



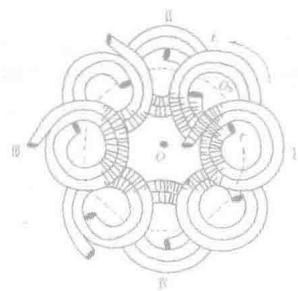
# 中药化学成分 程序化分离制备

王晓 杨滨 主编



化学工业出版社





# 中药化学成分 程序化分离制备

王晓 梁滨 主编



化学工业出版社  
· 北京 ·

本书首先对中药化学成分及其分离纯化技术进行了概述，然后每类化合物按照概述、化合物结构与性质、提取分离纯化的思路，分述优选了 195 种中药化学成分的分离制备。书中特别引用了大量作者自己的研究成果，从提取、富集与纯化，步骤清晰，重现性好，达到“程序化”分离制备的目的。

本书汇集大量的实例，突出实际应用，适用于从事中药研发与生产的专业技术人员、相关专业的高校教师和高年级本科生、研究生以及从事植物化学、食品、天然产物资源研究的技术人员进行阅读和参考。

#### 图书在版编目 (CIP) 数据

中药化学成分程序化分离制备/王晓，杨滨主编. —北京：  
化学工业出版社，2018.8

ISBN 978-7-122-32396-5

I. ①中… II. ①王… ②杨… III. ①中药化学成分-  
分离-制备 IV. ①R284

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2018) 第 130937 号

---

责任编辑：成荣霞

文字编辑：刘志茹

责任校对：秦 姣

装帧设计：王晓宇

---

出版发行：化学工业出版社（北京市东城区青年湖南街 13 号 邮政编码 100011）

印 装：中煤（北京）印务有限公司

710mm×1000mm 1/16 印张 30 1/4 字数 555 千字

2019 年 1 月北京第 1 版第 1 次印刷

---

购书咨询：010-64518888 售后服务：010-64518899

网 址：<http://www.cip.com.cn>

凡购买本书，如有缺损质量问题，本社销售中心负责调换。

---

定 价：198.00 元

版权所有 违者必究

## 《中药化学成分程序化分离制备》

### 编写人员名单

主编 王 晓 杨 滨

副主编 于金倩 段文娟 王岱杰

编写人员(按姓氏笔画排序)

于金倩 马 然 王 晓 王召平 王岱杰

井 凤 田善鸣 仙云霞 吕海花 朱 媛

刘 峰 刘 倩 刘建华 闫慧娇 孙兆林

孙常磊 纪文华 杨 滨 李怀志 宋祥云

张敏敏 陈静娴 赵 伟 赵恒强 段文娟

耿岩玲 高乾善

## 前言

FOREWORD

中药及药用植物的化学成分十分复杂，含有多种生物活性成分，这些成分也是其治疗疾病的物质基础，故提取分离其有效部位或有效单体成分是中药学研究的一项重要内容。目前认为中药的有效成分主要包括蒽醌、生物碱、黄酮、香豆素、木脂素、萜类、皂苷等类化合物。获得目标化合物单体是进一步确定其化学结构、研究其药理活性的首要条件，也是对其进行结构改造、化学合成和研究化合物构效关系的前提，这些成分也往往是控制产品质量的关键指标。因此开展中药有效成分的分离纯化对推动中药新药研究及中药现代化等方面都具有重要意义。

