新药化学全合成路线手册

（1999～2007）

Total Synthesis of New Drugs Approved During 1999 ~ 2007



陈清奇　主编







科学出版社
www.sciencep.com

需要全本请访问 www.ertongbook.com

新药化学全合成路线手册
(1999～2007)

Total Synthesis of New Drugs Approved During 1999～2007

陈清奇　主编

科学出版社
北京

内 容 简 介

本书主要介绍了新药的化学合成方法，覆盖了美国食品与药品管理局（FDA）于1999～2007年批准上市的所有新分子实体药物共170余个。针对每一种药物给出了药物简介、药物化学结构信息、化学全合成路线等。这些合成路线大多是目前制药工业中正在使用的生产工艺，有较高的实用性与学术价值。本书共包含了数千个有机合成反应，数百种药物中间体的合成制造方法和数个非常有参考价值的附录。

本书适合于制药企业、化学合成企业和其他研究药物的科研人员，以及高校药学和有机合成专业的科研与教学人员使用。

图书在版编目(CIP)数据

新药化学全合成路线手册（1999～2007）/陈清奇主编．—北京：科学出版社，2008

ISBN 978-7-03-021468-3

Ⅰ．新… Ⅱ．陈… Ⅲ．药物—化学合成 Ⅳ．TQ460.31

中国版本图书馆CIP数据核字（2008）第039492号

策划编辑：沈红芬 / 责任编辑：王 霞 / 责任校对：朱光光

责任印制：刘士平 / 封面设计：黄 超

版权所有，违者必究。未经本社许可，数字图书馆不得使用

科学出版社 出版

北京东黄城根北街16号

邮政编码：100717

http://www.sciencep.com

双青印刷厂 印刷

科学出版社发行 各地新华书店经销

*

2008年6月第 一 版 开本：787×1092 1/16

2008年6月第一次印刷 印张：33 1/2

印数：1—2 000 字数：788 000

定价：128.00元

（如有印装质量问题，我社负责调换〈双青〉）

《新药化学全合成路线手册（1999～2007）》编写人员

主　编　陈清奇

编　者（按姓氏汉语拼音排序）

陈冰子　陈清奇　涂　斌

肖紫微　薛　松　张　驿

作者简介

陈冰子

女，浙江温州乐清人。1995年毕业于北京大学化学系，获理学博士学位，研究论文为《生物活性天然产物的全合成》。1999～2002年在美国波士顿大学化学系从事核苷酸和核酸（DNA和RNA）的合成工作。2002～2007年在麻省理工学院生物工程系从事基因损害及突变的分析研究和药物毒理机制的研究。负责和参与多个科研项目的策划和实施。现在美国马萨诸塞州一家药物公司从事新药研发和药物合成工作。专业背景：合成有机化学、药物化学、分析化学和生物有机化学。研究范围：合成天然产物、生物活性天然产物类似物、小分子药物、核苷酸和核酸（DNA和RNA）、蛋白质药物的化学结构改造、有机分子的合成策略、合成路线的设计、多步有机合成、合成方法和有机分子分析鉴定方法的发展、化学结构与药物有效性及毒副作用的关系，以及基因损害和突变机制。

陈清奇

男，湖南安仁人。1982年毕业于郴州师范专科学校化学系。1987年毕业于延边大学化学系有机化学研究生班。1993年毕业于北京大学化学系获理学博士学位（指导导师：金声教授、马金石教授）。研究领域为有机合成及药物化学。曾先后在奥地利、美国、加拿大的四所国际知名大学从事生物制药、新药合成与新药研发工作。从1999年起，供职于生物制药领域，曾先后在美国和加拿大数家生物技术及生物制药高科技公司从事药物合成、新药研发、原料药的合成与生产、中试合成工艺开发。目前在美国北卡罗来纳州的一家生物制药公司主管新药研发、原料药及药物中间体的化学全合成。主要工作成果：成功地主持了20多个与开发新药相关的研究项目，开发了数个药物的化学全合成生产工艺，这些成果已被几家制药厂采用并应用于实际生产中。直接参与研究的新药中，已有3种获美国FDA及全球80多个国家相关部门批准上市。负责设计和研究出的新分子实体药已有数种进入了临床前或临床试验阶段。到目前为止，已在国际知名科技刊物发表了近90篇科技论文，拥有数项发明专利。曾在2000年入选为中国科学院“百人计划”教授及博士生导师。主要编著有《小分子药物的生产制造与化学全合成路线手册》（湖南科学技术出版社，2008年1月出版）和《美国药品专利研究指南》（科学出版社，2008年6月出版）。

