

(1)

中药现代研究 与临床应用

主编 阴 健 郭力弓

学苑出版社

中药现代研究与临床应用

I

主 审

肖 培 根

主 编

阴 健 郭力弓

学苑出版社

(京)新登字 151 号

项目规划与设计：郭力弓 阴 健 常新全

2V36/3/22

中药现代研究与临床应用 I

主 编：阴 健 郭力弓
出版发行：学苑出版社 邮政编码：100032
杜 址：北京市西城区成方街 33 号
印 刷：北京仰山印刷厂
经 销：各地新华书店
开 本：787×1092 1/16
印 张：64.375 字 数 2142 千字
印 数：2000
版 次：1993 年 10 月 北京第 1 版
1994 年 1 月 第 1 次印刷
ISBN 7-5077-0558-7/R·91
定 价：78 元（精）

学苑版图书印、装错误可随时退换。

前 言

中药学是在中医临床实践基础上总结出来的防病治病的实用科学。中药学和其他自然科学一样，在实践的基础上不断丰富和发展，不仅临床实践为中药学发展起到了重要的推动作用，而且中药的实验研究对中药学的发展起着重要的作用。在古代我国一些医药学家对药物制造技术，药物的某些性质进行过初步的实验研究，对一些药物的理化性质的认识，在当时居于世界的前列。许多药物制造技术与炼丹术有关。例如《周易参同契》记载：“河上姤女，灵而最神，得火则飞，不见埃尘……欲将制之，黄芽为根。”阐明水银（河上姤女）具有挥发性，用其挥发性和硫黄（黄芽）反应，即生成丹砂（即硫化汞）。另外书中对金、水银、铅等物质所获得的化学知识，可以说是我国制药化学之肇端。又如葛洪在《抱朴子·内篇》中记载了不少烧丹炼汞的实验，炼丹设备和丹方等化学知识都是通过实验而获得的。在《苏沈良方》中所列小便中炼“秋石”法，有阴、阳两种炼法，有人认为这就是我国古代提炼“激素”的开始，其年代比西方早很多年。不过以上这些实验由于受到历史水平的限制，没有形成系统的实验科学，但在当时还是难能可贵的。

自十九世纪末，二十世纪初，随着“西学东渐”之风的兴盛，采用生药、化学、药理等方法对中药的实验研究越来越广泛。例如从麻黄中提取得到麻黄素，并认为麻黄素是麻黄“止咳平喘”的有效成分。从常山中分离出抗疟有效成分常山碱，对抗疟药的研究和发展有重要意义。自本世纪二十年代至四十年代末所进行的药学实验研究，围绕着中药进行了大量的工作，当时用实验方法研究的中药有数十种之多，并总结出多种学术专著出版。由于历史条件的限制，许多研究工作还不够深入，但这些工作为建国以后的研究打下了坚实的基础。

建国以后，随着政府的大力提倡和支持，中药事业得到了空前的发展，通过对单味药的系统研究，阐明了许多药物的主要有效成分及作用机制。而且发现一些中药的多方面功效与其所含的不同类型的化学成分有密切的关系。例如甘草中的甘草酸和黄酮就分别与其解毒和抗溃疡作用有关。又如乌头碱类成分一直不能完全说明附子的“回阳救逆”作用，而活性极强的去甲乌药碱的发现则很好说明了这种作用。因此中药的多方面功效与其复杂的化学成分之间有一定的关系。通过研究还发现有些作用类似的不同中药含有相同的化学成分，例如具有“温里”

作用的附子、干姜、吴茱萸、丁香等都含有去甲乌药碱,说明去甲乌药碱与某些中药的“温里”作用有密切关系。另外,药物之间的相互关系还体现在配伍之后对药效发生了影响,例如芍药甘草汤中芍药与甘草配伍后升高了甘草次酸的血药浓度,说明芍药影响了甘草次酸的体内过程。又如白虎加人参汤中人参能促进知母的降血糖作用。用实验方法阐明复方的作用机理有一定的合理性。

从以上研究结果可以看出,中药不同于一般的植物药,中药有独特理论体系和临床用药方法,因此对中药进行现代研究,应该与中医药理论、中医药古籍文献以及中医临床实践密切联系起来,真正做到在继承中求发展。例如从“失笑散”对心血管的明显疗效中,人们受到启发,从蒲黄中筛选出降低血清胆固醇和甘油三酯的有效成分;从治疗慢性粒细胞性白血病的当归芦荟丸中通过拆方分析得到了有效成分蒽玉红。另外从“青蒿截疟”的传统用法中受到启发,发现新型抗疟药青蒿素。再有,中医临床使用五味子烤熟或制成蜜丸治疗肝炎,有明显的降转氨酶作用,借鉴这一用法发现了具有保肝作用的中间体联苯双酯。从以上例子可以看出,进行中药的现代研究与中医药理论、中医药古籍文献和中医临床实践密切结合,对新药的开发将会起到事半功倍的作用。

