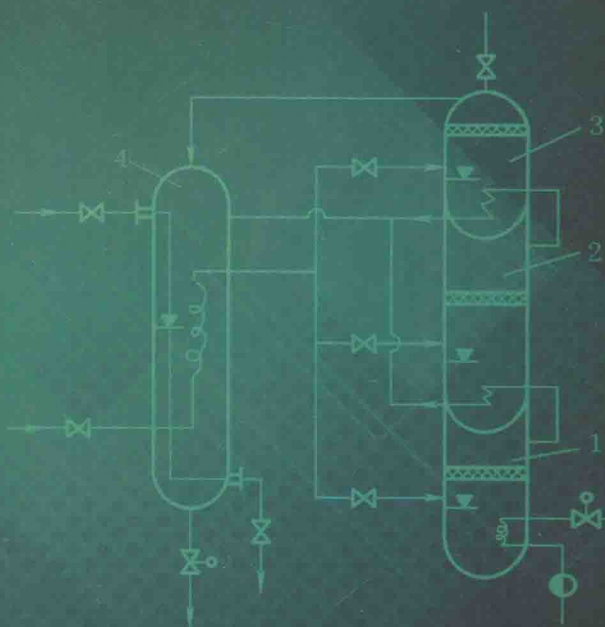


国家卫生和计划生育委员会“十二五”规划教材
全国高等医药教材建设研究会“十二五”规划教材
全国高等学校制药工程、药物制剂专业规划教材
供制药工程专业用

制药工程导论

主 编 宋 航

副主编 章亚东 武法文 贡济宇



人民卫生出版社
PEOPLE'S MEDICAL PUBLISHING HOUSE

国家卫生和计划生育委员会“十二五”规划教材
全国高等医药教材建设研究会“十二五”规划教材
全国高等学校制药工程、药物制剂专业规划教材
供制药工程专业用

制药工程导论

主 编 宋 航

副主编 章亚东 武法文 贡济宇

编 者 (以姓氏笔画为序)

付廷明 (南京中医药大学)

贡济宇 (长春中医药大学)

宋 航 (四川大学化学工程学院)

陈国良 (沈阳药科大学)

武法文 (中国药科大学)

承 强 (四川大学化学工程学院)

郭 强 (牡丹江医学院)

章亚东 (郑州大学化工与能源学院)

图书在版编目 (CIP) 数据

制药工程导论 / 宋航主编. —北京: 人民卫生出版社,
2014

ISBN 978-7-117-18485-4

I. ①制… II. ①宋… III. ①制药工业-化学工程-高等
学校-教材 IV. ①TQ46

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2014) 第 030792 号

人卫社官网	www.pmph.com	出版物查询, 在线购书
人卫医学网	www.ipmph.com	医学考试辅导, 医学数 据库服务, 医学教育资 源, 大众健康资讯

版权所有, 侵权必究!

制药工程导论

主 编: 宋 航

出版发行: 人民卫生出版社 (中继线 010-59780011)

地 址: 北京市朝阳区潘家园南里 19 号

邮 编: 100021

E - mail: pmph@pmph.com

购书热线: 010-59787592 010-59787584 010-65264830

印 刷: 中国农业出版社印刷厂

经 销: 新华书店

开 本: 787×1092 1/16 印张: 15

字 数: 374 千字

版 次: 2014 年 4 月第 1 版 2014 年 4 月第 1 版第 1 次印刷

标准书号: ISBN 978-7-117-18485-4/R · 18486

定 价: 28.00 元

打击盗版举报电话: 010-59787491 E-mail: WQ@pmph.com

(凡属印装质量问题请与本社市场营销中心联系退换)

