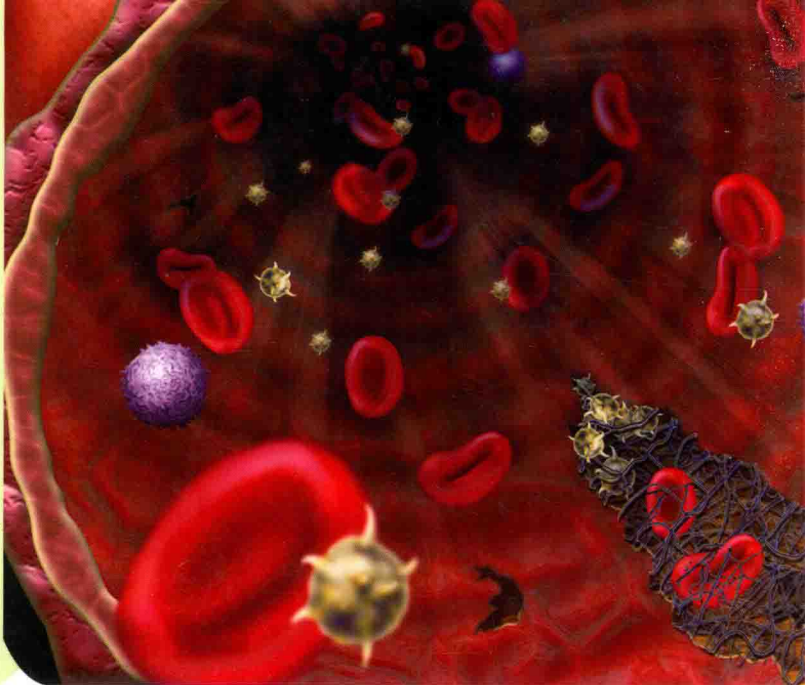




全国高职高专化学课程
“十三五”规划教材



工作过程导向

药物化学

(第二版)

YAOWU
HUAXUE

● 杨波 徐宁 主编



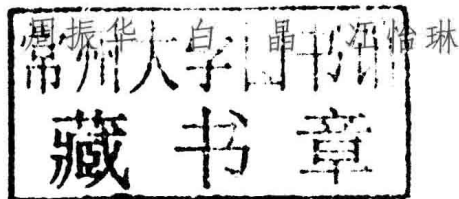
华中科技大学出版社
<http://www.hustp.com>

全国高职高专化学课程“十三五”规划教材

药物化学

(第二版)

主 编 杨 波 徐 宁
副主编 何敬文 黄金敏 赵艳霞 闫生辉



华中科技大学出版社

中国·武汉

图书在版编目(CIP)数据

药物化学/杨波,徐宁主编.—2版.—武汉:华中科技大学出版社,2017.7
全国高职高专化学课程“十三五”规划教材
ISBN 978-7-5680-2455-6

I. ①药… II. ①杨… ②徐… 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 303597 号

药物化学(第二版)

杨波 徐宁 主编

Yaowu Huaxue

策划编辑:王新华

责任编辑:王新华

封面设计:刘 卉

责任校对:何 欢

责任监印:周治超

出版发行:华中科技大学出版社(中国·武汉)

电话:(027)81321913

武汉市东湖新技术开发区华工科技园

邮编:430223

录 排:华中科技大学惠友文印中心

印 刷:武汉华工鑫宏印务有限公司

开 本:787mm×1092mm 1/16

印 张:21.25

字 数:500千字

版 次:2017年7月第2版第1次印刷

定 价:46.00元



本书若有印装质量问题,请向出版社营销中心调换
全国免费服务热线:400-6679-118 竭诚为您服务
版权所有 侵权必究

内 容 提 要

本教材分为十一个学习情境。在绪论中,介绍了课程的内容、任务、学习重点与方法,药物化学的建立和发展动向,以及药物的通用名、商品名和化学名。学习情境 1 是药物化学基本知识,主要介绍药物的变质反应、代谢反应、基本结构与结构修饰,以及新药研究与开发的初步知识。学习情境 2 至学习情境 11 是临床上最常用的十大类药物及相关的实训内容。

