

高职高专 制药技术类专业系列规划教材



ZHONGYAO HUAXUE SHIYONG JISHU

# 中药化学实用技术

主 编 杨俊杰 李利红



重庆大学出版社  
<http://www.cqup.com.cn>

高职高专制药技术类专业系列规划教材

# 中药化学实用技术

主 编 杨俊杰 李利红

副主编 杨宁辉 苏振宏 林 静

参 编 (以姓氏笔画为序)

吴心怡 骆 航 费 娜

主 审 王青博

重庆大学出版社

## 内 容 提 要

本书以体现“基础知识、基本理论、基本技能”的高等职业教育为特点,重点突出实用性。其内容包括绪论,中药化学成分的提取、分离,糖和苷,醌类化合物,苯丙素类化合物,黄酮类化合物,萜类和挥发油,皂苷类,强心苷类,生物碱类化合物,其他类中药化学成分,中药标准提取物,中药活性成分的研究等内容。教材编写改变以往理论与实践分开的形式,按理实一体化编写,并根据当前中药化学的发展趋势增添了海洋天然药物、中药标准提取物等内容,紧跟学术研究前沿,同时又与生产一线接轨。

本书可作为高职院校药学、中药及相关类专业的教材,也可供执业药师考试、自学、成人教育等作为参考用书。

### 图书在版编目(CIP)数据

中药化学实用技术/杨俊杰,李利红主编. —重庆:  
重庆大学出版社,2016. 1

高职高专制药技术类专业系列规划教材

ISBN 978-7-5624-9586-4

I. ①中… II. ①杨…②李… III. ①中药化学—高等职业教育—教材 IV. ①R284

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2015)第 317732 号

高职高专制药技术类专业系列规划教材

### 中药化学实用技术

主 编 杨俊杰 李利红

副主编 杨宁辉 苏振宏 林 静

策划编辑:袁文华

责任编辑:陈 力 版式设计:袁文华

责任校对:张红梅 责任印制:张 策

\*

重庆大学出版社出版发行

出版人:易树平

社址:重庆市沙坪坝区大学城西路 21 号

邮编:401331

电话:(023) 88617190 88617185(中小学)

传真:(023) 88617186 88617166

网址: <http://www.cqup.com.cn>

邮箱: [fxk@cqup.com.cn](mailto:fxk@cqup.com.cn) (营销中心)

全国新华书店经销

重庆市国丰印务有限责任公司印刷

\*

开本:787×1092 1/16 印张:18.25 字数:456 千

2016 年 1 月第 1 版 2016 年 1 月第 1 次印刷

印数:1—2 000

ISBN 978-7-5624-9586-4 定价:37.00 元

本书如有印刷、装订等质量问题,本社负责调换  
版权所有,请勿擅自翻印和用本书  
制作各类出版物及配套用书,违者必究

## 高职高专制药技术专业系列规划教材

### 编委会

(排名不分先后,以姓氏拼音为序)

陈胜发 房泽海 符秀娟 郭成栓 郝乾坤  
黑育荣 洪伟鸣 胡莉娟 李存法 李荣誉  
李小平 林创业 龙凤来 聂小忠 潘志恒  
任晓燕 宋丽华 孙波 孙昊 王惠霞  
王小平 王玉姝 王云云 徐洁 徐锐  
杨军衡 杨俊杰 杨万波 姚东云 叶兆伟  
于秋玲 袁秀平 翟惠佐 张静 张叶  
赵珍东 朱艳

## 高职高专制药技术专业系列规划教材

### 参加编写单位

(排名不分先后,以单位拼音为序)

