



“十二五”江苏省高等学校重点教材

(编号: 2014-1-110)

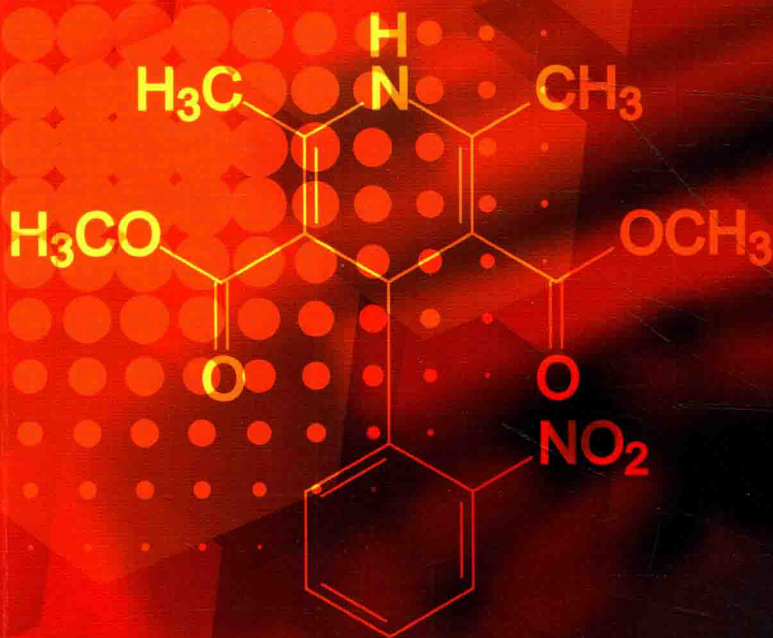
获中国石油和化学工业优秀教材奖

药物化学

第二版

杨友田 於学良 主 编

邵顺章 副主编



YAOWU
HUAXUE



化学工业出版社



“十二五”江苏省高等学校重点教材（编号：2014-1-110）

获中国石油和化学工业优秀教材奖

药物化学

第二版

杨友田 於学良 主 编
邵顺章 副主编



化学工业出版社

· 北京 ·

本书分理论和实训两部分。理论部分为绪论和各论共十章，重点以药物的化学结构为主线，介绍典型药物制备方法、理化性质、鉴别原理、化学稳定性、构效关系、体内代谢及临床应用等；实训部分有药物化学实训基本知识、药物制备及鉴别、药物变质反应实训等。

本书及时增补 2015 年版《中国药典》收载品种及国内外近年上市的新药，章末附有模拟范题；本书可供高职高专药学类各专业使用，可作为药学类毕业生应聘考试、职称考试及执业药师资格考试等参考用书，也可作为医药从业人员培训和自学用书。

图书在版编目 (CIP) 数据

药物化学/杨友田, 於学良主编. —2 版. —北京: 化学工业出版社, 2016. 5

“十二五”江苏省高等学校重点教材

ISBN 978-7-122-26580-7

I. ①药… II. ①杨… ②於… III. ①药物化学-高等职业教育-教材 IV. ①R914

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2016) 第 057406 号

责任编辑: 旷英姿

文字编辑: 李 瑾

责任校对: 宋 玮

装帧设计: 史利平

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 刷: 北京永鑫印刷有限责任公司

装 订: 三河市宇新装订厂

787mm×1092mm 1/16 印张 17 $\frac{1}{2}$ 字数 416 千字 2016 年 7 月北京第 2 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: 36.00 元

版权所有 违者必究

编写人员

主 编 杨友田 於学良

副主编 邵顺章

编 者 (以姓名笔画为序)

杨友田 (盐城卫生职业技术学院)

邵顺章 (盐城市药品检验所)

周振华 (永州职业技术学院)

於学良 (苏州卫生职业技术学院)

单静静 (江苏联合职业技术学院南通卫生分院)

孟 姝 (盐城卫生职业技术学院)

钟 嫻 (江苏建康职业学院)

曹立群 (常德职业技术学院)

薛 璟 (苏州卫生职业技术学院)

