

中等专业学校教材

药物化学

刘绍雄 主编 曹观坤 主审

中国医药科技出版社

中等专业学校教材

药 物 化 学

主 编	刘 绍 雄
主 审	曹 观 坤
参编人员	李 翠 仙
	何 敬 文
	刘 振 梅

中国医药科技出版社

内 容 提 要

本书是国家医药管理局组织编写的中等专业学校教材。它针对我国现有医疗条件和制药水平，并适当参考国外近年来的科研成就选择常用药物，重点介绍其合成路线、理化性质、测定原理、鉴别方法和药理作用等，并通过复习题，使学生消化吸收所学到的知识。为了培养学生的实际操作能力，书中系统地编入了实验内容，附有“药物中英文名称对照表”，以方便学生查阅资料。

本书内容翔实，富有中专特色，适用于中等医药学校各类专业还可作为职工培训教材之用。

药 物 化 学

刘绍雄 主编

*

中国医药科技出版社 出版

(北京西直门外北礼士路甲38号)

北京市卫顺印刷厂 排版

北京市卫顺印刷厂 印刷

新华书店北京发行所 发行

*

开本787×1092mm¹/₁₆ 印张 29½

字数 681千字 印数1—8100

1991年6月第1版 1991年6月第1次印刷

ISBN 7-5067-0267-3/G·0007

定价: 7.20元

编写说明

本书为医药中等专业学校教材，由国家医药管理局组织编写，供化学制药工艺、药物制剂工艺和药物分析技术等专业使用。也可作为相关专业学生用书及医药职工培训教材。

本书包括正文19章和9个实验，除第一、十八、十九章为通论外，其余各章皆为各论。每章开始有概述，章末编有复习题。各论基本上按药理作用或药效分章节，以化学结构分类，每类药物选有两个以上的典型药，每个典型药包括化学结构式、药物命名、别名、来源或合成路线、理化性质、测定原理、作用与用途等内容。选择的合成路线皆为国内通用，典型药物以常用药为主，其它药列表介绍。实验集中在书后，内容少而精，既照顾到不同专业的要求，又能满足化学单元反应的理论教学和单元操作的技能培训。书末附录编有“常用无机药物”及“药物中英文名称对照表”，以方便学生课外查阅有关资料。

本书新颖实用，简明扼要，富有中专特色。使用时，各专业应根据不同的教学大纲、教学时间的要求，选取有关章节和实验。

广州医药中等专业学校高级讲师刘绍雄任本书主编，参加编写的还有北京医药器械学校高级讲师李翠仙、山东医药工业学校讲师何敬文和天津制药学校讲师刘振梅。初稿完成后，由中国药科大学曹观坤副教授主审，并在北京召开了审稿会议。本书的编写工作自始至终得到有关领导及编者所在学校的大力支持和帮助，许多生产、科研和教学单位提供了宝贵的资料，并对编写大纲和初稿提出了中肯的修改意见，特在此表示感谢！

由于编者水平有限，编写时间紧迫，本书错漏之处在所难免，恳请读者批评指正。

编者

1990年8月

目 录

第一章 绪论	1
前言	1
一、药物化学的研究内容和任务	1
二、药物化学的发展与我国药物化学的发展和成就	1
三、药物的质量和标准	4
第二章 麻醉用药	6
概述	6
第一节 全身麻醉药	6
一、吸入全麻药	7
麻醉乙醚(7) 氟烷(8)	
二、静脉全麻药	9
盐酸氯胺酮(9) 羟丁酸钠(10)	
三、药物的油水分配系数与全麻作用	11
第二节 局部麻醉药	11
一、酯类局麻药	12
盐酸普鲁卡因 (12)	
二、酰胺类局麻药	15
盐酸利多卡因(15) 盐酸卡波卡因(16)	
三、化学结构与药效的关系	17
第三节 肌肉松弛药	19
氯化琥珀胆碱(20) 肌安松(21) 舒筋灵 (22)	
复习题	23
第三章 镇静催眠药、抗癫痫药及安定药	25
概述	25
第一节 镇静催眠药	25
一、巴比妥类药物	25
(一) 巴比妥类药物的结构和分类	25
(二) 巴比妥类药物的通性	26
(三) 巴比妥类药物的一般合成方法	27
(四) 典型药物	28
苯巴比妥(28) 异戊巴比妥 (29) 司可巴比妥钠(30)	
(五) 构效关系	31
二、非巴比妥类药物	32
格鲁米特(32) 甲丙氨酯(34)	
第二节 抗癫痫药	36
苯妥英钠(37) 乙琥胺(39) 丙戊酸钠 (41)	

