

全国中等卫生学校教材

经卫生部教材评审委员会审定的规划教材

供药剂士专业用

# 中药化学

第二版

吴继杰 主编

人民卫生出版社

(京) 新登字081号

1

图书在版编目(CIP)数据

中药化学/张继杰主编。-2版。-北京：人民卫生出版社，1994  
ISBN 7-117-00104-6

I. 中… II. 张… III. 中药化学-中等专业学校-教材 IV. R284

中国版本图书馆CIP数据核字(94)第02496号

中 药 化 学

第 二 版

张继杰 主编

人 民 卫 生 出 版 社 出 版  
(北京市崇文区天坛西里10号)

河 北 省 邢 化 市 印 刷 厂 印 刷  
新华书店北京发行所发行

787×1092毫米 16开本 22 $\frac{1}{2}$ 印张 4插页 519千字  
1986年11月第1版 1994年10月第2版第9次印刷  
印数：01 321—108 420

ISBN 7-117-00104-6/R·105 定价：11.70元

著作权所有，请勿擅用本书制作各类出版物，违者必究。

## 第二版说明

全国中等卫生学校11个专业使用的77种教材系卫生部1983年组织编写，于1985～1987年出版发行。

为进一步提高中等卫生学校的教材质量，培养合格的中等卫生人才，1992年11月决定对这套教材进行小修订。

这次修订基本维持原教材体系，只更正其中的错误和不当之处，在总字数不增加的前提下，修改的幅度一般不超过20%。主要修订的有：改正错误的内容、数据、图表等；删除淘汰的35种临床检验项目与方法；使用国家公布的名词与法定计量单位等；更新陈旧的内容，如不符合《中华人民共和国药典》的内容，不符合医学模式转变的内容等；删除针对性不强、对中等卫生学校不适用的内容等。

本次修订由主编负责。因为时间紧，改动范围不大，部分教材未能邀请第一版全体编审者参与工作，特此说明。

卫生部教材办公室

1993年6月

## 第二版前言

本书是根据1992年11月卫生部教育司召开的“全国中等卫生学校教材修订工作会议”精神，对1986年版的《中药化学》作的修订本。

本书基本保持原教材编写体系与章节不变，修订的内容有以下几方面：①纠正了原教材中个别错误或不恰当的叙述、构图和计量单位；②精简了“有机酸”、“氨基酸、蛋白质和酶”、“中药有效成分研究的一般途径”等章节的内容，以减少与其他教材不必要的重复或对中等卫生学校不适用部分的内容；③改写了“萜类化合物”、“中药制剂质量控制标准”的理论与实验部分，使之更适合于教学实际；④为了加强学生实际操作能力，增加了部分实验内容。

参加本书修订的有湖南衡阳市卫生学校张继杰、湖南医药专科学校唐得时、山东省卫生学校臧溪、浙江省卫生学校张若芳，全部文稿经主编统一整理、校对。原第一版教材编写人，湖南医药专科学校翁发旺因病未能参加此次修订，对于他为本书所付出的辛勤劳动，谨表示衷心的感谢。同时也感谢湖南省卫生厅科教处对本教材大力支持。

由于这是一次过渡性的小修订，时间紧迫，不可能作较大的变动，加之编者水平有限，新增改的内容仍会有不当之处，原有内容也或有可斟酌之处，恳请各兄弟学校在使用本书过程中，不吝指正。

张继杰

1993年9月

## 编写说明

本教材是根据中华人民共和国卫生部（82）卫教字第68号文件颁发的《中等卫生学校药剂士专业教学计划》的规定，定名为《中药化学》。由卫生部委托湖南省卫生学校（现改为湖南省卫生职工医学院）唐得时主编；浙江省卫生学校张若芳同志、山东省济南卫生学校臧滨同志、湖南省卫生学校翁发旺同志等参加协编；湖南省中医药研究院刘立群研究员担任主审，在广泛征求全国各兄弟卫校意见的基础上，将原由南京药学院刘成基同志主编，丁林生同志和本教材现在的编者参编的1980年版全国中等卫校药剂士专业试用教材《中草药化学》进行增补并作了较多的修改而成。

