

《药物化学》

贾 娴

第一章 药物的化学结构与药效的关系

1. 药物产生药效的过程: 吸收、分布、代谢、组织结合, 以及在作用部位产生作用等。

2. 药物的两种作用方式

(1) 结构非特异性药物, 代表药: 全身麻醉药。

(2) 结构特异性药物, 大多数药物都属于结构特异性药物

3. 影响药物产生药效的主要因素

4. 药效团的含义

5. 药物的水溶性和脂溶性 评价药物亲水性或亲脂性大小的标准是药物的脂水分配系数:

$$P = \frac{C_{\text{org}}}{C_{\text{w}}}$$

C_{org} 表示药物在非水相中或正辛醇中的浓度; C_{w} 表示药物在水中的浓度。 P 值常以 $\lg P$ 表示。

6. 影响药物水溶性的因素

7. 药物以非解离的形式(分子形式)被吸收, 通过生物膜进入细胞后, 以解离形式起作用, 掌握各种酸碱性药物在胃肠道的吸收情况。

8. 药物结构的官能团对物理化学性质的影响: 增加水溶性的基团; 增加脂溶性的基团。

9. 受体和酶电子云分布的不均衡性

10. 来自药物立体结构对药效的影响主要有: 药物结构中官能团间的距离, 药物结构中取代基的空间排列以及药物的手性中心。

11. 手性药物的对映体之间的药物活性的差异

(1) 对映异构体之间活性及强度相同。抗组胺药异丙嗪、局麻药丙胺卡因。

(2) 对映异构体之间活性相同, 但强度不同。例如抗过敏药马来酸氯苯那敏。

(3) 一个异构体有活性, 另一个无活性。例如抗高血压药物 L-甲基多巴仅 L 型有效。

(4) 对映体之间活性相反。例如利尿药依托唑啉左旋体有利尿作用, 右旋体有抗利尿作用; 扎考比利右旋体有 5-HT₃ 受体拮抗作用, 而左旋体有 5-HT₃ 受体激动作用。

(5) 对映异构体之间具有不同类型的药理活性。例如右丙氧芬有镇痛作用, 左丙氧芬有止咳作用。

12. 几何异构体对药效的影响几何异构药效差异 如反式(E 式)己烯雌酚有效, 而顺式体(Z 式)无效。

13. 优势构象与药效构象的差异

(1) 优势构象 最稳定的构象称作优势构象。

(2) 药效构象 药物与受体间相互作用时, 要求其结构和构象产生互补性, 这种互补的药物构象称

作药效构象。药效构象不一定是药物的最低能量构象。构象异构体为动态异构体,对其研究相对于对映异构和几何异构要困难得多。

13. 药物和生物大分子键合形式有: 共价键和非共价键。

1. 共价键键合类型是一种不可逆的结合形式, 如烷化剂类抗肿瘤药。
2. 非共价键的键合类型是可逆的。形式有: 范德华力、氢键、疏水键、静电引力、电荷转移复合物、偶极相互作用力等。

第二章 药物化学结构与体内生物转化的关系

一、药物代谢 定义。

二、药物代谢反应的分类 两相: 第 I 相生物转化与第 II 相生物结合。

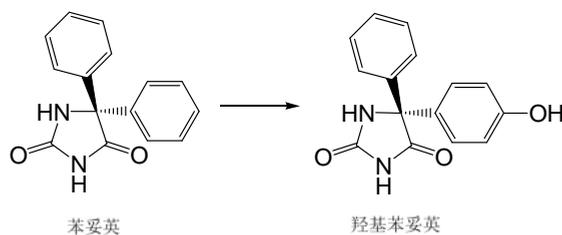
1. I 相生物转化, 也称作药物的官能团化反应。是体内的酶对分子进行氧化、还原、水解和羟化等反应, 在药物分子中引入或暴露出羟基、羧基、氨基、巯基等极性官能团。

2. II 相生物结合, 由 I 相代谢引入或暴露出的极性官能团与内源性成分发生共价键的结合反应, 生成极性大, 易溶于水的结合物, 最终排出体外。

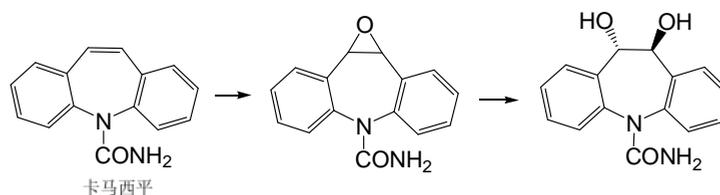
三、药物的官能团化反应(第 I 相生物转化)

1、含芳环药物的代谢

多生成酚的代谢产物, 芳环上的供电子取代基能使反应容易进行, 吸电子取代基则削弱反应的进行程度。例如: 苯妥英在体内代谢后生成羟基苯妥英失去生物活性。

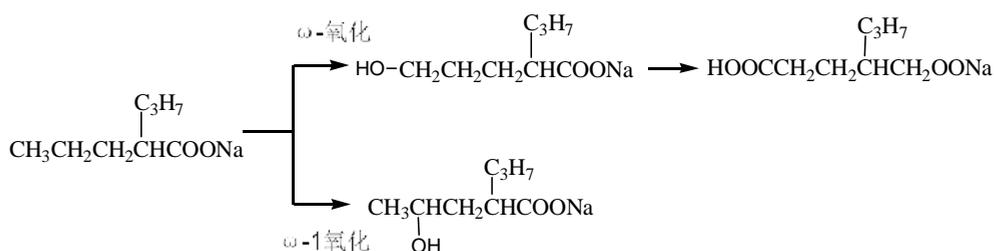


2、烯烃和炔烃(氧化、水解反应) 氧化活性: 炔>烯>芳香烃。例如卡马西平的体内代谢, 首先形成环氧化物, 为活性产物, 进一步水解成两个羟基。

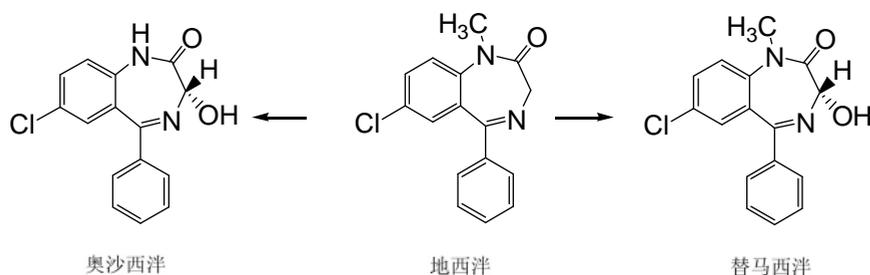


i. 饱和碳原子的代谢(氧化反应) 烷烃易发生以下氧化反应:

在长碳链末端碳上进行氧化生成醇称作 ω -氧化。在长碳链末端倒数第二个碳上进行氧化生成醇称作 $\omega-1$ 氧化。



在苄位、烯丙位或羰基邻位碳上更易发生羟化反应。如镇静催眠药地西洋在体内代谢成为替马西洋和奥沙西洋。均为代谢活性产物。

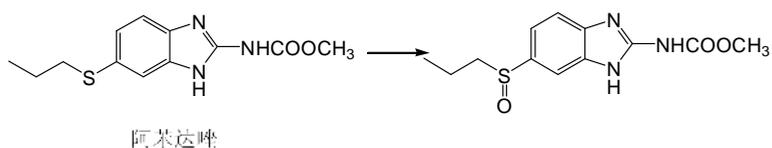


- ii. 卤代烃(氧化脱卤反应) 例如, 氯霉素氧化即生成羰酰氯, 为产生毒性的根源。
- iii. 胺类(氧化反应): 在和氮原子相连接的碳原子上发生 N-脱烷基化和脱胺反应;
- iv. 含氧药物的代谢

- (1) 醚类 发生与 O-脱烷基化反应, 生成醇或酚, 进一步氧化成羧酸。例如可待因。
- (2) 醇类 氧化生成羰基化合物, 伯醇氧化成醛, 进而几乎全部转化成羧酸; 仲醇氧化生成酮, 也可不发生氧化直接经结合反应排出体外。
- (3) 酮类 可发生还原反应生成仲醇。

v. 含硫药物

- (1) 硫醚类 (R-S-R') 可发生两类氧化反应。



- (2) 含亚砷基的药物 也可还原生成硫醚。例如, 非甾体抗炎药舒林酸为前药。
- (3) 含硫羰基药物 易发生氧化脱硫代谢。例如, 抗肿瘤药塞替派。

- vi. 含硝基药物的代谢(-NO₂) 芳香族硝基被还原生成芳香胺基。如氯霉素。
- vii. 酯和酰胺类药物(占比例较大) 发生水解反应。

注意: 利用酯基和酰胺基团体内易水解的性质, 可将羧基或者酚羟基、醇合成为酯(前体药物), 体内水解释放出原药而发挥作用。

四、药物的结合反应(第 II 相生物结合)

药物的结合反应(II 相代谢)也需在酶催化下进行,可发生结合反应的官能团主要有羟基、氨基、羧基、巯基及杂环氮原子等。

i. 与葡萄糖醛酸的结合反应 为药物代谢的最主要的途径。新生儿体内葡萄糖醛酸转移酶活性不足,使用氯霉素易导致“灰婴综合症”。

ii. 形成硫酸酯的结合反应 羟基、氨基、羟胺基可发生此结合反应。

iii. 与氨基酸的结合反应 许多含有羧基的药物均可发生这种结合反应。

iv. 与谷胱甘肽的结合反应 在谷胱甘肽转移酶的催化下,药物中具有亲电性的官能团或经代谢产生的具有亲电性的基团与谷胱甘肽结合。

v. 乙酰化结合反应 如对氨基水杨酸的乙酰化反应。

vi. 甲基化结合反应 含有酚羟基、氨基,巯基的药物,均可在体内经甲基转移酶的催化下进行甲基化反应。

五、药物的生物转化和药学研究

i. 药物的生物转化对临床合理用药的指导

(1) 药物的口服生物利用度,前系统的首过代谢

(2) 合并用药 两个以上药物共同使用,药物的相互作用及其实例。

(3) 给药途径 针对前系统的首过代谢会降低药物的口服利用度,临床中可以合理地设计不同的给药途径。

ii. 药物的生物转化在药物研究中的应用

(1) 前药原理的应用

[1] 前药的含义

[2] 类型: ①形成酯基的前药:例如:贝诺酯、丙酸睾酮、维生素 E 醋酸酯、氟奋乃静庚酸酯、琥乙红霉素等;②形成酰氨基的前药:例如:美法仑的前药氮甲等;③形成亚氨基的前药。

[3] 前药的用途 6 个用途

(2) 硬药和软药原理

[1] 硬药:是指具有发挥药物作用所必需的结构特征的化合物,在体内不易发生代谢或化学转化,避免产生不必要的毒性代谢产物,以增加药物的活性。临床应用的硬药很少。如前列地尔易代谢失活,其衍生物米索前列醇为硬药,作用时间长。

[2] 软药:本身有活性的药物,进入体内后经已预知和可控的代谢途径很快失活,并生成

对人体无毒副作用的代谢物而排出体外。

[3] 软药和前药的区别: 软药本身有活性, 体内代谢后失活; 前药本身无活性, 体内代谢后释放出活性化合物。

第三章 药物的化学结构修饰

一、药物的化学结构修饰

目的是改善药物代谢动力学性质, 并提高疗效、降低毒副作用。

二、药物化学结构修饰对药效的影响

1. 改善药物的吸收 例如: ①青光眼治疗药 β -受体阻断剂噻吗洛尔的丁酰化; ② β -内酰胺类抗生素氨苄西林经结构修饰成新戊酰氧甲酯。

2. 延长药物的作用时间 例如: ①氟奋乃静制成高级脂肪酸酯②睾酮制成丙酸睾酮。

3. 增强药物作用部位的选择性 例如: ①去氧氟尿苷水解出氟尿嘧啶, 产生特定部位的抗肿瘤作用; ②美法仑分子结构中含有苯丙氨酸提高其对肿瘤组织的选择性。

4. 降低药物的毒副作用 例如: 贝诺酯可降低阿司匹林游离羧基对胃肠的刺激作用。

5. 提高药物的稳定性 例如: 维生素 E 和维生素 A 制成醋酸酯后稳定性明显提高。

6. 改善药物的溶解性能 例如: 双氢青蒿素制得其琥珀酸单酯单钠盐水溶性大增。

7. 消除不适宜的制剂性质 例如, 红霉素碳酸乙酯和琥珀酸单酯, 苦味消失。克林霉素制成棕榈酸酯消除了原有的苦味, 制成磷酸酯还避免了注射时的疼痛。

三、药物化学结构修饰的常用方法

1. 酯化和酰胺化修饰

(1) 羧基——酯化和酰胺化修饰 实例较多, 例如: 匹氨西林、头孢呋辛酯、贝诺酯等。羧基的酯化修饰是一种前药修饰。

(2) 羟基——酯化修饰 例子较多。

(3) 氨基——酰胺化修饰 例如: 抗肿瘤药美法仑的氨基被甲酰化得到氮甲, 刺激性下降, 抗结核药对氨基水杨酸的氨基被苯甲酰化后, 稳定性增加。

2. 酸碱性药物——成盐法 使药物水溶性升高, 稳定性增大, 以及减少药物的刺激性。

3. 其他修饰法 举例说明:

(1) 将地西洋开环, 再与赖氨酸形成酰胺, 得到 Ro-7355, 其水溶性大大高于地西洋。Ro-7355 进入体内后, 脱去赖氨酸并进一步关环生成地西洋, 发挥镇静和抗焦虑作用。

(2) 将维生素 B₁ 的噻唑环打开, 再形成二硫化物, 可制得丙舒硫胺和呋喃硫胺, 两者脂溶性高

于维生素 B₁，口服吸收快速完全，在体内可重新形成维生素 B₁。

第四章 抗生素

一、抗生素的作用机制

1. 抑制细菌细胞壁的合成。如 β -内酰胺类抗生素
2. 与细胞膜相互作用。如多黏菌素和短杆菌素
3. 干扰蛋白质的合成。如大环内酯类、氨基糖苷类、四环素类、氯霉素类
4. 抑制核酸的转录和复制。如利福霉素类抗生素

二、抗生素按照化学结构类型不同的分类 ① β -内酰胺类；② 四环素类；③ 氨基糖苷类；④ 大环内酯类；⑤ 氯霉素类；⑥ 其他结构类型。

三、 β -内酰胺类抗生素

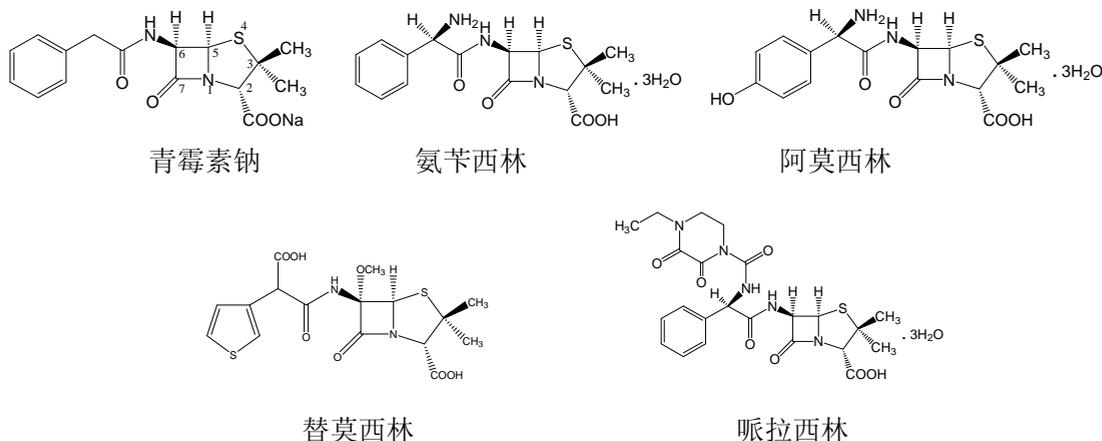
6-氨基青霉烷酸(6-APA)的发现是半合成抗生素研究和开发的基石。

共同结构特点 分子中含有由四个原子组成的 β -内酰胺环的抗生素，该结构为发挥生物活性的必要基团。

1. β -内酰胺类抗生素的分类

① 青霉素类；② 头孢菌素类；③ β -内酰胺酶抑制剂类；④ 非经典 β -内酰胺抗生素类。

2. 青霉素类 代表性药物:青霉素钠、氨苄西林、阿莫西林、哌拉西林、替莫西林。



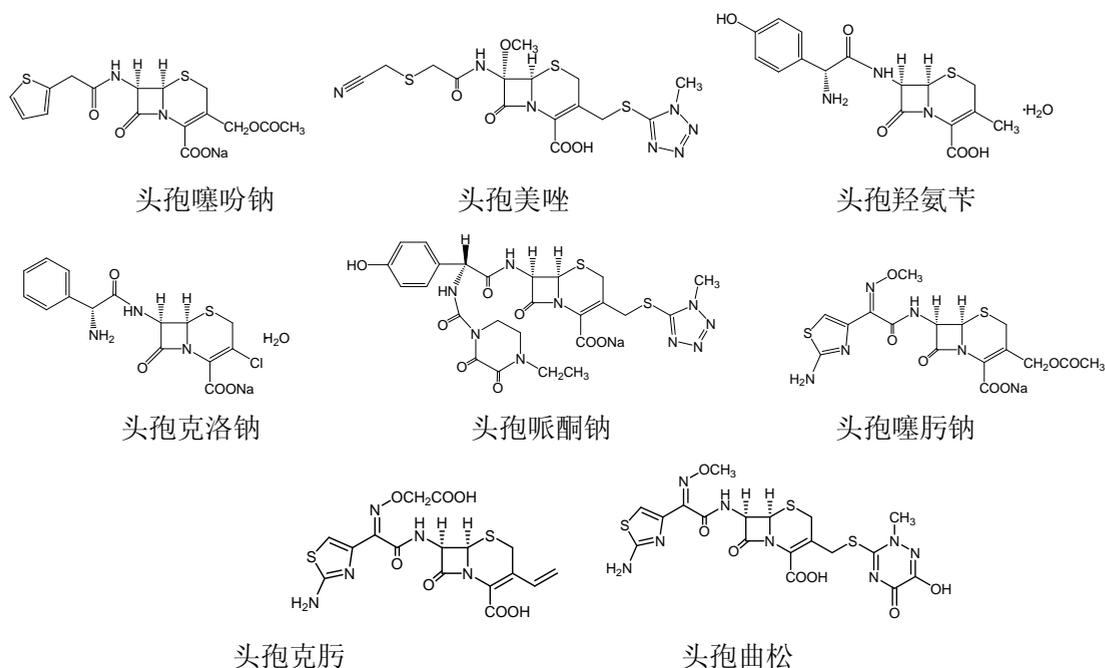
共同结构特点 以青霉烷酸为母体，在 6 位连有不同取代基，三个手性碳构型为 2S, 5R, 6R。			
药名	结构特点及化学名称	理化性质	临床用途
青霉素钠 (青霉素 G 钠)	6 位连有苯乙酰氨基 (2S, 5R, 6R)-构型	为发酵产物。① 在酸、碱条件下均不稳定，产生不同的产物② 水溶液在室温下不稳定，故制成粉针剂。	革兰氏阳性菌。对 β -内酰胺酶不够稳定、有严重过敏反应（所含杂质引起）。
氨苄西林	连有 2-氨基-苯乙酰氨基为氨苄西林，苯位手性碳为 R 构型，四个手性中心	①水溶液不太稳定，可发生分解反应。②在室温放置聚合；③具有 α -氨基酸的性质，与茚三酮试液显色反应。	第一个用于临床的广谱半合成青霉素。有耐酸作用，临床用粉针剂

阿莫西林	连有 4-羟基-苯乙酰氨基，手性碳为 R 构型，为右旋体	应 ④ 可发生双缩脲反应	口服吸收较好
哌拉西林	氨苄西林氨基上引入 4-乙基-2,3-二氧代-哌嗪-1-甲酰基，改变抗菌谱		广谱抗菌药
替莫西林	结构中在 6 位连有，甲氧基以及 2-羧基-噻吩-3-乙酰基。	在 β-内酰胺环的 6 位上有甲氧基取代的青霉素抗生素，具有良好的耐酶活性。	

5. 头孢菌素

合成基本原料：7-氨基头孢烷酸（7-ACA）和 7-氨基-3-去乙酰氧基头孢烷酸（7-ADCA）。

代表性药物：头孢噻吩钠、头孢羟氨苄、头孢克洛、头孢哌酮钠、头孢美唑、头孢噻肟钠。



共同结构特点：均以头孢烯为母体，区别在于 3 位和 7 位取代基的不同。两个手性碳的构型为 6 R, 7 R。头孢羟氨苄和头孢克洛 7 位取代基相似，头孢羟氨苄比头孢克洛多一羟基，主要区别是头孢克洛的 3 位是氯（在头孢菌素中只有这一例）；头孢噻肟钠和头孢噻吩钠 3 位取代基相同，均为乙酰氧基亚甲基（天然头孢类共有的取代基），不同在于头孢噻肟钠的 7 位是 2-氨基-3-噻唑乙酰基，在乙酰基的邻位连甲氧亚胺，而头孢噻吩钠的 7 位是噻吩-2-乙酰基；头孢哌酮钠和头孢美唑 3 位取代基相同，均为 1-甲基-1H-1,2,3,4-四唑-1-基。除 7 位侧链不同外，最大的区别是头孢美唑的 7 位有 α-甲氧基。

共同理化性质：头孢菌素母体由 β-内酰胺环与六元的氢化噻嗪环组成，而且氮原子的未共有电子对与氢化噻嗪环的双键共轭，使得头孢菌素类对酸稳定，可以口服。

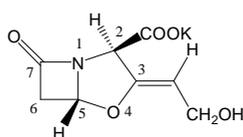
药名	结构特点及化学名称	理化性质	临床用途
头孢羟氨苄	(6 R, 7 R)-构型	固体稳定，pH 8.5 以下较为稳定，pH 9 以上迅速分解。	对革兰阳性菌较好，可口服。
头孢噻肟钠	7 位氨基噻肟取代，3 位酯基	①甲氧肟基的引入使药物对内酰胺酶的稳定性增大；②2-氨基噻唑基增加了药物与细菌青霉素结合蛋白的亲和能力；③甲氧肟基为顺式活性大。光照下，顺式可转化为反式，须避光保存	第三代头孢菌素。
头孢噻吩钠	3 位酯基，侧链含有噻吩结构	体内代谢 3 位乙酰氧基发生酯水解，然后形成内酯失去活性。	注射给药。

头孢美唑	7 位有 α -甲氧基、3 位含有四氮唑结构		耐酶
头孢克洛	3 位氯原子取代的头孢菌素，并将氯苄西林的侧链引入其分子中。	3 位氯的引入，使其对碱和亲核试剂变得稳定，活性提高，药代动力学性质改善。	敏感菌所致感染，口服药
头孢哌酮钠	为 3 位甲基上以巯基杂环取代乙酰氧基的头孢菌素，化学名中关注“哌嗪”和“四唑”	杂环的芳香性及亲水性可提高其抗菌性并显示良好的药代动力学性质，在血中的浓度较高	对绿脓杆菌的作用较强。
头孢克肟	结构中 3 位烯炔	对 β -内酰胺酶稳定	第三代头孢菌素
头孢曲松	7 位氨基噻吩取代，3 位三氮杂环取代		第三代头孢菌素

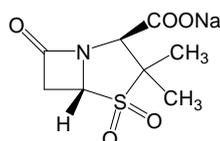
4. β -内酰胺类抗生素的构效关系

5. β -内酰胺酶抑制剂

结构类型的分类：①氧青霉烷类（克拉维酸钾）；②青霉烷砜类（舒巴坦钠）。



克拉维酸钾

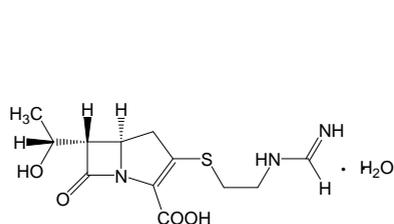


舒巴坦钠

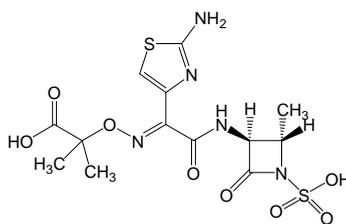
药名	结构特点	临床用途
克拉维酸钾	以氧青霉烷为母体，2 位连有羧酸钾，3 位连有羟甲乙炔基；结构不稳定。	①是一种自杀机制的 β -内酰胺酶抑制剂；①有微弱的抗菌活性，单独使用无效，常用 β -内酰胺抗生素联合应用以提高疗效；②可使阿莫西林、头孢菌素类抗生素增效；③克拉维酸和阿莫西林组成的复方制剂（奥格门汀片剂）
舒巴坦钠	以青霉烷为母体，2 位连有羧酸钠，4 位硫被氧化成砜	①不可逆竞争性 β -内酰胺酶抑制剂，通过与 β -内酰胺酶发生不可逆的反应而使酶失活；②与氨苄西林合用时，能显著提高抗菌作用；③将氨苄西林与舒巴坦通过亚甲基相连形成双酯结构的前体药物，称为舒它西林。

