



“十二五” 高职高专药学类专业规划教材

药物化学

(第2版)

YAOWU HUAXUE

主编 马英



“十二五” 高职高专药学类专业规划教材

药物化学

(第2版)

主编 马 英

河南科学技术出版社

· 郑州 ·

图书在版编目 (CIP) 数据

药物化学/马英主编. —2 版. —郑州: 河南科学技术出版社, 2012. 8
(“十二五” 高职高专药学类专业规划教材)
ISBN 978 - 7 - 5349 - 5673 - 7

I. ①药… II. ①马… III. ①药物化学 - 高等职业教育 - 教材 IV. ①R914

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2012) 第 094989 号

出版发行: 河南科学技术出版社

地址: 郑州市经五路 66 号 邮编: 450002

电话: (0371) 65788613 65788629

网址: www.hnstp.cn

策划编辑: 范广红 赵振华

责任编辑: 杨艳霞

责任校对: 马晓灿

封面设计: 张 伟

版式设计: 栾亚平

责任印制: 张 巍

印 刷: 开封智圣印务有限公司

经 销: 全国新华书店

幅面尺寸: 185 mm × 260 mm 印张: 23 字数: 532 千字

版 次: 2012 年 8 月第 2 版 2012 年 8 月第 4 次印刷

定 价: 42.00 元

如发现印、装质量问题, 影响阅读, 请与出版社联系调换。

丛书编审委员会名单

主任 林忠文
副主任 郭争鸣 王自勇 马晓健 周小雅
黄敏琪 陈根强
委员 (按姓氏笔画排序)
丁明星 马 英 马卫真 马俊义
马晓健 王 峰 王文宝 王自勇
王和平 韦 超 毛理纳 方 虹
冯务群 冯丽珍 刘永录 刘茵华
李 菁 李飞雁 李秀丽 李炳诗
杨雄志 吴长忠 张 媛 陆曙梅
陈 斌 陈电容 陈洪群 陈根强
林忠文 罗红梅 罗国海 周小雅
周焯辉 郑裕红 赵卫峰 侯飞燕
姚荣林 夏苗芬 郭向群 郭争鸣
涂 冰 黄敏琪 梁 谷 梁李广
梁春贤 喻晓雁 程春杰 谢光远
谢国武

《药物化学》（第2版）编写人员名单

主 编 马 英

副主编 周惠燕 陈海燕

编 者 （按姓氏笔画排序）

马 英 冯 川 李 达 余卫国

陈 维 陈东林 陈海燕 周惠燕

徐蓓华

编写说明

2006年教育部颁布的《关于全面提高高等职业教育教学质量的若干意见》中提出：高等职业教育应全面提高教学质量，明确培养高素质技能型人才的目标，加大课程建设与改革的力度，以就业为导向，工学结合，增强学生的职业能力。据此，河南科学技术出版社于2006年组织全国10所院校编写了“十一五”高职高专药学类专业规划教材。经过几年的使用，这套教材逐步得到大家的认可，销量逐年上升，特别是《天然药物学》被评为普通高等教育“十一五”国家级规划教材。

为了适应构建现代职业教育体系和国家进一步深化医药卫生体制改革的需要，及时反映最新版《中华人民共和国药典》的内容，汇集最新教改成果，提高教材质量，突出教材特色，河南科学技术出版社于2011年4月组织全国12个省（区）30所高职高专院校药学类专业、中药专业的教学骨干、领导齐聚郑州，商讨“十二五”高职高专药学类专业、中药专业系列教材的出版事宜。“十一五”期间，各参编院校在提高教学质量、深化教学改革方面均做了大量的工作。如广西卫生职业技术学院与当地医药企业开展校企合作，进行订单培养、合作开发课程、优化人才培养方案等教学改革，学院招生人数与就业率节节攀升，其药学专业得到中央财政支持高等职业学校专业建设项目立项支持。浙江医药高等专科学校大力推进教学改革，中药专业以项目驱动方式组织教学，获得省、市两级重点教材建设项目的支持。我们依托这些优秀的教学资源 and 经验丰富的作者队伍，力争此版教材在前一版的基础上，质量更高、特色更强。

