

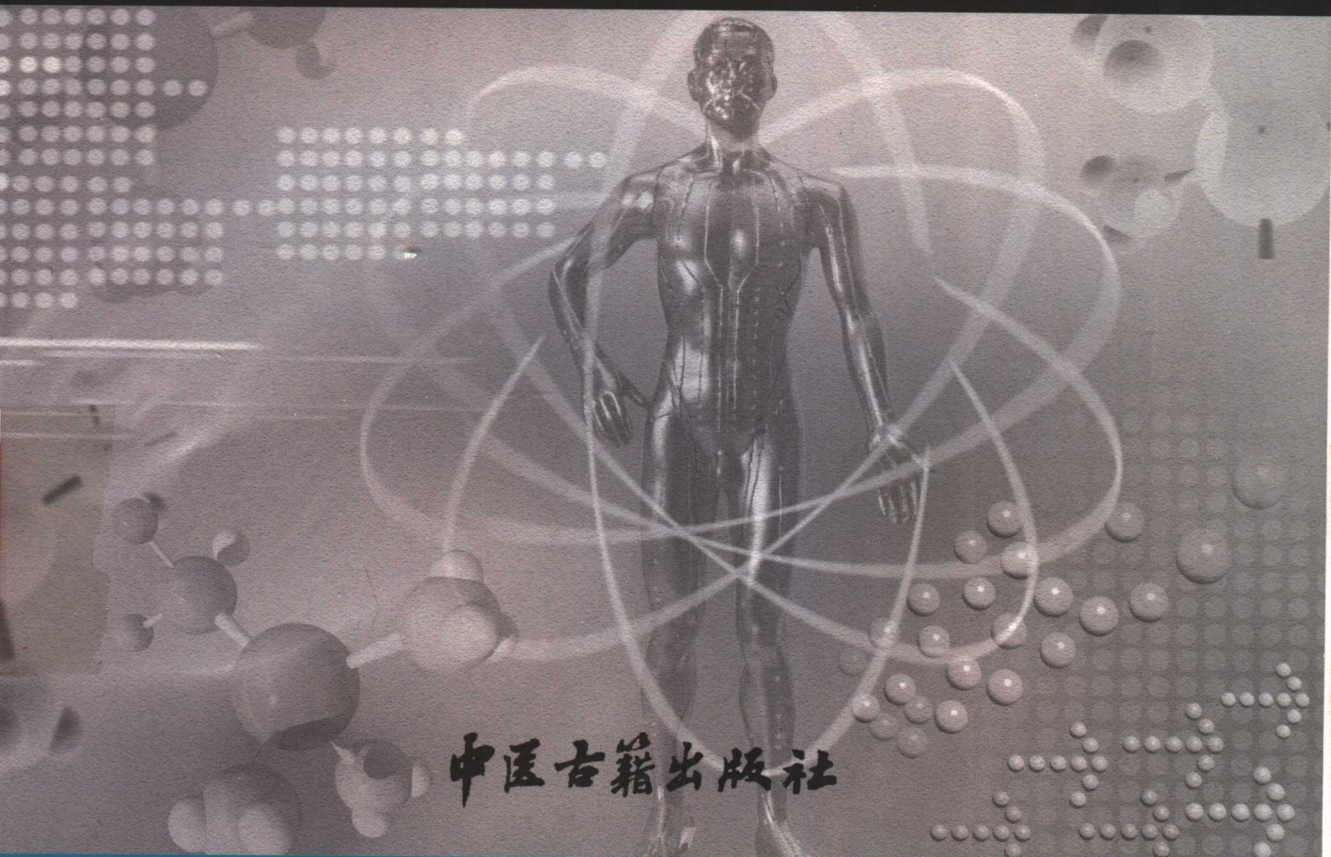
新世纪高等中医药院校系列教材
XINSHIJIGAODENGZHONGYIYAORYUANXIAO
XILIEJIAOCAI

主编◎梁光义

中药化学

ZHONGYAOHUAXUE

[供各类高等中药类专业用]



中医古籍出版社

新世纪高等中医药院校系列教材

中药化学

(供各类高等中医、中药类专业用)

- 主 编** 梁光义 (教授, 贵阳中医学院)
- 副主编** 匡海学 (教授, 黑龙江中医药大学)
- 包国荣 (教授, 福建中医学院)
- 罗永明 (教授, 江西中医学院)
- 编 委** 刘桂芳 (教授, 辽宁中医学院)
- 林翠英 (教授, 天津中医学院)
- 饶高雄 (教授, 云南中医学院)
- 魏慧芬 (副教授, 贵阳中医学院)
- 朱 英 (副教授, 浙江中医学院)
- 郭 玫 (副教授, 甘肃中医学院)
- 武孔云 (教授, 贵阳中医学院)
- 危 英 (副教授, 贵阳中医学院)
- 宋 丹 (助理研究员, 贵阳中医学院)

