

<<高等药物化学>>

图书基本信息

书名：<<高等药物化学>>

13位ISBN编号：9787122104090

10位ISBN编号：7122104095

出版时间：2011-11

出版时间：化学工业出版社

作者：白东鲁,陈凯先

页数：1226

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;高等药物化学&gt;&gt;

## 前言

20世纪50年代,已故蒋明谦教授写过一本《高等药物化学》,这是当时国际上专门讨论药物设计和结构活性关系的早期专著之一。

以后近50年来,国内曾出版过数种供药学院系本科生和硕士生用的药物化学教材,但未有一本全面阐述药物分子设计原理方法,药物的作用机理和各大类药物研发新进展的高级读物和中型参考书。

20世纪80年代后,药物化学的研究对象和内容有了很大的扩充和延伸。

目前药物的化学合成、制造工艺及药物化学分析均已发展成独立的药学分支学科。

而一些管理和经济学科正融入到药物化学中,使药物设计、研发与全球和各国的社会经济发展水平以及医疗保险紧密结合。

另一方面药物作用机理和体内过程的研究也已成为药物化学涉及的重要领域。

本书的内容及时反映了药物化学学科的这一变迁。

本书内容覆盖了药物化学中的各个领域,是一本系统性强,原理和实践并重的药物化学参考书。

在体裁上它有别于已出版的同类书籍。

总论部分对药物研究开发的理论、方法、技术、战略战术以及相关学科对本学科的推动等方面的内容进行了比较全面、系统、深入的介绍。

对新药研发的法规、药物经济学、药物的知识产权保护,糖类、蛋白质、趋化因子类药物和手性药物均有专章介绍。

反映了药物化学最新进展以及与管理科学和经济学的紧密结合。

各论部分重点讲述各类药物近15年的新进展,同时又对临床上重要的药物作总结性的回顾。

各论中以各类药物分子设计,结构与活性的关系和作用原理为重点。

限于篇幅,一些近十年进展不大或应用面不广的药物,例如抗寄生虫病药物、抗甲状腺药物、维生素、造影剂、放射性同位素药物和光敏治疗药物等,则被略去。

各章撰写者都是从事该领域研究的专家,熟悉该领域最新动态。

每章末均有最新、最重要的参考读物和文献,以便读者根据这些文献对相关领域作更深入的调研。

由于本书有数十位作者,各人文笔和各章体裁不尽相同,望读者谅解。

2008年开始,国家对新药研发投入巨资,我国新药研发正面临新的契机。

希望本书的出版对推动我国新药研发,对从事药物化学和新药研发的各类人员的工作有所裨益。

本书是一本集体编著的中型学术参考书,而药物化学学科又进展迅速,其研究领域不断扩大,这使我们在全书内容的安排上难免有疏漏和不尽合理之处,还望读者不吝批评指正。

主编和全体作者对化学工业出版社相关工作人员在本书出版过程中付出的努力,对上海医药集团和国家科学技术学术著作出版基金的资助出版,深表谢意。

白东鲁 陈凯先2011年5月

## <<高等药物化学>>

### 内容概要

本书是一部全面介绍药物化学各种原理、研究方法和技术，反映药物化学学科在20世纪末和21世纪初的发展水平的权威著作。

全书分成总论和各论两大部分。

总论部分就有关药物研究开发的理论、方法、技术、战略战术以及相关学科对本学科的推动等方面的内容进行了比较全面、系统、深入的介绍；对新药研发的法规，药物经济学，药物的知识产权保护，糖类、蛋白质、趋化因子类药物和手性药物均有专章介绍。

