



北京大学药学院 权威打造
资深培训专家

2008 版

国家执业药师 资格考试 口袋书

西药

药物化学

YAOWU HUAXUE

主编 高希梅

- 详解大纲考点
- 明晰考试重点
- 精选考试真题
- 冲刺过关必备

 北京科学技术出版社

药 物 化 学

高希梅 主编



北京科学技术出版社

图书在版编目 (CIP) 数据

药物化学/高希梅主编. —北京: 北京科学技术出版社, 2008. 3

(国家执业药师资格考试口袋书·西药)

ISBN 978 - 7 - 5304 - 3655 - 4

I. 药… II. 高… III. 药物化学 - 药剂
人员 - 资格考核 - 自学参考资料 IV. R914

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2008) 第 008778 号

药物化学

作 者: 高希梅

责任编辑: 白 莎

责任校对: 黄立辉

责任印制: 韩美子

封面设计: 樊润琴

出 版 人: 张敬德

出版发行: 北京科学技术出版社

社 址: 北京西直门南大街 16 号

邮政编码: 100035

电话传真: 0086 - 10 - 66161951 (总编室)

0086 - 10 - 66113227 (发行部)

0086 - 10 - 66161952 (发行部传真)

电子信箱: bjkjpress@163.com

网 址: www. bjkjpress. com

经 销: 新华书店

印 刷: 三河市国新印装有限公司

开 本: 787mm × 1092mm 1/48

字 数: 150 千

印 张: 6

版 次: 2008 年 3 月第 1 版

印 次: 2008 年 3 月第 1 次印刷

印 数: 1—4000

ISBN 978 - 7 - 5304 - 3655 - 4/R · 1025

定 价: 108.00 元 (全套 6 册)



京科版图书, 版权所有, 侵权必究。

京科版图书, 印装差错, 负责退换。

前 言

国家执业药师资格考试是一种职业准入考试，考试遵照以用定考的原则，和一般的专业考试有所不同，为配合每年一度的考试，辅导应试人员备考，我社邀请北京大学医学部和北京中医药大学的多位教授编写了这套《执业药师资格考试口袋书》。

本套口袋书是这些教授多年执业药师考试辅导经验的总结，具有以下特点：

1. 体积小，携带方便。考生可以随手将其装于口袋中，在闲暇时间随时翻看、随地复习，实用性很强。

2. 紧紧围绕大纲，条理清晰。分项列出考点，对大纲中的重点内容进行了强调，同时对只需了解的部分也做了提示，帮助考生形成系统的知识体系，以便进行更好的复习。

3. 内容精炼，重点突出。使考生能在有限的时间内抓住重点和考点，进行有效地复习，掌握考试的主要内容。

执业药师资格考试考生的背景不同、基础各异，在复习考试时可根据各自的情况有所侧重。对于本备考材料（口袋书）所列考点则均

应掌握或熟悉，这是迎接考试的基本要求。使用本书时应注意：①通过各“章或节”项下的“阅读提示”提出各“章”及各“节”的重点。②对各“考点”的内容应注重理解，在理解的基础上记忆，因为考题的形式可以有多种变化。③带★的“考点”和有下列划线的内容为考试的重点和难点，应着重进行复习和记忆。

由于时间紧迫，疏漏和不当之处在所难免，敬请广大应试人员和其他读者批评指正，以便改进。在此，预祝各位考生能够顺利通过考试！

如何准备《药物化学》考试

《药物化学》是一门专业性较强的科目，对大部分考生来说，可能会感到记忆起来很困难。笔者从事了多年的执业药师培训工，有一些心得和体会，在此愿与各位考生共同探讨，希望能对你们有所帮助。

首先，制定一个合理的复习计划。一般应至少安排三遍复习，且第一、二、三遍复习占用时间比例大约应为 2:3:1。第一遍是将复习指导粗看一遍，力求对整体内容在心中有个明确的轮廓，而不应首先死记硬背全书内容；第二遍应在第一遍的基础上详细地理解、记忆各个知识点，并对其进行归纳总结，力求掌握所有重点、难点内容；第三遍则应快速翻阅复习指导，拾遗补缺，强化记忆难点内容。

其次，适当练习做题。在进行了全面复习的基础之上，应开始做一些真题或模拟题，这样不但可以检验前面的复习效果，而且可以考查自己对哪些知识还有疏漏，更重要的是可以熟悉考试，合理安排做题时间，以防实战时怯场，发挥不出自己的真实水平。

《药物化学》的许多内容记忆起来可能比

较困难，考生一定要选择一种适合自己的记忆方法。如将难记的东西记在小卡片上并随身携带，每天睡觉之前在脑子里过一遍当天复习的内容等，这样印象会更深。另外，《药物化学》和《药理学》的某些知识点有交叉，可以互相结合着记忆。