第三节 安定药	42
一、吩噻嗪类	42
盐酸氯丙嗪(43) 奋乃静(44)	
二、苯并二氮杂革类	45
安定 (46)	
三、丁酰苯类	47
盐酸三氟哌丁苯 (48)	
复习题	49
第四章 解热镇痛药与非甾体消炎药	51
概述	51
第一节 解热镇痛药	51
一、水杨酸类	52
乙酰水杨酸(52) 氟苯水杨酸(54)	
二、乙酰苯胺类	56
对乙酰氨基苯酚(57) 扑炎痛(59)	
三、吡唑酮类	59
安乃近 (60)	
第二节 非甾体消炎药	63
一、吡唑烷酮及吡唑衍生物类	63
羟基保泰松(63) 炎痛净(65)	
二、吲哚乙酸类	67
吲哚美辛(67) 痛灭定(69)	
三、邻氨基苯甲酸衍生物	70
甲灭酸(71) 双氯灭痛(72)	
四、芳基烷酸类	74
布洛芬(74) 联苯乙酸(75) 萘普生(76) 萘普酮(78)	
五、苯并噻嗪类	80
炎痛喜康 (80)	
复习题	81
第五章 镇痛药及镇咳祛痰药	83
概述	83
第一节 镇痛药	84
一、异喹啉类	85
盐酸吗啡 (85)	
二、苯基哌啶类	86
盐酸哌替啶 (86)	
三、氨基酮类	88
盐酸美沙酮 (88)	
四、苯吗喃类	89
镇痛新 (89)	

第二节 镇咳祛痰药	91
一、镇咳药	91
(一) 中枢性镇咳药	91
磷酸可待因(91) 枸橼酸维静宁(92) 盐酸氯哌啶 (93)	
(二) 末梢镇咳药	94
敌退咳 (94)	
二、祛痰药	93
愈创木酚甘油醚(96) 杜鹃素(97) 盐酸溴己新 (98)	
附表 常用平喘药	99
复习题	100
第六章 中枢兴奋药及利尿药	102
概述	102
第一节 中枢兴奋药	102
一、黄嘌呤类	102
咖啡因 (103)	
二、其它类	105
尼可刹米(105) 克脑迷(106) 盐酸氯酯醒 (107)	
第二节 利尿药	109
氢氯噻嗪(109) 呋喃苯胺酸(111) 利尿酸(112) 螺内酯(113)	
复习题	115
第七章 作用于传出神经系统的药物	117
概述	117
第一节 拟胆碱药	117
一、直接作用于胆碱受体的拟胆碱药	117
硝酸匹鲁卡品 (117)	
二、抗胆碱酯酶药	118
(一) 可逆性抗胆碱酯酶药	118
毒扁豆碱(118) 水杨酸毒扁豆碱(119) 溴化新斯的明 (119)	
(二) 不可逆性抗胆碱酯酶药及胆碱酯酶复活剂	120
第二节 抗胆碱药	121
一、解痉药	121
溴化丙胺太林 (121)	
二、中枢性抗胆碱药	123
盐酸苯海索(123) 左旋多巴(123)	
第三节 拟肾上腺素药	124
盐酸异丙基肾上腺素(125) 盐酸苯肾上腺素(125)	
第四节 抗肾上腺素药	127
酚苄明(127) 甲磺酸酚妥拉明(128)	
复习题	128
第八章 抗组织胺药	129

