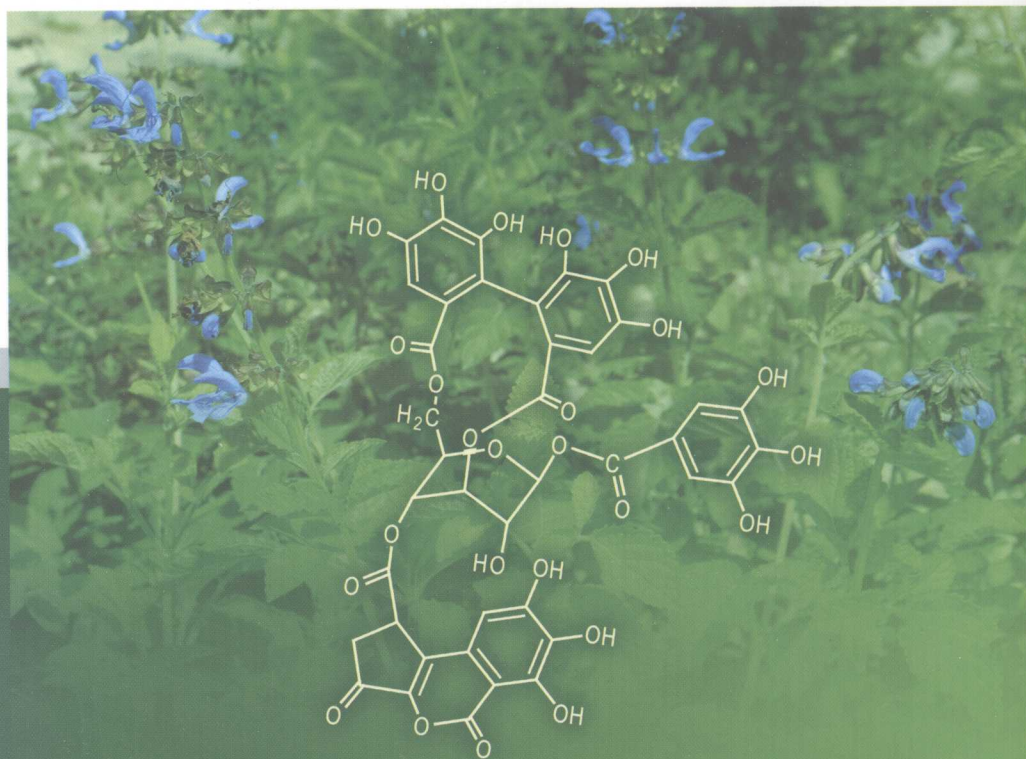


天然产物化学 丛书

酚酸化学

张东明 主编



化学工业出版社

天然产物化学 丛书

酚 酸 化 学



张东明 主编



化学工业出版社

· 北京 ·

本书作为《天然产物化学丛书》分册之一,系统全面地介绍了天然产物中酚酸类化合物的研究概况。根据酚酸类化合物母核的特点,分别介绍了9类化合物的结构特点、生源关系及分布、提取分离、理化性质、谱学特征、结构测定、结构修饰与构效关系、化学合成、生物活性。

本书适合从事天然产物化学、植物化学、药物化学、有机化学等专业的研究生与科研人员作为研究参考用书。

图书在版编目(CIP)数据

酚酸化学/张东明主编. —北京:化学工业出版社,
2008.12
(天然产物化学丛书)
ISBN 978-7-122-03736-7

I. 酚… II. 张… III. 缩酚酸类-研究 IV. 0625.54

中国版本图书馆CIP数据核字(2008)第147126号

责任编辑:李晓红 梁虹

装帧设计:关飞

责任校对:顾淑云

出版发行:化学工业出版社(北京市东城区青年湖南街13号 邮政编码100011)

印装:化学工业出版社印刷厂

787mm×1096mm 1/16 印张22 字数562千字 2009年1月北京第1版第1次印刷

购书咨询:010-64518888(传真:010-64519686)

