

中国药学会上海分会  
年会论文资料汇编

1978年7月

## 前 言

在以英明领袖华主席为首的党中央抓纲治国战略决策指引下，为了切实贯彻《中共中央关于召开全国科学大会的通知》中关于“科学技术协会和各种专门学会要积极开展工作”的指示精神，认真贯彻“百花齐放、百家争鸣”的方针，活跃学术空气，繁荣医药科学，提高医药科研和药学工作质量，努力赶超世界先进水平，为加速实现我国四个现代化贡献力量，我会于1978年4月11日至15日召开了文化大革命以来第一次学术年会。这次年会共收到生药学、天然药物化学、合成药物化学、抗菌素、药剂学、药物分析、药理学等方面的论文、经验总结及专题综述共300余篇，在会上以各种形式进行交流。这是近年来全市广大药学科技人员抵制了“四人帮”的干扰，为保障人民健康，在药学科研、药品生产和临床药学工作中总结出来的科研成果和宝贵经验。为了满足广大药学科技人员的需要，在年会领导小组的主持下，将来稿整理汇编成册，以供参考。

由于我们水平有限，时间匆促，编辑工作中一定存在不少缺点错误，请读者批评指正。

中国药学会上海分会  
1978年7月

F2

# 目 录

## 综 述

新药研究发展趋向 .....	中国科学院上海药物研究所	1
近年国外天然药研究概况 .....	第二军医大学药理学系中草药学教研室	6
关于中草药的研究工作 .....	上海化学工业专科学校	11
临床药学前瞻 .....	上海市第六人民医院等	19
药物代谢动力学与制剂研究 .....	上海第一医学院药理学系	23
处方设计前的工作 .....	上海第一医学院药理学系	26
膜剂的国内外概况 .....	上海医药工业研究院	31
栓剂的进展 .....	上海医药工业研究院	37
获得性耐药性的生化机理 .....	上海第一医学院药理学系	39
薄层层析技术在药物分析中的若干进展 .....	上海医药工业研究院中药、分析研究室	41
药理学进展的几个方面 .....	上海第一医学院药理教研组	49

## 论 文 摘 要

### 生 药 学

抗宫颈癌中草药掌叶半夏的初步研究 .....	上海中药二厂等	56
止血药断血流的研究 .....	上海医药工业研究院等	57
丹参茎叶代替丹参的初步探讨 .....	上海第七制药厂	58
用人体胃癌组织美兰法筛选 900 种植物的抗癌活性 .....	长宁区中心医院等	58
104种植物对小鼠移植性肿瘤的抑制作用 .....	上海师范大学生物系等	60
滇产几种雪上一枝蒿类药材的生药鉴定研究 .....	上海市卫生局药品检验所	60
蛇六谷的原植物和生药鉴定 .....	上海市卫生局药品检验所	61
淫羊藿的药用植物品种调查及生药学研究 .....	第二军医大学药理学系中草药学教研室	62
中药金银花原植物的研究 .....	复旦大学生物系	63
药用植物种子鉴别的研究 (一)伞形科果实 .....	第二军医大学药理学系中草药学教研室	64
陕西省药用的“威灵仙”——黑刺菝葜根和秦岭菝葜根的生药学研究 .....	第二军医大学药理学系中草药学教研室	66
柘树的生药鉴定及与柞木、蒙栎的区别 .....	上海市卫生局药品检验所	67
秦皮药材的研究——品种来源调查和秦皮乙素测定方法的研究 .....	第二军医大学药理学系中草药学教研室等	68
黄藤的原植物和生药鉴定 .....	中国科学院上海药物研究所	69
镇痛中草药七叶莲的生药学研究 .....	上海第一医学院药理学系生药学教研室	70

民间治疗肝炎中草药木半夏根皮的生药学研究 .....	上海第一医学院药系生药学教研组	71
十种出口大黄生药的质量分析 .....	上海第一医学院药系生药学教研组	72
穿心莲成份分析研究 .....	上海市农业科学院园艺研究所	72
穿心莲栽培留种试验 .....	上海市农业科学院园艺研究所	73
知母引种栽培试验 .....	上海市农业科学院园艺研究所	74
山银柴胡的引种栽培 .....	上海市农业科学院园艺研究所	75
前胡引种栽培 .....	上海市农业科学院园艺研究所	75
川续断引种栽培 .....	上海市农业科学院园艺研究所	76
川芎露地越夏留种和栽培技术研究 .....	上海市农业科学院园艺研究所	76
北沙参引种栽培试验 .....	上海市农业科学院园艺研究所	77

### 天然药物化学

青蒿素的结构和反应 .....	中国科学院上海有机化学研究所等	78
丹参有效成份的研究 I. 丹参酮 II-A 磺酸钠和次甲丹参醌的化学结构 .....	中国科学院上海药物研究所	79
丹参有效成份的研究 II. 紫丹参甲素的化学结构 .....	中国科学院上海药物研究所	80
丹参有效成份的研究 I. 儿茶酚醛的分离与鉴定 .....	上海第九制药厂等	81
通关藤有效成份研究 .....	上海医药工业研究院等	81
人参茎叶中皂甙的提取工艺和含量测定方法 .....	上海中华制药厂	82
土槿乙酸化学结构的初步研究 .....	中国科学院上海药物研究所	84
石蒜科生物碱的研究 VIII. 中国水仙中抗癌成份漳州水仙碱的分离和鉴定 .....	中国科学院上海药物研究所	84
抗癌植物喜树化学成份的研究 IV. 抗癌新生物碱11-羟基喜树碱 .....	中国科学院上海药物研究所	85
防己科植物地不容的化学研究(第三报) I-箭毒碱和异紫堇定碱的分离和鉴定 .....	中国科学院上海药物研究所	86
博落回有效成份的研究 .....	中国科学院上海药物研究所	87
中药延胡索有效成份延胡索丑素的化学结构和构型 .....	中国科学院上海药物研究所	88
海南轮环藤肌松有效成份初步研究 .....	上海医药工业研究院等	88
轮环藤属植物化学成份的研究 I. 毛叶轮环藤肌松有效成份的研究 .....	中国科学院上海药物研究所	89
粉叶轮环藤的化学和药理研究 I. 粉叶轮环藤生物碱的化学研究 .....	上海中医研究所中草药研究室中麻小组等	90
国产美登木中抗肿瘤成份的研究 .....	中国科学院上海药物研究所等	91
青木香有效成份的研究 II. 增噬力酸的主要成份 .....	中国科学院上海药物研究所	92
垂盆草化学成份的研究 I. 有效成份垂盆草甙的分离与结构 .....	中国科学院上海药物研究所	93
包公藤有效成份的分离和初步鉴定 .....	上海第二医学院化学教研组	93
翼梗五味子有效成份的研究 翼梗五味子酯、五味子酚、去氧五味子素 和翼梗五味子酸的结构 .....	中国科学院上海药物研究所	95

