

<<药物合成设计>>

图书基本信息

书名：<<药物合成设计>>

13位ISBN编号：9787548100119

10位ISBN编号：7548100116

出版时间：2010-6

出版时间：张万年 第二军医大学出版社 (2010-06出版)

作者：张万年 编

页数：403

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>

<<药物合成设计>>

前言

化学药物的设计与合成是现代药物研究与生产的一项最重要的核心技术。

一个好的药物分子设计方案或含量极微的天然先导化合物，如果不能用化学方法合成出来，那就什么研究也开展不了。

一个很好的候选药物即便可以合成出来，但如果成本太高难以实现产业化生产，还是不能成为药物。市场上非常畅销的药物，如果生产厂家很多，市场竞争会十分激烈，这时先进的低成本合成工艺就成为生产企业的生命线。

因此，对于药物研究、生产或相关技术服务的从业人员来说，熟练地掌握药物合成设计技术是必不可少的至胜法宝。

药物化学合成技术的发展经历了一个非常漫长曲折的历史进程，长期以来一直被人们视为一种复杂而又高深莫测的技术。

化学大师Woodward的维生素B₁₂。

全合成把复杂化合物的合成技术作为一种艺术最完美地展现在世人面前，又由当代最著名的化学家Corey把化学合成由艺术转变成为科学，他综合运用有机化学理论、化学反应知识、各种先进的合成技术和计算机技术，创立了反合成分析法，为药物合成设计奠定了坚实的基础。

本书就是从这项近代发展起来的反合成分析法入手，系统地讲述了反合成分析法的基本规则、原理和策略，并通过展示大量目标化合物的合成设计实例，重点介绍了反合成分析法进行药物合成设计的基本步骤、主要手段和运用技巧。

药物合成设计中最常遇到、也是最难解决的技术问题是化学反应的选择性控制和手性合成技术，本书针对这两项技术单列两章作了系统的阐述。

对于同一个目标化合物用反合成分析法可以设计出多条合成路线，如何正确的评价与选择一条最理想的合成路线至关重要，为此本书设立专门章节讲述了合成路线评价的原则与标准。

<<药物合成设计>>

内容概要

《药物合成设计》介绍了化学药物的设计与合成是现代药物研究与生产的一项最重要的核心技术。一个好的药物分子设计方案或含量极微的天然先导化合物，如果不能用化学方法合成出来，那就什么研究也开展不了。一个很好的候选药物即便可以合成出来，但如果成本太高难以实现产业化生产，还是不能成为药物。市场上非常畅销的药物，如果生产厂家很多，市场竞争会十分激烈，这时先进的低成本合成工艺就成为生产企业的生命线。因此，对于药物研究、生产或相关技术服务的从业人员来说，熟练地掌握药物合成设计技术是必不可少的至胜法宝。

药物化学合成技术的发展经历了一个非常漫长曲折的历史进程，长期以来一直被人们视为一种复杂而又高深莫测的技术。

化学大师Woodward的维生素B₁₂。

全合成把复杂化合物的合成技术作为一种艺术最完美地展现在世人面前，又由当代最著名的化学家Corey把化学合成由艺术转变成为科学，他综合运用有机化学理论、化学反应知识、各种先进的合成技术和计算机技术，创立了反合成分析法，为药物合成设计奠定了坚实的基础。

《药物合成设计》就是从这项近代发展起来的反合成分析法入手，系统地讲述了反合成分析法的基本规则、原理和策略，并通过展示大量目标化合物的合成设计实例，重点介绍了反合成分析法进行药物合成设计的基本步骤、主要手段和运用技巧。

药物合成设计中最常遇到、也是最难解决的技术问题是化学反应的选择性控制和手性合成技术，《药物合成设计》针对这两项技术单列两章作了系统的阐述。

对于同一个目标化合物用反合成分析法可以设计出多条合成路线，如何正确的评价与选择一条最理想的合成路线至关重要，为此《药物合成设计》设立专门章节讲述了合成路线评价的原则与标准。

