



普通高等教育“十五”国家级规划教材



普通高等教育“十一五”国家级规划教材

国家精品课程教材

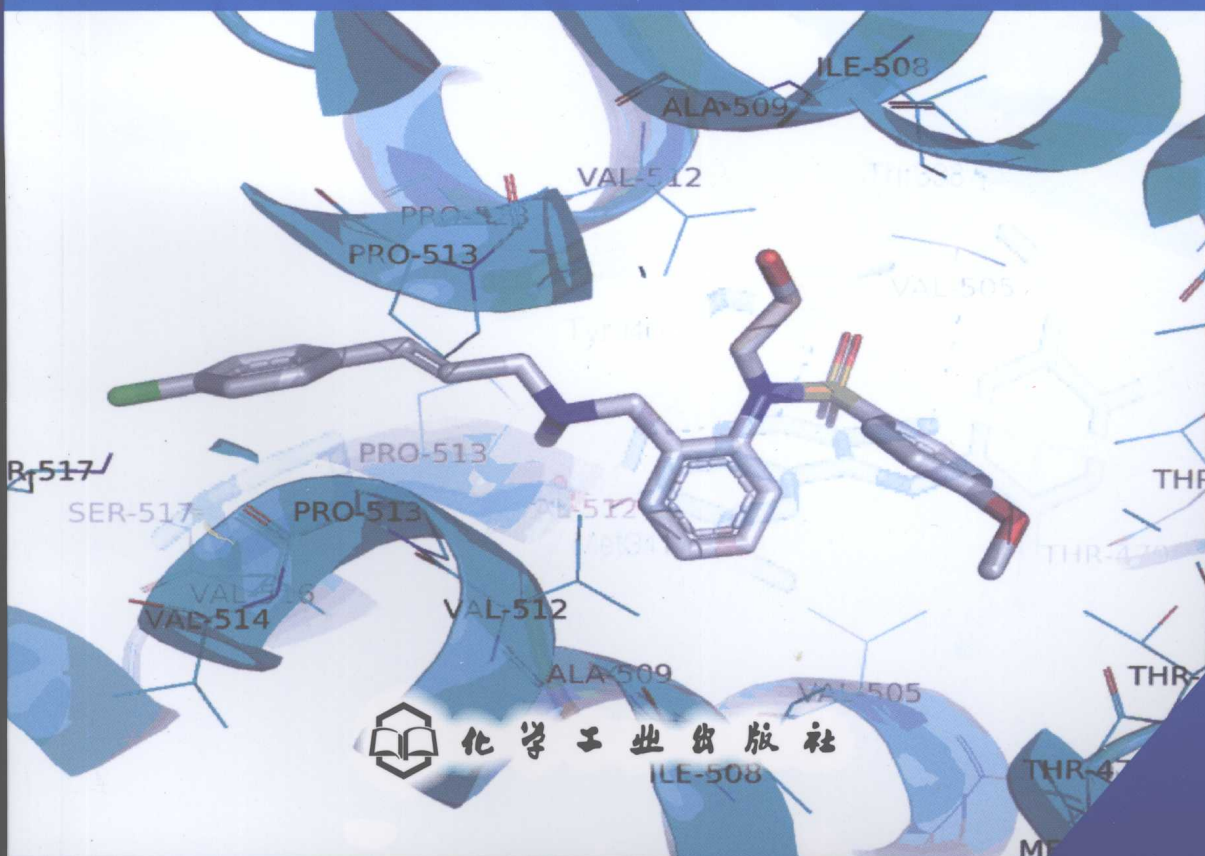
# 药物化学

Medicinal Chemistry

第二版

主编 尤启冬

主审 彭司勋



普通高等教育“十五”国家级规划教材  
普通高等教育“十一五”国家级规划教材  
国家精品课程教材

# 药物化学

第二版

主编 尤启冬  
主审 彭司勋



化学工业出版社

·北京·

本书是教育部普通高等教育“十五”和“十一五”国家级规划教材。

本教材保留了第一版的大部分特点，但对结构框架进行了适当调整和改变，删除了第一版中相对较陈旧的内容，新增加了一些章节，并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典型例子。

本教材以突出新药研究与开发为主线，结合新药设计、发现和发展过程，介绍了新药研究中所使用的方法、原理；介绍了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进行了讲解。

