

全国高等医药院校试用教材

(供药学专业用)

药物化学

四川医学院主编

人民卫生出版社

全国高等医药院校试用教材

(供药学专业用)

药 物 化 学

主 编 单 位

四 川 医 学 院

编 写 单 位

上海第一医学院 北 京 医 学 院

沈 阳 药 学 院 南 京 药 学 院

四川医学院

人 民 卫 生 出 版 社

药 物 化 学
四 川 医 学 院 主 编

人 民 卫 生 出 版 社 出 版
四 川 新 华 印 刷 厂 印 刷
新 华 书 店 北 京 发 行 所 发 行

787×1092毫米16开本 39印张 4插页 910千字

1981年1月第1版第3次印刷

印数：17,301—21,100

统一书号：14048·3770 定价：3.05元

编写说明

本书是由卫生部组织有关高等医药院校编写的试用教材，供药学专业使用。

本教材内容在总体安排上，除绪论外，分为各论及通论两篇。各论篇的系统主要是按药物效用分章，再按药物的化学结构分类。主要讨论药典收载化学药物的发展、类型、制备路线、理化性质和必要的构效关系，侧重于药物的理化性质和必要的构效关系。通论篇是对各论的系统总结，着重于化学结构与理化性质的关系和提高药物效力、克服药物毒副作用的化学结构修饰方法，使学生在各论基础上获得某些规律性的认识，并对药物的化学结构与生理活性的关系作较为系统的讨论。

各院使用本书时，可根据教学安排，选定讲授章节，使学生掌握本门课程的基本理论、基本知识和学习方法，其余各章供学生自学参考。

本书由四川医学院主编，参加编写的有上海第一医学院、北京医学院、沈阳药学院、南京药学院和四川医学院。初稿完成后，蒙朱廷儒教授、彭司勋教授和李正化教授评审，特此表示感谢。

本书系试用教材，限于编著者水平以及时间紧迫，错漏之处，在所难免，请各院校在使用过程中不断总结经验，提出宝贵意见，以便进一步修订。

药物化学教材编写组

1979. 3

目 录

绪论	1
一、药物化学的研究对象和任务	1
二、药物化学的近代发展与我国药物化学事业的成就	2
三、化学药物的质量和质量标准	5
各论	9
第一章 麻醉药	9
第一节 全身麻醉药	9
一、吸入麻醉药	9
二、静脉麻醉药	13
第二节 局部麻醉药	15
一、苯甲酸酯类	17
二、对氨基苯甲酸酯类	18
三、酰胺类	22
四、化学结构和局麻作用的关系	25
第二章 镇静、催眠、抗癫痫及安定药	26
第一节 巴比妥类及其同型物	26
一、巴比妥类药物的一般合成法	27
二、巴比妥类药物的一般性质	28
三、典型药物	30
四、构效关系	33
第二节 乙内酰脲类及其同型物	36
第三节 氨基甲酸酯类	40
第四节 吩噻嗪类及其类似物	41
第五节 苯并二氮杂革类	46
第六节 丁酰苯类	51
第三章 解热镇痛药及抗炎药	53
第一节 解热镇痛药	53
一、水杨酸类	54
二、酰苯胺类	57
三、吡唑啉酮类	59
第二节 抗炎药	65
一、芳基烷酸类	65
二、吲哚及吲哚啉类	67
三、吡唑烷酮类	70
四、邻氨基苯甲酸类	73
第四章 镇痛药及镇咳祛痰药	75
第一节 镇痛药	75

