

<<化学合成原料药开发>>

图书基本信息

书名：<<化学合成原料药开发>>

13位ISBN编号：9787122116376

10位ISBN编号：7122116379

出版时间：2011-8

出版单位：化学工业

作者：张文雯

页数：143

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>

## <<化学合成原料药开发>>

### 内容概要

本书以化学合成原料药开发的工作内容为主线，教材前6章按照化学合成原料药开发工作简述、化学合成原料药的开发生策略、原料药开发的可行性论证、原料药合成路线及试验方案确定、化学原料药合成反应、化学原料药合成技术几方面内容进行编写，集中阐述了化学原料药开发项目实施过程中所需的法规原则、方法过程及理论知识。

教材的最后一章按照原料药开发的不同策略设置了不同层次的项目实例，按工作过程设置项目任务，结合职业情境给出了项目实施的具体流程，为项目化教学提供参考。

本书为项目化课程实施教材，可供高职高专制药技术类专业使用，也可供相关专业的成人教育、中职教学、职业培训以及从事化学原料药及中间体开发的技术人员参考。

## <<化学合成原料药开发>>

### 书籍目录

#### 第一章 化学合成原料药开发工作简述

##### 第一节 原料药开发工作的基本流程

- 一、调研目标化合物
- 二、可行性论证
- 三、确定合成路线
- 四、确定小试方案
- 五、明确合成路线
- 六、原料药及中间体结构确证
- 七、合成路线优化