相对于“十一五”高职高专药学类专业规划教材，本次编写的教材具有以下特点：

第一，体现教学改革成果。为了更好地服务于培养医药行业高素质技能型人才的目标，将《基础化学》分成了《有机化学》和《无机化学》。并根据职业岗位群的需要和毕业学生的反馈，增加了《中医药基础》、《GMP、GSP、GAP实用技术》和《中医药膳实用技术》等专业特色教材，以拓宽学生的视野，增强其职业能力。

第二，体现工学结合。“十二五”高职高专中药专业项目化规划教材，以项目化教学方式，按照理论实践一体化形式组织内容，边学边实践，以适应中药专业现代化、标准化、规范化的要求。《天然药物化学》教材改为理论实践一体化教材《天然药物化学实用技术》，保留了《天然药物提取分离技术》这本特色教材。药学类专业、中药专业两个系列的教材我们都吸纳了行业一线的专家，要求每门专业课教材至少有一位医药企业的专家参与，结合行业标准制定课程目标与编写大纲，突出对学生职业能力的培养。

第三，体现创新性。为了拓宽学生的知识面，密切课程之间的联系，加强对学生的

创新思维、创新能力和自主学习能力的培养，各本教材都有选择地编写了学习要点、知识链接、知识拓展、实例分析、学习小结、思考题等内容，供学生自学。其中，知识链接侧重纵向知识联系，重在介绍与药学类专业、中药专业相关的知识对接、使用，提高学生的学习兴趣和兴趣；知识拓展则侧重横向知识联系。

本版教材的编写人员为一直在教学一线工作的教师，有丰富的教学经验和教材编写经验，他们把在长期教学和编写教材中积累的宝贵经验运用到这次编写过程的始终，并将其发扬光大，使本系列教材风格更加突出，特色更加鲜明。

为了确保教材的编写质量，编写人员在浙江、内蒙古、云南、贵州、河南等省（区）召开了编写会、定稿会，这与各个参编院校领导的大力支持是分不开的。为使教材编出特色、提高质量，各位主编、副主编和编委加班加点，几易其稿，付出了大量的心血。河南科学技术出版社的领导对本套教材也极为重视，在此一并表示衷心的感谢！

由于编者水平有限，如有纰漏与瑕疵之处，还望广大师生批评指正，以便及时修改。

林忠文

2012年1月

前 言

本教材是按照“‘十二五’高职高专药学类专业规划教材”编委会议精神对《药物化学》(马英主编)进行修订的新版本。

《药物化学》自2007年7月出版以来,得到了广大师生和药物化学同行的肯定。第2版是在第1版的基础上,根据近年来国内外药物化学新进展和学生的实际需要,对内容进行修订、增补而成的。第2版在编写过程中,除了坚持三基(基本理论、基本知识、基本技能)、五性(思想性、科学性、先进性、启发性、适用性)外,注重在遵循药物化学的基本规律和系统性的基础上,突出培养面向医药行业的、具有可持续发展与良好适应能力的高素质技能型专门人才,按照实用为先的原则进行编写。

与第1版教材相比,第2版教材删除了相对比较陈旧的内容,参考执业药师考试大纲变化,增加了一些新的药物,尤其是近年来临床应用较多的新药。

本教材分为理论和实验两大部分,理论部分共十六章,实验部分有六个实验。除第一、第二、第十六章为通论外,其余各章均为各论。每章章首有内容提要,章末编有思考题。各论基本上按药理作用或药效分章节,以化学结构分类,重点叙述了化学药物的结构、性质、稳定性及构效关系等,简单叙述了各大类药物的发展过程、最新进展及体内代谢,对药物的合成也作了适当的介绍。在编写时,除代表性药物外,其他药物列表介绍。实验部分集中放在书后,内容少而精,各专业可根据不同需要选用其中内容。

本教材由浙江医药高等专科学校副教授马英担任主编,参加编写的还有广西卫生管理干部学院陈海燕,湖南中医药高等专科学校李达,遵义医药高等专科学校陈东林,沈阳药科大学高等职业技术学院冯川,浙江医药高等专科学校周惠燕、徐蓓华、余卫国、陈维。

