



全国普通高等中医药院校药学类专业“十三五”规划教材
(第二轮规划教材)

供药学、药物制剂、临床药学、制药工程及相关专业使用

药物化学

(第2版)

主编◎许军 严琳



中国健康传媒集团
中国医药科技出版社



医药学堂
WWW.YIYAOXT.COM

全国普通高等中医药院校药学类专业“十三五”规划教材（第二轮规划教材）

药 物 化 学

（第2版）

（供药学、药物制剂、临床药学、制药工程及相关专业使用）

主 编 许 军 严 琳

副主编 张春桃 李家明 刘玉红 李艳杰 韩 波

编 者 （以姓氏笔画为序）

刘玉红（山东中医药大学）

米浩宇（长春工业大学）

牟佳佳（天津中医药大学）

李念光（南京中医药大学）

李晓坤（河南中医药大学）

李庶心（军事科学院军事医学研究院
辐射医学研究所）

张丽丽（山西中医药大学）

陈桂荣（辽宁中医药大学）

钟 霞（海南医学院）

柴慧芳（贵阳中医学院）

韩 波（成都中医药大学）

刘燕华（江西中医药大学）

许 军（江西中医药大学）

严 琳（河南大学）

李艳杰（长春中医药大学）

李家明（安徽中医药大学）

邱 玺（湖北中医药大学）

张 龙（长春工业大学）

张春桃（湖南中医药大学）

胡春玲（湖北中医药大学）

徐 伟（福建中医药大学）

黄 维（成都中医药大学）



中国健康传媒集团
中国医药科技出版社

内 容 提 要

本教材是“全国普通高等中医药院校药学类专业‘十三五’规划教材（第二轮规划教材）”之一，依照教育部相关文件精神，根据本专业教学要求和课程特点，结合《中国药典》（2015年版）和国家执业药师资格考试大纲编写而成。全书共分二十二章，从药物的化学结构出发，注重介绍各类药物的发现和发展、药物的化学结构、制备合成方法、理化性质、体内代谢、构效关系、临床应用以及毒副作用，新药的研究，简要介绍药物设计与研究方法。本教材为书网融合教材，即纸质教材有机融合电子教材，教学配套资源，题库系统，数字化教学服务（在线教学、在线作业、在线考试）。

本教材传承了第一版的特点，实用性强，主要供中医药院校药学类专业使用，也可作为医药行业考试与培训的参考用书。

图书在版编目（CIP）数据

药物化学/许军，严琳主编. —2版. —北京：中国医药科技出版社，2018.8

全国普通高等中医药院校药学类专业“十三五”规划教材（第二轮规划教材）

ISBN 978-7-5214-0253-7

I. ①药… II. ①许… ②严… III. ①药物化学-中医学院-教材 IV. ①R914

中国版本图书馆CIP数据核字（2018）第097851号

美术编辑 陈君杞

版式设计 诚达誉高

出版 中国健康传媒集团 | 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 889×1194mm^{1/16}