近年来，我国中药化学、植物化学工作者每年都从很多中药或药用植物中分离制备了大量化合物，但绝大多数没有进行深入药理活性的研究。大多数据报道的分离过程很烦琐、描述模糊，所采用的技术多数是常规柱色谱、重结晶等技术，而且分离周期长，制备效率低，很难重现。这些直接限制了中药现代化研究的进程。因此，开发高效、规范、可重现的分离制备程序，需求非常迫切。近年来，在中药有效成分分离方面出现了许多新技术、新方法，而一些新的分离技术具有简单、快速、高效、损失率低、被测组分与基体有效分离、准确度高等优势，并取得了显著的效益。在新的分离纯化技术中，高速逆流色谱和高效制备液相色谱因其重现性好、分离速度快、分离效率高，而成为广泛使用的“程序化”分离技术。高速逆流色谱技术可消除固态的固定相对目标活性成分的不可逆吸附、失活、变性等不良反应，而高效制备液相色谱技术可使目标活性成分的分离达到很高的分离效率和分辨率，直观性和目标性较强。两种分离技术相结合，可互补不足，实现活性成分快速、高效的分离。因此，建立规范的提取、富集、分离纯化程序，是解决化合物重现性制备的关键，也是深入研究化合物活性，进行深度开发的前提。

本书是根据笔者多年从事科研工作的实践，收集了大量 2000 年以后的有关利用高速逆流色谱和高效制备液相色谱分离制备中药药效成分的国内外文献资料，并结合笔者多年来从事中药化学研究的成果及应用实践编写而成。首先是通过建立标准的高效液相色谱分析方法，对中药材材料进行分析，获取所含化合物的基本信息。然后进行规范的提取和富集，最后通过高速逆流色谱或高效制备液相应用标准的溶剂系统及运行参数进行纯化，获得的成分再用上述分析总样所建立的高效液相色谱法去分析纯度，对比确定所制备的化合物。通过这样的思路，笔者对优选的 195 种中药的化学成分的分离制备进行了描述，特别是引用了大量本实验室的研究成果，简明扼要，有较好的重现性，力图达到“程序化”分离制备的目的。

本书编写内容突出了技术的科学性与实用性，可供从事中药研发与生产的技术人员、相关专业的高校教师和高年级本科生、研究生以及从事植物化学、食品、天然产物资源研究的技术人员进行参考。由于编者水平有限和时间仓促，疏漏和不妥之处在所难免，恳请广大读者批评指正，以利于今后改进提高。最后感谢化学工业出版社的大力支持，感谢各位编者为本书做出的贡献！

编者

2018年6月

1. 1 中药与中药化学成分 .....	1
1. 2 中药化学成分的复杂性与药效物质 基础 .....	1
1. 3 “程序化”分离中药化学成分的 必要性 .....	2
1. 4 高速逆流色谱 .....	3
1. 4. 1 高速逆流色谱概述 .....	3
1. 4. 2 高速逆流色谱的原理 .....	3
1. 4. 3 高速逆流色谱的工作步骤 .....	5
1. 5 高效制备液相色谱 .....	6
1. 5. 1 高效制备液相色谱的原理 .....	6
1. 5. 2 高效制备液相色谱溶剂系统的选择 .....	7
1. 5. 3 高效制备液相色谱的工作步骤 .....	8
参考文献 .....	8

第 1 章  
绪论

1

2. 1 巴戟天 .....	10
2. 2 大黄 .....	13
2. 3 丹参 .....	16
2. 4 贯叶连翘 .....	21
2. 5 何首乌 .....	25
2. 6 虎杖 .....	28
2. 7 决明子 .....	30
2. 8 芦荟 .....	32
2. 9 茜草 .....	33
2. 10 紫草 .....	35
参考文献 .....	38

第 2 章  
蒽醌类化  
合物

10

### 第3章 生物碱类 化合物

39

3. 1	板蓝根	39
3. 2	长春花	40
3. 3	大青叶	41
3. 4	地不容	43
3. 5	东南野桐	45
3. 6	峨眉千里光	47
3. 7	防己	48
3. 8	附子	49
3. 9	钩藤	53
3. 10	钩吻	55
3. 11	古柯	59
3. 12	荷梗	61
3. 13	荷叶	62
3. 14	胡椒	64
3. 15	黄柏	68
3. 16	黄花乌头	69
3. 17	黄连	73
3. 18	苦参	78
3. 19	苦地丁	81
3. 20	苦豆子	83
3. 21	苦木	85
3. 22	辣椒	89
3. 23	莲子心	91
3. 24	骆驼蓬子	93
3. 25	马钱子	94
3. 26	千层塔	96
3. 27	牵牛子	97