概述	129
第一节 组胺H ₁ 受体拮抗剂	129
盐酸苯海拉明(131) 扑尔敏(134) 盐酸异丙嗪(135) 盐酸赛庚啶(136)	
第二节 组织胺H ₂ 受体拮抗剂	139
西咪替丁(141) 盐酸雷尼替丁(142)	
复习题	143
第九章 心血管系统药物	144
概述	144
第一节 降血脂药	144
烟酸肌醇酯(145) 氯贝丁酯(146)	
第二节 抗心绞痛药	147
硝酸异山梨酯(149) 双嘧达莫(150)	
第三节 抗高血压药	151
利血平(154) 盐酸可乐定(155) 地巴唑(156) 卡托普利(157)	
第四节 抗心律失常药	158
盐酸普萘洛尔(160) 溴苄胺(161) 盐酸普鲁卡因胺 (162)	
第五节 止血药	165
酚磺乙胺(165) 氨甲苯酸(166) 氨甲环酸 (167)	
复习题	168
第十章 抗寄生虫病药	170
概述	170
第一节 驱肠虫药	170
枸橼酸哌嗪(171) 盐酸左旋咪唑(172) 甲苯咪唑 (173)	
第二节 抗血吸虫及血丝虫病药	174
呋喃丙胺(174) 枸橼酸乙胺嗪(175) 吡喹酮 (177)	
第三节 抗疟药	179
磷酸氯喹(180) 磷酸伯氨喹(182) 乙胺嘧啶(183) 青蒿素(183)	
复习题	184
第十一章 抗菌药及抗病毒药	186
第一节 抗结核病及抗麻疯病药	186
一、抗结核病药	186
对氨基水杨酸钠(186) 异烟肼(188) 盐酸乙胺丁醇 (190)	
二、抗麻疯病药	191
氨苯砜 (192)	
第二节 硝基呋喃类抗菌药	192
呋喃唑酮(193) 呋喃妥因(194)	
第三节 吡酮酸类抗菌药	195
萘啶酸(197) 吡哌酸(198) 诺氟沙星(199) 依诺沙星(200)	
第四节 抗真菌药	201
克霉唑(202) 益康唑(204)	

第五节 抗病毒药	205
盐酸金刚烷胺(205) 碘苷(206) 盐酸吗啉胍(207) 酞丁胺(208)	
第六节 消毒防腐药	209
苯扎溴铵(210) 度米芬(211) 醋酸洗必泰 (212)	
复习题	213
第十二章 磺胺类药物	215
概述	215
第一节 磺胺类药物的结构、命名和分类	217
第二节 磺胺类药物的理化性质、制菌机理和构效关系	218
一、磺胺类药物的理化性质	218
二、磺胺类药物的制菌机理和构效关系	222
第三节 常用磺胺类药	224
磺胺醋酸钠(224) 磺胺嘧啶(225) 磺胺嘧啶银(226) 磺胺甲噁唑(228)	
第四节 抗菌增效剂	230
甲氧苄氨嘧啶 (230)	
第五节 磺酰脲类降血糖药	233
甲苯磺丁脲(234) 格列本脲(235) 苯乙双胍 (236)	
复习题	237
第十三章 抗生素	238
概述	238
一、抗生素的分类及抗菌谱	238
二、抗生素的生物合成	238
第一节 β -内酰胺类抗生素	239
一、青霉素及半合成青霉素	240
(一) 青霉素	240
青霉素钠 (241)	
(二) 半合成青霉素	243
耐酸青霉素(243) 耐酶青霉素(243) 广谱青霉素(244) 苯唑青霉素钠(246)	
氨苄青霉素钠(247)	
二、头孢菌素类	247
头孢噻吩钠(250) 头孢氨苄(251)	
第二节 氯霉素及其衍生物	252
氯霉素 (252)	
第三节 四环素类抗生素	254
盐酸土霉素(256) 盐酸四环素(257) 盐酸脱氧土霉素 (257)	
第四节 氨基糖甙类抗生素	258
硫酸链霉素(259) 硫酸卡那霉素(260) 硫酸庆大霉素 (261)	
第五节 大环内酯类抗生素	262
红霉素(262) 麦迪霉素(263) 乙酰螺旋霉素 (264)	
第六节 其它类抗生素	265