- |              |              |
|--------------|--------------|
| 安徽中医药大学      | 淮南联合大学       |
| 安徽中医药高等专科学校  | 江苏农牧科技职业学院   |
| 毕节职业技术学院     | 江西生物科技职业技术学院 |
| 广东岭南职业技术学院   | 江西中医药高等专科学校  |
| 广东食品药品职业学院   | 乐山职业技术学院     |
| 海南医学院        | 辽宁经济职业技术学院   |
| 海南职业技术学院     | 陕西能源职业技术学院   |
| 河北化工医药职业技术学院 | 深圳职业技术学院     |
| 河南牧业经济学院     | 苏州农业职业技术学院   |
| 河南医学高等专科学校   | 天津渤海职业技术学院   |
| 河南医药技师学院     | 天津生物工程职业技术学院 |
| 黑龙江民族职业学院    | 天津现代职业技术学院   |
| 黑龙江生物科技职业学院  | 潍坊职业学院       |
| 呼和浩特职业学院     | 武汉生物工程学院     |
| 湖北理工学院医学院    | 信阳农林学院       |
| 湖北生物科技职业学院   | 杨凌职业技术学院     |
| 湖南永州职业技术学院   | 重庆广播电视大学     |
| 湖南环境生物职业技术学院 | 淄博职业学院       |



## 前 言

为了适应制药类专业高等职业教育的快速发展和教学改革的需要,加强教材建设,提高教材质量,由重庆大学出版社策划组织,由全国多所高等药学院校合作编写本书。

本书在编写时紧扣高等职业教育制药类专业培养目标,以“应用型”为需求,以岗位为导向,坚持“基础知识、基本理论、基本技能”“思想性、科学性、先进性、启发性、适用性”原则,突出实用性。改变以往理论与实践分开的形式,理实一体化编写。编写过程中紧跟中药化学研究前沿。在原有中药化学分类的基础上,增加了海洋类药物。针对目前中药标准提取物的兴起和不断发展壮大,专门增加了中药标准提取物章节,弥补了传统教学对新兴产业的不足。

本书在内容上共分为 13 个项目,包括绪论,中药化学成分的提取、分离,糖和苷,醌类化合物,苯丙素类化合物,黄酮类化合物,萜类和挥发油,皂苷类,强心苷类,生物碱类化合物,其他类中药化学成分,中药标准提取物,中药活性成分的研究。本书可供高等职业教育中药学和药学及其相关专业使用,也供教学科研及相关从业者参考。

本书绪论、项目 1 由杨俊杰(信阳农林学院)编写;项目 2 由骆航(湖南永州职业技术学院)编写;项目 3、项目 11 由吴心怡(河南医学高等专科学校)编写;项目 4、项目 6 由杨宁辉(河南医学高等专科学校)编写;项目 5 由林静(湖北理工学院医学院)编写;项目 7、项目 8 由苏振宏(湖北理工学院医学院)编写;项目 9 由李利红(河南牧业经济学院)编写;项目 10、项目 12 由费娜(河南医药技师学院)编写。

本书在编写过程中参考并引用了大量教材、专著、文献,在此对原作者深表感谢。本书还得到了河南同源制药有限公司王青博高级工程师的大力支持并担任主审,在此表示衷心的感谢!

由于编者水平所限,本书疏漏之处在所难免,真诚希望读者批评指正。

编 者

2016 年 1 月

# 目 录 CONTENTS

绪 论	1
任务 0.1 中药化学研究的目的是与意义	2
任务 0.2 中药及天然药物有效成分研究概况	5
任务 0.3 中药中各类成分简介	7
技能实训 0.1 中药化学实验的基本要求与操作	10
项目小结	11
复习思考题	11
项目 1 中药化学成分的提取、分离技术	12
任务 1.1 中药化学有效成分的提取技术	12
任务 1.2 中药化学成分的分离	19
任务 1.3 中药化学成分色谱分离法	25
技能实训 1.1 薄层色谱练习	46
技能实训 1.2 纸色谱练习	47
技能实训 1.3 柱色谱练习	48
项目小结	48
复习思考题	49
项目 2 糖和苷	50
任务 2.1 糖类	50
任务 2.2 苷类	58
任务 2.3 糖和苷的提取分离	64
任务 2.4 糖和苷的提取分离实例——氰苷	66
技能实训 2.1 黄芪多糖的提取分离	68
项目小结	70
复习思考题	70
项目 3 醌类化合物	71
任务 3.1 醌类化合物的生物活性及结构类型	72
任务 3.2 醌类化合物的理化性质	77
任务 3.3 醌类化合物的提取与分离技术	79
任务 3.4 醌类化合物的检识技术	82
任务 3.5 醌类中药实例	90

