

2. 结构非特异性药物和结构特异性药物的概念。
3. 药物的理化性质对活性的影响、药物与靶点的相互作用。

第三章 药物结构与药物代谢

1. 代谢反应的类型。
2. 药物代谢在药物研发中的应用。

第四章 新药研究的基本原理和方法

1. 先导化合物的发现和优化的基本途径。
2. 药物研发的主要过程。

第五章 镇静催眠和抗癫痫药

1. 镇静催眠药和抗癫痫药的分类和代表性药物。
2. 地西洋等典型药物的化学结构、合成、构效关系。

第六章 精神和神经疾病治疗药

1. 抗精神病和抗抑郁药的分类和代表性药物、药理作用。
2. 氯丙嗪、帕罗西汀等典型药物的化学结构、合成、构效关系。

第七章 神经退行性疾病治疗药物

1. 抗帕金森和抗阿尔茨海默症药物的药理作用和典型药物的结构。

第八章 镇痛药

1. 阿片样镇痛药的作用机制，以及合成镇痛药的结构分类和代表性药物。
2. 哌替啶和芬太尼等典型药物的化学结构、合成、构效关系。

第九章 非甾体抗炎药的作用机制

1. 非甾体抗炎药的作用机制，和结构分类和代表性药物。
2. 布洛芬和吲哚美辛等典型药物的化学结构、合成、构效关系。

第十章 拟胆碱药和抗胆碱药

1. 拟胆碱药和抗胆碱药类别和代表性药物。
2. 乙酰胆碱酯酶抑制剂的作用机制和代表药物溴新斯的明的结构与合成。
3. 代表药物溴丙胺太林和苯磺阿曲库铵的结构、和作用机制。
4. 软药的概念。

第十一章 抗变态反应药

1. 组胺受体的类型和生理作用。
2. 组胺 H1 受体拮抗剂的类型和主要临床作用。
3. 马来酸氯苯那敏和盐酸西替利嗪等典型药物的化学结构、合成、构效关系。

第十二章 消化系统药物

1. 组胺 H2 受体拮抗剂西咪替丁的开发历程和临床应用。
2. 质子泵抑制剂的发现、发展和临床应用。
3. 代表药物奥美拉唑的化学结构、主要临床用途和奥美拉唑循环（前药循环）。

第十三章 降血糖药物

1. 降血糖药物的分类、代表性药物和作用机制。

2. 盐酸二甲双胍、马来酸罗格列酮和磷酸西格列汀的化学结构和主要临床用途。
3. 马来酸罗格列酮的合成方法。

第十四章 作用于肾上腺素受体的药物

1. 肾上腺素药物的发展历程，结构类型和构-效关系。
2. 拟肾上腺素类代表药物肾上腺素、盐酸麻黄碱、盐酸多巴酚丁胺和硫酸沙丁胺醇的化学结构和主要临床用途。
3. 抗肾上腺素药物的类型和构-效关系。
4. 盐酸普萘洛尔的化学结构和主要临床用途及其合成方法

第十五章 抗高血压药物和利尿药

1. 抗高血压和利尿药的分类、代表性药物和作用机制。
2. 血管紧张素转化酶抑制剂和血管紧张素 II 受体拮抗剂的概念、结构特点和构-效关系。
3. 二氢吡啶类钙离子通道阻滞剂的构-效关系。
4. 卡托普利、氯沙坦和硝苯地平典型药物的化学结构、合成方法。

第十六章 心脏疾病药物和血脂调节药

1. 强心苷类药物的结构特点。
2. 抗心律失常药物的分类和作用机制，以及普罗帕酮和胺碘酮等典型药物的化学结构、主要临床用途与合成方法。
3. 抗心绞痛药物的类型和作用机制，硝酸甘油的化学结构和主要临床用途。
4. 血脂调节药物的分类，以及羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑制剂的作用机制。
5. 氟伐他汀钠和吉非罗齐等典型药物的化学结构、主要临床用途。