涂　斌

男，河南固始人。1994年毕业于河南大学化学系。2000年毕业于中国科学院感光化

需要全本请访问 www.ertongbook.com

学研究所，获理学博士学位（指导导师：马金石教授），研究领域为有机合成。2000～2003年在美国内华达大学化学系 David A. Lightner 博士的实验室从事博士后研究，研究领域是天然化合物胆红素及其类似物的全合成。2003～2005 年在美国波士顿大学化学系 T Ross Kelly 教授的实验室从事天然化合物的全合成。在国际知名科技刊物发表 12 篇科技论文。目前供职于化学制药领域，主要从事药物合成、新药研发、药物的中试合成及工艺开发。成功地开发了几个新分子实体药的化学全合成生产工艺，其中已有一种进入临床一期试验阶段。

肖紫微

男，湖南益阳人。1996 年毕业于北京大学化学系，获学士学位。1998 年毕业于美国俄亥俄州州立大学，获生物化学硕士学位。2003 年毕业于加拿大不列颠哥伦比亚大学化学系，获理学博士学位（指导导师：David H. Dolphin 教授）。2003～2006 年在美国哈佛大学做博士后（指导导师：Irving Goldberg 教授），从事有机合成及药物化学方面研究。在国际知名科技刊物上发表了多篇科技论文，并已获得多项发明专利。目前在美国加利福尼亚州从事药物及药物中间体的化学合成研发工作。

薛　松

男，江苏常州人。1992 年毕业于中国科学技术大学应用化学系（87 级少年班学生）。1997 年获美国罗格斯大学（Rutgers University）化学博士学位（指导导师：Robert Moss 教授），后在美国芝加哥大学化学系做博士后研究（指导导师：William Wulff 教授）。1998 年至今在诺华（Novartis）制药公司工作，现为研究员（fellow）。主要从事药物合成及中试合成工艺开发。到目前为止，已在国际知名科技刊物上发表 17 篇论文，并拥有 4 项国际发明专利。

张　驿

男，江苏泰县人。1991 年毕业于南京大学化学系，同年进入中国科学院感光化学研究所从事有机合成工作。2001 年毕业于中国科学院化学研究所，获博士学位（指导导师：马金石教授）。研究领域为有机合成及生物有机化学。曾先后在美国纽约州立大学石溪分校以及弗吉尼亚大学从事有机合成以及分子影像学研究工作。到目前为止，已在国际知名科技刊物发表 20 多篇科技论文，并拥有数项发明专利。

前　言

一个新药的诞生是人类智慧和巨额资金的结晶，也是人类医药科技发展的又一个里程碑。新药开发研制的成功在一定程度上也能展示出一个国家的综合科技实力和整体经济实力。国外的统计数字显示，研制一种新药所需的费用为 8 亿～12 亿美元，历时 8～14 年，需要上百乃至上千名跨学科、跨行业的优秀科学家参与。研制新药的过程也极为复杂：在临床前活性化合物的筛选过程中，科学家平均需要从上百至上千个化合物中才能筛选出 1 个适合于人体临床试验的化合物。而每 20 个进入临床试验的化合物，最终只有 1～2 个能获准进入市场。即使是已获批准上市的新药，进入临床使用一段时间后，也仍有少数会因为意想不到的毒副作用而被停止上市。新药研究开发的难度和风险由此可见一斑。

自改革开放以来，我国医药工业飞速发展，医药工业总产值由 1978 年的 64 亿元增加到 2007 年的 6000 亿元。30 年增长了近 100 倍，成绩斐然。然而，我们也应该看到，我国在小分子药物的研究、开发、生产与应用方面起步较晚，其发展步伐远远落后于西方发达国家。据统计，我国目前的化学药物 97%以上是仿制品，自主开发的化学药物不到 3%。这其中除了历史的原因外，最主要的是研究开发新药耗资巨、难度大、风险高、周期长。而另一方面，随着我国人口数量的不断增加和人口老龄化状况日益加剧，对治疗性药物及预防性药物的需求将会大幅增加。所以，进一步加快发展我国制药工业是非常必要的。我国的国情和新药研发的难度与风险决定了我国的制药工业在今后相当长的一段时间内要采取合法仿制国外药与自主研发新药相结合的战略措施。本书就是为了顺应我国医药工业发展在这两方面的需要而编写的。首先，了解国外最新批准的新药信息对于我国的新药研发有直接的帮助作用和间接的指导意义。我们可以从中汲取经验和教训，避免走弯路，减少浪费和降低损失。其次，研究已知药物合成路线对于改善现正应用的合成工艺路线、降低生产成本、合理地设计新的药物合成工艺路线将有很大帮助。对于制药企业而言，一个好的药物全合成路线可以大大缩短生产周期、简化生产工艺、降低生产成本、节约能源、减少或消除对环境的化学污染，其经济效益及社会效益都是极为显著的。

