



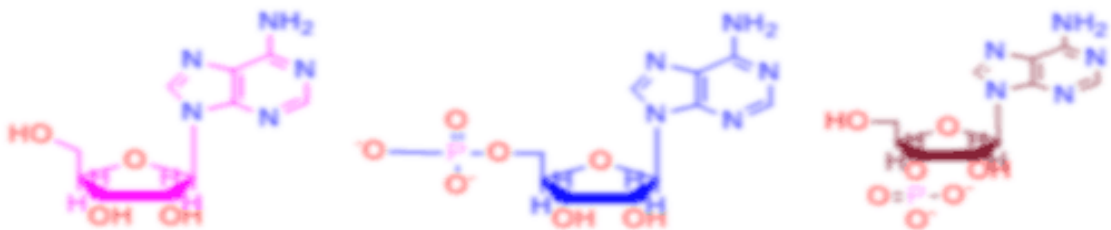
安徽中醫藥高等專科學校

2019 安徽省《藥物化學》精品線下開放課程

安徽中醫藥高等專科學校 | 藥學系

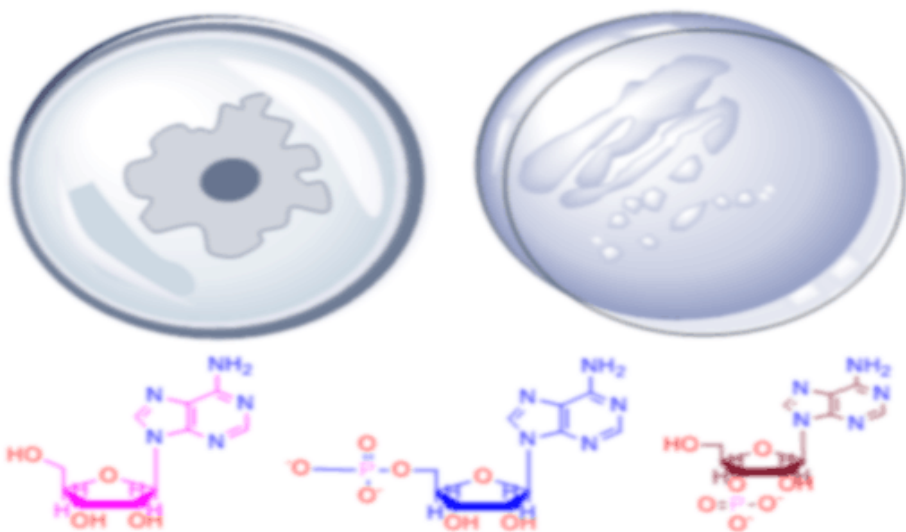
Anhui College of Traditional Chinese Medicine | Department of Pharmacy

藥物化學與藥物分析教研室 | 張曉沖





第六章 心血管系统药物





心血管系统疾病是一类常见、多发病，它严重危害人类健康，是人类健康的“头号杀手”。因此，此类药物的研究越来越受到重视，且发展迅速。



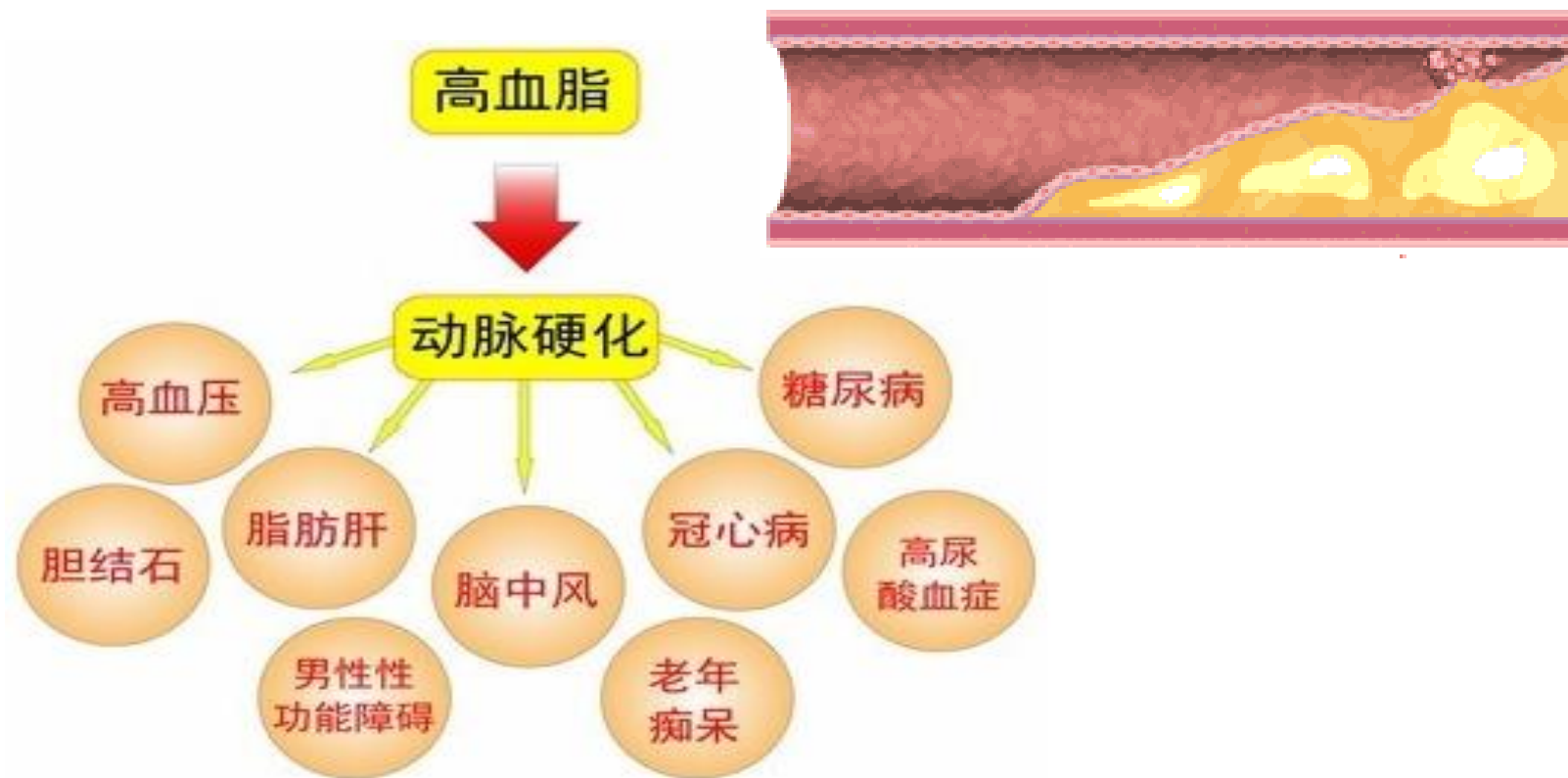
心血管系统药物是发展较快的一类药物，每年开发的新药较多，是目前临床上各类药物中最庞杂的一大类。