从中药中提取的天然有效成分并不一定是理想的治疗药物,对动植物有效成分进行结构改造、半合成和合成,筛选出疗效更高、毒性更小的化合物才能给人们提供最理想的药物。例如青蒿素是治疗疟疾的特效药,但还存在用量偏大,复发率较高的缺点,将青蒿素改造成双氢青蒿素、青蒿酯钠,其抗疟作用比青蒿素明显增强。从秋水仙中得到了秋水仙碱,通过结构改造得到秋水仙酰胺,抗癌作用不变,而毒性大大降低。因此,通过结构改造发现了许多疗效高、毒副作用小的有效成分,而且这些新药比某些天然成分更具有优越性。还有一点需要引起重视的是,近年药用植物组织培养技术发展很快,国内外对此进行了大量的研究。如通过组织培养生产出高产植株;通过细胞悬浮、发酵培养进行有效成分的生产等。这些研究工作,对发现新的有效成分,培养出成本高、难于种植的药用植物的代用品起到了不可估量的作用,但如何把组织培养的药材与临床实际用药结合起来,也将是今后研究的一个新课题。

与国外相比,国内对一些中药的应用研究特别是剂型开发偏显不足。例如,在国外甘草制剂很多,其有效成分甘草酸(铵盐、钠盐)、甘草次酸、去甘草酸部分、甘草总黄酮均有制剂,并已发展成临床应用的药物。又如具有“滋补强壮”作用的人参在国外应用广泛,除药用外,在化妆品中用于皮肤和头发的营养剂等,国际市场对人参需求量很大,但至今主要由韩国等国供应,我国人参产品尚缺乏竞争力。但可以相信,随着经济实力的增强和技术的不断发展,我国在这

方面会不断赶上。

总之,对单味中药进行系统的实验研究,需要如化学、分析、制药、基础医学、临床医学以及植物学、组织培养、基因工程等多学科密切配合,这种跨学科的研究使人们对中药的认识大大地深化了。把现代科学方法与传统中医药理论相结合,这一研究思路已在对蒲黄、五味子、青蒿、青黛等药的研究中取得了丰硕的成果,也是对这种研究方法充分的肯定,并为今后新药研究提供了有益的借鉴。

总之,建国四十年来,我国的中药现代研究取得了大量的成果,这些成果均散在发表于数以百种的期刊文献中,其中较为全面总结的有《中药大辞典》(引用的研究资料截止至1972年)。而近二十年来,中药的现代研究发展迅速,亟需重新进行较全面的总结,为进一步的研究提供完善的基础资料。抱着这一目的,本书的编者们精选目前临床最常用中药119种,对其多学科研究成果的文献资料进行了系统的搜集、归纳、整理,并进行了综述,其中部分资料是通过与国外权威检索机构联机得到的。这样就使本书具有资料新、全、可靠等特点。有一点特别需要说明的是,由于中药原植物研究和中药单味药传统用法在一般书中都有较为详细的介绍,本书受篇幅所限,未收载原植物研究,也只收载了中药的现代医学病名下的临床应用情况。

对常用中药研究成果进行总结是一项工作量很大,而且极其艰苦的工作,全体编者团结一致,密切协作,付出了大量的心血和劳动,现在终于完成此书并将与读者见面了。如果本书能为中医药工作者提供一些参考,这将是我们的最大欣慰。我们真诚希望广大读者对本书提出宝贵意见,以便及时改正其中的缺点和错误,使之不断完善。最后让我们感谢中国中医研究院中药研究所王孝涛、刘美兰、岳凤先、倪慕云、杨立新等专家及北京中医学院的各位专家对本书的部分章节给予的热心指导和帮助。

编者

1993年10月

编写说明

1. 本书收载目前临床最常用而且研究较深入的中药共 119 味。各药的来源系根据《中华人民共和国药典》1990 年版（第一部）、《中药大辞典》及全国高等中医院校统编教材。药名排列以笔划为序。
2. 每味药依次收录以下项目：（1）来源，（2）性味与归经，（3）功用与主治，（4）化学成分，（5）成分分析，（6）药理作用，（7）制剂学研究，（8）炮制学研究，（9）组织培养，（10）现代临床应用。其中动、植物来源、性味与归经、功用与主治为各药必具项目，其余七项研究不全者自然从缺。
3. 上条中第（4）项至第（10）项中所引用的文献均系国内外公开发表的文献，部分会议论文及内部资料也均转引自公开发表的文献。本书引用的文献资料截止下限一般为 1992 年，部分常用期刊的资料引用至 1993 年。
4. 【化学成分】项中介绍的化学成分均为《中华人民共和国药典》1990 版（第一部）中规定的动、植物来源及药用部位所含的化学成分。有些药的其他药用部位或同属其他植物的化学成分研究较多的，也给予简要介绍，并作说明。
5. 【成分分析】项主要介绍该药的鉴别方法，主要成分的含量测定方法，特别着重介绍了近年发展较快的色谱和光谱测定方法等。
6. 【药理作用】项记述该药及有效成分的药理实验结果，包括药理作用及其机制、体内过程和毒副作用。在篇幅允许的情况下注意介绍药理实验中涉及的动物模型、观察指标、给药途径及剂量。
7. 【组织培养】介绍各药材原植物的组织培养研究。若来源不止一个种的，按种逐一介绍。如枸杞组织培养、宁夏枸杞组织培养。
8. 【现代临床应用】介绍各药用于现代医学病名下各种病症的治疗，主要介绍单味药的用法及三味以内的小方在临床上的应用。凡三味以上的复方临床应用报道，未收入本书，与方剂的临床应用以示区别。
9. 本书附录中简要介绍了民族药的研究，台、港、澳地区及国外研究中药的概况。最后为书中涉及的化学成分的结构式索引。
10. 本书中所使用的符号及英文缩写表示如下：kg（千克），g（克），mg（毫克）， μg （微克），ng（毫微克），L（升），ml（毫升）， μl （微升）， cm^2 （平方厘米），M（摩尔浓度，mol/L），nm（纳米），mm（毫米）， λ （波长）， λ_s