书中所选的全合成路线多数是国外制药厂目前正在使用的生产工艺。一个被制药工业最后采用的药物化学全合成路线通常都是从实验室的克级规模开始，经过数次优化后，再进行千克级中试合成。中试成功后，再进行试生产，最后逐步完善到大量生产。整个过程需要有机合成化学家、化学工程师、质量检测和质量控制专家、工厂技术人员和管理人员的密切配合。所以，一个成功的药物合成工艺是众多科学家和工程技术人员共同的智慧结晶。本书所收集和介绍的药品合成路线是全球数以万计的有机化学家及药物化学家的心血与智慧的产物，在一定程度上代表了人类药物合成技术的最高水准。

作为一名多年从事药物合成和新药开发的科技工作者，每当我看到一些别具匠心的药物全合成路线之后常常兴奋不已，对设计和开发这些合成工艺的科学家也满怀深深的敬

意，把这些优秀的合成路线汇编成书是我多年来的心愿。然而，要将这一理想付诸现实却又是何等艰难！编写新药的化学全合成路线需要查阅大量的科技文献和专利说明书，然后再用化学结构绘图软件将其中优秀的全合成路线一一编写出来。很显然，这是一项巨大的工程，靠一人之力，在短时间内完成几乎是不可能的。我在开始构思、选题编写时也非常犹豫。一方面我有全职的工作，正在负责数项重大的新药研究开发项目，工作压力大，工作任务繁重。另一方面，还要照顾家庭。我非常担心做不好这项工作，因此寻找合作伙伴共同编写此书成了我的想法之一。2007 年初，我把这一想法同几位正在美国从事药物研发或研究领域与生物制药相关的专家朋友谈了谈，没想到他们非常支持我的想法，并欣然同意利用业余时间参与本书的编写工作。他们是张驿、肖紫微、涂斌、薛松、陈冰子、扬兰英、梅雪峰等博士。没有他们的鼓励和支持，我想我很难有信心和勇气来开展这项费时费力的艰苦工作。虽然后来梅雪峰和扬兰英由于某些原因不得已退出，但他们的帮助和鼓励对本书的问世起了非常积极的作用。大家都知道，在美国，时间就是金钱，而费力费时的编书工作特别是编写专业科技著作根本不可能有什么好的经济回报。但大家的心愿都是一样的，都乐于用自己的专业知识在能力所及的情况下为祖国的医药发展做点事，哪怕是微不足道的一点点。可以这么说，没有张驿、肖紫微、涂斌、薛松、陈冰子等博士每人数百小时的艰苦劳动，就不会有本书的诞生。我们多次讨论编写方案和编写内容，大家共同为编好本书出谋划策。所以，本书是六位留美药物化学家和有机合成化学家辛勤劳动与集体智慧的结晶，也代表了六位大陆学子报效祖国的一点心愿。

此外，我还要借此机会感谢我父母含辛茹苦的养育之恩和兄弟姐妹的深厚感情；感谢我的妻子刘智坤、女儿陈中艺（Linda Chen）及儿子陈中天（Jesse Chen）多年来对我的大力支持与帮助，没有家人的支持和理解，我不可能夜以继日地花上数千小时来编写本书；同时，我还要感谢马金石、马金声、姜贵吉、李成政、Heinz Falk、David A. Lightner、David Dolphin 等老一辈科学家的帮助和教诲，他们的严谨治学之道和对科学真理的不懈追求无时无刻不在影响和激励着我，使我终生受益。最后，我还要感谢周文能、周小知、赵云清、汪秋安、杨定桥等老朋友多年来的友谊和对我的大力帮助。