<<药物合成设计>>

书籍目录

第一章 药物合成设计概论第一节 药物合成设计概述一、化学合成设计的发展史二、化学合成发展趋势三、药物合成设计新技术四、药物合成设计主要任务五、药物合成设计主要策略第二节 目标分子考察一、结构对称性分析二、重复结构的分析三、目标分子化学反应性四、类似物合成借鉴五、仿生物合成借鉴六、优先转化的结构七、特殊的结构类型第二章 反合成分析法第一节 反合成分析的常用术语和主要手段一、反合成分析常用术语二、反合成分析主要手段第二节 一基团切断一、醇及其衍生物的合成设计二、烯烃的合成设计三、芳香酮的合成设计四、羧酸及其衍生物的合成设计五、饱和烃的合成设计第三节 二基团切断一、——羟基羰基化合物的合成设计二、——不饱和羰基化合物的合成设计三、1,3——二羰基化合物的合成设计四、1,5——二羰基化合物的合成设计第四节 非逻辑切断一、1,2——二氧化化合物的合成设计二、1,4——二氧化化合物的合成设计三、1,6——二羰基化合物的合成设计第五节 杂原子化合物合成设计一、醚类化合物的合成设计二、胺类化合物的合成设计第六节 环状化合物的合成设计一、三元环的合成设计二、四元环的合成设计三、五元环的合成设计四、六元环的合成设计第七节 杂环化合物的合成设计一、饱和杂环的合成设计二、芳香杂环的合成设计第三章 手性合成设计第一节 手性合成概述一、手性合成常用术语二、手性合成设计的三大策略第二节 手性拆分一、直接结晶拆分法二、化学拆分法三、生物拆分法四、色谱拆分法五、包络拆分法第三节 基于“手性源”的合成设计一、常见的“手性源”化合物二、以氨基酸作为“手性源”的合成设计三、以有机酸作为“手性源”的合成设计四、以胺基醇作为“手性源”的合成设计五、以糖作为“手性源”的合成设计第四节 基于不对称合成反应的合成设计一、手性环氧化物的合成设计二、手性1,2-二醇和手性β-胺基醇的合成设计三、基于不对称氢化反应和还原反应的合成设计四、生成不对称碳碳键的合成设计第四章 药物合成设计中的选择性控制第一节 选择性的定义和分类一、选择性的定义二、选择性的分类第二节 选择性控制方法一、反应底物的选择性控制二、反应试剂和条件的选择性控制三、反应位点的选择性控制四、官能团的选择性保护第五章 药物合成路线的评价和选择第一节 合成路线评价的原则和标准第二节 合成路线效率评价指标一、反应步骤和总收率二、原料和试剂三、合成操作和安全性四、反应安排五、绿色化学合成第六章 新药反合成分析实例一、神经系统药物1. 帕罗西汀2. 利培酮3. 富马酸喹硫平4. 齐拉西酮5. 右哌甲酯6. 艾司西酞普兰7. 度洛西汀8. 阿立哌唑9. 普瑞巴林二、心血管系统药物1. 氯吡格雷2. 兰地洛尔3. 盐酸考尼伐坦4. 西他塞坦钠5. 雷诺嗪6. 莫扎伐普坦三、呼吸系统药物1. 沙美特罗2. 孟鲁司特钠3. 酒石酸阿福特罗四、非甾体类消炎药1. 罗非昔布2. 帕瑞昔布钠3. 罗美昔布五、抗肿瘤药1. 来曲唑2. 阿那曲唑3. 拓扑替康4. 吉非替尼5. 盐酸埃洛替尼6. 培美曲唑二钠盐7. 尼罗替尼水合盐酸盐8. 拉帕替尼六、抗过敏药1. 西替利嗪2. 非索非那定3. 盐酸依匹斯汀4. 富马酸卢帕他定七、抗糖尿病药1. 罗格列酮2. 米格列奈钙二水合物八、抗菌药1. 环丙沙星2. 左氟沙星3. 莫西沙星4. 加雷沙星5. 利奈唑酮九、抗真菌药1. 依帕康唑2. 福司氟康唑十、抗病毒药1. 奈韦拉平2. 磷酸奥司他韦十一、治疗尿失禁药物1. 琥铂酸索非那新2. 咪达那新十二、其他药物1. 西地那非2. 霉酚酸钠3. 伐仑克林酒石酸盐

章节摘录

插图：固相合成技术是近年来发展起来的合成新技术，它具有以下几个优点：（1）适宜自动化操作：固相合成大大简化了反应操作，其基本过程是通过固相载体结构中的一些具有反应活性的基团与反应物结合，形成带有反应物结构的固相载体，然后通过多相反应，将其它反应物逐一连接到固相载体上，最后再用一定方法将目标化合物从固相载体上切割下来，得到最终产物。

依次操作只需三个环节，即投料、过滤和清洗，完全具备自动化合成的潜力。

目前，许多自动化或半自动化的固相合成仪已经在实验室中使用。

（2）纯化方法简单：在一个多步骤的合成反应中，每一步所需的纯化操作仅是对固相载体进行简单地冲洗，多余的试剂和副产物经洗涤和过滤就可除去，从而省去了传统合成法耗时费力的分离和纯化过程。

（3）反应比较彻底：在固相有机合成反应中，增加反应物的投料量，可以使反应进行得迅速和趋于彻底，获得较高产率。

（4）树脂可循环使用：若解离条件适宜或通过简单手段进行活性基团的再生，固相载体即可以多次使用。

（5）符合绿色合成要求：固相有机合成是绿色化学的重要组成部分，具有不污染环境、节约溶媒、减少耗能和无爆燃性等优点，成为发展绿色化学的新途径和开发制备绿色产品的重要手段。

<<药物合成设计>>

编辑推荐

《药物合成设计》是由第二军医大学出版社出版的。

<<药物合成设计>>

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>