

药学专业课堂笔记 口袋丛书

复习有帮手 考试轻松过

药物化学

课堂笔记

主编 / 贾 嫻 主审 / 孙铁民

药学专业课堂笔记口袋丛书编写委员会 组织编写

特 点



课堂笔记——紧扣教学大纲和要求



重点难点提示——掌握重要知识点，便于学习



测试及考研——精选历年考试、考研真题



课堂随记——便于学生随时随地记忆和复习



人民军医出版社

PEOPLE'S MILITARY MEDICAL PRESS

中国药科大学教材 第2版

主编 曹雪琴 副主编 张淑娟

药物化学

课堂笔记

主编 曹雪琴 副主编 张淑娟

化学工业出版社 中国药科大学教材 第2版

前言

- 一、本书特点——本书为药科大学教材，第2版。
- 二、本书编写——本书为药科大学教材，第2版。
- 三、本书编写——本书为药科大学教材，第2版。
- 四、本书编写——本书为药科大学教材，第2版。



化学工业出版社
CHINA CHEMICAL INDUSTRY PRESS

药学专业课堂笔记口袋丛书

药物化学课堂笔记

YAOWU HUAXUE KETANG BIJI

主 编 贾 娴

主 审 孙铁民



人民军医出版社

PEOPLE'S MILITARY MEDICAL PRESS

北 京

图书在版编目(CIP)数据

药物化学课堂笔记/贾 娴主编. —北京:人民军医出版社, 2011. 1

(药学专业课堂笔记口袋丛书)

ISBN 978-7-5091-4478-7

I. ①药… II. ①贾… III. ①药物化学—高等学校—教学参考资料 IV. ①R914

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2010)第 227622 号

策划编辑:高玉婷 文字编辑:李 燕 吴 倩 责任审读:伦踪启

出 版 人:石 虹

出版发行:人民军医出版社

经销:新华书店

通信地址:北京市 100036 信箱 188 分箱

邮编:100036

质量反馈电话:(010)51927290;(010)51927283

邮购电话:(010)51927252

策划编辑电话:(010)51927300-8020

网址:[www. pmmp. com. cn](http://www.pmmp.com.cn)

印刷:京南印刷厂 装订:桃园装订有限公司

开本:850mm×1168mm 1/36

印张:13 字数:395 千字

版、印次:2011 年 1 月第 1 版第 1 次印刷

印数:0001~3000

定价:29.80 元

版权所有 侵权必究

购买本社图书,凡有缺、倒、脱页者,本社负责调换

《药学专业课堂笔记口袋丛书》

编审委员会名单

主 编 赵春杰
编 委 (以姓氏笔画为序)
马恩龙 王齐放 宋少江
张 嵘 张丽娟 范晓文
周丽娜 周晓棉 赵 兵
赵春杰 贾 英 贾 娴
徐 成 彭 纓

《药物化学课堂笔记》

分册编委

主 编 贾 娴
主 审 孙铁民
编 委 (以姓氏笔画为序)
付 晔 赵燕芳 贾 娴
翟 鑫

内 容 提 要

本书是《药学专业课堂笔记口袋丛书》之一,由国内著名药科大学教学一线的教师编写,整套书都是按照最新版国家规划教材编写。在编排风格上,简单概括为“三框一栏”。“”课堂笔记框,严格按照最新版国家规划教材编写,省去记录时间,集中精力听课。“”重点难点提示框,考试重点内容。“”测试及考研框,指导考研方向。“”课堂随记栏,边学边记,真正把书本的知识变成自己的知识。本书适合药学专业本科生学习使用,同时也可作为药学专业研究生入学考试、药学成人教育考试的参考书。

丛书前言

教育部对高校进行的大评估已转为专业认证,我国高等学校药学类本科专业认证(以下简称专业认证)工作目前已对广东药学院、海南医学院、内蒙古医学院、中国药科大学和沈阳药科大学进行了试点认证,以期提高药学类专业办学质量。全国药学本科专业认证标准中将药学本科专业认证课程体系分为五类:①人文及社会科学课程体系。②数学、物理、信息技术课程体系。③化学基础课程体系。④生物学与医学基础课程体系。⑤学科专业课程体系。其中,化学基础课程体系、生物学与医学基础课程体系和学科专业课程体系课程是主干课程,即无机化学、分析化学、有机化学、物理化学、人体解剖生理学、微生物学、免疫学基础、生物化学、临床医学概论、药物化学、药剂学、药理学、药物分析、天然药物化学和生药学等。