本书可供药学专业、制药工程专业本科生作为专业课教材使用，也可供相关专业科研人员学习参考。

### 图书在版编目 (CIP) 数据

药物化学/尤启冬主编. —2版. —北京: 化学工业出版社, 2008.7

普通高等教育“十五”国家级规划教材. 普通高等教育“十一五”国家级规划教材. 国家精品课程教材  
ISBN 978-7-122-03155-6

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

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2008) 第 091581 号

---

责任编辑: 宋林青  
责任校对: 王素芹

文字编辑: 李姿娇  
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: 北京市振南印刷有限责任公司

装 订: 三河市宇新装订厂

787mm×1092mm 1/16 印张 35 字数 896 千字 2008 年 10 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: 49.00 元

版权所有 违者必究

# 《药物化学》(第二版)编写组

主编 尤启冬

主审 彭司勋

参加编写人员 (以姓氏笔画为序)

尤启冬 (中国药科大学)

叶德泳 (复旦大学药学院)

孙铁民 (沈阳药科大学)

胡永洲 (浙江大学药学院)

徐云根 (中国药科大学)

徐 正 (四川大学华西药学院)

雷小平 (北京大学药学院)

# 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基本制作完毕，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。

编者

2008年4月于南京

# 第一版序

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。

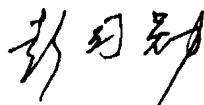
我于 20 世纪 50 年代与有关药学院校同仁编写了全国第一本药学专业药物化学教材，以后多次进行修订。由于科学技术进步，各次修订本的内容不断得到更新。该教材现已列入教育部普通高等教育“十五”规划教材，并由尤启冬教授担任主编，这一工作的延续将使教材的建设得到很好的发展。

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

# 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 Fooye'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**



# 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)	1
三、我国药物化学的发展 (Achievements of PRC in Medicinal Chemistry)	4
四、药物化学发展的新方向 (Some New Trends in Medicinal Chemistry)	5
参考文献	6
选读资料	6
<b>第一章 新药研究与开发概论 (Brief Introduction of New Drug Research &amp; Development)</b>	<b>7</b>
第一节 新药研究与开发的过程和方法 (Process and Methods of New Drug Research and Development)	7
一、药物发现的过程 (Process of Drug Discovery)	8
二、新药的开发阶段 (Development of New Drugs)	8
第二节 药物合成研究和质量标准 (Synthetic Research and Quality Standard of Drugs)	10
一、药物合成及工艺研究 (Synthetic Research of Drugs)	10
二、药品质量和质量标准 (Quality and Quality Standard of Drugs)	11
三、我国新药的分类和管理要求 (Classification and Administration of New Drugs in PRC)	12
四、新药研究和开发中的其他问题 (Other Problems in the Research and Development of New Drugs)	12
参考文献	14
选读资料	15
<b>第二章 药物设计的基本原理和方法 (Basic Principles of Drug Design)</b>	<b>16</b>
第一节 先导化合物发现的方法和途径 (Approaches for Lead Discovery)	16
一、从天然产物活性成分中发现先导化合物 (From Bioactive Component of Natural Resources)	16
二、通过分子生物学途径发现先导化合物 (From Molecular Biology Research)	19
三、通过随机机遇发现先导化合物 (From Accidental Discovery)	20
四、从代谢产物中发现先导化合物 (From Metabolites)	21
五、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)	21
六、从药物合成的中间体中发现先导化合物 (From Synthetic Intermediates)	22
七、通过计算机辅助药物筛选寻找先导化合物 (By Screening of Compound Databases)	22
八、通过其他方法得到先导化合物 (Other Methods)	23
第二节 先导化合物的优化 (Lead Optimization)	25
一、烷基链或环的结构改造 (Alterations of Compound with Alkyl or Ring)	25
二、生物电子等排 (Bioisosteres)	27
三、前药原理 (Prodrug Principle)	31
四、软药 (Soft Drug)	34
五、硬药 (Hard Drug)	35
六、孪药 (Twin Drug)	35

