



“十二五”普通高等教育本科国家级规划教材



普通高等教育“十一五”国家级规划教材



普通高等教育“十五”国家级规划教材

药物化学

第三版

Medicinal Chemistry

尤启冬 主编

彭司勋 主审



化学工业出版社

配套课件 免费索取



“十二五”普通高等教育本科国家级规划教材



普通高等教育“十一五”国家级规划教材



普通高等教育“十五”国家级规划教材

药物化学

第三版

尤启冬 主编

彭司勋 主审



化学工业出版社

·北京·

《药物化学》是教育部普通高等教育“十五”、“十一五”国家级规划教材和“十二五”普通高等教育本科国家级规划教材。

《药物化学》(第三版)删除了第二版中相对比较陈旧的内容,增加一些现代药物化学的新知识点,尤其是近年来新的学科知识,同时对原有的章节进行适当的调整,不仅保留了药物化学课程中各类药物的具体内容,更重要的是,通过前四章内容系统介绍了药物的化学结构所反映的理化性质、结构特征、药物代谢特点与药物活性的关系,即近年来学术界和产业界公认的“构-性关系”、“构-效关系”和“构-代关系”,这是药物的化学本质,也是药物化学的核心所在。

《药物化学》(第三版)以新药研究与开发为主线,结合新药设计、发现和发展过程,介绍新药研究中所使用的方法、原理;介绍各类药物的结构类型、理化性质、构效关系、变化规律以及主要合成路线;并将经典的药物设计方法、QSAR研究与计算机辅助药物设计结合在一起讲解。

《药物化学》(第三版)可供药学类各专业、制药工程专业本科生作为专业课教材使用,也可供相关科研人员学习参考。

图书在版编目(CIP)数据

药物化学/尤启冬主编. —3版. —北京:化学工业出版社, 2015. 10

“十二五”普通高等教育本科国家级规划教材

普通高等教育“十一五”国家级规划教材

普通高等教育“十五”国家级规划教材

ISBN 978-7-122-24850-3

I. ①药… II. ①尤… III. ①药物化学-高等学校-教材
IV. ①R914

中国版本图书馆CIP数据核字(2015)第180017号

责任编辑:宋林青 褚红喜
责任校对:吴静

装帧设计:关飞

出版发行:化学工业出版社(北京市东城区青年湖南街13号 邮政编码100011)

印装:三河市延风印装有限公司

787mm×1092mm 1/16 印张35 $\frac{1}{4}$ 字数890千字 2016年1月北京第3版第1次印刷

购书咨询:010-64518888(传真:010-64519686) 售后服务:010-64518899

网 址: <http://www.cip.com.cn>

凡购买本书,如有缺损质量问题,本社销售中心负责调换。

定 价: 55.00 元

版权所有 违者必究

《药物化学》(第三版)编写组

主编 尤启冬

主审 彭司勋

编写人员 (以姓氏笔画为序)

尤启冬 (中国药科大学)

邓卫平 (华东理工大学药学院)

叶德泳 (复旦大学药学院)

孙铁民 (沈阳药科大学)

周海兵 (武汉大学药学院)

胡永洲 (浙江大学药学院)

徐云根 (中国药科大学)

黄志纾 (中山大学药学院)

雷小平 (北京大学药学院)

序

随着人类进入 21 世纪，生命科学得到了快速发展，为保障人类健康起到了积极作用，生命科学丰硕的研究成果也促进了以新药的研究和开发为主要内容的药物化学学科的发展。此次“药物化学”教材的修订正是体现这样的一个主要精神。教材的编写中，以新药的设计、发现、发展过程为主线，展示给读者研究新药的思路和途径。

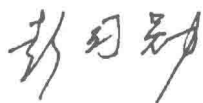
我于 20 世纪 50 年代与有关药学院校同仁编写了全国第一本药学专业药物化学教材，以后多次进行修订。由于科学技术进步，各次修订本的内容不断得到更新。该教材现已列入教育部普通高等教育“十五”规划教材，并由尤启冬教授担任主编，这一工作的延续将使教材的建设得到很好的发展。

