



全国中医药行业高等教育“十三五”规划教材



全国高等中医药院校规划教材（第十版）

天然药物化学

（新世纪第二版）

（供药学、护理学等专业用）

主 编 尹 莲

全国百佳图书出版单位
中国中医药出版社

全国中医药行业高等教育“十三五”规划教材

全国高等中医药院校规划教材（第十版）

天然药物化学

（新世纪第二版）

（供药学、护理学等专业用）

主 编

尹 莲（南京中医药大学）

副主编

吴锦忠（福建中医药大学）

郭 玫（甘肃中医药大学）

邓雁如（天津中医药大学）

周洪雷（山东中医药大学）

宋小妹（陕西中医药大学）

编 委（以姓氏笔画为序）

王先友（河南大学药学院）

危 英（贵阳中医学院）

何细新（广州中医药大学）

陈 勇（南京中医药大学）

咎俊峰（湖北中医药大学）

黄 维（成都中医药大学）

王举涛（安徽中医药大学）

刘 洋（北京中医药大学）

陈 杰（江西中医药大学）

陈建真（浙江中医药大学）

原红霞（山西中医药大学）

中国中医药出版社

· 北 京 ·

图书在版编目 (CIP) 数据

天然药物化学/尹莲主编. —2 版. —北京: 中国中医药出版社, 2017. 7

全国中医药行业高等教育“十三五”规划教材

ISBN 978-7-5132-4209-7

I. ①天… II. ①尹… III. ①生物药-药物化学-高等学校-教材 IV. ①R284

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2017) 第 109716 号

中国中医药出版社出版

北京市朝阳区北三环东路 28 号易亨大厦 16 层

邮政编码 100013

传真 010 64405750

廊坊市三友印务装订有限公司印刷

各地新华书店经销

开本 850×1168 1/16 印张 26 字数 648 千字

2017 年 7 月第 2 版 2017 年 7 月第 1 次印刷

书号 ISBN 978-7-5132-4209-7

定价 73.00 元

网址 www.cptcm.com

社长热线 010-64405720

购书热线 010-89535836

侵权打假 010-64405753

微信服务号 zgzyycbs

微商城网址 <https://kdt.im/LIdUGr>

官方微博 <http://e.weibo.com/cptcm>

天猫旗舰店网址 <https://zgzyycbs.tmall.com>

如有印装质量问题请与本社出版部联系 (010 64405510)

版权专有 侵权必究

全国中医药行业高等教育“十三五”规划教材

全国高等中医药院校规划教材（第十版）

专家指导委员会

名誉主任委员

王国强（国家卫生计生委副主任 国家中医药管理局局长）

主任委员

王志勇（国家中医药管理局副局长）

副主任委员

王永炎（中国中医科学院名誉院长 中国工程院院士）

张伯礼（教育部高等学校中医学类专业教学指导委员会主任委员
天津中医药大学校长）

卢国慧（国家中医药管理局人事教育司司长）

委员（以姓氏笔画为序）

马存根（山西中医药大学校长）

王 键（安徽中医药大学教授）

王省良（广州中医药大学校长）

王振宇（国家中医药管理局中医师资格认证中心主任）

方剑乔（浙江中医药大学校长）

孔祥骊（河北中医学院院长）

石学敏（天津中医药大学教授 中国工程院院士）

匡海学（教育部高等学校中药学类专业教学指导委员会主任委员
黑龙江中医药大学教授）

吕文亮（湖北中医药大学校长）

刘 力（陕西中医药大学校长）

刘振民（全国中医药高等教育学会顾问 北京中医药大学教授）

安冬青（新疆医科大学副校长）

许二平（河南中医药大学校长）

孙忠人（黑龙江中医药大学校长）
严世芸（上海中医药大学教授）
李占永（中国中医药出版社副总编辑）
李秀明（中国中医药出版社副社长）
李金田（甘肃中医药大学校长）
杨 柱（贵阳中医学院院长）
杨关林（辽宁中医药大学校长）
余曙光（成都中医药大学校长）
宋柏林（长春中医药大学校长）
张欣霞（国家中医药管理局人事教育司师承继教处处长）
陈可冀（中国中医科学院研究员 中国科学院院士 国医大师）
陈立典（福建中医药大学校长）
陈明人（江西中医药大学校长）
武继彪（山东中医药大学校长）
范吉平（中国中医药出版社社长）
林超岱（中国中医药出版社副社长）
周仲瑛（南京中医药大学教授 国医大师）
周景玉（国家中医药管理局人事教育司综合协调处副处长）
胡 刚（南京中医药大学校长）
洪 净（全国中医药高等教育学会理事长）
秦裕辉（湖南中医药大学校长）
徐安龙（北京中医药大学校长）
徐建光（上海中医药大学校长）
唐 农（广西中医药大学校长）
彭代银（安徽中医药大学校长）
路志正（中国中医科学院研究员 国医大师）
熊 磊（云南中医学院院长）