##### 第二节 原料药开发实验室要求

- 一、实验室建设中的设施和环境要求
- 二、仪器设备要求
- 三、试剂要求
- 四、实验室EHS管理要求

##### 课后总结与思考

#### 第二章 化学合成原料药的开发策略

##### 第一节 化学合成原料药的仿制开发

- 一、国内化学原料药的生产特点
- 二、仿制药的地位
- 三、仿制药研究的基本原则
- 四、仿制药研究应注意的问题

##### 第二节 化学合成原料药的工艺改进开发

- 一、工艺改进的原因
- 二、工艺改进的内容
- 三、工艺改进的原则
- 四、工艺改进的主要途径

##### 第三节 化学合成原料药的创新开发

- 一、化学合成原料药创新开发的意义
- 二、原料药创新开发需注意的问题

##### 课后总结与思考

#### 第三章 原料药开发的可行性论证

##### 第一节 市场调研

- 一、市场供给状况
- 二、市场需求状况
- 三、市场前景

##### 第二节 查阅法规资料

- 一、药品注册管理法
- 二、中国药典

##### 第三节 查阅文献资料

- 一、专利
- 二、期刊
- 三、美国化学文摘
- 四、工具书

##### 第四节 撰写原料药开发可行性研究报告

- 一、报告内容及撰写注意事项

## <<化学合成原料药开发>>

### 二、报告提纲

#### 课后总结与思考

### 第四章 原料药合成路线及试验方案确定

#### 第一节 合成路线的选择原则

##### 一、可行性原则

##### 二、经济性原则

##### 三、安全环保性原则

#### 第二节 试验方案的确定

##### 一、反应原料配比

##### 二、反应溶剂

##### 三、反应条件

##### 四、反应仪器及装置

#### 第三节 工艺路线的优化

##### 一、单因素试验优化法

##### 二、正交试验优化法

#### 第四节 工艺路线的评价

#### 课后总结与思考

### 第五章 化学原料药合成反应

#### 第一节 卤化反应

##### 一、卤取代反应

##### 二、卤加成反应

##### 三、卤置换反应

#### 第二节 烃化反应

##### 一、O?烃化反应

##### 二、N?烃化反应

##### 三、C?烃化反应

#### 第三节 酰化反应

##### 一、C?酰化反应

##### 二、N?酰化反应

##### 三、O?酰化反应

#### 第四节 缩合反应

##### 一、活泼亚甲基化合物的缩合反应

##### 二、醛醇缩合反应

##### 三、醛酮间的缩合反应

##### 四、羧酸及其衍生物的缩合

#### 第五节 磺化反应

##### 一、磺化剂

##### 二、影响磺化反应的因素

#### 第六节 硝化反应

##### 一、硝化剂

##### 二、影响硝化反应的因素

##### 三、硝化反应副产物

#### 第七节 氧化反应

##### 一、过氧化氢

##### 二、锰化合物

##### 三、铬化合物

##### 四、硝酸

## <<化学合成原料药开发>>

### 五、含卤氧化剂

#### 第八节 还原反应

##### 一、催化氢化还原

##### 二、化学还原

#### 第九节 外消旋体的拆分

##### 一、机械拆分法

##### 二、选择性吸附法

##### 三、化学拆分法

#### 课后总结与思考

### 第六章 化学原料药合成技术

#### 第一节 原料药合成实验技术概述

##### 一、合成技术

##### 二、分离纯化技术

#### 第二节 原料药合成中的薄层色谱技术

##### 一、薄层色谱技术的应用

##### 二、薄层色谱的制作

##### 三、薄层色谱法操作步骤

#### 第三节 原料药合成中的柱色谱技术

##### 一、吸附剂的选择

##### 二、洗脱剂的选择

##### 三、柱色谱的操作步骤

#### 课后总结与思考

### 第七章 项目实例

#### 【学习情境一】化学合成原料药仿制开发

##### 【入门项目】抗胆碱药溴化丁基东莨菪碱原料正溴丁烷的制备

##### 任务一 撰写调研报告

##### 任务二 选择仿制路线

##### 任务三 确定小试方案

##### 任务四 明确合成路线

##### 任务五 优化小试方案

##### 任务六 确定最终工艺

#### 【学习情境二】化学合成原料药仿制开发

##### 【主导项目】抗菌药左旋氧氟沙星原料(S)-(+)-2-氨基丙醇的制备

##### 任务一 撰写调研报告

##### 任务二 选择合成路线

##### 任务三 确定小试方案

##### 任务四 明确合成路线

##### 任务五 优化小试方案

##### 任务六 确定最终工艺

#### 【学习情境三】化学合成原料药工艺改进开发

##### 【主导项目】解热镇痛类药阿司匹林的合成工艺改进

##### 任务一 撰写立项书

##### 任务二 确定旧工艺的改进方案

##### 任务三 拟定小试优化方案

##### 任务四 摸索小试优化条件

##### 任务五 实施小试最优方案

##### 任务六 评价优化新工艺

## <<化学合成原料药开发>>

【学习情境四】化学合成原料药创新开发

【自主项目】局部麻醉药原料苯佐卡因的制备

一、模拟的职业领域描述

二、苯佐卡因的技术信息

三、任务设置

四、工作建议

五、工作中的帮助

六、组织说明

附录

附录1 常用正交表

附录2 常见液体有机物与水形成的二元共沸体系

附录3 常用有机溶剂的介电常数及物理性质

参考文献

## &lt;&lt;化学合成原料药开发&gt;&gt;

## 章节摘录

版权页：插图：我国多数仿制药生产企业的实力较好，其基础设施、劳动力成本均具有相对优势。人力资源方面，中国目前有几十万科研人员从事化学制药科技的工作，上马仿制药生产可以减少很多前期准备工作，大大缩短产品开发时间。

中国药品生产企业现阶段的特点也决定了必须走以仿制为主要发展方向的道路。

目前我国药品生产企业普遍存在资金投入量小、科研实力不强的特点。

发达国家的强大药企每项原料药的独立开发费用约为0.3亿~1.6亿美元，而国内企业的实力与他们比较还有较大的差距，因此，就现阶段而言，仿制是我国制药业的主流。

但创新才是我国制药业生产兴旺发达的不竭动力，做好、做足仿制药市场，不断强化研发力量，为药品创新奠定基础。

二、仿制药的地位药品受专利保护，不能随意仿制生产，但药品的专利权是有时间性的，在法定保护期内，专利权人享有独占权，一旦保护期满，任何人都可以无偿利用其发明创造。

有相当数量即将到期的重要商标名药品疗效好、副作用小，仍具有很强的生命力，因而成为一项巨大的公共社会财富。

意大利仿制化工医药协会（CPA）公布的数据显示，全球化学原料药市场规模在2008年已经超过900亿美元，其中2008年全球仿制药销售额达到780亿美元，比上一年增长4%。

仿制药之所以为全球追捧，是因为创新药不仅开发成本高，市场化周期长，而且研发成功率仅为万分之一。

面对这样的高门槛，能跨入者凤毛麟角。

而包括仿制药在内的非专利药能够满足如今大多数疾病的需要，价格却仅为创新药的10%左右。

另外，世界范围内均面临着降低卫生费用的压力，这也使得仿制药备受青睐。

目前世界各国都在持续降低医药费用，如法国药品被强制降价40%，美国在许多治疗领域降低了药品价格，我国许多药品也已经被列入了最高限价目录。

所有这些都使得全球制药工业在寻找新的更具成本优势的仿制药市场。

统计数据显示，2008年全球有年销售额约200亿美元的药品专利过期，而2011~2015年间又有销售额达770亿美元的药品专利过期。

随着这些重磅级专利产品在上世界上独占期的结束，仿制药市场可望以14%左右的速度增长。

而大批专利药的到期，也意味着仿制药领域竞争的加剧。

## <<化学合成原料药开发>>

### 编辑推荐

《化学合成原料药开发》为高职高专“十二五”规划教材之一。

<<化学合成原料药开发>>

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>