



TCM Series of Active Components

Active Components on Digestive and Respiratory Systems in TCM

中药药理活性成分丛书

中药影响消化呼吸系统 活性成分

周家驹 谢桂荣 严新建◎编著

科学出版社



TCM Series of Active Components

Active Components on Digestive and Respiratory Systems in TCM

中药药理活性成分丛书

中药影响消化呼吸系统 活性成分

周家驹 谢桂荣 严新建 编著

湖北工业大学图书馆



01302734



科学出版社

北京

R288/29

✓

内 容 简 介

本丛书共 10 分册,各分册按化合物结构类型划分章节,采用了规范的植物分类学、化学、药理学数据表达方法,包括表达中药原植物的简化拉丁双名法、表达化合物立体化学特征的分子结构图及格式统一的癌细胞简明代码等,对相关学科核心信息实现了科学、精炼的表述。书末附有化合物药理活性索引、化合物中文名称索引、化合物英文名称索引、植物中文名称及活性成分索引、植物拉丁学名及活性成分索引,完备的索引集可帮助读者快速实现各种途径的内容查找。本丛书与医药各专科对口,可作为中、西医临床医生和从事相关管理、科研、开发、教学的医药工作者、大学生、研究生以及对中药现代化感兴趣的各界读者查找、了解中药活性成分来源、结构、药理活性的一套小型工具书。

图书在版编目(CIP)数据

中药影响消化呼吸系统活性成分 / 周家驹, 谢桂荣, 严新建编著. —北京: 科学出版社, 2012.3

(中药药理活性成分丛书)

ISBN 978-7-03-033829-7

I. 中… II. ①周… ②谢… ③严… III. ①呼吸系统疾病-中药材-生物活性-中药化学成分②消化系统疾病-中药材-生物活性-中药化学成分 IV.

R284

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2012)第 043828 号

责任编辑: 向小峰 戚东桂/责任校对: 钟 洋

责任印制: 刘士平/封面设计: 范璧合

版权所有, 违者必究。未经本社许可, 数字图书馆不得使用

科 学 出 版 社 出 版

北京东黄城根北街 16 号

邮政编码: 100717

<http://www.sciencep.com>

双 青 印 刷 厂 印 刷

科学出版社发行 各地新华书店经销

*

2012 年 3 月第 一 版 开本: 787×1092 1/16

2012 年 3 月第一次印刷 印张: 26

字数: 851 000

定价: 128.00 元

(如有印装质量问题, 我社负责调换)

《中药药理活性成分丛书》序

过去十几年来,作为中国科学院过程工程研究所分子设计课题组的长期课题“中药化学信息研究”的阶段成果,我们相继编写出版了英文的《中药》第一、二版(英国 Ashgate 出版社,1999,2003),中文的《中药原植物化学成分手册》(化学工业出版社,2004),中文三卷本的《中药原植物化学成分集》(科学出版社,2009)和英文六卷本的《中药大全》(Springer 出版社,2011)。最后两套书籍的出版标志着该课题的既定任务终告完成,以后的工作则转为按照一套已经成形且行之有效的规范继续收集逐年产生的新信息,并在数据结构和表达方面不断改进,使之趋于完善。

现在呈献给广大读者的这套《中药药理活性成分丛书》是该课题近两年的最新结果。编写这套丛书的起因是:国内外读者反映,上面的工具书确有实用参考价值,但篇幅巨大,价格昂贵,使用不便,不太适合普及。我们就想到编写一套和医药各专科一一对口的系列丛书,以便各专业医药工作者和社会各界读者在日常工作和生活中方便地作为小型工具书参考使用。参照《Goodman & Gilman 治疗学的药理学基础》(第 11 版)采用的国际上最新的药物分类系统,结合中药现代研究和发展的实际情况,编写了下面 10 个分册:《中药抗癌活性成分》、《中药抗微生物感染活性成分》、《中药抗炎活性成分》、《中药抗氧化抗衰老活性成分》、《中药抗寄生虫活性成分》、《中药影响心脑血管系统活性成分》、《中药影响神经系统活性成分》、《中药影响消化呼吸系统活性成分》、《中药活性成分中的酶抑制剂》和《多靶标的中药活性成分》。