售后服务:010-64518899

网 址: <http://www.cip.com.cn>

凡购买本书,如有缺损质量问题,本社销售中心负责调换。

定 价:58.00元

版权所有 违者必究

《天然产物化学丛书》编委会

主 任 于德泉

副主任 孙汉董

委 员 (按姓氏汉语拼音排列)

孔令义	林瑞超	陆 阳	师彦平	石建功	孙汉董
谭仁祥	屠鹏飞	王锋鹏	于德泉	庾石山	张东明
张培成	再帕尔·阿不力孜				

序

过去半个多世纪,天然产物化学快速发展,取得了举世瞩目的成就,主要体现在以下方面:首先,天然产物化学结构多样性充分展现。发现并拓展了许多具有重要理论意义和应用价值的分子结构骨架体系并衍化成众多复杂天然产物结构,极大丰富了天然产物化学的内容,促进有机化学发展。多发色团吡啶生物碱和异喹啉生物碱,复杂环系萜类化合物,特异取代基的黄酮、香豆素和木脂素衍生物以及植物环肽、聚酮类等天然产物,结构奇异,变化万千,显示了大自然造就结构艺术的无穷魅力。

再者,复杂结构全合成艺术日臻完善并达到了新的高峰。数以百计的复杂结构天然化合物成功地被手性全合成,且反应收率及光学选择性不乏达到实际应用水平。逆合成原理应运而生,开创了合成设计新纪元。多项研究成果获得世界化学最高奖——诺贝尔奖。有机合成伟大艺术独特魅力得到空前完美展现。

第三,生物活性多样性紧伴化学结构多样性。过去半个多世纪,国际上研发成功的不少原创性重量级新药,多源于天然产物或其衍生物。在1982—2002年全球上市的小分子药物中,6%直接来自天然产物,其余55%亦与天然产物紧密关联。在天然产物化学发展中,色谱、波谱等物理学方法的应用起到关键作用。以HPLC为代表的色谱学方法极大提高了分离纯化的效率,使一些往常难以分离的成分达到了高效纯化目的。波谱学方法包括MS, NMR, CD, X-ray等,开创了新的结构测定思维和手段,一个复杂天然产物结构仅需毫克级样品、耗时数日,便可完成结构研究包括立体构型测定。

我国是天然药物资源丰富的国家,药用植物有万余种,且有数千年民间用药经验,为从中发现生物活性物质、研发创新药物提供了广阔研究空间。在过去半个多世纪,我国天然药物化学研究取得了快速发展,成绩显著,研制成功了青蒿素等一系列天然创新药物。我国已形成了一支学科齐全、人员结构组成较合理、仪器设备基本达国际水平、从事天然药物化学研究的科研创新群体,正在为国家创新药物的研发而努力奋斗。

天然产物化学出版物,国内外已有不少版本,有大型系列参考书,亦有专论编著,篇幅有大有小,内容各有侧重与特点。但关于天然产物化学的系列图书,国内尚无版本面世。我国天然产物化学研究虽取得了显著成绩,但与国际先进水平相比,总体看还存在较大差距。为增强我国天然产物化学研究创新能力,提高研究水平,适应我国中草药大国的国际地位,化学工业出版社高瞻远瞩,决定推出这套《天然产物化学丛书》(以下简称《丛书》),以使广大从事天然产物化学研究的科学工作者系统了解掌握这一学科的系统知识和该领域的现状和未来发展,提高我国天然产物化学研究水平和创新能力,适应时代的需求。

《丛书》共有《天然产物研究方法和技术》、《生物碱化学》、《单萜和倍半萜化学》、《二萜化学》、《三萜化学》、《甾体化学》、《香豆素化学》、《黄酮化学》、《木脂素化学》、《醌类化学》、《酚酸化学》、《天然糖化学》、《蛋白质类化学》13个分册,涵盖了天然产物化学的主

要内容，各分册由主编组织国内本领域专家编写，他们大多为正从事教学和科研的中青年学术骨干。《丛书》涉及面广，内容丰富，工作量浩瀚。《丛书》的出版工程浩大，得到各方鼓励与帮助，尤其是化学工业出版社领导和编辑的大力支持方可完成。参与《丛书》编写的各位主编和数以百计的专家、学者，在繁重的教学科研中，耗费大量时间与精力不辞辛苦地完成编著，在此对他们表示衷心感谢。化学工业出版社的编辑同志认真审阅和修改，精心排版，做了大量工作，在此对他们的辛勤努力表示诚挚的谢意。