一、异噻啉类·····	77
二、苯基哌啶类·····	83
三、氨基酮类·····	85
四、苯吗喃类·····	87
五、吗啡烃类及其它镇痛药·····	89
六、结构与疗效关系·····	91
第二节 镇咳祛痰药·····	93
第五章 中枢兴奋药及利尿药·····	99
第一节 中枢兴奋药·····	99
一、黄嘌呤类·····	99
二、吡啶酰胺类·····	102
三、苯氧乙酸酯类·····	103
第二节 利尿药·····	106
一、有机汞利尿药·····	106
二、磺酰胺类利尿药·····	108
三、含氮杂环类·····	113
四、 α, β -不饱和酮类·····	116
第六章 解痉药及肌肉松弛药·····	118
第一节 解痉药·····	118
一、颠茄生物碱类·····	118
二、合成解痉药·····	121
第二节 肌肉松弛药·····	126
一、生物碱类肌肉松弛药·····	127
二、合成肌肉松弛药·····	128
第七章 拟肾上腺素药·····	133
第一节 苯乙胺类拟肾上腺素药·····	133
第二节 苯异丙胺类拟肾上腺素药·····	141
第三节 化学结构与药效的关系·····	145
第八章 抗组织胺药·····	147
第一节 氨基醚类抗组织胺药·····	149
第二节 二胺类抗组织胺药·····	154
第三节 丙胺类抗组织胺药·····	159
第四节 抗组织胺药的构效关系·····	163
第九章 心血管系统药物·····	166
第一节 降血脂药·····	166
第二节 抗心绞痛药·····	169
第三节 抗高血压药·····	173
第四节 抗心律失常药·····	183
一、噻啉生物碱·····	183
二、胺基丙醇类·····	185
三、酰胺类·····	188

第五节 止血药	189
第十章 寄生虫病防治药	192
第一节 驱肠虫药	192
一、倍半萜类	192
二、噻嗪类	194
三、咪唑类	195
四、季铵类	196
五、酚类	197
第二节 血吸虫病及血丝虫病用药	200
一、血吸虫病用药	200
二、血丝虫病用药	203
第三节 抗疟药	204
一、奎宁	204
二、合成抗疟药	206
第四节 抗阿米巴药	211
第十一章 抗菌药	213
第一节 抗结核病药	213
一、对氨基水杨酸类	213
二、酰胺及酰胺类	216
三、乙二胺类	220
第二节 抗麻风病药	222
第三节 硝基呋喃类抗菌药	225
第四节 异噻唑类及萘啶类抗菌药	228
第五节 消毒防腐药	232
一、氯胺类	232
二、染料类	233
三、季铵盐类	237
四、双缩二脲类	238
第十二章 磺胺类药物	241
第一节 磺胺类药物的发展和命名	241
一、磺胺类药物的发展及其在药物化学上的重要意义	241
二、磺胺类药物的结构、命名和分类	242
第二节 磺胺类药物的理化性质	242
第三节 制菌机理和构效关系	246
第四节 典型药物	248
第十三章 抗菌素	258
第一节 概述	258
一、抗菌素的分类	258
二、抗菌素的生物合成	258
三、抗菌素的抗菌谱	260
第二节 β -内酰胺类抗菌素	260

一、青霉素	260
二、半合成青霉素	264
三、头孢菌素	270
第三节 氯霉素及其衍生物	272
第四节 四环素类	277
第五节 氨基糖甙类	281
一、链霉素	281
二、卡那霉素	282
三、庆大霉素	284
四、新霉素	284
五、巴龙霉素	285
第六节 大环内酯类	286
第七节 利福霉素及其衍生物	287
第八节 多肽、多烯类	289
一、多粘菌素	289
二、放线菌素	290
三、博莱霉素	290
四、制霉菌素	291
五、两性霉素B	292
第九节 其他抗菌素	293
第十四章 抗肿瘤药	297
第一节 烷化剂	297
一、氮芥类	298
二、乙烯亚胺类	306
三、磺酸酯及卤代多元醇类	307
四、亚硝基脲类	308
第二节 抗代谢物	310
一、嘧啶类抗代谢物	310
二、嘌呤类抗代谢物	312
三、叶酸类抗代谢物	314
第三节 生物碱	315
第四节 其他抗肿瘤药	318
一、双二酮嘧啶类	318
二、三氮烯咪唑类	319
三、甲基胍衍生物	319
四、丙脒脲和羟基脲	320
五、蒽醌素及羟基蒽醌素	321
第十五章 甾类药物	321
第一节 概论	321
一、甾类药物的结构和立体化学	321
二、甾类药物的命名	322
三、甾类化合物的常用反应	324