在本教材的编写过程中,得到各编者学校及有关专家的大力支持,在此一并致以衷心感谢。

限于编者的水平,书中欠妥及疏漏之处,恳请使用本教材的广大师生不吝批评指正。

编者

2012年3月

目 录

绪论	(1)		
一、药物化学研究的内容	(1)		
二、药物化学的发展	(2)		
三、药物的质量	(3)		
四、药物名称	(3)		
第一章 药物的化学结构与药效的关系	(5)	第一节 官能团化反应	(20)
第一节 药物的基本结构和结构改变	(5)	一、氧化反应	(20)
一、生物电子等排原理	(6)	二、还原反应	(24)
二、前药原理	(7)	三、水解反应	(25)
第二节 药物理化性质和药效的关系	(9)	第二节 结合反应	(26)
一、药物的溶解度和分配系数对药效的影响	(9)	一、葡萄糖醛酸结合	(26)
二、药物的解离度对药效的影响	(10)	二、硫酸结合	(26)
第三节 药物的电子云密度分布和药效的关系	(11)	三、乙酰化结合	(27)
第四节 药物立体结构和药效的关系	(12)	四、甲基化结合	(27)
一、光学异构	(12)	五、氨基酸结合	(28)
二、几何异构	(14)	六、谷胱甘肽结合	(28)
三、构象异构	(15)	第三章 麻醉药	(29)
第五节 键合特性和药效的关系	(16)	第一节 全身麻醉药	(29)
一、氢键	(17)	一、吸入麻醉药	(29)
二、电荷转移复合物	(17)	二、静脉麻醉药	(32)
三、金属离子配合物	(17)	第二节 局部麻醉药	(35)
第二章 药物代谢	(19)	一、苯甲酸酯类	(36)
		二、酰胺类	(37)
		三、其他类	(38)
		四、局麻药构效关系	(39)
		第四章 镇静催眠药、抗癫痫药和抗精神失常药	(46)
		第一节 镇静催眠药	(46)
		一、苯二氮草类	(47)
		二、巴比妥类	(51)

三、其他类镇静催眠药·····	(56)	第一节 拟胆碱药·····	(120)
第二节 抗癫痫药·····	(57)	一、胆碱受体激动剂·····	(121)
第三节 抗精神失常药·····	(61)	二、乙酰胆碱酯酶抑制剂·····	(122)
一、抗精神病药·····	(61)	第二节 抗胆碱药·····	(125)
二、抗焦虑药·····	(68)	一、M胆碱受体阻断剂·····	(125)
三、抗抑郁药·····	(69)	二、N胆碱受体阻断剂·····	(131)
四、抗躁狂药·····	(71)	第九章 抗过敏药和抗溃疡药 ·····	(134)
第五章 解热镇痛药和非甾体		第一节 抗过敏药·····	(134)
抗炎药 ·····	(73)	一、氨基醚类·····	(135)
第一节 解热镇痛药·····	(74)	二、乙二胺类·····	(136)
一、水杨酸类·····	(74)	三、丙胺类·····	(136)
二、乙酰苯胺类·····	(77)	四、哌嗪类·····	(137)
三、吡唑酮类·····	(78)	五、三环类·····	(137)
第二节 非甾体抗炎药·····	(80)	六、哌啶类·····	(138)
一、吲哚乙酸类·····	(80)	七、经典组胺 H ₁ 受体拮抗剂	
二、3, 5-吡唑烷二酮类·····	(82)	的构效关系·····	(139)
三、邻氨基苯甲酸类·····	(84)	八、过敏介质与抗过敏药·····	(140)
四、芳基烷酸类·····	(85)	第二节 抗消化道溃疡药·····	(145)
五、1, 2-苯并噻嗪类·····	(89)	一、组胺 H ₂ 受体拮抗剂·····	(145)
第六章 镇痛药和镇咳祛痰药 ·····	(92)	二、质子泵抑制剂·····	(149)
第一节 镇痛药·····	(92)	第十章 心血管系统药物 ·····	(152)
一、吗啡及其衍生物·····	(92)	第一节 调血脂药·····	(152)
二、合成镇痛药·····	(96)	一、苯氧乙酸类·····	(153)
三、内源性镇痛物质·····	(102)	二、烟酸类·····	(156)
四、镇痛药构效关系·····	(102)	三、羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶	
第二节 镇咳祛痰药·····	(104)	抑制剂·····	(157)
一、镇咳药·····	(104)	四、其他类·····	(159)
二、祛痰药·····	(107)	第二节 抗心绞痛药·····	(160)
第七章 拟肾上腺素药 ·····	(109)	一、硝酸酯及亚硝酸酯类·····	(160)
一、拟肾上腺素药物的		二、钙拮抗剂·····	(162)
发展·····	(109)	三、β-受体阻断剂·····	(168)
二、拟肾上腺素药物的一般		第三节 抗高血压药·····	(168)
代谢过程·····	(111)	一、作用于交感神经系统的	
三、拟肾上腺素药物的构效		药物·····	(169)
关系·····	(112)	二、神经节阻断药·····	(169)
四、具有儿茶酚结构的拟肾上		三、血管扩张药物·····	(170)
腺素药物的理化通性·····	(113)	四、作用于肾素-血管紧张素-醛	
第八章 拟胆碱药和抗胆碱药 ·····	(120)	甾酮系统的药物·····	(171)