除学习情境 6 抗肿瘤药物和学习情境 7 抗寄生虫药物只列出知识模块外,其他学习情境都是按知识模块和实训模块编写的。知识模块中各类药物按药效和化学结构分类,介绍药物类型及代表药物,探讨药物结构与疗效的关系、化学结构对药物稳定性的影响、理化性质与药物相互作用的关系及主要药物化学合成方法等。实训模块列出了相关的实验内容。

本教材可供高职高专药学类、制药类及相关专业教学使用,也可供医药企业职工培训及有关药学人员参考使用。

第二版前言

我国高职高专教育人才培养模式的基本特征是以服务为宗旨,以就业为导向,以适应行业发展和岗位需要为目标,以培养技能型、应用型人才为根本任务,重点是培养学生的职业技能和职业素养,以增强学生的就业竞争力和发展潜力。

按照我国高职高专教育人才培养模式,结合教学工作实际,全体编写人员一致认为,在教学过程中,以全面提高学生的综合能力为中心,从知识、能力和素质结构出发,在传统的教育体系中,增加素质养成元素,将职业素质的养成融入教学过程中。以典型的药物为载体,提倡“任务驱动”教学法,使学生在具体的任务引领下,通过“教、学、做”一体化的模式,主动地去学习职业技能课中的知识和技能。教学内容服务于后续课程,突出应用性,考虑关联性和学生的可持续发展。同步培养学生的诚实守信、吃苦耐劳、善于沟通和合作的职业素质,最大限度地提高学生的学习兴趣,培养学生的操作能力,增强学生的发展潜力。

药物化学是关于药物的发现、发展和确证,并在分子水平上研究药物作用方式的一门科学。遵循职业教育规律,结合药物化学的研究对象和任务,针对职业院校学生的实际情况,以理论知识“够用、实用、适用、能用”为度,突出职业教育特色,确定本教材的整体编写框架和内容。

药物化学教材的编写立足于专业基础与实际能力的培养,主要通过理论教学情景设计和实验操作训练,进行药物化学基本知识、基本技能和基本操作的学习与掌握。在整门课程内容编排上,考虑到学生的认知水平,由浅入深地安排课程内容,实现能力的递进。药物的大类别按药理作用和临床应用划分,便于与后续课程药理学等药学类课程接轨。每类药物又按化学结构特征分类,关注药物的化学特性及稳定性,与有机化学、药物分析及药物制剂技术的知识相关联,从而有利于培养学生的就业竞争力和发展潜力,同时也为学生将来考取执业药师资格打下基础。

本教材按十一个学习情境安排学习内容。绪论中主要说明药物化学的研究对象、任务、学习重点与方法,介绍药物化学的建立、



发展历史和发展动向。学习情境 1 是药物化学基本知识,主要介绍药物的变质反应、代谢反应、基本结构与结构修饰以及新药研究与开发的初步知识。学习情境 2 至学习情境 11 依次是中枢神经系统药物、外周神经系统药物、消化系统药物、心血管系统药物、抗肿瘤药物、抗寄生虫药物、合成抗菌药及抗病毒药、抗生素、激素和维生素十大类药物的学习内容及相关的实训内容。

本教材在内容编排方式上作了较大变更,按照高职高专学生的学习规律设计学习情境,每个学习情境中的内容按照由易到难的顺序编排。实训内容不仅使知识得到巩固,还能增强学生的动手能力,培养学生的职业素质。

本教材结构设计新颖,绪论之后安排十一个学习情境。学习情境均设置了学习目标。知识模块后的同步检测项目有利于学生学习与自测。实训模块的实验讨论题可促使学生养成勤动脑筋、用心观察的习惯。