由于科研教学任务繁重，时间紧迫，书中难免有不当和错误之处，还望读者不吝批评指正。

于德泉，孙汉董
2007年12月

前 言

2005年,于德泉和孙汉董两位院士主持发起了大型专著《天然产物化学丛书》的编写工作。《酚酸化学》作为该丛书的其中一个分册,主要对天然产物中的酚酸类化合物进行了归纳和介绍。

在植物界中,酚酸是一类分布很广泛的芳香类次生代谢产物,在种子、叶、根、茎中分别参与了多种生理活动,包括:营养摄取、蛋白质合成、酶的活性、光合反应、抑制其它植物生长的成分合成等。该类成分不仅是植物生存的基础物质,也与人们的生活息息相关、密不可分。人们日常食用的水果、蔬菜、谷物和茶及药用植物等都富含该类成分。当人们提及英国红茶、中国茶的独特口感、水果那鲜嫩诱人的颜色以及享誉全球的红葡萄酒时,就不得不想到酚酸类成分。更重要的是它们的药理作用,如抗氧化作用,调解免疫系统紊乱抗肿瘤和抗病毒等功效。

关于酚酸,人们开始应用的年代远远早于我们对它的认识,比如,5000年前埃及人就利用植物多酚做成了经久耐用的革制品。我国古代奴隶制时期,皮革的生产已经相当发达。虽然当时人们对它的制作机理根本不明白,但随着科学的发展和技术的进步,人们逐渐发现这类天然产物与生物体内的蛋白质、多糖、生物碱、微生物、酶、金属离子都有作用,并探索了它们的抗氧化、捕捉自由基、衍生化等化学特性。现在,人们已分别从化学、生物、医药、农牧、食品、日用化学品等角度对该类化合物进行了深入细致的研究,取得了相当大的研究进展。

经过我们的查阅以酚酸为题的书籍在国内外寥寥无几,但有一些专业巨著详细科学地介绍了其中一类或多类化合物的研究情况,如由 Celestino Santos-Buelga 和 Gary Williamson 编著的《Methods in Polyphenol Analysis》,孙达旺编写的《植物单宁化学》,Rebecca J Robbins 完成的《Phenolic Acids in Foods: An Overview of Analytical Methodology》。此外,在天然产物化学方面关于酚酸的文献综述也不乏枚举:Watzl, Bernhard 等人发表了“Phenolic acids” *Ernaehrungs-Umschau* 2001, 48(10), 413-416(German); Van Sumere, C. F. 发表的“Phenols and phenolic acids”, *Methods Plant Biochem*, 1, 29-73(English) 1989; Bandyukova, V. A. 发表的“Plant phenol acids, their esters and glycosides”, *Khim. Prir. Soedin.*, (3), 263-73(Russian) 1983; 等等;还有大量关于酚酸的药理活性和分析方法的综述就不再一一赘述。编者希望通过本分册将酚酸类成分的化学及其研究进展作一个比较系统的介绍,以便于从事天然产物化学和药学等相关领域的科学工作者及广大师生参考。

本书由概论和各论共10章组成,总体以化合物的结构分类,重点对每一分类化合物的结构特点、结构类型、生源合成、提取分离、理化性质、结构测定与谱学特征、构效关系、化学合成、生物活性等方面进行了详细介绍,既对化学结构有明确的描述,又包括普遍的生

物活性，还有它们的来源、纯化精制工艺、合成改造。各章的排列上，既考虑它们之间生源合成的联系，又考虑结构的复杂性和多样性，同时，对研究进展迅猛、材料丰富的丹酚酸和茶多酚单独安排了章节进行了介绍。在语言上，尽量做到简洁准确、贴切到位。在内容上，尽量做到科学、准确、全面、新颖。