(测定波长), λ_R (参比波长), LD_{50} (半数致死量), ED_{50} (半数有效量), MLD (最小致死量), MIC (最小抑制浓度), HPLC (高效液相色谱), GC (气相色谱), UV (紫外光谱), IR (红外光谱), MS (质谱), NAA (萘乙酸), BA (6-苄基嘌呤), MS (2, 4-二氯苯氧乙酸), IAA (吲哚乙酸), KT (激动素), ZT (玉米素), IBA (吲哚丁酸)。

肖 序

随着人类要回归大自然的思潮在全球的流行,天然药物及传统草药重新受到了青睐和关注。其中,中医中药由于它独特的理论体系、悠久的历史背景、丰富的药物资源以及突出的治疗效果,因而更加受到国际上的重视。最近十余年来,通过对中药的系统研究,发表了浩如烟海的文章及论著。如何能够正确并迅速地获得这方面的资料及信息,便是一个突出的难题和热点。

《中药现代研究与临床应用》的编者,面对挑战,不畏艰难,大胆实践,对常用中药的化学成分、分析方法、药理作用、制剂学和炮制研究、组织培养及现代临床应用等内容开展了大量的收集、整理和编写工作。然后经各学科的权威专家的审阅定稿,由学苑出版社出版,终于与广大读者见面了。

我有幸先睹,感到全书具有以下几个特点:首先是“精”,所收集的内容先从目前临床上最常用以及现代研究比较深入的中药入手,这样便可做到精选和集中,具有很大的实用价值。其次是“新”,全书网罗了近十年来在中药研究方面的最新成果,因而能帮助广大读者迅速掌握这些研究结果及最新的研究动向。最后则是“全”,编者通过与美国化学文摘计算机的联机检索,使对目前国内外常用中药的研究,基本上均能比较完整地收集并反映在全书之中。

因此,我感到全书确实可以对中药的科研、教学、临床、生产、管理、外贸等各个方面起到很好的参考作用。我也愿意借此机会向广大的中医药工作者、医药大专院校师生们慎重地推荐这样的一部好书。

中国医学科学院药用植物资源开发研究所 所长
世界卫生组织传统医学合作中心 主任

肖培根 教授

1993年3月16日

姜 序

中药学是我们的祖先在长期同疾病作斗争中,积累起来的经验总结和智慧结晶,对我国的民族生存繁衍作出了巨大的贡献。随着科学技术的进步,中药学也在不断地发展提高。我国的医药科技工作者运用现代科技方法和手段,对之开展了广泛的研究,不断开拓新功效,阐明防治疾病的物质基础和作用原理,极大地深化了对中药的认识。

中药学,作为一门科学,同其他自然科学一样,都是通过继承—开拓—总结—提高而发展的。适时地将中药研究开拓的结果予以汇集总结,对中药的发展具有重要的意义。本书的编者有鉴于此,抱着为中药学发展作贡献的强烈愿望,在工作之余,广搜文献,分析改证,去芜存菁,锲而不舍,编著了是书,精神可钦。

这本书有三个特点:一是编者都系从事中药科研教学的专业工作者;二是资料搜集全而新;三是取材严谨。这些特点,使得本书具有较强的科学性和较高的实用性。

目前,我国的医药事业正处在重大转折和新的起飞点上。从1993年1月1日起,我国实行了药品专利。药品专利的实施,必将有力促进和提高我国的新药创制水平和能力。对于中药研究来说,也是一个巨大的推动。《中药现代研究与临床应用》一书的出版,既可为中药新药、包括有效成分制剂、有效部位制剂、新的复方制剂等的创制提供丰富的资料,也可为创制新的化学实体药物提供信息、来源、借鉴。愿本书的面世,为我国医药事业的发展、为中药研究的深入出一份力。

中国中医研究院中药研究所 所长
世界卫生组织传统医学合作中心 主任

姜廷良 研究员

1993年4月

主 审

肖培根 教授 中国医学科学院药用植物资源开发研究所

特约专题审阅 (按内容顺序排列)

化 学 成 分	陈德昌	教授	卫生部药品检定所
成 分 分 析	倪坤仪	教授	中国药科大学
药 理 作 用	李连达	教授	中国中医研究院西苑医院
制 剂 学 研 究	曹春林	教授	北京中医学院
炮 制 学 研 究	张士臣	教授	北京中医学院
组 织 培 养	陈和荣	教授	中国中医研究院中药研究所
现代临床应用	颜正华	教授	北京中医学院

主 编

阴 健 郭力弓

分科主编

化 学 成 分	巢志茂	郭亚红
成 分 分 析	常新全	丁丽霞
药 理 作 用	顾海鸥	阴 健
制 剂 学 研 究	梁 惠	吴 清
炮 制 学 研 究	梁 惠	
组 织 培 养	李宗友	
现代临床应用	郑虎占	郭力弓
化学成分索引	金文姗	吉 力

编 委 (按姓氏笔划排序)