本套丛书以药学专业认证主干课程为主,依据药学专业本科教育的培养目标和药学类本科教学大纲的基本要求,针对学生听课记录困难、复习抓不住重点及不熟悉考试题型和题量等实际问题,展示精要知识,帮助学生课上集中听讲,复习抓住重点,达到事半功倍的效果。另外,面对目前本科生考研的趋势,本套丛书还增加了一部分考研真题。

本套丛书每章由“”课堂笔记、“”重点难点提示、“”测试及考研三大部分组成,同时还设有“”课堂随记栏便于学生随书记录,方便记忆。课堂笔记部分紧扣最新教学大纲和要求,以“★★★”“★★”和“★”标出掌握、熟悉和了解的内容,便于学生复习时有所侧重;重点难点提示部

分,依据最新教学大纲,对每一章节内容提出具体的要求,并简明扼要地阐述各章的基本要点、重点和难点,有利于学生掌握重要知识点,提高学习效率;测试及考研部分,根据每章的具体情况题型调整,包含历年考试与考研真题,并提供简要的参考答案。本套丛书每册专门提供了3或4套近年考试真题及解答,供学生选择试做,力求让学生熟悉和了解考试题型、题量及难度。

本套丛书有三大特点:①作者权威。本套丛书作者均为多年工作于教学第一线的具有副高以上职称的教师,教学经验丰富;②实用性强。本套丛书有课堂笔记、复习及练习等多项功能,全面解决学生听课记录困难、复习抓不住重点等实际问题;③方便携带。本套丛书设计为口袋书,便于学生随身携带,随时随地拿出来复习,轻松应对考试。

本套丛书由沈阳药科大学药学专业课堂笔记口袋丛书编写委员会编写,书中可能存在错误和疏漏,敬请各位读者海涵,同时欢迎各位同仁和读者批评、指正。

药学专业课堂笔记口袋丛书编写委员会

2010年8月

前言

本书是依据药学专业本科教育的培养目标和药学类本科《药物化学教学大纲》的基本要求,围绕药物化学课程的主要知识点,以轻松、高效地掌握相关理论知识,帮助学生学好药物化学课程为目标而编写的。

本书各章节的编排顺序与尤启东主编国家规划教材《药物化学》(第6版)相同。在编排风格上,简单概括为“三框一栏”。“”课堂笔记框,严格按照最新版国家规划教材编写,省去记录时间,集中精力听课;“”重点难点提示框,考试重点内容;“”测试及考研框,指导考研方向;“”课堂随记栏,边学边记,真正把书本的知识变成自己的知识。课堂笔记是本书根据教学大纲和要求,以“★★★”“★★”和“★”标出掌握、熟悉和了解的内容,便于学生复习时有所侧重;在重点难点提示部分,依据教学大纲,对每一章节内容提出具体的要求,并简明扼要地阐述各章的基本要点、重点和难点,有利于学生掌握知识点,提高学习效率;测试及考研部分,根据每章的具体情况进行题型调整,包括单项选择题、多项选择题、填空题、合成题、问答题、药物设计题、结构与药理活性题等,并提供简捷的参考答案。本书最后专门提供了3套考试模拟题及解答供读者选择试做,力求让学生熟悉和了解考试题型、题量及难度。

本书由沈阳药科大学药物化学教研室孙铁民老师担任主

审,贾娴、赵燕芳、付晔、翟鑫老师编写。

由于编者的水平和能力所限,书中可能会有不妥之处,敬请各位读者海涵,同时欢迎各位同行专家和读者指正。

编 者

2010年8月

目 录

绪论	(1)
第一章 新药研究与开发概论	(4)
第二章 药物设计的基本原理和方法	(8)
第三章 药物的结构与生物活性	(16)
第四章 药物代谢	(24)
第五章 镇静催眠药和抗癫痫药	(33)
第六章 精神神经疾病治疗药	(51)
第七章 神经退行性疾病治疗药物	(67)
第八章 镇痛药	(80)
第九章 局部麻醉药	(90)
第十章 拟胆碱和抗胆碱药物	(98)
第十一章 组胺受体拮抗剂及抗过敏药和抗溃疡药	(117)
第十二章 作用于肾上腺素能受体的药物	(137)
第十三章 抗高血压药和利尿药	(158)
第十四章 心脏疾病治疗药物和血脂调解药	(185)
第十五章 甾体激素类药物	(208)
第十六章 降血糖药和骨质疏松治疗药物	(222)
第十七章 合成抗菌药	(235)
第十八章 抗病毒药	(263)
第十九章 抗生素	(278)
第二十章 抗肿瘤药物	(304)
第二十一章 抗寄生虫药	(327)
第二十二章 非甾体抗炎药	(337)
第二十三章 维生素	(365)
考试真题(一)及答案	(377)
考试真题(二)及答案	(387)
考试真题(三)及答案	(398)