五、肾上腺素受体阻断剂 … (174)	一、 β -内酰胺类抗生素的 结构、分类 …… (215)
六、钙拮抗剂 …… (176)	二、 β -内酰胺类抗生素的 发展 …… (216)
七、利尿药及其他药物 …… (176)	三、稳定性 …… (231)
第四节 抗心律失常药 …… (176)	四、作用机制 …… (231)
一、钠通道阻断剂 …… (177)	五、过敏反应 …… (231)
二、 β -受体阻断剂 …… (179)	第二节 四环素类抗生素 …… (232)
三、钾通道阻断剂 …… (182)	一、四环素类抗生素的发展 … (232)
四、钙通道阻断剂 …… (183)	二、四环素类抗生素的 稳定性 …… (233)
第五节 强心药 …… (183)	三、四环素类抗生素的作用 机制和耐药性 …… (234)
一、强心苷 …… (183)	第三节 氨基糖苷类抗生素 … (236)
二、磷酸二酯酶抑制剂 …… (184)	一、氨基糖苷类抗生素的 发展 …… (236)
第十一章 抗菌药和抗病毒药 … (185)	二、氨基糖苷类抗生素的结构 和特性 …… (236)
第一节 喹诺酮类抗菌药 …… (185)	第四节 大环内酯类抗生素 … (239)
一、喹诺酮类药物分类 …… (185)	一、大环内酯类抗生素的 发展 …… (239)
二、发展概况 …… (187)	二、大环内酯类抗生素的 稳定性 …… (241)
三、构效关系 …… (189)	第五节 氨基糖苷类抗生素 …… (244)
第二节 磺胺类药物及抗菌增 效剂 …… (192)	第六节 其他类抗生素 …… (247)
一、磺胺类药物的发展 …… (192)	一、多肽类抗生素 …… (247)
二、磺胺类药物的构效 关系 …… (194)	二、林可霉素和克林霉素 … (247)
三、磺胺类药物的作用 机制 …… (194)	三、磷霉素 …… (248)
四、抗菌增效剂 …… (195)	四、大观霉素 …… (248)
第三节 抗结核病药 …… (197)	第十三章 抗肿瘤药 …… (250)
一、抗生素类抗结核病药 … (197)	第一节 烷化剂 …… (250)
二、合成类抗结核病药 …… (199)	一、氮芥类 …… (251)
第四节 抗真菌药 …… (202)	二、乙烯亚胺 (乙撑亚胺) 类 …… (254)
一、抗生素类抗真菌药 …… (203)	三、亚硝基脲类 …… (255)
二、合成类抗真菌药 …… (203)	四、磺酸酯及多元醇类 …… (256)
三、其他抗真菌药 …… (206)	第二节 抗代谢药 …… (257)
第五节 抗病毒药 …… (207)	一、嘧啶拮抗物 …… (257)
一、核苷类抗病毒药物 …… (207)	
二、非核苷类抗病毒药物 … (211)	
三、蛋白酶抑制剂 …… (211)	
四、其他抗病毒药物 …… (212)	
第十二章 抗生素 …… (215)	
第一节 β -内酰胺类抗生素 …… …… (215)	