6. 非经典的 β -内酰胺类抗生素

1. 按照结构类型的分类 可分为：①碳青霉烯类（亚胺培南）；②单环 β -内酰胺类（氨曲南）。



亚胺培南



氨曲南

药名	结构特点	临床用途
亚胺培南	β -内酰胺环与二氢吡咯环并在一起。用亚甲基取代了青霉素的硫原子	为沙纳霉素衍生物，强于沙纳霉素，抗菌谱广。临床常肾肽酶抑制剂西司他丁合用，可防止亚胺培南在肾脏被肾肽酶破坏，延长作用时间。
氨曲南	以 β -内酰胺环为母体，1 位氮上有磺	第一个上市的全合成单环 β -内酰胺抗生素。对需氧革兰氏阴性

酸基，2 位有甲基，3 位有复杂取代的酰氨基。	菌有很强活性，对 β -内酰胺酶稳定。耐受性好，副作用发生率很低。
-------------------------	---

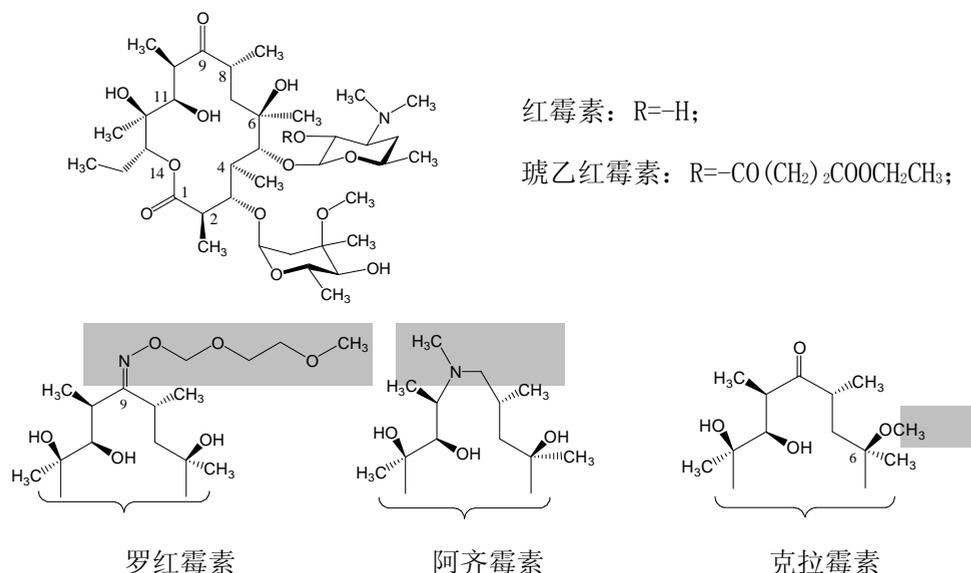
二、大环内酯类抗生素

1. 分类 可分为：①14 元大环内酯类；②16 元大环内酯类。

链霉菌产生的一类**弱碱性**的抗生素，分子结构特征为含有一个**内酯结构**的**十四元或十六元**大环，通过内酯环上的羟基与去氧氨基糖或 6-去氧糖缩合成**碱性苷**。抑制细菌蛋白质的合成，毒性低，无严重不良反应。因都具有内酯环，酸碱酶都不稳定

2. 14 元大环内酯类（红霉素、琥乙红霉素、罗红霉素、克拉霉素、阿齐霉素）。

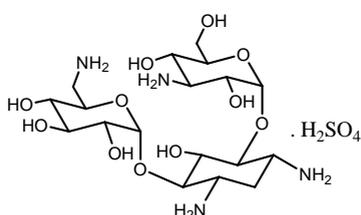
共同结构 为 14 元大环内酯类，3 位连有红霉素糖，5 位连有去氧氨基糖，除 9 位含有酮，13 位含有乙基外，在 2, 4, 6, 8, 10,, 12 位含有甲基，在 6, 11, 12 含有羟基。			
药名	结构特点	理化性质	临床用途
红霉素	由红霉内酯与去氧氨基糖缩合而成碱性苷。含有 14 个原子的大环，9 位一个羰基，内酯环的 C-3, C-5 与糖连接。	酸性下不稳定，6 羟基与 9 酮形成的半缩酮的羟基失去活性。	广谱抗生素。结构改造均在 6 位和 9 位进行
琥乙红霉素	红霉素 5 位的氨基糖 2” 羟基与琥珀酸乙酯所成的酯。在体内可水解释放出红霉素而起到抗菌作用	胃酸中稳定无苦味	与红霉素相同。前体药物
罗红霉素	为红霉素 C-9 位的衍生物，可阻止 6 位羟基与 9 位羰基的缩合	稳定性增加。明显改善口服生物利用度。	作用强，肺组织中浓度较高
阿齐霉素	将红霉素经贝克曼重排后得到的扩环产物，第一个环内含氮原子的 15 元环的大环内酯抗生素。	碱性增大，在组织中浓度较高，体内半衰期长	抗菌谱与红霉素相近，但作用较强
克拉霉素	红霉素 6 位甲基化产物		



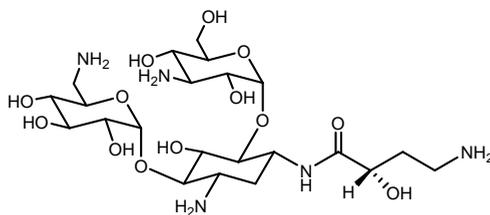
3. 16 元大环内酯类 代表性药物麦迪霉素、麦白霉素：麦迪霉素主要成分为麦迪霉素 A₁，麦白霉素含麦迪霉素 A₁ 约 40%，二者对葡萄球菌、链球菌等有高效。

三、氨基糖苷类抗生素

代表用药 链霉素、卡那霉素、庆大霉素、新霉素、巴龙霉素和核糖霉素、阿米卡星。



硫酸卡那霉素



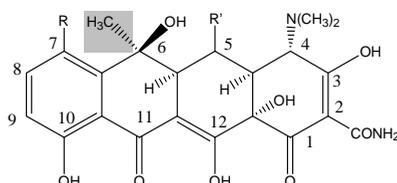
阿米卡星

特点 ①氨基糖与氨基醇形成的苷，碱性，常制成结晶性的硫酸盐或盐酸盐，水溶性高，须注射给药；②都有肾脏毒性、对第八对颅脑神经有损害，引起不可逆耳聋，儿童慎用。

药名	结构特点	临床用途
硫酸卡那霉素	广谱抗生素，易产生耐药性	
阿米卡星（丁胺卡那霉素）	在1位氮上连有氨基羟丁酰侧链，侧链的构型对其抗菌活性很重要。其构型为L-(-)型，若为D-(+)型抗菌活性大为降低。	卡那霉素半合成衍生物，注射给药。

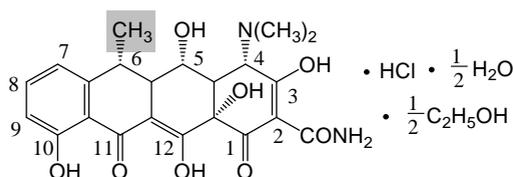
四、四环素类抗生素

以氢化并四苯为基本骨架的一类广谱抗生物。

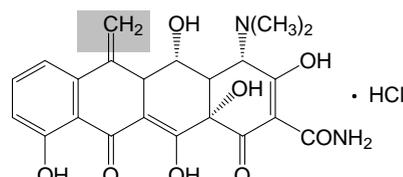


1. 天然的四环素（金霉素、土霉素和四环素）分子结构中含有许多的酚羟基、烯醇羟基及羰基，可同多种金属离子形成不溶性螯合物，如钙，镁，铁，铝，形成四环素牙，6位羟基是不稳定因素，所以去掉该羟基，得到一系列的四环素类抗生素。

2. 半合成代表性药物 盐酸多西环素、盐酸美他环素：



盐酸多西环素



盐酸美他环素

共同结构特点 两药均以氢化并四苯为母体，为四环素、土霉素的类似物。去除土霉素的6位羟基，即为多西环素；将土霉素的6位羟基与6位甲基脱水即得美他环素。

药名	结构特点	临床用途
盐酸多西环素	去掉土霉素的6位羟基，化学性质变得稳定	抗菌活性明显提高
盐酸美他环素	又称作盐酸甲烯土霉素。为土霉素6位甲基与6位羟基脱水的甲烯衍生物。	脂溶性提高，口服吸收良好，作用时间较长。

第五章 合成抗菌药

一、喹诺酮类抗菌药

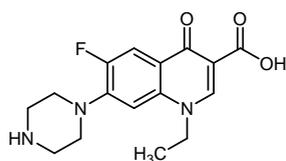
是一类以原核生物 DNA 回旋酶和拓扑异构酶 IV 为作用靶点的合成抗菌药

1. 发展史

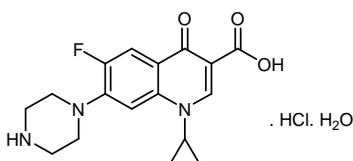
发展过程	结构特点	临床用途	代表药物
第一阶段		仅对革兰阴性菌有效	萘啶酸, 吡咯米酸和奥索利酸
第二阶段	引入哌嗪基团	对革兰阴性阳性菌、对绿脓杆菌有效	吡哌酸和西诺沙星
第三阶段	引入氟原子	扩大到对支原体和衣原体以及分支杆菌都有作用	诺氟沙星、环丙沙星、氧氟沙星、左氧沙星、洛美沙星、依诺沙星、托舒氟沙星、帕珠沙星和加替沙星

2. 按照结构类型不同的分类: ①萘啶羧酸类; ②吡啶并嘧啶羧酸类; ③喹啉羧酸类。

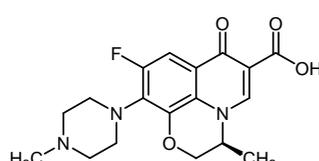
3. 代表性药物 诺氟沙星、盐酸环丙沙星、左氧氟沙星。



诺氟沙星



盐酸环丙沙星



左氧氟沙星

药名	结构特点	化学名	理化性质	临床用途
诺氟沙星	喹啉羧酸类, 在 1 位连有乙基, 6 位和 7 位取代基与环丙沙星相同	1-乙基-6-氟-1, 4-二氢-4-氧代-7-(1-哌嗪基)-3-喹啉羧酸	光照下可分解, 生成哌嗪开环物; 在酸性下加热回流可发生脱羧反应	第三代喹诺酮类药物。
盐酸环丙沙星	喹啉羧酸类, 在 1 位连有环丙基, 在 6 位连有氟, 在 7 位连有 1-哌嗪基	1-环丙基-6-氟-1, 4-二氢-4-氧代-7-(1-哌嗪基)-3-喹啉羧酸盐酸盐一水合物	稳定性良好, 在稀盐酸中加热可检出哌嗪开环物和脱羧物	为第三代的代表性药物
左氧氟沙星	1, 8 位间形成含氧的六元环; 为氧氟沙星的左旋体。	(S)-(-)-体	活性是氧氟沙星的 2 倍, 水溶性是氧氟沙星的 8 倍, 易制成注射剂	为第三代喹诺酮类, 毒副作用最小的。

4. 代谢特点 喹诺酮类药物一般可发生: ①3 位羧基与葡萄糖醛酸的结合反应; ②在哌嗪环 3' 位发生羟化反应, 引入的羟基可进一步氧化成酮。

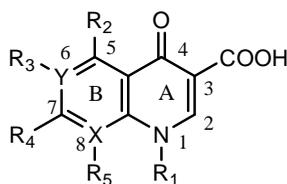
5. 喹诺酮类抗菌药的理化性质

(1) 3, 4 位羧基和酮羰基, 容易和金属离子如钙、镁、铁、锌等形成螯合物, 降低了药物的活性, 使体内金属离子流失。

(2) 室温下稳定, 光照分解, 酸性回流下可进行脱羧。

(3) 7 位含氮杂环在酸性条件下, 水溶液光照可发生分解反应。

6. 构效关系



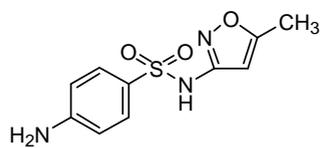
(1) A 环必须；(2) B 环可为苯环 (Y=X=CH)、嘧啶环 (Y=X=N) 等；(3) 3 位羧基和 4 位羰基为活性必需基团；(4) 1 位可为乙基、氟乙基或环丙基；(5) 6 位引入氟活性大增；(7) 7 位引入五元或六元杂环，抗菌活性增加；(8) 8 位引入氟、甲氧基或与 1 位成氧环，活性增加。

7. 喹诺酮类药物的毒性

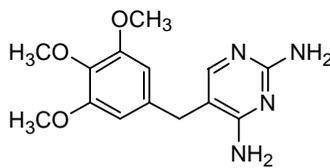
喹诺酮类药物结构中 3、4 位分别为羧基和酮羰基，极易和金属离子如钙、镁、铁、锌等形成螯合物，降低抗菌活性，使体内金属离子流失。

二、磺胺类抗菌药及抗菌增效剂

代表性药物：磺胺甲噁唑、甲氧苄啶。



磺胺甲噁唑



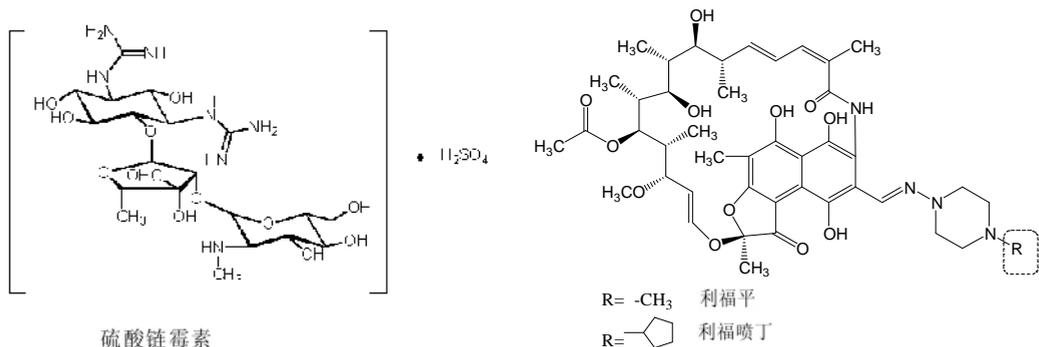
甲氧苄啶

药名	结构特点	化学名	临床用途
磺胺甲噁唑	对氨基苯磺酰胺为母体，在磺酰胺的氮原子上连有 5-甲基-3-异噁唑基。	4-氨基-N-(5-甲基-3-异噁唑基)-苯磺酰胺	为二氢叶酸合成酶抑制剂，为磺胺类药物中使用最广泛的药物
甲氧苄啶	以 2, 4-二氨基嘧啶为母体，在 5 位连有 3, 4, 5-三甲氧基苯甲基	甲氧苄啶与磺胺甲噁唑组成复方制剂，称作复方新诺明。	为二氢叶酸还原酶抑制剂，与磺胺甲噁唑合用，对细菌体内叶酸合成产生双重阻断作用。也作为四环素等抗生素的增效剂。

第六章 抗结核药

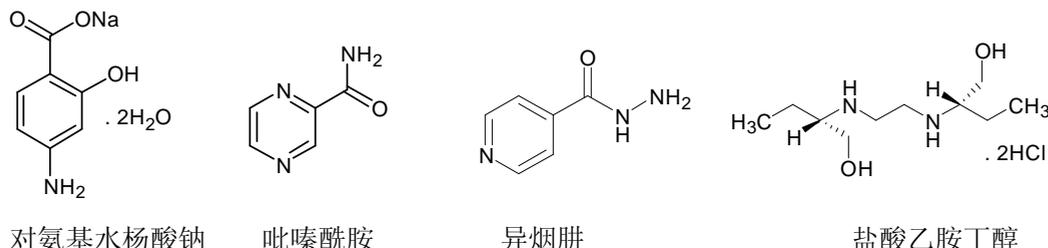
分类：① 抗生素类抗结核药（硫酸链霉素、利福平、利福喷丁）；② 合成抗结核药（对氨基水杨酸钠、异烟肼、盐酸乙胺丁醇）

一、抗生素类抗结核药 代表药：硫酸链霉素、利福平、利福喷丁。



药名	结构特点	理化性质	临床用途
硫酸链霉素	由链霉胍、链霉糖和 N-甲基葡萄糖三部分组成	分子结构中有三个碱性中心，可以与各种酸成盐	治疗各种结核病。有肾毒性。
利福平 利福喷丁	半合成抗生素，大环内酰胺结构，含有乙酸酯、1,4-萘二酚、内酰胺等，后者为利福平哌嗪氮甲基被环戊基取代的衍生物	①鲜红色结晶性粉末；②遇光变质，水溶液易氧化损失效价；③遇亚硝酸液易被氧化成暗红色的酮类化合物；④萘二酚结构在碱性条件下氧化成醌型化合物；⑤在强酸条件下，C=N 键易水解成醛和氨基哌嗪。	抗结核病药 作用靶位：抑制细菌 DNA 依赖的 RNA 聚合酶 (DDRP)

二、合成抗结核病药 代表性药物：对氨基水杨酸钠、吡嗪酰胺、异烟肼、盐酸乙胺丁醇。

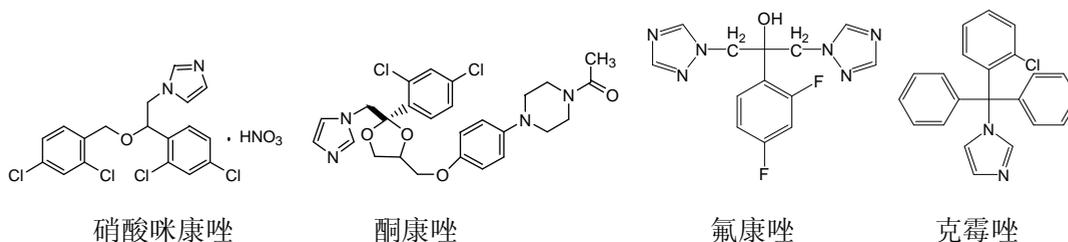


药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
异烟肼	以吡啶为母体，在 4 位上连有甲酰肼 化学名为：4-吡啶甲酰肼	① 肼基具有较强的还原性②在酸性下与铜离子螯合③酰肼基在酸、碱条件下，可水解生成异烟酸和游离肼，毒性较大，很多因素可促进水解反应。④代谢产物为乙酰异烟肼⑤乙酰肼为产生肝脏毒性的原因	常用抗结核药，常与链霉素，卡那霉素和对氨基水杨酸钠合用，
盐酸乙胺丁醇	乙二胺两个氮原子上分别连有正丁醇-2-基	①有二个手性碳，由于分子有对称性，实际仅有三个对映异构体，药用为 R, R 构型的右旋体；②本品的氢氧化钠水溶液与硫酸铜反应，生成深蓝色络合物。③代谢：两个羟基-醛基-酸	主要用于耐异烟肼、链霉素的结核杆菌感染的肺结核等
对氨基水杨酸钠	以水杨酸为母体，在羧基的对位连有氨基	因为排泄快使用剂量大而且只对结核杆菌有抑制作用，所以很少单独使用，多与异烟肼、链霉素和用，以增加疗效和避免细菌产生耐药性	对结核杆菌的对氨基苯甲酸合成起抑制的作用
吡嗪酰胺	烟酰胺的生物电子等排体	烟酰胺的抗代谢物，干扰 NAD 的合成	一线抗结核药

第七章 抗真菌药

分类 ①抗生素类；②唑类（分为：三氮唑类、咪唑类）；③其他类。

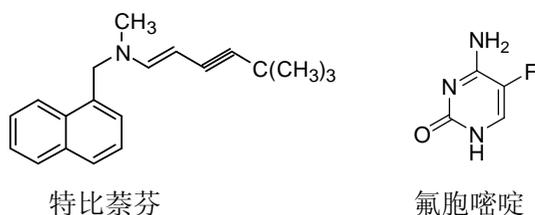
一、唑类 代表性药物：氟康唑、克霉唑、硝酸咪康唑、酮康唑。



共同结构特点：分子中至少有一个唑环，都是以唑环 1 位氮原子通过中心碳原子与芳烃相连，芳烃基一般为一卤或二卤取代苯环，对立体化学要求十分严格。

药名	结构特点及化学名	临床用途
硝酸咪康唑	以咪唑为母体； 1-[2-(2,4-二氯苯基)-2-[(2,4-二氯苯基)甲氧基]乙基]-1H-咪唑硝酸盐。	深部真菌感染
酮康唑	以咪唑为母体； 1-乙酰基-4-[4-[2-(2,4-二氯苯基)-2-[1H-咪唑-1-甲基]-1,3-二氧戊环-4-甲氧基]苯基]-哌嗪	第一个口服抗真菌药。深部真菌感染有效。对缓解前列腺癌有作用
氟康唑	以 1,2,4-三氮唑为母体，分子有对称性，两三氮唑通过 2-丙醇相连，并在 2-丙醇的 2 位连有 2,4-二氟苯基 α -(2,4-二氟苯基)- α -(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)-1H-1,2,4-三唑-1-乙醇	可使真菌细胞失去正常的甾醇，起到抑制真菌的作用
克霉唑	克霉唑以咪唑为母体，在氮原子上连有取代的三苯甲基	广谱抗真菌药

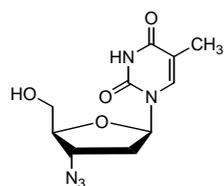
二、其他抗真菌药 代表性药物特比萘芬、氟胞嘧啶：



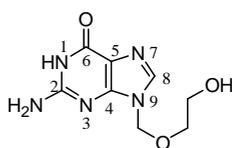
药名	结构特点	临床用途
特比萘芬	烯丙胺类	抑制真菌细胞麦角甾醇合成过程中的鲨烯环氧酶，并使鲨烯在细胞中蓄积而产生杀菌作用。为口服广谱抗真菌药。
氟胞嘧啶		抗真菌药，常与两性霉素合用

第八章 抗病毒药

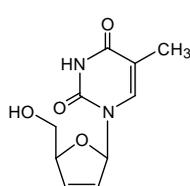
一、核苷类抗病毒药物（又可分为：① 非开环核苷类：如碘苷（第一个临床用药）、司他夫定、齐多夫定、拉米夫定。② 开环核苷类：如阿昔洛韦）。



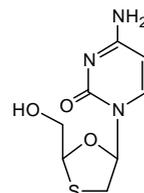
齐多夫定



阿昔洛韦



司他夫定

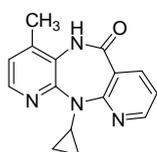


拉米夫定

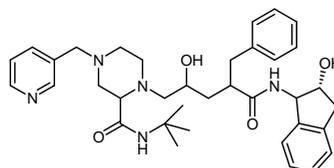
药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
齐多夫定	非开环核苷类，胸苷类似物； 3'-叠氮基-2'，3'-双脱氧胸腺嘧啶核苷		第一个治疗艾滋病的药，有骨髓抑制作用。
阿昔洛韦（无环鸟苷）	开环核苷类，鸟嘌呤9位连2-羟乙氧甲基。9-(2-羟乙氧甲基)鸟嘌呤	1位氮上的氢显弱酸性，遇氢氧化钠可成钠盐溶于水	第一个上市的开环类核苷类抗病毒药
司他夫定	脱氧胸苷的脱水产物，含双键	在体内5'位磷酸化后有抑制逆转录酶活性	艾滋病及相关综合征
拉米夫定	双脱氧硫代胞苷化合物，两种异构体都有活性；抗艾滋病、乙肝，提高免疫力。		

二、非核苷类抗病毒药物 代表药物奈韦拉平

药名	结构特点	化学名	临床用途
奈韦拉平	二吡啶并二氮卓酮类化合物	11-环丙基-5，11-二氢-4-甲基-6H-二吡啶并[3,2-b:2'3'-e][1,4]-二氮卓-6-酮	专一性 HIV-I 逆转录酶抑制剂



奈韦拉平

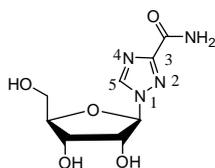


茛地那韦

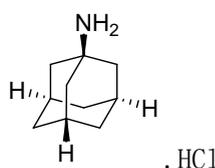
三、蛋白酶抑制剂 代表药物：茛地那韦

药名	结构特点	临床用途
茛地那韦	含有茛结构	用于 HIV-I 感染者，特异性蛋白酶抑制剂，抑制病毒复制。

四、其他抗病毒药物 代表药物：利巴韦林、盐酸金刚烷胺



利巴韦林

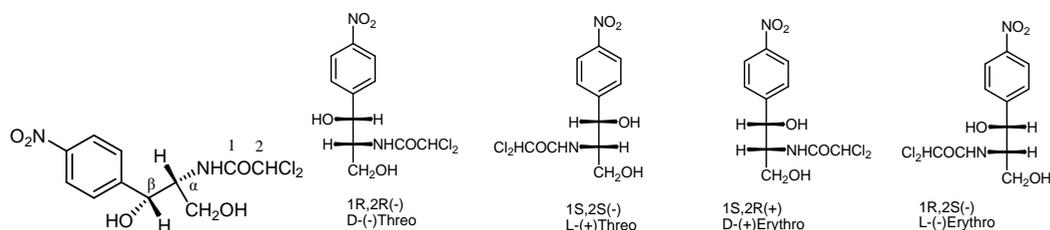


盐酸金刚烷胺

药名	结构特点	化学名	临床用途
利巴韦林（三氮唑核苷、病毒唑）	非开环核苷类药物，三氮唑核苷，病毒唑） 1位连有呋喃核糖基	1-β-D-呋喃核糖基-1H-1,2,4-三氮唑-3-羧酰胺	广谱抗病毒药，也可以抑制艾滋病前期症状
盐酸金刚烷胺	对称的三环状胺		抑制病毒颗粒穿入宿主细胞。预防治疗 A 型流感