印张 28

字数 603千字

初版 2014年8月第1版

版次 2018年8月第2版

印次 2018年8月第1次印刷

印刷 三河市国英印务有限公司

经销 全国各地新华书店

书号 ISBN 978-7-5214-0253-7

定价 65.00元

版权所有 盗版必究

举报电话：010-62228771

本社图书如存在印装质量问题请与本社联系调换

全国普通高等中医药院校药学类专业“十三五”规划教材（第二轮规划教材）

编写委员会

主任委员 彭 成（成都中医药大学）

副主任委员 朱 华（广西中医药大学）

杨 明（江西中医药大学）

冯卫生（河南中医药大学）

刘 文（贵阳中医学院）

彭代银（安徽中医药大学）

邱智东（长春中医药大学）

委 员（以姓氏笔画为序）

王 建（成都中医药大学）

文红梅（南京中医药大学）

邓 赟（成都中医药大学）

池玉梅（南京中医药大学）

严 琳（河南大学）

杨 云（云南中医学院）

杨武德（贵阳中医学院）

李小芳（成都中医药大学）

吴 虹（安徽中医药大学）

吴啟南（南京中医药大学）

何 宁（天津中医药大学）

张 梅（成都中医药大学）

张朔生（山西中医药大学）

陈振江（湖北中医药大学）

周长征（山东中医药大学）

郑里翔（江西中医药大学）

胡 明（四川大学）

郭 力（成都中医药大学）

容 蓉（山东中医药大学）

巢建国（南京中医药大学）

蒋桂华（成都中医药大学）

傅超美（成都中医药大学）

裴 瑾（成都中医药大学）

王诗源（山东中医药大学）

尹 华（浙江中医药大学）

史亚军（陕西中医药大学）

许 军（江西中医药大学）

严铸云（成都中医药大学）

杨怀霞（河南中医药大学）

李 峰（山东中医药大学）

李学涛（辽宁中医药大学）

吴培云（安徽中医药大学）

吴锦忠（福建中医药大学）

张 丽（南京中医药大学）

张师愚（天津中医药大学）

陆兔林（南京中医药大学）

金传山（安徽中医药大学）

周玖瑶（广州中医药大学）

赵 骏（天津中医药大学）

夏厚林（成都中医药大学）

郭庆梅（山东中医药大学）

康文艺（河南大学）

彭 红（江西中医药大学）

韩 丽（成都中医药大学）

曾 南（成都中医药大学）

全国普通高等中医药院校药学类专业“十三五”规划教材（第二轮规划教材）

出版说明

“全国普通高等中医药院校药学类‘十二五’规划教材”于2014年8月至2015年初由中国医药科技出版社陆续出版，自出版以来得到了各院校的广泛好评。为了更新知识、优化教材品种，使教材更好地服务于院校教学，同时为了更好地贯彻落实《国家中长期教育改革和发展规划纲要（2010-2020年）》《“十三五”国家药品安全规划》《中医药发展战略规划纲要（2016-2030年）》等文件精神，培养传承中医药文明，具备行业优势的复合型、创新型高等中医药院校药学类专业人才，在教育部、国家药品监督管理局的领导下，在“十二五”规划教材的基础上，中国健康传媒集团·中国医药科技出版社组织修订编写“全国普通高等中医药院校药学类专业‘十三五’规划教材（第二轮规划教材）”。

本轮教材建设，旨在适应学科发展和食品药品监管等新要求，进一步提升教材质量，更好地满足教学需求。本轮教材吸取了目前高等中医药教育发展成果，体现了涉药类学科的新进展、新方法、新标准；旨在构建具有行业特色、符合医药高等教育人才培养要求的教材建设模式，形成“政府指导、院校联办、出版社协办”的教材编写机制，最终打造我国普通高等中医药院校药学类专业核心教材、精品教材。

本轮教材包含47门，其中39门教材为新修订教材（第2版），《药理学思维导图与学习指导》为本轮新增加教材。本轮教材具有以下主要特点。

一、教材顺应当前教育改革形势，突出行业特色

教育改革，关键是更新教育理念，核心是改革人才培养体制，目的是提高人才培养水平。教材建设是高校教育的基础建设，发挥着提高人才培养质量的基础性作用。教材建设以服务人才培养为目标，以提高教材质量为核心，以创新教材建设的体制机制为突破口，以实施教材精品战略、加强教材分类指导、完善教材评价选用制度为着力点。为适应不同类型高等学校教学需要，需编写、出版不同风格和特色的教材。而药学类高等教育的人才培养，有鲜明的行业特点，符合应用型人才培养的条件。编写具有行业特色的规划教材，有利于培养高素质应用型、复合型、创新型人才，是高等医药院校教育教学改革的体现，是贯彻落实《国家中长期教育改革和发展规划纲要（2010-2020年）》的体现。

二、教材编写树立精品意识，强化实践技能培养，体现中医药院校学科发展特色

本轮教材建设对课程体系进行科学设计，整体优化；对上版教材中不合理的内容框架进行适当调整；内容（含法律法规、食品药品标准及相关学科知识、方法与技术等）上吐故纳新，实现了基础学科与专业学科紧密衔接，主干课程与相关课程合理配置的目标。编写过程注重突出中医药院校特色，适当融入中医药文化及知识，满足21世纪复合型人才培养的需要。