虽然笔者竭尽全力希望把本书编写得尽善至美，但限于知识水平，加之时间仓促，书中不足与错误之处难免，恳请同行和读者批评指正。

陈清奇 博士

2007 年圣诞节于美国北卡罗来纳州教堂山市

（Chapel Hill, North Carolina, USA）

本书使用说明

本书包含1999～2007年美国食品与药品管理局（FDA）批准上市的新分子实体药，共170个。针对每一个药物，作者在全面而系统的文献检索基础上，从大量的科学论文和专利说明书中精心挑选了最新、最好、最有实用价值的化学合成方法。全书以合成路线图的方式描述药物的合成工艺和流程。这些合成路线大多是目前制药工业中正在使用的，有较高的实用性与可靠性。对参与反应的起始原料、中间体、反应产物都给出了详细的化学结构。每一步化学合成反应都给出了重要的化学试剂、催化剂、所使用的溶剂、合成反应条件及详尽的科技文献出处与专利文献号，文献覆盖范围为1920～2007年。除此之外，针对每一个药物分子，本书给出了其英文名、中文名、化学结构、化学式、相对分子质量、化学元素分析、药物类别、美国化学会CAS登记号、申报厂商、批准日期、适应证、药物基本信息等。其中“药物基本信息”部分简单介绍了该药物的作用机制。

本书包含数千个有机合成反应，数百种药物中间体的合成制造方法，数个非常有用的附录，因此可作为有机合成、药物化学、药物合成、生物制药等专业的科研及教学参考书。

本书由六位在制药领域中有丰富经验的留美化学家精心设计和编写而成，内容简洁，通俗易懂，具有很强的实用性和较高的学术价值。

为了让读者更好地使用本书，现将本书中的有关条目做一详细说明。

1. 药物英文名 本书按药物英文通用名称的字母顺序编排。药物通用名又称为药物的学名或国际非专有名称，是由各国政府规定的、国家药典或药品标准采用的法定药物名。对某一特定的药物分子，通用名是唯一的。通用名的命名不能暗示该药物的疗效，但一定程度上可隐含或暗示药物分子的化学结构。

2. 药物中文名 中文通用名大多系英文通用名的音译，且以四字居多，现在使用的简体中文通用名均收录在由中华人民共和国国家药典委员会编纂的《中国药品通用名称》中，该文件规定中文药物通用名，具有法律性质。本书中的药物中文通用名以《中华人民共和国药典》的现行版和《中国药品通用名称》为准。由于本书的研究对象是新分子实体药，其中有不少药物目前尚没有收入《中华人民共和国药典》和《中国药品通用名称》，对于这些药物的中文名称，则主要从医药专业刊物和医药中文网站所提供的中文名称中挑选。选择的依据是国家药典委员会的《中国药品通用名称命名原则》，详见国家药典委员会的相关网页：http://www.chp.org.cn/news/huayao/070808mc/fj4.htm。极少数药物在《中华人民共和国药典》、《中国药品通用名称》、公开刊物及医药网页中没有收入，则标上“暂无中文名”，并依据国家药典委员会的《中国药品通用名称命名原则》提供试译名供读者参考。

3. 美国化学会 CAS 登记号*： CAS 登记号相当于一个化合物的身份证，是该物质的唯一数字识别号码。美国化学会的化学文摘服务社（Chemical Abstracts Service，CAS）负责为每一种出现在文献中的化学物质分配一个 CAS 登记号，其目的是为了避免化学物质因有多种名称而引起混乱，使数据库的检索更为方便。目前，几乎所有的化学数据库都可以使用 CAS 登记号检索。CAS 登记号以流水账形式登记，没有任何内在含义。目前很多国家也会要求在申报化学物品进出口海关时提供化学物质 CAS 登录号，由此可明显看出其重要性。截至 2007 年 11 月 24 日，CAS 已经登记了 33 191 963 种有机和无机化合物，59 485 059 种生物序列，并且还以每天 4000 多种的速度增加。

一个 CAS 登记号以连字符“-”分为三部分：第一部分有 2～6 位数字，第二部分有 2 位数字，第三部分有 1 位数字作为校验码。校验码的计算方法为 CAS 顺序号（第一、二部分数字）的最后一位乘以 1，最后第二位乘以 2，依此类推，然后再把所有的乘积相加，再把和除以 10，其余数就是第三部分的校验码。举例来说，水（H_2O）的 CAS 登记号前两部分是 7732-18，则其校验码＝（8×1＋1×2＋2×3＋3×4＋7×5＋7×6）mod 10＝105 mod 10＝5（mod 是求余运算符）。不同的同分异构体分子有不同的 CAS 登记号。少数情况下也有同一个 CAS 登记号来表示一类分子。

4. 药物类别 药物分类的方法很多，本书采用中国常用的药物分类方法，详细的信息可参考中国药网：http://www.chinapharm.com.cn/html/database/drugmanual/。

