

全国中医药行业高等中医药院校成人教育规划教材（专科）

中药化学

供药学、中药学、药物制剂、生物制药、中药资源与开发、药物分析等专业使用

国家中医药管理局人事教育司 / 指导

全国中医药成人教育学会、湖南科学技术出版社 / 组织编写

主编单位：陕西中医学院

主编：宋小妹（陕西中医学院）

主审：石任兵（北京中医药大学）

全国中医药行业高等中医药院校成人教育规划教材 (专科)

中药化学

供药学、中药学、药物制剂、生物制药、中药资源与开发、药物分析等专业使用

国家中医药管理局人事教育司 / 指导

全国中医药成人教育学会、湖南科学技术出版社 / 组织编写

主编单位：陕西中医学院

主 编：宋小妹（陕西中医学院）

副 主 编：窦德强（辽宁中医药大学）

关 枫（黑龙江中医药大学）

陈建真（浙江中医药大学）

冯维希（连云港中医药高等职业技术学校）

编 者：王洪兰（南京中医药大学）

王 瑞（上海中医药大学）

关 枫（黑龙江中医药大学）

邓雁如（天津中医药大学）

曲 杨（辽宁中医药大学）

冯维希（连云港中医药高等职业技术学校）

宋小妹（陕西中医学院）

杨黎彬（西安医学院）

陈建真（浙江中医药大学）

郭 玫（甘肃中医学院）

雷敬卫（河南中医学院）

廖华军（福建中医药大学）

主 审：石任兵（北京中医药大学）

图书在版编目 (C I P) 数据

中药化学 / 宋小妹主编. — 长沙 : 湖南科学技术出版社, 2012. 8

全国中医药行业高等中医药院校成人教育规划教材. 专科
ISBN 978-7-5357-7178-0

I. ①中… II. ①宋… III. ①中药化学—成人高等教育—教材 IV. ①R284

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2012) 第 050606 号

全国中医药行业高等中医药院校成人教育规划教材 (专科)

中药化学

指 导: 国家中医药管理局人事教育司

组织编写: 全国中医药成人教育学会、湖南科学技术出版社

主编单位: 陕西中医学院

主 编: 宋小妹

主 审: 石任兵

责任编辑: 石 洪 邹海心

文字编辑: 席小泉 唐艳辉

出版发行: 湖南科学技术出版社

社 址: 长沙市湘雅路 276 号

<http://www.hnstp.com>

邮购联系: 本社直销科 0731-84375808

印 刷: 长沙宇航印刷有限公司

(印装质量问题请直接与本厂联系)

厂 址: 长沙市河西望城坡航天大院

邮 编: 410205

出版日期: 2012 年 8 月第 1 版第 1 次

开 本: 787mm×1092mm 1/16

印 张: 13.5

字 数: 330000

书 号: ISBN 978-7-5357-7178-0

定 价: 27.00 元

(版权所有·翻印必究)

全国中医药行业高等中医药院校成人教育规划教材 (专科)

编写领导小组名单

主 任：洪 净 郑炳生 黄一九

副 主 任：周 杰 徐英敏 王子寿 黄政德 石 洪

小组成员：(按姓氏笔画为序)

马承严 王仁安 王济平 王彦辉 王慧生

卞 瑶 江 滨 许克祥 刘桂玲 张茂昌

张 志 李献平 李瑞洲 何文斌 何清平

陈革新 陈 莘 邹本贵 周国辉 金卫东

贺新怀 赵冀生 洪 雁 祝 捷 郝达富

贾 勇 聂亚飞 秦祖杰 常富林 曹世奎

黄水清 梁 华 鄂蕴娟 蒋冠斌 韩建民

韩爱丽 游卫平 魏希启 魏东明 戴其舟

办公室主任：邹海心

出版说明

《全国中医药行业高等中医药院校成人教育规划教材》（专科、专升本）是在国家中医药管理局人事教育司精心指导下，首次组织全国二十多家高等中医药院校及全国高职高专学校编写的中药学等专业成人教育规划教材。本套教材的编写，旨在培养适应社会主义现代化建设和中医药事业发展需要的，德、智、体、美全面发展，具备中药学基础理论、基本知识、基本技能以及相关的中医学、药学等方面的知识和能力，掌握一定的人文社会科学、自然科学和中国传统文化知识，能从事中药生产、科研、教学、管理等方面工作，具有良好的职业道德和职业素质，富有创新意识的中药专门人才。