石吊兰抗结核有效成份的研究 .....	中国科学院上海药物研究所	95
佛耳草治疗慢性气管炎的研究 .....	上海市防治慢性气管炎佛耳草协作组	96
降血脂中草药——虎杖化学成份的分离和鉴定 .....	上海第一医学院药理学天然药物化学教研组	97
虎杖根茎中白藜芦醇甙的提取方法改进 .....	上海第一医学院药理学天然药物化学教研组	98
沙氏鹿茸草有效成份的研究 .....	上海中医研究所植化组等	99
薏苡仁抗癌成份的提取及其药理和疗效初步观察 .....	上海第一医学院中山医院药剂科	99
大蒜有效成份研究 .....	上海第二制药厂合成药研究所	100
尿激酶提取方法的研究 .....	上海医药工业研究院	101

## 合成药物化学

冠心病药物的研究 I. 带有取代氨基乙酰胺基的环状化合物的合成 .....	中国科学院上海药物研究所	102
冠心病药心酮胺的合成 .....	上海第九制药厂	102
乳酸心可定新合成法的研究 .....	上海第九制药厂	103
肿瘤化学治疗的研究 1(3)-取代和 1,3-双取代-5-氟尿嘧啶类衍生物 .....	上海医药工业研究院	103
肿瘤化学治疗的研究: 亚硝脒类衍生物 .....	上海医药工业研究院	104
用氘代溶剂交换法制备的标记药物 .....	中国科学院上海药物研究所	105
丙亚胺的药理、临床及合成研究 .....	上海第十二制药厂	106
乙氨芬酮的合成 .....	上海第十二制药厂	106
环胞苷的合成 .....	上海第十二制药厂	107
蕃剑麻皂素资源利用的研究 用微生物转化方法在 A 环上引入 1,4 双键 .....	中国科学院上海有机化学研究所等	107
光学活性 D-18-甲基炔诺酮全合成新方法研究 .....	上海医药工业研究院	108
雌三醇合成工艺的研究 .....	上海第九制药厂	109
抗孕-53 异构体的合成 .....	上海医药工业研究院	109
抗着床药物三氟甲基三苯乙烯衍生物的研究 .....	中国科学院上海药物研究所	110
抗着床药物研究三氟甲基取代 1,2-二苯乙烯类化合物的合成 .....	中国科学院上海药物研究所	111
男用节育药物研究——棉酚一些衍生物的合成及筛选 .....	上海第五制药厂等	112
男用节育药物研究——酚胺类化合物的合成及筛选 .....	中国科学院上海药物研究所	112
男用节育药物研究——氯丙二醇衍生物的合成及筛选 .....	中国科学院上海药物研究所	113
新的半合成抗菌素——硫脒头孢菌素(C-18)的研究 .....	上海医药工业研究院	114
关于血吸虫病化学治疗的研究 5-硝基咪喃乙烯类杂环衍生物的合成 .....	上海医药工业研究院	115
关于血吸虫病化学治疗的研究 $\alpha$ -卤代- $\beta$ -(5-硝基-2-咪喃)丙烯酰胺类衍生物的合成 .....	上海医药工业研究院	116
关于血吸虫病化学治疗的研究——香豆素类衍生物的合成 .....	上海医药工业研究院	117
抗血吸虫病新药咪喃丙胺顺式异构体的研究 .....	上海医药工业研究院	117
新型抗血吸虫药茚满类化合物的合成 .....	上海寄生虫病研究所药物化学研究室	118
新型抗血吸虫药氯乙酰胺类化合物的合成 .....	上海寄生虫病研究所药物化学研究室	119
硝唑咪类抗血吸虫病新药的合成 .....	上海寄生虫病研究所药物化学研究室	120

抗疟新药磷酸咯萘啶(7351)的合成 .....	上海寄生虫病研究所药物化学研究室	120
疟疾防治药物的研究 关于喹唑啉类、嘧啶类衍生物的合成及其抗疟作用 .....	上海医药工业研究院	121
脑啡肽的合成 .....	中国科学院上海药物研究所	122
镇痛药合成研究 II.强效镇痛药芬太尼的合成 .....	中国科学院上海药物研究所	123
治疗三叉神经痛新药酰胺咪嗪的合成 .....	上海第二制药厂合成药研究所	124
肌肉松弛药——肌安松的生产工艺改进 .....	第二军医大学药系有机药物化学教研室	124
氟碳人造血液 .....	中国科学院上海有机化学研究所 604 组等	125
新型血浆代用品羧甲基糖淀粉的研究 I.化学部分 .....	"403"血浆代用品研究协作组	125
喹啉臭氧化制备烟酸 .....	上海医药工业研究院	126
自对硝基甲苯制备甲氧苄胺嘧啶中间体 3,4,5-三甲氧基苯甲醛 .....	上海医药工业研究院等	127
石吊兰素及其类似化合物的合成 .....	中国科学院上海药物研究所等	128
五味子素类似物的研究 .....	中国科学院上海药物研究所	129
4-氨基喹啉衍生物的合成及其对实验性矽肺的治疗作用 .....	上海医药工业研究院	129
萤光标记剂——异硫氰基萤光素的合成 .....	第二军医大学药系有机药物化学教研室	130
碘化胆固醇的化学合成研究 .....	上海第九制药厂	131

## 抗 菌 素

氨基糖甙抗菌素的化学研究 I.甘露糖基-3'-脱氧巴龙霉素类的结构 .....	中国科学院上海药物研究所	132
抗菌素 798 的研究 .....	上海医药工业研究院	133
抗肿瘤抗菌素的化学研究 I.新抗肿瘤抗菌素——C-1329 B 的分离与结构 .....	中国科学院上海药物研究所	134
抗肿瘤抗菌素的研究——自力霉素类的分离与结构 .....	中国科学院上海药物研究所	135
抗肿瘤抗菌素链褐霉素的研究 .....	上海医药工业研究院	137
抗代谢抗菌素——L-4-氧代赖氨酸的研究 .....	中国科学院上海药物研究所	138
一种高度稳定的固相青霉素酰胺酶 .....	上海第三制药厂等	139
红霉素链霉菌 13-123、9-203 菌株的选育及发酵特性研究 .....	上海第三制药厂抗菌素研究所	140
争光霉素组份的初步研究 .....	上海第三制药厂抗菌素研究所	140
头孢菌素 C 产生菌的选育及发酵研究 .....	上海第三制药厂抗菌素研究所	141
农抗 101-己及庚的分离及结构 .....	中国科学院上海药物研究所	142

## 药 剂 学

中药粗末煎剂的实验研究 .....	上海中医学院药系	143
一号超声波探头乳剂的制备 .....	上海市第六人民医院药剂科	144
高浓度硫酸钡胶浆剂的试制 .....	上海市嘉定县南翔医院	144
胃双重造影用硫酸钡制剂的研究 .....	上海第一医学院华山医院	146
溃疡散和溃疡合剂止血作用的比较 .....	华东医院	146
色甘酸二钠粉末混悬气雾剂的研制 .....	上海第七制药厂气雾剂小组	147

