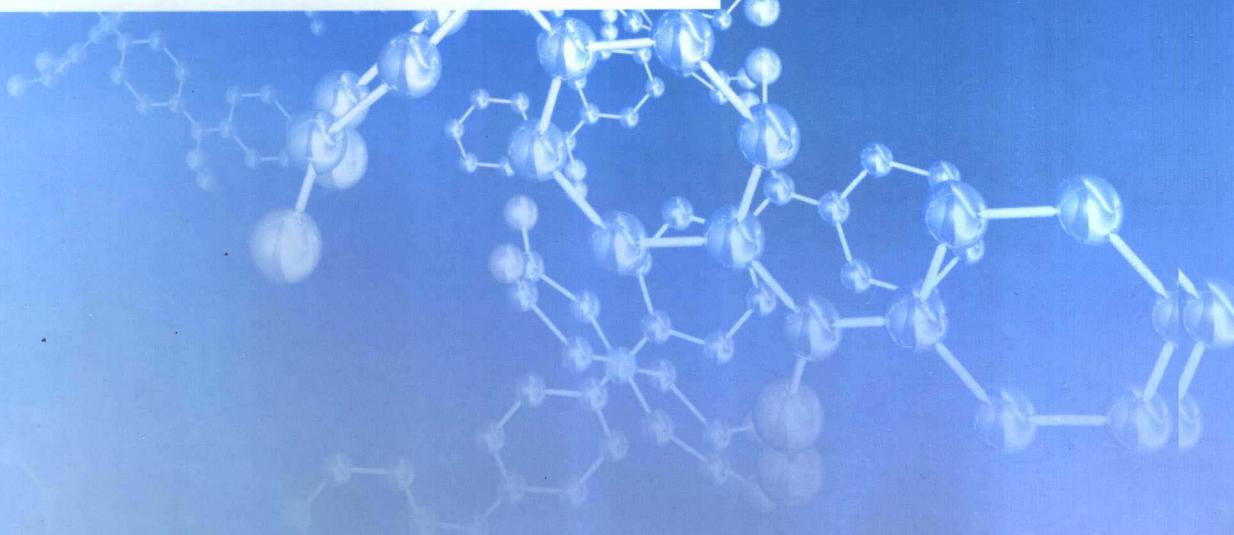


主编 孙文基

天然药物成分 提取分离与制备

(第三版)

TIANRAN YAOWU CHENGFEN
TIQU FENLI YU ZHIBEI



中国医药科技出版社

天然药物成分提取分离与制备

(第三版)

主编 孙文基

中国医药科技出版社

内 容 提 要

本书选编了多年来刊载于期刊、专著及教科书中的部分天然药物 464 种成分的提取分离和制备的成熟实验方法，结合编者的实践经验，分别列举了成分的名称、原植物、结构式，阐述了提取与分离方法、主要物性及参考文献，有些成分还介绍了有代表性的合成方法。科学性强、经得起重复、拿来就能做。是一本具有实用价值的实际操作工具书。