参考文献 .....	36
选读资料 .....	37
<b>第三章 药物的结构与生物活性 (Structure-Activity Relationships of Drugs)</b> .....	38
<b>第一节 药物的结构与活性的关系 (Structure-Activity Relationships of Drugs)</b> .....	38
一、影响药物活性的主要因素 (Main Factors Affecting Pharmaceutical Activity) .....	38
二、药物的理化性质对活性的影响 (Effects of Physical and Chemical Properties of Drugs on Pharmacologic Activity) .....	39
三、药物和受体间的相互作用对药效的影响 (Affection of the Interaction of Drug and Receptor on Potency) .....	41
<b>第二节 二维定量构效关系 (2D-Quantitative Structure-Activity Relationships)</b> .....	47
一、疏水性参数 (Lipophilicity Parameters) .....	48
二、电性参数 (Electronic Parameters) .....	49
三、立体参数 (Steric Parameters) .....	49
四、Hansch 方法在药物设计中的应用 (Hansch Method Using in Drug Design) .....	50
<b>第三节 三维定量构效关系与计算机辅助药物设计 (3D-QSAR and Computer-Aided Drug Design)</b> .....	51
一、基于受体结构的药物设计 (Receptor-Structure-Based Drug Design) .....	51
二、基于小分子的药物设计 (Molecule-Based Drug Design) .....	53
参考文献 .....	57
选读资料 .....	58
<b>第四章 药物代谢 (Drug Metabolism)</b> .....	59
<b>第一节 官能团化反应 (Functionalization Reactions)</b> .....	59
一、氧化反应 (Oxidation) .....	60
二、还原反应 (Reduction) .....	64
三、水解反应 (Hydrolysis) .....	64
<b>第二节 结合反应 (Conjugation Reaction)</b> .....	65
一、葡萄糖醛酸结合 (Glucuronic Acid Conjugation) .....	66
二、硫酸结合 (Sulfate Conjugation) .....	67
三、氨基酸结合 (Conjugation with Amino Acids) .....	67
四、谷胱甘肽或巯基尿酸结合 (Glutathione or Mercapturic Acid Conjugation) .....	68
五、乙酰化结合 (Acetylation) .....	69
六、甲基化结合 (Methylation) .....	69
<b>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)</b> .....	70
参考文献 .....	72
选读资料 .....	72
<b>第五章 镇静催眠药和抗癫痫药 (Sedative-Hypnotics and Antiepileptics)</b> .....	74
<b>第一节 苯二氮草类催眠镇静药 (Sedative-Hypnotics of Benzodiazepines)</b> .....	74
一、1,4-苯二氮草类药物的发现 (Discovery of Benzodiazepines) .....	74
二、苯二氮草类药物的作用机制 (Mechanism of Action of Benzodiazepines) .....	75
三、苯二氮草类药物的发展和构效关系 (Development and Structure-Activity Relationships of Benzodiazepines) .....	75
四、苯二氮草类药物的代谢 (Metabolism of Benzodiazepines) .....	77
<b>第二节 非苯二氮草类 GABA<sub>A</sub> 受体激动剂 (Nonbenzodiazepine GABA<sub>A</sub> Agonists)</b> .....	81

