

<<红豆杉属植物的化学研究>>

图书基本信息

书名：<<红豆杉属植物的化学研究>>

13位ISBN编号：9787122146311

10位ISBN编号：7122146316

出版时间：2013-1

出版时间：化学工业出版社

版权说明：本站所提供下载的PDF图书仅提供预览和简介，请支持正版图书。

更多资源请访问：<http://www.tushu007.com>

## <<红豆杉属植物的化学研究>>

### 前言

植物在其漫长的生物进化过程中合成了许许多多结构各异的次级代谢产物 (secondary metabolites), 这些次级代谢产物结构的多样性使它们不仅具有各种各样的生物活性, 还常常发现它们具有全新的作用机制, 因此使之成为人们探索生命科学和药物药理学不可或缺的工具药和分子探针。

紫杉醇 (Taxol) 就是从植物中发现的优秀的天然抗癌药物的一个杰出代表——具有全新的结构和全新的作用机制, 目前它不仅在临床上广泛应用于乳腺癌和卵巢癌的治疗, 还被广泛用于生命科学的基础研究, 并极大地促进了有机合成化学、药物化学和分子生物学的发展。

目前, 紫杉醇已成为40年来发现的最优秀的天然抗癌药物之一。

2011年是发现紫杉醇结构40周年, 我们对紫杉醇发现的曲折历史过程和相关研究进行了一下总结, 希望能为对该领域研究感兴趣的读者提供尽可能完整的参考资料和文献, 以纪念这一伟大发现。

并谨以此书纪念著名抗癌药物紫杉醇和抗癌药物先导化合物喜树碱的发现者Dr.Wall和Dr.Wani。

在编写过程中, 承蒙化学工业出版社编辑们的热情支持和帮助, 提出了很多宝贵意见和建议, 在此表示衷心的感谢。

尽管我们做了认真的编写工作, 但由于学术水平和编写能力有限, 加之时间仓促, 不当和遗漏之处在所难免, 敬请广大读者予以指正。

最后向所有被引用文献的作者表示衷心的感谢, 如引用文献有遗漏, 则向作者表示由衷的歉意。

紫杉醇的发现者Dr.Wall和Dr.Wani编著者2012年3月

## <<红豆杉属植物的化学研究>>

### 内容概要

《红豆杉属植物的化学研究:紫杉烷类化合物的研究》内容简介：红豆杉属植物中的紫杉烷类化合物具有重要的药物研究价值。

其中，紫杉醇已成为40年来发现的最优秀的天然抗癌药物之一，其不仅在临床上广泛应用于治疗乳腺癌和卵巢癌的治疗，还被广泛用于生命科学的基础研究，并极大地促进了有机合成化学、药物化学和分子生物学的发展。

书中详尽阐述了红豆杉属植物化学成分研究进展、紫杉醇研究进展、紫杉烷类化合物研究进展和紫杉烷类化合物的核磁共振氢谱特征，并附有常见紫杉烷类化合物的核磁共振波谱图（100张）和不同类型紫杉烷类化合物（56个）的氢谱和碳谱数据，可为紫杉烷类化合物和紫杉醇的研究提供较为权威和翔实的资料。

《红豆杉属植物的化学研究:紫杉烷类化合物的研究》可供从事天然药物化学和肿瘤药物学的研究人员参考。

## &lt;&lt;红豆杉属植物的化学研究&gt;&gt;

## 书籍目录

第一章红豆杉属植物研究概述 第一节红豆杉属植物概述 1.红豆杉属植物 2.红豆杉的分布 3.我国红豆杉的野生资源及现状 4.我国引种的曼地亚红豆杉 第二节红豆杉属植物化学研究概述 1.紫杉烷类化合物研究历史 2.紫杉烷类化合物的结构类型 3.重要的或代表性的紫杉烷类化合物的结构 4.常见的几类主要紫杉烷类化合物的立体构型 5.结束语 参考文献 第二章紫杉醇研究进展 第一节紫杉醇研究概述 1.紫杉醇的研究历史和应用 2.紫杉醇的结构和波谱 3.紫杉醇的抗癌机制 4.紫杉醇在植物中的分布 5.紫杉醇的化学半合成 6.紫杉醇的生物合成途径 7.紫杉醇新剂型的开发与应用 第二节紫杉醇提取、分离、纯化工艺的研究进展 1.紫杉醇的分离工艺概述 2.紫杉醇的粗提工艺 3.紫杉醇的纯化工艺 4.分离纯化紫杉醇的工艺过程 第三节紫杉醇的构效关系研究 1.A环 2.B环 3.C环 4.4位乙酰基 5.D环 6.C—13侧链 7.进入临床试验的紫杉醇类似物 第四节紫杉醇的全合成 1.全合成总体战略 2.全合成路线分析 3.结语 参考文献 第三章紫杉烷类化合物研究进展 第一节紫杉烷类化合物 第二节紫杉烷类化合物常见的化学反应 1.紫杉宁及其衍生物常见的化学反应 2.紫杉醇和巴卡亭 常见的化学反应 3.巴卡亭 的化学重排反应 4.紫杉烷类化合物的异构化反应 第三节紫杉烷类化合物的生物转化 1.微生物转化 2.微生物转化条件 3.生物转化的影响因素 参考文献 第四章紫杉烷类化合物的核磁共振氢谱特征 1.紫杉烷类二萜化合物的基本骨架 2.各类骨架的氢谱 3.紫杉烷类化合物中取代基的氢谱特征 参考文献 附录2不同类型紫杉烷类化合物氢谱和碳谱数据 缩写表

