

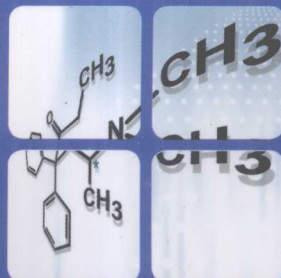
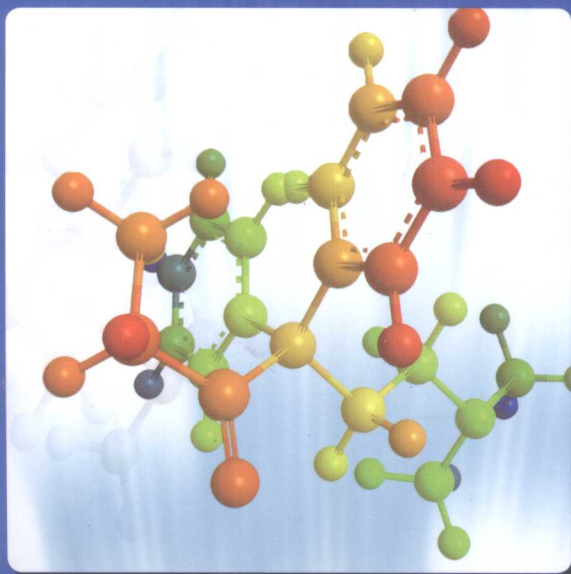
MEDTIME
医大时代教育

北京大学医学远程教育系列教材

Medicinal Chemistry

药物化学

主编 徐 萍
吴艳芬



北京大学医学出版社

北京大学医学远程教育系列教材

Medicinal Chemistry

药物化学

主 编 徐 萍 吴艳芬

编写人员 (按姓氏笔画排序)

许凤荣

李正香

吴艳芬

邹晓民

徐 萍

雷小平



北京大学医学出版社

图书在版编目(CIP)数据

药物化学 / 徐萍, 吴艳芬主编. —北京: 北京

大学医学出版社, 2008.3

ISBN 978-7-81116-459-6

I. 药… II. ①徐…②吴… III. 药物化学—高等教育:
远程教育—教材 IV. R914

中国版本图书馆CIP数据核字(2008)第010127号

药物化学

主 编: 徐萍 吴艳芬

出版发行: 北京大学医学出版社(电话: 010-82802230)

地 址: (100083) 北京市海淀区学院路38号 北京大学医学部院内

网 址: <http://www.pumpress.com.cn>

E-mail: booksale@bjmu.edu.cn

印 刷: 北京圣彩虹制版印刷技术有限公司

经 销: 新华书店

责任编辑: 张彩虹 责任校对: 张 雨 责任印刷: 郭桂兰

开 本: 787mm × 1092mm 1/16 印张: 28 字数: 697千字

版 次: 2008年3月第1版 2008年3月第1次印刷 印数: 1-4000册

书 号: ISBN 978-7-81116-459-6

定 价: 49.60元

版权所有, 违者必究

(凡属质量问题请与本社发行部联系退换)

本书由

北京大学医学部科学出版基金

北京大学医学网络教育学院课程建设基金

资助出版

前言

随着各行业执业资格要求的实施,药学领域应用型人才的培养已经成为药学教育的重要组成部分。北京大学医学网络学院相继招收了药学专业的专科和本科学生,“药物化学”是主干课程之一。我们在教学实践中深感有必要编写一本适合远程教学特点的、以应用型人才所需要的药物化学知识为主要内容的《药物化学》教材。期望本书不仅作为网络药学专业本专科学生、夜大药学专业本专科学生、执业药师资格考试应考人员的学习教材,还可成为大家工作中的案头参考书。

药物化学的学科内容大致可分为两部分,一是研究现有药物,二是发现创制新药。鉴于针对的读者群是药品生产和应用领域人员,本书以介绍药物化学基础知识和临床常用药物为主要内容,以《中华人民共和国药典》为技术标准,紧扣国家执业药师资格考试大纲,简述各类药物发展现状,从药物的化学结构出发,讨论各类药物与贮存保管、药物相互作用、临床使用等有关的性质,探讨临床常用药的作用机理,以及药物在体内产生药效和毒副作用的本质。全书分为九个单元:化学治疗药物、中枢神经系统药物、传出神经系统药物、心血管系统药物、呼吸系统药物、消化系统药物、免疫及内分泌系统药物、维生素类药物、总论,共计二十七章。

