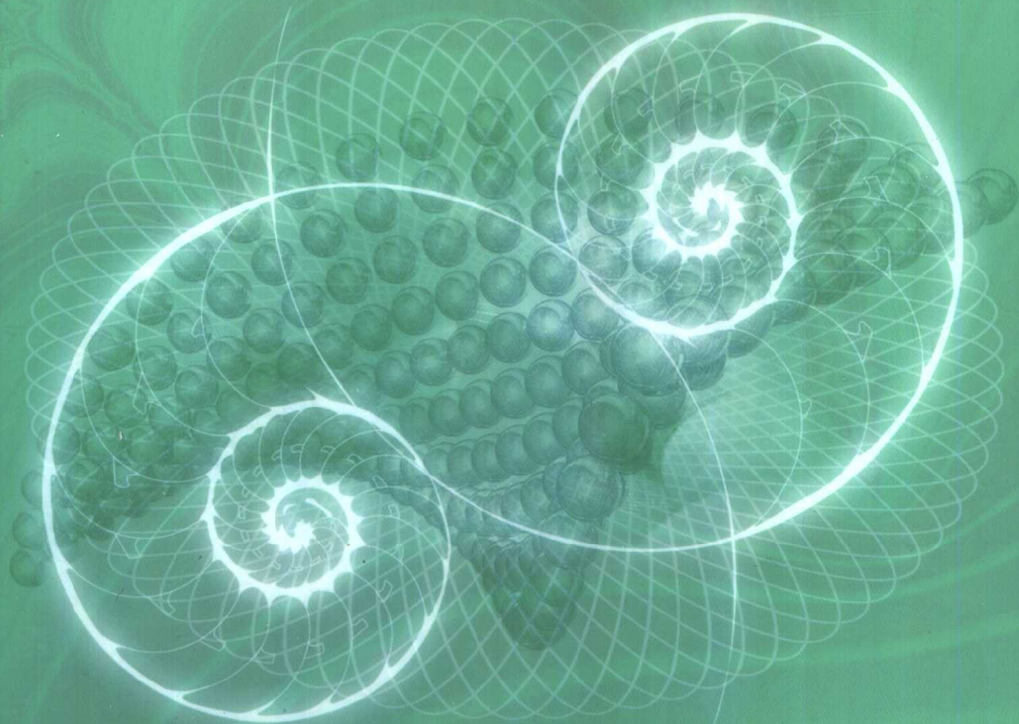


上卷

新编

药物合成手册

朱宝泉 李安良 杨光中 周 斌 主编



化学工业出版社

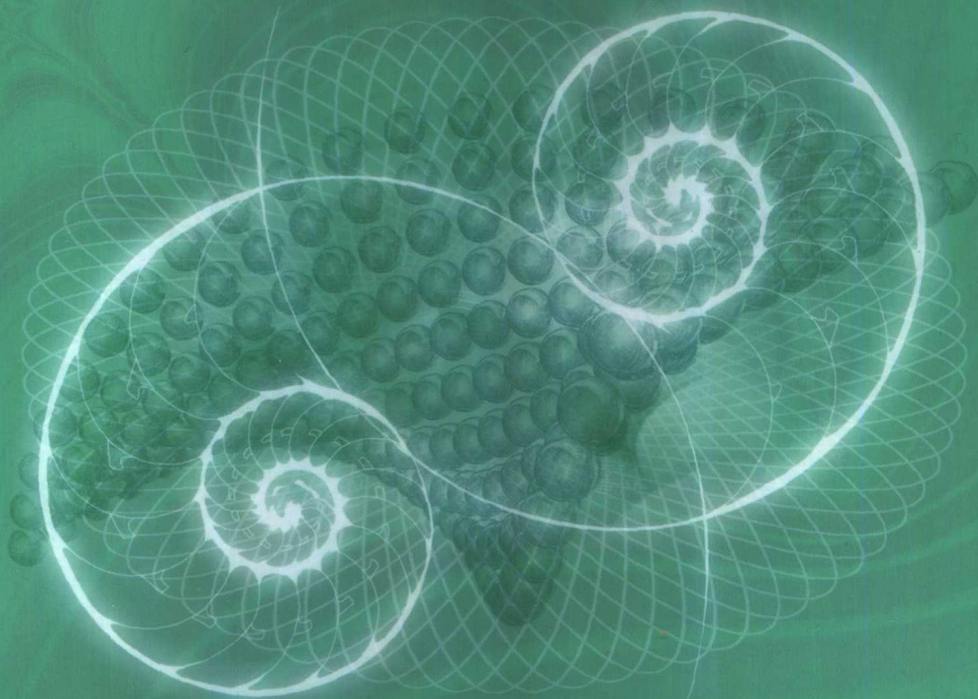
现代生物技术与医药科技出版中心

下卷

新编

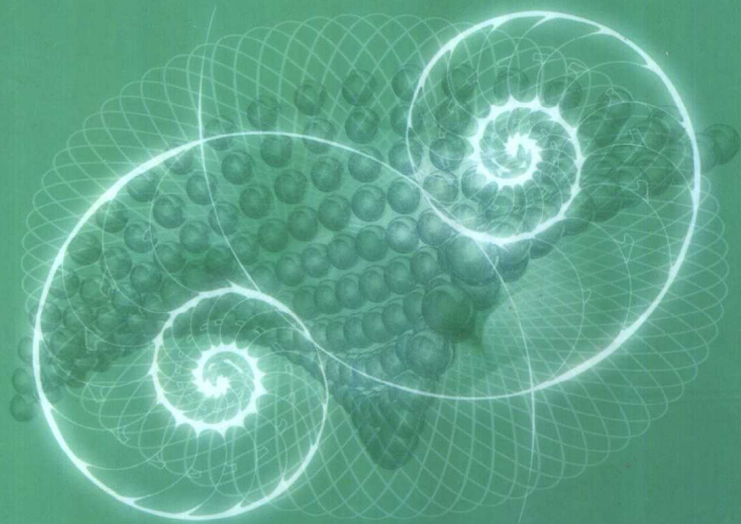
药物合成手册

朱宝泉 李安良 杨光中 周 斌 主编



化学工业出版社

现代生物技术与医药科技出版中心



ISBN 7-5025-4235-3



9 787502 542351 >

ISBN 7-5025-4235-3/R · 142 定价：280.00元（上、下卷）

新编药物合成手册

上 卷

朱宝泉 李安良 杨光中 周 斌 主编

化 学 工 业 出 版 社

现代生物技术与医药科技出版中心

·北 京·

新编药物合成手册

下 卷

朱宝泉 李安良 杨光中 周 斌 主编

化 学 工 业 出 版 社

现代生物技术与医药科技出版中心

·北 京·

(京)新登字 039 号

图书在版编目 (CIP) 数据

新编药物合成手册/朱宝泉等主编. —北京: 化学工业出版社, 2002.12
ISBN 7-5025-4235-3

I. 新… II. 朱… III. 化学合成-药物-手册
IV. TQ460.31-62

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2002) 第 089036 号

新编药物合成手册

朱宝泉 李安良 杨光中 周 斌 主编

责任编辑: 张文虎

文字编辑: 周熹微

责任校对: 陈 静

封面设计: 潘 峰

*

化 学 工 业 出 版 社 出版发行
现代生物技术与医药科技出版中心

(北京市朝阳区惠新里 3 号 邮政编码 100029)

发行电话: (010) 64982530

http://www.cip.com.cn

*

新华书店北京发行所经销

北京管庄永胜印刷厂印刷

三河市东柳装订厂装订

开本 787 毫米×1092 毫米 1/16 印张 94 $\frac{3}{4}$ 字数 2387 千字

2003 年 8 月第 1 版 2003 年 8 月北京第 1 次印刷

ISBN 7-5025-4235-3/R·142

定 价: 280.00 元 (上、下卷)