第十七章 甾体激素类药物

1. 激素类药物类型和代表性药物。
2. 激素类药物不同类型典型药物的化学结构、主要临床用途。
3. 己烯雌酚的化学结构、作用原理和合成方法。

第十八章 抗生素

1. 抗生素药物的概念和结构分类。
2. β -内酰胺类抗生素的结构特点、性质特点、作用机制、耐药机制。
3. 半合成青霉素和半合成头孢菌素类抗生素的制备方法。

第十九章 合成抗菌药

1. 抗菌药的分类和代表性药物，代谢拮抗的概念和磺胺类抗菌药的作用机制。
2. 磺胺甲噁唑和甲氧苄啶的化学结构、主要临床用途与合成方法。
3. 喹诺酮类抗菌药的作用机制，构-效关系，诺氟沙星和环丙沙星的化学结构和主要临床用途、合成方法。
4. 抗真菌代表药物氟康唑和特比萘芬的化学结构和主要临床用途、合成方法。

第二十章 抗病毒药

1. 抗病毒药分类和作用机制，阿昔洛韦和利巴韦林的化学结构和临床用途。

2. 抗非逆转录病毒药物磷酸奥司他韦的化学结构和主要临床用途。
3. 抗病毒药的发展历程和趋势, 代谢拮抗原理在抗病毒药物研发中的应用。
4. 抗艾滋病代表药物齐多夫定的化学结构和主要临床用、合成方法。

第二十一章 抗肿瘤药物

1. 抗肿瘤药物的分类和作用机制, 环磷酰胺、顺铂的化学结构和临床用途, 环磷酰胺的合成方法以及体内作用原理。
2. 干扰 DNA 合成的药物分类, 5-氟尿嘧啶的化学结构、临床用途和合成方法。
3. 代谢拮抗原理在抗肿瘤药物研究与开发中的应用。
4. 肿瘤信号通路抑制剂、以及甲磺酸伊马替尼的化学结构、主要临床用途。

参考教材或主要参考书:

1. 《药物化学》第四版, 尤启冬 郭小可主编, 2025 年出版, 化学工业出版社

四、样卷

一、单项选择题 (30 题, 每题 2 分, 共计 60 分)

1、“药物化学”最准确的英文名是:

- A、 Medical Chemistry B、 Medicinal Chemistry
C、 Pharmaceutical Chemistry D、 Drug Chemistry

2、下面不属于药物化学主要研究内容的为:

- A、 设计新的活性化合物分子
B、 研究药物如何在临床中应用
C、 研究化学药物的制备原理与合成路线
D、 研究化学药物的作用机制及其代谢规律

3、通常来讲, 只有能为受体识别并与受体结构互补的药物构象, 才产生特定的药理效应。把药物分子与受体相互作用时, 药物与受体互补并结合的构象, 称为:

- A、 优势构象 B、 药效构象
C、 等效构象 D、 对应构象

4、向苯二氮草类化学结构中 1,2 位并入三唑环后活性增强的原因是:

- A、 药物对代谢的稳定性及对受体的亲和力均增大

- B、 药物亲水性增大
- C、 药物极性增大
- D、 药物对代谢的稳定性增加

5、既能用于镇静催眠，又能用于抗癫痫的药物是：

- A、 氯雷他定
- B、 苯巴比妥
- C、 地西洋
- D、 艾司唑仑

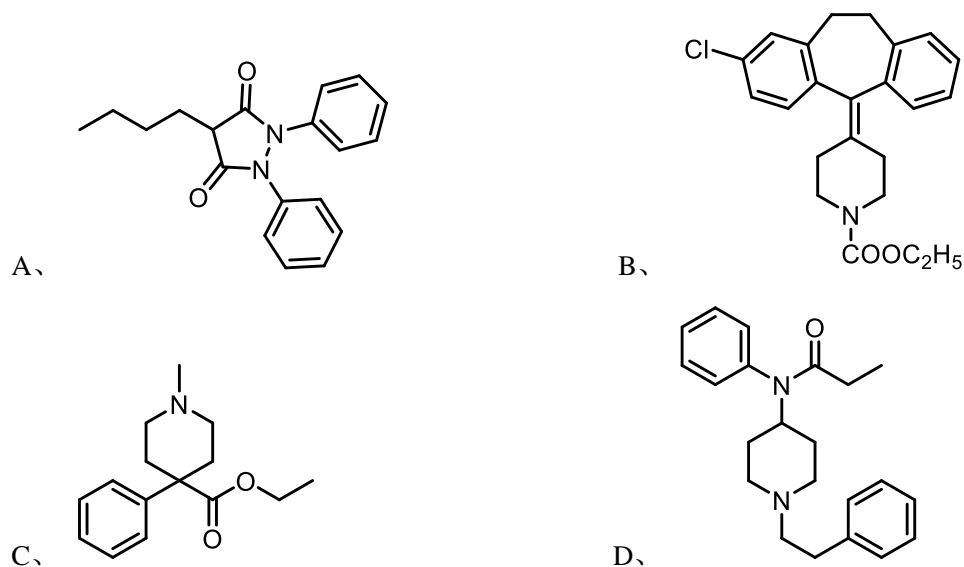
6、将奋乃静制成长链脂肪酸酯（例如癸氟奋乃静）前药的目的是：

- A、 增强选择性
- B、 提高稳定性
- C、 延长药效维持时间
- D、 降低毒副作用

7、关于阿尔兹海默病病因的三大假说不包含以下哪一个：

- A、 胆碱能假说
- B、 自由基损伤假说
- C、 $A\beta$ 异常沉积假说
- D、 Tau 蛋白假说

8、芬太尼是一个全合成的强效镇痛药，但是公安部、国家卫健委和国家药监局联合发布公告宣布，从2019年5月1日起将芬太尼类物质列入《非药用类麻醉药品和精神药品管制品种增补目录》，也就是说对芬太尼类物质实施整类列管。下列哪个是芬太尼的化学结构式：



9、吗啡可以通过激动 μ -受体发挥强效镇痛作用，下面哪个基团不是其发挥镇痛活性的药效团：

14、以下不属于经典的 H₁ 受体拮抗剂的药物类别的是：

- A、 氨烷基醚类
- B、 乙二胺类
- C、 烯丙胺类
- D、 三环类

15、奥美拉唑的作用机制是：

- A、 组胺 H₁ 受体拮抗剂
- B、 5-HT 受体抑制剂
- C、 质子泵抑制剂
- D、 羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑制剂

16 下列不是治疗 II 型糖尿病的主要药物类型的是：

- A、 胰岛素分泌促进剂
- B、 α 受体激动剂
- C、 胰岛素增敏剂
- D、 α -葡萄糖苷酶抑制剂

17、下列关于二甲双胍的描述错误的是：

- A、 几乎以原型经肾脏排泄，肾功能损耗者禁用，老年人禁用
- B、 可以通过缓慢地提高给药剂量以及在进餐时服用药物方法来降低急性作用
- C、 适合过度肥胖并对胰岛素耐受患者，有时会出现体重减轻的现象
- D、 直接促进胰岛素分泌

18、多巴胺和肾上腺素性质不稳定，易被氧化，这是因为其结构中含有：

- A、 羧基
- B、 氨基
- C、 两个邻位酚羟基
- D、 共轭二烯

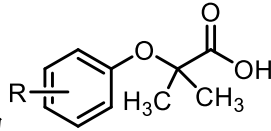
19、下列不具有抗高血压作用的药物是：

- A、 盐酸哌唑嗪
- B、 利血平
- C、 氯沙坦
- D、 吉非罗齐
- E、 卡托普利

20、奎尼丁属于：

- A、 强心苷类强心药
- B、 钠离子通道阻滞剂，抗心律失常
- C、 硝酸酯类抗心绞痛药
- D、 降血脂药，促进胆固醇的排泄

21、西格列汀的化学结构式为：



25、苯氧乙酸酯类降血脂药的结构为  ，关于其构效关系不正确的是：

- A、以硫取代氧可以提高降血脂作用
- B、双甲基取代降脂作用最强
- C、羧基不是药物活性的必须基团
- D、芳环保证了药物亲脂性，并能与蛋白质链某些部分互补