本书具有以下特点:

1. 在内容的选择和编排上突出了实用性和系统性。以人体系统为单元,分章介绍相关药物化学知识和重要药物。

2. 适合于远程学习者使用。在每个章、节前都设有“内容导航”和“学习目标”;当重要的概念在教材中不同章、节重复出现时,“温故知新”提供给学习者方便的检索;某些章、节后有“重点回顾”,课文中还插入相关的思考内容。每章后还提供一定数量的“自测习题”,供学习者熟悉课程考试的题型,但习题并不覆盖所有要求掌握的内容。

3. 版面设计美观新颖,套色印刷突出重点。而且每页中均有一定的留白,方便学习者作笔记。留白处的注解是专为远程学习者设计的,以方便自学。

本书的编写人员均为北京大学药学院药物化学系现任教师,教学经验丰富,承担多个轨道“药物化学”教学,包括北京大学药学长学制本硕连读、应用药学本科、网络药学专升本、网络药学专科、药学夜大专升本、药学夜大专科、执业药师资格考试考前培训等。教学效果获得普遍好评,其中药学长学制“药物化学”课程获得2006年国家级精品课程。本书也是我们这个团队所有教师多年潜心教学研究的心血结晶之一,奉献给热爱药学教育事业的同仁和学生。

本书作为一项北京大学医学网络学院课程开发项目,也是北京大学医学远程教育系列教材之一,自始至终得到网络学院刘虹副院长及课程开发组其他老师的全力支持和帮助,在此

谨致谢意!

本书在药物化学远程教育教学改革方面做出尝试,必有不足之处。衷心希望关心远程教育的药物化学同仁及读者们提出宝贵批评意见和建议。

徐萍 吴艳芬

2007年11月

目 录

绪 论	1	三、磺胺类药物的构效关系	36
一、药物化学的研究内容及其发展概况	1	四、抗菌增效剂	36
二、药物的命名	2	第二节 喹诺酮类抗菌药	38
第一章 化学治疗药物	5	一、喹诺酮类药物的发展	38
第一章 抗生素	6	二、喹诺酮类药物的作用机制	39
第一节 β -内酰胺类抗生素	6	三、喹诺酮类主要药物	40
一、 β -内酰胺类抗生素的分类	7	四、喹诺酮类药物的构效关系	42
二、青霉素类	8	第三节 其它合成抗菌药	43
三、头孢菌素类	13	一、硝基咪唑类	44
四、 β -内酰胺酶抑制剂	20	二、硝基呋喃类	45
五、非经典 β -内酰胺类抗生素	21	三、异喹啉类	45
第二节 大环内酯类抗生素	22	自测习题	46
一、大环内酯类抗生素的作用机制	23	第三章 抗结核药	48
二、大环内酯类主要药物	23	一、合成抗结核药	49
第三节 氨基糖苷类抗生素	25	二、抗结核抗生素	52
一、氨基糖苷类抗生素的作用及毒性	26	自测习题	54
二、氨基糖苷类抗生素的代表药物	26	第四章 抗真菌药	56
第四节 四环素类抗生素	28	一、影响真菌膜麦角甾醇的药物	57
第五节 其它类抗生素	29	二、不影响真菌膜麦角甾醇的药物	61
一、氯霉素	29	第五章 抗病毒药	63
二、磷霉素	30	第一节 核苷类抗病毒药物	64
三、盐酸克林霉素	31	一、不开环核苷类抗病毒药物	64
自测习题	31	二、开环核苷类抗病毒药物	66
第二章 合成抗菌药	33	第二节 非核苷类抗病毒药物	68
第一节 磺胺类药物及抗菌增效剂	33	第三节 蛋白酶抑制剂	69
一、磺胺类药物的的发展及作用机制	33	第四节 其它抗病毒药物	70
二、磺胺类的代表药物	35	自测习题	71

第六章 抗寄生虫药	73
第一节 抗疟药	74
一、喹啉醇类	74
二、氨基喹啉类	76
三、2,4-二氨基嘧啶类	78
四、青蒿素类	79
第二节 驱肠虫药	80
第三节 抗血吸虫病和抗丝虫病药物	82
一、抗血吸虫病药	82
二、抗丝虫病药	83
自测习题	85
第七章 抗肿瘤药	86
第一节 烷化剂	86
一、氮芥类	87
二、乙撑亚胺类	89
三、亚硝基脲类	90
四、甲磺酸酯及多元醇类	90
五、金属配合物类	91
第二节 抗代谢物	92
一、嘧啶类	93
二、嘌呤类	95
三、叶酸类	96
第三节 抗肿瘤天然药物及其衍生物	97
一、抗肿瘤生物碱	98
二、抗肿瘤抗生素	101
第四节 其它抗肿瘤药	103
自测习题	104

