

2021 年中国医药工业研究总院

硕士研究生入学考试药物化学专业

药物化学考试大纲

一、考试基本要求及适用范围概述

本《药物化学》考试大纲适用于中国医药工业研究总院药学药物化学专业的硕士研究生入学考试。

药物化学是利用化学的概念和方法发现确证和开发药物，从分子水平上研究药物在体内的作用方式和作用机理的一门学科。研究任务包括：研究药物的化学结构和活性间的关系（构效关系）；药物化学结构与物理化学性质的关系；阐明药物与受体的相互作用；鉴定药物在体内吸收、转运、分布的情况及代谢产物；通过药物分子设计或对先导化合物的化学修饰获得新化学实体创制新药。学生需要掌握药物研发的基本理论和基本方法，药物的作用机制、构效关系，代表性药物的结构特点、合成方法和应用。了解目前药物治疗中尚待解决的问题及新的治疗领域及发展趋势。前 4 章为总论部分，要求学生掌握药物研究与开发的基本理论和基本方法，药物代谢反应类型和前药设计的基本理论和方法。第 5 章到第 21 章为各论，按目前新药研究的重点领域分类。要求考生掌握每类药物的结构特点、作用机理、结构与活性关系、代表性药物的基本结构、命名规则、合成路线、作用特点及药代动力学状况。

二、考试形式

硕士研究生入学药物化学考试为闭卷，笔试。专业基础综合（本专业为“有机化学”和“药物化学”）考试时间为 180 分钟，满分合计 300 分。本部分“药物化学”试卷满分为 150 分。

试卷结构（题型）：名词解释、简答题、问答题

三、考试内容

1. 绪论

考试内容

- 1) 药物化学的研究内容和任务
- 2) 药物化学的研究和发展
- 3) 我国药物化学的发展
- 4) 药物化学发展的新方向

考试要求

- 1) 掌握药物化学的研究内容和任务
- 2) 了解药物化学的研究和发展
- 3) 了解我国药物化学的发展
- 4) 了解药物化学发展的新方向

2. 新药研究与开发概论

考试内容

- 1) 新药研究与开发的过程和方法
 - a、药物发现的过程
 - b、新药的开发阶段
- 2) 药物合成研究和质量标准
 - a、药物合成及工艺研究
 - b、药品质量和质量标准
- 3) 我国新药的分类和管理要求
- 4) 新药研究和开发中的其他问题

考试要求

- 1) 掌握新药研究与开发的过程和方法
 - a、药物发现的过程
 - b、新药的开发阶段
- 2) 掌握药物合成研究和质量标准
 - a、药物合成及工艺研究
 - b、药品质量和质量标准
- 3) 掌握我国新药的分类和管理要求

4) 了解新药研究和开发中的其他问题

3. 药物设计的基本原理和方法

考试内容

1) 概论

2) 先导化合物发现的方法和途径

a、随机发现

b、从天然药物的活性成分中获得

c、以体内内源性活性物质作为先导化合物

d、从药物代谢产物中寻找

e、通过观察药物的临床副作用或者老药新用-

f、基于生物大分子的结构设计得到

g、通过组合化学合成得到

h、从药物合成的中间体中发现

i、其他新发展的方法

3) 掌握先导化合物的优化

a、烷基链或环的结构改造

b、生物电子等排

c、前药原理

d、软药

e、硬药

f、孪药

g、用定量构效关系方法优化先导化合物

4) 药物的结构与药效关系

a、药物产生作用的主要因素

b、药物的理化性质对活性的影响

c、药物和受体间相互作用对药效的影响

5) 定量构效关系方法

a、疏水性参数

- b、电性参数
- c、立体参数
- d、Hansch 方法在药物设计中的应用

6) 计算机辅助药物设计简介

- a、直接药物设计
- b、间接药物设计

考试要求

1) 掌握先导化合物发现的方法和途径

- a、随机发现
- b、从天然药物的活性成分中获得
- c、以体内内源性活性物质作为先导化合物
- d、从药物代谢产物中寻找
- e、通过观察药物的临床副作用或者老药新用-
- f、基于生物大分子的结构设计得到
- g、通过组合化学合成得到
- h、从药物合成的中间体中发现
- i、其他新发展的方法