第二节 甾类激素药物	329
一、雌甾烷类药物及其合成代用品	329
二、雄甾烷类药物	332
三、孕甾烷类药物	337
第三节 甾类避孕药	349
第十六章 维生素	358
第一节 脂溶性维生素	359
一、维生素A	359
二、维生素D	362
三、维生素E	365
四、维生素K	368
第二节 水溶性维生素	370
一、维生素B ₁ 及其衍生物	370
二、维生素B ₂ 及其衍生物	374
三、维生素B ₆	379
四、烟酸衍生物	382
五、维生素B ₁₂ 类	383
六、维生素C	384
七、维生素U	388
八、其他维生素	389
第十七章 诊断用药及解毒药	391
第一节 诊断用药	391
第二节 解毒药	398
一、有机磷解毒药	398
二、砷和重金属解毒药	400
三、氰化物解毒药	404
第十八章 药用聚合物	406
第一节 葡聚糖类	406
第二节 司班和吐温	408
第三节 纤维素衍生物	410
第四节 离子交换树脂	412
第五节 聚硅氧烷类	414
第六节 其它药用聚合物	416
通论	419
第十九章 有机药物的化学结构与物理性质的关系	419
第一节 药物的化学结构与沸点和熔点的关系	419
一、化学结构与沸点	419
二、化学结构与熔点	421
第二节 药物的化学结构与药物的溶解度	425
一、溶剂的结构特征及其与溶解度的关系	425
二、溶质的结构特征与溶解度的关系	426

第三节 药物的化学结构与药物的臭和味	429
一、化学结构与臭的关系	429
二、化学结构与味的关系	430
第四节 药物的化学结构与药物的颜色	431
第五节 药物的化学结构与紫外吸收	434
第六节 药物的化学结构与红外吸收	436
一、药物的化学结构与红外吸收	436
二、有机药物红外光谱的解析	439
第二十章 有机药物的酸碱性	443
第一节 酸性药物的类型及酸性强度	443
一、酸性功能基的类型及酸性强度顺序	443
二、各类酸性药物	446
第二节 碱性药物的类型及碱性强度	450
一、碱性功能基的类型及其碱性强度顺序	450
二、各类碱性药物	452
第三节 影响药物酸碱性强度的因素	458
一、药物的化学结构与酸碱强度的关系	458
二、影响酸碱性的外部因素	467
第四节 多酸、碱功能基药物的酸碱性强度	468
第二十一章 药物的水解性	472
第一节 具水解性药物的类型	472
第二节 药物水解的影响因素	475
一、药物的水解速度与半衰期	475
二、药物的化学结构与水解性的关系	476
三、影响药物水解的因素	482
第三节 防止药物水解的方法	486
第二十二章 药物的氧化性还原性	489
第一节 药物的还原性	489
一、具还原性药物的类型	489
二、药物氧化的类型及机理	491
三、药物发生自动氧化可能性的估计	494
四、化学结构与还原性的关系	494
五、影响药物自动氧化的因素	498
六、防止药物自动氧化的方法	501
第二节 药物的氧化性	503
一、具氧化性药物的类型	503
二、药物的化学结构与氧化性的关系	504
三、外界因素对氧化能力的影响	506
第二十三章 有机药物的化学结构修饰(一) 成盐反应	507
第一节 成盐反应在药物化学结构修饰中的作用	508
第二节 成盐反应的类型及其特点	510