国家卫生和计划生育委员会“十二五”规划教材 全国高等学校制药工程、药物制剂专业规划教材

出版说明

《国家中长期教育改革和发展规划纲要(2010-2020年)》和《国家中长期人才发展规划纲要(2010-2020年)》中强调要培养造就一大批创新能力强、适应经济社会发展需要的高质量各类型工程技术人才,为国家走新型工业化发展道路、建设创新型国家和人才强国战略服务。制药工程、药物制剂专业正是以培养高级工程化和复合型人才为目标,分别于1998年、1987年列入《普通高等学校本科专业目录》,但一直以来都没有专门针对这两个专业本科层次的全国规划性教材。为顺应我国高等教育教学改革与发展的趋势,紧紧围绕专业教学和人才培养目标的要求,做好教材建设工作,更好地满足教学的需要,我社于2011年即开始对这两个专业本科层次的办学情况进行了全面系统的调研工作。在广泛调研和充分论证的基础上,全国高等医药教材建设研究会、人民卫生出版社于2013年1月正式启动了全国高等学校制药工程、药物制剂专业国家卫生和计划生育委员会“十二五”规划教材的组织编写与出版工作。

本套教材主要涵盖了制药工程、药物制剂专业所需的基础课程和专业课程,特别是与药学专业教学要求差别较大的核心课程,共计17种(详见附录)。

作为全国首套制药工程、药物制剂专业本科层次的全国规划性教材,具有如下特点:

一、立足培养目标,体现鲜明专业特色

本套教材定位于普通高等学校制药工程专业、药物制剂专业,既确保学生掌握基本理论、基本知识和基本技能,满足本科教学的基本要求,同时又突出专业特色,区别于本科药学专业教材,紧紧围绕专业培养目标,以制药技术和工程应用为背景,通过理论与实践相结合,创建具有鲜明专业特色的本科教材,满足高级科学技术人才和高级工程技术人才培养的需求。

二、对接课程体系,构建合理教材体系

本套教材秉承“精化基础理论、优化专业知识、强化实践能力、深化素质教育、突出专业特色”的原则,构建合理的教材体系。对于制药工程专业,注重体现具有药物特色的工程技术性要求,将药物和工程两方面有机结合、相互渗透、交叉融合;对于药物制剂专业,则强调不单纯以学科型为主,兼顾能力的培养和社会的需要。

三、顺应岗位需求,精心设计教材内容

本套教材的主体框架的制定以技术应用为主线,以“应用”为主旨甄选教材内容,注重学生实践技能的培养,不过分追求知识的“新”与“深”。同时,对于适用于不同专业的同一

课程的教材,既突出专业共性,又根据具体专业的教学目标确定内容深浅度和侧重点;对于适用于同一专业的相关教材,既避免重要知识点的遗漏,又去掉了不必要的交叉重复。

四、注重案例引入,理论密切联系实践

本套教材特别强调对于实际案例的运用,通过从药品科研、生产、流通、应用等各环节引入的实际案例,活化基础理论,使教材编写更贴近现实,将理论知识与岗位实践有机结合。既有用实际案例引出相关知识点介绍,把解决实际问题的过程凝练至理性的维度,使学生对于理论知识的掌握从感性到理性;也有在介绍理论知识后用典型案例进行实证,使学生对于理论内容的理解不再停留在凭空想象,而源于实践。

五、优化编写团队,确保内容贴近岗位

为避免当前教材编写存在学术化倾向严重、实践环节相对薄弱、与岗位需求存在一定程度脱节的弊端,本套教材的编写团队不但有来自全国各高等学校具有丰富教学和科研经验的一线优秀教师作为编写的骨干力量,同时还吸纳了一批来自医药行业企业的具有丰富实践经验的专家参与教材的编写和审定,保障了一线工作岗位上先进技术、技能和实际案例作为教材的内容,确保教材内容贴近岗位实际。

本套教材的编写,得到了全国高等学校制药工程、药物制剂专业教材评审委员会的专家和全国各有关院校和企事业单位的骨干教师和一线专家的支持和参与,在此对有关单位和个人表示衷心的感谢!更期待通过各校的教学使用获得更多的宝贵意见,以便及时更正和修订完善。

