

高纲 4414

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（2026 年）

I 课程性质与课程目标

一、课程性质和特点

《药物化学(本)》是江苏省高等教育自学考试药学(专升本)专业中的一门必修课程,以培养考生药学相关基础知识和基本理论为主要目的。

《药物化学(本)》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机制的一门学科。本学科建立在化学学科基础上,涉及生物学、医学、药学及计算机科学等各个学科的内容,研究潜在药物作用靶标、药物的化学结构、制备原理、理化性质、体内代谢和构效关系等,进而发现、发明和开发药物,并从分子水平上研究药物在体内的作用方式和作用机理。本课程是药学类与制药工程类各专业的重要专业课。

通过本课程的学习,考生可以全面而系统地掌握药物化学的基础知识、基本理论和基本方法,为日后适应企业的药品应用、生产、研究和开发工作打下坚实的基础,力争成为具有创新意识和创业能力的应用型科技人才。

二、课程目标

《药物化学(本)》课程设置的目的是使考生能够:

- 1.掌握代表药物的体内代谢、作用机制、临床应用及构效关系等。
- 2.熟悉代表药物的结构、命名及理化性质。
- 3.了解药物的开发、生产现状及最新进展。
- 4.培养和提高考生发现问题、提出问题、分析问题和解决问题的能力,为培养医药行业的高素质技能技术型人才奠定基础。

三、课程的重点和难点

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。各章的重点和难点在后文的“III 课程内容与考核要求”中有详细的介绍,请社会助学单位及自考生准确把握。

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

绪 论

一、课程内容

本章介绍药物化学的研究内容、主要任务、研究方法与发展历程，我国药物化学的发展历史，以及新药研究与开发的过程和方法。

二、考核知识点和考核要求

识记：①药物化学的研究和发展。

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；②药品的名称管理。

三、本章重点和难点

本章重点和难点：①药物化学的研究内容及任务；②新药研究与开发的过程和方法；③药品名称管理。

第一章 药物靶标与药物-靶标相互作用

一、课程内容

本章主要介绍蛋白质的结构与功能、药物靶标及作用于靶标的药物、药物与靶标的键合作用。

二、考核知识点和考核要求

识记：①受体的主要类型；②核酸与作用于核酸的药物；③药物与靶标的常见键合类型。

领会：①药物的各类靶标（受体、酶、结构蛋白等）；②药物的结构变化与产生药效的关系；③酶促反应与酶的催化作用；④药物与受体的作用方式；⑤药

物与靶标间产生相互作用的原理。

应用：①作用于靶标的药物与其所产生的药效。

三、本章重点和难点

本章重点和难点：①药物与靶标的键合作用；②药物的结构变化与产生药效的关系；③药物与受体的作用方式；④作用于靶标的药物与其所产生的药效。

第二章 药物结构与生物活性

一、课程内容

本章主要介绍药物理化性质与药物结构对药物活性的影响。

二、考核知识点和考核要求

识记：①药物发现的核心任务；②药物结构中的母核和结构片段对药物的吸收和药效的影响。

领会：①影响药物药效学性质的因素；②药物的亲脂性对药物活性的影响；③药物分子的酸碱性质对其药代动力学的影响；④手性药物对映异构体在体内发挥药效的常见分类及代表药物。

应用：①Lipinski 规则；②药物的 pK_a 与药物药效间的关系；③药物的各类官能团对药效的影响；④药物的构型、构象对药效的影响。

三、本章重点和难点

本章重点和难点：①药物理化性质对药物活性的影响；②Lipinski 规则；③药物结构对药物活性的影响。

第三章 药物结构与药物代谢

一、课程内容

本章主要介绍药物代谢涉及的两大反应类型：I 相生物转化反应与 II 相生物转化反应，并探讨药物代谢研究在新药研发中的应用。

二、考核知识点和考核要求

识记：①I 相生物转化（官能团化反应）的定义；②II 相生物转化（结合反应）的定义。

领会：①发生 I 相生物转化反应的代表药物、主要代谢途径及产物；②发生 II 相生物转化反应的代表药物及主要产物；③通过药物代谢研究进行新药开发的策略。

应用：①I 相生物转化反应类型；②II 相生物转化反应类型；③典型药物的设计原理。

三、本章重点和难点

本章重点和难点：①药物发生的主要官能团化反应；②药物发生的主要结合反应类型；③药物代谢研究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