这一章按照治疗疾病的类型，分为：调血脂药、抗心绞痛药、抗心律失常药、抗高血压药、抗血栓药和强心药等。

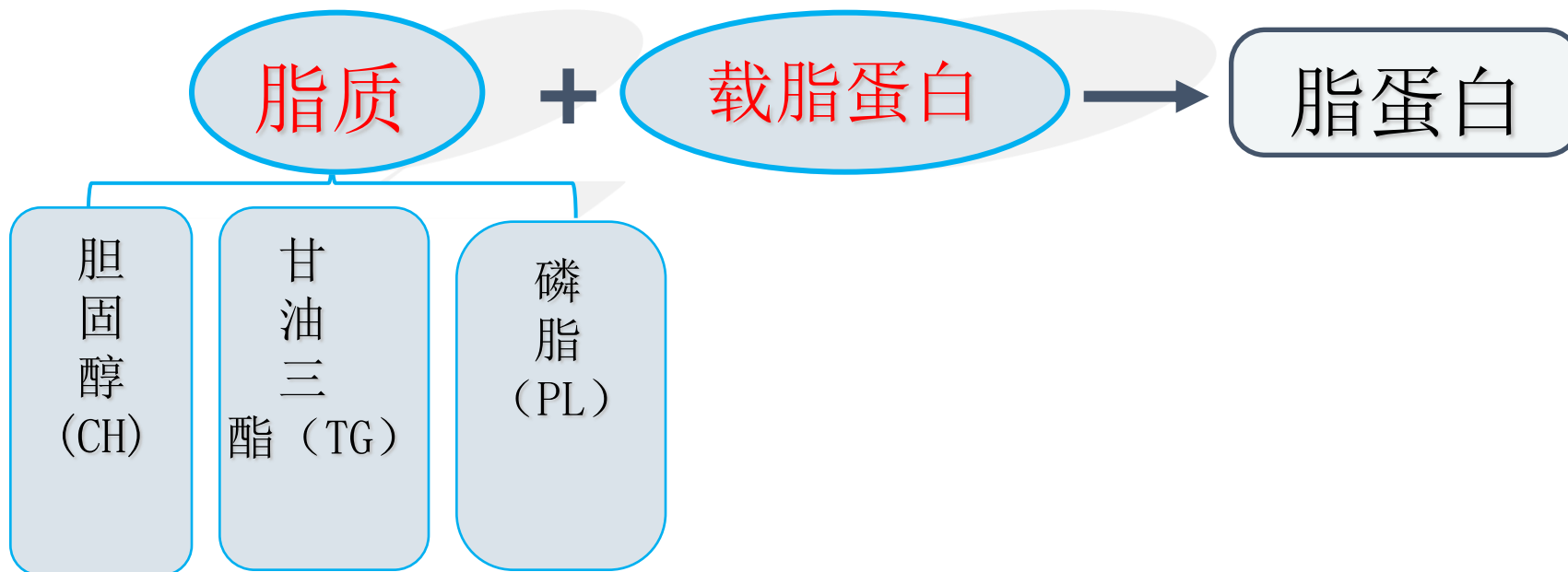
第一节 调血脂药

(抗动脉粥样硬化药)