二、嘌呤拮抗物	(259)	二、维生素 B ₂	(307)
三、叶酸拮抗物	(261)	三、维生素 B ₆	(308)
第三节 其他抗肿瘤药物	(263)	四、维生素 C	(309)
一、生物碱类	(263)	第十六章 新药研究与开发	(313)
二、抗肿瘤抗生素	(265)	第一节 先导化合物的发现	(314)
三、铂配合物	(267)	一、天然生物活性成分	(314)
四、杂类化合物	(268)	二、改进现有药物	(316)
第十四章 甾类药物	(270)	三、药理模型筛选与偶然 发现	(318)
第一节 概述	(270)	第二节 先导化合物优化的一般 方法	(320)
第二节 甾类药物	(272)	一、药动学方面的优化	(320)
一、雌激素类药物	(272)	二、药效学方面的优化	(324)
二、雄激素类药物	(276)	第三节 全新药物设计简介	(329)
三、孕激素类药物和抗孕 激素	(281)	一、全新药物设计的建立	(329)
四、肾上腺皮质激素类 药物	(287)	二、全新药物设计的概念与 意义	(330)
第三节 甾类药物的一般性质	(293)	三、全新药物设计的应用	(330)
一、羰基反应	(293)	实验指导	(332)
二、皮质激素 17 位 α -醇酮基 的还原性	(294)	药物化学实验的安全知识	(332)
三、甲基酮和亚甲基酮的 反应	(294)	一、火灾、爆炸、中毒、触电 等事故的预防	(332)
四、羟基反应	(294)	二、事故的处理和急救	(333)
五、与强酸(或强酸加溶剂) 的呈色反应	(294)	实验记录及实验报告	(334)
六、炔基反应	(295)	一、实验记录	(334)
七、薄层色谱法	(295)	二、实验报告格式	(334)
八、红外分光光度法	(295)	三、实验产率的计算	(335)
九、紫外分光光度法	(295)	合成药物质量控制的基本方法	(335)
第十五章 维生素	(297)	一、熔点	(335)
第一节 脂溶性维生素	(297)	二、薄层色谱法	(336)
一、维生素 A	(298)	三、红外吸收光谱法	(339)
二、维生素 D	(299)	四、紫外-可见吸收 光谱法	(340)
三、维生素 E	(301)	实验一 盐酸普鲁卡因的合成	(340)
四、维生素 K	(303)	一、实验目的	(340)
第二节 水溶性维生素	(305)	二、实验原理	(341)
一、维生素 B ₁	(305)	三、主要试药及仪器	(341)
		四、操作步骤	(342)

五、注释	(342)	三、主要试药及仪器	(348)
实验二 苯巴比妥的制备	(343)	四、操作步骤	(348)
一、实验目的	(343)	五、注释	(348)
二、实验原理	(343)	实验五 磺胺醋酰钠的合成 ...	(349)
三、主要试药及仪器	(344)	一、实验目的	(349)
四、操作步骤	(344)	二、实验原理	(349)
五、注释	(345)	三、主要试药及仪器	(349)
实验三 苯妥英钠的合成	(345)	四、操作步骤	(349)
一、实验目的	(345)	五、注释	(350)
二、实验原理	(345)	实验六 盐酸苯海索的制备 ...	(351)
三、主要试药及仪器	(346)	一、实验目的	(351)
四、操作步骤	(346)	二、实验原理	(351)
五、注释	(347)	三、主要试药及仪器	(351)
实验四 乙酰水杨酸的合成 ...	(347)	四、操作步骤	(352)
一、实验目的	(347)	五、注释	(353)
二、实验原理	(347)	参考文献	(354)

绪 论

一、药物化学研究的内容

药物是指具有预防、缓解、诊断、治疗疾病及调节机体生理功能的物质。根据药物的来源不同，可分为天然药物、化学合成药物和生物药物。将从天然矿物、动物、植物中提取的有效成分及经化学合成或生物合成制得的，既具有药物的功效，同时又有确切化学组成的药物称为化学药物。目前临床应用的大多数药物是化学药物。化学药物一般分为无机药物、有机合成药物、从动植物或微生物代谢产物中提取的天然药物三大类。