为帮助读者学习和拓宽知识面,也为了使学习过程变得轻松有趣,在一些学习情境中加入了知识链接、助记卡片。

本书由杨波、徐宁主编。参加本书编写的有:石家庄职业技术学院杨波,安庆医药高等专科学校徐宁,淄博职业学院何敬文,荆州职业技术学院黄金敏,武汉职业技术学院赵艳霞,郑州职业技术学院闫生辉,永州职业技术学院周振华,内蒙古通辽医学院白晶,黑龙江农垦科技职业学院江怡琳。

在本教材编写过程中借鉴和参考了国内外大量的参考文献及相关教材,许多老师提供了非常宝贵的建议,同时得到了编者所在院校的大力支持,本教材第一版作者付出了大量的劳动,打下了良好的基础,在此一并表示感谢。

虽然编者十分重视写作质量,但因编者水平有限,不足之处在所难免,敬请广大读者及同行专家提出宝贵意见。

编 者

目录

绪论	/1
学习目标	/1
同步检测	/8
实训 1 药物化学实验基础	/9
第 1 部分 实验室基本知识	/9
第 2 部分 实验常用装置及其应用	/13
学习情境 1 药物化学基本知识	/18
学习目标	/18
1.1 药物的变质反应	/19
1.2 药物的代谢反应	/24
1.3 药物的构效关系	/28
1.4 药物的结构修饰	/32
1.5 新药研究与开发	/35
同步检测	/41
实训 2 药物氧化变质实验	/43
学习情境 2 中枢神经系统药物	/45
学习目标	/45
2.1 解热镇痛抗炎药与抗痛风药	/46
2.2 镇痛药	/57
2.3 镇静催眠药	/66
2.4 抗癫痫药	/73
2.5 抗精神失常药	/75
2.6 中枢兴奋药	/85
同步检测	/88
实训 3 解热镇痛药的性质实验	/90
实训 4 阿司匹林的制备	/91



学习情境3 外周神经系统药物 /94

- 学习目标 /94
- 3.1 胆碱能神经系统用药 /95
- 3.2 拟肾上腺素药 /106
- 3.3 神经退行性疾病治疗药物 /112
- 3.4 组胺 H₁受体拮抗剂 /115
- 3.5 局部麻醉药 /126
- 同步检测 /135
- 实训5 苯佐卡因的合成 /139

学习情境4 消化系统药物 /142

- 学习目标 /142
- 4.1 抗溃疡药 /143
- 4.2 止吐药和催吐药 /149
- 4.3 促动力药 /152
- 4.4 肝胆疾病辅助治疗药 /154
- 同步检测 /157
- 实训6 药物的水解变质反应 /159

学习情境5 心血管系统药物 /162

- 学习目标 /162
- 5.1 抗高血压药 /163
- 5.2 抗心绞痛药 /170
- 5.3 抗心律失常药 /174
- 5.4 抗心力衰竭药 /175
- 5.5 调血脂药 /177
- 同步检测 /181
- 实训7 心血管系统药物的性质实验 /182

学习情境6 抗肿瘤药物 /185

- 学习目标 /185
- 6.1 烷化剂 /186
- 6.2 抗代谢药 /194
- 6.3 抗肿瘤天然药物 /199
- 6.4 铂配合物 /203
- 同步检测 /205

学习情境 7 抗寄生虫药物	/207
学习目标	/207
7.1 驱肠虫药	/208
7.2 抗疟药	/211
7.3 抗其他寄生虫药	/216
同步检测	/220
学习情境 8 合成抗菌药及抗病毒药	/222
学习目标	/222
8.1 磺胺类药物	/223
8.2 抗菌增效剂	/228
8.3 喹诺酮类抗菌药	/229
8.4 抗结核药	/233
8.5 抗真菌药	/237
8.6 抗病毒药	/240
同步检测	/241
实训 8 磺胺醋酰钠的合成	/243
学习情境 9 抗生素	/245
学习目标	/245
9.1 概述	/246
9.2 β -内酰胺类抗生素	/246
9.3 四环素类抗生素	/256
9.4 氨基糖苷类抗生素	/258
9.5 大环内酯类抗生素	/261
9.6 氯霉素类抗生素	/263
同步检测	/265
实训 9 抗生素的定性鉴别	/267
学习情境 10 激素	/270
学习目标	/270
10.1 甾体激素	/271
10.2 胰岛素及口服降血糖药	/291
10.3 抗甲状腺药	/297
同步检测	/298
实训 10 甾体药物的定性鉴别	/300