本章主要介绍药物分子的微观结构与宏观性质，苗头化合物、先导化合物与候选药物的定义、发现和结构改造的方法与途径，药物分子优化的目的与常用方法，以及计算机辅助药物设计的基础知识。

二、考核知识点和考核要求

识记：①药物的宏观性质；②苗头化合物的定义和来源；③候选药物的选定原则。

领会：①药物的微观结构与药效的关系；②先导化合物的定义和来源；③苗头化合物和先导化合物进行结构改造、构效关系研究的常用方法。

应用：①药物分子修饰和优化的目的；②药物分子修饰和优化的常用方法。

三、本章重点和难点

本章重点和难点：①药物分子的微观结构与宏观性质；②药效团的定义、特征；③苗头化合物和先导化合物的定义和来源；④候选药物的选定原则；⑤药物分子的修饰和优化的目的和方法。

第五章 镇静催眠药和抗癫痫药

一、课程内容

本章介绍镇静催眠药和抗癫痫药的结构分类；介绍代表药物（地西洋、艾司唑仑、咪达唑仑、佐匹克隆、酒石酸唑吡坦、雷美替安、苯巴比妥、异戊巴比妥、苯妥英钠、卡马西平、普瑞巴林、丙戊酸钠和拉莫三嗪）的结构、理化性质、作用机制和临床应用；介绍奥沙西洋、硝西洋的结构和临床应用；重点介绍地西洋的合成，以及苯二氮草类药物、巴比妥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苯二氮草类药物的结构改造；②褪黑素受体激动剂的作用机制和合

理药物设计方法；③苯巴比妥双内酰亚胺结构与药物稳定性、使用方法的关系。

领会：①镇静催眠药的分类及作用机制；②抗癫痫药的分类及作用机制；③奥沙西洋、硝西洋、咪达唑仑、异戊巴比妥、丙戊酸钠和拉莫三嗪的结构和临床应用。

应用：①苯二氮草类药物的构效关系；②巴比妥类药物的构效关系；③地西洋、艾司唑仑、佐匹克隆、酒石酸唑吡坦、雷美替安、苯巴比妥、苯妥英钠、卡马西平和普瑞巴林的结构、理化性质、体内代谢和临床应用。

三、本章重点和难点

本章重点和难点：①镇静催眠药的分类、代表药物及作用机制；②抗癫痫药的分类、代表药物及作用机制；③1,4-苯二氮草类药物的构效关系；④非苯二氮草类 GABA 受体激动剂的作用机理及代表药物；⑤巴比妥类药物的构效关系等；⑥地西洋的合成。

第六章 精神神经疾病治疗药

一、课程内容

本章重点介绍抗精神病药、抗抑郁药、抗焦虑药及抗躁狂药的结构分类；介绍各类代表药物（盐酸氯丙嗪、奋乃静、癸氟奋乃静、氯普噻吨、氟哌啶醇、舒必利、氨磺必利、氯氮平、奥氮平、盐酸阿米替林、帕罗西汀、草酸艾司西酞普兰、米氮平、盐酸文拉法辛、丁螺酮、碳酸锂）的结构、理化性质与临床应用；介绍抗精神病药和抗抑郁药的作用机制，以及盐酸氯丙嗪的合成方法。

二、考核知识点和考核要求

识记：①抗精神病药物的发展历程；②抗抑郁药物的发展历程；③非经典抗精神病药物的“多靶标药物设计”；④吩噻嗪类药物与受体的结合模式。

领会：①癸氟奋乃静、奥氮平、盐酸文拉法辛、米氮平、丁螺酮、碳酸锂的结构和临床应用；②抗精神病药物的分类及作用机制；③抗抑郁药物的分类及作用机制；④盐酸氯丙嗪的光毒化过敏反应。