药物化学是研究化学药物的化学结构、制备方法、理化性质、构效关系、生物效应、体内代谢、调剂及储存过程的化学变化，以及寻找新药的途径和方法等的一门综合性学科。药物化学以化学学科为基础，与生物化学、药理学、药代动力学和计算机等学科相互渗透，与药剂学、药物分析、化学制药工艺学、药物设计学乃至药事管理学密不可分，是药学领域中一门重要的应用性学科。

最早的药物化学始于天然药物有效成分的提纯和结构研究，逐步发展到药物合成、构效关系及结构改造等诸多领域，当时的英文名称为 Pharmaceutical Chemistry。随着合成药物的不断涌现，研究内容的不断丰富，形成了天然药物化学、合成药物化学及药物分析等学科。而随着化学结构与药效关系研究的深化，药物在体内的作用机制、代谢与转运过程等临床药学研究的发展，药物化学覆盖的内容不断丰富，于是近代药物化学的英文名称改为 Medicinal Chemistry。

药物化学的主要任务：

1. 为有效、合理地应用现有化学药物提供理论基础 通过研究化学药物的结构与理化性质、化学稳定性，为药物剂型的选择与制备、药物的分析检验、药物的储存和保管提供服务。通过研究药物理化性质、体内代谢、生物效应及构效关系，为药物间的配伍禁忌及合理用药、化学药物的结构修饰等提供必要的基本理论和技能。

2. 为生产化学药物提供先进、经济的方法和工艺 通过研究优化化学药物合成路线和工艺条件，寻找和发展新原料、新试剂、新技术、新工艺和新方法，降低药品生产成本。不断提高药品的产量和质量也是药物化学的重要任务之一。

3. 为寻找和发现新药，不断探索出新药研究和开发的途径和方法 通过综合运用化学、生物学等学科的理论知识和实践技能，研究化学药物的结构和生物活性间的关

系,探索药物设计的途径和方法。创制疗效好、毒副作用低的新药是当今药物化学的一项重要任务。

高职高专药学专业的药物化学课程,着重于药物化学三个任务的第一方面,即为有效、合理地应用现有化学药物提供理论基础。在学习中,同学们应始终以药物的化学结构为核心,从结构出发,联系药物的命名、制备、性质、稳定性、构效关系、体内代谢及结构修饰等,理解和掌握化学药物在体内和体外产生的一系列化学变化,药物制备及储存过程中可能发生的变质反应及预防措施,熟悉药物的构效关系及化学结构修饰方法,了解新药的研制和开发的相关知识。

二、药物化学的发展

药物化学是从药理学中分化独立出来的一门应用学科,而对药物的化学研究则和化学、生物学、医学的研究发展密不可分。最早的药物化学是从动、植物中提取有效成分。从19世纪初开始,人们已能从阿片中分离提取出具有良好镇痛作用的吗啡,从金鸡纳树皮中分离提取出具有抗疟疾作用的奎宁,从莨菪中分离提取出具有解痉作用的阿托品,以及从古柯树叶中分离提取出可卡因等。同时,随着化学工业的发展,人们开始从一些化学工业产品中筛选具有药理作用的药物,如用氯仿和乙醚作为全身麻醉药,水合氯醛作为镇静催眠药应用于临床。由于有机合成化学为生物学实验提供了化合物基础的来源,人们在总结化合物生物活性的基础上提出了药效团的概念,指导人们开始有目的地进行药物合成研究。19世纪末期发现了苯佐卡因、阿司匹林等一些化学合成药物。药物化学才真正地逐渐形成一门重要的独立的学科。

20世纪30年代磺胺类药物的发现,使细菌感染性疾病的治疗有了有效的药物,并创立了药物的抗代谢作用机制学说。40年代青霉素用于临床,开辟了从微生物代谢产物中寻找抗生素的途径,使药物化学的理论和实践都有了飞速的发展。50~60年代抗精神失常药和甾体激素类药物,60~70年代 β -受体阻断剂类心血管药物和 H_2 受体拮抗剂类抗溃疡药物,70~80年代钙拮抗剂和前列腺素类药物、免疫调节剂及各种酶抑制剂等取得了突破性进展。

