

<<药物化学进展>>

图书基本信息

书名：<<药物化学进展>>

13位ISBN编号：9787122131881

10位ISBN编号：7122131882

出版时间：2012-5

出版时间：化学工业出版社

作者：彭司勋 编

页数：315

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;药物化学进展&gt;&gt;

## 前言

本卷收载14篇综述文章,其中有关依据蛋白-蛋白相互作用界面结构进行药物设计与发现的文章1篇;涉及新靶点的有镇痛药物、雌激素调节药物、TNF相关药物,涉及代谢通路的有作用于角鲨烯代谢通路药物,涉及新技术和工具的有肽核酸研究以及多糖药物研究,抗感染药物4篇,抗肿瘤药物3篇。

“靶向蛋白质-蛋白质相互作用的小分子药物发现进展”介绍了近年来化学小分子与病毒表面融合以及与一些功能蛋白表面作用的研究进展,对发现新型作用机制的药物具有重要的学术参考价值。

“瞬时受体电位香草酸亚型1 (TRPV1) 拮抗剂的研究进展”介绍了瞬时受体电位香草酸亚型1 (TRPV1) 的结构及其生化药理学作用,重点综述了4类TRPV1受体拮抗剂的研究进展,同时也谈及这些拮抗剂存在的问题及今后的对策,对研究此类镇痛药的读者将会有所启发和帮助。

“雌激素相关受体及其小分子调节剂的研究进展”介绍了雌激素相关受体 (estrogen-related receptors, ERR), ERR作为转录因子通过与辅助因子 (coregulator) 相互作用调控目标基因的表达,是构成性活化的受体。

结合广泛的基因功能学和生物化学研究表明, ERR除参与雌激素信号途径外,还调控糖脂代谢、线粒体生物合成和功能等能量代谢通路。

开发ERR的小分子调节剂对于理解和治疗ERR相关的疾病,如糖尿病、骨质疏松症和癌症等将有重要意义。

“角鲨烯代谢通路及其相关化学防御功能”就角鲨烯在不同生物中的不同的代谢方式,以及在其代谢通路中,代谢产物的生物多样性进行较为详尽的综述。

不同结构类型的多种角鲨烯代谢产物的生物活性各异。

该文可以为相关代谢产物的抑制或者药物研发提供有益的参考思路。

“抗真菌先导结构研究进展”介绍了近年来抗真菌先导化合物的发现和优化所取得的最新进展,重点关注具有新颖化学骨架、抗真菌活性强和类药性好的抗真菌先导结构,对其构效关系和作用模式进行了总结。

指出,未来10年间临床应用的抗真菌药物还是以唑类和脂肽类为主,同时克服这两类药物的缺陷。

“艾滋病治疗的新靶点-VIF”重点介绍了APOBEC3G蛋白及其抗病毒作用机制、VIF对APOBEC3G蛋白的拮抗作用方式以及VIF的结构与功能;并以VIF为靶点的抗HIV药物设计方法,对研究人员具有重要的参考价值。

“抗流感病毒药物的研究进展”就流感病毒复制周期,以及针对流感病毒功能结构开展的药物研究开发进行了较为详细的介绍,并就这类药物未来的开发研究方向进行了简述。

本文对抗病毒药物的研发具有积极的参考意义。

“抗乙型肝炎病毒药物研究进展”对慢性乙肝流行病原发病机制、目前临床使用的治疗药物、未来的研究策略以及各类在研的治疗药物等均做了较为系统的介绍,对于研究此类药物的人员具有很好的参考作用。

“多糖药物研究进展”综述了多糖药物发展简史、提取分离、纯化工艺、理化性质、结构分析方法,以及主要药效活性,对糖类药物的研究具有借鉴意义。

“B Raf激酶抑制剂的研究进展”B Raf激酶是肿瘤细胞信号转导通路中的一个成员, B Raf作为一个确认的抗肿瘤靶点,其抑制剂的研究开发成为抗肿瘤药物研究的热点。

