

供高职、高专药学专业用

· 全国高等职业技术教育卫生部规划教材 ·

天然药物化学

主编 吴剑峰 · 副主编 叶桂存



人民卫生出版社

全国高等职业技术教育卫生部规划教材
供高职、高专药学专业用

天 然 药 物 化 学

主 编 吴剑峰

副主编 叶桂存

编 者(以姓氏笔画为序)

王天玲(甘肃省定西地区卫生学校)

王 宁(山东省卫生学校)

王昌利(陕西中医学院)

叶桂存(湖北省黄冈卫生学校)

李海燕(广东省佛山职工医学院)

李 端(安徽中医药高等专科学校)

吴剑峰(广东省佛山职工医学院)

明延波(辽宁中医学院职业技术学院)

蒋爱品(北京卫生学校)

戴君武(成都卫生学校)

人 民 卫 生 出 版 社

图书在版编目(CIP)数据

天然药物化学/吴剑峰主编. - 北京：
人民卫生出版社,2003
ISBN 7-117-05359-3

I. 天… II. 吴… III. 药物化学:生药学
IV. R284

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2003)第 002027 号

天 然 药 物 化 学

主 编: 吴 剑 峰

出版发行: 人民卫生出版社(中继线 67616688)

地 址: (100078)北京市丰台区方庄芳群园 3 区 3 号楼

网 址: <http://www.pmph.com>

E-mail: pmph@pmph.com

印 刷: 北京人卫印刷厂

经 销: 新华书店

开 本: 787×1092 1/16 **印 张:** 19.5

字 数: 445 千字

版 次: 2003 年 2 月第 1 版 2003 年 2 月第 1 版第 1 次印刷

标准书号: ISBN 7-117-05359-3/R·5360

定 价: 22.00 元

著作权所有,请勿擅自用本书制作各类出版物,违者必究

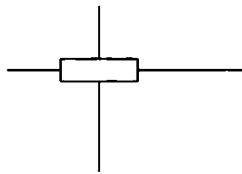
(凡属质量问题请与本社发行部联系退换)

全国高等职业技术教育卫生部规划教材出版说明

医学高等职业技术教育作为我国高等教育的重要组成部分，近年来发展迅速。为保障教育质量，规范课程设置和教学活动，促进我国高等职业技术教育的良性发展，卫生部教材办公室决定组织编写医学高等职业技术教育教材。2001年11月，卫生部教材办公室对我国医学高等职业技术教育现状（专业种类、课程设置、教学要求）进行了调查，并在此基础上提出了医学高等职业技术教育卫生部规划教材的编写原则，即以专业培养目标为导向，以职业技能培养为根本，满足三个需要（学科需要、教学需要、社会需要），力求体现高等职业技术教育的特色。同时，教材编写继续坚持“三基五性”的原则，但基本理论和基本知识以“必须，够用”为度，强调基本技能的培养，特别强调教材的实用性与先进性；考虑到我国高等职业技术教育模式发展中的多样性，在教材的编写过程中，提出了保障出口（毕业时的知识和技能水平），适当兼顾不同起点的要求，以保障教材的适用性。教材编写注意了与专业教育、中等职业教育的区别。从2002年4月起，卫生部教材办公室陆续启动了医学检验、医学影像技术、药学、口腔工艺技术、护理学专业卫生部规划教材的编写工作。

2002年5月，卫生部教材办公室在湖北黄石召开了“全国医学高等职业技术教育药学专业和口腔工艺技术专业卫生部规划教材主编人会议”，正式启动了高等职业技术教育药学专业卫生部规划教材的编写工作。本套教材包括了药学专业的专业基础课和专业课，共计10种。其配套教材亦陆续出版。

| | | | | | |
|------|-----|---------|---------|-----|-----|
| 无机化学 | 主 编 | 黄南珍 | 天然药物学 | 主 编 | 王兴顺 |
| | 副主编 | 欧英富 | | 副主编 | 李建民 |
| 有机化学 | 主 编 | 刘 斌 | 天然药物化学 | 主 编 | 吴剑峰 |
| | 副主编 | 李玮路 | | 副主编 | 叶桂存 |
| 分析化学 | 主 编 | 谢庆娟 | 药剂学 | 主 编 | 孙耀华 |
| | 副主编 | 潘国石 | | 副主编 | 江 丰 |
| 药物化学 | 主 编 | 王玮瑛 | 制剂技术与设备 | 主 编 | 江 丰 |
| | 副主编 | 杨运旭 冯丽华 | | | |
| 药物分析 | 主 编 | 石东方 | 药理学 | 主 编 | 王迎新 |
| | 副主编 | 牛彦辉 | | 副主编 | 于天贵 |