前言

Preface

《药物化学》第一版，被列为2014年江苏省高等学校重点教材建设项目[修订教材；苏教高(2014)11号]。

《药物化学》第二版是在总结第一版的经验、汲取近期出版的多种药物化学教科书优点及紧扣《中华人民共和国药典》(2015年版)等基础上编写完成的新版本。

《药物化学》第二版编写过程中，对照教育部普通高等学校高等职业教育(专科)专业目录(2015年)中医药卫生大类、药品制造类及食品药品管理类等专业设置，对应职业类别及相应接续本科专业，把握技术技能型人才培养目标，兼顾续接本科需求，力图体现教材科学性、合理性、实用性和前瞻性。

《药物化学》第二版编写期间，适逢《中华人民共和国药典》(2015年版)出版发行和正式实施，编写时做到教材与药典内容同步，将现行版药典中左奥硝唑、多潘立酮等大量新增品种及时纳入教材，将2010年版药典收载而2015年版药典未收载品种，如安乃近原料及片剂、酮康唑片剂和胶囊剂等一律予以删除并作更新说明。

《药物化学》第二版继续保持第一版教材紧跟市场脉搏、彰显时代气息的特色，增加了十八元环大环内酯类抗生素、唑啉烷酮类抗生素、二肽基肽酶-4抑制剂和钠-葡萄糖协同转运蛋白2抑制剂口服降血糖药等新颖内容，编录了喹诺酮类药物非那沙星、合成抗结核药迪拉马尼及抗真菌药艾沙康唑等2014年和2015年间国外上市的新药。为方便教学，本书配有电子课件。

《药物化学》第二版秉承兼顾学生目标自测和与执业药师资格考试接轨的风格，配有众多模拟习题，并对第一版部分题目进行了增减和优化。

《药物化学》第二版仍由原先国内6所医药卫生类高职高专兄弟院校老师参加编写，邀请盐城市药品检验所邰顺章同志担任副主编，中国药科大学尤启冬教授担纲主审，盐城市第一人民医院王庆光主任药师对教材中临床常用药物的选取及典型药物的筛选提出了诸多宝贵意见，在此对他们的大力支持致以由衷感谢！

《药物化学》第二版在编写过程中虽然各位编者勤奋努力、精耕细作，但限于业务水平和教学经验，书中疏漏之处在所难免，主编热忱欢迎广大读者赐教指正。

杨友田 於学良

2016年3月

第一版前言

Preface

为进一步落实《教育部关于全面提高高等职业教育教学质量的若干意见》文件精神，细化《高等职业学校专业教学标准》，更新课程内容，提高人才培养的针对性和适用性，加之《中华人民共和国药典》（2010年版）实施启用和药物更新较快等特点，本书的编写工作由此应运而生。

本教材编写紧扣药物化学结构这一主线，继而剖析药物结构与化学药物性质、药物发生变质反应、药典中的化学鉴别方法、药品贮存与养护、药品剂型选择、药物代谢反应及通过结构修饰寻找新药等之间的内在关系。在编写过程中，着力以培养职业能力为主线构建教材体系，遵循人才成长规律，针对药学行业自身特点，对接职业资格标准和“双证书”推进要求，结合生产过程，设计工作任务；注重以未来工作岗位实际为导向构建教材内容，理论部分模拟药品流通领域和使用单位按照人体解剖系统或药品临床用途进行分类方法组建教材章节，实训部分模拟制药企业药物合成的工作任务或流通及使用单位药品贮存养护的工作场景设计教学内容，剔除验证性实验。此外，及时收录2010年版药典增补品种和国内外近年上市新药，彰显时代气息，章末配有较大题量的模拟范题和参考答案，便于学生学习目标自测及毕业生职称考试和执业药师资格考试等参考借鉴。

本教材分为理论和实训两部分。理论部分包括绪论和各论10章；实训部分主要有药物化学实训基本知识、药物制备及鉴别、药物变质反应实训及常用药物化学鉴别实训等。本教材适用于高职高专职业院校药学、药物制剂技术、药物分析技术、生物制药技术、药品经营与管理等专业，亦可作为各级各类用人单位招聘考试、药品类专业技术职称考试及全国执业药师资格考试等应试复习的参考用书。为方便教学，本书还配有电子教案。

