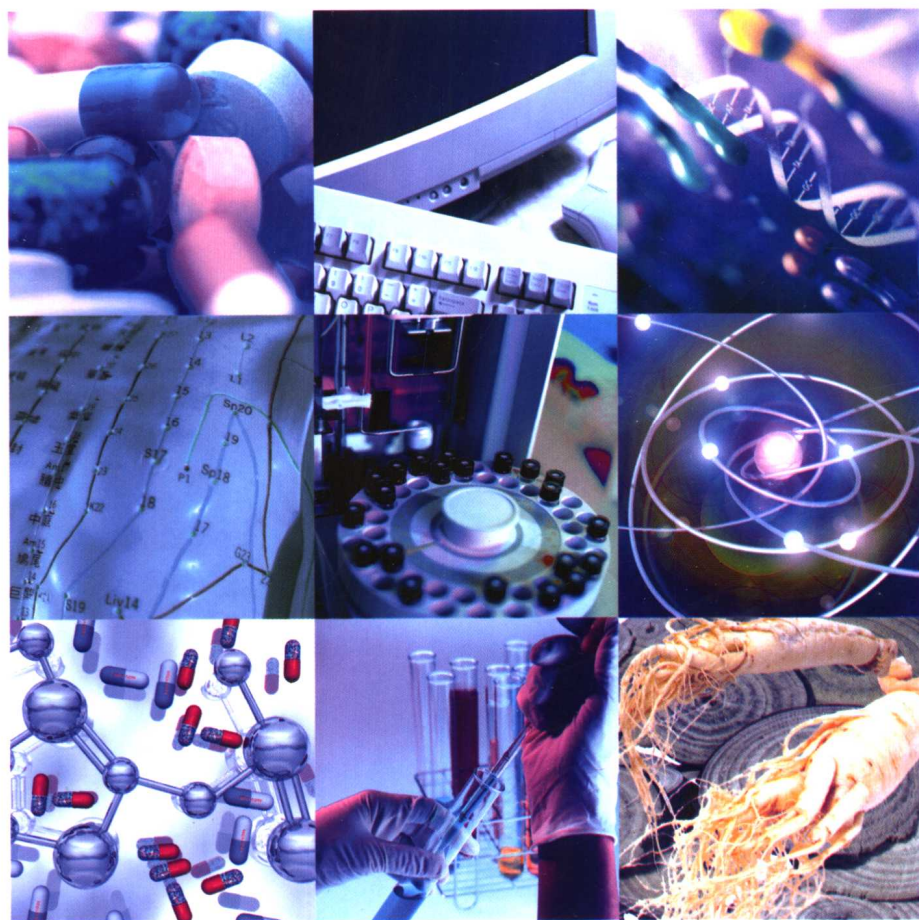


全国医药中等职业技术学校教材

# 药物化学基础

全国医药职业技术教育研究会 组织编写

叶云华 主编 张春桃 主审



化学工业出版社

现代生物技术与医药科技出版中心

全国医药中等职业技术学校教材

# 药物化学基础

全国医药职业技术教育研究会 组织编写  
叶云华 主编 张春桃 主审

(京)新登字 039 号

**图书在版编目(CIP)数据**

药物化学基础/叶云华主编. —北京:化学工业出版社, 2005.12

全国医药中等职业技术学校教材

ISBN 7-5025-8043-3

I. 药… II. 叶… III. 药物化学-专业学校-教材  
IV. R914

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2005) 第 150239 号

---

全国医药中等职业技术学校教材

**药物化学基础**

全国医药职业技术教育研究会 组织编写

叶云华 主编 张春桃 主审

责任编辑:余晓捷 孙小芳 陈燕杰

文字编辑:周 侗

责任校对:顾淑云

封面设计:关 飞

\*

化 学 工 业 出 版 社 出版发行  
现代生物技术与医药科技出版中心

(北京市朝阳区惠新里 3 号 邮政编码 100029)