前　　言

本书是由卫生部教材办公室组织编写的全国高等职业技术教育药学专业卫生部规划教材。教材内容的编写紧紧围绕培养符合药学岗位需求的高等技术应用型人才的目标，体现“基本知识必需、够用，强调技能”的教育特色，融传授知识、培养能力、提高素质为一体，注重培养学生创新、获取信息及终身学习的能力，以适应我国高等职业技术教育改革和发展的需要。

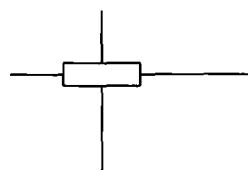
全书共分十三章，重点突出天然药物活性成分提取、分离与鉴定的方法与技术。介绍各类型化合物时，以实例中的活性成分为主，反映学科前沿水平。本书编写在理论学时与实验学时的比例安排上，为提高学生实践能力，增加了实验课学时数，实验选择结合药学进展，囊括基本操作技术。在实验指导的编写上，增加了常用实验技术简介、常用分析仪器基本操作规程及实验室安全事故处理措施等内容，以符合岗位需求。附录中编有天然药物化学成分英汉对照和常用名词缩写。

本书在编写过程中，得到编者所在院校的大力支持，在此表示诚挚的感谢。

为了体现药学高职教育的特色，我们在本书的编写上做了一些尝试，但鉴于编者对高等职业技术教育的理解及学术水平有限，加之编写时间仓促，难免有不当和谬误之处，敬请广大读者批评指正。

编　　者

2002年10月



目 录

| | |
|----------------------------------|----|
| 第一章 绪论 | 1 |
| 一、概述 | 1 |
| 二、天然药物化学的发展与未来 | 2 |
| 三、天然药物化学的应用价值 | 4 |
| 四、天然药物化学成分的溶解性能 | 7 |
| | |
| 第二章 提取分离鉴定的方法与技术 | 8 |
| 第一节 天然药物化学成分的提取方法与技术 | 8 |
| 一、溶剂提取法 | 9 |
| 二、水蒸气蒸馏法 | 12 |
| 三、超临界流体萃取技术 | 12 |
| 第二节 天然药物化学成分分离、精制、鉴定的方法与技术 | 13 |
| 一、系统溶剂分离法 | 14 |
| 二、两相溶剂萃取法 | 15 |
| 三、沉淀法 | 18 |
| 四、结晶与重结晶法 | 19 |
| 五、色谱法 | 21 |
| 六、透析法 | 36 |
| 七、升华法 | 37 |
| 八、分馏法 | 37 |
| 第三节 天然药物化学有效成分结构测定的一般步骤 | 38 |
| 一、测定程序 | 38 |
| 二、测定方法 | 39 |
| | |
| 第三章 生物碱 | 47 |
| 第一节 结构与分类 | 47 |
| 一、有机胺类生物碱 | 47 |
| 二、吡啶类生物碱 | 48 |
| 三、莨菪烷类生物碱 | 49 |
| 四、异喹啉类生物碱 | 49 |
| 五、吲哚类生物碱 | 51 |
| 六、其他类生物碱 | 52 |

| | |
|-------------------------|-----------|
| 第二节 理化性质 | 54 |
| 一、性状 | 54 |
| 二、旋光性 | 54 |
| 三、碱性 | 54 |
| 四、溶解性 | 57 |
| 五、沉淀反应 | 57 |
| 六、显色反应 | 58 |
| 第三节 提取与分离 | 59 |
| 一、提取 | 59 |
| 二、分离 | 60 |
| 第四节 鉴定 | 61 |
| 一、化学方法 | 62 |
| 二、色谱法 | 62 |
| 第五节 实例 | 63 |
| 一、麻黄 | 63 |
| 二、黄连 | 66 |
| 三、苦参 | 70 |
| 四、洋金花 | 73 |
| 五、防己 | 75 |
| 六、川乌 | 77 |
| 第四章 苷类 | 79 |
| 第一节 结构与分类 | 79 |
| 一、按苷键原子分类 | 79 |
| 二、按苷元结构分类 | 83 |
| 三、按苷类在植物体内的存在状况分类 | 83 |
| 第二节 理化性质 | 83 |
| 一、一般形态和溶解性能 | 83 |
| 二、旋光性 | 84 |
| 三、苷键的裂解 | 84 |
| 第三节 提取与分离 | 87 |
| 一、提取 | 87 |
| 二、分离 | 87 |
| 第四节 鉴定 | 87 |
| 一、糖的化学鉴定 | 88 |
| 二、糖的色谱鉴定 | 88 |
| 第五节 实例—苦杏仁 | 89 |
| 第五章 酚类 | 91 |
| 第一节 结构与分类 | 91 |
| 一、苯酚类 | 91 |
| 二、萘酚类 | 92 |