2) 掌握先导化合物的优化

- a、烷基链或环的结构改造
- b、生物电子等排
- c、前药原理
- d、软药
- e、硬药
- f、孪药
- g、用定量构效关系方法优化先导化合物

3) 掌握药物的结构与药效关系-

- a、药物产生作用的主要因素
- b、药物的理化性质对活性的影响
- c、药物和受体间相互作用对药效的影响

- 4) 了解定量构效关系方法
 - a、疏水性参数
 - b、电性参数
 - c、立体参数
 - d、Hansch 方法在药物设计中的应用
- 5) 了解计算机辅助药物设计
 - a、直接药物设计
 - b、间接药物设计

4. 药物代谢

考试内容

- 1) 官能团化反应
 - a、氧化反应
 - b、还原反应
 - c、水解反应
- 2) 结合反应
 - a、葡萄糖醛酸结合
 - b、硫酸结合
 - c、乙酰化结合
 - d、甲基化结合
 - e、氨基酸结合
 - f、谷胱甘肽或巯基尿酸结合
- 3) 药物代谢的影响因素及其在新药研究开发中的应用
 - a、药物代谢的影响因素
 - b、药物代谢在新药研究和开发中的应用
 - c、药物的结构与代谢关系的研究

考试要求

- 1) 掌握官能团化反应
 - a、氧化反应

- b、还原反应
- c、水解反应
- 2) 掌握结合反应
 - a、葡萄糖醛酸结合
 - b、硫酸结合
 - c、乙酰化结合
 - d、甲基化结合
 - e、氨基酸结合
 - f、谷胱甘肽或巯基尿酸结合
- 3) 了解药物代谢的影响因素及其在新药研究开发中的应用
 - a、药物代谢的影响因素
 - b、药物代谢在新药研究和开发中的应用
 - c、药物的结构与代谢关系的研究

5. 麻醉药

考试内容

- 1) 全身麻醉药
 - a、吸入性麻醉药
 - b、静脉麻醉药
- 2) 局部麻醉药
 - a、局部麻醉药的发展
 - b、局部麻醉药的结构类型
 - c、局部麻醉药的构效关系-
 - d、局部麻醉药的作用机理

考试要求

- 1) 掌握全身麻醉药
 - a、吸入性麻醉药
 - b、静脉麻醉药
- 2) 掌握局部麻醉药

- a、局部麻醉药的发展
- b、局部麻醉药的结构类型
- c、局部麻醉药的构效关系
- d、局部麻醉药的作用机理

6. 镇静催眠药和抗癫痫药-

考试内容

1) 巴比妥类镇静催眠药-

- a、巴比妥类药物的结构
- b、巴比妥类药物的作用机理
- c、巴比妥类药物的构效关系-
- d、巴比妥类药物的一般性质
- e、巴比妥类药物的合成通法

2) 苯二氮卓类催眠镇静药-

- a、1,4-苯二氮卓类药物的发现
- b、苯二氮卓类的发展和构效关系-
- c、苯二氮卓类的作用机理
- d、苯二氮卓类的一般理化性质
- e、苯二氮卓类的代谢

3) 其他类镇静催眠药

- a、非苯二氮卓类受体激动剂
- b、吡咯酮类
- c、喹唑酮类
- d、氨基甲酸酯类

4) 抗癫痫药

- a、抗癫痫药物的作用机理
- b、苯二氮卓类
- c、酰胺类
- d、亚氨基芪类

- e、类似物
- f、脂肪酸类
- g、其他类

考试要求

- 1) 掌握巴比妥类镇静催眠药
 - a、巴比妥类药物的结构
 - b、巴比妥类药物的作用机理
 - c、巴比妥类药物的构效关系-
 - d、巴比妥类药物的一般性质
 - e、巴比妥类药物的合成通法
- 2) 掌握苯二氮卓类催眠镇静药
 - a、1,4-苯二氮卓类药物的发现
 - b、苯二氮卓类的发展和构效关系-
 - c、苯二氮卓类的作用机理
 - d、苯二氮卓类的一般理化性质
 - e、苯二氮卓类的代谢
- 3) 掌握其他类镇静催眠药
 - a、非苯二氮卓类受体激动剂
 - b、吡咯酮类
 - c、喹唑酮类
 - d、氨基甲酸酯类
- 4) 掌握抗癫痫药
 - a、抗癫痫药物的作用机理
 - b、苯二氮卓类
 - c、酰胺类
 - d、亚氨基类
 - e、类似物
 - f、脂肪酸类
 - g、其他类

