

有机药物化学

Н. А. 朴烈奥勃拉任斯基

著

Э. И. 盖恩金

高等学校教学用书

有机药物化学

Н. А. 朴烈奥勃拉任斯基

Э. И. 盖恩金

著

袁开基、单长生等

译

袁开基校

化学工业出版社

本書提供有关天然的和合成的有机药物的性质、结构和制取方法的知識，尤其着重講属于杂环系的药物（生物碱类、維生素类、激素类及它們的合成类似物）。原書經苏联文化部高等教育局审定作为化学工業高等学校教学参考書。

本書可供高年級学生、研究生、科学工作者和工程师以及其他工作于复杂有机化学范疇的人作学习指导之用。它不但对于一切研究有机化学者有用处，而且对其他与有机化学有关專業的專家，特别是医学專家亦然。

本書由袁开基、薛芬、費楚华、單長生、陶叔五人譯出，由袁开基总校，最后全稿又經袁承業加工整理。

Н. А. ПРЕОБЖЕНСКИЙ · Э. И. ГЕНКИН

ХИМИЯ
ОРГАНИЧЕСКИХ
ЛЕКАРСТВЕННЫХ
ВЕЩЕСТВ

ГОСХИМИЗДАТ (МОСКВА 1953 ЛЕНИНГРАД)

有机藥物化学

袁开基、單長生等 譯

袁开基 校

化学工業出版社（北京安定門外和平北路）出版

北京市書刊出版業營業許可証出字第092号

北京市印刷一厂印刷 新华書店發行

| | |
|------------------|---------------|
| 开本：787×1092 1/16 | 1958年5月第1版 |
| 印張：36 1/4 | 1958年5月第1次印刷 |
| 字数：760千字 | 印数：1—3522 |
| 定价：(10)5.00元 | 書号：15063·0163 |

目 录

| | |
|-------------------------------------|-----|
| 譯 序 | 6 |
| 序 | 8 |
| 緒 論 | 9 |
| 藥物的分类 | 14 |
| 杂环族藥物 | 16 |
| 第一章 吡唑族藥物 | 19 |
| 安替比林 | 20 |
| 匹拉米董 | 28 |
| 安乃近 | 32 |
| 二氧化匹拉米董 | 33 |
| 第一章的参考文献 | 36 |
| 第二章 咪唑族藥物 | 38 |
| 植物性神經藥物及其作用 | 40 |
| 組氨酸 | 44 |
| 組胺 | 47 |
| 抗組胺藥 | 50 |
| 硫組氨酸甲基內鹽 | 57 |
| 咪唑啉衍生物 | 59 |
| 毛果芸香屬生物鹼类 | 62 |
| 毛果芸香鹼的結構 | 64 |
| 毛果芸香鹼的合成 | 67 |
| 毛果芸香鹼的代用品 | 72 |
| 皮渥丁(維生素H) | 74 |
| 絡合維生素 B 族 | 83 |
| 維生素 B ₁₂ | 85 |
| 維生素 B ₁₂ 的生物活性 | 85 |
| 維生素 B ₁₂ 的化学性質及其結構 | 86 |
| 鈷維生素类(維生素 B ₁₂ 族) | 92 |
| 偽維生素 B ₁₂ | 94 |
| 第二章的参考文献 | 96 |
| 第三章 啞唑衍生物的藥物 | 101 |
| 可拉唑 | 109 |
| 第三章的参考文献 | 111 |
| 第四章 吡啶族和嘓嗶啶族藥物 | 113 |
| 吡啶 | 118 |
| 菸叶生物鹼(菸鹼和阿那培新) | 122 |
| 菸鹼酸及其衍生物 | 127 |
| 菸鹼酸 | 127 |
| 菸鹼酰胺 | 130 |
| 吡嗪羧酸的酰胺类和腺类 | 134 |
| 檳榔生物鹼(檳榔鹼) | 138 |
| 檳榔鹼的合成代用品 | 141 |
| 維生素 B ₆ 族 | 142 |
| 維生素 B ₆ 的結構及合成 | 143 |
| 維生素 B ₆ 的化学性質和生物意义 | 149 |
| 維生素 B ₆ 的同系物和对抗物 | 154 |
| 泛酸 | 155 |
| 北美山梗菜生物鹼类(北美山梗菜鹼) | 159 |
| 第四章的参考文献 | 162 |
| 第五章 託嘓族藥物 | 166 |