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、草酸艾司西酞普兰的结构、理化性质和临床应用；②吩噻嗪类药物的构效关系。

三、本章重点和难点

本章重点和难点：①经典抗精神病药物的作用机制；②抗精神病药物的分类、结构和性质；③吩噻嗪类药物的结构改造和构效关系；④吩噻嗪类药物与受体的作用方式；⑤氯丙嗪的体内代谢过程；⑥氯丙嗪的结构稳定性；⑦抗抑郁药的分类、结构和性质；⑧盐酸氯丙嗪的合成方法。

第七章 神经退行性疾病治疗药物

一、课程内容

本章主要介绍抗帕金森病药物和抗阿尔茨海默病药物的结构分类，介绍代表药物（盐酸罗匹尼罗、盐酸普拉克索、左旋多巴、盐酸多奈哌齐、重酒石酸利斯的明、盐酸美金刚）的结构、理化性质、体内代谢和临床应用，以及盐酸罗匹尼罗、盐酸普拉克索和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抗帕金森病药物的分类和作用机制；②抗阿尔茨海默病药物的分类和作用机制。

领会：①盐酸罗匹尼罗、盐酸普拉克索、左旋多巴、盐酸多奈哌齐、重酒石酸利斯的明和盐酸美金刚的结构、理化性质、体内代谢和临床应用。

三、本章重点和难点

本章重点和难点：①抗帕金森病药物的结构类型、药理作用特点、作用机制及代表药物；②抗阿尔茨海默病药物的结构类型、药理作用特点、作用机制及代表药物；③盐酸罗匹尼罗、盐酸普拉克索和盐酸多奈哌齐的合成方法。

第八章 镇痛药

一、课程内容

本章主要介绍常用镇痛药的结构分类、吗啡的结构特点及结构改造；介绍代表药物（盐酸吗啡、喷他佐辛、盐酸哌替啶、枸橼酸芬太尼、盐酸美沙酮）的化学结构、理化性质、体内代谢及临床应用；介绍可待因、海洛因、纳洛酮、曲马多的化学结构和临床应用；介绍阿片受体、阿片样物质的相关内容，以及盐酸哌替啶的合成方法。

二、考核知识点和考核要求

识记：①吗啡的结构改造；②阿片受体的分类。

领会：①吗啡的结构特点；②可待因、海洛因、纳洛酮、曲马多的化学结构

和临床用途。

应用：①合成镇痛药的结构分类；②盐酸吗啡、喷他佐辛、盐酸哌替啶、枸橼酸芬太尼、盐酸美沙酮的化学结构、理化性质、体内代谢及临床应用。

三、本章重点和难点

本章重点和难点：①吗啡的结构特点、作用机制、临床应用；②吗啡的结构改造及衍生物的特点；③合成镇痛药的分类、结构类型及代表药物；④盐酸哌替啶的合成方法。

第九章 非甾体抗炎药

一、课程内容

本章主要介绍解热镇痛药和非甾体抗炎药的结构类型和作用机理；介绍代表药物（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、塞来昔布、艾瑞昔布、别嘌醇和非布司他）的化学结构、理化性质、体内代谢及临床应用；介绍贝诺酯、舒林酸、萘丁美酮、丙磺舒的化学结构和临床应用；介绍花生四烯酸的主要代谢途径，以及双氯芬酸钠、布洛芬的合成方法。

二、考核知识点和考核要求

识记：①花生四烯酸代谢途径和炎症介质；②苯胺类解热镇痛药代谢化学与毒性的关系。

领会：①贝诺酯、舒林酸、萘丁美酮、丙磺舒的化学结构和临床应用；②花生四烯酸的主要代谢途径；③芳基丙酸类和1,2-苯并噻嗪类药物的构效关系。

应用：①解热镇痛药和非甾体抗炎药的结构类型和作用机理；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、塞来昔布、艾瑞昔布、别嘌醇和非布司他的化学结构、理化性质、体内代谢及临床应用。