第三节 水溶性盐类药物的制备	514
一、选择成盐试剂的原则	514
二、制备方法的一般讨论	516
三、典型盐类药物的制备	517
第四节 延效用水不溶性盐类的制备	521
第二十四章 有机药物的化学结构修饰(二) 成酯反应	523
第一节 成酯修饰的作用	523
第二节 成酯修饰药物类型	527
第三节 成酯反应影响因素	531
一、成酯试剂化学结构对反应活性的影响	532
二、反应条件的影响	533
第四节 典型药物的成酯修饰和制备	537
一、氯霉素成酯修饰和药物前体制备	537
二、苄基青霉素的成酯修饰和药物前体制备	540
三、水杨酸成酯修饰和药物前体制备	541
四、氟奋乃静的成酯修饰和药物前体制备	543
五、孕酮成酯修饰和药物前体制备	543
六、羧苄青霉素成酯修饰和药物前体制备	545
第二十五章 有机药物的化学结构修饰(三) 酰胺化反应	547
第一节 酰胺化修饰的作用	547
第二节 酰胺化剂类型及酰胺化反应影响因素	551
第三节 典型药物的修饰和制备	555
第二十六章 有机药物的精制处理	559
第一节 药物的杂质来源	559
第二节 药物的精制方法及其特点	561
第三节 药物的精制处理	563
一、提高药物质量的精制处理	564
二、变质药物的精制	566
三、青霉素的质量问题及精制方法	567
第二十七章 有机药物的化学结构与药效关系	570
第一节 药物发生药效的决定因素	571
第二节 理化性质对药效的影响	572
一、溶解度对药效的影响	573
二、解离度对药效的影响	574
第三节 药物代谢过程中的构效关系	576
第四节 药物与组织或受体相互作用的构效关系	579
一、电子密度分布的影响	579
二、立体因素的影响	583
第五节 药物与受体形成复合物发生药理作用时的构效关系	587
一、药物与受体可逆性结合时的构效关系	587
二、药物与受体不可逆结合时的构效关系	591

第六节 定量结构—活性关系和药物设计.....	593
中文药名索引	595
外文药名索引	603

绪 论

一、药物化学的研究对象和任务

恩格斯教导我们：“每一门科学都是分析某一个别的运动形式或一系列互相关联和互相转化的运动形式的，因此，科学分类就是这些运动形式本身依据其内部所固有的次序的分类和排列，而它的重要性也正是在这里。”毛主席进一步指出：“科学研究的区分，就是根据科学对象所具有的特殊矛盾性。”药物化学是一门什么性质的科学？研究对象的特殊的矛盾性是什么？

具有治疗、缓解、预防和诊断疾病，以及具有调节机体功能的化合物称作化学药物。用辩证唯物主义观点和方法，研究化学药物的化学结构、理化性质、化学制备以及化学结构与药理效力相互关系，并研究寻求新药的途径和方法的一门学科，便是药物化学。显然它是应用化学的一个分支，也是一门与生物化学、药理学等生理科学相互联系而又相互促进的边缘科学。

药物化学的主要任务有三方面：(1)为有效地利用现有药物提供理论基础。深入研究药物的化学结构与理化性质的关系，药物的构效关系，对药物的使用保存、剂型的选择和制备、分析检验，以及化学结构修饰等等提供必要的基本理论、基本知识和一些技能。(2)为生产化学药物提供经济方法和工艺。研究制造化学药物的新原料、新工艺、新技术、新方法和新试剂是主要内容。提高产品质量和产量，降低生产成本，是其中中心环节。把这些研究成果付诸生产实践，则是生产工艺学的范畴。近二十年来把这些方面独立成为化学制药工艺学。近年来一门新的学科分支——有机合成设计——已经建立。它是研究有机物合成的基本方法和规律的学科。它的发展在复杂天然有机化合物的合成中取得显著成效，将使药物的合成设计得到快速而有效的方法，从而获得经济合理的生产路线。(3)寻求优良新药，不断探索寻求新药的途径和方法。中西结合必能多、快、好、省地创制疗效好、毒性小、副作用少的新药。化学结构与药理效力相互关系的深入认识，分子生物学、分子药理学、量子化学、物理有机化学的移植和应用，都将使寻求新药的途径和方法获得有效的成果，从而导致更多新药的合成。一门新兴学科分支——新药设计——已经形成。