全国高等医药教材建设研究会

人民卫生出版社

2014年2月

附：国家卫生和计划生育委员会“十二五”规划教材 全国高等学校制药工程、药物制剂专业规划教材目录

序号	教材名称	主编	适用专业
1	药物化学 *	孙铁民	制药工程、药物制剂
2	药剂学	杨 丽	制药工程
3	药物分析	孙立新	制药工程、药物制剂
4	制药工程导论	宋 航	制药工程
5	化工制图	韩 静	制药工程、药物制剂
5-1	化工制图习题集	韩 静	制药工程、药物制剂
6	化工原理	王志祥	制药工程、药物制剂
7	制药工艺学	赵临襄 赵广荣	制药工程、药物制剂
8	制药设备与车间设计	王 沛	制药工程、药物制剂
9	制药分离工程	郭立玮	制药工程、药物制剂
10	药品生产质量管理	谢 明 杨 悦	制药工程、药物制剂
11	药物合成反应	郭 春	制药工程
12	药物制剂工程	柯 学	制药工程、药物制剂
13	药物剂型与递药系统	方 亮 龙晓英	药物制剂
14	制药辅料与药品包装	程 怡 傅超美	制药工程、药物制剂、药学
15	工业药剂学	周建平 唐 星	药物制剂
16	中药炮制工程学 *	蔡宝昌 张振凌	制药工程、药物制剂
17	中药提取工艺学	李小芳	制药工程、药物制剂

注：* 教材有配套光盘。

全国高等学校制药工程、药物制剂专业 教材评审委员会名单

主任委员

尤启冬 中国药科大学

副主任委员

赵临襄 沈阳药科大学

蔡宝昌 南京中医药大学

委 员 (以姓氏笔画为序)

于奕峰 河北科技大学化学与制药工程学院

元英进 天津大学化工学院

方 浩 山东大学药学院

张 珩 武汉工程大学化工与制药学院

李永吉 黑龙江中医药大学

杨 帆 广东药学院

林桂涛 山东中医药大学

章亚东 郑州大学化工与能源学院

程 怡 广州中医药大学

虞心红 华东理工大学药学院

前 言

制药工程导论是制药工程专业学生在大学一年级接触到的第一门专业基础课,并与化工制图构成了第一学年主要的工程基础教育课程。因此,制药工程导论既要为学生进行后继工程课程的学习提供“知识地图”,也应通过展示工程技术在药品生产中的应用,进而提高学生的学生兴趣,更好地了解工程与工程师的“真实情景”。

因此,本教材在广度上,定位于向学生介绍制药工业所需的共性科学理论体系、工程科学技术在制药工业中的应用,介绍药品生产相关的主要工程概念和工程师职业特征,以使更多的学生对药品生产的工程特点和工程与工程师活动有一个总体把握;在深度上,定位于化学工程科学技术与药品生产的融合,介绍本领域内独特的研究对象、研究方法和理论深度,通过侧重物理图景的浅显阐述,为学生后继学习“化工原理”、“制药分离工程”、“制药工艺学”、“药物制剂工程”和“制药设备与车间设计”等工程类专业课程提供必要的指南,尤其是有助于理解制药工程专业课程的整体知识构架和各个专业课程之间的联系。本书强调引入定性和定量研究方法,从而努力使学生具有进行技术和工艺创新所需的学科知识和研究能力。在教学目标上,使学生了解后继课程之间的联系与综合应用概况,并为有兴趣的学生提供进行深度自学、钻研的一定引导。

作为入门性的工程导论课程,本书关注“以学生为中心”的自主学习模式的养成。当然,自主学习模式也许意味着学生的知识积累可能是“跳跃”性的、归纳性的。这不同于较为习惯的知识传授模式。本书尝试通过核心知识点、能力要求的教学,形成学生自主学习的“起跳点”、“生长点”,促使学生获得基本训练并在毕业后不断自学。这些知识点、生长点的合理分布,构成本书必要的知识广度;而每一个知识点、生长点内的方法介绍和案例分析等则体现本书潜在的理论深度。

