

《药物化学》教学大纲

(供四年制药学等专业使用)
(依据全国统编教材第七版修订)
药物化学教研室修订
二零一五年七月

一、前言

药物化学是一门用现代科学方法研究化学药物的化学结构、制备原理、理化性质、体内代谢、构效关系、生物活性以及发展新药的科学，是药学专业的一门专业基础课。

教学任务：

- 1、常用药物的通用名、化学命名、化学结构、合成方法、理化性质和用途。重要药物类型的构效关系。
- 2、为药物的贮存、制剂、分析和管理的提供相应的化学基础。
- 3、重要药物在体内发生的与代谢有关的化学变化及与生物活性的关系。为合理使用化学药物提供理论基础。
- 4、各类药物的发展、结构类型和最新进展。
- 5、新药研究的基本方法和近代新药发展方向。

二、理论内容和要求

第一章 绪论

【目的要求】

1. 掌握：药物的化学命名方法
2. 熟悉：药物化学的研究对象和任务
3. 了解：药物化学的起源与发展

【教学内容】

第一节 药物化学的起源与发展

1. 传统的新药研究与开发的模式
2. 现代的新药开发与研究的内容

第一节 药物的命名

1. 通用名
2. 化学名
3. 商品名

第二章 中枢神经系统药物

【目的要求】

1. 掌握：

苯巴比妥、地西洋、氯丙嗪、氟哌丁醇的结构、名称、理化性质、体内代谢及用途

2. 熟悉：

(1) 镇静催眠药、抗癫痫药、抗精神失常药、镇痛药和中枢兴奋药的结构类型和作用机制

(2) 唑吡坦、奥沙西洋、苯妥英钠、氯氮平、氯普噻吨、阿米替林、舒必利、哌替啶的结构、化学名称及用途。

(3) 巴比妥类药物和苯并氮杂卓类药物的构效关系

3. 了解：

(1) 三唑仑、丙戊酸钠、丙咪嗪、卡马西平、普罗加比、盐酸纳洛酮、丁螺环酮、美沙酮的结构及用途

(2) 抗精神病药和中枢兴奋药的发展

(3) 异戊巴比妥和盐酸甲氯芬酯的合成路线

【教学内容】

第一节 镇静催眠药

1. 巴比妥类：异戊巴比妥等代表药的化学名，结构及特征，理化性质及合成工艺；巴比妥类药的构效关系

2. 苯二氮卓类：地西洋等代表药的化学名，结构及特征，理化性质；地西洋的构效关系；地西洋的合成工艺

3. 唑吡坦类：酒石酸唑吡坦的化学名，结构及特征，理化性质及体内代谢；酒石酸唑吡坦的合成路线

4. 其他类：一些具有酰胺结构的镇静催眠药

第二节 抗癫痫药物

1. 苯妥英钠：化学名，结构及特征，理化性质，体内代谢，临床应用及作用机制

2. 卡马西平：化学名，结构及特征，理化性质，体内代谢，临床应用及作用机制

3. 普罗加比：化学名，结构及特征，理化性质，体内代谢，临床应用及作用机制

第三节 抗精神病药

1. 吩噻嗪类：盐酸氯丙嗪的化学名，结构及特征，理化性质，合成，代谢，以及改造后的药物

2. 噻吨类：氯普噻吨代表药的结构与名称

3. 丁酰苯类：氟哌啶醇的名称，结构与特征，理化性质，体内代谢机构效关系；氟哌啶醇的改造药

物的结构与名称

4. 苯甲酰胺类：舒必利代表药的化学名称，结构与特征
5. 二苯氮卓类：氯氮平的化学名称，结构与特征，理化性质，体内转化过程，以及结构改造后的药物
6. 其他类：利培酮

第四节 抗抑郁药

1. 三环类抗抑郁药：盐酸丙咪嗪的化学名称，结构与特征，体内代谢以及制备方法；其他三环类抗抑郁药，阿米替林，丙咪嗪
2. 单胺氧化酶抑制剂：盐酸氟西汀的化学名，结构与特征，理化性质，制备方法
3. 5-羟色胺重摄取抑制剂：舍曲林等药物

第五节 镇痛药

1. 吗啡生物碱类：吗啡的结构，理化性质，结构特征，临床应用；
2. 吗啡改造后的药物，海洛因，氢吗啡酮，羟吗啡酮，埃托啡，二氢埃托啡，纳洛酮；吗啡类药物的构效关系
3. 合成类镇痛药：盐酸派替啶的化学名称，结构与特征，理化性质，派替啶结构改造后的药物；盐酸美沙酮的化学名称，理化性质，体内的代谢途径，合成路线；喷他佐辛的化学名称与结构，理化性质，在体内的代谢途径以及合成工艺；
4. 其他苯吗喃类药物：非那罗辛的名称与结构
5. 其他一些药物：盐酸曲马多，奈福泮等