最后，感谢所有直接或间接帮助完成本书编写工作的成员。因为酚酸化学涉及内容广泛，尽管本书各章都经过我们各位编者的仔细推敲和复核，但肯定仍存在一些缺点和问题，望各位读者能不吝指正。

本书能顺利完成并出版，得到了化学工业出版社及责任编辑的大力支持。此外，于德泉和孙汉董两位院士在百忙中还为本书的编写提出了宝贵的意见和建议，在此深表谢意。

张东明

2008年9月于北京

目 录

第 1 章 绪论	1
1.1 概述	1
1.2 酚酸的分类及结构特点	1
1.2.1 苯甲酸为母核的酚酸类成分	1
1.2.2 桂皮酸为母核的酚酸类成分	2
1.2.3 其它类型化合物	2
1.3 酚酸的提取分离	3
1.4 酚酸的结构测定方法	3
1.5 酚酸的含量测定方法	5
1.6 酚酸的理化性质	5
第 2 章 没食子酸类化合物	7
2.1 概述	7
2.2 结构分类、生源关系及其分布	9
2.2.1 结构分类与分布	9
2.2.2 生源关系	15
2.3 理化性质	19
2.4 结构测定与谱学特征	20
2.4.1 紫外光谱	20
2.4.2 核磁共振谱 (NMR)	21
2.4.3 质谱	25
2.4.4 旋光性	25
2.5 构效关系	27
2.6 化学合成	28
2.6.1 1 β ,3,6-三-O-没食子酰葡萄糖酯的合成	30
2.6.2 2,3-二-O-没食子酰基葡萄糖酯的合成	30
2.6.3 二(三)-O-没食子酸的合成	31
2.7 生物活性	31
2.7.1 抗肿瘤作用	31
2.7.2 抗氧化、抗自由基作用	32
2.7.3 杀锥虫作用	32
2.7.4 保肝活性	32
2.7.5 对血管的作用	32
2.7.6 其它作用	32
2.7.7 安全性	32
2.8 结语	33
参考文献	33
第 3 章 鞣花酸鞣质	36
3.1 概述	36

3.2 结构分类	36
3.2.1 吡喃葡萄糖 ¹ C ₁ 构型鞣花酸鞣质	38
3.2.2 吡喃葡萄糖 ¹ C ₄ 构型鞣花酸鞣质	39
3.2.3 船式吡喃葡萄糖鞣花酸鞣质	42
3.2.4 葡萄糖为开环的鞣花酸鞣质	43
3.2.5 寡聚鞣花酸鞣质	46
3.2.6 其它类型鞣花酸鞣质	53
3.3 生源合成	57
3.4 结构测定与谱学特征	59
3.4.1 化学方法	59
3.4.2 薄层色谱检测鞣花酸鞣质	60
3.4.3 HPLC 分析检测鞣花酸鞣质	61
3.4.4 波谱学结构鉴定方法	61
3.5 理化性质	68
3.6 结构修饰与构效关系	69
3.7 化学合成	70
3.7.1 C-C 键偶联 (葡萄糖 4/6 位)	70
3.7.2 2/3 位 C-C 偶联	71
3.7.3 2,4 位的 HHDP 合成	72
3.7.4 C-O 键偶联 (m ⁻)	73
3.7.5 端基异构体的合成	74
3.7.6 鞣花酸鞣质的合成	76
3.8 生物活性及其应用	78
3.8.1 抗氧化作用	79
3.8.2 抗肿瘤作用	79
3.8.3 抗病毒作用	79
3.8.4 抗凝血作用	80
3.8.5 EA 的抗突变、防癌作用	80
3.8.6 其它生物活性	80
3.9 结语	81
参考文献	81

第 4 章 聚黄烷醇多酚	84
4.1 概述	84
4.2 结构分类	84
4.2.1 单体黄烷醇	84
4.2.2 寡聚黄烷醇类化合物	85
4.2.3 红粉和酚酸	100
4.3 生物合成	101
4.3.1 儿茶素和表儿茶素的生物合成	101
4.3.2 聚黄烷醇多酚的生物合成	102
4.4 化学反应	102
4.4.1 聚黄烷醇多酚的降解	102
4.4.2 聚黄烷醇多酚的酸催化裂解	103
4.4.3 醚键的形成反应	103
4.4.4 聚合反应	105