学习情境11 维生素 /304

学习目标 /304

11.1 脂溶性维生素 /305

11.2 水溶性维生素 /313

同步检测 /320

实训 11 水溶性维生素的性质实验 /322

参考答案 /324

参考文献 /327

绪 论

学习目标



能力目标

- (1) 能说出化学药物和药物化学的基本概念。
- (2) 知道药物化学的主要任务、学习内容及学习方法。
- (3) 能区分药物的通用名、商品名和化学名,并知道其特点。
- (4) 能对药物化学的建立与发展有初步的认识。



知识目标

- (1) 了解药物及药物化学的基本概念,了解药物化学的发展。
- (2) 熟悉药物化学的基本任务。
- (3) 掌握药物化学的三种主要的名称及命名要点。



素质目标

充分了解药物化学的研究对象和任务。对于结构简单的药物分子,能进行化学命名;对于结构复杂的药物分子,能将化学名称与其结构对应起来理解。

通过现场学习和实训,掌握药物化学实训基本知识与技能。会进行常用实验装置的安装与仪器设备的使用。

知识模块

一、药物化学的研究对象和任务

药物化学(medicinal chemistry)是关于药物的发现、发展和确证,并在分子水平上研



究药物作用方式的一门学科。它是建立在多种化学和生物学科基础上,应用化学和生物学原理研究药物和发展新药的一门学科,是联系化学、生物学、药学和医学的重要桥梁学科之一。

药物化学的主要研究对象是化学药物。具有预防、治疗、缓解、诊断疾病或调节机体功能,并有确切化学结构的物质称为化学药物。化学药物是目前临床用药的“主力军”。化学药物按来源可以分为无机药物、天然药物和有机合成药物。其中由矿物加工得到的药物称为无机药物,从天然药物中提取的有效成分(或单体)或微生物发酵产生的药物称为天然药物,有机合成药物是指化工原料通过全合成方法(由基本的化工原料经化学合成制得药物的方法)或半合成方法(由已经具备基本结构的天然物质经化学合成制得药物的方法)制得的药物。

药物化学的任务主要有以下三点。

(1) 合理用药。为更加有效地利用现有药物提供必要的理论基础和依据,通过深入探讨药物的化学结构与理化性质的关系及变化规律,特别是药物的结构与化学稳定性之间的关系、药物的杂质来源和体内代谢,为药物的剂型选择与制备、鉴别方法、杂质检查、含量测定、保管储存等提供理论支撑;通过在分子水平上讨论构效关系,更深入地阐明药物的作用机制、药物在体内代谢过程中产生毒副作用的本质,从而指导临床合理用药。

(2) 生产药物。为生产化学药物提供科学实用的方法和工艺,实现药物的产业化。主要是研究药物的合成原理及路线,选择适宜的原料和方法,大规模生产药物。重点是降低生产成本,不断提高产品的质量和产量。

(3) 开发新药。通过药物分子设计或对具有一定生物活性的化合物进行分离、鉴定,发现有价值的先导化合物,再对先导化合物进行优化改造,创造出疗效更好的新药;还可以在总结归纳现有药物构效关系、构毒关系等的基础上,对现有药物进行结构修饰,进一步发现疗效更好、毒副作用更小、使用更方便的优良药物。

二、药物化学课程内容及学习方法

药物化学是药学类各专业的一门必修课程,应在学习无机化学、有机化学、生物化学等课程的基础上开设,为学生学习后续课程(如药剂学、药物分析)提供必要的化学知识和理论基础,并与药理学课程相互联系,为药学工作人员提供必要的药学理论知识。