中医古籍出版社

责任编辑 刘从明

封面设计 于天水

图书在版编目 (CIP) 数据

中药化学/梁光义主编. -北京: 中医古籍出版社, 2005.8

(新世纪高等中医药院校系列教材)

ISBN 7-80174-329-6

I. 中… II. 梁… III. 中药化学-中医学院-教材 IV. R284

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2005) 第 069734 号

中医古籍出版社出版发行

(北京东直门内南小街 16 号 100700)

全国各地新华书店经销

北京西郊伟业印刷厂印刷

787mm×1092mm 16 开 21.625 印张 510 千字

2005 年 8 月第一版 2005 年 8 月第一次印刷

印数: 0001~2500 册

ISBN 7-80174-329-6/R·328

定价: 30.00 元

编写说明

本书是卫生部、国家中医药管理局领导组织编写的全国高等中医药院校中药类专业系列教材。

本教材1998年由人民卫生出版社出版以来，广大师生在使用过程中，提出了一些宝贵的意见，我们根据这些意见对本教材进行了修订。本教材适合中药专业本科及专科、有关专业成人教育（函大、夜大、自学考试等）的师生使用，也可作为参加执业药师考试的药学人员复习参考书。

本教材根据中药类专业本、专科教育的目的和特点，介绍了中药化学的基本理论、基础知识和基本技能。全书分为十一章，第一、二章介绍本学科的目的、意义、进展和一般研究方法，第三章至第十一章系统地介绍各类重要中药化学成分的化学结构、理化性质、提取分离、检识、化学结构研究和研究实例，各章后附有思考题。

本教材由梁光义（贵阳中医学院）为主编，匡海学（黑龙江中医药大学）、包国荣（福建中医学院）、罗永明（江西中医学院）为副主编，刘桂芳（辽宁中医学院）、林翠英（天津中医学院）、饶高雄（云南中医学院）、魏慧芬（贵阳中医学院）、朱英（浙江中医学院）、郭玫（甘肃中医学院）、武孔云（贵阳中医学院）、危英（贵阳中医学院）、宋丹（贵阳中医学院）等老师为编委合作编写。

本教材的编写得到各参编院校的支持，人民卫生出版社匡罗均、任刚同志对1998年版本教材的出版，中医古籍出版社社长刘从明同志对本版教材的出版给予了通力合作与帮助，林佳（贵阳中医学院）参与了本教材索引的编排等工作，作者在此一并表示衷心的感谢。

由于编者水平及能力有限，不当及错误之处，敬请广大读者予以指正。

梁光义

2005年5月28日

目 录

第一章 绪论	(1)
第一节 概述	(1)
第二节 学习中药化学的目的意义	(2)
一、研制新药、为人类健康服务.....	(2)
二、阐明中医药防病治病的基本原理.....	(6)
第三节 中药有效成分研究的一般方法	(8)
一、中药化学研究课题的选择.....	(8)
二、中药化学成分的预试.....	(9)
三、中药化学成分的提取分离.....	(10)
四、中药化学成分的检识.....	(10)
五、中药化学成分的结构研究.....	(10)
第四节 各类中药化学成分简介及分类	(14)
一、按照组成元素分类.....	(14)
二、按照特殊生物活性分类.....	(14)
三、按照生物合成途径分类.....	(14)
四、按照特殊物理性质或用途分类.....	(15)
五、按照基本母核分类.....	(15)
六、按照生源途径结合基本母核类型分类.....	(15)
第二章 中药化学成分的提取分离及检识方法	(16)
第一节 中药化学成分的提取方法	(16)
一、溶剂提取法.....	(16)
二、水蒸气蒸馏法.....	(19)
三、超临界流体提取法.....	(19)
四、微波提取法.....	(21)
五、其他提取方法.....	(23)
第二节 中药化学成分的分离方法	(24)
一、系统溶剂分离法.....	(24)
二、两相溶剂萃取法.....	(25)
三、沉淀法.....	(26)
四、盐析法.....	(27)
五、透析法与超滤法.....	(28)
六、蒸馏法.....	(28)
七、结晶法.....	(30)
八、分子识别分离有效成分.....	(33)