本教材由国内6所医药卫生类高职高专兄弟院校老师参加编写，邀请行业一线老师邵顺章同志担任副主编，中国药科大学尤启冬教授欣然担纲主审，并对教材体系和全书审校工作提出了诸多宝贵意见，在此由衷深致谢意！本教材在全体编审人员共同努力下，虽然几经修稿，但仍存有不足或疏漏，恳请各位同仁和广大读者予以指正和赐教，以便进一步修订。

杨友田 於学良

2013年5月

◎ 绪论

1

- 一、药物化学课程定位及任务 1
- 二、药物质量 2
- 三、药物名称 3

◎ 第一章 中枢神经系统药物

4

- 第一节 镇静催眠药 4
 - 一、苯二氮草类 4
 - 二、巴比妥类 6
 - 三、其他类 7
- 第二节 抗癫痫药 8
 - 一、乙内酰脲类 8
 - 二、二苯并氮草类 9
 - 三、其他类 9
- 第三节 抗精神失常药 10
 - 一、抗精神病药 10
 - 二、抗抑郁药 12
- 第四节 镇痛药 14
 - 一、吗啡及其半合成衍生物 14
 - 二、合成镇痛药 16
 - 三、构效关系 20
- 第五节 全身麻醉药 20
 - 一、吸入性麻醉药 20
 - 二、静脉麻醉药 21
- 第六节 中枢兴奋药 22
 - 一、黄嘌呤类 22
 - 二、酰胺类 24
- 第七节 解热镇痛药 25
 - 一、水杨酸类 25
 - 二、苯胺类 27
 - 三、吡唑酮类 28

第八节 非甾体抗炎药	29
一、3,5-吡唑烷二酮类	29
二、邻氨基苯甲酸类	29
三、1,2-苯并噻嗪类	30
四、芳基烷酸类	31
本章模拟范题	34
参考答案	37

◎ 第二章 外周神经系统药物

38

第一节 拟胆碱药	38
一、胆碱受体激动剂	39
二、抗胆碱酯酶药	40
第二节 抗胆碱药	42
一、M 胆碱受体拮抗剂	42
二、N 胆碱受体拮抗剂	44
第三节 拟肾上腺素药	47
一、儿茶酚胺类	47
二、非儿茶酚胺类	50
三、拟肾上腺素药构效关系	54
第四节 局部麻醉药	55
一、对氨基苯甲酸酯类	55
二、酰胺类	57
三、氨基酮类	58
第五节 组胺 H ₁ 受体拮抗剂	58
一、氨基醚类	59
二、乙二胺类	60
三、丙胺类	60
四、三环类	61
五、哌嗪类	63
六、哌啶类	63
本章模拟范题	64
参考答案	67

◎ 第三章 循环系统药物

68

第一节 血脂调节药	68
一、苯氧乙酸类	68
二、烟酸类	69
三、羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑制剂	69

第二节 抗心绞痛药	71
一、亚硝酸酯及硝酸酯类	71
二、钙通道阻滞剂	73
三、 β 受体阻滞剂	76
第三节 抗心律失常药	77
一、钠通道阻滞剂	77
二、延长动作电位时程药物	78
第四节 抗高血压药	80
一、作用于自主神经系统的药物	80
二、血管紧张素转化酶抑制剂	82
三、血管紧张素 II 受体拮抗剂	84
四、血管平滑肌扩张药	85
第五节 利尿药	85
一、多羟基化合物	86
二、含氮杂环类	86
三、 α, β -不饱和酮类	86
四、苯并噻嗪类及磺酰胺类	87
五、醛甾酮拮抗剂类	89
本章模拟范题	90
参考答案	93

◎ 第四章 消化系统药物

94

第一节 抗溃疡药	94
一、 H_2 受体拮抗剂	95
二、质子泵抑制剂	96
第二节 促动力药和止吐药	98
一、促动力药	98
二、止吐药	99
第三节 合成解痉药	101
一、叔胺类合成解痉药	101
二、季铵类合成解痉药	102
本章模拟范题	103
参考答案	106