版权所有 违者必究

该书如有缺页、倒页、脱页者, 本社发行部负责退换

编写说明

本手册共编写了三百多种合成药的制备方法，并对每一合成药的结构式和化学名、来历、适应证、副作用、急性毒性、临床评价、制剂销售额、原料药产量及价格、制剂和药价基准、原料药的理化性质、原料药制法、原料及中间体的年需要量等分项简介。其中来历主要记载该药开发研究简况，并说明该药首次批准上市的年月及商品名等；副作用项列出临床产生副作用的例数及百分率；急性毒性主要记载动物试验的 LD_{50} 值；临床评价记述临床试验所得统计结果；制剂销售额、原料药产量及价格项中制剂销售额为估计值，原料药产量是按制剂销售额和药价基准算出的，原料药价格是按药价基准算出的制剂价的 15% 来计算；制剂及药价基准项中药价基准多半是 1988 年所制订的价格，个别为 1990 年的价格，仅供参考；本手册尽量将 1992 年制造销售该品种制剂的生产厂商及商品名、规格列出以供参考；原料药制法项中尽量说明其流程，在有几种制法时，选择有代表性的制法的实验例加以详细说明，其他制法仅列出流程；各药制备时原料及中间体年需要量按代表性制法中各反应工序的收率算出，各反应收率采用估计值计算。另外，本手册中提到的分子量为相对分子质量，不另加说明。

本手册中合成药按英文通用名字母顺序排列，分上、下两卷出版，上卷为药名首字母 A~F，下卷为药名首字母 G~Z。本手册目录相当于英文索引，文后附有中文名索引及 CAS 登录号索引。

本手册有关药名按中华人民共和国卫生部药典委员会编辑发表的《中国药品通用名称》（化学工业出版社，1997）为依据。化学词汇按《英汉化学化工词汇（第四版）》（化学工业出版社，2001）为准。

本手册编辑过程，虽经多次审校，但难免有错误之处，请读者见谅并提宝贵意见。

目 录

(按英文字母为序)

上 卷

Acebutolol Hydrochloride	盐酸醋丁洛尔	1
Aceglutamide Aluminum	醋谷胺铝	3
Actarit	阿克他利	6
Acyclovir	阿昔洛韦	8
Albendazole	阿苯达唑	12
Alacepril	阿拉普拉	15
Alclofenac	阿氯芬酸	19
Alfacalcidol	阿法骨化醇	24
Alminoprofen	阿明洛芬	32
Alprazolam	阿普唑仑	36
Alprenolol Hydrochloride	盐酸阿普洛尔	43
Ambroxol Hydrochloride	盐酸氨溴索	48
Amfenac Sodium	氨芬酸钠	51
Amlodipine Besilate	苯磺酸氨氯地平	54
Amosulalol Hydrochloride	盐酸氨磺洛尔	57
Amoxicillin	阿莫西林	60
Ampicillin	氨苄西林	69
Amrinone	氨力农	76
Argatroban	阿加曲班	78
Arotinolol Hydrochloride	盐酸阿罗洛尔	82
Astemizole	阿司咪唑	86
Atenolol	阿替洛尔	89
Azasetron Hydrochloride	盐酸阿扎司琼	92
Azelastine Hydrochloride	盐酸氮革斯丁	95
Azulene	萘	98
Bacampicillin Hydrochloride	盐酸巴氨西林	101
Baclofen	巴氯芬	104
Bendazac	苕达酸	107
Benserazide Hydrochloride	盐酸苕丝肼	110
Benzbromarone	苯溴马隆	112
Betamethasone Dipropionate	二丙酸倍他米松	115
Betamethasone Sodium Phosphate	倍他米松磷酸钠	119
Bevantolol Hydrochloride	盐酸贝凡洛尔	129