第九章 其他抗感染药

一、氯霉素类抗生素 代表性药物：氯霉素

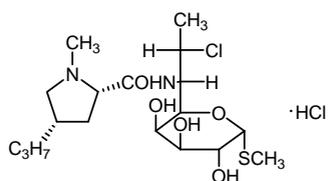


氯霉素

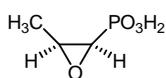
药名	结构特点	化学名	理化性质	临床用途
氯霉素	1, 3-丙二醇为母体, 1 位连有 4-硝基苯基, 2 位连有二氯乙酰氨基, 构型为 D-苏式-(-) 体	D-苏式-(-)-N-[α-(羟基甲基)-β-羟基-对硝基苯基]-2, 2-二氯乙酰胺	①含有 2 个手性中心, 有 4 个对映异构体, 氯霉素为 1R, 2R-苏式构型; ②性质稳定, 特别是对热较稳定; ③在强酸或强碱条件下, 酰胺键和二氯键水解。在无水乙醇中呈右旋性; 醋酸乙酯中呈左旋性。	对革兰氏阳性阴性菌都有作用, 临床主要用于治疗伤寒等疾病。长期使用可引起再生障碍性贫血。

二、其他抗生素 代表性药物盐酸克林霉素、磷霉素。

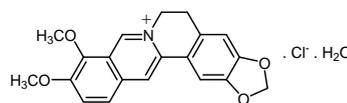
药名	结构特点	临床用途
克林霉素	为脯氨酸衍生物, 是林可霉素 7 位氯取代物	抑制蛋白质的合成, 用于厌氧菌引起的感染, 临床上是金黄色葡萄球菌感染引起的骨髓炎的首选治疗用药
磷霉素	为环氧丙烷衍生物	结构最小抗生素



盐酸克林霉素



磷霉素



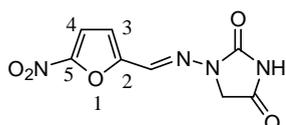
盐酸小檗碱

三、异喹啉类抗菌药 代表性药物：盐酸小檗碱（常称作盐酸黄连素）

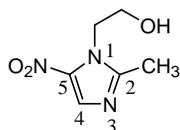
药名	结构特点	理化性质	临床用途
盐酸小檗碱（盐酸黄连素）	异喹啉为母体。以三种形式存在, 季铵碱式、醇式和醛式。其中以季铵碱式（结构式所示）最稳定。	①为黄连的抗菌活性成分, 亲水性极强, 不易被体内吸收。②可被高锰酸钾氧化生成小檗二酸、小檗醛和去氢小檗碱。	抗菌活性强, 毒副作用低, 常用于菌痢及胃肠炎。

四、硝基呋喃类 代表性药物：呋喃妥因（呋喃坦啶）

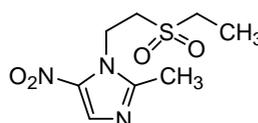
药名	结构特点	理化性质	临床用途
呋喃妥因（呋喃坦啶）	含有硝基呋喃结构, 以及 2, 4-咪唑烷二酮结构	①吸收消除速度都很快。②结构中含有酰亚胺, 呈弱酸性, 加水及氨试液后再加入硝酸银试液即生成黄色银盐沉淀; ③水溶液加氢氧化钠呈现深橙红色	口服吸收迅速, 在尿液中有较高浓度, 临床适于泌尿系统感染



呋喃妥因



甲硝唑



替硝唑

五、硝基咪唑类 代表性药物：甲硝唑、替硝唑。

药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
甲硝唑	2-甲基-5-硝基咪唑-1-乙醇	① 酸碱条件下呈现不同颜色②两个显色反应	口服，抗厌氧菌，抗滴虫病的首选药物
替硝唑	以5-硝基咪唑为母体，1位连有乙磺酰乙基，2位为甲基	口服吸收良好，可通过血脑屏障。临床用于厌氧菌的系统和局部感染以及败血症，毛滴虫病、阿米巴病	

第十章 寄生虫病防治药

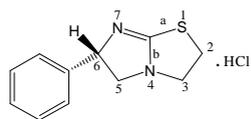
一、驱肠虫药按照结构分类 ① 哌嗪类② 咪唑类③ 噻啶类④ 苯咪类⑤ 三萜类和酚类

二、抗疟原虫药按照结构分类 ① 喹啉醇类② 氨基喹啉类③ 2, 4-二氨基噻啶类④ 青蒿素类

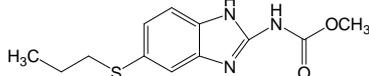
三、掌握代表性药物的结构、化学名称以及理化性质与临床用途

1. 驱肠虫药 代表性药物：盐酸左旋咪唑、阿苯达唑；共同结构特点：属于咪唑类。

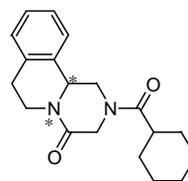
药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
盐酸左旋咪唑	四氢咪唑并噻唑为母体，在6位连有苯基，有手性；S-(-)-6-苯基-2, 3, 5, 6-四氢咪唑并[2, 1-b] 噻唑盐酸盐	①S-构型左旋体的驱虫作用强；②与氢氧化钠水溶液共沸，生成红色配位化合物；③结构中叔氮原子可生物碱沉淀剂反应。	①选择性抑制虫体肌肉中延胡索酸还原酶的活性，为广谱驱肠虫药；②免疫调节作用。
阿苯达唑 (丙硫咪唑、肠虫清)	以苯并咪唑为母体	体内迅速代谢氧化成活性代谢物-阿苯达唑亚砷而起作用	为广谱驱肠虫药，有致畸作用，孕妇及2岁以下幼儿禁用



盐酸左旋咪唑



阿苯达唑



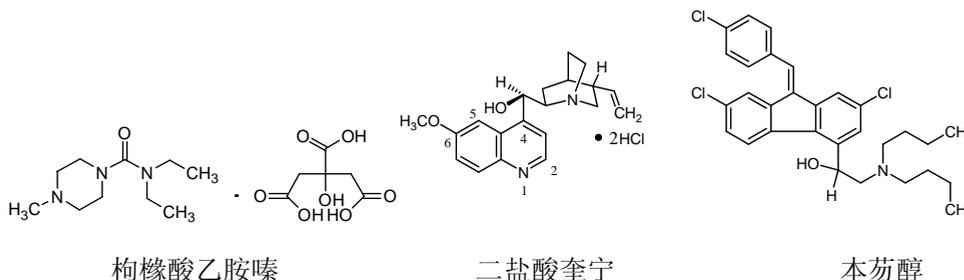
吡喹酮

3. 抗血吸虫药 代表性药物：吡喹酮

药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
吡喹酮	以氢化异喹啉并哌嗪酮为母体；	含有二个手性中心，临床使用外消旋体	新型广谱抗寄生虫药，对虫的糖代谢有明显抑制作用

4. 抗丝虫药 代表性药物：枸橼酸乙胺嗪

药名	结构特点	化学名	理化性质	临床用途
枸橼酸乙胺嗪	以哌嗪为母体	4-甲基-N,N-二乙基-1-哌嗪甲酰胺枸橼酸二氢盐	加氢氧化钠后与钼酸胺-硫酸试液加热可生成氨蓝色沉淀	除抗丝虫外，还有抗微丝蚴虫及成虫的作用



5. 抗疟药

分类：①喹啉醇类（如：奎宁、本芬醇）②氨基喹啉类（如：磷酸氯喹，磷酸伯氨喹）③2,4-二氨基嘧啶类（如：乙胺嘧啶）④青蒿类（如：青蒿素，蒿甲醚）

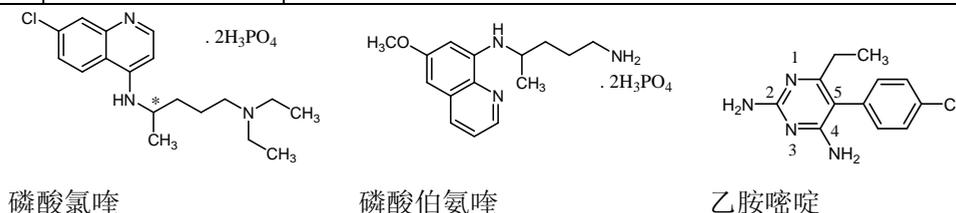
(1) 喹啉醇代表药物：二盐酸奎宁、本芬醇

药名	结构特点及化学名	临床用途
二盐酸奎宁	由喹啉环和喹核碱环两部分组成，分子中有四个手性碳，其异构体活性不同	作用于疟原虫的红细胞内期裂殖体，有解热作用和子宫收缩作用。控制疟疾的症状
本芬醇	苯基取代的茛醇； α -(二正丁基胺甲基)-2,7-二氯-9-(对-氯苯亚甲基)-4-茛甲醇	杀灭疟原虫红细胞内期无性体。用于恶性疟疾

(2) 氨基喹啉类 代表药：磷酸氯喹、磷酸伯氨喹。

共同结构特点：在 6 位连有甲氧基，在 8 位连有 1-甲基-4-氨基丁基。

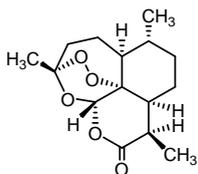
药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
磷酸氯喹	以 4-氨基喹啉为母体；	①有一个手性碳，使用外消旋体；②易溶于水，水溶液呈酸性	分子插入疟原虫 DNA 双螺旋链之间，形成稳定的复合物，从而影响 DNA 复制。控制疟疾的传播和复发。
磷酸伯氨喹	以 8-氨基喹啉为母体；	对于良性疟疾红细胞外期裂殖子中的各型疟原虫配子体有较强的杀灭作用，因而用于控制良性疟的复发和阻碍疟疾的传播。只能口服。	



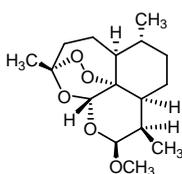
(3) 2, 4-二氨基嘧啶类 代表药物：乙胺嘧啶

药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
乙胺嘧啶	以 2, 4-二氨基嘧啶为母体；6-乙基-5-(4-氯苯基)-2, 4-嘧啶二胺	含有共价键氯原子，在与碳酸钠灼灼后，其水溶液显氯离子反应	可抑制二氢叶酸还原酶，使疟原虫的繁殖受到抑制。临床主要为疟疾预防用药

(4) 青蒿素类 代表药：青蒿素、蒿甲醚。



青蒿素



蒿甲醚

药名	结构特点	理化性质	临床用途
青蒿素	为天然倍半萜内酯类	①分子中含有过氧键，遇淀粉碘化钾试液显紫色；②内酯键在氢氧化钠水溶液中加热可水解，遇盐酸羟胺试液及三氯化铁试液生成深紫红色。	高效、速效抗疟药，复发率高
蒿甲醚	青蒿素酯羰基还原成醇的甲醚衍生物		为半合成药物，活性比青蒿素强

第十一章 抗肿瘤药物

一、抗肿瘤药的分类

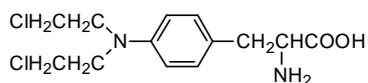
①烷化剂；② 抗代谢药；③抗肿瘤天然药物及其半合成衍生物；④ 其他抗肿瘤药物。

二、烷化剂

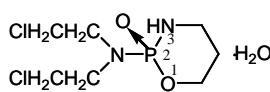
生物烷化剂的定义。生物烷化剂属于细胞毒类药物。

分类 ①氮芥类；②乙撑亚胺类；③亚硝基脲类；④甲磺酸酯及多元醇类；⑤金属配合物抗肿瘤药物。

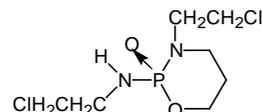
1. 氮芥类 代表性药物 美法仑、环磷酰胺、异环磷酰胺



美法仑



环磷酰胺

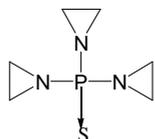


异环磷酰胺

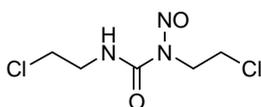
药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
美法仑	化学结构包括氮芥和 L-苯丙氨酸部分	①氮芥易在碱性水溶液中水解②氨基酸与茛三酮的显色反应。	抗肿瘤
环磷酰胺	氧氮磷杂环己烷为母体，在磷上连有双(β-氯乙基)，磷成氧化物 P-[N, N-双(β-氯乙基)]-1-氧-3-氮-2-磷杂环己烷-P-氧化物一水合物。	水溶液不稳定，遇热更易分解；含一个结晶水为固体，失去结晶水即液化	前药，临床抗癌谱较广，对正常细胞和肿瘤细胞有一定选择性，毒性较小。
异环磷酰胺	环磷酰胺一个氯乙基与 3 位氮上氢互换	前体药物，体内经酶代谢活化后发挥抗肿瘤作用	

2. 乙撑亚胺类 代表性药物塞替派

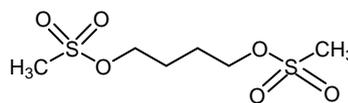
药名	结构特点	理化性质	临床用途
塞替派	以乙撑亚胺为母体	结构中含有硫代磷酰基，脂溶性大，对酸不稳定，不能口服，需静脉给药。	前体药物，体内代谢生成替派而起作用。治疗膀胱癌的首选药



塞替派



卡莫司汀



白消安

3. 亚硝基脲类 代表性药物卡莫司汀

药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
卡莫司汀	1, 3-双(2-氯乙基)-1-亚硝基脲	酸碱稳定性差，分解放出氮气和二氧化碳	广谱抗肿瘤活性，易通过血脑屏障进入脑脊液，适用于脑瘤，中枢神经系统肿瘤及恶性淋巴瘤等的治疗。

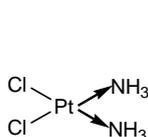
4. 甲磺酸酯及多元醇类 代表性药物白消安

药名	结构特点	化学名	理化性质	临床用途
白消安	1, 4-丁二醇为母体，并成二甲磺酸酯	1, 4-丁二醇二甲磺酸酯	酯结构，在氢氧化钠水溶液中，可水解并生成丁二醇，再经分子内脱水生成四氢呋喃	双功能烷化剂。可口服使用，且吸收良好。临床主要用于慢性粒细胞性白血病的治疗

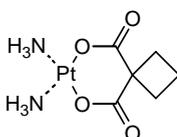
5. 金属配合物抗肿瘤药

临床使用的金属配合物抗肿瘤药主要指的是金属铂的配合物。

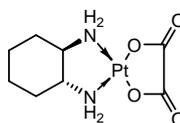
代表性药物：顺铂、卡铂、奥沙利铂。



顺铂



卡铂



奥沙利铂

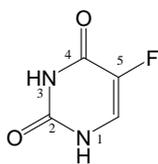
药名	结构特点	理化性质	临床用途
顺铂	为无机氨和氯负离子与金属铂的顺式配合物	①亮黄色或橙黄色结晶性粉末；②静脉给药，供药用的是含有甘露醇和氯化钠的冷冻干燥粉；③加热至 170° 转化为反式，270° 熔融同时分解成金属铂；④对光和空气不敏感；⑤水溶液不稳定，发生水解及构型转换，最终生成毒性物，但毒性产物在 0.9%氯化钠溶液中不稳定，可转换为顺铂，不会导致临床中毒	治疗各种癌症，为治疗睾丸癌和卵巢癌的一线药物
卡铂	为无机氨和环丁二羧酸负离子与金属铂的配合物 注意：第二代铂配合物		毒性低。抗肿瘤效果比顺铂好
奥沙利铂	草酸根合铂，含有手性 注意：第一个上市的抗肿瘤手性铂配合物		对结肠癌有较好疗效

三、抗代谢药

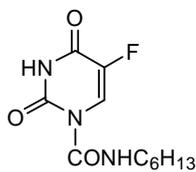
通过抑制肿瘤细胞的生存和复制所必需的代谢途径，导致肿瘤细胞死亡。

1 按照结构类型不同的分类 ①嘧啶类（尿嘧啶类、胞嘧啶类）②嘌呤类；③叶酸类。

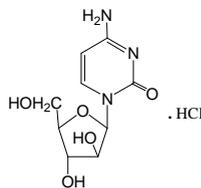
2. 嘧啶类 代表性药物：氟尿嘧啶、阿糖胞苷、卡莫氟



氟尿嘧啶



卡莫氟

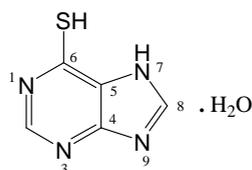


阿糖胞苷

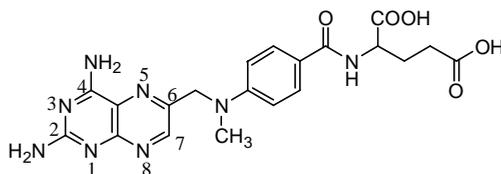
药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
氟尿嘧啶	以尿嘧啶为母体，在 5 位连有氟。 5-氟-2, 4 (1H, 3H)-嘧啶二酮	亚硫酸钠水溶液中不稳定。在强碱性条件下，可在 3, 4 位间开环。	抗肿瘤谱广，治疗实体肿瘤的首选药
阿糖胞苷	以胞嘧啶为母体，在 1 位连有 1-β-D-阿拉伯呋喃糖基 1-β-D-阿拉伯呋喃糖基-4-氨基-2 (1H)-嘧啶酮盐酸盐	在体内转化为活性的三磷酸阿糖胞苷发挥抗癌作用。主要用于治疗急性粒细胞白血病。与其他抗肿瘤药物合用可提高疗效。口服吸收差，需静脉滴注给药	
卡莫氟	为氟尿嘧啶衍生物，氟尿嘧啶的 1 位氢被 N-正己氨基甲酰基取代。	是氟尿嘧啶的前体药物，在体内水解成氟尿嘧啶，临床尤其对结肠癌、直肠癌有较高疗效。	

3. 嘌呤类 代表性药物：巯嘌呤：

药名	结构特点	化学名	临床用途
巯嘌呤	将黄嘌呤 6 位羟基以巯基取代得巯嘌呤	6-嘌呤硫醇一水合物	在体内代谢为有活性的 6-巯代次黄嘌呤（硫代肌苷酸），抑制腺酰琥珀酸合成酶。用于各种急性白血病的治疗



巯嘌呤



甲氨蝶呤

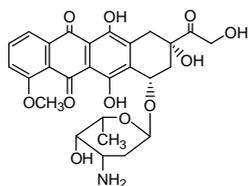
4. 叶酸类 代表性药物：甲氨蝶呤：

药名	结构特点	理化性质	临床用途
甲氨蝶呤	以蝶啶为母体，在 2, 4 位连有二氨基，6 位连有甲氨基，在甲氨基的氮原子上连有苯甲酰谷氨酸	在强酸性水溶液中不稳定，苯甲酰基水解生成谷氨酸和蝶呤酸，并失去抗癌活性	叶酸拮抗剂，可与二氢叶酸还原酶结合，抑制 DNA 和 RNA 的合成，阻止肿瘤细胞的生长，产生抗肿瘤作用。主要用于急性白血病、绒毛膜上皮癌、恶性葡萄胎等的治疗

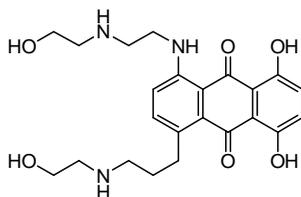
四、抗肿瘤天然药物及其半合成衍生物

1. 按照来源不同的分类 ① 抗肿瘤抗生素；② 抗肿瘤植物药有效成分

2. 抗肿瘤抗生素 代表性药物：阿霉素、米托蒽醌。



阿霉素



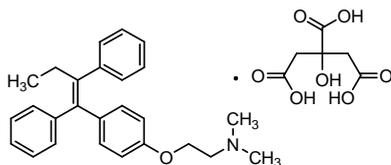
米托蒽醌

药名	结构特点	理化性质	临床用途
阿霉素	阿霉酮通过糖苷键与柔红糖胺相连	蒽环糖苷抗生素。具有脂溶性蒽环配基和水溶性柔红糖胺，又有酸性酚羟基和碱性氨基	为广谱抗肿瘤药
米托蒽醌	9, 10-蒽二酮为母体，在1, 4-位分别连有羟基，5, 8位分别连有2-羟乙基[（氨乙基）氨基]		为细胞周期非特异性药物

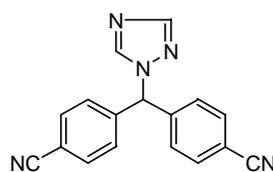
3. 抗肿瘤植物药有效成分及其衍生物

药名	临床用途
长春新碱	含有三个碱性中心。作用于微管蛋白，还可以干扰蛋白质代谢，临床用于急慢性白血病、小细胞肺癌、睾丸癌等的治疗
紫杉醇	广谱抗肿瘤药，临床治疗乳腺癌、卵巢癌有效率较高
依托泊苷	鬼臼生物碱类，对单核细胞白血病有效，为小细胞肺癌化疗首选药
替尼泊苷	鬼臼生物碱类，能透过血脑屏障，为脑瘤首选药。

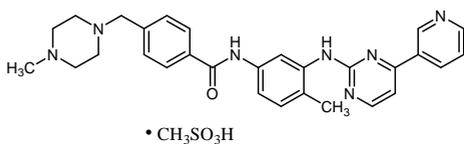
五、其他抗肿瘤药 代表性药物： 枸橼酸他莫昔芬、来曲唑、甲磺酸伊马替尼、吉非替尼。



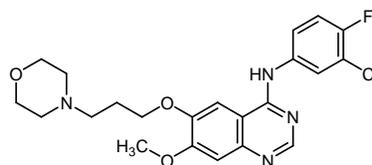
枸橼酸他莫昔芬



来曲唑



甲磺酸伊马替尼



吉非替尼

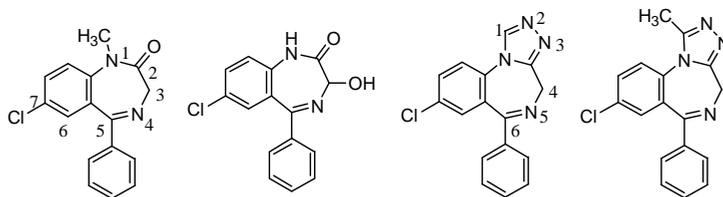
药名	结构特点	临床用途
枸橼酸他莫昔芬	三苯乙烯类化合物	①抗雌激素药，为治疗绝经后晚期乳腺癌的一线药物
来曲唑	含1, 2, 4-三氮唑结构	为芳香化酶抑制剂，治疗抗雌激素治疗无效的晚期乳腺癌
甲磺酸伊马替尼		抑制多条酪氨酸激酶受体通路，治疗慢性粒细胞白血病
吉非替尼		表皮生长因子受体酪氨酸激酶抑制剂。

第十二章 镇静催眠药及抗焦虑药

一、苯二氮卓类

特点：副作用和成瘾性较巴比妥类小，为镇静、催眠、抗焦虑药物的首选药物。

代表药物：地西洋、奥沙西洋、艾司唑仑、阿普唑仑。



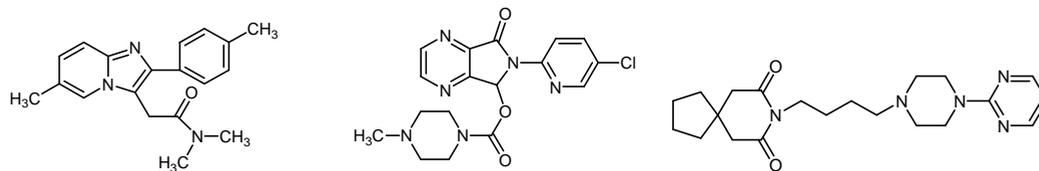
地西洋 奥沙西洋 艾司唑仑 阿普唑仑

药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
地西洋（安定）	以1,4-苯并二氮杂卓为母体(卓环为七元环)，7位有氯；	在酸性下，西洋类1,2位酰胺键和4,5位亚胺键可水解开环	镇静、抗焦虑作用
奥沙西洋（舒宁、去甲羟安定）	地西洋的活性代谢物。右旋强于左旋，临床使用消旋体；	1,2位酰胺键在酸性下加热水解开环后生成芳香伯胺，可发生芳香伯胺显色反应，地西洋的活性代谢物，副作用很轻	
艾司唑仑	三氮唑	酸性下，西洋类1,2位酰胺键和4,5位	镇静催眠药
阿普唑仑	在艾司唑仑三氮唑环上带上一个甲基；	亚胺键可水解开环。唑仑类因1,2位并合三唑环，不能发生水解。	

体内代谢 在西洋类的3位和唑仑类的4位可发生羟化反应，生成的羟基可与葡萄糖醛酸结合而排出体外；地西洋的1位可发生N-脱甲基反应,C-3羟基化；奥沙西洋为地西洋的活性代谢物。

鉴别：奥沙西洋 1,2位酰胺键在酸性下加热水解开环后生成芳香伯胺，经重氮化后可与β-萘酚偶合，生成橙色偶氮物，放置过程中色渐变深。而地西洋1,2位酰胺键水解开环后生成仲胺，不能发生重氮化和偶合显色反应。