三、本章重点和难点

本章重点和难点：①非甾体抗炎药的作用靶标；②解热镇痛药的结构类型、作用机制、代表药物的性质和代谢；③非甾体抗炎药的结构类型和作用机制；④非甾体抗炎药代表药物的构效关系、性质和体内代谢；⑤痛风治疗药的代表药物；⑥芳基丙酸类和1,2-苯并噻嗪类药物的构效关系；⑦双氯芬酸钠、布洛芬的合成方法。

第十章 拟胆碱药和抗胆碱药

一、课程内容

本章主要介绍拟胆碱药和抗胆碱药的结构类型和作用机理；介绍代表药物（硝酸毛果芸香碱、溴新斯的明、硫酸阿托品、盐酸苯海索、溴丙胺太林、右旋氯筒箭毒碱、苯磺阿曲库铵）的化学结构、理化性质、体内代谢及临床应用；介绍合成 M 受体拮抗剂的构效关系；介绍氢溴酸东莨菪碱、氢溴酸山莨菪碱、樟柳碱、氯琥珀胆碱的化学结构和临床应用，以及盐酸苯海索的合成方法。

二、考核知识点和考核要求

识记：①乙酰胆碱的生物合成及其生理作用特点；②乙酰胆碱受体的分类。

领会：①拟胆碱药和抗胆碱药的结构类型和作用机理；②氢溴酸东莨菪碱、氢溴酸山莨菪碱、樟柳碱、氯琥珀胆碱的化学结构和临床应用；③氯琥珀胆碱为代表的软药的设计思路。

应用：①硝酸毛果芸香碱、溴新斯的明、硫酸阿托品、盐酸苯海索、溴丙胺太林、右旋氯筒箭毒碱、苯磺阿曲库铵的化学结构、理化性质、体内代谢及临床应用；②合成 M 受体拮抗剂的构效关系。

三、本章重点和难点

本章重点和难点：①拟胆碱药和抗胆碱药的结构类型和作用机理；②合成 M 受体拮抗剂的构效关系；③拟胆碱药和抗胆碱药代表药物的化学结构、理化性质、体内代谢及临床应用；④盐酸苯海索的合成方法；⑤软药的设计思路。

第十一章 抗变态反应药物

一、课程内容

本章主要介绍变态反应的发生机制；介绍组胺受体的分类、组胺的结构和生理作用；介绍组胺 H₁ 受体拮抗剂的结构类型和构效关系；介绍代表药物（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）的化学结构、理化性质、体内代谢及临床应用；介绍盐酸苯海拉明、阿伐斯汀、阿司咪唑和孟鲁司特钠的化学结构和临床用途；介绍马来酸氯苯那敏和盐酸西替利嗪的合成方法。

二、考核知识点和考核要求

识记：①变态反应的发生机制；②组胺受体的分类；③组胺的结构和生理作

用。

领会：①盐酸苯海拉明、阿伐斯汀、阿司咪唑和孟鲁司特钠的化学结构和临床用途。

应用：①马来酸氯苯那敏、盐酸赛庚啶、盐酸西替利嗪、氯雷他定、盐酸非索非那定的化学结构、理化性质、体内代谢及临床应用；②H₁受体拮抗剂的结构类型和构效关系。

三、本章重点和难点

本章重点和难点：①组胺 H₁ 受体拮抗剂的结构类型及代表药物；②H₁受体拮抗剂的构效关系；③马来酸氯苯那敏和盐酸西替利嗪的合成方法。

第十二章 消化系统药物

一、课程内容

本章主要介绍胃壁细胞的泌酸过程及抗溃疡药物的作用机理；介绍 H₂受体拮抗剂的结构类型、结构改造历程和构效关系；介绍质子泵抑制剂的研发历程和构效关系；介绍代表药物（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）的化学结构、理化性质、体内代谢和临床用途；介绍法莫替丁、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，以及盐酸雷尼替丁的合成方法。

二、考核知识点和考核要求

识记：①H₂受体拮抗剂的结构改造历程及对新药研发的指导意义；②质子泵抑制剂的研发历程和构效关系；③奥美拉唑的体内循环和光学结构特征；④胃肠促动药和镇吐药的作用机制。

