

<<药物化学>>

图书基本信息

书名：<<药物化学>>

13位ISBN编号：9787040340471

10位ISBN编号：704034047X

出版时间：2012-8

出版时间：高等教育出版社

作者：徐文方 编

页数：419

版权说明：本站所提供下载的PDF图书仅提供预览和简介，请支持正版图书。

更多资源请访问：<http://www.tushu007.com>

## &lt;&lt;药物化学&gt;&gt;

## 内容概要

《高等学校制药工程专业系列教材：药物化学（第2版）》是普通高等教育“十一五”国家级规划教材，也是教育部制药工程专业教学指导分委员会组织编写的高等学校制药工程专业系列教材之一，是在第一版的基础上，经过五年教学实践，根据制药工程专业本科生培养目标的要求修订而成的。本书着重阐述临床常用各类药物的化学结构类型、构效关系、典型药物的化学命名和合成方法，以及与药物稳定性和药效有关的化学性质，注重新上市药物介绍，扩展学生视野，强化学生对药物化学前沿领域的了解。

本书可供制药工程专业、药物制剂专业和药学专业本科生作为专业基础课教材使用，也可供相关专业科研人员参考。

## &lt;&lt;药物化学&gt;&gt;

## 书籍目录

绪论 0.1 药物化学的基本定义、任务及与其他学科的关系 0.1.1 药物化学的基本定义 0.1.2 药物化学的主要研究任务 0.1.3 药物化学与其他学科的关系 0.2 药物化学的历史与现状 0.2.1 药物化学的历史回顾 0.2.2 我国药物化学的发展成就 0.3 学习药物化学的基本要求 0.3.1 掌握药物制剂的化学原理 0.3.2 为药物分析奠定化学理论基础 0.3.3 掌握药物化学结构修饰的基本原理和方法 第1章 麻醉药 1.1 局部麻醉药 1.1.1 局部麻醉药的发展 1.1.2 局部麻醉药的结构类型 1.1.3 局部麻醉药的作用机理及构效关系 1.1.4 典型药物介绍 1.2 全身麻醉药 1.2.1 吸人性麻醉药 1.2.2 静脉麻醉药 1.2.3 典型药物介绍 小结与学习要求 思考题 第2章 镇静催眠药、抗癫痫药及抗精神失常药 2.1 镇静催眠药 2.1.1 苯二氮革类 2.1.2 新型非苯二氮革类 2.1.3 其他类型药物 2.2 抗癫痫药 2.2.1 巴比妥类 2.2.2 乙内酰脲类和丁二酰亚胺类 2.2.3 三环类抗癫痫药 2.2.4 脂肪酸类 2.2.5 GABA类似物 2.2.6 其他抗癫痫药物 2.3 抗精神病药 2.3.1 吩噻嗪类 2.3.2 噻吨类 (thioxanthenes) 2.3.3 二苯并杂革类 (dibenzodiazepines) 2.3.4 丁酰苯类 2.3.5 苯甲酰胺类 2.3.6 非经典抗精神病药 2.4 抗抑郁药 2.4.1 神经递质再摄取抑制剂 2.4.2 其他抗抑郁药 小结与学习要求 思考题 第3章 解热镇痛药和非甾体抗炎药 3.1 水杨酸类 3.2 酰化苯胺类 3.3 吡唑酮类 3.3.1 5—吡唑啉酮类 3.3.2 3, 5—吡唑烷二酮类 3.3.3 典型药物介绍 3.4 芳基烷酸类 3.4.1 芳基乙酸类 3.4.2 芳基丙酸类 3.4.3 典型药物介绍 3.5 1, 2—苯并噻嗪类 3.6 其他类 小结与学习要求 思考题 第4章 镇痛药和镇咳祛痰药 4.1 镇痛药 4.1.1 吗啡及其衍生物 4.1.2 合成镇痛药 4.1.3 镇痛药物的构效关系与药效团 4.1.4 阿片受体和阿片样物质 4.2 镇咳祛痰药 4.2.1 镇咳药 4.2.2 祛痰药 小结与学习要求 思考题 第5章 中枢兴奋药及利尿药 5.1 中枢兴奋药 5.1.1 生物碱类 5.1.2 酰胺类 5.1.3 苯乙胺类 5.1.4 其他类 5.1.5 典型药物介绍 5.2 利尿药 5.2.1 磺酰胺类利尿药的发现与发展 5.2.2 磺酰胺类利尿药的构效关系 5.2.3 噻嗪类 (Na<sup>+</sup>—Cl<sup>-</sup>转运抑制剂) 5.2.4 其他类 5.2.5 典型药物介绍 小结与学习要求 思考题 第6章 解痉药及肌肉松弛药物 6.1 解痉药 6.1.1 茄科生物碱类 6.1.2 合成解痉药 6.1.3 典型药物介绍 6.2 肌肉松弛药 6.2.1 非去极化型肌肉松弛药 6.2.2 去极化型肌肉松弛药 6.2.3 典型药物介绍 小结与学习要求 思考题 第7章 肾上腺素能药物 7.1 儿茶酚胺及其类似物 7.1.1 儿茶酚胺类的生物合成和代谢 7.1.2 儿茶酚胺类的化学性质及合成通法 7.2 拟肾上腺素药 7.2.1 受体激动剂 7.2.2 受体激动剂 7.2.3 受体激动剂 7.2.4 肾上腺素受体激动剂的构效关系 7.3 肾上腺素受体阻断剂 7.3.1 竞争性受体拮抗剂 7.3.2 非竞争性受体拮抗剂 7.3.3 典型药物介绍 小结与学习要求 思考题 第8章 心血管系统药物 8.1 强心药 8.1.1 强心苷类 8.1.2 儿茶酚胺类 8.1.3 其他类 8.1.4 典型药物介绍 8.2 作用于离子通道药物 8.2.1 钙通道阻滞剂 8.2.2 钠通道阻滞剂 8.2.3 钾通道阻滞剂 8.2.4 钾通道开放剂 8.3 作用于肾上腺素能神经系统的药物 8.3.1 Mg<sup>2+</sup>—ATP酶抑制剂 8.3.2 作用于肾上腺素能受体的药物 8.3.3 受体阻滞剂 8.4 影响肾素—血管紧张素—醛固酮系统的药物 8.4.1 肾素—血管紧张素—醛固酮系统 8.4.2 血管紧张素转化酶抑制剂 8.4.3 血管紧张素受体 (AT) 拮抗剂 8.4.4 肾素抑制剂 8.5 一氧化氮供体药物 8.5.1 硝酸酯类 8.5.2 非硝酸酯类 8.6 调节血脂药 8.6.1 他汀类 8.6.2 苯氧乙酸类 8.6.3 烟酸类 小结与学习要求 ..... 第9章 抗过敏药及抗溃疡药物 第10章 寄生虫病防治药物 第11章 抗生素 第12章 合成抗菌药物 第13章 抗病毒药物 第14章 抗肿瘤药物 第15章 肾上腺皮质激素及性激素 第16章 维生素 第17章 降血糖药物 第18章 新药设计与开发 附录 中文索引 英文索引