2 • 中药化学 •	
第三节 中药化学成分的色谱分离法	(33)
一、吸附色谱法	(33)
二、分配色谱法	(35)
三、离子交换色谱法	(37)
四、大孔树脂色谱法	(39)
五、凝胶色谱法	(40)
六、其他色谱法	(42)
第四节 中药化学成分的检识方法	(45)
一、理化检识	(45)
二、色谱检识	(47)
第三章 糖和苷类	(49)
第一节 糖	(49)
一、概述	(49)
二、糖的结构与分类	(49)
三、糖的理化性质	(53)
四、糖的提取分离	(54)
五、糖的检识	(55)
第二节 苷类	(56)
一、概述	(56)
二、苷类的结构与分类	(57)
三、苷类的理化性质	(61)
四、苷类的提取分离	(63)
五、苷类的检识	(66)
第三节 糖和苷类的结构研究	(67)
一、化学方法	(67)
二、光谱方法	(68)
第四章 醌类	(72)
第一节 概述	(72)
第二节 醌类的结构与分类	(72)
一、苯醌类	(72)
二、萘醌类	(73)
三、菲醌类	(73)
四、蒽醌类	(74)
第三节 醌类的理化性质	(76)
一、醌类的物理性质	(76)
二、醌类的化学性质	(76)
第四节 醌类的提取分离	(80)
一、醌类的提取	(80)
二、醌类的分离	(82)

第五节 醌类的检识	(83)
一、醌类的理化检识	(83)
二、醌类的色谱检识	(84)
第六节 醌类化合物的结构研究	(85)
一、UV 光谱	(85)
二、IR 光谱	(85)
三、NMR 谱	(86)
四、MS 谱	(87)
五、结构研究实例	(87)
第七节 醌类的研究实例	(88)
一、大黄	(88)
二、丹参	(91)
第五章 香豆素和木脂素	(94)
第一节 概述	(94)
第二节 香豆素类	(95)
一、香豆素类的结构与分类	(95)
二、香豆素类的理化性质	(97)
三、香豆素类的提取分离	(100)
四、香豆素类的检识	(101)
第三节 木脂素类	(101)
一、木脂素类的结构与分类	(102)
二、木脂素类的理化性质	(106)
三、木脂素类的提取分离	(109)
四、木脂素类的检识	(110)
第四节 香豆素和木脂素类化合物的结构研究	(110)
一、香豆素类化合物的结构研究	(110)
二、木脂素类化合物的结构研究	(111)
三、结构研究实例	(112)
第五节 香豆素和木脂素的研究实例	(113)
一、秦皮	(113)
二、五味子	(115)
三、补骨脂	(117)
第六章 黄酮类化合物	(119)
第一节 概述	(119)
第二节 黄酮类化合物的结构与分类	(120)
一、黄酮类和黄酮醇类	(120)
二、二氢黄酮类和二氢黄酮醇类	(121)
三、异黄酮类	(122)
四、查耳酮类	(122)

4 • 中药化学 •	
五、噢啉类	(122)
六、双黄酮类	(123)
七、其他黄酮类	(123)
第三节 黄酮类化合物的理化性质	(124)
一、黄酮类化合物的性状	(124)
二、黄酮类化合物的溶解性	(125)
三、黄酮类化合物的酸碱性	(126)
四、黄酮类化合物的显色反应	(126)
第四节 黄酮类化合物的提取分离	(129)
一、黄酮类化合物的提取	(129)
二、黄酮类化合物的分离	(129)
第五节 黄酮类化合物的检识	(133)
一、黄酮类化合物的理化检识	(133)
二、黄酮类化合物的色谱检识	(134)
第六节 黄酮类化合物的结构研究	(135)
一、UV 光谱	(135)
二、IR 光谱	(139)
三、NMR 谱	(140)
四、MS 谱	(142)
五、结构研究实例	(144)
第七节 黄酮类化合物的研究实例	(145)
一、槐米	(145)
二、葛根	(146)
三、黄芩	(148)
第七章 萜类和挥发油	(151)
第一节 萜类	(151)
一、概述	(151)
二、萜类的结构与分类	(152)
三、萜类的理化性质	(159)
四、萜类的提取分离	(161)
五、萜类的检识	(162)
六、萜类的研究实例	(163)
第二节 挥发油	(166)
一、概述	(166)
二、挥发油的化学组成	(167)
三、挥发油的理化性质	(167)
四、挥发油的提取分离	(169)
五、挥发油的检识	(172)
六、挥发油的研究实例	(173)