药物化学的主要任务和研讨内容既然是多方面的，作为药学专业学习的内容，必然应有更强的针对性，才能在短时间内加以熟习和掌握。根据药学专业培养目标要求，本书着重于第一及第三两个方面内容的讨论；对于药物合成则扼要地叙述。使在学习本课程以后，能熟悉常用药物的结构类型，并了解化学结构与疗效关系、寻求新药的途径与方法；熟悉化学结构与理化性质的关系及其规律性；熟悉常用药物的制备原理，药物杂质来源与制备的关系，化学结构修饰的基本方法，并有制备化学药物的基本技能。以便有效地利用现有药物，中西结合，为工农兵保健事业服务，为实现四个现代化服务，为创造我国新药学作出贡献。

二、药物化学的近代发展与我国药物化学事业的成就

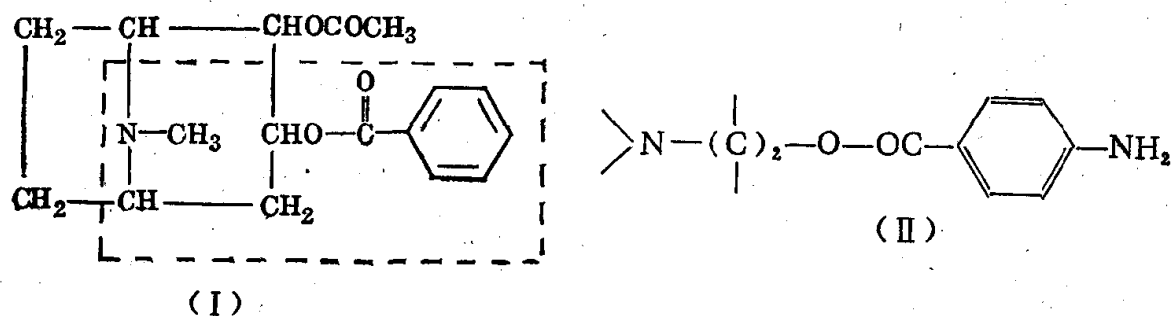
(一) 药物化学的近代发展

药物化学的建立和发展是以近代化学及化学工业的建立和发展为基础的。初期的药物化学是以从天然药物中提炼有效成分为其特点的。如从金鸡纳树皮里提炼抗疟药奎宁，鸦片里提炼镇痛药吗啡，古柯叶中提炼局部麻药古柯碱等等。这些都为认识化学药物提供了物质基础。

其后，染料化学及其他化学工业的发展，化学合成方法的日益进步，医疗上也要求更多更廉的药品，促使把许多化学工业产品特别是把染料及其中间体进行药理试验，发现它们的药效，导致化学药物范围的扩大，并初步形成药物的化学合成和工业生产。如从煤焦油分离出的酚具有抗菌效力，经过化学衍化，才有了肠道消毒药水杨酸苯酯(沙罗)的应用。染料中间体苯胺及乙酰苯胺的解热镇痛作用的发现，经过结构改造，导致对乙氧基乙酰苯胺(非那西汀)与对羟乙酰苯胺(扑热息痛)的临床使用。随着化学药物范围的扩大，化学合成方法的创新，药物合成工业也逐渐形成，积累了大量的药物合成知识及技术。药物合成理论也开始萌芽，沙罗原理便是当时著称的一种。药物化学也开始独立成为一门学科。

在大量感性认识的基础上，人们便考虑为什么一些化学药物会产生同一药效，而另外一些药物则产生其他生理效果。化学结构与药理作用的相互联系便提出来了。这种设想在药物化学发展史上是一个重大的进步。促使人们应用化学合成知识和技术，去寻求新的药物。由于当时科学水平的限制和世界观的不同，染料的基团学说便引用到药物化学中来。因此，药物的有效基团论便由此产生。它认为药物的药理效力是由分子内几个显特殊药效的基团所表现出来的生理活性，如由酚基、胺基(氨基)等等所引起。这种看法虽然认识到药物的疗效由客观存在的化学特定结构所引起，显示了唯物的论点。但却把复杂的化学结构仅仅归纳为几个显示药效的基族，忽视了药物分子的整体性，把局部当作整体，存在着机械论的缺点，阻碍了新药的创制。