全书内容分为三篇，第一篇总论共三章，主要介绍学习中药化学的意义和目的、中药发展近况、中药化学成分提取分离的基本方法和技术以及层析法等；第二篇各论共十一章，分别介绍各类化学成分的结构、性质、检识反应、提取分离、层析检识以及提取分离实例等；第三篇共二章，分别讨论中药化学成分研究的一般途径和中药化学成分与中药制剂制备、质量控制、稳定性之间的关系。书中各章节后附有复习思考题；书后附有教学大纲、实验指导和附录等。并结合中药新分离、鉴定技术的发展，简要地介绍了液滴逆流分配法、干柱层析法、低压柱层析法、高效液相层析法等。本书所涉及的中药，为国内常见的植物性中药，但也包括少量世界著名的植物药如颠茄、三尖杉、洋地黄等。

为了使本书内容更符合中等卫校的教学实际，编者曾邀请山东省莱阳卫生学校高琴章、江西省卫生学校楼松青、安徽省芜湖中医学校沈漪涟、长春市卫生学校徐世忱、贵阳市卫生学校田利孝、湖北省黄石卫生学校吴盛堂、湖南省衡阳地区卫生学校张继杰，北京市卫生学校何大林等八位从事中草药化学教学多年的老师参加定稿讨论，承蒙他们以认真负责的精神，对本书初稿提出许多宝贵意见。本书初稿曾送南京药学院中草药化学教研组赵守训教授审阅，承蒙他在百忙中对初稿内容给予许多指正。湖南省卫生职工医学院林作华、林安第二同志为本书绘制插图和化学成分结构式等，在此一并致以衷心的感谢。

由于编者水平所限，书中难免有许多缺点和错误之处，诚恳希望各兄弟卫校在使用本书过程中，及时提出批评意见，以便再版时修订改进。

唐得时  
一九八六年三月

# 目 录

## 第一篇 总 论

<b>第一章 概论</b> .....	1
第一节 学习中药化学的意义和目的 .....	1
第二节 中药化学发展概况 .....	3
第三节 中药有效成分的概念及化学成分的主要类型 .....	4
<b>第二章 中药化学成分提取、分离的基本方法和技术</b> .....	7
第一节 中药化学成分一般提取法 .....	7
一、水提取法 .....	7
二、有机溶剂提取法 .....	8
三、其它提取法 .....	11
第二节 中药化学成分的分离和纯化 .....	12
一、液-液萃取法 .....	12
二、沉淀法 .....	16
三、盐析法 .....	18
四、透析法 .....	18
五、吸附法 .....	18
六、结晶、重结晶和分步结晶法 .....	20
<b>第三章 层析分离法</b> .....	23
第一节 概述 .....	23
第二节 柱层析法 .....	23
一、液-固吸附柱层析 .....	23
二、液-液分配柱层析 .....	27
三、干柱层析 .....	30
第三节 薄层层析 .....	33
一、吸附薄层层析 .....	33
二、制备性薄层层析 .....	37
第四节 纸层析 .....	38
一、纸层析的一般原理 .....	38
二、化合物的分子结构与其R <sub>f</sub> 值的关系 .....	38
三、操作注意事项 .....	40
第五节 聚酰胺层析 .....	41
一、基本原理 .....	41
二、实验技术 .....	43
第六节 离子交换柱层析法 .....	44
一、分离原理 .....	44
二、离子交换树脂的选择 .....	44

三、溶剂的选择 .....	44
四、实验技术 .....	45
五、离子交换层析法在中药成分分离方面的应用 .....	45
第七节 凝胶层析法 .....	46
一、葡聚糖凝胶的结构及型号 .....	47
二、葡聚糖凝胶层析的分离原理 .....	47
三、实验技术 .....	47
第八节 其它层析法 .....	49
一、气相层析 .....	49
二、高效液相层析 .....	50
三、低压柱层析 .....	50