参与教材编写的专家以科学严谨的治学精神和认真负责的工作态度，以建设有特色的、教师易用、学生易学、教学互动、真正引领教学实践和改革的精品教材为目标，严把编写各个环节，确保教材建设质量。

三、坚持“三基、五性、三特定”的原则，与行业法规标准、执业标准有机结合

本轮教材修订编写将培养高等中医药院校应用型、复合型药学类专业人才必需的基本知识、基本理论、基本技能作为教材建设的主体框架，将体现教材的思想性、科学性、先进性、启发性、适用性作为教材建设灵魂，在教材内容上设立“要点导航”“重点小结”模块对其加以明确；使“三基、五性、三特定”有机融合，相互渗透，贯穿教材编写始终。并且，设立“知识拓展”“药师考点”等模块，与《国家执业药师资格考试考试大纲》和新版《药品生产质量管理规范》（GMP）、《药品经营质量管理规范》（GSP）紧密衔接，避免理论与实践脱节，教学与实际工作脱节。

四、创新教材呈现形式，书网融合，使教与学更便捷、更轻松

本轮教材全部为书网融合教材，即纸质教材与数字教材、配套教学资源、题库系统、数字化教学服务有机融合。通过“一书一码”的强关联，为读者提供全免费增值服务。按教材封底的提示激活教材后，读者可通过 PC、手机阅读电子教材和配套课程资源，并可在线进行同步练习，实时反馈答案和解析。同时，读者也可以直接扫描书中二维码，阅读与教材内容关联的课程资源（“扫码学一学”，轻松学习 PPT 课件；“扫码练一练”，随时做题检测学习效果），从而丰富学习体验，使学习更便捷。教师可通过 PC 在线创建课程，与学生互动，开展在线课程内容定制、布置和批改作业、在线组织考试、讨论与答疑等教学活动，学生通过 PC、手机均可实现在线作业、在线考试，提升学习效率，使教与学更轻松。此外，平台尚有数据分析、教学诊断等功能，可为教学研究与管理提供技术和数据支撑。

本套教材的修订编写得到了教育部、国家药品监督管理局相关领导、专家的大力支持和指导；得到了全国高等医药院校、部分医药企业、科研机构专家和教师的支持和积极参与，谨此，表示衷心的感谢！希望以教材建设为核心，为高等医药院校搭建长期的教学交流平台，对医药人才培养和教育教学改革产生积极的推动作用。同时精品教材的建设工作漫长而艰巨，希望各院校师生在教学过程中，及时提出宝贵的意见和建议，以便不断修订完善，更好地为药学教育事业发展和保障人民用药安全有效服务！

中国医药科技出版社

2018 年 6 月

前言 PREFACE

本教材是“全国普通高等中医药院校药学类专业‘十三五’规划教材（第二轮规划教材）”之一。为更加适应我国“十三五”高等中医药教育事业发展的新形势、新目标和新要求，以及知识的不断更新，本教材编写围绕普通高等中医药教育及专业学习特点，以及国家执业药师资格考试的要求，突出了“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）、三特定（特定的对象、特定的要求、特定的限制）”原则。本教材传承了第一版教材的特点，按照药物临床用途分为二十二章，各章修订了创新药物，编写从药物的化学结构出发，注重介绍各类药物的发现和发展、药物的化学结构、制备合成方法、理化性质、体内代谢、构效关系、临床应用以及毒副作用，新药的研究，简要介绍药物设计与研究方法。各章收入了药物研究的最新成果，同时侧重药物化学的基础理论和应用知识的阐述，使学生在尽可能短的时间内掌握所学课程知识，更好地为我国高等中医药教育人才培养服务。

本教材主要撰写分工为：许军编写第一章，柴慧芳编写第二章，胡春玲编写第三章，黄维编写第四章，李念光编写第五章，李晓坤编写第六章，李庶心编写第七章，李家明编写第八章，米浩宇、张龙编写第九章，牟佳佳编写第十章，刘燕华编写第十一章，张春桃编写第十二章，陈桂荣编写第十三章，刘玉红编写第十四章，严琳编写第十五章、十六章，韩波编写第十七章，邱玺编写第十八章，张丽丽编写第十九章，李艳杰编写第二十章，钟霞编写第二十一章，徐伟编写第二十二章。