本文介绍了肿瘤细胞信号转导通道及其对肿瘤生长、凋亡、转移等的影响,尤其对B Raf激酶抑制剂的类型、机制及临床研究做了详细介绍,为开拓抗肿瘤药物新领域提供了思路。

“Cdc25磷酸酶及其抑制剂研究进展”也是抗肿瘤药物研究,以细胞周期蛋白Cdc25磷酸酶为靶点,介绍其抑制剂作为抗肿瘤药物的研究进展。

Cdc25磷酸酶可参与调控细胞周期的各个阶段,从而影响肿瘤的发生、发展和转移。

本文介绍了3类Cdc25磷酸酶抑制剂,并总结了构效关系及这类药物的研究展望,对研究此类靶向抗肿瘤药物具有指导意义。

“多靶点抗肿瘤酪氨酸激酶抑制剂的研究进展”较详细地介绍了酪氨酸激酶作为受体与非受体的

## &lt;&lt;药物化学进展&gt;&gt;

生理活性及其抑制剂发展概况，酪氨酸激酶具有多靶点抗肿瘤作用，分析了它们的作用靶点与结构特点；对该类已上市与正在临床研究阶段的药物也进行了介绍，为此类药物研究提供了较好的信息。

“肽核酸作为药物和诊断试剂的开发应用前景”介绍了肽核酸（peptidenucleic acid, PNA）及其衍生物的基本性质，以及作为药物和诊断试剂的研究进展。

随着新的化学衍生物和类似物的不断增多，PNA的性能和实用性也将进一步改进，这也将促进性能更好的创新分析诊断技术的开发和应用从而推动PNA药物和诊断试剂的研发。

“肿瘤坏死因子超家族及其相关生物药物的研究进展”综述了肿瘤坏死因子（tumor necrosis factor, TNF）及其受体系统的结构，国内外已上市和正在研发的此类生物药物及其特点。

TNF是一类蛋白家族，目前已发现19名成员，TNF通过与其受体家族相互作用，在机体免疫系统、造血系统、形态发生和发育等过程中发挥重要生理作用。

此文有助于理解肿瘤坏死因子及其受体作为疾病治疗靶标的作用。

本卷主要作者均为在各自研究领域有所成就的专家、教授，对他们百忙中为本卷撰稿表示衷心的感谢。

彭司勋中国药科大学2011年12月

## <<药物化学进展>>

### 内容概要

本书是“药物化学进展”系列图书的第8部，该系列图书邀请国内药物化学和有关学科的专家从各自研究或熟悉的领域撰写文章，多侧重于新药的新理论、新靶点、新成果和新方法的介绍，旨在便于读者了解新药研究的前沿动态，有助于扩展视野，开拓思路。

本书收载14篇综述文章，其中有关依据蛋白-蛋白相互作用界面结构进行药物设计与发现的文章1篇；涉及新靶点的有镇痛药物、雌激素调节药物、TNF相关药物，涉及代谢通路的有作用于角鲨烯代谢通路药物，涉及新技术和工具的有肽核酸研究以及多糖药物研究，抗感染药物4篇，抗肿瘤药物3篇。

