

第一章 绪 论

基本要求:

1. 了解药物化学的起源与发展及我国药物化学的现状, 熟悉药物化学学科的研究内容和发展方向。了解药物化学课的学习内容。
2. 熟悉中国药品通用名称及化学名的命名规则; 了解商品名的作用及命名要求。

第二章 新药设计和开发

基本要求:

1. 熟悉药物作用的生物靶点; 药物作用的体内过程; 影响药物疗效的某些理化因素和立体因素; 药物-受体相互作用的化学过程。
2. 熟悉新药开发的基本途径: 熟悉先导化合物及其来源和先导化合物的优化方法。
3. 熟悉计算机辅助药物设计的基本原理, 了解对接术, 构象分子场分析方法, 3-D 定量构效关系, 药效结构模型法。
4. 了解“基因工程”的一般原理、方法及其在新药研发中的应用。

第三章 中枢神经系统药物

基本要求:

1. 熟悉镇静催眠药的结构类型和作用机制。掌握异戊巴比妥、地西泮的化学名、理化性质、体内代谢及用途。熟悉异戊巴比妥的合成路线及巴比妥类药物的构效关系。了解唑吡坦的结构、化学名及用途。
2. 熟悉抗癫痫药物的结构类型和作用机制。熟悉苯妥英钠的结构、化学名及用途。了解卡马西平、普罗加比的结构和用途。
3. 熟悉抗精神病药的结构类型和作用机制。了解抗精神病药的发展。掌握氯丙嗪的结构、化学名、理化性质、体内代谢及用途。熟悉氯氮平的结构、化学名及用途。了解氟哌啶醇的结构、化学名、理化性质、体内代谢及用途。
4. 熟悉抗抑郁药的结构类型和作用机制。了解抗抑郁药的发展。掌握丙咪嗪的化学名、理化性质、体内代谢及用途。了解氟西汀的结构、化学名及用途。
5. 熟悉中枢兴奋药的结构类型和作用机制。了解中枢兴奋药的发展。掌握咖啡因的结构、化学名、理化性质、体内代谢及用途。了解咖啡因的合成路线。了解吡拉西坦、甲氯芬酯的结构和用途。
6. 熟悉镇痛药的结构类型和作用机制。了解镇痛药发展。掌握吗啡的结构、化学名、理化性质、体内代谢、构效关系及用途。熟悉哌替啶的结构、化学名及用途。了解美沙酮、喷他佐辛的结构和用途。

第四章 外周神经系统药物

基本要求:

1. 掌握拟胆碱药物的类型。掌握胆碱受体激动剂的构效关系。掌握乙酰胆碱酯酶抑制剂的作用机制及应用特点。了解胆碱受体激动剂和乙酰胆碱酯酶抑制剂的发展和现状。掌握氯贝胆碱、溴新斯的明的化学名、结构、理化性质和用途。了解毒蕈碱、尼古丁的结构及作用。; 了解毛果芸香碱、他克林、多奈培齐的结构和用途。
2. 掌握抗胆碱药物的类型。掌握硫酸阿托品、溴丙胺太林的结构、理化性质、用途和 M 胆碱受体拮抗剂的构效关系。熟悉莨菪类药物的构效关系。了解氢溴酸东莨菪碱、氢溴酸山莨菪碱、氢溴酸樟柳碱、右旋氯筒箭毒碱、泮库溴胺的结构、作用特点和用途。了解 M 胆碱受体拮抗剂的发展。了解 N 胆碱受体拮抗剂的发展及结构类型。
3. 掌握肾上腺素受体激动剂的基本结构类型及其构效关系。掌握肾上腺素、盐酸麻黄碱的化

学名、结构及其特点、作用、理化性质和用途。熟悉拟肾上腺素药物的构效关系。了解沙丁胺醇的化学名、结构及其特点、作用、理化性质和用途。了解去甲肾上腺素、异丙肾上腺素的结构和用途。了解拟肾上腺素药物的发展。