丁丽霞	马双成	王静竹	吉力	乔淑贞	江华	刘佳春	任卫军
朱斌	朱贺年	阴健	李宗友	李淑莉	吴清	何亚利	张增新
张玲	张联合	郑虎占	郝素梅	杨智	金文姗	周洁	孟紫芊
洪纓	胡文忠	胡玉宁	郭亚红	郭力弓	郭兰萍	郭海蓉	柳红芳
阎永红	顾海鸥	梁新武	梁惠	常新全	常增荣	储戟农	巢志茂
彭江南	彭健	景红军	焦玉凤				

参加编写人员 (按姓氏笔划排序)

丁爱利	于红静	王海良	王福平	王效菲	王桂芹	王元涛	王玠
王双玲	王锦燕	卢建秋	叶茹	仝燕	关怀	朴将虎	任晋
乔蓉霞	毕桂芝	毕桂英	宋秀坤	苏海军	巫析	吴静芬	吴倩
李小玉	李秋艳	李景田	李保玲	李秀兰	何民	何芳	张春英
张再新	张雪君	杨丽彩	杨赴云	陈平	金宏宇	孟繁兴	郑金红
宗桂珍	赵志英	赵青红	骆杰伟	高永前	黄欣	黄依玲	崔宇航
崔海峰	梁立新	董泽洪	董泽启	葛亢	谢春荣	温殿	魏峰
雷小玉	廖静	熊怡深	阙胤梅				

目 录

1 人 参	(1)	34 白头翁	(245)
2 三 七	(33)	35 白 芍	(247)
3 三尖杉	(44)	36 白果	(253)
4 干 姜	(50)	37 白芷	(256)
5 大青叶	(52)	38 瓜 蒌	(260)
6 大 枣	(57)	39 半边莲	(263)
7 大 黄	(61)	40 半夏	(264)
8 大 蒜	(86)	41 地骨皮	(271)
9 山茱萸	(96)	42 地 黄	(272)
10 山 药	(99)	43 西洋参	(279)
11 山 楂	(101)	44 当 归	(285)
12 川 芎	(108)	45 肉苁蓉	(298)
13 马钱子	(118)	46 延胡索	(300)
14 长春花	(127)	47 全 蝎	(310)
15 天南星	(133)	48 决明子	(316)
16 天花粉	(135)	49 冰 片	(318)
17 天 麻	(140)	50 防 己	(322)
18 木 香	(145)	51 防 风	(328)
19 木 贼	(147)	52 红 花	(330)
20 五味子	(148)	53 远 志	(336)
21 牛 黄	(157)	54 杜 仲	(339)
22 牛 膝	(168)	55 苍 术	(345)
23 丹 参	(171)	56 芦 荟	(348)
24 (川) 贝 母	(189)	57 赤 芍	(352)
25 巴 豆	(191)	58 连翘	(356)
26 甘 草	(196)	59 吴茱萸	(359)
27 石 膏	(213)	60 牡丹皮	(363)
28 龙胆	(216)	61 何首乌	(369)
29 仙鹤草	(219)	62 沙 棘	(375)
30 冬凌草	(223)	63 羌 活	(380)
31 冬虫夏草	(227)	64 补骨脂	(382)
32 生 姜	(235)	65 陈 皮	(387)
33 白 术	(241)	66 附 子	(391)

67 青蒿	(401)	98 黄芩	(559)
68 刺五加	(411)	99 黄连	(569)
69 苦杏仁	(420)	100 黄柏	(587)
70 苦参	(424)	101 黄芪	(592)
71 败酱草	(432)	102 猪苓	(605)
72 虎杖	(434)	103 鹿茸	(607)
73 罗布麻	(439)	104 麻黄	(612)
74 知母	(444)	105 斑蝥	(622)
75 金钱草	(447)	106 葛根	(626)
76 金银花	(449)	107 紫苏	(632)
77 鱼腥草	(457)	108 紫草	(634)
78 细辛	(464)	109 蒲黄	(641)
79 枳实	(468)	110 淫羊藿	(646)
80 栀子	(471)	111 雷公藤	(652)
81 枸杞子	(477)	112 槟榔	(666)
82 荆芥	(482)	113 酸枣仁	(671)
83 茵陈	(484)	114 熊胆	(674)
84 茯苓	(489)	115 稀签草	(679)
85 厚朴	(492)	116 薄荷	(681)
86 鸦胆子	(497)	117 藿香	(685)
87 钩藤	(502)	118 蟾酥	(687)
88 独活	(506)	119 麝香	(695)
89 洋金花	(509)		
90 穿心莲	(517)	附录	
91 绞股蓝	(524)	我国民族药发展概况及现代研究	
92 秦艽	(534)		(706)
93 秦皮	(535)	我国台湾地区中药学发展简介	(711)
94 桂枝	(538)	国外中药研究发展简介	(712)
95 柴胡	(540)	本卷化学成分索引	(717)
96 党参	(548)		
97 益母草	(555)		

人 参

【来源】本品为五加科植物人参 *Panax ginseng* C. A. Mey. 的干燥根。栽培者为“园参”，野生者为“山参”。多于秋季采挖，洗净；园参经晒干或烘干，称“生晒参”，蒸制后干燥，称“红参”；山参经晒干，称“生晒山参”。

【性味与归经】甘、微苦，平。归脾、肺、心经。

【功能与主治】大补元气，复脉固脱，补脾益肺，生津，安神。用于体虚欲脱，肢冷脉微，脾虚食少，肺虚喘咳，津伤口渴，久病虚羸，惊悸失眠，阳痿宫冷；心力衰竭，心源性休克。