《高等药物化学》反映了药物化学与管理科学和经济学的紧密结合。

各论部分以各类药物分子设计、结构与活性的关系和作用原理为重点，阐述了各类药物近15年的新进展，同时对临床上重要的药物作了总结性的回顾。

每章末均附有最新、最重要的参考读物和文献，以便读者根据这些文献对相关领域作更深入的调研。

本书可供从事药物化学教学、科研和生产以及临床药学、药剂学、药理学、药物分析等专业的科技人员，以及高等院校化学和药学专业高年级本科生、研究生学习参考。

## &lt;&lt;高等药物化学&gt;&gt;

## 书籍目录

## 第1部分 总论

## 第1章 绪论

## 第2章 药物的化学结构、理化性质与生物活性

## 第3章 药物代谢与新药研发

## 第4章 药物作用靶标、化合物的活性筛选

## 第5章 组合化学和高通量合成

## 第6章 分子模拟与药物设计

## 第7章 化学信息学与药物发现

## 第8章 先导物的发现途径和优化策略

## 第9章 天然产物与新药的研究开发

## 第10章 药物合成的化学与工艺研究

## 第11章 手性药物

## 第12章 生物技术与新药研究

## 第13章 糖类药物的化学与生物学

## 第14章 肽、蛋白质药物的化学与生物学

## 第15章 趋化因子受体调节剂

## 第16章 药物的专利保护

## 第17章 新药研发与法规管理

## 第18章 新药上市前后的药物

## 经济学研究

## 第2部分 各论

## 第19章 麻醉药物

## 第20章 镇静催眠和抗癫痫药物

## 第21章 镇痛药物

## 第22章 非甾体抗炎药物

## 第23章 中枢兴奋药物

## 第24章 抗精神失常药物

## 第25章 抗帕金森病和阿尔茨海默病药物

## 第26章 抗糖尿病药物

## 第27章 抗骨质疏松药物

## 第28章 抗过敏和抗溃疡药物

## 第29章 作用于胆碱能系统药物

## 第30章 作用于肾上腺素能系统药物

## 第31章 作用于5-羟色胺、多巴胺和GABA系统药物

## 第32章 抗生素

## 第33章 抗菌和抗真菌的合成药物

## 第34章 抗肿瘤药物

## 第35章 抗艾滋病药物

## 第36章 抗病毒药物

## 第37章 抗高血压药物和利尿药物

## 第38章 止血药物和抗血栓药物

## 第39章 心脏疾病和血脂调节药物

## 第40章 呼吸系统药物

## 第41章 皮质激素类药物

## 第42章 免疫抑制剂与器官移植药物

<<高等药物化学>>

第43章 减肥有关药物

第44章 性激素和生育调节药物

中文索引

英文索引

## 章节摘录

版权页：插图：有时一个先导化合物活性低的原因可能是因为在溶剂中优势构象的比例较少所致。构象的能量高低决定了其在所有构象中所占的比例。

如果构象能量较高，可能导致其在所有构象中所占比例较低。

因此，如果一个化合物的生物活性构象是一种能量较高的构象，由于其在众多构象中的比例低而表现出与受体亲和力差。

药物在药物受体复合物中的活性构象可以根据柔性分子合成相应的具有一定构象的刚性类似物的方法进行确定。

潜在的药效团通过环状或不饱和的结构片段以特定的构象嵌入到药物分子中，通过测试这些刚性构象类似物的活性，选择活性最好的作为进一步优化的原型化合物。

刚性构象类似物还可以测定药物分子的药效构象，这是因为一些药效团中关键的功能基团在刚性构象类似物中具有特定的空间取向。

这种方法的主要缺点是为了合成柔性化合物的刚性类似物常常需要在原来的结构中引入额外的原子或化学键的作用，而这些原子和化学键的引入很可能会影响化合物的物理化学性质。

因此，刚性构象类似物和药物分子在大小、形状和质量上都应尽可能一致。

2.6 讨论药物对机体的作用，表现为药效与毒性，本质上是药物（小）分子与生物大分子在三维空间中的物理和化学过程的结果，是药物的特异性表现。是药物分子的个性行为，其根本是药物的化学结构所决定的。

因此，无论是在药物分子设计或优化时，除了要注意发现具有特定药理活性的新型结构外，同时需要兼顾药物的物理化学性质和药代动力学性质，过分地强调药效强度和选择性，追求高活性，而忽略物化和药代性质，会导致药物的效力低下，达不到治疗效果，这往往也是体外有活性而体内无效的原因。

药物的物理化学性质不仅决定了药代动力学的某些性质，而且还影响制剂的质量。

良好的物化性质，会使剂型设计更加自如，获得高质量的剂型。

不良的物化性质可使药物先天不足，因为通过制成适宜的制剂只在一定程度上改善溶出性、吸收性和在体内的分布与存留时间，不能从根本上解决问题。

另一方面，理想和理想的类药化合物结构和性质的知识对苗头化合物的富集、先导物的识别和优化是有价值的。

也就是说在大多数成功化合物的理化性质的范围内寻找具有相同结构特征或相似特征的化合物将会大大提高从苗头化合物到先导物再到最佳候选药物的成功率。

例如：有人分析了1983年以前，1983~1992年以及1993~2002年三个不同时间段上市口服药物理化性质的平均值（表2-10），发现口服药物的性质均值没有实质性的变化，认为这些保持不变的性质是口服类药分子中最重要的理化性质。

<<高等药物化学>>

编辑推荐

《高等药物化学》是国家科学技术学术著作出版基金资助出版。

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>