

紫杉醇进行了定量分析。Heaton^[8]和 Jagota^[9]采用超临界色谱(supercritical fluid chromatography, SFC)对紫杉醇进行了定量分析。Jaziri 等^[10]用酶标法(ELISA)对紫杉醇进行了分析检测,检测限可达 0.6 ng/mL。Rizzo^[11]用 C₈ 柱准确地定量了血液中的紫杉醇。

3 紫杉醇的半合成

关于紫杉醇的合成,1994 年美国科学家 Nicolaou^[12]与 Holton^[13]小组先后用不同的路线全合成了紫杉醇,但都不能工业化生产。到目前为止,全世界还没有能够进行工业化合成生产紫杉醇的可行路线。因此,人们把目光集中投入到紫杉醇的半合成上。

根据紫杉醇的化学结构与生物活性的构效关系,大多数科学家均用 10-DAB 做半合成的前体材料。1988 年 Potier 等用欧洲红豆杉针叶中分离的 10-DAB 作原料,经过 C7-OH 保护, C10-OH 乙酰化, C-13 位与保护侧链酯化以及最后水解得到紫杉醇。Nicolaou^[12]和 Holton^[13]从巴卡亭 III 开始半合成了紫杉醇和多烯紫杉醇。目前,半合成的紫杉醇已被批准在多个国家上市。

4 结语

目前,在紫杉醇的药理活性、分离测定方法、提取纯化技术,紫杉醇系列化合物的化学结构及其生物活性、化学结构改造和主要活性物质的人工合成及半合成,新的药物制剂与剂型,紫杉醇类似物的开发与利用等方面,都取得了巨大的进展。特别是在紫杉醇的化学结构与其药理活性的构效关系上,获得了重要成果。我国大规模工业化反相制备色谱填料的大批量生产,也必将有力地推动紫杉醇提取分离与应用工业的迅速发展。

参考文献:

- [1] Mattina M J L, Macechern G J. Extraction, purification by solid phase extraction and high-performance liquid chromatographic analysis of taxanes from ornamental *Taxus* needles [J]. *J Chromatogr*, 1994, 679(2): 269.

- [2] Jennings D W. Supercritical extraction of taxol from the bark of *Taxus brevifolia* [J]. *J Supercrit Flu*, 1992, 5(1): 1
- [3] Witherup K M, Look S A, Stasko M W, *et al*. *Taxus spp.* Needles contain amounts of taxol comparable to the bark of *Taxus brevifolia*: analysis and isolation [J]. *J Nat Prod*, 1990, 53(5): 1249
- [4] Harvey S D, Campbell J A, Kelsey R G, *et al*. Separation of taxol from related taxanes in *Taxus brevifolia* extracts by isocratic elution reverse phase microcolumn high-performance liquid chromatography [J]. *J Chromatogr*, 1991, 58(7): 300
- [5] Kopycki W J, Elshohly H N, Chesney M J D. HPLC determination of taxol and related compounds in *Taxus* plant extracts [J]. *J Liq Chromatogr*, 1994, 17(12): 2569
- [6] Chan K C. Separation of taxol related compounds by micellar electrokinetic chromatography [J]. *J High Resolut Chromatogr*, 1994, 17(1): 51
- [7] Hempel G. Determination of paclitaxel in biological fluids by micellar electrokinetic chromatography [J]. *J Chromatogr*, 1996, 745(12): 173
- [8] Heaton D M. Application of supercritical fluid extraction and supercritical fluid chromatography to the production of taxanes as anticancer drugs [J]. *J High Resolut Chromatogr*, 1993, 16(4): 666
- [9] Jagota N K. Supercritical fluid chromatography of paclitaxel [J]. *J Chromatogr*, 1996, 721(2): 315
- [10] Jaziri M, Homes J. Enzyme immunoassay methods for the *in vitro* detection of secondary plant products [J]. *In Vitro*, 1991, 27(3): 291
- [11] Rizzo J, Riley C, Hoff D V, *et al*. Analysis of anticancer drugs in biological fluids: determination of taxol with application to clinical pharmacokinetics [J]. *J Pharm Biomed Anal*, 1990, 8(2): 159
- [12] Nicolaou K C, Yang Z, Liu J J, *et al*. Total synthesis of taxol [J]. *Nature*, 1994, 367: 630
- [13] Holton R A, Somozza C, Kim H B, *et al*. First total synthesis of taxol [J]. *J Am Chem Soc*, 1994, 116: 1597

《中草药》杂志售过刊信息

《中草药》杂志编辑部尚存部分过刊合订本,包括:1974-1975 年、1976 年、1979 年、1988—1993 年(80 元/年),1996、1997 年(110 元/年)、1998 年(120 元/年)、1999 年(135 元/年)、2000 年(180 元/年)、2001—2003 年(200 元/年)、2004 年(220 元/年)、2005 年(260 元/年)、2006 年(280 元/年)、2007 年(280 元/年)、2008 年(280 元/年)。1996 年增刊(50 元)、1997 年增刊(45 元)、1998 年增刊(55 元)、1999 年增刊(70 元)、2000 年增刊(70 元)、2001 年增刊(70 元)、2002 年增刊(65 元)、2003 年增刊(65 元)、2004 年增刊(65 元)、2005 年增刊(65 元)、2006 年增刊(65 元)、2007 年增刊(65 元)、2008 年增刊(55 元)。欢迎订购。订阅者请直接与《中草药》杂志编辑部联系。

电话: (022) 27474913 23006821

传真: (022) 23006821

E-mail: zcyzzbjb@sina.com