

院士科普书系 第4辑

药物与化学

梁晓天 主编

清华大学出版社
北 京

暨南大学出版社
广 州

内容简介

“神农尝百草”是人类最早利用药物治疗病的传说之一。在漫长的治病防病过程中,人类对药物的了解和制备从简单到复杂,从自然利用到人工合成,从宏观实物到微观分子,直到形成现代药物学。本书较为通俗地介绍了药物学的发展史、现代药物的分类、中草药的研究、抗生素、天然海洋药物、内源性活性物质和药物、手性药物、药物的剂型、药物分子设计、新兴的组合化学、化学品的质量控制、天然产物的全合成等内容。

版权所有,翻印必究。举报电话:010-62782989 13901104297 13801310933

图书在版编目(CIP)数据

药物与化学/梁晓天主编. —北京:清华大学出版社;广州:暨南大学出版社,2004.11

(院士科普书系/路甬祥主编)

ISBN 7-302-09141-2

I. 药… II. 梁… III. 药物学—普及读物 IV. R9-49

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2004)第 076729 号

出版者:清华大学出版社

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

社总机:010-62770175

地址:北京清华大学学研大厦

邮编:100084

客户服务:010-62776969

组稿编辑:宋成斌

文稿编辑:魏艳春

印装者:清华大学印刷厂

发行者:新华书店总店北京发行所

开本:140×203 印张:6.625 字数:131千字

版次:2004年11月第1版 2004年11月第1次印刷

书号:ISBN 7-302-09141-2/R·63

印数:1~3000

定价:12.00元

本书如存在文字不清、漏印以及缺页、倒页、脱页等印装质量问题,请与清华大学出版社出版部联系调换。联系电话:(010)62770175-3103 或(010)62795704

《院士科普书系》编委会

编委会名誉主任 周光召 宋 健 朱光亚

编委会主任 路甬祥

编委会委员 (按姓氏笔划排序)

王佛松 王 越 王 夔 方智远 卢永根

母国光 旭日干 刘大响 刘元方 刘鸿亮

关 桥 汤钊猷 许根俊 孙鸿烈 李大东

李廷栋 李依依 杨 乐 吴有生 吴德馨

何凤生 何鸣元 汪旭光 汪品先 陆建勋

陈可冀 陈运泰 陈建生 陈厚群 范维唐

季国标 金怡濂 周干峙 周永茂 周 恒

郑健超 赵忠贤 胡仁宇 钟万勰 钟南山

洪德元 姚福生 秦伯益 顾诵芬 钱七虎

徐冠华 殷瑞钰 黄志镗 龚惠兴 梁栋材

编委会执行委员 郭传杰 葛能全 钱文藻 罗荣兴

编委会办公室主任 罗荣兴(科学时报社)

副主任 何仁甫(中国科学院学部联合办公室)

冯应章(中国工程院学部工作部)

蔡鸿程(清华大学出版社)

周继武(暨南大学出版社)

总 策 划 罗荣兴 周继武 蔡鸿程

总 责 任 编 辑 周继武 蔡鸿程 宋成斌

提高全民族的科学素质

——序《院士科普书系》

人类走到了又一个千年之交。

人类的文明进程至少已有六千余年。地球上各个民族共同创造了人类文明的灿烂之花。中华文明同古埃及文明、古巴比伦文明、古印度文明、古希腊文明等一起，是人类文明的发源地。

十五世纪之前，以中华文明为代表的东方文明曾遥遥领先于当时的西方文明。从汉代到明代初期，中国的科学技术在世界上一一直领先长达十四个世纪以上。在那个时期，影响世界文明进程的重要发明中，相当部分是中华民族的贡献。

后来，中国逐渐落后了。中国为什么落后？近代从林则徐以来许多志士仁人就不断提出和思索这个历史课题。但都没有找到正确的答案。以毛泽东同志、邓小平同志为代表的中国共产党人作出了唯一正确的回答：中国落后，是由于生产力的落后和社会政治的腐朽。西方列强对中国的欺凌，更加剧了中国经济的落后和国家的衰败。而落后就要挨打。所以要进行革命，通过革命从根本上改变旧的生产关系和政