一边工作一边复习，的确很不容易。但是，只要考生能将自己的复习时间安排好，将考试内容和自己的工作结合起来记忆，做到把握重点、全面复习，一定可以取得好成绩。

目 录

第一章 总论	1
第一节 药物的化学结构与药效的关系	1
一、药物理化性质	1
二、药物的电子云密度分布与立体 结构	5
三、键合特性	7
第二节 药物化学结构与体内生 物转化的关系	8
一、药物的官能团化反应（第Ⅰ相 生物转化）	8
二、药物的结合反应（第Ⅱ相生物 结合）	11
三、药物的生物转化和药学研究	13
第三节 药物的化学结构修饰	15
一、药物化学结构修饰的作用	15
二、药物化学结构修饰的常用方法	17
第二章 化学治疗药物	19
第一节 抗生素	19
一、基本要求	19
二、 β -内酰胺类	20
三、大环内酯类	30
四、氨基糖苷类	32

五、四环素类·····	33
第二节 合成抗菌药·····	35
一、基本要求·····	35
二、喹诺酮类·····	39
三、磺胺类及抗菌增效剂·····	42
第三节 抗结核药·····	44
一、基本要求·····	44
二、抗生素·····	45
三、合成药·····	46
第四节 抗真菌药·····	49
一、基本要求·····	49
二、唑类抗真菌药物·····	51
三、其他抗真菌药物·····	54
第五节 抗病毒药·····	55
一、基本要求·····	55
二、核苷类抗病毒药物·····	57
三、非核苷类抗病毒药物·····	60
四、蛋白酶抑制剂·····	61
五、其他抗病毒药物·····	62
第六节 其他抗感染药·····	64
一、基本要求·····	64
二、各种常用药物·····	64
第七节 抗寄生虫药·····	69
一、基本要求·····	69
二、驱肠虫药物·····	70
三、抗血吸虫病和抗丝虫病药物·····	72
四、抗疟药·····	74
第八节 抗肿瘤药·····	77
一、基本要求·····	77

二、烷化剂	78
三、抗代谢药物	82
四、抗肿瘤天然药物及其半合成 衍生物	86
五、其他抗肿瘤药物	88
第三章 中枢神经系统药物	89
第一节 镇静催眠药及抗焦虑药	89
一、基本要求	89
二、苯二氮草类	90
三、其他类	95
第二节 抗癫痫及抗惊厥药	96
一、基本要求	96
二、巴比妥类及其类似物	98
三、其他类	100
第三节 抗精神失常药	103
一、基本要求	103
二、抗精神病药	104
三、抗抑郁药	107
四、抗狂躁症药	110
第四节 改善脑功能的药物	111
一、基本要求	111
二、改善脑功能的药物	111
第五节 镇痛药	114
一、基本要求	114
二、作用阿片受体类药物	115
三、其他类药物	121
第四章 传出神经药物	123
第一节 影响胆碱能神经系统药物	123
一、基本要求	123

二、胆碱受体激动剂	126
三、胆碱酯酶抑制药	127
四、M 胆碱受体拮抗剂	128
五、N 胆碱受体拮抗剂	132
第二节 影响肾上腺素能神经 系统药物	135
一、基本要求	135
二、拟肾上腺素药	138
三、肾上腺素受体拮抗药	145
第五章 心血管系统药物	149
第一节 抗心律失常药	149
一、基本要求	149
二、钠通道阻滞剂	150
三、钾通道阻滞剂	152
第二节 抗心力衰竭药	153
一、基本要求	153
二、强心苷类	154
三、磷酸二酯酶抑制剂	154
第三节 抗高血压药	156
一、基本要求	156
二、作用于中枢的抗高血压药	156
三、作用于交感神经系统的抗高 血压药	158
四、影响肾素血管紧张素系统的 药物	158
五、钙通道阻滞剂	162
第四节 血脂调节药及抗动脉粥样硬 化药	167
一、基本要求	167



二、羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑 制剂	168
三、苯氧乙酸类	170
第五节 抗心绞痛药	172
一、基本要求	173
二、硝酸酯类	173
三、其他类	176
第六节 利尿药	176
一、基本要求	176
二、碳酸酐酶抑制剂	178
三、 $\text{Na}^+ - \text{K}^+ - 2\text{Cl}^-$ 同向转运抑 制剂	178
四、 $\text{Na}^+ - \text{Cl}^-$ 同向转运抑制剂	180
五、肾内皮细胞钠通道阻滞剂	181
六、盐皮质激素受体拮抗药	182
第六章 呼吸系统药物	184
第一节 平喘药	184
一、基本要求	184
二、 β_2 肾上腺素受体激动剂	185
三、M 胆碱受体拮抗剂	187
四、影响白三烯的药物	188
五、肾上腺皮质激素类药物	190
六、磷酸二酯酶抑制剂	191
第二节 镇咳祛痰药	193
一、基本要求	193
二、镇咳药	193
三、祛痰药	195
第七章 消化系统药物	198
第一节 抗溃疡药	198

