

<<手性药物研究与评价>>

图书基本信息

书名：<<手性药物研究与评价>>

13位ISBN编号：9787122103895

10位ISBN编号：7122103897

出版时间：2011-7

出版时间：化学工业出版社

作者：尤启冬,林国强 主编

页数：905

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>

<<手性药物研究与评价>>

内容概要

本书第1部分主要介绍手性药物的制备原理、合成方法、生物催化合成技术、拆分、分离与分析方法、生物学评价以及手性药物的审评原则及管理要求；第2部分收集了自2000年以来国内外上市的手性药物，以及目前仍在临床前、临床中研究的手性活性化合物共300多个，并附有主要参考文献。对手性药物目前研究的现状，候选药物的特点、进展与评价进行了综合性的介绍。

本书可供从事手性药物研究与开发的院校、研究单位和企业作为参考，以掌握手性药物研究的现状；可供初涉此领域的学生和研究人员系统学习手性药物的有关知识；也可供大专院校的学生、研究生和教师作为参考书。

<<手性药物研究与评价>>

作者简介

尤启冬，中国药科大学药学院院长，教授，博士生导师。
国家药典委员会第九届委员、第十届执行委员，国家及江苏省药品监督管理局新药审评专家，中国药学会理事、药物化学专业委员会副主任委员，江苏省药学会副秘书长、常务理事、江苏省药物化学专业委员会主任委员。
担任《药学进展》杂志副主编，《药学学报》、《中国药物化学杂志》等13本杂志的常务编委、编委等职务。
担任《International Journal of Medicinal Chemistry》杂志的编委。

尤启冬教授的研究领域为基于天然产物、生物分子结构和配体结构的药物设计研究、创新药物成药性研究。
主持国家"863"项目、国家自然科学基金项目、国家重大科技专项等项目若干项。

尤启冬，教授荣获省部级科技进步奖5项，国家及省级教学成果奖4项。
1994年获教育霍英东优秀青年教师奖，1999年享受国务院颁发政府特殊津贴，2004年获江苏省“五一劳动奖章”，2005年获江苏省有突出贡献的中青年专家，2006年获国家教育部“高等学校教学名师”，2010年获第十一届吴阶平医学研究奖——保罗·杨森药学研究奖。
发表SCI论文150余篇，申请专利37项，授权专利26项，主编《手性药物——研究与应用》、《化学药物制备的工业化技术》、《药物化学》等著作和教材多本。

<<手性药物研究与评价>>

书籍目录

第1部分

- 1 手性化合物的基本知识3
 - 1 1 手性是自然界的属性3
 - 1 2 手性药物4
 - 1 3 手性、不对称性与光学活性6
 - 1 4 手性的命名及有关术语7
 - 1 4 1 命名7
 - 1 4 2 与手性有关的术语10
 - 1 5 对映体组成的测定11
 - 1 5 1 比旋光度的测定12
 - 1 5 2 核磁共振谱法(NMR)13
 - 1 5 3 使用手性柱的色谱法15
 - 1 6 绝对构型的测定18
 - 1 6 1 X射线衍射法18
 - 1 6 2 化学相关法18
 - 1 6 3 普雷洛格规则21
 - 1 6 4 霍洛法22
 - 1 6 5 NMR法23
- 参考文献25
- 2 手性药物的不对称合成方法27
 - 2 1 手性药物与不对称合成27
 - 2 2 不对称合成的定义与表述34
 - 2 3 不对称合成的方法分类35
 - 2 4 有机分子催化的不对称反应36
 - 2 5 不对称氧化反应41
 - 2 5 1 烯丙醇的不对称环氧化反应41
 - 2 5 2 非官能团化的烯烃的不对称氧化 反应44
 - 2 5 3 内消旋环氧化合物的不对称失对 称性作用46
 - 2 5 4 烯烃的不对称双羟化反应48
 - 2 5 5 不对称羟氨化反应50
 - 2 5 6 不对称氮杂环丙烷化反应52
 - 2 5 7 不对称Bayer Villiger氧化反应52
 - 2 6 不对称氢化反应及还原反应54
 - 2 6 1 碳碳双键的不对称催化氢化54
 - 2 6 2 羰基化合物的不对称催化氢化 反应61
 - 2 6 3 硼杂 唑烷催化还原体系63
 - 2 6 4 羰基的直接不对称还原胺化 反应65
 - 2 7 不对称碳碳键的生成67
 - 2 7 1 底物控制的碳碳键生成反应67
 - 2 7 2 试剂控制或催化的不对称碳碳键生成反应72
 - 2 8 不对称反应中的新概念84
 - 2 8 1 不对称反应中的非线性立体化学效应84
 - 2 8 2 二中心协同催化作用86
- 参考文献87
- 3 手性药物的生物催化合成技术94

<<手性药物研究与评价>>

- 3 1 概述94
- 3 2 生物催化剂94
 - 3 2 1 生物催化剂的筛选94
 - 3 2 2 生物催化剂发现和改造的分子 方法98
 - 3 2 3 高稳定性生物催化剂的制备 方法104
- 3 3 生物催化合成反应的体系108

.....

第2部分

中英文术语对照表876

索引892

英文药名索引895

<<手性药物研究与评价>>

章节摘录

版权页：插图：当前，已有许多方法可以用来得到光学活性的药物化合物。

即便现在有了不对称合成方法，经典的外消旋体拆分仍是一种基本的、常用的手段。

但是，拆分方法仅将外消旋体中 useful 的一半分离出来，这里还有分离尽可能完全（即最多量达50%）的问题，以及拆分后剩余一半无用对映体的再转化或复原成原来的外消旋体的问题。

最近，在外消旋体拆分上一个很重要的发展是，应用称为模拟流动床色谱的层析方法，其拆分能力可以达到成吨级的水平。

另一种拆分方法称为包结法，即利用一些光学活性化合物，例如一种从光学活性酒石酸衍生得到的双二芳基取代二醇，与消旋化合物包结后，利用两种对映体不同的结晶行为达到拆分目的。

TADDOL包结法可达到许多含氮、氧及硫化合物以至于氨基酸、羟腈化合物、烷氧基丙酮以及噁唑烷类的对映体的分离。

也称为不对称动力学拆分，是将消旋体转化为单一对映体，但例子不多。

其他的合成方法有从易得的天然产物如氨基酸、酒石酸、乳酸、碳水化合物、生物碱以及萜类为手性原料的化学转化方法。

当然，也有利用酶、微生物及植物组织培养等进行的生物转化。

生物转化是从潜手性前体合成对映体纯化合物的一个高效、实用的途径。

由于基因改造的工程酶的发展很快，生物转化虽然有时在某一步反应中起到化学反应无法企及的作用，但总的来说受到反应底物范围等一系列的限制。

近20年来，在发现与上述方法互为补充和立体选择性更高的不对称反应中，化学家们已获得了巨大的成功。

本章就是通过一些实例表述在药物合成中应用的不对称合成方法，同时，着重介绍金属和非金属催化剂的合成方法。

<<手性药物研究与评价>>

编辑推荐

《手性药物研究与评价》：国家科学技术学术著作出版基金资助出版“十二五”国家重点图书。

<<手性药物研究与评价>>

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>