技能实训 3.1 虎杖中蒽醌的提取分离与检识 .....	94
项目小结 .....	95
复习思考题 .....	96
<b>项目 4 苯丙素类化合物</b> .....	97
任务 4.1 简单苯丙素 .....	98
任务 4.2 香豆素 .....	99
任务 4.3 木脂素类 .....	109
技能实训 4.1 秦皮中七叶苷、七叶内酯的提取、分离和鉴定 .....	115
项目小结 .....	116
复习思考题 .....	116
<b>项目 5 黄酮类化合物</b> .....	118
任务 5.1 黄酮类化合物的生物活性及结构类型 .....	119
任务 5.2 黄酮类化合物的理化性质 .....	125
任务 5.3 黄酮类化合物的提取与分离技术 .....	129
任务 5.4 黄酮类化合物的检识与结构测定 .....	133
任务 5.5 黄酮实例 .....	140
技能实训 5.1 槐米中芸香苷及槲皮素的提取分离与检识 .....	144
项目小结 .....	146
复习思考题 .....	147
<b>项目 6 萜类和挥发油</b> .....	148
任务 6.1 萜类 .....	149
任务 6.2 挥发油 .....	160
技能实训 6.1 丁香中挥发油的提取分离与检识 .....	170
项目小结 .....	172
复习思考题 .....	172
<b>项目 7 皂苷类</b> .....	173
任务 7.1 概述 .....	174
任务 7.2 理化性质 .....	177
任务 7.3 提取分离 .....	180
任务 7.4 中药实例 .....	184
技能实训 7.1 穿山龙中甾体皂苷元的提取分离与检识 .....	189
项目小结 .....	190
复习思考题 .....	191



项目 8 强心苷类 .....	192
任务 8.1 结构与分类 .....	193
任务 8.2 理化性质 .....	196
任务 8.3 提取分离 .....	197
任务 8.4 检识 .....	199
任务 8.5 中药实例——毛花洋地黄 .....	201
技能实训 8.1 夹竹桃强心苷的提取分离与鉴定 .....	203
项目小结 .....	205
复习思考题 .....	205
项目 9 生物碱类化合物 .....	206
任务 9.1 生物碱的结构类型 .....	207
任务 9.2 生物碱的理化性质 .....	215
任务 9.3 生物碱的提取与分离技术 .....	217
任务 9.4 生物碱的检识与结构测定 .....	221
任务 9.5 生物碱实例 .....	224
技能实训 9.1 盐酸小檗碱的提取分离与检识 .....	236
技能实训 9.2 防己中粉防己碱的提取分离与检识 .....	238
项目小结 .....	241
复习思考题 .....	241
项目 10 其他中药化学成分 .....	242
任务 10.1 有机酸 .....	243
任务 10.2 鞣质 .....	246
任务 10.3 氨基酸和蛋白质 .....	251
任务 10.4 海洋天然药物 .....	252
任务 10.5 动物药 .....	254
任务 10.6 矿物药 .....	255
项目小结 .....	257
复习思考题 .....	257
项目 11 中药标准提取物 .....	258
任务 11.1 中药标准提取物概述 .....	259
任务 11.2 中药标准提取物发展状况 .....	260
任务 11.3 中药标准提取物实例 .....	262
项目小结 .....	267
复习思考题 .....	267

项目 12 中药活性成分的研究 .....	268
任务 12.1 中药活性成分的研究过程 .....	269
任务 12.2 中药活性成分的研究方法 .....	270
任务 12.3 中药有效成分结构测定和结构修饰 .....	274
技能实训 12.1 中药化学成分预试验 .....	278
项目小结 .....	281
复习思考题 .....	281
参考文献 .....	282

# 绪论

## 【知识目标】

- 熟悉中药化学的研究对象、任务和目的,中药化学成分的种类。
- 了解国内外研究中药化学有效成分的概况和发展趋势。
- 掌握有效成分、无效成分、有效部位、有效部位群的概念,中药化学成分的分类。