购书咨询:(010) 64982530

(010) 64918013

购书传真:(010) 64982630

<http://www.cip.com.cn>

\*

新华书店北京发行所经销

北京永鑫印刷有限责任公司印刷

三河市宇新装订厂装订

开本 787mm×1092mm 1/16 印张 12 $\frac{3}{4}$  字数 298 千字

2006 年 1 月第 1 版 2006 年 1 月北京第 1 次印刷

ISBN 7-5025-8043-3

定 价: 23.00 元

---

**版权所有 违者必究**

该书如有缺页、倒页、脱页者,本社发行部负责退换

## 内 容 提 要

本书为全国医药中等职业技术学校教材，由全国医药职业技术教育研究会组织编写。

全书共分 14 章。内容包括：绪论；中枢神经系统药物；解热镇痛药与非甾体抗炎药；外周神经系统药物；消化系统药物；心血管系统药物；抗菌药及抗病毒药；抗生素；抗肿瘤药物；抗寄生虫病药物；利尿药及口服降血糖药；甾体激素类药物；维生素类药物；药物化学基础综合知识。书后还附有实验，可供教学使用。

本书可供药物制剂专业学生使用，也适用于药物分析检验及医药商品营销等专业使用。

# 全国医药职业技术教育研究会委员名单

会 长 苏怀德 国家食品药品监督管理局

副会长 (按姓氏笔画排序)

王书林 成都中医药大学峨眉学院  
严 振 广东化工制药职业技术学院  
陆国民 上海市医药学校  
周晓明 山西生物应用职业技术学院  
缪立德 湖北省医药学校

委 员 (按姓氏笔画排序)

马孔琛 沈阳药科大学高等职业技术学院  
王吉东 江苏省徐州医药高等职业学校  
王自勇 浙江医药高等专科学校  
左淑芬 河南中医学院药学高职部  
白 钢 苏州市医药职工中等专业学校  
刘效昌 广州市医药中等专业学校  
闫丽霞 天津生物工程职业技术学院  
阳 欢 江西中医学院大专部  
李元富 山东中医药高级技工学校  
张希斌 黑龙江省医药职工中等专业学校  
林锦兴 山东省医药学校  
罗以密 上海医药职工大学  
钱家骏 北京市中医药学校  
黄跃进 江苏省连云港中医药高等职业技术学校  
黄庶亮 福建食品药品职业技术学院  
黄新启 江西中医学院高等职业技术学院  
彭 敏 重庆市医药技工学校  
彭 毅 长沙市医药中等专业学校  
谭骁或 湖南生物机电职业技术学院药学部

秘书长 (按姓氏笔画排序)

刘 佳 成都中医药大学峨眉学院  
谢淑俊 北京市高新职业技术学院

# 全国医药中等职业技术教育教材 建设委员会委员名单

**主任委员** 苏怀德 国家食品药品监督管理局

**常务副主任委员** 王书林 成都中医药大学峨眉学院

**副主任委员** (按姓氏笔画排序)

李松涛 山东中医药高级技工学校

陆国民 上海市医药学校

林锦兴 山东省医药学校

缪立德 湖北省医药学校

**顾问** (按姓氏笔画排序)

齐宗韶 广州市医药中等专业学校

路振山 天津市药科中等专业学校

**委员** (按姓氏笔画排序)

王质明 江苏省徐州医药中等专业学校

王建新 河南省医药学校

石 磊 江西省医药学校

冯维希 江苏省连云港中药学校

刘 佳 四川省医药学校

刘效昌 广州市医药中等专业学校

闫丽霞 天津市药科中等专业学校

李光锋 湖南省医药中等专业学校

彭 敏 重庆市医药技工学校

董建慧 杭州市高级技工学校

潘 雪 北京市医药器械学校

**秘书** (按姓氏笔画排序)

王建萍 上海市医药学校

冯志平 四川省医药学校

张 莉 北京市医药器械学校

# 前 言

半个世纪以来，我国中等医药职业技术教育一直按中等专业教育（简称为中专）和中等技术教育（简称为中技）分别进行。自 20 世纪 90 年代起，国家教育部倡导同一层次的同类教育求同存异。因此，全国医药中等职业技术教育教材建设委员会在原各自教材建设委员会的基础上合并组建，并在全国医药职业技术教育研究会的组织领导下，专门负责医药中职教材建设工作。

鉴于几十年来全国医药中等职业技术教育一直未形成自身的规范化教材，原国家医药管理局科技教育司应各医药院校的要求，履行其指导全国药学教育、为全国药学教育服务的职责，于 20 世纪 80 年代中期开始出面组织各校联合编写中职教材。先后组织出版了全国医药中等职业技术教育系列教材 60 余种，基本上满足了各校对医药中职教材的需求。

