

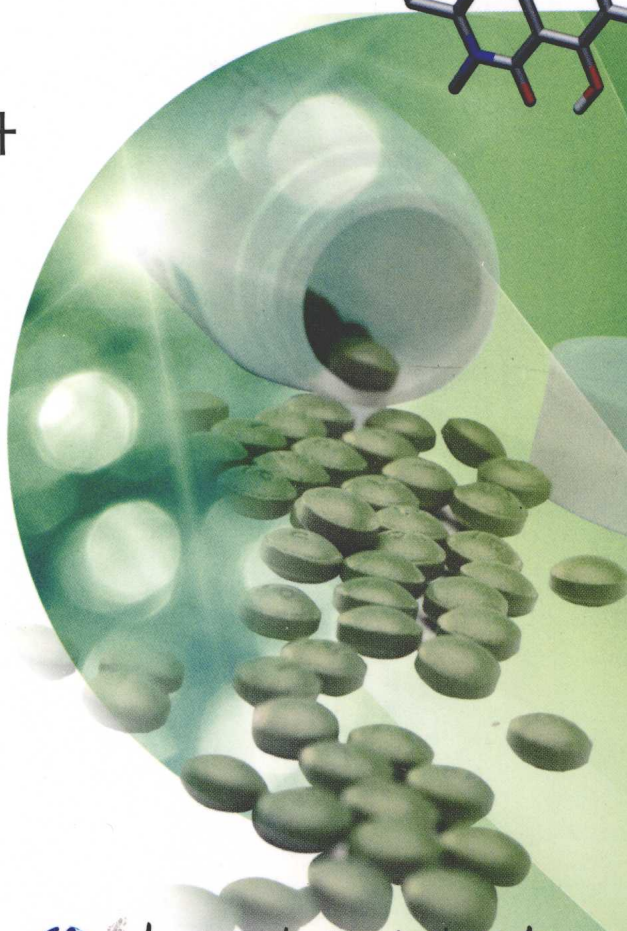
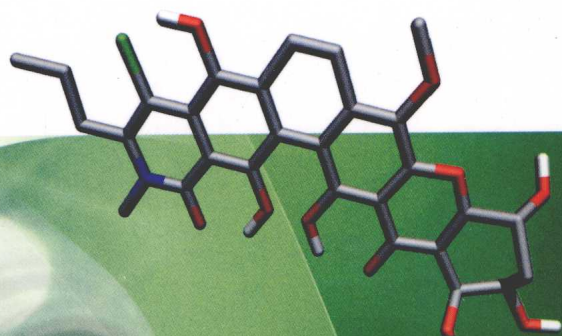
全国医药高职高专规划教材

药物化学与分析

YAOWU HUAXUE YU FENXI

(供医药营销专业用)

主编 马廷升



 中国医药科技出版社

全国医药高职高专规划教材

(供医药营销专业用)

药物化学与分析

YAO WU HUA XUE YU FEN XI

主 编 马廷升

主 审 杨宏健

副主编 刘志华

编写人员 马廷升 姚祖福 刘志华

朱兰寸 黄 刚



中国医药科技出版社

内 容 提 要

本书是医药营销专业教材之一,根据医药营销专业的特点,以基本理论知识和技能“必需、够用”为原则,把相近学科分析化学、药物化学、药物分析进行有机整合为《药物化学与分析》,剔除一些过深的理论知识,增强了教材的实用性和先进性。

全书共三篇二十章。方法篇以药品检验程序为链条,按鉴别、检查、含量测定及制剂分析等分别介绍药物分析的原理、方法;药物篇以药物化学知识为基础,介绍药物的发展、结构修饰、构效关系、临床应用等知识,并介绍典型药物的理化性质、检查、含量测定方法;技能篇精选了9个实验,既有基本技能训练,又有综合性设计实验,以提高学生的操作技能。