导入：



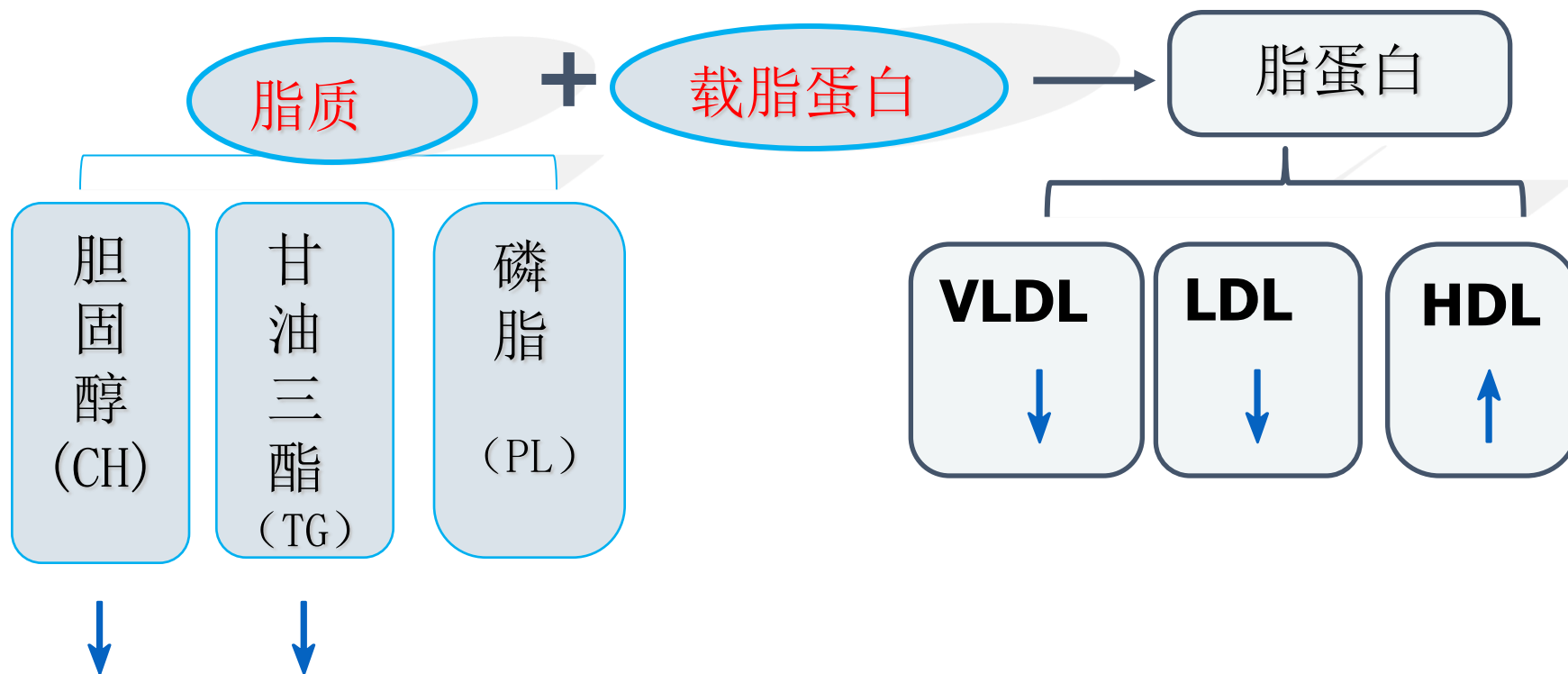


导入：

脂蛋白：电荷、体积、密度等不同，可分为：

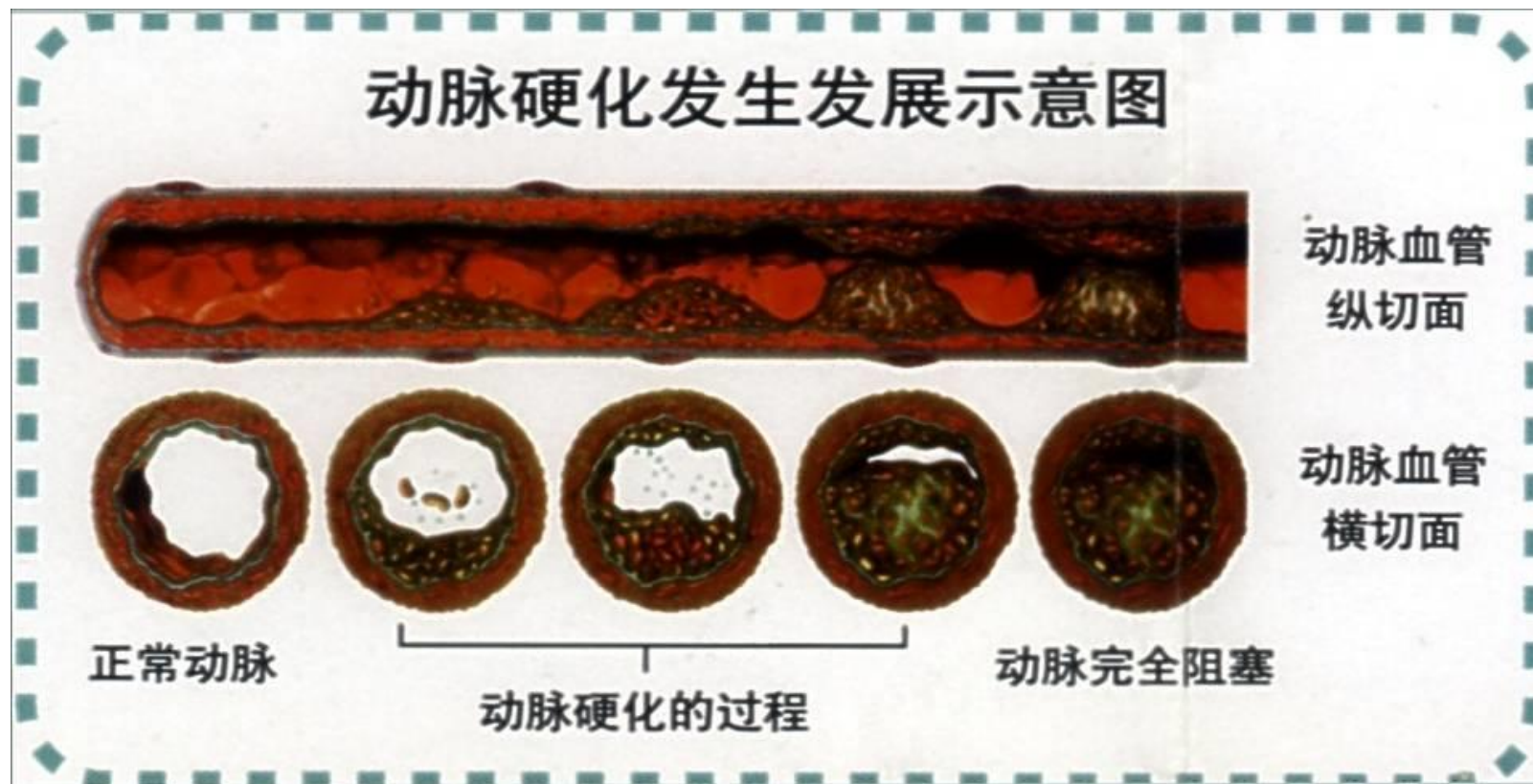
- ①乳糜微粒 (CM)
- ②极低密度脂蛋白 (VLDL)
- ③中等密度脂蛋白 (IDL)
- ④低密度脂蛋白 (LDL)
- ⑤高密度脂蛋白 (HDL)