《全国中医药行业高等中医药院校成人教育规划教材》（专科、专升本）根据“政府指导，学会主办，学校联办，出版社协办”的精神编写出版，即国家中医药管理局人事教育司宏观指导；全国中医药成人教育学会、湖南科学技术出版社具体组织；全国高等中医药院校广泛参与，既是教材编写的主体，又是教材的使用单位；湖南科学技术出版社负责教材的出版，并协助政府、学会、院校，提供编辑出版方面的服务和经费支持。这种四位一体的运作机制，旨在有机结合各方面的优质资源，有效调动各方面的积极性，有力保证教材的科学性、权威性、公认性和教学适应性。

2008年1月在湖南长沙召开《全国中医药行业高等中医药院校成人教育规划教材》（专科、专升本）编写出版工作会议；2009年3月26日在北京召开本教材的编写领导小组组长会议；同年8月，在长沙召开全体主编会议。几次会议明确了本套教材的编写遵循以下原则：

1. 少而精的原则：中医药行业成人高等教育的形式为业余学习，均以自学为主，面授为辅。学员多为在职从业人员。因此，教材编写必须掌握理论够用为度，重在实用，便于自学，贯彻少而精的原则。要突出重点，讲清难点，切忌照搬全日制普通高校教材。各门课程教材字数篇幅限制在每面授课时3000字以下（含教学大纲，教学大纲作为附录编入教材）。

2. 循序渐进的原则：中医药行业成人高等教育分专科和本科两个层次，本科教育的适用对象为专升本学员，专科、本科分别编写教学大纲和教材。因此，同一课程的专科、本科教材内容，做到由浅入深，由易到难，逐步深化，紧密衔接，避免了知识点不必要的重复或疏漏，体现循序渐进的原则。各位主编负

责同一课程的专科、专升本两个层次教材内容相互衔接,各课程之间的大纲教学内容相互协调。

3. 因材施教的原则:中医药行业成人教育的对象主要在基层,其学习、工作、文化基础条件相对较差。教材编写应正视现实,适应教学需求,避免内容过难、过繁、过宽。另外,本套教材中的中医类课程如《中医学基础》、西医类课程如《解剖生理学》、《药理学》等,编写时注意适应中药专业的需求,体现中医药思维,同时兼顾学历教育和执业资格、职称考试的需求。

中医药行业成人教育是中医药人才队伍建设的一个重要组成部分,尽管我们在全国高等中医成人教育教材上有着相当不错的成绩,积累了许多的经验,但是,中药成人教育教材是在国家中医药管理局人事教育司的指导下首次尝试,前进的道路仍十分漫长,还有许多课题需要我们去探索,还有很多困难有待我们去克服,教材编写是教育事业的一项基础工作,直接关系到教学质量的提高,编好教材不仅需要作者们呕心沥血,更需要教学师生的关心和支持,诸如课程设置是否合理、教学内容详略是否恰当、大纲安排是否切合实际等等,都有待于广大师生提出批评和建议,以便今后修订再版时更臻完善。

最后,我们要感谢参编院校的领导和各位主编、编者,他们为教材的编写做出了无私的贡献和积极的努力;感谢使用教材的院校领导和师生,他们一直关心教材的编写情况,并提出了很多的宝贵建议。由于时间紧,任务重,在编写和编辑的过程中难免存在着各种各样的问题,敬请各位读者谅解!

湖南科学技术出版社

2012年6月

前 言

《中药化学》是在国家中医药管理局人事教育司指导下，由全国中医药成人教育学会、湖南省科学技术出版社组织编写的全国中医药行业高等中医药院校成人教育规划教材之一。

根据成人在职教育的特点，教材编写时掌握理论够用为度，重在实用，便于自学，贯彻少而精的原则，突出重点，讲清难点，不同于全日制普通高校教材。本教材的编写内容，注重培养学生的综合知识与技能。全书共分为十一章，第一章绪论，重点介绍中药化学的任务和研究对象及学习中药化学的意义；第二章中药化学成分提取、分离与鉴别方法，重点介绍中药化学成分研究常用的提取分离鉴别的原理和方法；第三章至第十一章详细介绍中药各类成分的结构特点、重要理化性质及提取分离检识方法等，每章后附有中药研究实例。另外，在每章中还附有目的要求、自学时数、自学指导，每章的复习思考题附有参考答案。附录列出了中药化学成分常用检出试剂配制法。