本书可供从事中药及天然药物研究开发人员、生产人员及医药院校师生参考。

图书在版编目 (CIP) 数据

天然药物成分提取分离与制备/孙文基主编. —3 版. —北京：中国医药科技出版社，2006.6

ISBN 7 - 5067 - 3436 - 2

I . 天… II . 孙… III . ①植物药—化学成分—提取②植物药—化学成分—分离③植物药—化学成分—制备 IV . R284

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2006) 第 063211 号

美术编辑 陈君杞

责任校对 张学军

版式设计 郭小平

出版 中国医药科技出版社

地址 北京市海淀区文慧园北路甲 22 号

邮编 100088

电话 010 - 62244206

网址 www.cspyp.cn www.mpsky.com.cn

规格 787 × 1092mm 1/16

印张 35

字数 789 千字

印数 1—4000

版次 2006 年 10 月第 3 版

印次 2006 年 10 月第 1 次印刷

印刷 北京昌平百善印刷厂印刷

经销 全国各地新华书店

书号 ISBN 7 - 5067 - 3436 - 2/R·2856

定价 78.00 元

本社图书如存在印装质量问题请与本社联系调换

第二版修订说明

本书自 1994 年出版，至今已历 5 年，深受读者欢迎与关怀。其原因主要是它实用性强、方法具体、可操作性好、取材详实而广泛，体例简明。不少读者提出再版要求，以适应科技进步的需要。基于此，按原定计划，每 5 年修订再版一次。这次修订，增加了一些新的化合物品种，如甲壳素、羧多糖、透明质酸，肝素钠和胡椒碱等几十种。特别收录了 Raphael Ikan 所著《Natural Products》一书中成熟的品种。改正了本书第一版的不足之处，更正了书中存在的错误，为使化学名称规范化，按《化学名词》规定，将原文献中的甙改为苷，体例及附录基本同第一版。此次修订，希望能得到读者更大的支持与欢迎，并提出宝贵意见。

编 者
1999 年元月 于西北大学

第三版修订说明

本书自 1994 年第一次出版以来，已历 11 年，其间，于 1999 年进行了一次修订，改正了原书中的部分错误，新增了 Raphael Ikan 所著《Natural Products》一书中成熟的品种。再版后深受读者欢迎。

本次修订是在原有基础上，根据读者的反映和要求，增加了化学结构式，增添了一些专利内容，改正了书中的错误。

按原定计划，每 5 年修订一次，此次增补修订，难免仍有不足之处，望读者在使用过程中，指出本书存在的不足及错误之处，以便下次修订时更正。

编 者

2005 年 7 月

于西北大学陕西省生物医药重点实验室

前　　言

本书是天然药物成分的提取、分离和制备的实用工具书。为适应天然药物科研生产发展的需要，结合我们的实践经验，选编了多年来刊载于杂志、专著及教科书中的成熟实验方法，以后还将补充、修订。全书参照 A. H. 勃拉特《有机合成》格式编写，但不完全一致，主要突出了实验的可行性。对于含量极微、操作复杂、难以重复者，不予选入。一些含量虽少，但方法奇妙、有代表性者，仍然选入。有几点说明如下。

1. 本书正文编写顺序按成分的英文名称字母顺序排列。书中所附英文名、中文名、分子式、原植物名四项索引，均按正文化合物编号，以利检索。通过化合物英文名称便可查找到相应信息。

2. 正文中各种方法的提出者，并非全是第一发明人，而多是文献的第一作者，或专著中引用的原始文献的第一作者。对专利方法，因有专利持有权，未列提出者。目的在于对实验方法负责及表示实验的可信性。复核人是对本实验过程进行过重复，结果可靠者。

3. 所列文献除正文引用者外，其他文献都是与之密切相关的其他实验方法及工艺改进，具有很大的参考价值。

4. 在合成项下，除全合成外，将半合成及同类衍生物的制备方法也列入其中。一是由于这些化合物具有实用性，二是方法有代表性。如芦丁项下有维脑路通的合成、甘草酸项下有甘草酸铋的制备等。

5. 外文名称索引中，异名含在其中。中文笔划索引中，也包括中文异名在内。

6. 为了忠实于实验，提取与分离过程尽量照原文献摘录，除明显错误及个别字句外，尽量不做改动。

由于完稿时间仓促，差错难免，敬请同仁多加指教，以期再版，逐步完善。

编　　者

2005年7月　于西北大学

目 录

正文	(1)
附录	(437)
索引	(474)
中文名笔划索引.....	(474)
英文名索引.....	(501)
植物拉丁名索引.....	(523)
分子式索引.....	(539)

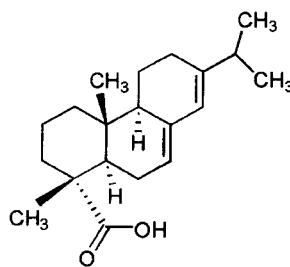
001 松香酸

(Abies acid)

提出者：林启寿^[1]

【原植物】 秦岭冷杉 (*Abies chensiensis* Van Tiegh.)

