



卫生部“十二五”规划教材

全国高等医药教材建设研究会“十二五”规划教材

全国高等学校药学专业第七轮规划教材

供药学类专业用

药物化学

第7版

主 编 尤启冬

副主编 孙铁民 李青山



CD-ROM



人民卫生出版社

PEOPLE'S MEDICAL PUBLISHING HOUSE

卫生部“十二五”规划教材
全国高等医药教材建设研究会“十二五”规划教材
全国高等学校药学专业第七轮规划教材
供药学类专业用

药 物 化 学

第 7 版

主 编 尤启冬

副主编 孙铁民 李青山

主 审 郑 虎

编 者 (以姓氏笔画为序)

王润玲 (天津医科大学)	郑 虎 (四川大学华西药学院)
尤启冬 (中国药科大学)	赵桂森 (山东大学药学院)
孙铁民 (沈阳药科大学)	徐 萍 (北京大学药学院)
李青山 (山西医科大学)	徐云根 (中国药科大学)
余 瑜 (重庆医科大学)	郭 丽 (四川大学华西药学院)
林汉森 (广东药学院)	甄宇红 (大连医科大学)

人民卫生出版社

图书在版编目 (CIP) 数据

药物化学/尤启冬主编. —7 版. —北京: 人民
卫生出版社, 2011. 8

ISBN 978 - 7 - 117 - 14434 - 6

I. ①药… II. ①尤… III. ①药物化学 - 高等
学校 - 教材 IV. ①R914

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2011)第 136890 号

门户网: www.pmph.com	出版物查询、网上书店
卫人网: www.ipmph.com	护士、医师、药师、中医 师、卫生资格考试培训

版权所有, 侵权必究!

本书本印次封底贴有防伪标, 请注意识别。

药 物 化 学 第 7 版

主 编: 尤启冬

出版发行: 人民卫生出版社 (中继线 010 - 59780011)

地 址: 北京市朝阳区潘家园南里 19 号

邮 编: 100021

E - mail: pmph@pmph.com

购书热线: 010 - 67605754 010 - 65264830

010 - 59787586 010 - 59787592

印 刷: 北京人卫印刷厂 (富华)

经 销: 新华书店

开 本: 787 × 1092 1/16 印张: 37

字 数: 899 千字

版 次: 1979 年 11 月第 1 版 2011 年 8 月第 7 版第 48 次印刷

标准书号: ISBN 978 - 7 - 117 - 14434 - 6/R · 14435

定价 (含光盘): 59.00 元

打击盗版举报电话: 010-59787491 E-mail: WQ@pmph.com

(凡属印装质量问题请与本社销售中心联系退换)

卫生部“十二五”规划教材 全国高等学校药学类专业第七轮规划教材

出版说明

全国高等学校药学类专业本科卫生部规划教材是我国最权威的药学类专业教材,于1979年出版第一版,1987年、1993年、1998年、2003年、2007年进行了5次修订,并于2007年出版了第六轮规划教材。第六轮规划教材主干教材29种,全部为卫生部“十一五”规划教材,其中22种为教育部规划的普通高等教育“十一五”国家级规划教材;配套教材25种,全部为卫生部“十一五”规划教材,其中3种为教育部规划的普通高等教育“十一五”国家级规划教材。本次修订编写出版的第七轮规划教材中主干教材共30种,其中修订第六轮规划教材28种。《生物制药工艺学》未修订,沿用第六轮规划教材;新编教材2种,《临床医学概论》、《波谱解析》;配套教材21种,其中修订第六轮配套教材18种,新编3种。全国高等学校药学专业第七轮规划教材及其配套教材均为卫生部“十二五”规划教材、全国高等医药教材建设研究会“十二五”规划教材,具体品种详见出版说明所附书目。