## 第二篇 各 论

第一章 生物碱 .....	52
第一节 概述 .....	52
第二节 生物碱的结构类型 .....	53
一、有机胺类 .....	53
二、吡咯啶衍生物类 .....	53
三、吡啶衍生物类 .....	54
四、颠茄烷衍生物类 .....	55
五、喹啉衍生物类 .....	56
六、异喹啉衍生物类 .....	56
七、吲哚衍生物类 .....	58
八、萜类衍生物类 .....	59
九、甾体衍生物类 .....	59
十、其它 .....	60
第三节 生物碱的一般性质和检识反应 .....	62
一、一般性质 .....	62
二、检识反应 .....	67
第四节 生物碱的提取 .....	68
一、酸水提取法 .....	68
二、亲水性溶剂提取法 .....	70
三、亲脂性溶剂提取法 .....	70
四、其它提取法 .....	70
第五节 生物碱的纯化和分离 .....	71
一、生物碱的纯化 .....	71
二、总碱的分离 .....	71
第六节 生物碱的薄层、纸层析检识法 .....	73
一、薄层层析检识法 .....	73
二、纸层析检识法 .....	73
第七节 生物碱实例 .....	74

一、麻黄生物碱类 .....	74
二、颠茄生物碱类 .....	78
三、三颗针生物碱类 .....	84
四、粉防己生物碱类 .....	89
五、苦参生物碱类 .....	92
六、喜树生物碱类 .....	95
<b>第二章 糖和甙类 .....</b>	<b>99</b>
<b>第一节 糖类 .....</b>	<b>99</b>
一、糖的结构类型 .....	99
二、糖的一般性质和检识反应 .....	103
三、糖的提取与分离 .....	105
四、糖的薄层、纸层析检识法 .....	107
五、多糖的提取分离实例 .....	108
<b>第二节 甙类 .....</b>	<b>109</b>
一、甙的结构类型 .....	110
二、甙类的一般性质和检识反应 .....	114
三、甙类的提取 .....	115
<b>第三章 黄酮类化合物 .....</b>	<b>116</b>
<b>第一节 概述 .....</b>	<b>116</b>
<b>第二节 黄酮类化合物的结构类型 .....</b>	<b>116</b>
一、黄酮类和黄酮醇类 .....	116
二、二氢黄酮类和二氢黄酮醇类 .....	117
三、查耳酮类 .....	118
四、双黄酮类 .....	119
五、异黄酮类 .....	119
六、其它黄酮类 .....	120
<b>第三节 黄酮类化合物的一般性质和检识反应 .....</b>	<b>122</b>
一、一般性质 .....	122
二、检识反应 .....	124
<b>第四节 黄酮类化合物的提取和分离 .....</b>	<b>126</b>
一、提取 .....	126
二、分离 .....	127
<b>第五节 黄酮类化合物的薄层、纸层析检识法 .....</b>	<b>129</b>
一、薄层层析检识法 .....	129
二、纸层析检识法 .....	130
<b>第六节 黄酮类化合物及其甙的提取分离实例 .....</b>	<b>131</b>
一、槐花米中芸香甙的提取 .....	131
二、黄芩中黄芩甙的提取 .....	133
三、补骨脂中补骨脂黄酮类的提取 .....	134
<b>第四章 醌类和蒽醌类 .....</b>	<b>137</b>
<b>第一节 醌类 .....</b>	<b>137</b>

一、概述.....	137
二、醌类结构类型.....	137
三、醌类的一般性质和检识反应.....	139
四、醌类的提取分离实例.....	140
<b>第二节 葵醌类.....</b>	<b>141</b>
一、概述.....	141
二、葵醌类的结构类型.....	141
三、葵醌类一般性质和检识反应.....	143
四、葵醌类及其甙的提取分离.....	146
五、葵醌类及其甙的薄层、纸层析检识法.....	147
六、葵醌类及其甙的提取分离实例.....	148
<b>第五章 香豆素类.....</b>	<b>152</b>
<b>第一节 概述.....</b>	<b>152</b>
<b>第二节 香豆素的结构类型.....</b>	<b>152</b>
一、简单香豆素类.....	152
二、呋喃香豆素类.....	153
三、吡喃香豆素类.....	153
四、其它香豆素类.....	154
<b>第三节 香豆素类化合物的一般性质和检识反应.....</b>	<b>155</b>
一、香豆素类化合物的一般性质.....	155
二、香豆素类化合物的检识反应.....	156
<b>第四节 香豆素类及其甙的提取和分离.....</b>	<b>157</b>
<b>第五节 香豆素类及其甙的薄层、纸层析检识法.....</b>	<b>157</b>
一、薄层层析检识法.....	157
二、纸层析检识法.....	158
<b>第六节 香豆素类的提取分离实例.....</b>	<b>158</b>
一、秦皮中香豆素的提取分离.....	158
二、祖师麻中祖师麻甲素的提取分离.....	159
三、补骨脂中补骨脂素和异补骨脂素的提取分离.....	160
<b>第六章 蒽类和挥发油.....</b>	<b>162</b>
<b>第一节 蒽的含义和分类.....</b>	<b>162</b>
<b>第二节 单蒽类.....</b>	<b>163</b>
一、单蒽的概述.....	163
二、单蒽的分类和代表物.....	163
三、环烯醚萜衍生物.....	165
<b>第三节 倍半蒽类化合物.....</b>	<b>167</b>
一、倍半蒽的概述和分类.....	167
二、倍半蒽类化合物实例.....	168
<b>第四节 二蒽类.....</b>	<b>171</b>
一、概述与分类.....	171
二、二蒽类化合物实例.....	172