第4章  
黄酮类化  
合物

3. 28 青风藤 .....	99
3. 29 三尖杉 .....	101
3. 30 石蒜 .....	102
3. 31 太子参 .....	105
3. 32 王不留行 .....	107
3. 33 乌头 .....	108
3. 34 吴茱萸 .....	111
3. 35 喜树 .....	116
3. 36 夏天无 .....	118
3. 37 小蔓长春花 .....	121
3. 38 延胡索 .....	123
3. 39 岩黄连 .....	127
3. 40 一枝蒿 .....	129
3. 41 虫草 .....	131
3. 42 浙贝母 .....	134
3. 43 紫金龙 .....	135
3. 44 紫锥菊 .....	137
参考文献 .....	138

4. 1 菊苣 .....	141
4. 2 白花败酱叶 .....	142
4. 3 白花蛇舌草 .....	144
4. 4 草豆蔻 .....	146
4. 5 草棉花 .....	149
4. 6 长瓣金莲花 .....	151
4. 7 川西獐牙菜 .....	152
4. 8 淡豆豉 .....	155
4. 9 淡竹叶 .....	156

4. 10	灯盏细辛	159
4. 11	丁香	160
4. 12	冬瓜	162
4. 13	风轮菜	164
4. 14	茯苓	166
4. 15	甘草	168
4. 16	葛根	173
4. 17	贯叶金丝桃	176
4. 18	过路黄	178
4. 19	杭白菊	179
4. 20	荷花	181
4. 21	红花	185
4. 22	厚果鸡血藤	186
4. 23	葫芦巴	188
4. 24	化橘红	190
4. 25	黄顶菊	192
4. 26	黄芪	194
4. 27	黄芩	198
4. 28	金钱草	201
4. 29	卷柏	203
4. 30	苦檀子	206
4. 31	龙牙草	208
4. 32	罗布麻	209
4. 33	麻里麻	213
4. 34	麦冬	215
4. 35	牡丹花	217
4. 36	木蝴蝶	219
4. 37	蒲公英	221
4. 38	忍冬藤	224
4. 39	桑椹	226

第5章  
香豆素类  
化合物

273

4.40 沙棘 .....	228
4.41 山楂 .....	230
4.42 山竹 .....	232
4.43 芍药花 .....	234
4.44 射干 .....	236
4.45 酸枣仁 .....	245
4.46 藤黄 .....	248
4.47 田基黄 .....	249
4.48 甜橙 .....	251
4.49 土茯苓 .....	253
4.50 莛丝子 .....	255
4.51 银杏叶 .....	256
4.52 淫羊藿 .....	257
4.53 鸳尾 .....	262
4.54 知母 .....	263
4.55 枳壳 .....	264
4.56 枳实 .....	266
4.57 紫锥菊 .....	268
参考文献 .....	270

5.1 白花前胡 .....	273
5.2 白头翁 .....	277
5.3 白芷 .....	278
5.4 补骨脂 .....	280
5.5 草珊瑚 .....	282
5.6 枸杞 .....	283
5.7 结香 .....	285
5.8 羌活 .....	286
5.9 秦皮 .....	287

第6章  
木脂素类  
化合物

299

5. 10 瑞香狼毒	289
5. 11 蛇床子	290
5. 12 石菖蒲	292
5. 13 无花果叶	293
5. 14 茵陈蒿	295
5. 15 紫花前胡	296
参考文献	298