该套教材曾为全国高等学校药学类专业唯一一套统编教材,后更名为规划教材,具有较高的权威性和一流水平,为我国高等教育培养大批的药学专业人才发挥了重要作用。随着我国高等教育体制改革的不断深入发展,药学类专业办学规模不断扩大,办学形式、专业种类、教学方式亦呈多样化发展,我国高等药学教育进入了一个新的时期。同时,随着国家基本药物制度建设的不断完善及相关法规政策、标准等的出台,以及《中国药典》(2010年版)的颁布等,对高等药学教育也提出了新的要求和任务。此外,我国新近出台的《医药卫生中长期人才发展规划(2011—2020年)》对我国高等药学教育和药学专门人才的培养提出了更高的目标和要求。为跟上时代发展的步伐,适应新时期我国高等药学教育改革和发展的要求,培养合格的药学专门人才,以满足我国医药卫生事业发展的需要,从而进一步做好药学类专业本科教材的组织规划和质量保障工作,全国高等学校药学专业教材第三、第四届评审委员会围绕药学专业第六轮教材使用情况、药学教育现状、新时期药学领域人才结构等多个主题,进行了广泛、深入地调研,并对调研结果进行了反复、细致地分析论证。根据药学专业教材评审委员会的意见和调研、论证的结果,全国高等医药教材建设研究会、人民卫生出版社决定组织全国专家对第六轮教材进行修订,并根据教学需要组织编写了部分新教材。

药学类专业第七轮规划教材的编写修订,坚持紧紧围绕全国高等学校药学类专业(本科)教育和人才培养目标要求,突出药学专业特色,以教育部新的药学教育纲要为基础,以国家执业药师资格准入标准为指导,按照卫生部等相关部门及行业用人要求,强调培养目标与用人要求相结合,在继承和巩固前六轮教材建设工作成果的基础上,不断创新

和发展,进一步提高教材的水平和质量。同时还特别注重学生的创新意识和实践能力培养,注重教材整体优化,提高教材的适应性和可读性,更好地满足教学的需要。

为了便于学生学习、教师授课,在做好传承的基础上,本轮教材在编写形式上有所创新,采用了“模块化编写”。教材各章开篇,以普通高等学校药学本科教学要求为标准编写“学习要求”,正文中根据课程、教材特点有选择性地增加“知识链接”“实例解析”“知识拓展”“小结”。为给希望进一步学习的学生提供阅读建议,部分教材在“小结”后增加了“选读材料”。

需要特别说明的是,全国高等学校药学专业第三届教材评审委员会成立于2001年,至今已10年,随着教育教学改革的发展和专家队伍的发展变化,根据教材建设工作的需要,在修订编写本轮规划教材之初,全国高等医药教材建设研究会、人民卫生出版社对第三届教材评审委员会进行了改选换届,成立了第四届教材评审委员会。无论新老评审委员,都为本轮教材工作做出了重要贡献,在此向他们表示衷心的感谢!

由于众多学术水平一流和教学经验丰富的专家教授都积极踊跃和严谨认真地参与本套教材的编写,从而使教材的质量得到不断完善和提高,并被广大师生所认同。在此我们对长期支持本套教材编写修订的专家和教师及同学们表示诚挚的感谢!

