

<<基于模仿创新的小分子药物发明>>

图书基本信息

书名：<<基于模仿创新的小分子药物发明>>

13位ISBN编号：9787030339928

10位ISBN编号：7030339924

出版时间：2012-5

出版时间：科学出版社

作者：陈清奇

页数：720

字数：1120000

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>

## <<基于模仿创新的小分子药物发明>>

### 内容概要

从模仿中创新是人类新药发明史上代价最小、风险最低、最流行、而且最成功的方法之一。

《基于模仿创新的小分子药物发明》以药物先导化合物为核心，通过探讨药物先导化合物化学结构的模仿、修饰和改良，进而揭示现代新药研发过程中模仿创新的成功秘诀。

全书共有21章，分别探讨20类不同药物的模仿创新方法，内容基本覆盖了现代医药领域中的主要类别，包括心脑血管药物、镇痛消炎药、镇痛药，抗高血压药，肠胃病药物，糖尿病药物、抗过敏类药物，抗炎药镇痛药、抗风湿药、抗菌药等。

每章内容基本由以下几个部分内容组成：先导化合物的导出、通过模仿先导化合物而获得成功的药物、已上市药物的化学结构分析、候选药物简介。

全书大量采用化学结构图解和表格归类，内容精简，信息量大，有利于读者快速了解和掌握新药研发的模仿创新基本原理和方法。

## <<基于模仿创新的小分子药物发明>>

### 作者简介

陈清奇，男，中国旅美化学家和药学家，现任美国Med Koo生物医药科研公司总裁，同时兼职华南师范大学和湘南学院客座教授、美国数家生物制药公司的技术顾问。

研究领域为药物化学、医学体外诊断技术。

研究方向为靶向抗癌新药研发、药物合成工艺、体外快速诊断新技术。

陈清奇1979年高中毕业于湖南安仁一中，1982年毕业于郴州师专（现名湘南学院），1989年获延边大学硕士学位，1993年获北京大学理学博士学位。

1993~2000年先后在奥地利Johannes-Kepler

University of Linz、美国The University of Nevada Reno、加拿大The

University of British

Columbia从事博士后科研工作。

自2000年起，先后在美国5家国际知名生物制药公司从事抗癌新药研究、药物合成工艺开发、靶向药物传输新技术、医学体外诊断技术等研发工作。

历任高级科学家、课题组长、研究室主任、科技副总裁和总裁等职务。

陈清奇曾于1999年入选中国科学院“百人计划”药物化学专业教授和博导，2009年入选中山大学“百人计划”，任药学院教授和博导，2010年入选江苏省张家港市首批“海归领军人才计划”，2011年获“中国科技创业计划”大赛二等奖。

陈清奇主要业绩包括：在美国成功创办了2家高科技生物医药相关企业；参与研发的新药中，已有3种被美国FDA和全球主要国家批准上市，另外主持研发的新药中，有多种已获准进入临床试验阶段和临床前试验阶段；参与或负责研发的医学体外诊断试剂产品中，已有2个系列十多个产品在美国获准上市；到目前为止编写和出版了总字数超过700万的7部药学著作；已发表了近90篇研究论文和提交了近20项发明专利申请；拥有多项与生物医药相关的高科技成果，可很快产业化，有望创造良好的社会和经济价值。