二、其他类 代表性药物唑吡坦、佐匹克隆、丁螺环酮



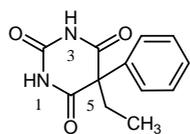
唑吡坦 佐匹克隆 丁螺环酮

药名	结构特点	临床用途
唑吡坦	含有咪唑并吡啶结构	为镇静催眠药，可选择性地作用于苯二氮卓ω1受体
佐匹克隆	哌嗪并吡咯酮类药物	第三代催眠药。作用于GABA _A 受体-氯离子通道复合物
丁螺环酮	具有螺环结构	抗焦虑药，被认为是特异性的突触5-HT _{1A} 受体激动剂

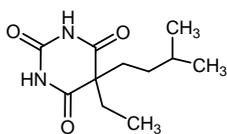
第十三章 抗癫痫及抗惊厥药

癫痫是由于大脑局部神经元过度兴奋，产生的阵发性放电。所导致的慢性、反复性和突发性的脑功能失调。

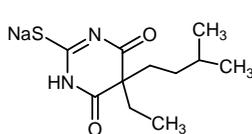
一、 巴比妥类及其类似物 代表性药物：苯巴比妥、异戊巴比妥、硫喷妥钠、苯妥英钠



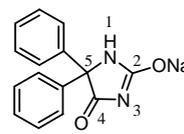
苯巴比妥



异戊巴比妥



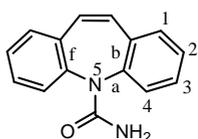
硫喷妥钠



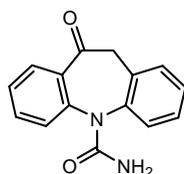
苯妥英钠

药名	化学名	理化性质	临床用途
苯巴比妥	5-乙基-5-苯基-2,4,6-三咪唑啉酮	①呈弱酸性可制成钠盐，化合物成碱性，水溶液暴露在空气可吸收空气中的二氧化碳可慢慢析出巴比妥类药物；②易水解开环，生成苯基丁酰脲并失效；③分子中含有-CONHCONHCO-结构，与吡啶和硫酸铜溶液反应显紫色。含硫巴比妥（硫喷妥）遇此试剂显绿色；④与亚硝酸钠和硫酸反应产生橙黄色。这一反应是苯环上的亚硝基化反应。	适于癫痫大发作的治疗
异戊巴比妥		5位取代的异戊基在体内比苯基代谢要快；为中等时间的催眠与抗惊厥药	
硫喷妥钠		为异戊巴比妥2位氧原子以硫替换得到的药物，药物脂溶性增大，易通过血脑屏障，作用快。但硫易被代谢，失效也快	超短时
苯妥英钠	5,5-二苯基-2,4-咪唑啉二酮钠盐	① 强碱弱酸盐，苯妥英钠水溶液显碱性，可吸收空气中的二氧化碳，出现混浊，密闭保存；② 水溶液在碱性下加热水解开环，生成α-氨基二苯乙酸和氨。注意：① 苯妥英钠代谢主要生成5位一个苯基的羟化物及开环产物，并可与葡萄糖醛酸结合排出体外。② 苯妥英钠代谢有“饱和代谢动力学”特性，若在短期内反复用药或大量使用时，可使代谢速度明显下降，从而产生毒性。	为癫痫大发作的首选
巴比妥类结构特点	苯巴比妥和异戊巴比妥均以巴比妥酸为母体，在5位上连有两个取代基，其中一个是乙基。其化学结构类型属于丙二酰脲类。硫喷妥钠化学结构类型属于丙二酰硫脲类。		

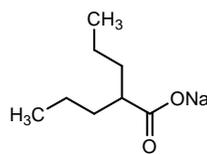
二、其他类 代表性药物：卡马西平、奥卡西平、丙戊酸钠：



卡马西平



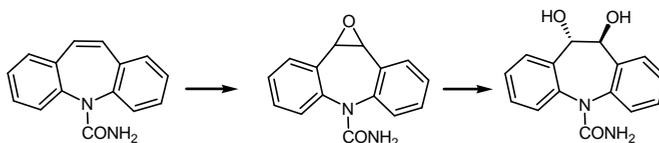
奥卡西平



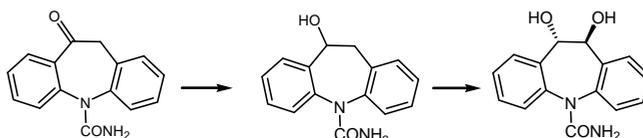
丙戊酸钠

药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
卡马西平	为二苯并氮杂卓类；5H-二苯并[b, f]氮杂卓-5-甲酰胺	光照变质，部分环化形成二聚体和氧化成10,11-环氧卡马西平，故需要避光保存	为广谱抗癫痫药，但偶见严重的皮肤过敏反应
奥卡西平	为氧代卡马西平		
丙戊酸钠	脂肪酸类；2-丙戊酸钠	广谱抗癫痫药，能抑制γ-氨基丁酸(GABA)的代谢，提高脑内GABA的浓度，抑制癫痫性冲动的扩散。适于其他药物无效的癫痫症的治疗。	

1. 注意：卡马西平体内代谢过程



2. 注意：奥卡西平体内代谢过程

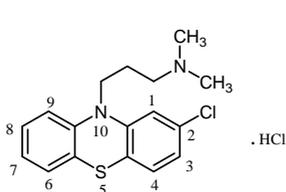


第十四章 抗精神失常药

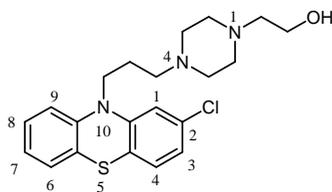
抗精神失常药包括抗精神病药和抗抑郁药。主要分为吩噻嗪类、噻吨类、二苯并氮杂卓类、丁酰苯类及其他类。代表性药物：盐酸氯丙嗪、奋乃静、舒必利、氟西汀。

一、抗精神病用药

1. 吩噻嗪类代表性药物 盐酸氯丙嗪、奋乃静



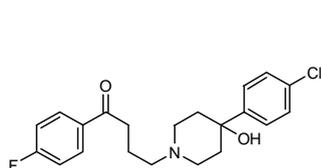
盐酸氯丙嗪



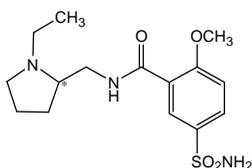
奋乃静

药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
盐酸氯丙嗪 (又名冬眠灵)	以吩噻嗪为母体； N,N-二甲基-2-氯-10H-吩噻嗪-10-丙胺盐酸盐	吩噻嗪环易被氧化，在空气中及光照下容易变成红色，因此注射剂中加入氢醌、连二亚硫酸钠、亚硫酸氢钠或VC等抗氧剂	为多巴胺的抑制剂，服药病人在光照下发生光毒化过敏反应
奋乃静	以吩噻嗪为母体，含有哌嗪环； 4-[3-(2-氯吩噻嗪-10-基)丙基]-1-哌嗪乙醇		吩噻嗪类抗精神病药物，两者均有一定的锥体外系副作用。

2. 其他类药物 代表药物：氟哌啶醇、舒必利



氟哌啶醇



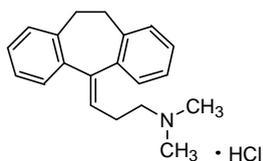
舒必利

药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
氟哌啶醇	1-(4-氟苯基)-4-[4-(4-氯苯基)-4-羟基-1-哌啶基]-1-丁酮	光照射颜色改变； 105°C 干燥发生部分降解	为丁酰苯类抗精神病药，活性强、锥体外系副作用大

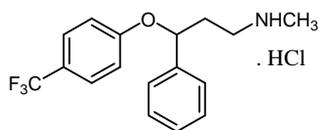
舒必利	有一手性碳原子，其中左旋体有活性； N-[(1-乙基-2-吡咯烷基)甲基]-2-甲 氧基-5-(氨基磺酰基)-苯甲酰胺	极易溶于氢氧化 钠；须避光密闭保 存	为一新型抗精神病药，抗精神分裂症抗抑 郁作用，锥体外系等副作用较轻
-----	---	--------------------------	--------------------------------------

二、抗抑郁药

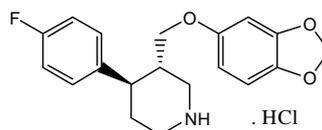
代表药物：盐酸阿米替林、盐酸氟西汀、盐酸帕罗西汀



盐酸阿米替林



盐酸氟西汀



盐酸帕罗西汀

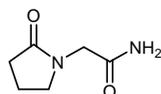
药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
盐酸阿米替林	二苯并环庚烯类（又称作三环类）抗抑郁药	代谢生成的 N-脱甲基物仍有活性，	去甲肾上腺素重摄取抑制剂。适用于内因性精神抑郁症
氟西汀	(±) N-甲基-[3-苯基-3-(4-三氟甲基苯氧基)-丙胺]盐酸盐	口服抗抑郁药。通过选择性抑制中枢神经对 5-羟色胺的再吸收起作用。代谢产物 N-去甲氟西汀仍有活性，为临床广泛使用的重要的抗抑郁药	
盐酸帕罗西汀	含有二恶茂结构，哌啶上有两个手性中心	口服抗抑郁药。选择性抑制中枢神经对 5-羟色胺的再吸收起作用。副作用小。	

第十五章 改善脑功能的药物

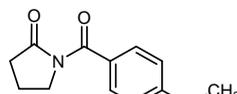
一、酰胺类中枢兴奋药

结构特点：具有五元环内酰胺类结构。为 γ -氨基丁酸(GABA)的衍生物。

代表性药物：吡拉西坦、茴拉西坦



吡拉西坦

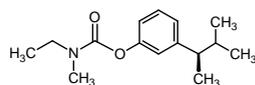


茴拉西坦

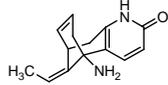
药名	化学名称/代谢	临床用途
吡拉西坦（脑复康、吡乙酰胺）	2-氧代-1-吡咯烷基乙酰胺	脑功能改善药
茴拉西坦	肝脏代谢，产物为 N-茴香酰-GABA	

二、乙酰胆碱酯酶抑制剂

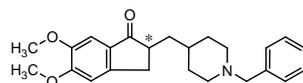
代表性药物：利斯的明、石杉碱甲、氢溴酸加兰他敏、多奈哌齐



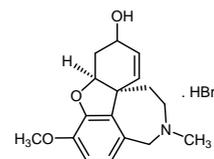
石杉碱甲



多奈哌齐



氢溴酸加兰他敏



利斯的明

药名	结构特点、化学名及理化性质	临床用途
利斯的明	氨基甲酸酯类, 含有酯基在碱水中可水解	选择性乙酰胆碱酯酶抑制剂。用于老年痴呆
石杉碱甲	为天然生物碱, 由吡啶-2-酮与二个六元酯环组成, 环外连有一丙烯基和伯氨基	治疗重症肌无力, 改善脑功能, 对脑血管硬化, 血管性或早老性记忆障碍均有改善
氢溴酸加兰他敏	四环结构; 治疗脊髓灰质炎后遗症, 肌肉萎缩及重症肌无力等, 儿童脑型麻痹。	
盐酸多奈哌齐	由二甲氧基二氢茛菪酮与 1-苯甲基哌啶-4-甲基组成; 2, 3-二氢-5, 6-二甲氧基-2-[1-(苯甲基)-4-哌啶基]甲基-1H-茛菪酮盐酸盐	对乙酰胆碱酯酶具有高度专一性, 用于老年痴呆症

第十六章 镇痛药

镇痛药按照来源可分为三大类: ①吗啡生物碱类, 代表性药物为吗啡; ②半合成镇痛药, 代表性药物为二氢埃托啡等; ③全合成镇痛药(又可分为吗啡喃类、苯吗喃类、哌啶类、氨基酮类、其他类), 代表性药物为盐酸哌替啶等。

一、作用于阿片受体的镇痛药

可使疼痛减轻或消除, 作用于阿片受体, 抑制痛觉中枢, 常具有成瘾性和耐受性, 大部分属于“国家麻醉药管理条例”进行管制的药物

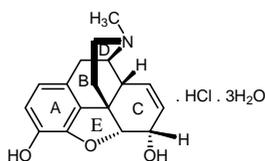
1. 吗啡生物碱类 盐酸吗啡

药名	结构特点	化学名称	临床用途
盐酸吗啡	以部分氢化的菲环为母体, 由五个稠杂环组成的刚性分子。5 个手性中心, 天然存在的吗啡为左旋体	17-甲基-3-羟基-4, 5 α -环氧-7, 8-二脱氢吗啡喃-6 α -醇盐酸盐三水合物	用于抑制由多种疾病引起的剧烈疼痛。亦用于麻醉前给药

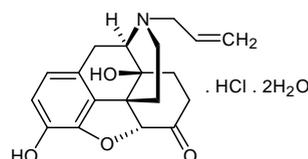
吗啡的理化性质

① 含酚羟基和叔氮原子显酸碱两性, 可与多种无机酸形成盐; ② 有左旋光性; ③ 在光照和空气存在下, 易发生氧化生成伪吗啡(吗啡二聚体, 毒性大)和 N-氧化吗啡并失效; ④ 水溶液在酸性下较稳定, 在中性和碱性下易氧化, 且光照或铁离子可促进氧化反应, 注射剂需要加稳定剂; ⑤ 在酸性水溶液中加热, 可发生脱水 and 重排转变成阿扑吗啡, 具有催吐作用; ⑥ 两个显色反应(Marquis 反应, Frohde 反应)。

本品具有成瘾性, 属于麻醉性镇痛药, 按国家法令进行管理。



盐酸吗啡



盐酸纳洛酮

2. 半合成镇痛药 以产自罂粟科植物生物碱的吗啡或蒂巴因为原料, 经结构修饰或改造而制得。代表性药物有可待因、氢吗啡酮、二氢埃托啡、丁丙诺啡等。

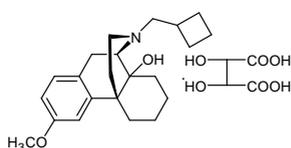
3. 吗啡受体拮抗剂的代表性药物 盐酸纳洛酮

药名	结构特点	临床用途
盐酸纳洛酮	在吗啡结构的基础上, 在 N 原子上引入烯丙基得到	吗啡受体拮抗剂纳洛酮及纳曲酮临床用作阿片类药物中毒的解救药

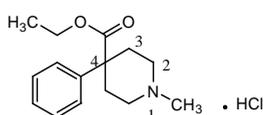
4. 合成镇痛药 结构类型及品种较多, 有的镇痛作用强于吗啡, 但绝大多数品种仍或多或少地表现出一定的成瘾性。

(1) 吗啡喃类代表药: 酒石酸布托啡诺

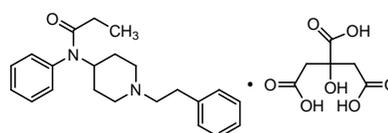
药名	结构特点	临床用途
酒石酸布托啡诺	吗啡结构改造中打开 E 环, 并将双键饱和, 醇羟基由 6 位转移到 14 位, N 上有环丁基甲基取代	用于中度和重度疼痛的镇痛, 也作为麻醉的辅助用药



酒石酸布托啡诺



盐酸哌替啶

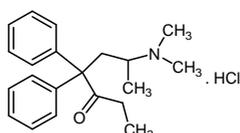


枸橼酸芬太尼

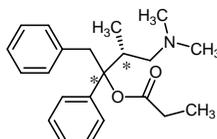
(2) 哌啶类代表性药物 盐酸哌替啶、枸橼酸芬太尼。合成镇痛药。

药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
盐酸哌替啶	哌啶环为母体; 1-甲基-4-苯基-4-哌啶甲酸乙酯盐酸盐	①水溶液用碳酸钠等碱化析出油滴状哌替啶; ②苯基对酯基水解有一定的空间阻碍作用, 通常条件下不易水解; ③注射给药	盐酸哌替啶镇痛活性仅为吗啡的 1/10, 成瘾性较弱
枸橼酸芬太尼	哌替啶结构改造后得到的镇痛药; N-[1-(2-苯乙基)-4-哌啶基]-N-苯基-丙酰胺枸橼酸盐		镇痛效力强, 成瘾性也强

(3) 氨基酮类及其类似物的代表性药物 盐酸美沙酮、右丙氧芬。



盐酸美沙酮



右丙氧芬

药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
盐酸美沙酮	3-庚酮结构	①含有一个手性中心, 左旋体活性大于右旋体, 临床使用消旋体; ②水溶液不稳定	①镇痛作用强, 并有一定镇咳作用; ②其代谢物仍有镇痛活性, 作用时间较长; ③成瘾性小, 临床上用于戒除海洛因成瘾的替代疗法; ④阿片 μ 受体激动剂。
右丙氧芬	结构中含有二个手性中心, 右丙氧芬为有止痛作用的右旋体, 左旋体有止咳作用		镇痛活性较弱, 适于轻中度疼痛的止痛

(4) 其他合成镇痛药 结构类型各异, 代表性药物有盐酸布桂嗪、苯噻啶、盐酸曲马多。



药名	结构特点	临床用途
盐酸布桂嗪	以哌嗪为母体，两个 N 原子上分别连有肉桂基和丁酰基	盐酸布桂嗪镇痛活性约为吗啡的 1/3，用药后起效迅速为其特点
苯噻啶	由苯环、噻吩、哌啶和一个七元脂环组成	为组胺 H1 受体拮抗剂，有镇静作用，临床主要用于偏头痛的防治
盐酸曲马多	以环己醇为母体，二个手性中心，反式取代，临床使用外消旋体	微弱 μ 受体激动剂，并抑制去甲肾上腺素和 5-HT 的重摄取阻断疼痛的传导。活性大于吗啡，但副作用较小

5. 镇痛药的构效关系：绝大多数临床使用的镇痛药在构效关系上符合阿片受体的三点结合学说。构效关系归结如下：①有一碱性中心，在生理 pH 下可电离成阳离子，并可与受体表面阴离子结合；②具有苯环，可与受体平坦区通过范德华力结合；③突出于吗啡环平面的碳 15, 16 位的亚乙基与受体凹槽结合。

第十七章 影响胆碱能神经系统的药物

一、拟胆碱药和抗胆碱药按照作用机制不同的分类

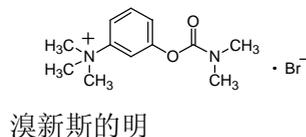
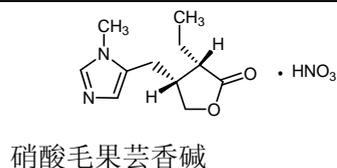
拟胆碱药分为：①胆碱受体激动剂；②乙酰胆碱酯酶抑制剂；

抗胆碱药分为：①M 胆碱受体拮抗剂；②N₁胆碱受体拮抗剂；③N₂胆碱受体拮抗剂。

二、拟胆碱药

1. 胆碱受体激动剂 代表性药物：硝酸毛果芸香碱：

药名	结构特点	理化性质	临床用途
硝酸毛果芸香碱	由咪唑环与 γ -丁内酯环通过亚甲基相连组成，含有二个手性碳	天然产物生物碱，遇光易变质	具有 M 胆碱受体激动作用，临床治疗原发性青光眼



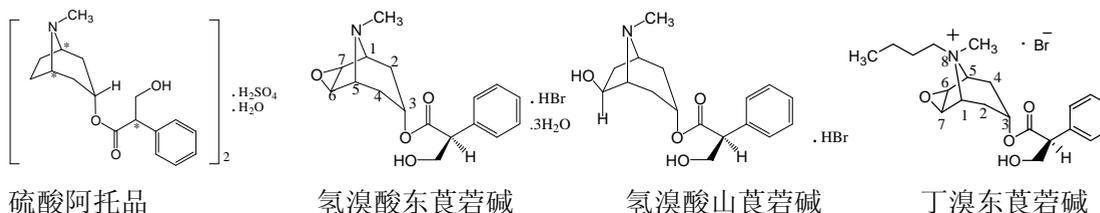
2. 乙酰胆碱酯酶抑制剂 代表性药物：溴新斯的明、氢溴酸加兰他敏、石杉碱甲、多奈哌齐、利斯的明

药名	结构特点	化学名称	理化性质	临床用途
溴新斯的明	含有氨基甲酸酯结构，季铵盐	溴化-N, N, N-三甲基-3-[(二甲氨基)甲酰氧基]苯铵	酯基在碱水中可水解	可逆性胆碱酯酶抑制剂，用于重症肌无力，腹胀气及尿潴留，中毒时用阿托品对抗

三、抗胆碱药

1. M胆碱受体拮抗剂 分类：①莨菪生物碱类；②合成的M胆碱受体拮抗剂。

(1) 莨菪生物碱类 代表性药物：硫酸阿托品、氢溴酸东莨菪碱、氢溴酸山莨菪碱、丁溴东莨菪碱。



药名	结构特点	理化性质	临床用途
硫酸阿托品	莨菪碱和莨菪酸合成的莨菪酯。含有 3 个手性中心，天然的阿托品左旋的拮抗性能比右旋体好，但中枢毒副作用也大，因此临床用其消旋体，安全性好	①含有叔胺有碱性，水溶液可使酚酞变红；②碱性条件下易水解；	抗胆碱药，对 M1, M2 受体均有作用，用于绞痛，有机磷中毒，眼科用于散瞳
氢溴酸东莨菪碱	天然生物碱。东莨菪碱在托品烷的 6, 7 位有一个环氧基，脂溶性升高	中枢副作用明显，临床主要作为镇静药	
氢溴酸山莨菪碱	天然生物碱。6-羟基增加了药物的极性，难于透过血脑屏障	又称 654-1, 654-2；适用于感染性中毒休克，血管性疾病，各种神经痛以及平滑肌痉挛等疾病	
丁溴东莨菪碱（解痉灵）	3-羟基与莨菪酸（托派）成酯，6, 7 位为环氧，8 位连有正丁基，季铵的溴化物，6 个手性碳。	东莨菪碱季铵化得到的药物，对中枢作用较弱，系外周抗胆碱药	用于各种病因引起的胃肠道痉挛、胆绞痛、肾绞痛

共同结构特点 均含托品环（又称莨菪醇），羟基成取代的苯乙酸酯，区别在于 6, 7 位所连的官能团不同，同时 8 位氮上的取代基也可不同。

注意：与阿托品比较，山莨菪碱在托品环的 6 位有羟基，极性增大；东莨菪碱在 6, 7 位有环氧环，极性增大；因此，极性大小的顺序是：山莨菪碱 > 阿托品 > 东莨菪碱；中枢作用强弱的顺序与其极性的顺序相反。

(2) 合成的 M 胆碱受体拮抗剂 合成 M 胆碱受体拮抗剂结构中含有“氨基醇”结构。

代表性药物：溴丙胺太林（普鲁本辛）

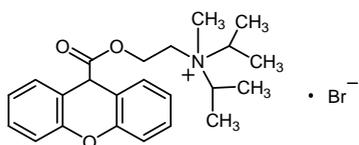
药名	结构特点	化学名	临床用途
溴丙胺太林（普鲁本辛）	以氧蒽为母体，在 9 位的羧基与取代的氨基乙醇成酯	溴化 N-甲基-N-(1-甲基乙基)-N-[2-(9H-占吨-9-甲酰氧基)乙基]-2-丙胺	有抑制胃肠道分泌的作用。因含季铵盐结构，中枢副作用小

2. N₁胆碱受体拮抗剂

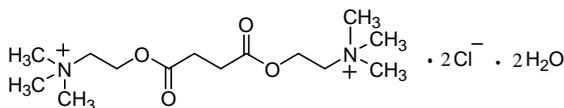
3. N₂胆碱受体拮抗剂 作用于骨骼肌神经接头处的运动终板膜上的乙酰胆碱 N₂受体，使神经冲动受阻，导致随意肌的松弛，临床作为肌肉松弛药。

(1) 外周性肌肉松弛药 代表性药物：氯化琥珀胆碱、苯磺酸阿曲库铵、泮库溴铵。

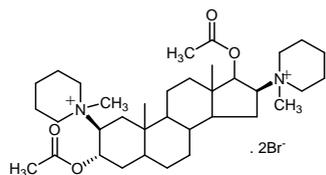
共同结构特点 两个季铵相距十几个碳原子的位置



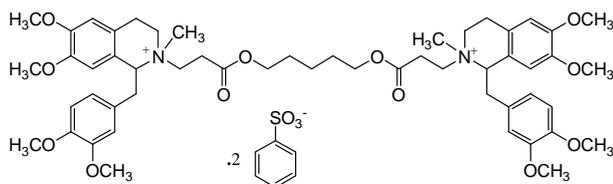
溴丙胺太林



氯化琥珀胆碱



泮库溴铵



苯磺酸阿曲库铵

药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
氯化琥珀胆碱	以琥珀酸为母体，与两分子氯化胆碱成酯；二氯化 2, 2' -[(1, 4-二氧-1, 4-亚丁基) 双(氧)] 双[N, N, N-三甲基乙铵] 二水合物	结构中含酯基，固体稳定，水溶液可水解，碱性下水解加快，故不能与碱性药物合用	为去极化型外周骨骼肌松弛药
苯磺酸阿曲库铵	四氢异喹啉类药物，具有双季铵结构，有 4 个手性中心。分子结构具有对称性。季铵氮上有较大的基团	可以在生理条件下发生 Hofmann 消除反应。避免了酶催化的代谢过程，副作用小	非去极化型肌肉松弛药
泮库溴铵	天然的具有雄甾母核的季铵生物碱经改造而得，在结构的环 A 和环 D 部分，各存在一个乙酰胆碱样的结构片段		甾体类非去极化型肌肉松弛药

