



全国普通高等中医药院校药学类“十二五”规划教材

药物化学

(供药学、药物制剂、临床药学、
→ 制药工程及相关专业使用)

主编●许 军 严 琳

中国医药科技出版社

全国普通高等中医药院校药学类“十二五”规划教材

药物化学

(供药学、药物制剂、临床药学、制药工程及相关专业使用)

主 编 许 军 严 琳

副主编 张春桃 李家明 刘玉红
李艳杰

中国医药科技出版社

内 容 提 要

本书是全国普通高等中医药院校药学类“十二五”规划教材之一,依照教育部相关文件精神,根据本专业教学要求和课程特点,结合《中国药典》和相关执业考试,编写而成。全书共分二十二章,从药物的化学结构出发,注重介绍各类药物的发现和发展、药物的化学结构、制备合成方法、理化性质、体内代谢、构效关系、临床应用以及毒副作用,新药的研究,简要介绍药物设计与研究方法。

本教材实用性强,主要供中医药院校药学类专业使用,也可作为医药行业考试与培训的参考用书。

图书在版编目(CIP)数据

药物化学 / 许军, 严琳主编. -- 北京: 中国医药科技出版社, 2014.8

全国普通高等中医药院校药学类“十二五”规划教材

ISBN 978-7-5067-6810-8

I. ①药… II. ①许… ②严… III. ①药物化学—中医学院—教材

IV. ① R914

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2014)第 159805 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 787 × 1092mm ¹/₁₆

印张 29 ³/₄

字数 623千字

版次 2014 年 8 月第 1 版

印次 2014 年 8 月第 1 次印刷

印刷 北京市密东印刷有限公司

经销 全国各地新华书店

书号 ISBN 978-7-5067-6810-8

定价 60.00 元

本社图书如存在印装质量问题请与本社联系调换

中国医药科技出版社全国高等医药教育 教材工作专家委员会

主任委员 邵明立

副主任委员 肖培根 陈冀胜 刘昌孝 李连达 周俊

委员 (按姓氏笔画排序)

朱 华 (广西中医药大学)

刘 文 (贵阳中医学院)

许能贵 (广州中医药大学)

杨 明 (江西中医药大学)

李 钦 (河南大学药学院)

李金田 (甘肃中医学院)

张万年 (宁夏医科大学药学院)

周桂桐 (天津中医药大学)

段金廌 (南京中医药大学)

高树中 (山东中医药大学)

彭 成 (成都中医药大学)

彭代银 (安徽中医药大学)

曾 渝 (海南医学院)

秘书长 吴少楨

办公室 赵燕宜 浩云涛

全国普通高等中医药院校药学类“十二五”规划教材

编写委员会

主任委员 彭 成（成都中医药大学）

副主任委员 朱 华（广西中医药大学）

曾 渝（海南医学院）

杨 明（江西中医药大学）

彭代银（安徽中医药大学）

刘 文（贵阳中医学院）

委 员 （按姓氏笔画排序）

王 建（成都中医药大学）

王诗源（山东中医药大学）

尹 华（浙江中医药大学）

邓 赟（成都中医药大学）

田景振（山东中医药大学）

刘友平（成都中医药大学）

刘幸平（南京中医药大学）

池玉梅（南京中医药大学）

许 军（江西中医药大学）

严 琳（河南大学药学院）

严铸云（成都中医药大学）

杜 弢（甘肃中医学院）

李小芳（成都中医药大学）

李 钦（河南大学药学院）

李 峰（山东中医药大学）

杨怀霞（河南中医学院）

杨武德（贵阳中医学院）

吴启南（南京中医药大学）

何 宁 (天津中医药大学)
张 梅 (成都中医药大学)
张 丽 (南京中医药大学)
张师愚 (天津中医药大学)
张永清 (山东中医药大学)
陆兔林 (南京中医药大学)
陈振江 (湖北中医药大学)
陈建伟 (南京中医药大学)
罗永明 (江西中医药大学)
周长征 (山东中医药大学)
周玖瑶 (广州中医药大学)
郑里翔 (江西中医药大学)
赵 骏 (天津中医药大学)
胡昌江 (成都中医药大学)
郭 力 (成都中医药大学)
郭庆梅 (山东中医药大学)
容 蓉 (山东中医药大学)
巢建国 (南京中医药大学)
康文艺 (河南大学药学院)
傅超美 (成都中医药大学)
彭 红 (江西中医药大学)
董小萍 (成都中医药大学)
蒋桂华 (成都中医药大学)
韩 丽 (成都中医药大学)
曾 南 (成都中医药大学)
裴 瑾 (成都中医药大学)