秘 书 长

王 键（安徽中医药大学教授）
卢国慧（国家中医药管理局人事教育司司长）
范吉平（中国中医药出版社社长）

办公室主任

周景玉（国家中医药管理局人事教育司综合协调处副处长）
林超岱（中国中医药出版社副社长）
李秀明（中国中医药出版社副社长）
李占永（中国中医药出版社副总编辑）

编审专家组

组 长

王国强（国家卫生计生委副主任 国家中医药管理局局长）

副组长

张伯礼（中国工程院院士 天津中医药大学教授）

王志勇（国家中医药管理局副局长）

组 员

卢国慧（国家中医药管理局人事教育司司长）

严世芸（上海中医药大学教授）

吴勉华（南京中医药大学教授）

王之虹（长春中医药大学教授）

匡海学（黑龙江中医药大学教授）

王 键（安徽中医药大学教授）

刘红宁（江西中医药大学教授）

翟双庆（北京中医药大学教授）

胡鸿毅（上海中医药大学教授）

余曙光（成都中医药大学教授）

周桂桐（天津中医药大学教授）

石 岩（辽宁中医药大学教授）

黄必胜（湖北中医药大学教授）

前言

为落实《国家中长期教育改革和发展规划纲要（2010-2020年）》《关于医教协同深化临床医学人才培养改革的意见》，适应新形势下我国中医药行业高等教育教学改革和中医药人才培养的需要，国家中医药管理局教材建设工作委员会办公室（以下简称“教材办”）、中国中医药出版社在国家中医药管理局领导下，在全国中医药行业高等教育规划教材专家指导委员会指导下，总结全国中医药行业历版教材特别是新世纪以来全国高等中医药院校规划教材建设的经验，制定了“‘十三五’中医药教材改革工作方案”和“‘十三五’中医药行业本科规划教材建设工作总体方案”，全面组织和规划了全国中医药行业高等教育“十三五”规划教材。鉴于由全国中医药行业主管部门主持编写的全国高等中医药院校规划教材目前已出版九版，为体现其系统性和传承性，本套教材在中国中医药教育史上称为第十版。

本套教材规划过程中，教材办认真听取了教育部中医学、中药学等专业教学指导委员会相关专家的意见，结合中医药教育教学一线教师的反馈意见，加强顶层设计和组织管理，在新世纪以来三版优秀教材的基础上，进一步明确了“正本清源，突出中医药特色，弘扬中医药优势，优化知识结构，做好基础课程和专业核心课程衔接”的建设目标，旨在适应新时期中医药教育事业发展和教学手段变革的需要，彰显现代中医药教育理念，在继承中创新，在发展中提高，打造符合中医药教育教学规律的经典教材。

本套教材建设过程中，教材办还聘请中医学、中药学、针灸推拿学三个专业德高望重的专家组成编审专家组，请他们参与主编确定，列席编写会议和定稿会议，对编写过程中遇到的问题提出指导性意见，参加教材间内容统筹、审读稿件等。

本套教材具有以下特点：

1. 加强顶层设计，强化中医经典地位

针对中医药人才成长的规律，正本清源，突出中医思维方式，体现中医药学科的人文特色和“读经典，做临床”的实践特点，突出中医理论在中医药教育教学和实践工作中的核心地位，与执业中医（药）师资格考试、中医住院医师规范化培训等工作对接，更具有针对性和实践性。

2. 精选编写队伍，汇集权威专家智慧

主编遴选严格按照程序进行，经过院校推荐、国家中医药管理局教材建设专家指导委员会专家评审、编审专家组认可后确定，确保公开、公平、公正。编委优先吸纳教学名师、学科带头人和一线优秀教师，集中了全国范围内各高等中医药院校的权威专家，确保了编写队伍的水平，体现了中医药行业规划教材的整体优势。