其中,《中药抗癌活性成分》、《中药抗微生物感染活性成分》、《中药抗炎活性成分》、《中药影响心脑血管系统活性成分》、《中药影响神经系统活性成分》、《中药影响消化呼吸系统活性成分》六个分册是和医学界几个主要专科相对应的;《中药抗寄生虫活性成分》核心内容是抗疟药物,是考虑到抗疟药物研究开发是一个有国际意义的课题,应该给以较多关注;而《中药抗氧化抗衰老活性成分》、《中药活性成分中的酶抑制剂》、《多靶标的中药活性成分》三个分册则是根据中药现代研究中人们十分关注的专题领域定题编写的;《中药抗氧化抗衰老活性成分》论及当前备受重视的抗氧化抗衰老领域;《中药活性成分中的酶抑制剂》专论分子药理学中无处不在的核心角色之一——酶的抑制剂;《多靶标的中药活性成分》则是期望告知人们关注多年的中药物质基础其实主要就是常见常用中药中含有的几百种多靶标、多来源的活性成分,对此给出直观的事实证据。

和前述的工具书《中药原植物化学成分集》、《中药大全》相比,在信息内容收集和数据结构编排两方面,这套丛书又有一些新的重要进展。

在内容上,一是对所有近 8000 种活性成分都给出了明确详尽的结构类型,这是我们过去未曾做到的;二是对 700 多种常见中药活性成分都收集、整理,给出了在原植物中的含量数据,这些定量含量信息是系统阐明中药物质基础的基础数据;三是对《中药抗癌活性成分》和《中药抗寄生虫活性成分》这两个分册收集补充了 2010 年的最新数据。

在编排格式上,我们期望兼顾该套丛书的工具性和可读性两个方面,力求做到既具备工具书有便于进行各种途径检索查找的功能,又适合读者像阅读一般专业书那样进行顺畅的阅读。

在作为工具书时,每个分册正文后面的5个索引将起到重要作用。例如,从任一药理活性条目查找有关活性成分;从中药原植物的中文名称或拉丁学名查找其全部有关化学成分;从化合物中文或英文名称查找其结构、结构类型、天然来源、药理活性及其他相关信息等。

作为一般书籍,本丛书各分册也具有良好的可读性,因为各分册正文是按照结构类型划分章节的。例如,读者期望了解有抗癌作用的黄酮类化合物的情况,直接阅读《中药抗癌活性成分》第3章即可。因为只有化合物的结构是和各种性质密切相关的,按照结构类型划分章节就保证了书中位置相近者,其内容一定密切相关。

总之,同时实现上述两种属性的具体措施是:一方面以结构为“纲”划分章节,以活性为“目”详述各自的属性,便于读者把握结构和活性关系的总体特征,起到纲举目张的作用;另一方面,利用编者长期从事计算机化学和科学数据库研究,有构建化学信息体系的经验,编制了完整的索引集,实现了除结构检索以外的几乎所有类型的信息检索功能。最后,对于复杂纷纭的药理活性数据,建立并实现了一整套简单明确、易于掌握使用的规范化的方法,例如,200多种癌细胞的CCC规范化代码。连同我们过去长期以来积累形成的用简化拉丁双名法表示中药原植物,用结构类型和立体化学分子结构图直观地表示化合物结构特征,用规范化格式精炼地定性或定量表达药理活性的方法等,对相关学科的核心信息全面实现了科学、精炼的表述。

期望这套《中药药理活性成分丛书》能以其简洁明快的表达方式向广大医药界、科学界及社会各界读者提供当前中药植物、化学、药理现代研究发展的总体概况,并对人们思考、探索、研究和实践“中药现代化”这一重大科学命题有所裨益。倘能如此,编者幸甚。

是为自序。

中国科学院过程工程研究所

周尔响

2012年1月于北京

体 例 说 明

本书正文是按照“结构为纲，活性为目”的格式框架编写的。我们以《天然产物字典》(Chapman & Hall, 1994)为基本依据，同时参照天然产物化学和中草药化学的相关书籍，建立了适用于中药化学信息的三层次结构类型表达体系。

该结构表达体系包括十三大类，在本丛书中，每一个大的类别各自成章。各章内容分别为生物碱、萜类、黄酮类、甾族化合物、脂肪族天然产物、聚酮化合物、含氧杂环、简单芳香化合物、多环芳香化合物、苯并呋喃和苯并吡喃类、香豆素类、木脂体和鞣质。对每一大类，又根据分子骨架结构特征或生源关系分为若干小类，各自成节。最后，对于数量巨大、结构类型繁多的生物碱和萜类化合物(以及少数脂肪族和芳香族天然产物)，在每一小类中再细分为若干具体类型。这个三层次结构表达体系的优点是科学实用，简繁得当，容易掌握。对于研究或了解成千上万种天然产物的结构和活性的关系，能起到提纲挈领的作用，有时甚至有一目了然的效果。浏览本丛书任一分册的目录，就可以了解该结构表达体系的具体内容，在此不再赘述。

