

国家级

精品

课程配套教材

全国高等医药院校药学类规划教材

QUANGUO GAODENG YIYAO YUANXIAO

YAOXUELEI GUIHUA JIAOCAI

药物化学

(第二版)

YAOWU
HUA XUE

主编 尤启冬

中国医药科技出版社

药物化学

第二版

Yanwen
Hua Xue

2010 2010

中国医药出版社

全国高等医药院校药理学类规划教材
国家级精品课程配套教材

药 物 化 学

(第二版)

主 编 尤启冬

副主编 孙铁民 徐云根

编 者 (以姓氏笔画为序)

王润玲 (天津医科大学)

尤启冬 (中国药科大学)

向 华 (中国药科大学)

孙铁民 (沈阳药科大学)

杨晓虹 (吉林大学药学院)

中国医药科技出版社

内 容 提 要

本书是全国高等医药院校药学类规划教材之一。本教材以我国教育部药学专业培养目标和要求为基础,按照医药行业用人要求,对第一版进行了较大的修改及补充。全书按照药物作用的系统分为九部分,二十四章。本书可作为全国高等医药院校药学类本科生和研究生的教材,也可供药物化学相关行业人员在工作中参考。

图书在版编目(CIP)数据

药物化学/尤启冬主编. —2版. —北京:中国医药科技出版社,
2011. 2

全国高等医药院校药学类规划教材. 国家级精品课程配套教材

ISBN 978 - 7 - 5067 - 4360 - 0

I. ①药… II. ①尤… III. ①药物化学 - 医学院校 - 教材
IV. ①R914

中国版本图书馆CIP数据核字(2010)第220756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 787×1092mm¹/₁₆

印张 38¹/₄

字数 791千字

初版 1999年9月第1版

版次 2011年2月第2版

印次 2011年2月第2版第1次印刷

印刷 北京金信诺印刷有限公司

经销 全国各地新华书店

书号 ISBN 978 - 7 - 5067 - 4360 - 0

定价 68.00元

本社图书如存在印装质量问题请与本社联系调换

全国高等医药院校药学类规划教材常务编委会

名誉主任委员 吴阶平 蒋正华 卢嘉锡

名誉副主任委员 邵明立 林蕙青

主任委员 吴晓明 (中国药科大学)

副主任委员 吴春福 (沈阳药科大学)

姚文兵 (中国药科大学)

吴少楨 (中国医药科技出版社)

刘俊义 (北京大学药学院)

朱依谆 (复旦大学药学院)

张志荣 (四川大学华西药学院)

朱家勇 (广东药学院)

委 员 (按姓氏笔画排列)

王应泉 (中国医药科技出版社)

叶德泳 (复旦大学药学院)

刘红宁 (江西中医学院)

毕开顺 (沈阳药科大学)

吴 勇 (四川大学华西药学院)

李元建 (中南大学药学院)

李 高 (华中科技大学同济药学院)

杨世民 (西安交通大学医学院)

陈思东 (广东药学院)

姜远英 (第二军医大学药学院)

娄红祥 (山东大学药学院)

曾 苏 (浙江大学药学院)

程牛亮 (山西医科大学)

秘 书 夏焕章 (沈阳药科大学)

徐晓媛 (中国药科大学)

浩云涛 (中国医药科技出版社)

高鹏来 (中国医药科技出版社)

出版说明

全国高等医药院校药学类专业规划教材是目前国内体系最完整、专业覆盖最全面、作者队伍最权威的药学类教材。随着我国药学教育事业的快速发展,药学及相关专业办学规模和水平的不断扩大和提高,课程设置的不断更新,对药学类教材的质量提出了更高的要求。