## 【技能目标】

- 能够正确区分中药化学中的有效成分和无效成分。

## 【知识点】

- 中药化学;有效成分;无效成分;有效部位;有效部位群;中药化学成分的分类。



## 案例导入

### 传统中医药与诺贝尔奖

2015年12月10日,我国科学家屠呦呦获得诺贝尔生理学或医学奖,成为中国首位获得诺贝尔生理学或医学奖的科学家。在致颁奖词时,诺贝尔生理学或医学奖评委汉斯·弗斯伯格对屠呦呦发现青蒿素的科学贡献予以高度评价。他表示:每年大概有50万人死于疟疾,其中大部分是儿童。据世卫组织最新的统计数据,世界上约有2.5亿人感染疟疾,近100万人因感染疟原虫而死亡。如果没有屠呦呦发现的青蒿素,那么2.5亿疟疾感染者中将有更多的人无法幸存下来。而这一发现起源于我国古代东晋时期名医葛洪所著《肘后备急方》,是古老的中医药给人类的一份礼物。青蒿素是中药化学研究的杰出成果,是我国科学家在疟疾治疗上对人类作出的巨大贡献。

中药化学是一门结合中医药理论,运用现代科学理论与方法研究中药化学成分的一门学科。其研究对象是中草药中具有生物活性或者能够预防治疗疾病的化学成分,即有效成分。研究内容包括各类中药化学成分的化学结构、理化性质、提取、分离、检识以及结构鉴定。

中药是药物的一个重要组成部分。人类自古以来,在长期与疾病作斗争的过程中,对中药

的应用积累了丰富的经验。例如我国流传的神话故事“神农尝百草，日遇七十二毒，得茶而解之”，说明中药的发现和应用是无数先人用生命为代价积累下来的宝贵财富。

中药来自于植物、动物、矿物等自然界中存在的有药理活性的天然产物，并以植物来源为主，种类繁多。我国明代李时珍著《本草纲目》中记载有 1 892 种，我国现代出版的《中药大辞典》中记载中草药多达 6 008 种。随着人们对天然药物认识的不断深入，在过去的几十年间，有 1 万多种海洋天然产物被发现，其中有重要生物活性并已申请专利的新化合物 300 多种。同时伴随生命科学的发展，许多内源性生理活性物质也正在不断地被揭示出来，将会有更多、更新的天然药物通过运用现代技术构建的新的生物活性测试体系被发现。

中药化学成分复杂，其中具有生物活性的称为有效成分；无生物活性的称为无效成分，如普通的蛋白质、糖类、油脂、树脂以及叶绿素等。但是有效成分和无效成分的划分不是一成不变的。一些过去认为是无效成分的化学物，如多糖、多肽、鞣质等，现代研究发现其具有新的生物活性，而过去认为的有效成分，经过进一步的深入研究，其用途和药效发生了改变。例如，麝香中抗炎的有效成分过去认为是麝香酮(musk ketone)，所以人工麝香的主要成分是化学合成麝香酮，而近些年的研究发现，抗炎的有效成分是多肽(polypeptide)。中草药中的有效成分很少是单一成分，往往是同一类型的多种成分，或者是多个成分类型。主要有效成分或者结构近似的一类成分称为有效部位，例如总黄酮、总皂苷、总生物碱等。主要有效部位合称为有效部位群。因此，对中草药有效成分的研究，必须缜密地、系统地、全面地进行，才能真实地反映中草药原有的生物活性。