託哌生物鹼类 166^o
 颠茄鹼和莨菪鹼 172
 颠茄鹼代用品的合成 174
 斯可波拉明 177
 古柯鹼 181
 託哌衍生物的立体結構 184

合成的局部麻醉药——古柯鹼的
 代用品 190
 安納細新 201
 奴佛士因 202
 基卡因 204
 第五章的参考文献 205

第六章 異喹啉族藥物 209

阿片生物鹼 211
 嗎啡 214
 嗎啡的結構 215
 N- 甲基嗎啡喃类的合成 220
 嗎啡的合成 223
 嗎啡生物鹼类的立体構型 230
 C₅ 和 C₉ 上的構型 230
 C₉ 和 C₁₃ 上的構型 231
 C₁₄ 上的構型 232
 嗎啡和可待因的異構 234
 嗎啡的衍生物 236
 可待因 237
 蒂巴因 243
 嗎啡的合成代用品 246
 立陀尔及其类似物 249

 勃罗米陀尔 252
 菲納酮 254
 怕怕非林 257
 合成的鎮痙药(怕怕非林的代用品) 261
 那可汀 267
 北美黃連生物鹼 271
 吐根生物鹼类(依米汀) 273
 依米汀的結構 274
 依米汀的合成 277
 依米汀类似物的合成 280
 美洲箭毒生物鹼 282
 士巴寇拉令的結構 285
 类美洲箭毒化合物的合成 288
 塞尔苏林和仙人掌科生物鹼类 296
 第六章的参考文献 299

第七章 喹啉族藥物 307

金雞納生物鹼类 308
 金雞納生物鹼类的結構 310
 金雞納生物鹼类的立体化学 310
 非对称中心 C₃ 及 C₄ 的構型 312
 非对称中心 C₃ 的構型 314
 非对称中心 C₉ 的構型 315
 金雞納生物鹼类的合成 317
 氫合奎宁的合成 317
 后麻米罗坤及奎宁的合成 320
 金雞納生物鹼的个别代表 324
 奎宁 324
 氫合叩笔灵及其烷基醚 326

 結構与抗瘧活性 327
 奎宁的合成类似物 331
 抗瘧药 333
 8-氨基喹啉的衍生物 333
 4-氨基喹啉的衍生物 342
 防腐剂与杀阿米巴剂 345
 局部麻醉剂 346
 苏夫卡因 347
 具有解热作用的喹啉衍生物 350
 阿託方 350
 第七章的参考文献 351