一、吡咯酮类 (Pyrrolidone)	81
二、咪唑并吡啶类 (Imidazo Pyridines)	82
第三节 抗癫痫药 (Antiepileptics)	84
一、抗癫痫药物的作用机制 (Mechanisms of Action of Antiepileptics)	84
二、巴比妥类及其同型药物 (Barbiturates and Homotypical Drugs of Barbiturates)	85
三、二苯并氮杂草类 (Dibenzoazepines)	90
四、GABA 类似物 (Analogues of GABA)	91
五、脂肪酸类 (Carboxylic Acids)	92
六、其他结构类药物 (Other Drugs)	93
参考文献	94
选读资料	94
<b>第六章 精神神经疾病治疗药 (Psychotherapeutic Drug)</b>	95
第一节 经典的抗精神病药 (Classical Antipsychotic Drugs)	95
一、吩噻嗪类 (Phenothiazines)	95
二、硫杂蒽类 (Thioxanthenes)	101
三、丁酰苯类及其类似物 (Butyrophenones and Analogues)	103
四、苯酰胺类 (Benzamides)	106
五、二苯二氮杂草类及其衍生物 (Dibenzodiazepines and Derivatives)	107
第二节 非经典的抗精神病药物 (Atypical Antipsychotic Drugs)	108
一、非经典的抗精神病药物的作用机制 (Mechanism of Action of Atypical Antipsychotic Drugs)	108
二、非经典的抗精神病药物 (Atypical Antipsychotic Drugs)	109
第三节 抗抑郁药 (Antidepressant Drugs)	111
一、单胺氧化酶抑制剂 (Monoamine Oxidase Inhibitors, MAOI)	112
二、5-羟色胺重摄取抑制剂 (Serotonin-Reuptake Inhibitors)	113
三、去甲肾上腺素重摄取抑制剂 (Norepinephrine-Reuptake Inhibitors)	115
四、 $\alpha_2$ 肾上腺素受体阻断剂 ( $\alpha_2$ Adrenoceptor Blockers)	118
第四节 抗焦虑药和抗躁狂药 (Antianxiety Drugs and Antimanic Drugs)	119
一、抗焦虑药 (Antianxiety Drugs)	119
二、抗躁狂药 (Antimanic Drugs)	119
参考文献	120
选读资料	120
<b>第七章 神经退行性疾病治疗药物 (Drug for Neurodegeneration Disease)</b>	121
第一节 抗帕金森病药 (Anti-Parkinson's Disease Drugs)	121
一、多巴胺替代物 (Dopamine Replacers)	122
二、外周脱羧酶抑制剂 (Peripheral Decarboxylase Inhibitors)	123
三、多巴胺 D 受体激动剂 (Dopamine Receptor Stimulants)	123
四、其他酶抑制剂 (Other Enzymes Inhibitors)	126
五、谷氨酸受体拮抗剂 (NMDA Receptor Antagonists)	127
六、其他药物 (Other Drugs)	127
第二节 抗阿尔茨海默病药物 (Anti-Alzheimer's Disease Drugs)	129
一、抑制 A $\beta$ 形成和沉积的药物 (Drugs of Inhibiting A $\beta$ Formation and Deposition)	129
二、胆碱能系统改善药物 (Drugs of Improving Cholinergic System)	130
三、NMDA 受体拮抗剂 (NMDA Receptor Antagonists)	133
四、抗氧化药物 (Antioxidation Drugs)	133

参考文献 .....	133
选读资料 .....	134
<b>第八章 镇痛药 (Analgesics) .....</b>	<b>135</b>
第一节 吗啡及其衍生物 (Morphine and its Derivatives) .....	135
第二节 合成镇痛药 (Synthetic Analgesics) .....	138
一、哌啶类 (Piperidines) .....	138
二、氨基酮类 (Aminoketones) .....	141
三、吗啡烃类及苯并吗喃类 (Morphinane and Benzomorphan) .....	142
四、其他药物 (Others) .....	144
第三节 阿片受体和阿片样物质 (Opiate Receptors and Opiate-Like Substances) .....	144
一、阿片受体 (Opiate Receptors) .....	144
二、阿片样物质 (Opiate-Like Substances, OLS) .....	146
参考文献 .....	148
选读资料 .....	148
<b>第九章 局部麻醉药 (Local Anesthetics) .....</b>	<b>149</b>
第一节 局部麻醉药的发展 (Development of Local Anesthetics) .....	149
第二节 局部麻醉药的结构类型 (Chemical Structures of Local Anesthetics) .....	150
一、对氨基苯甲酸酯类 ( <i>p</i> -Aminobenzoates) .....	150
二、酰胺类 (Amides) .....	152
三、氨基酮类 (Aminoketones) .....	155
四、氨基醚类 (Aminoethers) .....	155
五、氨基甲酸酯类 (Carbamates) .....	156
第三节 局部麻醉药的构效关系 (Structure-Activity Relationships of Local Anesthetics) .....	156
第四节 局部麻醉药的作用机制 (Action Mechanism of Local Anesthetics) .....	157
参考文献 .....	159
选读资料 .....	159
<b>第十章 拟胆碱和抗胆碱药物 (Cholinergic Agents and Anticholinergic Agents) .....</b>	<b>160</b>
第一节 拟胆碱药 (Cholinergic Agents) .....	162
一、胆碱受体激动剂 (Cholinoceptor Agonists) .....	162
二、胆碱受体激动剂的构效关系 (Structure-Activity Relationships of Cholinoceptor Agonists) .....	163
三、乙酰胆碱酯酶抑制剂 (Acetylcholinesterase Inhibitors) .....	164
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) .....	168
第二节 抗胆碱药 (Anticholinergic Agents) .....	169
一、颠茄生物碱类抗胆碱药 (Belladonna Alkaloids Anticholinergic Agents) .....	169
二、合成抗胆碱药 (Synthetic Anticholinergic Agents) .....	172
三、M胆碱受体拮抗剂的构效关系 (Structure-Activity Relationships of Muscarinic Antagonists) .....	175
四、N胆碱受体拮抗剂 (Nicotinic Antagonists) .....	176
参考文献 .....	182
选读资料 .....	182
<b>第十一章 组胺受体拮抗剂及抗过敏和抗溃疡药 (Histamine Receptor Antagonists and Related Antiallergic and Antiulcer Agents) .....</b>	<b>183</b>