一、利福霉素类抗生素	265
利福平 (266)	
二、多肽、多烯类及其它抗生素	267
复习题	270
第十四章 抗肿瘤药物	271
概述	271
第一节 烷化剂	271
一、氮芥类	272
(一) 脂肪氮芥	272
(二) 芳香氮芥	273
(三) 氨基酸氮芥	274
消瘤芥 (275)	
(四) 杂环氮芥	276
环磷酰胺 (276)	
二、乙撑亚胺类	278
噻替派 (278)	
三、磺酸酯及卤代多元醇类	279
白消安 (279)	
四、亚硝基脲类	280
环己亚硝脲 (280)	
五、生物还原烷化剂	281
喜树碱(281) 丝裂霉素C (282)	
第二节 抗代谢物	283
一、嘧啶拮抗物	284
(一) 尿嘧啶衍生物	284
氟尿嘧啶 (284)	
(二) 胞嘧啶衍生物	285
盐酸阿糖胞苷 (286)	
二、嘌呤拮抗物	287
巯嘌呤(287) 磺巯嘌呤钠(289)	
三、叶酸拮抗物	290
甲氨蝶呤 (290)	
第三节 其它抗肿瘤药物	291
一、生物碱类	291
(一) 长春碱类	291
长春花碱酰胺 (292)	
(二) 秋水仙碱类	292
秋水仙碱 (292)	
(三) 三尖杉碱类	292
三尖杉酯碱 (292)	

二、抗肿瘤抗生素	293
更生霉素(293) 柔红霉素(293)	
三、杂类化合物	294
盐酸甲基苄肼(294) 氮烯咪胺(294) 羟萘酮胺(294) 丙亚胺(295)	
复习题	295
第十五章 甾体激素类药物	296
概述	296
第一节 甾体激素类药物的分类与合成	297
一、甾体激素类药物的分类	297
二、甾体激素类药物的合成	298
第二节 雌激素类药物	300
己烯雌酚(301) 雌二醇(302) 炔雌醇 (303)	
第三节 雄激素类药物	305
一、雄性激素	305
甲基睾丸素(305) 丙酸睾丸素(306)	
二、促蛋白同化激素	307
苯丙酸诺龙(308) 康复龙(310) 康力龙 (311)	
第四节 孕激素类药物	311
黄体酮(312) 醋酸甲地孕酮(313) 甲基炔诺酮(316) 双炔失碳酮(318)	
第五节 肾上腺皮质激素类药物	319
氢化可的松(320) 醋酸地塞米松(322)	
复习题	326
第十六章 维生素	328
概述	328
第一节 脂溶性维生素	328
一、维生素A	328
维生素A醋酸酯 (330)	
二、维生素D	334
维生素D ₂ (334) 维生素D ₃ (335)	
三、维生素E	335
维生素E醋酸酯 (336)	
四、维生素K	338
维生素K ₁ (338) 维生素K ₃ (339)	
第二节 水溶性维生素	340
维生素B ₁ (340) 维生素B ₂ (342) 维生素B ₆ (345) 维生素C (347)	
复习题	352
第十七章 天然药物——萜类和生物碱类	354
概述	354
第一节 萜类药物	354
一、萜的分类	354