领会：①抗溃疡药物的分类；②组胺 H₂受体拮抗剂的构效关系；③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。

应用：①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化学结构、理化性质、体内代谢和临床用途。

三、本章重点和难点

本章重点和难点：①抗溃疡药物的分类；②组胺 H₂受体拮抗剂的结构分类和构效关系；③组胺 H₂受体拮抗剂代表药物的理化性质、体内代谢及作用机制；

④质子泵抑制剂代表药物及作用机制；⑤盐酸雷尼替丁的合成。

第十三章 降血糖药和骨质疏松治疗药

一、课程内容

本章主要介绍降血糖药和骨质疏松治疗药物的发展、作用机制及结构分类；介绍代表药物（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、帕立骨化醇和阿仑膦酸钠）的结构、理化性质和临床用途；介绍胰岛素、格列齐特、格列美脲、达格列净、骨化三醇、降钙素和利塞膦酸钠的化学结构和临床用途，以及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降血糖药和骨质疏松治疗药物的发展和作用机制。

领会：①降血糖药和骨质疏松治疗药物的结构分类；②胰岛素、格列齐特、格列美脲、达格列净、骨化三醇、降钙素和利塞膦酸钠的化学结构和临床用途。

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、帕立骨化醇和阿仑膦酸钠的结构、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降血糖代表药物的分类、体内代谢、作用机制及临床应用；②骨质疏松治疗药物的分类和代表药物；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

本章主要介绍肾上腺素受体的分类、分布及激动后产生的生理效应；介绍儿茶酚胺的生物合成及代谢途径；介绍拟肾上腺素药和抗肾上腺素药的分类和肾上腺素受体激动剂的构效关系；介绍 β 受体阻断剂的构效关系；介绍代表药物（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）的化学结构、理化性质、体内代谢及临床用途；介绍去甲肾上腺素、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、酚妥拉明、盐酸酚苄明、美托洛尔和艾司洛尔的结构和临床用途；介绍盐酸多巴酚丁胺、硫酸沙丁胺醇和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、分布及激动后产生的生理效应；②儿茶酚胺

的生物合成及代谢途径；③拟肾上腺素药和抗肾上腺素药的分类。

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、酚妥拉明、盐酸酚苄明、美托洛尔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化学结构、理化性质、体内代谢及临床用途；②肾上腺素受体激动剂的构效关系；③ β 受体阻断剂的构效关系。

三、本章重点和难点

本章重点和难点：①拟肾上腺素药和抗肾上腺素药的分类；②肾上腺素受体激动剂的构效关系；③ β 受体阻断剂的构效关系；④盐酸多巴酚丁胺、硫酸沙丁胺醇和盐酸普萘洛尔的合成。

第十五章 抗高血压药和利尿药

一、课程内容

本章主要介绍各种抗高血压药物的作用靶点和抗高血压药物的分类；介绍代表药物（卡托普利、马来酸依那普利、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；介绍利血平、依那普利拉、赖诺普利、福辛普利、缬沙坦、尼群地平、尼莫地平、桂利嗪、螺内酯的结构及临床用途；介绍ACE抑制剂的构效关系和1,4-二氢吡啶类钙通道阻滞剂的构效关系，以及卡托普利的合成方法。

二、考核知识点和考核要求

识记：①抗高血压药物的作用靶点；②抗高血压药物的研究进展；③利尿药的分类及作用机制。

领会：①利血平、依那普利拉、赖诺普利、福辛普利、缬沙坦、尼群地平、尼莫地平、桂利嗪、螺内酯的结构及临床用途；②ACE抑制剂的构效关系。

应用：①卡托普利、马来酸依那普利、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；②1,4-二氢吡啶类钙通道阻滞剂的构效关系。

三、本章重点和难点

本章重点和难点：①抗高血压药物的作用靶点、分类、代表药物及作用机制；②利尿药的分类、代表药物及其作用机制；③ACE 抑制剂的构效关系；④1, 4-二氢吡啶类钙通道阻滞剂的构效关系；⑤卡托普利的合成。