<b>第五节 挥发油</b>	175
一、概述	175
二、挥发油的化学组成	176
三、挥发油的一般性质和检识反应	177
四、挥发油的提取	183
五、挥发油中各成分的初步分离	184
六、挥发油的提取分离实例	188
<b>第七章 强心甙</b>	191
第一节 概述	191
第二节 强心甙的结构类型	191
一、强心甙元	191
二、强心甙的糖	193
三、甙元和糖连接方式	193
第三节 强心甙的一般性质和检识反应	195
一、强心甙的一般性质	195
二、强心甙的检识反应	197
第四节 强心甙的提取和分离	199
一、原生甙的提取	199
二、次生甙的提取	200
三、强心甙的分离和纯化	200
第五节 强心甙的提取分离实例	201
<b>第八章 皂甙</b>	204
第一节 概述	204
第二节 皂甙的结构类型	204
一、甾体皂甙	204
二、三萜皂甙	207
第三节 皂甙的一般性质和检识反应	209
一、皂甙的一般性质	209
二、皂甙的检识反应	210
第四节 皂甙的提取和分离	211
一、皂甙的提取	211
二、皂甙的分离与精制	211
三、皂甙元的提取	212
第五节 皂甙的薄层、纸层析检识法	212
一、皂甙的薄层层析检识	212
二、皂甙的纸层析检识	213
第六节 皂甙提取分离实例	214
一、薯蓣中薯蓣皂甙和薯蓣皂甙元的提取	214
二、白头翁中白头翁皂甙的提取	215
<b>第九章 氨基酸、蛋白质和酶</b>	217
第一节 氨基酸	217

一、概述	217
二、氨基酸的分类	217
三、氨基酸一般性质和检识反应	218
四、氨基酸的提取和分离	220
五、氨基酸的薄层、纸层析检识法	222
六、氨基酸的提取分离实例	223
第二节 蛋白质和酶	224
一、概述	224
二、一般性质和检识反应	224
三、蛋白质的提取分离	226
<b>第十章 有机酸</b>	<b>228</b>
第一节 概述	228
第二节 有机酸的结构类型	228
第三节 有机酸的一般性质	229
第四节 有机酸的提取和分离	230
第五节 有机酸的薄层、纸层析检识法	231
第六节 有机酸的提取分离实例	232
<b>第十一章 其它成分</b>	<b>235</b>
第一节 鞣质	235
一、概述	235
二、鞣质的分类	235
三、鞣质的一般性质和检识反应	239
四、鞣质的提取、分离及提取实例	240
第二节 油脂和蜡	241
一、概述	241
二、油脂和蜡的一般性质	242
三、油脂和蜡的除去方法	242
第三节 树脂	243
一、概述	243
二、树脂的一般性质	244
三、树脂的除去方法	244
第四节 色素	245
一、概述	245
二、色素的一般性质	246
三、色素的除去方法	246