第一节 组胺 H <sub>1</sub> 受体拮抗剂和抗过敏药物 (Histamine H <sub>1</sub> -Receptor Antagonists and Related Antiallergic Agents)	184
一、经典的 H <sub>1</sub> 受体拮抗剂 (Classical H <sub>1</sub> -Receptor Antagonists)	184
二、非镇静 H <sub>1</sub> 受体拮抗剂 (Nonsedative H <sub>1</sub> -Receptor Antagonists)	189
三、组胺 H <sub>1</sub> 受体拮抗剂的构效关系 (Structure-Activity Relationships of Histamine H <sub>1</sub> -Receptor Antagonists)	193
第二节 过敏介质与抗过敏药 (Allergic Mediators and Antiallergic Agents)	193
一、过敏介质释放抑制剂 (Inhibitors of Allergic Mediator Release)	193
二、过敏介质拮抗剂 (Allergic Mediator Antagonists)	194
三、钙通道阻断剂 (Calcium Channel Blockers)	195
第三节 组胺 H <sub>2</sub> 受体拮抗剂和抗溃疡药物 (Histamine H <sub>2</sub> -Receptor Antagonists and Antiulcer Agents)	195
一、H <sub>2</sub> 受体拮抗剂抗溃疡药物结构类型 (Structure Types of H <sub>2</sub> -Receptor Antagonists as Antiulcer Agents)	197
二、组胺 H <sub>2</sub> 受体拮抗剂的构效关系 (Structure-Activity Relationships of Histamine H <sub>2</sub> -Receptor Antagonists)	201
第四节 质子泵抑制剂 (Proton Pump Inhibitor)	202
一、不可逆型质子泵抑制剂 (Irreversible Proton Pump Inhibitor)	203
二、不可逆型质子泵抑制剂的构效关系 (SAR of Irreversible Proton Pump Inhibitor)	205
三、可逆型质子泵抑制剂 (Reversible Proton Pump Inhibitor)	205
参考文献	205
选读资料	206
<b>第十二章 作用于肾上腺素能受体的药物 (Drugs Affecting Adrenergic Receptor)</b>	<b>207</b>
第一节 拟肾上腺素药物 (Adrenergic Agents)	209
一、拟肾上腺素药物 (Adrenergic Agents)	210
二、 $\alpha$ 受体激动剂 ( $\alpha$ Agonists)	212
三、选择性 $\beta$ 受体激动剂 (Selective $\beta$ Agonists)	215
四、肾上腺素受体激动剂的构效关系 (Structure-Activity Relationships of Adrenergic Receptor Agonists)	218
五、 $\beta_3$ 受体激动剂 ( $\beta_3$ Agonist)	219
第二节 抗肾上腺素药 (Adrenergic Antagonists)	220
一、 $\alpha$ 受体阻断剂 ( $\alpha$ Adrenergic Blockers)	220
二、 $\beta$ 受体阻断剂 ( $\beta$ Adrenergic Blockers)	222
三、对 $\alpha$ 和 $\beta$ 受体都有阻断作用的药物 (Mixed $\alpha/\beta$ -Adrenergic Blockers)	228
参考文献	229
选读资料	229
<b>第十三章 抗高血压药物和利尿药 (Antihypertensive Agents and Diuretics)</b>	<b>230</b>
第一节 抗高血压药物 (Antihypertensive Agents)	230
一、交感神经药物 (Sympatholytic Drugs)	230
二、血管扩张药物 (Vasodilators)	235
三、血管紧张素转换酶抑制剂和血管紧张素 II 受体拮抗剂 (Angiotensin Converting Enzyme Inhibitors and Angiotensin II Receptor Antagonists)	236
四、钙离子拮抗剂 (Calcium Blockers)	249
第二节 利尿药 (Diuretics)	257
一、碳酸酐酶抑制剂 (Carbonic Anhydrase Inhibitors)	258