本轮教材出版后,各位教师、学生在使用过程中,如发现问题请反馈给我们,以便及时更正和修订完善。

全国高等医药教材建设研究会

人民卫生出版社

2011年5月

卫生部“十二五”规划教材 全国高等学校药学类专业 第七轮规划教材书目

序号	教材名称	主编	单位
1	药学导论(第3版)	毕开顺	沈阳药科大学
2	高等数学(第5版)	顾作林	河北医科大学
	高等数学学习指导与习题集(第2版)	王敏彦	河北医科大学
3	医药数理统计方法(第5版)	高祖新	中国药科大学
4	物理学(第6版)(配光盘)	武 宏	山东大学物理学院
	物理学学习指导与习题集(第2版)	武 宏	山东大学物理学院
5	物理化学(第7版)(配光盘)	李三鸣	沈阳药科大学
	物理化学学习指导与习题集(第3版)	李三鸣	沈阳药科大学
	物理化学实验指导(第2版)(双语)	崔黎丽	第二军医大学
6	无机化学(第6版)	张天蓝	北京大学药学院
	无机化学学习指导与习题集(第3版)	姜凤超	华中科技大学同济药学院
7	分析化学(第7版)(配光盘)	李发美	沈阳药科大学
	分析化学学习指导与习题集(第3版)	赵怀清	沈阳药科大学
	分析化学实验指导(第3版)	赵怀清	沈阳药科大学
8	有机化学(第7版)	陆 涛	中国药科大学
	有机化学学习指导与习题集(第3版)	陆 涛	中国药科大学
9	人体解剖生理学(第6版)	岳利民	四川大学华西基础医学与法医学院
		崔慧先	河北医科大学
10	微生物学与免疫学(第7版)	沈关心	华中科技大学同济医学院
11	生物化学(第7版)	姚文兵	中国药科大学
12	药理学(第7版)	朱依淳	复旦大学药学院
		殷 明	上海交通大学药学院
	药理学学习指导与习题集(第2版)	程能能	复旦大学药学院
13	药物分析(第7版)	杭太俊	中国药科大学
	药物分析学习指导与习题集***	于治国	沈阳药科大学
	药物分析实验指导***	范国荣	第二军医大学
14	药用植物学(第6版)	张 浩	四川大学华西药学院
	药用植物学实践与学习指导***	黄宝康	第二军医大学

续表

序号	教材名称	主编	单位
15	生药学(第6版)	蔡少青	北京大学药学院
	生药学实验指导(第2版)	刘塔斯	湖南中医药大学
16	药物毒理学(第3版)	楼宜嘉	浙江大学药学院
17	临床药物治疗学(第3版)	姜远英	第二军医大学
18	药物化学(第7版)(配光盘)	尤启冬	中国药科大学
	药物化学学习指导与习题集(第3版)	孙铁民	沈阳药科大学
19	药剂学(第7版)	崔福德	沈阳药科大学
	药剂学学习指导与习题集(第2版)	王东凯	沈阳药科大学
	药剂学实验指导(第3版)	崔福德	沈阳药科大学
20	天然药物化学(第6版)	吴立军	沈阳药科大学
	天然药物化学习题集(第3版)	吴立军	沈阳药科大学
	天然药物化学实验指导(第3版)	吴立军	沈阳药科大学
21	中医药学概论(第7版)	王建	成都中医药大学
22	药事管理学(第5版)(配光盘)	杨世民	西安交通大学医学院
	药事管理学学习指导与习题集(第2版)	杨世民	西安交通大学医学院
23	药学生物学(第4版)	张景海	沈阳药科大学
24	生物药剂学与药物动力学(第4版)	刘建平	中国药科大学
	生物药剂学与药物动力学学习指导与习题集(第2版)	李高	华中科技大学同济药学院
25	药学英语(上、下册)(第4版)(配光盘)	史志祥	中国药科大学
	药学英语学习指导(第2版)	史志祥	中国药科大学
26	药物设计学(第2版)	徐文方	山东大学药学院
27	制药工程原理与设备(第2版)	王志祥	中国药科大学
28	生物技术制药(第2版)	王凤山	山东大学药学院
29	生物制药工艺学*	何建勇	沈阳药科大学
30	临床医学概论**	于锋	中国药科大学
31	波谱解析**	孔令义	中国药科大学

*为第七轮未修订,直接沿用第六轮规划教材;**为第七轮新编教材;***为第七轮新编配套教材。

全国高等学校药学专业第四届 教材评审委员会名单

顾 问

郑 虎 四川大学华西药学院

主任委员

毕开顺

副主任委员

姚文兵 朱家勇 张志荣

委 员 (以姓氏笔画为序)