第二单元 中枢神经系统药物 ... 107

第八章 镇静催眠药和抗焦虑药	108
一、醛类	109
二、苯二氮䓬类	110
三、咪唑并吡啶类	114
四、其它类	115
第九章 抗癫痫药	116
一、巴比妥类	117
二、乙内酰脲类	119
三、二苯并氮杂䓬类	120

四、脂肪酸类	121
五、其它类	122

第十章 抗精神失常药	123
第一节 抗精神病药	124
一、吩噻嗪类	124
二、噻吨类	127
三、丁酰苯类	127
四、苯甲酰胺类	128
五、非典型抗精神病药	129
第二节 抗抑郁药	129
一、去甲肾上腺素重摄取抑制剂 ...	129
二、5-羟色胺重摄取抑制剂	130
三、单胺氧化酶抑制剂 (MAOI) ...	131
第三节 抗躁狂症药	132
自测习题	133

第十一章 益智药和抗痴呆药	136
一、酰胺类中枢兴奋药	137
二、叔胺类乙酰胆碱酯酶抑制剂 ...	138

第十二章 镇痛药	140
一、吗啡生物碱类镇痛药	141
二、半合成镇痛药	143
三、合成镇痛药	143
四、其它合成镇痛药	147
六、阿片受体和吗啡类镇痛药的 构效关系	148
自测习题	150

第三单元 传出神经系统药物 ... 153

第十三章 外周胆碱能神经系统药物	154
第一节 胆碱能神经系统药物的分类	155
第二节 M受体激动剂	156
一、胆碱酯类M受体激动剂	157
二、生物碱类M受体激动剂	158
第三节 乙酰胆碱酯酶抑制剂	159
第四节 M受体拮抗剂	160
一、茄科生物碱类M受体拮抗剂 ...	160
二、合成的M受体拮抗剂	163

第五节 N受体拮抗剂	164
一、去极化型肌肉松弛药	165
二、非去极化型肌肉松弛药	166
自测习题	168

第十四章 外周肾上腺素能神经系统药物 ..170

第一节 肾上腺素受体激动剂	171
一、肾上腺素受体激动剂的分类 ...	172
二、 α 受体激动剂	172
三、 α 和 β 受体激动剂	174
四、 β 受体激动剂	176
五、肾上腺素受体激动剂的构效关系	177
第二节 肾上腺素受体拮抗剂	178
一、 α 受体拮抗剂	178
二、 β 受体拮抗剂	180

第四单元 心血管系统药物 ... 185

第十五章 心血管药物 186 |

第一节 抗心律失常药	187
一、抗心律失常药的发展与分类 ...	188
二、钠通道阻滞剂	188
三、钾通道阻滞剂	190

第二节 抗心力衰竭药 191 |

一、抗心力衰竭药的分类	192
二、强心苷类	192
三、磷酸二酯酶抑制剂	193

第三节 抗高血压药 194 |

一、抗高血压药的分类	195
二、中枢性抗高血压药	196
三、作用于交感神经系统的 抗高血压药	197
四、血管扩张药	197
五、影响肾素-血管紧张素-醛固酮 系统的药物	198
六、钙通道阻滞剂	202

第四节 血脂调节药及抗动脉粥样硬化药

一、羟甲戊二酰辅酶A还原酶抑制剂	207
二、苯氧乙酸类	209
三、烟酸类	210
四、其它类	211

第五节 抗心绞痛药 211 |

一、抗心绞痛药的分类	212
二、硝酸酯类	212
二、其它类	214

第六节 利尿药 214 |

一、渗透性利尿药	215
二、碳酸酐酶抑制剂	216
三、 $\text{Na}^+-\text{K}^+-2\text{Cl}^-$ 同向转运抑制剂...	216
四、 Na^+-Cl^- 同向转运抑制剂	217
五、肾内皮细胞 Na^+ 通道阻滞剂	218
六、盐皮质激素受体拮抗剂	219