本书适合从事新药研发的人员阅读参考，同时也可作为相关专业高年级本科生、研究生的教学参考书。

## &lt;&lt;药物化学进展&gt;&gt;

## 书籍目录

- 1靶向蛋白质 蛋白质相互作用的小分子药物发现进展  
Recent progress in targeting protein protein interactions for small molecule drugs discovery
- 聂爱华<sup>2</sup>瞬时受体电位香草酸亚型1 (TRPV1) 拮抗剂的研究进展  
Development of transient receptor potential vanilloid 1 (TRPV1) antagonists
- 王敬杰黄文龙钱海戴冬艳<sup>3</sup>雌激素相关受体及其小分子调节剂的研究进展  
Progress in the Research of Estrogen Related Receptor and Their Small Molecular Modulator
- 丁克彭丽洁陆小云<sup>4</sup>角鲨烯代谢通路及其代谢产物的生物多样性  
Squalene metabolic pathways and their biological diverse metabolites
- 张强何红平邸迎彤李顺林张于郝小江<sup>5</sup>抗真菌先导结构研究进展  
New Lead Structures in Antifungal Drug Discovery
- 盛春泉张万年<sup>6</sup>艾滋病治疗的新靶点--VIF  
VIF:New target for the treatment of AIDS
- 黄文林张亮仁张礼和<sup>7</sup>抗流感病毒药物的研究进展  
Recent Developments in Anti-influenza Virus Drugs
- 黄坤尤启冬<sup>8</sup>治疗慢性乙型肝炎的药物研究进展  
Progress in the Research of drugs for Chronic Hepatitis B Therapy
- 徐晨<sup>9</sup>多糖药物研究进展  
Research Progress of Polysaccharide Drug Candidates
- 王莹尹鸿萍王旻<sup>10</sup>B Raf激酶抑制剂的研究进展  
刘海春陈亚东陆涛<sup>11</sup>CDC25磷酸酶及其抑制剂研究进展  
Research Advances on CDC25 Phosphatase and CDC25 Phosphatase Inhibitors
- 李子元王宜运徐进宜吴晓明姚和权<sup>12</sup>多靶点抗肿瘤酪氨酸激酶抑制剂的研究进展  
Progress in the Research of Antitumor Multi-target Tyrosine Kinase Inhibitors
- 丛欣黄伟殷晓进廖清江<sup>13</sup>肽核酸作为药物和诊断试剂的开发应用前景  
Prospects of PNA in Drug Discovery and Diagnosis
- 吕小伟刘传法<sup>14</sup>肿瘤坏死因子超家族及其相关生物药物的研究进展  
Progress in the Research of Tumor Necrosis Factor and Its Receptor Families and the Derived Biological Therapeutics
- 华子春冯速邱樊

## 章节摘录

版权页：插图：1.1引言 在生物体中，许多关键的细胞功能包括细胞生长、DNA复制、转录活性、翻译和跨膜信号转导都由多蛋白质复合物调控，而这种蛋白质复合物的功能、活性和特殊性通常由发生于不同复合物亚单元之间的蛋白质—蛋白质相互作用（protein—protein interactions, PPI）所控制。

在人类蛋白质网络中包含了大约375000种蛋白质—蛋白质相互作用。

人们已经证明异常的PPI能引发癌症、感染疾病和神经退行性疾病等人类多种疾病。

因此，在过去的十年内，靶向蛋白质—蛋白质相互作用成为人们发现和开发新型药物的重要策略。

目前，文献中已经报道了大量的能够调控蛋白质—蛋白质相互作用的抑制剂和稳定剂，本文主要介绍蛋白质—蛋白质相互作用小分子抑制剂的研究进展。

1.2 蛋白质—蛋白质相互作用：“热点”氨基酸与“热点区域”蛋白质—蛋白质相互作用发生在两种相同或不同蛋白质相互接触的特定结构域表面，一般认为彼此发生作用的表面积大约有1500~3000，这种相互作用能够调控由于蛋白质的界面接触而形成的蛋白质复合物的生物功能。

蛋白质—蛋白质相互作用的驱动力很大程度来自于残基之间的疏水效应，但氢键和静电相互作用也时常扮演着关键的角色。

参与蛋白质—蛋白质相互作用的氨基酸残基在位于各自的蛋白结构系列中有的是连续的，有的是非连续的，这些连续或非连续的残基相互之间的作用使得蛋白质与蛋白质以高的亲和力结合。

但蛋白质与蛋白质之间的结合能并不是平均分配在所有相互作用的氨基酸残基上，而是在大多数情况下有可能集中在相互接触的某个区域中的几个氨基酸残基，这种氨基酸称为“热点”（hot spot）氨基酸。

关于“热点”氨基酸的一个里程碑性的工作是Clackson和Wells所做的利用丙氨酸扫描和蛋白质晶体X射线衍射分析方法对人生长激素（hGH）与其第一结合受体（hGHbp）胞外结构域结合的研究。

<<药物化学进展>>

编辑推荐

《药物化学进展(8)》适合从事新药研发的人员阅读参考,同时也可作为相关专业高年级本科生、研究生的教学参考书。

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>