| | |
|--------------------------|------------|
| 三、菲醌类 | 93 |
| 四、蒽醌类 | 93 |
| 第二节 理化性质 | 97 |
| 一、性状 | 97 |
| 二、升华性 | 97 |
| 三、溶解性 | 97 |
| 四、酸碱性 | 97 |
| 五、显色反应 | 98 |
| 第三节 提取与分离 | 101 |
| 一、提取 | 101 |
| 二、分离 | 102 |
| 第四节 蒽醌的色谱鉴定 | 105 |
| 一、薄层色谱 | 105 |
| 二、纸色谱 | 105 |
| 第五节 结构测定 | 106 |
| 一、紫外光谱 | 106 |
| 二、红外光谱 | 107 |
| 三、核磁共振谱 | 108 |
| 四、质谱 | 109 |
| 五、结构鉴定实例——大黄酚的结构鉴定 | 109 |
| 第六节 实例 | 110 |
| 一、大黄 | 110 |
| 二、丹参 | 114 |
| 第六章 黄酮类化合物 | 118 |
| 第一节 结构与分类 | 118 |
| 一、黄酮苷元的结构分类 | 118 |
| 二、黄酮中糖的结构分类 | 123 |
| 第二节 理化性质 | 123 |
| 一、性状 | 123 |
| 二、溶解性 | 123 |
| 三、酸碱性 | 124 |
| 四、显色反应 | 125 |
| 第三节 提取与分离 | 127 |
| 一、提取 | 127 |
| 二、分离 | 128 |
| 第四节 鉴定 | 130 |
| 一、硅胶薄层色谱 | 130 |
| 二、聚酰胺薄层色谱 | 130 |
| 三、纸色谱 | 131 |
| 第五节 结构测定 | 132 |
| 一、紫外-可见光谱 | 132 |

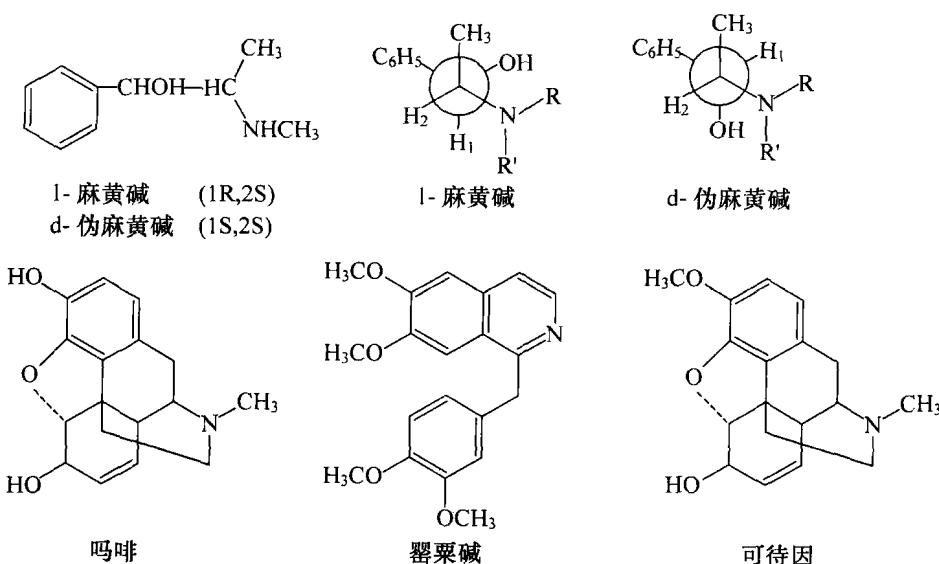
| | |
|--------------------------|------------|
| 二、氢核磁共振谱 | 135 |
| 三、质谱 | 139 |
| 第六节 实例..... | 141 |
| 一、黄芩 | 141 |
| 二、槐米 | 142 |
| 三、葛根 | 143 |
| 四、银杏 | 144 |
| 第七章 香豆素和木脂素 | 147 |
| 第一节 香豆素 | 147 |
| 一、结构与分类 | 147 |
| 二、理化性质 | 150 |
| 三、提取与分离 | 152 |
| 四、鉴定 | 153 |
| 五、实例 | 153 |
| 第二节 木脂素 | 155 |
| 一、结构与分类 | 156 |
| 二、理化性质 | 159 |
| 三、提取与分离 | 160 |
| 四、鉴定 | 161 |
| 五、实例 | 161 |
| 第八章 荚类和挥发油 | 163 |
| 第一节 荚类 | 163 |
| 一、概述 | 163 |
| 二、生源 | 164 |
| 三、结构与分类 | 165 |
| 四、理化性质 | 175 |
| 五、实例—紫杉 | 176 |
| 第二节 挥发油..... | 177 |
| 一、概述 | 177 |
| 二、组成 | 178 |
| 三、理化性质 | 179 |
| 四、提取与分离 | 180 |
| 五、鉴定 | 183 |
| 六、实例 | 186 |
| 第九章 皂苷 | 189 |
| 第一节 结构与分类 | 189 |
| 一、甾体皂苷 | 189 |
| 二、三萜皂苷 | 191 |
| 第二节 理化性质 | 193 |

