

卫生部规划教材

高等医药院校教材

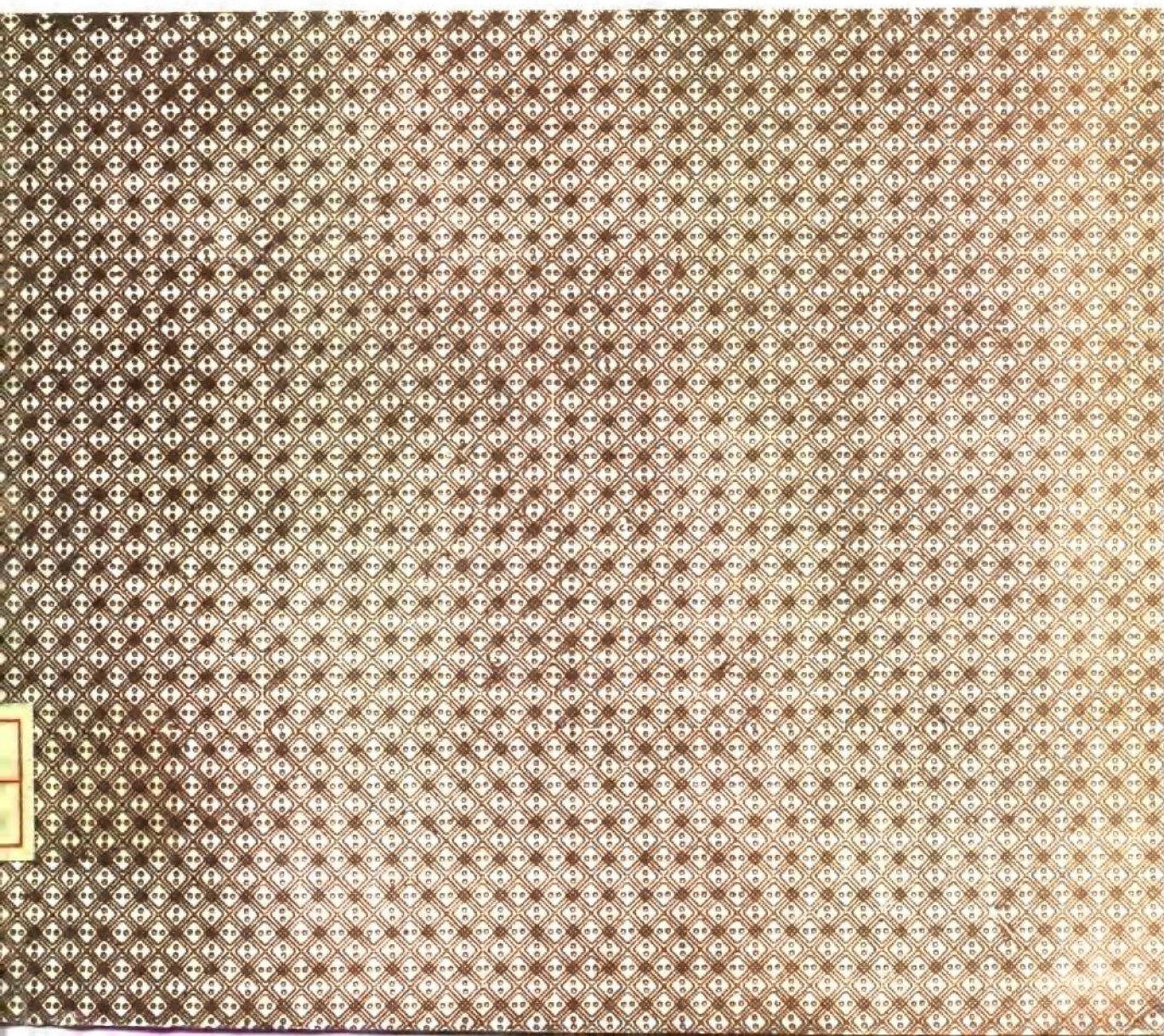
供药学类专业用

天然药物化学

第 二 版

姚 新 生 主 编

人 民 卫 生 出 版 社



高等医药院校教材

(供药类专业用)

天然药物化学

(第二版)

姚新生 主编

编 委

赵守训 (中国药科大学 教授)
潘德济 (上海医科大学 教授)
张如意 (北京医科大学 教授)
王明时 (中国药科大学 教授)
陈英杰 (沈阳药学院 教授)
王锋鹏 (华西医科大学 教授)
姚新生 (沈阳药学院 教授)

人民卫生出版社

(京)新登字081号

图书在版编目 (CIP) 数据

天然药物化学/姚新生主编. —北京: 人民卫生出版社, 1994

ISBN 7-117-00063-5

I. 天…

II. 姚…

III. 药物化学

IV. R914

天然药物化学

第 二 版

姚 新 生 主 编

人 民 卫 生 出 版 社 出 版

(北京市崇文区天坛西里 10 号)

