

药物化学

Medicinal Chemistry



宁素云

主要内容

- ❖ 一、药物化学的定义；
- ❖ 二、药物化学的研究内容；
- ❖ 三、药物化学的任务；
- ❖ 四、学习药物化学的方法；
- ❖ 五、药物化学的发展史；
- ❖ 六、药物的质量与标准；
- ❖ 七、药品的名称；
- ❖ 八、药物作用的靶点。

一、Medicinal Chemistry 的含义

药物

含义：指用于治疗、预防、诊断疾病及调节机体生理功能、提高生活质量、保持身体健康的物质。

分类：根据来源不同，分为天然药物、化学合成药物和生物药物。

化学药物

含义：化学组成和结构明确的药物。（如吗啡）

来源：化学合成、动植物提取、生物合成等。

药物化学

含义：是研究化学药物的化学性质和合成、药物与生物体的相互作用、发现和发展新药的一门综合性学科。

英文：medicinal chemistry

二、药物化学的研究内容

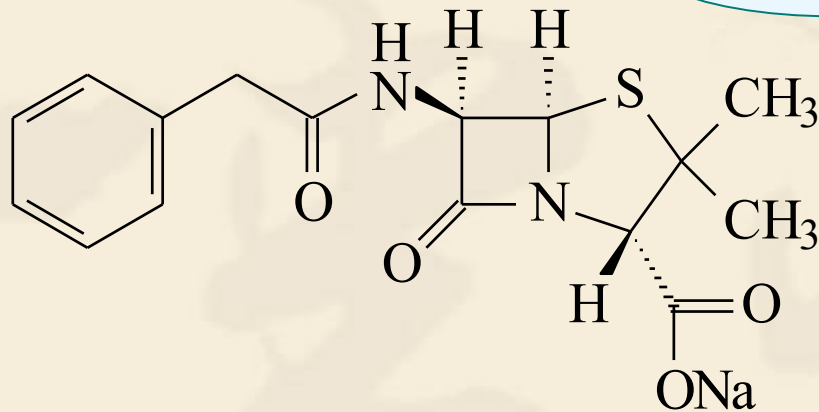
- ❖ 化学药物的结构组成、理化性质、制备方法、构效关系、稳定性、生物效应、体内代谢以及新药的发现和发明。

三、药物化学的任务

➤ 1. 为有效利用已知的化学药物提供理论基础

(基本任务)