此次修订章节有所调整，增添了不少新的内容，并吸取了国外最新出版的药物化学教材和参考书中新的知识，使教材更符合时代的要求。

教材在修订中，内容兼顾了药学类和制药工程类各专业的要求，各学校在使用时可以根据自己的需要，对各专业教学有所侧重。

教材的修订工作得到全国主要医药院校的药物化学教师的大力支持。这些教师都在教学和科研的第一线，有丰富的教学经验，为教材的修订作出了不懈努力。

希望各院校在教学实践中提出宝贵意见，以便再次修订和充实，使该教材的质量不断得到提高，更符合教学要求。



2003 年 10 月于南京

前 言

由尤启冬教授主编、彭司勋院士主审的《药物化学》教材已先后被列为普通高等教育“十五”、“十一五”国家级规划教材和“十二五”普通高等教育本科国家级规划教材，自发行以来受到各医药院校的广泛欢迎，也取得了喜人的成绩。中国药科大学和沈阳药科大学以该教材为基础开展课程建设，两校的“药物化学”课程先后被评为国家精品课程，2009年获得国家教学成果二等奖。

与第二版教材相比，第三版教材删除了第二版中相对比较陈旧的内容，增加一些现代药物化学的新知识点，尤其是近年来新的学科知识，同时对原有的章节进行了适当的调整。根据药物化学的最新发展，将第二版中第一章“新药研究与开发概论”的内容和“绪论”合并为“绪论”；将第二版中第三章“药物结构与生物活性”改为第一章名称不变，新增了药物化学结构、理化性质对药物成药性和生物活性的影响；将第二版中第四章“药物代谢”改为第二章，并改名为“药物结构与代谢”；将第二版中第二章“药物设计的基本原理和方法”改为第三章，将第二版中第三章的部分内容与其合并；将第二版中第十一章“组胺受体拮抗剂及抗过敏和抗溃疡药”改为两章分别为第十章“抗变态反应药物”和第十一章“消化系统药物”；删除了第二版中第二十三章“维生素”的内容。以上改动使教材内容更能反映学科发展的新需求。

修改后的教材，不仅保留了药物化学课程中各类药物的内容，更重要的是，通过修改后的第一章至第四章内容系统介绍了药物的化学结构所反映的理化性质、结构特征、药物代谢特点与药物活性的关系，即近年来学术界和产业界公认的“构-性关系”、“构-效关系”和“构-代关系”，这是药物的化学本质，也是药物化学的核心所在。

本版教材在编写过程中得到了国内八所高校长期从事药物化学教学和科研工作的教师的大力支持。沈阳药科大学孙铁民教授编写了第二章和第十二章；北京大学药学院雷小平教授编写了第四章和第五章；复旦大学药学院叶德泳教授编写了第九章、第十章、第十一章和第十三章；浙江大学药学院胡永洲教授编写了第六章和第八章；华东理工大学药学院邓卫平教授编写了第七章和第十八章；武汉大学药学院周海兵教授编写了第十六章和第十九章；中山大学药学院黄志纾教授编写了第十七章和第二十章；中国药科大学徐云根教授编写了第十四章和第十五章；中国药科大学尤启冬教授编写了绪论、第一章和第三章，并对全书进行修改和统稿。但限于业务水平和教学经验，教材不免仍有缺点、不足甚至疏漏之处，恳请广大读者和各院校在使用中提出宝贵意见。

为方便教学，本书有配套电子课件，使用本书作教材的院校可向出版社索取，songlq75@126.com。

尤启冬

2015年4月于南京

第一版前言

“药物化学”课程是药学类和制药工程类各专业的重要专业课程之一。教育部在对高等教育和专业设置调整基础上决定“十五”期间建设一批规划教材。本教材是在原有彭司勋院士主编的“药物化学”规划教材（1999年）基础上，进行重新修订的，并已被列为教育部普通高等教育“十五”规划教材。

教材编写过程中，充分听取了国内主要的教材使用单位的意见，参考并借鉴了最新出版的药物化学教材和参考书（如 Foye's Principles of Medicinal Chemistry, 2002 年第 5 版；Burger's Medicinal Chemistry & Drug Discovery, 2003 年第 6 版），保留了原有教材的部分特点，对原有章节和内容作了较大的调整，充实了一些新的知识，删除了一些较为陈旧的内容，使课程的知识体系更加合理。

随着科学技术的发展和学科的相互渗透，药物化学学科的研究内容已由原有的以化学为主的研究转变为以新药的寻找和发现为主要内容的体系。在修订教材中，突出新药研究与开发的主线，结合新药的设计、发现和发展过程，介绍新药研究过程中所使用的方法、原理，介绍各类药物的结构类型、理化性质、构效关系、变化规律以及主要合成路线。针对近年来手性药物研究和发展的趋势，在本教材中增加介绍手性药物的有关化学和生物活性的内容。由于药学类专业和制药工程类专业的人才培养目标不同，对药物化学知识的侧重点有所差别，因此教材的编写中考虑到这一点，在内容上有所兼顾。