北 京 市 卫 顺 印 刷 厂 印 刷

新 华 书 店 北 京 发 行 所 发 行

787×1092毫米 16开本 33¼印张 4插页 761千字

1988年5月第1版 1995年4月第2版第9次印刷

印数: 42 346—46 445

ISBN 7-117-00063-5/R·64 定价: 19.80元

著作权所有, 请勿擅自用本书制作各类出版物, 违者必究。

说 明

这套“普通高等教育医药类规划教材”是卫生部组织编写的规划教材。初版始于1978年，迄1983年出齐。1985年至1989年进行了第二轮修订。这次第三轮修订工作是1990年开始的。由于出版单位和课程设置的变动，故新版教材的版次略有不同，多数为第三版，少数为二版和一版，请读者注意。本教材紧密结合药学专业培养目标要求，着重基础理论基本知识，亦反映本学科的新发展。本教材可供药学及相关专业选用。全套教材现为19种，均经卫生部聘任的全国药学专业教材评审委员会审定。教材名录如下：

- | | | |
|--------------------|-----|----|
| 1. 《高等数学》（第二版） | 方积乾 | 主编 |
| 2. 《医药数理统计方法》（第二版） | 方积乾 | 主编 |
| 3. 《物理学》（第二版） | 王鸿儒 | 主编 |
| 4. 《物理化学》（第三版） | 鲁纯素 | 主编 |
| 5. 《无机化学》（第二版） | 王 夔 | 主编 |
| 6. 《分析化学》（第三版） | 孙毓庆 | 主编 |
| 7. 《有机化学》（第三版） | 廖清江 | 主编 |
| 8. 《人体解剖生理学》（第三版） | 钱梓文 | 主编 |
| 9. 《微生物学》（第三版） | 王道若 | 主编 |
| 10. 《生物化学》（第三版） | 陈琼华 | 主编 |
| 11. 《药理学》（第三版） | 竺心影 | 主编 |
| 12. 《药物分析》（第三版） | 安登魁 | 主编 |
| 13. 《药用植物学》（第二版） | 沈联德 | 主编 |
| 14. 《生药学》（第二版） | 徐国钧 | 主编 |
| 15. 《药物化学》（第三版） | 李正化 | 主编 |
| 16. 《天然药物化学》（第二版） | 姚新生 | 主编 |
| 17. 《药剂学》（第三版） | 奚念朱 | 主编 |
| 18. 《中医学基础》（第三版） | 李向中 | 主编 |
| 19. 《药事管理学》 | 吴 蓬 | 主编 |

以上教材均由人民卫生出版社出版，新华书店总店科技发行所发行。

全国药学专业教材评审委员会

主任委员：	彭司勋			
副主任委员：	郑 虎			
委 员：	王 夔	安登魁	胡 晋	
	奚念朱	楼之岑	龙 燭	
秘 书：	翁玲玲			

编写说明

本书是由卫生部、国家医药管理局领导组织编写的全国高等医药院校药学类专业的教材。

第二版是编者在第一版教材(王宪楷教授主编,人民卫生出版社,1986年)基础上,对本书各章内容均做了重要的修改与调整。总论中增加了植物成分生物合成、提取分离及结构测定方法等内容;各论中除增加鞣质一章外,并将原来的甾类、强心甙类及皂甙类等内容重新调整分为萜类、三萜及其甙类、甾体及其甙类三个章节;增加第十一章“天然药物的开发”等内容,重点介绍中药或天然药物中活性部位及活性成分的研究方法,以适应在我国实行化合物专利、开展新药研究工作的需要。书后附录还列出了目前在国内外作为法定药物应用或具有重要生理活性化合物的名称、来源及生理活性,以利学生重点掌握。另外,各章编排顺序也按认识规律重新作了调整,每章并列出的重要的精选文献,可供读者进一步参考使用。

本教材编写任务由赵守训(中国药科大学)、潘德济(上海第一医科大学)、张如意(北京医科大学)、王明时(中国药科大学)、陈英杰(沈阳药学院)、王锋鹏(华西医科大学)及姚新生(沈阳药学院)等七位教授合作分担,并由姚新生担任主编。参加编写工作的还有胡昌奇副教授。绘图及索引编排工作分别由张生及王喆星同志(沈阳药学院)担任。在修编过程中,各院校有关教师对本书编写工作提出了不少意见与建议。人民卫生出版社孙祖基、匡罗均同志对本书出版工作也给予了通力合作与帮助,在此一并表示衷心的感谢!