在本教材编写过程中，王薇、刘超、李渊源、宋蓓等同志参与了部分工作，在此表示衷心感谢。

限于作者水平和能力，书中难免有不妥之处，敬请读者斧正为盼。

《中药化学》(专科)编委会

2012年6月

目 录

第一章 绪论	1
第一节 中药化学的任务和研究对象	1
第二节 中药化学在中医药现代化中的作用	3
一、阐释中药作用的药效物质基础,探索中药防治疾病的作用原理	3
二、阐明中药炮制原理,改进炮制工艺	3
三、改进中药传统剂型,提高临床疗效	3
四、提高中药质量控制水平,保证临床用药的安全有效	4
五、利于中药新产品的开发,扩大药源	4
自学指导	5
第二章 中药化学成分提取、分离与鉴别方法	7
第一节 中药化学成分的提取方法	8
一、溶剂提取法	8
二、水蒸气蒸馏法	11
三、升华法	11
四、超临界流体萃取法(SFE)	12
五、超声波提取技术(UE)	12
六、提取液的浓缩	12
第二节 中药化学成分的分离精制方法	13
一、溶剂法	14
二、沉淀法	15
三、结晶法	16
四、分馏法	17
五、色谱法	17
第三节 中药化学成分的检识及结构测定	24
一、中药化学成分的检识方法	24
二、现代波谱技术在中药化学成分结构测定中的应用	26
自学指导	26
第三章 生物碱	31
第一节 概述	32
一、生物碱的含义、分布、存在形式及生物活性	32
二、生物碱的结构分类	32
第二节 生物碱的性质	37
一、性状	37
二、溶解性	37
三、碱性	38

四、沉淀反应	40
第三节 生物碱的提取与分离	40
一、生物碱的提取	41
二、生物碱的分离	41
三、水溶性生物碱的分离	44
第四节 生物碱的检识	45
一、化学检识	45
二、色谱检识	45
第五节 含生物碱的中药实例	46
一、麻黄	46
二、黄连	49
三、苦参	50
四、洋金花	52
五、防己	53
六、延胡索	55
七、马钱子	57
八、乌头（附子）	58
九、含生物碱的其他常用中药	60
自学指导	61
第四章 苷类	64
第一节 概述	65
一、苷类的含义	65
二、苷的结构与分类	66
第二节 苷类化合物的理化性质	68
一、性状	68
二、溶解性	68
三、旋光性	68
四、苷键的裂解	68
第三节 苷类化合物的提取分离	70
一、提取方法	70
二、分离方法	70
第四节 苷类化合物的检识	72
一、理化检识	72
二、色谱检识	72
第五节 含苷类化合物的中药实例	73
一、天麻	73
二、虎杖	74
三、含苷类的其他常用中药	75
自学指导	75
第五章 醌类化合物	78

第一节 醌类化合物的结构与分类	78
一、苯醌	79
二、萘醌	79
三、菲醌	80
四、蒽醌	80
第二节 醌类化合物的理化性质	83
一、性状	83
二、溶解性	83
三、酸碱性	83
四、颜色反应	84
第三节 醌类化合物的提取分离	86
一、醌类化合物的提取	86
二、醌类化合物的分离	87
第四节 醌类化合物的检识及波谱特征	87
一、化学检识	87
二、色谱检识	88
三、波谱特征	88
第五节 含醌类化合物的中药实例	89
一、大黄	89
二、丹参	90
三、含醌类化合物的其他常用中药	92
自学指导	92
第六章 香豆素和木脂素	94
第一节 香豆素类化合物	94
一、香豆素类化合物的结构与分类	95
二、香豆素类化合物的性质	96
三、香豆素类化合物的提取分离	97
四、香豆素类化合物的检识及波谱特征	98
第二节 木脂素类化合物	98
一、木脂素类化合物的结构与分类	98
二、木脂素类化合物的性质	101
三、木脂素类化合物的提取分离	102
四、木脂素的检识	102
第三节 含香豆素和木脂素类化合物的中药实例	102
一、秦皮	102
二、南五味子	103
三、含香豆素和木脂素的其他常用中药	105
自学指导	106
第七章 黄酮类化合物	108
第一节 概述	109