二、萜类衍生物的化学性质	355
(一) 不饱和键的反应	355
(二) 酯化反应	355
(三) 氧化反应	355
(四) 脱氢反应	356
(五) 重排反应	356
三、萜类药物的提取与分离	356
四、典型萜类药物	356
薄荷脑(356) 樟脑(358) 冰片(359) 穿心莲(360)	
第二节 生物碱类药物	361
一、生物碱的分类	362
(一) 有机胺类	362
(二) 吡咯衍生物类	362
(三) 吡啶衍生物类	362
(四) 莨菪烷衍生物类	362
(五) 喹啉及异喹啉衍生物类	363
(六) 吲哚衍生物类	363
二、生物碱的一般性质	364
三、生物碱的提取方法	364
四、生物碱的分离和鉴定	364
五、生物碱的含量测定	366
六、常用的生物碱类药物	366
盐酸麻黄碱(366) 硫酸阿托品(369) 盐酸可卡因(371) 奎宁(372) 盐酸吗啡(372)	
盐酸小檗碱(373) 利血平(375) 马来酸麦角新碱(376)	
复习题	377
第十八章 有机药物的化学结构与性质	378
概述	378
第一节 药物的化学结构与物理性质	378
一、化学结构与沸点	378
二、化学结构与熔点	380
三、化学结构与溶解度	382
四、化学结构与臭和味	385
五、化学结构与颜色	386
六、化学结构与紫外吸收	389
七、化学结构与红外吸收	390
第二节 药物的化学结构与化学性质	392
一、药物的酸碱性	392
二、药物的水解性	393
三、药物的氧化性和还原性	395

第三节 电荷迁移络合物的稳定性和溶解性	400
一、电荷迁移络合物与药物的稳定性	401
二、电荷迁移络合物与药物的溶解性	402
第四节 药物的理化性质与药效	402
一、溶解度对药效的影响	403
二、解离度对药效的影响	404
三、晶型对药效的影响	405
复习题	405
第十九章 有机药物的化学结构修饰	407
概述	407
第一节 药物化学结构修饰的作用	407
第二节 成盐修饰	411
一、成盐药物的类型	411
二、选择成盐试剂的原则	413
三、盐类药物的制备	414
对氨基水杨酸钠的制备(414) 磺胺嘧啶钠的制备(415)	
第三节 成酯和成酰胺修饰	415
一、成酯和成酰胺修饰类型	415
二、成酯及成酰胺反应的影响因素	418
三、成酯和成酰胺药物的制备实例	420
苄基青霉素乙酰氧甲酯的制备(420) 扑炎痛的制备(420) 氟奋乃静庚酸酯	
的制备(421) 双乙酰氨苯砒的制备(422)	
复习题	422
实验部分	424
实验一 扑热息痛的制备及定性鉴别	424
实验二 盐酸普鲁卡因的合成及定性鉴定	426
实验三 扑炎痛的合成	430
实验四 磺胺醋酸钠的合成及定性鉴别	432
实验五 地巴唑的合成、定性鉴别及含量测定	433
实验六 盐酸苯海索的合成、定性鉴别及含量测定	437
实验七 烟酸的合成、定性鉴别及含量测定	440
实验八 几种有机药物的定性鉴别	441
实验九 维生素和抗生素类药物的定性鉴别	443
附录一 常用无机药物	446
附录二 药物中英文名称对照表	448

第一章 绪 论

前 言

药物是具有预防、治疗、缓解和诊断疾病，以及具有调节机体功能的物质。药物学是研究药物的科学，是人类在与疾病作斗争的过程中，不断积累起来的药物知识宝库。我国古代就有“神农尝百草，一日遇七十毒”的传说，早在二千多年前便有了《神农本草经》等药学专著。我国明代杰出的医药学家李时珍编著的《本草纲目》，其内容极其丰富，为我国药学打下了良好的根基。在 15~18 世纪，由于西欧工业革命和资本主义兴起，促进了自然科学的迅猛发展，进而利用理化科学方法研究制取药物，大规模工业生产药物，极大地充实丰富了药物学的理论与实践。到 19 世纪由于药物学内容的发展，便在学科上分为药物化学、药理学、药剂学、药物分析等学科。

一、药物化学的研究内容和任务

目前医学临床应用的药物大部分是化学药物，其中从矿物加工制得的为无机药物，用有机化工原料合成或半合成的为合成药物，从动植物中提取的有效成分，或微生物产生的为天然药物。就组成来说，合成药物与天然药物又可称为有机药物。

