



卫生部“十一五”规划教材 全国高等医药教材建设研究会规划教材

全国高等学校教材·供临床药学专业用

临床药物化学

主 编 翁玲玲



人民卫生出版社
PEOPLE'S MEDICAL PUBLISHING HOUSE

卫生部“十一五”规划教材
全国高等医药教材建设研究会规划教材
全国高等学校教材
供临床药学专业用

临床药物化学

主 编 翁玲玲

编 者 (以姓氏笔画为序)

王润玲 (天津医科大学)

吕子敏 (同济大学药学院)

杨晓虹 (吉林大学药学院)

陈有亮 (西安交通大学医学院)

赵桂森 (山东大学药学院)

翁玲玲 (四川大学华西药学院)

甄宇红 (大连医科大学)

雷小平 (北京大学药学院)

人 民 卫 生 出 版 社

图书在版编目 (CIP) 数据

临床药物化学/翁玲玲主编. —北京: 人民卫生出版社,
2007. 8

ISBN 978-7-117-08910-4

I. 临… II. 翁… III. 药物化学-医学院校-教材
IV. R914

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2007) 第 099234 号

本书本印次封底贴有防伪标。请意识别。

临床药物化学

主 编: 翁玲玲

出版发行: 人民卫生出版社 (中继线 010-67616688)

地 址: 北京市丰台区方庄芳群园 3 区 3 号楼

邮 编: 100078

网 址: [http://www. pmph. com](http://www.pmph.com)

E - mail: pmph @ pmph. com

购书热线: 010-67605754 010-65264830

印 刷: 北京汇林印务有限公司

经 销: 新华书店

开 本: 787 × 1092 1/16 印张: 31. 25

字 数: 721 千字

版 次: 2007 年 8 月第 1 版 2007 年 8 月第 1 版第 1 次印刷

标准书号: ISBN 978-7-117-08910-4/R · 8911

定 价: 53.00 元

版权所有, 侵权必究, 打击盗版举报电话: 010-87613394

(凡属印装质量问题请与本社销售部联系退换)

卫生部“十一五”规划教材

全国高等学校临床药学专业教材

出版说明

看病难看病贵问题长期困扰着我国广大患者,由于药物的不合理应用而加重患者病情,或损害其身体健康的事件也时有发生。医疗机构迫切需要临床药学专门人员开展临床药学工作,为社会降低医疗成本,为公众提供安全有效的药学服务,解决长期难以解决的“看病难看病贵问题”。要实现这一目标必须在药学本科教育中大力发展临床药学教育,在医院长期开展临床药师人才培养。

为满足社会的需要,目前我国有多所高等学校和部分医院已在开展临床药学教学和人才培养工作。卫生部于2005年12月发出了《关于开展临床药师培训试点工作的通知》(卫办科教发[2005]257号),决定在全国开展临床药师培训试点工作,1年多来已在全国设立50个试点单位,工作进展顺利。但无论学校或培训试点单位,目前尚无一套针对性强的教材适合于教学和培训的需要,在教学、培训过程中都是借用其他专业教材或自编教材,这就在一定程度上存在着教材的针对性差,教师不好教,学生不好学,以及因学校和培训单位不同而培养出学生的知识结构、能力水平不一,难以适应岗位要求的情况。

针对我国高等学校临床药学教育和全国临床药师培训的需要,全国高等医药教材建设研究会、卫生部教材办公室在2004年7月正式开始临床药学专业教材编写调研论证工作。在广泛调研的基础上,2006年4月全国高等医药教材建设研究会、卫生部教材办公室组织全国专家进行了专题论证,确定了编写供全国高等学校临床药学专业教学使用的规划教材的内容特色和品种(包括新组织编写教材15种和与其他专业共用教材7种);同时,为保证教材的质量,成立了全国高等学校临床药学专业教材评审委员会。论证会后即开始主编、编者遴选工作,经过全国各医药学教育、科研、医疗的推荐,全国高等学校临床药学专业教材评审委员会遴选,卫生部教材办公室最终确定了主干教材与配套教材主编、副主编和编者,并于2006年6月正式开始编写。2007年初,在卫生部的领导下,由卫生部教材办公室组织,全国高等医药教材建设研究会进行了卫生部“十一五”规划教材评审工作,本套教材及其配套教材全部入选卫生部“十一五”规划教材。

本套教材的编写,坚持以五年制临床药学本科教育为主体,以专业培养目标为方向,以临床药师所需知识和技能为导向,立足“三基”(基本理论、基本知识、基本技能),突出“五性”(思想性、科学性、先进性、启发性、适用性),注重能力培养。以化学、药学