3. 突出精品意识，完善学科知识体系

结合教学实践环节的反馈意见，精心组织编写队伍进行编写大纲和样稿的讨论，要求每门

教材立足专业需求,在保持内容稳定性、先进性、适用性的基础上,根据其在整个中医知识体系中的地位、学生知识结构和课程开设时间,突出本学科的教学重点,努力处理好继承与创新、理论与实践、基础与临床的关系。

4. 尝试形式创新,注重实践技能培养

为提升对学生实践技能的培养,配合高等中医药院校数字化教学的发展,更好地服务于中医药教学改革,本套教材在传承历版教材基本知识、基本理论、基本技能主体框架的基础上,将数字化作为重点建设目标,在中医药行业教育云平台的总体构架下,借助网络信息技术,为广大师生提供了丰富的教学资源 and 广阔的互动空间。

本套教材的建设,得到国家中医药管理局领导的指导与大力支持,凝聚了全国中医药行业高等教育工作者的集体智慧,体现了全国中医药行业齐心协力、求真务实的工作作风,代表了全国中医药行业为“十三五”期间中医药事业发展和人才培养所做的共同努力,谨向有关单位和个人致以衷心的感谢!希望本套教材的出版,能够对全国中医药行业高等教育的发展和中医药人才的培养产生积极的推动作用。

需要说明的是,尽管所有组织者与编写者竭尽心智,精益求精,本套教材仍有一定的提升空间,敬请各高等中医药院校广大师生提出宝贵意见和建议,以便今后修订和提高。

国家中医药管理局教材建设工作委员会办公室

中国中医药出版社

2016年6月

编写说明

本教材是根据国务院《中医药健康服务发展规划（2015-2020年）》《教育部等六部门关于医教协同深化临床医学人才培养改革的意见》（教研〔2014〕2号）的精神，在国家中医药管理局教材建设工作委员会宏观指导下，以全面提高中医药人才的培养质量、积极与医疗卫生实践接轨、为临床服务为目标，依据中医药行业人才培养规律和实际需求，由国家中医药管理局教材建设工作委员会办公室组织建设的，由全国开设天然药物化学的高等院校联合编写的全国中医药行业高等教育“十三五”规划教材。

根据《天然药物化学》课程的培养目标及教学大纲的规定，本书内容主要以各类天然药物的化学成分为对象，着重介绍各重要类型化学成分的结构特征、理化性质、提取分离、纯化精制以及主要类型化学成分的结构鉴定的基本理论、基本知识和基本技能。结合中医药院校的特点，内容上注意突出中医药特色，体现中药及其理论。提取分离、结构鉴定的研究实例主要列举常用的、重要的中药例子。同时，针对本书主要为药学、药物制剂、制药工程等药学类专业使用，为培养应用型人才的目标，力求体现实用性，注意教材内容与实际工作相结合，加强了天然药物化学成分提取、分离技术方面的内容，将提取分离、结构研究方法单列一章，较详细地概述了天然药物化学成分提取分离鉴定的基本方法和近年来该领域的一些新技术、新发展，并在多数章节编写了提取分离实例；各类成分代表性药物介绍涵盖执业药师资格考试指南知识点，并介绍了2015年版《中华人民共和国药典》（以下简称《中国药典》）中相应的指标成分及其检识方法。

全书共十三章。第一章绪论，介绍天然药物化学的基本知识、研究现状与发展趋势；第二章介绍天然药物化学成分的提取、分离和结构研究方法，增加了现代提取分离的新方法、新技术以及结构修饰、生物转化方法；第三章至第十二章分别讨论各主要类型化学成分的结构特点、理化性质、检识方法、提取分离方法，增加了代表性药物的研究实例介绍；第十三章讨论天然药物研究与开发的一般程序与方法，为开发新药打下一定的基础。

本教材的编写队伍由长期工作在教学、科研一线的多位教授、副教授组成。具体分工为：第一章由尹莲编写，第二章由邓雁如、陈勇编写，第三章由刘洋、吴锦忠编写，第四章由宋小妹编写，第五章由原红霞编写，第六章由何细新编写，第七章由黄维、咎俊峰编写，第八章由危英编写，第九章由陈建真编写，第十章由郭玫编写，第十一章由王举涛编写，第十二章由陈杰编写，第十三章由周洪雷编写，附录由王先友编写。

本书可作为全国高等医药院校药学类各专业本科生的教学用书，中药学类各专业本科生的教学辅助用书，还可供执业药师资格考试及广大医药工作者参考。

在本书编写过程中，得到了各位编委和相关院校的大力支持；参考了吴立军教授主编的《天然药物化学》（人民卫生出版社出版）、匡海学教授主编的《中药化学》（中国中医药出版社出版）以及董小萍教授主编的《天然药物化学》（新世纪全国高等中医药院校规划教材，中

国中医药出版社出版), 在此一并表示衷心的感谢!