本教材按照 32~48 学时进行编写,各学校可根据实际情况选讲有关内容。全书分为总论、原料药的制造及制剂生产、药品生产质量工程及系统设计、药物生产技术发展及新药研发等四大部分,内容贯穿整个药物制造的全过程。共计十一章,由宋航主编,章亚东、武法文及贡济宇任副主编。编写分工如下:第一章、第五章、第十章:宋航,第二章、第八章:承强,第三章:章亚东,第四章:付廷明,第六章:郭强,第七章:贡济宇,第九章:武法文,第十一章:陈国良。本教材为高校教师与企业专家合作完成,强调未来工程人才综合素质与能力的塑

造。本书作为高等院校相关专业师生教学用书和参考书,也可供制药领域的管理和技术人员阅读参考。

本书在编写过程中,姚田、左涛等学生在资料收集、整理及制图等方面也作出了积极贡献。本书在编写中引用了一些文献,由于篇幅有限,仅列出其中主要的一部分,在此谨向所有著作权者表示诚挚的感谢。

编 者

2014 年 2 月

目 录

第一篇 总 论

第一章 药物与制药产业	1
第一节 药物的发现与发展.....	1
一、药物发现过程.....	1
二、药品的生命周期.....	3
第二节 制药工业的形成与发展.....	5
一、制药工业的形成过程.....	5
二、制药工业技术途径的发展.....	6
第三节 医药产业发展概况.....	7
一、世界医药产业发展概况.....	7
二、中国医药产业发展概况.....	8
三、中国医药产业发展前景.....	9
第二章 工程师与制药工程	13
第一节 工程师与职业素养.....	13
一、工程师的职业活动与工程师名词的起源和含义.....	13
二、工程师的执业制度.....	14
三、职业素养.....	15
第二节 工程技术的特点与基本原理.....	17
一、科学、技术、工程的特点.....	17
二、工程方法的基本原理.....	18
第三节 制药工程.....	20
一、现代制药工业的分类和主要特点.....	20
二、制药工程技术的学科构成.....	20
三、制药工程技术的作用及主要内容.....	21
第四节 工程教育.....	22
一、中国工程教育概况.....	22

二、工程教育模式与发展	23
三、工程教育认证与国际化	24
四、制药工程专业教育的发展及培养要求	25

第二篇 原料药的制造及制剂生产

第三章 化学制药工业过程	27
---------------------------	----

第一节 化学药物合成基本原理	27
一、卤化反应	28
二、硝化反应	28
三、磺化反应	28
四、重氮化反应	29
五、氧化反应	29
六、还原反应	29
七、烃化反应	29
八、酰化反应	30
九、缩合反应	31
十、环合反应	31
第二节 化学药物合成途径设计	31
一、化学药物合成途径设计的基本原则	31
二、化学药物合成途径设计的基本策略	33
三、化学药物合成途径设计的基本方法	34
第三节 化学药物合成工艺路线的选择与评价	38
一、化学反应类型的选择	38
二、合成工艺路线的评价原则	38
三、合成步骤和总收率	39
四、原辅材料供应	40
五、原辅材料更换和合成步骤改变	41
六、合成工艺设计中的需要综合考虑的相关因素及设计案例	45
第四节 化学药物合成工艺的优化	48
一、影响制药工艺反应过程的主要因素	48
二、工艺优化的作用及基本方法	49
三、优化路线时需综合考虑的问题	50
第五节 绿色化学及其在化学制药领域中的应用	52
一、绿色化学基本含义	53
二、绿色化学的基本原则	53
三、绿色化学在化学制药领域的应用实例	53
第六节 化学药物制造的过程研究与开发	55
一、化学药物制造的一般工业过程	55
二、化学药物制造的工业过程开发	56

