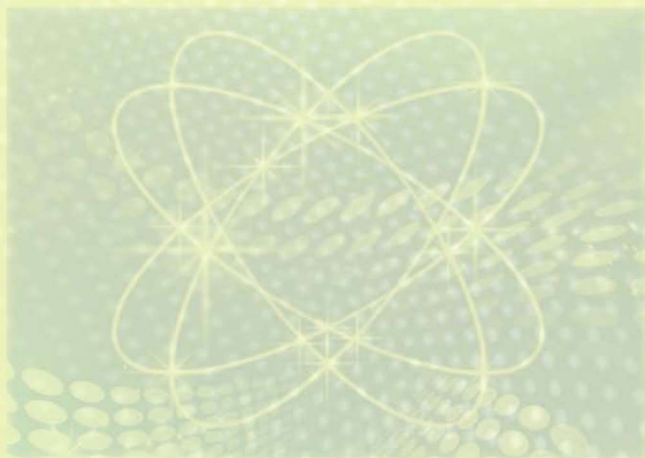


病魔克星——药物化学漫谈

李仁利 著



湖南教育出版社

图书在版编目 (CIP) 数据

病魔克星：药物化学漫谈/李仁利著. —2 版.

—长沙：湖南教育出版社，2012.4

(走近化学/宋心琦主编)

ISBN 978-7-5355-2634-2

I. ①病… II. ①李… III. ①药物化学—普及读物

IV. ①R914-49

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2012) 第 072922 号

从 书 名 走近化学

书 名 病魔克星——药物化学漫谈

作 者 李仁利 著

责任编辑 李小娜 阮 林

责任校对 崔俊辉

出版发行 湖南教育出版社出版发行 (长沙市韶山北路 443 号)

网 址 <http://www.hneph.com> <http://www.shoulai.cn>

电子邮箱 228411705@qq.com

客 服 电话 0731-85486742 QQ 228411705

经 销 湖南省新华书店

印 刷 湖南天闻新华印务邵阳有限公司

开 本 710×1000 16 开

印 张 15

字 数 151 200

版 次 1998 年 10 月第 1 版 2012 年 1 月第 2 版第 1 次印刷

书 号 ISBN 978-7-5355-2634-2

定 价 30.00 元

20 世纪 90 年代，在新的全球性科学技术发展高潮和随之而来的激烈竞争初现端倪之时，湖南教育出版社的《科学家谈物理》、《科学家谈生物》、《走近化学》、《化学·社会·生活》等丛书陆续出版，在当时为数不多的原创学科科普中，其内容的新颖、作者阵容的强大、语言文字的生动堪称首屈一指。这套学科科普凝聚了当时物理学、生物学、化学领域的大家们的远见卓识和汗水心血。以“大科学家写科普”的严肃认真的态度和细腻别致的情怀，为当时的青少年——21 世纪的主人们在接受基础教育的同时，扩展科技视野，了解学科现状和发展趋势提供了一条最权威、最前沿、最贴近的通道。大家们字里行间所流露出来的对科学世界的向往与痴迷、对科学事业的热爱和虔诚，也深深地感动和影响了一代青少年。

二十余年之后，我们选择以“中国原创科普经典”的名义再次整理出版这套科普则有着非凡的意义。其一是原创的弥足珍贵。这么多大科学家的学识、思想、精神汇聚于此实属不易。时至今日，这其中的许多人已经离开我们，但他们的所著所言却是具有恒久长远的生命力的。这些原创于今时今日的我们，其珍贵是不言而喻的。其二是经典的不可复制。科学技术的发展日新月异，这套科普所展现的有些内容也许不是如今最前沿的知识，但它所记录的是这个发展过程中不可或缺的一步或几步，它已经成为经典。因此除了将某些符号和计量单位与现在的规定接轨外，我们没有做大的改动，选择尽量保留它的原貌。其三是精神的代代传承。这些著名的科学家们不仅深入浅出地讲解了科普知识，更自然由衷地表达着对科学的热爱与敬畏，这些精神的甘露润物细无声。我们真心期待 21 世纪的青少年朋友们也能悉心来感受和传承，向伟大的科学和伟大的科学家们致敬！

需要说明的是，时隔多年，有些作者如今已经离世，有些作者现在已经联系不上，但我们一直在努力寻找中。如果有作者或作者的家人、朋友获悉我们再版这套书的情况，请跟我们联系，我们一并付酬致谢。