4.4.5 异构化反应	105
4.5 化学合成	106
4.6 提取分离	107
4.7 波谱特征	110
4.7.1 紫外光谱和红外光谱	110
4.7.2 核磁共振谱	110
4.8 生物活性	116
4.8.1 抗氧化活性	116
4.8.2 保护心血管作用	117
4.8.3 抗癌活性	117
4.8.4 抗炎作用	118
4.8.5 抗菌、抗病毒作用	119
4.8.6 调节血小板活性	119
4.8.7 免疫调节活性	119
4.8.8 防止急性肾衰竭	119
4.8.9 其它药理活性	120
4.9 结语	120
参考文献	120
第5章 间苯三酚类化合物	123
5.1 概述	123
5.2 结构多样性、分布及其生物活性	123
5.2.1 酰基间苯三酚	123
5.2.2 间苯三酚鞣质	157
5.3 生物合成途径	168
5.3.1 聚酮途径	168
5.3.2 焦磷酸异戊二烯途径	168
5.3.3 亲电加成途径	171
5.3.4 Diels-Alder 途径	171
5.3.5 碳正离子途径	171
5.3.6 其它途径	172
5.4 结构测定与谱学特征	174
5.4.1 紫外光谱特征	174
5.4.2 红外光谱特征	175
5.4.3 ^1H NMR 特征	176
5.4.4 ^{13}C NMR 特征	176
5.4.5 质谱特征	178
5.5 理化性质和化学反应	179
5.5.1 理化性质	179
5.5.2 化学反应	180
5.6 化学合成	180
5.7 结语	182
参考文献	183
第6章 苯丙酸类化合物	188
6.1 概述	188

6.2 结构分类与生源途径	188
6.2.1 结构分类	188
6.2.2 生源途径	193
6.3 提取和分离	194
6.4 色谱分析方法	195
6.4.1 薄层色谱法	195
6.4.2 高效液相色谱法	196
6.4.3 其它分析方法	196
6.5 光谱性质	197
6.5.1 紫外光谱	197
6.5.2 红外光谱	197
6.5.3 质谱	197
6.5.4 核磁共振谱	198
6.6 结构研究实例	198
6.7 incarvillateine 衍生物的化学合成	201
6.8 生物活性	204
6.8.1 抗氧化活性	204
6.8.2 抗炎镇痛活性	205
6.8.3 抗病毒活性	205
6.8.4 抗肿瘤活性	206
6.8.5 抗菌活性	206
6.8.6 益智活性	207
6.8.7 其它作用	208
6.9 结语	208
参考文献	209
第7章 绿原酸及奎宁酸类衍生物	211
7.1 概述	211
7.2 结构分类	211
7.2.1 单酯类	211
7.2.2 二酯类	212
7.2.3 三酯类	213
7.2.4 四酯类	214
7.3 提取分离	214
7.3.1 提取	214
7.3.2 分离	214
7.4 理化性质	215
7.5 分析方法	215
7.5.1 薄层色谱法	215
7.5.2 高效液相色谱法 (HPLC)	215
7.6 波谱特征	216
7.6.1 紫外光谱	216
7.6.2 红外光谱	217
7.6.3 核磁共振谱	217
7.6.4 质谱	218
7.7 结构鉴定实例	219