第八章 皂苷	(176)
第一节 概述	(176)
第二节 皂苷的结构与分类	(176)
一、甾体皂苷.....	(176)
二、三萜皂苷.....	(180)
第三节 皂苷的理化性质	(182)
一、皂苷的性状.....	(182)
二、皂苷的旋光性.....	(182)
三、皂苷的溶解性.....	(182)
四、皂苷的发泡性.....	(183)
五、皂苷的溶血性.....	(183)
六、皂苷与胆甾醇生成分子复合物.....	(183)
七、皂苷与金属盐类的反应.....	(183)
八、皂苷的水解.....	(183)
九、皂苷的显色反应.....	(184)
第四节 皂苷及皂苷元的提取分离	(184)
一、皂苷及皂苷元的提取.....	(184)
二、皂苷及皂苷元的分离.....	(185)
第五节 皂苷的检识	(186)
一、皂苷的理化检识.....	(187)
二、皂苷的色谱检识.....	(187)
第六节 皂苷类化合物的结构研究	(188)
一、UV 光谱.....	(188)
二、IR 光谱.....	(188)
三、NMR 谱.....	(188)
四、MS 谱.....	(189)
五、结构研究实例.....	(191)
第七节 皂苷的研究实例	(193)
一、人参.....	(193)
二、甘草.....	(196)
三、薤白.....	(199)
第九章 强心苷	(201)
第一节 概述	(201)
第二节 强心苷的结构与分类	(201)
一、强心苷的结构.....	(201)
二、强心苷的分类.....	(205)
第三节 强心苷的理化性质	(206)
一、强心苷的性状.....	(206)
二、强心苷的溶解性.....	(206)

6 • 中药化学 •	
三、强心苷的脱水反应.....	(206)
四、强心苷的水解反应.....	(206)
五、强心苷的显色反应.....	(208)
第四节 强心苷的提取分离.....	(209)
一、强心苷的提取.....	(209)
二、强心苷的分离.....	(210)
第五节 强心苷的检识.....	(211)
一、强心苷的理化检识.....	(211)
二、强心苷的色谱检识.....	(212)
第六节 强心苷类化合物的结构研究	(213)
一、UV 光谱	(213)
二、IR 光谱	(213)
三、NMR 谱	(213)
四、MS 谱.....	(214)
五、结构研究实例	(214)
第七节 强心苷的研究实例.....	(217)
一、毛花洋地黄.....	(217)
二、黄花夹竹桃.....	(219)
第十章 生物碱	(221)
第一节 概述.....	(221)
一、生物碱的含义、分布、存在形式及生物活性.....	(221)
二、生物碱的生物合成简介	(222)
第二节 生物碱的结构与分类.....	(223)
一、鸟氨酸(脯氨酸)系生物碱.....	(223)
二、赖氨酸系生物碱.....	(224)
三、苯丙氨酸和酪氨酸系生物碱.....	(225)
四、色氨酸系生物碱.....	(230)
五、邻氨基苯甲酸系生物碱与鸟氨酸或赖氨酸衍生的生物碱.....	(231)
六、组氨酸系生物碱.....	(232)
七、萜类生物碱.....	(232)
八、甾体类生物碱.....	(234)
九、其他类型的生物碱.....	(234)
第三节 生物碱的理化性质.....	(235)
一、生物碱的性状.....	(235)
二、生物碱的旋光性.....	(236)
三、生物碱的碱性.....	(237)
四、生物碱的溶解性.....	(243)
五、生物碱的沉淀反应.....	(244)
六、生物碱的显色反应.....	(245)

第四节 生物碱的提取分离	(245)
一、总生物碱的提取	(245)
二、生物碱的分离	(247)
第五节 生物碱的检识	(250)
一、生物碱的理化检识	(250)
二、生物碱的色谱检识	(251)
第六节 生物碱类化合物的结构研究	(252)
一、化学方法	(252)
二、光谱方法	(253)
三、结构研究实例	(255)
第七节 生物碱的研究实例	(256)
一、防己	(256)
二、洋金花	(258)
三、川乌、附子、草乌	(263)
四、麻黄	(266)
五、黄连	(271)
第十一章 其他成分	(276)
第一节 鞣质	(276)
一、概述	(276)
二、鞣质的结构与分类	(276)
三、鞣质的理化性质	(279)
四、鞣质的提取分离和除去鞣质的方法	(280)
五、鞣质的检识	(282)
第二节 多糖	(283)
一、概述	(283)
二、多糖的分类	(283)
三、多糖的理化性质	(286)
四、多糖的提取分离	(288)
五、多糖的检识	(290)
六、多糖的提取分离实例	(290)
第三节 氨基酸、环肽、蛋白质和酶	(291)
一、氨基酸	(291)
二、环肽	(295)
三、蛋白质和酶	(297)
第四节 有机酸	(299)
一、概述	(299)
二、有机酸的结构与分类	(299)
三、有机酸的理化性质	(300)
四、有机酸的提取分离	(300)

8 • 中药化学 •	
五、有机酸的检识.....	(301)
第五节 甾类.....	(302)
一、植物甾醇类.....	(302)
二、脱皮素类.....	(303)
三、胆汁酸类.....	(305)
四、蟾酥.....	(307)
附录.....	(309)
中药化学汉英对照索引.....	(309)
中药化学英汉对照索引.....	(322)