【化学成分】人参的化学成分研究已有一些综述性的文章^[1-6]，现在根据结构类型整理如下。

1. 皂甙类

迄今为止，从红参、生晒参或白参中共分离出30余种人参皂甙。它们可分为三组。

(1) 齐墩果酸组 人参皂甙 R_0 (ginsenoside R_0)。

(2) 原人参二醇组 人参皂甙 (ginsenoside) R_{A_1} ^[7-9]， R_{A_2} ^[7,9]， R_{A_3} ^[9]， R_{B_1} ， R_{B_2} ， R_{B_3} ， R_C ， R_D ；20 (s)-人参皂甙 R_{G_5} ^[10,11]；人参皂甙 R_{G_3} ^[12]， R_{H_2} ^[10,11]， R_{S_1} ， R_{S_2} ^[13]；丙二酰基人参皂甙 R_{B_1} ， R_{B_2} ， R_C ， R_D ^[14]；三七皂甙 (notoginsenoside) R_1 ^[9]；西洋参皂甙 R_1 ^[13]；20 (R)-人参皂甙 h_2 ；20 (S)-人参皂甙 h_2 。

(3) 原人参三醇组 人参皂甙 R_E ， R_F ；20-葡萄糖基人参皂甙 R_F ；人参皂甙 R_{G_1} ， R_{G_2} ；20 (R)-人参皂甙 R_{G_2} ^[10,11]；人参皂甙 R_{H_1} ^[1]；20 (R)-人参皂甙 R_{H_1} ^[10,11]，三七人参皂甙 R_1 ^[13]，人参皂甙 R_{H_3} ， R_F ^[15]；假人参皂甙 (pseudoginsenoside saponin) F_{11} ， R_{P_1} ， R_{T_1} ；Chikusetsusaponin IV 和 IVa^[16]。

2. 挥发性成分

人参炔醇 (panaxynol)，人参环炔醇 (panaxydol)^[17]，十七碳-1-烯-4，6-二炔-3，9-二醇 (heptadeca-1-en-4，6-diyn-3，9-diol)^[18]，人参炔三醇 (panaxytriol)^[10,11,19]，人参炔 (ginsenyne) A、B、C、D、E 和两个未知结构的聚乙炔烯化合物 (A-2，A-3)^[20]。

α -人参烯 (α -panasinsene)， β -人参烯 (β -panasinsene) β -金合欢烯 (β -farnesene)，双环大牻牛儿烯 (bicyclogermacrene)， β -榄香烯 (β -elemene)， γ -榄香烯 (γ -elemene)， α -新丁香三环烯 (α -neodovene)， β -新丁香三环烯 (β -neodovene)， α -葎草烯 (α -humulene)， β -葎草烯 (β -humulene)，石竹烯 (caryophyllene)，石竹烯醇， β -古芸烯 (β -gurjunene)， α -古芸烯 (α -gurjunene)， α -芹子烯 (α -selinene)， β -芹子烯 (β -selinene)， γ -芹子烯 (γ -selinene)，芹子-

4 (14)，7 (11)-二烯 [selin-4 (14)，7 (11)-diene]， α -愈创烯 (α -guaiene)， γ -葎澄茄烯 (γ -cubebene)， β -广藿香烯 (β -patchoulene)，艾里莫酚烯，十七烷醇-1 (heptadecanol-1)，人参萜醇等^[23]。

还含有辛醛 (octanal)，5-甲基-2-糠基呋喃， γ -杜松烯 (γ -cadinene)，反式 β -金合欢烯 (trans- β -farnesene)， β -愈创烯 (β -guaiene)， β -马阿里烯 (β -maaliene)，顺式异丁香烯 (cis-caryophyllene)， δ -榄香烯 (δ -elemene)，十四烷 (tetradecane)，十五烷 (pentadecane)，十六烷 (hexadecane)，2，6-二特丁基-4-甲基苯酚 (2，6-ditertbutyl-4-methyl-phenol)，十七烷 (heptadecane)， δ -杜松烯 (δ -cadinene)，韦得醇 (widdrol)， β -甜没药烯 (β -bisablene)，十八烷 (octadecane)，喇叭醇 (abrol)，2，6-二特丁基-对苯二酚， α -榄香烯 (α -elemene)，十三烷 (tridecane)，艾里莫酚烯 (eremophifene)， γ -广藿香烯 (γ -patchoulene)，雪松醇 (cedrol)， γ -古芸烯 (γ -gurjunene)，十二烷 (dodecane)，别香橙烯 (alloaromadendrene)，反式丁香烯 (trans-caryophyllene)，二十烷 (eicosane)， α -檀香烯 (α -santalene)， α -依兰烯 (α -muurolene)，帕鲁斯特醇 (palustalol)， β -Demene， α -檀香醇 (α -santalol)， β -桉油醇 (β -eubesmool)，草酸丁二酯 (di-n-butyl oxalate)^[24]。

3. 有机酸及酯

柠檬酸 (citric acid)，异柠檬酸 (isocitric acid)，延胡索酸 (fumaric acid)，酮戊二酸，油酸 (oleic acid)，亚油酸 (linoleic acid)，顺丁烯二酸 (cis-butendicarboxylic acid)，苹果酸 (malic acid)，丙酮酸 (pyruvic acid)，琥珀酸 (succinic acid)，酒石酸 (tartaric acid)，人参酸 (panax acid)，水杨酸 (salicylic acid)，香草酸 (vanillic acid)，对羟基肉桂酸 (p-hydroxycinnamic acid)，甘油三酯 (triglyceride)，三棕榈酸甘油酯 (palmitin)，三亚油酸甘油酯，棕榈酸 (palmitic acid)， α ， γ -二棕榈酸甘油酯^[23]，糖基甘油二酯^[25]。