药物化学是应用化学的原理和方法研究药物的一门科学。它的内容是运用现代科学方法研究药物的化学结构、合成路线、理化性质、构效关系、质量检查、调制及贮存过程的化学变化，为提高医药产品的质量和产量，降低生产成本和探索寻找新药的途径和方法打下基础。为适应医药生产的需要，本教材只着重介绍有机药物，无机药物列表介绍供参考，见附录一。

药物化学对不同专业提出了不同的要求：

1. 对化学制药工艺专业，在熟悉各类药物基本结构的基础上，研究有机药物的制备原理和合成路线，探讨和选择合理的合成方法和路线，不断提高药物的质量和产量。
2. 对药物制剂工艺专业，应熟悉各类药物的主要结构和用途，了解典型药物的构效关系，掌握常用药物的结构特点以及调配制剂的有关理化性质，为药物配伍和剂型选择打下理论基础，为探索新药作准备。
3. 对药物分析技术专业，要熟悉各类典型药物的结构特点、理化性质及合成路线，掌握药物在质量分析上的有关原理和方法，为制订药品质量标准、控制和提高产品质量提供重要根据。

综上所述，由于化学制药工艺学、药剂学和药物分析三门学科分别承担各专业所需更具体、更深入的研究内容，因此，药物化学的教学内容，着重于常用典型药物的基本理论和基本知识，并通过实验，培养学生的基本技能。

二、药物化学的发展与我国药物化学的发展和成就

(一) 药物化学的发展

从19世纪开始,由于科学技术的迅猛发展,人们得以利用化学方法提取天然药物中的有效成分,如从金鸡纳树皮里提取抗疟药奎宁,从鸦片中提取镇痛药吗啡等。通过对天然药物中有效成分的研究,精确地测定其理化性质和化学结构,人们开始利用化学合成方法大量制取药物。其后由于染料等化学工业的发展,利用煤焦油中分离出的产品为原料,实现了大规模生产药物。由苯酚经过化学衍化,制得肠道消毒药水杨酸苯酯(沙罗)。从染料中间体苯胺及乙酰苯胺的解热镇痛作用,导致非那西丁与扑热息痛的临床使用。药物合成工业的形成,极大地丰富了药物合成知识和技术,使药物化学成为一门独立的学科。

随着天然药物和合成药物数量的增加和应用,对药物化学结构的研究,使人们开始探索药物的药效基团,提出了药物的构效关系概念。本世纪初,药物的研究转向从药理作用相同的化合物中,寻找产生效应的共同基本结构,并利用药物化学上的一些原理来改变基本结构上的取代基团或扩大基本结构的范围。如从可卡因的结构演变得到普鲁卡因类局部麻醉药的基本结构。同时在具有基本结构的药物中,发现同类型药物间的相对强度或毒性的大小,大多由基本结构上各种取代基团的性质所决定。这种单纯剖析化学结构寻找新药的方法,虽然重视了分子的整体性,但也仅是一种经验研究方法,不能多快好省地创造新药。

本世纪30年代中期发现了百浪多息和磺胺后,一般认为,它们的抗菌活性是由于竞争性对抗细菌所必需的对氨基苯甲酸,使细菌的代谢受到阻断,从而创立了抗代谢学说,这一学说不仅能够阐明一些药物的作用机理,并把寻找新药的途径和方法又推进了一大步。后来抗生素的发现与发展,半合成抗生素的兴起,长效磺胺的出现、抗结核药的创制,合成抗疟药及抗癌药的发展等,给化学合成和生产技术上带来了新方法和新技术。通过对药物基本结构的研究,确定具有药理效用的母体化合物,进而对母体化合物结构的改造,寻找疗效更好的化学药物,至今仍是沿用的新药研究方法之一。

进入本世纪50年代,由于化学与生物学科的进展,新药的大量临床应用,促进了对机体复杂酶系统的研究,使许多药物在机体内的作用机理和代谢变化逐步得到阐明。人们可以进一步利用生理生化知识来寻找新药,改变了过去单纯从药物的化学结构寻找其显效原因的方法。

