

课程名称：药物合成

一、课程编码：1000032

课内学时：32 学分：2

二、适用学科专业：药物化学、有机化学,应用化学,精细化工专业

三、先修课程：有机化学、高等有机化学、药物设计学

四、教学目标：

通过本课程的学习,使专业硕士研究生初步了解药物合成路线的设计和合成控制策略,了解药物合成方法的新进展,同时掌握一些常见重要药物及药物中间体的合成方法及技巧,提升学生从事有机合成或药物合成的能力。

五、教学方式：

多媒体与板书相结合进行课堂讲授,穿插上习题课,学生参与课堂讨论。

六、主要内容及学时分配

- | | |
|------------------------|-------|
| 1. 绪论 | 2 学时 |
| 1.1 药物合成的作用及发展 | |
| 1.2 合成方法分类 | |
| 1.3 合成研究途径 | |
| 1.4 如何学习药物合成 | |
| 2. 药物合成设计基本原理 | 6 学时 |
| 2.1 合成设计的准备工作 | |
| 2.2 目标分子的考察 | |
| 2.3 逆合成分析法 | |
| 2.4 合成路线的选择与考察 | |
| 3. 合成控制方法与策略 | 6 学时 |
| 3.1 区域专一性控制-反应性差异的利用 | |
| 3.2 区域专一性控制-导向基及保护基的应用 | |
| 3.3 区域专一性控制-潜在官能团的应用 | |
| 4. 药物合成中常用的基本反应 | 10 学时 |
| 4.1 与药物分子骨架形成相关的反应 | |
| 4.2 药物分子中官能团的引入与转换 | |
| 4.3 有机药物化学结构的修饰 | |
| 5. 药物与中间体的合成 | 6 学时 |
| 5.1 含脂环及环状结构的药物 | |
| 5.2 含芳香基的药物 | |
| 5.3 甾体类药物 | |
| 5.4 与吗啡结构有关的药物 | |
| 5.5 β -内酰胺类抗生素 | |
| 5.6 多肽和多聚核苷酸的化学合成 | |
| 5.7 含杂环药物 | |
| 6. 药物合成方法新进展 | 2 学时 |
| 6.1 生物催化合成反应 | |
| 6.2 电化学合成反应在药物合成中的应用 | |
| 6.3 光化学反应在药物合成中的应用 | |

- 6.4 相转移催化反应在药物合成中的应用
- 6.5 组合化学
- 6.6 微波催化合成反应在药物合成中的应用

七、考核与成绩评定

成绩以百分制衡量。

成绩评定依据:平时作业成绩占 30%，期末笔试成绩占 70%。

八、参考书及学生必读参考资料

1. 姜凤超编著. 药物合成[M]. 北京: 化学工业出版社, 2008.
2. 闻韧. 药物合成反应(第二版)[M]. 北京: 化学工业出版社, 2003.
3. Boger DL. Modern Organic Synthesis[M]. La Jolla (USA): TSRI press, 1999.

九、大纲撰写人: 章军