## 任务 0.1 中药化学研究的目的是与意义

### 0.1.1 探索中药防病治疗疾病的原理、阐明中药的药效物质基础

近年来，关于中医药的争议不断，其中反对者的理由之一就是中医药是如何治疗疾病的。如何用现代科学手段来阐述中医药治病救人的机理，是关系中医药存亡的关键所在。通过对中药进行有效成分的研究，不仅可以阐明中药产生功效的究竟是何物物质，也为探索中药防治疾病的原理提供了前提和物质基础。例如，麻黄中的挥发油成分  $\alpha$ -松油醇( $\alpha$ -terpineol)是其发汗散寒的有效成分；其平喘的有效成分是麻黄碱(ephedrine)和去甲麻黄碱(norpseudoephedrine)；而利水的有效成分则是伪麻黄碱(pseudoephedrine)。车前子具有利尿通淋、渗湿止泻、清肝明目、清热化痰的作用，现代研究发现，其主要有效成分是类叶升麻苷(acteoside)，其具有血管紧张素酶抑制活性和利尿作用。研究发现，温热药附子、吴茱萸、细辛、丁香等都含有消旋去甲乌药碱，此成分为  $\beta$ -受体激动剂，具有加强心肌收缩力，加快心率，促进脂肪、糖代谢等的一系列作用，这些作用与热性药的药性基本上一致，因此，推测去甲乌药碱可能是“热性”中药的物质基础。

### 0.1.2 研究中药化学成分间的相互作用, 阐明中药复方配伍原理

复方配伍是中医用药的特点之一。在中药方剂的煎煮或其他剂型制备过程中,各种有效成分之间发生了复杂的理化反应。例如,生脉散为中医古典精方,古代医家用于抢救热伤元气,脉微欲绝等危重病人。经研究,其三味药单用均不如复方。以红参-麦冬-五味子(1:3:1.5)水煎,发现生成一种新物质,经结构测定为5-羟甲基糠醛(5-HMF),该物质在三味药中仅五味子少量含有,药效试验表明5-HMF具有抗心肌缺血作用,可代表生脉散的疗效成分。甘草与甘遂属于中药“十八反”之一。现代研究表明,在煎煮过程中,甘草的有效成分甘草皂苷(glycyrrhizin)能够增加甘遂毒性成分的溶出,使其毒性增加。

### 0.1.3 探索中药加工炮制过程中的化学成分变化, 阐明中药炮制原理

中药炮制是中医用药的一大特色。大多数中药需要由原料加工炮制成饮片方可入药。通过炮制可以改变性味归经,消除毒副作用,以及增强疗效等作用。但中药炮制大多是靠经验,客观标准很难统一,所以目前我国各省市仍沿用自己的《中药炮制规范》。通过研究中药炮制前后有效成分的变化,有助于揭示中药炮制的原理,简化、规范炮制过程,控制饮片质量。

黄芩过去的炮制方法分为南北两种。南方认为黄芩有小毒,需要反复水漂,变绿后切片干燥,品种为“淡黄芩”;北方则是在锅内蒸软后切片干燥,以色黄者为佳。后经研究发现,黄芩的主要有效成分为黄芩苷,水泡后,会引起黄芩苷水解生成黄芩素,易氧化转换成醌类衍生物而显绿色。由此可见,北方加工方法较为科学,加热可起到“杀酶保苷”的作用,避免其有效成分分解。延胡索的有效成分为生物碱类化合物,用水煎煮,溶出成分较少,醋炙后,其生物碱与醋酸形成易溶于水的醋酸盐,使水煎液中总生物碱溶出量增加,从而增强延胡索的镇痛作用。乌头的毒性成分为双酯型生物碱,经过蒸煮后,双酯型生物碱水解为单酯型生物碱,再进一步水解为有机胺类生物碱,保留了镇痛消炎作用,而毒性却大大降低。

### 0.1.4 有利于改进药物剂型、提高药物质量和临床疗效

中药最早的剂型为汤剂,距今已有三千多年的历史,后世增加了丸、散、膏、丹、酒剂、锭剂、栓剂、搽剂等40多种剂型。传统剂型大都存在技术落后、产品粗糙、卫生不达标、疗效不稳定等问题。现在引入了片剂、胶囊、滴丸等剂型,但是始终无法完全替代传统剂型,尤其是汤剂。为了研制开发出高效、优质、安全、稳定的“三效”(高效、速效、长效)、“三小”(剂量小、毒性小、副作用小)、“三便”(贮存、携带、服用方便)的新型中药,中药化学在中药制剂的研制中,起着十分重要的作用。

中药制剂过程中采取的提取、分离、浓缩、干燥、灭菌等步骤都与中药化学成分的理化性质密切相关。只有在原料药的化学成分性质清楚的情况下,才能有针对性地进行制剂工艺、剂型的设计,参数的优化。目前一些剂型改革,特别是中药注射剂,有很多失败的案例,无不与此有关。