第八章 吡啶族及兩苯駢噁嗪族藥物 355

吡啶防腐剂类(佛来夫吡啶,雷佛奴耳) 357 | 抗瘧药(阿克利亨) 361

| | | | |
|-----------------------------------|------------|-------------------------------------|-----|
| 吡啶化合物的結構与抗瘧活性 | 364 | 第八章的参考文献 | 369 |
| 兩苯腓噻嗪的衍生物 | 366 | | |
| 第九章 嘧啶族葯物 | 372 | | |
| 嘧啶的衍生物 | 377 | 維生素 B ₂ 的結構与合成 | 411 |
| 嘧啶生物鹼的結構 | 379 | 維生素 B ₂ 的結構和性質的特異点 | 420 |
| 嘧啶生物鹼类的合成 | 381 | 叶酸族維生素 | 422 |
| 維生素 B ₁ (阿羅稜、硫胺) | 394 | 叶酸 | 425 |
| 維生素 B ₁ 的結構 | 395 | 叶酸的类似物与对抗物(抗叶酸) | 437 |
| 維生素 B ₁ 的合成 | 399 | 黃芩山鹼 | 439 |
| 維生素 B ₁ 分子結構的独特性 | 407 | 第九章的参考文献 | 441 |
| 維生素 B ₂ (核黃素) | 409 | | |
| 第十章 吡啶族葯物 | 446 | | |
| 毒扁豆鹼或依色林 | 450 | 麦角生物鹼 | 471 |
| 毒扁豆鹼的結構 | 451 | 麦角酸及異麦角酸的結構 | 474 |
| 毒扁豆鹼的合成 | 451 | 麦角生物鹼类分子的多肽部分 | 481 |
| 毒扁豆鹼的合成代用品 | 455 | 麦角生物鹼类及其合成类似物的結構 与生理作用 | 485 |
| 波罗寿令 | 456 | 第十章的参考文献 | 488 |
| 番木鱈鹼(土的宁) | 458 | | |
| 番木鱈鹼的結構 | 460 | | |
| 第十一章 抗生素 | 492 | | |
| 青霉素类 | 505 | 苏联短桿菌肽 | 553 |
| 青霉素的結構 | 509 | 苏联短桿菌肽的結構和合成 | 553 |
| 青霉素类物質的合成 | 520 | 苏联短桿菌肽的生产制造 | 557 |
| 青霉素类的結構和作用 | 522 | 左旋霉素和合霉素 | 558 |
| 青霉素的生产制造 | 525 | 氯霉素(左旋霉素)的結構 | 560 |
| 青霉素类的分析方法 | 529 | 左旋霉素(氯霉素)的合成 | 564 |
| 鏈霉素 | 531 | 金霉素与地霉素 | 568 |
| 鏈霉素的結構和合成 | 533 | 金霉素与地霉素的化学結構 | 570 |
| 鏈霉素的生产制造 | 547 | 第十一章的参考文献 | 574 |
| 鏈霉素的分析方法 | 551 | | |
| 索 引 | 585 | | |

高等學校教學用書

有機藥物化學

H. A. 朴烈奧勃拉任斯基

Э. И. 蓋恩金

著

袁開基、單長生等

譯

袁開基校

化學工業出版社

本書提供有关天然的和合成的有机药物的性质、结构和制取方法的知識，尤其着重講属于杂环系的药物（生物碱类、維生素类、激素类及它們的合成类似物）。原書經苏联文化部高等教育局审定作为化学工業高等学校教学参考書。

本書可供高年級学生、研究生、科学工作者和工程师以及其他工作于复杂有机化学范疇的人作学习指导之用。它不但对于一切研究有机化学者有用处，而且对其他与有机化学有关專業的專家，特别是医学專家亦然。

本書由袁开基、薛芬、費楚华、單長生、陶叔五人譯出，由袁开基总校，最后全稿又經袁承業加工整理。

Н. А. ПРЕОБАЖЕНСКИЙ · Э. И. ГЕНКИН

ХИМИЯ
ОРГАНИЧЕСКИХ
ЛЕКАРСТВЕННЫХ
ВЕЩЕСТВ

ГОСХИМИЗДАТ(МОСКВА 1953 ЛЕНИНГРАД)

有机藥物化学

袁开基、單長生等 譯

袁开基 校

化学工業出版社（北京安定門外和平北路）出版

北京市書刊出版業營業許可証出字第092号

北京市印刷一厂印刷 新华書店發行

| | |
|------------------|---------------|
| 开本：787×1092 1/16 | 1958年5月第1版 |
| 印張：36 1/4 | 1958年5月第1次印刷 |
| 字数：760千字 | 印数：1—3522 |
| 定价：(10)5.00元 | 書号：15063·0163 |