Bromhexine Hydrochloride	盐酸溴己新	133
Bromperidol	溴哌利多	138
Brotizolam	溴替唑仑	141
Brovincamine Fumarate	富马酸溴长春胺	145
Budesonide	布地奈德	148
Bunazosin Hydrochloride	盐酸布那唑嗪	150
Bunitrolol Hydrochloride	盐酸布尼洛尔	153
Cadralazine	卡屈嗪	156
Calcitriol	骨化三醇	160
Calcium Hopantenate	高泛酸钙	169
Camostat Mesilate	甲磺酸卡莫司他	171
Captopril	卡托普利	173
Carbazochrome Sodium Sulfonate	卡络磺钠	181
Carbenicillin Disodium	羧苄西林钠	184
Carbidopa	卡比多巴	189
Carbocisteine	羧甲司坦	192
Carfecillin Sodium	卡非西林钠	195
Carteolol Hydrochloride	盐酸卡替洛尔	198
Cefaclor	头孢克洛	203
Cefadroxil	头孢羟氨苄	210
Cefalexin	头孢氨苄	219
Cefaloridine	头孢噻啉	227
Cefalotin Sodium	头孢噻吩钠	231
Cefamandole Sodium	头孢孟多钠	234
Cefapirin Sodium	头孢匹林钠	240
Cefatrizine Propylene Glycol	头孢曲秦丙二醇	245
Cefazolin Sodium	头孢唑啉钠	252
Cefbuperazone Sodium	头孢拉宗钠	259
Cefditoren Pivoxil	头孢托仑酯	265
Cefepime Hydrochloride	盐酸头孢吡肟	270
Cefixime	头孢克肟	276
Cefmenoxime	头孢甲肟	283
Cefmetazole Sodium	头孢美唑钠	292
Cefminox Sodium	头孢米诺钠	301
Cefodizime Sodium	头孢地秦钠	305
Cefoperazone Sodium	头孢哌酮钠	310
Cefotaxime Sodium	头孢噻肟钠	316
Cefotetan Sodium	头孢替坦钠	325
Cefotiam Dihydrochloride	盐酸头孢替安	327
Cefotiam Hexetil Hydrochloride	盐酸头孢替安酯	331

Cefoxitin Sodium 头孢西丁钠	340
Cefozopran 头孢唑兰	347
Cefpiramide Sodium 头孢匹胺钠	352
Cefpodoxime Proxetil 头孢泊肟酯	356
Cefradine 头孢拉定	361
Cefroxadine 头孢沙啉	366
Cefsulodin Sodium 头孢磺啉钠	373
Ceftazole Sodium 头孢替唑钠	376
Ceftizoxime Sodium 头孢唑肟钠	382
Cefuroxime Axetil 头孢呋辛酯	392
Cefuzonam Sodium 头孢唑南钠	401
Cetraxate 西曲酸酯	405
Chlorhexidine Glucorate 葡糖酸氯己定	409
Chlormadinone Acetate 氯地孕酮	412
Chlorphenesin Carbamate 氯苯甘油氨酯	415
Ciclosporin 环孢素	417
Cilnidipine 西尼地平	429
Cilostazol 西洛地唑	432
Cimetidine 西咪替丁	434
Cinepazide Maleate 马来酸桂哌齐特	443
Cinnarizine 桂利嗪	446
Ciprofloxacin Hydrochloride 盐酸环丙沙星	452
Cisapride 西沙必利	456
Cisplatin 顺铂	459
Citicoline 胞磷胆碱	461
Clavulanic Acid Potassium 克拉维酸钾	466
Clidanac 环氯茛酸	469
Clobetasol Propionate 丙氯倍他索	475
Clonazepam 氯硝西洋	480
Clorazepic Acid Dipotassium 二钾氯氮草	488
Clotiazepam 氯噻西洋	491
Cromolym Sodium 色甘酸钠	497
Cyclandelate 环扁桃酯	500
Dacarbazine 达卡巴嗪	503
Dantrolene Sodium 丹曲林钠	504
Delapril Hydrochloride 盐酸地拉普利	510
Denopamine 地诺帕明	515
Dexamethasone Dipropionate 丙酸地塞米松	521
Diazepam 地西洋	527
Dibekacin 地贝卡星	536