全国高等医药院校药学类规划教材编写委员会在调查和总结上轮药学类规划教材质量和使用情况的基础上,经过审议和规划,组织中国药科大学、沈阳药科大学、广东药学院、北京大学药学院、复旦大学药学院、四川大学华西药学院、北京中医药大学、西安交通大学医学院、华中科技大学同济药学院、山东大学药学院、山西医科大学药学院、第二军医大学药学院、山东中医药大学、上海中医药大学和江西中医学院等数十所院校的教师共同进行药学类第三轮规划教材的编写修订工作。

药学类第三轮规划教材的编写修订,坚持紧扣药学类专业本科教育培养目标,参考执业药师资格准入标准,强调药学特色鲜明,体现现代医药科技水平,进一步提高教材水平和质量。同时,针对学生自学、复习、考试等需要,紧扣主干教材内容,新编了相应的学习指导与习题集等配套教材。

本套教材由中国医药科技出版社出版,供全国高等医药院校药学类及相关专业使用。其中包括理论课教材 82 种,实验课教材 38 种,配套教材 10 种,其中有 45 种入选普通高等教育“十一五”国家级规划教材。

全国高等医药院校药学类规划教材
编写委员会

2009 年 8 月 1 日

第二版前言

药物化学是药学类各专业必修的重要专业课程之一，主要学习药物结构与药效的关系，药物的理化性质、鉴别方法、合成方法等，也为药学相关课程如药剂学、药物分析等的学习打下基础，是全面掌握药学领域各学科知识的重要桥梁。本教材紧扣药学类专业本科教育培养目标，以教育部药学专业培养目标和要求为基础，按照医药行业用人要求，进行教材内容的编写。

随着科学技术的发展和学科的相互渗透，药物化学学科的研究内容已由原有的以化学为主的研究转变为以化学、生物学、临床应用相结合的研究体系。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。

教材的编排上考虑药物作用靶点、药物治疗的用途以及药物研究与开发的原理和方法，共分为九大部分：作用于神经系统的药物，影响神经递质的药物，影响心脑血管系统的药物，影响消化系统的药物，化学治疗药物，影响激素调控系统的药物，影响免疫系统的药物维生素，药物研究与开发的基本原理和方法。

本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。本书共有二十四章，沈阳药科大学孙铁民教授编写了第十、十一、十五章；武汉大学胡先明教授编写了第一、十三、十七章；吉林大学杨晓虹教授编写了第二、三、六章；西安交通大学药学院陈有亮教授编写了第七、十六、二十一章；天津医科大学王润玲教授编写了第十二、十八、十九章；中国药科大学徐云根教授编写了第八、九、十四章，向

药物化学

华教授编写了第二十二、二十三、二十四章，李玉艳副教授编写了第四、五、二十章内容。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

2010年8月

目录

CONTENTS



绪论	(1)
一、药物化学的研究内容和任务	(1)
二、药物化学的发展	(2)
三、我国药物化学的发展	(4)

第一部分 作用于神经系统的药物

第一章 镇静、催眠药和抗癫痫药	(9)
第一节 苯二氮革类镇静催眠药	(9)
一、苯二氮革类药物的发展	(10)
二、苯二氮革类药物的作用机制	(12)
三、苯二氮革类药物的理化性质	(13)
四、苯二氮革类药物的构效关系	(14)
五、苯二氮革类药物的立体化学	(15)
六、内源性的苯二氮革受体配体和苯二氮革受体拮抗剂	(16)
七、苯二氮革类药物的体内代谢	(17)
第二节 非苯二氮革类 GABA _A 受体激动剂	(21)
一、吡咯酮类	(21)
二、咪唑并吡啶类	(24)
第三节 抗癫痫药	(26)
一、抗癫痫药物的发展	(26)
二、抗癫痫药物的作用机制	(27)
三、巴比妥类及同型药物	(28)
四、二苯并氮杂革类	(35)
五、GABA 类似物	(37)