三、化学制药反应器类型及其操作方式	59
四、反应过程放大	62
第四章 中药及天然药物制药工业过程	65
第一节 概述	65
一、中医药的形成与发展	66
二、天然药物科学的形成与发展	69
三、中药和天然药物的发展趋势	70
第二节 中药与天然药物原材料加工	71
一、药材质量控制与中药材生产质量管理规范(GAP)	71
二、中药炮制加工技术	72
第三节 中药与天然药物的提取分离和纯化过程	75
一、提取	76
二、精制和纯化	77
三、中药与天然药物提取分离新技术	79
第五章 生物制药过程	84
第一节 概述	84
一、生物药物及其发展简史	84
二、生物药物的分类	85
第二节 微生物发酵制药	86
一、概述	86
二、微生物发酵制药的基本工艺及过程控制	87
三、大规模发酵罐的设计与放大	89
四、青霉素的工业化发酵技术	89
第三节 现代生物技术制药的基本原理与工艺	90
一、现代生物技术制药的技术与工程体系	90
二、基因工程在现代生物技术制药中的地位和作用	92
三、现代生物技术制药工艺过程	92
四、现代生物技术应用实例	93
第四节 生物制药分离技术	94
一、预处理和细胞破碎	94
二、初步分离	96
三、纯化分离和成品加工	97
四、分离工艺放大	99
五、生物分离纯化实例	100
第六章 制剂及其生产工艺技术	102
第一节 概述	102
一、药物剂型的用途及药效	102

二、药物制剂的发展	103
三、药物制剂工程	104
第二节 固体制剂主要生产技术及基本工艺	107
一、原料药晶型及尺度控制	107
二、固体输送与混合	109
三、干燥	111
四、制粒	112
五、包衣	113
六、片剂的制备	114
七、颗粒剂及丸剂的制备	115
八、胶囊剂及散剂的制备	117
第三节 液体制剂及注射用无菌粉末的基本生产工艺技术	119
一、口服液制剂的基本生产工艺	119
二、注射液和输液制剂的基本生产工艺	120
三、注射用无菌粉末的基本生产工艺	123
四、外用液体制剂的基本生产工艺	124
第四节 气雾剂的基本生产工艺	125
一、气雾剂的用途及组成	125
二、气雾剂的制备生产工艺	126
第五节 半固体制剂的基本生产工艺	126
一、软膏剂	126
二、眼膏剂	127
三、凝胶剂	127
四、栓剂	127
第六节 新剂型与新技术	127
一、药物传输系统	127
二、制剂新技术	129
第七节 仿制药质量一致性研究	130
一、仿制药质量一致性的意义	130
二、仿制药质量一致性的评价	130

第三篇 药品生产质量工程及系统设计

第七章 药品生产过程质量检测与控制	133
第一节 概述	133
一、药品的质量特性	133
二、药品质量管理与监控	135
第二节 药品质量标准及分析检验工作程序	136
一、药品质量分析检验的作用及分类	136
二、药品质量标准	138

三、药品检验工作程序及主要内容	140
四、药品质量分析检验常用方法	141
第三节 药品生产过程的在线质量分析与监测	148
一、过程分析在药品生产质量控制中的作用	148
二、药品生产过程在线质量分析与检测主要内容	149
三、药品生产过程在线质量控制方法与技术简介	151
第八章 药品生产监管与质量保证	155
第一节 药品生产的监管	155
一、市场经济中的行政监管作用	155
二、我国药品行政监管的实施	156
第二节 药品生产质量管理规范(GMP)	157
一、药品生产质量管理规范的基本理念	157
二、药品生产质量管理规范的基本框架	158
三、质量风险管理	159
第三节 药品生产验证	160
一、药品生产验证的引入	160
二、药品生产验证实施	161
三、药品生产验证的正确运用	162
第四节 药品技术转移	163
一、药品技术转移的概念	163
二、药品技术转移的实施	164
第九章 制药工程设计	167
第一节 概述	167
一、制药工程设计的基本概念和程序	167
二、制药工程设计的基本规范	169
第二节 工艺设计及设备选型	169
一、工艺流程设计与优化	169
二、物料与能量衡算	171
三、工艺设备选型与设计	172
第三节 车间与厂房设计	174
一、原料药生产车间设计与 GMP	174
二、制剂生产设计与 GMP	175
三、公用工程的设计	178
第四节 洁净(无菌)生产区域的气流组织	179
一、我国 GMP 对空气净化化的要求	179
二、气流组织	180
第五节 制药过程的安全设计及环境保护	181
一、制药过程的安全设计	181