本教材为书网融合教材，即纸质教材有机融合电子教材，教学配套资源，题库系统，数字化教学服务（在线教学、在线作业、在线考试）。本教材适用于药学、药物制剂、制药技术、临床药学、制药工程、药品营销、药事管理等高等医药院校相关专业的教学，也可供相关药学工作者作参考用书使用。

本书的编写和出版得到了所有编者及其所在单位各级领导和有关专家的大力支持与帮助，在此致以衷心的感谢。由于编者业务水平和教学经验所限，疏漏和不妥之处在所难免，敬请广大读者和同行专家批评指正。

编者
2018年6月

目录 CONTENTS

第一章 ● 绪论

第一节 药物化学的研究内容、药物化学发展的过程、发展动态和趋势	1
第二节 药物作用靶点和药物的名称	4

第二章 ● 镇静催眠药和抗癫痫药

第一节 镇静催眠药	8
一、苯二氮草类	8
二、杂环类	13
第二节 抗癫痫药物	16

第三章 ● 精神疾病治疗药

第一节 抗精神病药	25
一、吩噻嗪类	26
二、噻吨类	29
三、丁酰苯类	29
四、苯二氮草类	32
五、取代苯甲酰胺类	33
第二节 抗抑郁药	34
一、单胺氧化酶抑制剂	34
二、去甲肾上腺素重摄取抑制剂	34
三、5-羟色胺重摄取抑制剂	35
第三节 神经退行性疾病治疗药	37
一、抗帕金森病药	37
二、抗阿尔茨海默病药	37
三、中枢兴奋药	38

第四章 ● 镇痛药

第一节 吗啡及其衍生物	42
-------------------	----

一、吗啡生物碱	42
二、吗啡衍生物	43
第二节 合成镇痛药	46
一、吗啡喃类	46
二、苯并吗喃类	46
三、哌啶类	48
四、氨基酮类	50
五、其他类	51
六、镇痛药的构效关系	52

第五章 ● 抗生素

第一节 β -内酰胺类抗生素	55
一、青霉素类	56
二、头孢菌素类	63
第二节 四环素类抗生素	75
第三节 氨基糖苷类抗生素	77
一、链霉素类	78
二、卡那霉素及其衍生物	78
三、庆大霉素 C 及其衍生物	79
四、新霉素类	80
第四节 大环内酯类抗生素	81
一、红霉素及其衍生物	81
二、麦迪霉素及其衍生物	86
三、螺旋霉素及其衍生物	86
第五节 氯霉素类抗生素和其他抗生素	87

第六章 ● 合成抗菌药、抗真菌药和抗寄生虫药

第一节 磺胺类药物及抗菌增效剂	90
第二节 喹诺酮类抗菌药	95
第三节 抗结核病药	100
第四节 抗真菌药	105
第五节 抗寄生虫药	110
一、驱肠虫药物	110
二、抗血吸虫病药物	111
三、抗疟药	112

第七章 ● 抗病毒药

第一节 抗非反转录病毒药物	119
一、抑制病毒复制的药物	119
二、干扰病毒核酸复制的药物	123
三、影响核糖体翻译的药物	129
第二节 抗艾滋病药物	130
一、反转录酶抑制剂	130
二、蛋白酶抑制剂	133
第三节 抗丙肝病毒药物	135

第八章 ● 抗肿瘤药

第一节 生物烷化剂	138
一、氮芥类	138
二、乙撑亚胺类	143
三、甲磺酸酯及卤代多元醇类	143
四、亚硝基脲类	144
五、金属配合物类	145
第二节 抗代谢药物	147
一、嘧啶类抗代谢物	147
二、嘌呤类抗代谢物	151
三、叶酸类抗代谢物	152
第三节 抗肿瘤抗生素	154
一、多肽类抗生素	154
二、醌类抗生素及其衍生物	155
第四节 抗肿瘤植物有效成分及其衍生物	158
一、喜树碱及其衍生物	158
二、鬼臼毒素及其衍生物	159
三、紫杉烷类	160
四、长春碱类	161
五、三尖杉碱类	162
第五节 抗肿瘤药的发展趋势	163
一、蛋白激酶抑制剂	163
二、组蛋白去乙酰化酶抑制剂	167
三、蛋白酶体抑制剂	168
四、肿瘤免疫疗法	169