| | |
|----------------------------|------------|
| 一、性状 | 193 |
| 二、溶解性 | 193 |
| 三、发泡性 | 193 |
| 四、溶血性 | 193 |
| 五、皂苷的水解 | 194 |
| 第三节 提取与分离 | 194 |
| 一、提取 | 194 |
| 二、精制与分离 | 194 |
| 第四节 鉴定 | 195 |
| 第五节 结构测定 | 196 |
| 一、紫外光谱 | 196 |
| 二、红外光谱 | 197 |
| 第六节 实例 | 198 |
| 一、穿山龙 | 198 |
| 二、人参 | 199 |
| 三、甘草 | 201 |
| 四、柴胡 | 203 |
| 第十章 强心苷 | 205 |
| 第一节 结构与分类 | 205 |
| 一、强心苷元部分 | 205 |
| 二、糖部分 | 206 |
| 三、糖和苷元的连接方式 | 207 |
| 四、结构和强心作用的关系 | 208 |
| 第二节 理化性质 | 209 |
| 一、性状 | 209 |
| 二、溶解性 | 209 |
| 三、水解性 | 209 |
| 第三节 提取与分离 | 211 |
| 一、提取 | 211 |
| 二、分离 | 211 |
| 第四节 鉴定 | 212 |
| 一、理化鉴定 | 212 |
| 二、色谱鉴定 | 214 |
| 第五节 实例—毛花洋地黄 | 214 |
| 一、去乙酰毛花苷丙的提取 | 215 |
| 二、地高辛的提取 | 217 |
| 第十一章 其他成分 | 219 |
| 第一节 鞣质 | 219 |
| 一、概述 | 219 |
| 二、结构与分类 | 219 |

| | |
|--------------------------------|------------|
| 三、理化性质 | 221 |
| 四、提取与分离 | 222 |
| 五、除去鞣质的方法 | 222 |
| 第二节 有机酸 | 223 |
| 一、结构与分类 | 224 |
| 二、理化性质 | 224 |
| 三、提取与分离 | 224 |
| 四、鉴定 | 225 |
| 五、实例—金银花 | 226 |
| 第三节 多糖、氨基酸、蛋白质、酶 | 227 |
| 一、多糖 | 227 |
| 二、氨基酸 | 228 |
| 三、蛋白质和酶 | 230 |
| 第四节 动物药活性成分 | 232 |
| 一、牛黄和熊胆 | 232 |
| 二、麝香 | 235 |
| 三、斑蝥 | 236 |
| 第十二章 天然药物活性成分的研究 | 238 |
| 第一节 研究途径 | 238 |
| 第二节 研究方法 | 239 |
| 一、调查研究 | 239 |
| 二、天然药物化学成分预试验 | 240 |
| 三、天然药物化学成分的提取、分离 | 245 |
| 四、天然药物活性成分的筛选 | 246 |
| 五、天然药物化学成分的鉴定和结构测定 | 249 |
| 第十三章 中药制剂分析 | 250 |
| 第一节 概述 | 250 |
| 一、中药制剂分析的目的与意义 | 250 |
| 二、中药制剂分析的特点 | 250 |
| 三、影响中药制剂质量的因素 | 251 |
| 四、中药制剂质量及标准的历史沿革 | 252 |
| 第二节 中药制剂分析工作的基本程序 | 253 |
| 一、取样 | 253 |
| 二、测试试样溶液的制备 | 254 |
| 三、定性鉴别、检查和含量测定 | 255 |
| 四、实验原始记录和检验报告 | 256 |
| 天然药物化学实验 | 261 |
| 一、天然药物化学实验须知 | 261 |
| 二、天然药物化学实验项目 | 263 |