二、环境保护	182
第六节 技术经济与工程概算	183
一、技术经济的指标体系	183
二、工程概算	184

第四篇 药物生产技术发展及新药研发

第十章 药物生产制造技术	187
第一节 生产单元和设备	187
一、反应器的计算模拟	187
二、微反应器及平行放大	191
三、挤出制粒	194
第二节 一次性生产技术及设备	196
一、一次性生产装置及应用简介	196
二、一次性使用技术的特点及发展前景	198
第三节 物料的循环使用和清洁工艺	198
一、物料的循环使用	198
二、清洁工艺	200
第十一章 新药研究与开发	204
第一节 概况	204
一、新药研发的现状及发展趋势	204
二、中国的药物研究	205
第二节 新药申报与审批	207
一、新药分类	207
二、新药的申报与审批	208
第三节 新药研究开发原理和过程	210
一、新药研究与开发过程	210
二、先导化合物的发现与优化	211
三、新药设计(先导化合物优化)的原理和方法	213
四、药学研究	216
五、药理毒理学研究	217
六、临床试验与生物等效性试验	218
第四节 新药研发中的新技术与新方法	218
一、计算机辅助药物分子设计	218
二、高通量药物筛选	220
三、组合化学	221
四、纳米药物技术	222
五、药物作用靶点	222
六、生物芯片技术	223

主要参考文献	225
--------------	-----

第一篇 总 论

第一章 药物与制药产业

学习目标

1. 初步掌握制药工程技术学科的构成、主要作用及基本内容,初步熟悉该专业本科人才培养的基本要求。
2. 初步熟悉国内外药物市场及制药产业的发展概况,了解其发展前景。
3. 了解药物发现 and 发展的历史,初步了解制药工业的形成及技术发展的基本历程。

第一节 药物的发现与发展

一、药物发现过程

人们对化学药物的研究最初是从植物开始的。19 世纪初,人们从植物中分离出了一些有效成分,如从鸦片中分离出了吗啡,从金鸡纳树皮分离得到了奎宁,从颠茄中分离出了阿托品,从茶叶中分离得到了咖啡因等。在 20 世纪初前后,由于植物化学和有机合成化学的发展,根据植物有效成分的构效关系合成了许多化学药物,促进了药物合成的发展。例如,根据柳树叶中的水杨苷和某些植物的挥发油中的水杨酸甲酯合成了阿司匹林(乙酰水杨酸)和水杨酸苯酯;根据毒扁豆碱合成了新斯的明;根据吗啡合成了派替啶和美沙酮。在这种情况下,许多草药的有效成分成为合成化学药物的模型,即先导化合物。根据天然化合物的构效关系,对其进行结构的简化或修饰,合成了大量自然界不存在的人工合成药物。下面将就药物发现及发展中有代表性的事例做进一步介绍。

(一) 阿司匹林镇痛类药物

1. 镇痛功能的发现 水杨酸早在公元前 1500 年就被用来治病了。1753 年,英格兰牧师 E·斯通尝试用一种极苦的柳树皮来治疗间断性神经紊乱,获得满意的效果。这种从柳树皮中提取的口味很苦的主要物质是水杨苷,即水杨酸的前体。在人体内,水杨苷会被水解成葡萄糖和水杨醇,水杨醇又会在胃部被氧化成水杨酸。