六、脂肪酸类	(37)
七、磺酰胺类	(38)
八、其他结构类药物	(38)
第二章 精神疾病治疗药	(40)
第一节 经典抗精神病药	(41)
一、吩噻嗪类	(41)
二、硫杂蒯类	(48)
三、丁酰苯类及其类似物	(50)
四、苯酰胺类	(54)
五、二苯二氮革类及其衍生物	(55)
第二节 非经典抗精神病药物	(55)
第三节 抗抑郁药	(59)
一、单胺氧化酶抑制剂	(61)
二、三环类抗抑郁药	(62)
三、选择性5-羟色胺再摄取抑制剂	(66)
第四节 抗躁狂药和抗焦虑药	(69)
一、抗躁狂药	(69)
二、抗焦虑药	(70)
第三章 神经退行性疾病治疗药	(73)
第一节 抗帕金森病药	(73)
一、拟多巴胺类药	(74)
二、外周脱羧酶抑制剂	(75)
三、多巴胺释放剂	(77)
四、多巴胺受体激动剂	(77)
五、辅助治疗药	(78)
第二节 抗老年痴呆症药	(80)
一、胆碱能药物	(80)
二、作用于 β 淀粉样多肽的AD治疗药	(86)
三、作用于tau蛋白的AD治疗药	(88)
第四章 阿片类镇痛药	(90)
第一节 吗啡及其半合成镇痛药	(90)
第二节 合成镇痛药	(94)
一、吗啡喃类	(95)
二、苯吗喃类	(95)
三、哌啶类	(96)

四、苯丙胺类	(96)
五、其他合成镇痛药	(97)
第三节 内源性阿片肽与阿片受体	(100)
一、内源性阿片肽	(100)
二、阿片受体	(100)
第五章 局部麻醉药	(103)
第一节 局部麻醉药的发展	(103)
第二节 局部麻醉药的构效关系	(105)
第三节 局部麻醉药的作用机制	(109)

第二部分 影响神经递质的药物

第六章 拟胆碱和抗胆碱药物	(117)
第一节 拟胆碱药	(118)
一、胆碱受体激动剂	(119)
二、乙酰胆碱酯酶抑制剂	(123)
第二节 抗胆碱药	(127)
一、茄科生物碱类 M 受体拮抗剂	(127)
二、合成 M 受体拮抗剂	(131)
三、N 胆碱受体拮抗剂	(134)
第七章 作用于肾上腺素能受体的药物	(138)
第一节 肾上腺素能神经递质的生物合成和体内代谢	(139)
一、肾上腺素能神经递质的生物合成	(139)
二、肾上腺素能神经递质的体内代谢	(139)
第二节 拟肾上腺素能受体药	(140)
一、 α 、 β -受体激动剂	(141)
二、 α -受体激动剂	(144)
三、 β -受体激动剂	(147)
四、构效关系	(150)
第三节 抗肾上腺素能药物	(151)
一、 α -受体拮抗剂	(151)
二、 β -受体拮抗剂	(153)
三、 β -受体拮抗剂的构效关系	(157)

第三部分 影响心脑血管系统的药物

第八章 高血压治疗药	(161)
第一节 中枢性降压药	(161)
第二节 作用于神经末梢的药物	(162)
第三节 血管扩张药物	(164)
一、钾通道调节剂	(164)
二、NO 供体药物	(165)
第四节 影响肾素-血管紧张素-醛固酮系统的药物	(166)
一、肾素-血管紧张素-醛固酮系统	(166)
二、肾素抑制剂	(167)
三、血管紧张素转化酶抑制剂	(168)
四、血管紧张素Ⅱ受体拮抗剂	(172)
第五节 钙通道阻滞剂	(175)
一、选择性钙通道阻滞剂	(176)
二、非选择性钙通道阻滞剂	(182)
第六节 利尿药	(183)
一、碳酸酐酶抑制剂	(184)
二、 $\text{Na}^+ - \text{K}^+ - 2\text{Cl}^-$ 协转运抑制剂	(184)
三、 $\text{Na}^+ - \text{Cl}^-$ 协转运抑制剂	(186)
四、肾小管上皮钠通道阻滞剂	(188)
五、盐皮质激素受体拮抗剂	(188)
第九章 心脏疾病药物和血脂调节药	(190)
第一节 强心药物	(190)
一、强心苷类	(190)
二、磷酸二酯酶抑制剂	(192)
三、钙敏化剂	(193)
第二节 抗心律失常药物	(193)
一、钠通道阻滞剂	(194)
二、钾通道阻滞剂	(198)
第三节 抗心绞痛药物	(201)
一、硝酸酯类	(201)
二、部分脂肪酸氧化抑制剂	(203)