二、Na <sup>+</sup> -Cl <sup>-</sup> 协转运抑制剂 (Na <sup>+</sup> -Cl <sup>-</sup> Cotransport Inhibitors)	259
三、Na <sup>+</sup> -K <sup>+</sup> -2Cl <sup>-</sup> 协转运抑制剂 (Na <sup>+</sup> -K <sup>+</sup> -2Cl <sup>-</sup> Cotransport Inhibitors)	261
四、阻断肾小管上皮 Na <sup>+</sup> 通道药物 (Blocking Agents of Renal Tubule Epithelium Sodium Channels)	263
五、盐皮质激素受体阻断剂 (Mineralocorticoid Receptor Antagonists)	263
参考文献	265
选读资料	265

<b>第十四章 心脏疾病药物和血脂调节药 (Drugs Affecting the Cardiac Disease and Plasma Lipids Regulators)</b>	266
第一节 强心药物 (Cardiac Agents)	266
一、强心苷类 (Cardiac Glycosides)	266
二、β 受体激动剂类 (β-Adrenoceptor Agonists)	268
三、磷酸二酯酶抑制剂 (Phosphodiesterase Inhibitors)	269
第二节 抗心律失常药物 (Antiarrhythmic Drugs)	270
一、抗心律失常药物的作用机制 (Action Mechanism of Antiarrhythmic Drugs)	270
二、抗心律失常药的分类 (Classification of Antiarrhythmic Drugs)	271
第三节 抗心绞痛药物 (Antianginal Drugs)	276
第四节 血脂调节药 (Plasma Lipids Regulators)	279
一、血脂的化学和生物化学 (Chemistry and Biochemistry of Plasma Lipids)	279
二、血脂调节药物 (Plasma Lipids Regulators Drugs)	281
参考文献	291
选读资料	291

<b>第十五章 甾体激素药物 (Steroid Hormone Drugs)</b>	292
第一节 概述 (Introduction)	292
一、甾体化合物的结构类型与命名 (Structure and Nomenclature of Steroids)	293
二、甾体激素半合成原料及中间体 (Raw Materials and Intermediate for Semi-Synthesis of Steroids)	294
三、甾体激素的体内生物合成途径 (Biosynthetic Pathway of Steroidal Hormones)	295
第二节 雌激素及抗雌激素 (Estrogens and Antiestrogens)	296
一、甾体雌激素 (Steroidal Estrogens)	296
二、非甾体雌性激素 (Nonsteroidal Estrogens)	298
三、抗雌激素和选择性雌激素受体调节剂 (Estrogen Antagonists and Selective Estrogen Receptor Modulators)	299
第三节 雄性激素、同化激素和抗雄性激素 (Androgenic, Anabolic Hormones and Androgen Antagonists)	300
一、雄性激素 (Androgens)	301
二、同化激素 (Anabolic Hormones)	302
三、抗雄性激素药物 (Androgen Antagonists)	304
第四节 孕激素和抗孕激素 (Progestogens and Antiprogestogens)	305
一、孕酮类孕激素 (Progesterone and its Derivatives)	305
二、19-去甲睾酮类孕激素 (19-Norandrostanes)	307
三、抗孕激素 (Antiprogestogen)	310
第五节 肾上腺皮质激素 (Adrenocorticoid Hormones)	312
一、肾上腺皮质激素的构效关系 (Structure-Activity Relationships of Adrenocorticoids)	313
二、代表药物 (Classical Adrenocorticoids)	315