因编者水平及能力有限,有不妥及谬误之处,敬请广大读者予以指正。

姚新生

1992年10月1日

目 录

第一章 总 论	1
第一节 绪论	1
第二节 生物合成	8
一、一次代谢及二次代谢	6
二、生物合成假说的提出	7
三、主要的生物合成途径	9
第三节 提取分离方法	19
一、中草药有效成分的提取	20
二、中草药有效成分的分离与精制	20
第四节 结构研究法	40
一、化合物的纯度测定	40
二、结构研究的主要程序	40
三、结构研究中采用的主要方法	41
第二章 糖和甙	63
第一节 单糖的立体结构	63
一、单糖的绝对构型	64
二、单糖的端基差向异构体	64
三、单糖的氧环	64
四、单糖的构象	65
第二节 糖和甙的分类	66
一、单糖	66
二、低聚糖	70
三、多聚糖	71
四、甙类	75
第三节 糖的化学性质	82
一、氧化反应	82
二、糠醛形成反应	84
三、羟基反应	85
四、羰基反应	89
五、硼酸络合反应	89
第四节 甙键的裂解	91
一、酸催化水解反应	91
二、酸催化甲醇解	93
三、乙酰解反应 (Acetolysis)	93
四、碱催化水解和 β -消除反应	94

五、酶催化水解反应	96
六、过碘酸裂解反应	98
七、糖醛酸甙的选择性水解反应	99
第五节 糖的核磁共振性质	100
第六节 糖链结构的测定	105
一、研究糖链结构的顺序	105
二、糖链结构研究实例	108
第七节 糖和甙的提取分离	112
一、铅盐沉淀法	113
二、铜盐沉淀法	113
三、活性炭柱层析	113
四、离子交换层析	113
五、凝胶过滤法 (Gelfiltration)	114
六、季铵氢氧化物沉淀法	114
七、分级沉淀或分级溶解法	114
八、蛋白质除去法	115
九、糖的提取分离实例	115
第三章 苯丙素类	117
第一节 香豆素	117
一、香豆素的结构类型	118
二、香豆素的化学性质	124
三、香豆素的波谱和其他物理性质	133
四、香豆素的结构研究实例	137
五、香豆素的提取分离	139
六、香豆素的生理活性	141
第二节 木脂素	143
一、木脂素的结构类型及其生源	143
二、木脂素的理化性质	154
三、木脂素的结构鉴定	156
四、木脂素的提取分离	162
五、木脂素的生理活性	163
第四章 醌类化合物	166
第一节 醌类化合物的结构类型	166
一、苯醌类	166
二、萘醌类	167
三、菲醌类	168
四、蒽醌类	169
第二节 醌类化合物的理化性质与呈色反应	173
一、物理性质	173
二、化学性质与呈色反应	174

第三节 醌类化合物的提取分离	177
一、游离醌类的提取方法	177
二、游离羟基蒽醌的分离	177
三、游离甙类与游离蒽醌衍生物的分离	177
四、蒽醌甙类的分离	178
第四节 醌类衍生物的结构测定	179
一、衍生物的制备	179
二、醌类化合物的紫外光谱	181
三、醌类化合物的红外光谱	182
四、醌类化合物的 ^1H -NMR谱	183
五、醌类化合物的 ^{13}C -NMR谱	184
六、醌类化合物的MS	186
七、结构鉴定举例	188
第五章 黄酮类化合物	191
第一节 概述	191
一、基本结构和分类	191
二、黄酮类化合物的生理活性	194
第二节 黄酮类化合物的性质与颜色反应	196
一、性状	196
二、溶解度	196
三、酸碱性	197
四、显色反应	198
第三节 黄酮类化合物的提取与分离	201
一、提取	201
二、分离	202
第四节 黄酮类化合物的检识与结构测定	206
一、层析在黄酮类鉴定中的应用	206
二、紫外光及可见光谱在黄酮类鉴定中的应用	207
三、氢核磁共振在黄酮类结构分析中的应用	214
四、碳核磁共振在黄酮类化合物结构鉴定中的应用	222
五、质谱在黄酮类结构测定中的应用	227
六、其他	234
七、结构鉴定实例	236
第六章 鞣质	241
第一节 概述	241
第二节 鞣质的化学结构与分类	241
一、可水解鞣质	242
二、缩合鞣质	247
三、新型鞣质	253

第三节 鞣质的生源	253
第四节 鞣质的提取与分离	256
一、样品预试	256
二、提取溶剂的选择	256
三、分离、纯化	258
第五节 鞣质的理化性质和波谱特征	259
一、鞣质的理化性质	259
二、鞣质的波谱特征	260
三、鞣质的重要化学反应	265
第六节 鞣质的生物活性	273
第七章 萜类化合物	276
第一节 概述	276
一、萜的定义和分类	276
二、萜类化合物的异戊二烯定则和生源	277
第二节 单萜类	278
一、单萜的概述	278
二、重要的单萜类化合物	280
三、环烯醚萜类化合物	286
第三节 倍半萜类	291
一、倍半萜的概述	291
二、重要的倍半萜化合物	292
三、愈创木内酯类及萜类	298
四、倍半萜研究实例—青蒿素	300
第四节 挥发油	302
一、挥发油的分布	302
二、挥发油的性质	303
三、挥发油的组成	303
四、挥发油的提取	306
五、挥发油的分离	308
六、挥发油的生物活性和应用	309
七、挥发油研究实例—水泽兰净油	310
第五节 二萜类及二倍半萜类	313
一、二萜的概述	313
二、重要的二萜化合物	318
三、二倍半萜类	323
第八章 三萜及其甙类	324
第一节 概述	324
第二节 四环三萜的结构类型	326
一、羊毛甾烷型	326