### 第三篇 中药有效成分的研究与中药制剂

<b>第一章 中药有效成分研究的一般途径</b>	<b>248</b>
第一节 概述	248
一、调查情况	248
二、动物实验	249

三、化学分析	249
第二节 中药化学成分预试验	250
一、预试验供试液的制备	252
二、各类成分的检查	252
三、层析预试法	258
第三节 中药化学成分的分离	261
一、常用的分离方法	261
二、分离实例	263
第四节 中药化学成分鉴定简介	266
一、物理常数测定	266
二、分子式测定	267
三、化合物结构式的确定	267
四、几种光谱分析法	268
<b>第二章 中药化学成分与中药制剂</b>	<b>279</b>
第一节 概论	279
第二节 中药化学成分与中药制剂生产工艺	279
一、中药化学成分在处理和提取分离过程中的变化	279
二、中药化学成分在药材煎煮过程中的变化	281
三、中药化学成分在汤液浓缩过程中的变化	284
第三节 中药化学成分与中药制剂的稳定性	285
一、氧化作用	285
二、水解作用	285
三、聚合（或缩合）作用	287
四、变旋作用	287
五、溶解度变化	288
六、霉变	288
第四节 中药化学成分与中药制剂的质量控制标准	288

### 实验 指 导

<b>中药化学实验须知</b>	<b>292</b>
实验一 薄层层析测定氧化铝的活性	293
实验二 麻黄中麻黄碱的提取、分离与检识	296
实验三 洋金花中东莨菪碱的提取、分离和检识	298
实验四 三棵针中小檗碱的提取、分离和检识	301
实验五 粉防己中粉防己碱和防己诺林碱的提取、分离和检识	304
实验六 槐米中芸香甙的提取、精制和检识	306
实验七 黄芩中黄芩甙的提取、精制和检识	309
实验八 虎杖中大黄素的提取、分离和检识	311
实验九 薯蓣中薯蓣皂甙元的提取、精制和检识	313
实验十 挥发油的提取和各类成分的检识	315
实验十一 青蒿中青蒿素的提取、分离和检识	319

实验十二 穿心莲中穿心莲内酯的提取、分离和检识	321
实验十三 中药化学成分的识别反应	323
实验十四 中药化学成分预试法	328
实验十五 中药制剂的定性鉴别与质量检查	332
附录	337
附录一 溶剂、取代基习用写法对照表	337
附录二 国产层析滤纸的性能与规格	337
附录三 常用检识试剂的配制及使用方法	337
附录四 常用有机溶剂的精制法	343
附录五 常用溶剂的物理常数	345
附录六 常用大孔吸附树脂性能表	346
附录七 国产主要离子交换树脂性能表	347

# 第一篇 总 论

## 第一章 概 论

### 第一节 学习中药化学的意义和目的

中药化学是一门应用现代化学理论和方法研究中药有效成分的学科。其内容主要是研究单味中药有效成分的提取、分离、理化性质、检识、结构测定、结构改造以及中药化学成分与中药制剂的关系等。

研究中药有效成分，具体说来，有以下几方面的意义。

#### (一) 为合理采集、妥善贮藏提供科学根据

中药常因采集季节和药用部位不同，其有效成分的存在和含量差异很大。当我们掌握原植物在生长过程中各部位有效成分的变化规律时，就能在最适宜的季节采集其有效成分含量最高的部位。例如麻黄的有效成分—麻黄碱，主要存在于其茎的髓部，以秋季含量最高（可达1.3%），因此，应在8～10月采集其茎，才能保证药材质量；青蒿素是青蒿抗疟的有效成分，测定各地产的青蒿中青蒿素的含量高峰，均在7月中旬至8月中旬花前盛叶期，所以采集青蒿以花前盛叶期为最好。

中药在贮藏过程中，受温度、日光、空气、蛀虫等影响，常会破坏其有效成分，使其部分或全部失效。因此，必须了解中药所含的成分，才能根据其理化特性，加以妥善贮藏。例如含有脂肪油、挥发油类的药材，在较高温度下，其油分容易向外溢出，并氧化变质。所以应贮藏于阴凉处。

#### (二) 为合理炮制、改进剂型提供理论基础

中药的炮制对中药饮片质量的影响很大，我们的祖先早就认识到通过饮片炮制手段，可以促使中药药性、气味发生各式各样的变化，从而提高其药效或降低烈性、减少毒性等。因此研究饮片炮制前后化学成分的物理化学变化，就有助于阐明炮制原理，提出合理的炮制方法和制订统一的炮制标准等。例如醋制元胡的“增效”原理，是使其镇痛有效成分生物碱成盐而易煎出；附子炮制“制毒”原理，是使其有毒成分乌头碱类减少，并水解成毒性仅为1/2000的乌头原碱；国内某些单位，在探知乌头类炮制“制毒”原理的基础上，将乌头类中药传统“水漂后辅料煮制”的炮制老工艺改为“水蒸”的新工艺，并提出新制品有毒成分乌头碱的限量检查，以控制其质量，即避免老工艺在泡、浸、漂过程中总生物碱的损失，又收到缩短工艺过程和制品安全、有效的效果。