4. 甾醇及其甙

β -谷甾醇 (β -sitosterol)，豆甾醇 (stigmasterol)，胡萝卜甙 (daucosterol)，酯甾醇，菜油甾醇 (campesterol)，人参皂甙 P [sitosteryl-O- (6-O-fatty acyl)-glucopyranoside]^[26-29]。

5. 含氮化合物

吡咯烷酮，胆碱 (choline)，三磷酸腺苷 (adenosine triphosphate)，氨，多肽，腺苷 (adenosine) 及天门冬氨酸、苏氨酸、丝氨酸、谷氨酸等十七种氨基酸^[30,31]。

6. 维生素类

维生素 (vitamine) B_1 、 B_2 、 B_{12} 、C；烟酸 (nicotinic acid)，泛酸，叶酸 (folic acid)，生物素 (biotin) 及菸酰胺^[34,35]。

7. 酶类

腺苷转化酶, L-天冬氨酸酶, β -淀粉酶, 酚酶, 转化酶, 蔗糖转化酶。

8. 微量元素

含铜、锌、铁、锰等二十多种微量元素。

9. 木质素

从朝鲜产人参中分离出戈米辛 N (gomisin N) 和戈米辛 A (gomisin A)^[32]。

10. 黄酮类

山奈酚 (kaempferol), 三叶豆甙和人参黄酮甙 (panasenoside)^[33]。

11. 糖类

(1) 单糖 果糖 (fructose), 葡萄糖 (glucose), 阿拉伯糖 (arabinose), 鼠李糖 (rhamnose), 葡萄糖醛酸 (glucuronic acid), 甘露糖 (mannose), 木糖 (xylose)^[36, 37]。

(2) 双糖 蔗糖 (sucrose), 麦芽糖 (maltose)^[36, 37]。

(3) 三糖 棉子糖 (raffinose), 人参三糖 (ginsenoside) A、B、C、D^[36, 37]。

(4) 多糖 人参含 38.7% 的水溶性多糖和 7.8~10.0% 的碱溶性多糖。其中 80% 左右为人参淀粉, 20% 人参果胶, 少量糖蛋白。主要由半乳糖醛酸、半乳糖、葡萄糖、阿拉伯糖残基组成, 也有少量鼠李糖及未知的戊糖衍生物。人参果胶中有两种酸性杂多糖 SA 和 SB^[38]。SA 是由半乳糖、阿拉伯糖、鼠李糖以 4.7:2.6:1 的比例组成, 并含 26% 半乳糖醛酸。SB 是由半乳糖、阿拉伯糖、鼠李糖以 3.3:1.8:1 的比例组成, 并含 76% 的半乳糖醛酸。

12. 其它 一种新多酚^[39], 麦芽醇 (maltol)^[40], 二十九烷 (nonacosane)^[23]。从愈伤组织中分离出 3-Methoxy-5- (1-O- β -D-glucopyranosyl) neptyl-2' (5H) -furanone^[40]。

【成分分析】

1. 成分鉴别

(1) 人参皂甙

① 提取人参总皂甙, 纯化后以甲醇溶解, 点于硅胶 G 薄层板上, 以正丁醇-乙酸乙酯-水 (4:1:5) 上层展开 11cm, 以硫酸-水 (1:1) 喷雾, 105℃ 烤 10 分钟, 在 365nm 紫外灯下观察, 可见 7~8 个斑点, 依次为人参皂甙 R₀、Ra、Rb、Rc、Rd、Re、Rf、及 Rg₁^[1]。

② 人参粉末以氯仿处理后, 加水饱和的正丁醇提取, 上清液加氨试液三倍量摇匀放置, 取上层蒸干, 残渣以甲醇溶解, 点于硅胶 G 薄层板上, 以氯仿-乙酸乙酯-甲醇-水 (15:40:22:10) 展开, 晾干后喷以 10% 硫酸乙醇液, 以 105℃ 烘数分钟, 置日光及紫外灯 (365nm) 下检视, 可鉴别人参皂甙 Rb₁、Re 和 Rg₁^[2]。

(2) 人参皂甙元 提取纯化的人参总皂甙元溶于甲醇, 在硅胶 G 薄层上, 以氯仿-乙醚 (1:1) 展

开, 以硫酸-水 (1:1) 喷雾后在 105℃ 烘烤显色, 薄层上应显五个以上斑点, 且其中有人参三醇、人参二醇及齐墩果酸^[3]。

2. 含量测定

(1) 人参露的分析^[4]

取人参露加浓 HCl 和 0.005N 的 KBr-KBrO₃ 水溶液摇匀, 用 0.005N 的 Na₂S₂O₃ 溶液滴定, 以 1% 淀粉溶液作指示剂。

(2) 人参皂甙及皂甙元

① 重量法^[5] 人参根组织培养物用 20 倍的 CH₂Cl₂-96% 乙醇 (94.2:5.86%) 恒沸混合液在 50℃ 水浴上提取, 提取物在 50℃ 分馏, 残渣在 60℃ 恒温箱中经 2~3 小时烘干, 称重, 人参根组织培养物中含人参皂甙 A、B、C、D、E、F。