治上层建筑,为解放和发展生产力开辟道路。于是,就有了八十多年前孙中山先生领导的辛亥革命,就有了五十年前我们党领导的新民主主义革命的胜利,以及随后进行的社会主义革命的成功。无论是革命还是我们正在进行的社会主义改革,都是为了解放和发展生产力。

邓小平同志提出的“科学技术是第一生产力”的著名论断,使我们对科学技术在经济和社会发展中的地位与作用的认识,有了新的飞跃。我们应该运用这一真理性的认识,深刻总结以往科学技术发展的历史经验,把我国科技事业更好地推向前进。中国古代科技有过辉煌的成果,但也有不足,主要是没有形成实验科学传统和完整的学科体系,科学技术没有取得应有的社会地位,更缺乏通过科技促进社会生产力发展的动力和机制。为什么近代科学技术首先在文艺复兴后的欧洲出现,而未能在中国出现,这可能是原因之一吧。而且,我国历史上虽然有着伟大而丰富的文明成果和优良的文化传统,但相对说来,全社会的科学精神不足也是一个缺陷。鉴往开来,继承以往的优秀文化,弥补历史的不足,是当代中国人的社会责任。

在新的世纪中,中华民族将实现伟大的复兴。在一个占世界人口五分之一的发展中大国里,再用五十年的时间基本实现现代化,这又是一项惊天动地的伟业。为实现这个光辉

的目标,我们应该充分发挥社会主义制度的优越性,坚持不懈地实施科教兴国战略。

科教兴国,全社会都要参与,科学家和教育家更应奋勇当先,在全社会带头弘扬科学精神,传播科学思想,倡导科学方法,普及科学知识。科教兴国也要抓好基本建设。编辑出版高质量的科普图书,就是一项基本建设,对于提高全民族的科学素质,是很有意义的。在《院士科普书系》出版之际,写了上面这些话,是为序。

A handwritten signature in black ink, reading '江泽民' (Jiang Zemin), written in a cursive style.

一九九九年十二月二十三日

人民交给的课题

——写在《院士科普书系》出版之际

世界正在发生深刻的变化。这一变化是 20 世纪以来科学技术革命不断深入的必然结果。从马克思主义的观点看来,生产力的发展是人类社会发展与文明进步的根本动力;而“科学技术是第一生产力”,因此,科学技术是推动社会发展与文明进步的革命性力量。从生产力发展的阶段看,人类走过了农业经济时代、工业经济时代,正在进入知识经济时代。

知识经济时代,知识取代土地或资本成为生产力构成的第一要素。知识不同于土地或资本,不仅仅是一种物质的形态,知识同时还是一种精神的形态。知识,首先是科学技术知识,将不仅渗透到生产过程、流通过程等经济领域,同时还将渗透到政治、法律、外交、军事、教育、文化和社会生活等一切领域。可以说,在新的历史时期,一个国家、一个民族能否掌握当代最先进的科技知识以及这些科技知识在国民中普及的程度将决定其国力的强弱与社会文明程度的高低。科技创新与科普工作是关系到一个国家、一个民族兴衰的

大事。

对于我们科技工作者来说,我们的工作应当包含两个方面:发展科技与普及科技;或者说应当贯穿于知识的生产、传播及应用的全过程。我们所说的科普工作,不仅是普及科学知识,更应包括普及科学精神和科学方法。

我们的党和政府历来都十分重视科普工作。党的十五大更是把树立科学精神、掌握科学方法、普及科技知识作为实施科教兴国战略和社会主义文化建设的一项重要任务提到了全党、全国人民和全体科学工作者的面前。

正是在这样的背景下,1998 年春由科学时报社(当时叫“中国科学报社”)提出创意,暨南大学出版社和清华大学出版社积极筹划,会同中国科学院学部联合办公室和中国工程院学部工作部,共同发起《院士科普书系》这一重大科普工程。

1998 年 6 月,中国科学院与中国工程院“两院”院士大会改选各学部领导班子,《院士科普书系》编委会正式成立,各学部主任均为编委会委员。编委会办公室在广泛征求意见的基础上拟出 150 个“提议书目”,在“两院”院士大会上向 1000 多名院士发出题为《请科学家为 21 世纪写科普书》的“约稿信”,得到了院士们的热烈响应。在此后的半年多时间里,有 176 名院士同编委会办公室和出版社签订了 175 本书的写作出版协议,开始了《院士科普书系》艰辛的创作过程。