根据药学类各专业培养目标,本课程主要讨论以下内容。

(1) 学习主线 药物的分类以及代表药物的名称及结构,这是学习药物化学的主线。需记忆的药物,重点是药物发展成大类的药物的基本结构,久用不衰且在发展中起先导作用的原型药物。

(2) 学习主体 典型药物化学结构特征分析是学习的难点所在,也是学习的主体。应将化学结构与理化性质、命名、制备方法、体内代谢等联系起来理解。要特别关注药物的结构与稳定性之间的关系、药物的结构与生物活性之间的关系,包括构效关系、构毒关系、构代关系。要特别关注有活性和有毒性的代谢物,这是学习的重点。

(3) 其他内容 熟悉各类药物的主要药理作用及临床应用,了解各类药物存在的主要问题及其发展趋势,熟悉药物的结构修饰;了解新药研究与开发的途径及方法。尽管新

药的研发难度大、周期长、风险高,但临床急需,利润丰厚,是医药界竞争的焦点,也是医药经济诱人的潜在增长点。

三、药物化学的建立与发展

药物是人类生息繁衍的必备物质,人类最早使用的药物是天然药物,药物化学学科的建立只是近百年的事。早在18世纪人们就从野生植物古柯叶中分离到具有局部麻醉作用的可卡因。到19世纪中期,研究的重点是从已在临床应用的植物、矿物中提取和分离有效成分,并确定其化学结构。有效成分如吗啡、奎宁、咖啡因等的确定和分离,为药物化学的发展奠定了基础。

19世纪中期以后,随着以染料化学为代表的化学工业的发展,化学物质和原料日益增多,人们开始对化学工业产品或中间体进行药理筛选,从中发现了许多有效的化学药物,如乙醚可作为麻醉药,水合氯醛可作为催眠镇静药等。这些药品的应用,也促进了制药工业的发展。19世纪末和20世纪初,制药工业开始大量合成和制备化学药物,如阿司匹林、苯佐卡因、氨替比林等。20世纪30年代中期,百浪多息和磺胺被发现后,陆续合成了许多磺胺类药物。1940年,青霉素的抗菌活性也得到临床肯定,成为第一个应用于临床的抗生素。如今化学药物的治疗范围日益扩大,已不限于治疗细菌感染疾病。1940年,随着代谢拮抗理论的建立,人们不仅阐明了抗菌药物的作用机制,也为寻找新药开拓了新的途径。例如,根据抗代谢学说发现了抗肿瘤药、利尿药和抗疟药等。药物结构与生物活性关系的研究也随之开展,为创制新药和先导化合物提供了重要依据。20世纪30、40年代是药物化学发展史上的丰收时代:人们发现的化学药物最多,并揭开了药物化学的新篇章,药物化学已发展成为一门独立的学科。

20世纪50年代后,药物在机体内的作用机制和代谢变化逐步被阐明。于是,人们开始通过联系生理、生化效应并针对病因来寻找新药,从而改进了过去单纯从药物的显效基团或基本结构寻找新药的方法。例如,利用潜效(latentiation)和前药(prodrug)概念,人们已设计出能降低毒副作用和提高选择性的新化合物。1952年发现了治疗精神分裂症的氯丙嗪后,精神神经疾病的治疗,取得了突破性进展。非甾体抗炎药是20世纪60年代中期以后研究的活跃领域,一系列抗炎新药先后上市。

20世纪50、60年代是药物化学发展的重要时期。60年代以后,构效关系研究发展很快,已由定性描述转向定量研究。定量构效关系(QSAR)是将化合物的结构信息、理化参数与生物活性进行分析计算,建立合理的数学模型,研究结构与效果之间的量变规律,为药物设计、先导化合物结构修饰与改造提供理论依据。

