

十一、中国药物化学

中国是中草药的故乡。1949年以前，中国化学家在中草药有效成分的研究方面已取得令人瞩目的成就，如麻黄素的药理作用、钩吻和汉防己生物碱等的分离及分析工作、雌性甾族激素的全合成等。在当时条件下，能取得这样的成绩，实属难能可贵。庄长恭、赵承嘏、黄鸣龙、纪育沣就是中国第一代药物化学家。

1952年，原中国科学院有机化学研究所独立为中国科学院上海药物研究所，所长为赵承嘏，1966年赵承嘏病故由高怡生任所长，嵇汝运任副所长。中国医学科学院也成立药物研究所，有药物化学家黄量和梁晓天从事研究工作。北京医学院（现为北京医科大学）成立了药学系，由著名药物学家王序任系主任，1984年王序病故后由王夔任系主任。从50年代到60年代前半期，中国的药物化学得到了蓬勃发展。在为改善人民卫生健康而向科学进军的征途中，中国化学家如汪猷、邢其毅、朱子清、黄耀曾等也曾参加药物化学研究。

赵承嘏等很早就从麻黄中分离出左旋麻黄素及其副碱左旋甲麻黄素；庄长恭等从汉防己分离出防己诺林碱，证明其为脱甲基倒地拱碱；以后，邢其毅研究了防己诺林碱分子中酚羟基的位置在C₇而不是在C₆；高怡生、赵承嘏从木防己分离得木防己甲、乙两素，乙素经甲基化即得甲素；赵承嘏、朱子清在1949年以前就从事浙贝母中生物碱的研究，确定了贝母素甲与乙为仲醇和酮的关系；1954年朱子清等对贝母素甲、乙及西贝素的结构进行了研究，证明它们是变型甾族生物碱，这一贝母生物碱的基本骨架是中国有机化学家提出来的，并已被国际化学界所接受。

在抗疟药物方面，中国科学工作者曾调查分析出多种抗疟中草药，其中有常山和青蒿。常山含有常山碱，其中-异构体有显著抗疟作用、效力超过奎宁148倍，但毒性也较大。

由于萝芙木碱具有降低血压的功能，50年代中国化学家和医药工作者曾在国产中药中广为搜寻，并对其化学性质、结构及药理作用取得有意义的结果。

60年代，在中国发现喜树中的喜树碱也具有抗癌功能，中国科学家对这类植物进行了普查和系统分离鉴定，有的已合成成功。中国科学家首先完成了对四种能抗癌的尖杉酯的半合成工作。

钩吻是治疗癌症的中药，30年代至40年代初，赵承嘏、朱子清就曾从国产钩吻中提取它的有效成分，证明其为生物碱；1961年朱子清、刘铸晋等用化学降解和光谱分析测定了钩吻的部分结构；最近，刘铸晋等进一步用核磁共振阐明了它的完整结构，属于新类型吲哚生物碱。

中国化学家曾在国内植物中分离得藤黄酸、别藤黄酸、冬凌草乙素、新疆紫草等抗癌物质。

中国化学家对抗瘤药物美登木素也进行了植物普查和分离鉴定，证明它是一个结构复杂的具有8个不对称碳原子的大环酰胺化合物；高怡生等从事着艰巨的全合成工作，已合成了大环化合物的两个半环分子，特别是内酯化这步合成工作是很出色的。

中国在30年代开始从事男性激素的研究，庄长恭曾报导雌性激素类似物去甲脱氢雌马甾醇的全合成。1949年后，中国甾族化学得到真正的发展。黄

鸣龙等合成了肾上腺皮质激素、女性激素及甾族口服避孕药，并投入了生产。为了适应计划生育的需要，中国有机化学家和医药化学家合作，开展了甾族口服避孕药物的合成与动物临床试验。黄鸣龙等通过七步反应合成可的松已用于工业生产。

在抗生素研究工作中，桔霉素是较早的一例。在化学方面，汪猷等曾进行了一系列结构与合成的研究。

1953—1955年，中国科学院和中国医学科学院的有关研究所、化学工业部医药工业研究部门曾同高等院校通力合作，对金霉素、土霉素、链霉素等从菌种、发酵、分离、化学性质与鉴定直到中间试验进行了一系列研究，后来又对四环素和青霉素的生物合成进行了研究。

黄耀曾对金霉素进行了化学降解研究；朱秀昌等合成了性质优良的阳离子交换树脂，可以从发酵液中分离链霉素类碱性抗生物质并用于生产；汪猷曾证明 Wolfrom 提出的链霉素结构有部分错误。

氯霉素的研究主要反映在全合成的工业生产方法上。邢其毅和戴乾圜应用曼尼希反应合成 α -甲胺基对硝基苯丙酮盐酸盐和利用普林斯反应合成中间体，为制造氯霉素提供了新的合成方法。

创新霉素完全是中国科学家分离，测定结构并合成的一种新抗生素。