急性肝炎冲剂的设计与疗效	华东医院药剂科中草药制剂室	148
安体舒通固体分散体的研究	上海第一医学院药剂学教研组	148
膜剂的新工艺	上海第七制药厂	150
溃疡膜剂的制备及临床应用	上海市第二人民医院药剂科	150
硫糖铝肠溶胶囊与非特异性溃疡性结肠炎	上海市第四人民医院药剂科	151
维生素A微型胶囊的研究	上海医药工业研究院等	152
冠心苏合丸的剂型改进——苏冰滴丸的试制	上海中药制药一厂	153
片剂薄膜包衣材料 聚甲基丙烯酸树脂乳胶漆的研究试制(胃崩性)	上海珊瑚化工厂等	154
B晶型无味氯霉素片剂及干糖浆试制	上海第二十一制药厂技术组	155
片剂辅料硫酸钙的研究试制	上海第十一制药厂等	155
复方制剂的研究——复方氯苯乙酸钙片剂的试制	上海医药工业研究院	159
二硝酸异山梨醇长效片剂研究	上海第一医学院药剂学教研组等	157
锦红片的研制	上海中医学院药学系	158
刺五加片的研制	上海第七制药厂	158
青黛片的制备及其抗白血病的初步临床疗效	上海第一医学院中山医院药剂科	159
青木香有效成份的研究 I. 增噬力酸的制取与临床应用	上海市第一人民医院药剂科等	160
复方制剂的研究——降胆葡胺咀嚼片的试制	上海长征药厂等	160
注射用水新工艺的探讨	上海第七制药厂	161
热原性质的初步探讨(第一报)	上海第七制药厂	162
注射用天花粉质量的研究	上海生物化学制药厂等	164
徐长卿中丹皮酚的研究及应用	上海第一制药厂中心试验室	165
大蒜注射液质量控制的初步探讨	上海第二医学院附属瑞金医院药剂科	166
三棱、莪术有效成份筛选及注射液的制备	上海第一医学院中山医院药剂科	166
七叶莲的研究 II. 三丁酸钠注射液的研究	上海中药一厂等	167
硫酸长春新碱注射液试制	上海延安制药厂等	168
乌头总碱注射液的试制	上海第一医学院华山医院药剂科	169
亚硫酸氢钠穿心莲内酯注射液的试制研究	上海中药二厂等	170
复方鱼腥草注射液的制备及临床应用	梅山工程指挥部职工医院草药组	171
万年青注射液的试制	上海中药二厂等	172
核桃树枝注射液的制备及临床观察	上海市金山县亭林人民医院制剂室	172
子宫脱垂治疗药的研究(第一、二报)	上海市第六人民医院药剂科等	173
大叶唐松草注射液及治疗胃癌的临床效果	长宁区中心医院等	174
大叶唐松草抗癌活性部位的分离	长宁区中心医院等	175
静脉注射用乳剂的研究 I. 脂肪乳剂输液的研究	上海医药工业研究院	176
关于静脉高营养注射液制备的探讨	上海第二医学院附属新华医院药剂科	177
全叶青兰注射液的研究	上海第十制药厂等	177
前列腺素制剂的研究 I. 长效dl-15-甲基前列腺素-F <sub>2α</sub> 注射剂的研究	上海第一医学院	178
前列腺素制剂的研究 II. 长效dl-15-甲基前列腺素-F <sub>2α</sub> 阴道海绵剂的研究	上海第一医学院	179
栓剂基质的研究半合成椰子油基质的试制	上海医药工业研究院	180

葱林外用制剂稳定性的实验观察 .....	华东医院药剂科	181
八角莲脂的制备 .....	上海第二医学院附属瑞金医院药剂科	182
“内障灵”滴眼液的制备 .....	上海第一医学院附属耳鼻喉科医院药剂科	183
升压药物的配伍试验 I. 去甲肾上腺素静脉滴注液的配伍试验 .....	上海第一医学院华山医院药剂科	184
升压药物的配伍试验 II. 新福林静脉滴注液的配伍试验 .....	上海第一医学院华山医院药剂科	185
四环素族药物临床使用分析 .....	虹口区中心医院药剂科	185
门诊急诊处方初步调查分析 .....	上海第四人民医院药剂科	186
光电自动药片计数包装机 .....	上海市海洋渔业公司保健站	187
电子数控中药配方机的研制 .....	华东医院等	188
小型电渗析器的研制 .....	中国人民解放军海军四一一医院药局	188

### 药 物 分 析

硬脂酸镁存在下,有机碱类药物片剂非水溶液直接滴定法的研究 .....	上海医药工业研究院	190
亚胺醌含量测定方法研究 .....	上海医药工业研究院中药、分析研究室	190
氨哮素制剂含量测定方法 .....	上海医药工业研究院中药、分析研究室	191
愈喘气雾剂中愈创木酚甘油醚的含量测定方法 .....	上海第七制药厂	192
丙酸睾丸素油剂的含量测定方法 .....	上海医药工业研究院中药、分析研究室	193
苯甲酸雌二醇油针剂的含量测定研究 .....	上海医药工业研究院中药、分析研究室	193
快诺酮中两个未知杂质的结构分析 .....	上海医药工业研究院中药、分析研究所	194
复方快诺酮片中炔雌醇的含量测定 .....	上海市卫生局药品检验所	195
毒物分析中乐果杀虫剂的薄层分析法 .....	中国人民解放军第二军医大学药理学系	195
防治电光性眼药——秦皮眼药水主要成份的含量测定 .....	上海中医学院附属龙华医院	196
径向纸层析在中草药制剂研制工作中的应用 .....	上海第七制药厂	197
103气相层析仪附件小型制备收集装置及其应用 .....	上海医药工业研究院中药、分析研究室等	198
103气相色谱仪毛细管色谱附件的装置及其应用 .....	上海医药工业研究院中药、分析研究室等	199
氨基糖甙类抗菌素的气相色谱测定 .....	上海医药工业研究院中药、分析研究室等	199
药物制剂中乙醇含量的气相色谱测定法 .....	上海第一医学院药理学系分析化学教研组	200
剑麻皂素中替告吉宁和海柯配质的高速液相色谱分析 .....	上海医药工业研究院中药、分析研究室等	200
高压液相层析法测定分配系数 I. 反相层析测定肉桂酸及有关化合物的分配系数 .....	中国科学院上海药物研究所	201
微量样品的红外光谱分析法 溴化钾微量压片 .....	中国科学院上海药物研究所	201
核磁共振光谱法在定量分析中的应用 .....	中国科学院上海药物研究所	202
热分析技术及其在药检工作中的应用 .....	上海市卫生局药品检验所	202
鲎试剂的制备 .....	上海第二医学院附属瑞金医院药剂科	203
尿激酶效价测定方法(气泡法)的研究 .....	上海医药工业研究院	204
自动永停滴定仪的研究 .....	上海市医药公司商品检验组等	206