二、达玛甾烷型	328
三、原萜烷型	331
四、葫芦烷型	332
五、其他四环三萜类型	334
第三节 五环三萜的结构类型	335
一、齐墩果烷型	338
二、乌苏烷型	341
三、羽扇豆烷型	343
四、何伯烷和异何伯烷型	344
五、其他五环三萜类型	345
第四节 理化性质	346
第五节 化学反应	348
一、3-羟基脱水反应	348
二、双键异构化	349
三、环丙烷环的反应	349
四、氧化	350
五、还原	351
六、甲基位移和骨架重排	351
七、内酯化反应	352
八、脱羧及水解	353
第六节 皂甙甙键的裂解反应	353
一、皂甙解法	353
二、西酯酸酐-醇酐法	354
三、醇酐-吡啶分解法	355
四、土壤微生物培养法	355
五、化学修饰—水解法	356
第七节 波谱特征	356
一、紫外光谱和红外光谱	356
二、质谱	357
三、核磁共振氢谱	359
四、核磁共振碳谱	359
第八节 提取与分离	360
一、三萜化合物的提取与分离	360
二、三萜皂甙的提取与分离	361
三、提取分离实例	362
第九节 结构研究实例	364
第十节 生物活性	369
第九章 甾体及其甾类	373
第一节 概述	373
第二节 C_{21} 甾类化合物	374

第三节 强心甙类	376
一、强心甙的概述	376
二、强心甙的化学结构和实例	377
三、强心甙的理化性质	388
四、强心甙的波谱特征	389
五、强心甙提取分离	397
六、强心甙结构鉴定实例	399
七、强心甙的生理活性	402
第四节 甾体皂甙	404
一、甾体皂甙的概述	404
二、甾体皂甙的化学结构和实例	405
三、甾体皂甙的理化性质	411
四、甾体皂甙元的波谱特征	412
五、甾体皂甙的提取与分离	417
六、甾体皂甙结构鉴定实例	418
第十章 生物碱	420
第一节 概述	420
一、生物碱的定义	420
二、生物碱在植物体中的积累和储藏	421
三、生物碱在植物界的分布	421
四、生物碱的存在形式	422
第二节 生物碱生物合成的基本原理	423
一、环合反应	423
二、C-N键的裂解	427
第三节 生物碱的分类、生源关系及其分布	428
一、来源于鸟氨酸的生物碱	429
二、来源于赖氨酸的生物碱	430
三、来源于邻氨基苯甲酸的生物碱	432
四、来源于苯丙氨酸和酪氨酸的生物碱	432
五、来源于色氨酸的生物碱	436
六、来源于萜类的生物碱	439
七、来源于甾体的生物碱	440
第四节 生物碱的理化性质	441
一、性状	441
二、旋光性	442
三、溶解度	442
四、生物碱的检识	442
五、生物碱的化学性质和反应	443
第五节 生物碱的提取与分离	459
一、总生物碱的提取	459
二、生物碱的分离	460

三、生物碱提取分离的实例	462
第六节 生物碱的结构鉴定与测定	468
一、光谱法在生物碱结构测定中的应用	468
二、生物碱结构测定的实例	478
第七节 生物碱的生理活性	482
第十一章 天然药物的开发	483
一、天然药物的开发程序	483
二、天然活性化合物的分离研究方法	485
三、天然化合物的化学修饰或结构改造	489
附录 药用天然化合物	495
索引	500

第一章 总 论

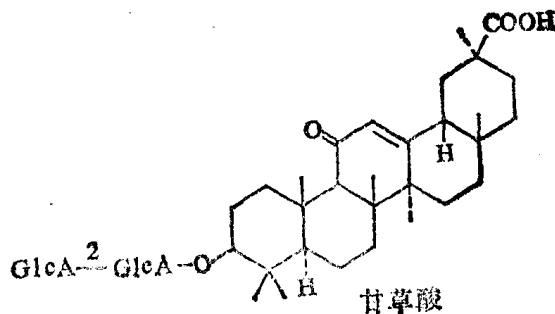
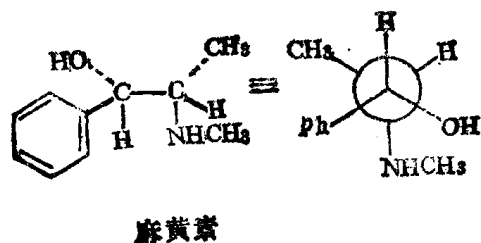
第一节 绪 论