传统中药制剂是我国历代药工长期生产实践的结晶，并在人民的医疗保健事业中发挥了巨大的作用，但由于历史条件的限制，尚存在某些不足之处。如成分复杂，药材产地和制法不同，其成分的差异很大，难以客观地控制有效成分的含量，致使某些制剂疗效不够稳定。由于传统剂型以口服和外用为主，一定程度上影响药物的吸收速度，显效较慢。因此，有必要在研究中药有效成分的基础上，创制既保持传统特点，又优于原有剂型的新剂型系列。如将汤剂改为颗粒速溶冲剂；将丸、散剂改为速效微型胶囊；以及

将中药有效成分（或有效部位）提取、分离出来，再制成近代剂型等等。

### （三）为真伪鉴别、质量控制提供客观指标

中药的真伪鉴别和质量控制是保证中药质量、充分发挥其药效的关键。因此，单凭传统经验进行识别和质控是很不够的。当我们探知中药有效成分的理化性质后，就可以对其提出更可靠的客观指标，并借以建立完善的药材（或制剂）标准。例如我国1990年版药典规定洋金花含生物碱以东莨菪碱计算，不得少于0.3%，这比以形态为主的质控标准更科学和客观。

### （四）为扩大资源、寻找新药源提供有效途径

当从某一中药分离出有效成分后，就可以根据此成分的理化特性，从亲缘科属植物，甚至从其它科属植物寻找同一有效成分，从而扩大了中药的资源。例如从毛茛科植物黄连中提出小檗碱后，根据小檗碱的理化特性，又发现小檗科、防己科、芸香科等许多植物中含有小檗碱，从而为提取小檗碱的原料开辟了广阔的资源。如果有些中药资源较缺或有效成分含量极微、或药理作用不太明显以及副作用较大，当找出其有效成分，弄清其化学结构后，就可以探索它们结构与作用的关系，改造其结构，或用化学合成法进行生产，或设计新的合成药以满足医疗需要。例如从秋水仙碱结构改造所得的秋水仙酰胺，抗癌效果不变，而毒性比秋水仙碱低10~20倍。从我国首创的青蒿素结构改造成的蒿甲醚、青蒿酯钠，其抗疟作用比青蒿素更强；可的松类皮质激素及一些甾体避孕药需要量大，可以利用天然资源薯蓣皂甙元进行半合成；古柯叶中有效成分古柯碱虽有很强的麻醉作用，但毒性较大、易于成瘾，为此，人们通过研究，设计合成了普鲁卡因等一系列结构较简单、毒性较低的局部麻醉药物。另外，我国首创的山莨菪碱（代号：654-2）也是先从中药唐古特山莨菪中分离出来并通过合成的抗中毒性休克的新药。

### （五）为探索中药治病原理创造有利条件

用现代科学方法探索中药治病的原理是当前医药工作者一项重大的任务。如果弄清了某种中药的有效成分，就有利于进一步探讨其作用机制，化学结构与疗效、毒性之间的关系，以及其在人体内的吸收、分布、代谢等过程，从而可达到以现代药理学表述中药功效的目的。例如从人参、黄芪、刺五加等扶正固本药物中提取、分离出多糖成分，通过药理试验证明其对机体免疫功能有促进作用后，就可初步认为中医的“扶正固本”治则可能与增强机体的免疫功能有关。又如大黄具有泻下、抗菌、消炎、抗肝炎等作用，经研究发现其主要起泻下作用的成分是番泻甙；大黄的消炎成分是原花青素类化合物，此化合物同时具有抗过敏作用；大黄中含有芦荟大黄素能抑制各种微生物的蛋白质的合成，故常用于肝、胆疾病的治疗。