限于编者水平和能力, 教材中若有不当及谬误之处, 敬请读者提出宝贵意见, 以便再版时修订提高。

《天然药物化学》编委会

2017年3月

目 录

第一章 绪论	1		
第一节 概述	1		
一、天然药物化学的研究对象	1		
二、天然药物化学的研究内容	2		
三、天然药物化学的任务和意义	4		
四、国内外天然药物化学研究进展与发展趋势	5		
第二节 天然药物化学成分及生物合成简介	7		
一、天然药物化学成分类型简介	7		
二、主要生物合成途径	9		
第三节 生物转化研究进展	14		
第二章 天然药物化学成分的提取、 分离和结构研究方法	18		
第一节 天然药物化学成分的提取方法	18		
一、溶剂提取法	19		
二、水蒸气蒸馏法	21		
三、升华法	22		
四、现代提取方法	22		
第二节 天然药物化学成分的分离方法	24		
一、两相溶剂萃取法	24		
二、结晶法	26		
三、沉淀法	27		
四、膜分离法	27		
五、色谱法	28		
六、其他分离方法	37		
第三节 天然药物化学成分的结构测定方法	38		
一、化合物的纯度测定	39		
二、结构研究的一般程序	39		
三、结构研究中常用的波谱分析方法	40		
第四节 天然药物化学成分的结构修饰	49		
一、天然药物化学成分结构修饰的准则	49		
二、天然药物化学成分结构修饰的方法	50		
第五节 天然药物化学成分的生物转化与代谢	52		
一、水解反应	52		
二、还原反应	52		
三、氧化反应	53		
四、结合反应	53		
第三章 生物碱	57		
第一节 概述	57		
一、生物碱的含义、分布及存在形式	57		
二、生物碱的生物活性	58		
三、生物碱的生物合成反应	58		
第二节 生物碱的结构与生源关系	59		
一、鸟氨酸系生物碱	60		
二、赖氨酸系生物碱	61		
三、酪氨酸系生物碱	62		
四、色氨酸系生物碱	63		
五、邻氨基苯甲酸系生物碱	65		
六、组氨酸系生物碱	65		
七、氨基化作用产生的生物碱	66		
八、甾体类生物碱	67		
第三节 生物碱的理化性质	67		
一、性状、旋光性、溶解性	67		
二、碱性	69		
三、沉淀反应	74		
四、显色反应	75		
第四节 生物碱的提取分离	76		
一、总生物碱的提取	76		
二、生物碱的分离	77		
第五节 生物碱的检识	81		

一、薄层色谱	81	六、苷键构型的确定	124
二、纸色谱	82	七、多糖结构研究实例	126
三、高效液相色谱	82		
四、气相色谱	83	第五章 醌类化合物	129
第六节 生物碱的结构测定	83	第一节 醌类化合物的结构、分类与生物活性	129
一、波谱法在生物碱结构测定中的应用	83	一、苯醌类	129
二、生物碱结构研究实例	87	二、萘醌类	130
第七节 含生物碱的天然药物实例	91	三、菲醌类	131
一、麻黄	91	四、蒽醌类	132
二、延胡索	92	第二节 醌类化合物的理化性质	136
三、黄连	94	一、物理性质	136
四、洋金花	96	二、化学性质	136
五、苦参	98	第三节 醌类化合物的提取与分离	139
第四章 糖和苷类化合物	101	一、醌类化合物的提取	139
第一节 糖和苷的分类	101	二、醌类化合物的分离	140
一、糖的分类	101	三、醌类化合物的提取与分离实例	141
二、苷的分类	106	第四节 醌类化合物的检识	142
第二节 糖和苷的理化性质	110	一、理化检识	142
一、糖的理化性质	110	二、色谱检识	142
二、苷的理化性质	113	第五节 醌类化合物的结构测定	143
三、糖和苷的检识	114	一、紫外光谱	143
第三节 苷键的裂解	115	二、红外光谱	145
一、酸水解	115	三、核磁共振氢谱	145
二、碱水解	116	四、核磁共振碳谱	146
三、酶催化水解	116	五、质谱	147
四、乙酰解反应	117	六、醌类衍生物的制备	148
五、氧化裂解法	117	七、醌类化合物结构研究实例	150
六、酸催化甲醇解	117	第六节 含醌类化合物的天然药物实例	151
第四节 糖和苷的提取分离	118	一、紫草	151
一、糖的提取分离	118	二、丹参	152
二、苷的提取分离	120	三、虎杖	152
第五节 糖和苷的结构测定	121		
一、多糖及苷的纯度测定	121	第六章 苯丙素类化合物	155
二、多糖及苷的分子量测定	122	第一节 概述	155
三、糖和苷中糖的种类和糖的数目测定	122	第二节 简单苯丙素类	156
四、苷中苷元和糖、糖和糖之间连接位置的确定	123	一、简单苯丙素类的结构及分类	156
五、糖与糖之间连接顺序的确定	124	二、简单苯丙素类的提取与分离	157
		三、简单苯丙素的研究实例	157