### 药 理

双羟萘酸副品红的药物代谢动力学研究 .....	中国科学院上海药物研究所等	207
药物代谢动力学常用计算程序 (4)多次给药时血液浓度的估算.....	上海市计算技术研究所等	207
先锋 18 的药物代谢动力学研究 .....	中国科学院上海药物研究所等	208
常咯啉的体内过程.....	中国科学院上海药物研究所等	208
常咯啉抗乌头碱诱发的心律失常机理探讨 .....	中国科学院上海药物研究所	209
常咯啉与其他抗心律失常药合并应用对电刺激家兔左心室致颤阈的影响 .....	上海第一医学院药理教研组	209
冠心苏合丸及其组成的初步药理研究.....	上海第一医学院药理教研组等	210
合用党参、丹参、附子、健心注射液治疗窦病综合症的药理.....	上海第一医学院药理教研组等	211
丹参酮 II-A 磺酸钠的药理研究 .....	中国科学院上海药物研究所	211
双脂嗪(扩冠嗪)对心血管系统的药理作用及与丹参合用时的初步实验疗效观察 .....	上海第一医学院药理学系药理生化教研组	212
决明子治疗高血脂作用的初步探讨 .....	上海邮电医院药剂科	213
微量血清总胆固醇直接测定法及降脂药物的筛选 .....	上海第一医学院药理学系	214
绵羊血液制剂 749 的免疫刺激效应与免疫恢复效应.....	中国科学院上海药物研究所等	215
国产尿激酶制剂的毒性试验.....	上海医药工业研究院生物化学研究室等	216
抗菌素氧代赖氨酸的抗肿瘤作用 .....	中国科学院上海药物研究所	217
乙亚胺的抗肿瘤作用 .....	上海第十二制药厂	217
注射用天花粉对早孕兔子宫的作用 .....	上海第一医学院药理教研组	218
15-甲基前列腺素- $F_{2\alpha}$ 和 13-去氧- $\omega$ -乙基前列腺素- $F_{2\alpha}$ 对妊娠大白鼠血中 孕酮的影响.....	上海第一医学院药理教研组	219
雌二醇衍生物的构效关系 .....	上海第一医学院药理教研组	220
复方苯酚糊剂用于妇女非手术绝育的药理研究 .....	上海医药工业研究院药理研究室	220
男用避孕药“2292”与 $\alpha$ -氯代甘油对猴毒性的比较研究 .....	上海第二制药厂	221
抗血吸虫药物氟乙酸类的毒性与儿茶酚胺引起心搏骤停作用.....	上海寄生虫病研究所	222
呋喃丙胺代谢与疗效的研究 .....	上海寄生虫病研究所药理室生化组等	223
用伊文思兰法观察呋喃丙胺对小白鼠胃的刺激作用及拮抗药物的探讨 .....	上海寄生虫病研究所药理研究室	223
鹤草酚的提取分离及其治疗动物血吸虫病的研究 .....	上海寄生虫病研究所药理室中草药组等	224
茛菪满脐类化合物 S 75029 实验治疗动物血吸虫病的疗效与毒性 .....	上海寄生虫病研究所药理研究室	225
血吸虫柠檬酸代谢研究与抗血吸虫病药物的寻找.....	上海寄生虫病研究所	226
新抗疟药磷酸咯啉与伯喹合用对大鼠血浆伯喹浓度的影响 .....	中国科学院上海药物研究所	227
驱除肠道寄生线虫广谱驱虫药——甲苯咪唑 .....	上海寄生虫病研究所钩虫病研究室	228
驱除肠道寄生线虫药物——双萘羟酸噻嘧啶 .....	上海寄生虫病研究所钩虫病研究室等	228
毛叶轮环藤(银不换)的肌松作用研究 .....	中国科学院上海药物研究所	229
粉叶轮环藤碘甲基化总碱 2 号的药理(初报) .....	上海中医学院	230
粉叶轮环藤总碱 II 号(即 2 号针剂)临床试用小结.....	上海中医学院附属曙光医院等	231
包公藤茎提取物的眼科药理试验 .....	上海第二医学院新医药学教研组等	231

氧代赖氨酸治疗肝炎的药理和临床研究	中国科学院上海药物研究所等	232
款冬花的药理研究(二) 对心血管系统的作用	上海中医学院药理教研组	223
款冬花的药理研究(三) 毒性及对中枢神经系统的作用	上海中医学院药理教研组	234
虎耳草的药理研究初报	上海中医学院药理教研组	235
抗菌剂 402 的毒性及药理研究	上海中医学院药理教研组	235
家兔酵母发热法	上海中医学院药理教研组	236

## 提要

石吊兰的概述及其应用	长宁区武夷路地段医院	238
青浦县中草药资源和药用情况的初步报导	青浦县朱家角人民医院	238
昆明山海棠的初步分离	上海第二制药厂	238
草河车有效成份研究	上海中医研究所中草药室植化组	238
治疗小儿肺炎的一些中草药制剂	上海第一医学院儿科医院药剂科	239
复方连钱草糖浆的制备及对传染性肝炎的疗效观察	松江县人民医院	239
20%口服谷固醇混悬剂的试制	上海医药工业研究院等	239
复方苯酚糊剂的研制	上海第七制药厂	239
几种治疗宫颈炎的中草药制剂制备方法和疗效观察	黄浦区张家浜街道医院	240
过氧乙酸溶液稳定性探讨	上海市第四人民医院药剂科	240
木贼滴眼液稳定性探讨	上海市第四人民医院药剂科中草药组	240
葡萄糖输液与不同浓度的四环素与氨茶碱配伍变化观察	上海市第四人民医院药剂科	240
白花蛇舌草注射液及其治疗胃癌与胃窦炎的临床观察	长宁区中心医院药物筛选小组	241
白花蛇舌草注射液的制备及对乙型肝炎的疗效观察	川沙县人民医院药剂科	241
艾叶油注射液的提制及治疗甲状腺瘤等介绍	上海第二制药厂中心试验室	241
黄药脂注射液制备方法探讨	上海市第四人民医院药剂科中草药组	241
在复床式离子交换树脂纯水器中加用弱碱性阴树脂增加产水量	上海市静安区静安医院	242
用锅炉回笼水以离子交换法制备纯水	上海中医学院附属曙光医院药剂科	242
盐酸青霉胺片的研制	上海第七制药厂	242
补骨脂素片及其临床应用	上海第二制药厂中心试验室	242
臭梧桐叶制剂的研究	上海中医学院药系	243
芩部丹片剂研制	上海中医学院药系	243
艾叶片和注射液的研究	上海第七制药厂	243
复方白及蒲黄止血散剂处方分析及疗效观察	黄浦区浦东中心医院药剂科	243
党参注射液的制备和对再生障碍性贫血的疗效	黄浦区张家浜街道医院	244
抗菌增效剂对抗结核药物增效作用的实验研究	上海结核病中心防治所	244
麻沸散的研究	上海中医学院	244
复方当归注射液扩血管作用的研究及对肢端动脉痉挛症的疗效观察	虹口区中心医院药剂科	244
鸡矢藤注射液药理作用探讨	南市区董家渡地段医院	245
中草药抗真菌成份的研究 桂皮醛抗真菌作用的体外实验	上海市第一人民医院药剂科	245