| | |
|----------------------------------|-----|
| 实验一 黄柏中盐酸小檗碱的提取分离与鉴定 | 263 |
| 实验二 防己中粉防己碱的提取分离与鉴定 | 265 |
| 实验三 一叶萩碱的提取分离与鉴定 | 268 |
| 实验四 大黄中游离蒽醌的提取与分离 | 270 |
| 实验五 槐米中芸香苷的提取、分离与鉴定 | 272 |
| 实验六 补骨脂中补骨脂素、异补骨脂素的提取分离与鉴定 | 274 |
| 实验七 八角茴香中挥发油的提取、分离与鉴定 | 277 |
| 实验八 中药制剂薄层色谱鉴别及应用 | 279 |
| 实验九 天然药物化学成分预试验 | 280 |
| 实验十 综合操作技能实验考核 | 282 |
| 三、天然药物化学基本操作技能 | 283 |
| 附录 I 天然药物化学成分英汉对照 | 292 |
| 附录 II 天然药物化学常用名词缩写 | 299 |

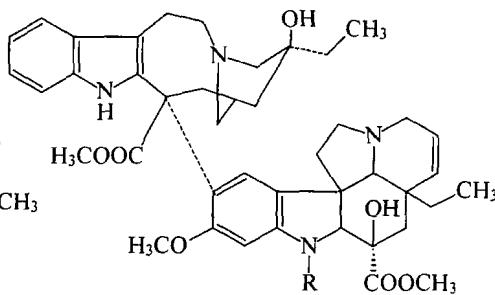
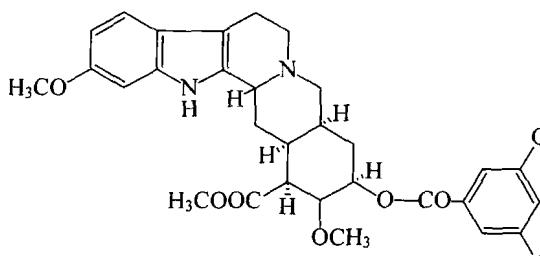
脂、叶绿素、纤维素、草酸钙等其他成分。一般认为天然药物中的蛋白质、多糖、淀粉、树脂、叶绿素、纤维素等成分是无效成分或者杂质。由此可见,有效成分是指经药理和临床筛选具有生物活性的单体化合物,能用结构式表示,并具一定的物理常数。具有生物活性的混合成分称有效部位。没有生物活性的称无效成分。应当指出的是:所谓有效成分与无效成分的概念不能机械的加以理解,随着对天然活性成分的不断开发,无效成分会变为有效成分。以多糖类成分为例,在提取分离中多数被视为无效成分而除去,但猪苓多糖、香菇多糖等多糖类成分已被证明是抗肿瘤的有效成分。根据临床用途,有效成分也会变为无效成分,如大黄中的蒽醌苷具致泻作用,鞣质具收敛作用,均为大黄中的活性成分,当临幊上用于致泻时,鞣质即成为杂质而在加工中被除去,因此有效和无效的划分是相对的。



二、天然药物化学的发展与未来

据国外文献记载,瑞典药剂师、化学家舍勒 K. W. Schelle 于 1769 年将酒石(酒石酸氢钾)转化为钙盐,再用硫酸分解制得酒石酸为从天然药物中分离有机化学成分的始端。而在人类的史前时期,我们的祖先就已经掌握了从动植物来源制作箭毒的技术,他们从各种天然物质中提取药用成分治疗疾病,明代李挺的《医学入门》(1575 年)中就记载了用发酵法从五倍子中得到没食子酸的过程。从天然药物中提取活性成分始于 19 世纪,第一个天然活性成分是 1805 年由德国药师塞图尔(Sertürner)从阿片中提取的吗啡碱,此后数十年从天然药物中发掘了大量的活性成分,如吐根碱(emetine)、奎宁(quinine)、马钱子碱(strychnine)、咖啡因(caffeine)、阿托品(atropine)、洋地黄毒苷(digitoxin)、毒毛旋花子苷(strophanthoside)等,以生物碱居多,都具有显著的生物活性,多数至今仍用作药物。但当时由于分析方法的落后,只能利用分馏和重结晶来纯化单体成分,发展速度缓慢。20 世纪 50 年代先后自印度萝芙木中获得降压成分利血平(reserpine),及从降血糖药长春花中获得抗癌活性成分长春碱(vinblastine)和长春新碱(vincristine),成为两个很有价值的药物,引起各方重视。天然药物化学的发展离不开现代科学技术的进步,1930 年前后,由于