从上述研究中药有效成分的意义看来，我们学习中药化学的最终目的，是为了继承发扬祖国医药学遗产，促进中医药现代化。

根据中等卫生学校药剂士专业培养目标，学生学习本课程的要求是：掌握中药有效成分主要类型的结构特征、主要理化性质、提取、分离、检识以及中药制剂的质量分析等基础理论、基本知识和实际技能，以便为将来从事中药制剂和有关初步科学的研究工作奠定基础。在学习过程中，可以通过各类成分的化学结构特征，分析认识其主要理化性质，并以此理解提取、分离、检识的原理，找出它们之间的内在联系和一般规律性。

目前，在人类“回归大自然”的新潮流中，中药及天然药物不仅是作为医疗、保健

药品，而且已延伸到食品、化妆品的领域，毫无疑问，中药化学在其中将起着重要的作用。作为药学专业的学生，应该努力学好这门重要的学科，为祖国以至全人类的医疗保健事业和美好幸福的生活贡献自己的全部才华。

## 第二节 中药化学发展概况

从天然药物中提取活性成分开始于1806年德国药师 Serturner从阿片中分离出吗啡(morphine)。此后不断报道从中药及天然药物中发现有生理活性的各种化合物，其中成为有代表性药物如吐根碱(emetine)、马钱子碱(strychnine)、奎宁(quinine)、黄连素(berberine)、阿托品(atropine)、可待因(codeine)、可卡因(cocaine)、麻黄碱(ephedrine)、芦丁(rutin)、洋地黄毒甙(digitoxin)、山梗菜碱(lobeline)、东莨菪碱(scopolamine)等，仍是目前常用的药物。本世纪50年代中，先后从萝芙木中发现具有降低血压活性的利血平和从长春花中发现抗癌成分长春碱以来，从中药及天然药物中寻找新的活性成分的研究工作，在国际上普遍引起重视，40多年来，由于各种分离和鉴定方法日益趋于快速、微量，使中药及天然药物活性成分的研究有很大的发展。现就几个主要方面的情况作一简略介绍：

### (一) 在发现生物碱的数目方面

1952年以前的100多年内仅共发现生物碱950种；1952～1962年10年中却发现了1107种；1962～1972年10年中则发现了3443种，约3倍于50年代所发现的生物碱。据Farnsworth仅对1976年一年所发表的不完全的文献统计：在高等植物和低等植物（包括羊齿植物、苔藓植物、地衣、菌类和海洋植物）中共发现有机化合物6364种（包括已知化合物），其中具有一种或数种生理活性的成分有325种，生物碱占73种，为数最多。据估计目前已发现生物碱大约有6000多种。

### (二) 在抗癌药物筛选工作方面

美国国立癌症研究所(NCI)从本世纪50年代开始至1980年已过筛了3万多种植物的抗肿瘤活性，并总结出最有希望的抗肿瘤活性成分是大环化合物、生物碱、二萜、木脂素和苦木素。美国、德国、俄罗斯等对担子菌类植物进行了大量的筛选工作，发现了银耳、香菇、茯苓、云芝等中所含的多糖对肿瘤有抑制作用。日本从印度苦楝(Melia azadirachta)树皮中分离出多糖类化合物Gla，从茜草(Rubia cordiflora 及 R. akane)根中分离出环状六肽类化合物RA-V和RA-VII，对多种肿瘤均显示较强的抑制作用，是三个很有希望的抗癌药。

### (三) 在研究有效成分方面

从中药及天然药中寻找有效成分的研究，近十几年来一直受到国内外医药界的重视，并取得很大的进展，现据有关文献作一简单介绍：①从茵陈蒿(Atemisia Capillaris Thunb)中分出的茵陈色原酮(Capillarisin)具有较强的利胆作用。②从麻黄根中分得两种大环生物碱——麻黄根碱A和B(Ephedradin A et B)，A具有显著的降血压作用。③从紫杉科植物北美短叶红豆杉(Taxus brevifolia Nutt)树皮中分出的紫杉醇(Taxol)，对晚期卵巢癌取得可喜的效果。④从苦丁茶(Ilex Cornuta Lindl)分出的腺苷(Adenosine)、3,4-二咖啡酰鸡核酸和3,5-二咖啡酰鸡核酸，均有抗血小板聚集和增加冠脉血流量的作用。⑤从生蒜(Allium sativum L)分出的Agoene(4,5,9-三