Diclofenac Sodium 双氯芬酸钠	546
Diflorasone Diacetate 二醋酸二氟拉松	555
Diflucortolone Valerate 戊酸二氟可龙	560
Diflunisal 二氟尼柳	563
Difluprednate 二氟泼尼酯	566
Dihydroergotoxine Mesilate 甲磺酸二氢麦角碱	570
Dilazep Dihydrochloride 盐酸地拉革	573
Dilevalol Hydrochloride 盐酸地来洛尔	577
Diltiazem Hydrochloride 盐酸地尔硫革	582
Dipyridamole 双嘧达莫	586
Disopyramide 丙吡胺	593
Dobutamine Hydrochloride 盐酸多巴酚丁胺	596
Docarpamine 多卡巴胺	599
Domperidone 多潘立酮	603
Dopamine Hydrochloride 盐酸多巴胺	607
Dosulepin Hydrochloride 盐酸度硫平	609
Doxifluridine 去氧氟尿苷	613
Efonidipine Hydrochloride 盐酸依福地平	618
Enalapril Maleate 马来酸依那普利	621
Enocitabine 依诺他滨	626
Enoxacin 依诺沙星	629
Eperisone Hydrochloride 盐酸乙哌立松	635
Epinastine Hydrochloride 盐酸依匹斯汀	637
Epirubicin Hydrochloride 盐酸表柔比星	641
Ethyl Loflazepate 氯氟草乙酯	645
Etodolac 依托度酸	649
Fadrozole Hydrochloride 盐酸法屈唑	652
Famotidine 法莫替丁	655
Fasudil Hydrochloride 盐酸法舒地尔	661
Felbinac 联苯乙酸	663
Felbinac Ethyl Ester 联苯乙酸乙酯	668
Felodipine 非洛地平	670
Flavoxate Hydrochloride 盐酸黄酮哌酯	673
Flomoxef Sodium 氟氧头孢钠	679
Fluconazole 氟康唑	685
Flucytosine 氟胞嘧啶	688
Fludiazepam 氟地西洋	691
Flunarizine Hydrochloride 盐酸氟桂利嗪	701
Flunitrazepam 氟硝西洋	703
Fluorouracil 氟尿嘧啶	709

Flurbiprofen 氟比洛芬	715
Flutamide 氟他胺	722
Fluticasone Propionate 丙酸氟替卡松	724
Formoterol Fumarate 富马酸福莫特罗	728
Fosfomycin 磷霉素	733
Furosemide 呋塞米	738
Fursultiamine 呋喃硫胺	741

下 卷

Gabexate Mesilate 甲磺酸加贝酯	745
Gadoteridol 钆特醇	748
Ganciclovir 更昔洛韦	751
Gliclazide 格列齐特	758
Guanabenz Acetate 醋酸胍那苄	761
Guanfacine Hydrochloride 盐酸胍法辛	763
Guspertimus Hydrochloride 盐酸胍立莫司	765
Haloxazolam 卤沙唑仑	768
Ibuprofen 布洛芬	771
Idarubicin Hydrochloride 盐酸伊达比星	778
Ifenprodil Tartrate 酒石酸艾芬地尔	782
Indapamide 吲达帕胺	785
Indeloxazine Hydrochloride 盐酸茛洛秦	788
Indenolol Hydrochloride 盐酸茛诺洛尔	792
Indometacin 吲哚美辛	796
Indometacin Sodium 吲哚美辛钠	804
Inosine Pranobex 异丙肌苷	806
Iomeprol 碘美普尔	809
Iopamidol 碘帕醇	812
Ioxilan 碘昔兰	816
Ipriflavone 伊普黄酮	820
Irinotecan Hydrochloride 盐酸伊立替康	823
Irsogladine Maleate 马来酸依索拉定	827
Isepamicin 异帕米星	830
Isosorbide Dinitrate 硝酸异山梨酯	833
Isosorbide Mononitrate 单硝酸异山梨酯	836
Itopride Hydrochloride 盐酸伊托必利	840
Ketotifen Fumarate 富马酸酮替芬	844
Lanconazole 拉诺康唑	849
Lansoprazole 兰索拉唑	851
Latamoxef Sodium 拉氧头孢钠	855