20世纪70年代至今,人们对药物潜在作用靶点的研究,对药物分子结构、功能的了解越来越深入。另外,分子力学和量子化学与药学科学的渗透,X衍射、生物核磁共振、数据库、分子图形学的应用,为研究药物与生物大分子三维结构、药效构象及其作用模式,探索构效关系提供了理论依据和先进手段。现认为3D-QSAR与基于结构的设计方法结合,将使药物设计更趋于合理化。对受体的深入研究,尤其是许多受体亚型的发现,促进了受体激动剂和拮抗剂的发展,为寻找特异性地作用于某一受体亚型的药物,提高药物的选择性提供了依据。



酶是具有高度特异性的蛋白质,生命活动中的许多现象是由酶催化产生的生化反应。随着对酶的三维结构、活性部位的深入研究,以酶为靶点进行的酶抑制剂研究取得了很大的进展。例如,通过干扰肾素(renin)-血管紧张素(angiotensin)-醛固醇(aldoosterone)系统调节而达到降压效用的血管紧张素转化酶(ACE)抑制剂,是20世纪70年代中期发展起来的抗高血压药。一系列的ACE抑制剂,如卡托普利、依那普利、赖诺普利等是治疗高血压、心力衰竭的重要药物。

离子通道类似于活化酶存在于机体的各种组织中,参与调节多种生理功能。20世纪70年代末发现的一系列钙拮抗剂(calcium antagonists)是重要的心脑血管疾病药,其中二氢吡啶类的研究较为深入,品种也较多,且各具药理特点。近年发现的钾通道调控剂为寻找抗高血压药、抗心绞痛药和Ⅰ类抗心律失常药开辟了新的途径。

细胞癌变是由于基因突变导致基因表达失调和细胞无限增殖性繁殖的疾病。把癌基因作为靶点,利用反义技术(antisense technology)抑制细胞增殖的方法,可设计新型抗癌药。

寻找内源性活性物质是药物化学研究的内容之一。近年来发现许多活性多肽和细胞因子,如心钠素(ANF)是20世纪80年代初从鼠心肌匀浆分离出的心房肽,具有很强的利尿、降压和调节心律的作用,内皮舒张因子(EDRF)一氧化氮(NO)是同时期证实由内皮细胞分泌具有舒张血管作用的物质,其化学本质是NO。NO是调节心血管系统、神经系统和免疫系统功能的细胞信使分子,参与机体的多种生理作用。20世纪90年代后,有关NO的研究已成为全世界研究的热点。

生物技术是近20年来发展的高新技术,医药生物技术已成为新兴产业和经济增长点。20世纪90年代初以来上市的新药中,生物技术产品占有较大的比例,并有迅速上升的趋势。通过生物技术改造传统制药产业可提高经济效益,利用转基因动物即乳腺生物反应器研制、生产药品,是21世纪生物技术领域研究的热点之一。

近年来发展的组合化学技术,能合成数量众多的结构相关的化合物,建立有序变化的多样性分子库,进行集约快速筛选。这种大量合成和高通量的筛选,无疑对发现新型的先导化合物和提高新药研究水平具有重要意义。

21世纪是生命科学发展的重要时期,生命科学研究的一些技术成果给新药研究带来了新的希望。人类基因组计划的实施揭示了人类生命的奥秘,而基因组科学的研究将从根本上改变药物发现和开发的模式。在认识了致病基因和基因功能以后,可以有针对性地设计和开发能从根本上改变疾病过程的新药,从而产生“从基因功能到药物”的药物研发新模式。人们在研究过程中通过寻找和发现与疾病相关的基因或致病基因,进行克隆和表达,并在此基础上表达得到相关蛋白质,获得新药作用的靶物质,对此靶物质进行三维结构研究,借助计算机技术手段,进行新药分子的设计或以该蛋白质为靶点进行药物筛选或用计算机对化合物库进行虚拟筛选,可以获得针对性更强、选择性更高的候选药物。

目前,国际上的药物研发策略已经从针对单个基因转变为针对多个基因(或基因调控网络),深入研究基因(靶点)之间的作用与联系,更注意考虑信号转导通路和功能系统的调控。目前国际上创新药物研究的发展趋势呈现两个显著的特点:一是生命科学前沿技术,如功能基因组、蛋白质组和生物信息学等与药物研究紧密结合,以发现和验证新型药