教材在结构体系上作了较大的调整，新增了第二章新药研究与开发概况，旨在使学生对新药的研究和开发过程有一个基本的了解。在第三章药物设计的基本原理和方法中，将经典的药物设计原理和方法、QSAR 的研究及计算机辅助药物设计（CADD）结合在一起加以介绍。由于心血管系统药物近一二十年来发现较快，内容较多，为此作了一些调整：将与肾上腺素受体有关的激动剂和拮抗剂合并到第十一章作用于肾上腺素能受体药物中；将“抗高血压药物”和“利尿药”合并为“第十二章”；“第十三章”改为“心脏疾病用药和血脂调节药”。考虑到糖尿病和骨质疏松症的治疗药物发展较快，在“第十八章影响激素调控的药物”中增加了部分相关的内容。

教材在编写过程中得到国内六所高校长期从事药物化学教学和科研的教师的大力支持。北京大学药学院雷小平编写了第三、六、七章和第九章的部分内容；上海复旦大学药学院叶德泳编写了第十、十一和十四章；四川大学华西药学院徐正编写了第四、十九、二十章和第九章的部分内容；沈阳药科大学孙铁民编写了第十二、十三、十五、十七章；华东理工大学虞心红编写了第八、十六章及第九章的部分内容；中国药科大学陈建华编写了第二十一章；中国药科大学尤启冬编写了第一、二、五、十八章内容，并对全书的稿件进行了修改和统稿。但限于业务水平和教学经验，教材不免仍有缺点、不足甚至疏漏之处，恳请广大读者和各院校在使用中提出宝贵意见以供再次修改。

特别要感谢的是中国药科大学的彭司勋院士对药物化学教材的建设和编写所付出的心

血。正是由于彭先生及许多老师们的长期积累才使本教材的改编有了良好的基础。在这次教材的编写中，彭先生担任主审，为本教材的编写提出了不少建议和意见。

在编写过程中，研究生苏红、曹鑫、祝丽萍、黄莉等为本教材稿件的汇总、整理和订正做了不少工作，在此表示感谢。

尤启冬

2003年10月于南京

第二版前言

由尤启冬教授主编、彭司勋院士主审的普通高等教育“十五”国家级规划教材《药物化学》自发行以来，受到各医药院校的广泛欢迎。以该教材为基础的药物化学课程的建设也取得了喜人的成绩，中国药科大学和沈阳药科大学的两门“药物化学”课程被评为国家精品课程，该教材2005年被江苏省教育厅评为“江苏省精品教材”，2007年被中国石油和化学工业协会评为“中国石油和化学工业优秀教材一等奖”。该教材此次再度被列为普通高等教育“十一五”国家级规划教材，仍由尤启冬教授主编、彭司勋院士主审。

与第一版教材相比，第二版教材删除了相对比较陈旧的内容，增加了一些现代药物化学的新知识点，尤其是近年来新药研究与发现的例子。

第二版教材对结构框架进行了适当的调整和改变，新增加了一些章节，如第三章（药物的结构与生物活性）、第七章（神经退行性疾病治疗药物）、第十六章（降血糖药物和骨质疏松治疗药物）、第十八章（抗病毒药）。第一版“麻醉药”一章中“全身麻醉药”一节删除，改为第九章（局部麻醉药）。

本教材在编写过程中得到了国内六所高校长期从事药物化学教学和科研的教师的大力支持。北京大学药学院雷小平教授编写了第二、三、五和六章；复旦大学药学院叶德泳教授编写了第十、十一和十二章；浙江大学药学院胡永洲教授编写了第七、二十一和二十二章；四川大学华西药学院徐正教授编写了第四、十五、十六和二十三章；沈阳药科大学孙铁民教授编写了第十三、十四和十七章；中国药科大学徐云根教授编写了第八和十九章；中国药科大学尤启冬教授编写了绪论和第一、九、十八、二十章，并对全书进行了修改和统稿。但限于业务水平和教学经验，教材中仍不免存在缺点、不足甚至疏漏之处，恳请广大读者和各院校在使用中提出宝贵意见。

在本教材编写过程中，研究生傅榕赓、汪小润、杨倩等为稿件的录入整理做了不少工作，在此表示感谢。

与本书配套的电子教案已制作完毕，为方便教师的教学，使用本书作教材的院校可向作者或出版社索取，songlq75@126.com。

编者

2008年4月于南京

目 录

绪论 (Introduction) / 1

一、药物化学的研究内容和任务 (the Scopes and Purpose of Medicinal Chemistry)	1
二、药物化学的研究和发展 (Research and Development of Medicinal Chemistry)	2
三、我国药物化学的发展 (Achievements of PRC in Medicinal Chemistry)	5
四、新药研究与开发的过程和方法 (Process and Methods of New Drug Research and Development)	6
选读文献	9