本教材适合医药高职高专、中专医药营销专业不同层次教学使用,也可作为医药行业培训和自学用书。

图书在版编目(CIP)数据

药物化学与分析/马廷升主编. —北京:中国医药科技出版社,2010.7

全国医药高职高专规划教材

ISBN 978-7-5067-4692-2

I. ①药… II. ①马… III. ①药物化学-高等学校:技术学校-教材
②药物分析-高等学校:技术学校-教材 IV. ①R914②R917③TQ460.7+2

中国版本图书馆CIP数据核字(2010)第100902号

美术编辑 张 璐

版式设计 郭小平

出版 中国医药科技出版社

地址 北京市海淀区文慧园北路甲22号

邮编 100082

电话 发行:010-62227427 邮购:010-62236938

网址 www.cmstp.com

规格 787×1092mm $\frac{1}{16}$

印张 13 $\frac{1}{2}$

字数 288千字

版次 2010年7月第1版

印次 2010年7月第1次印刷

印刷 廊坊市华北石油华星印务有限公司

经销 全国各地新华书店

书号 ISBN 978-7-5067-4692-2

定价 28.00元

· 本社图书如存在印装质量问题请与本社联系调换

前言

药物化学与分析

医药营销专业为高等医药院校新开设专业,主要培养既具有医药专业知识,又具有营销知识的复合型人才,深受医药企业青睐。该专业因为课程多、时间紧,不能简单按医药专业设置课程授课,而应根据医药营销专业的特点,以基本理论知识和技能“必需、够用”为原则,把相近学科进行合并,剔除一些过深的理论知识,以增强教材的实用性和先进性。基于此思路,我们把相近学科分析化学、药物化学、药物分析进行有机整合为《药物化学与分析》,在医药营销专业进行了三年的教学改革实践,取得良好效果,成为医药营销专业的精品课程。

根据分析化学、药物化学、药物分析之间的知识规律性和关联性,我们按方法篇、药物篇、技能篇三大板块进行有机整合。

(1) 方法篇 以药物分析学科中的药品检验程序为链条,按鉴别、检查、含量测定及药物制剂分析等内容分别介绍药物分析的原理、方法。考虑到医药营销专业的特点,我们编写教材的过程中,将偏深、偏难内容删除,编写教材的深度和难度真正做到因地制宜,适合医药营销专业学生。

(2) 药物篇 以药物化学知识为基础,介绍常用药物的发展、结构修饰、构效关系、体内代谢、临床应用等知识,并对每章节中典型代表药物,介绍其理化性质、鉴别、检查、含量测定方法。这样把药物学与分析方法学有机地结合起来,把难度大、实用少的药物合成路线删掉,使得教材浅显易懂。

(3) 技能篇 精选设计了9个实验,既有基本技能训练,如:天平的称量、滴定的操作,又有综合性设计实验,如:氯苯那敏的分析,包含了天平、滴定及紫外分光光度计操作,以有效地提高学生的操作技能。

感谢主编单位怀化医学高等专科学校对本书的出版给予的支持和帮助。

由于时间仓促及水平有限,书中难免存在一些不足,敬请各位专家、同行和学生提出宝贵建议,以使该教材质量不断提高和完善。

马廷升

2010年4月29日

目 录

药物化学及分析

第一章 绪论	(1)
一、药物化学与分析的性质和任务	(1)
二、药品质量标准	(2)
三、课程的学习要求	(3)

第一篇 方法篇

第二章 药品检验工作的基本程序	(7)
一、样品审查	(7)
二、取样	(7)
三、检验	(7)
四、记录与写出检验报告	(8)
第三章 药物的鉴别方法	(10)
一、药物鉴别的一般程序	(10)
二、鉴别药物的方法	(11)
第四章 药物的杂质检查方法	(17)
第一节 药物的杂质来源及种类	(17)
一、杂质的来源	(17)
二、杂质的种类	(18)
第二节 杂质的检查和限量计算	(18)
一、杂质的限量检查	(18)
二、杂质的限量计算	(19)
三、应用示例	(20)
第三节 一般杂质的检查方法	(20)
一、氯化物检查法	(20)
二、硫酸盐检查法	(21)