26、齐多夫定是临床上常用抗病毒药物，其作用机制为：

- A、整合酶抑制剂
- B、逆转录酶抑制剂
- C、HIV 蛋白酶抑制剂
- D、融合酶抑制剂

27、下列关于干扰病毒复制初始时期的药物说法错误的是：

- A、M₂ 蛋白抑制剂主要通过干扰 M₂ 蛋白离子通道活性来干扰病毒的复制
- B、M₂ 蛋白抑制剂的代表药物是金刚烷胺类化合物
- C、干扰素能够直接灭活细胞，终止病毒的复制
- D、干扰素是一种糖蛋白，具有抑制病毒生长、细胞增值和免疫调节的活性

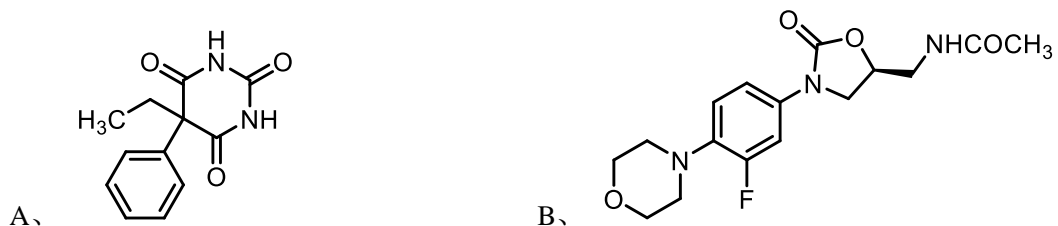
28、下列哪个是属于作用于结构蛋白的抗肿瘤药物：

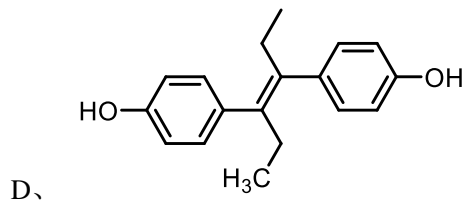
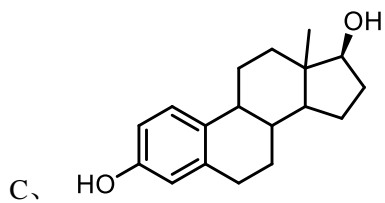
- A、顺铂
- B、环磷酰胺
- C、紫杉醇
- D、喜树碱

29、氮芥类药物以什么方式与 DNA 结合而使其失活或分子断裂：

- A、共价键
- B、离子键
- C、氢键
- D、范德华力

30、己烯雌酚的结构是：



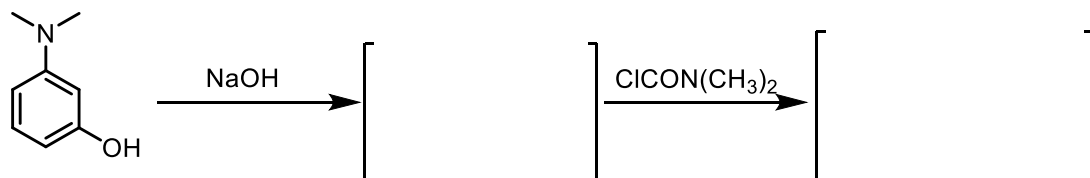


二、完成反应方程式 (10 空, 每空 2.0 分, 共计 20 分)