王凤山 山东大学药学院
刘俊义 北京大学药学院
朱依淳 复旦大学药学院
朱家勇 广东药学院
毕开顺 沈阳药科大学
张志荣 四川大学华西药学院
张淑芳 中国执业药师协会
李 高 华中科技大学同济药学院
李元建 中南大学药学院
李勤耕 重庆医科大学
杨世民 西安交通大学医学院
杨晓红 吉林大学药学院
陆 涛 中国药科大学
陈 忠 浙江大学药学院
罗光明 江西中医学院
姚文兵 中国药科大学
姜远英 第二军医大学
曹德英 河北医科大学
黄 民 中山大学药学院
彭代银 安徽中医学院
潘卫三 沈阳药科大学

前 言

《药物化学》第七版在全体编委的努力下终于正式出版发行了。本教材在多版主编郑虎教授的领导下,经过十余年的建设在全国范围内产生了深远的影响,成为药学类专业主要的教科书。承蒙人民卫生出版社和郑虎教授的推荐,让我担任该教材第七版的主编,感到所担负的责任重大。在教材的编写过程中,得到广大编委的支持和帮助,出版社也给予了积极的配合,使该教材的编写得以顺利进行,并完成了编写任务。特别是在第七版教材的编写中,我们仍邀请郑虎教授担纲该教材的主审,郑虎教授为本教材的编写提出了不少建议和意见,并为本教材的质量把关。

第七版《药物化学》教材基本传承了第六版教材的章节安排,结合药学专业对学生培养的要求和对药学知识的理解,在教材中增加了药物代谢反应一章。在教材的编排形式上在广泛听取教学第一线教师的意见的基础上进行了一些改动,在教材的内容安排上尽量考虑药物化学与生物学、临床应用等紧密结合。在本教材中注重介绍各类药物的发现和发展过程,药物的结构类型、理化性质、构效关系、变化规律,及主要合成路线,兼顾介绍新药的设计、发现和发展过程,以及新药研究过程中所使用的方法、原理。

第七版教材在编写过程中得到国内高校中长期从事药物化学教学和科研的教师的大力支持和鼎力相助。第七版教材共有十四章,中国药科大学尤启冬教授参加编写第一章和第十四章,四川大学华西药学院郭丽教授编写第二章,北京大学药学院徐萍教授编写第三章,广东药学院林汉森教授编写第四章和第十二章,大连医科大学甄宇红教授编写第五章,沈阳药科大学孙铁民教授编写第六章和第九章,山西医科大学李青山教授编写第七章,中国药科大学徐云根教授编写第八章,天津医科大学王润玲教授编写第十章,重庆医科大学余瑜教授编写第十一章,山东大学药学院赵桂森教授编写第十三章。中国药科大学尤启冬教授对全书的稿件进行阅读、修改和统稿。但限于业务水平和教学经验仍会有缺点、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和批评。

编者

2011年7月

目 录

第一章 绪论 introduction	1
第一节 药物化学的起源与发展 historical development of medicinal chemistry	1
第二节 药物的命名 nomenclature of drug substances	7
第二章 中枢神经系统药物 central nervous system drugs	13
第一节 镇静催眠药 sedative-hypnotics	13
一、苯二氮草类 (benzodiazepines)	13
二、巴比妥类 (barbiturates)	21
三、非苯二氮草类 GABA _A 受体激动剂 (nonbenzodiazepines GABA _A agonists)	26
第二节 抗癫痫药物 antiepileptics	28
一、酰胺类 (ureides)	29
二、苯二氮草类 (benzodiazepines)	32
三、二苯并氮杂草类 (dibenzazepines)	32
四、GABA 衍生物 (analogy of GABA)	34
五、脂肪酸类及其他类 (carboxylic acids and others)	35
第三节 抗精神病药 antipsychotics	37
一、吩噻嗪类 (phenothiazines)	37
二、噻吨类 (thioxanthenes)	43
三、丁酰苯类 (butyrophenones)	44
四、二苯并二氮草类及其衍生物 (dibenzodiazepines and their derivatives)	47
五、取代苯甲酰胺类 (benzamides)	49
第四节 抗抑郁药 antidepressants	50
一、单胺氧化酶抑制剂 (monoamine oxidase inhibitors, MAOI)	51
二、5-羟色胺重摄取抑制剂 (serotonin-reuptake inhibitors)	52
三、去甲肾上腺素重摄取抑制剂 (norepinephrine-reuptake inhibitors)	54
第五节 镇痛药 analgesics	58
一、吗啡及其衍生物 (morphine and its derivatives)	58
二、合成镇痛药 (synthetic analgesics)	62
三、阿片受体和内源性阿片样镇痛物质 (endogenic opiate-like analgesics)	69