为进一步推动全国教育管理体制改革和教学改革，使人才培养更加适应社会主义建设之需，自 20 世纪 90 年代末，中央提倡大力发展职业技术教育，包括中等职业技术教育。据此，自 2000 年起，全国医药职业技术教育研究会组织开展了教学改革交流研讨活动。教材建设更是其中的重要活动内容之一。

几年来，在全国医药职业技术教育研究会的组织协调下，各医药职业技术院校认真学习有关方针政策，齐心协力，已取得丰硕成果。各校一致认为，中等职业技术教育应定位于培养拥护党的基本路线，适应生产、管理、服务第一线需要的德、智、体、美各方面全面发展的技术应用型人才。专业设置必须紧密结合地方经济和社会发展需要，根据市场对各类人才的需求和学校的办学条件，有针对性地调整和设置专业。在课程体系和教学内容方面则要突出职业技术特点，注意实践技能的培养，加强针对性和实用性，基础知识和基本理论以必需够用为度，以讲清概念，强化应用为教学重点。各校先后学习了《中华人民共和国职业分类大典》及医药行业工人技术等级标准等有关职业分类、岗位群及岗位要求的具体规定，并且组织师生深入实际，广泛调研市场的需求和有关职业岗位群对各类从业人员素质、技能、知识等方面的基本要求，针对特定的职业岗位群，设立专业，确定人才培养规格和素质、技能、知识结构，建立技术考核标准、课程标准和课程体系，最后具体编制为专业教学计划以开展教学活动。教材是教学活动中必须使用的基本材料，也是各校办学的必需材料。因此研究会首先组织各学校按国家专业设置要求制订专业教学计划、技术考核标准和课程标准。在完成专业教学计划、技术考核标准和课程标准的制订后，以此作为依据，及时开展了医药中职教材建设的研讨和有组织的编写活动。由于专业教学计划、技术考核标准和课程标准都是从现实职业岗位群的实际需要中归纳出来的，因而研究会组织的教材编写活动就形成了以下特点：

1. 教材内容的范围和深度与相应职业岗位群的要求紧密挂钩，以收录现行适用、成熟规范的现代技术和管理知识为主。因此其实践性、应用性较强，突破了传统教材以理论

知识为主的局限，突出了职业技能特点。

2. 教材编写人员尽量以产学结合的方式选聘，使其各展所长、互相学习，从而有效地克服了内容脱离实际工作的弊端。

3. 实行主审制，每种教材均邀请精通该专业业务的专家担任主审，以确保业务内容正确无误。

4. 按模块化组织教材体系，各教材之间相互衔接较好，且具有一定的可裁减性和可拼接性。一个专业的全套教材既可以圆满地完成专业教学任务，又可以根据不同的培养目标和地区特点，或市场需求变化供相近专业选用，甚至适应不同层次教学之需。

本套教材主要是针对医药中职教育而组织编写的，它既适用于医药中专、医药技校、职工中专等不同类型教学之需，同时因为中等职业教育主要培养技术操作型人才，所以本套教材也适合于同类岗位群的在职员工培训之用。

现已编写出版的各种医药中职教材虽然由于种种主客观因素的限制仍留有诸多遗憾，上述特点在各种教材中体现的程度也参差不齐，但与传统学科型教材相比毕竟前进了一步。紧扣社会职业需求，以实用技术为主，产学结合，这是医药教材编写上的重大转变。今后的任务是在使用中加以检验，听取各方面的意见及时修订并继续开发新教材以促进其与时俱进、臻于完善。

愿使用本系列教材的每位教师、学生、读者收获丰硕！愿全国医药事业不断发展！

全国医药职业技术教育研究会

2005年6月



## 编写说明

本书为全国医药中等职业技术学校教材，由全国医药职业技术教育研究会组织编写，主要适用于药物制剂专业使用，也适用于药物分析检验及医药商品营销等专业使用。

本书的编写以培养第一线技术操作型人才为目的，以“必需、够用”为原则，为后续课程的学习提供必要的药物化学的基础理论知识，同时也加强学生动手能力的培养。

本书由湖南省医药学校叶云华编写第一章、第十三章、第十四章及实验部分；河南省医药学校李玉华编写第六章、第七章；广州市医药中专学校邓红艳编写第三章、第八章、第十章；上海市医药学校孙若兰编写第四章、第五章；江苏省徐州医药中等专业学校韦淑梅编写第二章、第十二章；湖南省医药学校羊利荣编写第九章、第十一章。由湖南中医学院张春桃副教授主审。