微量元素分析法的导入,试料量降至毫克水平,推进了天然成分的分析工作。近30年来,各种色谱技术的广泛应用,使微量天然新化合物的分离纯化简便易行。同时,红外光谱、核磁共振、质谱等波谱新技术问世,结构研究工作趋向微量、快速和准确。新技术的兴起使研究天然药物化学成分的周期大大缩短,以生物碱类成分为例,1952~1962年的10年间发现新生物碱的数目为1107种,超过此前100年间发现的总数(950种),但1962~1972年的10年间发现的新生物碱数(3443种)又比前十年超出了三倍之多。目前,生物碱类成分总数已达到1万多个。此外研究工作的深度与广度也得到拓展,机体内源性生物活性物质,微量、水溶性及大分子等过去难以提取纯化的物质均已进入研究阶段。



建国以来,我国对天然药物化学的研究进展,引起了国际医药界的瞩目。陆续进行了麻黄素、小檗碱(berberine)、芦丁(rutin)、加兰他敏(galathamine)、山道年(santonin)、咖啡因等天然药物的工业生产,对过去依赖进口的去乙酰毛花苷丙(cediland)、地高辛(digoxin)、阿托品、秋水仙碱(colchicine)等也先后研制投产,薯蓣皂苷元(diosgenin)的工业生产及其资源开发研究更取得了巨大的成就,不仅保证了国内需要,还有大量出口。据不完全统计,迄今已对300余种中药进行了较系统的化学药理研究,发现了600余种有生物活性的单体化合物,其中近100种已开发成为新药,广泛用于临床。如①作用于中枢神经的药物:山莨菪碱(anisodamine)、樟柳碱(anisodine)均为胆碱受体阻滞剂,山莨菪碱用于抢救各种中毒性休克,樟柳碱用于治疗血管性神经性头痛;罗痛定(rotundine)有镇痛、安定、催眠、肌松等神经药理作用。②抗癌药:高三尖杉酯碱(homoharringtonine)对急性粒细胞白血病有较好治疗效果;从中国紫杉中分离得到了高纯度的紫杉醇(taxol),临幊上用于治疗卵巢癌、乳腺癌、食管癌;羟基喜树碱(10-hydroxy-camptothecine)作为治疗消化道癌、肺癌等的新药,已在全世界推广。③心、脑血管药物:蝙蝠葛碱(daurocine)能够抗心率失常;芹菜甲素(apigenin A)对局部脑缺血有明显改善作用;丹参中的水溶性成分丹酚酸A、丹酚酸B、丹酚酸C等有显著的抗脑缺血、抗血栓、脑保护等作用。④作用于肝脏的药物:从北五味子分离得到的五味子丙素(wuweizisu C)有较强的降血清谷丙转氨酶的作用。⑤作用于免疫系统的药物:灵芝多糖能使免疫抑制剂、抗肿瘤药引起的免疫功能抑制和衰老所致的免疫功能障碍明显恢复;临床研究已肯定雷公藤甲素(triptolide)等成分对风湿性关节炎、系统性红斑狼疮等自身免疫性疾病有独特治疗作用。⑥抗生育药:天花粉蛋白用于中期孕妇引产,与前列腺素合用可用于抗早孕;棉酚是新型男性不育化合物。⑦抗疟疾药:青蒿素(artemisinin)及其衍生物作用快、毒性低,尤其对脑型疟效果显著,是国际公

认的从中药中发掘出的抗疟疾良药。⑧改善学习、记忆和抗老年痴呆药:人参皂苷(ginsenosides)Rg₁ 和 Rb₁ 能改善记忆的全过程即记忆的获得、巩固和再现,人参皂苷 Rg₁ 尚有抗细胞凋亡作用。特别是近一、二十年来,随着国家经济实力的增强和对外开放政策的贯彻,大大推动了天然药物化学领域与国外同行间学术交流与人员交往,促进了研究队伍的成长和研究水平的提高。HPLC(高效液相色谱)、DCCC(液滴逆流色谱)、RLCC(旋转液滴逆流色谱)、CPC(离心分配色谱)及 MS(质谱)、NMR(核磁共振谱)、ORD(旋光谱)、X 线单晶衍射等一系列近代分离分析仪器设备和新技术的引进也为天然药物化学的研究工作奠定了必要的物质基础,使天然药物化学成分的研究日新月异,蓬勃发展。