第十六章 心脏疾病药物和血脂调节药

一、课程内容

本章主要介绍心脏疾病相关药物的分类及作用机制；介绍高血脂的产生原因及血脂调节药的发现、发展；介绍代表药物（奎尼丁、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；介绍地高辛、扎莫特罗、氨力农、普罗帕酮、氯贝丁酯、非诺贝特、利多卡因、美西律和普鲁卡因胺的结构和临床用途，以及吉非罗齐的合成方法。

二、考核知识点和考核要求

识记：①抗心力衰竭药的分类及作用特点；②抗心律失常药的分类及各类药物的作用机制；③抗心绞痛药的分类；④血脂的化学和生物化学基础。

领会：①地高辛、扎莫特罗、氨力农、普罗帕酮、氯贝丁酯、非诺贝特、利多卡因、美西律和普鲁卡因胺的结构和临床用途。

应用：①奎尼丁、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。

三、本章重点和难点

本章重点和难点：①抗心律失常药的分类、代表药物及作用机制；②抗心绞痛药的分类及作用特点；③苯氧乙酸酯类降血脂药物的构效关系；④吉非罗齐的合成。

第十七章 甾体激素类药物

一、课程内容

本章主要介绍甾体激素的生物合成和甾体激素类药物的结构特征、分类、作用机制，以及结构改造方法；介绍非甾体雌激素立体结构与药理活性的关系；介绍代表药物（雌二醇、己烯雌酚、枸橼酸氯米芬、福美坦、丙酸睾酮、苯丙酸诺龙、醋酸甲地孕酮、炔诺酮、左炔诺孕酮、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、雷洛昔芬、氟维司群、非那雄胺、氟他胺、

黄体酮、阿帕他胺、米索前列醇、可的松、氢化可的松、醛固酮、氟轻松的结构和临床用途；介绍肾上腺皮质激素的构效关系和己烯雌酚的合成方法。

二、考核知识点和考核要求

识记：①甾体激素类药物的结构特征、分类和作用机制。

领会：①各类甾体激素类药物的结构改造方法；②炔雌醇、雷洛昔芬、氟维司群、非那雄胺、氟他胺、黄体酮、阿帕他胺、米索前列醇、可的松、氢化可的松、醛固酮、氟轻松的结构和临床用途。

应用：①雌二醇、己烯雌酚、枸橼酸氯米芬、福美坦、丙酸睾酮、苯丙酸诺龙、醋酸甲地孕酮、炔诺酮、左炔诺孕酮、米非司酮和醋酸地塞米松的结构、理化性质和临床用途；②己烯雌酚立体结构与药理活性的关系；③肾上腺皮质激素的构效关系。

三、本章重点和难点

本章重点和难点：①甾体激素类药物的结构特征、分类和作用机制；②非甾体雌激素立体结构与药理活性的关系；③各类甾体激素类药物的结构改造方法；④肾上腺皮质激素的构效关系；⑤己烯雌酚的合成。

第十八章 抗生素

一、课程内容

本章主要介绍抗生素的分类及作用机制；介绍 β -内酰胺类抗生素的结构特点、构效关系、作用机制；介绍 β -内酰胺类抗生素的耐药性及耐药机制；介绍耐酸、耐酶和广谱青霉素的研究思路；介绍代表药物（青霉素、阿莫西林、克拉维酸、舒巴坦、四环素、盐酸多西环素、阿米卡星、阿奇霉素和氯霉素）的结构、理化性质和临床用途；介绍氨基糖苷类、头孢羟氨苄、头孢丙烯、头孢布烯、头孢克肟、亚胺培南、氨曲南、舒他西林、红霉素和万古霉素的结构和临床用途；介绍四环素类、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；介绍半合成红霉素衍生物的结构改造、半合成青霉素和头孢菌素类药物的合成方法。