鉴于现代药物化学学科的迅速发展，本书尽量反映当代药物化学的主要内容，以满足学生今后在药物生产等方面的需要，体现中等职业教育特色。

各校在使用本教材时，可根据自己的专业特点、教学计划及教学要求，选择讲授内容、复习思考题及实验内容，使学生在有限的教学时数内，掌握本课程的基本理论知识和基本操作技能。

本书虽经各位编者认真努力编写，但由于时间仓促，编者水平有限，错误疏漏之处在所难免，恳请广大读者批评指正。

编者

2006年1月

# 目 录

<b>第一章 绪论</b> .....	1
一、药物化学的研究内容和任务.....	1
二、药物化学的发展简介.....	1
三、药物的质量和标准.....	2
四、药物的名称.....	3
<b>第二章 中枢神经系统药物</b> .....	5
<b>第一节 镇静催眠药</b> .....	5
一、巴比妥类.....	5
二、苯二氮革类.....	6
三、咪唑并吡啶类.....	7
<b>第二节 抗癫痫药</b> .....	8
<b>第三节 抗精神病药</b> .....	9
一、吩噻嗪类.....	9
二、噻吨类(硫杂蒯类).....	11
三、二苯并氮杂革类.....	11
四、丁酰苯类.....	12
五、苯甲酰胺类.....	13
<b>第四节 抗抑郁药</b> .....	13
<b>第五节 镇痛药</b> .....	14
一、吗啡及其衍生物.....	14
二、合成镇痛药.....	16
三、镇痛药的构效关系.....	19
<b>第六节 中枢兴奋药</b> .....	19
一、黄嘌呤类.....	20
二、酰胺类.....	21
三、苯氧乙酸酯类.....	22
<b>第七节 全身麻醉药</b> .....	22
一、吸入麻醉药.....	22
二、静脉麻醉药.....	23
复习思考题.....	24
<b>第三章 解热镇痛药与非甾体抗炎药</b> .....	26
<b>第一节 解热镇痛药</b> .....	26
一、水杨酸类.....	26
二、苯胺类.....	28
三、吡唑酮类.....	29

第二节 非甾体抗炎药 .....	30
一、3,5-吡唑烷二酮类 .....	30
二、邻氨基苯甲酸类 .....	31
三、吲哚乙酸类 .....	32
四、芳基烷酸类 .....	32
五、苯并噻嗪类 .....	34
复习思考题 .....	35
<b>第四章 外周神经系统药物 .....</b>	<b>36</b>
第一节 局部麻醉药 .....	36
一、局麻药的发展及分类 .....	36
二、常用药物 .....	37
三、局麻药的构效关系 .....	39
第二节 拟胆碱药 .....	40
一、胆碱受体激动剂 .....	40
二、乙酰胆碱酯酶抑制剂 .....	41
第三节 抗胆碱药 .....	42
一、M胆碱受体拮抗剂 .....	42
二、N胆碱受体拮抗剂 .....	43
第四节 拟肾上腺素药 .....	44
一、苯乙胺类 .....	44
二、苯异丙胺类 .....	45
三、拟肾上腺素药的构效关系 .....	46
第五节 组胺 H <sub>1</sub> 受体拮抗剂 .....	46
一、氨基醚类 .....	47
二、乙二胺类 .....	48
三、丙胺类 .....	48
四、三环类 .....	49
五、哌嗪类 .....	50
六、哌啶类 .....	51
复习思考题 .....	51
<b>第五章 消化系统药物 .....</b>	<b>52</b>
第一节 抗溃疡药 .....	52
一、组胺 H <sub>2</sub> 受体拮抗剂 .....	52
二、质子泵抑制剂 .....	53
第二节 止吐药 .....	54
第三节 促动力药 .....	54
复习思考题 .....	55
<b>第六章 心血管系统药物 .....</b>	<b>56</b>
第一节 强心药 .....	56
第二节 调血脂药 .....	57