## &lt;&lt;红豆杉属植物的化学研究&gt;&gt;

## 章节摘录

版权页：插图：微波辅助萃取可大量减少提取时间，减少溶剂用量，加上少量无机酸用微波溶解萃取基质以做深入的成分分析已是惯例。

5g紫杉的新鲜针叶含湿量为55%~65%，在5mL水中浸泡，然后用10mL 95%乙醇于85℃微波辅助液液萃取9~10min，可得到90%紫杉烷。

若原料重与乙醇用量比率维持不变（小于0.25），冻干原料含湿量低于10%，萃取收率可达100%。

Durand等应用了离心分配色谱，使用一个色谱柱就可以从粗原料中得到纯度较高的紫杉醇，而且一次处理量很大。

另外需注意的是紫杉醇键合物，即在紫杉醇的基本骨架上又以化学键的形式结合了其他大分子的一类物质。

常见的一般为水溶性的糖基紫杉醇，如7—木糖基紫杉醇和7—木糖基—10—去乙酰基紫杉醇等。

由于紫杉醇不溶于水，因此人们推测，紫杉醇键合物可能是紫杉醇在植物体内运输的一种特殊形式。

用甲醇或以95%乙醇浸提红豆杉的树皮和树叶，经去脂后，用氯仿—水或二氯甲烷—水萃取，再通过柱色谱分离、纯化，此方法往往使糖基化紫杉醇进入水相而有所损失。

如Carver D.R.等利用木聚糖酶、纤维素酶、果胶酶酶解短叶红豆杉培养细胞和树皮的甲醇浸膏，发现经木聚糖酶酶解后紫杉烷类化合物的含量比未经酶解处理的分别提高了3倍和0.2倍。

以上各种方法得到的是低纯度的紫杉醇，往往是紫杉烷类化合物伴随其他萜类化合物、类脂、叶绿素和酚类出现，要得到纯品紫杉醇，还需进一步纯化和精制。

3.紫杉醇的纯化工艺 将红豆杉植物或细胞培养物的粗提物进一步纯化是获得纯品紫杉醇的关键步骤，目前占主导地位的工艺是色谱方法。

为使后续工作易于进行，色谱过程之前还需要进行一些相关技术处理以降低分离纯化的难度。

（1）色谱纯化法 最早用于分离纯化紫杉醇的方法是色谱法，柱色谱被用作紫杉醇的预分离与最终分离工作，而薄层色谱被用作紫杉醇的检验和纯化。

目前，随着分离工艺的不断改进，色谱法也有了较大改进。

各种用于紫杉醇分离纯化的色谱方法有高效液相色谱、薄层色谱、超临界流体色谱、电泳色谱、免疫亲和色谱（immuno affinity chromatography, IAC）、高速逆流色谱等。

在用液相色谱纯化紫杉醇时，操作大都在室温下进行，所用填料多是惰性介质，流动相的性质也较温和，有利于保持紫杉醇原有的构象和生理活性。

各种类型的高效液相和薄层色谱的共同缺点是：负载量小，不适于日常大量样品的处理，仅能达到半制备规模的水平。

硅胶柱色谱一般红豆杉的粗品浸膏多含有一些低极性或非极性类杂质如焦油、胶质类，一方面会黏附在固定相，使硅胶失去吸附能力；另一方面使流出液流速缓慢。

对于这类杂质，可采用一些低极性的醚类和烷类有机溶剂进行固液萃取除去，如李春斌等采用了原始浸膏5倍体积的石油醚（60~90℃）。

或者对柱子改造，加大流速也可得到高纯度紫杉醇。

此外，粗提物中还共存大量鞣质酸等酸性杂质，可与碱液发生类似皂化的反应，用水洗涤除去。

但需要注意的是紫杉醇在碱性环境中很不稳定，易裂解成巴卡亭和其他一些物质。

有实验表明乙酸乙酯作溶剂，1mol/L氢氧化钠并不能使紫杉醇裂解，使浸膏碱洗成为可行的一步。

如果多次洗涤出现乳化现象，可改用浓度为0.5mol/L盐水（NaCl）洗涤，洗涤后有机相用无水硫酸钠进行脱水。

紫杉醇在正己烷中沉淀较好，因此如果想进一步降低纯化难度可将待分离液用正己烷沉淀。

## <<红豆杉属植物的化学研究>>

### 编辑推荐

《红豆杉属植物的化学研究:紫杉烷类化合物的研究》可供从事天然药物化学和肿瘤药物学的研究人员参考。

<<红豆杉属植物的化学研究>>

版权说明

本站所提供下载的PDF图书仅提供预览和简介, 请支持正版图书。

更多资源请访问:<http://www.tushu007.com>