近十多年来,化学药物的合成技术进展很快,许多结构复杂的天然药物都已能化学合成。化学药物的研究也深入到分子水平,研究药物与体内生物大分子的作用机理,受体的结构和性能,以及药物分子与其相适应的立体结构,药物分子在体内代谢变化与生物膜和酶的关系等一系列问题。化学药物的结构、理化性质与药理作用相互关系的研究,已向定量方面发展。如将药物分子的结构、理化性质与生物活性,通过某些数学模型建立定量关系,有可能定向地改变分子的理化性质,以提高或改进药物的生物活性,而且在一些药物合成评价前,能预测其生物活性,这样减少了寻找新药的盲目性和大量的合成工作,避免了大量人力物力的耗费。

近年来,通过多学科的协作研究,认识到调节机体平衡的重要,如扰乱机体内的一系列相互制约、相互配合的调节体系,使某一环节失调,便产生病态,根据其生化机理,合成有关药物,利用这些外源性化学物质来调整体内各体系的平衡以矫正病态。如广泛存在于机体各组织的前列腺素,对许多生理功能起着调节作用。从脑中分离得到的脑啡

肽，能调节痛觉，有镇痛作用。从体内分离的生长激素抑放激素，能抑制体内胰高血糖素的分泌，可以降低血糖含量和 β -羟基丁酸的浓度，防止糖尿病患者因酸中毒而昏迷，甚至死亡。

药物化学和其它学科一样，都是在自然规律的探索和经济建设的需要中，通过实践积累了丰富的感性认识，经过去粗取精，去伪存真和由表及里的认识过程，逐步上升成为理性认识，反过来又指导实践，如此循环往复，不断得到发展。

(二) 我国药物化学的发展和成就

我国药学有着几千年的历史，是世界药学开发最早的国家之一。但由于长期封建社会的统治，科学技术极端落后，药学得不到发展，徘徊在原有的水平上。解放前，我国是个半封建半殖民地社会国家，没有自己的工业和技术，医药工业非常落后，除少数制剂外，几乎所有原料药品全赖进口。

新中国成立后，医药卫生事业得到了飞跃的发展。中国共产党和人民政府为了彻底改变旧中国医药工业的落后面貌，有计划有步骤地积极恢复和发展医药卫生事业，确定以原料药物生产为主，解决全国用药问题。经过几个五年计划的努力，在全国各地建立了原料药物的生产基地，使我国医药工业生产获得了很大的发展，如 1952 年~1957 年，全国医药工业的总产值，增加了 5.74 倍。1958 年后我国医药工业的面貌有了更迅速的变化，甾类激素发展到工业生产的规模。维生素、抗生素、解热镇痛药、磺胺类药、抗寄生虫病药等的品种和产量都有很大增加。1982 年医药工业 12 大类化学药品总产量完成近 5 万吨，1984 年已提前完成第六个五年计划指标。目前，我国生产的原料药品种已有 1 300 多种，心血管药、中枢神经系统药物、口服避孕药、半合成抗生素和吡酮酸类（喹诺酮）抗菌药等也都已批量生产。一些主要大宗药品不仅能满足国内需要，还可部分出口，1987 年创汇达 7 亿美元。

在药品质量管理方面，自 1979 年以来，医药工业系统推行全面质量管理，制定了《医药产品质量管理办法》，坚持每年进行质量评比。1984 年我国公布了《药品管理法》，1988 年又正式颁布了《药品生产质量管理规范》，成为我国的 GMP，它要求严格控制药品生产过程的各个环节，并实行全过程的质量管理。它是保证药品质量的有效措施，使我国医药生产进入一个新的阶段，逐步走向规范化和现代化。

在党的领导下，我国医药科研贯彻了科研工作为社会主义建设服务的方针，迅速改变了旧中国医药科研工作的落后面貌。化学药物研究工作在新产品试制、新药寻找等方面都有很大的进展。以常见病、多发病、职业病和战备药品为重点，在防治血吸虫病药、抗肿瘤药、心血管药、新止血药和前列腺素及其衍生物的合成方面，都取得了很大成绩。平阳霉素、创新霉素则是我国发现的新抗生素。牛胰岛素的全合成及其结构的研究，更是具有世界先进水平。