目 录

| | |
|-------------------------------------|------------|
| 譯 序 | 6 |
| 序 | 8 |
| 緒 論 | 9 |
| 藥物的分类 | 14 |
| 杂环族藥物 | 16 |
| 第一章 吡唑族藥物 | 19 |
| 安替比林 | 20 |
| 匹拉米董 | 28 |
| 安乃近 | 32 |
| 二氧化匹拉米董 | 33 |
| 第一章的参考文献 | 36 |
| 第二章 咪唑族藥物 | 38 |
| 植物性神經藥物及其作用 | 40 |
| 組氨酸 | 44 |
| 組胺 | 47 |
| 抗組胺藥 | 50 |
| 硫組氨酸甲基內鹽 | 57 |
| 咪唑啉衍生物 | 59 |
| 毛果芸香屬生物鹼类 | 62 |
| 毛果芸香鹼的結構 | 64 |
| 毛果芸香鹼的合成 | 67 |
| 毛果芸香鹼的代用品 | 72 |
| 皮渥丁(維生素H) | 74 |
| 絡合維生素 B 族 | 83 |
| 維生素 B ₁₂ | 85 |
| 維生素 B ₁₂ 的生物活性 | 85 |
| 維生素 B ₁₂ 的化学性質及其結構 | 86 |
| 鈷維生素类(維生素 B ₁₂ 族) | 92 |
| 伪維生素 B ₁₂ | 94 |
| 第二章的参考文献 | 96 |
| 第三章 啞唑衍生物的藥物 | 101 |
| 可拉唑 | 109 |
| 第三章的参考文献 | 111 |
| 第四章 吡啶族和嘧啶族藥物 | 113 |
| 吡啶 | 118 |
| 菸叶生物鹼(菸鹼和阿那培新) | 122 |
| 菸鹼酸及其衍生物 | 127 |
| 菸鹼酸 | 127 |
| 菸鹼酰胺 | 130 |
| 吡啶羧酸的酰胺类和腺类 | 134 |
| 嘧啶生物鹼(嘧啶鹼) | 138 |
| 嘧啶鹼的合成代用品 | 141 |
| 維生素 B ₆ 族 | 142 |
| 維生素B ₆ 的結構及合成 | 143 |
| 維生素 B ₆ 的化学性質和生物意义 | 149 |
| 維生素 B ₆ 的同系物和对抗物 | 154 |
| 泛酸 | 155 |
| 北美山梗菜生物鹼类(北美山梗菜鹼) | 159 |
| 第四章的参考文献 | 162 |
| 第五章 託嘧族藥物 | 166 |

託哌生物鹼类 166^o
 颠茄鹼和莨菪鹼 172
 颠茄鹼代用品的合成 174
 斯可波拉明 177
 古柯鹼 181
 託哌衍生物的立体結構 184

合成的局部麻醉药——古柯鹼的
 代用品 190
 安納細新 201
 奴佛士因 202
 基卡因 204
 第五章的参考文献 205

第六章 異喹啉族藥物 209

阿片生物鹼 211
 嗎啡 214
 嗎啡的結構 215
 N- 甲基嗎啡喃类的合成 220
 嗎啡的合成 223
 嗎啡生物鹼类的立体構型 230
 C₅ 和 C₉ 上的構型 230
 C₉ 和 C₁₃ 上的構型 231
 C₁₄ 上的構型 232
 嗎啡和可待因的異構 234
 嗎啡的衍生物 236
 可待因 237
 蒂巴因 243
 嗎啡的合成代用品 246
 立陀尔及其类似物 249

 勃罗米陀尔 252
 菲納酮 254
 怕怕非林 257
 合成的鎮痙药(怕怕非林的代用品) 261
 那可汀 267
 北美黃連生物鹼 271
 吐根生物鹼类(依米汀) 273
 依米汀的結構 274
 依米汀的合成 277
 依米汀类似物的合成 280
 美洲箭毒生物鹼 282
 士巴寇拉令的結構 285
 类美洲箭毒化合物的合成 288
 塞尔苏林和仙人掌科生物鹼类 296
 第六章的参考文献 299

第七章 喹啉族藥物 307

金雞納生物鹼类 308
 金雞納生物鹼类的結構 310
 金雞納生物鹼类的立体化学 310
 非对称中心 C₃ 及 C₄ 的構型 312
 非对称中心 C₃ 的構型 314
 非对称中心 C₉ 的構型 315
 金雞納生物鹼类的合成 317
 氫合奎宁的合成 317
 后麻米罗坤及奎宁的合成 320
 金雞納生物鹼的个别代表 324
 奎宁 324
 氫合叩笔灵及其烷基醚 326

 結構与抗瘧活性 327
 奎宁的合成类似物 331
 抗瘧药 333
 8-氨基喹啉的衍生物 333
 4-氨基喹啉的衍生物 342
 防腐剂与杀阿米巴剂 345
 局部麻醉剂 346
 苏夫卡因 347
 具有解热作用的喹啉衍生物 350
 阿託方 350
 第七章的参考文献 351