绪 论



课堂笔记

一、药物化学的研究内容和任务**

1. 药物化学 是关于药物发现、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。是建立在化学学科基础上,涉及生物学、医学和药学等各个学科的内容。

2. 药物化学研究的主要内容 基于潜在药物作用靶点,设计新的活性化合物分子;研究化学药物的制备原理、合成路线及其稳定性;研究化学药物的化学结构与生物体相互作用的方式、体内吸收、分布和代谢的规律及其代谢产物;研究药物的构效关系、构代关系、构毒关系等;寻找和发现新药。

3. 重要内容 如何设计和合成新药。

4. 药物化学的主要任务 发现先导化合物,并进行结构优化和改造,创造出疗效好、不良反应小的新药;对现有药物的改造;实现药物的产业化;研究药物的理化性质、变化规律、杂质来源和体内代谢等。

5. 药物化学总目标 创制新药和有效地利用或改进现有药物,不断地提供新品种,促进医药工业的发展,为保障人民健康服务。

二、药物化学的研究和发展*

1. 19 世纪中期 化学工业发展(乙醚——全身麻醉药;水合氯醛——镇静药)。

2. 19 世纪末 20 世纪初 阿司匹林、苯佐卡因、安替比林、非那西汀。开始探索药物的药效团、作用机制、受体结构、构效关系。

3. 20 世纪初期 药物化学研究基本理论的总结和应用;同系原



理、同型原理、电子等排原理和拼合原理。

4. 20 世纪 30 年代 磺胺类药物及其作用机制——“代谢拮抗”学说。

5. 20 世纪 40 年代 青霉素类抗生素时代。

6. 20 世纪 50 年代 对酶、蛋白质、受体、离子通道的性能和作用有了深入的研究,发现抑制药和调控剂。

7. 20 世纪 60 年代 激素药物时代,皮质激素、口服避孕药。定量构效关系。

8. 20 世纪 70 年代 化学治疗药、心血管、肿瘤、内分泌。

9. 20 世纪 80 年代 合成抗生素等,组合化学。

10. 20 世纪 90 年代 新的药物设计和发现的方法不断产生和发展,如基于结构的药物设计、基于机制的药物设计、基于靶点的药物设计等方法。

11. 近年来 生命科学的迅猛发展、新药的设计和研究,由单纯的化学方法向以生物学为导向的、化学和分子生物学相结合的方向发展。

三、我国药物化学的发展★

我国创制药:抗肿瘤药包括氮甲、干磷酰基芥、平阳霉素、斑蝥素及其衍生物、三尖杉酯等生物碱;山莨菪碱、樟柳碱;石杉碱甲;青蒿素、双氢青蒿素、蒿甲醚、青蒿琥酯(抗疟药);联苯双酯(抗肝炎);羟甲芬太尼(镇痛药)。

四、药物化学发展的新方向★

1. 新药研究的新模式。
2. 计算机辅助药物设计的新方法。
3. 手性药物。



重点难点提示

1. 掌握药物化学的研究内容和任务。
2. 熟悉药物化学的研究和发展。
3. 了解我国药物化学的发展和药物化学发展的新方向。
4. 难点是药物化学发展的新方向。



测试及考研

一、填空题

1. 药物化学研究的主要内容:基于潜在(),设计新的();研究化学药物的()、()及其稳定性;研究化学药物的()与()相互作用的方式、(),分布和()的规律及其代谢产物;研究药物的()、()等;寻找和发现新药。

2. 药物化学的主要任务:发现(),并进行(),创造出疗效好、不良反应小的新药;对现有药物的改造;实现药物的产业化;研究药物的理化性质、变化规律、杂质来源和体内代谢等。

二、问答题

什么是药物化学? 写出药物化学研究的内容和任务。

答案:

一、

1. 药物作用靶点,活性化合物分子,制备原理,合成路线,化学结构,生物体,体内吸收,构效关系代谢,构代关系,构毒关系;2. 先导化合物,结构优化和改造。

二、略。

(贾 炯)