为基础,以医学为支撑,强调药学学科与医学学科的融合。突破现有药学、医学教材的编写模式,注意基础课、专业基础课、专业课程内容取舍和相关知识的相互渗透与衔接,具有更强的针对性。

全国高等学校临床药学专业教材编写工作严格按照卫生部教材办公室“931”质量控制体系进行。在卫生部教材办公室的组织和严格管理,以及在全国高等学校临床药学专业教材评审委员会的指导下,各门教材主编、编者同心协力,积极参加主编人会议、编写会议和定稿会议,始终贯彻会议精神,克服各种困难,以对我国临床药学事业高度负责的态度认真编写教材,保证教材的质量和水平,并达到人民卫生出版社“齐、清、定”的交稿要求。经过1年多的努力,全国高等学校临床药学类专业规划教材即将出版,并向全国公开发行业。

本套教材主要供临床药学专业本科教学使用,也可作为临床药师培训和相关领域在校教育及继续教育教材。

虽然临床药学专业高等教育起步较晚,教学工作和有关教材的编写还需要不断总结、完善,但我们仍希望本套教材的出版有利于临床药学的教育和临床药学专门人才的培养,促进我国临床药学教育事业健康的向前发展,为社会提供更多合格的临床药学人才。

整套教材包括:①基础课程,②医学基础课程,③药学课程,④临床药学课程,⑤临床医学课程,共五个模块。新编教材15种,与其他专业教材共用7种。

(1) 基础课程教材5种

《基础化学》(新编)

《有机化学》(新编)

《临床药学导论》(新编)

《医用高等数学》(与临床医学专业共用)

《医学统计学》(与临床医学专业共用)

(2) 医学基础课程教材5种

《人体解剖生理学》(新编)

《医学生物学基础》(新编)

《微生物学与免疫学》(新编)

《生物化学》(与临床医学专业共用)

《病理生理学》(与临床医学专业共用)

(3) 药学课程教材4种

《药剂学》(新编)

《临床药物化学》(新编)

《药理学》(与临床医学专业共用)

《药物分析》(与药学专业共用)

(4) 临床药学课程教材5种

《临床药理学》(新编)

《临床药物代谢动力学》(新编)

《临床药学英语》(新编)

《临床药物治疗学》(新编)
《医院药事管理》(与药事管理专业共用)

(5) 临床医学课程教材 3 种

《诊断学》(新编)
《内科学基础》(新编)
《外科学总论》(新编)

全套新编教材有:主干教材 15 种,配套教材 4 种,具体品种如下:

- | | | |
|------------------|------|------|
| 1. 临床药学导论 | 蒋学华 | |
| 2. 基础化学 | 徐春祥 | |
| 3. 有机化学 | 宋宏锐 | |
| 有机化学学习指导与习题集 | 宋宏锐 | |
| 4. 微生物学与免疫学 | 黄 敏 | |
| 微生物学与免疫学学习指导与习题集 | 黄 敏 | |
| 5. 人体解剖生理学 | 徐玉东 | |
| 6. 医学生物学基础 | 范礼斌 | |
| 7. 临床药理学 | 王怀良 | 陈凤荣 |
| 临床药理学学习指导与习题集 | 王怀良 | 陈凤荣 |
| 8. 临床药物代谢动力学 | 曾 苏 | |
| 9. 临床药物治疗学 | 李 俊 | |
| 10. 药剂学 | 方晓玲 | |
| 药剂学学习指导与习题集 | 龙晓英 | |
| 11. 临床药物化学 | 翁玲玲 | |
| 12. 外科学总论 | 张阳德 | |
| 13. 内科学基础 | 邹和建 | 陈 垦 |
| 14. 诊断学 | 李学奇 | |
| 15. 临床药学英语 | 李大魁 | |

全国高等医药教材建设研究会

卫生部教材办公室

2007 年 6 月 1 日

全国高等学校临床药学专业教材

评审委员会

- 顾问 金有豫 首都医科大学
吴永佩 卫生部医院管理研究所药事管理研究部,
中国医院协会药事管理专业委员会
郑虎 四川大学华西药学院
- 主任委员 桑国卫 全国人大常委会教科文卫专门委员会,
中国药品生物制品检定所
李大魁 中国药学会,北京协和医院
- 副主任委员 张淑芳 中国执业药师协会,国家食品药品监督管理局执业药师资格认证中心
李俊 安徽医科大学
蒋学华 四川大学华西药学院
朱东亚 南京医科大学
- 委员 (以姓氏笔画为序)
于锋 中国药科大学
刘克辛 大连医科大学
刘俊义 北京大学药学院
印晓星 徐州医学院
孙建平 哈尔滨医科大学
朱依谆 复旦大学药学院
罗向红 沈阳药科大学
娄红祥 山东大学