### 0.1.5 建立和完善中药材和中成药的质量标准

中药特别是植物药,其质量受到品种、产地、栽培条件、采收、贮藏、加工等因素影响,制剂质量也不易稳定。过去传统的检验方法依靠眼看、口尝、粉末显微等手段,具有很大的不确定性。为了更好地控制中药的质量,在严格按照《中药材生产质量管理规范》(GAP)的要求进行中药材栽培、生产,以及严格按照《药品生产质量管理规范》(GMP)的要求进行中药制剂生产的同时,现在越来越多地应用中药化学的检识反应、鉴别方法、各种色谱法以及各种波谱法对中药材及其制剂进行定性鉴别和含量测定,并尽可能对其生产的全过程进行监控。

在中药材和中成药的质量控制中,如果能确定其有效成分,则应以其有效成分为指标,建立定性鉴别和含量测定的方法,以此来控制质量。如果其有效成分还不清楚时,可以采用该主要化学成分或标志性化学成分为指标进行。

在中药物制剂中,除了可控制有效成分外,如果有效成分含量过低,还可控制有效部位,例如总皂苷、总生物碱等。

由于中药成分复杂,单一的指标难以全面表述其质量。近年来,我国正逐步采用指纹图谱来控制天然药物和制剂的质量。常用的如红外指纹图谱、高效液相指纹图谱、气相指纹图谱等。制剂中注射剂首先采用了气相指纹图谱技术来控制质量。

### 0.1.6 促进中药资源的合理利用与开发

中药材由于受到生长周期、产地等因素制约,导致一些品种供不应求,价格昂贵。通过对有效成分的化学结构和性质的研究,在其他植物中筛选此成分,从而扩大药源。例如小檗碱(berberine)最初是从毛茛科黄连中提取,后来从小檗科、芸香科、防己科等植物中也可分离得到,目前小檗碱提取物主要来自小檗科的三颗针,以及芸香科的黄柏,而不是黄连。具有抗癌活性的石蒜碱(galanthidine)、伪石蒜碱(pseudolycorine)及抗胆碱脂酶药加兰他敏(galanthamine),最初由石蒜科石蒜属中的几种植物的鳞茎中提取,后来发现水仙属水仙中也含有此成分。

从天然药物中筛选具有生物活性的成分,是国内外新药研发的重要途径之一。有些有效成分由于生物活性不太强,或者毒副作用较大,或者结构复杂,或者药用资源太少等因素,不能直接开发成新药,可以通过结构改造、化学合成等方法来完成。例如,抗癌活性显著的紫杉醇(paclitaxel),最初发现存在于美国太平洋西北沿岸的红豆杉树皮中,但是此树生长得十分缓慢,数量有限且其中有效成分的含量非常低,治疗一个病人需要6棵百年树龄的红豆杉,但美国严禁砍伐。后来在我国云南发现了具有同样药用价值的中国红豆杉,但由于保护不力,滥砍盗伐严重,几乎造成原始红豆杉林灭绝。现在的紫杉醇以及其抗癌同源衍生物可以通过其前体进行化学半合成制得。古柯叶中含有效成分古柯碱(erythroxyton),其具有很强的局部麻醉作用,但毒性大,容易成瘾。后经过结构改造,合成普鲁卡因(procaine),结构比古柯碱简单,毒性却远低于古柯碱,成为目前临床广泛使用的麻醉药。

## 任务 0.2 中药及天然药物有效成分研究概况

### 0.2.1 国内研究概况

#### 1) 历史沿革

中药的应用有着悠久的历史,除了应用原药材之外,还发明了一些化学成分加工品。早在 2 000 多年前,人们就利用大米或其他粮食为原料,煮熟后加麦芽作为糖化剂制造出饴糖。被后世尊称为“医圣”的东汉名医张仲景发明的名方“小建中汤”即以饴糖为君药。明代《本草纲目》中记载了没食子酸的制备方法,“看药上长起长霜,药则已成矣”,而“长霜”就是生成了没食子酸。在《本草纲目》中还有升华法制备、纯化樟脑的记载。