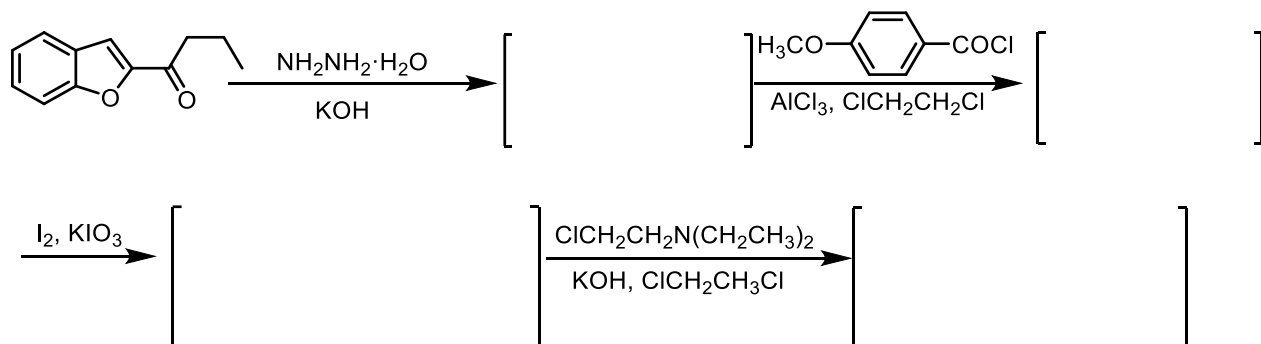
1、完成下列西咪替丁的合成



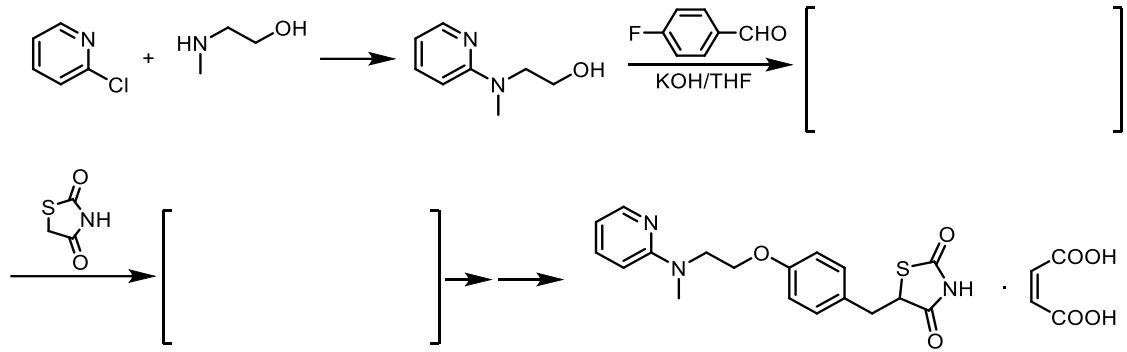
2、完成下列溴新斯的明的合成



3、完成下列盐酸胺碘酮的合成



4、完成下列马来酸罗格列酮的合成



三、简答题（4 题，每题 10.0 分，共计 40 分）

- 1、请简述磺胺及其抗菌增效剂的作用机制，以及如何通过代谢拮抗的概念设计药物结构。
- 2、简述抗非甾体抗炎药的药物结构类别（各举一例药物名称），并简要说明非甾体抗炎药的作用机制。
- 3、肾素-血管紧张素-醛固酮系统是人体内调节血流量、电解质平衡以及动脉血压所必须的高效系统，请简要描述该系统，并写出基于该系统所开发的抗高血压药物的分类和代表性药物（画出结构）。
- 4、请写出 β -内酰胺类抗生素结构分类和代表性药物名称（画出结构），并以半合成青霉素为例简述结构改造的主要目的。

三、合成题（3 题，每题 10 分，共计 30 分）

1、简述环磷酰胺的抗肿瘤作用机制，并写出以双（2-羟乙基）胺为起始原料合成环磷酰胺的工艺路线。

2、简要说明己烯雌酚具有雌激素功能的主要原因，并选择合适的原料画出其合成工艺路线。

3、画出以 2-甲基吡啶为起始原料合成马来酸氯苯那敏的工艺路线，并写出其作用靶标和临床用途。