天然药物化学是运用现代科学理论与方法研究天然药物中化学成分的一门学科。其研究内容包括各类天然药物的化学成分（主要是生理活性成分或药效成分）的结构特点、物理化学性质、提取分离方法以及主要类型化学成分的结构鉴定知识等。此外，还将涉及主要类型化学成分的生物合成途径等内容。

天然药物是药物的一个重要组成部分。人类自古以来，在与疾病作斗争过程中，通过以身试药、日积月累，对天然药物的应用累积了丰富的经验。在中国，天然药物又称为中草药，更具有自己的特色，与中医一起构成了中国民族文化的瑰宝，是中华民族五千年来得以繁衍昌盛的一个重要原因，也是全人类的宝贵遗产。

天然药物来自植物、动物、矿物，并以植物来源为主，种类繁多。以中草药为，仅《本草纲目》（明，李时珍）中就记载了1892种。《本草纲目拾遗》（清，赵学敏）又补充了1021种。相信随着科学、技术的进步，医疗实践的发展以及国家、地区、民族间文化交流的扩大，这个数字还会不断变化、发展。例如，近来号称“生命的摇篮”、占地球表面积2/3的海洋中所含生物资源由于科学技术的进步正在不断得到开发，出现了许多可喜的苗头。又如随着生命科学的进步、人体自身机能调节系统的不断阐明，许多内源性生理活性物质也正在不断地被揭露出来。在此基础上人们运用在分子水平上建立起来的新的生物活性测试体系进行广泛的筛选，还将会发现更多、更新的天然药物。

天然药物之所以能够防病治病，其物质基础在于所含的有效成分。然而一种天然药物往往含有结构、性质不尽相同的多种成分。例如中药麻黄（*Ephedra* spp. 的地上全草）中就含有左旋麻黄素（1-ephedrine）等多种生物碱类物质以及挥发油、淀粉、树脂、叶绿素、纤维素、草酸钙等其它成分；中药甘草（*Glycyrrhiza uralensis* 的根及根茎）中则含有甘草酸（glycyrrhizin）等多种皂甙以及黄酮类、淀粉、纤维素、草酸钙等成分。以上两例中，左旋麻黄素具有平喘、解痉作用，甘草酸则具有抗炎、抗过敏、治疗胃溃疡的作用，分别被认为是麻黄及甘草中的代表性有效成分。但淀粉、树脂、叶绿素等则一般认为是无效成分或者杂质。以麻黄及甘草为原料制成的浸膏或制剂，其质

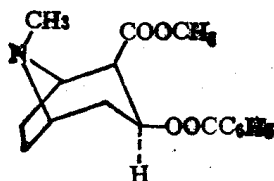


量常分别以左旋麻黄素及甘草酸的含量为基准进行控制。加工生产过程中并注意设法除去那些无用的杂质，以得到富集有效成分的制剂或甚至直接得到这些有效成分的纯品。麻黄素盐酸盐及甘草酸的钠、钾盐及铵盐目前均已作为正式药品收载在许多国家的药典上。

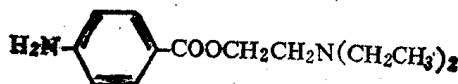
应当强调指出，从中草药及其它天然药物中，真正搞清有效成分的品种是不多的。更多的只是一些生理活性成分，即经过不同程度药效试验或生物活性试验，包括体外 (in vitro) 及体内 (in vivo) 试验，证明对机体具有一定生理活性的成分。但是，它们并不一定是真正代表各该天然药物临床疗效的有效成分。另外，所谓有效成分或生理活性成分与无效成分或非生理活性成分的概念也不能简单地机械地理解。以氨基酸、蛋白质、多糖类成分为例，在多数场合下均视为无效成分，并在加工过程中尽量除去，但在鸢尾菜、天花粉、猪苓等药物中，却分别被证实是各该中药驱虫（鸢尾菜中的氨基酸）、引产（天花粉中的蛋白质）及抗肿瘤（如猪苓中的多糖）的有效成分。

从天然药物中分离所含的有机化学成分，国外文献一般记载^[1,2]，系以瑞典药师、化学家舍勒 (K. W. Scheele, 1742~1786) 1769年将酒石 (酒石酸氢钾) 转化为钙盐，再用硫酸分解制得酒石酸作为开端。后来，舍勒又用类似方法从天然物中得到了苯甲酸 (1775)、乳酸 (1780)、苹果酸 (1785)、没食子酸 (1786) 等有机酸类物质。但其实古代中国早在这之前就有了明确的记载。例如明代李时珍的《医学入门》(1575) 中记载了用发酵法从五倍子中得到没食子酸的过程。书中谓“五倍子粗粉，并矾、曲和匀，如作酒曲样，入瓷器遮不见风，候生白取出”。《本草纲目》卷39中则有“看药上长起长霜，药则已成矣”的记载。这里的“生白”、“长霜”均为没食子酸生成之意，是为世界上最早制得的有机酸，比舍勒的发明早了二百年。又如樟脑的记载在中国最早见于1711年洪遵著的《集验方》一书，后由马可勃罗传至西方。《本草纲目》卷34下并详尽记载了用升华法等制备、纯化樟脑的过程。但欧洲直至18世纪下半叶才提出了樟脑纯品。由此可见，古代中国的医药化学与其它自然科学一样，当时也在世界上居于领先地位，故有“医药化学来源于中国”的高度评价，这是作为后人的我们应当引以自豪的。