第三节 香豆素类	158	第四节 黄酮类化合物的提取与分离	194
一、香豆素的结构与分类	158	一、黄酮类化合物的提取	194
二、香豆素的理化性质	160	二、黄酮类化合物的分离	195
三、香豆素的提取分离方法	162	三、黄酮类化合物的提取分离实例	198
四、香豆素的检识	163	第五节 黄酮类化合物的色谱检识	199
五、香豆素的结构研究	163	一、薄层色谱法	199
六、含香豆素的天然药物实例——秦皮	166	二、纸色谱法	200
第四节 木脂素	167	第六节 黄酮类化合物的结构测定	201
一、木脂素的结构类型与生物活性	167	一、紫外及可见光谱	201
二、木脂素的理化性质	170	二、核磁共振谱	204
三、木脂素的提取与分离	171	三、质谱	212
四、木脂素的结构测定	172	四、黄酮类化合物结构研究中应注意的问题	215
五、含木脂素的天然药物实例——五味子	175	五、黄酮类化合物的结构研究实例	217
第七章 黄酮类化合物	178	第七节 含黄酮类化合物的天然药物实例 ...	219
第一节 概述	178	一、槐米	219
一、黄酮类化合物生物合成的基本途径	178	二、黄芩	220
二、黄酮类化合物的生物活性	179	三、葛根	221
第二节 黄酮类化合物的结构与分类	181	四、银杏叶	222
一、黄酮类	182	第八章 鞣质及其他酚类	225
二、黄酮醇类	182	第一节 鞣质	225
三、二氢黄酮类	183	一、鞣质的化学结构与分类	225
四、二氢黄酮醇类	183	二、鞣质的理化性质	232
五、异黄酮类	184	三、鞣质的提取与分离	233
六、二氢异黄酮类	184	四、鞣质的检识	235
七、高异黄酮类	185	五、除去鞣质的方法	237
八、查耳酮类	185	六、鞣质的结构研究	237
九、二氢查耳酮类	186	七、鞣质结构研究实例	242
十、橙酮类	186	第二节 其他酚类	242
十一、花色素类	186	一、芪类	242
十二、黄烷醇类	186	二、缩酚酸类	247
十三、双黄酮类	187	三、多聚间苯三酚类	252
十四、其他黄酮类	188	第九章 萜类和挥发油	255
第三节 黄酮类化合物的理化性质及显色反应	189	第一节 概述	255
一、性状	189	一、萜类的含义和分类	255
二、溶解性	190	二、萜类的生源学说	256
三、酸性与碱性	191	第二节 萜类	258
四、显色反应	191	一、萜类的结构类型及重要代表物	258

二、萜类化合物的理化性质	272
三、萜类化合物的提取分离	274
四、萜类化合物的结构测定	275
五、含萜类化合物的天然药物研究实例	278
第三节 挥发油	280
一、挥发油的组成与分类	281
二、挥发油的理化性质	283
三、挥发油的提取与分离	284
四、挥发油成分的鉴定	288
五、挥发油的研究实例	289
第十章 三萜及其苷类	294
第一节 概述	294
一、三萜类化合物的生物合成	294
二、三萜类化合物的生物活性	296
第二节 三萜类化合物的结构与分类	296
一、四环三萜的结构类型	299
二、五环三萜的结构类型	301
第三节 三萜类化合物的理化性质	303
一、物理性质	303
二、化学性质	304
三、溶血作用	304
第四节 三萜类化合物的提取与分离	305
一、三萜皂苷的提取	305
二、三萜皂苷的分离	305
三、三萜皂苷的提取分离实例	306
第五节 三萜类化合物的检识	307
一、理化检识	307
二、色谱检识	307
第六节 三萜类化合物的结构测定	308
一、紫外光谱	308
二、核磁共振谱	308
三、质谱	310
四、结构研究实例	310
第七节 含三萜皂苷的天然药物实例	312
一、人参	312
二、甘草	314
三、柴胡	315