前言

1989年原华西医科大学药学院（现四川大学华西药学院）在中国首办“临床药学专业”，揭开了“临床药学”人才教育的帷幕，至今已近20年，在此期间“临床药学专业”教育时起时伏，我国的临床药师职业在一些医院得到创建及发展，现在这种国际上通行的“临床药师”职业已逐渐被我国医药学者们认同。药学学科要为医疗卫生事业服务。医疗工作迫切需要药学部门的合作和配合，社会对合理用药、提高药效、减少毒副作用发生率的呼声越来越高，因此急需临床药师为医疗提供安全、有效的药学服务。加强临床药学教育，尽快培养更多的临床药师迫在眉睫。

虽然临床药学教育在我国已开展多年，至今所使用的教材仍主要借用现有医学生及药学生的教材，这种凑合着使用的局面不能满足临床药学专业培养目标的要求。全国高等医药教材建设研究会、卫生部教材办公室经过广泛的调研和论证工作，深感组织全国医药教学、医疗工作者编写一套针对临床药学专业培养目标和教学需要的“临床药学专业”规划教材的迫切性和必要性，这无疑对临床药学专业的进一步发展和临床药学人才的培养将起着推动作用。《临床药物化学》教材即是本次规划出版本套教材中的一种。

为了编写好这一本《临床药物化学》，我们对现有国内外《药物化学》教材及参考书进行了研究分析，发现我国已出版发行的《药物化学》教材已经很多，其中许多质量很高，内容也较全面。在众多的《药物化学》教材中，再编写出一本适合临床药学专业用的药物化学教材尚属开创性的工作，难度较大。考虑到目前多数院校的临床药学专业采用药学类规划教材第五版《药物化学》（主编郑虎，人民卫生出版社出版），相对其他药物化学教材而言，该教材与临床药学专业培养目标更为接近。因此，本次编写的《临床药物化学》教材在此教材框架基础上做了进一步调整，增加了与临床用药有关的内容，删除了新药开发的相关内容。贯彻以合理用药为主线，临床重点常用药物为中心，以化学为基础，向临床药学专业学生介绍必须掌握的药物基本知识及药物化学基本原理。

本教材的内容分为两部分。第一部分分为十章，介绍临床重点常用的各类药物，包括化学结构、中英文名称、理化性质、体内代谢途径、构效关系、临床用途、毒副作用及药物间相互作用。第二部分为总论部分，共有六章（药物的化学结构，理化性质，药物代谢，毒副作用，手性药物及药物相互作用），这部分内容是在学生掌握了各类药物基本知识后，结合临床用药的需要，而介绍的有关药物化学原理的知识，重点仍突出药物的化学内容，以及尽量少的药理内容。

本教材除作为临床药学专业教学用书使用外，还可作为临床医学专业、临床药师、临床医务人员的参考用书。

由于各位编者的辛勤劳动才使本书的编写工作顺利完成。潘佳博士为本书做了大量具体的工作，在此一并表示感谢。

编写首本《临床药物化学》教材，是一次尝试。从药物化学角度介绍临床合理用药的文献较少，素材难找，这给本教材的编写带来困难，加之时间短促，错误难免，恳请读者们提出宝贵意见，以便再版时改正。

翁玲玲

2007 年 5 月于四川大学华西药学院

目 录

第一章 绪论	1
第一节 新药的发现及开发	2
一、新药研究的化合物来源	3
二、新药研究中的先导化合物的优化	4
第二节 一些载入史册的药物	5
第二章 中枢神经系统药物	14
第一节 镇静催眠药	14
地西洋	15
艾司唑仑	17
佐匹克隆	20
第二节 抗癫痫药物	21
苯妥英钠	22
丙戊酸钠	24
托吡酯	26
第三节 抗精神失常药	27
一、抗精神病药	27
盐酸氯丙嗪	28
氟哌啶醇	32
二、抗抑郁药	36
盐酸氯米帕明	38
盐酸帕罗西汀	40
三、抗焦虑药	42
盐酸丁螺环酮	42
四、抗帕金森病药	43
左旋多巴	44
罗匹尼罗	46
第四节 镇痛药和中枢兴奋药	48
一、镇痛药	48
盐酸吗啡	48
盐酸哌替啶	52
枸橼酸芬太尼	54