第九章

● 拟胆碱药和抗胆碱药

第一节 拟胆碱药	172
一、胆碱受体激动剂	172
二、乙酰胆碱酯酶抑制剂	174
第二节 抗胆碱药	177
一、M 胆碱受体阻断剂	177
二、N 胆碱受体阻断剂	181

第十章

● 拟肾上腺素能药物

一、非选择性 α 和 β 受体激动剂	188
二、选择性 α 受体激动剂	191
三、选择性 β 受体激动剂	193
四、拟肾上腺素能药物的构效关系	196

第十一章 ● 麻醉药

第一节 全身麻醉药	197
一、吸入麻醉药	198
二、静脉麻醉药	199
三、全身麻醉药的构效关系	200
第二节 局部麻醉药	201

第十二章 ● 心血管疾病治疗药

第一节 调血脂药	209
一、羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑制剂	209
二、苯氧烷酸类药物	215
三、烟酸及其衍生物	218
四、胆固醇吸收抑制剂	219
第二节 抗心绞痛药	219
一、NO 供体药物	220
二、 β 受体阻断剂	223
第三节 抗高血压药	228
一、作用于自主神经系统的药物	228
二、影响肾素-血管紧张素-醛固酮系统的药物	232
三、作用于离子通道的药物——钙阻断剂	239
四、利尿药及其他药物	239

第四节	抗心律失常药	240
一、	钠通道阻滞剂	240
二、	β 受体阻断剂	244
三、	钾通道阻滞剂	244
四、	钙通道阻滞剂	246
第五节	强心药	254
一、	强心苷类	254
二、	磷酸二酯酶抑制剂	256
三、	钙敏化剂	256
四、	β 受体激动剂	257
第六节	抗血小板及抗凝药	258
一、	抗血小板药	258
二、	抗凝药	260

第十三章 ● 泌尿相关疾病治疗药

第一节	利尿药和抗尿失禁药	262
一、	多元醇类	262
二、	磺酰胺类	263
三、	噻嗪类	266
四、	苯氧乙酸类	268
五、	蝶啶类	269
六、	甾体类	270
第二节	前列腺增生治疗药	273
一、	5α -还原酶抑制剂	273
二、	α 受体阻断剂	274
第三节	性功能障碍改善药	276
一、	磷酸二酯酶抑制剂	276
二、	α 受体阻断剂	278

第十四章 ● 解热镇痛药及非甾体抗炎药

第一节	解热镇痛药	282
一、	苯胺类	283
二、	水杨酸类	284
三、	吡唑酮类	286
第二节	非甾体抗炎药	287
一、	非选择性的非甾体抗炎药	287

二、选择性的非甾体抗炎药	298
第三节 抗痛风药	302
第十五章 ● 抗变态反应药	
一、抗变态反应药的研究进展	306
二、组胺 H_1 受体阻断剂	308
三、组胺 H_1 受体阻断剂的构效关系	317
第十六章 ● 消化疾病治疗药	
第一节 抗溃疡药	319
一、组胺 H_2 受体阻断剂	320
二、质子泵抑制剂	324
第二节 促胃动力药	328
一、多巴胺 D_2 受体阻断剂	329
二、 $5-HT_4$ 受体激动剂	330
第三节 止吐药	331
一、 $5-HT_3$ 受体阻断剂	332
二、 NK_1 受体阻断剂	334
第十七章 ● 平喘镇咳祛痰药	
第一节 平喘药	337
一、作用于白三烯系统的药物	338
二、肾上腺糖皮质激素类药物	340
三、磷酸二酯酶抑制剂	344
第二节 镇咳药	347
一、中枢性镇咳药	347
二、外周性镇咳药	349
第三节 祛痰药	349
第十八章 ● 降血糖药、甲状腺激素药和抗甲状腺药	
第一节 降血糖药	352
一、胰岛素及其类似物	352
二、胰岛素分泌促进剂	354
三、胰岛素增敏剂	359
四、 α -葡萄糖苷酶抑制剂	361
五、新靶点的口服降血糖药	361