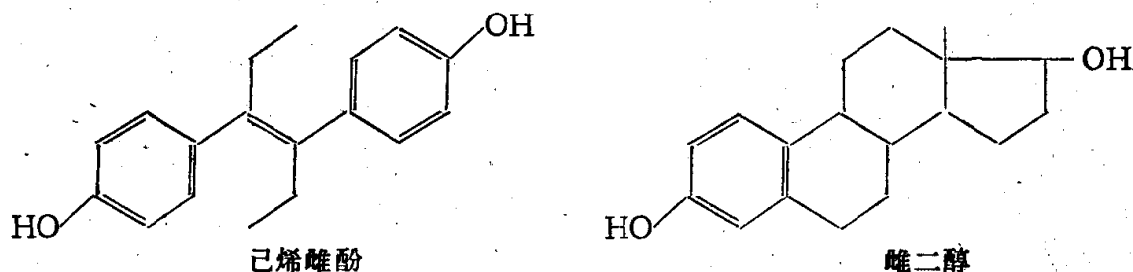
从天然药物分离出的有效成分，在化学结构认识以后，使人们用化学合成方法去改造它们，从而获得许多有效药物。如从古柯碱(I)的化学结构简化中，合成了对氨基苯甲酸羟酯及羟胺基乙酯(II)，具有局部麻醉作用。



复杂药物结构的简化，导致新的药物的制得，使人提出药物的“基本结构”的设想。认为化学药物中显示药理效力的不是某些功能基，而是某些特定的基本化学结构，如果这种特定结构改变，将会导致这一药效的减弱，甚至完全失去。这种特定结构上的适当变化，将使药效强度有所变化，而不会失去特定的生理活性。如古柯碱分子中苯甲酸羟胺

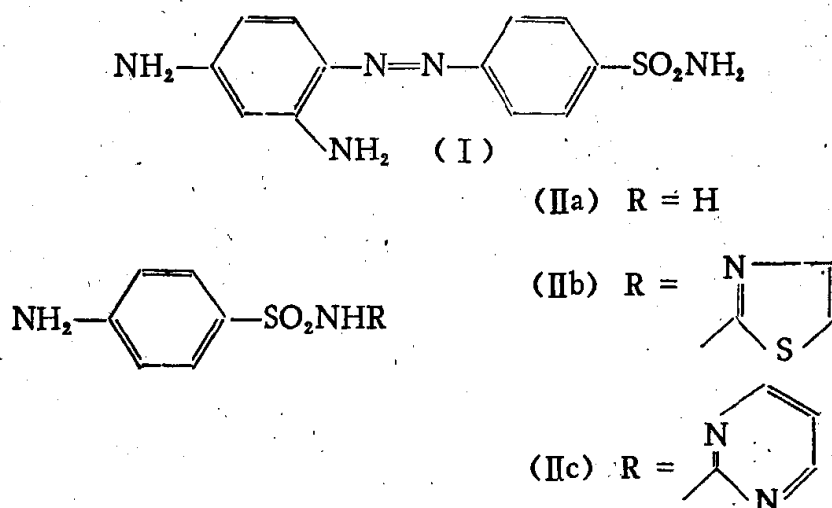
基羟酯〔(I) 中虚线所示〕是显示局部麻醉效力的基本结构。对氨基苯甲酸羟胺基乙酯的基本化学结构与它相同，故显示局部麻醉效力。这种寻求新药的设想和方法，重视了分子的整体性，因而在新药创制中，取得一些显著结果。但是，它忽略了药物与机体的统一性，没有从药物在机体内生理生化过程来考虑，因而单纯从化学结构来加以剖析和简化，构成新药合成中一种经验研究方法，不能多快好省地创制新药。