第一章 药物结构与生物活性 (Structure-Activity Relationships of Drugs) / 10

第一节 药物理化性质对药物活性的影响 (Affection of Physical and Chemical Properties of Drugs on Pharmacologic Activity)	11
一、药物结构与理化性质 (Chemical Structure and Physico-Chemical Properties of Drugs)	11
二、药物的亲脂性和药物活性 (Lipophilic Properties and Pharmacological Activities of Drugs)	12
三、药物的 pK_a 和药物活性 (pK_a and Pharmacological Activities of Drugs)	13
四、药物溶解度与药物活性 (Solubility and Pharmacological Activities of Drugs)	14
五、药物结构与药物透膜性 (Chemical Structure and Permeability of Drugs)	17
第二节 药物的结构对药物活性的影响 (Affection of Drug Structure on Pharmacological Activities)	18
一、药物与受体的键合作用 (Binding of Drugs on Receptor)	19
二、药物的各官能团对药效的影响 (Affection of Functional Groups of Drugs on Pharmacological Activities)	20
三、药物电荷分布对药效的影响 (Affection of Charge Distribution of Drugs on Pharmacological Activities)	22
四、药物的立体异构体对药效的影响 (Affection of Stereoisomers of Drugs on Pharmacological Activities)	22
第三节 药物结构对药物转运的影响 (Affection of Drug Structure on Transportation)	25
一、药物化学结构对膜转运的影响 (Affection of Drug Structure on Membrane Transportation)	25
二、药物化学结构对血脑屏障透过性的影响 (Affection of Drug Structure on Blood-Brain Barrier Penetration)	27
第四节 药物结构对药物毒副作用的影响 (Affection of Drug Structure on Side Effects and Toxicities)	28
一、药物对细胞色素 P450 的作用 (Action of Drugs on Cytochrome P450)	28
二、药物对心脏快速延迟整流钾离子通道 (hERG) 的影响 (Affection of Drugs on hERG)	29
选读文献	32

第一节 官能团化反应 (Functionalization Reactions)	33
一、氧化反应 (Oxidation)	34
二、还原反应 (Reduction)	42
三、水解反应 (Hydrolysis)	42
第二节 结合反应 (Conjugation Reactions)	43
一、葡萄糖醛酸结合 (Glucuronic Acid Conjugation)	44
二、硫酸结合 (Sulfate Conjugation)	45
三、氨基酸结合 (Conjugation with Amino Acids)	46
四、谷胱甘肽或巯基尿酸结合 (Glutathione or Mercapturic Acid Conjugation)	47
五、乙酰化结合 (Acetylation)	49
六、甲基化结合 (Methylation)	50
第三节 药物代谢研究在药物开发中的应用 (Application of Drug Metabolism Research in Drug Development)	51
选读文献	54

第一节 先导化合物发现的方法和途径 (Approaches for Lead Discovery)	55
一、从天然产物活性成分中发现先导化合物 (From Bioactive Component of Natural Resources)	56
二、通过从分子生物学途径发现先导化合物 (From Molecular Biology Research)	58
三、通过随机机遇发现先导化合物 (From Accidental Discovery)	59
四、从代谢产物中发现先导化合物 (From Metabolites)	60
五、通过从临床药物的副作用或者老药新用途中发现新药 (From Side-Effect or New Purpose of Medicine)	60
六、从药物合成的中间体中发现先导化合物 (From Synthetic Intermediates)	61
七、通过计算机辅助药物筛选寻找先导化合物 (By Screening of Compound Databases)	62
八、通过其他的方法得到先导化合物 (Other Methods)	63
第二节 先导化合物的优化 (Lead Optimization)	64
一、烷基链或环的结构改造 (Alterations of Compound with Alkyl or Ring)	64
二、生物电子等排 (Bioisosteres)	66
三、前药原理 (Prodrug Principle)	70
四、软药 (Soft Drug)	74
五、硬药 (Hard Drug)	74
六、孪药 (Twin Drug)	75
第三节 定量构效关系 (Quantitative Structure-Activity Relationships)	76
一、疏水性参数 (Lipophilicity Parameters)	77
二、电性参数 (Electronic Parameters)	78
三、立体参数 (Steric Parameters)	78
四、Hansch 方法在药物设计中的应用 (Hansch Method Using on Drug Design)	78
第四节 计算机辅助药物设计 (Computer-Aided Drug Design)	80
一、基于受体结构的药物设计 (Receptor-Structure-Based Drug Design)	80
二、基于小分子的药物设计 (Molecular-Based Drug Design)	82