四、阿片样镇痛药的构效关系(structure-activity relationships of opioid analgesics)	73
第六节 神经退行性疾病治疗药物 drug for neurodegeneration disease	74
一、抗帕金森病药(antiparkinsonism agents)	74
二、抗阿尔茨海默病药物(anti-Alzheimer disease agents)	79
第三章 外周神经系统药物 peripheral nervous system drugs	84
第一节 拟胆碱药 cholinergic drugs	84
一、胆碱受体激动剂(cholinoceptor agonists)	85
二、乙酰胆碱酯酶抑制剂(acetylcholinesterase inhibitors)	88
第二节 抗胆碱药 anticholinergic drugs	92
一、生物碱类 M 受体拮抗剂(M receptor antagonist of alkaloids)	92
二、合成 M 受体拮抗剂(synthetic M receptor antagonists)	96
三、N 受体拮抗剂(N receptor antagonists)	100
第三节 肾上腺素受体激动剂 adrenergic receptor agonists	106
一、拟肾上腺素药物(adrenomimetic drugs)	107
二、 α_2 受体激动剂(α_2 adrenergic receptor agonists)	112
三、选择性 β 受体激动剂(selective β adrenergic receptor agonists)	114
四、肾上腺素受体激动剂的构效关系(structure-activity relationships of adrenergic receptor agonists)	118
第四节 组胺 H_1 受体拮抗剂 histamine H_1 receptor antagonists	118
一、经典的 H_1 受体拮抗剂(typical H_1 antihistamines)	120
二、非镇静 H_1 受体拮抗剂(nonsedating H_1 antihistamines)	125
三、组胺 H_1 受体拮抗剂的结构特点(structure characteristics of H_1 antihistamines)	131
第五节 局部麻醉药 local anesthetics	131
一、局部麻醉药的发展(development of local anesthetics)	132
二、苯甲酸酯类局部麻醉药(local anesthetics of benzoates)	133
三、酰胺类局部麻醉药(local anesthetics of amides)	135
四、氨基酮类及其他类局部麻醉药(local anesthetics of amino ketones and others)	137
五、局部麻醉药的作用机制和构效关系(action mechanism of local anesthetics and their structure-activity relationships)	139
第四章 循环系统药物 circulatory system agents	142
第一节 β 受体阻滞剂 β adrenergic receptor block agents	142
一、 β 受体阻滞剂(β adrenergic antagonists)	142
二、 β 受体阻断剂结构与活性关系(structure-activity relationships of β adrenergic antagonists)	149
第二节 钙通道阻滞剂 calcium channel blockers	149