第一章 绪论

第一节 概述

中药化学是一门结合中医药基本理论,主要运用化学、物理的理论和研究方法研究中药化学成分的学科。

中药化学的研究对象是中医药防治疾病的物质基础——中药化学成分,通过中药化学成分的理化性质、提取分离、检识、结构测定等方面,对中药化学成分进行研究。

中药的化学成分十分复杂,如从30多种乌头属植物中分离鉴定了百余种生物碱类化学成分。中药中具有生物活性、能起防病治病作用的单一化学成分称为有效成分。如小檗碱(berberine)、麻黄碱(ephedrine)、芦丁(rutine)等。不具有生物活性、不能起防病治病的化学成分称为无效成分。如普通的蛋白质、碳水化合物、油脂等。有效成分的含量超过50%的中药提取分离部分称为有效部位。有效部位含有一个主要有效成分或一组结构相近的有效成分,如人参总皂苷、银杏总黄酮、苦参总碱等。有效成分与无效成分的划分是相对的,一些曾被认为是无效成分的物质,如多糖、蛋白质等,通过深入研究也发现了不少重要的生物活性。

19世纪初,法国药学家Derosone(1804年)和德国药学家Sertürner(1806年)从鸦片中提取分离出具有镇痛镇咳作用的有效成分吗啡(morphine),开创了现代从天然产物中提取分离有效成分的历史。此后有效成分不断地从药用植物中被分离出来用于临床,如奎宁(quinine)、阿托品(atropine)、芦丁、利血平(reserpine)、洋地黄毒苷(digitoxin)等。

我国有机化学家赵承嘏先生于20世纪30年代对著名中药麻黄、延胡索等进行了研究,提取分离出麻黄碱、延胡索乙素(dl-tetrahydropalmatine)等有效成分。此后,我国药学家和化学家对中药化学成分进行了十分广泛深入的研究,提取分离出许多有效成分,如青蒿中的抗疟疾成分青蒿素(qinghaosu),北五味子的抗肝炎成分五味子素(schisandrin)类,黄芩的抗菌成分黄芩素(baicalein)和黄芩苷(baicalin),穿心莲的抗菌成分穿心莲内酯(andrographolide),天麻的镇静催眠成分天麻素(gastrodin),川芎中作用于心血管系统的成分川芎嗪(tetramethylpyrazine),银杏作用于心脑血管的成分银杏内酯A、B、C(ginkgolide A, B, C)、银杏素(ginkgetin),异银杏素(isoginkgetin)等,红豆杉的抗肿瘤成分紫杉醇(taxol),喜树的抗肿瘤成分喜树碱(camptothecine),三尖杉的抗肿瘤成分三尖杉酯碱(harringtonine)类等。

随着科学技术的进步,中药化学的研究方法和手段得到了迅速发展。20世纪50年代以前,提取分离有效成分的方法主要是溶剂法、沉淀法、结晶法等,只能提取分离出含量高、性质稳定、易于结晶的中药化学成分,如吗啡、小檗碱、芦丁等。70年代以来,各种色谱法应用于中药化学成分的研究和生产,使提取分离的能力得到了很大的提高。如美登

木碱 (maytansine) 在美登木中的含量仅为千万分之二, 也能被成功地提取分离出来。在中药化学成分的化学结构测定方面, 50 年代前主要是应用降解、转化、合成等化学方法, 花费的时间长, 需要的样品量大。如 1804 年提取分离出吗啡的单体后, 直到 1925 年才测确定其化学结构, 1952 年才完成化学全合成的工作, 前后花费了近 150 年的时间。在核磁共振、质谱、红外光谱、紫外光谱、旋光谱、圆二色谱、X-衍射等测试技术广泛应用于中药化学成分的结构测定后, 使中药化学成分的结构测定工作变得准确、快速、所需样品量亦趋微量。现在测定一个中药化学成分的化学结构往往只需要几毫克样品, 不仅已知化合物, 即使是新化合物, 一般也能在几天至几个月内完成其化学结构的鉴定或测定工作。

近年来, 中药中一些水溶性的、热不稳定的、分子量大的化学成分, 如多糖、多肽、鞣质等的提取分离和结构测定方法有了很大的发展, 研究报道越来越多, 成为研究中药有效成分的新领域。

