

<<实用药物化学>>

图书基本信息

## <<实用药物化学>>

### 内容概要

《实用药物化学（原著第3版）》是迄今为止内容最为丰富的综合性药物化学专著之一，涵盖了整个创新药物研发过程中所涉及的基本原理、常用方法及最新技术与发展趋势。

《实用药物化学（原著第3版）》详细讨论了先导化合物发现的新进展，包括自动化高通量筛选技术、组合化学和X射线结晶技术在药物发现和优化中的应用等，同时探讨了药物研发和生产中的法律和经济方面的问题。

《实用药物化学（原著第3版）》的50多名作者来自8个国家，长期从事创新药物研究。所撰写的内容是作者在各自研究领域中所积累知识和经验的系统总结。



## 书籍目录

第一版序言 第二版序言 第三版序言 第一部分药物化学概要 第1章药物发现史 1.1引言 1.2药物发现的200年历史 1.3近代药物研发的新趋势 参考文献 第2章药物化学的定义和目的、药物作用阶段及药物分类 2.1定义和目的 2.2药物作用阶段 2.3药物的分类 参考文献 第3章药效的测定和表示 3.1引言 3.2体外实验 3.3离体实验 3.4体内实验 参考文献 第4章药物分子靶标 4.1引言 4.2药物靶标：酶 4.3药物靶标：膜转运蛋白 4.4药物靶标：电压门控离子通道 4.5药物靶标：非选择性阳离子通道 4.6配体直接门控离子通道（内源性离子受体通道） 4.7内源性活性酶受体 4.8偶联到各种胞浆蛋白的受体 4.9 G—蛋白偶联受体（GPCRs） 4.10药物靶标：细胞核受体 参考文献 第5章药物靶标，靶标识别、鉴定和筛选 5.1引言 5.2改进疾病病因的识别 5.3生物药物疗法 5.4药物靶标识别 5.5从活性化合物到先导化合物 5.6临床生物标记物 5.7小结 参考文献 第二部分先导化合物的发现策略 第6章先导化合物的发现策略及假设 6.1简介 6.2策略一：类似物设计 6.3策略二：系统筛选 6.4策略三：生物信息的开发利用 6.5策略四：计划性研究及合理设计方法（应用实例） 6.6总结 参考文献 第7章高通量筛选和药物发现 7.1简介 7.2历史背景 7.3从筛选到先导化合物 7.4先导化合物来源于筛选的药物 7.5近来的应用实例 7.6结论 参考文献 第8章作为药物及先导化合物结构的天然产物 8.1绪论 8.2天然产物在药物发现和开发中的重要性 8.3基于天然产物的有效药物发现的方法设计 8.4天然产物及其类似物作为药物的案例 8.5未来天然产物作为药物和药物设计模板的研究方向 8.6总结 参考文献 第9章化合物库建设中的生物学导向及多样性导向合成 9.1简介 9.2多样性导向合成 9.3生物学导向合成 9.4结论与展望 参考文献 第10章虚拟筛选：使用数据库挖掘技术的候选化合物发现方法 10.1引言 10.2化学结构的表示方法 10.3数据挖掘方法 10.4数据库搜索 10.5应用 10.6结论及未来的研究方向 参考文献 第11章基于碎片的药物设计 11.1配体—蛋白质相互作用：基本原理 11.2制药企业在20世纪90年代后期的药物发现状况 11.3什么是FBDD 11.4 FBDD化合物库的创建和分析 11.5核磁共振 11.6 X射线衍射晶体学 11.7其他生物物理和生物化学筛选技术 11.8活性碎片的后续发展方法 11.9未来发展的趋势 参考文献 第12章类先导性和类药性 12.1引言 12.2评价类药性 12.3选择更好的先导化合物：类先导性 12.4结论 参考文献 第13章网络直通车：利用因特网作为药物化学的工具 13.1简介 13.2博客 13.3维基 13.4化合物信息 13.5化合物的生物学性质 13.6药物信息 13.7物理化学信息 13.8分子性质的预测和计算 13.9化合物供应商 13.10化合物合成 13.11化学软件程序 13.12分析 13.13化学出版物 13.14专利信息 13.15毒理学 13.16元站点和技术服务提供商数据库 第三部分构效关系初探 第14章同系物分子变换：插烯物和插苯物 14.1同系物系列 14.2插烯物和插苯物 参考文献 第15章基于电子等排原理的分子变换 15.1引言 15.2历史：电子等排概念的发展 15.3电子等排和生物电子等排修饰 15.4骨架迁越 15.5对电子等排结构变换的分析 15.6少数类金属物—毒性电子等排体 参考文献 第16章环系转换 16.1引言 16.2模拟性方法 16.3剖裂方法 16.4拼接方法 16.5结语 参考文献 第17章药物化学中的构象限制和（或）立体障碍 17.1引言 17.2实例研究 17.3总结与展望 参考文献 第18章同二聚体和异二聚体配体：挛药原理 18.1引言 ..... 第四部分取代基和官能团：构效关系的定性和定量问题 第五部分空间组织、受体定位和分子模拟 第六部分化学修饰对药代动力学性质的影响 第七部分溶解与配方问题的药物和化学解决方法 第八部分新药开发：法律和经济方面