2. 副作用的解决及合成方法改进 19 世纪,拜耳药物研究所的一位化学研究员 F·霍夫曼的父亲因风湿病服用水杨酸,对胃造成了很大的伤害,最终不得不停止用药。为了找到一种对胃没有刺激的镇痛药,霍夫曼在实验室里尝试了合成许多和水杨酸相似的化合物。终于在 1897 年利用改进的合成路线合成了纯度更高的阿司匹林,发现其可以很好地发挥抗炎镇痛作用并没有产生严重的肠胃副作用。后来的研究证实,阿司匹林进入人体后被分解成真正发挥疗效的化合物水杨酸,其作为水杨酸的前药,并不会对胃带来副作用,这样就避免直接服用水杨酸而造成的肠胃副作用。

3. 作用机制的揭示 尽管阿司匹林在 20 世纪中期已获得商业上极大的成功,然而它的作用机制直到上市销售使用 70 年后,于 1971 年才被揭示。后来不久,又发现了其他的非甾体抗炎药如布洛芬、萘普生也是通过抑制环氧酶来发挥作用的。1975 年,伯格斯特朗和萨米埃尔松证实了 RCS 是前列腺素家族中的一员——前列环素 A_2 。由于发现了前列腺素与相关生物活性物质的关系,进一步揭示了非甾体抗炎的机理,万恩、伯格斯特朗和萨米埃尔松于 1982 年共同获得了诺贝尔生理学或医学奖。

如何较大规模合成阿司匹林是一项亟待解决的问题。水杨酸是阿司匹林合成的主要原料或前体。1859 年,马尔堡大学的德国化学家 H·科尔贝发展了一种合成水杨酸的方法,只需在高压下将苯酚与二氧化碳接触即可,该反应在有机化学书中被称作科尔贝反应;1853 年,蒙彼利埃大学的法国化学家 C·热拉尔第一次用水杨酸钠和乙酰氯合成了阿司匹林;1869 年,德国化学家 K·克劳特也通过相似的方法合成了阿司匹林。由于拜耳公司 F·霍夫曼的合成产品纯度更好,从而使小型染料生产商拜耳公司,在 1899 年实现了镇痛解热药阿司匹林的市场化。

4. 更好镇痛药物的发现 阿司匹林作为镇痛药物长期大剂量地使用,仍然会发生肠胃出血,从而导致死亡,神奇的药物并不完美。

(1) 布洛芬:第二次世界大战以后,由于阿司匹林在商业上的巨大成功,药物公司开始试图寻找比阿司匹林更有效而副作用更少的药物。借助于新的抗炎症检测模型的建立,1960 年,化学家尼科尔森合成了叔丁基苯乙酸,发现其对于治疗风湿性关节炎很有效,但由于一些患者出现了皮疹而停止使用。与叔丁基苯乙酸非常相似的另一个药物(异丁卡因)虽然不会引起皮疹,但少数患者长期服用被发现其对肝脏有害,又导致异丁卡因在英国停止使用。但异丁卡因在日本却很受欢迎,因为在日本人中并没有产生对肝脏的危害,可能是由于人种差异,药效发挥的作用也不同。后来发现,异丁基苯丙酸尽管不是最有效的药物,但却是安全性最高的药物。于是一家小型制药公司于 1969 年将异丁基苯丙酸投入了英国市场,取名为布洛芬(ibuprofen)。

布洛芬的成功,将一个名不见经传的小型制药公司推向国际市场,最终成为抗炎药物研究领域的佼佼者。直到今天布洛芬仍然被广泛应用,被称为名副其实的“超级阿司匹林”。

异丁卡因和布洛芬在安全性上的惊人差异可以作为药理学中一条理论的典范:一个小分子中的微小变化都可能对药效带来巨大影响。分子结构上布洛芬(异丁基苯丙酸)只比异丁卡因(异丁基苯乙酸)多了一个碳,异丁卡因分子上多了一个甲基就成为对肝脏无害的布洛芬。

(2) 萘普生:萘普生也是一种与布洛芬药理作用相同的丙酸,但是萘普生比布洛芬的药效强两倍,并且在体内的作用期比布洛芬长很多。萘普生由一家美国制药公司研制,于 1976 年进入美国市场,在销售的顶峰时期,其年销售额超过了 10 亿美元,并保持为在 20 世