5. 申报厂商 指该药物临床试验完成后，向 FDA 申请上市的申请人。

6. FDA 批准日期 指该药物获得 FDA 批准上市的日期。

7. 化学结构、化学式、相对分子质量、元素分析 药物的化学结构可以从以下几个免费数据库中获得：

（1）美国国家医学图书馆（U.S. National Library of Medicine）的化学身份证高级数据库（CHEMIDPLUS ADVACED），其网址是 http://chem.sis.nlm.nih.gov/chemidplus/。目前该数据库共含有 38 万多种化合物。可使用的检索方法有药品通用名、学名、商品名、美国化学会 CAS 登记号、化学式、药物分类号、定位代码等。

（2）药品说明书网页，www.rxlist.com 和 www.drugs.com 几乎收集了所有药品的说明书。可使用药品的商品名或通用名检索。

（3）药品生产企业的产品介绍网页及随药品包装的产品说明。

（4）生物大分子药物的化学结构信息可从加拿大的药品银行网页中查找。其网页是 http://redpoll.pharmacy.ualberta.ca/drugbank/index.html。该数据库目前收集了 FDA 批准的小分子药物 1000 多个，生物大分子药物 100 多个，正在人体临床试验的药物 3000 多个。

化学式、相对分子质量、元素分析通过使用美国 Cambridgesoft 公司的 ChemOffice Ultra 2006 软件计算得到。

8. 其他名称 一般的药品除了具备通用名外，还拥有商品名。商品名是药品生产厂

---

* 本部分内容摘自维基百科：网页为 http://zh.wikipedia.org/wiki/CAS%E5%8F%B7，以及美国化学会 CAS 的官方网页：http://www.cas.org/expertise/cascontent/registry/regsys.html。

商为树立品牌形象而编制的，具有商标的性质，也是药物合法的名称，但不是药物的唯一名称。当每一药物的专利过期后就会有很多其他制药厂商仿制该药，通常这些制药厂也会给其仿制药品申请一个商品名。另外，本书还给出了药物化学名称，需要说明的是，这些化学名是直接摘自该药的药品说明书，并不一定符合国际纯化学和应用化学联合会（International Union of Pure and Applied Chemistry，IUPAC）的统一化学命名法。

9. 适应证 这部分内容主要摘自药品说明书。

10. 药物简介 本栏目主要摘要介绍了该药物的作用机制，这部分内容主要从该药品的生产厂家产品说明书中摘录。药品说明书除了从FDA的橙色数据库*和生产厂家的官方网页中查阅外，还可以从一些专业网站中查阅。

下面几个网站收集了大量药品中文说明书：

中国药网：www. chinapharm. com. cn。

药典在线：www. newdruginfo. com；www. ydzx. cn。

药源网：www. wanneter. com。

中国癌症信息库：www. bufotanine. com。

中华肿瘤医学网：china. tumor. cn。

中国抗肿瘤药品论坛：www. tumourdrug. com。

广州新稀特大药房：www. newdrug. com. cn。

印度抗肿瘤药房：www. induyaofang. in。

广州抗百济肿瘤药房网页：www. cancerotc. com。

天下医药网：www. ayiyao. com。

以下几个网站收集了大量英文药品说明书：

美国FDA新药数据库入门网页：http://www. accessdata. fda. gov/scripts/cder/drugsatfda/index. cfm或http://www. fda. gov/cder/drug/DrugSafety/DrugIndex. htm。

美国FDA“澄色药品数据库”入门网页：http://www. fda. gov/cder/ob/default. htm。

美国处方药名录：www. rxlist. com。

美国药品网：www. drugs. com。

11. 合成路线 化学合成路线主要是依据多种大型化学和药品数据库的系统检索结果，再参考原始研究论文编写而成的。全书所有的化学结构和有机合成路线图都采用美国Cambridgesoft公司的ChemOffice Ultra 2006，按统一格式绘制而成。

12. 参考文献 参考文献的格式完全按出版社的要求统一编写。关于参考文献中所使用的期刊和专利代号缩写，本书采用国际上通用的缩写方法，为了方便读者查阅，本书还附上了期刊和专利代码缩写表。最后需要说明的是，本书的引用的研究结果一般忠实于原作，直接引用其发表时的数据单位，不再做单位换算改动。

---

* FDA药品橙色数据库的入门网页为http://www. fda. gov/cder/ob/default. htm.