# 综 述

## 新药研究发展趋向

中国科学院上海药物研究所 嵇汝运

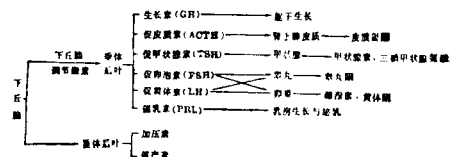
创制新药的研究方式，百年来已经形成一个公式：将天然药物的有效成分，或有生物作用的合成化合物作为基础，将其化学结构进行改造，从中寻找活性更高或毒性更低的新物质。在这探索过程中，设想在生物体的某个分子部分能与药物分子相结合，然后产生作用。与药物的化学结构大同小异的一系列化合物，也能以强弱不等的作用力与这生物体的分子部分相结合，因而含糊地将这生物体内与药物相结合的部位称为受体。进入到七十年代，由于实验技术日益昌明，基础研究逐步深入，受体已不再只是抽象的概念<sup>[1]</sup>，乙酰胆碱的烟碱样受体已经分出，肾上腺素能神经 $\beta$ 受体以及胰岛素、雌激素等受体的存在已经证实。并且，人们开始理解在体内、体外不断变化的环境中，机体内调节系统怎样协调其代谢变化与生理作用，将功能保持在稳定的状态。稳定状态被扰乱便导致疾病。药物或有毒物质也都作用在维持稳定的体系。应用近代物理与化学技术还从体内分离并鉴定了一些起着调节作用的微量物质。基础研究的成果，无疑将影响新药研究的方向。

近年来对于神经与激素的活动进行了大量研究，因为大量生命活动，通过神经或激素传递讯息。神经恍如电报，神经纤维传递电的讯息。激素恍如无线电，产生激素的细胞将讯号投入循环血流，顺流虽能遍及全身，效应细胞却依赖其特异的受体，选取有关激素，

结合而产生生理效应。各种激素不是孤立地产生作用，而是许多激素相互协同或相互制约。例如下丘脑释放一系列调节激素，经门静脉流至垂体，激发或抑制垂体激素的释放<sup>[2]</sup>，其中兴奋垂体激素释放的，称为释放激素(RH)，抑制垂体激素释放的，称为抑放激素(RIH)。下丘脑调节激素有下列十种。

- 促皮质素释放激素(CRH)
- 促甲状腺素释放激素(TRH)
- 促黄体素释放激素(LHRH)
- 促卵泡素释放激素(FSHRH)
- 生长素释放激素(GHRH)
- 生长素抑放激素(GHRIH)
- 催乳素释放激素(PRH)
- 催乳素抑放激素(PRIH)
- 促黑素释放激素(MRH)
- 促黑素抑放激素(MRIH)

只有豌豆样大小的人的前垂体，经下丘脑调节激素的作用，分别释放一系列垂体激素，这些垂体激素又作用于外周器官，促使释放相应外周激素，例如垂体释放的促甲状腺素，作用于甲状腺以释放甲状腺素、三碘甲状腺氨酸等，而垂体释放的促皮质素，则作用于肾皮质以释放可的松等皮质甾酮。各类激素之间作用如下图所示：

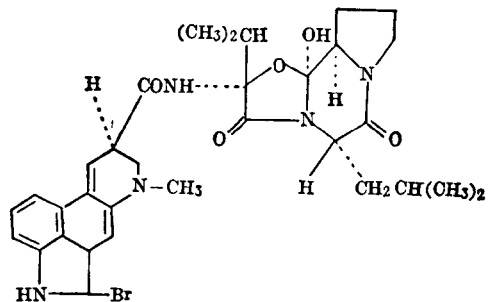


这样，几类激素的相互作用，控制着生长、性发育、生殖、甲状腺功能等，很大程度上关系到机体对紧急与疾病的反应。因此，那一种激素释放偏高或偏低，就会产生病态。掌握了这些机理，就有可能创制新药，人为地改变激素的分泌，从而矫正病态，以下仅略举数例。

垂体释放的生长素促进躯体生长和性激素活力，加速骨折愈合，降低血胆固醇浓度，并加快合成蛋白质。生长阻滞的患者如侏儒等补充以生长素，可恢复其生长<sup>[3]</sup>，反之，生长素偏高，就可能患肢端肥大病。下丘脑对生长素释放的控制以抑制为主，生长素抑放激素(Somatostatin)抑制垂体释放生长素，并从而减低胃酸的分泌，还抑制胰岛素与胰高血糖素的分泌。胰腺所分泌的胰岛素将血液中葡萄糖转运至肝脏贮藏，因而降低血糖，胰高血糖素将肝脏内贮藏的葡萄糖调至血内，因而增高血糖。糖尿病患者胰岛素或其受体不足，而胰高血糖素过多。胰高血糖素还促使肝脏内脂酸氧化，并将氧化产物 $\beta$ -羟基丁酸等释至血内，便增高血内酸度，而使患者因酸中毒而昏迷，甚或死亡。滴注生长素抑放激素。可抑制胰高血糖素释放，防止患者酸中毒<sup>[4]</sup>。如果进一步改变其化学结构，增强对胰高血糖素分泌的抑制，但减弱对胰岛素分泌的抑制，应有可能发展为新型糖尿病药物。

垂体还分泌有催乳素，促进泌乳及促使乳房正常发育。催乳素降低体内促黄体素与促卵泡素的分泌，后二种垂体激素对于女性本有调节月经、促进排卵、兴奋卵巢分泌雌激素等性激素的功能。催乳素过多的妇女，往往闭经而不排卵。中枢多巴胺能神经通过下丘脑抑制垂体分泌催乳素。因之，兴奋多巴胺能神经的药物也有抑制催乳素之效。左旋多巴的作用时间过于短促，麦角类药物如麦角考宁(Ergoconine)可减少催乳素，但有兴奋子宫平滑肌与收缩血管作用。用近年发现2-溴- $\alpha$ -麦角隐亭(Bromocryptine, CB 154)<sup>[5]</sup>为强

大的多巴胺能神经受体激动剂，没有麦角考宁的副作用，闭经多年的妇女应用后月经来潮，并恢复生殖力<sup>[6]</sup>。



2-溴- $\alpha$ -麦角隐亭

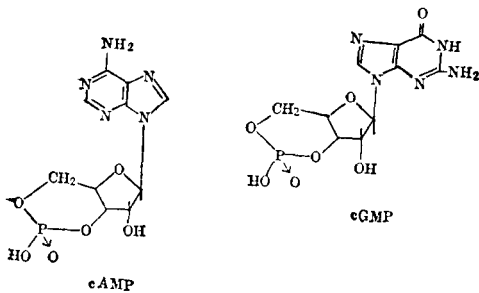
近年实验结果提示，催乳素与乳癌也有一定联系。高剂量的催乳素能使大鼠或小鼠产生乳癌，大鼠截除垂体后肿瘤消失，但注射催乳素后又复生长。这个线索引人设想用多巴胺能激动剂以控制催乳素，从而治疗乳癌。可是，雌激素与黄体酮对于乳癌的产生也有一定影响<sup>[7]</sup>，因而设计新药，还必须同时考虑几种激素。

前述下丘脑调节激素都是肽链不长的多肽化合物，垂体激素也是多肽激素，其肽链较下丘脑激素为长，已经进行过许多探索，发现有些合成物质比天然激素有更强作用，另有一些物质具有拮抗作用，进一步研究会发现更多的多肽类药物以矫正由于激素作用缺陷而产生的疾病。