第四章 镇静催眠药和抗癫痫药 (Sedative-Hypnotics and Antiepileptics) / 86

第一节 镇静催眠药 (Sedative-Hypnotics)	86
一、镇静催眠药的发展及分类 (Development and Classification of Sedative-Hypnotics)	86
二、镇静催眠药的作用靶标及作用机制 (Target and Mechanism of Action)	87
三、苯二氮草类催眠镇静药 (Sedative-Hypnotics of Benzodiazepines)	89
四、非苯二氮草类 GABA _A 受体激动剂 (Nonbenzodiazepine GABA _A Agonists)	96
五、褪黑素受体激动剂 (Melatonin Receptor Agonists)	98
第二节 抗癫痫药 (Antiepileptics)	99
一、巴比妥类药物 (Barbiturates)	100
二、巴比妥类的同型药物 (Homotypical Drugs of Barbiturates)	103
三、二苯并氮杂草类 (Dibenzoazepines)	105
四、GABA 类似物 (Analogues of GABA)	106
五、脂肪酸类 (Carboxylic Acids)	107
六、其他结构类药物 (Other Drugs)	107
选读文献	108

第五章 精神神经疾病治疗药 (Psychotherapeutic Drug) / 109

第一节 经典的抗精神病药 (Classical Antipsychotic Drugs)	109
一、吩噻嗪类 (Phenothiazines)	109
二、硫杂蒯类 (Thioxanthenes)	115
三、丁酰苯类及其类似物 (Butyrophenones and Analogues)	117
四、苯甲酰胺类 (Benzamides)	119
五、二苯二氮草类及其衍生物 (Dibenzodiazepines and Derivatives)	120
第二节 非经典的抗精神病药物 (Atypical Antipsychotic Drugs)	121
一、非经典的抗精神病药物的作用机制 (The Mechanism of Atypical antipsychotic drugs)	121
二、非经典的抗精神病药物 (Atypical Antipsychotic Drugs)	122
第三节 抗抑郁药 (Antidepressive Drugs)	125
一、单胺氧化酶抑制剂 (Monoamine Oxidase Inhibitors, MAOIs)	126
二、去甲肾上腺素重摄取抑制剂 (Norepinephrine Reuptake Inhibitors)	127
三、选择性 5-羟色胺重摄取抑制剂 (Selective Serotonin Reuptake Inhibitors)	130
四、新发展的抗抑郁药 (New Antidepressant Drugs)	133
第四节 抗焦虑药和抗躁狂药 (Antianxiety Drugs and Antimanic Drugs)	136
一、抗焦虑药 (Antianxiety Drugs)	136
二、抗躁狂药 (Antimanic Drugs)	137
选读文献	137

第六章 神经退行性疾病治疗药物 (Drug for Neurodegeneration Disease) / 138

第一节 抗帕金森病药 (Anti-Parkinson's Disease Drugs)	138
一、抗帕金森病药物的作用机制 (Action Mechanism of Anti-Parkinson's Disease Drugs)	138

二、作用于多巴胺能神经系统的药物 (Agents on Dopaminergic Neural System)	139
三、NMDA 受体拮抗剂 (NMDA Receptor Antagonists)	144
四、腺苷 A _{2A} 受体抑制剂 (Adenosine A _{2A} Receptor Inhibitors)	144
五、作用于其他靶点的药物 (Agents on Other Targets)	145
第二节 抗阿尔茨海默病药物 (Anti-Alzheimer's Disease Drugs)	147
一、胆碱能系统改善药物 (Drugs of Improving Cholinergic System)	148
二、 β 、 γ -分泌酶抑制剂 (β 、 γ -Secretase Inhibitors)	152
三、Tau 蛋白抑制剂 (Tau Protein Inhibitors)	154
四、H ₃ 受体拮抗剂 (H ₃ Receptor Antagonists)	155
五、NMDA 受体拮抗剂 (NMDA Receptor Antagonists)	156
六、抗氧化药物 (Antioxidation Drugs)	156
选读文献	157

第七章 镇痛药 (Analgesics) / 158

第一节 吗啡及其衍生物 (Morphine and Its Derivatives)	158
第二节 合成镇痛药 (Synthetic Analgesics)	161
一、吗啡烃类及苯并吗喃类 (Morphinane and Benzomorphanes)	161
二、哌啶类 (Piperidines)	163
三、氨基酮类 (Aminoketones)	165
四、其他类 (Others)	167
第三节 阿片受体和阿片样物质 (Opiate Receptors and Opiate-Like Substances)	167
一、阿片受体及其晶体结构 (Opiate Receptors and Their Crystal Structures)	167
二、阿片样物质 (Opiate-Like Substances, OLS)	168
选读文献	170