一、L-型钙通道阻滞剂作用机制(action mechanism of L-type calcium channel blockers)	150
二、1,4-二氢吡啶类钙通道阻滞剂及其构效关系(1,4-dihydropyridine calcium channel blockers and their structure-activity relationships)	150
三、苯并硫氮草类钙通道阻滞剂(benzothiazepin calcium channel blockers)	155
四、苯烷基胺类钙通道阻滞剂(phenylalkylamine calcium channel blockers)	157
五、其他类钙通道阻滞剂(other miscellaneous calcium channel blockers)	159
第三节 钠、钾通道阻滞剂 sodium and potassium channels blockers	160
一、钠通道阻滞剂(sodium channels blockers)	160
二、钾通道阻滞剂(potassium channels blockers)	164
第四节 血管紧张素转化酶抑制剂及血管紧张素Ⅱ受体拮抗剂 angiotensin converting enzyme inhibitors and angiotensin Ⅱ receptor antagonists	166
一、血管紧张素转化酶抑制剂(angiotensin converting enzyme inhibitors, ACEIs)	167
二、血管紧张素Ⅱ受体拮抗剂(angiotensin Ⅱ receptor antagonists)	172
第五节 NO 供体药物 NO donor drugs	175
一、NO 供体药物作用机制(action mechanism of NO donor drugs)	176
二、硝酸酯及亚硝酸酯类(nitrates and nitrites)	176
第六节 强心药 cardiac agents	180
一、强心苷类(glycosides)	181
二、强心苷类药物构效关系(structure-activity relationships of glycosides)	183
第七节 调血脂药 lipid regulators	184
一、血脂的化学和生物化学(chemistry and biochemistry of lipid)	184
二、羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑制剂(HMG-CoA reductase inhibitors)	184
三、影响胆固醇和三酰甘油代谢药物(drugs affecting metabolism of cholesterol and triglycerides)	188
第八节 抗血栓药 antithrombotic drugs	192
一、抗血小板药(antiplatelet agents)	192
二、抗凝血药(anticoagulated blood agents)	194
第九节 其他心血管系统药物 other miscellaneous circulatory system agents	196
一、作用于 α 肾上腺素受体的药物(drugs acting on α adrenergic receptors)	196
二、作用于血管平滑肌药物和作用于交感神经末梢药物(drugs acting on vascular smooth muscle and sympathetic nerve ending)	198
第五章 消化系统药物 digestive system agents	202
第一节 抗溃疡药 anti-ulcer agents	202
一、H ₂ 受体拮抗剂(H ₂ receptor antagonists)	205
二、质子泵抑制剂(proton pump inhibitors)	209
第二节 止吐药 antiemetics	215
一、5-HT ₃ 受体拮抗剂(5-HT ₃ receptor antagonist)	216

二、NK ₁ 受体拮抗剂(NK ₁ receptor antagonists)	219
第三节 促胃动力药 prokinetics	221
一、多巴胺 D ₂ 受体拮抗剂(D ₂ receptor antagonists)	223
二、5-HT ₄ 受体激动剂(5-HT ₄ receptor antagonist)	226
第四节 肝胆疾病辅助治疗药物 adjuvant for hepatic and biliary diseases	227
一、肝病辅助治疗药物(adjuvant for hepatic diseases)	227
二、胆病辅助治疗药(adjuvant for biliary diseases)	232
第六章 解热镇痛药和非甾体抗炎药 antipyretic analgesics and nonsteroidal anti-inflammatory agents	235
第一节 解热镇痛药 antipyretic analgesics	235
一、水杨酸类药物(salicylic acids)	236
二、苯胺类药物(anilines)	239
第二节 非甾体抗炎药 nonsteroidal anti-inflammatory agents	241
一、吡唑酮类药物(pyrazolones)	241
二、邻氨基苯甲酸类药物(anthranilic acids)	244
三、芳基烷酸类药物(aryl carboxylic acids)	245
四、1,2-苯并噻嗪类(1,2-benzothiazines)	253
五、选择性 COX-2 抑制剂(selective COX-2 inhibitors)	255
第七章 抗肿瘤药 antineoplastic agents	258
第一节 生物烷化剂 bioalkylating agents	258
一、氮芥类(nitrogen mustards)	259
二、乙撑亚胺类(aziridines)	263
三、亚硝基脲类(nitrosoureas)	263
四、磺酸酯类(sulfonates)	265
五、金属铂配合物(organoplatinum compounds)	267
第二节 抗代谢药物 antimetabolic agents	270
一、嘧啶拮抗物(pyrimidine antimetabolites)	270
二、嘌呤拮抗物(purine antimetabolites)	273
三、叶酸拮抗物(folate antimetabolites)	275
第三节 抗肿瘤抗生素 anticancer antibiotics	277
一、多肽类抗生素(peptide antibiotics)	277
二、蒽醌类抗生素(anthracyclines)	279
第四节 抗肿瘤的植物药有效成分及其衍生物 anticancer compounds from plants and their derivatives	282
一、喜树碱类(camptothecins)	282
二、长春碱类(vinca alkaloids)	284
三、紫杉醇类(taxanes)	286
第五节 肿瘤治疗的新靶点及其药物 new targets and the related drugs	289