参考文献 .....	318
选读资料 .....	319
<b>第十六章 降血糖药物和骨质疏松治疗药物 (Hypoglycemic Drugs and Drugs Used to Treat Osteoporosis) .....</b>	<b>320</b>
第一节 降血糖药物 (Hypoglycemic Drugs) .....	320
一、胰岛素及其类似物 (Insulin and its Analogues) .....	320
二、胰岛素分泌促进剂 (Promoter to Insulin Secretion) .....	322
三、胰岛素增敏剂 (Insulin Enhancers) .....	327
四、 $\alpha$ -葡萄糖苷酶抑制剂 ( $\alpha$ -Glucosidase Inhibitors) .....	329
第二节 骨质疏松治疗药物 (Drug Used to Treat Osteoporosis) .....	331
一、激素及相关药物 (Hormones and Related Agents) .....	331
二、双膦酸类药物 (Bisphosphonates) .....	333
参考文献 .....	334
选读资料 .....	334
<b>第十七章 合成抗菌药 (Synthetic Antibacterial Agents) .....</b>	<b>335</b>
第一节 合成抗菌药 (Synthetic Antibacterial Agents) .....	335
一、磺胺类抗菌药物及抗菌增效剂 (Sulfonamides and Antibacterial Synergists) .....	335
二、喹诺酮类抗菌药 (Quinolone Antimicrobial Agents) .....	341
三、噁唑烷酮类抗菌药 (Oxazolidinone Antibacterial Agents) .....	350
第二节 抗结核药物 (Tuberculostatics) .....	351
一、合成抗结核药物 (Synthetic Antitubercular Agents) .....	351
二、抗结核抗生素 (Antitubercular Antibiotics) .....	356
第三节 合成抗真菌药 (Synthetic Antifungal Agents) .....	360
一、作用于真菌膜上麦角甾醇的药物 (Agents on Ergosterol of Fungi Membrane) .....	361
二、麦角甾醇生物合成抑制剂——唑类抗真菌药物 (Ergosterol Biosynthesis Inhibitors—Azole Antifungal Agents) .....	363
三、角鲨烯环氧化酶抑制剂 (Squalene Epoxidase Inhibitors) .....	365
四、其他药物 (Other Drugs) .....	367
参考文献 .....	367
选读资料 .....	367
<b>第十八章 抗病毒药 (Antiviral Agents) .....</b>	<b>368</b>
第一节 抗非逆转录病毒药物 (Antinonretroviral Agents) .....	368
一、抑制病毒复制初始时期的药物 (Agents Acting on Early Steps of Viral Replication) .....	369
二、干扰病毒核酸复制的药物 (Agents Acting on Viral Nucleic Acid Replication) .....	372
三、影响核糖体翻译的药物 (Agents Acting on Viral Ribosome Translation) .....	377
第二节 抗逆转录病毒药物 (Antiretroviral Agents) .....	378
一、逆转录酶抑制剂 (Reverse Transcriptase Inhibitors) .....	378
二、HIV 蛋白酶抑制剂 (HIV Protease Inhibitors) .....	382
参考文献 .....	386
选读资料 .....	386
<b>第十九章 抗生素 (Antibiotics) .....</b>	<b>388</b>
第一节 $\beta$ -内酰胺类抗生素 ( $\beta$ -Lactam Antibiotics) .....	388

一、基本结构特点和作用机制 (Characteristics of Structure and Mechanism of Action)	388
二、青霉素类 (Penicillins)	392
三、头孢菌素类 (Cephalosporins)	400
四、非经典的 $\beta$ 内酰胺抗生素和 $\beta$ 内酰胺酶抑制剂 (Nonclassical $\beta$ -Lactam Antibiotics and $\beta$ -Lactamase Inhibitors)	406
第二节 四环素类抗生素 (Tetracycline Antibiotics)	409
一、四环素类抗生素 (Tetracyclines)	409
二、四环素类抗生素的构效关系、作用机制和耐药性 (SAR, Mechanism of Action and Bacterial Resistance of Tetracyclines)	412
第三节 氨基糖苷类抗生素 (Aminoglycoside Antibiotics)	413
一、链霉素 (Streptomycin)	414
二、卡那霉素及其衍生物 (Kanamycin and its Derivatives)	414
三、庆大霉素 C 及其衍生物 (Gentamycin and its Derivatives)	416
四、新霉素类 (Neomycins)	417
第四节 大环内酯类抗生素 (Macrolide Antibiotics)	418
一、大环内酯类抗生素的结构特征、理化性质和作用机制 (Structural Characteristics, Physicochemical Properties and Action Mechanism of Macrolide Antibiotics)	418
二、红霉素及其衍生物 (Erythromycin and its Derivatives)	419
三、麦迪霉素及其衍生物 (Midecamycins and its Derivatives)	424
四、螺旋霉素及衍生物 (Spiramycins and its Derivatives)	425
第五节 其他抗生素 (Miscellaneous Antibiotics)	425
一、氯霉素及其衍生物 (Chloramphenicol and its Derivatives)	425
二、林可霉素及其衍生物 (Lincomycins and its Derivatives)	428
三、磷霉素 (Fosfomycin)	429
参考文献	429
选读资料	429
<b>第二十章 抗肿瘤药物 (Antineoplastic Agents)</b>	<b>430</b>
第一节 直接作用于 DNA 的药物 (Agents Directly Acting on DNA)	430
一、烷化剂 (Alkylating Agents)	430
二、金属铂络合物 (Platinum Complexes)	437
三、博来霉素类 (Bleomycin)	439
四、作用于 DNA 拓扑异构酶的药物 (Topoisomerase Inhibitors)	441
第二节 干扰 DNA 合成的药物 (Agents Interfering with DNA Synthesis)	445
一、叶酸拮抗物 (Antifolates)	446
二、嘧啶拮抗物 (Pyrimidine Antimetabolites)	448
三、嘌呤拮抗物 (Purine Antimetabolites)	452
第三节 抗有丝分裂的药物 (Antimitotic Agents)	453
一、在微管蛋白上有一个结合位点的药物 (Antitumor Agents Having One Binding-Points on Tubulin)	454
二、在微管蛋白上有两个结合点的药物 (Antitumor Agents Having Two Binding-Point Son Tubulin)	454
三、作用在聚合状态微管的药物 (Antitumor Agents Acting on the Polymerization State of Microtubule)	455
第四节 基于肿瘤信号传导机制的药物 (Agents on Signal Transduction Pathway Mechanism of Tumor)	456
一、蛋白激酶抑制剂 (Protein Kinase Inhibitors)	456