【结构式】



【提取与分离】

割破松树干，流出的黏稠状汁液为松脂，内含有大量挥发油。松脂经水蒸气蒸馏，分除挥发油为松节油，余留的不挥发性部分为松香（rosin）。将上等松香（未被氧化的）溶解于98%醋酸中，加热回流约2h，趁热滤除不溶物，放冷滤液，松香酸即结晶析出。收集晶体，重结晶1次。将结晶溶于乙醇中，加入氢氧化钠水溶液使成酸性钠盐结晶析出，反复重结晶，待熔点恒定后，将结晶再溶于乙醇中，加盐酸酸化，并加水稀释，得纯松香酸^[2]。

【主要物性】

$[\alpha]_D - 104^\circ$, mp. 171~173°C; $[\alpha]_D - 116^\circ$, mp. 174~175°C, 为板状单晶（含水乙醇）。不溶于水，溶于乙醇、苯、氯仿、乙醚、丙酮、稀氢氧化钠溶液。UV λ_{\max} nm: 241。UV $\lambda_{\max}^{\text{EtOH}}$ nm (log ε): 237 (4.2)。 $^1\text{H-NMR}$: 0.67, 0.83, 1.18, 1.96, 5.68, 12.45。 $^{13}\text{C-NMR}$: 38.3 (C₁), 18.1 (C₂), 37.2 (C₃), 46.3 (C₄), 44.9 (C₅), 25.6 (C₆), 120.5 (C₇), 135.5 (C₈), 51.0 (C₉), 34.5 (C₁₀), 22.5 (C₁₁), 27.5 (C₁₂), 145.1 (C₁₃), 122.5 (C₁₄), 34.8 (C₁₅), 20.9 (C₁₆), 21.4 (C₁₇), 185.4 (C₁₈), 16.7 (C₁₉), 14.0 (C₂₀)。MS m/z (%): 302 (M⁺, 62), 121 (49), 105 (78), 93 (49), 91 (100), 79 (55), 77 (56), 67 (45)。分子式: C₂₀H₃₀O₂。分子量: 302.44。

参 考 文 献

1 林启寿. 中草药成分化学. 北京: 科学出版社, 1977. 529

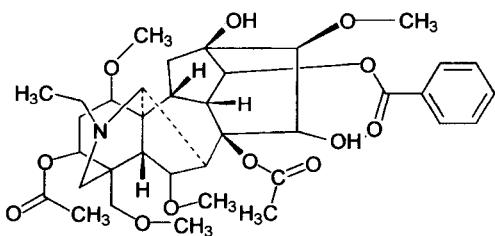
2 米勒. 现代有机化学实验(中译本). 上海: 上海翻译出版公司, 1987. 209

002 3-乙酰乌头碱 (3-Acetylaconitine)

提出者：畅行若^[1]

【原植物】 伏毛铁棒锤 (*Aconitum flavum* Hand-Mazz.)

【结构式】



【提取与分离】

将宁夏六盘山产伏毛铁棒锤块根粉碎后，用碱磨苯泡法提取，所得生物碱部分，经氧化铝层析，乙酰洗脱，分得2个主要生物碱，即3-乙酰乌头碱和乌头碱。

【主要物性】

mp. 196~197℃, $[\alpha]_D^{24} + 18.6^\circ$ ($c = 1.0$, 氯仿)。MS m/z : 687 (M^+), 672, 656, 628, 612, 596, 568, 537。分子式: $C_{36}H_{49}O_{12}N$ 。

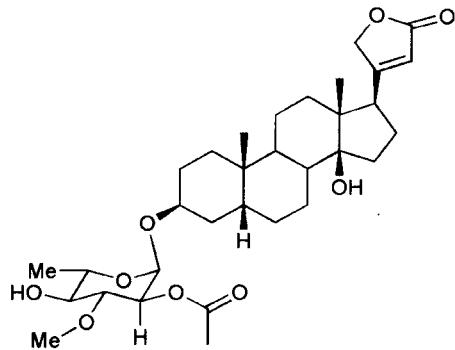
参 考 文 献

- 1 畅行若, 等. 药学学报, 1981, (6): 474

003 2'-乙酰黄夹次昔乙 (2'-Acetylneriifolin)

【原植物】 黄花夹竹桃 (*Thevetia peruviana* (Pers.) K. Schum.)