二、考核知识点和考核要求

识记：① β -内酰胺类抗生素的结构特征、作用机制及耐药机制；②耐酸、耐酶和广谱青霉素的研究思路；③四环素类、氨基糖苷类和大环内酯类抗生素的

结构特点、作用机制及临床用途；④半合成红霉素衍生物的结构改造。

领会：①氨苄西林、头孢羟氨苄、头孢丙烯、头孢布烯、头孢克肟、亚胺培南、氨曲南、舒他西林、红霉素和万古霉素的结构和临床用途。

应用：①青霉素、阿莫西林、克拉维酸、舒巴坦、四环素、盐酸多西环素、阿米卡星、阿奇霉素和氯霉素的化学结构、理化性质和临床用途；②青霉素的构效关系。

三、本章重点和难点

本章重点和难点：① β -内酰胺类抗生素的结构特点及作用机制；②青霉素的构效关系；③四环素类、氨基糖苷类和大环内酯类抗生素的结构特点、毒副作用及临床用途；④半合成青霉素和头孢菌素类药物的合成方法。

第十九章 合成抗菌药

一、课程内容

本章主要介绍磺胺类药物和喹诺酮类药物的结构特征、作用机理及构效关系；介绍磺胺类药物和抗菌增效剂的作用机制；介绍 Wood-Fields 学说和喹诺酮类药物的发展概况；介绍抗结核药物和抗真菌药物的作用机理；介绍代表药物（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、盐酸乙胺丁醇、贝达喹啉、氟康唑和特比萘芬）的化学结构、理化性质和临床用途；介绍磺胺嘧啶、磺胺异噁唑、萘啶酸、吡哌酸、氧氟沙星、莫昔沙星、利福平、两性霉素 B、克霉唑、酮康唑、伊曲康唑、萘替酚的结构和临床用途，以及诺氟沙星的合成方法。

二、考核知识点和考核要求

识记：①磺胺类药物和喹诺酮类药物的结构特征和作用机理；②喹诺酮类药物的发展概况；③细菌对喹诺酮类药物产生耐药性的原因；④抗结核药物和抗真菌药物的作用机理。

领会：①磺胺嘧啶、磺胺异噁唑、萘啶酸、吡哌酸、氧氟沙星、莫昔沙星、利福平、两性霉素 B、克霉唑、酮康唑、伊曲康唑、萘替酚的结构和临床用途。

应用：①磺胺类药物和喹诺酮类药物的构效关系；②磺胺类药物和抗菌增效剂的作用机制；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、盐酸乙胺丁醇、贝达喹啉、氟康唑和特比萘芬的化学结构、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磺胺类药物和喹诺酮类药物的作用机制和构效关系；②磺胺及抗菌增效剂的作用原理；③Wood-Fields 学说；④抗结核药物和抗真菌药物的作用机理和代表药物；⑤诺氟沙星的合成。

第二十章 抗病毒药

一、课程内容

本章主要介绍病毒的生命周期；介绍抗 DNA 病毒和抗 RNA 病毒的研究进展，以及代谢拮抗原理在嘧啶核苷类和嘌呤核苷类抗病毒药物中的应用；介绍代表药物（碘苷、阿昔洛韦、阿德福韦酯、齐多夫定、恩曲他滨、利匹韦林、多拉韦林、茚地那韦、索磷布韦、艾维雷韦、磷酸奥司他韦、玛巴洛沙韦和利巴韦林）的结构、理化性质和临床用途；介绍阿糖胞苷、更昔洛韦、司他夫定、拉米夫定、盐酸金刚烷胺、替洛隆的结构和临床用途，以及利巴韦林的合成方法。

二、考核知识点和考核要求

识记：①抗 DNA 病毒和抗 RNA 病毒的研究进展。

领会：①代谢拮抗原理在核苷类抗病毒药物中的应用；②阿糖胞苷、更昔洛韦、玛巴洛沙韦、沙奎那韦、司他夫定、茚地那韦、盐酸金刚烷胺、艾维雷韦的结构和临床用途。

应用：①碘苷、阿昔洛韦、齐多夫定、利匹韦林、奈韦拉平、索磷布韦、磷酸奥司他韦、利巴韦林的结构和理化性质，以及临床用途。

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药物；②代谢拮抗原理在核苷类抗病毒药物中的应用；③利巴韦林的合成。