一、苯氧乙酸类 .....	57
二、烟酸类 .....	58
三、羟甲戊二酰辅酶 A 还原酶抑制剂类 .....	59
第三节 抗心绞痛药 .....	60
一、硝酸酯及亚硝酸酯类 .....	60
二、钙通道阻滞剂 .....	61
三、 $\beta$ 受体阻断剂 .....	63
四、其他类 .....	63
第四节 抗高血压药 .....	64
一、作用于中枢神经系统的降压药 .....	64
二、作用于交感神经系统的降压药 .....	65
三、神经节阻断药 .....	66
四、血管扩张药 .....	66
五、肾上腺素 $\alpha_1$ 受体阻断剂 .....	66
六、影响肾素-血管紧张素-醛固酮系统的药物 .....	67
第五节 抗心律失常药 .....	69
一、钠通道阻滞剂 .....	69
二、 $\beta$ 受体阻断剂 .....	70
三、钾通道阻滞剂 .....	71
四、钙通道阻滞剂 .....	72
第六节 抗血栓药 .....	72
复习思考题 .....	73
<b>第七章 抗菌药及抗病毒药 .....</b>	<b>75</b>
第一节 磺胺类抗菌药及抗菌增效剂 .....	75
一、磺胺类抗菌药的发展 .....	75
二、磺胺类抗菌药的构效关系 .....	76
三、磺胺类抗菌药的作用机制 .....	76
四、抗菌增效剂 .....	77
五、典型药物 .....	78
第二节 喹诺酮类抗菌药 .....	79
一、喹诺酮类抗菌药的发展及分类 .....	79
二、喹诺酮类抗菌药的构效关系 .....	80
三、典型药物 .....	81
第三节 抗结核病药 .....	82
一、合成抗结核病药 .....	82
二、抗生素类抗结核病药 .....	84
第四节 抗真菌药 .....	84
一、唑类抗真菌药 .....	85
二、抗真菌抗生素 .....	86
三、其他抗真菌药 .....	86

第五节 抗病毒药 .....	87
一、三环胺类抗病毒药 .....	87
二、核苷类抗病毒药 .....	88
三、其他抗病毒药——干扰素 .....	89
复习思考题 .....	89
<b>第八章 抗生素 .....</b>	<b>91</b>
第一节 $\beta$ -内酰胺类抗生素 .....	91
一、青霉素及半合成青霉素类抗生素 .....	92
二、头孢菌素类抗生素 .....	97
三、非经典的 $\beta$ -内酰胺类抗生素及 $\beta$ -内酰胺酶抑制剂 .....	101
四、 $\beta$ -内酰胺类抗生素的构效关系 .....	103
第二节 四环素类抗生素 .....	103
第三节 氨基糖苷类抗生素 .....	104
第四节 大环内酯类抗生素 .....	106
第五节 氯霉素类抗生素 .....	109
第六节 其他类抗生素 .....	111
一、多黏菌素 .....	111
二、林可霉素 .....	111
复习思考题 .....	111
<b>第九章 抗肿瘤药物 .....</b>	<b>113</b>
第一节 生物烷化剂 .....	113
一、氮芥类 .....	113
二、亚乙基亚胺类 .....	115
三、亚硝基脲类 .....	115
四、磺酸酯及多元醇类 .....	116
第二节 抗代谢药物 .....	116
一、嘧啶拮抗物 .....	117
二、嘌呤拮抗物 .....	118
三、叶酸拮抗物 .....	119
第三节 天然抗肿瘤药物 .....	120
一、抗肿瘤抗生素 .....	120
二、抗肿瘤的植物药有效成分及其衍生物 .....	121
第四节 抗肿瘤金属配合物 .....	122
复习思考题 .....	123
<b>第十章 抗寄生虫病药物 .....</b>	<b>124</b>
第一节 驱肠虫药 .....	124
第二节 抗疟药 .....	125
第三节 抗血吸虫病药 .....	126
第四节 抗阿米巴病药 .....	127
复习思考题 .....	128