第十八章 影响肾上腺素能神经系统的药物

作用于肾上腺素能受体药物的分类

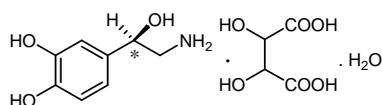
- 按照作用机制分为二类：(1) 拟肾上腺素药；(2) 肾上腺素受体阻断药。
- 肾上腺素能受体分为： α 受体（包括 α_1 和 α_2 亚型）； β 受体（包括 β_1 和 β_2 亚型）。

一、拟肾上腺素药

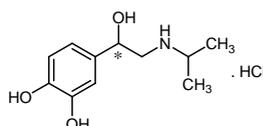
基本化学结构 β -苯乙胺，当 β -苯乙胺 α 碳上连接有羟基时，连羟基碳原子具有手性，其立体构型对活性有显著影响。*R* 构型的左旋体生物活性较强。本类药物国家按照一类精神药品进行管理。

1. 儿茶酚胺类

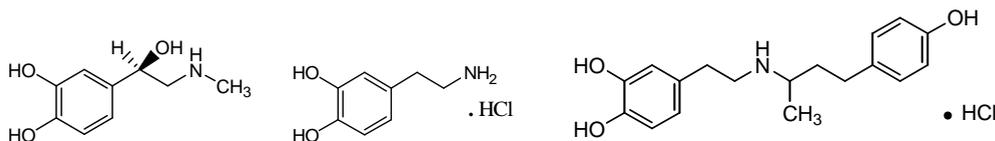
肾上腺素、盐酸多巴胺、重酒石酸去甲肾上腺素、盐酸异丙肾上腺素、盐酸多巴酚丁胺



重酒石酸去甲肾上腺素



盐酸异丙肾上腺素



肾上腺素

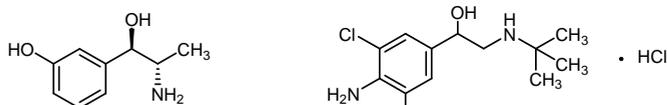
盐酸多巴胺

盐酸多巴酚丁胺

共同结构特点	即以儿茶酚（邻苯二酚）为母体，在一个酚羟基的对位连有乙醇胺		
共同理化性质	均含儿茶酚结构，易氧化变色并聚合，在碱性下或铁、铜等金属存在下，氧化更快		
体内代谢特点	MAO 脱氨基形成醛，COMT 催化甲基化		
药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
重酒石酸去甲肾上腺素	去甲基，含有一个手性中心； (R) -4- (2-氨基-1-羟基乙基) -1, 2-苯二酚重酒石酸盐一水合物	含手性碳，临床使用 R 型左旋体。在一定条件下可消旋化	有升高血压的作用，临床用于休克时的抢救
盐酸异丙肾上腺素	N 上异丙基取代； 4-[(2-异丙氨基-1-羟基) 乙基] -1, 2-苯二酚盐酸盐	经注射或制成喷雾剂给药容易吸收	β-受体激动剂。用于支气管哮喘
肾上腺素	含有一个手性碳，临床使用 R 型左旋体。可发生消旋化	对 α 和 β 受体都有激动作用。临床上用于急救。	
盐酸多巴胺	化学结构中无手性； 4-[(2-氨基乙基) -1, 2-苯二酚盐酸盐	多巴胺受体激动剂，β 受体激动剂，也有一定的 α 受体激动作用。临床上用于休克	
盐酸多巴酚丁胺	含有一个手性碳； 两对映异构体均对 β 1 受体有选择性激动作用，左旋体对 α 1 受体有激动作用，右旋体对 α 1 受体有阻断作用。	临床使用外消旋体。临床用于治疗器质性心脏病所发生的心力衰竭	

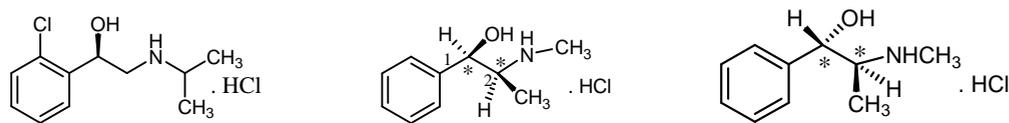
2. 非儿茶酚胺类

代表性药物：酒石酸间羟胺、盐酸克仑特罗、盐酸氯丙那林、盐酸麻黄碱、盐酸伪麻黄碱。



间羟胺

盐酸克仑特罗



盐酸氯丙那林

盐酸麻黄碱

盐酸伪麻黄碱

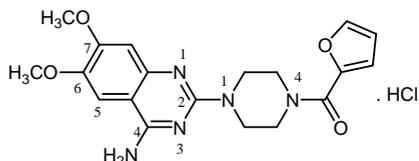
共同特点	均含有苯乙醇胺结构，无儿茶酚结构，不易被氧化		
药名	结构特点及化学名	临床用途	
重酒石酸间羟胺	激动 α 受体，有升压作用，临床用作抗休克及手术引起的低血压等		
盐酸克仑特罗 俗称“瘦肉精”	3, 5 位被氯原子所取代，不被 COMT 甲基化，口服有效	选择性 β 2 受体激动剂，支气管扩张作用极强，用量很小	
盐酸氯丙那林	又名氯喘通	选择性 β 受体激动剂，亦用于抗哮喘	
盐酸麻黄碱	以苯丙烷为母体，1, 2 位两个手	(1R, 2S) -2-甲氨基-苯丙烷-1-醇盐酸盐	

	性中心构型为 1R, 2S。	混合作用型药物, 对 α 和 β 受体均有激动作用
盐酸伪麻黄碱	两个手性中心构型为 1S, 2S	临床作为抗感冒药复方制剂的成分

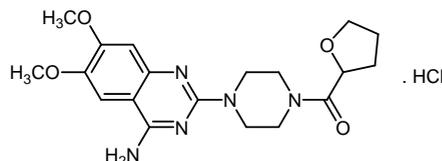
二、肾上腺素受体拮抗剂

1. α 受体阻断剂: 可选择性的阻断血管收缩有关的 α 受体, 可使与血管舒张有关的 β 受体的作用显示出来, 导致血压下降, 该类药用于改善微循环, 治疗外周性血管痉挛性疾病以及血栓疾病等。

代表性药物盐酸哌唑嗪、盐酸特拉唑嗪



盐酸哌唑嗪



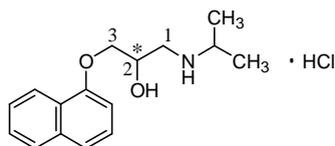
盐酸特拉唑嗪

药名	结构特点	化学名	临床用途
盐酸哌唑嗪	以喹唑啉环为母体, 在喹唑啉环 2 位连有哌嗪环, 4 位连有伯氨基, 6, 7 位连有甲氧基; 盐酸哌唑嗪的哌嗪的另一氮原子上连有呋喃-2-甲酰基, 盐酸特拉唑嗪为四氢呋喃-2-甲酰基	1-(4-氨基-6, 7-二甲氧基-2-喹唑啉基)-4-(2-呋喃甲酰)哌嗪盐酸盐	选择性 α_1 受体阻断剂, 适于轻中度高血压的治疗。
盐酸特拉唑嗪			同上。但作用时间长, 也用于对良性前列腺肥大导致的排尿困难的治疗

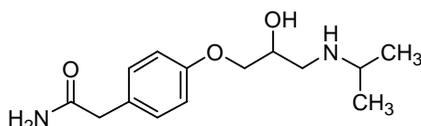
2. β 受体拮抗剂 临床用于心绞痛, 心肌梗死, 高血压, 心律失常等疾病的治疗, 也用于偏头痛, 青光眼的治疗

三类: ①非选择性 β 受体阻断剂 (普萘洛尔); ②选择性 β_1 受体阻断剂 (阿替洛尔、美托洛尔); ③兼有 α_1 受体阻断作用的 β 受体阻断剂 (拉贝洛尔)。

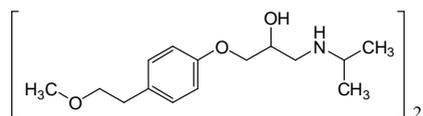
代表性药物: 盐酸普萘洛尔、阿替洛尔、酒石酸美托洛尔、拉贝洛尔。



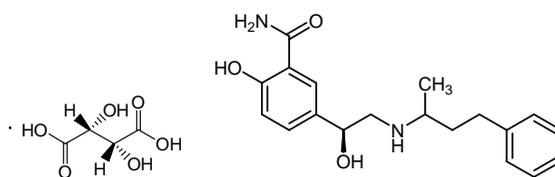
盐酸普萘洛尔



阿替洛尔



酒石酸美托洛尔



拉贝洛尔

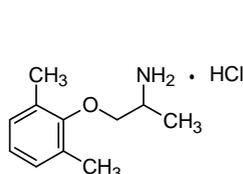
共同结构特点	均以芳氧丙醇胺为母体, 芳香环多为苯环, 也可为萘环 (如普萘洛尔), 氮原子上连有异丙基。选择性 β_1 受体阻断剂的结构特点是在丙醇胺侧链的对位有取代基。		
药名	化学名	理化性质	临床用途

盐酸普萘洛尔 (心得安)	1-异丙氨基 -3-(1-萘氧基) -2-丙醇 盐酸盐	① 在稀酸中易分解; ② 与硅钨酸试液反应生成淡红色沉淀; ③ 含有一个手性碳, S型左旋体活性强于R型右旋体。临床使用外消旋体。	用于心绞痛、窦性心动过速等心律失常及高血压的治疗, 副作用稍多
阿替洛尔(氨酰心安)		临床使用外消旋体	选择性β ₁ 受体阻断剂,
酒石酸美托洛尔		临床使用外消旋体	
拉贝洛尔	为选择性α ₁ 和β受体拮抗剂, 临床用于重症高血压和充血性心衰的治疗。在有效性和选择性上都较优		

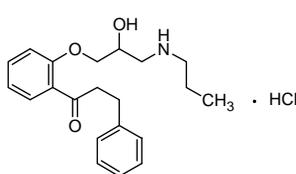
第十九章 抗心律失常药

1. 按照作用机制的分类 分为: ①钠通道阻滞剂(如: 盐酸美西律); ②β受体阻断剂(如: 普萘洛尔); ③钾通道阻滞剂(如: 胺碘酮); ④钙通道阻滞剂(如: 维拉帕米)。

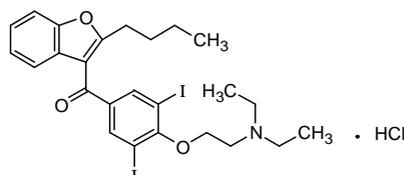
2. 代表性药物 盐酸美西律、盐酸普罗帕酮、盐酸胺碘酮:



盐酸美西律



盐酸普罗帕酮

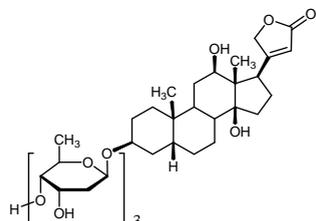


盐酸胺碘酮

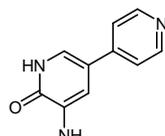
药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
盐酸美西律	含有苯基烷基醚结构, 与利多卡因相似; 1-(2,6-二甲基苯氧基)-2-丙胺盐酸盐	在碱性尿液中以游离形式存在, 极易在肾小管重吸收	为I _b 型钠通道阻滞剂, 主要用于室性早搏、室性心动过速等
盐酸普罗帕酮	含有β受体阻断剂类的基本结构: 苯氧丙醇胺, 因此兼有β受体阻断剂作用	为I _c 型钠通道阻滞剂, 用于治疗室性、室上性心动过速等; 兼有轻度β受体的拮抗作用	
盐酸胺碘酮	苯并呋喃结构, 含碘药物	钾通道阻滞剂	

第二十章 抗心力衰竭药

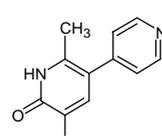
分类: ①强心苷类(如: 地高辛) ②磷酸二酯酶抑制剂(如: 氨力农, 米力农)。



地高辛



氨力农



米力农

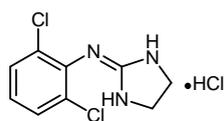
药名	结构特点	临床用途
地高辛	强心甾烯为甙元, 与三分子糖形成苷	中等作用时间的强心苷。(该药的安全范围小, 强度不够大, 排泄慢, 易于积蓄中毒, 需住院监测下使用)。

氨力农	含有连吡啶结构	磷酸二酯酶抑制剂，主要用于对强心苷治疗无效的严重心衰
米力农	在氨力农类似物；化学名：1, 6-二氢-2-甲基-6-氧-(3, 4'-联吡啶)-5-甲腈	作用强于氨力农

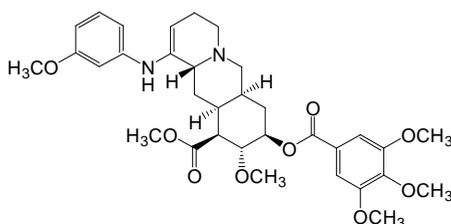
第二十一章 抗高血压药

一、分类：①中枢性降压药（如：可乐定）；②作用于交感神经系统的降压药（如：利舍平）；③神经节阻断药（如：美卡拉明）；④血管扩张药（如：米诺地尔）；⑤肾上腺素 α_1 受体阻断剂（如：哌唑嗪）；⑥影响肾素-血管紧张素-醛固酮系统的药物（如：卡托普利）。

1. 中枢降压药 代表药物：甲基多巴、盐酸可乐定。
2. 作用于交感神经系统的降压药 代表性药物：利舍平



盐酸可乐定



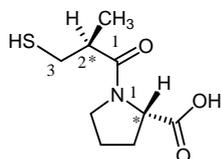
利舍平

药名	结构特点及化学名称	理化性质	临床用途
盐酸可乐定 又名可乐宁	以亚胺型和氨基型两种互变异构体存在，以亚胺型结构为主； 2-[(2, 6-二氯苯基) 亚氨基]咪唑烷盐酸盐		α_2 受体激动剂，中枢降压药
利舍平	吲哚类生物碱，五环稠和结构，含有两个酯基； 夹竹桃植物罗芙木有效成分	易发生氧化，生成无效 的黄绿色荧光产物	神经介质耗竭类药物，降压药

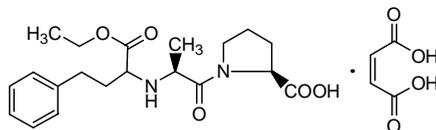
3. 影响肾素-血管紧张素-醛固酮系统的药物

(1) 血管紧张素转化酶(ACE)抑制剂：血管紧张素 II 作用于血管紧张素 II 受体，产生很强的血管收缩作用，使血压上升。血管紧张素转化酶(ACE)是血管紧张素 II 体内合成的限速酶，本类药物即以之为靶点。

代表药物：卡托普利、马来酸依那普利、福辛普利、赖诺普利。



卡托普利

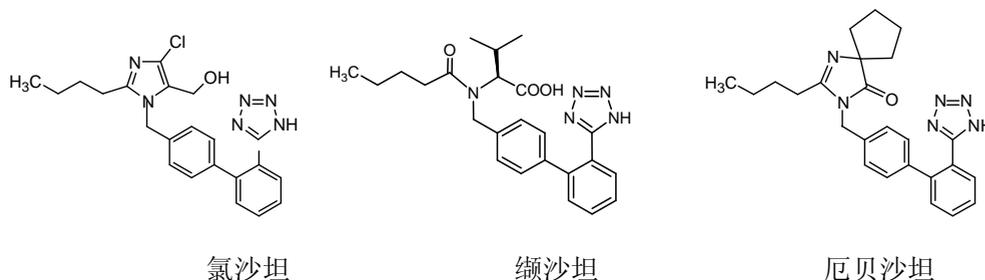


马来酸依那普利

药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
卡托普利（又称巯甲丙脯酸）	L-脯氨酸N原子上形成酰胺，含有两个手性，都为S型； 1-[(2S) -2-甲基-3-巯基-1-氧代丙基]-L-脯氨酸	在水溶液中巯基易氧化成二硫化物；巯基可使碘试液褪色	血管紧张素转化酶抑制剂
马来酸依那普	含有三个手性中心，均为S型；	在体内酯基水解后	为长效血管紧张素转

利（苯丁酯脯酸）	N-[(S)-1-乙氧羰基-3-苯丙基]-L-丙氨酰-L-脯氨酸顺丁烯二酸盐	产生活性，为前体药物	化酶抑制剂
----------	--	------------	-------

(2) 血管紧张素 II 受体拮抗剂：代表药物：氯沙坦、缬沙坦、厄贝沙坦。



药名	结构特点	理化性质	临床用途
氯沙坦	含有联苯结构，苯环上连有四氮唑基，另一苯环上连有取代的咪唑基	四氮唑结构呈酸性	第一个上市的血管紧张素 II 受体拮抗剂。无干咳的副作用。临床用于降压、抗心衰等。
缬沙坦	含有联苯结构，苯环上连有四氮唑基，另一苯环上连有酰胺键		不含咪唑环的血管紧张素 II 受体拮抗剂，停药后不易反跳
厄贝沙坦	含有联苯结构，苯环上连有四氮唑基，另一苯环上连有螺环结构		血管紧张素 II 受体拮抗剂，能特异性地拮抗 AT1 受体

4. 钙通道阻滞剂类

分类：①二氢吡啶类；②芳烷基胺类；③苯噻氮卓类；④三苯哌嗪类。

(1) 二氢吡啶类 代表性药物：硝苯地平、尼群地平、氨氯地平、尼莫地平。



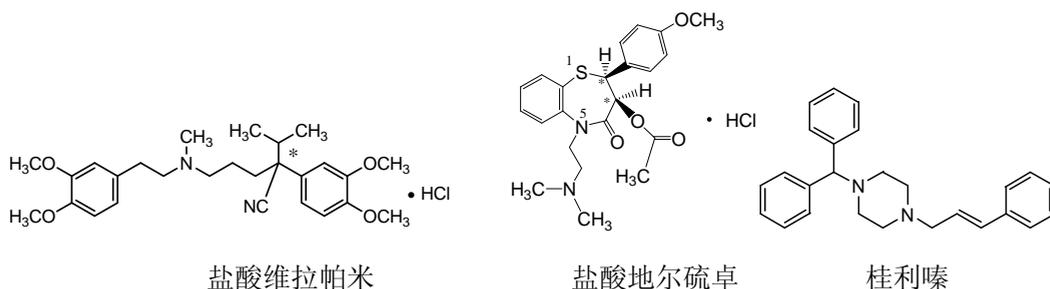
共同结构特点以吡啶为母体，1，4 位各有一个氢即 1，4-二氢吡啶。多在 2，6 位有甲基，3，5 位有羧酸酯，4 位多有 2 或 3 位取代的苯基。

药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
硝苯地平	所列四种二氢吡啶类药物中唯一不含手性的药物；2，6-二甲基-4-(2-硝基苯基)-1，4-二氢-3，5-吡啶二甲酸二甲酯	遇光易发生分子内的歧化反应，降解后产生有毒产物。应避光保存	钙通道阻滞剂，用于治疗冠心病，心绞痛，高血压
尼群地平	1，4-二氢吡啶环的 3，5 位上所连接的两个羧酸酯结构不同，4 位碳原子具有手性。		钙通道阻滞剂
氨氯地平	唯一结构中含有氯的药物，含有手性碳。		
尼莫地平	含有手性碳；钙通道阻滞剂，为选择性脑血管扩张药，用于各种原因导致的脑缺血和偏头痛的治疗。与其他三个在临床用途上有所区别		

(2) 芳烷基胺类 代表性药物：盐酸维拉帕米

药名	结构特点	临床用途
盐酸维拉	为叔胺类，氮上带有双 3，4 二甲氧苯烷基，有一	钙通道阻滞剂，临床用于阵发性室上性心动过速、

帕米	手性碳，临床使用外消旋体。	心绞痛及高血压的治疗
----	---------------	------------



(3) 苯噻氮卓类 代表性药物：盐酸地尔硫卓：

药名	结构特点	理化性质	临床用途
盐酸地尔硫卓	以 1, 5-苯并硫氮杂卓为母体，含有两个手性中心	临床使用的 2S, 3S 体	高度选择性钙离子通道阻滞剂

(4) 三苯哌嗪类 代表性药物：桂利嗪（肉桂苯哌嗪，脑益嗪）：

药名	结构特点	临床用途
桂利嗪（肉桂苯哌嗪，脑益嗪）	以哌嗪为母体，在一侧氮上连有二苯甲基，另一侧氮上连有肉桂基（注意同镇痛药布桂嗪的区别）	三苯哌嗪类钙通道阻滞剂，直接扩张血管平滑肌，临床用于脑血管障碍、脑动脉硬化等

第二十二章 血脂调节药及抗动脉粥样硬化药

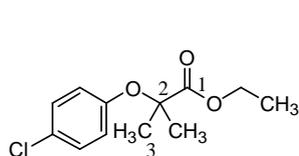
一、分类：①羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑制剂类（如：洛伐他汀）；②苯氧乙酸类（如：氯贝丁酯）；③烟酸类（如：烟酸肌醇）。

1. 羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶 (HMG-CoA 还原酶) 抑制剂类 代表药：洛伐他汀、氟伐他汀、辛伐他汀、阿托伐他汀。

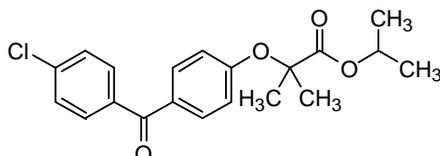


药名	结构特点	理化性质	临床用途
洛伐他汀	以多氢萘为母体，含有 β-羟基-δ-内酯环，8 个手性中心； β-羟基-δ-内酯在体内水解开环生成 β, δ-二羟基酸，因此为前体药物	易氧化形成吡喃二酮。 内酯环在酸碱催化下可迅速水解开环	天然羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑制剂
氟伐他汀	含有吡啶环 含氟代苯基和吡啶环	全合成的 HMG-CoA 还原酶抑制剂	
阿托伐他汀	多取代吡咯环，二羟基戊酸侧链	全合成的 HMG-CoA 还原酶抑制剂类药物	

2. 苯氧乙酸类 代表性药物 氯贝丁酯、非诺贝特



氯贝丁酯



非诺贝特

药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
氯贝丁酯， 又名安妥明	①结构中含有苯氧乙酸侧链；②在其对位分别连有氯；③在羧基α位连有两个甲基④羧基与乙醇酯； 2-甲基-2-(4-氯苯氧基)丙酸乙酯	①油状液体，有特臭；②遇光分解为对氯苯酚；③酯基可水解，口服吸收良好，体内代谢为活性代谢物氯贝酸	前药，有显著降甘油三酯作用，临床用于高甘油三酯血症治疗
非诺贝特	苯氧乙酸对位连有对氯苯甲酰基；羧基与异丙醇形成酯。	前药，在体内迅速代谢成非诺贝特酸而起降血脂作用。	

第二十三章 抗心绞痛药

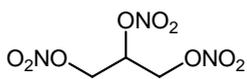
分类：①硝酸酯和亚硝酸酯类；②钙通道阻滞剂类；③其他类。

一. 硝酸酯和亚硝酸酯类 代表性药物：硝酸甘油、硝酸异山梨醇酯

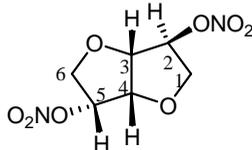
共同结构特点：多元醇类的硝酸或亚硝酸酯。

理化性质：两者室温下稳定，受热或撞击可发生爆炸。

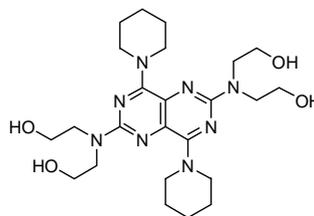
药名	化学名及理化性质	临床用途
硝酸甘油	①油状液体；②碱性条件下迅速分解。体内代谢生成1, 2-和1, 3-甘油二硝酸酯，甘油单硝酸酯，甘油。	用于心绞痛急性发作治疗，可舌下含服。 作用特点：起效快，作用时间短。
硝酸异山梨醇酯	1, 4:3, 6-二脱水-D-山梨醇硝酸酯； 遇水和硫酸可水解，生成硝酸，若缓慢向其硫酸水解液中加入硫酸亚铁试液，在界面处显棕色	血管扩张药，活性强于硝酸甘油，作用时间也比硝酸甘油长，可用于预防和缓解心绞痛。



硝酸甘油



硝酸异山梨醇酯



双嘧达莫

二. 其他类 代表性药物：双嘧达莫（潘生丁、哌啶醇）

药名	结构特点	临床用途
双嘧达莫(潘生丁、哌啶醇)	分子结构有一定对称性。以嘧啶并嘧啶为母环，在嘧啶环2位连有二羟乙氨基，在4位上连有1-哌啶基。	较强的冠脉扩张剂。用于慢性冠状动脉功能不全、心绞痛，心梗等

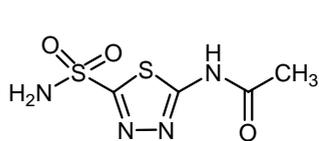
第二十四章 利尿药

分类：①渗透性利尿药；②碳酸酐酶抑制剂；③髓祥利尿药；④保钾利尿药。

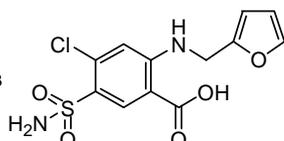
一、渗透性利尿药 代表性药物：甘露醇、山梨醇等。主要用于脑水肿等。

二、碳酸酐酶抑制剂 代表性药物：乙酰唑胺

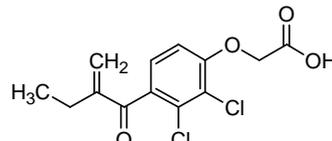
药名	结构特点	临床用途
乙酰唑胺	磺胺衍生物，含有噻二唑，磺酰胺基	主要用于脑水肿等，长时间或大量使用可引起“酸中毒”