我国对中药化学成分 (天然药物化学) 的研究十分重视, 取得了很大的成绩, 如 2003 年我国学者在国内外核心期刊上就发表论文 400 多篇, 分离鉴定化合物 2200 多个, 其中新化合物 604 个。今后, 中药化学将进一步加强与中医药传统理论、中医临床、中药鉴定、中药药理、中药制剂等相关学科的配合与联系, 加强国内、国际合作, 扬长避短, 继续采用先进的提取分离和结构测定方法研究中药有效成分, 重视中药复方化学成分的研究, 重视中药化学在中药现代化过程中的作用。为研制疗效更好、毒副作用更小的新药, 为更好地阐明和发展中医药理论, 为提高中药材、中药制剂生产和质量的水平, 做更多的工作。

第二节 学习中药化学的目的意义

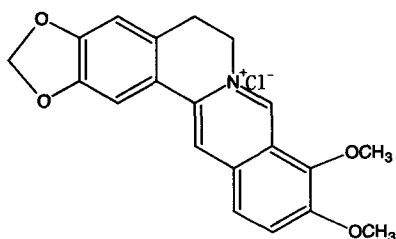
一、研制新药、为人类健康服务

研究中药中具有生物活性的化学成分, 通过与中药鉴定学、药理学、毒理学、制剂学、临床药理学等学科的密切配合, 研制疗效好、毒副作用小、使用安全方便的新药, 一直是中药化学研究工作的一个重要的内容。这项工作关系到人类的健康与发展, 其意义重大而深远。通过这一途径研制新药的成功率比较高, 但是这项工作要求的技术难度大, 研制时间长, 资金投入大。

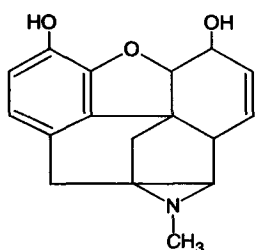
(一) 中药化学成分直接用于临床

通过中药化学成分研制出的许多药物目前仍是临床的基本用药。如麻黄素 (麻黄碱)、黄连素 (盐酸小檗碱)、阿托品、利血平、洋地黄毒苷等药物。20 世纪 70 年代以来, 我国成功地从中药中研制了青蒿素、天麻素、甘草甜素等药物用于临床。

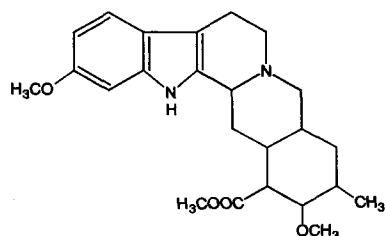
有些中药有效成分的疗效好、毒副作用小, 在中药中含量较高, 可以从其原植物中提取分离出来供临床使用。如黄连素 (盐酸小檗碱)、吗啡、利血平等药物。



盐酸小檗碱



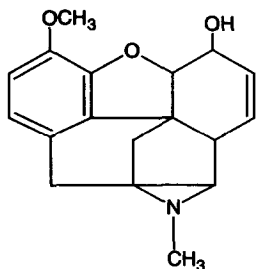
吗啡



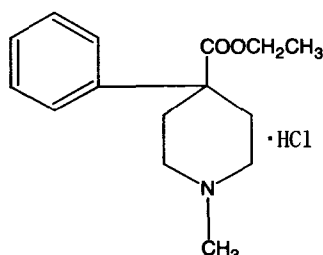
利血平

(二) 中药化学成分的衍生物用于临床

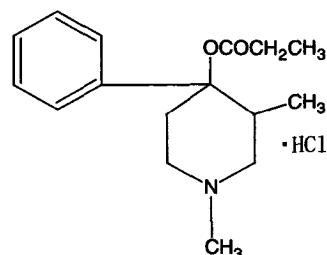
有些中药有效成分由于生物活性不太强，或毒副作用较大，或结构太复杂，或溶解度不够好等，可以用其为先导化合物，进行结构修饰或结构改造，通过对其衍生物进行生物活性的筛选，寻找疗效更好、毒副作用更小、制备更容易、使用更方便的药物。如吗啡是从鸦片分离出来的一个具有很强的麻醉、镇静、镇痛、镇咳作用的单体药物，但其成瘾性极大，在临床上被严格限制使用。通过对吗啡进行结构修饰和结构改造，发现一系列疗效好、成瘾性小的药物，如可待因 (codeine)、度冷丁 (dolantin)、安那度尔 (anadol) 等。