秘 书 长	王应泉				
办 公 室	赵燕宜	浩云涛	何红梅	黄艳梅	

本书编委会

主 编 许 军 严 琳

副主编 张春桃 李家明 刘玉红 李艳杰

编 委 (以姓氏笔画排序)

刘玉红 (山东中医药大学)

刘燕华 (江西中医药大学)

米浩宇 (长春工业大学)

许 军 (江西中医药大学)

牟佳佳 (天津中医药大学)

李念光 (南京中医药大学)

李家明 (安徽中医药大学)

李晓坤 (河南中医学院)

李艳杰 (长春中医药大学)

李庶心 (军事医学科学院放射与辐射医学研究所)

严 琳 (河南大学)

邱 玺 (湖北中医药大学)

张 龙 (长春工业大学)

张丽丽 (山西中医学院)

张春桃 (湖南中医药大学)

胡春玲 (湖北中医药大学)

钟 霞 (海南医学院)

徐 伟 (福建中医药大学)

柴慧芳 (贵阳中医学院)

陶雪芬 (浙江中医药大学)

黄 维 (成都中医药大学)

韩 波 (成都中医药大学)

出版说明

在国家大力推进医药卫生体制改革，健全公共安全体系，保障饮食用药安全的新形势下，为了更好的贯彻落实《国家中长期教育改革和发展规划纲要（2010—2020年）》和《国家药品安全“十二五”规划》，培养传承中医药文明，具备行业优势的复合型、创新型高等中医药院校药学类专业人才，在教育部、国家食品药品监督管理局的领导下，中国医药科技出版社根据《教育部关于“十二五”普通高等教育本科教材建设的若干意见》，组织规划了全国普通高等中医药院校药学类“十二五”规划教材的建设。

为了做好本轮教材的建设工作，我社成立了“中国医药科技出版社高等医药教育教材工作专家委员会”，原卫生部副部长、国家食品药品监督管理局局长邵明立任主任委员，多位院士及专家任专家委员会委员。专家委员会根据前期全国范围调研的情况和各高等中医药院校的申报情况，结合国家最新药学标准要求，确定首轮建设科目，遴选各科主编，组建“全国普通高等中医药院校药学类‘十二五’规划教材编写委员会”，全面指导和组织教材的建设，确保教材编写质量。

本轮教材建设，吸取了目前高等中医药教育发展成果，体现了涉药类学科的新进展、新方法、新标准；旨在构建具有行业特色、符合医药高等教育人才培养要求的教材建设模式，形成“政府指导、院校联办、出版社协办”的教材编写机制，最终打造我国普通高等中医药院校药学类核心教材、精品教材。

全套教材具有以下主要特点。

一、教材顺应当前教育改革形势，突出行业特色

教育改革，关键是更新教育理念，核心是改革人才培养体制，目的是提高人才培养水平。教材建设是高校教育的基础建设，发挥着提高人才培养质量的基础性作用。教育部《关于普通高等院校“十二五”规划教材建设的几点意见》中提出：教材建设以服务人才培养为目标，以提高教材质量为核心，以创新教材建设的体制机制为突破口，以实施教材精品战略、加强教材分类指导、完善教材评价选用制度为着力点。鼓励编写、出版适应不同类型高等学校教学需要的不同风格和特色的教材。而药学类高等教育的人才培养，有鲜明的行业特点，符合应用型人才培养的条件。编写具有行业特色的规划教材，有利于培养高素质应用型、复合型、创新型人才，是高等医药院校教学改革的体现，是贯彻落实《国家中长期教育改革和发展规划纲要（2010—2020年）》的体现。

二、教材编写树立精品意识，强化实践技能培养，体现中医药院校学科发展特色

本轮教材建设对课程体系进行科学设计，整体优化；根据新时期中医药教育改革现状，增加与高等中医药院校药学职业技能大赛配套的《中药传统技能》教材；结合药学应用型特点，同步编写与理论课配套的实验实训教材，独立建设《实验室安全与管理》教材。实现了基础学科与专业学科紧密衔接，主干课程与相关课程合理配置的目标；编写过程注重突出中医药院校特色，适当融入中医药文化及知识，满足 21 世纪复合型人才培养的需要。