自测习题 220 |

第五单元 呼吸系统药物 221

第十六章 平喘药 222 |

一、选择性 β_2 肾上腺素受体激动剂 ..	224
二、M胆碱受体拮抗剂	226
三、磷酸二酯酶抑制剂	226
四、肾上腺皮质激素	227
五、影响白三烯的药物	229

自测习题 230 |

第十七章 镇咳药和祛痰药 232 |

第一节 镇咳药 233 |

一、中枢性镇咳药	233
二、外周性镇咳药	234

第二节 祛痰药 234 |

一、黏痰溶解药	234
二、恶心性祛痰药	237
三、刺激性祛痰药	237

自测习题 237 |

第六单元 消化系统药物 239

第十八章 抗溃疡药 240 |

第一节 组胺 H_2 受体拮抗剂 241 |

一、西咪替丁的发现	241
二、典型药物	243

第二节 质子泵抑制剂 245 |

第三节 其它抗溃疡药物 247 |

自测习题	248
------------	-----

第十九章 胃动力药和止吐药	249
---------------------	-----

第一节 胃动力药	249
----------------	-----

第二节 止吐药	252
---------------	-----

第七单元 免疫及内分泌系统 药物 255

第二十章 非甾体抗炎药	256
-------------------	-----

第一节 非甾体抗炎药的作用机制	258
-----------------------	-----

一、花生四烯酸的代谢途径与炎症	258
-----------------------	-----

二、非甾体抗炎药的作用靶点	259
---------------------	-----

第二节 解热镇痛药	260
-----------------	-----

一、水杨酸类	260
--------------	-----

二、苯胺类	263
-------------	-----

三、吡唑酮类	264
--------------	-----

第三节 非甾体抗炎药	265
------------------	-----

一、3,5-吡唑烷二酮类	265
--------------------	-----

二、邻氨基苯甲酸类	266
-----------------	-----

三、芳基烷酸类	266
---------------	-----

四、1,2-苯并噻嗪类	271
-------------------	-----

五、苯基砷类(昔布类)	273
-------------------	-----

第四节 抗痛风药	274
----------------	-----

一、抗痛风发作药	274
----------------	-----

二、尿酸排泄剂	275
---------------	-----

三、尿酸合成阻断剂	275
-----------------	-----

自测习题	277
------------	-----

第二十一章 抗变态反应药	278
--------------------	-----

第一节 组胺H ₁ 受体拮抗剂	280
----------------------------------	-----

一、乙二胺类	281
--------------	-----

二、氨基醚类	282
--------------	-----

三、哌嗪类	284
-------------	-----

四、丙胺类	284
-------------	-----

五、三环类	285
-------------	-----

六、哌啶类	287
-------------	-----

第二节 过敏反应介质相关抗过敏药	288
------------------------	-----

自测习题	289
------------	-----

第二十二章 甾体激素类药物	290
---------------------	-----

第一节 雌激素类药物	291
------------------	-----

一、甾体雌激素	292
---------------	-----

二、非甾体雌激素	295
----------------	-----

三、雌激素受体拮抗剂	295
------------------	-----

第二节 雄激素类药物	296
------------------	-----

一、雄性激素	297
--------------	-----

二、蛋白同化激素	298
----------------	-----

三、抗雄激素	299
--------------	-----

第三节 孕激素类药物	300
------------------	-----

一、孕酮类孕激素	300
----------------	-----

二、甾酮类孕激素	302
----------------	-----

三、孕激素受体拮抗剂	303
------------------	-----

第四节 肾上腺皮质激素类药物	304
----------------------	-----

一、皮质激素分类	304
----------------	-----

二、糖皮质激素构效关系	305
-------------------	-----

三、糖皮质激素的主要药物	306
--------------------	-----

自测习题	308