二、中枢兴奋药	56
咖啡因	57
尼可刹米	60
第三章 外周神经系统药物	63
第一节 拟胆碱药和抗胆碱药	63
一、拟胆碱药	63
硝酸毛果芸香碱	65
溴新斯的明	66
石杉碱甲	67
二、抗胆碱药	68
硫酸阿托品	69
氢溴酸东莨菪碱	70
溴丙胺太林	71
盐酸苯海索	72
泮库溴铵	74
苯磺阿曲库铵	76
第二节 拟肾上腺素药	77
一、 α 、 β 肾上腺受体激动剂	78
肾上腺素	78
盐酸麻黄碱	79
二、 α 肾上腺受体激动剂	80
盐酸可乐定	81
三、 β 肾上腺受体激动剂	82
盐酸多巴酚丁胺	82
第三节 抗过敏药	85
一、经典的 H_1 受体拮抗剂	85
盐酸苯海拉明	87
马来酸氯苯那敏	88
盐酸赛庚啶	90
二、无嗜睡作用的 H_1 受体拮抗剂	91
咪唑斯汀	93
盐酸西替利嗪	94
第四节 局部麻醉药	95
一、普鲁卡因的发现	95
二、局麻药的结构类型和药物	96
盐酸普鲁卡因	96
盐酸利多卡因	98

第四章 循环系统药物	100
第一节 β 受体阻断剂	100
盐酸普萘洛尔	101
盐酸艾司洛尔	103
盐酸拉贝洛尔	104
第二节 钙通道阻滞剂	105
一、二氢吡啶类	106
苯磺酸氨氯地平	106
二、苯并硫氮草类	108
盐酸地尔硫草	108
三、芳烷胺类	109
盐酸维拉帕米	109
第三节 钠、钾通道阻滞剂	111
一、钠通道阻滞剂	111
硫酸奎尼丁	111
二、钾通道阻滞剂	113
盐酸胺碘酮	113
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	114
一、血管紧张素转化酶抑制剂	115
卡托普利	116
马来酸依那普利	117
福辛普利钠	118
二、血管紧张素 II 受体拮抗剂	119
缬沙坦	120
第五节 NO 供体药物	122
硝酸异山梨酯	122
第六节 强心药	123
一、强心苷	124
二、磷酸二酯酶抑制剂	125
氨力农	125
第七节 调血脂药	126
一、羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑制剂	126
辛伐他汀	126
二、影响胆固醇和甘油三酯代谢药物	129
非诺贝特	129
第八节 抗血栓药	130
盐酸噻氯匹定	131

第五章 消化系统药物	133
第一节 抗溃疡药	133
一、 H_2 受体拮抗剂	135
盐酸雷尼替丁	136
法莫替丁	138
二、质子泵抑制剂	140
奥美拉唑	141
雷贝拉唑钠	143
第二节 促动力药	145
多潘立酮	146
盐酸伊托必利	147
枸橼酸莫沙必利	148
第三节 止吐药	149
一、 $5-HT_3$ 受体拮抗剂	150
昂丹司琼	151
托烷司琼	152
盐酸帕洛诺司琼	153
二、 NK_1 受体拮抗剂	154
第六章 内分泌系统药物	156
第一节 性激素类	156
一、雌激素及抗雌激素	157
炔雌醇	160
枸橼酸他莫昔芬	163
二、雄性激素和蛋白同化激素	165
苯丙酸诺龙	167
三、孕激素及抗孕激素类	169
醋酸甲地孕酮	171
炔诺酮	173
米非司酮	175
第二节 肾上腺皮质激素	176
泼尼松龙	178
醋酸地塞米松	180
醋酸氟轻松	183
曲安奈德	185
第三节 胰岛素及口服降糖药	187
胰岛素	191