20 世纪即将过去，日益临近的 21 世纪的脚步声已经清晰可辨。世界各国为迎接新世纪而制定的种种规划即将逐一付诸实施，新的全球性科学技术发展高潮和随之而来的激烈竞争已初见端倪，“山雨欲来风满楼”是世纪之交的科技发展与竞争态势的最佳写照。为了帮助青少年朋友在未来的竞争中迎接挑战，把握机会，继《科学家谈物理》、《科学家谈生物》等丛书之后，湖南教育出版社又推出了一套《走近化学》丛书。这套丛书，对于帮助今天的青少年——21 世纪的主人们，在接受基础教育的同时，扩展科技视野。了解化学的现状和发展趋势，明确化学家的任务和责任，是大有裨益的。因此，湖南教育出版社的这一远见卓识，理所当然地得到中国化学界的广泛响应和支持。中国化学会的积极参与和丛书编委会的组成，则保证

了这套科普读物出版计划的顺利实施。

化学是这样的一门科学：苍茫宇宙中浩瀚的物质世界，在化学家看来，不过是千百万种化合物的存在与组合，而且是由为数不多的几十种常见元素所组成。它们之间的差别，仅在于元素的种类、原子的数目和原子构建成分子（或构建成晶体等）时方式的不同而已。

化学是这样的一门科学：化学反应，其机理几乎是各有千秋，对反应条件又极其敏感，以致对于一些化学现象，人们有时不免众说纷纭，莫衷一是。但是化学反应所遵循的最基本的物理定律，却屈指可数，简单明了。

化学是这样的一门科学：它与其他学科和新技术的发展提供了必要的物质条件，但在社会对新技术成就的一片赞扬声中，它却甘于默默无闻。

化学是这样的一门科学：它和其他学科的相互交叉与渗透日益深化，新的化学分支学科层出不穷，但是化学的理论基础却离不开化学元素论、元素周期律、化学键理论和物质结构理论。

化学是这样一门科学：除非你已经学会透过宏观现象辨析原子、分子行为的思维方法，并熟悉化学所用的语言和语法规则，否则尽管在实际生活中化学和人的关系是如此的密不可分，可是在很多人的心目中，化学却显得那么

的陌生和遥远。以致有些人在充分享受化学对现代物质文明所作的种种贡献的同时，会不公平地把现代文明社会中的失衡与灾难的责任，归之于化学！

统计资料表明，世界专利发明中有 20% 与化学有关；发达国家从事研究与开发的科技人员中，化学与化工专家占一半左右；化工企业产品的更新换代依靠化学的进步，而化工产品的产值和出口比例在国民经济中一直保持着领先的地位。这些数据足以证明化学在社会发展和提高人民生活质量中具有重要作用。

因此，这套《走近化学》丛书的任务，是通过向广大青少年读者介绍生动有趣的化学现象、引人入胜的化学成就和辽阔无垠的化学前景，消除广大读者对化学的陌生感和因此产生的畏惧心理。作者们在字里行间有意或无意流露出来的对科学世界的痴迷和对科学事业的虔诚，都会引起读者的共鸣。你会和作者一样，产生出一种在知识海洋中遨游时清风拂面、心旷神怡、与大自然融为一体的快感，使自己的聪明才智得到进一步的培育，使自己的志趣得到进一步的提炼和升华。这套丛书取名为《走近化学》，正是呼唤我们向化学走近！

经过三年的努力，《走近化学》丛书的第一辑终于和广大青少年朋友见面了。丛书共分三辑，预计在 2000 年

全部完成。

编委会衷心感谢中科院院士、原中国科学院院长、著名化学家卢嘉锡教授及中科院院士、著名化学家张青莲教授慨允为丛书题词。衷心感谢中科院院士、原中国科学院副院长、著名材料科学家严东生教授代表中国化学会为丛书作序。对湖南教育出版社的领导及担任责任编辑和编委的李小娜、阮林，以及中国化学会的领导及办公室工作人员为丛书所作的指导和支持，在此一并表示谢忱。

亲爱的青少年朋友们，如果这套丛书能够有助于你摆脱常年在题海和应试的桎梏下产生的几丝无奈，为迎接明天而主动地学习，从而使你的生活与学习走向一片更加灿烂与广袤的天地，我们将会感到无比的欣慰。我们坚信，科学可以使人变得更加聪明而坚强。“欲与天公试比高”将是 21 世纪中华青少年的风采！

《走近化学》编委会

（宋心琦执笔）

1997 年 8 月

内 容 简 介

早期的药物发现和研究与化学学科的发展有密切的关系。随着各学科的发展，当今的药学已是化学、生命科学、计算机化学等多学科的综合体现。为了反映当今药学的状况，提高读者对药物的使用和对药物在治疗疾病中的重要性的认识，本书选择、介绍了药物的一般知识、麻醉药、抗微生物药、抗生素、抗肿瘤药和药物的结构与生物活性关系等六个方面的内容。书中对一些著名学者的成功业绩和他们的思考方法也作了一些介绍，希望能让读者在增加药学知识的同时在思维方法上也有所启发。