第八章 吡啶族及兩苯駢噻嗪族藥物 355

吡啶防腐剂类(佛来夫吡啶,雷佛奴耳) 357

抗瘧药(阿克利亨) 361

| | | | |
|-----------------------------------|------------|-------------------------------------|-----|
| 吡啶化合物的結構与抗瘧活性 | 364 | 第八章的参考文献 | 369 |
| 兩苯腓噻嗪的衍生物 | 366 | | |
| 第九章 嘧啶族葯物 | 372 | | |
| 嘧啶的衍生物 | 377 | 維生素 B ₂ 的結構与合成 | 411 |
| 嘧啶生物鹼的結構 | 379 | 維生素 B ₂ 的結構和性質的特異点 | 420 |
| 嘧啶生物鹼类的合成 | 381 | 叶酸族維生素 | 422 |
| 維生素 B ₁ (阿羅稜、硫胺) | 394 | 叶酸 | 425 |
| 維生素 B ₁ 的結構 | 395 | 叶酸的类似物与对抗物(抗叶酸) | 437 |
| 維生素 B ₁ 的合成 | 399 | 黃常山鹼 | 439 |
| 維生素 B ₁ 分子結構的独特性 | 407 | 第九章的参考文献 | 441 |
| 維生素 B ₂ (核黃素) | 409 | | |
| 第十章 吡啶族葯物 | 446 | | |
| 毒扁豆鹼或依色林 | 450 | 麦角生物鹼 | 471 |
| 毒扁豆鹼的結構 | 451 | 麦角酸及異麦角酸的結構 | 474 |
| 毒扁豆鹼的合成 | 451 | 麦角生物鹼类分子的多肽部分 | 481 |
| 毒扁豆鹼的合成代用品 | 455 | 麦角生物鹼类及其合成类似物的結構 与生理作用 | 485 |
| 波罗寿令 | 456 | 第十章的参考文献 | 488 |
| 番木鱈鹼(土的宁) | 458 | | |
| 番木鱈鹼的結構 | 460 | | |
| 第十一章 抗生素 | 492 | | |
| 青霉素类 | 505 | 苏联短桿菌肽 | 553 |
| 青霉素的結構 | 509 | 苏联短桿菌肽的結構和合成 | 553 |
| 青霉素类物質的合成 | 520 | 苏联短桿菌肽的生产制造 | 557 |
| 青霉素类的結構和作用 | 522 | 左旋霉素和合霉素 | 558 |
| 青霉素的生产制造 | 525 | 氯霉素(左旋霉素)的結構 | 560 |
| 青霉素类的分析方法 | 529 | 左旋霉素(氯霉素)的合成 | 564 |
| 鏈霉素 | 531 | 金霉素与地霉素 | 568 |
| 鏈霉素的結構和合成 | 533 | 金霉素与地霉素的化学結構 | 570 |
| 鏈霉素的生产制造 | 547 | 第十一章的参考文献 | 574 |
| 鏈霉素的分析方法 | 551 | | |
| 索 引 | 585 | | |

譯 序

本書原作者之一，朴列奧勃拉任斯基教授，對於搞藥物化學或生物鹼化學的同志們大概不是生疏的。早在1933年他就第一個合成了毛茛蕪香鹼（正魯卡品），最近（1950年）又首先完全合成了吐根鹼（依米汀）。他曾兩次得到斯大林獎金。因此這本原著的質量是可以絕對保證的，問題只是譯文是否與原書的質量相配稱而已。

原作者是蘇聯莫斯科精細化工學院的教授。關於精細化工學院，也值得介紹一下，因為這類學校中國還沒有，而且似乎其他國家也沒有；若不了解精細化工學院的性質，也難體會本書的目的。據我們所知，精細化工學院教學的範圍是精細化學藥品，包括藥品、香料和照相材料等等。它不像一般的化工學院偏重於工學，而是偏重於有機化學，它主要是培養研究人才。

至於本書內容的說明，原序已經說得很詳細，這裡不必再說了。

翻譯本書最傷腦筋的是譯名的問題，我國在這方面的基礎實在太差了。本書以雜環族化合物為主體，而雜環族化合物的命名法在命名工作中卻又是一個死角。這給予本書的翻譯工作以極大的困難。