降血脂的原理：





临床上血浆胆固醇 $\gt 230\text{mg}/100\text{ml}$ 和甘油三脂 $\gt 140\text{mg}/100\text{ml}$ ，统称为高血脂症。



当血脂长期↑，血脂及分解产物会沉积在动脉管壁内
→血管壁增厚变硬，弹性↓，管壁变窄→动脉粥样硬化（因动脉内膜积聚的脂质外观呈黄色粥样，∴又称动脉粥样硬化）。



分类：根据作用不同





分类：根据结构和作用原理

- HMG-CoA还原酶抑制剂(他汀类)
- 苯氧乙酸类/芳氧乙酸类
- 其他：烟酸



一、HMG-CoA还原酶抑制剂

洛伐他汀、辛伐他汀、阿托伐他汀

二、芳氧乙酸类：

氯贝丁酯、吉非罗齐、非诺贝特

三、其他类：

烟酸、亚油酸、阿昔莫司



在此输入您的标题内容

一、HMG-CoA还原酶抑制剂

原理：可阻断体内胆固醇合成。

选择性强，疗效确切，

能↓LDL，↑HDL。

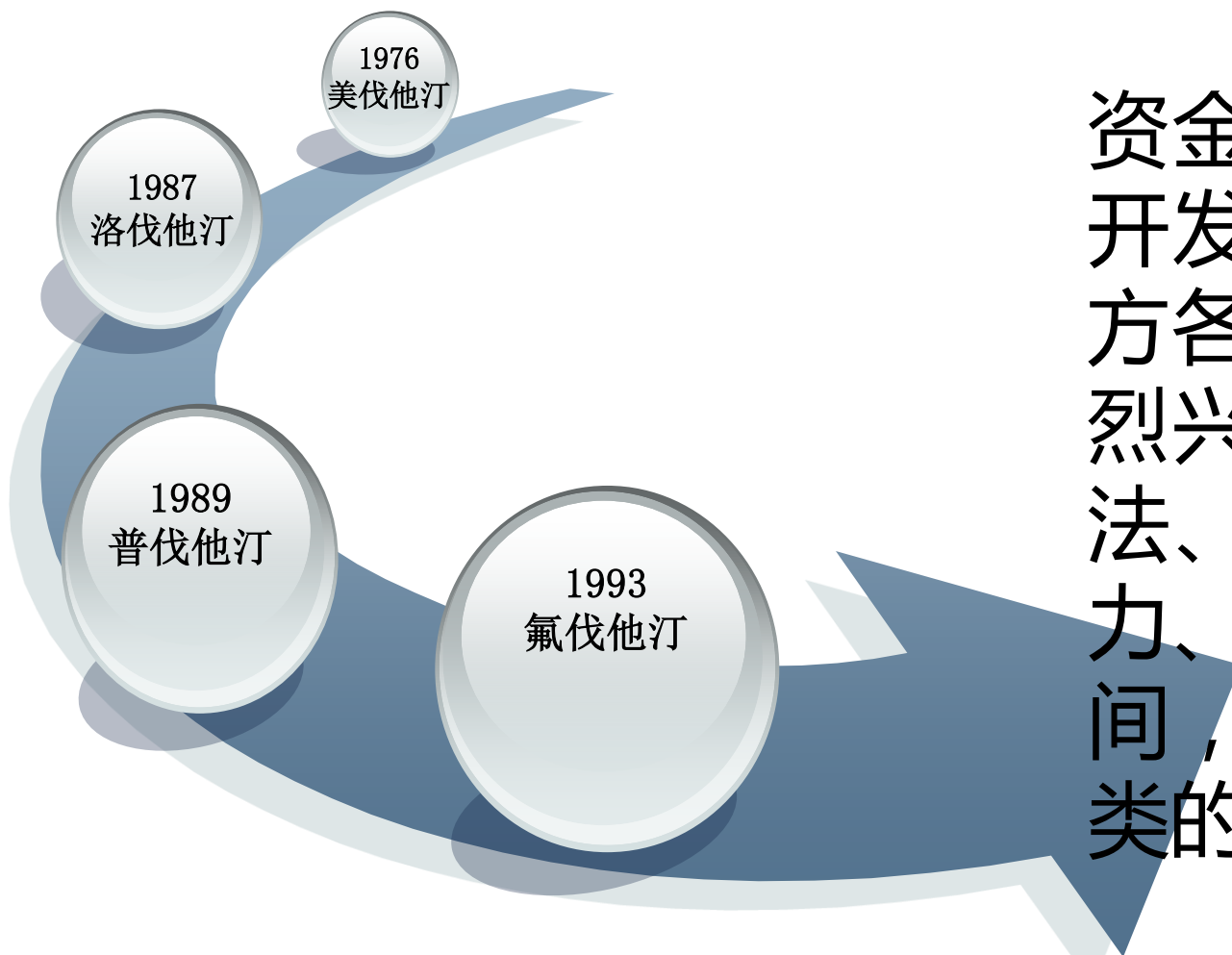


一、HMG-CoA还原酶抑制剂

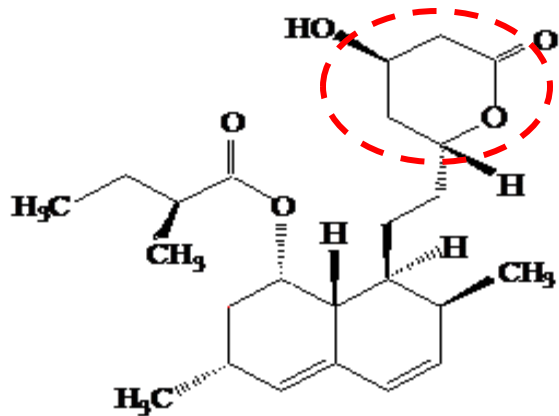
他汀类：最早是日本学者在从事霉菌代谢物的研究发现的美伐他汀(它是羟甲戊二酰辅酶A还原酶的抑制剂)，开启了寻找、发展HMG-CoA还原酶抑制剂类降血脂药的新纪元。



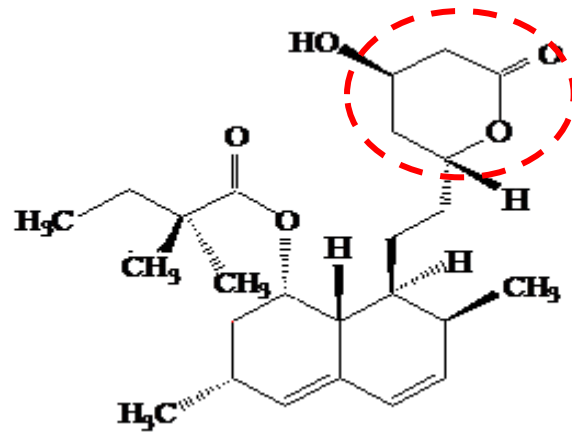
一、HMG-CoA还原酶抑制剂



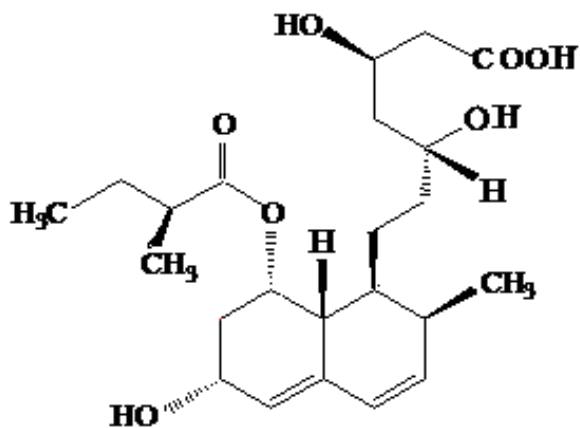
但日本未投入大的资金深入开发，失去了开发优势。却引起了西方各国医药界同行的强烈兴趣。美、德、英、法、瑞典等投入大量人力、财力，在不到20年间，开发了10多个他汀类的降血脂药。