【结构式】



【提取与分离】

专利方法:^[1]见黄夹次昔乙(neriifolin)项。

【主要物性】

mp. 218~220℃。[α]_D - 91° (CHCl₃)。UV λ_{max}^{EtOH} nm: 218。

参 考 文 献

- 1 Muchowski, et al. United States Patent 3933791. Obtention of digitoxigenin from neriifolin and 2' - acetylneriifolin. January 20, 1976

004 乌头碱 (Aconitine)

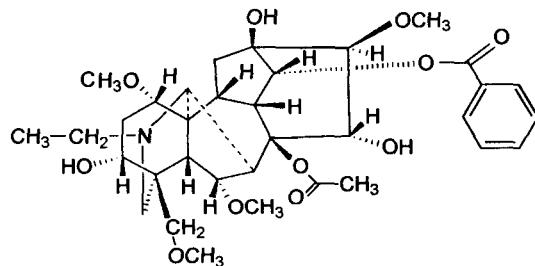
提出者: 朱任宏^[1]

复核者: 孙文基^[2]

【异名】 Acetylbenzoylaconine

【原植物】 川乌 (*Aconitum carmichaeli* Debx)

【结构式】



【提取与分离】

取川乌粉末2kg,用10%碳酸钠溶液湿润,磨匀,加2倍量苯,室温浸泡(约1周),苯浸液用2%盐酸提取5~6次,合并提取液,用氨水碱化,析出大量白色沉淀,过滤,沉淀物用水洗涤数次,干燥后得约2g。将此干燥物溶于2%盐酸,过滤,滤液用氯仿提取数次,蒸去氯仿所得残留物再用盐酸溶解,氨水碱化,乙醚提取,蒸去乙醚得固体物约1g。将此固体溶于少量氯仿后上碱性氧化铝层析柱,乙醚洗脱,薄层检查,相同斑点流份合并,蒸去溶剂,所得结晶依次为次乌头碱、乌头碱、新乌头碱。将乌头碱再用乙醇重结晶。

【主要物性】

mp. 204℃, [α]_D + 17.3°。易溶于氯仿、苯、无水乙醇和乙醚;难溶于水,微溶于石油醚。毒性: LD₅₀ (老鼠) 静脉注射0.166mg/kg, 肌内注射0.328mg/kg, 口服1mg/kg。分子式: C₃₄H₄₇NO₁₁。分子量: 645.72。

参 考 文 献

- 1 上海药物研究所. 中草药有效成分提取与分离(第2版). 上海: 上海科学技术出版社, 1983. 279
- 2 孙文基, 等. 药学学报, 1989, (1): 71

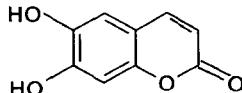
005 七叶内酯 (Aesculetin)

提出者: 杨红^[1]

【异名】 马栗树皮素

【原植物】 木犀科白蜡树属植物白蜡树 (*Fraxinus chinensis* Roxb)、苦枥白蜡树 (*F. rhynchophylla* Hance) 或宿柱白蜡树 (*F. stylosa* Lingelsh) 的树皮。

【结构式】



【提取与分离】

见七叶苷 (Esculin) 项下。

【主要物性】

黄色针状结晶, mp. 276℃。易溶于沸乙醇及氢氧化钠液, 可溶于乙酸乙酯, 稍溶于沸水。几不溶于乙醚、氯仿。分子式: C₉H₆O₄。分子量: 178.15。

参 考 文 献

- 1 杨红. 中药化学实验技术. 北京: 化学工业出版社, 2004. 100

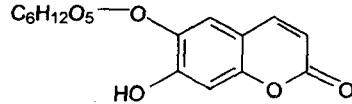
006 七叶苷 (Aesculin)