## <<基于模仿创新的小分子药物发明>>

### 书籍目录

#### 前言

#### 本书使用说明

#### 1 拉唑类质子泵抑制剂

1.1 质子泵抑制剂首创药物：奥美拉唑

1.2 拉唑类Me-Too药物

1.3 拉唑类Me-Too候选药物

#### 2 苯甲酸、苯乙酸、苯丙酸类镇痛抗炎药

2.1 苯甲酸类镇痛抗炎药

2.2 苯乙酸类镇痛抗炎药

2.3 苯丙酸类镇痛抗炎药物

#### 3 东莨菪碱类抗胆碱药物

3.1 首个东莨菪碱Me-Too药物：溴甲基东莨菪碱

3.2 东莨菪碱类Me-Too药物

3.3 东莨菪碱类Me-Too候选药物

#### 4 噻唑烷二酮类降糖药

4.1 噻唑烷二酮类首创药物：曲格列酮

4.2 模仿成功的噻唑烷二酮类Me-Too药物

4.3 噻唑烷二酮类Me-Too候选药物

#### 5 司琼类止吐药物

5.1 司琼类首创药物：昂丹司琼

5.2 模仿成功的司琼类Me-Too药物

5.3 司琼类Me-Too药物

5.4 司琼类Me-Too候选药物

#### 6 磺脲类降血糖药物

6.1 磺脲类首创药物：氨磺丁脲

6.2 磺脲类Me-Too药物

6.3 磺脲类Me-Too候选药物

#### 7 唑嗪类降压药

7.1 唑嗪类首创药物：哌唑嗪

7.2 模仿成功的唑嗪类Me-Too药物

7.3 唑嗪类Me-Too药物

7.4 唑嗪类Me-Too候选药物

#### 8 二氢吡啶类降压药

8.1 二氢吡啶类首创药物：硝苯地平

8.2 二氢吡啶类Me-Too药物

8.3 二氢吡啶类Me-Too候选药物

#### 9 普利类降压药

9.1 普利类首创药物：卡托普利

9.2 普利类Me-Too药物

9.3 普利类Me-Too候选药物

#### 10 沙坦类降压药

10.1 沙坦类创新药物：氯沙坦

10.2 沙坦类Me-Too药物

10.3 沙坦类Me-Too候选药物

#### 11 他汀类调脂药

## <<基于模仿创新的小分子药物发明>>

- 11.1 他汀类首创药物：洛伐他汀
- 11.2 他汀类Me-Too药物
- 11.3 他汀类Me-Too候选药物
- 12 贝特类降脂药
  - 12.1 贝特类首创药物：氯贝特
  - 12.2 贝特类Me-Too药物
  - 12.3 贝特类Me-Too候选药物
- 13 四环素类抗生素
  - 13.1 四环素类首创药物：土霉素
  - 13.2 四环素类Me-Too药物
  - 13.3 四环素类Me-Too候选药物
- 14 内酰胺类抗生素
  - 14.1 青霉素类抗生素
  - 14.2 B-内酰胺酶抑制剂类Me-Too药物
- .....
- 15 喹诺酮类抗菌药
- 16 康唑类抗真菌药
- 17 昔康类抗炎药
- 18 昔布类抗炎药
- 19 二膦酸类抗骨病药
- 20 曲普坦类止痛药
- 21 苯二氮类抗焦虑药
- 22 药物结构修饰中常用的化学试剂

## &lt;&lt;基于模仿创新的小分子药物发明&gt;&gt;

## 章节摘录

版权页：插图：11 他汀类调脂药“他汀类”调脂药是近年全球最为热销的药物类别之一。

他汀类药物具有疗效确切、安全可靠、副作用少等特点。

国内最常见的他汀类药物有5种：洛伐他汀、辛伐他汀、普伐他汀、氟伐他汀和阿托伐他汀。

从来源上分，他汀类药物可分为天然化合物（如洛伐他汀、辛伐他汀、普伐他汀、美伐他汀）和完全人工合成化合物（如氟伐他汀、阿托伐他汀、西立伐他汀、罗伐他汀、匹伐他汀）。

他汀类药物（statins）属于羟甲基戊二酰辅酶A还原酶（3-hydroxy-3-methyl-glutaryl-CoA reductase, HMG-CoA）抑制剂，此类药物通过竞争性方式抑制内源性胆固醇合成限速酶（HMG-CoA）还原酶，阻断细胞内羟甲戊酸代谢途径，使细胞内胆固醇合成减少，促使血清胆固醇清除。

他汀类药物除具有降低体内胆固醇水平和调节血脂作用外，还可改善血管内皮功能，延缓动脉粥样硬化程度、抗炎、保护神经和抗血栓等。

世界上第一个上市的他汀类药物是美国Merck公司1987年研发的洛伐他汀。

20世纪80年代末上市的他汀类药物还有1988年在瑞典上市的辛伐他汀，1989年在日本上市的普伐他汀。

目前全球已陆续开发上市的他汀类药物已有10余种（参见本章11.2）。

11.1 他汀类首创药物：洛伐他汀 洛伐他汀（Lovastatin）是一种天然产物，常见的食物如蚝蘑（oyster mushrooms）和红曲米（red yeast rice）中含有该化合物。

根据维基百科介绍，科学家早在20世纪70年代就发现天然化合物Compactin和洛伐他汀对羟甲戊二酰辅酶A（HMG-CoA）还原酶有强抑制作用。

进一步研究发现这两个化合物都可显著降低人体LDL胆固醇水平。

但临床试验发现洛伐他汀的药理活性更好，于是Merck公司选择洛伐他汀做进一步临床试验，并于1987年被批准上市。

Compactin和洛伐他汀的化学结构非常相似，但洛伐他汀的母核环上多1个甲基。

洛伐他汀可用于治疗高胆固醇血症和混合型高脂血症。

根据洛伐他汀的药品说明书介绍，洛伐他汀在体内可通过竞争性方式抑制胆固醇合成过程中的限速酶羟甲戊二酰辅酶A（HMG-CoA）还原酶的活性，使体内胆固醇的合成受阻，进而发挥降胆固醇作用。洛伐他汀除了可降低血胆固醇外，还可降低低密度脂蛋白胆固醇水平，对动脉粥样硬化和冠心病的防治有显著效果。

此外，洛伐他汀还具有多种其他生物活性，包括降低血清三酰甘油水平和增高血高密度脂蛋白水平。

洛伐他汀口服吸收良好，其蛋白结合率高达95%，达峰时间为2-4小时，半衰期为3小时。

83%从粪便排出，10%从尿排出。

洛伐他汀最常见的不良反应为胃肠道不适、腹泻、胀气，其他还有头痛、皮疹、头晕、视物模糊和味觉障碍。

此外，洛伐他汀偶可引起血转氨酶可逆性升高，因此需监测肝功能。

洛伐他汀的药品为口服片剂，目前上市的有每片20 mg和40 mg两种剂型。

洛伐他汀的专利已经过期，目前在美国已有多家公司申报洛伐他汀仿制药上市。

## <<基于模仿创新的小分子药物发明>>

### 编辑推荐

《基于模仿创新的小分子药物发明》可供从事新药研究和开发的科研人员、企业管理人员阅读，也可供有机化学专业、药学专业、生物制药专业等高等院校的高年级学生、研究生、教师及科研人员使用。

<<基于模仿创新的小分子药物发明>>

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>