三、铁盐检查法	(22)
四、重金属检查法	(23)
五、砷盐检查法	(24)
六、酸碱度检查	(25)
七、干燥失重测定法	(25)
第四节 特殊杂质的检查	(26)
第五章 药物的含量测定 (滴定分析法)	(27)
第一节 滴定分析概论	(27)
一、滴定分析法及其分类	(27)
二、滴定分析法对化学反应的要求及滴定方式	(28)
三、标准溶液	(29)
四、滴定分析计算	(30)
第二节 酸碱滴定法	(31)
一、酸碱指示剂的变色原理	(31)
二、酸碱滴定类型及指示剂的选择	(32)
三、应用示例——乙酰水杨酸 (阿司匹林) 的测定	(34)
第三节 配位滴定法	(34)
一、EDTA 及其金属离子配位作用	(34)
二、基本原理	(34)
三、滴定条件的选择	(34)
四、金属指示剂	(35)
五、应用示例——铝盐的测定	(35)
第四节 沉淀滴定法	(35)
一、滴定曲线	(35)
二、指示终点的方法	(36)
三、应用示例——氯化铵的含量测定	(36)
第五节 氧化还原滴定法	(37)
一、滴定曲线	(37)
二、指示剂	(37)
三、亚硝酸钠法	(38)
四、应用示例——盐酸普鲁卡因含量的测定	(38)
第六节 非水溶液中的酸碱滴定法	(39)
一、碱的滴定	(39)
二、酸的滴定	(39)
三、应用示例——有机碱的氢卤酸盐的含量测定	(40)

第六章 药物的含量测定 (仪器分析法)	(41)
第一节 紫外-可见分光光度法	(41)
一、基本原理——朗伯-比尔定律	(41)
二、紫外-可见吸收光谱	(42)
三、偏离光吸收定律的因素	(42)
四、紫外-可见分光光度计	(43)
五、应用示例	(44)
第二节 色谱法	(44)
一、气相色谱法 (GC)	(45)
二、高效液相色谱法 (HPLC)	(47)
第七章 药物制剂分析方法	(51)
第一节 概述	(51)
第二节 片剂分析	(51)
一、基本步骤和常规检查	(52)
二、含量测定	(52)
第三节 注射剂分析	(54)
一、基本步骤和常规检查	(54)
二、含量测定	(55)

第二篇 药物篇

第八章 麻醉药	(61)
第一节 全身麻醉药	(61)
一、临床药物概述	(61)
二、典型药物分析	(63)
第二节 局部麻醉药	(65)
一、临床药物概述	(65)
二、构效关系	(68)
三、典型药物分析	(68)
第九章 镇静催眠药、抗癫痫药及抗精神病药	(71)
第一节 镇静催眠药	(71)
一、临床药物概述	(71)
二、巴比妥类药物结构与药效的关系	(74)
三、典型药物分析	(74)
第二节 抗癫痫药	(75)

一、临床药物概述	(75)
二、典型药物分析	(76)
第三节 抗精神病药	(76)
一、临床药物概述	(76)
二、典型药物分析	(77)
第十章 解热镇痛药及非甾体抗炎药	(80)
第一节 解热镇痛药	(80)
一、临床药物概述	(80)
二、典型药物分析	(83)
第二节 非甾体抗炎药	(85)
一、临床药物概述	(85)
二、典型药物分析	(88)
第十一章 镇痛药	(90)
第一节 吗啡及其半合成衍生物	(90)
一、临床药物概述	(90)
二、典型药物分析	(93)
第二节 吗啡的全合成代用品	(94)
一、临床药物概述	(94)
二、典型药物分析	(96)
第三节 镇痛药的构效关系	(96)
第十二章 抗组胺药	(98)
第一节 H_1 受体拮抗剂	(98)
一、临床药物概述	(98)
二、构效关系	(101)
三、典型药物分析	(102)
第二节 H_2 受体拮抗剂	(103)
一、临床药物概述	(103)
二、 H_2 受体拮抗剂的构效关系	(104)
三、典型药物分析	(104)
第十三章 拟肾上腺素药	(106)
第一节 临床药物概述	(106)
第二节 一般代谢过程	(107)
第三节 构效关系	(108)
第四节 典型药物分析	(109)