第四节 血脂调节药	(204)
一、羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑制剂	(204)
二、苯氧乙酸类	(209)
三、烟酸及其衍生物	(212)
四、其他降血脂药物	(213)

第四部分 影响消化系统的药物

第十章 抗溃疡药	(217)
第一节 H ₂ 受体拮抗剂	(218)
一、咪唑类	(220)
二、呋喃类	(221)
三、噻唑类	(223)
四、哌啶甲苯类	(224)
五、H ₂ 受体拮抗剂的构效关系	(224)
第二节 质子泵抑制剂	(225)
第十一章 胃动力药和止吐药	(230)
第一节 胃动力药	(230)
一、多巴胺 D ₂ 受体拮抗剂	(230)
二、5-HT ₄ 受体激动剂	(232)
第二节 止吐药	(235)
一、作用机制和分类	(235)
二、5-HT ₃ 受体拮抗剂	(235)

第五部分 化学治疗药物

第十二章 合成抗菌药	(241)
第一节 喹诺酮类抗菌药	(241)
一、喹诺酮类药物的发展	(241)
二、喹诺酮类药物的作用机制	(243)
三、喹诺酮类药物的化学结构与抗菌活性的关系	(244)

第二节 磺胺类抗菌药及抗菌增效剂	(248)
一、磺胺类药物的的发展	(248)
二、磺胺类药物的构效关系	(250)
三、磺胺类药物的作用机制	(250)
四、吸收和代谢	(251)
五、磺胺类药物的理化性质	(251)
六、抗菌增效剂	(253)
第三节 抗真菌药	(255)
一、抗生素类抗真菌药	(255)
二、唑类抗真菌药	(257)
三、其他抗真菌药	(262)
第四节 抗结核病药	(263)
第十三章 抗病毒药	(268)
第一节 病毒及抗病毒药物的作用机制	(269)
一、病毒的分类	(269)
二、病毒生命周期	(270)
三、抗病毒药物作用机制	(271)
第二节 干扰病毒复制初期的药物	(272)
一、干扰病毒吸附的药物	(272)
二、干扰病毒穿入、脱壳的药物	(273)
三、干扰素	(277)
第三节 抑制病毒核酸复制的药物	(278)
一、嘧啶核苷类	(279)
二、嘌呤核苷类	(281)
三、非核苷类	(285)
第四节 基于其他机制的抗病毒药物	(287)
第五节 抗人免疫缺陷病毒药物	(288)
一、融合抑制剂	(289)
二、逆转录酶抑制剂	(290)
三、HIV 蛋白酶抑制剂	(294)
四、整合酶抑制剂	(298)
第十四章 抗生素	(300)
第一节 β -内酰胺类抗生素	(301)
一、青霉素类	(302)
二、头孢菌素类	(311)
三、非经典的 β -内酰胺抗生素	(318)