本书附录收录了在《中国药典》及地方标准中收载以及在国外作为药物应用的重要天然化合物，可供学习及工作中参考。其中，许多化合物作为药品一直沿用至今，不少化合物在药理教科书上并作为典型的药物加以讨论，有些化合物看来在相当长的一个历



可卡因
(古柯树叶中成分)



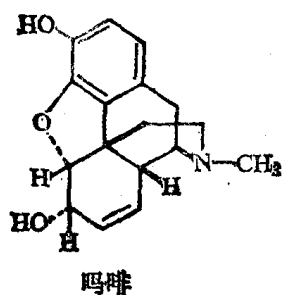
普鲁卡因
(合成品，局麻药)

[1] 宫崎利夫，他。天然物化学。朝仓书店，1937：181

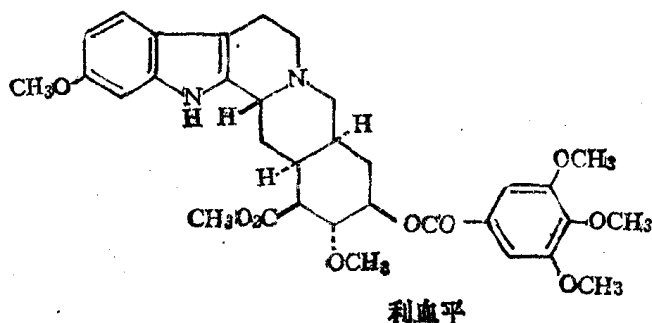
[2] 三桥 博，他。天然物化学，改订第三版，南江堂，1989：4

史时期内还难以用合成药物代替；有些生物活性天然化合物则是现代合成药物的先导化合物。其中，从古柯叶中得到的可卡因 (cocaine) 为先导化合物合成的普鲁卡因 (procaine) 等一系列局麻药可算是这方面工作的一个突出典型。

天然药物化学的发展离不开现代科学技术的进步。过去，一个天然化合物从天然药物中分离、纯化，到确定结构、人工合成需要很长的时间。以吗啡 (morphine) 为例，从1804~1806年开始发现，到1925年提出正确结构，1952年人工全合成，总共花了约150年时间。而利血平 (reserpine) 从发现、确定结构，到人工全合成，只用了几年时



(鸦片成分，止痛)



(蛇木中成分，降压)

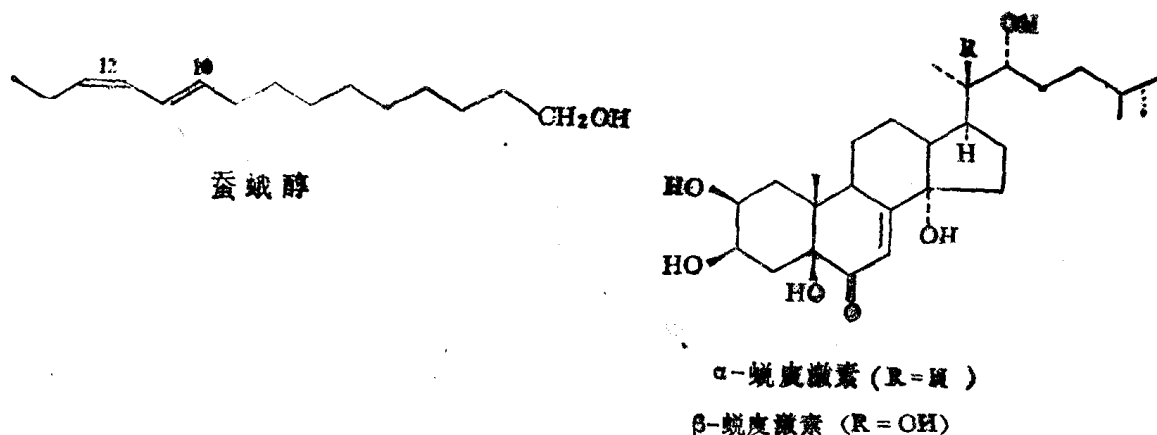
间 (1952~1956)。近30年来，由于各种层离技术及波谱解析技术的进步及广泛应用，天然药物化学的发展取得了更为显著的进步，研究工作的速度大大加快，水平大大提高，研究工作的深度与广度也已今非昔比。许多过去令人望而生畏、不敢涉足的领域，如机体内源性生理活性物质，微量、水溶性、不安定的成分以及大分子物质等都已提到了研究日程。仅以生物碱类成分为例，1952~1962年中发现的新生物碱数目 (1107) 就已超过了在此之前100年中发现的总数 (950)，但1962~1972年的十年中发现的新生物碱数 (3443) 又比前10年超出了三倍之多。目前，生物碱类成分总数已达到1万左右^[3]。现在，人们对于那些常量、易得的成分已不太感兴趣了，转而注意那些微量甚至超微量的活性成分，包括水溶性的、不安定的成分以及生物体内源性生理活性物质，企图从中发现新的化合物或者新的骨架类型。科学技术的进步使得人们已有可能实现这个目标。1961年Butenandt^[4]从蚕 (*Bombyx mori*) 的雌性成虫 (蛾) 的腹部分离并确定结构的蚕蛾醇 (bombykol, 10E, 12-Z-hexadien-1-ol) 可作为超微量生理活性物质分离的一个突出例子。作者从50万头蚕蛾中才得到12mg的蚕蛾醇NABS衍生物。这是一种雌性信息素 (pheromone)，其 10^{-10} μg/ml的超微量浓度即对蚕的雄性成虫示有明显的诱引活性。

