

依据最新考试大纲编写

国家执业药师 资格考试 **掌中宝** 系列

药物化学 第2版

钟毅

名师引领 洞悉考试规律
突出 复习事半功倍

随书赠送 药师在线
WWW.CMSTPX.COM

30元优惠学习卡
一书 一卡 一号
网上验证

中国医药科技出版社

013031021

国家执业药师资格

R914

17-2

药物化学

(第2版)

主 编

钟毅



药师在线

www.cmstpx.com

优惠卡

¥30元

国家执业药师资格考试

因为专注所以卓越

课程超市—因材施教 个性定制培训方案
 在线考场—真实演练 自我薄弱环节
 权威名师—指点迷津 效果事半功倍

卡号: 2013347884

密码:

1. 具有
2. 具体
3. 使用
4. 方法
5. 指导



北航

C1638754

中国医药科技出版社

R914

17-2

130180819

图书在版编目 (CIP) 数据

药物化学/钟毅主编. —2 版. —北京: 中国医药科技出版社,
2013. 2

(国家执业药师资格考试掌中宝系列)

ISBN 978-7-5067-5810-9

I. ①药… II. ①钟… III. ①药物化学-药剂人员-资格考
试-自学参考资料 IV. ①R914

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2012) 第 267920 号

美术编辑 陈君杞

版式设计 郭小平

出版 中国医药科技出版社

地址 北京市海淀区文慧园北路甲 22 号

邮编 100082

电话 发行: 010-62227427 邮购: 010-62236938

网址 www.cmstp.com

规格 710×1000mm $\frac{1}{32}$

印张 8 $\frac{1}{4}$

字数 179 千字

初版 2011 年 12 月第 1 版

版次 2013 年 2 月第 2 版

印次 2013 年 2 月第 2 版第 1 次印刷

印刷 北京密东印刷有限公司

经销 全国各地新华书店

书号 ISBN 978-7-5067-5810-9

定价 18.00 元

本社图书如存在印装质量问题请与本社联系调换

二 版 前 言

国家执业药师资格考试是国家为了保障人民群众合理安全用药的一项重要举措，《国家药品安全“十二五”规划》进一步强调执业药师在药品使用领域的重要作用。中国医药科技出版社20年来致力于为有志于从事执业药师工作的读者提供优质的参考图书，助力执业药师工作。2012年我们在已有图书的基础上，邀请业内培训专家，以便于记忆、便于携带为目的，编辑出版《国家执业药师资格考试掌中宝系列》，图书上市后，凭借新颖的版式、小巧的开本，实用的内容。受到广大读者的热情欢迎。

为了回馈广大读者的厚爱，我们组织专家，结合最新考试方向和读者反馈。对本书进行了全新修订，并对书中存在的疏漏进行了订正，希望本套图书能给广大一线的考生复习备考提供帮助。同时，我社欢迎读者在使用过程中，提出宝贵意见，我们将在今后的修订中，不断吸收大家的意见，推出更好的图书，编辑室邮箱 yykj401@163.com。

编写说明

国家执业药师资格考试是国家为保障人民用药安全的一项重要资格准入制度，凡符合条件经过本考试并成绩合格者，由国家颁发《执业药师资格证书》，表明其具备了申请执业药师注册的资格。鉴于执业药师对安全合理用药的重要性，考试具有一定的难度。

为了更好的帮助广大考生学习掌握执业药师应具备的知识，我们在已出版的系列考试辅导图书的基础上，约请具有多年考前辅导经验的专家编写本套掌中宝图书。本套图书具有以下特点：

1. 选择小开本设计，便于广大在职考生复习携带；
2. 考点分级，便于考生安排复习重点；
3. 浓缩考试精华，叙述精当够用，提升复习效率；
4. 精心总结的复习图、表，更好的复习效果。

本书用“★”多少代表考点重要层级。“★★★”代表非常重要，需要熟练掌握；“★★”代表重要，应掌握主要考点内容；“★”代表普通考点或考试中较少命题的考点，应熟悉了解。

受编写时间的限制，书中存在的疏漏及不当之处敬请广大读者批评指正，以便在修订中不断完善。

在此，预祝各位考生通过自己的辛勤努力，顺利通过执业药师考试。

反馈邮箱：yykj401@yahoo.cn。

如何复习药物化学

《药物化学》在执业药师考试中是很重要的一门学科，是执业药师必备的药学专业知识的重要组成部分，考试的内容主要包括：①各类药物的分类、结构类型、临床主要用途、作用机制、构效关系及代谢特点；②代表药物的化学结构、理化性质、稳定性和使用特点；③一些重要药物在体内外相互作用的化学变化以及在体内的生物转化过程及其化学变化和对生物活性的影响；④手性药物的立体化学结构、构型和生物活性特点；⑤药物在生产 and 贮存过程中可能产生的杂质及相应的生物学作用；⑥特殊管理药品的结构特点和临床用途等。对本课程的学习，有以下几点建议。