提出者: 杨红^[1]

【异名】 马栗树皮苷

【原植物】 木犀科白蜡树属植物白蜡树 (*Fraxinus chinensis* Roxb)、苦枥白蜡树 (*F. rhynchophylla* Hance) 或宿柱白蜡树 (*F. stylosa* Lingelsh) 的树皮。

【结构式】



【提取与分离】

1. 七叶昔、七叶内酯的提取

取秦皮粗粉 150g 于索氏提取器中，加 400ml 乙醇回流 10~12h，得乙醇提取液。减压回收溶剂至浸膏状，即得总提取物。

2. 七叶昔、七叶内酯的分离

在上述浸膏中加 40ml 水热溶之，移于分液漏斗中，以等体积氯仿萃取 2 次，将氯仿提取过的水层蒸去残留氯仿，加等体积乙酸乙酯萃取 2 次 - 合并乙酸乙酯液，以无水硫酸钠脱水，减压回收溶剂至干，残留物溶于温热甲醇中，浓缩至适量、放置析晶，即有黄色针状结晶析出。滤取结晶，水、甲醇反复重结晶，即得七叶内酯。

将乙酸乙酯萃取过的水层浓缩至适量，放置析晶，即有微黄色晶体析出。滤取结晶，以甲醇、水反复重结晶，即得七叶昔。

【主要物性】

白色粉末状结晶，mp. 205℃。易溶于热水（1:13），可溶于乙醇（1:24），微溶于冷水（1:610），难溶于乙酸乙酯，不溶于乙醚、氯仿，在稀酸中可水解，水溶液有蓝色荧光。分子式：C₁₅H₁₆O₉。分子量：340.29。

参 考 文 献

- 1 杨红. 中药化学实验技术. 北京：化学工业出版社. 2004. 100

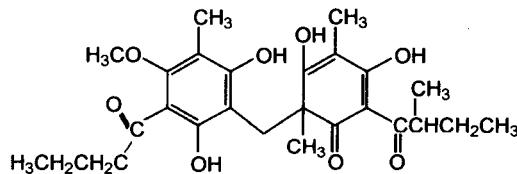
007 鹤草酚

(Agrimonol)

提出者：沈阳药学院^[1]

【原植物】 龙芽草 (*Agrimonia pilosa* Ledeb.)

【结构式】



【提取与分离】

取龙芽草（仙鹤草）根芽用石油醚提取，提取液浓缩后放置，析出晶粥，离心，沉淀物用石油醚洗涤后再用氯仿溶解，过滤，氯仿溶液中加石油醚后放置，析出结晶，过滤，得鹤草酚。

【主要物性】

浅黄色斜方棱状结晶，mp. 138.5~139.5℃。UV $\lambda_{\text{max}}^{\text{环己烷}}$ nm (ε)：235 (27000)，292.5 (26000)，330 (13400)。IR ν (KBr) cm⁻¹：3500 (H₂O)，1665 (β-双酮)，1600，1367。MS m/z：474 (M⁺)，237，181。¹H-NMR (CDCl₃)：0.90 (t, J = 7.2, 3H)，1.02 (t,

$J = 7.6, 3\text{H}$), 1.08 (s, 3H), 1.20 (d, $J = 6.4, 3\text{H}$), 1.44 (q, $J = 7.2, 2\text{H}$), 1.70 (q, $J = 7.2, 2\text{H}$), 1.94 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 3.06 (t, $J = 5, 2\text{H}$), 3.10~3.24 (m, 2H), 3.80 (s, 3H), 3.90 (q, $J = 6.6, 1\text{H}$)。分子式: $C_{26}H_{34}O_8$ 。分子量: 474.53。