7. 精神神经疾病治疗药

考试内容

- 1) 抗精神病药
 - a、吩噻嗪类
 - b、硫杂蒯类
 - c、丁酰苯类及其类似物
 - d、苯酰胺类
 - e、二苯二氮卓类及其衍生物
 - f、抗精神病药物的作用机理
- 2) 非经典抗精神病药物
- 3) 抗抑郁药
 - a、单胺氧化酶抑制剂,
 - b、-羟色胺重摄取抑制剂-
 - c、去甲肾上腺素重摄取抑制剂-
- 4) 抗躁狂药和抗焦虑药
 - a、抗躁狂药
 - b、抗焦虑药

考试要求

- 1) 掌握抗精神病药
 - a、吩噻嗪类
 - b、硫杂蒯类
 - c、丁酰苯类及其类似物
 - d、苯酰胺类
 - e、二苯二氮卓类及其衍生物
 - f、抗精神病药物的作用机理
- 2) 掌握非经典抗精神病药物
- 3) 掌握抗抑郁药
 - a、单胺氧化酶抑制剂
 - b、羟色胺重摄取抑制剂

- c、去甲肾上腺素重摄取抑制剂
- 4) 掌握抗躁狂药和抗焦虑药
 - a、抗躁狂药
 - b、抗焦虑药

8. 镇痛药

考试内容

- 1) 吗啡及其衍生物
- 2) 合成镇痛药
 - a、哌啶类
 - b、氨基酮类
 - c、吗啡烃类及苯并吗喃类
 - d、其他
- 3) 阿片受体和阿片样物质
 - a、阿片受体
 - b、阿片样物质

考试要求

- 1) 掌握吗啡及其衍生物
- 2) 掌握合成镇痛药
 - a、哌啶类
 - b、氨基酮类
 - c、吗啡烃类及苯并吗喃类
 - d、其他
- 3) 掌握阿片受体和阿片样物质
 - a、阿片受体
 - b、阿片样物质

9. 非甾体抗炎药

考试内容

- 1) 非甾体抗炎药的作用机理
 - a、花生四酸的代谢途径与炎症
 - b、非甾体抗炎药的作用靶点
- 2) 解热镇痛药
- 3) 非甾体抗炎药
 - a、非选择性的非甾体抗炎药
 - b、选择性环氧合酶--2 抑制剂
- 4) 痛风治疗药

考试要求

- 1) 掌握非甾体抗炎药的作用机理
 - a、花生四酸的代谢途径与炎症
 - b、非甾体抗炎药的作用靶点
- 2) 掌握解热镇痛药
- 3) 掌握非甾体抗炎药
 - a、非选择性的非甾体抗炎药
 - b、选择性环氧合酶--2 抑制剂
- 4) 掌握痛风治疗药

10. 拟胆碱和抗胆碱药物

考试内容

- 1) 拟胆碱药
 - a、胆碱受体激动剂
 - b、胆碱受体激动剂的构效关系
 - c、乙酰胆碱酯酶抑制剂
 - d、有机磷酸酯的抗胆碱酯酶作用和胆碱酯酶复能药
- 2) 抗胆碱药
 - a、颠茄生物碱类拟胆碱药
 - b、合成抗胆碱药
 - c、胆碱受体拮抗剂的构效关系