分离提纯方法及鉴定手段的进展，使人们认识更多的与机体代谢有关的化学物质，以及机体内的代谢物，发现它们的药理效力，并把它们用于临床治疗。如抗坏血酸（维生素C）、硫胺（维生素B₁）、维生素A、男性激素、女性激素等等。不仅扩大了化学药物的范围，也扩展了寻求新药的途径；在药物与机体的统一性上也带来了新的认识。在药物合成理论和技术上取得重大的进展。结构和疗效的关系也深入到分子的空间排列和大小。己烯雌酚和己烯雌酚的化学结构虽然与女性甾体激素（如雌二醇）不同，但它们却有着相近的空间结构，因而有相近的生理活性。



由于这些药物对人体代谢有密切关系，临床应用较为广泛，特别是维生素类药物，这就促使药物合成工业蓬勃发展，合成技术也日益创新。

红色百浪多息（I）治疗某些细菌性传染病获得成功后，发现它的抗菌活性是由于在人体内转变为对氨基苯磺酰胺（IIa）所引起，通过结构改造，找到了毒性较小的磺胺噻唑（IIb）、磺胺嘧啶（IIc）等等，发展成为磺胺类抗菌药。



经过人们的仔细研究，发现磺胺类药物的抗菌活性，是竞争性对抗细菌所必需的对氨基苯甲酸所参与的代谢作用的结果。从而创立了抗代谢学说。把寻求新药的途径和方法又推进了一大步，更促进了对化学药物生理生化过程的了解。

抗菌素的发现与发展、半合成抗菌素的兴起、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等都给化学药物开拓了新领域，化学合成和生产技术上带

来了新方法、新技术、新原料和新试剂，为药物化学的进一步发展打下了更为丰富的物质基础。药物合成工业已坚实地成为化学工业的一个重要分支。虽然这些药物大多从某一活性“母体”经过结构衍化而来，但是药物的构效关系已深入到药物如何达到作用部位并与生物大分子相互作用的范畴。定量构效关系已开始建立。药物设计开始成为一门新兴学科，从药物化学学科中逐渐分化出来。经验筛选方法的束缚正逐渐摆脱，预计方法逐渐被采用，从而能有计划、有选择地进行合成和筛选，避免大量人力物力的耗费。

机体是矛盾统一体。在生命的复杂变化中，它有着各种精巧的调节途径，存在动态平衡，以维持生命过程的正常运行。如果某一环节失调，便可呈现病态。如根据其化学机理，探讨较小分子对于机体组分的生物大分子的作用模式，合成有关物质，将有可能借助外源性化学物质来矫正病态。某些有调节作用的各种微量物质已从体内加以分离和鉴定。例如生长激素抑放激素 (Somatostatin) 是十四肽，能抑制体内胰高血糖素的分泌。后者有将贮存在肝内的葡萄糖转运至血内的作用，增高血糖浓度。如胰高血糖素过多，会招致糖尿病的发生；也可促使脂肪酸氧化，产生 β -羟基丁酸，乃使患者因酸中毒而昏迷，甚至死亡。滴注生长激素抑放激素可以降低血糖含量和 β -羟基丁酸的浓度，因而改善症状。如能用人工合成方法改变天然氨基酸组合，可望得到新的治疗药物，这就开辟了寻求新药的新途径和新方法，开创了药物化学研究的新方向。新的药物化学分支正在建立中。

(二) 我国药物化学事业的成就

解放后，党中央十分重视和关心广大人民群众的健康，关心医药卫生事业的发展，因而取得显著的成就。

在化学药物生产方面，解放前原料药物的制造工业基本上是空白点。除少数无机药物外，几种有机合成药物都不能大量生产。药品价格昂贵。广大劳动人民处于有病无药治、有药无钱买的状况。

解放后，制药工业在自力更生基础上，有计划有步骤地加以恢复和发展，面向工农兵，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。使化学制药工业有一个合理的布局，为形成完整的化学制药工业体系打下扎实的基础。成百个大型化学制药厂的设立，以及成千个中小型化学制药厂的兴起，不仅生产和供应了我国所需的化学药物，而且还能出口，支援其他国家人民。医疗上所需的一般化学药物都能自给；数量上也有大幅度的增长；质量上达到或超过药典要求和有关规定。在生产工艺上尽量利用我国原材料，设计生产工艺路线；新技术、新工艺、新原料、新产品不断出现，成本日益降低。