Levonorgestrel 左炔诺孕酮	859
Limaprost 利马前列素	866
Lomefloxacin Hydrochloride 盐酸洛美沙星	873
Lorazepam 劳拉西洋	877
Losartan Potassium 氯沙坦钾	883
Loxoprofen Sodium 氯索洛芬钠	888
Manidipine Hydrochloride 盐酸马尼地平	891
Medazepam 美达西洋	896
Mefenamic Acid 甲芬那酸	904
Mepirizole 美吡哌唑	910
Meropenem 美罗培南	915
Mesna 美司纳	920
Methyldopa 甲基多巴	922
Meticrane 美替克仑	930
Metoclopramide 甲氧氯普胺	932
Metoprolol Tartrate 酒石酸美托洛尔	940
Metrizamide 甲泛葡胺	945
Mexiletine Hydrochloride 盐酸美西律	949
Miconazole 咪康唑	951
Midodrine Hydrochloride 盐酸米多君	954
Mifepristone 米非司酮	957
Milrinone Lactate 乳酸米力农	962
Minocycline Hydrochloride 盐酸米诺环素	964
Misoprostol 米索前列醇	969
Mofezolac 莫苯唑酸	974
Moxisylyte Hydrochloride 盐酸莫西赛利	977
Nadolol 纳多洛尔	982
Nafamostat Mesilate 甲磺酸萘莫司他	985
Nafarelin Acetate 醋酸那法瑞林	988
Nalidixic Acid 萘啶酸	991
Naproxen 萘普生	997
Nedaplatin 奈达铂	1006
Netilmicin 奈替米星	1009
Nicardipine Hydrochloride 盐酸尼卡地平	1015
Nicergoline 尼麦角林	1019
Nicomol 尼可莫尔	1023
Nicorandil 尼可地尔	1026
Nifedipine 硝苯地平	1028
Nilvadipine 尼伐地平	1032
Nisoldipine 尼索地平	1036

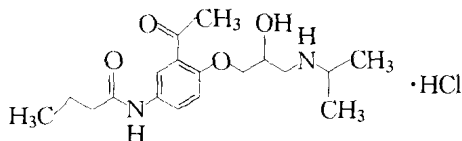
Nitrazepam 硝西洋	1039
Nitrendipine 尼群地平	1047
Nizatidine 尼扎替丁	1050
Nizofenone Fumarate 富马酸尼唑苯酮	1054
Norfloxacin 诺氟沙星	1058
Ofloxacin 氧氟沙星	1062
Omeprazole 奥美拉唑	1066
Ondansetron Hydrochloride 盐酸昂丹司琼	1072
Oxaprozin 奥沙普秦	1075
Oxazolam 奥沙唑仑	1078
Oxprenolol Hydrochloride 盐酸氧烯洛尔	1081
Oxybutynin Hydrochloride 盐酸奥昔布宁	1086
Pamidronic Acid Disodium 帕米膦酸二钠	1089
Pantethine 泛硫乙胺	1092
Pentoxifylline 己酮可可碱	1100
Pergolide Mesilate 甲磺酸培高利特	1108
Picosulfate Sodium 匹可硫酸钠	1112
Pimobendan Hydrochloride 盐酸匹莫苯	1116
Pinacidil 吡那地尔	1120
Pindolol 吲哚洛尔	1122
Pipemidic Acid 吡哌酸	1131
Piperacillin 哌拉西林	1138
Pirarubicin 吡柔比星	1141
Pirenoxine 吡诺克辛	1146
Piretanide 吡咯他尼	1149
Pirmenol Hydrochloride 盐酸吡美诺	1153
Piroxicam 吡罗昔康	1157
Pivmecillinam Hydrochloride 盐酸匹美西林	1163
Plaunotol 普劳诺托	1166
Polaprezinc 聚普瑞锌	1168
Pranlukast 普仑司特	1171
Pranoprofen 普拉洛芬	1174
Prasterone Sodium Sulfate 普拉睾酮硫酸钠	1179
Probucol 普罗布考	1181
Procaterol Hydrochloride 盐酸丙卡特罗	1185
Proglumide 丙谷胺	1188
Propafenone Hydrochloride 盐酸普罗帕酮	1191
Propagermanium 丙帕锗	1193
Propentofylline 丙戊茶碱	1196
Propofol 丙泊酚	1198