<b>第十一章 利尿药及口服降血糖药</b> .....	129
第一节 利尿药.....	129
第二节 口服降血糖药.....	130
一、磺酰脲类降血糖药.....	131
二、双胍类降血糖药.....	132
复习思考题.....	132
<b>第十二章 甾体激素类药物</b> .....	133
第一节 甾类药物概述.....	133
一、甾类药物的结构.....	133
二、甾类药物的分类.....	133
三、甾类药物的命名.....	134
四、甾类药物的合成.....	135
五、甾类药物的一般性质.....	135
第二节 雌激素类药物.....	136
一、雌激素及其衍生物.....	136
二、雌激素合成代用品.....	138
三、抗雌激素药物.....	138
第三节 雄激素类药物.....	139
一、雄性激素类药物.....	139
二、蛋白同化激素.....	140
第四节 孕激素类药物和甾体避孕药物.....	141
一、孕激素类药物.....	141
二、甾体避孕药.....	143
三、抗孕激素.....	143
第五节 肾上腺皮质激素类药物.....	144
复习思考题.....	146
<b>第十三章 维生素类药物</b> .....	148
第一节 脂溶性维生素.....	148
一、维生素 A .....	148
二、维生素 D .....	150
三、维生素 E .....	152
四、维生素 K .....	152
第二节 水溶性维生素.....	154
复习思考题.....	158
<b>第十四章 药物化学基础综合知识</b> .....	159
第一节 药物的变质反应.....	159
一、药物的水解反应.....	159
二、药物的自动氧化反应.....	161
三、药物的其他变质反应.....	163
第二节 新药开发的途径和方法.....	163

一、先导化合物的发现.....	163
二、先导化合物优化的一般方法.....	165
复习思考题.....	168
<b>实验部分</b> .....	169
实验一  阿司匹林的合成及定性鉴别 .....	169
实验二  对乙酰氨基酚的制备及定性鉴别.....	170
实验三  盐酸普鲁卡因的合成及定性鉴别.....	173
实验四  几种有机药物的定性鉴别.....	175
实验五  烟酸的合成及定性鉴别.....	177
实验六  磺胺醋酰钠的合成及定性鉴别.....	178
实验七  维生素类和抗生素类药物的性质实验.....	180
实验八  药物的稳定性实验.....	182
<b>参考文献</b> .....	186

# 第一章 绪 论

## 一、药物化学的研究内容和任务

药物是指对疾病具有预防、治疗、诊断作用，或用于调节人体生理功能、提高生活质量、保持身体健康的特殊物质。根据药物来源和性质的不同，可以分为中药或天然药物、化学合成药物、生物药物等。临床使用的药物很大一部分是通过化学合成或生物合成的方法得到的，既具有药物的功效，又具有确切的化学组成与化学结构的化合物，即化学药物。化学药物可以是无机的矿物质或合成的有机化合物，也可以是从天然药物中提取得到的有效单体，以及通过发酵方法得到的抗生素等。

药物化学是以化学药物作为其研究对象，是融合化学学科和生命科学学科知识的一门交叉学科，它的研究内容是应用化学的原理和现代科学的方法研究化学药物的化学结构、理化性质、制备方法、构效关系、药物作用的化学原理、调剂及贮存中的化学变化，以及寻找新药的途径和方法等。药物化学是属于应用化学的范畴，它是建立在无机化学、有机化学、分析化学、生物化学等化学学科的基础上，同时又与生命科学学科密切相关，涉及的范围较广，是一门综合性学科。

药物化学基础是药物制剂专业非常重要的专业基础课，它为药物制剂技术提供必要的药物化学知识。要求熟悉各类药物的主要结构和临床用途，了解典型药物的构效关系，掌握常用药物的结构特点以及与调配剂有关的理化性质，为合理的药物配伍和剂型选择提供理论依据，指导新药开发。

对于药物化学基础这门课程的学习，应从药物的化学结构入手，由结构联系到理化性质、化学制备等，使学习内容互有联系，形成一个整体。当然，学习药物化学基础这门课程，对中等职业学校学生而言，还应该掌握一些相关的基本操作技能，提高动手能力。

## 二、药物化学的发展简介

药物化学与早期的药物学有着密切的联系。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，它又与生物学、医学的发展密切相关。

有史记载以来，人们对药物的应用源于天然产物特别是植物。从 19 世纪开始，由于化学学科的发展，人们从阿片中分离提纯了吗啡，从金鸡纳树皮中提取到奎宁，从古柯叶中得到了可卡因等，这些为“药物化学”的形成提供了基础。后来，随着化学学科的进一步发展，特别是有机合成技术的发展，临床医学家开始从有机化合物中寻找对疾病有治疗作用的化合物，如发现了水合氯醛的镇静作用及乙醚的麻醉用途。由于有机合成化学为生物学实验提供了化合物基础的来源，人们在总结化合物生物活性的基础上提出了药效基团的概念，指导人们开始有目的的药物合成研究。到 19 世纪末，随着苯佐卡因、阿司匹林、安替比林等一些化学合成药物的出现，药物化学才真正形成一门独立的学科。