第二十一章 抗肿瘤药物

一、课程内容

本章主要介绍常用抗肿瘤药物的作用靶点、分类、结构特点及作用机制；介绍代谢拮抗原理在抗肿瘤药物中的应用和抗肿瘤药物的发展方向；介绍代表药物（环磷酰胺、卡莫司汀、顺铂、米托蒽醌、氟尿嘧啶、甲氨蝶呤、盐酸阿糖胞苷、巯嘌呤和甲磺酸伊马替尼）的结构、理化性质和临床用途；介绍盐酸氮芥、氮甲、

异环磷酰胺、塞替派、洛莫司汀、卡铂、博来霉素、喜树碱、白消安、伊立替康、吉非替尼、硼替佐米、更生霉素、阿柔比星、替加氟、吉西他滨、磺巯嘌呤钠、长春碱、紫杉醇、舒尼替尼的结构和临床用途，以及环磷酰胺和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抗肿瘤药物的作用靶点、分类、结构特点及作用机制；②抗肿瘤药物的发展方向。

领会：①盐酸氮芥、氮甲、白消安、异环磷酰胺、塞替派、洛莫司汀、卡铂、博来霉素、喜树碱、伊立替康、吉非替尼、硼替佐米、更生霉素、阿柔比星、吉西他滨、磺巯嘌呤钠、长春碱、紫杉醇、舒尼替尼的结构和临床用途；②环磷酰胺在体内发挥药效的原理。

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、氟尿嘧啶、甲氨蝶呤、盐酸阿糖胞苷、巯嘌呤、甲磺酸伊马替尼的结构和理化性质，以及临床用途。

三、本章重点和难点

本章重点和难点：①抗肿瘤药物的作用靶点、分类、结构特点及作用机制；②环磷酰胺在体内发挥药效的原理；③烷化剂的抗肿瘤作用机制；④代谢拮抗原理在抗肿瘤药物中的应用；⑤环磷酰胺和甲磺酸伊马替尼的合成。

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

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。其目的是对个人自学、社会助学和课程考试命题进行指导和规定。

考试大纲明确了课程学习的内容以及要求的深度与广度，规定了考试的范围和标准。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，是自考生学习教材、掌握课程内容知识范围和程度的依据，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

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

本课程使用教材为：药物化学（第五版），尤启东、郭小可主编，化学工业出版社，2025 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，以便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、作出判断和解决问题。
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. 本课程考试试卷中可能采用的题型有：单项选择题、填空题、名词解释题、简答题、论述题等。
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. 环磷酰胺主要用于（ ）
 - A. 解热镇痛
 - B. 心绞痛的缓解和预防
 - C. 治疗胃溃疡
 - D. 淋巴肉瘤，何杰金氏病

参考答案：D

二、填空题

1. 奥美拉唑是用于治疗胃和十二指肠_____的质子泵抑制剂。

参考答案：溃疡

三、名词解释题

1. 前药

参考答案：前药也称前体药物、前驱药物等，是指一类在体外无活性或活性较小，在体内经酶或非酶作用，释放出活性物质而产生药理作用的化合物。

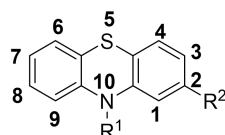
四、简答题

1. 简述非甾体抗炎药的作用靶标。

参考答案：（1）环加氧酶；（2）脂加氧酶。

五、论述题

1. 根据吩噻嗪类药物的结构通式，试述该类药物的构效关系。



参考答案：

- （1）吩噻嗪环的三环结构用各种生物电子等排体替代，也具有治疗精神病作用；
- （2）吩噻嗪环的 2 位引入吸电子取代基可增强活性，作用强度与吸电子性能成正比；
- （3）当吩噻嗪环 2 位引入 S 原子时，锥体外系副作用减轻；
- （4）吩噻嗪母核 10 位氮原子与侧链氮原子间相隔 3 个直链碳原子时作用最强；
- （5）10 位氮原子上的取代基是含 N 的碱性基团，常为叔胺，可为脂肪叔氨基，也可为氮杂环。