第六节 中枢兴奋药

1. 根据药物作用的选择性和用途，中枢兴奋药的分类；按化学结构及来源的分类级代表药
2. 咖啡因的理化性质和全合成路线；其他天然黄嘌呤衍生物和合成黄嘌呤类药物
3. 吡拉西坦的化学名称与结构特征，理化性质，临床应用。其结构改造后的药物；吡拉西坦的合成路线
4. 盐酸甲氯芬酯的化学名称，结构与特征，理化性质，合成路线

第三章 外周神经系统药物

【目的要求】

1. 掌握：氯贝胆碱、硫酸阿托品、肾上腺素、盐酸麻黄碱、盐酸苯海拉明、盐酸普鲁卡因的结构、化学名称、理化性质、体内代谢及用途。

2. 熟悉：

(1) 拟胆碱药、抗胆碱药、拟肾上腺素药、组胺 H_1 受体拮抗剂、局部麻醉药的结构类型和作用机制

(2) 溴新斯的明、氢溴酸山莨菪碱、溴丙胺太林、马来酸氯苯那敏、盐酸利多卡因的结构、化学名称及用途。

3. 了解：

(1) 沙丁胺醇、盐酸达克罗宁的结构及用途

(2) 盐酸苯海拉明、盐酸普鲁卡因、盐酸利多卡因的合成路线

(3) 拟胆碱药、拟肾上腺素药、组胺 H_1 受体拮抗剂和局部麻醉药的构效关系

(4) 拟胆碱药、抗精神病药、中枢兴奋药的发展

【教学内容】

第一节 拟胆碱药

1. 胆碱受体激动剂

(1) 胆碱受体的分类

(2) 常见的胆碱受体激动剂；代表药氯贝胆碱的化学名称与结构特征，理化性质；拟胆碱药物的构效关系；氯贝胆碱的制备

2. 乙酰胆碱酯酶抑制剂

(1) 溴新斯的明的化学名称，结构与特征，理化性质，临床应用，制备

(2) 其他较经典的抗胆碱酯酶药

第二节 抗胆碱药

1. 茄科生物碱类 M 胆碱受体拮抗剂

(1) 硫酸阿托品的化学名称，结构与特征，理化性质；阿托品的类似物

(2) 氢溴酸山莨菪碱的化学名称，结构及特征，理化性质，合成路线

2. 合成 M 胆碱受体拮抗剂

(1) 溴丙胺太林的化学名称，结构及特征，理化性质；M 受体拮抗剂的构效关系

3. N 胆碱受体拮抗剂的类型及临床应用

第三节 拟肾上腺素药

1. 肾上腺素药的作用机制及临床使用这类药物的分类及用途

2. 肾上腺素的化学名，结构及特征，理化性质及体内代谢，制备方法

3. 盐酸麻黄碱的化学名，结构及特征，理化性质，体内转化过程，生物制备

4. 沙丁胺醇的化学名，结构及特征，理化性质，构效关系，合成路线
5. 拟肾上腺素药的构效关系

第四节 组胺 H₁ 受体拮抗剂

1. 组胺参与生理过程的意义 组胺受体的三种亚型
2. H₁ 受体拮抗剂按化学结构的分类级代表药
3. 马来酸氯苯那敏的化学名与结构特征，理化性质，生物利用度及合成路线；丙胺类结构改造的其不饱和类似物
4. 盐酸赛庚啉的化学名与结构特征，理化性质，药物动力学及药代学，临床应用；以及在其基础上的改造药物和他们的临床应用；盐酸赛庚啉的制备方法
5. 盐酸西替利嗪的化学名，结构及特征，理化性质，药理作用，制备方法；其他派嗪类抗组胺药物
6. 咪唑斯汀的化学名与结构特征，理化性质，生物利用度；哌啶类 H₁ 受体拮抗剂

第五节 局部麻醉药

1. 盐酸普鲁卡因的化学名，结构及特征，理化性质，及简化天然可卡因的过程，制备方法，体内的代谢
2. 部分酯类局部麻醉药的结构与名称
3. 盐酸利多卡因的化学名，结构及特征，理化性质，代谢途径，化学合成路线
4. 部分酰胺类局部麻醉药特点及用途
5. 盐酸达克罗宁的化学名，结构及特征，理化性质，药物动力学，合成路线
6. 局部麻醉药的构效关系及立体结构与活性之间的关系探讨