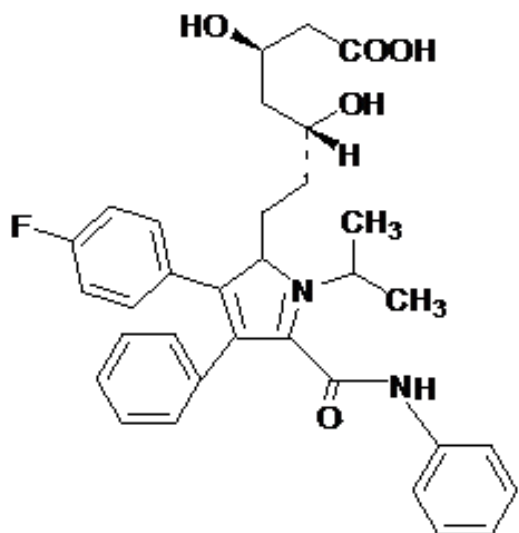
洛伐他汀



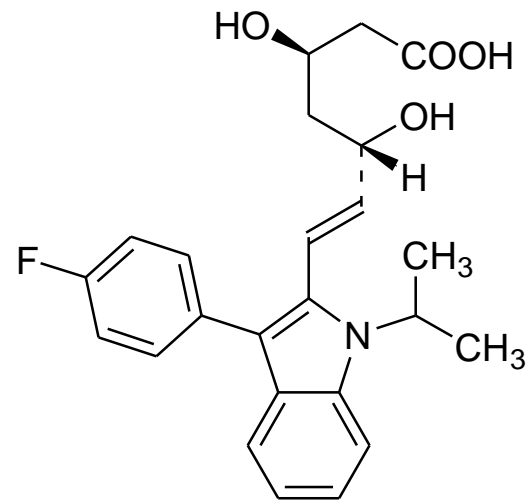
辛伐他汀



普伐他汀



阿托伐他汀



氟伐他汀



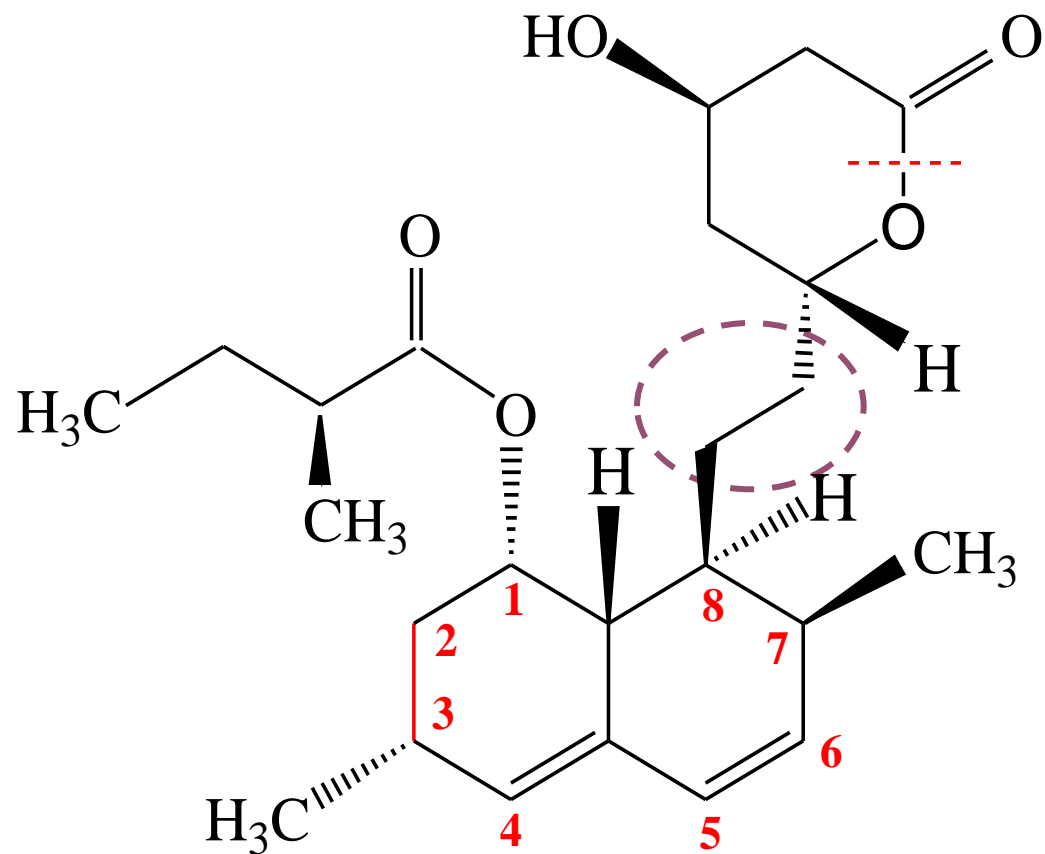
典型药物：

(一) 洛伐他汀

(二) 辛伐他汀

(三) 阿托伐他汀

(一) 洛伐他汀



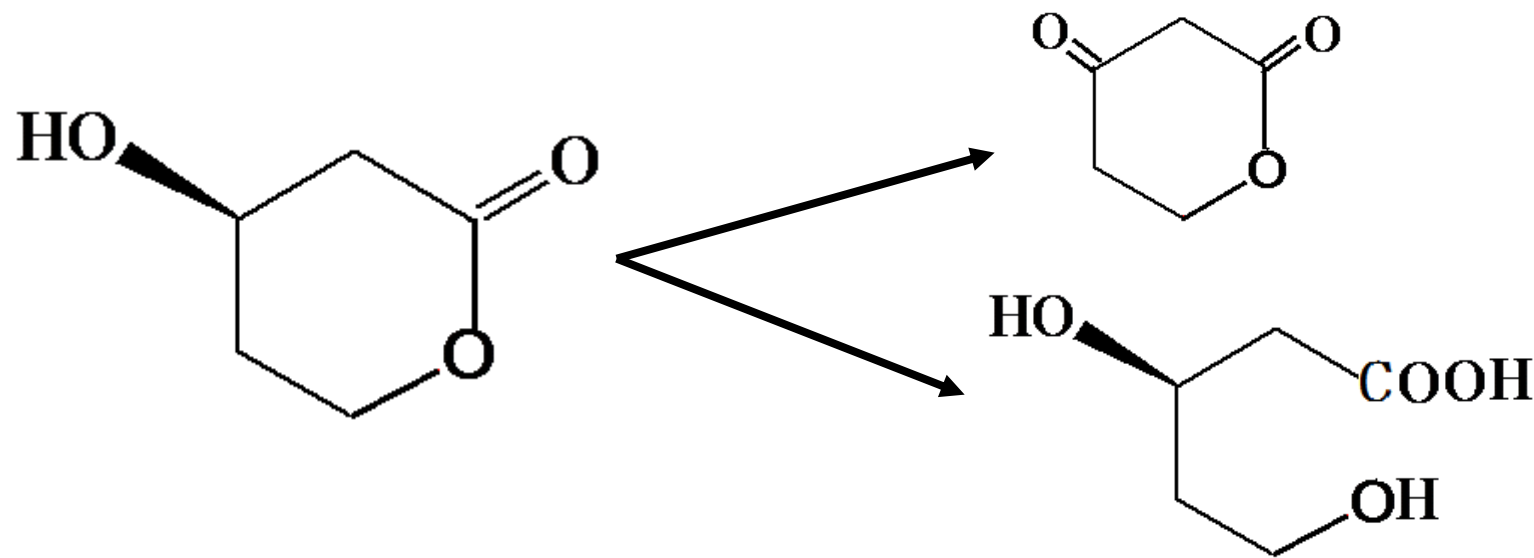
1、结构特点:

- ①两个酯键
- ②两环之间有2个碳相连
- ③有10氢化萘结构

2、稳定性

①六元内酯环上的羟基，易氧化→二酮吡喃

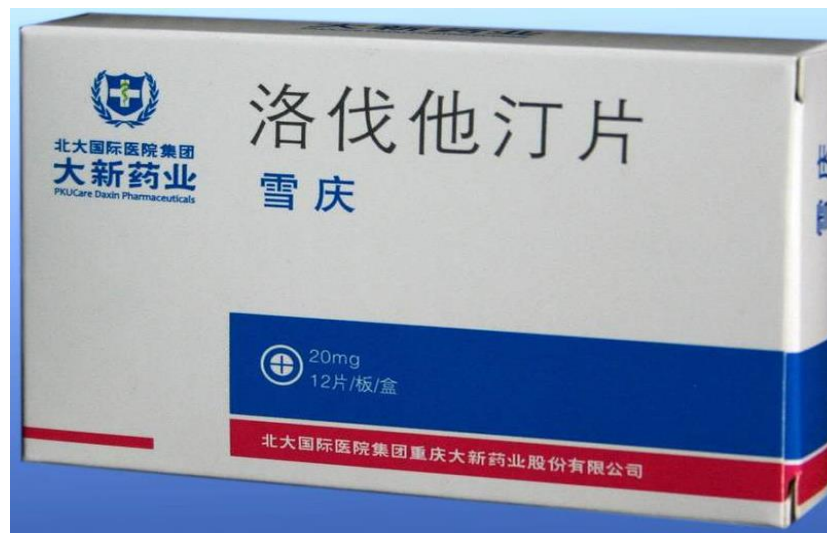
②有内酯结构，易水解生成羟基酸。





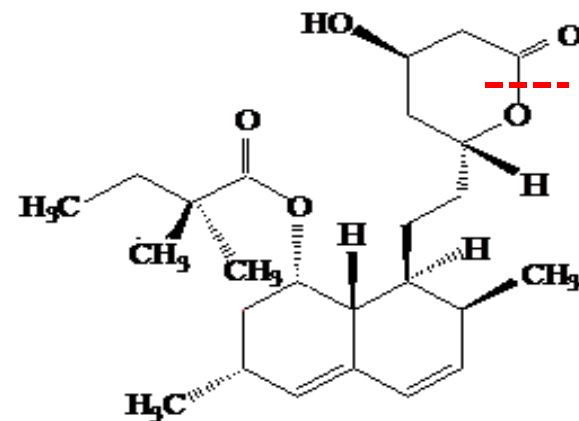
3、药效

洛伐他汀（前药），水解产生 β -羟基酸。
↓胆固醇，适度↑HDL。用于高胆固醇血症为
主的高脂血症。不良反应少、轻。



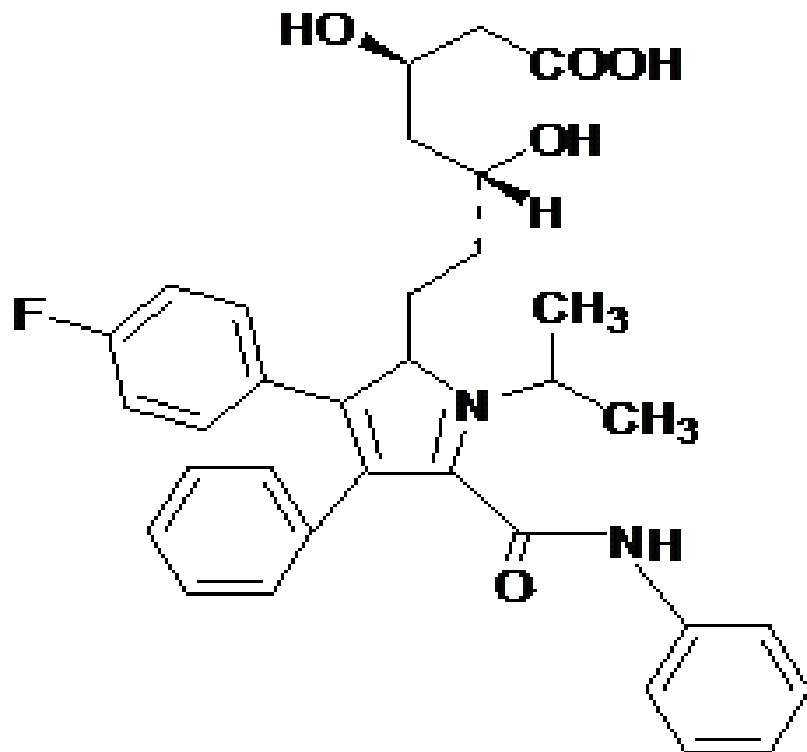
避光、密封保存

(二) 辛伐他汀



- 辛伐他汀与洛伐他汀相似，仅在侧链 α 碳上多了一个甲基，也有内酯环，是前药，水解为 β -羟羧酸显效。作用与洛伐他汀相似，不良反应比洛伐他汀稍小。

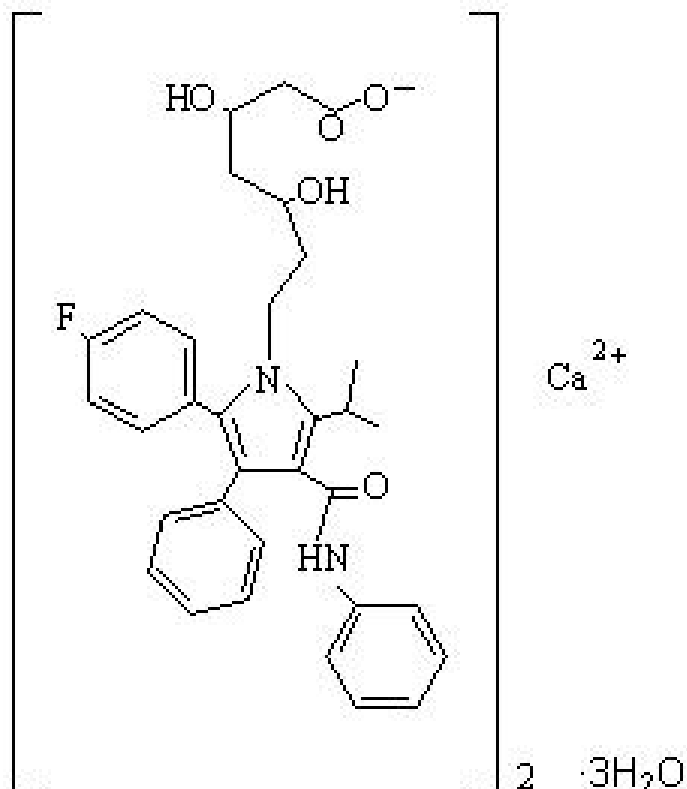
(三) 阿托伐他汀



1、结构特点：

结构与洛伐他汀相差较大，
具有3,5-二羟基羧酸结构，
是活性的必须基团。

(三) 阿托伐他汀钙



2、药效：

强效，用于治疗高胆固醇血症和混合型高血脂；冠心病和脑中风的防治。

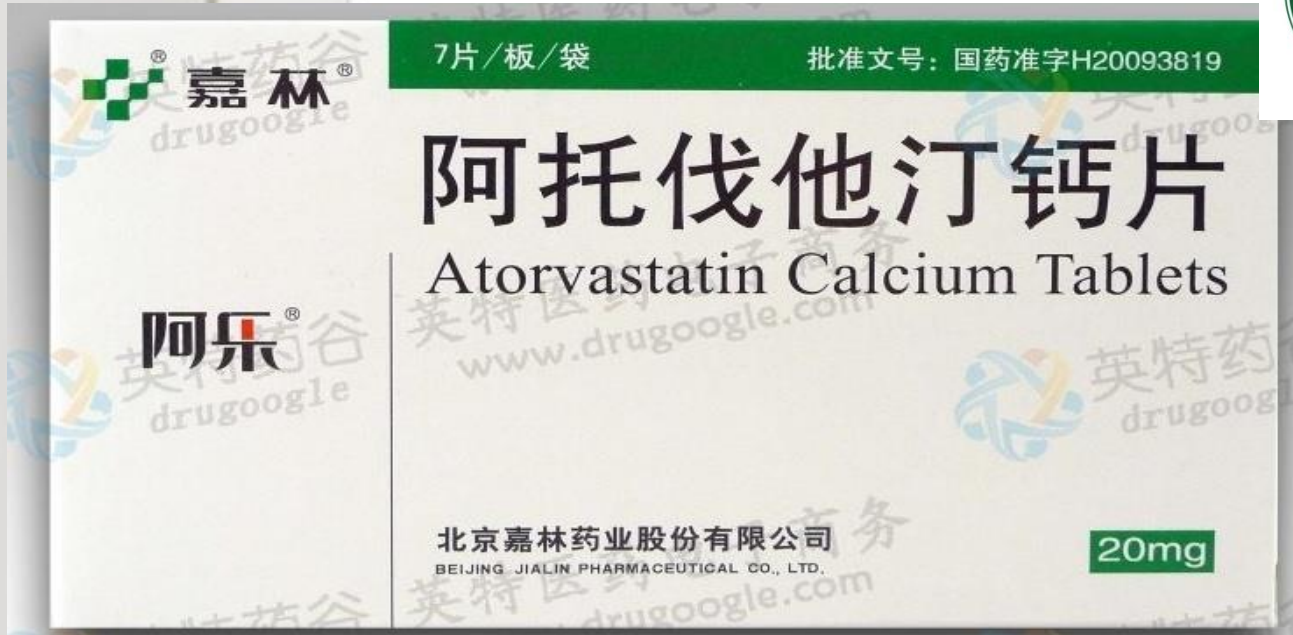


立普妥®
阿托伐他汀钙片
20mg



辉瑞制药有限公司

20毫克 × 7片



嘉林®
drugoogle