	第二节 甲状腺激素药和抗甲状腺药	363
	一、甲状腺激素药	363
	二、抗甲状腺药	364
第十九章	● 骨质疏松治疗药	
	一、促进钙吸收药物	367
	二、抗骨吸收药物	371
第二十章	● 甾体激素类药	
	第一节 雌激素类药物	378
	一、甾体雌激素药物	378
	二、非甾体雌激素药物	380
	三、选择性雌激素受体调节剂	382
	第二节 雄激素类药物	382
	一、雄性激素	382
	二、蛋白同化激素	384
	三、抗雄性激素	386
	第三节 孕激素类药物	387
	一、孕激素和甾体避孕药	387
	二、抗孕激素	390
	第四节 肾上腺皮质激素药物	392
第二十一章	● 维生素	
	第一节 脂溶性维生素	398
	一、维生素 A 类	399
	二、维生素 D 类	400
	三、维生素 E 类	402
	四、维生素 K 类	404
	第二节 水溶性维生素	405
	一、B 族维生素	405
	二、维生素 C 类	409
第二十二章	● 药物设计的基本原理和方法	
	第一节 药物的结构与生物活性	413
	一、药物的基本结构和结构改造	414
	二、理化性质对药效的影响	414

三、电子密度分布和官能团对药效的影响	415
四、键合特性对药效的影响	416
五、立体结构对药效的影响	417
第二节 新药设计与开发	418
一、先导化合物发现的方法和途径	418
二、先导化合物的优化	421
三、定量构效关系	424
四、计算机辅助药物设计	428
● 参考文献	430

第一章 绪 论



扫码“学一学”

要点导航

系统学习药物化学的内容和任务，以药物的化学结构为中心、学习药物化学知识，药物的名称。了解药物化学的发展的过程、发展动态和趋势与我国药物化学事业的成就。

人文知识介绍

化学和药物的历史渊源非常古老，自从有了人类，化学和药物便与人类结下了不解之缘。从远古到公元前约 1500 年，人类学会在熊熊的烈火中由黏土制出陶器、由矿石提炼出金属，学会用谷物酿酒、给丝麻等织物染上颜色等。这些都是在实践经验的直接启发下经过长期摸索而来的最早的化学工艺，是化学的萌芽时期。中国古书中有“神农尝百草，始有医学”的记载，可见中国人用天然植物作为药物的历史在炎黄二帝时期即已开始。古希腊时期也有用药的记载，医学先驱希波克拉底已开始用矿物和植物治病。化学药物则始于为求得长生不老的炼丹物。

药物化学 (medicinal chemistry) 是药物和化学的结合，是建立在医学、化学和生物学基础上，发明与发现药物、合成药物、阐明药物理化性质、在分子水平上研究揭示药物作用规律的一门学科，是药学领域中重要的带头学科。药物的制备和研究，创新药物的产生是保障人们身体健康的重要工作目标。随着人类的进步和医学、化学和生物学的进展，随着与疾病相关的新的靶标陆续发现，又为创新药物研究提供了巨大机遇。

第一节 药物化学的研究内容、药物化学发展的过程、发展动态和趋势

药物指能影响机体生理、生化和病理过程，用以预防、缓解、诊断、治疗疾病、有目的地调节机体生理功能效应，规定有适应证或者功能主治、用法和用量的物质。国家把药物分类为处方药和非处方药，处方药必须凭处方购买。药物根据来源的不同，可分为天然药物、化学药物和生物药物。天然药物是指动物、植物、矿物等自然界中存在的有药理活性的天然产物。化学药物主要来自于矿物、动物和植物中提取的有效化学成分单体、化学合成、生物发酵制得的药物。生物药物是利用生物体、生物组织、细胞、体液等制造的药物。目前在临床仍以化学药物为主。