分析检验、剂型选择、保存贮藏、结构修饰、合理配伍等



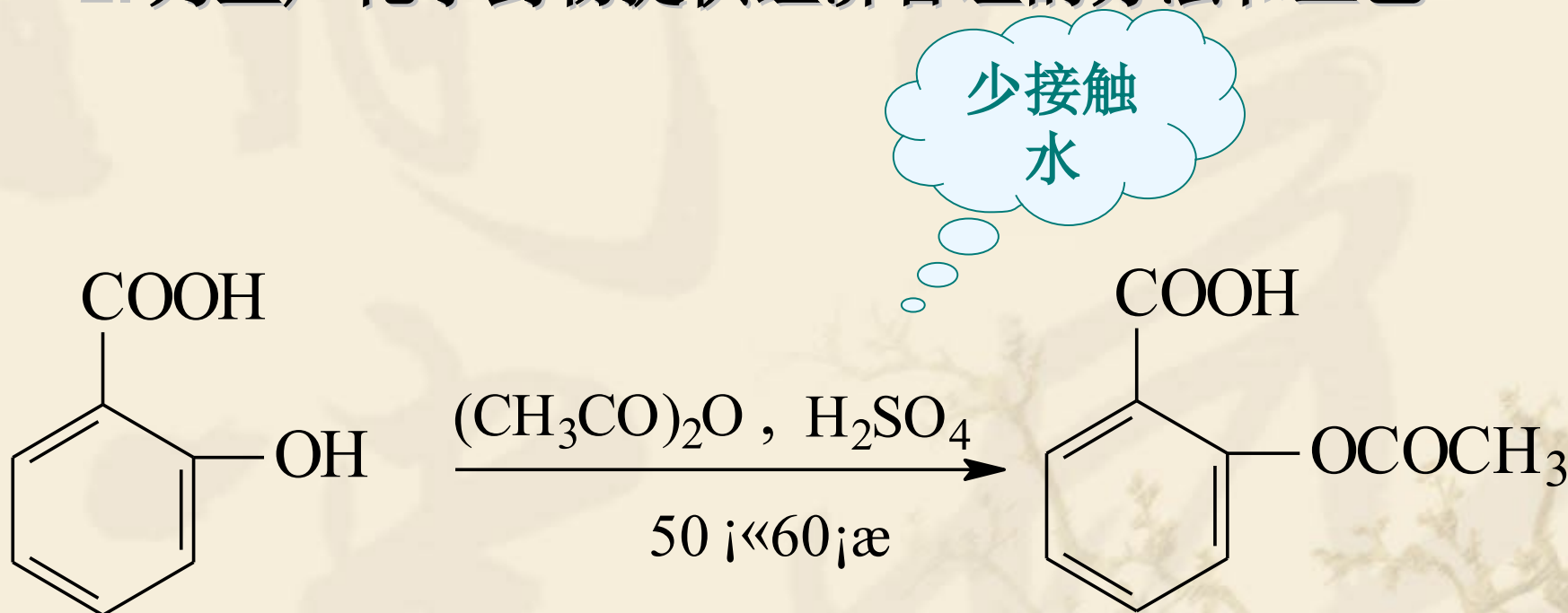
粉针剂、
现配现用

学生能力训练

- ❖ 请问这位护士小姐的操作对吗？为什么？
- ❖ 在一卫生院里，因患者需要注射磺胺类药物，有位护士长看其处方中配有磺胺嘧啶钠（**SD-Na**）和甲氧苄啶（**TMP**）乳酸盐两种针剂，想起这两个药物合用时可增加抗菌效力，于是准备将两只针剂同时混合于同一注射器中给患者进行推注。
- ❖ 要点解析：不正确。因为 **SD-Na** 属于强碱弱酸盐，**TMP** 乳酸盐属于强酸弱碱盐，两者混合则会发生盐的复分解反应，分别产生 **SD** 和 **TMP** 的沉淀，造成针管堵塞，影响使用；甚至会导致局部毛细血管栓塞，引起红肿、渗血、炎症等反应。

三、药物化学的任务

❖ 2. 为生产化学药物提供经济合理的方法和工艺



❖ **3. 创制、开发新药（当前主要任务）**

四、学习药物化学的方法

- ❖ 药物化学是建立在基础化学上的专业基础应用学科，是对基础化学特别是有机化学知识运用，因涉及的药物品种繁多、结构复杂，临床用途各异，所以该课程对于初学者可能比较难，但每个学科都有其自身的特点和规律，在没有了解和掌握之前，自然会遇到一些困难，只要目标明确，学习认真和刻苦专研，就一定会在学习中获得主动，从而产生极大的兴趣，将这门课程学好。

1. 应将基础化学特别是有机化学的基础打好

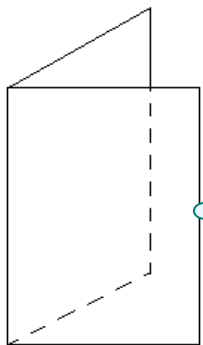
- ❖ 在充分认识和掌握有机化学知识的基础上进行药物化学的学习，并且要善于联系和运用有机化学知识。
- ❖ (1) 药物的化学结构由各种官能团组成；
- ❖ (2) 药物化学中涉及许多药物的化学反应。

要求：
随时翻阅有机化学书！

2. 学会归纳总结，培养自学能力

- ❖ 充分的阅读教材
- ❖ （1）通读；
- ❖ （2）理解阅读。

读书“越读越薄”



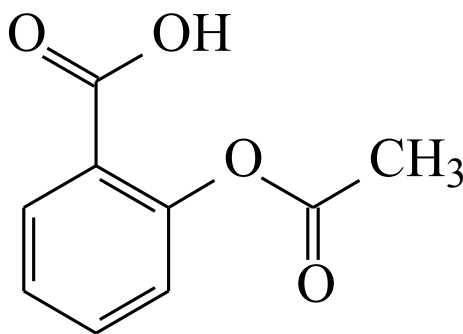
卡片
记忆

“药剂要记，药化要画”

3. 学会记忆

- ❖ 以化学结构为中心，机械记忆与理解记忆
- ❖ 相结合

2-(乙酰氧基)苯甲酸



解热镇痛药
阿司匹林
(Aspiri
n)

酸碱
中和
滴定
法测
定含
量

1. 具有羧基→有酸性；
2. 具有酯基→易水解（水解后产生的水杨酸遇三氯化铁显紫堇色）。

化学名称

化学结构

鉴别

化学性质

4. 认真做练习

❖ 做同步测试题

“举一反三”