## 章节摘录

版权页：插图：正如在白细胞中的发现一样，PI3K通路在多种不同类型的细胞中均存在。它们主要是控制细胞发育和分化。

癌细胞中的PI3K信号肽对旁路正常发育限制控制的最重要的作用是促进PI3K抑制剂的开发。

近年来的研究表明，PI3K跟许多疾病，如心力衰竭和自身免疫及炎症疾病的发病机制是密切相关的。

然而，PI3K抑制剂开发必须充分考虑对不同PI3K亚型的选择性问题，如PI3K通路抑制剂，包括酪氨酸激酶抑制剂在内，一般用于癌症的治疗，但它们也可能诱导心脏病。

有意思的是，纳巴霉素的哺乳动物靶标（m-TOR）的抑制剂，作为PI3K的一个下游效应物，对心脏并没有副作用，这表明它可以用作靶向下游的效应物。

相反，PI3K亚型的选择性抑制剂目前被推荐作为一类新的治疗急性心肌梗死的药物。

多酚类化合物白藜芦醇（resveratrol）具有化学预防和化学治疗的特点，通常被认为是跟组蛋白脱乙酰基酶HDAC3抑制有关，但也能抑制PI3K。

这表明将药物的治疗用途和它们已知的靶标联系起来实际上是很难的。

4.10 药物靶标：细胞核受体 细胞核受体是一类配体门控的转录因子，它们调节基因表达，通常以同源二聚体或者异二聚体形式存在。

其配体通常是一些亲脂性的分子，如甾体激素、甲状腺激素、维生素D、维生素A酸、自由脂肪酸类介质、以及大量未知的分子（图4.8）。

这些配体控制着大多数真核生物的发育、分化、繁殖以及代谢平衡。

细胞核受体可以细分为三个亚型的超家族，即甾体激素受体家族和甲状腺/类视色素受体家族，它们包括大部分已开发出来的药物的靶标；孤儿受体家族包括细胞核受体家族的半数成员，它们之所以叫孤儿受体主要是因为它们配体的固有特征目前仍然是未知的，然而它们的成药性目前已经受到广泛的重视。

甾体激素受体家族包括雄激素受体（AR）、雌激素受体（ER）、黄体酮受体（PR，A和B）、糖皮质激素受体（GR）和盐皮质激素受体（MR）。

传统模型表明，这些受体一旦与激素配体结合，就会释放出如hsp90之类的热休克蛋白质，并转移到细胞核内，进一步在上游启动位点处以二聚体形式与复发性效应元件结合。

<<实用药物化学>>

编辑推荐

《实用药物化学(原著第3版)》对从事药物研发的科技工作者、高等院校医药相关专业的师生都具有重要的参考价值。

版权说明

本站所提供下载的PDF图书仅提供预览和简介，请支持正版图书。

更多资源请访问:<http://www.tushu007.com>