

<<手性合成与手性药物>>

图书基本信息

书名：<<手性合成与手性药物>>

13位ISBN编号：9787122023230

10位ISBN编号：7122023230

出版时间：2008-4

出版时间：化学工业出版社

作者：林国强，王梅祥 主编

页数：449

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>

## <<手性合成与手性药物>>

### 前言

从20世纪90年代起，国际上掀起了手性合成（又称对映选择性合成）及相关科学研究与应用的热潮，在一定程度上促进了手性药物以及高效选择性绿色合成的发展。

我国科学家也注意到这一重要研究方向，并陆续有出色的工作见报。

国家自然科学基金委员会适时组织了我国化学和生物学两个学科的研究人员，集中力量在手性药物的化学和生物学的某些方面开展基础研究。

首先是“九五”计划期间，由中国医学科学院药物研究所和中国科学院上海有机化学研究所的黄量与戴立信两位院士主持的国家自然科学基金“九五”重大项目《手性药物的化学与生物学研究》批准立项，经过4年努力，在黄皮酰胺、丁基苯肽、羟甲芬太尼和异硫氰基羟甲芬太尼等手性化合物及所进行的促智、抗细胞凋亡、抗老年痴呆、抗血栓形成以及镇痛作用的持续性和成瘾性等多方面研究，有若干重要发现，为推动我国具有自主知识产权的手性药物研发积累了经验。

## <<手性合成与手性药物>>

### 内容概要

本书汇集了对手性合成与手性药物研究中若干科学问题的研究成果。

在简要介绍手性合成、手性药物基础知识的基础上，按反应方法学，分别介绍了生物催化不对称合成、不对称还原与氧化反应、不对称碳-碳键形成反应、不对称Baylis-Hillman反应、金属卡宾经由的不对称催化叶立德反应、生物碱及相关药物的不对称合成、串联重排反应、可回收高效手性催化剂及其不对称催化合成。

最后，介绍了作用于M受体手性分子的药理学研究。

本书可供药物化学和有机化学专业的科研工作者阅读，也可作为相关专业研究生与高年级本科生的教材。

## &lt;&lt;手性合成与手性药物&gt;&gt;

## 书籍目录

1手性药物概述 1.1 引言 1.2 手性药物的药理学 1.3 手性药物的药代动力学 1.3.1 手性药物的吸收 1.3.2 手性药物的分布 1.3.3 手性药物的代谢 1.3.4 代谢酶的基因多态性 1.3.5 手性药物的排泄 1.3.6 手性药物异构体之间的相互作用 1.3.7 手性药物异构体的相互转化 1.3.8 影响手性药物立体选择性的其他因素 1.4 手性药物的毒理学 1.4.1 活性与副作用可以分离 1.4.2 活性与副作用不可分离 1.4.3 活性异构体产生新的毒副作用 1.5 从消旋体到单一异构体的手性转换 1.5.1 手性转换实现疗效与副作用的分离 1.5.2 手性转换优化药代动力学性质 1.5.3 手性转换开发新适应证 1.5.4 手性转换的经验 1.6 手性药物的药学 1.6.1 合成工艺 1.6.2 结构确证 1.6.3 制剂处方及工艺 1.6.4 质量研究与质量标准 1.6.5 稳定性研究 1.6.6 手性分析方法 参考文献2 生物催化法合成手性药物及中间体 2.1 引言 2.2 生物催化剂的筛选 2.2.1 生物催化剂的来源 2.2.2 生物催化剂的筛选方法 2.2.3 生物催化剂的筛选实例 2.3 生物催化的氧化还原 2.3.1 生物催化的氧化反应 2.3.2 生物催化的羰基还原 2.3.3 醇的酶促脱氢反应 2.3.4 辅酶再生 2.4 环氧化物的酶促开环 2.4.1 环氧水解酶 2.4.2 环氧化物的对映选择性酶促水解 2.4.3 环氧化物的对映归一性酶促水解 2.5 酯酶催化的手性拆分 2.5.1 引言 2.5.2 脂肪酶的手性识别机理 2.5.3 脂肪酶催化的动力学拆分 2.5.4 脂肪酶或酯酶的应用实例 2.6 羟肟酶催化的羟肟化反应 2.6.1 光学纯羟肟醇的研究及应用 2.6.2 羟肟裂解酶的分类和机理 2.6.3 微水有机相中的酶促羟肟化反应 2.6.4 微水酶促粗反应体系的改良 2.6.5 甲砒霉素和氟甲砒霉素的酶化学法合成 2.6.6 巴达木羟肟裂解酶的初步纯化与表征 2.7 脘和酰胺的对映选择性生物转化反应及应用 2.7.1 脘的生物催化水解 2.7.2 外消旋脘和酰胺的对映选择性生物转化反应 2.7.3 二脘的立体选择性生物转化 2.8 糖苷的酶促合成 2.8.1 逆水解法合成烷基糖苷 2.8.2 糖苷酶催化的转糖苷反应 2.8.3 糖苷转移酶的合成应用 参考文献3 不对称还原和氧化反应 3.1 不对称氧化还原反应概论 3.2 不对称还原反应及其应用 3.2.1 不对称氢化反应及其应用 3.2.2 不对称氢转移反应及其应用 3.2.3 不对称还原反应与手性配体的发展历程 3.3 新的手性配体的设计合成及应用 3.3.1 新的手性配体的设计思想与合成 .....4 不对称催化形成碳-碳键5 不对称 Baylis-Hillman反应及其应用6 金属卡宾经由的不对称催化叶立德反应7 生物碱及相关药物的不对称合成8 串联重排反应及其在活性天然产物合成中的应用9 可回收高效手性催化剂及其在不对称催化合成中的应用10 作用于M受于手性分子的药理学