参与教材编写的专家都以科学严谨的治学精神和认真负责的工作态度，以建设有特色的、教师易用、学生易学、教学互动、真正引领教学实践和改革的精品教材为目标，严把编写各个环节，确保教材建设精品质量。

三、坚持“三基五性三特定”的原则，与行业法规标准、执业标准有机结合

本套教材建设将应用型、复合型高等中医药院校药学类人才必需的基本知识、基本理论、基本技能作为教材建设的主体框架，将体现高等中医药教育教学所需的思想性、科学性、先进性、启发性、适用性作为教材建设灵魂，在教材内容上设立“要点导航、重点小结”模块对其加以明确；使“三基五性三特定”有机融合，相互渗透，贯穿教材编写始终。并且，设立“知识拓展、药师考点”等模块，和执业药师资格考试、新版《药品生产质量管理规范》（GMP）、《药品经营管理质量规范》（GSP）紧密衔接，避免理论与实践脱节，教学与实际工作脱节。

四、创新教材呈现形式，促进高等中医药院校药学教育学习资源数字化

本轮教材建设注重数字多媒体技术，相关教材陆续建设课程网络资源，藉此实现教材富媒体化，促进高等中医药院校药学教育学习资源数字化，帮助院校及任课教师在 MOOCs 时代进行的教学改革，提高学生学习效果。前期建设中配有课件的科目可到中国医药科技出版社官网（www.cmstp.com）下载。

本套教材编写得到了教育部、国家食品药品监督管理总局和中国医药科技出版社全国高等医药教育教材工作专家委员会的相关领导、专家的大力支持和指导；得到了全国高等医药院校、部分医药企业、科研机构专家和教师的支持和积极参与，谨此，表示衷心的感谢！希望以教材建设为核心，为高等医药院校搭建长期的教学交流平台，对医药人才培养和教育教学改革产生积极的推动作用。同时精品教材的建设工作漫长而艰巨，希望各院校师生在教学过程中，及时提出宝贵的意见和建议，以便不断修订完善，更好的为药学教育事业发展和保障人民用药安全服务！

中国医药科技出版社
2014 年 7 月

本教材是全国普通高等中医药院校药学类“十二五”规划教材。教材编写围绕普通高等中医药教育及专业学习特点，以及国家执业药师资格考试的要求，突出了“三基（基本理论，基本知识，基本技能）、五性（思想性，科学性，先进性，启发性，适用性）、三特定（特定的对象、特定的要求、特定的限制）”原则。本教材按照药物临床用途分为二十二章，编写从药物的化学结构出发，注重介绍各类药物的发现和发展、药物的化学结构、制备合成方法、理化性质、体内代谢、构效关系、临床应用以及毒副作用，新药的研究，简要介绍药物设计与研究方法。各章收入了药物研究的最新成果，同时侧重药物化学的基础理论和应用知识的阐述，使学生在尽可能短的时间内掌握所学课程知识，更好地为我国高等中医药教育人才培养服务。

本教材主要撰写为：许军编写第1章，柴慧芳编写第2章，胡春玲编写第3章，黄维编写第4章，李念光编写第5章，李晓坤编写第6章，李庶心编写第7章，李家明编写第8章，米浩宇编写第9章，牟佳佳编写第10章，刘燕华编写第11章，张春桃编写第12章，陶雪芬编写第13章，刘玉红编写第14章，严琳编写第15章、16章，韩波编写第17章，邱玺编写第18章，张丽丽编写第19章，李艳杰编写第20章，钟霞编写第21章，徐伟编写第22章。

本教材适用于药学、药物制剂、制药技术、临床药学、制药工程、药品营销、药事管理等高等医药院校相关专业的教学，也可供作药学工作者参考用书。

本书的编写和出版得到了中国医药科技出版社、全国普通高等中医药院校药学类“十二五”规划教材编写委员会、参编学校各级领导和有关专家的大力支持与帮助，在此致以衷心的感谢。