6. 1 臭灵丹	299
6. 2 丹参	300
6. 3 鬼臼	304
6. 4 厚朴	307
6. 5 金银花	308
6. 6 连翘	310
6. 7 牛蒡子	316
6. 8 肉苁蓉	320
6. 9 五味子	323
6. 10 辛夷	327
6. 11 杏香兔耳风	331
6. 12 洋薊	333
6. 13 紫锥菊	335
6. 14 芝麻	338
参考文献	340

7  
第7章  
萜类化  
合物

342

7. 1 蟾酥 .....	342
7. 2 赤芍 .....	346
7. 3 穿心莲 .....	347
7. 4 刺五加 .....	349
7. 5 胆汁 .....	350
7. 6 冬凌草 .....	353
7. 7 杜仲 .....	355
7. 8 茯苓皮 .....	356
7. 9 甘遂 .....	358
7. 10 红豆杉 .....	360
7. 11 黑紫橐吾 .....	361
7. 12 苦棟子 .....	363
7. 13 款冬花 .....	365
7. 14 辣椒 .....	367
7. 15 雷公藤 .....	369
7. 16 灵芝 .....	372
7. 17 龙胆 .....	374
7. 18 木香 .....	376
7. 19 柿子叶 .....	377
7. 20 土荆皮 .....	379
7. 21 乌药 .....	381
7. 22 香附 .....	383
7. 23 小白花地榆 .....	384
7. 24 野马追 .....	385
7. 25 银杏叶 .....	387
7. 26 紫菀 .....	388
7. 27 桀子 .....	390
参考文献 .....	391

## 第8章 皂苷类化 合物

393

8.1 大蒜 .....	393
8.2 穿龙薯蓣 .....	396
8.3 独角莲 .....	398
8.4 甘草 .....	399
8.5 黄芪 .....	400
8.6 桔梗 .....	403
8.7 苦瓜 .....	407
8.8 三七 .....	409
8.9 人参 .....	412
8.10 洋地黄 .....	415
参考文献 .....	416

## 第9章 其他类化 合物

418

9.1 白首乌 .....	418
9.2 白术 .....	419
9.3 波棱瓜子 .....	421
9.4 川芎 .....	423
9.5 当归 .....	427
9.6 防风 .....	429
9.7 红景天 .....	430
9.8 红曲 .....	432
9.9 姜黄 .....	436
9.10 芦荟 .....	438
9.11 绿叶地锦 .....	440
9.12 山药 .....	442

9.13 生姜 .....	443
9.14 石榴皮 .....	448
9.15 仙茅 .....	449
9.16 玄参 .....	451
9.17 远志 .....	453
9.18 紫苏叶 .....	454
参考文献 .....	456
 拉丁文索引 .....	457
 中文索引 .....	458

# 第 1 章 绪论

## 1.1 中药与中药化学成分

中药有着悠久的药用历史，是中华民族传统文化的瑰宝，它是我国各民族在防治疾病的实践中发现并运用，并不断予以增补的天然药及基本不改变其理化属性的简单加工品，是“传统中药”“草药”和“民族药”的总和。“传统中药”通常是指载于中药典籍，以传统中医理论阐释药理并指导临床使用，加工炮制规范，至今仍广泛应用的天然药及其简单加工品。“草药”是传统中药的初级形式，传统中药是草药的提高阶段。“民族药”是我国除汉族外各兄弟民族使用的天然药物，可分为类传统中药型、类草药型和中间型。

中药是一个有层次和结构的有机整体，单一的有效成分并不能充分阐述中药的药效物质机理，其药效来自多种化学成分多靶点的相互协同和增效作用，而中药的药效物质基础研究的难点在于其化学成分的复杂性<sup>[1]</sup>。迄今为止，许多中药，特别是一些常用中药的化学成分或有效成分已经得到深入的研究，其防病治病的物质基础有的已经被基本阐明。如麻黄中  $\alpha$ -松油醇具有发汗散寒的功效，麻黄碱和去甲麻黄碱具有平喘的功效，且后者还具有升压、利尿的作用。但是多数中药的药效成分仍然未被阐明。如中药青蒿的研究，我国科学家屠呦呦等人从黄花蒿中分离出的有效成分青蒿素具有较好的抗氯喹原虫的作用，广泛用于疟疾的治疗。但青蒿素却不具备中药青蒿所具有的退虚热、凉血、解暑的功效。由此可见，中药的药效是多种成分互相作用的结果。因此，只有深入研究中药的化学成分，才能真正明确中药治疗疾病的机理，保障用药的安全性、有效性和稳定性，推动中药事业的发展，加速中药走向世界的步伐。