乙酰唑胺



呋塞米



依他尼酸

三、 $\text{Na}^+ - \text{K}^+ - 2\text{Cl}^-$ 同向转运抑制剂

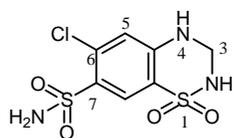
代表性药物：呋塞米、依他尼酸

药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
呋塞米 (速尿)	以苯磺酰胺为母体，在磺酰基的邻位连有氯原子为主要结构特征； 2-[(2-呋喃甲基) 氨基]-5-(氨磺酰基)-4-氯苯甲酸	①具有酸性；②其钠盐水溶液遇酸性药物可析出呋塞米沉淀；③加氢氧化钠和氯化钠可制成供注射用的水溶液；④钠盐水溶液可水解，温度升高分解加速。	有效的治疗浮肿。还有温和的降血压作用
依他尼酸(又名利尿酸)	以苯氧乙酸为母体，侧链取代有 α ， β 不饱和酮； 2, 3-二氯-4-(2-亚甲基丁酰基) 苯氧基乙酸	水溶液不稳定，本品加氢氧化钠试液煮沸；支链上的亚甲基易分解产生甲醛，与变色酸钠在硫酸溶液中反应，成深紫色。	为强效、速效、短时利尿剂，用于浮肿，应注意控制用量，以防止引起电解质紊乱。

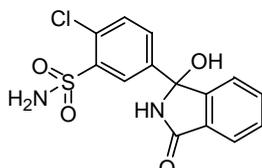
四、 $\text{Na}^+ - \text{Cl}^-$ 同向转运抑制剂

代表性药物：氢氯噻嗪(双氢克尿塞)、氯噻酮

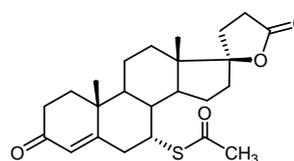
药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
氢氯噻嗪 (双氢克尿塞)	6-氯-3, 4-二氢-2H-1, 2, 4-苯并噻二嗪-7-磺酰胺-1, 1-二氧化物	①含有两个磺酰胺基，2位上的氢酸性较强，可制成钠盐后可制成注射液；②室温在230℃加热2小时成淡黄色；③在水溶液中可水解	利尿药，用于多种类型的水肿及高血压症
氯噻酮	以苯磺酰胺为母体，在磺酰基的邻位连有氯原子	但口服吸收缓慢且不完全，为长效利尿药，长期服用须适当补钾。	



氢氯噻嗪



氯噻酮



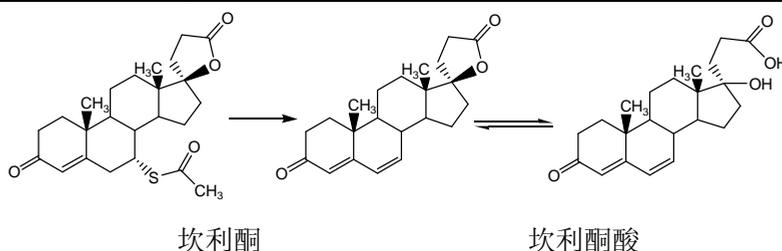
螺内酯

五、保钾利尿药 分类：①醛固酮拮抗剂；②蝶啶类利尿剂。

六、盐皮质激素受体拮抗剂(醛固酮拮抗剂)

代表性药物：螺内酯(又名安体舒通)

药名	结构特点及化学名	体内代谢	临床用途
螺内酯	为甾类化合物	口服后大部分在肝脏代谢，脱去乙酰巯基，生成坎利酮和坎利酮酸	为醛固酮拮抗剂，单独使用副作用较多，可与氢氯噻嗪合用以减少副作用。作为利尿剂已少见



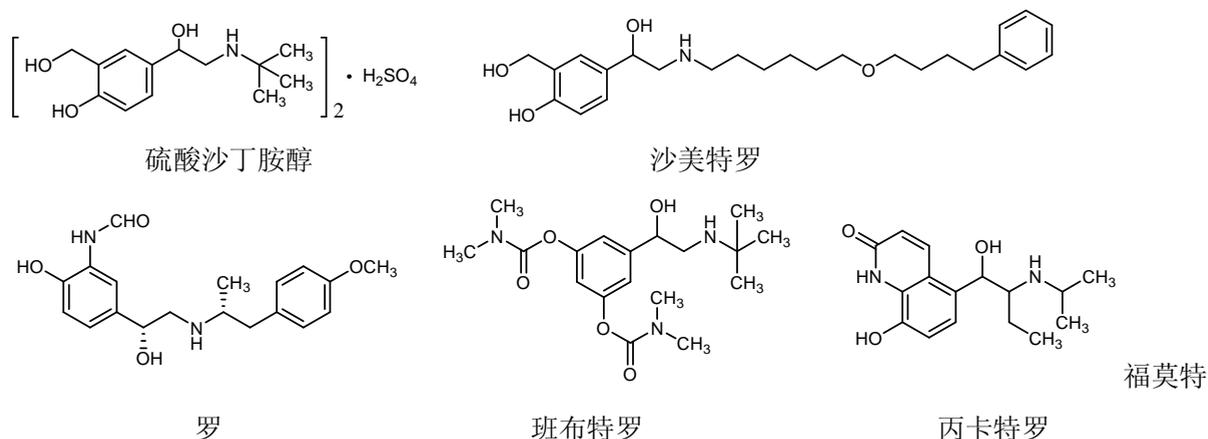
螺内酯体内代谢途径

第二十五章 平喘药

分类： β_2 -肾上腺素受体激动剂、M胆碱受体抑制剂、糖皮质激素、与白三烯有关的药物和茶碱等

一、 β_2 -肾上腺素受体激动剂

代表性药物：硫酸沙丁胺醇、沙美特罗、福莫特罗、班布特罗、丙卡特罗

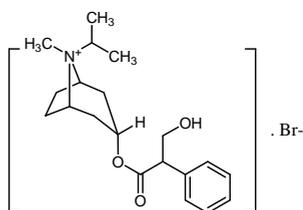


药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
硫酸沙丁胺醇	末端叔丁基； 1-(4-羟基-3-羟甲基苯基)-2-(叔丁氨基)乙醇硫酸盐	有两个光学异构体，R(-)活性高于S(+)	为选择性激动 β_2 受体，用于哮喘。
沙美特罗	为沙丁胺醇末端叔丁基换为苯丁氧基己基的化合物，亲脂性增加； (R,S)-1-(4-羟基-3-羟甲基苯基)-2-苯丁氧基己氨基乙醇		长效 β_2 受体激动剂，适用于慢性哮喘病人
福莫特罗	新型长效 β_2 受体激动剂，具有高度选择性，兼有抗炎作用		
班布特罗	特布他林间苯二酚酯化产物，前体药物	体内经代谢酯水解释放出特布他林而起作用	口服平喘药
丙卡特罗	新型高选择性 β_2 受体激动剂		

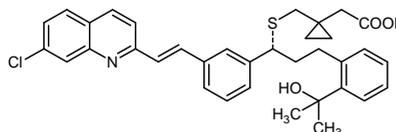
二、M胆碱受体拮抗剂

代表性药物 异丙托溴铵（溴化异丙阿托品）

药名	结构特点	理化性质	临床用途
异丙托溴铵（溴化异丙阿托品）	阿托品叔胺连上异丙基形成季铵盐	由于有酯基的存在，碱性条件下易水解。具有莨菪碱的性质	由于具有季铵盐结构，中枢作用小，为优秀的平喘药



异丙托溴铵



孟鲁司特

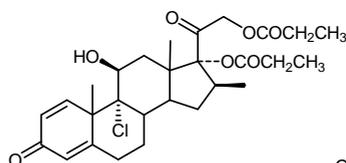
三、影响白三烯的药物

代表药物：孟鲁司特、扎鲁司特、齐留通

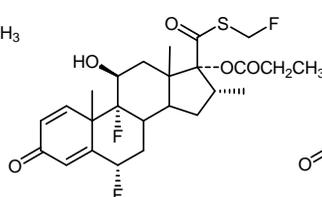
药名	结构特点	临床用途
孟鲁司特	结构中含有喹啉基，一个手性中心，双键两侧以反式取代	选择性白三烯受体拮抗剂，平喘药

四、糖皮质激素药物

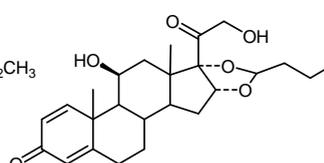
代表性药：丙酸倍氯米松、丙酸氟替卡松、布地奈德



丙酸倍氯米松



丙酸氟替卡松

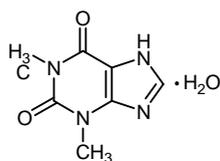


布地奈德

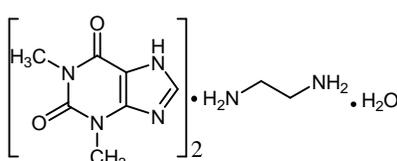
药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
丙酸倍氯米松	16β-甲基-11β, 17α, 21-三羟基-9α-氯孕甾-1,4-二烯-3,20-二酮-17,21-二丙酸酯	水解成单丙酸酯(有活性)、倍氯米松(无活性)	气雾剂为平喘药，外用可治疗各种炎症皮肤病
丙酸氟替卡松	17位β-硫代羧酸酯	17位β-硫代羧酸酯水解失去活性，可避免激素全身作用	口服或吸入给药，平喘药；外用可治疗皮肤炎症
布地奈德	结构中含有缩酮结构	缩酮结构体内迅速代谢，产物活性较低，避免全身性作用	气雾剂，用于哮喘

五、磷酸二酯酶抑制剂

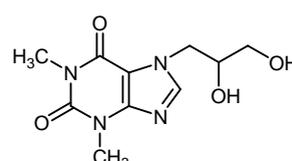
代表性药物：茶碱、氨茶碱、二羟丙茶碱



茶碱



氨茶碱



二羟丙茶碱

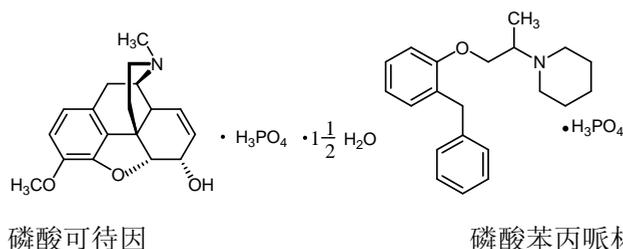
药名	化学名/结构特点	体内代谢	临床用途
茶碱	1, 3-二甲基-3, 7-二氢-1H-嘌呤-2, 6-二酮一水合物。	在肝中代谢, 可脱掉 N-甲基, 或 8 位氧化成尿酸, 从尿中排泄	磷酸二酯酶抑制剂, 适合中度哮喘病人长期使用, 配合小剂量 β_2 激动剂或吸入糖皮质激素效果更好
氨茶碱	茶碱与乙二胺的复盐, 水溶性增加		注射剂, 治疗支气管哮喘等疾病
二羟丙茶碱	茶碱二羟丙基取代的衍生物		注射剂, 治疗支气管哮喘等疾病

第二十六章 镇咳祛痰药

镇咳祛痰药按照作用机制的分类

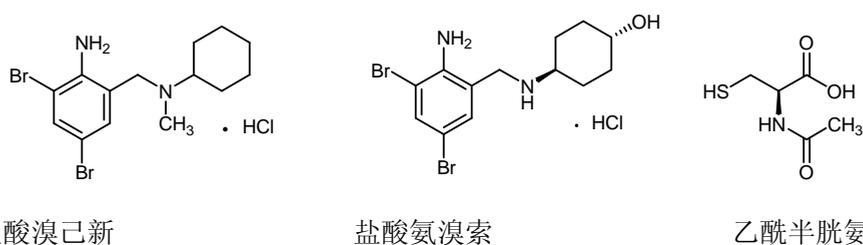
- 镇咳药分为二类: ①中枢性镇咳药; ②外周性止咳药。
- 祛痰药分为二类: ①痰液稀释药; ②粘痰溶解药。

一、镇咳药 代表性药物磷酸可待因(中枢性镇咳药)、磷酸苯丙哌林



药名	化学名/结构特点	体内代谢	临床用途
磷酸可待因	为吗啡酚羟基的 3 位甲基化产物	体内少量代谢产生吗啡也有一定的成瘾性	直接抑制延脑的咳嗽中枢, 对咳嗽有很强的抑制作用。
磷酸苯丙哌林	1-[2-(2-苄基苯氧基)-1-甲基乙基]哌啶磷酸盐		具有平滑肌解痉作用, 同时抑制咳嗽中枢, 镇咳作用强

二、祛痰药 代表性药物盐酸溴己新、盐酸氨溴索、乙酰半胱氨酸:



药名	化学名/结构特点	体内代谢/理化性质	临床用途
盐酸溴己新	N-甲基-N-环己基-2-氨基-3, 5-二溴苯甲胺盐酸盐	可降低痰液粘稠度, 使痰液易于咳出。其代谢物仍有活性	
盐酸氨溴索	为溴己新的环己烷烷基化、N-去甲基的活性代谢物。含两个手性碳	肝脏代谢, 产物为二溴代邻氨基苯甲酸	黏痰溶解剂, 兼有一定的镇咳作用
乙酰半胱氨酸	N-乙酰基-L-半胱氨酸	①巯基化合物, 避光保存。②不可接触金属等③不可与两性霉素、氨基苄西林合用。	①黏痰溶解剂, 可喷雾吸入; ②用作对乙酰氨基酚过量的解毒

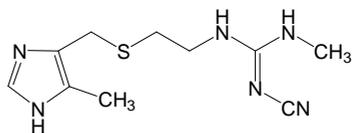
第二十七章 抗溃疡药

抗溃疡药有三类：①组胺 H₂受体拮抗剂；②质子泵抑制剂；③前列腺素类胃粘膜保护剂。

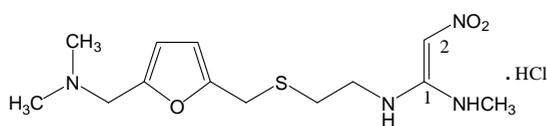
一、组胺 H₂受体拮抗剂

分为：①咪唑类；②呋喃类；③噻唑类；④哌啶甲苯类。代表性药物：西咪替丁、盐酸雷尼替丁、法莫替丁。

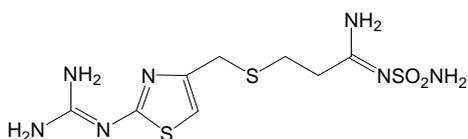
共同结构特点	雷尼替丁、西咪替丁、法莫替丁分别以呋喃、咪唑和噻唑为母环，在母环上均有两个取代基，其中长链取代基末端带有平面极性结构。	
药名	理化性质	临床用途
盐酸雷尼替丁	① 有顺反异构体，临床用反式体；② 固体极易潮解，吸潮后颜色变深。	H ₂ 受体拮抗剂第二代产品，活性强，起效快，作用时间长。副作用小。临床用于治疗十二指肠溃疡等
西咪替丁	对湿、热稳定。在稀盐酸中会引起氰基的水解，生成氨甲酰胍，加热进一步水解成胍。与铜离子结合生成蓝灰色沉淀（与一般胍化合物区别）灼热放出硫化氢，能使醋酸铅试纸显黑色。	H ₂ 受体拮抗剂第一代产品。停药后复发率高及有抗雄激素副作用为其主要缺点
法莫替丁	第三代 H ₂ 受体拮抗剂，活性比西咪替丁，雷尼替丁大。	



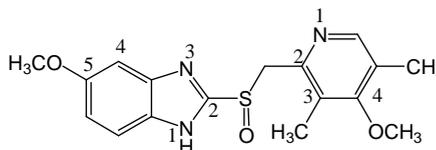
西咪替丁



盐酸雷尼替丁



法莫替丁



奥美拉唑

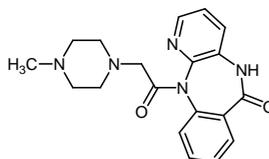
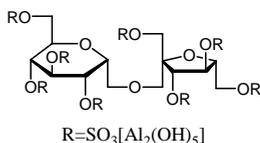
二、质子泵抑制剂 为 H⁺/K⁺-ATP 酶（质子泵）酶抑制剂，该酶在胃酸分泌中起到重要的作用。

结构式中都含有苯并咪唑结构。代表性药物：奥美拉唑、潘妥拉唑、兰索拉唑

药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
奥美拉唑	化学结构由苯并咪唑环、吡啶环和联结这两个环系的亚磺酰基构成；	① 具有弱酸、弱碱两性；② 在水溶液中不稳定，对强酸也不稳定。③ 亚磺基上硫有手性，临床用外消旋体	本品对 H ⁺ /K ⁺ -ATP 酶（质子泵）有选择性抑制作用，用于治疗十二指肠溃疡；提示：体外无活性，是前体药物。

三、其他抗溃疡药物

广泛用于抗溃疡的药物：硫糖铝、枸橼酸铋钾、哌伦西平

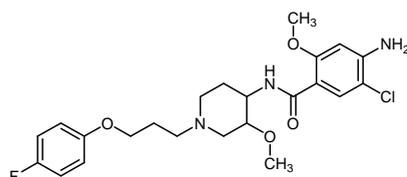


硫糖铝		哌仑西平
药名	结构特点	临床用途
硫糖铝	蔗糖硫酸酯的碱式铝盐	胃黏膜保护剂，促进溃疡的愈合
枸橼酸铋钾	三价铋复合物，易吸潮，水溶液为微碱性的胶体溶液	在胃液 pH 条件下，在溃疡表面或溃疡基地肉芽组织形成一种坚固的氧化铋胶体沉淀，成为保护性膜。临床常用的抗溃疡药物之一
哌仑西平	选择性抗胆碱能药物。抑制胃酸分泌，缓解胃痉挛所致的疼痛。预防近视眼	

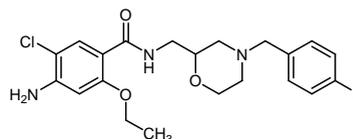
第二十八章 胃动力药和止吐药

一、胃动力药 促进胃肠道内容物向前移动的药物。

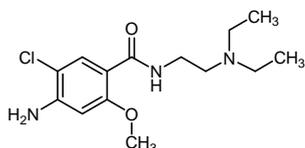
代表性药物：西沙必利、莫沙必利、甲氧氯普胺、多潘立酮



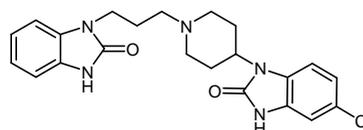
西沙必利



莫沙必利



甲氧氯普胺

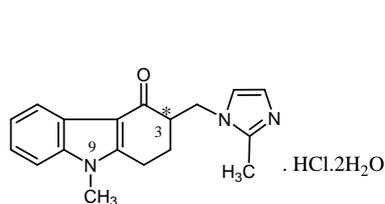


多潘立酮

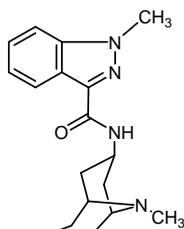
药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
西沙必利	苯甲酰胺衍生物，分子中甲氧基和苯甲酰胺基均在哌啶环的同侧，为顺式。	两个手性碳原子，药用顺式的两个外消旋体。	广泛地用于各种胃肠道动力障碍性疾病
莫沙必利	苯甲酰胺衍生物，分子中有吗啉结构	新型胃动力药。强效选择性 5-HT ₄ 受体激动剂；椎体外系副作用小	
甲氧氯普胺	苯甲酰胺衍生物，普鲁卡因类似物	多巴胺 D ₂ 受体拮抗剂，有促动力和止吐作用，第一个用于临床的促动力药。有椎体外系副作用	
多潘立酮	5-氯-1-[1-[3-(2,3-二氢-2-氧代-1H-苯并咪唑-1-基)丙基]-4-哌啶基]2,3-二氢-1H-苯并咪唑-2-酮	多巴胺 D ₂ 受体拮抗剂，促进胃肠道的蠕动。椎体外系副作用较少。促进胃动力和止吐作用	

二、止吐药 5-HT₃受体拮抗剂

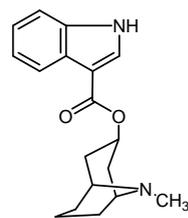
代表性药物：盐酸昂丹司琼、格拉司琼、托烷司琼



盐酸昂丹司琼



格拉司琼



托烷司琼

药名	结构特点及化学名	临床用途
昂丹司琼	以 N-甲基-四氢咪唑酮为母体，3-位碳具有手性，R 型的活性最大； 1, 2, 3, 9-四氢-9-甲基-3-[(2-甲基-1H-咪唑-1-基)甲基]-4H-咪唑-4-酮盐酸盐二水合物	为强效 5-HT ₃ 受体拮抗剂，可用于治疗癌症病人的恶心，呕吐症状
格拉司琼	5-HT ₃ 受体拮抗剂，具有高效、高选择性	
托烷司琼	5-HT ₃ 受体拮抗剂，双重阻断呕吐反射中的介质的化学传递。预防癌症化疗的呕吐。	

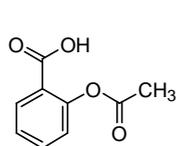
第二十九章 非甾体抗炎药

(1) 解热镇痛药分为水杨酸类、苯胺类、吡唑酮类；(2) 非甾体抗炎药分为 3, 5-吡唑烷二酮类、芬那酸类、芳基烷酸类、1, 2-苯并噻嗪类。

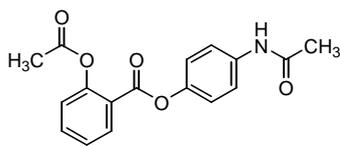
一、解热镇痛药

1. 水杨酸类 代表性药物：阿司匹林、贝诺酯

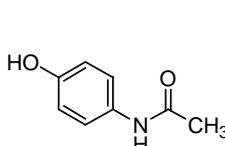
药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
阿司匹林（乙酰水杨酸）	以水杨酸为母体，酚羟基成乙酯； 2-(乙酰氧基)苯甲酸	①水解后加硫酸可析出白色的水杨酸沉淀。②水溶液与三氯化铁试液一起加热时，遇三氯化铁可显紫堇色。③不能溶于碳酸钠溶液。④鉴别水杨酸方法 ⑤乙酰水杨酸酯副产物，易引起过敏反应。	①抑制环氧合酶的活性。②小剂量预防血栓和心肌梗死的发生。
贝诺酯	对乙酰氨基酚与阿司匹林形成的酯	在体内水解产生阿司匹林和对乙酰氨基酚起作用，产生协同治疗作用	阿司匹林的前药，对胃无刺激作用



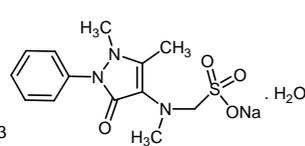
阿司匹林



贝诺酯



对乙酰氨基酚



安乃近

2. 苯胺类 代表性药物：对乙酰氨基酚（扑热息痛）

药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
对乙酰氨基酚	以苯胺为母体，氨基被乙酰化，且其对位连有羟基； N-(4-羟基苯基)乙酰胺	①在潮湿条件下会慢慢水解生成对氨基酚；②对氨基酚易进一步氧化颜色逐渐变深；③含有酚羟基，遇三氯化铁试液显蓝紫色；④在酸性下水解暴露出芳伯胺后呈芳伯胺显色反应；⑤对氨基酚用亚硝酸铁氰化钠试液的呈色反应来限量测定。	有解热镇痛作用，但强度稍弱于阿司匹林，无抗炎作用

3. 吡唑酮类 代表性药物 安乃近

药名	结构特点	理化性质	临床用途
安乃近	以吡唑酮为母体，4 位氨基上连有甲基和亚甲基磺酸钠	① 含有亚甲基磺酸钠结构和一分子结晶水，水溶性较好；② 易氧化，应避光密封保存。	解热镇痛作用较强，但毒副作用也较大。仅用于其它镇痛药难以控制的高热，临床已少用

二、非甾体抗炎药

结构类型

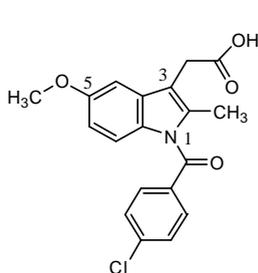
1. 3, 5-吡唑烷二酮类 主要有保泰松和羟布宗（又称作羟基保泰松），后者为前者的活性代谢物，毒副作用小于前者。羟布宗有较好的消炎镇痛作用。

2. 芬那酸类 又称作邻氨基苯甲酸类，亦称灭酸类，为水杨酸的羟基被取代的苯氨基置换的产物。代表性药物有甲芬那酸、氯芬那酸、氟芬那酸等。

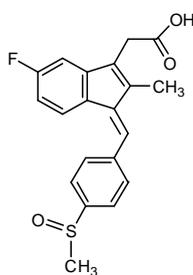
3. 芳基烷酸类 分为二类：芳基乙酸类和芳基丙酸类（又称作芳基 α -甲基乙酸类）。