硫代十二-1,6,11—三烯-9-氧化物)具有显著的抗血栓形成活性。⑥从菊科植物短萼飞蓬(灯盏细, 灯盏花*Erigeron breviscarpus* (vant) Hard-Mazz)分出的灯盏花甲素和乙素的混合物, 为我国创制的治疗脑血管疾病的黄酮类新药, 现已用于临床治疗脑血管疾病所致的瘫痪, 疗效较好。⑦我国继中期妊娠引产药天花粉蛋白质之后, 又从芫花(*Daphne genkwa* Sieb. et Zucc)根中分出具有中期引产活性的芫花酯甲、乙、丙和丁4个二萜类化合物, 其中以乙酯作用最强, 已制成芫花乙酯注射剂, 用于中、晚期妊娠引产。⑧从绞股蓝(*Gynostemma pentaphyllum*)提出主要成分皂甙的化学结构与人参皂甙基本相似(已鉴定其中6种为人参皂甙R<sub>b1</sub>、R<sub>b3</sub>、R<sub>d</sub>、F<sub>2</sub>、K和R<sub>g3</sub>), 药理试验亦证明具有类似人参皂甙的活性。⑨景天科红景天属植物红景天(*Rhodiola rosea* L.)是一种适应原样药物, 类似人参、刺五加的滋补强壮作用, 却无人参兴奋作用过强和刺五加引起便秘的副作用, 具有抗缺氧、抗寒冷、抗辐射作用, 有提高工作效率, 延缓机体衰老防治老年疾病的重要功能。红景天含有多种化学成分, 一般用Rosavidine(属桂皮醇甙)和红景天甙(Salidroside对羟基苯乙醇葡萄糖甙)的含量作为红景天质量控制标准。红景天属植物是寻找和研究抗衰老药物的重要对象, 我国资源丰富, 开发这一药物, 对医药工业和食品工业都有十分重大的意义。

#### (四) 在化学成分分离、分析和结构测定技术方面

应用现代科学技术进行中药化学成分分离、分析和结构测定的工作, 近10多年来有了较大的进展。如气相色谱、高效液相色谱、液滴逆流层析、双波长薄层扫描、紫外、红外、质谱、氢磁共振谱、碳磁共振谱、气-质-电子计算机联用。X线衍射等先进手段大大提高了分离、分析和结构测定的能力和速度, 为中药中微量成分的研究开辟了广阔前景。现在不仅对毫克(mg)、微克(μg)级能进行分离鉴定, 而且还能对纳克(ng)和皮克(pg)级的微量成分进行分离和结构测定。

最后, 有必要提到的是: 近年来在研究中药有效成分的同时, 发现有些中药的粗提取物比其中某一种纯品成分的生理活性为好, 副作用也小。如日本佐藤昭彦等在用人子宫颈癌细胞培养筛选中药的抗癌活性时, 发现有些具抗癌活性的提取物, 愈纯化活性愈高, 同时毒性也愈大; 另一类, 其提取物的活性很强, 无毒性, 但愈纯化其活性则愈低。又如萝芙木根的浸出物长期服用, 没有服利血平所引起的抑郁症等副作用; 萝芙木碱的解痉活性比萝芙木根的作用时间长, 毒性低等等。这些都说明一种生物活性指标, 可能是由多种成分彼此协同作用而达到的。因而中药化学对中药古验方、复方和中药炮制的研究, 对各种成分协同作用机理和炮制原理的探索, 就起着很重要的作用。

### 第三节 中药有效成分的概念及化学成分的主要类型

#### (一) 有效成分的概念

中药的化学成分极为复杂, 往往一种中药中就含有许多的化学成分, 但并不是所有的成分都能起到防治疾病的作用。根据医药工作者长期实践经验和现在的科学认识水平, 通常将中药所含的化学成分分为有效成分和无效成分两类。所谓有效成分一般是指具有生理活性、能用分子式和结构式表示并具有一定的物理常数(如熔点、沸点、旋光度、溶解度等)的单体化合物; 如果尚未提纯成为单体化合物的, 一般称为有效部分或有效部位; 而与有效成分共存的其它化学成分, 则一般视为无效成分。有效成分和无效成分