## &lt;&lt;手性合成与手性药物&gt;&gt;

## 章节摘录

插图：1 手性药物概述1.1 引言手性是自然界的基本属性，也是生命系统最重要的属性之一。作为生命体三大物质基础的蛋白质、核酸及糖等都是由具有手性的结构单元组成。如组成蛋白质的氨基酸除少数例外，大多是L-氨基酸；组成多糖和核酸的天然单糖大都是D构型的。因此生物体内所有的生化反应、生理反应无不表现出高度的立体特异性，外源性物质进入体内所引发的生理生化反应过程也具有高度的立体选择性。

手性药物是指分子结构中含有手性中心或不对称中心的药物，它包括单一的立体异构体、两个或两个以上立体异构体的混合物。

手性化合物除了通常所说的含手性中心的化合物外，还包括含有轴手性、平面手性、螺旋手性等因素的化合物。

由于药物作用靶点（如受体、酶或离子通道等）结构上的高度立体特异性，手性药物的不同立体异构体与靶点的相互作用有所不同，从而产生不同的药理学活性，表现出立体选择性。同样，药物进入体内后与机体内具有高度立体特异性的代谢酶及血浆蛋白或转运蛋白等相互作用，手性药物的不同异构体在体内也将表现出不同的药代动力学特征，具有立体专一性。更值得注意的是，有些手性化合物在体内甚至可能发生构型变化而改变其药效和毒副作用。

手性药物的发展经历了三个阶段。

在20世纪80年代以前，药物研究属于二维药理学和治疗学阶段，除天然来源的药物及其衍生物，市场上的手性药物主要为消旋体形式。

80年代，随着手性药物制备技术、手性药物分析技术的快速发展以及分子药理学研究的深入，人们逐渐认识到药效学和药物处置的立体选择性的重要性。

发现消旋体中的对映异构体往往具有不同的生物活性，从而将具有所需药理活性的异构体称为“优构体”，将无活性或具有毒性的异构体称为“劣构体”。

进入90年代，人们进一步认识到手性药物不同异构体之间的关系具有复杂性，手性药物的不同异构体可能具有不同的生物活性，也可能对生物活性都有贡献，不同异构体还可能相互影响，产生药理学或药代动力学相互作用。

## <<手性合成与手性药物>>

### 编辑推荐

《手性和成手性药物》可供药物化学和有机化学专业的科研工作者阅读，也可作为相关专业研究生与高年级本科生的教材。

<<手性合成与手性药物>>

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>