

中华人民共和国卫生部审訂

高等医药院校用

葯物化学教学大綱

1963.3

药物化学教学大纲

开本：787×1092/32 印张：14/16 字数：18千字

中华人民共和国卫生部审订

人 民 卫 生 出 版 社 代 印

(北京图书出版业营业许可出字第〇四六号)

• 北京前门大街门牌三十六号 •

通 县 印 刷 厂 印 刷

新华书店北京发行所发行 • 各地新华书店经售

统一书号：14018·2854

1963年10月第1版—第1次印刷

定 价：0.11元

印 数：1—1,050

葯物化学教学大綱

(供葯学专业用)

一、本課程的目的和任务

葯物化学为专业課之一，根据培养目标和教学計劃的規定，本課程的任务是培养学生具有葯物化学的基本理論和专业知識，掌握葯物分析的原理及技能，掌握葯物的理化特性及其主要变化規律，熟悉化学葯物制备的原理及基本技能；了解葯物研究的一般途徑和发展方向，并能独立工作的葯师。

通过本課程学习，学生应达到的基本要求：

(1) 了解葯物化学的发展，及解放后我国的发展情况。

(2) 掌握葯物分析鉴定的原理，主要方法和技能；了解不同分析方法选择的原則和应用范围，以及葯品規格制訂的依据。

(3) 熟悉化学葯物制备的原理和基本技能，了解有关制备路綫选择的原則和杂质来源。

(4) 能根据葯物的結構，掌握其理化特性和主要变化規律，并能应用于葯物鉴定，配制和貯藏等方面。

(5) 明确葯物的主要用途，了解化学結構与葯理作用的关系及葯物的研究和发展方向。

二、課程內容

藥物化學是一門內容廣泛的應用學科。根據藥學專業要求和特點，課程內容應以藥物分析，理化特性和藥物製備為主要內容。課堂教學以藥典收載和常用的藥物為主，其次是有發展前途的新藥，並適當介紹本門學科的最新成就，同時選擇典型的藥物，系統地講授其來源和發展，製備過程及雜質來源、性狀、鑑別、含量測定、主要用途和貯藏等，使學生對於藥物有較全面和完整的知識，其餘內容作一般講授或自學，為此講授過程中建議注意下述部分：

（1）講授製備過程時，結合製備路線選擇的介紹，重點講授國內或其他較好的製備的方法和反應原理，以及控制產品產量的關鍵問題，並在此基礎上說明製備時可能帶來的雜質及檢查原理，這樣不僅使學生對藥物的製備過程有較完整的知識，並可了解藥典規定某種藥物必須檢查某些雜質的原因。

（2）講授藥物性質時，應指出藥物結構與性質的依賴關係，從而根據結構特徵，闡明某一類型藥物有關檢驗，穩定性和配制等方面共性，通過分析比較又指出個別藥物的特性及外界條件不同所引起的變化及其防止方法，使學生達到比較靈活地運用這些基本知識的目的。

（3）講授含量測定時，首先應是藥典方法的原理，以及操作中注意點，其次通過結構的分析，可介紹其他方法和選用原則以及優缺點等，使學生可根據不同條件能夠靈活運用。

鑑於藥物化學內容的豐富，課堂教學主要是在有限的時間內通過講授給予學生有關藥物化學的基本理論和必須的專

业知識、更重要的是在教学过程中訓練其科学的思想方法和扩大自己知識領域的学习方法，使具有在工作中善于发现問題和解决問題的基本能力。

其次葯物化学內容較為广泛，除掌握重点外，課堂講授应以葯物的結構为中心，然后根据其結構引伸出制备的方法、性状、檢驗、稳定性和新葯发展等一系列問題，即以結構为綱，将整个葯物化学的知識，有机地联系，避免形成各种知識的堆积和現象的罗列，从而影响学生的吸收。

教学大綱基本上是根据化学分类的原則，无机葯物依据門捷列夫周期系分类，有机葯物一般按照有机化合物的分类方法。天然葯物由于它們具有的某些共同性或特殊作用，分別列为专章，此外，为了教学的需要，也可采用化学和葯理的混合分类法。