一、黄酮类化合物的含义、分布及主要生物活性	109
二、黄酮类化合物的结构与分类	109
第二节 黄酮类化合物的性质	112
一、性状	112
二、旋光性	113
三、溶解性	113
四、酸性	113
五、显色反应	113
第三节 黄酮类化合物的提取分离	115
一、黄酮类化合物的提取	115
二、黄酮类化合物的分离	115
第四节 黄酮类化合物的检识及波谱特征	118
一、化学检识	118
二、色谱检识	118
三、黄酮类化合物在甲醇溶液中的紫外光谱特征	118
第五节 含黄酮类化合物的中药研究实例	119
一、槐米	119
二、银杏叶	120
三、含黄酮类化合物的其他常用中药	121
自学指导	122
第八章 萜类和挥发油	125
第一节 萜类	125
一、萜类的含义、分类及生物活性	125
二、萜类化合物的结构和分类	126
第二节 挥发油	133
一、概述	133
二、挥发油的组成	134
三、挥发油的通性	134
四、挥发油的提取分离	135
五、挥发油的检识	138
六、含挥发油的中药实例	139
自学指导	143
第九章 皂苷	145
第一节 皂苷类化合物的结构与分类	145
一、甾体皂苷	146
二、三萜皂苷	147
第二节 皂苷类化合物的理化性质	149
一、性状	149
二、溶解性	150
三、发泡性	150

四、水解性·····	150
五、颜色反应·····	150
六、溶血作用·····	151
第三节 皂苷类化合物的提取分离·····	151
一、皂苷的提取方法·····	151
二、皂苷的精制与分离·····	151
第四节 皂苷类化合物的检识及波谱特征·····	152
一、理化检识·····	152
二、色谱检识·····	152
三、波谱特征·····	153
第五节 含皂苷的中药实例·····	153
一、人参·····	153
二、甘草·····	155
三、柴胡·····	157
四、绞股蓝·····	158
五、穿山龙·····	160
六、含皂苷类成分的常用中药·····	161
自学指导·····	162
第十章 强心苷·····	164
第一节 概述·····	165
一、强心苷的含义、分布及生物活性·····	165
二、强心苷的结构与分类·····	165
第二节 强心苷的性质·····	168
一、性状·····	168
二、溶解性·····	168
三、水解反应·····	168
四、颜色反应·····	170
第三节 强心苷的提取与分离·····	172
一、强心苷的提取·····	172
二、强心苷的分离·····	172
第四节 强心苷的检识及波谱特征·····	173
一、化学检识·····	173
二、色谱检识·····	173
三、波谱特征·····	173
第五节 含强心苷的中药实例·····	174
一、毛花洋地黄·····	174
二、含强心苷的其他常用中药·····	178
自学指导·····	179
第十一章 其他成分·····	181
第一节 其他成分简介·····	181

一、鞣质.....	181
二、有机酸.....	183
三、氨基酸.....	184
四、蛋白质和酶.....	184
五、多糖.....	185
六、有机含硫化合物.....	186
第二节 动物药化学成分简介.....	186
一、动物药化学成分类型.....	187
二、常用动物药化学成分简介.....	187
第三节 矿物药化学成分简介.....	190
一、矿物药的分类.....	190
二、主要矿物药化学成分简介.....	191
自学指导.....	191
附录.....	193
《中药化学》教学大纲	197

第一章 绪 论

【目的要求】

1. 掌握中药化学成分的概念。
2. 熟悉中药化学的任务和研究对象。
3. 了解中药化学在中医药现代化研究中的作用。

【自学时数】

4 学时。

中药化学是以中医药理论为指导,运用化学理论、方法及其他现代科学理论和技术研究中药化学成分的科学。研究内容包括中药化学成分的结构分类、理化性质、提取分离及鉴定等。从中药化学研究过程来看,化学成分的提取、分离依据是化学成分的理化性质,而理化性质又是由其化学结构决定的,因此,进行中药化学成分的分​​离鉴定,确定其化学结构,是中药化学研究的核心内容,也是开展中药现代研究的基础和关键,其结果对于阐释中药药效作用的物质基础、探索中药防病治病的作用原理、阐明中药炮制原理、改进炮制工艺、改进中药传统剂型、提高临床疗效、提高中药质量控制水平、保证临床用药安全有效及扩大药源,开发新药等具有重要意义。