第八章 非甾体抗炎药 (Nonsteroidal Antiinflammatory Drugs) / 171

第一节 非甾体抗炎药的作用机制 (Mechanism of Action for NSAIDs)	171
一、花生四烯酸代谢途径和炎症介质 (Metabolism of Arachidonic Acid and Inflammatory Mediator)	171
二、非甾体抗炎药的作用靶点 (Target of NSAIDs)	173
第二节 解热镇痛药 (Antipyretic Analgesics)	174
一、苯胺类 (Anilines)	174
二、水杨酸类 (Salicylic Acids)	176
三、吡唑酮类 (Pyrazolones)	178
第三节 非甾体抗炎药 (Nonsteroidal Antiinflammatory Drugs)	179
一、非选择性的非甾体抗炎药 (Nonselective NSAIDs)	179
二、选择性环氧合酶-2 抑制剂 (Selective Cyclooxygenase-2 Inhibitors, COX-2 抑制剂)	190
第四节 痛风治疗药 (Agents Used to Treat Gout)	195
一、抑制尿酸生成的药物 (Drugs that Decrease Uric Acid Formation)	195
二、促进尿酸排泄药物 (Drugs that Increase Uric Acid Secretion)	197
三、急性痛风期治疗药物 (Drugs for Acute Gout Treatment)	197
选读文献	198

第九章 拟胆碱和抗胆碱药物 (Cholinergic Agents and Anticholinergic Agents) / 199

第一节 拟胆碱药 (Cholinergic Agents)	201
一、胆碱受体激动剂 (Cholinoceptor Agonists)	201
二、胆碱受体激动剂的构效关系 (Structure-Activity Relationships of Cholinoceptor Agonists)	203
三、乙酰胆碱酯酶抑制剂 (Acetylcholinesterase Inhibitors)	204
四、有机磷酸酯的抗胆碱酯酶作用和胆碱酯酶复能药 (Cholinesterase Inhibition of Organophosphates and Cholinesterase Reactivator)	207
第二节 抗胆碱药 (Anticholinergic Agents)	208
一、颠茄生物碱类抗胆碱药 (Belladonna Alkaloids Anticholinergic Agents)	209
二、合成抗胆碱药 (Synthetic Anticholinergic Agents)	211
三、M 胆碱受体拮抗剂的构效关系 (Structure-Activity Relationships of Muscarinic Antagonists)	214
四、N 胆碱受体拮抗剂 (Nicotinic Antagonists)	214
选读文献	220

第十章 抗变态反应药物 (Antiallergic Agents) / 221

第一节 组胺 H ₁ 受体拮抗剂和抗变态反应药物 (Histamine H ₁ -Receptor Antagonists and Related Antiallergic Agents)	222
一、经典的 H ₁ 受体拮抗剂 (Classical H ₁ -Receptor Antagonists)	222
二、非镇静 H ₁ 受体拮抗剂 (Nonsedative H ₁ -Receptor Antagonists)	226
三、组胺 H ₁ 受体拮抗剂的构效关系 (Structure-Activity Relationships of Histamine H ₁ -Receptor Antagonists)	231
第二节 过敏介质与抗变态反应药物 (Allergic Mediators and Antiallergic Agents)	231
一、过敏介质释放抑制剂 (Inhibitors of Allergic Mediator Release)	232
二、过敏介质拮抗剂 (Allergic Mediator Antagonists)	232
三、钙通道阻滞剂 (Calcium Channel Blockers)	233
选读文献	233

第十一章 消化系统药物 (Digestive System Agents) / 234

第一节 抗溃疡药物 (Antiulcer Agents)	234
一、H ₂ 受体拮抗剂抗溃疡药物 (H ₂ -Receptor Antagonists as Antiulcer Agents)	234
二、质子泵抑制剂 (Proton Pump Inhibitors)	242
第二节 胃动力药和止吐药 (Prokinetic Drugs and Antiemetic Drugs)	247
一、胃动力药 (Prokinetic Drugs)	247
二、止吐药 (Antiemetic Drugs)	251
选读文献	256

第十二章 降血糖药物和骨质疏松治疗药物 (Hypoglycemic Drugs and Drugs Used to Treat Osteoporosis) / 257