本書所用譯名，以譯音為主，但已有較確當的譯意名稱的，仍採用譯意，或譯意與譯音兼用。這樣自然也不是頂妥善的辦法，但我們認為還是比較妥當的，因為譯音的伸縮性比較大，易於從一個名稱衍化成另一個與其接近的名稱，而這樣的事例又是很多的。例如，衍生於番木鱉鹼的有斯屈利辛倪尼酸、斯屈利辛倪諾酸和斯屈利辛倪諾尼酸，衍生於百路新的有百路新諾羅酸與百路新諾羅農酸。在譯音的時候，兩個接近的譯名，如上例，儘量採用相同的同音字。至於同一原文，自然在本書里只有一種譯音法。

有些冠詞我們為了方便而採用譯意，如“變”、“別”等；但有些我們卻採用了譯音，如“依立屈羅型”與“德里阿型”等。

翻譯時為了統一譯名，我們採取了先譯好目錄與索引，然後在進行翻譯時，再從索引的譯稿找得統一的譯名。這個翻譯的索引，現在實質上成為本書的“俄中名詞索引”。其內容按照中文名詞的首字筆劃編排，並舉出頁數者，成為“中文名詞索引”。“中文名詞索引”中加註俄文的名詞，乃是不見於原索引、亦不見於“俄中名詞索引”的名詞。

總之，關於譯名問題，我們盡我們的力量做了，缺點還是很多的。但是我們以為本書的翻譯，對於中文的化學命名工作，也可能有一些幫助，因為它給了命名工作一個實際的考驗。倘若因此而使中文的化學命名工作向前推進一步，那也可算是我們的收穫之一了。

參加本書翻譯工作的計有：上海第一医学院藥学系有机化学教研組的袁开基、薛芬、費楚华三人以及北京中国医学科学院藥物系的單長生、陶权二人，所以是分成上海和北京兩組进行翻譯的。北京組担任的是第七章至第十一章，其中第七章至第十章由單長生执笔，第十一章由陶权执笔。其余部分包括序言、目录和索引等等都是由上海組担任的。我本人譯了譯本74頁以前的材料，还譯了原書的索引。故正文第一章由我执笔，第二章由我与薛、費、三人执笔，第三、四兩章由薛芬执笔，第五章由費楚华执笔，第六章由薛、費二人执笔。她們倆还編排了譯本的索引。又全部譯稿中非我个人所譯的部分，也都經我逐字逐句审校，所以我个人是应負全書的主要責任的。

由于我們的水平所限，翻譯中的錯誤和缺点在所难免，希望讀者予以批評、指正。

袁开基

上海第一医学院藥学系
有机化学教研組

1956年7月15日

序

为了适应现在有机药物化学迅速发展情况，就需要有一本包括合成的和天然的药物（其中有生物碱、维生素、激素、配醣物、抗生素以及它们的合成类似物）的教学用的课本。现有的有关有机药物化学的课本，很有些是过了时的，而且不能充分保证培养熟练的专家，以应这日新月异精细的有机合成工业的需要；特别感到的是，几乎完全没有关于杂环族药用化合物（其中有許多近代最主要的药剂）的有系统的文献。因此“有机药物化学”首先出版关于杂环化合物的部分是适宜的。这部分包括抗生素的化学，虽然不是一切抗生物都是杂环族衍生物。将抗生物分别作为一个独立部门，是因为它们的来源特殊，且有基本共同的制造方法（生物合成）。大概最近的将来，把抗生素作为药物化学的一个特别部门，将会失去其意义；更恰当的办法，是把它们按照化学分类，作为族类的代表，与其他药物一併来考虑。从高等植物中取得大量新的抗生素以及其他一些事实，会消除抗生素、生物碱和维生素之间的界限；而根据它们的化学性质研究，可以把它们归纳到这类或那类化合物里。

严格地说，维生素不是药物，而是生命必需的食物因子；但这类物质的代表，其所以要在本书内讨论，是因为它们在现代医学里已被广泛采用，与各式各样的特效药一样，用来治疗许多疾病。从它们的化学本质上看，维生素是很接近某些生物碱、抗生素和合成药物的。