第十一章 甾体及其苷类	318
第一节 概述	318
一、甾体化合物的结构与分类	319
二、甾体化合物的生物合成途径	319
三、甾体类化合物的颜色反应	320
第二节 强心苷类化合物	321
一、概述	321
二、强心苷的结构与分类	322
三、强心苷的结构与活性的关系	324
四、强心苷的理化性质	325
第三节 甾体皂苷	336
一、概述	336
二、甾体皂苷的结构与分类	337
三、甾体皂苷的理化性质	339
四、甾体皂苷的提取与分离	340
五、甾体皂苷的检识	341
六、甾体皂苷类化合物的波谱特征	341
七、含甾体皂苷的天然药物实例	343
第四节 C_{21} 甾类化合物	347
一、概述	347
二、 C_{21} 甾类化合物的结构特点与主要性质	347
第五节 植物甾醇类	347
一、概述	347
二、植物甾醇类的结构特点与主要性质	348
第六节 胆汁酸类化合物	348
一、概述	348
二、胆汁酸的结构特点	349
三、胆汁酸的化学性质	349
四、胆汁酸的检识	350
五、胆汁酸的提取分离	350
六、含胆汁酸天然药物实例	351
第七节 昆虫变态激素	352
一、概述	352
二、昆虫变态激素的结构特点与主要性质	353
第十二章 海洋天然药物	355
第一节 概述	355
第二节 海洋天然药物的结构类型与生物	

活性	356
一、大环内酯类化合物	356
二、聚醚类化合物	358
三、肽类化合物	360
四、C ₁₅ 乙酸原化合物	361
五、前列腺素类似物	362
第三节 海洋天然药物的提取与分离方法 ...	363
一、海洋天然药物的提取	364
二、海洋天然药物的分离	364
三、海洋天然药物的研究实例	365
第十三章 天然药物的研究与开发	369
第一节 天然药物开发的一般程序	371
一、新药研发的两个阶段	371

二、研究对象和研究方法的确定	372
第二节 天然活性成分的研究方法	373
一、研究思路与方法	373
二、研究与开发实例	374
附录 主要药用天然化合物	378
一、生物碱类	378
二、萜类	383
三、苯丙素类	389
四、黄酮类	391
五、甾体类	394
六、醌类	396
七、其他类	397

第一章 绪论

大纲提示:

1. 了解天然药物化学学科的研究内容、任务及其在本专业中的地位。
2. 了解本学科的发展概况、主要研究方法及发展趋势。
3. 了解天然药物各类成分及其与生物合成途径的关系。

第一节 概述

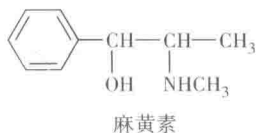
天然药物化学是运用现代科学理论、技术和方法研究天然药物中化学成分（主要是活性成分）的化学结构特征、理化性质、提取分离方法、结构鉴定、生物合成途径及结构修饰等的一门学科。天然药物指动物、植物和矿物等自然界中存在的具有药理活性的天然产物。在中国，天然药物又称为中草药，是祖国传统医药学的宝贵遗产及中华民族的文化瑰宝。我国天然药物资源丰富，为天然药物化学研究提供了良好的平台。

一、天然药物化学的研究对象

天然药物来自于植物、动物、矿物、微生物和海洋生物等，并以植物来源为主，是目前我国新药研究和开发的重点。东汉时的《神农本草经》，全书载药 365 种，其中植物药 252 种，动物药 67 种，矿物药 46 种。隋唐时期的《新修草本》收药 844 种药材，分为玉石、草、木、兽禽、虫、鱼、果菜、米谷等 9 类。明朝李时珍在《本草纲目》中载药 1892 种，清朝赵学敏在《本草纲目拾遗》中又补充药物 1021 种，1993 年出版的《中华药海》载药 8000 多种。我国 1994 完成的天然药物资源普查已确认我国现有天然药物约 12807 种，药用植物 11118 种，并以双子叶植物为主，药用动物 1574 种。此外，占地球表面积 2/3 的海洋里生活着约 400000 种生物，在其生长和代谢过程中，产生大量具有特殊化学结构并具有特殊生理活性的物质，是开发新型天然药物的重要资源。