第一节 中药化学的任务和研究对象

中药化学是以中医药理论为指导,运用化学理论、方法及其他现代科学理论和技术研究中药化学成分的科学。其研究内容主要包括中药化学成分(主要是生理活性成分和有效成分)的化学结构、理化性质、提取、分离、检识、结构鉴定与确定、生物合成途径和必要的化学结构修饰或改造,以及有效成分结构与中药药效之间的关系等。

中药作为中药化学的主要研究对象,是祖国医药学的重要组成部分,也是我国传统医学防治疾病的重要武器。然而,随着现代科学技术的进步和发展,中药的概念及内涵也在发生着一些变化。以往被人们所熟知的中药主要指中药材,是指在某特定自然条件、生态环境的地域内所产的药材;而现代广义的中药包括中药材、中药饮片、中药提取物及中药复方等,从目前来看,这些都被作为中药化学的研究对象,纳入中药化学研究的范畴。

中药除少数为人工制成品外,大都是来自植物、动物、矿物的非人工制品,并以植物来源为主,并且种类繁多。据我国中国药材公司和全国中药资源普查办公室自 1985 年至 1994

年对全国中药资源进行全面调查的结果,我国天然中草药共有 12807 种,其中植物药为 11146 种,动物药 1581 种,矿物药 80 种。

中药的化学成分按其化学特性来分包括有机化合物和无机化合物两大类。有机化合物进一步按其结构类型又分为生物碱类、黄酮类、香豆素类、蒽醌类、强心苷类、皂苷类、萜类和挥发油等。无机化合物为矿物药的主要化学成分,也是某些植物药的有效成分。如夏枯草含有钾元素的无机盐,初步认定是其降压的有效成分。

中药化学成分若按其有效性来分,可分为有效成分和无效成分。所谓有效成分主要是指具有一定生理活性的化学成分,包括生物碱类、各种苷类(黄酮苷、蒽醌苷、皂苷、强心苷等)、萜类和挥发油等。如黄连中的小檗碱,具有抗菌消炎作用;槐米中的芦丁具有抗炎、抗病毒及类似于维生素 P 的作用;大黄中的大黄素具有抗菌、止咳、抗肿瘤、降血压、泻下等作用。而把不具有生理活性的化学成分称为无效成分,主要包括植物多糖、蛋白质、树脂、叶绿素、鞣质等,在中药制剂过程中往往被除去。然而,随着中药现代研究的不断进步,许多曾被认为无效的化学成分被重新发现新的生物活性和药理作用,有的还被作为中药制剂的原料药用于中药制剂的生产并用于临床。如由氟尿嘧啶、海藻多糖、黄芪多糖组成的复方抗癌制剂对小鼠体内移植肉瘤(S180)、小鼠肝癌(H22)均有显著的抑制作用,与化疗药物氟尿嘧啶相比,抑瘤作用增强,毒副作用降低。猪苓多糖注射液制剂具有抗肿瘤、增强免疫及保肝作用,临床用于治疗慢性肝炎、肿瘤等;天花粉蛋白具有引产作用;五倍子鞣质能凝固并破坏癌细胞,具抗肿瘤作用,对小鼠肉瘤 S180,人类宫颈癌细胞 JTC26 的抑制率均达 90% 以上等。因此,中药有效成分和无效成分只是一个相对概念。

近些年,在中药现代化研究中常常出现有效部位和有效部位群的概念。所谓“有效部位”是指从单味药材或复方中提取得到的具有相近化学性质的一类化合物(药效成分群),如总生物碱、总黄酮等;“有效部位群”则是指中药或复方中几类有效部位的集合。

中药的化学成分是中药发挥各种临床疗效的物质基础,中药化学成分十分复杂,通常情况下,一种中药往往含有几种不同结构类型的化学成分,而每种类型化学成分又可能包含几种乃至几十种化学成分。如中药黄芪除含有皂苷(主要有黄芪苷 I、II、III、IV、V、VI、VII、异黄芪苷 I、II、IV 及大豆皂苷 I 等)成分外,还含有黄酮类(主要有槲皮素、山柰黄素、异鼠李素、鼠李异柠檬素、羟基异黄酮、异黄烷、芦丁、芒柄花素、毛蕊异黄酮等)及多糖类等。单味中药已经如此,中药复方就更复杂了,这不仅体现了中药化学成分的复杂性,也体现了中药功效的多样性,中药化学成分是中药发挥各方面临床疗效或多种药理作用的物质基础,也是中药化学研究的主要目的。