------------	-----

第二十三章 胰岛素和口服降血糖药	310
------------------------	-----

第一节 胰岛素	311
---------------	-----

第二节 口服降血糖药	313
------------------	-----

一、胰岛素分泌促进剂	313
------------------	-----

二、胰岛素增敏剂	317
----------------	-----

自测习题	319
------------	-----

第八单元 维生素类药物 321

第二十四章 维生素类药物	322
--------------------	-----

第一节 脂溶性维生素	323
------------------	-----

一、维生素A	323
--------------	-----

二、维生素D	326
--------------	-----

三、维生素E家族	328
----------------	-----

四、维生素K家族	328
----------------	-----

第二节 水溶性维生素	330
------------------	-----

一、维生素B家族	330
----------------	-----

二、维生素C	332
--------------	-----

自测习题	335
------------	-----

第九单元 总论 337

第二十五章 药物化学结构与药效的关系	338
--------------------------	-----

第一节 药物产生作用的主要因素	339	二、还原反应	362
一、药物产生作用的主要因素	339	三、水解反应	363
二、结构非特异性药物	340	第三节 药物 II 相代谢反应	364
三、结构特异性药物	340	一、与葡萄糖醛酸的结合	365
四、药效团	340	二、与硫酸的结合	365
第二节 药物的理化性质对活性的影响 ..	341	三、与氨基酸的结合	366
一、溶解度和分配系数对药效的		四、与谷胱甘肽的结合	366
影响	341	五、其它结合反应	367
二、解离度对药效的影响	341	第四节 研究药物代谢的指导意义	368
第三节 药物与受体的作用方式对药效		一、发现新的先导化合物	368
的影响	343	二、对现有的药物进行合理的修饰 ..	369
一、药物与受体的结合方式	343	三、指导临床合理用药	370
二、药物与受体的键合对药效的		自测习题	373
影响	343	第二十七章 药物的化学结构修饰	375
三、药物的各种功能基团对药效的		第一节 药物分子结构修饰的作用	376
影响	344	一、进行药物分子结构修饰的目的 ..	376
四、立体因素对药效的影响	346	二、药物分子结构修饰的作用	376
第四节 药物定量构效关系简介	348	第二节 药物分子结构修饰的常用方法 ..	381
一、基本概念	348	一、酯化修饰	381
二、二维定量构效关系	349	二、酰胺化修饰	381
三、三维定量构效关系及计算机		三、成盐修饰	382
辅助药物设计简介	350	四、成环和开环修饰	383
自测习题	352	自测习题	384
第二十六章 药物代谢	354	自测习题参考答案	387
第一节 概论	355	中文专业词汇索引	397
一、基本概念	355	英文专业词汇索引	417
二、代谢反应的分类	356		
三、代谢过程所需要的酶系	357		
四、代谢反应的结果	357		
第二节 药物 I 相代谢反应	357		
一、氧化反应	357		

绪 论

内容导航

- 一、药物化学的研究内容及其发展概况
- 二、药物的命名

学习目标

通过对本章的学习，希望同学们达到以下要求：

1. 了解药物化学的研究内容和发展概况，理解掌握药物化学知识对从事药品研究、生产、经营、使用等工作的重要意义。
2. 了解药物的名称体系及其命名原则。

一、药物化学的研究内容及其发展概况

药物化学 (medicinal chemistry) 的研究对象是药物，是人们用来预防、治疗或诊断疾病，以及调节人体功能、提高生活质量和保持身体健康的物质。按照药物的来源和制备方法的不同，可分为天然药物（如中药）、合成药物和生物药物。其中采用化学或生物合成方法得到的、具有确定分子结构的化学药物，正是药物化学的特定研究对象。

化学药物的本质是化合物，是具有特殊生物活性的化合物，其活性表现为与人体相互作用后产生的药理作用和毒副作用。因此药物化学家首先要研究的就是药物分子的化学结构特征，及其理化性质、酸碱性、溶解性、稳定性等等，以及化学结构与这些性质之间关系的规律性（即药物的构性关系），为设计药物剂型、制定药物分析检验标准、保证药品在生产、流通、贮存过程中的质量、临床上科学合理用药等方面提供依据。其次，药物化学家要研究化学药物的生产工艺，提供最先进、最有效、最环保、最经济的制备方法。另外，药物化学家还必须研究药物在体内发挥作用的化学过程，包括药物的吸收、分

布、代谢、排泄的药物动力学过程，与药物靶点（受体、酶、核酸、离子通道等）相互结合并产生活性/毒性的药效学/毒理学过程，以及药物结构与其药效之间关系的规律性（即药物的构效关系），从而认识药物作用的化学本质。这不仅可以解释已有药物的作用机制，更为发现和创制新药奠定了基础。事实上，药物化学学科快速持续发展的根本动因就是研发新药。上述几方面的研究内容注定了药物化学是由化学和生命科学相互交叉的综合性学科，尤其以有机化学、生物化学、药理学为其重要基础。