可待因

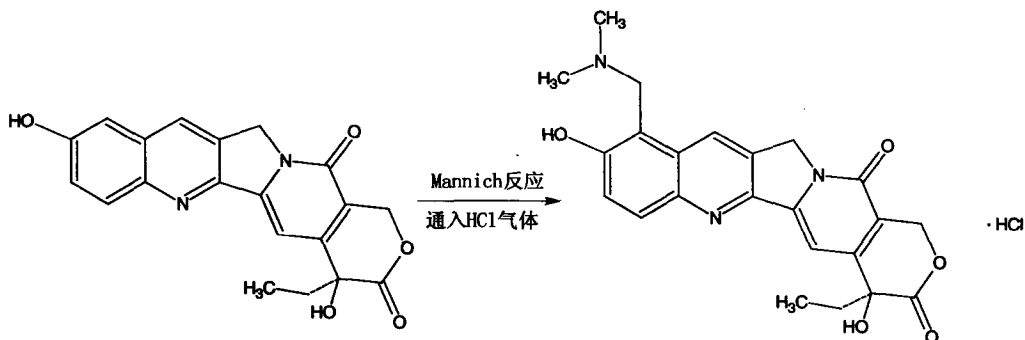


度冷丁



安那度尔

喜树碱有很好的抗肿瘤活性，但其对泌尿系统的毒性大，临床的使用受到很大的限制。通过衍生物的合成，使其变为水溶性的衍生物盐酸拓扑替康，代谢途径产生变化，由原来主要通过肾脏代谢变为主要通过肝脏代谢，在保持其抗肿瘤活性的同时，明显减小了喜树碱对泌尿系统的毒性，有利于其在临床上的使用。

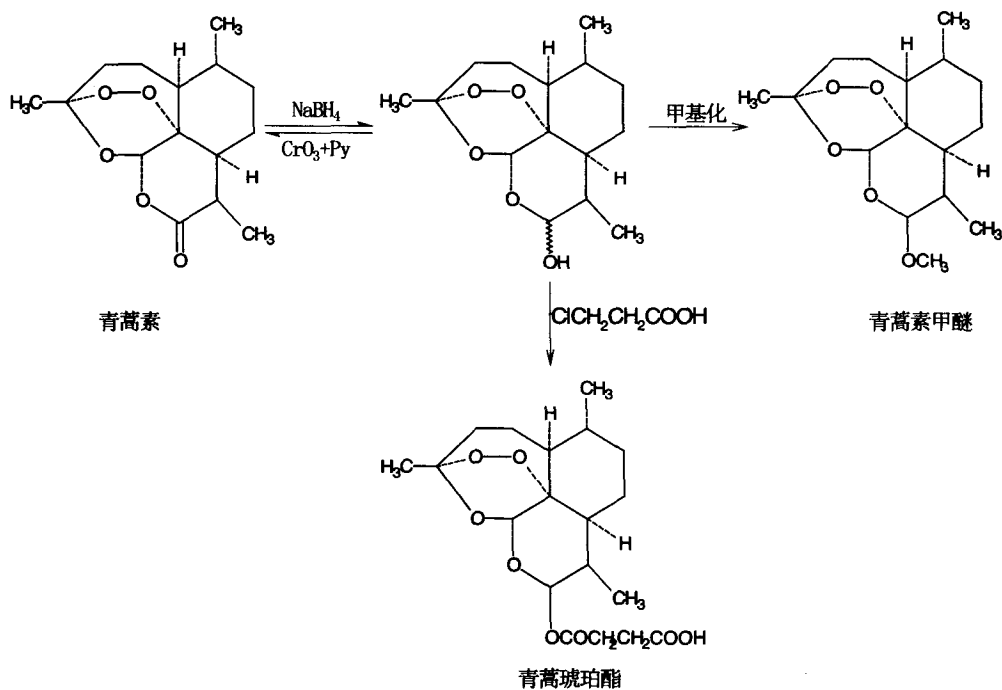


10-羟基喜树碱

盐酸拓扑替康

青蒿素是从中药青蒿中提取分离出来的抗疟疾的有效成分，是一个具有过氧化结构的倍半萜类化合物。青蒿素在水和油中的溶解度均不好，临床使用不方便，影响疗效。为了解决青蒿素的溶解性能不好的缺点，对青蒿素进行一系列的化学结构修饰，将青蒿素结构中的羰基还原成羟基，再制备成水溶性的青蒿琥珀单酯钠 (artesanate) 和油溶性的蒿甲醚 (artemether)，这两个青蒿素的衍生物都有速效低毒、溶解性好、生物利用度高、便于临床使用等优点，目前已工业化生产用于临床。

以中药化学成分为基础研制新药的命中率也较高，一般为千分之一左右，但是从一般的化合物中研制新药的命中率仅为二万分之一。值得指出的是，由于中药的生物多样性，中药化学成分的结构千差万别，结构类型十分丰富，这些自然界产生出来的丰富化学结构很多是化学家想象不出来的，这些化学结构为我们提供了丰富的寻找新药的模版，成为药