7片/板/袋

批准文号：国药准字H20093819

阿托伐他汀钙片
Atorvastatin Calcium Tablets

阿乐®
drugoogle

北京嘉林药业股份有限公司
BEIJING JIALIN PHARMACEUTICAL CO., LTD.

20mg

排名	品类	2015	2016E	EI*
1	立普妥(阿托伐他汀钙片)	31.00%	30.60%	99
2	可定(瑞舒伐他汀钙片)	8.10%	9.60%	119
3	阿乐(阿托伐他汀钙片)	9.10%	9.00%	98
4	舒降之(辛伐他汀片)	6.50%	6.20%	94
5	尤佳(阿托伐他汀钙胶囊)	3.90%	4.80%	122
6	辛可(辛伐他汀分散片)	3.90%	2.90%	74
7	血脂康胶囊(北京北大维信)	3.00%	2.70%	88
8	瑞舒伐他汀钙片(南京正大天晴)	1.80%	2.30%	127
9	来适可(氟伐他汀钠胶囊)	1.80%	1.50%	85
10	美百乐镇(普伐他汀钠片)	1.50%	1.40%	94
TOP10品类合计		70.60%	70.80%	99



2019

安徽省《药物化学》精品线下开放课程

安徽中医药高等专科学校 | 药学系

Anhui College of Traditional Chinese Medicine | Depart of Pharmacy

药物化学与药物分析教研室 | 张晓冲