展望未来,生物活性跟踪分离方法将成为研究天然活性成分的主流,研究工作者将选用多指标活性筛选体系,以得到真正的活性成分,并且充分考虑成分的体内代谢过程,注意人体内源性环境对天然药物化学成分的影响;中药质量评价体系和中药复方化学成分的研究也将进入实质性研究阶段。指纹图谱作为中药材及中成药的一种新的质量控制技术,得到国内外研究人员的关注,指纹图谱运用现代分析手段和方法,客观、全面地评价中药质量,对保证中药疗效的发挥具积极意义;天然药物活性成分研究得到的成果将不只是提供用作研究开发新药的先导化合物,还将为标准提取物的制备提供科学基础;应用多学科的理论和技术,促进天然药物化学研究的深入。新药研究是多学科合作的系统工程,而天然药物化学与药物分析、药物化学、生药学、分子生物学、生物工程、微生物学、药理学、毒理学均有密切的关系,其发展必须充分利用相关学科的理论、方法和技术进行综合研究。

世界各国的实践早已证明,天然传统药物历来就是创新药物研究开发的重要源泉。天然药物化学研究的发展为新药开发提供了多样性的化学物质基础,在中国,结合千百年传统医学的宝贵经验,相信天然药物化学成分的研究工作一定会在本世纪对人类做出更大的贡献。

三、天然药物化学的应用价值

21 世纪天然药物的研究成为热点。天然药物化学的应用价值具体表现在:

(一) 开辟扩大药源、促进新药开发

天然药物有效性的物质基础在于它的有效成分。当某一天然药物的疗效肯定,但药源缺乏时,我们就可以根据此天然药物中有效成分的化学结构和理化性质,分析和寻找其他动植物中或同一植物的不同部位是否含有此种成分,从而开辟和扩大药源。如最初从毛茛科植物黄连中发现的小檗碱有抗菌消炎作用,因黄连生长缓慢而资源有限,供不应求。根据小檗碱理化特性,经寻找发现小檗属的三颗针,防己科的古山龙,芸香科的黄柏等植物中也含有此成分,开辟了提取小檗碱的广阔药源,而且三颗针、古山龙已成为提取小檗碱的主要原料。又如通过对人参的不同部位进行有效成分测定,发现不仅是人参根中含有效成分人参皂苷,人参茎、叶中也含有丰富的人参皂苷,由此提示对同一植物不同部位的有效成分研究可更合理地使用药材,扩大药源。

开发天然药物有效成分的另一途径,就是根据有效成分的结构特点进行人工合成和结构改造,以扩大药源和创制高效低毒的新药物。至今人工合成生产天然药物有效成分的例子很多,如麻黄中的麻黄碱,洋金花中的阿托品,天麻中的天麻苷(gastrodin),茶叶中

病的作用机制上将会有突破。

(三) 控制天然药物及其制剂的质量

天然药物防治疾病的作用，与其有效成分的存在和含量的多少有关，而有效成分又受天然药物的品种、产地、采收季节、加工方法、贮存条件的影响而变化。如麻黄中的麻黄碱在春季较低，从夏季到八、九月含量渐高至顶峰，随后含量又逐渐降低。若不研究麻黄碱含量随季节变化的规律，就很难保证麻黄在临床上的合理运用。因此，只有研究了天然药物的有效成分，才能通过含量测定的方法控制天然药物及其制剂的质量。如中药银黄注射液是由金银花、黄芩两味中药中提取的有效部位配制而成。实验证明：绿原酸（chlorogenic acid）为金银花中的主要有效成分之一，黄芩苷（baicalin）为黄芩的主要有效成分，故可用高效液相色谱法测定黄芩苷和绿原酸的含量，以控制银黄注射液的质量。