◎ 第五章 内分泌系统药物

107

第一节 甾体激素类药物概述	107
第二节 雌激素及合成代用品	108
一、雌激素	108

二、合成代用品	109
三、构效关系	110
第三节 雄激素及蛋白同化激素	111
一、雄激素	111
二、构效关系	112
三、蛋白同化激素	112
第四节 孕激素类药物	114
一、孕酮类孕激素	114
二、甾酮类孕激素	116
三、甾体避孕药	116
第五节 肾上腺皮质激素	118
一、糖皮质激素	118
二、盐皮质激素	121
第六节 含氮激素类药物简介	121
第七节 胰岛素及口服降血糖药	123
一、胰岛素	123
二、口服降血糖药	124
本章模拟范题	129
参考答案	132

◎ 第六章 化学治疗药

133

第一节 喹诺酮类药物	133
一、喹诺酮类药物的发展	133
二、喹诺酮类药物的作用机制及构效关系	136
第二节 磺胺类药物及抗菌增效剂	137
一、磺胺类药物	137
二、抗菌增效剂	139
第三节 抗结核药	140
一、抗结核抗生素	140
二、合成抗结核药	142
第四节 抗真菌药	144
一、抗真菌抗生素	144
二、唑类合成抗真菌药	145
三、烯丙胺类抗真菌药	146
第五节 抗病毒药	146
一、核苷类抗病毒药	147
二、非核苷类抗病毒药	151
第六节 抗寄生虫病药	152
一、抗疟药	152

二、驱肠虫药	154
三、抗血吸虫病药	155
四、抗滴虫病药	156
第七节 抗肿瘤药	157
一、生物烷化剂	157
二、抗代谢抗肿瘤药	160
三、抗肿瘤植物药及抗肿瘤抗生素	163
四、金属铂配合物抗肿瘤药	166
本章模拟范题	167
参考答案	169

◎ 第七章 抗生素

170

第一节 β -内酰胺类抗生素	170
一、青霉素及半合成青霉素类	171
二、单环 β -内酰胺类	175
三、碳青霉烯类	175
四、 β -内酰胺酶抑制剂	177
五、头孢菌素类	177
第二节 氨基糖苷类抗生素	181
第三节 大环内酯类抗生素	184
一、十四元环大环内酯类抗生素	185
二、十五元环大环内酯类抗生素	187
三、十六元环大环内酯类抗生素	187
四、十八元环大环内酯类抗生素	188
第四节 四环素类抗生素	188
第五节 氯霉素及其衍生物	190
第六节 其他类抗生素	192
一、磷霉素	192
二、林可霉素及其衍生物	193
三、噁唑烷酮类抗生素	193
本章模拟范题	194
参考答案	196

◎ 第八章 维生素

197

第一节 脂溶性维生素	197
一、维生素 A	197
二、维生素 D	199
三、维生素 E	202

四、维生素 K	204
第二节 水溶性维生素	205
一、B 族维生素	205
二、维生素 C	209
本章模拟范题	211
参考答案	213

◎ 第九章 药物变质反应与药物代谢反应

214

第一节 药物变质反应	214
一、药物水解变质反应	214
二、药物自动氧化变质反应	218
三、药物其他变质反应	219
第二节 药物代谢反应	221
一、I 相代谢反应	221
二、II 相代谢反应	225
三、药物代谢与药物活性	229
本章模拟范题	230
参考答案	232

◎ 第十章 药物构效关系及新药研发简介

233

第一节 药物的构效关系	233
一、药物基本结构与药效关系	233
二、药物立体结构与药效关系	234
三、药物理化性质与药效关系	237
第二节 新药研发简介	238
一、新药研发的特点	238
二、先导化合物的发现	239
三、先导化合物优化的一般方法	240
本章模拟范题	243
参考答案	246