4. 掌握组胺 H₁ 受体拮抗剂的结构类型。熟悉马来酸氯苯那敏、盐酸赛庚啶、盐酸西替利嗪、咪唑斯汀的化学名、结构、理化性质和用途。了解盐酸苯海拉明、盐酸曲吡那敏、酮替芬的结构和用途。了解第一代（经典）抗组胺药物的发展及结构变换。了解第二代（非镇静性）抗组胺药物的发展。

5. 掌握局部麻醉药的结构类型。掌握盐酸普鲁卡因、盐酸利多卡因的化学名、结构、理化性质和用途。掌握局麻药的构效关系。熟悉可卡因到普鲁卡因的研究思路及过程。了解盐酸丁卡因、盐酸布比卡因、盐酸达克罗宁的结构、作用特点和用途。了解局麻药发展和现状。

第五章 循环系统药物

要求基本：

1. 掌握 β -受体阻滞剂的分类及各类药物的作用特点；掌握 β -受体阻滞剂的构效关系。掌握盐酸普萘洛尔的结构、化学名、理化性质、体内代谢、临床应用及合成路线。熟悉酒石酸美托洛尔的结构、化学名及应用。了解 β -受体阻滞剂的发展。

2. 了解钙通道阻滞剂的分类。熟悉钙通道阻滞剂的构效关系。掌握硝苯地平的结构、化学名、理化性质、体内代谢、临床应用及合成路线。熟悉盐酸地尔硫卓的结构、化学名、代谢及应用。了解盐酸维拉帕米的结构、化学名、代谢及应用。了解尼莫地平、尼群地平等同类药物的结构及应用。

3. 熟悉钠通道阻滞剂的分类及各类药物的作用特点。熟悉盐酸胺碘酮的结构、化学名、理化性质、体内代谢、临床应用及合成路线。熟悉硫酸奎尼丁的结构、化学名及应用，了解盐酸美西律的结构及应用。

4. 熟悉 ACEI 及 Ang II 受体拮抗剂的作用机制；了解 ACEI 及 Ang II 受体拮抗剂的发展。掌握卡托普利的结构、化学名、理化性质、体内代谢、临床应用及合成路线。熟悉氯沙坦的结构、化学名及应用。了解马来酸依那普利等同类药的结构及应用。

5. 熟悉 NO 供体药物的作用机制。掌握硝酸甘油的结构、化学名、理化性质、体内代谢及临床应用。了解硝酸异山梨酯、吗多明、硝普钠的结构及应用。

6. 了解强心甙类药物的构效关系。掌握地高辛的结构、理化性质、代谢、作用机制及临床应用。了解米力农、多巴酚丁胺、匹莫苯的结构及应用。了解其它类型强心药的作用特点。

7. 熟悉调血脂药的类型及作用机制；掌握他汀类药物的构效关系。掌握洛伐他汀的结构、化学名、理化性质、体内代谢及临床应用。了解辛伐他汀、阿托伐他汀、普伐他汀、吉非罗齐、非诺贝特及烟酸的结构及应用。

8. 熟悉抗血栓药的分类；了解抗血栓药的发展。熟悉氯吡格雷、华法林钠的结构、化学名及应用；熟悉阿司匹林的抗血栓机制。

9. 熟悉利血平的结构特点、化学名及应用。了解酚妥拉明、哌唑嗪、可乐定、莫索尼定、甲基多巴、胍屈嗪、胍乙啶的结构及应用。

第六章 消化系统药物

基本要求：

1. 掌握抗溃疡药物的结构类型和作用机制。掌握西咪替丁、奥美拉唑的结构、化学名称、理化性质、体内代谢及用途。熟悉雷尼替丁的结构、化学名称及用途。了解西咪替丁的合成路线。

2. 熟悉止吐药的结构类型和作用机制。掌握昂丹司琼的结构、化学名称、理化性质、体内代谢及用途。了解地芬尼、多硫乙拉嗪的结构特点及用途。了解昂丹司琼的合成路线。

3. 熟悉西沙必利的结构、化学名称、理化性质、体内代谢及用途。熟悉多潘立酮的结构、化学名称及用途。了解甲氧氯普胺的结构特点、用途、不良反应和现状。了解促动力药的作用。

