

药物化学和天然产物化学专家 ——记中国药理学发展奖药物化学奖获得者谢毓元院士



谢毓元,男,中国科学院院士,1924年4月出生于北京市,1949年9月毕业于清华大学化学系,1961年前苏联科学院天然有机化合物化学研究所副博士。现任中国科学院上海药物研究所研究员,学位委员会主任。

从事科研工作50余年,在药物化学和天然产物化学两个领域都作出了显著贡献。在血吸虫病化疗药物研究中,为减轻常用锑剂吐酒石毒性,设计合成了一系列巯基与锑的螯合物,其中一个曾试验用于治疗耕牛血吸虫病,虽未最后成药,但其中间体二巯基丁二酸经药理及临床实验,对解救重金属中毒非常有效,由上海新亚药厂投产。此后在全国先后发生的多起砷中毒或其它中毒事故中,挽救了无数生命,尤其是在1991年郑州发生的大面积砷中毒事故中,一次抢救了七百余名学生。为此与本所药理学家共同获得了国家科技进步二等奖。1966年接受核工业部任务,研究放射性核素促排药物,设计合成的多个系列螯合剂中,噻胺酸(原名螯核胺酸)对²³⁹铀、²³⁴钍、⁹⁵锆等放射性核素的促排效果优于文献报道的螯合剂;酰磷钙钠对放射性⁹⁰锶的促排效果也优于文献报道的螯合剂,且均经国际同行验

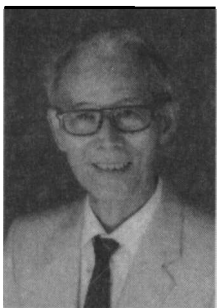
证。为此先后获得了国防科委三等奖和卫生部一等奖。目前他还从事骨质疏松症药物研究,合成的化合物中,有几个经动物试验证明效果明确,已申请了专利,并由上海市科委立项,正在进行临床前各项试验。

在前苏联留学时期,主要从事天然产物的全合成,毕业论文“四环素类化合物的合成”得到较高评价。回国后对本所发现的中草药生理活性成分莲心碱、新疆甘草查尔酮等进行研究,完成了它们的结构确定和全合成工作,对我国当时这一领域的工作起了推动作用。为此与本所其他同志共同获得了国家自然科学二等奖。

除基础研究外,还在开发研究上有所建树。治疗帕金森病药物左旋多巴原来依靠进口,价格昂贵。他从野生植物薰豆中以较高收率提取得到,并制定了生产工艺。从此不再依赖进口,使患者得到廉价药品。还研究制定了植物生长激素表油菜内酯的低成本生产工艺,已在江门农药厂生产。这些都对国民经济产生良好影响。

迄今已培养博士14名,硕士7名;在读博士生5名,硕士生2名,在国内外学术期刊发表论文120余篇,申请专利6项。还担任《中国药物化学杂志》副主编,《有机化学》、《中国药理学》和日本《Heterocycles》编委,上海市化学化工学会顾问委员会主任。

开拓四氢原小檗碱同类物作用于脑内 DA 受体的研究领域 ——记中国药理学发展奖地奥中药奖一等奖获得者金国章院士



金国章,男,1927年6月6日出生于浙江省永康市。1952年毕业于浙江大学理学院药学系。同年进入中国科学院上海药物研究所,历任研究实习员、助理研究员、副研究员、研究员。现任该所研究员,博士生导师、神经药理学家、中国科学院院士。1982-1983年任法国国家健康卫生研究院(INSERM、U-171)客座研究员,1987

年任香港大学生理系客座研究员。现为浙江大学兼职教授。1980年以来,为中国药理学会常务理事、理事,中国药理学会神经药理专业委员会副主任、主任,中国药理学报编委。1988-2000年为上海市药理学会常务理事,神经药理专业组负责人。1992-2000年为生理学报编委。1992-1996为国

家重点项目《脑内多巴胺神经系统功能、结构和配体研究》的负责人。

金国章教授50多年的最主要科研成就就是在国际上,开拓了四氢原小檗碱同类物(THPBs)作用于脑内DA受体的研究领域,并发现左旋千金藤啶碱(Stepholidine, *l*-SPD)具有D1激动-D2阻滞双重新型药理作用,具体内容如下:

中药延胡索为历代中医药学者推崇的著名镇痛药。1956-1964年成功地证明它的主要有效成分是左旋四氢巴马汀(*l*-THP)。后来又进一步证明 *l*-THP 是脑内多巴胺(DA)受体拮抗剂,并将其发展成药物,载入国家药典,成为药理学教本内容。1980年以来,以 *l*-THP 为源头,开拓了四氢原小檗碱同类物(THPBs)与DA受体相互作用的新研究领域。在数十种天然或合成的THPBs构效关系研究中,证明无羟基-THPBs和单羟基-THPBs均是DA受体拮抗剂。