需要全本请访问 www.ertongbook.com

目　录

前言

本书使用说明

Abarelix　阿巴瑞克 …… 1
Acamprosate Calcium　阿坎酸钙 …… 2
Adefovir Dipivoxil　阿德福韦酯 …… 4
Alfuzosin Hydrochloride　盐酸阿夫唑嗪 …… 8
Alitretinoin　阿利维 A 酸 …… 11
Almotriptan Malate　苹果酸阿莫曲坦 …… 15
Alosetron Hydrochloride　阿洛司琼 …… 16
Aminolevulinic Acid Hydrochloride　5-氨基酮戊酸盐酸盐 …… 18
Amprenavir　安瑞那韦 …… 22
Anidulafungin　阿尼芬净 …… 26
Apomorphine Hydrochloride　盐酸阿扑吗啡 …… 28
Aprepitant　阿匹坦 …… 31
Argatroban　阿加曲班 …… 35
Aripiprazole　阿立哌唑 …… 37
Arsenic Trioxide　三氧化二砷 …… 41
Articaine Hydrochloride　盐酸阿替卡因 …… 42
Atazanavir　阿扎那韦 …… 43
Atomoxetine　阿托莫西汀 …… 46
Avobenzone　阿伏苯宗 …… 50
Azacitidine　阿扎胞苷 …… 52
Balsalazide Disodium　巴柳氮 …… 55
Bexarotene　蓓萨罗丁 …… 57
Biskalcitrate　枸橼酸铋钾 …… 60
Bivalirudin　比伐卢定 …… 61
Bortezomib　硼替佐米 …… 62
Bosentan　波生坦 …… 63
Caspofungin Acetate　醋酸卡泊芬净 …… 66
Cefditoren Pivoxil　头孢托仑 …… 72
Cetrorelix Acetate　醋酸西曲瑞克 …… 78

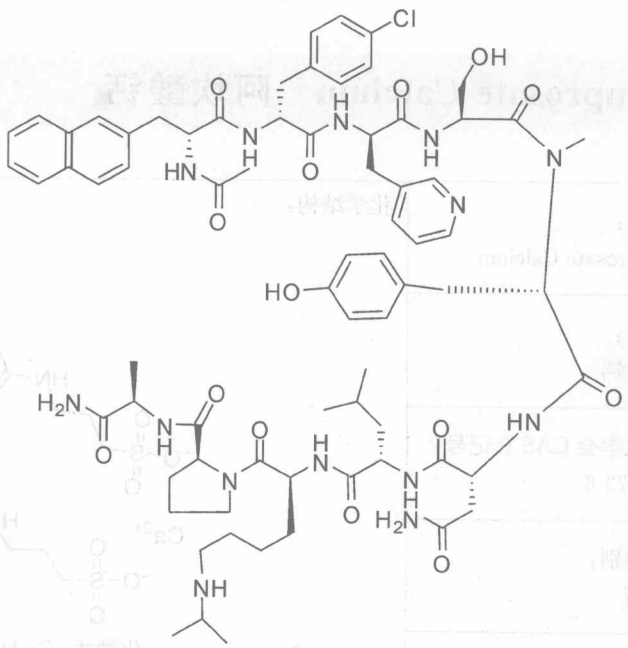
Cevimeline Hydrochloride 盐酸西维美林 …… 79
Ciclesonide 环索奈德 …… 81
Cilostazol 西洛他唑 …… 84
Cinacalcet Hydrochloride 盐酸西那卡塞 …… 86
Clofarabine 克罗拉滨 …… 88
Colesevelam Hydrochloride 盐酸考来维仑 …… 90
Conivaptan Hydrochloride 盐酸考尼伐坦 …… 91
Dalfopristin 达福普丁 …… 94
Daptomycin 达托霉素 …… 95
Darifenacin Hydrobromide 氢溴酸达非那新 …… 96
Darunavir 地瑞纳韦 …… 98
Dasatinib 达沙替尼 …… 102
Decitabine 地西他滨 …… 105
Deferasirox 去铁斯若 …… 106
Desloratadine 地氯雷他定 …… 107
Dexmedetomidine Hydrochloride 盐酸右美托咪定 …… 109
Docosanol 正二十二醇 …… 111
Dofetilide 多非利特 …… 112
Doxercalciferol 度骨化醇 …… 115
Duloxetine Hydrochloride 盐酸度洛西汀 …… 118
Dutasteride 度他雄胺 …… 122
Ecamsule 依荧舒 …… 124
Eletriptan Hydrobromide 氢溴酸依来曲普坦 …… 125
Emtricitabine 恩曲他滨 …… 127
Entacapone 恩他卡朋 …… 131
Entecavir 恩替卡韦 …… 133
Epinastine Hydrochloride 盐酸依匹斯汀 …… 136
Epirubicin Hydrochloride 盐酸表阿霉素 …… 138
Eplerenone 依普利酮 …… 141
Erlotinib Hydrochloride 盐酸埃罗替尼 …… 147
Ertapenem Sodium 厄他培南钠 …… 150
Eszopiclone 艾司佐匹克隆 …… 152
Ethinyl estradiol 炔雌醇 …… 154
Etonogestrel 依托孕烯 …… 156
Exemestane 依西美坦 …… 158
Ezetimibe 依泽替米贝 …… 159
Fondaparinux Sodium 磺达肝素钠 …… 163
Formoterol Fumarate 富马酸福莫特罗 …… 167