序 言



嚴东生

由中国化学会和湖南教育出版社共同组织、约请著名化学家撰写的《走近化学》丛书，是我国近年来为满足青少年读者了解化学和学习化学的需要而出版的一套科普丛书。其内容覆盖面之广，作者阵容之强，是多年来罕见的。丛书的选题不仅紧密结合科学技术发展的实际，更着重于作者和读者之间思想和体会的交流。加以文字流畅，内容新颖并富有趣味，我相信它必将成为广大青少年的良师益友。对于有志于从事科学技术工作的青少年，则更有启迪和激励的作用。

21 世纪即将来临，目前尚处于发展中国家之列的中国，在未来几十年里世界高新科技的发展与竞争中，将面临极其严峻的挑战。化学不仅会和其他学科一样，保持着自 20 世纪 50 年代以来的迅猛发展势头，而且和生命、信息、材料与环境等科技领域的相互渗透也会日益

深入。了解化学和应用化学的水平将对社会生产力的发展和人民生活质量的提高起着关键的作用，化学基础知识也将成为充实新世纪公民基本素质的重要内容之一。因此，《走近化学》丛书的问世所起到的积极作用，一定会得到社会各界的支持和肯定，也一定会受到广大青少年读者的欢迎。

《走近化学》丛书涉及现代化学的多个侧面，介绍了人们在这些领域内的最新成就，反映了作者对该领域未来发展的精辟见解。它将有广大青少年读者开阔视野，激起他们对科学技术工作的兴趣，提高他们对科学技术推动社会发展的重要作用的认知。对于有志于从事科学技术的青少年读者则更能起到启蒙的作用。当然，科学技术事业的发展，要依靠千百万科学技术人员的辛勤劳动和杰出科学家的殚精竭虑与艰苦实践，不可能一蹴而就。我们应当从丛书中所展示的前辈科学家所经历过的失败与成功的史实中吸取经验与教训，以增强我们积极参与国际科学技术领域竞争的自信心和力量。

光阴荏苒，岁月蹉跎，在新的世纪里，振兴中华、造福人类的历史责任已无可推卸地落在今天青少年一代人的肩上。年轻的朋友们，先进的科学技术像明日的朝阳一样，将由你们用双手高高托起！

1997年9月

前言



药物是用于治疗、预防和诊断疾病所用化学物质的总称。它的来源很广，有来自植物、动物或矿物的，也有化学合成的，还有一些是诸如血清、疫苗等生物制品。尽管有些药物的有效成分还不清楚，或化学结构尚未阐明，但绝大多数药物的化学结构是清楚的。尚未搞清有效成分或化学结构的药物，它们也应该都是化学物质。

自有疾病以来，人类就在寻找治疗疾病的方法。最早用于治病的药物主要来自天然物，因而有“神农尝百草”这样美丽的传说，后来又有李时珍所编撰的《本草纲目》，这是一本世界上最早的“天然药物百科全书”。19 世纪化学的发展，开始出现一些人工合成的新物质供治疗疾病选择。有一些简单的化合物曾用作药物，如氧化亚氮 (N_2O)、乙醚、氯仿等用作麻醉剂，苯酚用作消毒药物等。随着化学科学和化学工业的发展，人们可以合成比较复杂的化合物后，药物的来源就又拓宽了，例如可以从染料和染料中间体中寻找能治病的化合物。这种情况一直延续至 20 世纪 50 年代。从而形成一种共识，即化学是药学

的发展基础。于是人们以化学的观点、化学的规律来看待药学中的现象，解决药学中的问题。化学的发展推动了药学的发展，而且今后化学仍将是药学的一个重要基础。

但是药学终究不等于化学，因为药物作用的对象是生物体（无论是人体还是病原体，都是生物体），这和化学就不同了。药物为什么能治病？药物是怎样治病的？药物需要怎样的结构才能更好地治病？要回答这些问题就不是单纯依靠化学所能完成的了。

生物学科包括细胞生物学、分子生物学、微生物学、免疫学、生物化学、生理学、药理学等学科对受体的揭示及人们对生物体内各种酶、辅酶、DNA 作用的了解，使药物作用的机制逐渐得到阐明，也对寻找新药提供了新的方法和思路。随着人类对体内生物活性物质的分离和作用的了解，以及发病机制的逐渐认识，为设计新药提供了新的作用靶点。例如，对调节血压因素的深入认识，使得钙拮抗剂、血管紧张素转化酶抑制剂、肾素抑制剂等新型降血压药相继问世；对体内胆固醇生物合成机制的研究，导致了 HMGCoA 抑制剂的产生。这些药物的出现，为治疗心血管系统疾病提供了更为有效的方法。人们通过对药物在体内过程的研究，结合物理化学发展了新的药物剂型和给药系统。计算机辅助设计方法应用于药物研究后，发展出计算机辅助药物设计的学科。当今的药学已经发展成为化学、生物和生命学科、计算机化学协同作战的领域。