【制备】

参见鹤草酚的全合成^[2]。

参 考 文 献

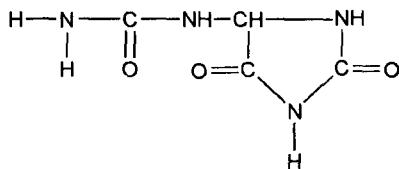
- 1 沈阳药学院. 中草药化学. 1974. 243
 - 2 湖南医药工业研究所. 中草药通讯, 1976, (6): 5
 - 3 陈玉昆. 中药提取生产工艺学. 沈阳: 沈阳出版社, 1992. 115
 - 4 沈阳药学院等. 中草药通讯, 1974, (5): 8

**008 尿囊素
(Allantoin)**

提出者：曾广方^[1]

【原植物】 马兜铃 (*Aristolochia debilis* Sieb. et Zucc.)

【结构式】

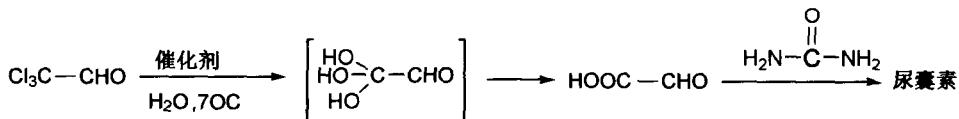


【分离与提取】

取土青木香(马兜铃根)5kg,乙醇渗漉2周,渗漉液减压浓缩,放置后析出混有白色针状结晶的黄色沉淀,滤过,将粗结晶用热水重结晶,再滤过,自热水可溶部分析出无色针状结晶,以热水重结晶2次,得尿囊素。

【制备】 尿囊素全合成^[2]

1. 反应式



2. 操作过程

将 50% 三氯乙醛水溶液 84g, 15% 胍类催化剂水溶液 58.5g 及水 150g, 分别加入 500ml 反应瓶中, 0.5h 内升温至 70℃, 搅拌反应 5h, 然后分批加入尿素 100g, 再反应 10h, 放置过夜, 冷却, 吸滤, 得白色粗品 28g, 粗品(湿)用 10 倍量去离子水和 1% 活性炭脱色后重结晶, 干燥得白色结晶粉末成品 20.5g, mp.232℃, 收率 51% (以三氯乙醛计)。

3. 专利方法^[3]

容量为 1200 L 搪瓷罐（配备固式搅拌器和前级冷凝器），搅拌条件下依次加入 324 kg 甲基乙醛酸甲基半缩醛，120 kg 甲醇，540 kg 尿素和 135 kg 8% 硫酸，混合物 pH 约为 1.5~1.8。密封罐体加热至 70℃持续 1 h 以上，混合物在 70℃开始剧烈沸腾。当混合物停止沸腾时，温度缓慢上升，蒸馏出约 60 L 甲醇，混合物沸点升高至 75℃，此温度下反应持续约 1 h 后，缓慢冷却并用 97kg 20% 氢氧化钠调节至 pH 7.3，再次加热到达沸点，加入氢氧化钠保持 pH 为 7.5~8，持续 2h。搅拌条件下反应混合物冷却至 20℃以下，离心，水洗，真空干燥。产量：359kg，收率 84.1%（理论），纯度：99.6%（酸定量法），熔点：220~223℃，硫酸盐： $< 1 \times 10^{-4}$ ，硫酸盐灰分： $< 0.1\%$ 。

【主要物性】

单斜片状或棱柱状结晶（水），mp. 238℃。1g 溶于 190ml 水、500ml 乙醇，在热水、热乙醇中溶解度更大，几不溶于乙醚。IR ν_{max} cm⁻¹：3450, 3330, 2940, 1790, 1640, 1610, 1520, 1470, 1370, 1320, 1280, 1190, 1010, 810, 780, 760, 710。分子式：C₄H₆N₄O₃。分子量：158.120。