至于从500kg蚕蛹才得到25mg结晶的蜕皮激素 (ecdysone) (1954年, Butenandt)^[5]可算是超微量物质分离的另一个突出例子。

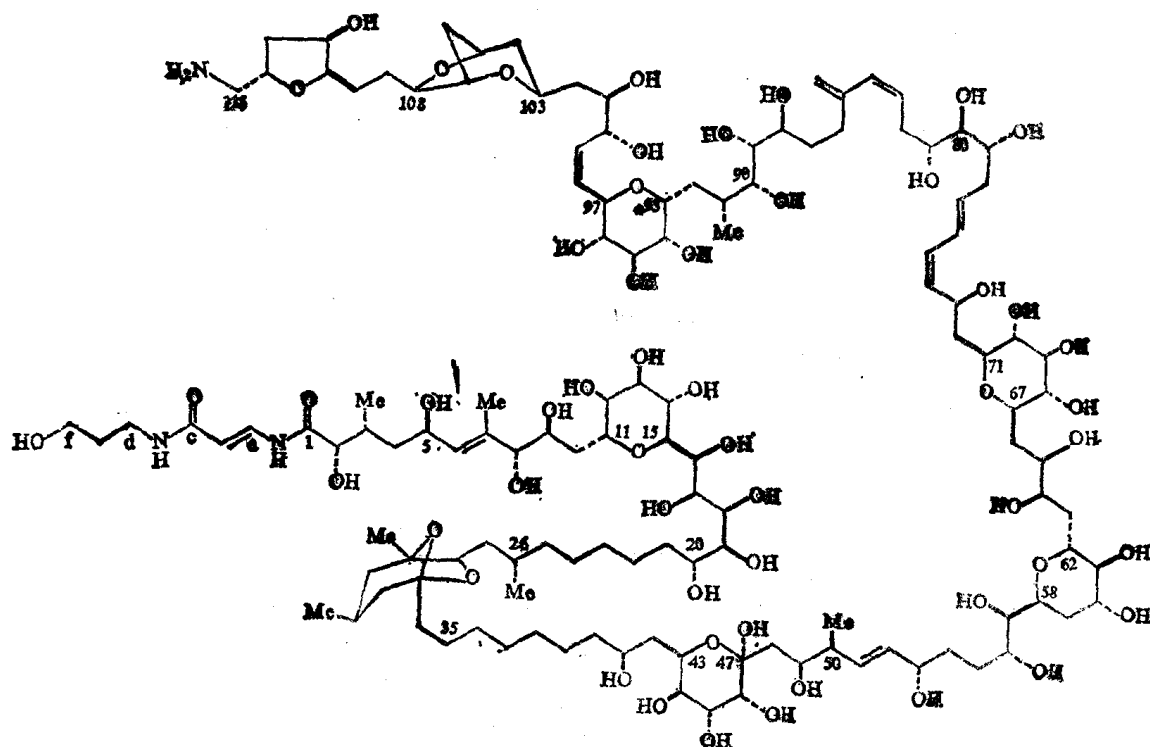
[3] Dictionary of Alkaloids, Chapman and Hall, 1989

[4] Butenandt, A. et al. *Z Physiol Chem* 1961, 324: 71; 1961, 324: 84. 转引高橋信孝, 他. 生理活性天然物化学, 第二版, 東京大学出版会, 1981: 175

[5] Butenandt, A., Karlson, P., *Z Naturforsch.* 1954, 88, 359. 转引高橋信孝, 他. 生理活性天然物化学, 第二版, 東京大学出版会, 1981: 139