② 比色法^[6-9, 11-19] 提取人参总皂甙用甲醇溶解, 以水稀释后, 加 8% 香草醛的乙醇溶液和 77% 的硫酸液, 混匀后置 60℃ 水浴上加热 10 分钟, 冰水浴中冷却 15 分钟, 在 544nm 处测定吸收度, 以人参皂甙 Re 为对照品计算人参皂甙的含量^[6], 线性范围为 30~150 μ g。人参精中的总皂甙经提取后以甲醇溶解, 加 5% 香草醛冰乙酸溶液与高氯酸溶液, 混匀, 置 60℃ 水浴上加热 15 分钟, 冷却后加适量冰乙酸, 离心后取上清液于 560nm 处测吸收度, 线性范围 40~320 μ g^[11]。此外, 制剂中总皂甙自盐酸介质提取至氯仿-丁醇 (1:6) 中, 蒸去有机溶剂后, 残渣溶于醋酸中, 并加入 HAc-浓 H₂SO₄ (1:1) 试剂, 60℃ 加热 25 分钟后在 520nm 处测吸收度^[19]。

③ 薄层层析-比色法^[20-30]

人参皂甙的测定

a. 人参根的甲醇提取液点于硅胶 G 薄层板上, 以氯仿-甲醇-水 (70:55:10) 展开 (展开时层析缸内置一盛少许冰醋酸的小杯), 挥干溶剂后置碘蒸气中显色, 划出斑点, 将碘吹尽刮取斑点位置的硅胶, 加入 5% 香草醛-冰醋酸溶液及高氯酸, 60℃ 加热 15 分钟, 冷却后加入适量冰醋酸, 离心, 取上清液在 560nm 处测吸收度, 以人参二醇为对照计算总皂甙的含量, 人参二醇的线性范围是 12.5~62.5 μ g^[20]。

b. 人参精适量点于硅胶 G 薄层板上, 以氯仿-甲醇-水 (60:50:10) 展开 6cm (置小杯冰醋酸于层析缸中), 挥干后于紫外灯下划出皂甙斑点, 刮取斑点部位的硅胶, 加水后置冰水浴中, 再分别加入 8% 香草醛乙醇溶液和 72% 硫酸溶液, 振荡后于冰水浴中冷却, 离心取上清液于 544nm 处测定吸收度, 人参皂甙 Rb 类的线性范围为 50.8~254 μ g^[21]。

c. 提取人参糖浆中的皂甙以甲醇溶解, 点于硅胶 G 薄层板上, 用正丁醇-乙酸乙酯-水 (4:1:5) 上层液展开, 110℃ 加热 5 分钟, 放冷, 碘蒸气显色后, 刮取皂甙部位的硅胶, 加入 5% 香草醛冰醋酸试液及高氯酸溶液, 60℃ 水浴上加热 15 分钟, 冷却后加适量冰醋酸, 离心取上清液于 546nm 测吸收度, 人

参总皂甙的线性范围为 $20 \sim 100 \mu\text{g}^{[22]}$ 。

d. 生脉注射剂蒸发后的残留物以甲醇溶解,在硅胶 G 板上,以氯仿-甲醇-水 (70:55:8) 展开,刮取用碘蒸气定位的各个斑点,在 60°C 以 5% 香草醛的冰醋酸溶液和高氯酸处理 15 分钟,混合液以乙酸稀释后离心,取上清液在 560nm 测吸光度,人参皂甙在 $60 \mu\text{g}$ 以下的校正曲线呈线性。

④薄层层析-斑点面积法^[31]

人参皂甙元的测定 精密称取纯化的人参总皂甙适量,加 50 倍量含 7% 盐酸和 50% 乙醇溶液加热回流 4 小时,水解后加水稀释以氯仿提取,干燥回收溶剂得总皂甙元,用乙酸乙酯溶解后点于硅胶 G 薄层板上,同时点人参二醇 (或人参三醇、齐墩果酸) 对照品,以苯-乙酸乙酯 (1:1) 展开,用 10% 硫酸的乙醇液喷雾,在 110°C 烘烤显色,求出与参皂甙元对照品 Rf 值相同斑点的面积,在单对数坐标纸上绘制标准曲线,样品中人参皂甙元斑点面积的平方根,在标准曲线上查得皂甙元浓度的对数,换算出百分含量。

⑤大孔吸附树脂-比色法^[32-36] 人参皂甙样品以甲醇溶解,过滤,溶液水浴蒸干,以水溶解,加入经处理的吸附树脂 D 型净化柱,用蒸馏水冲洗弃去水溶液,改用 95% 乙醇冲洗,滤液于 80°C 减压抽干,加入 5% 香草醛-冰醋酸及高氯酸试液, 70°C 水浴加热 15 分钟,冷却后加冰醋酸稀释,在 560nm 测定吸光度,以精制人参皂甙为对照品绘制标准曲线,由回归方程计算人参皂甙的含量^[32]。人参四逆汤中人参皂甙经提取后同法测定^[33]。