Frovatriptan Succinate 氟伐曲坦 …… 171
Fulvestrant 氟维司群 …… 174
Gadobenate Dimeglumine 钆贝葡胺 …… 178
Gadoversetamide 钆弗塞胺 …… 179
Galantamine Hydrobromide 加兰他敏 …… 180
Ganirelix Acetate 醋酸加尼瑞克 …… 189
Gatifloxacin 加替沙星 …… 192
Gefitinib 吉非替尼 …… 195
Gemifloxacin Mesylate 甲磺酸吉米沙星 …… 200
L-Glutamine 左旋谷氨酰胺 …… 202
Ibandronate Sodium 伊拜磷酸钠 …… 204
Iloprost 伊洛前列素 …… 206
Imatinib Mesylate 甲磺酸伊马替尼 …… 209
Ketotifen Fumarate 富马酸酮替芬 …… 211
Lenalidomide 来那度胺 …… 214
Levetiracetam 左乙拉西坦 …… 216
Linezolid 利奈唑胺 …… 219
Lopinavir 洛匹那韦 …… 224
Lubiprostone 鲁比前列酮 …… 227
Meloxicam 美洛昔康 …… 231
Memantine Hydrochloride 盐酸美金刚 …… 234
Mequinol 对甲氧基苯酚 …… 237
Metronidazole 甲硝唑 …… 238
Micafungin Sodium 米卡芬净钠 …… 239
Mifepristone 米非司酮 …… 241
Miglustat 美格鲁特 …… 245
Moxifloxacin Hydrochloride 盐酸莫西沙星 …… 247
Nateglinide 那格列奈 …… 249
Nelarabine 奈拉滨 …… 251
Nepafenac 奈帕芬胺 …… 254
Nitazoxanide 硝唑尼特 …… 255
Nitisinone 尼替西农 …… 256
Norelgestromin 诺孕曲明 …… 258
Octocrylene 奥克立宁 …… 260
Olmesartan 奥美沙坦酯 …… 261
Orlistat 奥利司他 …… 265
Osletamirvir Phosphate 磷酸奥司他韦 …… 277
Oxaliplatin 奥沙利铂 …… 286

Oxcarbazepine 奥卡西平 …… 288
Paliperidone 帕潘立酮 …… 294
Palonosetron Hydrochloride 盐酸帕洛诺司琼 …… 296
Pantoprazole 泮托拉唑 …… 297
Pemetrexed Disodium 培美曲塞二钠 …… 301
Pemirolast Potassium 普利敏钾 …… 306
Pentetate Calcium Trisodium 喷替酸钙钠 …… 308
Pentetate Zinc Trisodium 喷替酸锌钠 …… 309
Perflexane （暂无中文名） …… 310
Perflutren （暂无中文名） …… 312
Pimecrolimus 吡美莫司 …… 314
Pioglitazone Hydrochloride 盐酸吡格列酮 …… 316
Posaconazole 泊沙康唑 …… 319
Pregabalin 普瑞巴林 …… 321
Prussian Blue 普鲁士蓝 …… 324
Quinupristin 奎奴普丁 …… 325
Rabeprazole Sodium 雷贝拉唑钠 …… 326
Ramelteon 拉米替隆 …… 330
Ranolazine 雷诺嗪 …… 332
Rapacuronium Bromide 瑞库溴胺 …… 335
Rasagiline Mesylate 甲磺酸雷沙吉兰 …… 336
Rifaximin 利福昔明 …… 337
Ritonavir 利托那韦 …… 338
Rivastigmin Tartarate 酒石酸利伐斯的明 …… 342
Rofecoxib 罗非昔布 …… 346
Rosiglitazone Maleate 马来酸罗格列酮 …… 351
Rosuvastatin Calcium 罗苏伐他汀钙 …… 354
Sertaconazole Nitrate 硝酸舍他康唑 …… 362
Sirolimus 西罗莫司 …… 364
Sitagliptin Phosphate 磷酸西他列汀 …… 366
Sodium Ferric Gluconate Complex in Sucrose Injection 葡萄糖酸铁钠复合盐的蔗糖溶液 …… 370
Sodium Oxybate 羟丁酸钠 …… 372
Solifenacin Succinate 琥珀酸素立芬新 …… 374
Sorafenib Tosylate 甲苯磺酸索拉非尼 …… 376
Sunitinib Malate 苹果酸舒尼替尼 …… 378
Tadalafil 他达拉非 …… 380
Technetium Tc-99m Depreotide （暂无中文名） …… 383
Tegaserod Maleate 马来酸替加色罗 …… 386