参 考 文 献

- 1 曾广方，柯荣棠. 药学学报, 1958, (1): 33
- 2 毛样源. 医药工业, 1990, (6): 249
- 3 Schermanz, et al. United States Patent 5196545. Process for the preparation of allantoin . March 23, 1993

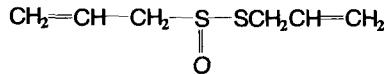
009 大蒜素 (Allicin)

提出者：谢文磊^[1]

【异名】 蒜辣素

【原植物】 大蒜 (*Allium sativum* L.) 的鳞茎。

【结构式】



【提取与分离】

1. 方法一

将大蒜头晾干粉碎，加入反应釜中，加热蒸馏，夹套蒸汽压约 0.1MPa，釜内盘管蒸汽压约 0.05MPa，15min 后，开始出现油水混合馏分，将馏分分离，油相进行减压蒸馏，收集 80~85℃ (15.3kPa) 的馏分，可得淡黄色大蒜素。

2. 方法二^[2]

大蒜用乙醇浸泡，乙醇抽提液减压蒸去大部分乙醇后，剩余液加水稀释，继续减压蒸馏，这时大蒜素随水一起蒸出，蒸出液用乙醚抽提，醚液浓缩干，即得油状大蒜素。

【主要物性】

浅黄色油状液体, bp. 80 ~ 85°C (0.2kPa), 相对密度 (d_4^{20}) 为 1.112, 折射率 (n_D^{20}) 为 1.561。易溶于乙醇、氯仿、乙醚、乙酸乙酯等有机溶剂, 不溶于水。具有强烈的大蒜气味。

参 考 文 献

- 1 谢文磊. 天然化工原料及产品手册. 北京: 化学工业出版社出版, 2004. 49
- 2 徐任生. 天然产物化学. 北京: 科学出版社, 1993. 8

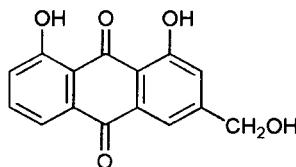
010 芦荟大黄素 (Aloeemodin)

提出者: 北京中医学院中药系^[1]
洪美芳^[2]

【异名】 芦荟泻素、Rhabarberberone

【原植物】 掌叶大黄 (*Rheum palmatum* L.)、药用大黄 (*R. officinale* Baill)、唐古特大黄 (*R. tanguticum* Maxim ex Regel), 其根统称大黄。

【结构式】



【提取与分离】

见大黄酸 (Rhein) 项下。

【主要物性】

橙色针状结晶 (甲苯), mp. 223 ~ 224°C。易溶于热乙醇。在乙醇及苯中呈黄色, 氨水及硫酸中呈绯红色。分子式: C₁₅H₁₀O₅。分子量: 270.23。

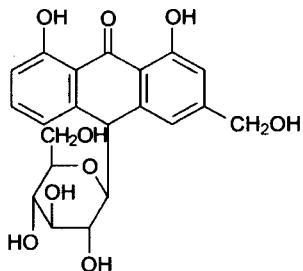
参 考 文 献

- 1 北京中医学院. 中药化学, 1974. 151
- 2 阙毓铭, 等. 中药化学实验操作技术. 北京: 中国医药科技出版社, 1988. 149
- 3 Raphael Ikan. Natural Products. A. Laboratory Guide, 2th, Academic Press inc, 1991: 59 ~ 61

011 芦荟昔 (Aloin)

【原植物】 芦荟 (*Aloe vera*)

【结构式】



【分离与提取】

专利方法^[1]：取 200 g 黄色芦荟汁，置 1 L 蒸馏瓶中 55℃ 减压浓缩，蒸发约 75% 的水分，加入 600 ml 乙酸乙酯萃取 3 次，萃取温度保持在 55~60℃，每次 30 min，弃去有机相，水相合并后 45~55℃ 减压浓缩，浓缩物（棕黄色固体，芦荟苷含量约为 45%~50%）溶于 640 ml 异丁醇（70℃），溶液冷却至 5℃ 析晶，持续 4 h。布氏漏斗滤出晶体，20 ml 异丁醇洗涤，干燥后即得芦荟苷。

【主要物性】

分子式：C₂₁H₂₂O₉。分子量：418.43。

参 考 文 献

- 1 Liu. United States Patent 4999376. Pharmaceutical composition for treating and preventing cardiovascular disease. March 12, 1991.