7.7.1 灰毡毛忍冬中的绿原酸类化合物	219
7.7.2 灯盏花中的绿原酸类化合物	221
7.8 生理活性	221
7.9 结语	222
参考文献	222
第8章 天然低聚芪类化合物	225
8.1 概述	225
8.2 低聚芪类化合物的结构分类与分布	226
8.2.1 二苯乙烯单体的结构	226
8.2.2 低聚芪类化合物的结构与分类	227
8.2.3 天然低聚芪类化合物在植物中的分布	233
8.3 低聚芪类化合物的波谱特征	233
8.3.1 核磁共振谱	233
8.3.2 质谱	236
8.3.3 紫外光谱	236
8.3.4 红外光谱	236
8.4 天然低聚芪类化合物的生源与构型的关系	236
8.5 天然低聚芪类化合物的生物活性	242
8.5.1 抗真菌和抗菌活性	242
8.5.2 抗氧化活性	243
8.5.3 抗炎和抗癌活性	246
8.5.4 蛋白激酶 C(PKC) 抑制活性	246
8.5.5 肿瘤坏死因子 (TNF α) 抑制活性	247
8.5.6 细胞毒抗肿瘤活性	247
8.5.7 酪氨酸酶抑制活性	248
8.5.8 对环氧酶的抑制活性	249
8.5.9 抗肝毒活性	249
8.5.10 其它生物活性	250
8.6 天然低聚芪类化合物的仿生合成	251
8.6.1 酶催化的合成	252
8.6.2 金属氧化剂催化的合成	252
8.6.3 紫外照射聚合	256
8.6.4 酸催化聚合	257
8.6.5 天然二苯乙烯-苯丙素类化合物及其仿生合成	261
8.7 结语	264
参考文献	264
第9章 丹参的酚酸类化合物	267
9.1 概述	267
9.2 结构分类	267
9.2.1 酚酸类化合物的结构	267
9.2.2 二萜醌类化合物的结构	271
9.2.3 其它酚类化合物	274
9.3 丹酚酸类化合物的生源途径	274
9.4 提取分离	274

9.4.1 总酚酸性化合物的提取	274
9.4.2 酚酸性化合物的分离	277
9.5 结构测定与谱学性质	277
9.5.1 丹酚酸类化合物的结构测定	277
9.5.2 二萜醌类化合物的结构鉴定	279
9.6 理化性质与化学合成	280
9.6.1 丹酚酸类化合物的合成	280
9.6.2 丹酚酸类化合物的甲基化反应及对其甲基化物的化学研究	283
9.6.3 丹酚酸 A 和 B 的转变	286
9.7 生物活性及其应用	286
9.7.1 对心脏的保护作用	287
9.7.2 丹酚酸 B 对动脉粥样硬化的防治作用	287
9.7.3 丹酚酸 A 对氧自由基减弱血管内皮依赖性舒张反应的逆转作用	288
9.7.4 脑保护作用	288
9.7.5 抗肝纤维化的作用	289
9.7.6 抗血栓作用	290
9.7.7 改善血液循环作用	291
9.7.8 丹酚酸 A 对糖尿病白内障的防治作用	291
9.7.9 其它作用	291
9.8 结语	292
参考文献	292
第 10 章 茶多酚	294
10.1 概述	294
10.2 茶多酚的结构类型与氧化途径	294
10.2.1 茶多酚的结构类型	294
10.2.2 茶多酚的氧化途径	298
10.3 茶多酚的提取和分离	301
10.3.1 茶多酚的提取	301
10.3.2 茶多酚的分离	305
10.3.3 具体实例	307
10.4 茶多酚的理化性质	307
10.5 茶多酚的分析方法	308
10.5.1 分光光度法	308
10.5.2 色谱法	309
10.6 茶多酚的结构鉴定和谱学特征	310
10.6.1 化学法	310
10.6.2 波谱法	311
10.7 茶多酚的结构修饰	315
10.8 茶多酚的合成	316
10.8.1 儿茶素类化合物的化学合成	316
10.8.2 茶黄素类化合物的合成	318
10.9 茶多酚的生物活性	319
10.9.1 抗氧化特性	319
10.9.2 神经保护作用	320
10.9.3 对心血管的保护作用	320

10.9.4	抗肿瘤作用	321
10.9.5	降血糖作用	321
10.9.6	抗菌抗病毒作用	321
10.9.7	护肝益肾	322
10.9.8	抗过敏作用	322
10.9.9	治疗口腔疾病	322
10.9.10	抗炎活性	322
10.10	茶多酚的构效关系	322
10.10.1	茶多酚清除氧自由基的化学构效关系	322
10.10.2	EGCG 的构效关系	323
10.10.3	EGCG 衍生物的构效关系	323
10.11	结语	324
	参考文献	324
	生物名称对照表	326
	化合物名称中英文对照表	328
	索引	332