Telbivudine　替比夫定 …… 388
Telithromycin　泰利霉素 …… 392
Temozolomide　替莫唑胺 …… 395
Tenofovir Disoproxil Fumarate　富马酸泰诺福韦酯 …… 398
Tetracycline Hydrochloride　盐酸四环素 …… 401
Tigecycline　替加环素 …… 404
Tinidazole　替硝唑 …… 407
Tiotropium Bromide　噻托溴铵 …… 408
Tipranavir　替拉那韦 …… 411
Travoprost　曲伏前列素 …… 416
Treprostinil Sodium　曲前列尼尔钠 …… 419
Tretinoin　维 A 酸 …… 424
Triptorelin Pamoate　双羟萘酸曲普瑞林 …… 428
Trospium Chloride　曲司氯铵 …… 429
Trypan Blue　台盼蓝 …… 430
Unoprostone Isopropyl（暂无中文名） …… 431
Valdecoxib　伐地昔布 …… 433
Vardenafil Hydrochloride　盐酸伐地那非 …… 435
Varenicline（暂无中文名） …… 441
Verteporfin　维替泊芬 …… 443
Voriconazole　伏立康唑 …… 445
Vorinostat　（暂无中文名） …… 448
Zaleplon　扎来普隆 …… 451
Zanamivir　扎那米韦 …… 455
Ziconotide　齐考诺肽 …… 456
Ziprasidone Hydrochloride　盐酸齐拉西酮 …… 457
Zoledronic Acid　唑来膦酸 …… 460
Zonisamide　唑尼沙胺 …… 462
附录 1　常用缩写表 …… 465
附录 2　2007 年 FDA 批准的新分子实体药 …… 505
附录 3　中文索引 …… 514

Abarelix 阿巴瑞克

英文名： Abarelix	化学结构： 
中文名： 阿巴瑞克	
美国化学会 CAS 登记号： 183552-38-7	
药物类别： 抗肿瘤药	
申报厂商： Praecis	
FDA 批准日期： 2003-11-25	

化学式：$C_{72}H_{95}ClN_{14}O_{14}$
相对分子质量：1416.06
元素分析：C, 61.07; H, 6.76; Cl, 2.50; N, 13.85; O, 15.82

其他名称：

Plenaxis®，化学名：*N*-乙酰-3-(2-萘基)-*D*-丙氨酰-4-氯-*D*-苯丙酰基-3-(3-吡啶基)-*D*-丙氨酰-*L*-丝氨酰-*N*-甲基-*L*-酪氨酰-*D*-天冬酰-*L*-亮氨酰-*N*-6-(1-甲基乙基)-*L*-赖氨酰-*L*-脯氨酰-1-*D*-丙氨酰胺。

适应证：

阿巴瑞克可用于治疗下述晚期前列腺癌男性患者：①不适宜用醋酸黄体激素释放激素（LHRH）激动剂治疗。②拒绝手术切除。③有下述一种和多种原因——由于癌转移的神经因素；尿路或膀胱出口堵塞，局部受损或癌转移性疾病；骨骼癌转移持续使用麻醉类镇痛药的骨严重疼痛。

药物简介：

阿巴瑞克是一种抗癌药，也是一种促性腺素释放激素（GnRH）拮抗剂，其作用机制为通过竞争性方式阻碍 GnRH 受体，抑制促性腺激素和相关的雄性激素生成而发挥作用。

需要全本请访问 www.ertongbook.com