二、蛋白酶体抑制剂 (Proteasome Inhibitors) .....	460
参考文献 .....	461
选读资料 .....	462
<b>第二十一章 抗寄生虫药 (Antiparasitic Drugs) .....</b>	<b>463</b>
第一节 驱肠虫药物 (Anthelmintic Drugs) .....	463
第二节 抗血吸虫药物 (Antischistosomes) .....	465
第三节 抗疟药物 (Antimalarial Drugs) .....	467
一、疟原虫的生命周期和抗疟药物的作用环 (Life Cycle of Malarial Protozoa and Antimalarial Drugs) .....	467
二、疟疾的预防和治疗药物 (Drugs for Treatment and Prevention of Malarial Disease) .....	468
参考文献 .....	475
选读资料 .....	475
<b>第二十二章 非甾体抗炎药 (Nonsteroidal Antiinflammatory Drugs) .....</b>	<b>476</b>
第一节 非甾体抗炎药的作用机制 (Mechanism of Action of Nonsteroidal Antiinflammatory Drugs) .....	476
一、花生四烯酸代谢途径和炎症介质 (Metabolism of Arachidonic Acid and Inflammatory Mediator) .....	476
二、非甾体抗炎药的作用靶点 (Target of Nonsteroidal Antiinflammatory Drugs) .....	477
第二节 解热镇痛药 (Antipyretic Analgesics) .....	478
一、苯胺类 (Anilines) .....	479
二、水杨酸类 (Salicylic Acids) .....	480
三、吡唑酮类 (Pyrazolones) .....	482
第三节 非甾体抗炎药 (Nonsteroidal Antiinflammatory Drugs) .....	483
一、非选择性的非甾体抗炎药 (Nonselective NSAIDs) .....	483
二、选择性的环氧合酶抑制剂 (Selective Cyclooxygenase-2 Inhibitors) .....	495
第四节 痛风治疗药 (Agents Used to Treat Gout) .....	499
参考文献 .....	501
选读资料 .....	501
<b>第二十三章 维生素 (Vitamins) .....</b>	<b>503</b>
第一节 脂溶性维生素 (Fat-Soluble Vitamins) .....	503
一、维生素 A 类 (Vitamins A) .....	504
二、维生素 D 类 (Vitamins D) .....	507
三、维生素 E 类 (Vitamins E) .....	510
四、维生素 K 类 (Vitamins K) .....	513
第二节 水溶性维生素 (Water-Soluble Vitamins) .....	514
一、维生素 B 类 (Vitamins B) .....	514
二、维生素 C 类 (Vitamins C) .....	518
三、叶酸类 (Folic Acids) .....	519
参考文献 .....	520
选读资料 .....	520
<b>索引 .....</b>	<b>521</b>