化学工业的兴起，特别是染料化学工业等的发展，促进了制药工业的发展。有机化学已



由合成简单化合物向合成复杂化合物发展,由杂环化合物的合成发展到杂环化学的形成,扩大了药物化学结构的多样性,加之这一时期药物活性评价已由动物代替人体进行研究,形成了实验药理学,减少了冒险性,扩大了药物筛选的范围,加快了新药研究的速度,增加了成功的机会,推动了药物化学的发展。

20世纪20~30年代,神经系统药物如麻醉药、镇静药、镇痛药、解热镇痛药等重要药物在临床已有广泛使用;30年代磺胺类药物的发现,为当时细菌感染性疾病提供了有效的药物,并且发展到利用体内代谢产物进行新药的设计和研发,创立了药物的抗代谢作用机制;40年代发现了青霉素,其医用价值至今仍是不可估量的,是一件划时代的成就,开创了从微生物代谢产物中寻找抗生素的思路,使药物化学的理论和实践都有了飞速的发展。后来随着四环素、链霉素、氯霉素、红霉素等抗生素的相继问世,特别是1944年链霉素的发现,使得当时对结核病就像现在人们对肿瘤或艾滋病一样谈虎色变的疾病得以攻克,是药物化学对人类的重要贡献。

抗生素长期使用后,细菌产生耐药性,加之人们希望获得抗菌谱更广、疗效更好、专一性更强或使用更方便的新抗生素的要求,人们采用半合成方法来研制新的抗生素,如利用6-氨基青霉烷酸(6-APA)或7-氨基头孢烷酸(7-ACA)作为母核,已合成目前正在临床使用的半合成青霉素类及头孢菌素类药物。同样也有许多各种各样的半合成红霉素、利福霉素等,都比它们天然化合物的疗效更强、副作用更小。

1924年已经使用硝酸甘油治疗心绞痛,之后利舍平于1953年作为降压药上市应用。20世纪50年代后,随着世界经济的发展、生活水平的提高,老龄化及心脑血管疾病成为人类第一死亡因素。也几乎是在同时,随着生物学科的发展,人们对体内的代谢过程、身体的调节系统、疾病的病理过程有了更多的了解,对蛋白质、酶、受体、离子通道等也有了更深入的研究,在心脑血管疾病的治疗方面发现了 $\beta$ 受体阻滞剂、钙通道阻滞剂、血管紧张素转化酶抑制剂等药物。另外,在肿瘤的化疗方面,也由最初的氮芥、烷化剂,发展到有目的地进行细胞生长周期的调控,使大部分肿瘤的治疗效果有了较大的提高。如抗代谢类药物甲氨蝶呤问世主要用于治疗白血病,20世纪50年代中期又将它用于治疗绒毛膜上皮癌,对未转移癌疗效达100%治愈。抗肿瘤抗生素、金属配合物、天然有效成分紫杉醇以及其他抗肿瘤药物的问世,均丰富了药物化学的内容。

20世纪60年代定量构效关系的研究,使药物化学由盲目地设计发展到有目的地合理设计,极大地丰富了药物化学的理论。80年代以后,计算机科学的应用,使药物设计更加合理、可行;组合化学方法的发展,使快速合成大量化合物成为可能;高通量和自动化筛选技术的应用,缩短了药物发现、发明的时间,大大加快了新药的寻找过程;生物技术特别是分子克隆技术、人类基因组学、蛋白组学的形成和发展,也为新药研究提供了更多的靶点。

### 三、药物的质量和标准

药物的质量与其疗效、毒性密切相关。所以,药物的质量直接影响到人民的身体健康和生命安全。在药物的制备、包装、贮存、制剂和调配等过程中都有引起变质的因素,因此,每一个从事药学工作的人员,都应树立药品质量第一的观点,在工作的全过程中,始终注意严格遵循操作规程,保证药物的质量。

对于药物质量的评定关键应考虑药物自身的疗效和毒副作用,即药物的安全性和有效