《院士科普书系》的定位是结合当代学科前沿和我国经济建设与社会发展的热点问题，普及科技知识、科学方法。科学性、知识性、实用性和趣味性是编写的总要求。

编写科普书对我国大多数院士来说是一个新课题。他们惯于撰写学术论文。如何把专业的知识和方法写成生动、有趣、有文采的科普读物，于科技知识中融入人文教育，不是一件容易的事。不少院士反映：写科普书比写学术专著还难。但院士们还是以感人的精神完成自己的书稿。在此过程中，科学时报社和中国科学院学部联合办公室、中国工程院学部工作部以及清华大学出版社、暨南大学出版社也付出了辛勤的劳动。

《院士科普书系》首辑终于出版了。这是人民交给科学家课题，科学家向人民交出答卷。江泽民总书记专门为《院士科普书系》撰写了序言，指出科普是科教兴国的基础工程，勉励科学家、教育家“在全社会带头弘扬科学精神，传播科学思想，倡导科学方法，普及科学知识”，充分表达了党的第三代领导集体对科普的重视，对提高全民族科技素质的殷殷期望。

《院士科普书系》将采取滚动出版的模式。一方面随着院士们的创作进程，成熟一批出版一批；另一方面随着科学技术的进步和创新，不断有新的题材由新的院士作者撰写。因此，《院士科普书系》将是一个长期的、系统的科普工程。

这一庞大的工程,不但需要院士们积极投入,还需要各界人士和广大读者的支持——对我们的选题和内容提出修订、完善的建议,帮助我们不断提高《院士科普书系》的水平与质量,使之成为国民科技素质教育的系统而经典的读本。在科学家群体撰写科普书方面,我们也要以此为起点为开端,参与国际竞争与合作,勇攀世界科普创作的高峰。

中国科学院院长
《院士科普书系》编委会主任

路甬祥

2000 年 1 月 8 日

前 言

《药物与化学》是集体创作的结晶,共有 10 位撰稿人。除最后短短的两章(第 11 及 12 章)是我写的之外,其他各章的作者是:郭宗儒(第 1 及 9 章),张翔(第 2 章),姬政(第 3 章),尹大力(第 4 章),黎莲娘(第 5 章),杨光中(第 6 章),刘瑞武(第 7 章),王东辉(第 8 章),王建新(第 10 章)。

王建新博士是旅居美国的药物化学工作者,感谢他撰写“组合化学”一章。组合化学正是他多年来主要从事的研究领域。其余的撰稿人都是中国医学科学院药物研究所的研究人员,在这里对他们的辛勤劳动深表谢意。

王东辉先生是一位年轻的学者,不幸刚过而立之年,遽然摧折,谨以此书,作为对他的一种纪念。

药物与化学是有着密切联系的两个科学领域,两个领域的“交盖面”非常广泛。本书在这个“交盖面”中所选定的内容,既要具有代表性,又要尽可能地介绍一些前沿课题。但必须承认,本书可能仍有重要的遗漏。另外,专业术语也是作者与读者能否顺利交流的严重障碍,这些术语又不能完全不用,而只能是“行话”少说。取舍之间,没有太大的把握。有时所用专业术语可能过多,这些完全是由于作者的表达能

力所限，尚希见谅。

全书从头至尾由姜芸珍女士整理了一遍，使之更加“通俗易懂”，在此亦深表感谢。

梁晓天

二〇〇二年八月

目 录

1 药物发展史

- 1.1 什么是药物 1
- 1.2 人类利用药物与疾病作斗争的实践 1
- 1.3 21 世纪的药物研究将融合众多的前沿学科 4

2 现代药物的分类

- 2.1 治疗由外来因素引起的疾病的药物 9
- 2.2 治疗由内源性病因致病的药物 16

3 中草药的研究

- 3.1 中药与草药 29
- 3.2 中医药文献 30
- 3.3 现代科学技术在中草药研究中的应用 30

4 抗生素——致病菌的天敌、人类的朋友

- 4.1 什么是抗生素 39
- 4.2 抗生素的起源 39
- 4.3 抗生素的发现和生产 41
- 4.4 抗生素的结构和分类 41
- 4.5 抗生素的作用机理 47
- 4.6 半合成抗生素 49