第十四章 拟胆碱药和抗胆碱药	(112)
第一节 拟胆碱药	(112)
一、临床药物概述	(112)
二、典型药物分析	(114)
第二节 抗胆碱药	(115)
一、临床药物概述	(115)
二、典型药物分析	(117)
第十五章 心血管系统药物	(120)
第一节 调血脂药	(120)
一、临床药物概述	(120)
二、典型药物分析	(123)
第二节 抗心绞痛药	(124)
一、临床药物概述	(124)
二、典型药物分析	(127)
第三节 抗高血压药	(127)
一、临床药物概述	(127)
二、典型药物分析	(130)
第四节 抗心律失常药	(130)
一、临床药物概述	(130)
二、典型药物分析	(131)
第十六章 抗肿瘤药	(133)
第一节 烷化剂	(133)
一、临床药物概述	(133)
二、典型药物分析	(135)
第二节 抗代谢药	(135)
一、临床药物概述	(135)
二、典型药物分析	(136)
第三节 其他类抗肿瘤药	(137)
第十七章 维生素	(139)
第一节 脂溶性维生素	(139)
一、临床药物概述	(139)
二、典型药物分析	(141)
第二节 水溶性维生素	(143)
第十八章 抗菌药	(146)

第一节 磺胺类药物及抗菌增效剂	(146)
一、临床药物概述	(146)
二、磺胺类药物的构效关系	(147)
三、磺胺类药物的作用机制	(148)
四、抗菌增效剂	(148)
五、典型药物分析	(149)
第二节 喹诺酮类抗菌药	(149)
一、临床药物概述	(149)
二、构效关系、作用机制	(151)
三、典型药物分析	(152)
第三节 抗结核病药	(153)
一、临床药物概述	(153)
二、典型药物分析	(154)
第十九章 抗生素	(156)
一、临床药物概述	(156)
二、 β -内酰胺类抗生素的作用机理	(162)
三、过敏反应	(163)
四、稳定性	(163)
五、典型药物分析	(163)
第二十章 甾类药物	(166)
第一节 甾类药物分类	(166)
第二节 雌甾类药物	(167)
一、临床药物概述	(167)
二、典型药物分析	(168)
第三节 雄甾类药物	(168)
一、临床药物概述	(168)
二、典型药物分析	(170)
第四节 孕甾类药物	(170)
一、临床药物概述	(170)
二、典型药物分析	(174)

第三篇 技能篇

☆ 药物化学与分析实验须知 ☆	(175)
实验一 分析天平的称量练习	(177)

实验二	滴定分析操作练习	(182)
实验三	酸碱标准溶液的配制与标定	(188)
实验四	几种有机药物的定性鉴别	(191)
实验五	葡萄糖的一般杂质检查	(193)
实验六	某些药物的特殊杂质检查	(196)
实验七	阿司匹林片的含量测定	(198)
实验八	氯苯那敏片的分析	(200)
实验九	黄体酮注射液的分析	(202)

绪 论

一、药物化学与分析的性质和任务

药物化学与分析是医药营销专业教学计划中的一门重要专业课程,是根据该专业培养方向和目标,把分析化学、药物化学、药物分析三门课程按其内在的联系和规律性,由方法篇、药物篇、技能篇三大板块进行科学设计和有机整合而形成的精品课程。药物化学与分析是应用化学的理论和方法来研究化学药物的组成、结构、化学结构与药效关系、药物作用的化学机理、体内代谢、理化性质、分析方法等内容,是一门综合性的应用学科。