近几年来我国在天然药物的研究上取得较大成果。我国药用植物资源丰富，应用中草药治病防病已积累有数千年经验。运用新的科学方法从中分离并鉴定了许多有药理作用的化学成分，发现有效成分的新型结构，进而合成其衍生物或类似物，为我国药物化学的发展，开拓了更广阔的领域。建国以来，我国创制的新原料药约 140 余种，其中半数以上是中草药的有效成分及其衍生物。但是，与一些发达国家相比，我国医药科研基础差，药物产品大多还是仿制国外已发展的药物。今后要自己开发、创制新药，尤其象

抗肿瘤药、抗艾滋病用药等，就应充分利用我国丰富的天然药物资源优势，不断开拓新的天然药物来源，这将是我国药物化学发展的重要方向。

三、药物的质量和标准

任何产品都有规定的质量等级标准，但药品与一般产品不同，它的质量好坏直接关系到广大人民的身体健康和生命安全。所以一般规定有合格与不合格两级标准，不达到质量合格标准的药物不得出厂销售，不得降级处理供药用，因此必须高度重视药物的质量问题。每一个医药工作者都应树立药品质量第一的观点。

评定药物质量有两个主要方面：

1. 药物的疗效和副作用。一个质量好的药物，应疗效好，且副作用和毒性都小。疗效不好的药物固然不能使用，即使药物的疗效很好，但毒性和副作用很大，也不能用于临床。吗啡具有很好的镇痛作用，但由于容易成瘾和呼吸抑制等副作用严重，只能限制使用。氨基比林有很好的抗风湿和解热镇痛作用，又因过敏反应较多，对造血系统有影响，可引起白细胞减少，所以也限制了使用。因此疗效好的药物，一般要求在治疗剂量范围内不产生严重的毒性反应，副作用较小，不影响疗效。为了不断提高药物的质量，现正朝着“三效”（高效、长效、速效）和“三小”（毒性小，用量小，副反应小）的方向发展。

2. 药物的纯度。对药物的纯度要求与对一般化学药品或试剂是有区别的。药物是用于防病治病的，首先要考虑它的杂质对人体健康和疗效的影响，即要求对人体没有危害性，又不影响疗效。而化学药品或试剂的纯度，只考虑杂质可能引起的化学变化是否影响它的使用目的和范围，并不考虑对人体的生理作用。因此化学药品或试剂，一般不能供作医药使用。

由于药物的来源是多方面的，制取的方法也较复杂，因此药物中杂质的来源亦是多方面的，但主要是制备过程中引入和贮存中分解产生。如制备过程中的原料、溶剂、中间体、副产物及设备等都有可能引入杂质。而在贮存中则因受到光线、温度、空气、湿度和微生物等的影响而分解产生杂质。所以药品标准中都规定要检查药物中所含的杂质。

药物中所含的杂质应该愈少愈好，但是要把杂质除尽，势必增加精制手续、增加成本、减少产量。另一方面，从生理上看存在一定数量的杂质，只要不影响疗效，亦无大碍。因此，药物不必是百分之百的纯品。但是对每一药物所含杂质的限量必需有规定，这就是药物纯度的规定。

药典对药物的纯度作了具体规定，其中主要有药物的理化性质、杂质和有效成分的含量等，由于它们之间互有联系，其中某项不符合药典规定，就说明其纯度不够。药典中的含量指标既要体现先进水平，又要在不影响疗效的原则下，根据生产和临床应用的实际作出合理的规定。

我国现行的药品质量标准分为三级标准，即《中华人民共和国药典》、《中华人民共和国卫生部药品标准》及地方性的各省、市、自治区《药品标准》。这些标准对不同收载的化学药物的纯度都有明确的规定。

《中华人民共和国药典》简称《中国药典》，是我国记载药品质量标准的国家法典，具有法律的约束力。它是管理药物生产、检验、供应和使用的依据。因此，药典对保障人民