d、胆碱受体拮抗剂

考试要求

1) 掌握拟胆碱药

a、胆碱受体激动剂

b、胆碱受体激动剂的构效关系

c、乙酰胆碱酯酶抑制剂

d、有机磷酸酯的抗胆碱酯酶作用和胆碱酯酶复能药

2) 掌握抗胆碱药

a、颠茄生物碱类拟胆碱药

b、合成抗胆碱药

c、胆碱受体拮抗剂的构效关系

d、胆碱受体拮抗剂

11. 作用于肾上腺素能受体的药

考试内容

1) 拟肾上腺素药

a、拟肾上腺素药物

b、 α 受体激动剂

c、选择性 β 受体激动剂

d、肾上腺素受体激动剂的构效关系

e、 β_3 受体激动剂

2) 抗肾上腺素药

a、 α 受体阻断剂

b、 β 受体阻断剂

c、对 α 受体和 β 受体都有阻断作用的药物

考试要求

1) 掌握拟肾上腺素药

a、拟肾上腺素药物

b、 α 受体激动剂

- c、选择性 β 受体激动剂
- d、肾上腺素受体激动剂的构效关系
- e、 β_3 受体激动剂
- 2) 掌握抗肾上腺素药
 - a、 α 受体阻断剂
 - b、 β 受体阻断剂
 - c、对 α 受体和 β 受体都有阻断作用的药物

12. 抗高血压药和利尿药

考试内容

- 1) 抗高血压药物
 - a、交感神经药物
 - b、血管扩张药物
 - c、血管紧张素转换酶抑制剂和血管紧张素 II 受体拮抗剂
 - d、钙离子拮抗剂
- 2) 利尿药
 - a、碳酸酐酶抑制剂
 - b、 Na^+-Cl^- 协转运抑制剂
 - c、 $\text{Na}^+-\text{K}^+-2\text{Cl}^-$ 协转运抑制剂
 - d、阻断肾小管上皮 Na^+ 通道药物
 - e、盐皮质激素受体阻断药

考试要求

- 1) 掌握抗高血压药物
 - a、交感神经药物
 - b、血管扩张药物
 - c、血管紧张素转换酶抑制剂和血管紧张素 II 受体拮抗剂
 - d、钙离子拮抗剂
- 2) 掌握利尿药
 - a、碳酸酐酶抑制剂

- b、Na⁺-Cl⁻ - 协转运抑制剂
- c、Na⁺-K⁺-2Cl⁻ - 协转运抑制剂
- d、阻断肾小管上皮 Na⁺通道药物
- e、盐皮质激素受体阻断药

13. 心脏疾病用药和血脂调节药

考试内容

- 1) 强心药物
 - a、强心苷类
 - b、-受体激动剂类-
 - c、磷酸二酯酶抑制剂
- 2) 抗心律失常药物
 - a、抗心律失常药物的作用机理
 - b、抗心律失常药的分类
- 3) 抗心绞痛药物
- 4) 血脂调节药
 - a、血脂的化学和生物化学
 - b、降血脂药物

考试要求

- 1) 掌握强心药物
 - a、强心苷类
 - b、-受体激动剂类-
 - c、磷酸二酯酶抑制剂
- 2) 掌握抗心律失常药物
 - a、抗心律失常药物的作用机理
 - b、抗心律失常药的分类
- 3) 掌握抗心绞痛药物
- 4) 掌握血脂调节药
 - a、血脂的化学和生物化学