由于编者业务水平和教学经验所限，疏漏和不妥之处在所难免，敬请广大读者和同行专家批评指正。

编者

2014年5月

第一章 绪论 / 1

- 第一节 药物化学的研究内容、药物化学发展的过程、发展动态和趋势 1
- 第二节 药物作用靶点和药物的名称 4

第二章 镇静催眠药和抗癫痫药 / 8

- 第一节 镇静催眠药 8
- 一、苯二氮草类 9
- 二、杂环类 13
- 第二节 抗癫痫药物 17

第三章 精神疾病治疗药 / 27

- 第一节 抗精神病药 27
- 一、吩噻嗪类 28
- 二、噻吨类 31
- 三、丁酰苯类 32
- 四、二苯氮草类 34
- 五、取代苯甲酰胺类 36
- 第二节 抗抑郁药 37
- 一、单胺氧化酶抑制剂 37
- 二、去甲肾上腺素重摄取抑制剂 37
- 三、5-羟色胺重摄取抑制剂 38
- 第三节 神经退行性疾病治疗药 40
- 一、抗帕金森病药 40
- 二、抗阿尔茨海默病药 41
- 三、中枢兴奋药 42

第四章 镇痛药 / 45

- 第一节 吗啡及其衍生物 45
- 一、吗啡生物碱 45
- 二、吗啡衍生物 46

第二节 合成镇痛药	49
一、吗啡喃类	50
二、苯并吗喃类	50
三、哌啶类	51
四、氨基酮类	54
五、其他类	55
六、镇痛药的构效关系	56

第五章 抗生素 / 58

第一节 β -内酰胺类抗生素	59
一、青霉素类	61
二、头孢菌素类	69
第二节 四环素类抗生素	81
第三节 氨基糖苷类抗生素	83
一、链霉素类	84
二、卡那霉素及其衍生物	85
三、庆大霉素C及其衍生物	86
四、新霉素类	86
第四节 大环内酯类抗生素	87
一、红霉素及其衍生物	88
二、麦迪霉素及其衍生物	93
三、螺旋霉素及其衍生物	94
第五节 氯霉素类抗生素和其他抗生素	94

第六章 合成抗菌药、抗真菌药和抗寄生虫药 / 98

第一节 磺胺类药物及抗菌增效剂	99
第二节 喹诺酮类抗菌药	104
第三节 抗结核病药	109
第四节 抗真菌药	114
第五节 抗寄生虫药	119
一、驱肠虫药物	120
二、抗血吸虫病药物	121
三、抗疟药	122

第七章 抗病毒药 / 129

第一节 抗非逆转录病毒药物	129
一、抑制病毒复制的药物	129
二、干扰病毒核酸复制的药物	133
三、影响核糖体翻译的药物	140

第二节 抗艾滋病药物	140
一、逆转录酶抑制剂	141
二、蛋白酶抑制剂	144
第八章 抗肿瘤药 / 147	
第一节 生物烷化剂	148
一、氮芥类	148
二、乙撑亚胺类	153
三、甲磺酸酯及卤代多元醇类	154
四、亚硝基脲类	154
五、金属配合物类	156
第二节 抗代谢药物	158
一、嘧啶类抗代谢物	158
二、嘌呤类抗代谢物	162
三、叶酸类抗代谢物	163
第三节 抗肿瘤抗生素	165
一、多肽类抗生素	165
二、醌类抗生素及其衍生物	167
第四节 抗肿瘤植物有效成分及其衍生物	170
一、喜树碱及其衍生物	170
二、鬼臼毒素及其衍生物	171
三、紫杉烷类	172
四、长春碱类	174
五、三尖杉碱类	175
第五节 抗肿瘤药的发展趋势	175
一、蛋白激酶抑制剂	176
二、组蛋白去乙酰化转移酶抑制剂	180
三、蛋白酶体抑制剂	181
第九章 拟胆碱药和抗胆碱药 / 184	
第一节 拟胆碱药	185
一、胆碱受体激动剂	185
二、乙酰胆碱酯酶抑制剂	187
第二节 抗胆碱药	190
一、M胆碱受体拮抗剂	190
二、N胆碱受体拮抗剂	195
第十章 拟肾上腺素能药物 / 199	
一、非选择性 α 和 β 受体激动剂	201