第四章 循环系统药物

【目的要求】

1. 掌握：普萘洛尔、硝苯地平、卡托普利、氯贝丁酯、硝酸甘油的结构、化学名称、理化性质、体内代谢及用途。
2. 熟悉：
 - (1) 作用于相关离子通道、受体、递质和酶的循环系统药物结构类型和作用机制，熟悉利尿药和调血脂药物的结构类型和作用机制。
 - (2) 美托洛尔酒石酸盐、地尔硫卓、盐酸胺酮、吗多明、烟酸、呋塞米的结构、化学名称及用途。
3. 了解：

(1) 维拉帕米、拉贝洛尔、利舍平、酚妥拉明、胍屈嗪、洛沙坦、米力农、甘露醇、依那普利马来酸盐、乙酰唑胺、依他尼酸、螺内酯、洛伐他丁、丙丁酚的结构特点及用途

(2) 普萘洛尔、硝苯地平、卡托普利、氯贝丁酯类药物的构效关系。了解作用于离子通道、受体、有关递质和酶抑制剂的循环系统药物的发展。

(3) 盐酸普萘洛尔、盐酸美西律的合成路线。

【教学内容】

第一节 β -受体阻滞剂

1. 心血管系统药物的概述
2. β -受体阻滞剂按与两种受体亚型亲和力的差异可分为三类及其代表药
3. 盐酸普萘洛尔的化学名，结构及特征，理化性质，临床应用，代谢途径，合成路线； β -受体阻滞剂的构效关系
4. 酒石酸美托洛尔的化学名，结构及特征，理化性质，临床应用，代谢途径；在其基础上得到选择性更强 β_1 -受体阻滞剂

第二节 钙通道阻滞剂

1. 钙通道阻滞剂的分类级代表药
1. 硝苯地平的化学名，结构及特征，理化性质，构效关系，根据构效关系进行的结构修饰合成出了一系列的“地平”类化合物
2. 盐酸地尔硫卓的化学名，结构及特征，理化性质，构效关系，合成路线
3. 盐酸维拉帕米的化学名，结构及特征，理化性质，体内代谢物，合成路线，临床应用

第三节 钠、钾通道阻滞剂

1. 钠钾通道阻滞剂
 - (1) 常用的钠通道阻滞剂的分类及代表药
 - (2) 硫酸奎尼丁的化学名，结构及特征，理化性质，临床应用
 - (3) 盐酸美西律的化学名，结构及特征，理化性质，代谢物，合成路线
2. 钾通道阻滞剂
 - (1) 常见的钾通道阻滞剂
 - (2) 盐酸胺碘酮的化学名，结构及特征，理化性质，临床应用，合成路线；临床使用的其他同类药物