不同中药,其化学成分的结构不同,性质各异。中药化学研究就是在掌握中医药传统理论知识的基础上,综合运用各种现代理论知识和方法,探索中药或中药复方中不同类型化学成分的结构性质及提取分离的检识方法和规律,用以进一步探索中药药效的物质基础,系统阐明中医药理论,为中医药现代化奠定基础。

进入 21 世纪以来,随着人们健康意识的增强,中医药以其独特的疗效和低毒、低副作用,越来越受到全世界人民的青睐。随着各种现代化研究技术手段和方法的广泛应用(如超临界流体萃取技术、大孔吸附树脂技术、高速逆流色谱技术、液相色谱技术及 MS、NMR、X-射线单晶衍射等),为中药化学研究提供了技术保障,必将促进中药化学的发展,进而推动中医药事业的发展和进步。

第二节 中药化学在中医药现代化中的作用

中药化学作为中药学及其相关专业的一门专业基础课,在其课程体系中具有极其重要的地位。因此,学好中药化学对于更好地理解 and 掌握其他专业课知识,开展中医药现代化的研究具有重要作用。

一、阐释中药作用的药效物质基础,探索中药防治疾病的作用原理

中药防病治病的物质基础是其所含有的各种化学成分。中药化学以中药传统功效主治为基础,通过采用中药化学的理论和方法进行中药化学成分的分析,并进行化学成分的提取分离,得到其中的各种化学成分,进一步结合药理、药效学或分子生物学技术等,确定其有效成分,并说明其防治疾病的作用机制。如中药大黄,中医认为具有泻下攻积、清热泻火、凉血解毒、逐瘀通经、利湿退黄的功效,主要用于实热积滞便秘、血热吐衄、湿热痢疾、黄疸尿赤、淋证、水肿及外治烧烫伤等。现代化学研究表明,大黄主要化学成分为醌类(蒽醌及二蒽酮类)、鞣质等成分。药理研究表明,其番泻苷类被认为是其泻下的主要有效成分,其作用机制为番泻苷在肠道细菌酶的作用下分解产生大黄酸蒽酮,大黄酸蒽酮可刺激大肠黏膜,使肠蠕动增加而泻下;另外大黄蒽苷和番泻苷 A 还可抑制肠细胞膜上 Na^+ 、 K^+ -ATP 酶,阻碍 Na^+ 转运,使肠内渗透压升高,保留大量水分,促进肠蠕动而起到泻下作用。

二、阐明中药炮制原理,改进炮制工艺

中药炮制是中医药的一门独特的制药技术,其目的在于提高中药饮片疗效、降低毒副作用、改变药物功效、便于贮藏和服用等。由于早期的中药炮制是建立在经验的基础上,对炮制理论、炮制原理缺乏客观科学的解释。因此,在中药化学研究的基础上,通过对中药饮片炮制前后化学成分的变化研究,来解释炮制条件导致化学成分改变的机制和规律,说明中药饮片炮制的原理,进而改进传统的炮制工艺,为中药饮片炮制的规范化、科学化奠定基础。如川乌为毛茛科植物乌头 (*Aconitum carmichaeli* Debx.) 母根的加工品,生川乌有毒,内服必须炮制,以降低毒性,称为制川乌。传统炮制方法多采用加复制法,该法工艺繁琐、炮制时间长、有效成分(总生物碱)损失较大。化学研究表明,乌头类中药(川乌、草乌、附子)主要化学成分为乌头类生物碱,该类成分既是其有效成分,也是毒性成分。通过对川乌炮制前后化学成分的变化研究表明,生川乌的主要化学成分为乌头碱(aconitine)等双酯型生物碱,而制川乌主要化学成分为乌头次碱(benzoylaconitine)和乌头原碱(aconine)等,它们分别为川乌加热炮制过程中,乌头碱相继发生乙酰基水解及苯甲酰基水解的产物。乌头次碱和乌头原碱具有乌头碱的药效作用,但其毒性仅为乌头碱的 $1/2000 \sim 1/4000$ 。因此认为,乌头类中药的炮制原理主要是通过加热过程促使双酯型生物碱的酯键水解,从而达到炮制解毒的目的。据此炮制原理,进一步对乌头的炮制工艺进行研究改进。改进后的炮制工艺具有炮制时间短、节省辅料、去毒效果好、有效成分不易丢失等优点。