◎ 药物化学实训

247

第一部分 药物化学实训基本知识	247
第二部分 药物化学实训内容	252
实训一 阿司匹林制备及鉴别	252
实训二 对乙酰氨基酚制备及鉴别	253
实训三 贝诺酯制备及鉴别	254
实训四 维生素 K ₃ 制备	256

实训五	几种常用药物的化学鉴别实训（一）	258
实训六	几种常用药物的化学鉴别实训（二）	260
实训七	药物水解变质反应实训	262
实训八	药物氧化变质反应实训	264

绪论

药物 (drug) 通常系指能影响机体生理、生化和病理过程, 用于预防、诊断、治疗疾病及有目的地调节机体生理机能的一类物质。根据药物的来源和性质不同, 可将药物分为天然药物、化学药物和生物药物, 其中, 化学药物在临床应用中最为广泛, 也是药物化学研究的对象。所谓化学药物一般系指具有药物的功效且化学结构已经明确的单一物质, 包括无机药物、化学合成或生物合成得到的有机药物、从天然药物中提取的有效成分、通过发酵方法得到的抗生素或半合成抗生素等。

一、药物化学课程定位及任务

药物化学是研究化学药物的结构组成、制备方法、理化性质、构效关系、生物效应、体内代谢以及寻找新药等一门综合性课程。药物化学是建立在有机化学和分析化学等药用化学前修课程基础上, 并为药理学、药物制剂技术及药物分析技术等后续课程服务, 因此, 药物化学是在药学领域中起到承上启下作用的一门重要的专业基础课程。

药物化学的主要任务为: 一是为有效、合理应用临床现有化学药物提供理论基础, 即通过化学药物的结构、理化性质、化学稳定性、体内代谢及构效关系等知识的学习, 为药物的贮存养护、药物分析检验方法的确立、药物剂型的选择、不同药物之间配伍禁忌及合理用药、化学药物的结构修饰等提供必要的基本理论, 根据这一任务范畴形成的药物化学常称之为 Medicinal Chemistry; 二是为生产化学药物提供科学合理、技术先进、经济实用的方法和工艺, 即通过研究、设计和改进化学药物现有合成路线或工艺条件, 寻找和优化新原料、新试剂、新技术、新工艺及新方法, 提高药物产量和质量, 降低药物生产成本, 满足广大平民百姓用放心药、用得起药的医疗保健需求, 根据这一任务范畴形成的药物化学常称之为 Pharmaceutical Chemistry; 三是为创制和研发新药提供便捷的途径和新颖的方法, 即通过数学、化学、生物医学及计算机辅助设计 (computer aided design) 等学科理论知识的综合运用, 探究化学药物的结构和生物活性之间的关系, 寻找新药设计的途径和方法, 创制疗效好、毒副作用小的新药, 根据这一任务范畴形成的药物化学常称之为 Drug Discovery and Design。

根据技术技能型人才培养目标和未来职业岗位 (群) 需求, 高职高专药品类专业学生学习药物化学课程主要侧重于上述三大任务中的第一个任务, 即为有效、合理应用临床现有化学药物提供理论基础, 并夯实必要的实践操作技能。因此, 在学习药物化学整个过程中, 要始终把握药物的化学结构, 要以结构为中心, 以官能团为抓手, 由官能团剖析化学药物的制备方法、理化性质、化学稳定性、构效关系、体内代谢及结构修饰等。通过学习, 要求掌握药物的化学结构或结构特点、理化性质及化学稳定性、制备及贮存过程中可能发生的变质反应及预防措施等基础理论知识和操作技能; 熟悉药物的制备方法、构效关系、药物的生物活

性及体内代谢过程；了解先导化合物的发现及对其进行优化改造从而开发新药的基础知识。

二、药物质量

药物质量直接影响患者身体健康和生命安全。为了保证药物安全、有效，必须建立统一的药品标准。《中华人民共和国药典》(简称《中国药典》)为法定的国家药品标准，由国家食品药品监督管理局批准颁布实施，是药品在生产、检验、使用及贮存养护等方面必须共同遵循的法定依据，不符合药品质量标准规定的药物不得供应和使用，否则即为违法行为。