物靶点作为主要目标,并取得了显著进展;二是理论和结构生物学、计算机和信息科学等新学科越来越多地参与到新药的发现和前期研究中,由此出现了一些新的研究领域和具有重要应用价值的新技术,它们将对创新药物研究与开发药物产生深远的影响。

在创新药物领域,最值得关注的重大技术进展之一是高内涵筛选技术(HCT)的创立。高内涵筛选是在保持细胞结构和功能完整性的前提下,尽可能地同时检测被筛样品对细胞的生长、分化、迁移、凋亡、代谢途径及信号转导等多个环节的影响,从单一实验中获取多种相关信息,以确定其生物活性和潜在毒性。从技术层面上讲,高内涵筛选是应用具有高分辨率的荧光数码影像系统,在细胞水平上实现检测指标多元化和功能化的筛选技术。该技术使得研究人员在新药研究的早期阶段就有可能获得活性化合物对细胞的毒性、代谢调节和对相关靶点的非特异性作用等多重效应的数据,对于提高发现先导化合物的速率和药物后期开发的成功率具有重要意义。

四、药物的名称

药物的名称包括药物的通用名、化学名、商品名等。

(一) 药物的通用名

每一个药品都有一个主要名称,这个名称就是药品的法定名称,我们称这种法定名称为药品通用名。中华人民共和国卫生部药典委员会编写的《中国药品通用名称》(化学工业出版社,1997年)是中国药品命名的依据。它是世界卫生组织推荐使用的“国际非专利药品名称(international non-proprietary names for pharmaceutical substance, INN)”为依据,结合我国的具体情况制定的。INN 是新药开发者在新药申请时向政府主管部门提出的正式名称,该名称是文献、教材及资料中以及在药品说明书中标明的有效成分的名称,在复方制剂中只能用它作为复方组分的使用名称。INN 已被世界各国普遍采用。



助记卡片

药物通用名特点

INN 为依据,结合国情 2 至 4;中国药品通用名,广泛采用无专利。

中国药物通用名命名规则(Chinese approved drug name, CADN)可概括为“中英对照谐音译,长音节词简缩译,相同词干表同类,响亮顺口中国式”(药名的字数一般为 3 或 4 个字,像中国人的名字)。其中词尾(少数为字头)对应的中文名及其类别见表 0-1。

表 0-1 词尾(少数为字头)对应的中文名及其类别

词尾或词头	英文名称	药物类别
-bufen/-profen	布芬/洛芬	非甾类抗炎药
-caine	卡因	局部麻醉药
-cillin	西林	青霉素类抗生素
cef-	头孢	头孢菌素类抗生素
-conazole	康唑	唑类抗真菌药



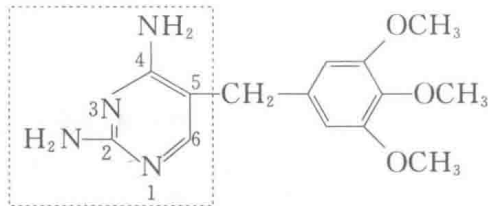
续表

词尾或词头	英文名称	药物类别
-dipine	地平	钙拮抗剂
-flurane	氟烷	全身麻醉药
-oxacin	沙星	喹诺酮类抗菌药
-pril	普利	ACE 抑制剂(抗高血压)
-tidine	替丁	H ₂ 受体拮抗剂(抗消化性溃疡)
-vir	韦	抗病毒药
-xicam	昔康	非甾类抗炎药

(二) 药物的化学名

药物的化学名能准确地反映出药物的化学结构,也是国际通用的名称之一。只有用化学命名法定型的药物名才是最准确的名称,这样的名称不容易造成误解与混杂。中文的药物化学名是根据中国化学会公布的《有机化学命名原则》命名,母体的选定与美国《化学文摘》(Chemical Abstract, CA)系统一致,然后将其他的取代基的位置和名称标出。在具体命名时与有机化合物有类似之处,但也有的不完全相同。对药物基本母核认定常常是最简单的部分,母核的名就是药物的母体名,而母体名通常是化合物的类名,如醇、酸、胺等,其他部分均被看成取代基;取代基的排列顺序也不像有机化学中那样严格按基团的大小顺序规则先小后大。对于手性化合物,规定它的立体构型或几何异构。