Propranolol Hydrochloride	盐酸普萘洛尔	1200
Prosultiamine	丙舒硫胺	1204
Quinapril Hydrochloride	盐酸喹那普利	1209
Ranitidine Hydrochloride	盐酸雷尼替丁	1214
Retinoic Acid	维 A 酸	1221
Rilmazafone Hydrochloride	盐酸利马扎封	1224
Scopolamine Butylbromide	丁溴东莨菪碱	1227
Seratrodast	塞曲司特	1230
Setiptiline Maleate	马来酸司普替林	1234
Simfibrate	双贝特	1236
Sobuzoxane	索布佐生	1239
Sucralfate	硫糖铝	1242
Sulbenicillin Disodium	磺苄西林钠	1244
Sulindac	舒林酸	1248
Sulpiride	舒必利	1260
Sultopride Hydrochloride	盐酸舒托必利	1268
Suplatast Tosilate	甲磺司特	1272
Talampicillin Hydrochloride	盐酸酞氨西林	1275
Tamoxifen Citrate	柠檬酸他莫昔芬	1279
Technetium [^{99m} Tc] Bicisate	比西酸锝 [^{99m} Tc]	1283
Technetium [^{99m} Tc] Mertiatide	巯替肽锝 [^{99m} Tc]	1287
^{99m} Tc Tetrofosmin	替曲膦锝	1289
Tegafur	替加氟	1291
Temocapril Hydrochloride	盐酸替莫普利	1300
Tenoxicam	替诺昔康	1306
Teprenone	替普瑞酮	1309
Terazosin Hydrochloride	盐酸特拉唑嗪	1311
Terfenadine	特非那定	1314
Terguride	特麦角脲	1317
Terodiline Hydrochloride	盐酸特罗地林	1320
Tiaprofenic Acid	噻洛芬酸	1322
Tiamide Hydrochloride	盐酸噻拉米特	1326
Ticarcillin Sodium	替卡西林钠	1332
Ticlopidine Hydrochloride	盐酸噻氯匹定	1336
Timepidium Bromide	噻哌溴铵	1339
Tizanidine Hydrochloride	盐酸替扎尼定	1342
Tiquizium Bromide	替喹溴铵	1346
Tocopherol Nicotinate	烟酸生育酚酯	1348
Tofisopam	托非索泮	1352
Tolfenamic Acid	托芬那酸	1355