5. 疑难问题及时解决

❖ 与同学讨论

❖ 查阅文献

❖ 求助老师

五、药物化学的起源与发展

药物化学作为一门学科开始于 19 世纪，当时统称为药理学，包括现今的药物化学、药理学、药剂学等内容。



一般将药物化学的发展过程分为三个阶段

发现阶段（discover）

发展阶段（develop）

设计阶段（design）

（一）发现阶段（discover）

19 世纪初～ 20 世纪 30 年代

- 从天然动植物中提取有效成分（可卡因、吗啡、阿托品）。
- 从化学产品、染料中间体筛选药物（苯酚、阿司匹林）。
- 十九世纪末德国药物学家培利希提出“化学治疗”的概念，
药物化学学科逐步建立。

(二) 发展阶段 (develop)

20 世纪 30 年代~ 20 世纪 60 年代

药物化学发展的黄金时期

- Domagk 首次将百浪多息治疗细菌感染，开创了现代化学治疗的新纪元。Woods 和 Fildes 建立“抗代谢学说”。
- “潜效”、‘‘先导化合物”、“前药原理”、“受体”、“酶” “离子通道”、“定量构效关系”等建立。
- 药物化学完成了由单纯化学模式到化学与生物学相结合的模式过渡。

(三) 设计阶段 (design)

20 世纪 60 年代~至今

一方面，面对某些疑难重症，如恶性肿瘤、心脑血管疾病和免疫性疾病等需要新药的开发

另一方面，欧洲出现了“**反应停**”事件，造成千百个严重畸型儿的出生，轰动了世界。

海豹



“海豹儿”





进一步研究发现当时使用的沙利度胺是**消旋体**，其**左旋体**引起畸形，而**右旋体**无此作用。

六、药物的质量与标准

- ❖ （一）药物的质量评定
- ❖ 1. 药物自身的疗效和不良反应；
- ❖ 2. 药物的纯度（药用纯度、药用规格）。
- ❖ 杂质的来源：（1）制备时引入或产生；
- ❖ 产生。

树立质量第一的观念！ 贮存时

❖ （二）药物的质量标准

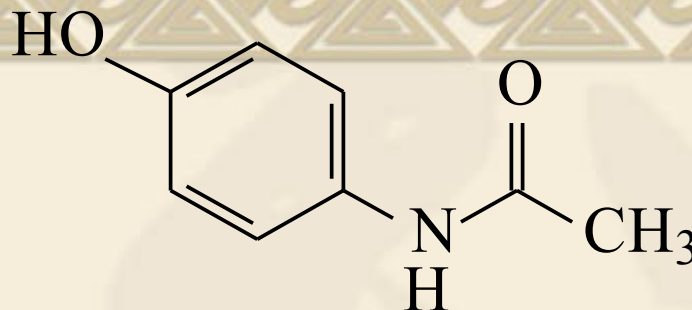
- ❖ 1. 《中华人民共和国药典》（简称《中国药典》）；
- ❖ 2. 国务院食品药品监督管理局颁布的药品标准（简称局版标准）。

七、药品的名称

通用名、化学名、
商品名

❖ **通用名**：即我国药典委员会编写的“中国药品通用名称”。如**对乙酰氨基酚**。任何药品说明书上都应标注通用名。

以国际非专利药名（international non-proprietary names for pharmaceutical substance，INN）（如**Paracetamol**）为依据，结合我国具体情况制定的。



化学名 是依据化学结构命名的。只有化学命名法才是最准确的命名。

英文化学名的命名原则现在多以美国化学文摘为依据（如 *N*-（4-Hydroxyphenyl）acetamide）

中文化学名的命名原则参考《英汉化学化工辞典》

（如 *N*-（4-羟基苯基）乙酰胺）

药品的名称

- ❖ **商品名（品牌名）**：许多生产厂家或企业为了树立自己的形象和品牌，往往给自己的产品注册商品名（品牌名），以示区别。如巴米尔为阿司匹林的商品名，药品宣传大多使用商品名（品牌名），消费者也对商品名（品牌名）比较熟悉，选购药品时，要注意选择质量好，信誉高的品牌。
如：**泰诺林、百服宁、必理通**

❖ **别名**：由于一定历史原因造成某药曾在一段时间使用过一个名称，后又统一改为现今的通用名，那个曾使用一段时间、人们已习惯的名称即称为别名。

❖ 如：**扑热息痛**

八、药物的作用靶点

- ❖ (一) 受体
- ❖ (二) 酶
- ❖ (三) 离子通道
- ❖ (四) 核酸

谢谢