我国于1953年首次颁布《中国药典》第一版，1963年和1977年分别修订颁布第二版和第三版，从1985年起开始每隔5年重新修订并颁布1次，分别为1985年版(第四版)、1990年版(第五版)、1995年版(第六版)、2000年版(第七版)、2005年版(第八版)、2010年版(第九版)及2015年版(第十版)。本教材所指的药典除另有说明外，均指《中国药典》2015年版。

《中国药典》2015年版由一部、二部、三部及四部构成，2015年6月5日经国家食品药品监督管理局(China Food and Drug Administration)批准颁布，于2015年12月1日正式实施。其中，一部收载药材和饮片、植物油脂和提取物、成方制剂和单味制剂等；二部收载化学药品、抗生素、生化药品以及放射性药品等；三部收载生物制品；首次将2010年版药典附录整合为通则，并与药用辅料单独成卷作为《中国药典》四部。

药物化学研究的药物几乎均为化学药物，因此，在实际工作中主要参照《中国药典》二部。药典对药物的质量作了具体的规定，主要有化学结构式、化学名、含量标准、性状、鉴别、检查、含量测定、类别、贮藏及制剂等。

药物质量评定主要基于两个方面：一是药物的疗效和毒副作用，如果一个药物的疗效不佳，达不到应有的治疗目的，即便其毒副作用再小仍旧失去临床价值；如果一个药物的疗效很好，但其不良反应(尤其是对肝脏、肾脏、心脏及血液等毒性)很大，也非理想的好药，亦难以被批准上市或上市后易被撤出市场。因此，质量好的药物应该是在治疗剂量内疗效显著，不良反应较小。二是药物的纯度，药典中体现药物纯度的指标主要有有效成分的含量(原料药含量一般不得少于98.5%、制剂含量一般应为标示量的90.0%~110.0%)、物理常数(熔点和比旋度等)及杂质限量等。

任何影响药品纯度的物质均称为杂质。对原料药而言，杂质是指除原料药中该药物化学实体之外的其他任何成分；对药物制剂而言，杂质视为药物制剂中原料药及辅料化学实体之外的其他任何成分。药物的杂质主要来自于两个方面：一是制备时引入，所用原料不纯、反应不完全残留的原料及试剂、反应过程产生的中间体和副反应产物以及反应所用容器等均可能在产品中夹带杂质；二是贮存时产生，药物贮存时由于受到外界条件(空气、日光、温度、湿度、微生物、金属离子等)的影响而发生的水解、分解、氧化、聚合等化学反应及发生霉变等亦均可能产生杂质。显然，质量好的药物应该是达到一定纯度且其中所含杂质越少越好，但考虑到除去杂质势必增加生产成本和降低产量、且完全除去杂质既不可能也无必要等综合因素，因此，在不影响药物疗效和人体健康的前提下，药物中允许杂质存在一定的限量。药典上对杂质限量规定一般以百分之多少(%)至百万分之多少(parts per million, ppm)表示。

药品是特殊的商品，作为一名药学从业人员，要从业先敬业，注重“把质量关、用放心药”的职业道德意识，树立“人的生命高于一切、药品质量重于一切”的责任感意识，在药

物生产、流通、贮藏及应用等各个环节自始至终严格按照药典质量标准要求控制药物的质量，确保药品安全、有效。

三、药物名称

药物名称包括通用名、化学名及商品名三种。

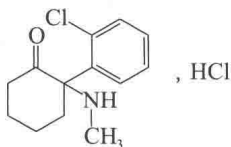
药物通用名 (generic name)，也称为国际非专利药品名称 (international nonproprietary name, INN)，是世界卫生组织 (world health organization, WHO) 推荐使用的名称。《中国药品通用名称》(Chinese approved drug names, CADN) 即以 WHO 推荐的 INN 为依据，由国家药典委员会负责组织制定并报国家食品药品监督管理局备案。药典中使用的名称即为通用名。