第四节 血管紧张素转化酶抑制剂及血管紧张素II受体拮抗剂

1. 血管紧张素转化酶抑制剂

(1) 血管紧张素转化酶的分类及代表药

(2) 卡托普利的化学名, 结构及特征, 理化性质, 合成路线, 构效关系; 马来酸依那普利

2. 血管紧张素 II 受体拮抗剂

(1) 常见的血管紧张素 II 受体拮抗剂的结构与名称

(2) 氯沙坦的化学名, 结构及特征, 理化性质, 体内代谢及构效关系

第五节 NO 供体药物

1. NO 的生理功能及临床研究进展

2. NO 供体药作用机制

3. 常见的 NO 供体药物的结构与名称

4. 硝酸甘油的化学名, 结构及特征, 理化性质, 生物转化及代谢, 临床应用

第六节 强心药

1. 常见的强心药的名称, 结构与说明

2. 地高辛的化学名, 结构及特征, 理化性质, 临床使用状况及其他强心甙类药物

3. 强心甙类药物的构效关系

第七节 调血脂药

1. 羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑制剂

(1) 常见的 HMG-CoA 还原酶抑制剂代表药及结构

(2) 洛伐他汀的化学名, 结构及特征, 理化性质, 构效关系, 临床应用

2. 影响胆固醇和甘油三酯代谢药物

(1) 常见的影响胆固醇和甘油三酯代谢的分类及代表药

(2) 吉非罗齐的化学名, 结构及特征, 理化性质, 代谢途径, 合成路线, 构效关系

第八节 抗血栓药

1. 血栓形成的诸多因素以及根据抗血栓的机制不同, 抗血栓药的分类

2. 常见的抗血栓药的中代表药及结构

3. 氯吡格雷的化学名, 结构及特征, 理化性质, 临床应用

4. 华法林钠的化学名, 结构及特征, 理化性质, 代谢途径, 合成路线, 临床应用

第九节 其它心血管系统药物

1. 作用于 α 肾上腺素受体的药物

(1) α 受体拮抗剂的分类及代表药的结构和名称, 药理作用

2. 作用于血管平滑肌药物和作用于交感神经末梢药物

(1) 作用于血管平滑肌药物和作用于交感神经末梢药物的类型及代表药

(2) 利血平的化学名，结构及特征，理化性质，构效关系，临床应用

第五章 消化系统药物

【目的要求】

1. 掌握：西咪替丁、昂丹司琼、甲氧氯普胺、联苯双酯的结构、化学名称、理化性质、体内代谢及用途。

2. 熟悉：

(1) 抗溃疡药物、止吐药的结构类型和作用机制。

(2) 雷尼替丁、奥美拉唑、地芬尼多、多潘立酮的结构、化学名称及用途。

3. 了解：

(1) 硫乙拉嗪、西沙比利、水飞蓟素、熊去氧胆酸的结构特点及用途。

(2) 西咪替丁、昂丹司琼、熊去氧胆酸的合成路线。

(3) 促动力药的作用和肝胆病辅助治疗药物的现状。

【教学内容】

第一节 抗溃疡药

1. 消化性溃疡的发病机制；胃酸分泌过程与药物作用的机制；常见的抗溃疡药物

2. H₂受体拮抗剂

(1) 西咪替丁的化学名，理化性质，研发过程，生物利用度，合成路线，临床应用

(2) 盐酸雷尼替丁的化学名，理化性质，药理特点，生物利用度及代谢，合成路线；相继开发的替丁类药物以及经验性构效关系总结

3. 质子泵抑制剂

(1) 奥美拉唑的化学名，结构及特征，理化性质，作用机理，临床应用，合成路线；其他拉唑类药物的开发

第二节 止吐药

1. 呕吐的发病机理以及按作用机理止吐药的分类

2. 5-HT₃拮抗剂

(1) 昂丹司琼的化学名，结构及特征，理化性质，开发背景以及开发的多种司琼类药物，昂丹司琼的生物利用度，临床应用，合成路线等

3. 其它止吐药

(1) 盐酸地芬尼多的化学名, 结构及特征, 理化性质, 合成路线, 临床应用等

(2) 马来酸硫乙拉嗪的化学名, 结构及特征, 理化性质, 作用机理及临床应用

第三节 促动力药

1. 促动力药的主要用途

2. 西沙必利的化学名, 结构及特征, 理化性质, 药理机理以及发展状况

3. 甲氧氯普胺的化学名, 结构及特征, 理化性质, 作用机理, 合成路线

4. 多潘立酮的化学名, 结构及特征, 理化性质, 作用机理及药理作用

第四节 肝胆疾病辅助治疗药物

1. 肝病辅助治疗药物

(1) 联苯双酯

(2) 水飞蓟宾

2. 胆病辅助治疗药物

(1) 熊去氧胆酸的化学名, 结构及特征, 理化性质, 化学合成路线及途径

第六章 解热镇痛药和非甾体抗炎药

【目的要求】

1. 掌握: 阿斯匹林、对乙酰氨基酚、贝诺酯、氟苯柳、吲哚美辛、布洛芬的结构、化学名称、理化性质、体内代谢及用途

2. 熟悉:

(1) 解热镇痛药和结构类型和作用机制

(2) 羟布宗、甲芬那酸、萘普生、双氯芬酸钠的结构、化学及用途。

(3) 布洛芬类药物的构效关系及体内代谢; 双氯芬酸钠的体内代谢。

3. 了解:

(1) 非甾体抗炎药的发展。

(2) 对乙酰氨基酚、布洛芬、双氯芬酸钠的合成路线。

【教学内容】

第一节 解热镇痛药

1. 解热镇痛药的作用机制及结构类型

2. 水杨酸类解热镇痛药

(1) 阿司匹林的结构, 化学名, 理化性质, 合成路线, 体内代谢及临床应用

3. 苯胺类解热镇痛药

(1) 对乙酰氨基酚的结构，化学名，理化性质，合成路线，体内代谢及临床应用

第二节 非甾体抗炎药

1. 炎症的发病机理以及按化学结构非甾体抗炎药的分类

2. 吡唑酮类非甾体抗炎药

(1) 羟布宗的结构，化学名，理化性质，临床应用

3. 邻氨基苯甲酸类非甾体抗炎药

(1) 甲芬那酸的结构，化学名，理化性质，临床应用等

4. 吲哚乙酸类非甾体抗炎药

(1) 吲哚美辛的结构，化学名，理化性质，发现过程，体内代学，临床应用

5. 芳基烷酸类非甾体抗炎药

(1) 布洛芬的结构，化学名，理化性质，构效关系，体内代谢，合成路线，临床应用等

(2) 萘普生的结构，化学名，临床应用

(3) 双氯芬酸纳的结构，化学名，体内代谢，合成路线，临床应用

6. 其它非甾体抗炎药

(1) 吡罗昔康的结构，化学名，临床应用

(2) 塞利西布的结构，化学名，临床应用

第七章 抗肿瘤药

【目标要求】

1. 掌握：盐酸氮芥、环磷酰胺、氟尿嘧啶、巯嘌呤、顺铂的结构、化学名称、理化性质、体内代谢及用途。

2. 熟悉：

(1) 抗肿瘤药的结构类型和作用机制

(2) 氮甲、塞替派、卡莫司汀和阿糖胞苷的结构、化学名称及用途。

3. 了解：

(1) 白消安、甲氨蝶呤、放线菌素 D、博来霉素、盐酸多柔比星、阿霉素和米托蒽醌的结构特点和用途。

(2) 抗肿瘤的植物药有效成分及其衍生物的发展。

(3) 环磷酰胺和氟尿嘧啶的合成路线。

【教学内容】

第一节 生物烷化剂

1. 生物烷化剂的作用机制及结构类型
2. 氮芥类烷化剂
 - (1) 盐酸氮芥的结构, 化学名, 理化性质, 作用机制, 体内代谢, 临床应用
 - (2) 环磷酰胺的结构, 化学名, 理化性质, 体内代谢, 合成路线, 临床应用
3. 乙撑亚胺类烷化剂
 - (1) 塞替派的, 化学名, 理化性质, 临床应用
4. 亚硝基脲类烷化剂
 - (1) 卡莫司汀的结构, 化学名, 理化性质, 临床应用
5. 磺酸酯及多元醇类烷化剂
 - (1) 白消安的结构, 化学名, 理化性质, 临床应用
6. 抗肿瘤金属化合物
 - (1) 顺铂的结构, 化学名, 理化性质, 体内代谢, 构效关系, 临床应用及新型铂配合物的研发

第二节 抗代谢药物

1. 抗代谢药物的作用机制及结构类型
2. 嘧啶拮抗物
 - (1) 氟尿嘧啶的结构, 化学名, 理化性质, 作用机制, 合成路线, 临床应用及其他半合成药物
 - (2) 盐酸阿糖胞苷的结构, 化学名, 理化性质, 临床应用
3. 嘌呤拮抗物
 - (1) 巯嘌呤的结构, 化学名, 理化性质, 作用机制, 临床应用
4. 叶酸拮抗物
 - (1) 甲氨蝶呤的结构, 化学名, 理化性质, 作用机制, 临床应用

第三节 抗肿瘤抗生素

1. 抗肿瘤抗生素的作用机制及结构分类
2. 多肽类抗生素
 - (1) 放线菌素 D 的结构特点及用途
 - (2) 盐酸平阳霉素的结构特点及用途
3. 蒽醌类抗生素
 - (1) 盐酸多柔比星的结构特点, 设计思想及用途

(2) 盐酸米托蒽醌的结构特点及用途

第四节 抗肿瘤的植物药有效成分及其衍生物

1. 羟喜树碱的结构特点，临床应用及其衍生物的发展
2. 盐酸长春碱的结构特点，临床应用及其衍生物的发展
3. 紫杉醇的结构特点，临床应用及其衍生物的发展

第八章 抗生素

【目的要求】

1. 掌握：青霉素钠（钾）、氨苄西林、头孢氨苄、四环素和氯霉素的化学名称、理化性质、体内代谢及用途。
2. 熟悉：
 - (1) β -内酰胺类、四环素类、氨基糖甙类、大环内酯类和氯霉素类抗生素的发展和作用机制。
 - (2) 克拉维酸、氨曲南、强力霉素、甲烯土霉素、红霉素的结构、化学名称及用途。
 - (3) β -内酰胺类抗生素的构效关系
3. 了解：
 - (1) 阿莫西林、头孢羟氨苄、舒巴坦、沙纳霉素、麦迪霉素、螺旋霉素和甲砒霉素的化学名称及用途。
 - (2) 半合成 β -内酰胺类抗生素、氯霉素的合成路线。