吗啡及有关镇痛药物在临床久已应用，近年发现脑内有特异性的吗啡受体，之后又发现还有内源性激动剂与这受体相作用，这类激动剂是多肽物质，称内啡肽(Endorphin)<sup>[8]</sup>，其中肽链最短的化合物只有五个氨基酸，称为脑啡肽(Enkephalin)<sup>[9]</sup>。后者设想为多肽能神经的递质，调节对痛的感觉，可能也影响精神行为。脑内另有一种十一个氨基酸组成的多肽，称为P物质<sup>[10]</sup>。P物质和脑啡肽都和痛觉有关，P物质传递痛感，而脑啡肽抑制痛。这二多肽在脑内与脊椎内并存在相同部位。传递较慢的微细神经纤维通至

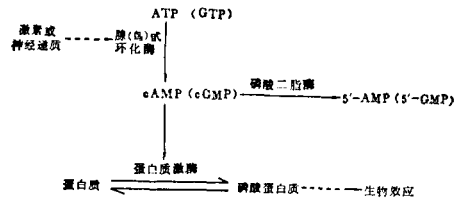
脊椎,兴奋时释放P物质以传递痛觉讯号。脑啡肽抑制这些纤维在放电时释放P物质,从而排除其痛觉讯号,这样便产生镇痛作用。吗啡等药物的镇痛作用是由于其构象类似脑啡肽,因而拟似脑啡肽的生物作用。人们久有愿望寻找没有成瘾性的镇痛药,理解痛觉传递的分子原理将有助于探索新药。

许多激素传递讯息,都通过二种环状核甙酸的中介作用,其一为环磷酸腺甙(cAMP),其二为环磷酸鸟甙(cGMP)。



首先发现激素传递讯息通过cAMP的中介作用<sup>[11]</sup>,激素与处在细胞膜外侧的受体结合,便激活处在细胞膜内侧的腺甙环化酶(Adenylyl cyclase),乃将三磷酸腺甙(ATP)转变为cAMP,后者将特异性的蛋白磷酸化<sup>[12]</sup>,从而产生许多效应,如氨基酸的转运,蛋白质的合成,线粒体内电子的转移等,因此,cAMP的作用是接受了激素的讯息,再在细胞以内转送这讯息,因而称为“第二信使”。一个激素分子与细胞作用后,可产生好几个cAMP分子。这样,通过cAMP,实际起了“放大”的作用。一些药物作用,也通过cAMP的环节。注射肾上腺素后,三秒钟内cAMP的浓度增至四倍,乃产生增强心肌收缩与增快心搏等效应。离子透入cAMP,或给以化学性质比cAMP更为稳定的二丁酰cAMP,也一如肾上腺素,产生正性肌力作用与正性传导作用,并增加冠状动脉血流。有些药物抑制腺甙环化酶,从而减低cAMP的产生,便有拮抗的效果,例如心得安等肾上腺素能

神经β受体阻滞剂抑制儿茶酚胺激活腺甙环化酶的反应,因而抑制心肌与减缓心搏,但它们并不抑制外源的二丁酰cAMP产生的正性肌力作用。反之,肾上腺素能神经β受体激动剂如异丙肾肾上腺素增加cAMP的浓度,促使肠、子宫、支气管等平滑肌舒张。cAMP经磷酸二酯酶的作用而水解,变为5'-腺甙单磷酸酯(5'-AMP),便使效应失去。有些药物由于作用于磷酸二酯酶而产生药理作用,例如茶碱、潘生丁、罂粟碱等抑制磷酸二酯酶,从而阻滞cAMP的破坏,乃加强了cAMP的舒张血管、支气管等平滑肌的效应。



许多激素如血管加压素、促皮质素、促黑素、促黄体素、甲状旁腺素、促甲状腺素等也通过cAMP为媒介,因之机体的许多生理效应通过cAMP的作用,如肌肉活动、细胞代谢、胃液分泌、中枢神经活动、肝细胞调节糖原代谢、甲状腺细胞产生甲状腺素、胰腺β细胞释放胰岛素等。可是,也有许多激素的作用不是通过cAMP,进一步探索发现另一环状核甙酸cGMP。后者通过鸟甙环化酶将三磷酸鸟嘌呤(GTP)转变生成。cGMP在各种组织都有存在,但含量仅及cAMP的1/10~1/5。在cAMP浓度较低的一些组织如脑髓、睾丸、肺等处,cGMP的含量却较多。乙酰胆碱在抑制心肌收缩的同时,细胞内cGMP浓度增至2~3倍,外源的cGMP加入至灌流的心脏,也一如乙酰胆碱抑制心肌收缩。催产素、胰岛素、5-羟色胺、组胺等产生效应时,也同时增加细胞内cGMP含量。

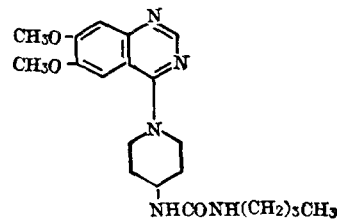
前述二种环状核甙酸中一种浓度偏高,就会阻止另一种核甙酸的生成、代谢或作用,因而这二种核甙酸往往产生相反效应,如收

缩与松弛，糖原的合成与分解等。异丙肾上腺素促使心肌收缩时，一方面升高 cAMP 的浓度，另一方面也同时降低 cGMP 的浓度。用茶碱类药物以增加细胞内 cAMP 浓度，也同时消除 cGMP 的效应。在免疫反应，cAMP 抑制抗原与抗体反应时所释放的化学媒介，而 cGMP 则加强这些媒介的释放。细胞的增生与接触抑制可能与这二种环状核甙酸的相对浓度有关，高浓度的 cAMP 抑制小鼠成纤维细胞增生而促进分化，cGMP 则抑制这效应。

既然二种环状核甙酸相互制约调节着细胞效应，二者浓度偏高或偏低，就会产生机能失调而呈病态。高血压在发展早期，持续的交感神经功能亢进或血管紧张素水平升高逐渐损坏腺甙环化酶，降低其对  $\beta$  受体兴奋的灵敏性，同时磷酸二酯酶活力增加，这样就使 cGMP: cAMP 比例增高。cAMP 促使血管平滑肌舒张，cGMP 则促使其收缩，cGMP: cAMP 的比例升高乃增加血管张力与外周阻力。同样，哮喘患者给肾上腺素后产生的 cAMP 比常人为低，说明腺甙环化酶的灵敏性已降低。皮质甾酮治疗哮喘的原理正在乎恢复这酶的灵敏性。在某些类型心脏麻痹症，胰高血糖素不足以激活心脏腺甙环化酶，牛皮癣患者的磷酸二酯酶活力增高，从而也增高 cGMP: cAMP 比例。癌症患者的腺甙环化酶的灵敏性也可能降低，而 cGMP 水平升高促使癌细胞分裂。在另一些疾病，cAMP 的水平过高，例如糖尿病患者的 cAMP 合成增快而破坏减慢，动脉粥样硬化动物模型的特征为腺甙环化酶活力升高而鸟甙环化酶活力降低，甲状腺机能亢进症由于长效甲状腺兴奋素过度激活腺甙环化酶。在精神病患者中，抑郁型患者尿中 cAMP 偏低，而狂躁型患者偏高。