⑥薄层扫描法^[37-51]

a. 提取人参皂甙用甲醇溶解,点于硅胶 GF₂₅₄ 薄层板上,同时点人参皂甙 R₀、Rb₁、Rb₂、Rc、Rg₁、Rg₂ 对照品的甲醇液,以氯仿-甲醇-水 (13:7:2) 展开,扫描测定人参皂甙 R₀、Rb₁、Rg₁ 和 Rg₂ 的含量;以正丁醇-乙酸乙酯-水 (4:1:1) 展开,测定人参皂甙 Rb₂、Rc、Rd 和 Re 的含量,扫描波长 525nm,参比波长 760nm,透射法直线扫描^[6,7]。

b. 人参皂甙提取液及人参皂甙对照品 R₀、Rb₁、Rb₂、Rc、Rd、Re、Rf、Rg₁ 和 Rg₂ 的甲醇溶液点于硅胶 G 薄层板上,以甲醇-氯仿-正丁醇 (1:1:1) 展开 15cm,挥干后以对甲氧基苯甲醛-硫酸的甲醇液喷雾, 130°C 加热 15 分钟显色,于 600nm 处扫描测定斑点面积,由校正曲线计算含量^[37]。

c. 取人参皂甙 Rb₁ (代表 Rb、Rc、Rd 组) 和人参皂甙 Re (代表 Re、Rf、Rg 组) 对照品,加水-乙醇 (3:1) 配制的 5% 硫酸液,加热水解 6 小时。水中加氯化钠饱和,用乙醚提取,无水硫酸钠干燥,蒸发至干得皂甙元,用吡啶溶解,按羟基数加 100 倍克分子量的 β -萘酚酞到溶液中,室温放置 3 小时后倾入含 4-二甲氨基吡啶的 5% 碳酸氢钠水溶液中并用氯仿提取,提取液经酸水洗后蒸去氯仿,反应

混合物加氯仿用硅胶柱分离,含紫外标记衍生物的洗脱液点在硅胶 GF₂₅₄ 薄层板上,以苯-氯仿-乙酸乙酯 (10:10:1) 展开,置双波长薄层扫描仪上在测定波长 285nm,参比波长 365nm 处测定,以斑点面积积分值与相应的人参皂甙元 (Rb₁ 或 Re) 绘制校正曲线。提取人参样品中的皂甙按上述步骤制得皂甙元并进行紫外衍生物制备、薄层层析、扫描测定,所得与参二醇和参三醇 β -萘酚酞相对应的斑点面积的积分值,在标准曲线上查得相应的重量,换算为样品中含人参皂甙 Rb、Rc、Rd 组和 Re、Rf、Rg 组的含量^[38]。

d. 人参皂甙提取物用甲醇溶解后点于硅胶 GF₂₅₄ 板上,以氯仿-乙酸乙酯-甲醇-水 (15:40:22:10) 展开,层析板浸入乙醇化的 5% 硫酸溶液后,在 105°C 加热 60 秒,冷后再浸入液体石蜡-正己烷 (1:1),在 366nm 进行荧光测定^[39]。

e. 复方人参酊在水浴上蒸干,用水和乙醚溶解,萃取后取水层加入已处理好的 Al₂O₃-大孔吸附树脂柱上,依次用水和 70% 乙醇液洗脱,收集 70% 乙醇洗脱液,蒸干后用甲醇溶解,点于硅胶 G 薄层板上,同时点人参皂甙 Re 对照液以氯仿-甲醇-水 (65:35:10) 展开,5% 硫酸乙醇液浸板, 100°C 烘 7 分钟,双波长反射法锯齿扫描,扫描测长 525nm,参比波长 680nm,人参皂甙 Re 线性范围 $1 \sim 6 \mu\text{g}^{[75]}$ 。

⑦棒状薄层层析法^[52] 提取人参总皂甙以甲醇溶解,点于涂布硅胶的石英棒上,以氯仿-甲醇-水 (65:35:10) 下层展开,薄层棒分离出的成分由氢火焰离子化检测器在原位定量检测, H₂ 流速为 165ml/min,空气流速为 2000ml/min,由记录器直接记录层析峰并测峰面积,以总皂甙的峰面积之和为 100,计算各个皂甙的相对含量。

⑧高效液相层析法^[53-74]

a. 提取人参皂甙制成甲醇溶液,注射入 μ Bondapak C₁₈ 色谱柱 (3.9×300mm) 上,以乙腈-水 (30:70) 2ml/min 下洗脱,203nm 检测,分离测定人参皂甙 Rb₁、Rb₂、Rc、Rd、Rf、Rg₂,以乙腈-水 (18:82) 在流速 4ml/min 下洗脱分离测定 Re 和 Rg₁,以标准曲线计算各皂甙的含量,此法可用于人参生药、干浸膏、流浸膏、片剂及软明胶胶囊中人参皂甙的测定^[53]。

b. 人参皂甙 Rb₁、Rb₂、Rc 和 Re (Rg₁) 溶于吡啶中,加入 10 倍克分子量的苯甲酰氯室温放置三天后倾入含 4-二甲氨基吡啶的 5% 碳酸氢钠水溶液中,沉淀用氯仿提取,经酸水洗后蒸去氯仿,残渣重新溶解,进行高效液相层析分析,色谱柱为硅胶 LS-310 不锈钢柱 (4×250mm),以正己烷-二氯甲烷-乙腈 (15:3:2) 为流动相,流速 4.0ml/min,检测波长 240nm 和 254nm,以峰高对皂甙量绘制标准曲线。样品中人参皂甙经提取后按上述步骤进行衍生化并层析分析,由标准曲线计算含量^[54]。