## 1.2 中药化学成分的复杂性与药效物质基础

中药按其所含主要成分分类，可分为植物药、动物药和矿物药，其中以植物药为主，并且种类繁多。我国从 1953 年开始编撰药典以来已经有 9 版，1953 年版《中国药典》收载药品 531 种，其中植物药与油脂类 65 种，动物药 13 种；2015 年版《中国药典》一部收载药材和饮片、植物油脂和提取物、成分配制剂和单味制剂等，品种共计 2598 种，且一部正文所收载的 618 味中药材

中，植物来源占 88.03%，动物来源占 7.28%，矿物来源占 4.69%<sup>[2]</sup>。随着科学技术的进步，还将会发现更多的中草药。每种中药的化学成分都十分复杂，就拿植物药来说，一味中药可能会含有上百种的化学成分，而这些成分又分为不同的类型，从物质基本类型，可分为有机物和无机物；按元素组成、结构母核，可分为蒽醌、生物碱、黄酮、苯丙素、香豆素、皂苷、萜类等；按酸碱性，可分为酸性、碱性、中性；按溶解性，可分为非极性（亲脂性）、中极性、极性（亲水性）。中药化学成分的复杂性，往往是一味中药具有多方面功效或药理作用的物质基础。

近年来，中药的研究思路越来越注重药效物质基础的研究，将中药的化学成分与其功效或药理作用进行相关性研究，对于阐明中药的药效成分及作用机制是不可或缺的。利用现代科学技术的方法和手段，加强对中药药效成分的研究，对明确中药的药效物质基础、治病机理，实现中药的安全、有效、稳定和可控具有重要意义。

### 1.3 “程序化”分离中药化学成分的必要性

分离制备中药的化学成分，是进行结构鉴定和药理药效学研究的基础工作，但是中药化学成分的复杂性大大增加了中药化学的研究难度。传统的分离技术更多依赖于常规柱色谱、重结晶等。常规柱色谱就是利用硅胶或氧化铝等常用的吸附材料作为固定相，这种方法操作简单，但分离时间长，需要大量溶剂，成本较高，产率较低，且会造成大量化学成分的不可逆吸附、失活、变性等，对于成分比较复杂或结构相近的成分来说，常常得不到理想的分离效果，而且分离过程往往难以重现。重结晶是利用固体混合物中目标组分在某种溶剂中的溶解度随温度变化有明显差异，实现分离提纯，该法由于其局限性，也不能广泛应用在中药成分的分离过程中。针对中药化学成分的研究，迫切需要一种重现性好、分离速度快、分离效率高的“程序化”分离技术，来提高中药化学成分的收率和质量。

近年来，中药化学的研究越来越注重以活性为指标，追踪有效成分的分离；在研究方法和手段上，更加重视引进和结合现代科学技术，来加快研究速度和提高研究的水平。特别需要将中药化学成分分离制备过程标准化和程序化，使之具备“可重现性”，这样可以大大降低中药化学工作者分离制备的时间，提高分离纯化的工作效率。目前运用较多的是高速逆流色谱和高效制备液相色谱，其中高速逆流色谱技术是一种不用固态支撑体的液-液分配色谱，可消除固态的固定相对目标活性成分的不可逆吸附、失活、变性等不良反应；同时，高速逆流色谱不需要复杂的样品前处理步骤，制备量大，可以直接进样分