第1章 绪论

张东明

中国医学科学院药物研究所

1.1 概述

酚酸类成分是植物体内的重要次生代谢产物,广泛分布在药用植物中,如忍冬科忍冬属的金银花,蔷薇科的托盘根,菊科的蒲公英、灯盏花,唇形科的鼠尾草,橄榄科的方榄,伞形科的当归、川芎等。

酚酸类化合物是一种良好的抗氧化剂。这是因为酚酸类化合物中的酚羟基是优良的氢或中子的给予体,对能引起生物组织膜因产生过氧化作用而导致结构和功能损伤的过氧自由基($\cdot\text{OOH}$)、羟自由基($\cdot\text{OH}$)等自由基有明显的清除作用。而自由基被认为是引起人体衰老和某些慢性疾病发生的原因之一。当人体内的自由基产生过多或清除过慢时,就会转而攻击各种细胞器官并使之受到损伤,从而加速机体的衰老过程并诱发各种疾病。现已证明多种疾病的发生和发展与自由基对组织细胞的损伤关系密切。因此,本书把具有抗氧化作用的植物多酚也进行专门介绍。随着多酚与蛋白质、多糖、生物碱、微生物、酶、金属离子的反应活性及抗氧化、捕捉自由基、衍生化反应等一系列化学行为被初步揭示,使人们看到了这类天然产物广阔的应用前景。

近30年来,随着结构鉴定技术的进步和新的分离技术在天然产物结构化学方面的应用,人类已经从植物中分离、鉴定了千余种酚酸类化合物,并对它们进行了广泛的药理活性研究,发现酚酸类化合物具有多方面的药理作用。除常见的收敛、抗菌消炎、止血、驱虫、止泻外,酚酸类化合物还表现出抗肿瘤、抗突变、抗脂质过氧化、抗变态反应、抗氧化、抗病毒、抗炎抑菌及抑制HIV复制等多种生物活性,引起了药物学和化学科技工作者的广泛关注,已成为天然药物化学研究的热点之一。

1.2 酚酸的分类及结构特点

酚酸类化合物是含有酚羟基和羧基的一类代谢产物成分,自然界植物中发现的酚酸类化合物的主要骨架类型有以下两类: $\text{C}_6\text{-C}_1$ 型,基本骨架是苯甲酸,如原儿茶酸、没食子酸; $\text{C}_6\text{-C}_3$ 型,如咖啡酸、阿魏酸、芥子酸等。在植物中分离得到的活性酚酸类化合物多数是一些复杂酚酸衍生物,如没食子酸鞣质由多个没食子酸与葡萄糖构成,丹酚酸由多个苯丙酸衍生物单元组成等。随着现代分离和结构分析技术的进步以及化学与生物学等多学科的合作和交叉,从天然产物中发现大量具有多种生物活性的植物多酚,如聚黄烷醇多酚、间苯三酚类、芪类化合物等。这些化合物也是目前天然产物化学研究的热点,本书中把它们单列成章,并将近年来研究的一些进展作一综述介绍。

1.2.1 苯甲酸为母核的酚酸类成分

1786年瑞典的Scheele首次从没食子中分离出没食子酸,其化学名称为3,4,5-三羟基苯甲酸。随

后的研究发现,没食子酸在植物内主要与其它基团形成酯或苷,其中相对分子质量在500以上的化合物被称为鞣质(或单宁),这类化合物广泛存在于高等双子叶植物中,在很多药用植物中作为有效成分发挥药理作用。例如,富含没食子鞣质的牡丹根皮可用来治疗高血压;熊果属植物叶子的浸泡液被证实具有和缓的收敛作用,可用作利尿剂及治疗膀胱和尿道等疾病的药物。没食子酸的化学性质活泼,能形成多种衍生物,如加热到250~260℃可发生脱羧,生成邻苯三酚。在植物体内通过各种氧化偶合、脱水、聚合、酯化等反应能够生成鞣花酸、黄没食子酚、六羟基联苯二酸及其衍生物,它们组成植物体内的另一大类次生代谢产物——鞣花酸鞣质。天然存在的鞣花酸鞣质都是没食子酸类化合物的代谢产物,还可参加自由基反应终止链式传递,在体内起到抗氧化的作用。另外,在五倍子和刺云实等植物中也发现了游离的二没食子酸和三没食子酸化合物,它们都是缩酚酸,由一个没食子酸的羧基与另一个没食子酸的酚羟基结合而成。