一、基本要求	198
二、组胺 H ₂ 受体拮抗药	199
三、质子泵抑制剂	201
四、其他药物	203
第二节 胃动力药和止吐药	204
一、基本要求	205
二、胃动力药	205
三、止吐药	208
第八章 影响免疫系统的药物	210
第一节 非甾体抗炎药	210
一、基本要求	210
二、解热镇痛药	212
三、非甾体抗炎药	215
四、抗痛风药	221
第二节 抗变态反应药	222
一、基本要求	222
二、组胺 H ₁ 受体拮抗药	223
三、过敏反应介质阻释剂	228
第九章 内分泌药物	230
第一节 肾上腺皮质激素类药物	230
一、基本要求	230
二、糖皮质激素类药物	231
第二节 性激素和避孕药	234
一、基本要求	235
二、雄激素类药物	235
三、雌激素类药物	238
四、孕激素类药物	240
第三节 胰岛素及口服降血糖药	244
一、基本要求	244

二、胰岛素	245
三、胰岛素分泌促进剂	246
四、胰岛素增敏剂	248
五、 α -葡萄糖苷酶抑制剂	250
第十章 维生素类药物	252
第一节 脂溶性维生素	252
一、基本要求	252
二、常用药物	252
第二节 水溶性维生素	257
一、基本要求	257
二、常用药物	258

第一章

总 论

第一节 药物的化学结构 与药效的关系

一、药物理化性质

【考点】药物的溶解度、分配系数、解离度和官能团对药效的影响

1. 药物的溶解度、分配系数对药效的影响 药物要到达受体部位，首先必须能溶解在体液内并被转运通过多种生物膜。因此药物必须具有一定的脂溶性和水溶性，即药物的脂溶性和水溶性要有一定的平衡。通常用脂水分配系数（P）表示这个平衡。

$P = C_0 / C_w$ ， C_0 表示药物在非水相中的浓度， C_w 表示药物在水相中的浓度。

脂水分配系数（P）表示化合物在脂相和水相中充分混合，达到平衡时分子浓度的比值。 $P > 1$ ，表示化合物脂溶性大； $P < 1$ ，表示化合物水溶性大。脂水分配系数（P）也常用 $\lg P$ 表示。

药物化学结构改变对脂水分配系数影响较大，引入亲脂性的烃基、卤原子、硫醚键等使

分子的脂溶性增加；引入亲水性的羧基、磺酸基、羟基、氨基、腈基等使分子的亲水性增加。

作用于中枢神经系统的药物，需通过血脑屏障，应具有相对较大的脂溶性。例如全身麻醉药中的吸入麻醉药，麻醉作用与 $\lg P$ 相关， $\lg P$ 在一定范围内越大，麻醉作用越强。巴比妥类药物， $\lg P$ 在 0.5 ~ 2.0 之间作用最好。因此，适度的亲脂性（ $\lg P$ 在一定范围内）有最佳药效。

2. 药物的解离度对药效的影响 临床上使用的多数药物为弱酸或弱碱，解离度与药物的解离常数（ pK_a ）及介质的 pH 有关系，在体液（pH7.4）中，以离子型（解离形式）和分子型（未解离形式）同时存在。例如下表列出巴比妥类药物在体液（pH7.4）中分子型（未解离形式）的百分率。

巴比妥类的 pK_a 及在体液中分子型的百分率					
	巴比妥酸	苯巴比妥酸	苯巴比妥	异戊巴比妥	海索比妥
pK_a	4.12	3.75	7.4	7.9	8.4
分子型%	0.052	0.022	50	75.97	90.0
(无活性) (有活性) 显效最快)					

巴比妥酸和苯巴比妥酸为强酸，在体液（pH7.4）中，几乎百分之百解离，不能透过血脑屏障，所以无活性。苯巴比妥、海索比妥等巴比妥类药物为弱酸，在体液（pH7.4）中，有近 50% 或更多以分子型存在，能透过血脑屏障，到达中枢，因此具有活性。海索比妥有近 90% 以分子型存在，透膜快所以显效最快。

药物以未解离的分子型透过生物膜，在膜内的水介质中解离成离子型，以离子型与受体结合，产生药理作用。因此药物应有适宜的解离度。

口服药物需通过胃肠道吸收，介质的 pH 影响药物的解离度，对药物的吸收分布有影响。弱酸性药物例如阿司匹林，在 pH1.4 的胃液中解离度小，主要以分子型存在，易透过胃黏膜被吸收。弱碱性药物例如麻黄碱，在胃液中主要以离子型存在，不易被吸收。而在碱性的肠液中（pH8.4），解离度小易被吸收。季铵盐类和磺酸类极性大，脂溶性低，在胃肠道吸收不完全，更不易透过血脑屏障。

3. 官能团对药效的影响

(1) 烃基：药物分子中引入烃基，可改变溶解度、解离度、分配系数，还可增加位阻，从而增加稳定性。

(2) 卤素：卤素是很强的吸电子基，可影响分子间的电荷分布、脂溶性及药物作用时间。如氟奋乃静的安定作用比奋乃静强 4 ~ 5 倍。

(3) 羟基：引入羟基可增强与受体的结合力，增加水溶性，改变生物活性。羟基取代在脂肪链上，常使活性和毒性下降。羟基取代在芳环上时，有利于和受体的碱性基团结合，使活性和毒性均增强。当羟基被酰化成酯或烃化成醚，其活性多降低。

(4) 巯基：巯基形成氢键的能力比羟基低，引入巯基时，脂溶性比相应的醇高，更易