#### 2) 近现代以来研究状况

我国近现代对中药化学成分的研究始于 20 世纪 20 年代,以麻黄碱的研究为代表。20 世纪 30 年代从延胡索中分离出延胡索乙素(消旋四氢巴马汀, *dl*-四氢掌叶防己碱, *dl*-tetrahydropalmatine)、丁素(*L*-四氢黄连碱, *L*-tetrahydrooptisine)、戊素(*dl*-四氢黄连碱 *dl*-tetrahydrooptisine)等止痛成分。50 年代建立大型天然麻黄素提取工业。据统计,我国科技工作者在 80 年代从中药中分离出 800 余个新成分,90 年代以来每年有 100 多种新成分被分离发现。例如,从陈皮中筛选出平喘作用的川陈皮素(nobiletin)、橙皮苷(hesperidin)。紫金牛中分离出岩白菜素(bergenin),可以替代磷酸可待因(codeine phosphate)。在五味子化学结构的基础上,合成联苯双酯(bifendate),是我国首创的一种治疗肝病的新药。从青蒿中分离出的青蒿素是一种新型的速效、低毒抗疟新药,为人类作出了巨大贡献。马桑寄生中分离出马桑毒素(coriamyrtin)、羟基马桑毒素(tutin)可以治疗精神分裂症。在中药中筛选出一批对肿瘤具有显著疗效的药物,如从喜树根和果实中分离出的喜树碱(camptothecine)对肠、胃道和头颈部癌等有较好的疗效;存在于秋水仙属植物的鳞茎和种子中的秋水仙碱(colchicine)对乳腺癌具有一定疗效;莪术挥发油中分离出莪术醇(curcumenol)和莪术二酮(curdione)对治疗宫颈癌有效;从青黛分离出的靛玉红(indirubin)可治疗慢性粒细胞白血病;斑蝥中提取的斑蝥素可延长原发性肝癌患者的生存期。对于至今人类还无法攻克的艾滋病(HIV),科学家们把希望寄托在中药上,研究发现,天花粉中的提取物 GLQ223,不会损伤健康细胞,但能选择性地杀伤已被 HIV 感染的细胞,并有抑制病毒复制的作用;羊栖菜中所含褐藻硫酸酯多糖(fucoidan)对 HIV 具有明显的抑制作用;中科院昆明研究所在中草药抗艾滋病的研究中发现 150 多种中药具有抗艾滋病活性,选用其各自的有效部位,组成了“SH 复方”制剂。经过临床应用,取得了良好效果。

## 0.2.2 国外研究概况

### 1) 研究起源与发展

瑞典药剂师卡尔·威尔海姆·舍勒(Carl Wilhelm Scheele)是近代有机化学的奠基人之一。1768年,他从植物中发现酒石酸,并于1796年化学合成得到。舍勒还从柠檬中制取出柠檬酸的结晶,从肾结石中制取出尿酸,从苹果中发现了苹果酸,从酸牛奶中发现了乳酸,还提纯过没食子酸。自19世纪初法国药学家Derosone(1804)和德国药学家Serturmer(1805)先后自鸦片中提取分离得到镇痛有效成分吗啡(morphine)以来,世界各国对天然产物所含化学成分的提取、分离和鉴定从未间断,而且越来越受到医药学者的的高度重视。1925年学界阐明了吗啡的化学结构,1952年实现全人工合成,从发现到合成,用了近150年时间。随后的研究周期就大大缩短,1952年发现利血平到1956年人工合成成功,只用了4年时间。此后,有效成分不断地从天然药物中分离出来,如奎宁(quinine)、阿托品(atropine)、芦丁(rutin)等。