问题 1 已知甲氧苄啶化学结构,试写出其化学名称。



分析 该问题是对已知结构的化合物进行化学命名,通常分以下四步进行。

第一步:选母体,定母体名,甲氧苄啶以嘧啶二胺为母体,其余均为取代基。

第二步:编号排序,给母体编号,方法与有机化学中的相同;给多个不同的取代基排出先后次序(实质是有机化学中的顺序规则,其要点是比较直接相连原子的原子序数,大者为大基团;若第一个原子相同,则依次比较第二个、第三个等)。

第三步:写全名称,本例中的化学名为 5-[(3,4,5-三甲氧基苯基)甲基]-2,4-嘧啶二胺。

对于结构复杂的药物的化学名,其排列顺序依次为

构型	(旋光方向)	取代基位次	个数	名称	母体名称
R,S	(d,l,或+,-)	1,2,3,4	二、三、四等		
D,L					
顺,反					

注意:数码与数码间,数码与符号间用“,”隔开,数码或符号与汉字之间用半字线“-”隔开。

第四步:检查核对,仔细检查化学名称的各项表述,应与化学结构呈一一对应关系,并从书写格式细节上再进一步核查,确保化学名称准确无误。

问题 2 已知盐酸利多卡因的化学名称为 2-(二乙氨基)-N-(2,6-二甲基苯基)乙酰胺盐酸盐一水合物,试写出其化学结构式。

分析 这是由药物的化学名称写出药物化学结构的问题,一般可按照以下五步进行。

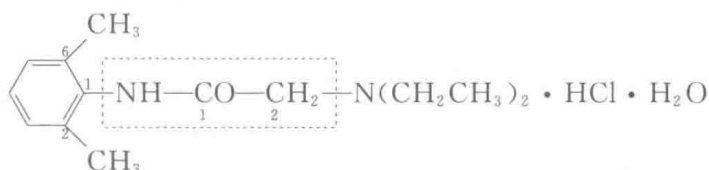
第一步:总体想象药物的轮廓。

第二步:细看母体名称,写出母体的结构,并给母体编号。

第三步:看取代基名,并将取代基逐一“翻译”成化学结构式的形式。

第四步:按位置、构型、编号等将取代基“装配”到母体上。

第五步:修饰完善,查对名称与化学结构是否一一对应。



正是由于化学名称与化学结构存在一一对应的关系,因此,可根据药物的化学名称写出药物的化学结构。

(三) 药品的商品名

药品的商品名可以得到注册保护,是生产厂家为保护其产品的生产权和市场占有权而使用的名称。例如,辉瑞制药有限公司注册的络活喜(Norvasc),为苯磺酸氨氯地平的商品名。



助记卡片

药物商品名特点

高雅规范不庸俗,不显作用和用途;响亮顺口无规律,注册清楚受保护。

同一种药由不同的企业生产,企业为了使自己的产品和其他企业生产的产品区别开来,就给自己的产品起一个名称,这就是商品名。药品使用商品名是国际制药业的惯例。商品名有利于企业提高产品质量,有利于企业创造品牌,因为它是独有的名称,具有商标的作用,消费者容易将名称和质量联系起来。商品名还有利于药品在使用以后,万一有不良反应,可以有效地进行追踪和溯源,从而有利于药品监管和指导医生用药。



课堂讨论

你对“一药多名”有什么看法? 试说明理由。

商品名的管理十分严格。根据《药品注册管理办法》的规定,只有新化学药品、新生物制品以及具有化合物专利的药品,经过国家药监部门批准,才可以使用商品名。也就是说,并非所有的药品都有商品名,比如说原料药、中药、仿制药就没有商品名。目前,国家