b、降血脂药物

14. 组胺受体拮抗剂及抗过敏和抗溃疡药

考试内容

1) 组胺 H1 受体拮抗剂和抗过敏药物

a、经典的 H1 受体拮抗剂

b、非镇静 H1 受体拮抗剂

c、组胺 H1 受体拮抗剂的构效关系

2) 过敏介质与抗过敏药

a、过敏介质释放抑制剂

b、过敏介质拮抗剂

c、钙通道阻断剂

3) 组胺 H2 受体拮抗剂和抗溃疡药物

a、结构类型

b、组胺 H2 受体拮抗剂的构效关系

4) 质子泵抑制剂

考试要求

1) 掌握组胺 H1 受体拮抗剂和抗过敏药物

a、经典的 H1 受体拮抗剂

b、非镇静 H1 受体拮抗剂

c、组胺 H1 受体拮抗剂的构效关系

2) 掌握过敏介质与抗过敏药

a、过敏介质释放抑制剂

b、过敏介质拮抗剂

c、钙通道阻断剂

3) 掌握组胺 H2 受体拮抗剂和抗溃疡药物

a、结构类型

b、组胺 H2 受体拮抗剂的构效关系

4) 掌握质子泵抑制剂

15. 抗寄生虫药

考试内容

- 1) 驱肠虫药物
- 2) 抗血吸虫药物
- 3) 抗疟药物
 - a、疟原虫的生命周期和抗疟药物的作用环节
 - b、疟疾的预防和治疗药物

考试要求

- 1) 掌握驱肠虫药物
- 2) 掌握抗血吸虫药物
- 3) 掌握抗疟药物
 - a、疟原虫的生命周期和抗疟药物的作用环节
 - b、疟疾的预防和治疗药物

16. 合成抗菌药和抗病毒药

考试内容

- 1) 合成抗菌药
 - a、磺胺类抗菌药物及抗菌增效剂
 - b、喹诺酮类抗菌药
 - c、噁唑烷酮类抗菌药
- 2) 抗结核药物
 - a、合成抗结核药物
 - b、抗结核抗生素
- 3) 合成抗真菌药
 - a、唑类抗真菌药
 - b、非唑类抗真菌药
- 4) 抗病毒药物-
 - a、金刚烷胺类
 - b、核苷类

c、HIV 酶抑制剂

d、其他

考试要求

1) 掌握合成抗菌药

a、磺胺类抗菌药物及抗菌增效剂

b、喹诺酮类抗菌药

c、噁唑烷酮类抗菌药

2) 掌握抗结核药物

a、合成抗结核药物

b、抗结核抗生素

3) 掌握合成抗真菌药

a、唑类抗真菌药

b、非唑类抗真菌药

4) 掌握抗病毒药物-

a、金刚烷胺类

b、核苷类

c、HIV 酶抑制剂

d、其他

17. 抗生素

考试内容

1) β -内酰胺类抗生素

a、基本结构特点和作用机理

b、青霉素类

c、头孢菌素类

d、非经典的 β -内酰胺抗生素和 β -内酰胺酶抑制剂

2) 四环素类抗生素

a、四环素类抗生素

b、四环素类抗生素的构效关系、作用机制和耐药性,

- 3) 氨基糖苷类抗生素
 - a、链霉素
 - b、卡那霉素及其衍生物
 - c、庆大霉素及其衍生物
 - d、新霉素类
- 4) 大环内酯类抗生素
 - a、大环内酯类抗生素的结构特征、理化性质和作用机理
 - b、红霉素及其衍生物
 - c、麦迪霉素及其衍生物
 - d、螺旋霉素及其衍生物
- 5) 其他抗生素
 - a、氯霉素及其衍生物
 - b、林可霉素及其衍生物
 - c、磷霉素

考试要求

- 1) 掌握 β -内酰胺类抗生素
 - a、基本结构特点和作用机理
 - b、青霉素类
 - c、头孢菌素类
 - d、非经典的 β -内酰胺抗生素和 β -内酰胺酶抑制剂
- 2) 掌握四环素类抗生素
 - a、四环素类抗生素
 - b、四环素类抗生素的构效关系、作用机制和耐药性,
- 3) 掌握氨基糖苷类抗生素
 - a、链霉素
 - b、卡那霉素及其衍生物
 - c、庆大霉素及其衍生物
 - d、新霉素类
- 4) 掌握大环内酯类抗生素

- a、大环内酯类抗生素的结构特征、理化性质和作用机理
- b、红霉素及其衍生物
- c、麦迪霉素及其衍生物
- d、螺旋霉素及其衍生物
- 5) 掌握其他抗生素
 - a、氯霉素及其衍生物
 - b、林可霉素及其衍生物
 - c、磷霉素

18. 抗肿瘤药

考试内容

- 1) 直接作用于 DNA 的药物
 - a、烷化剂
 - b、金属铂配合物
 - c、博来霉素类
 - d、作用于 DNA 拓扑异构酶的药物
- 2) 干扰 DNA 合成的药物
 - a、嘧啶拮抗物
 - b、嘌呤拮抗物
 - c、叶酸拮抗物
- 3) 抗有丝分裂的药物
 - a、在微管蛋白上有一个结合位点的药物
 - b、在微管蛋白上有两个结合点的药物
 - c、作用在聚合状态微管的药物