在化学药物的研究方面，解放后的成就也是显著的。解放前，化学药物的研究除个别地进行外，对于制药工业的设计与研究，则是空白点。

解放后，全国陆续成立了一批医药工业研究院、设计院和药物研究所，科技人员不断增加。贯彻了科学研究为无产阶级政治服务，为社会主义建设服务的方针，坚持实行中西医结合、面向工农兵和预防为主方针，在党的领导下，大搞群众运动，加强协作，科研工作取得可喜的成就。如维生素、激素、避孕药、抗菌素、磺胺类、解热镇痛药等的生产，都是我国科研人员和有关工程人员试制研究、设计施工建成投产的，其中有不少的创造。胰岛素的全合成不仅开创全世界人工合成有生物活性的蛋白质的先例，而

且对于生命起源也提供了科学试验的论证，获得全世界有关科学家的好评。新药试制水平有相当的提高，试制时间大为缩短。根据我国原材料情况，创造新的合成路线也日益增多。创制新药的能力也日益提高，血吸虫病治疗药、新抗菌素、抗着床避孕药、抗癌药等方面都有一些例子。在继承发扬中国医药学方面也取得一定成就。传统用药有效成分的提炼和鉴认上有显著进步，并进行有效的合成，提供了新的化学药物。如黄连素等的全合成法生产显示了我国医药工业研究的一个特色。在制药工厂设计上水平也不断提高，新设计、新工艺不断出现，新原料、新试剂不断应用，为我国制药工业作出了宝贵贡献。

在药学教育事业方面，也有显著的成就。解放前只有几个药学院系，培养的人员大多从事药剂、生药、药检等方面的工作。药物合成及化学制药人材的培养则是空白。解放后，大力充实整顿原有药科院系，相继成立化学制药专业及药物化学专业，培养药物合成及化学制药的专门人材。在毛主席教育方针指引下，贯彻了教育为无产阶级政治服务、与生产劳动相结合的方针，培养出大批德智体全面发展、有社会主义觉悟、有文化的劳动者。解放后培养出的药学人材，比解放前四十年总和多几倍，一支无产阶级的又红又专的医药卫生科技队伍已经初步形成。

当前，我国社会主义科技事业和医药教育事业已进入一个兴旺发达的新阶段，光明的前景正展现在我们面前。

三、化学药物的质量和质量标准

(一) 化学药物的杂质来源与纯度

在生产及贮存过程中引进或产生的、药物以外的其他化学物质称作杂质。如药物为光学活性物质，它的消旋物和手征性对映体都是杂质。氯霉素为左旋品，消旋品含霉素及右旋品都应认作杂质。如药物为消旋品，它的光学活性物也应认作杂质。阿托品为外消旋混合物，左旋性的莨菪碱则为杂质。

化学药物的杂质来源主要有两方面，一是生产过程中引进和产生的，另一是贮存过程中，外界条件的变异引起的。前一方面是主导的，对化学药物的质量起着重要的影响。

生产过程中化学反应不完全，会使粗品中含有反应原料。反应中的副产物和副反应产物也能引入产品中。由于使用原料多为工业品，也可能带来一些其他杂质。产品的不安定性在制备和干燥过程中也会引起变质，产生杂质。因此，生产过程中对引入杂质的因素应加以避免，或通过精制，将杂质除去。

扑热息痛生产过程的乙酰化反应是可逆反应，随着反应条件控制是否得当，乙酰化完成程度就有高低，残留的对氨基酚量也有差异，但残存仍不可避免，故产品中应检查它的存在。对氨基酚（I）的湿品在空气中极易被氧化为亚氨基醌（II），再进一步水解为苯醌（III），缔合后颜色变深变蓝。