药物是指用于预防、诊断、缓解和治疗疾病以及有目的地调节人体生理功能的物质。包括化学药品、抗生素、生化药品、放射性药品、生物制品、中药饮片和中成药等,是一种关系人民生命健康的特殊商品。通过药物化学与分析课程的学习,能认识和熟悉药物的组成、结构、理化性质、药物的质量标准及其检测手段、药物结构与性质的联系、结构与药效的联系等有关理论、方法与技能,并将其运用到药物的调剂、制剂、质量检查、贮存保管和临床应用等工作中,以确保药物的质量。

药物化学与分析的主要任务如下。

(1) 为有效地利用现有药物提供理论基础。只有研究和认识了药物的组成、结构、理化性质、构效关系等,才能更有效、合理地应用药物,以解决好药物的调配、分析检验、使用和贮存等问题,确保药物的质量,更好地服务于人类保健事业。

(2) 加强药物研究、生产、贮存、使用等过程中的质量控制。药品质量直接关系到人民的身体健康与生命安全,只有质量合格的药品才能供使用,每个药学工作者及医务工作者必须牢固树立药品质量第一的观点。药品的质量控制是一个全过程的控制,包括药物的研制、生产、经营、贮藏、调配、检验以及其临床使用等诸多环节的质量控制,我国对药品质量控制的全过程具有指导性作用的法令文件有《药品非临床研究质量管理规范》(GLP),《药品生产质量管理规范》(GMP),《药品经营质量管理规范》(GSP),《药品临床试验管理规范》(GCP)。药物质量控制的主要内容有:真伪鉴别、纯度检查、有效性和安全性检查以及有效成分的含量测定等,目的是保证药物临床应用中的有效性和安全性。

(3) 探索药品营销的专业技巧。药品营销不仅仅是简单把药品推销给客户或患者取得合理利润,还应该把健康的理念带给他们,把药品相关的专业知识传授给他们。如在推销喹诺酮类新药司帕沙星,如能从药物的构效关系、化学作用机理方面出发,与大家比较熟悉的同类药物诺氟沙星(氟哌酸)进行比较分析,新药新在哪里;根据药物的理化性质分析如何保存和使用,你的客户或患者会觉得你是真正的专家内行,会很快取得信任,这样经济效益和社会效益会达到双赢的效果。

二、药品质量标准

药物的质量标准即药品标准,是对药物的各品种做出的质量指标和检验方法的技术规定。它对保证药品质量,促进药品生产和管理,确保用药的安全有效均有极其重要的作用。它是药品生产、检验、管理、供应和使用部门必须遵循的依据,具有法律的约束力。为了保证药品质量,应该遵循国家规定的药品质量标准进行药品检验和质量控制工作。国家设有专门负责药品检验的法定机构,即各级药品检验所;药厂、医药公司以及医院药房等单位也设立相应的药品质量检验部门。

(一) 国家药品质量标准

我国现行药品质量标准有《中华人民共和国药典》(简称《中国药典》)和《中华人民共和国食品药品监督管理局标准》(简称《局颁标准》)。

1. 《中华人民共和国药典》

《中华人民共和国药典》(简称《中国药典》)是我国用于药品生产和管理的法典,由国家食品药品监督管理局药典委员会编纂,经国务院批准后,国家食品药品监督管理局颁布执行。《中国药典》收载的品种为疗效确切、被广泛应用、能批量生产、质量水平较高、并有合理的质量控制手段的药品。《中国药典》已出版了九版,分别为1953、1963、1977、1985、1990、1995、2000、2005、2010年版。2005、2010年版分成三部,一部收载中药材、中成药;二部收载化学药品、抗生素、生物药品等;三部收载生物制品。

药典的内容一般分为凡例、正文、附录三部分。为了正确地理解与使用药典,对凡例部分应予逐条地阅读和分析。正文部分收载药品或制剂的质量标准,其主要内容为:药品的性状、鉴别、检查、含量测定、类别、剂量以及贮存等。附录部分记载了制剂通则、一般杂质检查方法、一般鉴别试验、有关物理常数测定法、试剂配制法,以及色谱法、氧瓶燃烧法等内容。