4. 熟悉联苯双酯的结构、化学名称、理化性质、体内代谢及用途。了解水飞蓟素、熊去氧胆

酸的结构特点及用途。了解肝胆疾病辅助治疗药物的现状。

第七章 解热镇痛药和非甾体抗炎药

基本要求:

1. 掌握阿司匹林、对乙酰氨基酚的化学名、结构、理化性质、体内代谢和合成及用途, 熟悉阿司匹林衍生物的结构和特点, 掌握苯胺类解热镇痛药代谢化学与毒性的关系。了解的水杨酸类解热镇痛药物的发展历史。
2. 掌握非甾体抗药物的分类, 熟悉羧布宗、吲哚美辛、甲芬那酸、吡罗西康、双氯芬酸钠、布洛芬和萘普生化学名、结构、理化性质、体内代谢和合成及用途, 掌握芳基丙酸类镇痛抗炎药的构效关系。熟悉布洛芬光学异构体代谢的活性变化, 熟悉 3, 5-吡唑烷二酮类药物的代谢物药物活性的变化, 3, 5-吡唑烷二酮类药物的结构与活性的关系。熟悉灭酸类药物立体结构特征, 了解芳基烷酸非甾体抗炎药物的发展概况。熟悉 COX-1 和 COX-2 的结构差别及其药理作用的特点。掌握塞利西布的化学名、结构和合成及以结构与活性关系。

第八章 抗生素

基本要求:

1. 了解 β -内酰胺抗生素的发展和作用机制; 熟悉 β -内酰胺抗生素的结构特点、分类。掌握 β -内酰胺抗生素构效关系; 熟悉半合成青霉素和头孢菌素的结构改造方法及一般合成方法。掌握青霉素的理化性质及在各种条件下的分解产物; 掌握青霉素钠、阿莫西林、头孢氨苄和头孢噻肟钠的结构、理化性质及临床应用; 了解苯唑西林钠、克拉维酸钾及氨曲南的结构及临床用途; 了解头孢菌素四代的划分及各代药物的特点
2. 了解氨基糖苷类抗生素的结构特点、临床应用及毒副作用; 了解细菌对氨基糖苷类抗生素产生耐药的主要原因及半合成氨基糖苷类抗生素的结构改造方法。
3. 了解四环素类抗生素的结构特点、临床应用及毒副作用; 熟悉天然四环素类抗生素的理化性质。
4. 了解大环内酯类抗生素的结构特点及临床应用; 熟悉红霉素的理化性质及半合成红霉素衍生物的结构改造方法; 熟悉红霉素、罗红霉素、阿齐霉素、克拉霉素及泰利霉素的作用特点。
5. 熟悉氯霉素的化学结构、理化性质及临床应用; 熟悉氯霉素的合成方法。

第九章 利尿药及合成降血糖药

基本要求:

1. 掌握口服降血糖药的结构类型。掌握甲苯磺丁脲、格列本脲的化学名、结构、理化性质和用途。熟悉磺酰脲类口服降血糖药的结构与代谢、作用时间的关系。了解氯磺丙脲、格列吡嗪的结构和用途。了解盐酸二甲双胍。了解磺酰脲类口服降血糖药的发展。了解格列美脲、米格列醇的结构和用途。
2. 掌握利尿药的分类及各类药物的作用机制。掌握氢氯噻嗪的结构、化学名、理化性质、体内代谢、临床应用及合成路线。熟悉呋塞米、螺内酯的结构、化学名、代谢及应用。了解乙酰唑胺、氨苯蝶啶的结构及应用。

第十章 维生素

基本要求:

1. 熟悉维生素 A 的化学结构, 理化性质, 各自的活性形式及用途。了解维生素 D 和维生素 E 的化学结构, 理化性质, 各自的活性形式及用途
2. 熟悉维生素 C 的化学结构, 理化性质, 各自的活性形式及用途。了解维生素 H 的结构特点及用途。

主要参考书

郑虎主编.《药物化学》(第五版).人民卫生出版社, 2003 年