这两类药物抗炎活性较强，毒副作用相对较轻。为临床常用药物

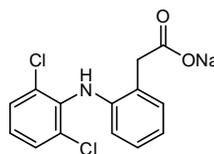
(1) 芳基乙酸类代表性药物 吲哚美辛、舒林酸、双氯芬酸钠、萘丁美酮、芬布芬。



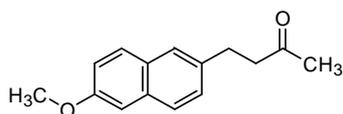
吲哚美辛



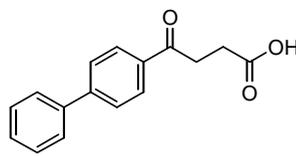
舒林酸



双氯芬酸钠



萘丁美酮



芬布芬

药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
吲哚美辛	吲哚乙酸结构； 2-甲基-1-(4-氯苯甲酰基)-5-甲氧基-1H-吲哚-3-乙酸	对光敏感；在强酸和强碱条件下，1 位酰胺键水解，生成的产物可氧化变色	抗炎作用明显，副作用很大
舒林酸	吲哚美辛的类似物，母体为茛环（即吲哚的-N=换成=C=）。1 位形成环外烯键	抗炎、镇痛。体外无效，需在体内还原为甲硫醚而产生活性（前药），因此起效缓慢。生成的活性代谢物甲硫醚在肾脏排泄较慢，所以半衰期较长，作用持久	
双氯芬酸钠	以苯乙酸为母体，2 位连有 2, 6-二氯代苯氨基，（又叫双氯灭痛）	有很强的解热、镇痛和抗炎作用，活性很强，副作用很小，为一临床广泛使用的非甾体抗炎药。	
萘丁美酮	又名萘普酮。为非酸性的前体药物，在体内代谢为-甲氧基-2-萘乙酸而产生作用。活性代谢物有花生四烯酸环氧酶-2 (COX-2) 抑制作用，无一般非甾体抗炎药的胃肠道副作用		

芬布芬	具有联苯结构；为非酸性的前体药物，在体内经多步代谢转化成联苯乙酸并产生抗炎作用
-----	---

(2) 芳基丙酸类代表性药物 布洛芬、萘普生、酮洛芬。



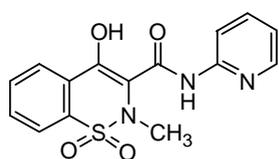
共同结构特点：芳基丙酸为母体，羧基 α-碳含有手性			
药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
布洛芬	2-(4-异丁基苯基)丙酸	①含有羧基，溶于氢氧化钠和碳酸钠溶液；②有手性碳，药理作用主要来自 S-(+) 异构体，R-(-) 在体内可转化为 S-(+) 体，故不必拆分。临床使用外消旋体。	解热、镇痛和抗炎
萘普生	含有萘环； (+)-α-甲基-6-甲氧基-2-萘乙酸	临床使用 S-(+) 体。临床用途与布洛芬和酮洛芬类似	
酮洛芬	二苯甲酮结构	临床用外消旋体。解热、镇痛和抗炎作用很强，亦有抗痛风作用	

4. 1, 2-苯并噻嗪类（又称为昔康类）

(1) 药物的特点：①抗炎镇痛效果强、毒性小；②长效非甾体抗炎药；③具有一定的酸性，但结构中不含有羧基，酸性来源于其结构中的烯醇式羟基。

(2) 代表性药物吡罗昔康（炎痛喜康）、美洛昔康：

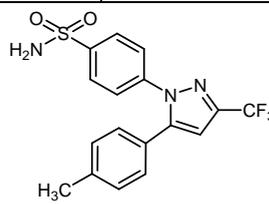
药名	结构特点	临床用途
吡罗昔康（炎痛喜康）	以 1, 2-苯并噻嗪为母体，1 位硫氧化为砷。	有镇痛及抗炎作用，毒副作用更小
美洛昔康	连有吡啶结构或甲基噻唑结构	



吡罗昔康



美洛昔康



塞来昔布

5. 选择性 COX-2 抑制剂

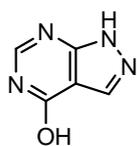
避免药物对胃肠道的刺激，降低毒副作用。代表性药物：塞来昔布

药名	体内代谢	临床用途
塞来昔布	苯环上 4-甲基羟基化，进一步氧化成羧酸，与葡萄糖醛酸结合，从尿中消除	选择性 COX-2 抑制剂，治疗类风湿性关节炎和骨关节炎引起的疼痛

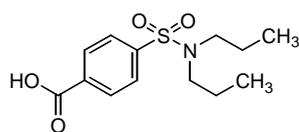
三、抗痛风药

1. 抗痛风药的作用原理 分为三类：(1) 抑制引发痛风的尿酸的生物合成（如别嘌醇）；(2) 促进尿酸的排泄（如阿司匹林）；(3) 消除由尿酸引起的炎症，产生抗炎和止痛作用。

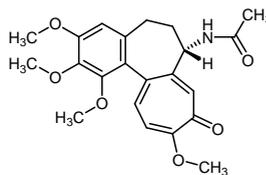
2. 代表性药物 别嘌醇、丙磺舒、秋水仙碱。



别嘌醇



丙磺舒



秋水仙碱

药名	临床用途
别嘌醇	别嘌醇及其代谢产物, 可抑制黄嘌呤氧化酶。临床用于痛风、痛风性肾病
丙磺舒	①可抑制尿酸在肾小管的再吸收, 用于慢性痛风的治疗。②竞争性地抑制弱有机酸类药物的排泄, 可以同青霉素合用, 可延长其作用时间, 辅助用药
秋水仙碱	天然活性生物碱, 对急性痛风性关节炎有选择性消炎的作用, 有抗肿瘤活性

第三十章 抗变态反应药

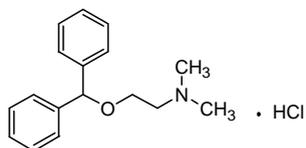
一、组胺 H₁ 受体拮抗剂

分类: ①氨基醚类; ②乙二胺类; ③哌嗪类; ④丙胺类; ⑤三环类; ⑥哌啶类。

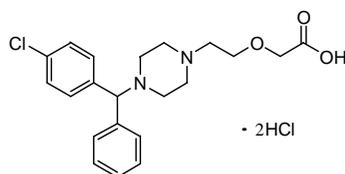
(1) 氨基醚类 代表性药物: 盐酸苯海拉明:

药名	化学名	理化性质	临床用途
盐酸苯海拉明	N,N-二甲基-2-(二苯基甲氧基)乙胺盐酸盐	①酸性; ②碱中和时可析出苯海拉明, 有特臭; ③可被过氧化氢氧化生成二苯甲酮、苯醇、苯甲酸及酚类物质; ④具有叔氮原子, 可与多种生物碱试剂发生反应。	抗过敏药, 抗晕动药。

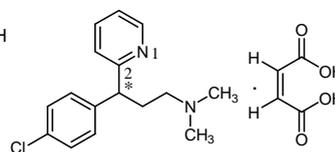
提示: 盐酸苯海拉明与 8-氯茶碱形成盐(称作晕海宁)作为抗晕动药, 既可抗晕止吐, 又可因 8-氯茶碱的中枢兴奋作用而无嗜睡的副作用。



盐酸苯海拉明



盐酸西替利嗪



马来酸氯苯那敏

2. 乙二胺类 将氨基醚类中的-O-用-N=代替即得到乙二胺类。代表性药物: 盐酸曲吡那敏、克立咪唑等。

3. 哌嗪类 将乙二胺类两个氮原子用亚乙基连成环即得哌嗪类。

代表性药物: 盐酸西替利嗪

药名	结构特点	临床用途
盐酸西替利嗪	以哌嗪为母体, 在一个氮原子上连有羧甲氧乙基, 另一氮原子上连有二苯甲基	选择性作用于 H ₁ 受体, 作用强而持久。属于非镇静类 H ₁ 受体拮抗剂, 常用的抗过敏药

4. 丙胺类 分别将氨基醚、乙二胺类中的-O-或-N=用=C=代替即得丙胺类。

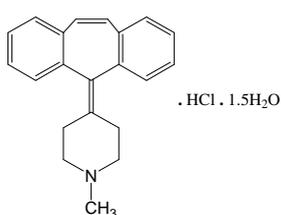
代表性药物：马来酸氯苯那敏（又称作扑尔敏）

药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
马来酸氯苯那敏 (扑尔敏)	以 2-吡啶丙胺为母体。一个手性碳； N, N-二甲基-γ-(4-氯苯基)-2-吡啶 丙胺顺丁烯二酸盐	含有一个手性碳，其中 S-(+) 体活性比 消旋体强约 2 倍，急性毒性也低。临床 使用外消旋体。有升华	用于抗过敏 性疾病

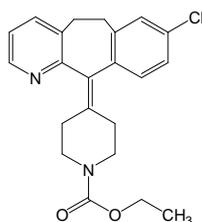
5. 三环类 将氨基醚类、乙二胺类和丙胺类的两个苯环通过一个或二个原子相连即得到三环类。

代表性药物：盐酸赛庚啶、富马酸酮替芬、氯雷他定。

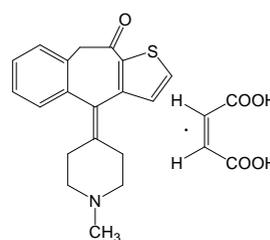
三者结构关系：盐酸赛庚啶以二苯并环庚三烯为母体；氯雷他定结构母体则是将盐酸赛庚啶的一个苯环用吡啶环置换，将环庚三烯的连接二个苯环的烯键饱和。富马酸酮替芬则是将盐酸赛庚啶的一个苯环用噻吩环替换，再将环庚三烯的连接二个苯环的烯键饱和，并在与噻吩相邻的碳上引入羧基。



盐酸赛庚啶



氯雷他定

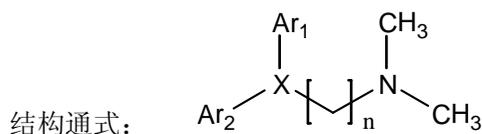


富马酸酮替芬

药名	理化性质	临床用途
赛庚啶	一分子本品含 1.5 个结晶水	具有较强的 H ₁ 受体拮抗作用，并具有一定的抗 5-HT 及抗胆碱作用。 临床用于荨麻疹等过敏性疾病。
氯雷他定	强效选择性非镇静 H ₁ 受体拮抗剂。	
富马酸酮替芬	抗组胺作用较强，作用时间长。临床用于治疗哮喘	

6. 哌啶类 将哌嗪类药物中一个氮原子用碳原子代替即得到吡啶类。代表性药物阿司咪唑、特非那定，均有较强 H₁ 受体拮抗作用。

7. 组胺 H₁ 受体拮抗剂的构效关系



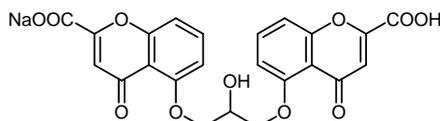
①Ar₁ 可为苯基，且可有氯或甲基取代，Ar₂ 可为苯基及其他五元或六元芳杂环；②X 可为氧、氮、碳，n 一般等于 2；③Ar₁ 和 Ar₂ 非共平面对保持活性最佳；④当手性中心靠近芳核时，对映异构体之间活性差别大。但当手性中心邻近叔 N 原子时，则对映异构体之间活性差别不明显；⑤几何异构体中一般反式体（E 式）活性大，如泰尔登、阿伐斯汀等。

二、过敏介质与抗过敏药

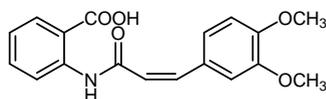
过敏反应除了同 H₁ 受体相关外，还同许多过敏介质有关，如白三烯、缓激肽、血小板活化因子等。

1. 过敏介质释放抑制剂

代表药物：色甘酸钠、曲尼司特；结构特点：结构中均含有羧基，为酸性抗过敏药。

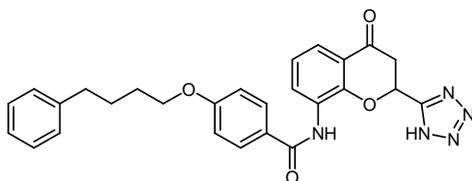


色甘酸钠



曲尼司特

2. 过敏介质拮抗剂 代表药物：扎鲁司特、普鲁司特



普鲁司特

临床用途：特异性 cysLT 受体拮抗剂，轻中度哮喘治疗药。

第九篇 内分泌药物

第三十一章 肾上腺皮质激素类药物

一、甾体分类

1. 按照基本结构类型可分为：①雄甾烷类；②雌甾烷类；③孕甾烷类。

2. 按照药理作用不同可分为：①性激素（又可分为：雌性激素、孕激素、雄性激素与蛋白同化激素）。②肾上腺皮质激素（又可分为：糖代谢皮质激素、盐代谢皮质激素）。

雌性激素以雌甾烷为母体；雄性激素和蛋白同化激素一般以雄甾烷为母体；孕激素以孕甾烷为母体。

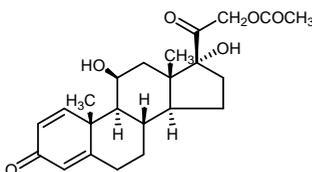
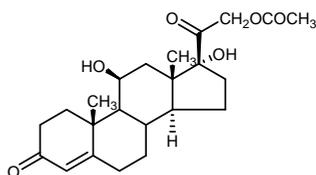
3. 甾体药物的结构特点：具有环戊烷并多氢菲母核，六个手性碳。

二、糖皮质激素类药物分类

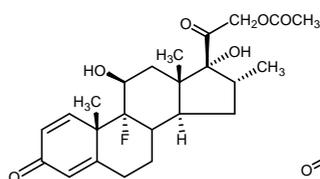
①盐皮质激素，如醛固酮；②糖皮质激素，如可的松和氢化可的松

糖皮质激素化学结构修饰的主要目的集中在如何将糖皮质激素活性与盐皮质激素活性分开，以减少副作用。

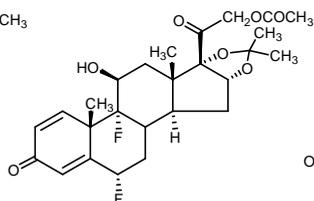
三、糖皮质激素的代表性药物 醋酸氢化可的松、醋酸泼尼松龙、醋酸地塞米松、醋酸氟轻松。



醋酸氢化可的松



醋酸泼尼松龙



醋酸地塞米松

醋酸氟轻松

醋酸曲安奈德

共同结构特点	以孕甾烷为母体，都含有 3-酮-4-烯，11β，17α-二羟基，21 醇成醋酸酯。		
药名	结构特点及化学名	理化性质/体内代谢	临床用途
醋酸氢化可的松	11β，17α，21-三羟基孕甾-4-烯-3，20-二酮-21-醋酸酯		用于风湿症、类风湿性关节炎等炎症疾病的治疗
醋酸泼尼松龙	含有 1-烯结构		
地塞米松	含有 1-烯，9α-氟，16α-甲基。若为 16β-甲基，称作醋酸倍他米松；	①需避光保存；② 显色反应	
醋酸氟轻松	在醋酸地塞米松的结构基础上，增加 6α-氟，并用羟基置换 16α-甲基，再将 16α，17α-二羟基与丙酮成缩酮。	用于包括神经性，接触性，脂溢性皮炎，湿疹，牛皮癣等在内的各种皮肤病。与抗生素一起使用	
醋酸曲安奈德	减轻损害性刺激所产生的疼痛的反应，特别由于创伤性、类风湿性关节炎等胶原性疾病及过敏性、神经性皮炎等皮肤病		

上述药物以醋酸地塞米松活性最强，副作用最小。糖皮质激素类药物长期大量使用可产生骨质疏松、多毛症、满月脸等副作用。

2. 糖皮质激素类药物的构效关系★

①21 羟基成醋酸酯（为前药）后，活性不变，作用时间延长；② 引入 1 位双键，抗炎活性增大；③在 9α 位引入氟原子，在活性增大的同时，盐代谢作用增大；④ 6 位引入氟原子，与在 9α 位引入氟原子产生同样的效果；⑤ 若在 9α 位引入氟原子的同时，在 16 位引入羟基或甲基，抗炎活性增加明显，潴留副作用几近消失；⑥16α-甲基转换成β-甲基，活性有所升高。

第三十二章 性激素和避孕药

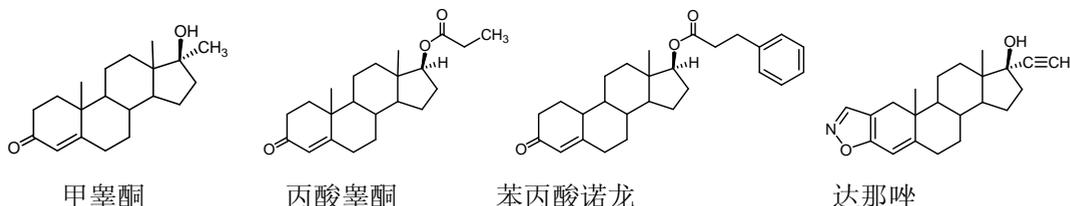
一、雄性激素类药物

1. 雄性激素、蛋白同化激素

(1) 临床应用特点：①雄性激素是维持雄性生殖器发育及促进第二性征发育的物质。雄性激素还具有蛋白同化活性，能促进蛋白质的合成，抑制蛋白质的代谢，使肌肉生长发达；②临床上雄性激素用于内源性激素分泌不足的补充疗法；③蛋白同化激素用于治疗病后虚弱和营养不良。

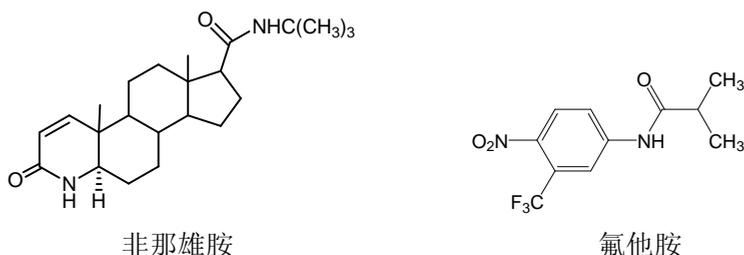
(2) 代表性药物：甲睾酮、丙酸睾酮、苯丙酸诺龙、达那唑。

共同结构特点：除苯丙酸诺龙以雌甾烷为母体外，其他三药均以雄甾烷为母体。



药名	结构特点及化学名	理化性质	临床用途
甲睾酮	含有 17 α -甲基和 17 β -羟基，还含有雄激素常见的 3-酮-4-烯； 17 α -甲基-17 β -羟基雄甾-4-烯-3-酮	为天然雄性激素睾酮的衍生物	用于雄性激素缺乏导致的疾病的治疗
丙酸睾酮	为甲睾酮去除 17 α -甲基后的丙酸酯； 17 β -羟基雄甾-4-烯-3-酮丙酸酯	本品为睾酮的长效衍生物，注射一次可维持药效 2-4 天	
苯丙酸诺龙	为甲睾酮去除 17 α -甲基和 19-甲基后的苯丙酸酯 17 β -羟基雌甾-4-烯-3-酮-3-苯丙酸酯	①为蛋白同化激素，因不含 19-甲基，雄性激素活性明显下降；②用于消耗性疾病的恢复期，也用于恶性肿瘤手术前后、严重骨质疏松及长期营养不良的辅助治疗；③女性长期大量使用，可产生轻微男性化的副作用。	
达那唑	甲睾酮 17 α -甲基被乙炔基置换后，在 2，3 位并合一个异噁唑环	弱雄性激素，兼有蛋白同化作用和抗孕激素作用	

2. 抗雄性激素药 代表性药物：非那雄胺、氟他胺。

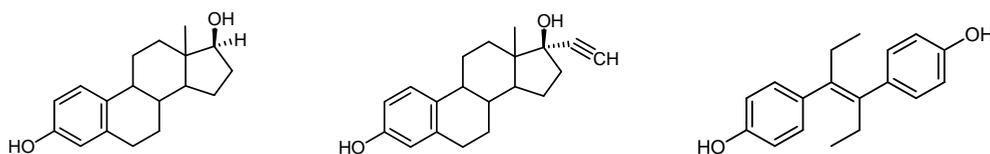


药名	结构特点	临床用途
非那雄胺	以 4-氮杂雄甾烷为母体	雄性激素生物合成抑制剂，临床用于良性前列腺增生的治疗
氟他胺	为非甾体药物，以硝基苯为母体，在 2 位有三氟甲基，在 4 位有异丁酰氨基	雄性激素受体拮抗剂，抗雄性激素，治疗前列腺癌

二、雌性激素类药物

雌性激素与孕激素一起完成女性周期、妊娠，授乳等方面的作用，还有降低胆固醇的作用。临床用于雌激素缺乏症，性周期障碍等，也用于治疗绝经症状和骨质疏松、乳腺癌和前列腺癌

1. 雌性激素类 代表性药物：甾体雌性激素（雌二醇、炔雌醇），非甾体雌激素（己烯雌酚）。



	雌二醇	炔雌醇	己烯雌酚
药名	结构特点及化学名	理化性质/体内代谢	临床用途
雌二醇	以雌烷为母环的化合物，A环以芳香环为其结构特征，3位酚羟基 雌甾-1, 3, 5(10)-三烯-3, 17β-二醇	①体内代谢形成雌三醇；②在3, 17位的羟基保持0.855nm的距离；③17位羟基体内氧化代谢失活。	雌激素，用于治疗卵巢功能不全引起的病症，如更年期障碍，子宫发育不全及月经失调等
炔雌醇	在雌二醇的17α位引入乙炔基即得炔雌醇； 3-羟基-19-去甲-17α-孕甾-1, 3, 5(10)-三烯-20-炔-17-醇	结构中含有炔基，其乙醇溶液遇硝酸银试液产生白色炔雌醇银沉淀	口服有效，活性是雌二醇的10~20倍。临床与孕激素合用产生抑制排卵的协同作用，可作为女性避孕药使用
己烯雌酚	以萘为母体，在苯环的对位含有羟基，在双键上连有两个乙基，立体构型与雌二醇很接近	含有两个酚羟基，可与三氯化铁发生呈色反应：先呈绿色，再慢慢变为黄色	非甾体雌激素，结构与天然雌激素十分接近；反式有效，顺式体无雌激素活性。临床用途与雌二醇相同

2. 抗雌激素药（雌激素受体拮抗剂）

可与雌激素受体持久而强烈地结合，从而产生雌激素受体拮抗作用。

代表药：氯米芬（不孕症的治疗药）、他莫昔芬（治疗雌激素依赖性的乳腺癌）、雷洛昔芬（治疗骨质疏松）。

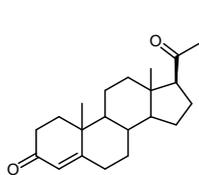
三、孕激素、甾体避孕药和抗孕激素药

1. 孕激素和甾体避孕药

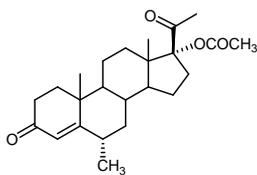
孕激素具有准备和维持妊娠的功能

代表性药物：黄体酮、醋酸甲羟孕酮、醋酸甲地孕酮、炔诺酮、左炔诺孕酮。

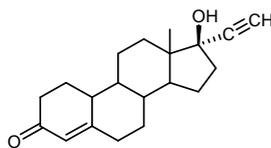
药名	结构特点及化学名	理化性质/体内代谢	临床用途
黄体酮	以孕甾烷为母体，在3, 20位有二酮，4, 5位有双键 孕甾-4-烯-3, 20-二酮	①有两种晶型，α型和β型；②20位有甲基酮结构，可与高铁离子络合，与亚硝基铁氰化钠反应生成兰紫色的阴离子复合物（特征反应）；③本品与羰基试剂如盐酸羟胺反应生成二肟；④与异烟肼反应则生成浅黄色的异烟腙化合物。	孕激素，临床用于黄体机能不足引起的先兆性流产和习惯性流产，月经不调等症
醋酸甲羟孕酮	以孕甾烷为母体，在黄体酮结构基础上，在6位有α-甲基，在17位有α-羟基醋酸酯	为口服、注射两用的孕激素，临床用途与黄体酮基本相同，大剂量可作为避孕药使用	
炔诺酮	以雌甾烷为母体，在17位均有β-羟基和α-乙炔基	17β-羟基-19-去甲-17α-孕甾-4-烯-20-炔-3-酮	口服有效，抑制排卵作用强于孕酮，临床用于痛经，功能性子宫出血，子宫内膜异位症等
左炔诺孕酮	13位为乙基取代，由于17位羟基的阻碍使得13位乙基不能自由旋转，产生新的光学活性	D-(-)-17α-乙炔基-17β-羟基-18-甲基雌甾-4-烯-3-酮	与炔诺酮相同，但孕激素活性是炔诺酮的100倍，是临床广泛使用的女性口服避孕药
醋酸甲地孕酮	醋酸甲羟孕酮类似物，在5, 6位形成双键即为醋酸甲地孕酮	高效避孕药，口服为黄体酮的75倍，无雌激素和雄激素的活性，本品与雌激素类药物配伍用作避孕药	