第一节 降血糖药物 (Hypoglycemic Drugs)	257
一、胰岛素及其类似物 (Insulin and Its Analogs)	257

二、胰岛素分泌促进剂 (Promoter to Insulin Secretion)	260
三、胰岛素增敏剂 (Insulin Enhancers)	266
四、 α -葡萄糖苷酶抑制剂 (α -Glucosidase Inhibitors)	270
五、二肽基肽酶-4 抑制剂 (Dipeptidyl Peptidase-4 Inhibitors)	271
六、钠-葡萄糖协同转运蛋白 2 抑制剂 (Sodium-Glucose Co-transporter 2 Inhibitors)	275
第二节 骨质疏松治疗药物 (Drug Therapies Used to Treat Osteoporosis)	276
一、激素及相关药物 (Hormones and Related Agents)	276
二、双膦酸类药物 (Bisphosphonates)	279
选读文献	282

第十三章 作用于肾上腺素能受体的药物 (Drugs Affecting Adrenergic Receptor) / 283

第一节 拟肾上腺素药物 (Adrenergic Agents)	285
一、拟肾上腺素药物 (Adrenergic Agents)	286
二、 α 受体激动剂 (α Adrenoceptor Agonists)	288
三、选择性 β 受体激动剂 (Selective β Adrenoceptor Agonists)	291
四、肾上腺素受体激动剂的构效关系 (Structure-Activity Relationships of Adrenergic Receptor Agonists)	294
五、 β_3 受体激动剂 (β_3 Adrenoceptor Agonist)	296
第二节 抗肾上腺素药 (Adrenergic Antagonists)	296
一、 α 受体拮抗剂 (α Adrenergic Antagonists)	296
二、 β 受体拮抗剂 (β Adrenergic Antagonists)	299
三、对 α 和 β 受体都有拮抗作用的药物 (Mixed α/β -Adrenergic Antagonists)	305
选读文献	306

第十四章 抗高血压药物和利尿药 (Antihypertensive Agents and Diuretics) / 307

第一节 抗高血压药物 (Antihypertensive Agents)	308
一、交感神经药物 (Drugs Acting on the Sympathetic Nervous System)	308
二、血管扩张药物 (Vasodilators)	309
三、影响肾素-血管紧张素-醛固酮系统的药物 (Drugs Acting on the Renin-Angiotensin-Aldosterone System)	311
四、钙离子通道阻滞剂 (Calcium Channel Blockers)	323
第二节 利尿药 (Diuretics)	332
一、碳酸酐酶抑制剂 (Carbonic Anhydrase Inhibitors)	332
二、 Na^+ - Cl^- 协转运抑制剂 (Na^+ - Cl^- Cotransport Inhibitors)	332
三、 Na^+ - K^+ - 2Cl^- 协转运抑制剂 (Na^+ - K^+ - 2Cl^- Cotransport Inhibitors)	335
四、阻断肾小管上皮 Na^+ 通道药物 (Blocking Agents of Renal Tubule Epithelium Sodium Channels)	336
五、盐皮质激素受体拮抗剂 (Mineralocorticoid Receptor Antagonists)	336
选读文献	338

第十五章 心脏疾病药物和血脂调节药 (Drug Affecting the Cardiac Disease and Plasma Lipids Regulators) / 339

第一节 强心药物 (Cardiac Agents)	339
一、强心苷类 (Cardiac Glycosides)	339
二、 β 受体激动剂类 (β Adrenergic Agonists)	341
三、磷酸二酯酶抑制剂 (Phosphodiesterase Inhibitors)	342
四、钙增敏剂 (Calcium Sensitizer)	343
第二节 抗心律失常药物 (Antiarrhythmic Drugs)	343
一、抗心律失常药物的作用机制 (Action Mechanism of Antiarrhythmic Drugs)	344
二、抗心律失常药的分类 (Classification of Antiarrhythmic Drugs)	344
第三节 抗心绞痛药物 (Antianginal Drugs)	350
一、硝酸酯及亚硝酸酯类 (Nitrates and Nitrites)	350
二、部分脂肪酸氧化 (Partial Fatty Acid Oxidation, pFOX) 抑制剂	353
第四节 血脂调节药 (Plasma Lipids Regulators)	354
一、血脂的化学和生物化学 (Chemistry and Biochemistry of Plasma Lipids)	354
二、血脂调节药物 (Plasma Lipids Regulators Drugs)	356
选读文献	365