物学家进行衍生物的合成的基础。在这些模版的基础上，我们已经研制出了不少的新药，将来还会有更多的新药从这些模版中研制出来，为人民的健康服务。

以上可以看出中药化学在新药研究中的重要意义。

(三) 其他来源的中药化学成分用于临床

此外，在扩大药源方面，有些从中药中研制出来的药物，其化学结构比较简单，可以用化学合成方法大量生产，供临床使用。如麻黄素、阿托品、天麻素等药物。有些有效成分在中药中含量少，或该中药产量小、价格高，可以从其他植物中寻找其代用品，扩大药源，大量生产供临床使用。如黄连素是黄连中的有效成分，用量很大，用黄连来生产成本高，通过调查发现三棵针、黄柏、古山龙等植物均含有黄连素，现用来作为生产黄连素的原料。同科属的植物往往含有化学结构相同或相似的化学成分，因此往往可以按植物的亲缘关系寻找代用品。如紫杉醇 (taxol) 是 20 世纪 70 年代从短叶红豆杉的树皮中发现的，

含量为 0.01%~0.06%。1992 年由美国 FDA 批准为抗癌新药。通过研究,在东北红豆杉、浆果红豆杉、云南红豆杉等几种红豆杉属植物中也寻找到紫杉醇,可作为生产紫杉醇的原料。但生产 1kg 紫杉醇要 1000~2000 棵树的树皮为原料,对生态环境破坏严重。为了解决这一问题,目前除了进行大量人工繁殖栽培外,还在探讨用化学合成法、真菌生产法、组织培养和细胞培养法等生产紫杉醇的可能性,其中植物细胞培养法已取得了明显的进展。

(四) 中药化学在中药制剂中的作用

近年来,中药制剂发展很迅速,除了传统的膏、丹、丸、散外,中药片剂、胶囊剂、冲剂、口服液、针剂、粉针剂等产品不断地被用于临床。中药化学在中药制剂的研制和质量控制中,起着十分重要的作用。表现在以下几个方面。

1. 中药制剂的制备工艺

根据中药化学成分的理化性质,研制合理的工艺,用经济、便利、安全的方法,将中药有效成分提取分离出来,将杂质除去,是中药制剂过程中的一个重要步骤。研究中药有效成分的提取分离工艺时,应根据中药化学成分的溶解性、酸碱性、挥发性等性质,选择适当的溶剂和提取分离方法,确定被提取药材的颗粒大小,溶剂的用量,提取的温度、时间、次数等因素。在衡量提取分离工艺的好坏时,应以有效成分或有效部位的提得率为指标,如果有效成分或有效部位不明确,可以提取物的生物活性为指标,不宜仅用出膏率为指标。在保证质量的前提下,应尽量选用水等价格低的溶剂,以降低成本。如中药穿心莲的提取分离工艺,过去《中国药典》规定用 85%乙醇为提取溶剂。研究表明,穿心莲的有效成分穿心莲内酯不溶于水,但将其在碱水中加热,其内酯开环成盐,可溶于水中被提取出来,再用盐酸将其水溶液调至中性,穿心莲内酯可环合复原。使用碱水代替 85%乙醇作为提取溶剂,可降低成本,不影响提取物的质量。所以《中国药典》(1995 年版一部)中改为用碳酸钠水溶液煎煮,提取液用盐酸调至中性的方法来提取穿心莲内酯。

中药提取物中化学成分的溶解性、酸碱性、挥发性、稳定性、生物利用度等性质是中药制剂剂型选择的主要考虑因素。中药提取物的水溶性较好,可制成口服液、针剂、冲剂等,如生脉饮、柴胡注射液、高三尖杉酯碱注射液、板蓝根冲剂、山楂冲剂等。如中药提取物水溶性不好,可选用片剂、胶囊剂等剂型,如复方丹参片、利血平片、养血生发胶囊等。中药提取物在醇中的溶解度好,可制成酒剂、酊剂等,如国公酒、舒筋活络酒、颠茄酊、远志酊等。

2. 中药制剂的质量控制

为了更好地控制中药制剂的质量,现越来越多地应用中药化学的鉴别反应、鉴别方法和各种色谱方法,如薄层色谱、高效液相色谱、气相色谱等对中药化学成分进行鉴别和含量测定,来达到对中药及其制剂进行质量控制的目的。如高效液相色谱在《中国药典》(1985 年版一部)中没有被用于中药及其制剂的质量控制,1990 年版有 5 个中药用其作为检验方法,1995 年版用高效液相色谱进行检验的中药及中药制剂增加到 11 个,如天麻、丹参、黄芩、小儿消炎栓、愈风宁心片等。

在中药复方制剂的质量控制中,应尽量选用组方中的君药、主要臣药,以及贵重药、毒剧药中有效成分、有效部位作为检测的对象。如龟龄集胶囊由人参、鹿茸、海马等 20 味中药组成,其中人参是君药,也是贵重药,故选用人参的有效成分人参皂苷的苷元人参