第二节 大环内酯类抗生素	(323)
一、红霉素类大环内酯抗生素	(323)
二、螺旋霉素及其衍生物	(329)
三、麦迪霉素及其衍生物	(330)
第三节 氨基糖苷类抗生素	(331)
一、链霉素	(331)
二、卡那霉素及其衍生物	(332)
三、庆大霉素 C 及其衍生物	(333)
四、新霉素类	(334)
第四节 四环素类抗生素	(335)
第五节 其他抗生素	(338)
一、氯霉素及其衍生物	(338)
二、林可霉素及其衍生物	(340)
第十五章 抗肿瘤药	(342)
第一节 直接作用于 DNA 的药物	(342)
一、烷化剂	(343)
二、金属铂配合物	(352)
三、直接作用于 DNA 的天然产物	(353)
四、DNA 拓扑异构酶抑制剂	(356)
第二节 抗代谢药物	(361)
一、嘧啶拮抗物	(361)
二、嘌呤拮抗物	(364)
三、叶酸拮抗物	(366)
第三节 抗有丝分裂的药物	(368)
一、在微管蛋白上有一个结合位点的药物	(368)
二、在微管蛋白上有两个结合点的药物	(369)
三、微管稳定剂及微管组装促进剂	(369)
第四节 基于肿瘤信号转导机制的药物	(370)
一、蛋白激酶抑制剂	(370)
二、蛋白酶体抑制剂	(375)
第十六章 抗寄生虫药	(376)
第一节 抗疟药物	(376)
一、疟原虫的生命周期和抗疟药物的作用环节	(376)
二、疟疾的预防和治疗药物	(377)
第二节 驱肠虫药物	(382)

一、哌嗪类	(382)
二、咪唑类	(383)
三、其他类驱肠虫药	(385)
第三节 抗血吸虫药物	(385)

第六部分 影响激素调控系统的药物

第十七章 甾体激素药物	(391)
第一节 概述	(391)
一、甾体激素的作用机制	(392)
二、甾体化合物的化学结构与命名	(392)
三、甾体激素半合成原料及中间体	(394)
四、甾体激素的体内生物合成途径	(394)
第二节 雄激素、蛋白同化激素及雄激素拮抗剂	(395)
一、概述	(395)
二、人工合成的雄激素和蛋白同化激素	(396)
三、构效关系	(401)
四、不良反应及禁忌证	(402)
五、雄激素拮抗剂	(402)
第三节 雌激素和雌激素拮抗剂	(403)
一、概述	(403)
二、甾体雌激素	(403)
三、甾体雌激素的代替品——非甾体雌激素	(407)
四、构效关系	(408)
五、不良反应及禁忌证	(408)
六、雌激素拮抗剂	(409)
第四节 孕激素和孕激素拮抗剂	(412)
一、概述	(412)
二、人工合成的孕激素	(412)
三、构效关系	(421)
四、孕激素拮抗剂	(421)
五、不良反应及禁忌证	(423)
六、甾体避孕药	(423)
第五节 肾上腺皮质激素	(425)

一、概述	(425)
二、合成糖皮质激素	(427)
三、一些常用的糖皮质激素类的药物	(433)
四、不良反应及禁忌证	(435)
五、肾上腺皮质激素拮抗剂	(436)
第十八章 降血糖药物和骨质疏松治疗药	(437)
第一节 降血糖药物	(437)
一、胰岛素	(437)
二、口服降血糖药	(439)
第二节 骨质疏松治疗药物	(451)
一、骨吸收抑制剂	(451)
二、骨形成促进剂	(454)

第七部分 影响免疫系统的药物

第十九章 非甾体消炎药	(459)
第一节 解热镇痛药	(459)
一、水杨酸类药物	(459)
二、苯胺类药物	(463)
三、吡唑酮类	(465)
第二节 非甾体抗炎药	(467)
一、3, 5-吡唑烷二酮类	(468)
二、邻氨基苯甲酸类	(469)
三、吲哚乙酸类	(471)
四、芳基烷酸类	(473)
五、1, 2-苯并噻嗪类	(477)
六、选择性 COX-2 抑制剂	(479)
七、非甾体抗炎药作用机制	(482)
第二十章 抗变态反应药物	(484)
第一节 组胺 H ₁ 受体拮抗剂	(484)
一、组胺 H ₁ 受体拮抗剂的发展	(484)