1. 摆正心态，知难而上

药物化学的重、难点是比较多的，考生容易产生畏难情绪。客观地讲，这门课程确实比较难学，但每门学科都有其自身的特点和规律，只要掌握正确的学习方法，认真复习，就一定会在学习中獲得主动，从而将这门课程学好。

2. 学会总结归纳

在学习《药物化学》这门课程时，首先要求熟悉化学结构，记忆的重点应是发展成大类的药物的基本结构，久用不衰的代表药和在发展中起先导作用的原型药。学习方法宜以

结构为中心，由结构联系性质、作用机制、临床用途、代谢特点等内容，认识同一章节药物的共同点，区分不同点，使学习内容互有联系，形成一个整体。在理解的基础上将每章内容的重点问题进行总结归纳，使书越读越薄。

3. 适度练习

为加深对知识的理解掌握，进一步巩固知识点。要做适度的练习，千万要记住题不在多而在于精。选取一些有针对性的练习题，特别是历年的全真考题进行练习，这样在巩固知识点的同时对出题思路也能有所认识，再根据往年的出题思路进行复习，以免出现花了时间抓不住考点的情况。但同时也应明确练习题仅是一种辅助记忆方式，最根本的还是要立足书本。

4. 制定计划，阶段复习

药物化学复习可分为三步走：第一步是按考试大纲要求，分章节复习，力求“细”和“实”；第二步是系统复习，前后贯通，把知识点串成线，突出重点，辅以综合练习；第三步是模拟应考，掌握考试技术和方式，检验复习效果，加强充实薄弱环节。

目录 Contents

第1章	抗生素	1
第2章	合成抗菌药	19
第3章	抗结核药	25
第4章	抗真菌药	30
第5章	抗病毒药	36
第6章	其他抗感染药	46
第7章	抗寄生虫药	50
第8章	抗肿瘤药	57
第9章	镇静催眠药及抗焦虑药	80
第10章	抗癫痫药及抗惊厥药	87
第11章	抗精神失常药	93
第12章	神经退行性疾病治疗药	110
第13章	镇痛药	114
第14章	影响胆碱能神经系统药物	123
第15章	影响肾上腺素能神经系统药物	132
第16章	抗心律失常药	143
第17章	抗心力衰竭药	147
第18章	抗高血压药	149
第19章	调血脂药及抗动脉粥样硬化药	161

第 20 章	抗心绞痛药	166
第 21 章	抗血小板药和抗凝药	168
第 22 章	利尿药	171
第 23 章	良性前列腺增生治疗药	176
第 24 章	抗尿失禁药	179
第 25 章	性功能障碍改善药	181
第 26 章	平喘药	184
第 27 章	镇咳祛痰药	190
第 28 章	抗溃疡药	194
第 29 章	胃动力药和止吐药	199
第 30 章	非甾体抗炎药	204
第 31 章	抗变态反应药	216
第 32 章	肾上腺皮质激素类药	222
第 33 章	性激素和避孕药	227
第 34 章	影响血糖的药物	237
第 35 章	骨质疏松症治疗药	245
第 36 章	脂溶性维生素	249
第 37 章	水溶性维生素	253

第 7 章 抗生素

第一节 β -内酰胺类抗生素

考点 1★ β -内酰胺类抗生素的化学结构的特点

① 分子内有一个四元的 β -内酰胺环，青霉素为 β -内酰胺环与四氢噻唑环并合，头孢菌素则为 β -内酰胺环与氢化噻嗪环并合。

② 青霉素与头孢菌素 2 位都有一个羧基，可以成盐增加水溶性或提高稳定性。

③ 青霉与头孢都有一个与酰基连接的氨基，青霉素类称为 6-氨基青霉烷酸 (6-APA)，头孢菌素类称为 7-氨基头孢烷酸 (7-ACA)。

④ 青霉素类母核上有 3 个手性碳原子 (2S, 5R, 6R)，头孢菌素类的母核上有 2 个手性碳 (6R, 7R)，都有旋光性。

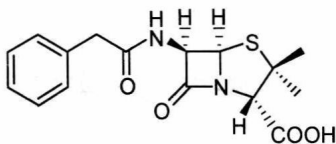
⑤ 6-APA 和 7-ACA 是 β -内酰胺类抗生素保持生物活性的基本结构。