近年来,采用基因工程和其他生物技术及用计算机辅助药物设计等技术发展新药都取得了很大进展。定量构效关系的研究,使药物化学的发展由盲目地设计到有目的地合理设计,从而极大地丰富了药物化学的理论。20世纪90年代初发展的组合化学方法,使快速、大量合成化合物成为可能;高通量和自动化筛选技术的应用,缩短了药物发现的时间,大大加快了新药寻找过程,生物技术特别是分子克隆技术、人类基因组学、蛋白组学的形成和发展,为新药的研究提供了更多的靶点。

药物化学的发展是和新药的研究开发分不开的,但是在其发展过程中又是和药物的应用相关联的。在临床应用中发现问题的,提出新的研究思路和要求。研究药物的理化性质和充分应用好现有的药物,已成为药物化学研究的一个重要组成部分。

三、药物的质量

药物质量的优劣直接影响人们的身体健康和生命安全，因此，作为一名药学工作者，必须牢固树立质量第一的观念，一定要严格把好药品质量关。

药物质量评定主要从以下两个方面加以考虑：

1. 药物自身的疗效和毒副作用，即安全性和有效性 质量好的药物应该是在治疗剂量内，疗效好、副作用和毒性小的药物。

2. 药物的纯度 药物纯度是指药物的纯杂程度，是药物中杂质限度的一种体现，具体表现在药物的性状、物理常数、有效成分的含量等。药物的杂质是指在生产、储存过程中引进或产生的药物以外的其他化学物质。杂质的存在不仅影响药物的纯度，同时还会带来非治疗活性的副作用，必须加以控制，通常要规定药物的杂质限度。药物中杂质限度制订的依据是在不影响疗效、不产生毒副作用的原则下，允许某些杂质有一定量的存在。

药物杂质主要来自两个方面：

(1) 制备时引入：在制备过程中，由于原料不纯、反应不完全、副反应及所用反应容器等都可产生或引入杂质。

(2) 储存时产生：药物在储存时，由于受到外界条件，如空气、日光、温度、湿度、金属离子等影响，发生氧化、水解、还原、聚合等化学反应从而产生杂质。

对于药物杂质限度的规定、药物纯度的规格，必须按照药品标准执行。我国的药品标准有《中华人民共和国药典》和《国家药品标准》。药品在未列入国家药典之前，按国家药品标准执行。

四、药物名称

药物的名称包括药物的通用名、化学名和商品名。

药物的通用名多采用世界卫生组织推荐使用的国际非专利药品名称（INN），它是新药开发者在新药申请时向政府主管部门提出的正式名称，不受专利和行政保护，也是文献、资料、教材及药品说明书中标明的有效成分的名称。我国药典委员会制定并编写了《中国药品通用名称（CADN）》，基本是以 INN 为命名依据，INN 没有的采用其他合适的英文名称为命名依据。CADN 是中国药品命名的依据，也是药典收录的药物名称。CADN 的中文名尽量与英文名相对应，采取音译、意译或音、意合译，以音译为主。在命名时还应避免采用可能给患者以暗示的有关药理学、解剖学、生理学、病理学或治疗学的药品名称，也不得用代号命名。CADN 对 INN 常采用的词干规定了其对应的中文译名。例如 Ami - triptyline，其中 triptyline 的中文译名为“替林”，整个药名音译为阿米替林。

药物的化学名是根据其化学结构式来进行命名的，化学名称可参考国际纯粹与应用化学联合会（IUPAC）公布的有机化合物命名原则及中国化学会公布的《有机化学物

质的系统命名原则（1960年）》进行命名。由于美国《化学文摘》（CA）的应用范围日益扩大，已被广泛接受，也成为药品化学命名的基本依据之一。

药物的商品名是制药企业为开发产品和占领市场而使用的名称，以此来保护自己并努力提高产品的声誉。商品名可以得到注册保护，但取用时不能暗示药物的疗效。

药物的三种名称在药品的说明书中都会同时出现，但在药品的标准和国家药典中只有药物的通用名和化学名。

（马 英）