药物在治疗和预防疾病方面起着非常重要的作用，但人们却一直未给以足够的重视。人们在疾病治愈后总是感谢医生的医术高超，殊

不知医生若手中无药恐怕也是难有作为。为了改变“重医轻药”的传统观念，本书特意选择叙述了几类疾病的攻克过程——在发现有效的药物之前，这些疾病肆虐横行，曾夺去千万人的生命，当时的名医也因无药而束手无策；而在发现有效的药物后，疾病立即得到控制——以此来突出药物所起的作用。本书还特意选择麻醉药来说明外科医生在没有麻醉药时的困境。虽然这些药物的发现是多学科研究人员，其中也包括医生在内，相互配合的结果，但化学家在其中起了很重要的作用，甚至是关键的作用。抗肿瘤药虽然在肿瘤的治疗中，所起的作用不像抗菌药那样有“扭转乾坤”的能力，但这类药能很好地体现各学科在解决肿瘤治疗中的“协同作战”情况，故在本书中也列为一章。

药物大致可分为机能性疾病治疗药、化学治疗剂（治疗病原性疾病的药）和治疗辅助剂。本书由于篇幅所限，所选内容刚好多集中于化学治疗剂，而对机能性疾病治疗药物未加介绍。为避免误解，特作以上说明。

人们一般对药物和正确使用药物等方面的知识缺乏了解，故在本书的第一章对药物、药物的剂型及正确使用药物等方面作了一些介绍。

药物的构效关系是药物化学学科的精华部分，也能体现药物与化学的密切关系，希望能通过这部分内容的介绍，提高读者对药学的兴趣。

书中对一些著名学者的成功业绩和他们的思考方法也作了一些介绍，希望能对青少年读者在增长药学知识的同时在思维方法上也有所启发。

目录

走近化学 · 病魔克星

前言 /001

1 保护人体健康的无名英雄——药物 /001

- 1.1 药物——神圣的商品 /002
- 1.2 药物使用中的学问 /005

2 外科学发展的先决条件——麻醉药 /014

- 2.1 外科医生令人讨厌的时代 /014
- 2.2 第一种麻醉药——笑气 /016
- 2.3 乙醚应用于外科手术 /022
- 2.4 氯仿也是一种麻醉剂 /028
- 2.5 寻找新麻醉剂 /031
- 2.6 寻找局部麻醉药 /035
- 2.7 麻醉药的功劳 /043

3 向致病微生物宣战 /045

- 3.1 由染色引发的“魔弹”遐想 /047
- 3.2 染料和药物联姻 /057
- 3.3 “白色瘟疫”及治疗药物的发现 /072

4 神通广大的抗生素 /080

- 4.1 青霉素的发现 /081
- 4.2 青霉素的化学 /090
- 4.3 发现头孢菌素 /096
- 4.4 抗痨抗生素——链霉素 /099
- 4.5 抗生素爆炸 /103
- 4.6 神通广大的抗生素 /106

5 与癌症搏斗的化学卫士 /108

- 5.1 癌是怎样产生的 /109
- 5.2 抗癌药物 /128
- 5.3 肿瘤细胞的耐药性 /172
- 5.4 生物疗法 /173
- 5.5 期待与希望 /183

6 药物的化学结构与生物活性间的关系 /186

- 6.1 对化学结构与生物活性关系的认识 /187
- 6.2 受体学说 /191
- 6.3 药物的理化性质与生物活性的关系 /202
- 6.4 药物的立体结构与生物活性的关系 /208
- 6.5 定量构效关系 /217

结束语 /219

保护人体健康的无名英雄 ——药物

有病就要看医生，这已经是基本常识了。但是如果没有药物，医生的医术再高，恐怕也会束手无策，这就好比是“巧妇难为无米之炊”。也许有人会说，外科医生凭一把手术刀就能治病。其实不然，外科手术如果没有麻醉药和消毒药，那将会是什么情况？这些内容我们将在后面的章节中介绍，这里就不重复了。因此，发明药物和制作药物的人就成了保护人类健康的无名英雄。

符合质量标准的药物可以起到保护人类健康的作用，但是假药和劣质药却会危害人类的健康和生命。正确并合理地使用药物可以治疗疾病，挽救危重病人的生命，不合理地使用药物常常会造成药害，甚至会造成重大医疗事故，所谓“庸医杀人”，确有其事。