

药化：药物的化学结构修饰 PDF转换可能丢失图片或格式，  
建议阅读原文

[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/17/2021\\_2022\\_\\_E8\\_8D\\_AF\\_E5\\_8C\\_96\\_EF\\_BC\\_9A\\_E8\\_c23\\_17010.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/17/2021_2022__E8_8D_AF_E5_8C_96_EF_BC_9A_E8_c23_17010.htm)

第十八章 药物的化学结构修饰  
化学结构修饰：不改变药物的基本结构和基团。  
化学结构改造：利用各种化学原理改变药物的基本结构和基团。

一、药物化学结构修饰的目的：  
1、提高药物对靶部位的选择性：抗肿瘤药物 磷雌酚-己烯雌酚 SMZ--N-酰基- -谷氨酰衍生物  
2、提高药物的稳定性：羧苄青霉素-茛满酯(成酯)  
3、延长药物的作用时间：用油剂给药 睾酮制成前药 氟奋乃静  
4、改善药物的吸收：提高生物利用度 增大脂溶性  
5、改善药物的溶解性：阿昔洛韦制成前药 苯妥英成酯  
6、降低药物的毒副作用：增加选择性、延长半衰期、提高生物利用度  
7、发挥药物配伍作用：  
二、成盐修饰：适于具酸性和碱性基团的药物  
1、酸性药物的成盐修饰：  
2、碱性药物的成盐修饰：脂肪氨基碱性强成无机酸盐，芳香氨基碱性弱作有机酸盐，降低毒性。  
三、成酯及成酰胺：  
1、具羧基成酯：布洛芬 萘普生  
2、具羟基成酯：可延长药物的半衰期 甲硝唑 红霉素  
3、具氨基成酰胺：增加药物的组织选择性 溶肉瘤素 氨基甲酰化成氮甲 别嘌醇 丝裂霉素  
四、具羰基药物、开环(阿普唑仑、VB1)、成环修饰  
100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 [www.100test.com](http://www.100test.com)