一、肿瘤细胞信号传导(tumor cell signal transduction)	289
二、肿瘤血管生长抑制剂(angiogenesis inhibitor)	291
三、反义核苷酸(antisense oligodeoxynucleotides)	293
第八章 抗生素 antibiotics	294
第一节 β -内酰胺类抗生素 β -lactam antibiotics	295
一、青霉素类(penicillins)	296
二、头孢菌素类(cephalosporins)	307
三、 β -内酰胺酶抑制剂及非经典的 β -内酰胺类抗生素(β -lactamase inhibitor and non-classical β -lactam antibiotics)	316
第二节 四环素类抗生素 tetracyclines antibiotics	320
第三节 氨基苷类抗生素 aminoglycoside antibiotics	323
第四节 大环内酯类抗生素 macrolide antibiotics	325
第五节 氯霉素类抗生素 chloramphenicol antibiotics	331
第九章 化学治疗药 chemotherapeutic agents	335
第一节 喹诺酮类抗菌药 quinolone antimicrobial agents	335
一、喹诺酮类药物的研究进展(development of quinolone antimicrobial agents)	335
二、喹诺酮类药物的作用机制(action mechanism of quinolone antimicrobial agents)	339
三、喹诺酮类药物(quinolone antimicrobial agents)	340
第二节 抗结核药物 tuberculostatics	343
一、合成抗结核药物(synthetic antitubercular agents)	343
二、抗结核抗生素(antitubercular antibiotics)	347
第三节 磺胺类药物及抗菌增效剂 antimicrobial sulfonamides and antibacterial synerists	350
第四节 抗真菌药物 antifungals drugs	355
一、抗真菌抗生素(antifungal antibiotics)	355
二、唑类抗真菌药物(azole antifungal agents)	357
三、其他抗真菌药物(other antifungal agents)	360
第五节 抗病毒药物 antiviral agents	361
一、抑制病毒复制初始时期的药物(agents inhibiting early viral replication)	361
二、干扰病毒核酸复制的药物(agents interfering with viral nucleic acid replication)	364
三、抗艾滋病药物(anti-AIDS agents)	369
第六节 抗寄生虫药 antiparasitic drugs	375
一、驱肠虫药(anthelmintic drugs)	375
二、抗血吸虫病药(antischistosomal)	377

三、抗疟药(antimalarial drugs)	378
第十章 降血糖药物及利尿药 hypoglycemic drugs and diuretics	385
第一节 降血糖药 hypoglycemic drugs	385
一、胰岛素及其类似物(insulin and analogues)	385
二、胰岛素分泌促进剂(promoter to insulin secretion)	388
三、胰岛素增敏剂(insulin enhancers)	392
四、 α -葡萄糖苷酶抑制剂(α -glucosidase inhibitors)	395
五、二肽基肽酶-IV抑制剂(dipeptidyl peptidase-IV inhibitors)	396
第二节 利尿药 diuretics	397
一、碳酸酐酶抑制剂(carbonic anhydrase inhibitors)	398
二、 $\text{Na}^+ - \text{Cl}^-$ 协转运抑制剂($\text{Na}^+ - \text{Cl}^-$ cotransport inhibitors)	399
三、 $\text{Na}^+ - \text{K}^+ - 2\text{Cl}^-$ 协转运抑制剂($\text{Na}^+ - \text{K}^+ - 2\text{Cl}^-$ cotransport inhibitors)	402
四、阻断肾小管上皮 Na^+ 通道药物(blocking agents of renal tubule epithelium sodium channels)	404
五、盐皮质激素受体阻断剂(mineralocorticoid receptor antagonists)	405
第十一章 激素类药物 hormone drugs	408
第一节 前列腺素类药物 prostaglandin drugs	409
第二节 肽类激素类药物 peptide hormone drugs	413
第三节 甾体激素类药物 steroid hormone drugs	416
一、甾体雌激素药物(steroidal estrogen drugs)	417
二、非甾体雌激素及抗雌激素药物(nonsteroidal estrogen drugs and antiestrogens)	421
三、雄性激素、蛋白同化激素和抗雄性激素药物(androgens、anabolic androgenic drugs and antiandrogens)	426
四、孕激素药物(progesterin drugs)	431
五、甾体避孕药物(steroidal contraceptives)	433
六、孕激素拮抗剂(antiprogestins)	436
七、肾上腺皮质激素药物(adrenal cortex drugs)	440
第十二章 维生素 vitamins	448
第一节 脂溶性维生素 fat soluble vitamins	448
一、维生素 A 类(vitamin A)	448
二、维生素 D 类(vitamin D)	452
三、维生素 E 类(vitamin E)	456
四、维生素 K 类(vitamin K)	460
第二节 水溶性维生素 water soluble vitamins	461
一、维生素 B 类(vitamin B)	462
二、维生素 C 类(vitamin C)	470