考点 2★★★ β -内酰胺类抗生素的作用机制：作用于黏肽转肽酶，抑制细菌细胞壁的合成。

一、青霉素及半合成青霉素类

考点★★★ 青霉素类均具有 β -内酰胺环骈氢化噻唑环。

青霉素



考点1★★★ 为 β -内酰胺环骈氢化噻唑环的 β -内酰胺类抗生素，主要用于革兰阳性菌 (G^+) 感染。

考点2★ 是一个有机酸，不溶于水，可溶于有机溶剂，稳定性差，易受到亲核性或亲电性试剂的进攻，使 β -内酰胺环破裂，导致青霉素失效或产生药效。常用其钠盐或钾盐，以增强其水溶性，其水溶液在室温下不稳定易分解，因此临床用其粉针剂，现配现用。在酸性、碱性或某些酶的条件下，均可使 β -内酰胺环破坏；遇到胺和醇会生成青霉酰胺和青霉酸酯，因此不能与一些碱性药物（如氨基糖苷类抗生素）一起使用，即使需同时使用也应在不同部位注射。

考点3★ 延长青霉素体内作用时间的方法：①与丙磺舒合用。②与分子量较大的胺制成难溶性盐。③将青霉素的羧基酯化。

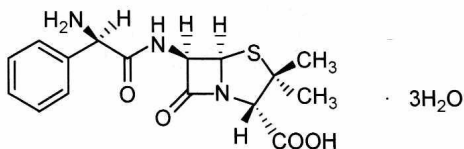
考点4★★ β -内酰胺类抗生素的过敏原：外源性过敏原主要来自 β -内酰胺类抗生素在生物合成时带入的残留量的蛋白多肽类杂质；内源性过敏原可能来自于生产、贮存和使用过程

中 β -内酰胺环开环自身聚合生成的高分子聚合物。青霉素类过敏原的主要抗原决定簇是青霉噻唑基。

考点5★ 青霉素钠的缺点：①对酸不稳定，不能口服；②抗菌谱比较狭窄，主要用于革兰阳性菌感染。③易产生耐药性（细菌能产生 β -内酰胺酶）。④有严重的过敏反应。

考点6★★ 半合成青霉素衍生物设计思想：①耐酸的半合成青霉素（侧链有吸电子基团，如非奈西林、丙匹西林）。②耐青霉素酶的半合成青霉素（侧链引入体积较大基团，如苯唑西林、氯唑西林、双氯西林）。③广谱的半合成青霉素（侧链引入极性基团，如氨苄西林）。

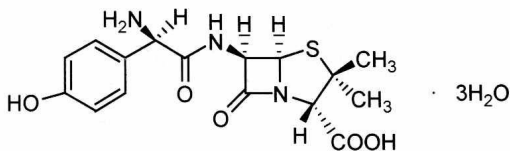
氨苄西林



考点1★★★ 侧链为苯甘氨酸的 β -内酰胺类广谱青霉素。

考点2★ 市售为三水合物：对酸稳定，可以口服，水溶液或碱性不太稳定，结构中有游离氨基侧链，容易发生聚合反应。

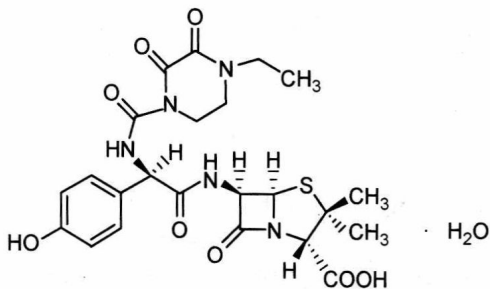
阿莫西林



考点1★★★ 侧链为对羟基苯甘氨酸的β-内酰胺类广谱青霉素。

考点2★ 与氨苄西林一样：侧链引入手性碳，为*R*右旋体；发生青霉素的降解反应和氨苄西林的聚合反应；水溶液中有磷酸盐、山梨醇、硫酸锌、二乙醇胺等时，发生分子内成环反应，生成2,5-吡嗪二酮。

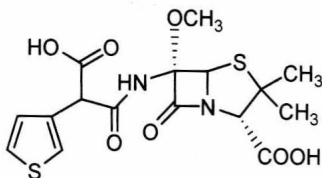
哌拉西林



考点1★★★ 在氨苄西林的侧链氨基上引入极性较大的哌嗪酮酸基团的β-内酰胺类抗生素。

考点2★ 具有抗铜绿假单胞菌活性。酸不稳定，注射给药。

替莫西林



考点1★★★ 为 β -内酰胺环的6位有甲氧基取代的青霉素类抗生素。

考点2★ 由于甲氧基的立体位阻，具有较好的耐酶活性。

二、头孢菌素及半合成头孢菌素类

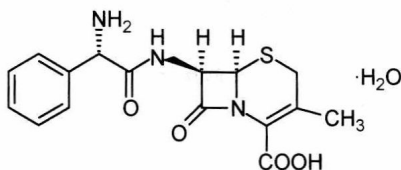
考点1★ 头孢菌素分子中C-3位存在的乙酰氧基是引起头孢菌素不稳定的主要原因。

考点2★ 7-ACA主要的结构改造部位：

- ① 7-酰胺基部分为抗菌谱的决定性基团。
- ② 7- α 氢原子被 α -甲氧基取代可增加对 β -内酰胺酶的稳定性。
- ③ 环中的硫原子对抗菌活性有较大影响。
- ④ 3-位取代基以甲基、卤素、杂环取代改变抗菌活性和药代动力学性质。