盐酸二甲双胍	195
格列吡嗪	196
阿卡波糖	198
马来酸罗格列酮	199
瑞格列奈	200
第七章 抗肿瘤药物	203
第一节 生物烷化剂	203
氮甲	204
异环磷酰胺	206
白消安	208
卡莫司汀	208
盐酸丙卡巴腓	210
奥沙利铂	211
第二节 抗代谢药物	213
盐酸吉西他滨	213
巯嘌呤	216
甲氨蝶呤	217
第三节 抗肿瘤抗生素	218
博来霉素	218
盐酸多柔比星	220
第四节 抗肿瘤植物有效成分及其衍生物	221
多西他赛	222
硫酸长春新碱	224
依托泊苷	226
羟喜树碱	227
第八章 合成抗菌药与抗病毒药	229
第一节 喹诺酮类抗菌药	229
莫西沙星	231
左氧氟沙星	232
第二节 磺胺类抗菌药及抗菌增效剂	234
磺胺甲噁唑	235
甲氧苄啶	238
第三节 抗真菌药	239
一、抗生素类抗真菌药	239
二、唑类抗真菌药	241
酮康唑	241

硝酸咪康唑	243
三、其他抗真菌药	244
第四节 抗病毒药物	245
一、核苷类抗菌药	246
齐多夫定	248
阿昔洛韦	249
二、其他类抗菌药	251
第五节 抗结核病药	253
利福喷丁	253
异烟肼	254
盐酸乙胺丁醇	256
 第九章 抗生素	258
第一节 β -内酰胺类抗生素	260
一、青霉素类	262
青霉素钾	262
氯唑西林钠	267
氨苄西林钠	268
二、头孢菌素类	271
头孢曲松钠	272
头孢氨苄	274
三、非经典的 β -内酰胺类抗生素	278
氨曲南	279
亚胺培南	280
法罗培南	281
四、 β -内酰胺酶抑制剂	282
舒巴坦	283
第二节 大环内酯类抗生素	284
一、红霉素及其衍生物	285
红霉素	285
阿奇霉素	288
泰利霉素	289
二、麦迪霉素及其衍生物	290
三、螺旋霉素及衍生物	291
第三节 氨基苷类抗生素	291
硫酸阿米卡星	292
第四节 其他类抗生素	295
氯霉素	295

盐酸林可霉素	297
磷霉素	299
盐酸多西环素	299
第十章 非甾体抗炎及抗痛风药物	303
第一节 解热镇痛药	303
一、乙酰苯胺类	304
对乙酰氨基酚	304
二、水杨酸类	305
阿司匹林	306
第二节 非甾体抗炎药	308
一、芳基、杂芳基烷酸类	309
双氯芬酸钠	310
依托度酸	311
二、苯并噻嗪类	313
美洛昔康	313
三、二苯基取代杂环类	314
塞来昔布	315
第三节 抗痛风药物	317
秋水仙碱	318
别嘌醇	320
第十一章 药物的化学结构与生物活性	322
第一节 药效团、药动团和毒性基团	323
一、药效团	323
二、药动团	325
三、毒性基团	328
第二节 取代基与生物活性	329
一、烷基	329
二、卤素	331
三、羟基与巯基	332
四、醚基和硫醚基	333
五、酸性基团	334
六、碱性基团	335
七、硝基	336
第三节 立体结构与生物活性	336
一、药物构型对生物活性的影响	337
二、药物构象对生物活性的影响	339

第十二章 药物的理化性质与生物活性	341
第一节 药物溶解度与生物活性.....	341
第二节 药物的脂水分配系数与生物活性.....	344
第三节 药物的晶型与生物活性.....	346
一、药物晶型的定义.....	346
二、晶型对体内过程的影响及其与疗效的关系.....	347
三、影响药物晶型的因素.....	349
第四节 药物解离度与生物活性.....	350
第十三章 化学结构与药物代谢	353
第一节 药物代谢的酶.....	354
一、细胞色素 P450 酶系.....	354
二、过氧化酶和其他的单加氧酶.....	355
三、非微粒体氧化酶.....	355
四、水解酶.....	355
第二节 I 相代谢.....	356
一、氧化反应.....	356
二、还原反应.....	361
三、水解反应.....	362
第三节 II 相代谢.....	363
一、葡萄糖醛酸结合.....	364
二、硫酸结合.....	366
三、氨基酸结合.....	367
四、谷胱甘肽结合.....	368
五、甲基化反应.....	369
六、乙酰化反应.....	371
第十四章 药物化学与毒副作用	373
第一节 药物化学结构与毒副作用.....	373
一、化学结构与毒性的关系.....	373
二、化学稳定性与毒性的关系.....	377
第二节 药物代谢与毒副作用.....	382
一、氧化反应与毒副作用.....	382
二、还原反应与毒副作用.....	385
三、水解反应与毒副作用.....	386
第三节 立体化学与毒副作用.....	387
第四节 药物质量与毒副作用.....	389