药物化学是药学领域对药物和活性进行研究的一门重要的带头学科。学习研究内容涉



及发明与发现药物、药物的化学结构特征、名称、理化性质、稳定性、制备、作用机理、毒副作用、构效关系等。

(1) 学习研究药物的化学结构以及理化性质, 为药物的化学结构修饰、剂型选择、药品的分析检测、保管贮藏和正确使用等奠定化学基础。

(2) 学习研究药物的化学结构与生物活性间的关系即构效关系 (Structure activity relationships, SAR), 从分子水平上揭示药物的作用机理, 研究药物进入体内后的生物效应、毒副作用及药物进入体内的生物转化等。

(3) 学习药物分子在生物体中作用的靶点以及药物与靶点结合的方式, 为临床药学的配伍禁忌和合理用药以及新药研究和开发过程中药物的结构改造奠定理论基础。

(4) 学习制备生产化学药物的先进、经济的方法和工艺。

(5) 为创制新药研究探索新的途径和方法。

药物化学的发展历程, 可简单概括为 3D 阶段。即发现阶段 (discovery)、发展阶段 (development) 和综合设计阶段 (design)。

最早的药物开始于天然物质, 早期人们用一些天然物质来治疗疾病与伤痛, 早在远古时代, 我们的祖先在与大自然作斗争中创造了原始医药学。人们在寻找食物的过程中, 发现某些食物能减轻或消除某些病症, 这就是发现和应用天然药物的起源。《神农本草经》就是流传下来的、中国现存最早的药物学专著。它总结了汉以前人们的药物知识, 该书分三卷, 载药 365 种 (植物药 252 种, 动物药 67 种, 矿物药 46 种), 分上、中、下三品, 并记述了君、臣、佐、使、七情和合、四气五味等药物学理论, 成为我国药物的精髓。长期临床实践和现代科学研究证明: 该书所载药效大多是正确的, 如麻黄治喘, 黄连治痢, 海藻治瘰等。

公元 657 ~ 659 年苏敬等组织编修本草, 于公元 659 年完稿, 名为《新修本草》(世称《唐本草》)。这是中国古代由政府颁行的第一部药典, 也是世界上最早的国家药典。该书共 50 多卷, 包括本草、药图、图经三部分, 载药 850 余种, 在国外影响较大。

明朝李时珍的《本草纲目》在药物发展史上有巨大贡献, 全书共 52 卷, 约 190 万字, 收载药物 1892 种, 插图 1160 帧, 药方 11000 余条, 分为 16 部、60 类, 是我国传统医学的经典著作, 它是几千年来祖国药物学的总结, 在国际上先后有多种文字的译本流传, 对世界自然科学做出举世公认的卓越贡献。

随着科学技术的不断进步发展, 特别是煤、染料等化学工业的崛起, 促进了药物的发展。19 世纪初, 药物主要是从动植物体中分离、纯化和鉴定有药用价值的有机化合物, 如从茶叶中提取具有中枢兴奋作用的咖啡因, 从古柯叶中提取具有麻醉作用的可卡因, 从罂粟中提取具有镇痛作用的吗啡, 从颠茄中提取具有解痉作用的阿托品等。19 世纪中期以后, 药物化学知识的发展, 有机合成方法的进步, 促进了药物的发展进步。1875 年 Buss 发现水杨酸盐具有解热与抗风湿作用, 1898 年德国 Hoffmann 合成阿司匹林, 到目前临床应用已有 100 多年; 1891 年 Ehrlich 发现染料亚甲蓝可用于治疗疟疾, 1926 年发现扑疟奎, 1932 年发现阿的平等合成抗疟药; 1910 年合成的肿凡纳明用于治疗梅毒等疾病, 提出了化学治疗的新概念。Ehrlich 提出化学治疗概念, 为现代化学药物的合成和进展奠定了基础。

20 世纪 30 年代中期由染料百浪多息, 发明了一系列磺胺类药物。1938 年合成了磺胺吡啶, 1940 年左右合成了磺胺噻唑、磺胺嘧啶等磺胺类药物, 1951 年至 1953 年间发现了