药物化学之涉及脂肪族、脂环族和芳香族有机化合物者，将在本课程的后面部分论到，那里也将包括个别的杂环族化合物，由于某些理由，它们宜于在非杂环化合物里讨论，例如：巴比土类将作环型酰胺的代表论述，而维生素E和K，则作为含有叶绿醇基的化合物；在论到亚苯甲基代邻羟苯乙酮、环型衍生物时，将合併研讨黄色素母酮及其异构的哈尔孔（Халкон）等等。

因为有机药物化学这门专业课程，习读于普通有机化学和有机合成方法两门课程之后，本书在有些情况下，毋须详解个别反应的机理，但从所举原文文献，可以详细了解到有关的问题。

在编写本书的时候，著者尽量采用苏联研究者和苏联本国工业上的新成就。

本书不便细述个别问题，因为这样可能成为丛书或论文。为了便利读者详细了解，著者收集了有关问题的文献，在每章之末列出了一张多少可算是详细的表，为了更具体化，在正文的适当处所，也标出所举文献之所在。

在叙述有关药理学和药物实际应用问题的时候，著者因为不是医学的专家，主要是利用相应的教科书、参考书以及散篇综合性论著。

著者

緒 論

近代有机化学發展的特点，乃是它更被划分成愈来愈多的独立部門。这不仅由于积聚了大量事实資料及实际需要，而且也与在研究个别类族的化合物时所引起的特殊問題有关。

正如由于在研究煤焦油产品过程中兴起了合成染料化学或由于研究聚合和聚縮反应的結果而产生高分子化合物化学一样，研究大量动物或植物来源的天然产物的結果就在有机化学中分辟了生物鹼化学，維生素化学、抗生素化学与甾体化学等等分枝。有机葯物化学及相应的制葯工業是为了适应那种需要广泛、全面研究与合成的、具有生理作用的天然化合物及其类似物或同系物的实验医学不断增长的要求。天然产物，特别是嗎啡鹼、奎宁鹼、咖啡鹼及其他生物鹼的研究对近代合成葯物化学的形成是具有特殊重要意义的。

下面是几种重要生物鹼的發現紀年表，这些生物鹼的研究促进了合成葯物化学的發展。

| 生物鹼名称 | 年 份 | | | 与生物鹼研究相关的 葯物化学范畴 |
|-------|------|------|------|---------------------|
| | 發 現 | 結構决定 | 合成实现 | |
| 嗎啡鹼 | 1806 | 1925 | 1952 | 麻醉葯，止痛葯，鎮靜葯 |
| 吐根鹼 | 1817 | 1949 | 1950 | |
| 咖啡鹼 | 1819 | 1883 | 1900 | 中樞神經兴奋葯 |
| 奎宁鹼 | 1820 | 1907 | 1945 | 化学治疗(抗瘧)及退热葯 |
| 颠茄鹼 | 1833 | 1897 | 1901 | 鎮痙葯 |
| 古柯鹼 | 1860 | 1898 | 1902 | 局部麻醉葯 |
| 毒扁头鹼 | 1864 | 1925 | 1935 | } 副交感神經葯 |
| 毛茛芸香鹼 | 1875 | 1930 | 1933 | |
| 麻黄鹼 | 1887 | 1893 | 1915 | 交感神經葯 |
| 寇拉令鹼 | 1895 | 1935 | 尚未合成 | 减弱肌肉的物質 |

有机葯物的發展与其他有关化学部門，特别是天然染料、合成染料及其中間体化学的發展有密切关系，同时也与其他科学如生物学及医学等有关。

由于系族的連貫性、許多性質的共同性、研究与制备(包括生产)方法的类似性及一系列的其他因素，目前可將下列各种物質归納于同一复杂有机化合物类族：

1. 染料；
2. 葯物 (天然的与合成的，包括生物鹼、維生素、激素与抗生素)；

3. 香料 (天然的与合成的);

4. 有机照相材料;