药物通用名具有强制性和约束性。同一种化学成分或相同配方组成的药品在我国境内的通用名是唯一的，凡上市流通的药品标签、说明书或包装上必须要用通用名。

药物通用名可由音译、意译或音意兼译得名，且以 2~5 字居多。音译得名的药物如阿司匹林 (Aspirin)、吗啡 (Morphine)；意译得名的药物如环磷酰胺 (Cyclophosphamide)、氢氯噻嗪 (Hydrochlorothiazide)；音意兼译得名的药物如环丙沙星 (Ciprofloxacin)、双氯芬酸 (Diclofenac)。

药物化学名可参考国际纯粹与应用化学会 (international union pure and applied chemistry, IUPAC) 公布的有机化合物命名原则及中国化学会公布的“有机化学物质系统命名原则”进行命名。由于美国化学文摘 (chemical abstracts, CA) 应用范围日益扩大且被广泛接受，故 CA 也成为药物化学名命名的基本依据之一。

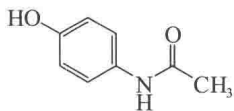
药物的化学名即依据该药物的化学结构式进行命名，命名时通常是先选取一个母体基本结构，然后将其他取代的位置和名称标出。例如：



盐酸氯胺酮 (Ketamine Hydrochloride)，以环己酮为母体，2 位有 2-(2-氯苯基) 和 2-(甲氨基) 两个取代基，故其化学名为：2-(2-氯苯基)-2-(甲氨基) 环己酮盐酸盐。

药物商品名是制药企业为开发产品和占领市场而使用的药品名称。药物的商品名可以注册得到保护，含同样活性成分的同一种药品，不同企业可注册不同商品名，代表企业的形象和产品的声誉，因此，与药物通用名和化学名仅有一个名称不同，同一药物的商品名可出现少则几个、多则数十个。

现以一个化学药物的结构为例，说明药物通用名、化学名及商品名三者关系：



通用名：对乙酰氨基酚；化学名：4'-羟基乙酰苯胺；商品名：扑热息痛、必理通及泰诺林等。

第一章

中枢神经系统药物

中枢神经系统药物 (central nervous system drugs) 是指对中枢神经活动起到抑制或兴奋作用, 用于治疗中枢神经系统疾病的一类药物。根据疾病种类或药物作用的不同, 中枢神经系统药物主要有镇静催眠药、抗癫痫药、抗精神失常药、镇痛药、全身麻醉药、中枢兴奋药; 鉴于解热镇痛药和非甾体抗炎药都是通过抑制下丘脑体温调节中枢前列腺素合成酶发挥其解热镇痛和消炎作用, 故将两者一并列入本章。

第一节 镇静催眠药

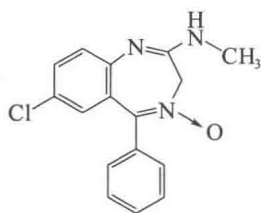
镇静催眠药 (sedative hypnotic) 属于抑制中枢神经系统的一类药物。该类物质通常在小剂量使用时表现镇静效果, 使患者处于安静状态, 随着剂量增加, 能使患者产生类似正常生理睡眠的状态, 有助于避免失眠损害人体健康和影响正常工作生活。此外, 该类物质大多兼有良好的抗焦虑或抗癫痫作用。

镇静催眠药按化学结构不同可分为苯二氮草类、巴比妥类及其他类。

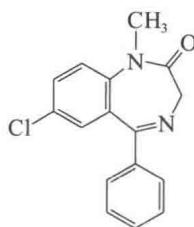
一、苯二氮草类

苯二氮草类 (benzodiazepines) 镇静催眠药具有作用优良和毒副作用小的特点, 目前几乎取代了传统的巴比妥类镇静催眠药, 成为镇静催眠及抗焦虑的首选药物。

氯氮草 (Chlordiazepoxide) 于 1960 年最先用于临床, 治疗精神抑郁性焦虑和失眠, 但该药久用骤停可致癫痫样发作及偶见粒细胞减少、阳痿及月经异常等不良反应。通过结构改造得到了副作用更小、在体内更稳定的同型物地西洋 (Diazepam), 于 1965 年用于临床。



氯氮草



地西洋

其后, 人们通过对地西洋结构修饰及体内代谢物的研究, 合成了一系列苯二氮草类药