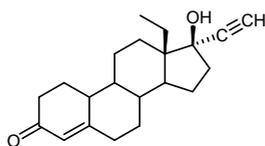
黄体酮



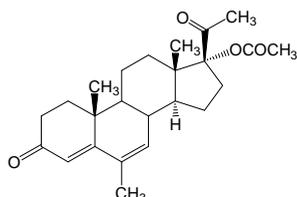
酸甲羟孕酮



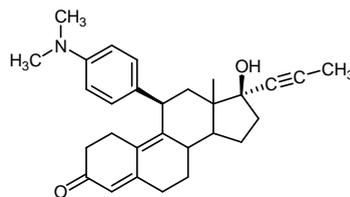
炔诺酮



左炔诺孕酮



醋酸甲地孕酮



米非司酮

2. 抗孕激素药 代表性药物：米非司酮：

药名	结构特点	临床用途
米非司酮	以雌甾烷为母体，含有 3-酮，4，5 和 9，10-二烯，11β-对二甲氨基苯基，17β-羟基和 17α-丙炔基	妊娠早期引产药，半衰期长达 34 小时，引产有效率高达 90%-95%

第三十三章 胰岛素及口服降糖药

糖尿病分类：胰岛素依赖型（I 型糖尿病），非胰岛素依赖型（II 型糖尿病）两种。

一、胰岛素

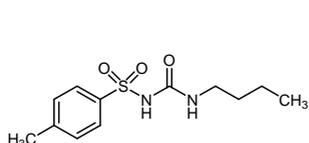
由两个肽链组成，合计共有 26 种 51 个氨基酸，具有蛋白质性质，两性；微酸性；溶液中不稳定，易产生脱氨衍生物，在体内其调节糖代谢的作用，治疗糖尿病。

二、口服降糖药

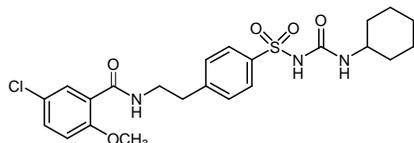
1. 胰岛素分泌促进剂

(1) 磺酰脲类 代表药物：甲苯磺丁脲、格列本脲、格列美脲、格列齐特、格列吡嗪

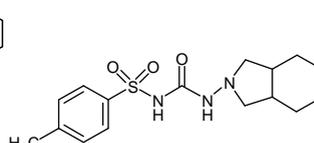
共同结构特点：结构式中含有磺酰脲结构。



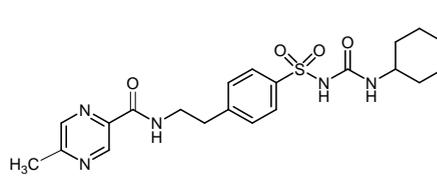
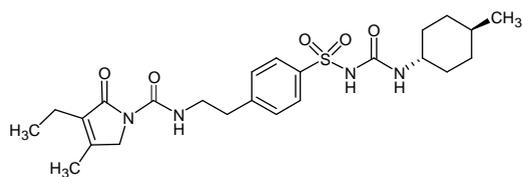
甲苯磺丁脲



格列本脲



格列齐特

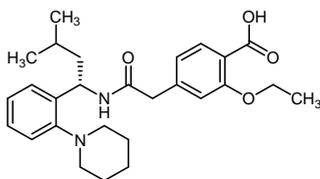


格列美脲

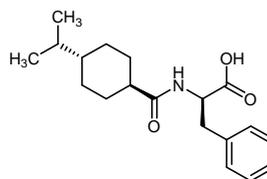
格列吡嗪

药名	结构特点及化学名	理化性质/体内代谢	临床用途
甲苯磺丁脲	结构中含有磺酰脲结构； N-[(丁氨基)羰基]-4-甲基苯磺酰胺	在肝脏中降解氧化为羧基或羟基衍生物而失活	降糖药
格列本脲 (优降糖)	苯环上磺酰基的对位引入了较大结构的侧链，脲基末段都带有脂环		第二代磺酰脲类口服降糖药
格列美脲	结构中苯环上磺酰基的对位含有噻唑酮结构，含有两个手性	用于 II 型糖尿病，可以同胰岛素共用	
格列齐特	结构中磺酰脲结构连接含氮杂环	用于有一定分泌胰岛素能力的中度 II 型糖尿病患者	
格列吡嗪	结构中苯环上磺酰基的对位含有吡嗪结构	促进胰岛 β 细胞分泌胰岛素能力	

(2) 非磺酰脲类 本类药物都是通过阻断胰腺 β 细胞上 ATP 敏感的钾通道，引起钙通道开放，刺激胰岛素分泌。 代表性药物：瑞格列奈、那格列奈。



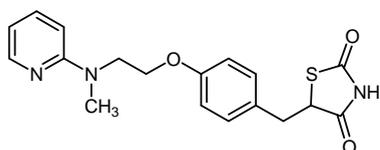
瑞格列奈



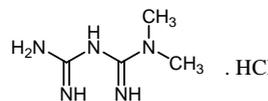
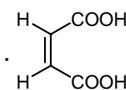
那格列奈

药名	结构特点	临床用途
瑞格列奈	氨基酰甲基苯甲酸衍生物，含有一个手性碳，活性：S(+)>R(-)，优势构象呈 U 型	主要用于 II 型糖尿病，被称为膳食葡萄糖调节剂
那格列奈		氨基丙酸衍生物。作用同上

2. 胰岛素增敏剂 代表性药物：马来酸罗格列酮、盐酸二甲双胍



马来酸罗格列酮



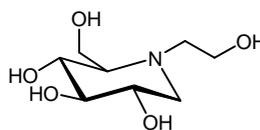
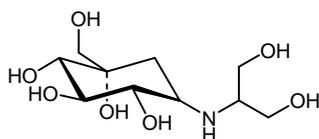
盐酸二甲双胍

药名	结构特点及化学名	理化性质/体内代谢	临床用途
盐酸二甲双胍	双胍结构；1, 1-二甲基双胍盐酸盐	强碱强酸盐，水溶液中性	降血糖，副作用小
马来酸罗格列酮	含有噻唑烷二酮结构	高选择性过氧化物酶体-增殖系统活化受体 γ (PPAR γ) 激动剂，增加胰岛素对受体靶组织的敏感性。适用于 II 型糖尿病患者	

3. α-葡萄糖苷酶抑制剂

减慢糖类水解产生葡萄糖的速度，延缓葡萄糖的吸收。此类适用于 I、II 型糖尿病患者。

代表药物：阿卡波糖、伏格列波糖、米格列醇



伏格列波糖

米格列醇

药名	结构特点	临床用途
阿卡波糖	放线菌属微生物中分离得到的低聚糖，四个糖基相联	降低单糖的吸收速率
伏格列波糖	氨基糖类似物；肠道内选择性抑制双糖水解酶，适用于餐后高血糖现象，胃肠道副作用较小	
米格列醇	葡萄糖类似物	强效抑制 α -葡萄糖苷酶，口服

第十篇 维生素类药物

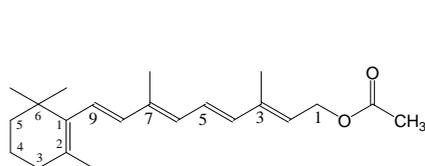
第三十四章 脂溶性维生素

一、维生素按照溶解性不同的分类

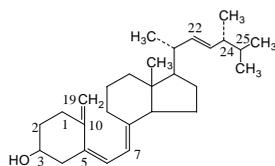
分为两类：①. 脂溶性维生素； ② 水溶性维生素。

二、脂溶性维生素

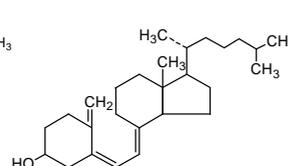
代表药物：维生素 A 醋酸酯、维生素 D₂、维生素 D₃、维生素 E、维生素 K₃。



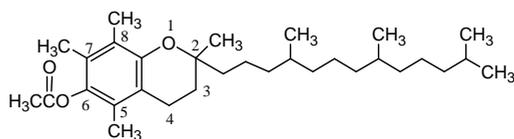
维生素 A 醋酸酯



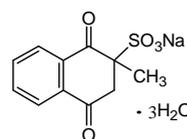
维生素 D₂



维生素 D₃



维生素 E



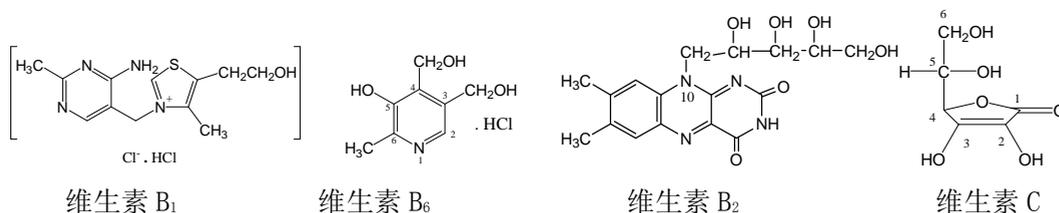
维生素 K₃

药名	结构特点	理化性质	临床用途
维生素 A 醋酸酯（又名视黄醇）	侧链上有四个双键，发现有 6 种异构体，其中全反式活性最强；	①易被氧化成环氧化物；②容易发生脱水；③加热或光照条件下可生成多种异构体，活性均下降；④长期贮存可部分发生异构化	主要用于夜盲症、角膜软化以及皮肤粗糙、干裂等
维生素 D ₂	D ₂ 和 D ₃ 区别仅在于 17 位侧链不同	可促进钙、磷的吸收，加速骨骼的钙化。临床用于儿童佝偻病、老年骨质疏松的治疗	
维生素 D ₃ （又称胆骨化醇）			
维生素 E（ α -生育酚醋酸酯）	以苯并二氢吡喃为母体，有三个手性中心，天然的为 R 型右旋体。合成的为消旋体	强碱性醇溶液共热，水解为 α -生育酚，酚羟基与三价铁离子作用变色	用于流产、不孕症的治疗
维生素 K ₃	以甲萘醌为母体	有促进凝血作用，也有镇痛作用。	

注意：维生素 D₃在体内需经肝脏和肾脏两次氧化代谢活化后，才产生促进钙磷吸收的作用，代谢的产物为 1, 25 位引入羟基。老年人体内催化维生素 D₃ 1 位代谢氧化的酶（肾脏 1 α -羟化酶）活性不足，因此人工合成出维生素 D₃ 的 1-羟基物，临床称作阿法骨化醇。老年人服用阿法骨化醇后，再在肝脏氧化代谢引入 25 羟基，产生活性

第十五章 水溶性维生素

水溶性维生素代表药：维生素 B₁、维生素 B₂、维生素 B₆、维生素 C。



药名	结构特点及化学名	临床用途
维生素 B ₁ (又名硫胺)	以 2-甲基-4-氨基-噻啉为母体，在 5 位连有 4-甲基-5-羟乙基噻唑，噻唑氮原子成氯化物，并成盐酸盐； 氯化-4-甲基-3-[(2-甲基-4-氨基-5-噻啉基)甲基]-5-(2-羟基乙基)噻唑噻盐	与糖代谢有关，临床用于多发性神经炎以及维生素 B ₁ 缺乏症状的治疗
维生素 B ₂ (又名核黄素)	维生素 B ₂ 以异咯嗪环为母体，在 10 位连有核糖的结构； 7, 8-二甲基-10-(D-核糖型-2, 3, 4, 5-四羟基戊基)异咯嗪	参与糖，脂肪蛋白代谢，维持正常视觉功能，促进生长；是前药
维生素 B ₆	又名盐酸吡多辛，含吡啉环； 5-羟基-6-甲基-3, 4-吡啉二甲醇盐酸盐	有止吐作用，也可用于脂溢性皮炎等皮肤病的辅助治疗
维生素 C(L- (+)-抗坏血酸)	以 γ-丁内酯为母体，在 2 位有双键，在 2, 3, 5, 6 位连有四羟基； L- (+)-苏阿糖型-2, 3, 4, 5, 6-五羟基-2-己烯酸-4-内酯	用于坏血病的预防及治疗

药名	理化性质
维生素 B ₁	① 固态稳定，有极强吸湿性；② 碱性溶液中分解；③ 与空气长期接触氧化成具有荧光的硫色素，活性消失，光照或重金属离子加速氧化反应。④ 在体内易被硫胺酶破坏
维生素 B ₂	① 溶解于稀氢氧化钠溶液；② 光照不稳定；③ 在酸性或中性溶液中可分解为光化色素；④ 碱性溶液中分解为感光黄素
维生素 B ₆	① 固体在干燥状态下稳定；② 维生素 B ₆ 是三种结构类似的化合物：吡多醇、吡多醛和吡多胺，体内相互转化。③ 维生素 B ₆ 水溶液遇空气氧化变色；④ 酚羟基与三氯化铁作用成红色⑤ 吡多辛为弱碱性，与盐酸成盐后呈酸性。
维生素 C	① 存在连二烯醇结构，水溶液显酸性；② 固体在干燥时稳定，在潮湿和光照下，颜色逐渐变黄；③ 在碳酸氢钠或稀氢氧化钠水溶液中，可生成 3-烯醇钠盐；④ 在强碱性条件下，内酯水解开环；⑤ 因连二烯醇具有较强还原性，易在空气中氧化，光照、金属离子、加热可促进氧化反应；⑥ 在水溶液中可被硝酸银、三氯化铁等氧化生成脱氢抗坏血酸；⑦ 内酯环水解后，可经进一步脱水、脱羧生成糠醛，并聚合显色；⑧ 结构中有两个手性碳原子，四个光学异构体，其中以 L(+)-抗坏血酸活性最强（注意掌握其化学结构）。



维生素C的四种形式

维生素C分子中含有两个手性碳原子,故有四个光学异构体,其中L(+)-抗坏血酸活性最高。

全真试题(药物化学部分)

一、最佳选择题,共16题,每题1分。每题的备选答案中只有一个最佳答案。

85. 盐酸普鲁卡因与生物大分子的键合形式不包括

- A. 范德华力 B. 疏水性相互作用
C. 共价键 D. 偶极-偶极作用
E. 静电引力

答案: D

86. 将噻吗洛尔(pKa9.2, lgP=-0.04)制成丁酰噻吗洛尔(lgP=2.08)的目的是

- A. 改善药物的水溶性 B. 提高药物的稳定性
C. 降低药物的毒副作用 D. 改善药物的吸收性
E. 增加药物对特定部位的选择性

答案: D

87. 喹诺酮类抗菌药可与钙、镁、铁等金属离子形成螯合物,是因为分子中存在

- A. 7位哌嗪基团 B. 6位氟原子
C. 8位甲氧基 D. 1位羟基
E. 3位羧基和4位酮羰基

答案: E

88. 为γ-氨基丁酸的环状衍生物。可促进乙酰胆碱合成的改善脑功能药物是

- A. 盐酸多奈哌齐 B. 利斯的明
C. 吡拉西坦 D. 石山碱甲
E. 氢溴酸加兰他敏

答案: C

89. 对盐酸麻黄碱描述错误的是

- A. 可通过血脑屏障 B. 属易制毒化学品
C. 构型为(1S,2S) D. 在水中易溶解
E. 构型为赤藓糖型

答案: C

90. 洛伐他汀的作用靶位是

- A. 血管紧张素转换酶 B. 磷酸二酯酶
C. 单胺氧化酶 D. 羟甲戊二酰辅酶A还原酶
E. 酪氨酸激酶

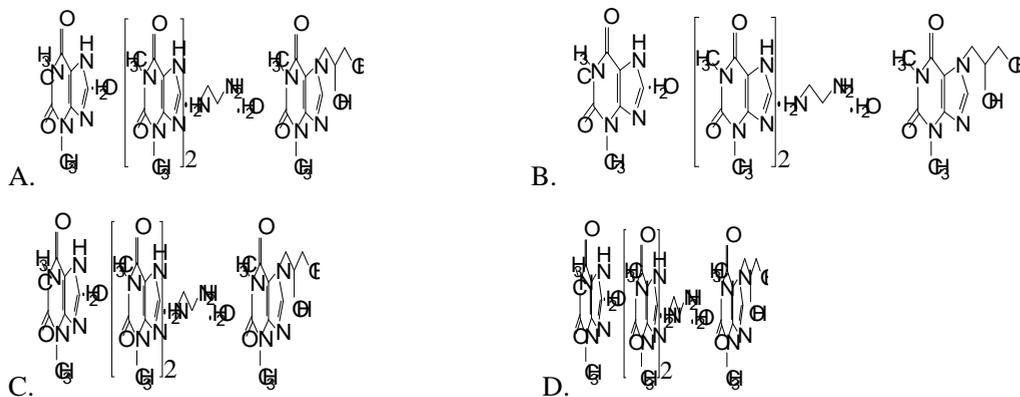
答案: D

91. 对单硝酸异山梨醇酯描述错误的是

- A. 原是硝酸异山梨酯的活性代谢物 B. 作用时间达6小时
C. 脂溶性大于硝酸异山梨酯 D. 无肝脏的首关代谢
E. 作用机制为释放NO血管舒张因子

答案: C

92. 氨茶碱的化学结构是



E. 在 16 位、17 位的羟基与丙酮缩合为缩酮, 增加疗效。 答案: C

98. 靶器官为乳腺的药物是

- A. 氯米芬
- B. 黄体酮
- C. 他莫昔芬
- D. 米非司酮
- E. 雷诺昔芬

答案: C

99. 经肝脏 D-25 羟化酶代谢直接生成骨化三醇的药物是

- A. 维生素 D₂
- B. 麦角骨化醇
- C. 阿法骨化醇
- D. 胆骨化醇
- E. 维生素 D₃

答案: C

100. 维生素 C 的化学命名是

- A. L(+)-苏阿糖型-2, 3, 4, 5, 6-五羟基-2-己烯酸-4-内酯
- B. L(-)-苏阿糖型-2, 3, 4, 5, 6-五羟基-2-己烯酸-4-内酯
- C. D(-)-苏阿糖型-2, 3, 4, 5, 6-五羟基-2-己烯酸-4-内酯
- D. D(+)-苏阿糖型-2, 3, 4, 5, 6-五羟基-2-己烯酸-4-内酯
- E. L(±)-苏阿糖型-2, 3, 4, 5, 6-五羟基-2-己烯酸-4-内酯

答案: A

二、配伍选择题, 共 32 题, 每题 0.5 分。备选答案在前, 试题在后。每组若干题。每组题均对应同一组备选答案, 每题只有一个正确答案, 每个备选答案可重复选用, 也可不选用。

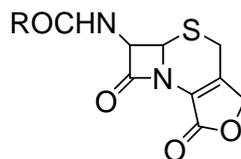
[101-102]

- A. 头孢曲唑
- B. 头孢噻吩钠
- C. 头孢克肟
- D. 头孢克洛
- E. 头孢羟氨苄

[101-102]

- A. 头孢曲松
- B. 头孢噻吩钠
- C. 头孢克肟
- D. 头孢克洛
- E. 头孢羟氨苄

1 水溶液在 pH8 以上室温条件下 水解生成



的药物是

2 结构中 7 位侧链为 片断的药物是

答案: 1.B 2.A

[103-104]

- A. 更昔洛韦
- B. 泛昔洛韦
- C. 昔多福韦
- D. 阿德洛韦
- E. 阿昔洛韦

1. 为喷昔洛韦前体药物的是

2.为第一个上市的开环核苷类抗病毒药物是

答案：1.B 2.E

[105-107]

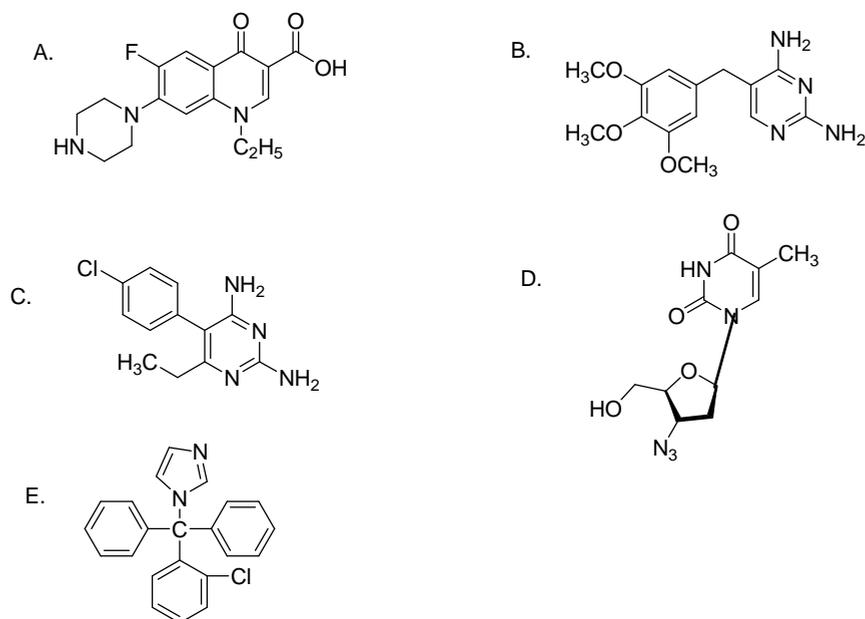
A. 磺胺甲噁唑 B. 来曲唑 C. 奥司他韦 D. 左氧氟沙星 E. 甲磺酸伊马替尼

11. 作用于酪氨酸激酶受体通路的抗肿瘤药物是

12. 作用于芳香化酶的抗肿瘤药物是

13. 作用于神经氨酸酶的抗病毒药物是

[108-111]



1.抑制病毒逆转录酶，用于艾滋病治疗的药物是

2.抑制二氢叶酸还原酶，用于疟疾预防和治疗的药物是

3.抑制二氢叶酸还原酶，用作抗菌增效剂的药物是

4.抑制甾醇 14 α -脱甲基酶，用于抗真菌的药物是

答案：1.D 2.C 3.B 4.E

[112-115]

A.甲氨蝶呤 B.巯嘌呤 C.吉西他滨 D.长春瑞滨 E.卡莫氟

14. 属尿嘧啶抗代谢物的药物是

15. 属胞嘧啶抗代谢物的药物是

16. 属嘌呤类抗代谢物的药物是

17. 属叶酸类抗代谢物的药物是

[116-118]

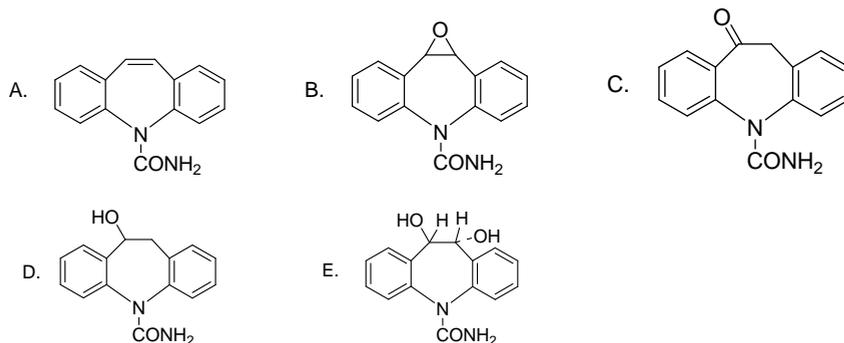
A. 苯巴比妥 B. 苯妥英钠 C. 加巴喷丁 D. 卡马西平 E. 丙戊酸钠

10. 含有环状丙二酰脲结构, 属国家特殊管理的精神药品是

11. 含有乙内酰脲结构, 具有“饱和代谢动力学”特点的药物是

12. 含有 γ -氨基丁酸结构, 口服吸收良好的药物是

[119-121]



9. 奥卡西平的化学结构是

10. 卡马西平的化学结构是

11. 奥卡西平和卡马西平共有的代谢物结构是

[129-130]

A. 瑞格列奈 B. 格列本脲 C. 罗格列酮 D. 二甲双胍 E. 阿卡波糖

1. 属于非磺酰脲类促胰岛素分泌剂的药物是

2. 属于噻唑烷二酮类胰岛素增敏剂的药物是

答案: 1.A 2.D

[131-132]

A. 醋酸氢化可的松 B. 醋酸地塞米松
C. 醋酸泼尼松龙 D. 醋酸氟轻松 E. 醋酸曲安奈德

1. 16α 位为甲基的药物是

2. $2,6\alpha$ 、 9α 双氟取代的药物是 答案: B、D

多选题

133. 使药物水溶性增加的结合反应有

A. 与氨基酸的结合反应 B. 乙酰化结合反应 C. 与葡萄糖醛酸的结合反应
D. 与硫酸的结合反应 E. 甲基化结合反应

答案: ACD

134. 下列抗抑郁药物中, 代谢产物与原药保持相同药效的药物有

A. 盐酸氟西汀 B. 文拉法辛 C. 舍曲林 D. 盐酸帕罗西汀 E. 盐酸阿米替林

答案: AB

135. 镇痛作用比吗啡强的药物有

A. 盐酸纳洛酮 B. 盐酸哌替啶 C. 右丙氧芬 D. 枸橼酸芬太尼 E. 盐酸美沙酮

答案: DE

136. 下列药物中属于前体药物的有

A. 洛伐他汀 B. 赖诺普利 C. 马来酸依那普利 D. 卡托普利 E. 福辛普利

答案: ACE

137. 下列钙拮抗剂中, 存在手性中心的药物有

A. 硝苯地平 B. 尼莫地平 C. 尼群地平 D. 桂利嗪 E. 氨氯地平

答案: BCE

139. 对奥美拉唑描述正确的有

A. 是前体药物 B. 具有手性, S 和 R 两种光学异构体疗效一致
C. 口服后在十二指肠吸收 D. 为可逆性质子泵抑制剂 E. 在酸性的胃壁细胞中发挥作用

答案: ABCE

140. 2. 属于 5-HT₃ 受体拮抗剂的有

A. 盐酸格拉司琼 B. 甲氧氯普胺 C. 托烷司琼 D. 多潘立酮 E. 盐酸昂丹司琼

答案: ACE