三、改进中药传统剂型,提高临床疗效

传统的中药制剂包括汤剂、丸剂、散剂和膏剂等,这些剂型普遍存在生产技术落后,产

品比较粗糙、给药途径少、使用不便、用量大、起效慢、卫生指标难以控制、质量稳定性差、携带不便等缺点,既不能适应现代医学防病治病的需要,更难适合国际市场的要求。中药现代化的实施和推进,为中药制剂的改革带来新的契机。目前,中药制剂除传统的丸、散、膏、丹剂型外,中药片剂、颗粒剂、胶囊剂、口服液、粉针剂等现代剂型的产品不断被开发和用于临床。尽管如此,与国外发达国家相比,中药制剂在生产技术、产品质量及稳定性等方面还存在一定差距。因此,以中药的化学成分研究为基础,通过对中药及复方有效成分、有效部位或有效部位群等的研究,结合现代先进的制剂技术进行中药制剂生产过程、制剂质量标准及稳定性的研究等,对于提高中药制剂质量和临床疗效,实现中药制剂的三效(高效、长效、速效)、三小(剂量小、毒性小、副作用小)、三方便(贮存、携带、服用方便)的特点,都具有重要的意义。目前,以中药有效成分或有效部位为原料生产的中药制剂如:葛根素注射液临床用于冠心病、心绞痛、心肌梗塞等症的治疗;黄芪多糖注射液用于各类病毒性疾病的治疗及绞股蓝总苷片用于高血脂症等病的治疗,效果良好。

四、提高中药质量控制水平,保证临床用药的安全有效

中药质量控制不仅包括中药(如中药材、中药饮片、中药提取物及中药复方制剂)的质量控制,也包括中药在生长(或栽培)、采收、炮制加工、贮藏、制剂生产过程的质量控制等。其产品质量的控制水平(包括有效成分的含量控制和有毒成分的限量控制等),直接关系到中药的有效性和安全性。现行中国药典的中药质量标准内容主要包括:性状、显微、鉴别、检查及有效成分的含量测定及有毒成分的限量测定等,但主要有效成分含量或有毒成分的限量控制,对于保证中药及制剂的安全性和有效性更为重要。如三黄片为大黄、黄连和黄芩三味中药提取物按一定比例组成的中药复方制剂,为控制该制剂质量,以大黄有效成分大黄素和大黄酚、黄连有效成分盐酸小檗碱及黄芩有效成分黄芩苷为含量控制指标,对其进行质量控制。每片(小片)含大黄以大黄素和大黄酚总量计,不得少于1.55 mg;盐酸小檗碱为4.0~5.8 mg;黄芩苷不得少于13.5 mg。另外,采用HPLC测定大黄药材中5个蒽醌类成分:芦荟大黄素、大黄酸、大黄素、大黄酚和大黄素甲醚的含量,按干燥品计算,其总量不得少于1.5%。马钱子中毒性成分士的宁成人一次服用5~10 mg可致中毒,30 mg可致死亡。川乌中的毒性成分是乌头碱,成人的致死量为3~4 mg。

然而,由于中药或中药复方化学成分的复杂性,或中药化学基础研究的不足,严重制约了中药质量的控制水平,如中药土茯苓、火麻仁等尚无含量测定项,有些以指标性成分作为含量控制指标,不能客观准确评价中药及中药制剂的质量。因此,应进一步加强中药的化学研究,为中药的质量控制提供必要的化学对照品,以提高中药的质量控制水平。

五、利于中药新产品的开发,扩大药源

随着天然药物愈来愈受到重视,以中药化学为基础,结合相关药理学、药物制剂学及临床研究等进行中药新药开发,已经成为我国入关以后,开发具有自主知识产权新药的重要手段,并具有广阔的前景。首先,中药经过数千年临床应用,疗效可靠,毒副作用小,因此,以中药为对象进行中药新药的开发研究,可以得到事半功倍的效果;其次,现代科技的进步和发展,促进了中药化学的发展,也为中药新药的研制奠定了物质基础。

从中药新药开发的例子来看,对于中药中含量比较高、疗效比较好的中药化学成分可以直接作为原料药进行新药的开发,如利血平,是由云南萝芙木(*Rauwolfia yunnanensis*