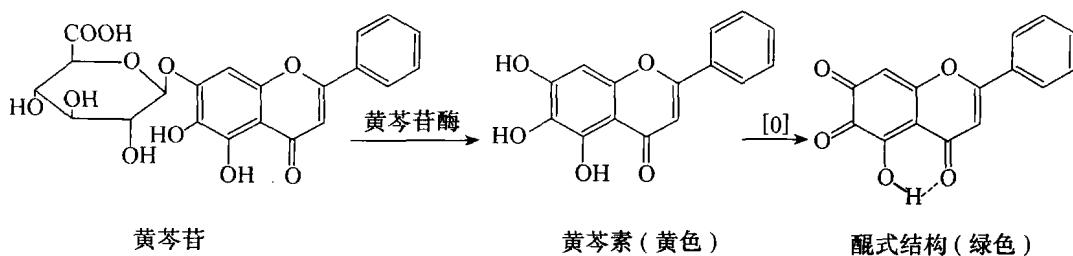
(四) 改进药物剂型，提高临床疗效

制剂的有效性、安全性、合理性，反映了医药水平和用药效果。应用了几千年的中药传统剂型丸、散、膏、丹、汤剂，已不能完全适应现代医学防治疾病的需要。为了提高疗效，降低毒、副作用，就必须在研究有效成分的基础上，从两方面入手研究中药新剂型：一是将中药经过提取分离后，去粗存精，去伪存真，用新技术加工成现代药物剂型。二是深入研究药物剂型在体内的吸收、分布、代谢、排泄规律，创制出遵循中医用药特点，发挥预期疗效的新剂型。

(五) 为中药炮制提供现代科学依据

中药炮制是中医药学中的传统制药技术。通过炮制，使中药中的化学成分发生变化，以达到增强疗效，降低毒、副作用，便于加工贮存及易于制剂和服用等目的。一种药物经过不同炮制也可发挥多方面疗效，如酒制大黄使泻下作用减弱，增强了清热、消炎、活血化瘀的作用；蜜制大黄适用于老年体弱的便秘；大黄炭适用于体内出血；石灰制大黄则适用于外伤出血；醋制大黄活血化瘀的作用特别突出。因此，历代医家十分重视中药炮制，明代陈嘉谟指出：“制药贵在适中，不及则功效难求，太过则气味反失……”。但传统炮制法往往没有客观一致的标准，如炒黄，炒焦等只是根据操作人的眼观经验来判断，所得炮制品难以规范。只有在清楚中药有效成分的基础上，用现代实验技术和方法对其进行定性定量分析，才能有效地控制炮制品的规格质量。

研究中药炮制前后化学成分的变化，有助于阐明炮制原理，改进和完善传统炮制方法和技术。如何首乌生品有润肠、解疮毒作用，而制品则有补肝肾作用。通过对首乌炮制前后的化学成分分析，得出：制首乌中具有致泻作用的蒽醌苷水解为几乎无泻下作用的游离蒽醌衍生物；生首乌的含糖量为5.8%，而制首乌的含糖量为10.84%。成分分析阐明了何首乌的炮制原理。又如传统黄芩炮制有冷浸和蒸煮两种方法，通过对有效成分黄芩苷分析显示：黄芩冷浸炮制时，黄芩苷被存在于同一植物中的酶水解为苷元黄芩素，黄芩素具邻位酚羟基易氧化为醌式结构而显绿色，作用下降；黄芩经蒸煮炮制时，可破坏其共存酶的活性，防止黄芩苷酶解，使药材保持黄色，疗效不变。成分分析结果与药理实验结果相符，同时也为传统的论点“应以黄为佳”提供了科学的理论依据。



四、天然药物化学成分的溶解性能

天然药物化学成分的溶解性能在各章节都将涉及,为了便于学习,特将天然药物中主要类型化学成分的溶解性能列表 1-1:

表 1-1 天然药物化学成分的溶解性能

| 水溶性成分 | 水、醇共溶成分 | 醇、脂共溶成分 | 脂溶性成分 |
|--------|---------|---------|-------|
| 单糖及低聚糖 | 生物碱盐 | 游离生物碱 | 油脂 |
| 淀粉 | 苷 | 苷元 | 蜡 |
| 粘液质 | 水溶性色素 | 脂溶性色素 | |
| 氨基酸 | 鞣质 | 挥发油 | |
| 蛋白质 | 水溶性有机酸 | 非水溶性有机酸 | |
| 无机成分 | | 树脂 | |

注:

1. 表中各类成分的溶解性能是指较纯的成分在较纯的溶剂中的溶解性能。
2. 水、醇共溶成分指既溶于水又溶于乙醇的成分。
3. 醇、脂共溶成分指既溶于乙醇又溶于亲脂性有机溶剂的成分。
4. 醇溶性成分主要指溶于 95% 乙醇的成分。
5. 脂溶性成分主要指溶于醋酸乙酯、乙醚、氯仿、苯、石油醚等有机溶剂的成分。
6. 蛋白质在热水中可凝固。
7. 淀粉溶于热水成胶体溶液,不溶于冷水。
8. 苷、苷元包括醌类、黄酮类、香豆素和木脂素、皂苷、强心苷等化学成分。
9. 鞣类的组成包括挥发油、树脂、皂苷元、植物色素等,属醇、脂共溶成分。

(吴剑峰)