证必要的自学时间，在学习中注重理论联系实际，应根据该课程的特点和自身实际情况，合理安排自学计划。

## **五、应考指导**

### **1. 如何学习**

本课程作为药学类专业的一门重要课程，建议学习本课程时注意以下几点：

（1）在学习本课程教材之前应先仔细阅读本大纲，了解本课程的性质和特点，熟知本课程的基本要求，在学习本课程时，能紧紧围绕本课程的基本要求。

（2）在自学教材的每一章之前，先阅读本大纲中对应章节的学习目的与要求、考核知识点与考核要求，以使自学时做到心中有数。

（3）学完后重点复习每章的重难点内容，进行相应的归纳总结。

### **2. 如何考试**

卷面整洁非常重要。书写工整，段落与间距合理，卷面赏心悦目有助于教师评分，教师只能为他能看懂的内容打分。回答所提出的问题。要回答所问的问题，而不是回答你自己乐意回答的问题！避免超过问题的范围。

## **六、对社会助学的要求**

1. 应熟知考试大纲对课程所提出的总的要求和各章的知识点。

2. 应掌握各知识点要求达到的层次，并深刻理解各知识点的考核要求。

3. 对考生进行辅导时，应以指定的教材为基础，以考试大纲为依据，不要随意增删内容，以免与考试大纲脱节。

4. 辅导时应对考生进行学习方法的指导，提倡考生“认真阅读教材，刻苦钻研教材，主动提出问题，依靠自己学懂”的学习方法。

5. 辅导时要注意基础、突出重点，要帮助考生对课程内容建立一个整体的概念，对考生提出的问题，应以启发引导为主。

6. 注意对考生能力的培养，特别是自学能力的培养，要引导考生逐步学会独立学习，在自学过程中善于提出问题、分析问题、做出判断和解决问题。

7. 要使考生了解试题难易与能力层次高低两者不完全是一回事, 在各个能力层次中都存在着不同难度的试题。

### 七、关于考试命题和考核的若干规定

1. 本大纲各章所提到的考核要求中, 各条细目都是考试的内容, 试题覆盖到章, 适当突出重点章节, 加大重点内容的覆盖密度。

2. 试卷对不同能力层次要求的试题所占的比例大致是: 识记占 20%, 领会占 30%, 应用占 50%。

3. 试题的难易程度分为四个等级: 易、较易、较难和难。在每份试卷中, 不同难度的试题的分数比例一般为 2:3:3:2。试题的难易程度与能力层次有不同的意义, 在各个能力层次上都有不同难度的试题。

4. 本课程考试试题可能采用的题型有: 单项选择题、判断改错题、名词解释题、简答题、论述题等类型。

5. 考试方式为闭卷、笔试, 考试时间为 150 分钟。评分采用百分制, 60 分为及格。考生只准携带 0.5 毫米黑色墨水的签字笔、铅笔、圆规、直尺、三角板、橡皮等必需的文具用品。不可携带计算器。

## 附录 题型举例

### 一、单项选择题

1. 下列属于抗结核药物的是 ( )

- A. 异烟肼                      B. 阿司匹林  
C. 阿奇霉素                    D. 红霉素

参考答案: A

### 二、判断改错题

1. 诺氟沙星是第一种上市的含氟喹诺酮药物, 具有抗菌谱广的特点。

参考答案: √。

### 三、名词解释题

1. 血脑屏障

参考答案: 指脑毛细血管壁与神经胶质细胞形成的血浆与脑细胞之间的屏障和由脉络丛形成的血浆和脑脊液之间的屏障, 这些屏障能够阻止某些物质 (多半是有害的) 由血液进入

脑组织。

#### 四、简答题

1. 简述 ACE 抑制剂的构效关系。

参考答案：

(1) N-环上必须含有与 ACE 底物 C-端羧酸酯相似的羧基，将羧基酯化可得其可口服的前药。

(2) 巯基有利于与锌离子结合，由于可形成二硫化物而减少其作用时间。

(3) 在 N-环上连有较大疏水基团有利于增加药效和改变药代动力学参数。

(4) ACE 抑制剂 L-构型的活性更高。

#### 五、论述题

1. 以氟尿嘧啶为例，试述代谢拮抗原理在抗肿瘤药物设计中的应用。

参考答案：

代谢拮抗就是设计与生物体内基本代谢物的结构有某种程度相似的化合物，使之竞争性地和特定的酶相作用，干扰基本代谢物的被利用，从而干扰生物大分子的合成；或以伪代谢物的身份掺入生物大分子的合成中，形成伪生物大分子，导致致死合成，从而影响细胞的生长。例如：尿嘧啶是体内正常的嘧啶碱基，其掺入肿瘤组织的速度比其它嘧啶快，利用生物电子等排原理，以氟原子代替尿嘧啶 5 位上的氢原子，得到氟尿嘧啶。