现将課程具体内容分为緒論，无机葯物，有机葯物和天然葯物，分述如下：

緒 論

(一) 葯物化学的范围和任务。

(二) 葯物化学发展簡史及解放后我国的发展和成就。

(三) 中国葯典和保証葯物質量的重要性以及葯品規格制訂的依据。

(四) 葯物中杂质来源及一般杂质限度检查法。

(五) 葯典分析方法概述及葯物分析方法研究的途徑。

(六) 研究新葯的途徑和方法。

①說明：

通过本課程研究对象和任务的講授說明本課程和有关基础課和专业課的关系，說明化学葯物制备和保証葯物質量对

人民保健事业的重要意义以及一般杂质限度检查原理和研究新药的途径和方法。

无 机 药 物

概 論

1. 无机药物的特性、来源及检验方法。

2. 无机药物的制备方法。

(一) 氧、水及过氧化氢

(二) 卤素及含锰药物

次氯酸盐，盐酸，氯化钠，溴化钾(钠)，碘，碘化钾(钠)，高锰酸钾。

(三) 硫及含硫的药物

升华硫，硫酸钠，硫代硫酸钠。

(四) 氮、磷、砷和铋的药物

氧化亚氮，氨，氯化铵，溴化铵，磷酸二氢钠，三氧化二砷，碱式碳酸铋。

(五) 碳和硼的药物

药用炭，二氧化碳，碳酸氢钠，硼酸，硼砂。

(六) 铝的药物

明矾，氢氧化铝凝胶，白陶土。

(七) 镁，钙和钡的药物

氧化镁，碳酸镁，硫酸镁，三硅酸镁，石膏，氯化钙，磷酸氢钙，硫酸钡。

(八) 锌和汞的药物

氧化锌，硫酸锌，金属汞，黄氧化汞，甘汞，升汞，氯化氨基汞。

(九) 铜，银和铁的药物

硫酸銅，硝酸銀，硫酸亞鐵。

②說明：

(1) 无机藥物的制备：应在无机化学的基础上着重講授达到藥用要求的制备过程或精制方法，加强学生对藥物和化合物区分的知識。

(2) 无机藥物的化学性質，着重講授有关藥物的分析稳定性和制备等方面的特性，应避免与无机化学不必要的重复。

(3) 无机藥物的含量測定，应在分析化学的基础上着重講授各类方法用于藥物分析时的要求和条件，以及制剂或混合物分析时，在測定前样品的原理和成份的分离等步驟。

有 机 藥 物

概 論

1. 有机藥物的来源，特性和檢驗方法。

2. 有机藥物的化学結構与藥理作用的关系。

(一) 烴类及卤代烴类

液状石蜡，凡士林，环丙烷，氯仿（麻醉用），氯乙烷，四氯乙烷，氟氯新。

③說明：

(1) 指出从烴类到卤代烴类的性質和藥理作用的一般变化，了解藥物的性質和作用，随着結構的改变，相应有所改变。

(2) 通过重点藥物的講授，了解达到藥用要求的制备和精制过程，和重要的杂质来源及其检查原理。