第一章 新药研究与开发概论



课堂笔记

一、新药研究与开发的过程和方法

1. 新药的发现分为 4 个阶段:靶分子的确定和选择、靶分子的优化、先导化合物的发现和先导化合物的优化。

2. 新药的开发阶段是居于新药的发现研究和市场化之间的重要过程,分为前期开发和后期开发两个部分。

3. 进入新药研究与开发阶段的具有一定活性的新化合物称为研究中的新药(investigating new drugs, IND)。

4. 前期开发主要包括临床前毒理学研究、IND 的制备、临床前各类研究、有选择的 I 期临床研究和早期的 II 期临床研究。

5. 后期开发主要涉及大量的临床研究工作,以及临床前及临床中所得数据的整理和药物的工业化过程。

6. 临床研究是在人体上进行的,以确证新药的药效结果和安全性,同时决定其给药途径和使用注意等事项。在我国,临床研究分为 I、II、III、IV 期。

(1) I 期临床研究:主要评价新药在人体中的安全性、耐受性(剂量和副作用)、人体中的药动学性质和药理学作用,而不对其疗效进行评价。

(2) II 期临床研究:在患者身上进行,主要评价新药的有效性;通过与对照药的比较,了解其治疗价值和安全性;确定新药的适应证及最佳治疗方案,包括剂量、给药途径、给药次数和疗程等;考察新药的不良反应及其危险性。

(3) III 期临床研究:通过随机、双盲对照试验的方法,进行大规模、较长时间的临床试验,确定药物的疗效,监测药物的不良反应。

(4) IV 期临床研究:新药上市后应用研究阶段。其目的是考察在广泛使用条件下的药物的疗效和不良反应,评价在普通或者特殊人

群中使用的利益与风险关系以及改进给药剂量等。

二、药物合成研究和质量标准

药物的质量首先决定于药物自身的疗效和不良反应,即药物的有效性和安全性。药物的疗效和副作用反映的是药物的内在质量。

药物的纯度反映的是药物的外在质量,主要考虑药物的含量和杂质。

药物的杂质是指在生产、储存过程中引起或产生的药物以外的其他化学物质,包括由于分子手性的存在而产生的非治疗活性的光学异构体。

药物质量标准中,有 2 个重要的指征:一是药物的纯度,即有效成分的含量;二是药物的杂质限度。

药典是国家控制药品质量的标准,是管理药物生产、检验、供应和销售及使用的依据,具有法律的约束力。

三、新药研究与开发中的知识产权与专利

医药领域的发明,可以分为以下几种。

1. 以医药为用途的活性物质(药物化合物)的发明。
2. 以药物化合物为活性组分的药物组合物(制剂)的发明。
3. 药物化合物或制剂的制备方法的发明。
4. 药物化合物或制剂的医药用途的发明。
5. 医疗器械的发明。
6. 疾病的诊断和治疗方法的发明。

药品专利的保护对象主要是药品领域的新的发明创造,包括新开发的原料药、新的药物制剂或复方、新的制备工艺或其改进。

专利能否授权的条件是该发明的新颖性、创造性和实用性。

我国专利实行的是早期公开、延迟审查制度,在专利自申请日起至专利权保护期限的 20 年中,包括双方互不干涉的过渡期、临时保护期限和保护期。

四、药物的命名

1. 药品的商品名 通常是针对药物的最终产品,即剂量和剂



型已确定的含有一种或多种药物活性成分的药品。含有相同药物活性成分的药品在不同的国家、不同的生产企业可能以不同的商品名销售。药品的商品名在选用时不能暗示药物的疗效和用途。

2. 药物的通用名 也称为国际非专利药品名称(international nonproprietary names, INN), 是新药开发者在新药申请过程中向世界卫生组织提出的名称, 不受专利和行政保护, 是所有文献、资料、教材以及药品说明书中标明的有效成分的名称。各个药物只有一个药品通用名。

中国药品通用名称(chinese approved drug names, CADN), 由我国药典委员会编写的药品命名, 基本上是以世界卫生组织推荐的INN为依据, 中文名尽量和英文名相对应, 以音译为主。



重点难点提示

1. 新药发现的过程。
2. 新药开发的研究内容。
3. 药品专利的基本常识。
4. 药品的商品名、INN 和 CADN 的含义。
5. NCE(新化学实体); IND(研究中的新药); NDA(新药申请); INN(国际非专利药品名称)。



测试及考研

一、最佳选择题

1. 化合物的结构与活性之间的关系被称为()
A. 构代关系 B. 构效关系
C. 构毒关系 D. 构活关系
2. 在患者身上进行临床试验, 主要评价供试药物的有效性的临床研究为()
A. I 期临床研究 B. II 期临床研究
C. III 期临床研究 D. IV 期临床研究

二、X 型题(多项选择题)

1. 新药的发现包括的研究内容为()
A. 靶分子的选择 B. 靶分子的确定
C. 先导化合物的发现 D. 先导化合物的优化