另外，过去在测定一个化合物结构时，往往需要用化学方法进行降解或作成适当衍生物进行比较才有可能予以确认，因此一般需要至少几百毫克或甚至几克的纯物质。十几毫克乃至几十毫克的物质往往因为无法测定而束之高阁。现在，由于科学技术的飞跃发展，尤其核磁 (NMR)、质谱 (MS) 及X线单晶衍射 (X-Ray Crystal Analysis) 在设备、性能及测试技术方面的大幅度改善，以及计算机的广泛运用，结构测定需要的样品数量已大幅度降低，几十毫克甚至十几毫克就可以完成测定工作。分子量在1000以下的大多数天然化合物甚至不必进行任何化学降解，单用 NMR 测试技术就可以决定其结构^[6]。有的微量成分，分子量虽然很大，结构也相当复杂，但只要能得到几粒良好的单晶（每边不少于0.1mm），则单独采用X线单晶衍射就可以在几天之内确定整个分



沙海葵毒素的结构

[6] 瀬戸治男，化学の領域，増刊142号，1983：1，化学，増刊，114号，1983，71

子的立体结构。1981年,由 Uemura^[7]及Moore^[8]两个研究组几乎同时发表的沙海葵毒素(palytoxin)可算是结构研究中一个最突出的例子。该化合物平均分子量高达2680,分子式为 $C_{129}H_{223}N_3O_{54}$,共含有64个不对称碳原子,其平面结构见上页。如此庞然大物从1974年提出纯品(60kg原料得到几个毫克),到1981年发表其上述平面结构也才用了不到10年时间。

除了超微量物质的分离及结构测定技术有明显的进步外,从1970年开始,天然物合成研究也迎来了蓬勃发展的时代。天然化合物合成在30年前多作为结构测定过程中的一种辅助手段,而且由于缺乏特异性的立体反应,含有多个不对称碳原子的化合物的合成几乎不可能进行。最近,以金属有机化合物为主,先后开发了许多特殊的合成试剂及合成技术,含多个不对称碳原子的天然物的合成也已成为研究的目标,立体选择性合成已经取得了明显的进步^[9,10]。这些都必将对天然药物化学的发展带来巨大的影响。

我国有着丰富的天然药物资源,在临床应用等许多方面更有着丰富的经验积累,是一个急待发掘、整理提高的伟大宝库。建国前,受着整个国家经济实力及科学技术综合发展水平等条件的限制,天然药物化学研究基本上没有什么突破,更没有建立起天然药物化学制药工业。临床应用的麻黄素等药物只能依赖进口,但富含麻黄素的中药麻黄等药材资源却大量出口。建国以来,尤其近一、二十年来,与其它各项科学事业一样,天然药物化学迎来了蓬勃发展的新时代。麻黄素、芦丁、西地兰等十几种天然药物产品的工业生产已经进行多年,甾体激素类药物原料——薯蓣皂甙元的工业生产及其资源开发研究更取得了巨大的成就,不仅保证了国内需要,还有大量出口。“中西医结合创造新医学、新药学”的号召及防病治病、开发新药的需要有力地推动着天然药物化学研究工作的深入发展及天然药物产品的新药开发研制工作。据1981年的统计资料^[11]表明,建国以来共研制新药104种,其中来自植物、动物有效成分及成分结构改造的有61种,占新药总数的58.6%。创制的新药64种中,有18种是中草药有效新成分。另有些新药是中草药有效成分的衍生物,如青蒿素甲醚、丹参酮ⅠA磷酸钠盐、 β -甲基地高辛、溴化异丙东莨菪碱等^[12]。目前,除原有的中国科学院上海药物所、昆明植物所、中国医学科学院药物所及药用植物资源开发所外,全国各地的医药院校、卫生部门几乎也都普遍设立了从事天然药物化学研究的机构。《天然药物化学》或《中药成分化学》已经成了医药院校中许多专业的必修课程。近十几年来,随着对外开放方针的贯彻执行,大大地推动了我国科学界与国外同行间的学术交流及人员交往。天然药物化学则是在药学及化学领域中与国外人员交往最为频繁、学术交流最为活跃的一个学科。这对提高我国研究水平,促进研究队伍的成长起到了重要的作用。国家经济实力的增强,HPLC、GC、MS、NMR、X线单晶衍射等一批近代分离分析设备、新材料、新试剂、新技术的引进也为天然药物化学研究工作的开展奠定了必要的物质基础。目前,我国天然药物化学研究工作

[7] Uemura, D. et al, Tetrahedron Lett 1981, 22: 2781

[8] Moore, R. E. et al, J Am Chem Soc 1981, 103: 2491

[9] R&Dレポート No 35. 生理活性物質の不整合合成技術。シーエムシ編集部, 1982年

[10] 磯部 稔, 他. 化学 増刊114号, 化学同人, 1983: 107

[11] 彭司勳等, 藥學通報1981, 16: 219

[12] 姚应鹏, 藥學通報 1980, 15: 257. 1981, 16: 420. 1983, 18: 352