### 2) 目前研究状况

当前,国际中药研究多集中在中国周边国家和地区,取得了大批成果。一些西方国家也逐渐重视对中医药的研究,从多方面渗透到中医药领域。

日本目前是除了我国以外,应用中药历史最悠久、范围最广、研究水平较高的国家。特别是最近几十年,其对众多常用中药的化学成分进行了较深入的研究,取得了一大批领先成果。如人参、黄芪、葛根、芍药、柴胡、桔梗、酸枣仁、附子等。不仅基本阐明了其化学成分,而且对这些药材的种植资源、栽培加工、质量研究、药效评价等方面进行系统研究,并对众多常用中药的化学成分进行了较为深入的研究,取得了一大批领先成果。例如,津村顺天堂设有300余人的中药研究所,并与大学联合开发新药,许多中药制剂得到了美国FDA和欧洲EMEA认证,目前占有日本与国际中药市场的80%。

德国目前药用植物达900余种,生产植物药品在2万种以上,占市售药品14万种的1/7。有调查表明,78%的德国妇女服用过草药,其中半数已学会选用一般植物药治疗疾病。

俄罗斯于1931年成立了药物研究所,选取民间常用草药进行现代药学分析,至1956年已知160种草药的主要成分与药理、药效学特征。20世纪80—90年代,其借助于计算机等现代科技手段分析了158个常用中医处方的药理作用、应用价值。此外,还有益母草提取物治疗神经官能症与早期高血压,杜仲制剂降压,荠菜、地榆、篇蓄或芝麻提取物止血,玉米须、薄荷利胆,黄芩降压等。

印度有6000种以上的植物被用于传统民间草药医疗。目前,印度官方现已认定了3000种以上植物的药用价值;有7000家左右的公司从事标准化或未标准化的传统医药生产。

## 0.2.3 研究技术发展概况

最初,人们研究中药化学成分时需要通过分馏和重结晶来纯化,化学降解或制备成衍生物进行比较,才有可能确认,耗时较长,一般需要至少几百毫克甚至几克的纯物质,这给含量普遍很低的天然化合物的研究带来了很大的不便。到了1930年,由于微量元素分析法的导入,试



样量降至毫克水平,推进了天然成分的分析工作。随着科学的发展,到了20世纪60年代,各种层析方法兴起,使微量天然新成分的分离纯化简便易行。现在由于二维、三维核磁共振技术,快原子轰击(FAB-MS)、二级电离(SIMS)、基质辅助激光解吸飞行时间质谱仪(MALDI-TOFMS)、傅里叶变换质谱仪(FT-MS)、感应耦合等离子体质谱仪(ICP-MS)等质谱技术的应用,特别是与高效液相、气相、毛细管电泳等分离手段的联合应用,在较短时间内就能确定化合物的结构,使研究周期大大缩短。

#### 0.2.4 中药化学研究发展趋势

目前,我国的中药化学成分研究在中医药理论阐明、新药研发、中药质量标准制订等方面均取得一系列成果,但不足以支撑整个中医药理论体系,很多细节尚不清楚。研究主要集中在一些热门中药材,冷背药材涉及不深入。中药材、中药饮片的质量标准仍需进一步发展完善。今后中药化学成分研究主要有以下几个方向:

- ①以符合中医药理论体系的活性指标追踪中药化学成分的分离。
- ②中药复方的化学成分研究。
- ③新技术手段在中药化学研究中的吸收与应用。

### 任务 0.3 中药中各类成分简介

药用植物在生长时期受到环境等因素的影响,在自身新陈代谢过程中,形成和积累了不同的化学物质。下面就已知的中药化学成分作简单介绍。

#### 0.3.1 中药化学成分的分类

中药化学成分可分为有效成分和无效成分。有效成分按照酸碱性可分为酸性成分、碱性成分、中性成分和两性成分。无效成分按照极性可分为脂溶性杂质和水溶性杂质。

##### 1) 有效成分

##### (1) 酸性成分

酸性成分包括:结构中含有酚羟基的化合物,如黄酮、醌类、苯丙素(香豆素、木脂素)及其苷类等;结构中含有羧基的化合物,如有机酸、葡萄糖醛酸等。

##### (2) 碱性成分

碱性成分主要指生物碱。

##### (3) 中性成分

中性成分是指分子结构中既无碱性基团也无酸性基团的化合物,如萜类和挥发油、甾体等。

##### (4) 两性成分

两性成分是指成分结构中既有碱性基团也有酸性基团,例如氨基酸、蛋白质等。