2. 《中华人民共和国食品药品监督管理局标准》

《中华人民共和国食品药品监督管理局标准》(简称《局颁标准》或《局标准》)也由药典委员会编纂出版,食品药品监督管理局颁布执行。《局标准》收载的品种为药典没有收载的品种。

(二) 常见国外药典简介

目前世界上许多国家都有其本国的药典,可供我们在药物化学与分析学习中参阅的国外药典主要有《英国药典》、《美国药典》、《日本药局方》、《欧洲药典》。

1. 《英国药典》

《英国药典》(British Pharmacopeia, 缩写为 BP) 目前最新版本为 2009 年版, 由三卷组成。第一卷内容包括绪论、通则、原料药质量标准。第二卷内容包括通则、制剂、血液制品、免疫制品、放射性药品、手术用品的质量标准, 药品的红外索引。第三卷收载兽医药品。《英国药典》(2009 年版) 由凡例、正文、附录和索引等内容组成。正文内容包括: 英文名称、分子结构式、分子式与分子量、化学文摘 (CA) 登录号、化学名称、作用与用途、制剂类型、来源或含量限度、性状、鉴别、检查、含量测定、贮藏。

2. 《美国药典》

《美国药典》(The Pharmacopoeia of the United States of American, 缩写为 USP), 由美国药典委员会编辑出版, 其最新版本是第 31 版, 与《美国国家处方集》(National Formulation, NF) 合并出版 (USP31. NF26), 新版《美国药典》自 2007 年 11 月 1 日执行。该药典由凡例、正文、附录、索引等内容组成, 正文部分共收载了三千多个药物品种 (制剂)。

3. 《日本药局方》

日本药典名称是《日本药局方》, 英文缩写为 JP, 最新版本为第十五改正版 [JP (XV)]。它由一部和二部组成, 共一册。一部收载有凡例、制剂总则 (即制剂通则)、一般试验方法、医药品各论 (主要为化学药品、抗生素、放射性药品以及制剂); 二部收载通则、生药总则、制剂总则、一般试验方法、医药品各论 (主要为生药、生物制品、调剂用附加剂等)、药品红外光谱集、一般信息等。索引置于最后, 《日本药局方》的索引有药物的日本名索引、英文名索引和拉丁名索引三种, 其中拉丁名索引用于生药品种。

4. 《欧洲药典》

《欧洲药典》(Ph. Eur) 由欧洲药典委员会编制、出版, 为 27 个成员国及欧共同体所认可。基本组成有凡例, 通用分析方法 (包括一般鉴别试验, 一般检查方法, 常用物理化学测定法, 常用含量测定方法, 生物检查和生物分析, 生药学方法)、对盛装容器和材料的要求、试剂、正文等。

三、课程学习要求

药物化学与分析是根据医药营销专业的特点, 以基本理论知识和技能“必需、够用”为原则, 剔除一些过深的理论知识, 以增强教材的实用性和先进性。课程由方法篇、药物篇、技能篇三部分组成, 学习要求如下。

(1) 方法篇 主要介绍了药物的分析方法学, 即药物的鉴别、检查、含量测定的方法, 要求学生能够熟练掌握药物分析的基本理论知识。

(2) 药物篇 主要介绍了临床常用药物的结构、构-效关系、作用机制及典型药物的分析。要求学生能根据药物结构分析药物的理化性质、鉴别、含量测定的原理和

方法。

(3) 技能篇 配合理论课, 安排了系列实验, 包括分析天平的使用、滴定基本操作及药物的鉴别、检查、含量测定等内容。要求学生认真操作, 观察现象, 掌握基本的操作技能。

思考题

1. 药物化学与分析研究的主要内容和主要任务有哪些?
2. 我国的国家药品质量标准有几种类型? 药品检验的法定机构是什么?
3. 《中国药典》分哪几个部分? 各部分的主要内容是什么? 国外主要国家和地区性药典的名称是什么?

第一篇

方 法 篇

在方法篇中，根据药品检验工作的基本程序，介绍了药物的鉴别方法、杂质检查方法、含量测定方法（滴定分析法、仪器分析法）及药物制剂分析方法等内容。