天然药物中能发挥防治疾病、有特定生理活性的单体成分称为有效成分。如麻黄 *Ephedra sinica* 中含有左旋麻黄素 (*l*-ephedrine)、右旋伪麻黄素 (*d*-pseudoephedrine) 等生物碱，还含挥发油、鞣质、纤维素、叶绿素、草酸钙等其他成分，其中麻黄素、伪麻黄素具平喘、解痉的作用，被认为是麻黄的有效成分。没有活性、不能起到防病治病作用的成分则被称为无效成分或者杂质，如麻黄中的鞣质、纤维素、叶绿素等成分。以麻黄制成的制剂，其质量以左旋麻黄素、右旋伪麻黄素为指标成分进行质量控制，在加工过程中应尽量除去无效成分，富集有效成

分。麻黄素盐酸盐目前已作为正式药品收载于许多国家的药典中。近年来,我国从天然药物中研究发现了一批具有消炎、抗癌、抗病毒及治疗心脑血管疾病功效的天然活性成分,如甲基莲心碱、人参皂苷、紫杉醇、紫草素等。



有效部位是指从天然药物中提取的经动物及临床试验证明有效的一类化学组分。天然药物中至少是由一类或几类化学成分组成,可将其看作一个“天然复方化学药”。如枳实 *Citrus aurantium* L. 含挥发油类、黄酮苷类、生物碱类等化学成分,挥发油有镇静和镇痛作用,黄酮苷类对离体肠平滑肌有收缩抑制作用,生物碱类有明显升血压作用。因此,挥发油、黄酮苷类和生物碱类分别为枳实的镇静和镇痛、抑制肠平滑肌收缩及升血压有效部位。德国用于治疗阿尔茨海默症的植物药银杏叶制剂,其提取物(EGb761)与原药材之比约为 50:1,其中总黄酮苷占 22%~27%、萜类内酯占 5%~7%。

值得注意的是,经体外(in vitro)及体内(in vivo)药效试验或生物活性试验评价的成分,是对机体具有一定生理活性的成分,不一定是真正代表天然药物临床疗效的有效成分。此外,有效成分(或生理活性成分)与无效成分(或非生理活性成分)的划分是相对的。以氨基酸、鞣质、蛋白质为例,在多数天然药物中被视为无效成分,并在加工过程中尽量除去,但鹧鸪菜 *Caloglossa leprieurii* 中的氨基酸是驱虫的有效成分,四季青 *Agrostis stolonifera* 中的鞣质是治疗烫伤、烧伤的有效成分,天花粉中的蛋白质是引产的有效成分。随着科学技术的进步,及对天然药物化学成分研究的逐步深入,原来被认为是无效成分的化合物,有的已被证明具有生理活性。如西洋参中的多糖具有增强人体免疫功能的作用,麝香的抗炎活性成分不是过去认为的麝香酮而是多肽等。

二、天然药物化学的研究内容

1. 天然药物成分的提取分离和结构鉴定 发现并确证天然药物化学成分的结构是天然药物化学的重要任务,即根据天然药物中成分的结构和性质差异,提取分离获得具有活性的有效成分并鉴定结构。常用的提取分离方法包括传统的技术(如溶剂提取、水蒸气蒸馏、酸碱提取、水提醇沉、重结晶等)和微量、高效的现代提取技术(如各种色谱技术、二氧化碳超临界萃取技术等)。结构鉴定常采用紫外光谱(UV)、红外光谱(IR)、核磁共振谱(NMR)、质谱(MS)、圆二色谱(ORD)等技术分析鉴定成分的结构。此外,有效部位是天然药物药效物质基础,采用合理的方案提取精制供药物研发也是天然药物研究的重要内容之一。

不少天然药物的有效成分含量很低。如云南红豆杉 *Taxus yunnanensis* 中所含的抗癌活性成分紫杉醇(taxol)含量仅为 0.01%~0.08%,因此,既要设计出合理的提取分离方案,还要采用核磁共振、质谱以及 X 射线单晶衍射等技术对微量成分进行结构鉴定。