既然为交叉学科，药物化学的研究方法和手段必然丰富多样，并且伴随着社会、科学进步而同步发展。简而言之，大约在19世纪中期，药物化学从药物学中分化独立出来，当时主要是运用化学方法提取分离植物药中的有效成分。例如，从阿片中提取吗啡、从颠茄中提取阿托品、从柳树叶中提取水杨酸、从古柯叶中提取可卡因等。同时由于当时有机化学已有了相当发展，人们从有机化合物中寻找药物也颇有所得，如发现了镇静催眠药水合氯醛和全身麻醉药乙醚等。之后人们逐渐认识到一些化学结构与活性的关系，提出了药效团的概念，开始有目的地改造天然产物的化学结构，至19世纪末发展了结构简单的合成药物，例如阿司匹林和普鲁卡因。至此现代药物化学已形成其重要的学科特点。

20世纪初，随着化学工业特别是有机合成化学的发展，极大地丰富了可用于筛选的化学结构。同时实验药理学的发展，使人们可以用动物模型代替人体来评价药物的作用。由此推动药物化学经历了半个多世纪的快速发展，发现了很多至今依然广泛使用的重要药物，如20年代的中枢镇静药、麻醉药、解热镇痛药等；30年代的磺胺是抗菌药物的重要突破，开创了从药物代谢产物寻找新药的途径，并创立了抗代谢学说；40年代的青霉素开创了从微生物分泌物中寻找抗生素的途径，多种抗生素相继被发现并用于临床，新的抗生素、半合成青霉素、头孢菌素的发展长盛不衰；50年代的甾体激素类药物是从内源性活性物质寻找新药的突出代表。

20世纪60年代以后，随着人们对疾病发生和发展过程认识的不断深入，对受体、酶、核酸、离子通道等生物大分子结构及功能的不断认知，药物靶点理论越来越多地用于合理药物设计，在取得巨大成功的同时，使药物化学理论和方法也得到迅速发展和丰富。如60年代的 β 受体拮抗剂、 H_2 受体拮抗剂；70年代的钙拮抗剂、血管紧张素转化酶抑制剂等等；80年代生物技术和计算机技术的应用使基于靶点结构的计算机辅助药物设计方法快速发展并迅速普及，目前已成为常规手段；90年代组合化学和高通量筛选技术的结合加快了新药研发速度。21世纪以来，随着人类基因组学和蛋白质组学研究的深入，为药物化学家提供了大量可用于药物设计的新靶点，这必将促进具有新作用机制的新药研发，同时也将带动药物化学学科进入新的发展纪元。

二、药物的命名

常用的药物名称有三类：通用名、化学名和商品名。这三种名称都有中、英文之分。

（一）通用名

世界卫生组织推荐的药物通用名称是国际非专利药品名称（International Non-proprietary Names of Pharmaceutical Substances, INN）。它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，不受专利及行政保护，任何该产品的生产者都可使用该名称，也是文献、教材、资料以及药品说明书中标明有效成分的名称。INN是药物的国际通用英文名称，其中同类型药物多具有相同词干。

我国药典委员会以INN为依据，制订并编写了《中国药品通用名称》（Chinese Approved Drug Names, CADN）。CADN是中国药品的命名依据，也是中国药典采用的药品名称。CADN的中文名根据药品性质和结构，尽量与INN相对应，采取音译、意译或音意合译，以音译为主，保持CADN的规范、统一和系列化。CADN对INN的词干规定了相应的中文译名，使同类药物的CADN也具有相同的词头或词尾，便于识别和记忆。例如青霉素类的INN词干是-cillin，CADN译作“西林”，Amoxicillin译作阿莫西林。头孢菌素类的INN词干是cef-，译作“头孢”，Cefalexin译作头孢氨苄。CADN还避免采用可能给患者以暗示的有关药理学、解剖学、生理学、病理学或治疗学的药品名称，也不得用代号命名。