1.2.2 桂皮酸为母核的酚酸类成分

当归、川芎、蒲公英等中药材的水溶性提取物中的主要单体活性成分阿魏酸(ferulic acid, FA)是以桂皮酸为母核的酚酸类成分的代表。由于该化合物在自然界中存在广泛,具有明确的药理活性和分子改造前景,所以对阿魏酸及其衍生物的研究受到了广泛的重视,而且阿魏酸已被开发成新药,在临床上用于心脑血管疾病的治疗。我国学者陈政雄等首次从唇形科鼠尾草属丹参中分离得到一种酚酸类化合物,称之为丹参酸乙(紫草酸 B, lithospermic acid B)。它由两分子咖啡酸与两分子3,4-二羟基苯基乳酸(即丹参素)缩合而成。而后又有研究者自9种鼠尾草属植物中获得各种多酚酸化合物,其中11个成分为新的缩酚酸类化合物。其化学结构是由R-(+)-B-(3,4-二羟基苯基)乳酸和咖啡酸的衍生物或咖啡酸的二聚物酯化而得,因此将其命名为丹酚酸A、B、C、D、E、F、G、H、I、J和异丹酚酸C以及甘肃鼠尾草酸A等。从菊科植物灯盏花中分离得到2个酚酸类化合物,结构分别为1-O-甲基-3,5-O-双咖啡酰奎宁酸甲酯和5-O-咖啡酰基奎宁酸乙酯。从金银花中也分离得到大量绿原酸类化合物,包括绿原酸和异绿原酸,其中异绿原酸为一混合物,它的异构体有7种,分别为4,5-二咖啡酰奎宁酸、3,4-二咖啡酰奎宁酸、3,5-二咖啡酰奎宁酸、1,3-二咖啡酰奎宁酸、3-阿魏酰奎宁酸、4-阿魏酰奎宁酸、5-阿魏酰奎宁酸。这些酚酸化合物也是中药的有效成分,被作为指标性成分用于中药的质量评价。

1.2.3 其它类型化合物

间苯三酚类化合物是一类非常重要的多酚类化合物,广泛分布于世界各地的药用、观赏、海洋植物当中。目前分离得到的间苯三酚类化合物达700余个。由于间苯三酚结构中含有多个活性位点,加上取代基的多样性,从生源上看它们可以衍生出纷繁复杂、结构多样的化合物。从自然界分离得到大量极性大、分子量较大的多聚间苯三酚类化合物。间苯三酚类化合物蕴含丰富的结构多样性,使得该类化合物具有多样的药理活性。目前已经发现间苯三酚类化合物具有抗菌、抗真菌、抗氧化、抗肿瘤、抗抑郁、降血糖、抗炎、抗疟原虫、扩张血管等多种生物活性,因此该类化合物的研究越来越受到重视。

芪类化合物(stilbenoids)系指具有1,2-二苯乙烯骨架的单体及其聚合物的总称。20世纪50年代初,King等人从龙脑香科的两种植物*Hopea odorata*和*Balanocarpus hemii*中分离得到第一个白藜芦醇的聚合体hopeaphenol,但其结构直到1966年才被确定为白藜芦醇四聚体,并通过其溴代衍生物的X射线衍射最终确定了其结构。迄今为止发现的该类化合物数量已超过500种以上,其结构也从单纯以白藜芦醇为单体的聚合体扩展到以其衍生物为母体及异种单体偶合的聚合体,并发现了它们的糖苷,形成了芪类化合物研究的新领域。

聚黄烷醇多酚又称缩合鞣质,该类化合物广泛存在于蔬菜、水果、豆类、谷物类、茶等