二、选择性 α 受体激动剂	204
三、选择性 β 受体激动剂	206
四、拟肾上腺素能药物的构效关系	209

第十一章 麻醉药 / 211

第一节 全身麻醉药	211
一、吸入麻醉药	212
二、静脉麻醉药	213
三、全身麻醉药的构效关系	215
第二节 局部麻醉药	215

第十二章 心血管疾病治疗药 / 222

第一节 调血脂药	223
一、羟甲戊二酰辅酶A还原酶抑制剂	223
二、苯氧烷酸类药物	229
三、烟酸及其衍生物	232
四、胆固醇吸收抑制剂	233
第二节 抗心绞痛药	234
一、NO供体药物	234
二、 β 受体阻滞剂	238
第三节 抗高血压药	243
一、作用于植物神经系统的药物	243
二、影响肾素-血管紧张素-醛固酮系统的药物	248
三、作用于离子通道的药物——钙拮抗剂	256
四、利尿药及其他药物	256
第四节 抗心律失常药	256
一、钠通道阻滞剂	257
二、 β 受体阻滞剂	260
三、钾通道阻滞剂	261
四、钙离子通道拮抗剂	262
第五节 强心药	270
一、强心苷类	270
二、磷酸二酯酶抑制剂	272
三、钙敏化剂	273
四、 β 受体激动剂	273
第六节 抗血小板及抗凝药	274
一、抗血小板药	274
二、抗凝药	276

第十三章 泌尿相关疾病治疗药 / 278

第一节 利尿药和抗尿失禁药	278
一、多元醇类	279
二、磺酰胺类	279
三、噻嗪类	282
四、苯氧乙酸类	284
五、蝶啶类	286
六、甾体类	286
第二节 前列腺增生治疗药	289
一、 5α -还原酶抑制剂	289
二、 α 肾上腺素受体拮抗剂	291
第三节 性功能障碍改善药	293
一、磷酸二酯酶抑制剂	293
二、 α 受体拮抗剂	294

第十四章 解热镇痛药及非甾体抗炎药 / 296

第一节 解热镇痛药	298
一、苯胺类	299
二、水杨酸类	300
三、吡唑酮类	302
第二节 非甾体抗炎药	303
一、非选择性的非甾体抗炎药	303
二、选择性的非甾体抗炎药	316
第三节 抗痛风药	320

第十五章 抗变态反应药物 / 323

一、抗变态反应药物研究进展	324
二、组胺 H_1 受体拮抗剂	326
三、组胺 H_1 受体拮抗剂的构效关系	336

第十六章 消化疾病治疗药 / 338

第一节 抗溃疡药	338
一、组胺 H_2 受体拮抗剂	340
二、质子泵抑制剂	344
第二节 促胃动力药	348
一、多巴胺 D_2 受体拮抗剂	348
二、5-HT $_4$ 受体激动剂	350
第三节 止吐药	351
一、5-HT $_3$ 受体拮抗剂	352

二、NK ₁ 受体拮抗剂	354
-------------------------------	-----

第十七章 平喘镇咳祛痰药 / 357

第一节 平喘药	357
一、作用于白三烯系统的药物	359
二、肾上腺糖皮质激素类药物	360
三、磷酸二酯酶抑制剂	364
第二节 镇咳药	368
一、中枢镇咳药	368
二、外周性镇咳药	370
第三节 祛痰药	370

第十八章 降血糖药、甲状腺激素药和抗甲状腺药 / 373

第一节 降血糖药	373
一、胰岛素及其类似物	373
二、胰岛素分泌促进剂	375
三、胰岛素增敏剂	380
四、 α -葡萄糖苷酶抑制剂	382
五、新靶点的口服降血糖药	383
第二节 甲状腺激素药和抗甲状腺药	384
一、甲状腺激素药	385
二、抗甲状腺药	385

第十九章 骨质疏松治疗药 / 388

一、促进钙吸收药物	389
二、抗骨吸收药物	393

第二十章 甾体激素类药 / 398

第一节 雌激素类药物	400
一、甾体雌激素药物	400
二、非甾体雌激素药物	403
三、选择性雌激素受体调节剂	404
第二节 雄激素类药物	405
一、雄性激素	405
二、蛋白同化激素	407
三、抗雄性激素	409
第三节 孕激素类药物	410
一、孕激素和甾体避孕药	410
二、抗孕激素	413

第四节 肾上腺皮质激素药物	415
第二十一章 维生素 / 422	
第一节 脂溶性维生素	423
一、维生素A类	423
二、维生素D类	425
三、维生素E类	426
四、维生素K类	428
第二节 水溶性维生素	429
一、维生素B族	429
二、维生素C类	434
第二十二章 药物设计的基本原理和方法 / 438	
第一节 药物的结构与生物活性	439
一、药物的基本结构和结构改造	439
二、理化性质对药效的影响	439
三、电子密度分布和官能团对药效的影响	440
四、键合特性对药效的影响	442
五、立体结构对药效的影响	443
第二节 新药设计与开发	444
一、先导化合物发现的方法和途径	444
二、先导化合物的优化	447
三、定量构效关系	450
四、计算机辅助药物设计	454
参考文献 / 456	