## 章节摘录

版权页：插图：4.1.4 阿片受体和阿片样物质 4.1.4.1 阿片受体的发现 1971年，Avram Goldstein首先提出脑细胞膜上存在特异的阿片结合位点，两年后瑞典和美国的科学家利用放射配体分析法证实了阿片受体（opioid receptor）的存在，而且发现各种镇痛药和阿片受体的亲和力与镇痛效力之间呈现高度相关。

1976年Martin等根据神经生理学观察，提出至少存在三种类型的阿片受体，即 $\mu$ 、 $\kappa$ 、 $\delta$ 。它们均为具有7个跨膜片段的G蛋白偶联受体，在药理上可进一步细分为 $\mu_1$ 、 $\mu_2$ 、 $\mu_3$ 、 $\kappa_1$ 、 $\kappa_2$ 、 $\delta_1$ 、 $\delta_2$ 、 $\delta_3$ 。

七个亚型。

1994年，科学家们又克隆出一种基本特征与阿片受体完全相同的阿片样受体（opioid receptor—like，ORL1），由于当时未发现内源性配基，故又称为孤儿受体（orphan receptor）。

目前研究认为， $\mu$ 受体介导了吗啡大多数的生物效应，其镇痛活性最强，成瘾性也最强； $\delta$ 受体成瘾性小，镇痛作用也不明显； $\kappa$ 受体镇痛活性介于两者之间，但在镇痛的同时有明显的致焦虑作用。

前面提到的吗啡类药物和多数合成镇痛药多属于 $\mu$ 受体激动剂，但随着吗啡结构中17位氮原子上引入不同的取代基，其衍生物对阿片受体激动能力可能下降，甚至转变为拮抗剂，如纳洛酮（4—15）。合成镇痛药中的布托啡诺（4—22）和喷他佐辛（4—24）属于混合激动—拮抗剂。

它们都是受体激动剂，前者是 $\mu$ 受体拮抗剂、后者是 $\mu$ 受体弱拮抗剂。

这种混合的激动—拮抗剂（mixed agonist—antagonists）与完全激动剂不同，对痛觉缺失有最高限度效应。

4.1.4.2 内源性阿片肽 阿片受体的发现提示脑内可能存在相应的内源性阿片样活性物质，不久从哺乳动物脑内发现两种五肽类化合物，称为脑啡肽（enkephalin），即甲硫氨酸脑啡肽（methionine—enkephalin，MEK）和亮氨酸脑啡肽（leucine—enkephalin，LEK）。

它们在脑内的分布与阿片受体近似，并能与阿片受体呈特异性结合而产生吗啡样作用，这种作用可被吗啡拮抗药纳洛酮所拮抗。

迄今已发现近20种作用与阿片生物碱相似的肽类，统称为内源性阿片肽。

多数内源性阿片肽的长度从5到33个氨基酸不等，其序列N端均连接MEK或LEK，这表明上述两种脑啡肽是内源性阿片肽与受体结合的部分。

内源性阿片肽可分为四个家族，除前面提到的脑啡肽家族外，还有内啡肽（endorphins）家族、强啡肽（dynorphin）家族和其他类型的阿片肽。

脑啡肽包括甲硫氨酸脑啡肽和亮氨酸脑啡肽，是脑内含量最高的阿片肽；内啡肽是从垂体中分离得到的几种较大的肽类，其中 $\beta$ -内啡肽（ $\beta$ -endorphin）作用最强，含31个氨基酸，镇痛活性是吗啡的10倍；强啡肽（dynorphin）主要包含强啡肽A（dynorphin—A）和强啡肽B（dynorphin—B），强啡肽A含17个氨基酸，是已知内源性阿片肽中活性最高的，活性是LEK的700倍；其他类型的阿片肽包括在南美蛙皮肤中发现的蛙皮素（dermorphin）、1995年发现的含17个氨基酸的孤啡肽（orphanin FQ，OFQ）和1997年发现的只含4个氨基酸的内吗啡肽（endomorphin）等。

有关的内源性阿片肽氨基酸序列详见表4—3。



版权说明

本站所提供下载的PDF图书仅提供预览和简介，请支持正版图书。

更多资源请访问:<http://www.tushu007.com>