012 苦杏仁苷 (Amygdalin)

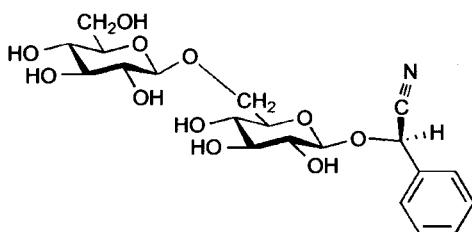
提出者：北京中医学院^[1]

复核者：郭良慧（西安医科大学药学系）

【异名】 扁桃苷

【原植物】 杏 (*Prunus armeniaca* L.)

【结构式】



【提取与分离】

将苦杏仁压榨去油（或捣碎后用石油醚脱脂），得杏仁饼（或去油后的杏仁渣），加乙

醇适量，加热回流提取2次，合并乙醇提取液，减压回收乙醇，放冷，加适量乙醚，放置，析出苦杏仁苷粗品，用冷乙醇洗涤后，得苦杏仁苷成品。

【主要物性】

三水合物为斜方柱状结晶（水），mp. 200℃，无水物 mp. 220℃， $[\alpha]_D^{20} - 42^\circ$ ，1g溶于12ml水、900ml乙醇、11ml沸乙醇，易溶于沸水，几不溶于乙醚。UV $\lambda_{\text{max}}^{\text{EtOH}}$ nm (ϵ)：268 (179)，262 (255)，257 (256)，251 (198)，208 (7210)。IR ν cm⁻¹：3330，2860，1640，1590，1490，1450，1270，1160，1060，690。分子式：C₂₀H₂₇NO₁₁。分子量：457.42。

参 考 文 献

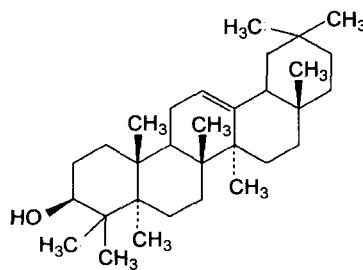
- 1 北京中医学院. 中药化学, 1974. 183
- 2 陈玉昆. 中药提取生产工艺学. 沈阳: 沈阳出版社, 1992. 116

013 β -香树脂醇 (β -Amyrin)

提出者：曾广方^[1]

【原植物】槲寄生 (*Viscum album* L.)

【结构式】



【提取与分离】

取槲寄生叶粉末2.7kg，以乙醚浸至色淡为止，醚液合并，蒸去醚后得醚浸膏（约500g），取1/2量用1%氢氧化钾乙醇溶液1L，分数次溶浸，将1%氢氧化钾乙醇溶液处理的不溶物，加12%氢氧化钾碱化，放冷析出固体，用乙醚提取，水洗，除去乙醚，干燥后得固体72g。取20g按常法乙酰化处理，分离得醚不溶的白色固体约2g，用乙醚-醋酸(1:1)混合液重结晶，得 β -香树脂醇乙酰化物无色针晶，mp. 236~240℃。经碱水解后 β -香树脂醇呈无色针晶。

【主要物性】

无色针晶（乙醇），mp. 186℃，bp. 243℃， $[\alpha]_D^{17} + 91.6^\circ$ ($c = 1.3$ 苯)。溶于22倍量的98%乙醇中，可溶于乙醚、苯、氯仿、冰醋酸，微溶于石油醚。分子式：C₂₀H₃₀O。分子量：426.70。

参 考 文 献

- 1 曾广方, 等. 药学学报, 1957, 5: 167