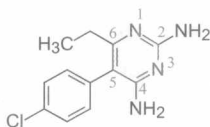
通用名是必须掌握的药物名称。对于药品应用领域人员而言，更应记住。

（二）化学名

化学药物均有确定的化学结构式，采用国际通用的化学命名法对其结构进行命名，得到的就是化学名。一个化学名只能对应唯一的结构式。

国际通用的英文化学名命名原则主要是国际纯化学和应用化学会（IUPAC）1979年公布的《有机化学命名法》。美国化学文摘（CA）是目前世界上公认收录化学文献和化合物最多、覆盖面最广的化学资料库，且对其收录的化合物均给以CA登录号和CA化学名，其命名也是遵循IUPAC的命名原则。由于化学药物均被其收录，所以药物的CA化学名也被广泛接受，成为药品化学名的主要依据。英文化学名命名时先选取结构式中的一部分作为母体，对母体原子进行排序编号，其他部分均视为母体上的取代基，取代基在命名中出现的先后是按照基团名称首字母顺序排列。当结构中含有杂环时，通常被选作母体。对手性药物要标出立体构型、几何构型或其他立体因素。命名复杂分子时，应该在保证准确的前提下尽量简单。例如抗疟药乙胺嘧啶（Pyrimethamine）的英文化学名为5-(4-chlorophenyl)-6-ethyl-2,4-pyrimidinediamine。

一个化学名只能对应唯一的结构式。但是由于采用的命名方法不同，一个结构式却可以有多个不同的化学名。



乙胺嘧啶

这与英文化学名中按照基团名称首字母顺序排列是不同的。

有些常用药品的商品名为人们所熟悉，应该予以重视。

中文化学名的命名原则主要依据中国化学会公布的《有机化学命名原则》(1980) (收于《英汉化学化工辞典》附录，科学出版社)。该原则是在 IUPAC 有机化合物命名原则的基础上，特别对取代基的中文名及排列顺序做出规定，基团次序按立体化学中的大小次序，小的原子或基团在先，大的在后。所以对同一个药物分子，因中英文命名中取代基顺序不同，故中英文化学名可能不完全对应。如上例中乙胺嘧啶的中文化学名为 6-乙基-5-(4-氯苯基)-2,4-嘧啶二胺，这是以嘧啶二胺为母体的命名。中国药典中乙胺嘧啶的化学名是 2,4-二氨基-5-(对氯苯基)-6-乙基嘧啶，这是以嘧啶为母体的命名。

需要说明的是，一个化学名只能对应唯一的结构式，为了准确起见，各国药典对其收录的药品都给出了化学名。由于药物的化学名多数比较冗长，理解掌握即可，不必记忆。另外，对同一个结构式，选取不同的母体，可以命名出不同的化学名，无对错之分。在药品使用领域，药典给出的化学名具有权威性。

(三) 商品名

药品作为商品，是制药企业的产品。商品名由企业自行命名，命名时不能暗示药品的作用、用途。由于商品名可以得到注册保护，生产企业可以利用商品名来保护自己并宣传和推广产品。同一种药物过了保护期后可以有多个厂家生产，因此主要成分相同的药品在市场上可能有多个产品，存在多个商品名。医生在处方中应使用通用名而非商品名。

(徐 萍)

第一单元

化学治疗药物

1

- 第一章 抗生素
- 第二章 合成抗菌药
- 第三章 抗结核药
- 第四章 抗真菌药
- 第五章 抗病毒药
- 第六章 抗寄生虫药
- 第七章 抗肿瘤药

第一章

抗 生 素

1928年弗莱明刚刚发现青霉素的时候，因其能杀灭细菌，所以称为抗菌素。后来发现，除能杀灭细菌外，对其它致病微生物如霉菌、支原体、衣原体等也有良好的抑制和杀灭作用，因此改称为抗生素。抗生素是某些微生物生长繁殖过程中的代谢产物和半合成或全合成的类似物，小剂量即能够抑制微生物的生长或杀灭微生物，对于宿主无毒或毒性很低。

抗生素（antibiotics）的作用机制可以归纳为四类：抑制细菌细胞壁的合成、与细胞膜相互作用、干扰蛋白质合成和抑制核酸的转录及复制。

抗生素的种类很多，按照化学结构分类，可分为 β -内酰胺类、四环素类、氨基糖苷类、大环内酯类、多肽多烯类和其它类。

第一节 β -内酰胺类抗生素

内容导航



- 一、 β -内酰胺类抗生素的分类
- 二、青霉素类
 - 青霉素钠
 - 氨苄西林
 - 阿莫西林
 - 哌拉西林
 - 替莫西林
- 三、头孢菌素类
 - 头孢羟氨苄
 - 头孢克洛
 - 头孢哌酮钠
 - 头孢噻肟钠
 - 头孢噻吩钠
 - 头孢美唑
 - 头孢克肟