考试要求

- 1) 掌握直接作用于 DNA 的药物
 - a、烷化剂
 - b、金属铂配合物
 - c、博来霉素类

- d、作用于 DNA 拓扑异构酶的药物
- 2) 掌握干扰 DNA 合成的药物
 - a、嘧啶拮抗物
 - b、嘌呤拮抗物
 - c、叶酸拮抗物
- 3) 掌握抗有丝分裂的药物
 - a、在微管蛋白上有一个结合位点的药物
 - b、在微管蛋白上有两个结合点的药物
 - c、作用在聚合状态微管的药物

19. 激素及相关药

考试内容

- 1) 肽类激素
 - a、胰岛素及合成降血糖药物
 - b、钙调节的相关激素
- 2) 甾体激素
 - a、概述
 - b、雌激素及抗雌激素
 - c、雄性激素、同化激素和抗雄性激素,
 - d、孕激素和抗孕激素
 - e、肾上腺皮质激素

考试要求

- 1) 掌握肽类激素
 - a、胰岛素及合成降血糖药物
 - b、钙调节的相关激素
- 2) 掌握甾体激素
 - a、概述
 - b、雌激素及抗雌激素
 - c、雄性激素、同化激素和抗雄性激素,

- d、孕激素和抗孕激素
- e、肾上腺皮质激素

20. 维生素

考试内容

- 1) 脂溶性维生素
 - a、维生素 A 类
 - b、维生素 D 类
 - c、维生素 E 类
 - d、维生素 K 类
- 2) 水溶性维生素-
 - a、维生素 B 类
 - b、维生素 C
 - c、叶酸类

考试要求

- 1) 掌握脂溶性维生素
 - a、维生素 A 类
 - b、维生素 D 类
 - c、维生素 E 类
 - d、维生素 K 类
- 2) 掌握水溶性维生素-
 - a、维生素 B 类
 - b、维生素 C
 - c、叶酸类

21. 药物生物技术

考试内容

- 1) 重组 DNA 技术
 - a、载体和目的基因的分

- b、限制性内切酶的应用
- c、载体和目的基因连接成重组体
- d、重组体的转化
- e、DNA 重组体的筛选与鉴定
- f、基因表达
- 2) 生物技术药物的开发与应用
 - a、生物药物与生物技术药物
 - b、生物技术药物的主要品种类型
 - c、生物技术药物
- 3) 生物技术药物的一般性质
 - a、生物技术药物的化学稳定性
 - b、生物技术药物的物理稳定性
- 4) 单克隆抗体技术
 - a、免疫球蛋白
 - b、单克隆抗体制备技术原理
 - c、单克隆抗体的主要医药用途
- 5) 生物技术与新药研究
 - a、生物技术与合理药物设计
 - b、建立新的药理模型和实验方法
 - c、反义药物
 - d、基因治疗
 - e、药物基因组学和药物蛋白质组学

考试要求

- 1) 了解重组 DNA 技术
 - a、载体和目的基因的分离
 - b、限制性内切酶的应用
 - c、载体和目的基因连接成重组体
 - d、重组体的转化
 - e、DNA 重组体的筛选与鉴定

- f、基因表达
- 2) 了解生物技术药物的开发与应用
 - a、生物药物与生物技术药物
 - b、生物技术药物的主要品种类型
 - c、生物技术药物
- 3) 了解生物技术药物的一般性质
 - a、生物技术药物的化学稳定性
 - b、生物技术药物的物理稳定性
- 4) 了解单克隆抗体技术
 - a、免疫球蛋白
 - b、单克隆抗体制备技术原理
 - c、单克隆抗体的主要医药用途
- 5) 了解生物技术与新药研究
 - a、生物技术与合理药物设计
 - b、建立新的药理模型和实验方法
 - c、反义药物
 - d、基因治疗
 - e、药物基因组学和药物蛋白质组学

四、考试要求

试卷务必书写清楚、符号和西文字母运用得当。答案必须写在答题纸上，写在试题纸上无效。