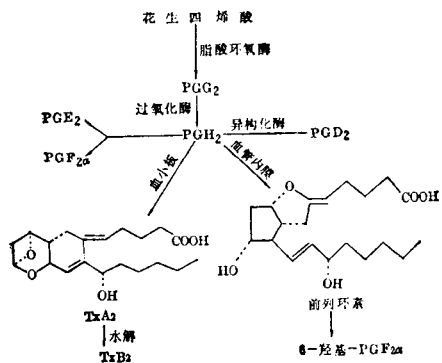
环状核甙酸水平偏高或偏低产生的病态，应有可能用药物来矫正。药物可通过四个环节产生作用<sup>[18]</sup>：(1) 特异性地阻断激素

对于环化酶的激活作用，例如心得安阻滞肾上腺素能神经  $\beta$  受体的兴奋以激活腺甙环化酶，阿托品阻滞乙酰胆碱对鸟甙环化酶的激活作用。(2) 细胞内环状核甙酸浓度超过与靶细胞产生效应的有效浓度，可能部分核甙酸在细胞内与特异性蛋白相结合，需用时再释放，如果找到一些干扰其结合的药物，将影响细胞内的浓度。(3) 拟似环状核甙酸作用的物质，应产生类似效应。咖啡碱、氯甲苯噻嗪 (Diazoxide)、潘生丁、胍苯吡嗪、烟酸、罂粟碱、双氢氯噻嗪类利尿药都抑制磷酸二酯酶，从而增加细胞内 cAMP 浓度。UK14,275 也通过这机理而有正性肌力作用，增加心输出量<sup>[14]</sup>。(4) 如果环状核甙酸过多，如狂躁症 cAMP 过高，牛皮癣 cGMP 过多，也可用药物以拮抗其作用。甲苯磺丁脲降低血糖的机理可能由于拮抗环状核甙酸的效应。



机体内还有一类具有高度生理作用的微量物质，称为前列腺素，作用于细胞膜，产生除极作用，释放结合的钙离子，从而调节细胞的功能与代谢，对于各种平滑肌或产生兴奋，或产生抑制。前列腺素  $E_2$ 、 $F_{2\alpha}$  等已应用于催产或流产，对高血压、哮喘、胃溃疡等疾病的治疗价值，也正在探索。近年发现在体内前列腺素转变的过程中，还有化学性质异常不稳定，但生理作用更为强大的化合物，调节血管张力与血小板凝聚等作用。迅速流动着的血流内血小板非可逆地凝聚是产生血栓的关键性前奏，动脉循环中血栓的产生，可能阻塞冠状血管或脑血管，从而发作心肌梗塞或脑卒中。前列腺素的前体为花生四烯酸，环氧化酶将其转变为  $PGG_2$ ，后者再在过氧化酶作用下转变为  $PGH_2$ 。血小板将  $PGH_2$  转变为

凝血噁烷  $A_2$  ( $TxA_2$ )<sup>[15]</sup>, 后者有着强大的血小板凝聚作用, 并强烈地收缩血管平滑肌。可是, 血管内膜另有一种酶, 可将  $PGH_2$  转变为前列环素 (Prostacyclin,  $PGI_2$ )<sup>[16]</sup>, 它有强大的作用阻止血小板凝聚, 并松弛血管, 降低血压。



前列环素促进 cAMP 的产生<sup>[17]</sup>,  $TxA_2$  则抑制其产生。 $TxA_2$  与前列环素这样二种作用强大, 但效应相反的物质相互配合与制约, 保证了循环系统的稳定<sup>[18]</sup>, 调节着包括冠状血管床在内的血管张力, 促凝聚与抗凝聚作用的平衡保持了血管的完整性。血小板试图粘着于血管内膜而释放  $PGH_2$ , 血管将这些物质转变为前列环素, 以阻止血小板粘附。前列环素还限制已产生的斑块发展, 甚而使其脱离血管, 以利于血管修复创伤。

循环系统内  $TxA_2$  与前列环素间如失去平衡, 例如  $TxA_2$  过多, 或前列环素不足, 便有可能产生血栓或高血压, 动脉粥样硬化模型兔的  $TxA_2$  转换率比对照兔高, 脂的过氧化抑制前列环素的合成。15-氢过氧化花生四烯酸 (15-HPAA) 尤为特异性的前列环素合成酶抑制剂。动脉粥样硬化斑块含有较高水平的脂过氧化物, 可能脂过氧化物使前列环素合成酶慢性中毒, 从而使冠状动脉血管合成前列环素减少, 从这角度出发, 应寻找一些药物抑制  $TxA_2$  的产生, 或加强前列环素的作用。阿司匹林类药物对冠心病的作用近年研究很多。这类药物作用在抑制环氧化酶的

环节上, 从而限制  $TxA_2$  的产生, 这对冠心病是有利的, 但前列环素的产生也要通过环氧化酶, 其合成也受抑制, 这对冠心病是不利的。因而, 阿司匹林的作用欠缺特异性, 不是治疗冠心病的合理药物。

$TxA_2$  与前列环素合成酶在机体广泛存在, 其生理作用不限于心血管系统, 例如前列环素对于支气管收缩的实验动物有强大舒张作用, 说明其对哮喘的作用。可是, 前列环素过多, 阻止血小板凝聚, 也可造成易于出血, 严重肾衰竭患者有出血并发症, 其静脉内前列环素多于常人。

癌症与抗癌药物的研究是举世瞩目的重大课题, 发表的报告很多, 这里只提一个问题, 癌细胞与正常细胞的重大区别在于无限增殖以及转移。另一方面, 已经癌变的细胞, 也有可能重新回复为正常地生长, 例如蔓延十分迅速的成神经细胞癌, 可在几个月内夺去患者的生命, 但也偶而神秘地转变为正常细胞, 患者自愈, 经几年后也不复发。近年实验结果提示细胞膜的功能畸变可能与癌症有关。由于这畸变, 癌细胞不能互相识别并粘附于邻近细胞, 因为细胞间的通讯要通过细胞膜。细胞膜的结构恍如蛋白质“岛屿”飘移在脂质“海洋”中, 有些蛋白质带有糖分子所组成的链, 称为糖甙。糖甙上的糖已鉴定的有六种, 但可以无数不同方式与蛋白质相结合。细胞可能利用膜上的糖分子以彼此识别, 例如甲细胞上的酶可将糖加至邻近乙细胞的糖甙上, 以改变其细胞表面, 从而互换情报。癌细胞可能由于酶或糖甙有缺陷, 不能互换糖。此外, 糖甙或糖酯也可作为受体, 导致细胞增生或分化, 例如甲细胞的糖甙作为受体, 与乙细胞带有糖的酶相结合。用放射性同位素标记, 可测知正常细胞具有分子量约 25 万的糖甙分子, 而癌细胞却很少这种受体。霍乱菌毒素促使细胞内大量产生 cAMP, 后者浓度增加便减慢细胞的增生, 但癌细胞的受体太少, 致使霍乱菌毒素也不能减慢癌

细胞增生。

生命活动不是静止不动的,而是“不断地自行产生并自行解决的矛盾”。机体有着一整套互相配合、互相制约的分子机理,以维持恒定的环境。可是,“对立的统一是有条件的,暂时的,相对的,而对立的互相排除的斗争则是绝对的”。近代基础研究阐明的一些分子机理,如释放与抑放、兴奋与抑制、cAMP 与 cGMP、增生与接触抑制等,与祖国医学千百年的实践总结出来的阴阳理论是一致的。《素问》说:“生之本,本于阴阳”。阴阳偏胜,即“阳生阴长,阳杀阴藏”,便会失去平衡,导致病态。机体的反馈功能,如前述血小板将  $PGH_2$  转变为  $TxA_2$ ,而血管却将其转变为作用相反的前列环素,也协助保持恒定,免除疾患,这又不禁令人回想祖国医学五行学说,相生相克的道理。张景岳说过:“造化之机,不可无生,亦不可无制,无生则发育无由,无制则亢而为害,必须生中有制,制中有生,才能运行不息,相反相成”。今天摆在我们面前的任务,是发掘祖国医学宝库,与近代基础科学相结合,进一步探索生命活动的物质基础,并在这基础上走出一条更合理化的创制新药道路,以便找出新药好药,征服各种顽症绝症,促进人民健康,让人民群众带着健康的身心,紧跟英明领袖华主席,为极大地提高整个中华民族的科学文化水平,胜利地完成建设社会主义的现代化强国的伟大历史使命而奋斗!