4.7	农用抗生素	52
4.8	结束语	53
5	天然海洋药物	
5.1	海洋生物中的抗癌成分	57
5.2	海洋生物中的抗病毒成分	64
5.3	海洋毒素	67
6	内源性活性物质和药物	
6.1	缺什么补什么——胰岛素治疗糖尿病	74
6.2	既正常又不正常——用避孕药造就 人工生理周期	78
6.3	出新但不换代——新降压药层出不穷	82
6.4	要镇痛,不要成瘾——镇痛药研究 任重道远	86
7	手性药物	
7.1	几个化学上的名词	90
7.2	何谓手性药物	93
7.3	手性药物的类型	94
7.4	具有光学活性的手性药物的制备方法	99
7.5	手性药物研究的动向与发展前景	105
8	药物的剂型	
8.1	口服剂型	110
8.2	经皮给药系统	112
8.3	靶向给药系统	113

8.4	高智能给药系统	116
9	药物分子设计	
9.1	引言	117
9.2	多样性是先导物产生的物质基础	120
9.3	先导物的优化是开发新药的必要阶段	128
10	化学万花筒——新兴的组合化学	
10.1	引言	134
10.2	组合化学的起源和发展	136
10.3	组合化学与传统化学的基本区别	140
10.4	分子库的设计与优化	142
10.5	组合合成	150
10.6	制药工业中的组合化学和组合化学工业	154
11	化学品的质量控制——兼评“水变油”的闹剧	
11.1	天然品与合成品	158
11.2	酿造酒与工业酒精	159
11.3	天然油与“人工”油	163
12	天然产物的全合成	
12.1	一叶秋碱的全合成	172
12.2	“接力”全合成	178
12.3	自动拆分	183
12.4	“汇合”合成	184
12.5	五味子丙素	186

1

药物发展史

1.1 什么是药物

药物是用来预防、治疗和诊断疾病的物质。人或动物的机体因各种原因失调或外来致病因素侵入,就会得病,而药物对纠正机体失调或消灭外来致病因素可呈现有益作用。

1.2 人类利用药物与疾病作斗争的实践

人类利用药物与疾病作斗争可追溯到史前。“神农尝百草”的传说说明当时人们

中国医药学具有悠久的历史。

已有用药物(主要是植物)治病的活动。我国是一个文明古国,具有悠久的药物发展史。公元前 1 世纪已经将 365 种植物药总结成《神农本草经》。该书是我国最早的药物专著。南北朝时的陶弘景将 730 种植物药编纂成《本草经集注》。到了唐代,编纂成带有绘画的《新修本草》,收载药物扩充到 850 种。明代的药物学家李时珍的巨著《本草纲目》,收载药物 1892 种,并附插图 1160 幅,方剂万余,集历代本草之大成,成为我国乃至世界的药学巨著,至今仍是研究天然药物的重要文献。

但是,在 19 世纪以前,中医用药物治疗疾病方法很朴素,动、植物药经简单处理,如水煎、酒浸或制成丸、散、膏、丹或将多种植物组方后水煎,给药途径多为口服或外用,直至今日,大多数中药还是沿用这一古老的给药方法。

19 世纪以后,西方的一些学者开始从植物中提取分离复合或单一的有效成分。例如,从未成熟的罂粟果皮中提取有镇痛作用的阿片,它是一种复合成分,从中人们又分离出了镇痛作用更强的单一成分——吗啡。但是,这一有效的镇痛药因为具有成瘾性,后来由药品变成了毒品。又如从植物毛花洋地黄的叶中分离出具有强心作用的成分,叫强心苷或强心甙,后来发展成不少强心药物,如洋地黄毒甙、地高辛、甲地高辛等。

我国学者首先从植物麻黄中分离出了具有独特治疗作用的单一成分——麻黄素,并介绍到西方,发展成治疗哮喘及过敏性疾病的药物,现已在全世界范围内广泛应用。从颠茄、莨菪和曼陀罗等茄科植物中分离出了莨菪类生物碱,具