考点3★★★ 头孢菌素类均具有 β -内酰胺环骈氢化噻嗪环。

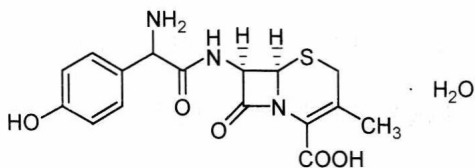
头孢氨苄



考点1★★★ 与氨苄西林的侧链同为苯甘氨酸的 β -内酰胺类头孢菌素。

考点2★ C-3位为甲基，侧链酸性下稳定，可口服。

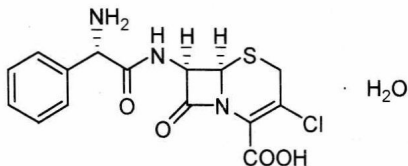
头孢羟氨苄



考点1★★★ 与阿莫西林的侧链同为对羟基苯甘氨酸的β-内酰胺类头孢菌素。

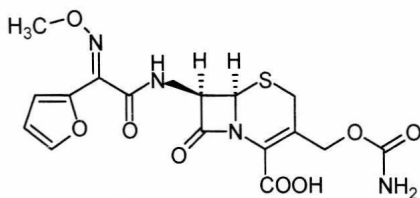
考点2★ C-3 位甲基，酸性下稳定，可以口服。作用时间长。

头孢克洛



考点★★ 为头孢氨苄的 C-3 位以氯原子取代甲基得到可以口服的半合成头孢菌素。

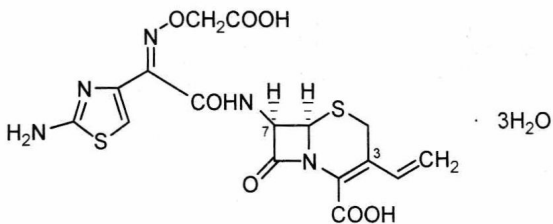
头孢呋辛



考点1★★ 在C-7位的氨基上连有顺式的甲氧苄基酰胺侧链的半合成头孢菌素，甲氧苄基对β-内酰胺酶有高度的稳定作用，对耐酶的淋球菌等作用更强。

考点2★ 头孢呋辛做成1-乙酰氧乙酯得到头孢呋辛酯后可口服，抗酸剂和H₂受体拮抗剂药物会降低口服吸收。

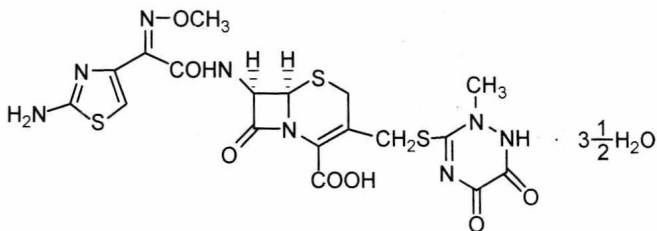
头孢克肟



考点1★★ C-3位上为乙烯基，C-7位侧链α位是顺式的乙酸氧苄基的半合成头孢菌素。

考点2★ 口服生物利用度较高，半衰期长，对β-内酰胺酶稳定。常见不良反应为肠道功能紊乱腹泻。

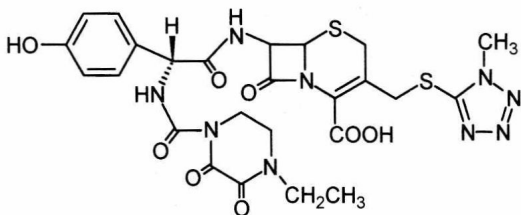
头孢曲松



考点1★★ C-3位引入酸性较强的杂环（三嗪二酮）的半合成头孢菌素。

考点2★ 产生独特的非线性剂量依赖性药代动力学性质，可通过脑膜，长期大量使用会引起胆囊炎症状，单剂可以治疗单纯性淋病。

头孢哌酮



考点1★★ 为3位甲基上以硫代甲基四氮唑杂环取代乙酰氧基，侧链氨基上引入极性较大的哌嗪酮酸基团的头孢菌素。

考点2★ 对铜绿假单胞菌作用强。注射给药。对能水解青霉素的 β -内酰胺酶敏感，对能水解头孢菌素的 β -内酰胺酶稳定。

硫酸头孢匹罗