第十三章 新药设计与开发 drug design and development	475
第一节 药物的化学结构与生物活性的关系 structure-activity relationships of drugs	476
一、理化性质与生物活性(physicochemical properties of drugs and their biological activity)	476
二、药物-受体相互作用(drug-receptor interaction)	478
第二节 先导化合物的发现 lead discovery	484
一、从天然产物得到先导化合物(from natural product sources)	484
二、以现有药物作为先导化合物(from approved drugs)	485
三、用活性内源性物质作先导化合物(from endogenous active substances)	487
四、利用组合化学和高通量筛选得到先导化合物(by combinational chemistry and high throughput screening)	487
五、利用计算机进行靶向筛选得到先导化合物(by screening compound databases)	488
第三节 先导化合物的优化 lead optimization	488
一、生物电子等排替换(bioisosteric replacement)	488
二、前药设计(prodrug design)	489
三、软药设计(soft drug design)	491
第四节 定量构效关系 quantitative structure-activity relationships	492
一、Hansch 方法(Hansch method)	493
二、Hansch 方法在药物设计中的应用(application of Hansch method in drug design)	497
三、三维定量构效关系(3D-QSAR)	498
第五节 计算机辅助药物设计 computer-aided drug design	501
一、直接药物设计(direct drug design)	501
二、间接药物设计(indirect drug design)	504
第十四章 药物代谢反应 drug metabolism	506
第一节 概述 introduction	506
第二节 药物代谢的酶 enzymes for drug metabolism	506
一、细胞色素 P450 酶系(cytochrome P450 enzyme system)	507
二、还原酶系(reductase)	508
三、过氧化物酶和单加氧酶(oxidases and other monooxygenases)	508
四、水解酶(hydrolases)	509
第三节 第 I 相的生物转化 phase I biotransformation	509
一、氧化反应(oxidations)	509
二、还原反应(reductions)	520
三、脱卤素反应(dehalogenation)	523
四、水解反应(hydrolysis)	523

第四节 第Ⅱ相的生物转化 phase II biotransformation	524
一、葡萄糖醛酸的结合(glucuronic acid conjugation)	525
二、硫酸酯化结合(sulfate conjugation)	526
三、氨基酸的结合(conjugation with amino acid)	527
四、谷胱甘肽结合(glutathione conjugation)	529
五、乙酰化结合(acetylation)	530
六、甲基化结合(methylation)	531
第五节 药物代谢在药物研究中的作用 role of drug metabolism in drug research	532
一、设计和发现新药(design and discovery of new drugs)	532
二、优化药物的药动学性质(optimization of drug pharmacokinetics)	533
三、解释药物的作用机制(explaining action mechanism of drugs)	534
附录	535
附录一 一些天然物的分离、结构阐明、合成与重要合成药物发明年代	535
附录二 药物研究中的新方法和新技术	537
附录三 选读文献	547
中英文对照索引	548