Tolmetin 托美丁	1357
Tolperisone Hydrochloride 盐酸托哌酮	1363
Toremifene Citrate 柠檬酸托瑞米芬	1367
Tosufloxacin Tosilate 甲苯磺酸托氟沙星	1372
Tranexamic Acid 氨甲环酸	1379
Tranilast 曲尼司特	1385
Trapidil 曲匹地尔	1389
Tretoquinol Hydrochloride 盐酸曲托喹酚	1393
Triazolam 三唑仑	1399
Tribenoside 三苜糖苷	1403
Trichlormethiazide 三氯噻嗪	1405
Trientine Hydrochloride 盐酸曲恩汀	1408
Trilostane 曲洛司坦	1410
Trimebutine Maleate 马来酸曲美布汀	1413
Trimetazidine Hydrochloride 盐酸曲美他嗪	1417
Troglitazone 曲格列酮	1420
Troxipide 曲昔派特	1425
Tulobuterol 妥洛特罗	1427
Ubidecarenone 泛癸利酮	1429
Unoprostone Isopropyl Ester 乌诺前列酮异丙酯	1443
Valproic Acid Sodium 丙戊酸钠	1448
Valsartan 缬沙坦	1452
Vecuronium Bromide 维库溴铵	1455
Vesnarinone 维司力农	1459
Vidarabine 阿糖腺苷	1463
Vinpocetine 长春西汀	1466
Voglibose 伏格列波糖	1469
Zonisamide 唑尼沙胺	1474
Zopiclone 佐匹克隆	1477
中文索引	1481
CAS 登录号索引	1486

盐酸醋丁洛尔 (Acebutolol Hydrochloride)

1. 结构式和化学名



化学名: *N*-[3-乙酰基-4-[2-羟基-3-[(1-甲基乙基)氨基]丙氧基]苯基]丁酰胺盐酸盐;
N-[3-Acetyl-4-[2-hydroxy-3-[(1-methylethyl) amino] propoxy] phenyl] butanamide hydrochloride

分子式: $C_{18}H_{28}N_2O_4 \cdot HCl$; 分子量: 371.89; CAS 登录号: 37517-30-9

2. 来历

由于 β 受体阻滞剂以同等程度阻滞心脏和支气管的 β 受体, 因此, 可能患支气管哮喘的患者或支气管痉挛的患者不可使用。但是开发选择性阻滞心脏 β 受体, 而几乎不或完全不阻滞支气管的 β 受体阻滞剂是很有意义的。故于 1969 年英国自苯并氧氮杂草 (benzoxazocine) 衍生物中找出了对心脏的 β 受体有选择性阻滞作用的化合物, 已在英国等 8 个国家上市。

1981 年 6 月钟纺制药公司以 Sectral 的商品名、罗纳·普朗克药品公司以 Acetanol 的商品名取得许可。

3. 适应证

口服: 轻度至中度原发性高血压、心绞痛、心律失常 (窦性心动过速、期前收缩、阵发性室上性心动过速、首次发生的心房纤颤、除纤颤后窦性心律的维持)。

注射: 麻醉时发生的心律失常, 包括窦性心动过速、心动过速型心律失常、期前收缩。

4. 副作用

口服: 副作用发生率 6.4% (340 例/5 289 例), 合计发生 455 例次 (8.6%)、循环器官症状 2.1%、呼吸器官症状 1%、精神神经系统症状 1.6%、消化系统症状 1.8%、泪液分泌减少 0.1%、过敏症 0.5% 等。

注射: 收缩期血压为 13.3kPa(100mmHg) 以下或减少 30% 以上有 7 例 (2.5%), 心功能不全、支气管痉挛等均未发现。

5. 急性毒性

$LD_{50}/mg \cdot kg$ 小鼠: 口服 = ♂ 4 850、♀ 4 050, 皮下注射 = ♂ 291、♀ 410, 腹腔注射 = ♂ 185、♀ 220, 静脉注射 = ♂ 53、♀ 59; 大鼠: 口服 = ♂ 6 710、♀ 6 620, 皮下注射 = ♂ 1 460、♀ 1 310, 腹腔注射 = ♂ 222、♀ 234, 静脉注射 = ♂ 103、♀ 105。

6. 制剂销售额、原料药产量及价格

项 目	制剂销售额/百万日元	原料药生产量/kg	原料药价格/日元·kg ⁻¹
1986 年	1 700	4 582	55 650