【教学内容】

第一节 β -内酰胺类抗生素

1. β -内酰胺类抗生素的结构特点及分类
2. 青霉素类
 - (1) 青霉素钠的结构，化学名，理化性质，作用机制；天然青霉素的分类及其缺点
 - (2) 苯唑西林钠的结构特点，化学名，理化性质，优点，临床应用
 - (3) 阿莫西林的结构特点，化学名，理化性质，优点，临床应用；
 - (4) 青霉素类抗生素的构效关系及半合成青霉素的方法
3. 头孢菌素类
 - (1) 头孢菌素 C 的结构特点，半合成头孢菌素的方法
 - (2) 头孢氨苄的结构，化学名，理化性质，优点，临床应用及四代头孢菌素的划分
 - (3) 头孢噻肟的结构特点，化学名，理化性质，优点，临床应用；头孢菌素类的构效关系

4. 非经典的 β -内酰胺抗生素及 β -内酰胺酶抑制剂

(1) 克拉维酸钾的结构特点, 化学名, 用途

(2) 氨曲南的结构特点, 化学名, 用途

第二节 四环素类抗生素

1. 四环素类抗生素的来源及结构特点

2. 四环素的结构特点, 化学名, 理化性质, 临床应用

第三节 氨基糖苷类抗生素

1. 氨基糖苷类抗生素的结构特点

2. 氨基糖苷类抗生素的发展及临床应用

第四节 大环内酯类抗生素

1. 大环内酯类抗生素的结构特点及作用机制

2. 红霉素结构特点, 理化性质, 临床应用

3. 泰利霉素结构特点, 临床应用

第五节 氯霉素类抗生素

1. 氯霉素的结构, 化学名, 理化性质, 体内代谢, 临床应用, 合成路线

第九章 化学治疗药

【目的要求】

1. 掌握: 诺氟沙星、磺胺嘧啶、异烟肼、阿昔洛韦、磷酸氯喹和阿苯达唑的结构、化学名称、理化性质、体内代谢及用途。

2. 熟悉: 吡哌酸、盐酸环丙沙星、磺胺甲恶唑、甲氧苄啶、盐酸乙胺丁醇、硝酸益康唑、奎宁的结构、化学名称及用途。

3. 了解:

(1) 喹诺酮类抗菌药、抗结核药物、磺胺类药物、抗真菌药物和抗病毒药物的发展和作用机制。

(2) 利福平、两性霉素 B、氟康唑、利巴韦林、盐酸金刚烷胺、吡嗪酮和青蒿素的结构特点和用途。

(3) 诺氟沙星、磺胺嘧啶和阿苯达唑的合成路线。

(4) 喹诺酮类、磺胺类药物药物的构效关系。

【教学内容】

第一节 喹诺酮类抗菌药

1. 喹诺酮类抗菌药的发展及结构分类

2. 吡哌酸的结构，化学名，作用机制，临床应用
3. 诺氟沙星的结构，化学名，构效关系，临床应用，合成路线
4. 盐酸环丙沙星的结构，化学名，临床应用

第二节 抗结核药物

1. 抗结核药物的结构分类
2. 异烟肼的结构特点，化学名，理化性质，发展过程，体内代谢，临床应用
3. 利福平的结构特点，结构改造，临床应用

第三节 磺胺类药物及抗菌增效剂

1. 磺胺嘧啶的结构特点，化学名，理化性质，作用机制，发展过程，合成路线，临床应用，构效关系
2. 甲氧苄啶结构，化学名，用途

第四节 抗真菌药物

1. 抗真菌抗生素的结构分类
 - (1) 两性霉素 B 结构特点，理化性质，临床应用
2. 唑类抗真菌药物
 - (1) 硝酸益康唑的结构特点，理化性质，临床应用
 - (2) 氟康唑的结构特点，理化性质，临床应用
3. 其他抗真菌药物

第五节 抗病毒药物

1. 病毒的发病机制及抗病毒药物的结构分类
 - (1) 两性霉素 B 结构特点，理化性质，临床应用
2. 三环胺类抗病毒药物
 - (1) 盐酸金刚烷胺的结构特点，作用机制，临床应用
3. 核苷类抗病毒药物
 - (1) 利巴韦林的结构特点，作用机制，临床应用
 - (2) 齐多定夫的结构特点，作用机制，临床应用
 - (2) 阿昔洛韦的结构特点，作用机制，体内代谢，临床应用

第六节 抗寄生虫药

1. 驱肠虫药的作用机制及结构分类
 - (1) 阿苯达唑的结构，化学名，理化性质，临床应用，合成路线

2. 抗血吸虫病药

(1) 吡喹酮的结构特点，临床应用

3. 抗疟药

(1) 硫酸奎宁的结构，化学名，临床应用

(2) 磷酸氯喹的结构，化学名，理化性质，作用机制，临床应用

(3) 青蒿素的结构特点，临床应用

第十章降血糖药物及利尿药

【目的要求】

1. 掌握：甲苯磺丁脲、格列本脲、盐酸二甲双胍、氢氯噻嗪的结构、名称与用途。
2. 熟悉：口服降糖药的类型及代表药各举一例；按利尿药的效能可分为几类，说出作用机制及代表药（一个）
3. 了解：甲苯磺丁脲、氢氯噻嗪、螺内酯的合成路线。