5. 用于各种工业的复杂有机化合物如增韧剂、抗氧化剂、乳化剂等。

这些物质的制造工艺, 由于它们的特殊性及复杂性, 常称为精细化学工艺。

复杂有机化合物的工业生产的特征是许多中间体的共同性及工艺过程的近似性。

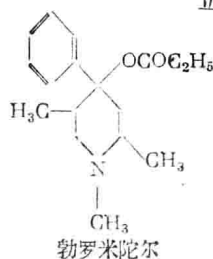
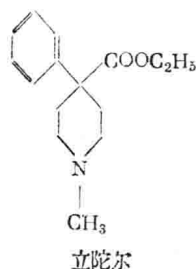
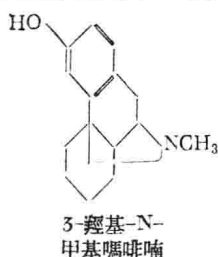
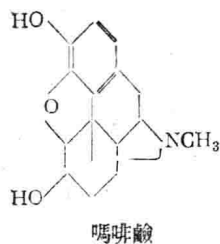
因此, 有机药物化学是复杂有机化合物化学的一部分。

在帝俄时代, 药物化学方面的系统研究几乎是沒有的。但是, 創造了有机结构理論的 A. M. 布特烈罗夫 (1828—1866), 第一次由硝基苯制得苯胺并創始人工合成染料的 H. H. 齐宁 (1812—1880) 的卓越发现, A. A. 沃斯克烈斯基 (1809—1880) 和 A. H. 威什涅格拉德茨基 (1851—1880) 在生物碱结构式方面的研究, 发现维生素的存在及其重要性的 H. И. 盧宁 (1854—1937), 证明叶绿素在植物光合作用中作用的 K. A. 提米利亞捷夫 (1843—1920) 及其他很多俄国科学家在化学及生物学方面的研究成就, 促进了自然科学包括生物活性和生物上重要的物质的化学之发展。可是, 帝俄时代沒有自己的制药工业, 巨大的原料潜力并没有被充分地利用。药物的需要几乎完全依赖进口来满足。

在苏维埃政权下, 情况显著地改变了。在苏联, 保健事业完全依靠本国制药工业, 而此项工业在短短的前三个五年计划内已成为工业中的一个先进部门了。

必需指出, 苏维埃制药工业的发展不仅速度是空前的, 而且发展过程也是

重要药用生物碱



独特的。例如在国外藥物的生产往往仅是合成染料工業的附屬品，而苏联的制藥工業則是按照完全独立的行業存在及發展的。

我們制藥工業的重要特点很明显地是傾向于合成，这不仅因为那些在苏联并不生長的热帶植物藥的主要成份需要用合成法来制取，而且也是因为試圖改变天然产物的結構，改进它的治疗效力而制备新的高效能藥物的緣故。

制藥工業的成就是与我国化学方面的成就是分不开的。在俄国卓越的有机化学家 A. M. 布特烈罗夫、H. H. 齐宁、B. B. 馬尔科夫尼科夫、A. E. 契契巴宾、A. E. 法沃尔斯基、H. Д. 捷林斯基等的工作基础上，我国科学家的研究成就已將苏联藥物科学提高到世界先进水平了。

在最近以前（20—25 年以前）大部分的藥物还是从天然資源提取或半合成的（从植物中提取生物鹼，从各种动物臟器制剂制取激素）。目前多数藥品則由合成方法制得，不仅合成了生物鹼，激素、維生素、氨基酸等的代用品，而且还进行了許多复杂天然产物的合成。例如医用維生素 C、B₁、B₂、B₆、B_C 等的需要，已完全由合成物来滿足。同样地，天然抗生素氯霉素已完全被合成的左旋霉素和合霉素来替代；合成的罌粟鹼、麻黃鹼和其他制剂都已大量生产了。

現在多数有实用价值的生物鹼已有了代用品（見圖解 1），而在某些情况下，合成品的治疗价值已超过了天然产品。

举个例說，3-羥基-N-甲基嗎啡喃、勃罗米陀尔和其他嗎啡代用品，在它們的分子中都含有嗎啡結構的基础。这些化合物比較簡單，合成也較易，而其在医学上的效用并不遜于嗎啡，并在很多情况下超过嗎啡。

的合成代用品

圖解 1