#### 主要参考文献

- [1] Ariens, E. J. and Beld, A. J.: *Biochem. Pharmacol.*, **26**: 913, 1977.
- [2] Vale, W. et al: *Clin. Endocrinol.*, **5**, Suppl., 1976.
- [3] Braunstein, G. D. et al: *New Eng. J. Med.*, **292**, 332, 1975.
- [4] Gerich, J. E. et al: *New Eng. J. Med.*, **292**, 985, 1975.
- [5] Johnson, A. M. et al: *Br. J. Pharmacol.*, **56**, 59, 1976.
- [6] Thorner, M. O. et al: *Br. Med. J.*, **4**, 694, 1975.
- [7] McGuire, W. L. et al: *J. Steroid Biochem.*, **7**: 875, 1976.
- [8] Li, C. H.: *Arch. Biochem. Biophys.*, **183**, 592, 1977.
- [9] Feldberg, W. and Smyth, D. G.: *Br. J. Pharmacol.*, **69**, 445, 1977.
- [10] Davies, J. and Dray, A.: *Nature*, **268**, 351, 1977.
- [11] Major, P. W. and Kilpatrick, R.: *J. Endocrinol.*, **52**, 593, 1972.
- [12] Greengard, P.: *Science*, **199**, 146, 1978.
- [13] Amer, M. S. and McKinney, G. R.: *Life Sci.*, **13**, 753, 1973.
- [14] Jackson, P. G. et al: *Br. J. Clin. Pharmacol.*, **5**, 7, 1978.
- [15] Fitzpatrick, F. A. and Gorman, R. R.: *Prostaglandins*, **14**, 881, 1977.
- [16] Bunting, S. et al: *Prostaglandins*, **12**, 897, 1976.
- [17] Tateson, J. S. et al: *Prostaglandins*, **13**, 389, 1977.
- [18] Gorman, R. R. et al: *Prostaglandins*, **13**, 377, 1977.

## 近年国外天然药研究概况

第二军医大学药系中草药学教研室

### 一、总的情况

最近二十年来,国外对天然药的研究极为重视,特别是植物成分的研究进展更快。在

这以前的几十年中,国外对天然药特别是植物药的品种和鉴定工作极为注意;而近二十年来对天然药的研究,多偏重于从植物系统

分类中找出它们相互间在化学成分上的亲缘关系,从而发展了植物化学分类学这样一门新学科。对于原来以鉴定药物真伪优劣为目的的植物形态学、组织学的研究,仅日本、苏联、印度等国家仍相当重视外,其余工业发达的国家,多着重于化学成分的探讨。由于这方面研究工作的迅速进展,使天然药成分化学发展成为植物化学中的一个主要分支;在植物化学这个领域里亦已成为一块最茂盛而丰产的园地。

### (一) 寻找新药

七十年代以来,国外比以前更加注意研究天然药,特别注意在植物界寻找抗癌药、心血管药、避孕药、强壮药以及神经系统药物等的资源。也注意到镇痛药、抗阿米巴和驱肠虫药、防治肝病及利胆的药物。降血糖药、抗血凝药以及对小儿麻痹症有效的药物和肌肉松弛剂等的研究,也受到重视。目前主攻方向集中在抗癌药、心血管药、抗感染药(抗病毒药)、自体免疫性疾病治疗用药等。对各种人体自卫机制的研究也因而愈益深入。

### (二) 研究面的扩大

1. 研究的对象 目前国际上天然药物研究的对象,除高等植物外,还注意到藻类、菌类和地衣类以及海洋生物;但又结合重点,集中对某些科属的植物进行研究。例如过去的重点是夹竹桃科,近年因寻找抗癌药,则较多地对粗榧科、卫矛科、瑞香科、大戟科的植物进行研究。菊科的地胆属植物、堆心菊属植物、泽兰属植物、斑鸠菊属植物、天人菊属植物也引人注目。在寻找人参等强壮药的代用品方面,则较重视对五加科、景天科植物的研究。

2. 重视民族植物药的研究 美、苏、英、法、日等国为了寻找新药,除了研究本国内的植物外,还向热带非洲、南美洲及东南亚等发展中国家调查当地民间常用的药用植物,进行植物分类和成分探讨,借以发现有效的品种。

3. 成分研究方面的新课题 在化学成分方面,生物碱、强心甙、三萜皂甙、甾体皂甙、香豆精等化合物的研究,仍维持兴盛的局面;黄酮类、萜烯类、多糖类、蛋白质和氨基酸等也都十分引人注目。例如在寻找抗癌药的各类活性成分中,多糖类占22%,蛋白质占12%,都是相当大的百分比,而多糖类则是由强化癌宿主生体的抗癌机构而达到间接抑癌作用的,这为抗癌药的研究开辟了一条新的途径。在对人体自卫机制的研究中,干扰素、前列腺素、下丘脑激素以及生长激素抑制因子等则是这方面的新课题。

### (三) 研究方法及途径

关于研究方法途径仍是多学科协同研究。以从事植物、化学、药理和临床的全面系统的研究收效较大,而以药理引路。药理研究方法中,机遇筛选仍系一种重要的方法。一物多筛仍将会广泛应用。在过去二十多年中,用这种方法找到了新药,也从老药找到了新用途。另外,经验式的研究方法也将必定更受重视。当前国外植物药研究的过程和成药基本上一样;不同的方面是:(1)要进行生药学研究,制定标准规格,以保证药物来源的真实性和其品质纯度及优良度;(2)要进行药用植物栽培、引种与培育新种的研究,以保证生产与科研的药源。

### (四) 研究技术的进步

新技术与新方法的应用,是近年国外植物药研究工作进展较快的一个主要原因。目前运用的各种层析法,如全自动化的气相色谱、高压液相色谱、分子筛层析、离子交换层析、高效薄层层析等等;超过滤技术、电泳、闪光分解、同位素技术等近年都有新的进展。在测定天然有机化合物结构方面的常用仪器有紫外分光光度计、红外分光光度计、质谱仪和核磁共振仪等;研究天然化合物的立体化学等方面,旋光谱仪、圆二色光谱仪、X线衍射仪等都起了分辨的作用。最近国外分析仪器仍不断有新的改进和发展,如气相色谱—质