【教学内容】

第一节 降血糖药

1. 糖尿病的发病机制及口服降血糖药的结构分类
2. 磺酰脲类降血糖药
 - (1) 甲苯磺丁脲的结构，化学名，理化性质，合成路线，临床应用
 - (2) 格列本脲的结构，化学名，理化性质，体内代谢，临床应用
3. 双胍类降血糖药
 - (1) 盐酸二甲双胍的结构，化学名，临床应用

第二节 利尿药

1. 利尿药的效能分类及作用机制
2. 呋塞米的结构，化学名，理化性质，发现历程，临床应用
3. 氢氯噻嗪的结构，化学名，理化性质，合成路线，临床应用
4. 乙酰唑胺的结构，化学名，理化性质，作用机制，合成路线，临床应用
5. 螺内酯的结构，化学名，理化性质，合成路线，临床应用
6. 氨苯喋啶的结构特点，临床应用

第十一章 激素

【目的要求】

1. 掌握：

- (1) 甾体药物分类及结构特征。
- (2) 雌二醇、丙酸睾酮、黄体酮和氢化可的松的结构、名称、理化性质、体内代谢及用途。

2. 熟悉：

- (1) 枸橼酸他莫昔芬、米非司酮、炔诺酮和醋酸地塞米松的结构、化学名称及用途。

3. 了解：

- (1) 米索前列醇、胰岛素、降钙素、己烯雌酚和左炔诺孕酮的结构特点及用途。
- (2) 雌二醇、丙酸睾酮的合成路线。
- (3) 抗雌激素、抗孕激素的构效关系。
- (4) 各种激素药物的作用机制。
- (5) 各类甾体药物的发展。

【教学内容】

第一节 前列腺素

1. 激素简介

- (1) 激素药物及用途
- (2) 激素药物的分类

2. 前列腺素基本化学结构及命名

- (1) 前列腺素的发现和发展
- (2) 前列腺素的生物合成

3. 米索前列醇的结构特点，与 PGE 的结构关系及代谢途径。

第二节 肽类激素

1. 多肽激素简介

2. 胰岛素的结构特点和用途
3. 降钙素的结构特点和用途

第三节 甾体激素

1. 甾体雌激素

- (1) 甾体药物分类及结构特征
- (2) 甾体激素简介，结构特点及命名，发展及化学合成
- (3) 雌激素结构特点
- (4) 天然雌激素的合成和代谢

- (5) 天然雌激素的结构改造
- 2. 甾体雌激素及抗雌激素
 - (1) 雌激素结构活性
 - (2) 己烯雌酚结构特点
 - (3) 抗雌激素的发现
 - (4) 抗雌激素他莫昔芬, 氯米芬, 雷洛昔芬的结构特点, 作用靶点, 用途
- 3. 雄激素和蛋白同化激素
 - (1) 雄性活性与蛋白同化活性
 - (2) 丙酸睾酮的结构, 化学名, 理化性质, 体内代谢及用途
- 4. 孕激素
 - (1) 醋酸甲羟孕酮的结构特点, 用途
- 5. 甾体避孕药
 - (1) 睾酮衍生物左炔诺孕酮的结构特点, 用途, 合成
- 6. 抗孕激素
 - (1) 米非司酮结构特点及基团的作用、结构靶点
 - (2) 与雌激素拮抗剂的结构关系
 - (3) 构效关系及合成
 - (4) 临床应用
- 7. 肾上皮质激素
 - (1) 结构特点
 - (2) 糖皮质激素临床主要用途
 - (3) 氢化可的松和地塞米松的结构改造
 - (4) 构效关系

第十二章 维生素

【目的要求】

1. 掌握: 维生素 A 醋酸酯、维生素 D₃、维生素 E 醋酸酯和维生素 C 的结构、名称、体内代谢及用途。
2. 熟悉: 维生素的分类和作用机制。
3. 了解: 维生素 D₃ 和维生素 C 的合成路线。