(二) 醇类，醚类及醛类

乙醇，三溴乙醇，三氯叔丁醇，甘油，3-甲基戊烷

(1)-3-醇，二巯基丙醇，乙醚（麻醉用），二乙烯醚，烏洛托品，水合氯醛，三聚乙醛。

④說明：

(1) 說明醇类，醚类及醛类一般的葯理作用和用途。

(2) 了解重点葯物的制备或精制过程，重要杂質的来源及其检查原理，熟习化学特性和測定方法等。

(三) 羧酸，羟酸类和酯类。

十一烯酸及其鋅盐，硬脂酸及其盐类，乳酸鈣，酒石酸及盐类，枸橼酸及盐类，葡萄糖酸鈣，依地酸鈣鈉。

亚硝酸异戊酯，月桂基硫酸酯鈉，大风子酸乙酯。

⑤說明：

(1) 通过某些羟酸及十一烯酸的制备分別了解发酵和裂化的基本知識。

(2) 熟习羧酸，羟酸及酯类的化学特性和測定的方法。

(3) 通过某些重点葯物的講授如依地酸盐类，了解如何根据原料选择制备路綫，与金屬絡合的化学特性在医药，及葯物分析上的广泛用途。

(四) 氨基甲酸酯及酰脲类

1. 氨基甲酸酯类——烏拉坦，密尔通和有关葯物。

2. 丙二酰脲及类似物——巴比妥，苯巴比妥，戊巴比妥鈉，阿米妥，硫噴妥鈉，杜立登，甲普龙。

3. 乙丙酰脲及类似物——苯妥英鈉，美索因，三甲双酮。

⑥說明：

(1) 了解各类葯物的一般制备方法及其关键性問題和发展的情况，通过密尔通的制备了解接触氢化的基本知識。

(2) 熟习各类药物的共性与特性并掌握各类药物鉴别及测定的原理和注意点。

(五) 季铵盐类和氮芥类

1. 季铵盐类

(1) 胆碱酯类——氯化乙酰甲胆碱，氯化氨甲酰胆碱。

(2) 肌肉松弛剂和植物神经节阻断剂——碘化+甲季铵，氯化丁二酰胆碱，溴化六甲季铵，喷妥林及有关抗高血压药物概述。

(3) 阳离子型局部抗感染药——氯化苯甲烃铵，溴化十六烷基吡啶铵。

(4) 治钩虫病药——灭虫宁

2. 氮芥类——盐酸氧化氮芥及有关抗肿瘤药概述。

⑦说明:

(1) 了解季铵盐类和氮芥类的一般制备方法，通过灭虫宁的制备，了解高压反应的基本知识。

(2) 熟习此二类药物的共性及特性并掌握重点药物测定原理和注意点。

(3) 了解抗肿瘤及抗高血压药物的现状和发展情况。

(六) 酚类和芳酸及其衍生物

(1) 酚类——已基间苯二酚，六氯甲双酚 (Hexachlorophenol), α -溴苯酚。

(2) 芳酸及其衍生物——苯甲酸及其钠盐，苯甲酸苄酯，水杨酸及其钠盐，阿斯匹林，对羟苯甲酸乙酯，水杨酰胺，对氨基水杨酸及其盐类。

说明:

(1) 了解重点药物的制备过程或精制过程及关键问

題，某些特殊反应如分子重排羧基化反应等原理。

(2) 熟习酚类，酚酸类和芳酸类及其衍生物的共性和特性，掌握重点藥物測定原理和注意点，以及在配制和保存时应注意的問題。

(七) 芳胺和芳烃胺类

非那西汀，苯海拉明，吡苾杂明，及抗組織胺藥概述。

說明：

(1) 通过芳胺衍生物的制备了解加速胺类酰化反应的基本原理。

(2) 了解重点藥物的制备过程杂质来源及检查原理。

(3) 掌握各类藥物的化学特性及測定原理。

(八) 芳磺酸及其衍生物

1. 糖精及氯胺类——糖精鈉及氯胺类藥物

2. 磺胺类——磺乙酰胺，磺胺噻唑，羧苯甲酰磺胺噻唑，磺胺脒，磺胺嘧啶，磺胺甲噁啶，磺胺双甲噁啶，磺胺甲噻及其他新磺胺藥物。

3. 磺酰胺类及磺酰脲类——乙酰唑胺，双氢克尿塞及其衍生物，对甲苯磺酰丁脲。

4. 苯砒类——氯苯砒，苯丙砒。

說明：

(1) 通过糖精及对甲苯磺酰丁脲的制备，学生进一步了解制备路綫的选择及副产品的綜合利用，熟悉磺胺类藥物制备的一般方法，关键性問題及我国的改进工作等。

(2) 熟习上述各类藥物的共性与特性，掌握重点藥物測定原理，注意点及应用范围等。

(3) 通过磺酰胺类利尿藥和磺酰脲类降血糖藥的發現，了解磺胺藥物广闊的发展前途。

(九) 含金属的有机药物

1. 含砷的有机药物——新肿凡纳明，硫肿凡纳明，盐酸二氯苯肿，卡巴肿。

2. 含锑的有机药物——葡萄糖酸锑钠，酒石酸锑钾及抗血吸虫病药物概述。

3. 含汞的有机药物——汞溴红，硫柳汞，汞撒利。

说明：

(1) 了解含金属有机药物制备过程中的主要反应。

(2) 熟悉含金属有机药物的特性并掌握测定金属方法的原理和注意点。

(3) 了解我国抗血吸虫病药物研究现状和成就。

(十) 药用染料及诊断用药

1. 三苯甲烷类及偶氮类——甲紫，苏拉明钠。

2. 酞类——双醋酐汀，碘酞钠，酞磺酞，荧光素钠，三溴酞酞乙酯。

3. 吖啶类及噻嗪类——雷佛奴，亚甲兰。

4. 有机碘化物——碘吡啦啥，乌乐康，碘化油。

说明：

(1) 了解重点药物的制备方法及其有机碘化物在不同条件下的碘化反应。

(2) 熟悉各类药物的共性与特性，掌握重点药物及其有机卤素化合物测定原理及注意点。

(十一) 杂环族合成药物

1. 呋喃及四唑衍生物——呋喃西林及其衍生物，卡地爱唑。

2. 吡唑酮衍生物——安替匹林，匹拉米董，安乃近，保太公。

3. 吡啶衍生物——尼可刹明，异菸肼，异丙基异菸肼。

4. 嘧啶及吡嗪衍生物——丙基硫氧嘧啶，驅蛔灵，海群生。

5. 喹啉及苯駢噻嗪衍生物——喹碘仿，异丙嗪，氯丙嗪及安宁药概述。

說明：

(1) 通过重点药物的講授，了解各种主要杂环的制备过程和特殊的反应。

(2) 熟悉各类杂环药物的共性和特性，掌握重点药物测定原理和注意点。

(3) 了解安定药物的发展概况。

(三) 除害用药及常用农药

1. 除害用药——滴滴涕，六六六，安妥。

2. 农药（主要为有机磷酸酯类）及其解毒剂——敌百虫，E605，馬拉松，碘化甲基吡啶甲醛肟（PAM）。

說明：

(1) 了解两类药物的主要类型和有关性质。

(2) 重点講授滴滴涕，六六六，敌百虫及对硫磷，介磷定等的制备过程及我国创造性的改进工作及其测定方法。

(三) 药用高聚物

1. 血浆代用品——右旋糖酐，聚乙烯四氢吡咯酮(PVP)

2. 聚乙二醇类和山梨醇类——聚乙二醇类(PEG)，司班(Span)，屯(Tween)

3. 药用离子交换树脂。

4. 纖維素衍生物及多聚硅化合物——甲基纖維素，羧甲基纖維素(CMC)，氧化纖維，聚硅氧。

說明：

(1) 通过各类药物的讲授, 了解高分子化合物制备和性质的基本知識。

(2) 指出高聚物在药學上的广泛用途和发展前途。

(三) 含放射性同位素的药物

1. 制备过程

2. 放射性强度, 純度及其測定

3. 各种輻射对人体容許剂量的确定。

4. 在医疗上应用的药物——含放射性同位素磷³², 鈷⁶⁰, 碘¹³¹的药物。

5. 抗射线病药物概述

6. 放射性药物的防护及取用, 貯运时的注意点。

說明:

在基础課讲授的原子核物理及原子核化学的基础上重点讲授放射性药物制备过程, 强度純度的測定, 防护, 取用及貯运时的注意点, 抗射线病药物概述等內容。

天 然 药 物

(一) 萜烯类及其衍生物

薄荷脑, 樟脑及其衍生物, 冰片, 山道年。

說明:

1. 了解萜类及其衍生物在医药上的用途。

(2) 重点讲授樟脑, 冰片, 山道年的制备过程有关异构化反应和測定原理。

(二) 生物碱及其合成代用品

1. 生物碱提取、分离和純化的原理和方法。

2. 生物碱含量的一般測定法。

3. 生物碱結構測定和研究的一般方法。

4. 苯胺衍生物——麻黃生物鹼，麻黃鹼，去氧麻黃鹼，苯丙胺。

5. 托派衍生物

(1) 颠茄生物鹼类——东莨菪鹼，阿托品及其合成代用品——后馬托品，溴本辛，普魯本辛。

(2) 古柯生物鹼类——古柯鹼

①古柯鹼合成代用品发展过程；

②合成代用品——苯佐卡因，普魯卡因，邦托卡因，賽洛卡因，組伯卡因。

6. 喹啉衍生物——奎宁及其盐类

(1) 奎宁合成代用品发展过程

(2) 合成代用品——氯胍，环氯胍，扑瘧奎琳，瘧蘇平，氯喹，伯氨喹琳，乙胺嘧啶。

7. 异喹啉衍生物

(1) 黃連生物鹼类——小蘗鹼

(2) 阿片生物鹼类——嗎啡罂粟鹼，可待因

①嗎啡代用品发展过程；

②嗎啡衍生物——狄奧宁，去水嗎啡，丙酮嗎啡。

③嗎啡合成代用品——度冷丁，普魯汀，美沙酮，N-甲基 3-羧嗎啡烃及其他嗎啡类新鎮痛药概述。

(3) 汉防己生物鹼类——汉防己甲素

(4) 延胡索生物鹼

8. 吲哚衍生物

(1) 番木鱉生物鹼类——土的宁

(2) 麦角生物鹼类——麦角新鹼，麦角胺。

(3) 毒扁豆生物鹼及其合成代用品——毒扁豆鹼，溴化新斯的明。

(4) 蘿芙木生物鹼類——利血平，利生胺，的生丁。

9. 亞氨基衍生物——毛果芸香鹼

10. 黃嘌呤衍生物——咖啡因，茶鹼，柯柯豆鹼及其復合物。

11. 其他生物鹼概述

(1) 常山生物鹼

(2) 貝母生物鹼

說明：

(1) 根據生物鹼的性質講授生物鹼提取分離和純化的一般原理和方法，並能根據生物鹼結構特徵，進行鑑別。

(2) 通過代表性藥物的講授，了解從天然藥物演變到合成代用品的過程以及藥物研究的一般途徑。

(3) 熟悉生物鹼的共性和化學特性，掌握測定生物鹼含量的一般方法，其中尤應注意非水溶液滴定，容量提取及離子交換法，在含量測定上的應用。

(三) 醣甙及鞣質

1. 醣類——葡萄糖，乳糖，淀粉。

2. 甙類——提取和純化的原理和方法。

苦杏仁甙類，蔥甙類，黃鹼素甙類，洋地黃強心甙類，皂甙類，蟾酥毒。

3. 鞣質——分類，性質及醫藥上的用途

說明：

(1) 了解甙類的性質和提純原理。可以葡萄糖和洋地黃強心甙類為代表講授其製備和提取過程和關鍵問題。

(2) 熟悉糖甙及鞣質的特性和區別，掌握糖和甙類測定方法的原理和注意點。

(4) 維生素

1. 維生素概述

2. 水溶性維生素——菸酸，菸酰胺，抗坏血素，維生素B₆，鹽酸硫胺、核黃素，維生素B₁₂，叶酸。

3. 油溶性維生素——硫辛酸，維生素E，維生素D，維生素A，維生素K。

說明：

(1) 通过維生素C和D的制备了解生物氧化和光化学反应用在葯物制备中的应用，通过維生素A及B，或B₂等講授，了解結構較复杂葯物制备的过程。

(2) 熟悉各类維生素的化学特性，掌握各类維生素測定原理和注意点。

(五) 激素

1. 激素概述

2. 含氮激素——腎上腺素(附安得諾新)，去甲腎上腺素，异丙腎上腺素，甲状腺素，胰島素，增血压素，催产素。

3. 甾体激素

(1) 男性激素及其衍生物——甲基睾丸素，丙酸睾丸素，17 α -乙基-19-去甲基睾丸素，睾丸素，丙酸內酯。

(2) 女性激素及其合成代用品 雌性二醇，己烷雌酚，己烯雌酚，双烯雌酚，妊娠素(Ethisteronum)，黄体酮及其衍生物。

(3) 腎上腺皮質激素——抗炎松，去氧皮質酮，可的松，氢化可的松，去氢可的松和去氢皮質醇以及二者的衍生物。

說明：

(1) 了解腎之腺素及其衍生物的制备过程，并說明其不稳定性及配制保存时的注意点。

(2) 了解从薯蓣皂甙元为原料制备各种主要甾体激素的过程及有关的特殊反应, 如沃氏氧化霉菌氧化, 去氢反应等。

(3) 熟悉各类激素的化学特性和分光光度法在激素分析上的应用。

(4) 熟悉各类激素测定原理和注意点, 并了解甾体激素的现状和发展前途。

(六) 抗菌素

1. 抗菌素概述及分类

2. 抗菌素的制备过程

3. 青霉素类——青霉素G.v.o., 二甲氧基苯青霉素, 普鲁卡因, 青霉素, 二苄基乙二胺青霉素(长效西林)

4. 链霉素类——链霉素, 双氢链霉素。

5. 四环素类——四环素, 土霉素, 金霉素。

6. 合霉素类——合霉素, 氯霉素及无味氯霉素。

7. 其他临床应用的抗菌素——红霉素, 新霉素, 制菌霉素, 卡那霉素, 多粘菌素, 环丝氨酸等。

说明:

(1) 了解抗菌素制备过程(发酵和提炼)的基本知识和特殊要求, 通过具体药物代表性地讲述各种提炼方法及其优缺点。

(2) 根据各类主要抗菌素结构的特征, 熟悉有关鉴定, 配制和稳定性等性质。

(3) 掌握主要抗菌素测定原理和注意点, 并了解抗菌素的现状和发展前途。