第十六章 甾体激素药物 (Steroid Hormone Drugs) / 366

第一节 雌激素及雌激素受体调控剂 (Estrogens and Estrogen Receptor Regulators)	369
一、甾体雌激素 (Steroidal Estrogens)	369
二、非甾体雌性激素 (Nonsteroidal Estrogens)	371
三、雌激素受体调控剂 (Estrogen Receptor Regulators)	372
第二节 雄性激素、同化激素和抗雄性激素 (Androgens, Anabolic Hormones and Androgen Antagonists)	376
一、雄性激素 (Androgens)	376
二、同化激素 (Anabolic Steroids)	377
三、抗雄性激素药物 (Androgen Antagonists)	379
第三节 孕激素和抗孕激素 (Progestogens and Antiprogestogens)	380
一、孕酮类孕激素 (Progesterone and Its Derivatives)	380
二、19-去甲睾酮类孕激素 (19-Norandrostanes)	382
三、抗孕激素 (Antiprogestogens)	385
第四节 肾上腺皮质激素 (Adrenocorticoid Hormones)	387
一、肾上腺皮质激素的构效关系 (Structure-Activity Relationship of Adrenocorticoids)	388
二、代表药物 (Classical Adrenocorticoids)	390
选读文献	391

第十七章 抗生素 (Antibiotics) / 392

第一节 β -内酰胺类抗生素 (β -Lactam Antibiotics)	393
一、 β -内酰胺类抗生素的结构特点、作用机制及耐药性 (Structural Characteristics, Mechanism of Action and Bacterial Resistance)	393

二、青霉素类 (Penicillins)	396
三、头孢菌素类 (Cephalosporins)	403
四、其他 β -内酰胺类抗生素 (Other β -Lactam Antibiotics)	409
五、 β -内酰胺酶抑制剂 (β -Lactamase Inhibitors)	410
第二节 四环素类抗生素 (Tetracycline Antibiotics)	413
一、四环素类抗生素的结构特点、作用机制及耐药性 (Structural Characteristics、Mechanism of Action and Bacterial Resistance)	413
二、四环素和盐酸多西环素 (Tetracycline and Doxycycline Hydrochloride)	414
第三节 氨基糖苷类抗生素 (Aminoglycoside Antibiotics)	416
一、氨基糖苷类抗生素的结构特点、作用机制及耐药性 (Structural Characteristics、Mechanism of Action and Bacterial Resistance)	417
二、链霉素 (Streptomycin)	417
三、卡那霉素及其衍生物 (Kanamycin and Its Derivatives)	418
四、庆大霉素及其衍生物 (Gentamicin and Its Derivatives)	419
五、新霉素类 (Neomycins)	421
第四节 大环内酯类抗生素 (Macrolide Antibiotics)	422
一、大环内酯类抗生素的结构特点、作用机制及耐药性 (Structural Characteristics、Mechanism of Action and Bacterial Resistance)	422
二、红霉素及其衍生物 (Erythromycin and Its Derivatives)	423
三、麦迪霉素及其衍生物 (Midecamycins and Its Derivatives)	428
四、螺旋霉素及衍生物 (Spiramycins and Its Derivatives)	428
第五节 其他抗生素 (Miscellaneous Antibiotics)	429
一、万古霉素及其他抑制细菌细胞壁生物合成的药物 (Vancomycin and Other Drugs Inhibiting on Biosynthesis of Bacterial Cell Wall)	429
二、氯霉素及其衍生物 (Chloramphenicol and Its Derivatives)	431
三、林可霉素及其衍生物 (Lincomycins and Its Derivatives)	433
四、磷霉素 (Fosfomycin)	434
选读文献	434

第十八章 合成抗菌药 (Synthetic Antibacterial Agents) / 435

第一节 合成抗菌药 (Synthetic Antibacterial Agents)	435
一、磺胺类抗菌药物及抗菌增效剂 (Sulfonamides and Antibacterial Synergists)	435
二、喹诺酮类抗菌药 (Antimicrobial Agents of Quinolones)	440
三、噁唑烷酮类抗菌药 (Antibacterial Agents of Oxazolidinones)	447
第二节 抗结核药物 (Tuberculostatics)	449
一、合成抗结核药物 (Synthetic Antitubercular Agents)	449
二、抗结核抗生素 (Antitubercular Antibiotics)	453
第三节 合成抗真菌药 (Synthetic Antifungal Agents)	456
一、作用于真菌膜上麦角甾醇的药物 (Agents on Ergosterol of Fungi Membrane)	457
二、唑类抗真菌药物 (Azole Antifungal Agents)	458
三、角鲨烯环氧化酶抑制剂 (Squalene Epoxidase Inhibitors)	460
四、其他药物 (Other Drugs)	462
选读文献	462