【教学内容】

第一节 脂溶性维生素

1. 维生素的分类和作用机制
2. 维生素 A 醋酸酯、维生素 D₃、维生素 E 醋酸酯的结构、名称、体内代谢及用途
3. 维生素 D₃的合成路线

第二节 水溶性维生素

1. 维生素 C 的结构、名称、体内代谢、合成路线及用途

第十三章 新药设计与开发

【目的要求】

1. 掌握：
 - (1) 产生药效的决定因素，溶解度，分配系数，电离度等理化性质对药效的影响。
 - (2) 前药的基本概念
2. 熟悉：
 - (1) 熟悉有机药物的化学结构与药效关系
 - (2) 制备前药的作用
3. 了解：
 - (1) 新药发现的四个途径，本书重点介绍的药物的由来和新药设计的基本思想。
 - (2) 药物的定量构效关系
 - (3) 前药设计的一般方法
 - (4) 计算机辅助设计的现况

【教学内容】

第一节 药物作用的生物学基础

1. 药物的结构分类和与受体的关系
2. 药物作用的生物靶点——受体、酶、离子通道、核酸
3. 药物作用的体内过程
4. 理化性质对药效的影响——溶解度、解离度
5. 药物立体结构对药效的影响——几何异构、光学异构及光学活性对药代过程的影响
6. 药物-受体作用的化学本质

第二节 新药开发的基本途径与方法

1. 新药的定义和药物设计的两个阶段
2. 先导化合物的发现
 - (1) 从天然资源
 - (2) 从现有的药物 ——利用副作用，研究药物代谢，me-too 药物
 - (3) 用活性内源性物质
 - (4) 组合化学与高通量筛选
3. 先导化合物的优化方法
 - (1) 采用生物电子等排体
 - (2) 前药设计
 - (3) 软药设计
 - (4) 定量构效关系的研究

第二节 计算机辅助药物设计简介

1. 计算机辅助药物设计的发展
2. 计算机辅助分子造型的优点
3. 计算机辅助药物设计的内容
4. 直接和间接的计算机辅助药物设计
5. 实例与现状

第十四章 药物代谢反应

【目的要求】

1. 掌握：
 - (1) 药物代谢酶的种类
 - (2) I 相转化、II 相转化的概念
2. 熟悉：
 - (1) 药物代谢酶的作用
 - (2) I 相、II 相转化的类型及作用
3. 了解：
 - (1) 药物代谢在药物研究中的作用

【教学内容】

第一节 概述

第二节 药物代谢的酶

1. 细胞色素 P450 酶系
2. 还原酶系
3. 过氧化酶和单加氧酶
4. 水解酶

第三节 第 I 相的生物转化

1. 氧化反应
2. 还原反应
3. 脱卤素反应
4. 水解反应

第四节 第 II 相的生物转化

1. 葡萄糖醛酸的结合
2. 硫酸酯化结合
3. 氨基酸的结合
4. 谷胱甘肽结合
5. 乙酰化结合
6. 甲基化结合

第五节 药物代谢在药物研究中的作用

1. 设计和发现新药
2. 优化药物的药动学性质
3. 解释药物的作用机制

三、实验内容和要求

1. 实验课的基本要求

药物化学实验是药专业学生的必修课，在培养计划中占很重要的地位。它旨在培养学生分析问题和解决问题的能力，是增强学生动手能力的重要手段。通过对药物化学实验课的学习，训练学生进行药物合成实验的基本技能，巩固有机化学的基础知识；验证课中所学的理论，加深对药物合成、药物化学理论、化合物性质及反应性能的理解；培养学生正确选择药物中间体，使学生能正确理解合成工艺过程的要点，进一步熟练合成实验的基本操作；培养学生理论联系实际的工作作风，实事求是、严格认真的科学态度和良好的工作习惯。

为适应药物化学学科的发展，紧密配合药物化学的理论课教学，将药物化学实验课开设药物合成单元反应，利用有机原料和合成的中间体，通过有机和药物合成的方法制备化学药物的原料药。

2. 实验项目

次 数	内 容	学时数
1	氯代叔丁烷的制备	6
2	Fridel-Crafts 反应制备对叔丁基苯酚	6
3	乙酰水杨酸的制备	6
4	1, 2-二苯乙二酮的制备	6
5	苯妥英及苯妥英钠的制备	6

四、学时分配

内容	总学时数	理论	实验
绪论	2	2	
中枢神经系统药物	13	7	6
外周神经系统药物	13	7	6
循环系统药物	6	6	
消化系统药物	4	4	
解热镇痛药和非甾体抗炎药	9	3	6
抗肿瘤药	6	6	
抗生素	8	8	
化学治疗药	8	8	
降血糖药物及利尿药	2	2	
激素类药物	3	3	
维生素	2	2	
新药设计与开发	13	1	12
药物代谢反应	1	1	
合计	90	60	30

五、参考文选

1. 参考书目：《药物化学》 仇文升主编 北京：高等教育出版社，1999.9