如果说上述的结构表达体系是“纲”，下面介绍的本书正文中的每一种化合物及其各种属性就是“目”，在英文写作的数据库和其他信息表达体系中称为“入口(entry)”。对每一个化合物入口，按顺序最多给出 13 项数据：分册中的化合物代码、英文名称、中文名称、英文别名、CAS 登录号、分子式、相对分子质量、物理化学性质、结构类别、药理活性、天然来源、参考文献和该化合物的化学结构式。其中，化合物代码、英文名称、分子式、相对分子质量、结构类别、药理活性、天然来源、参考文献和化学结构式各项是必须有数据的非空项目，其他几项是根据原始文献尽量给出的可选项。应该指出，在看似复杂纷纭的诸多类别信息中，分子结构及其类型，规范化的药理活性，以及用中文名和拉丁名“捆绑”表达的天然来源这三项是最有价值的核心信息。

1. 化合物代码 即本分册正文中化合物的顺序号，用黑体给出，是一个非空项。在后面的五个索引中，也都是用化合物代码来代表化合物，从索引中查到化合物代码之后，就可方便地从正文部分查到该化合物的全部信息。

2. 化合物英文名 化合物英文名用黑体给出，首字母大写，是一个非空项。前缀中所用的 α -, β -, γ -, δ -, ϵ -, ξ -, ψ -...(+), (-), ($\pm$), *dl*-, *D*-, *L*-, *R*-, *S*-; *cis*-, *trans*-, *Z*-, *E*-, Δ (双键符号); *o*-, *m*-, *p*-; *O*-, *N*-, *S*-; *sec*-, *ter*-, *ent*-, *meso*-, *rel*-等符号均为斜体。但 *iso*-, *epi*-, *abeo*-, *seco*-, *nor*-等用正体。对极少数没有英文名的化合物，采用了一种可以自解释其原始参考文献来源的英文名称代码。

3. 化合物中文名 化合物中文名用黑体给出。对英文原始文献中的化合物没有中文名的，大部分都根据通用的规则给出了中文试用名。这些由本书编者给出的化合物中文名都加了“*”标记。

4. 化合物英文学名或别名 对多数化合物，本书只给出一个英文名，部分常见化合物给出了英文别名。

5. CAS 登录号 本书只对部分化合物给出了 CAS 登录号，表达在方括弧中。

6. 分子式 在化合物分子式中，各元素按国际上通用的 Hill 规则排序。

7. 相对分子质量 化合物相对分子质量表达在分子式之后的圆括弧中, 小数点后取两位数字。

8. 物理化学性质 收集的物理化学性质包括晶形、熔点、沸点、旋光等。

9. 结构类别 是一个非空项。用上述三层次结构表达体系的最后一个层次的结构类型表达, 在小标题【类型】后面给出。

10. 药理活性 是一个非空项。对每一入口化合物的药理活性实验数据, 在小标题【活性】后面给出。同一化合物有多项药理活性时, 各项数据平行排列, 用分号隔开。来自不同原始文献的同种药理活性数据一般不予合并。各项活性数据的出现先后顺序是随机的, 并不表示其重要性的顺序, 只有毒性数据 LD_{50} 等统一规定放在最后。在每一项药理活性数据中, 按照下面的规范化的格式进行细节的描述: 药理项目名称(关于该项药理性质的进一步描述, 实验对象, 定量活性数据, 对照物, 定量活性数据, 关于作用机制等的补充描述)。对于发表了实验数据但是未发现明显活性甚至没有活性的数据, 同样作为有价值的科学实验数据加以收集, 因此, 数据收集范围不仅包括活性成分, 也包括少量无活性成分, 这些无活性结果的表达格式是“活性条目+实验无活性”。这样的格式保证了在活性索引中无活性结果紧随在同一条目有活性结果之后, 便于读者查找相关信息。

11. 天然来源 对每一个化合物的中药原植物信息, 在小标题【来源】后面给出。在本书中, 绝大多数情况下天然来源是指原植物, 也有极少数情况下是动物或其他生物。为方便读者确认原植物物种, 对该化合物的每一种天然来源原植物都同时采用先后给出中文名和拉丁学名的“捆绑”表达方式。部分植物在文献及工具书中只有拉丁学名而查不到中文名的, 大部分已由本书作者根据植物学常规的命名规则予以命名。这些由本书作者命名的植物中文名在正文和索引中出现时标有“*”。对植物拉丁学名, 参考近年来国外一些植物学词典的表达方式, 采用简洁的双名方式给出, 即略去物种发现人和命名人的信息。对于收集了两个或两个以上拉丁学名的植物(同物异名), 在第一个拉丁学名(正名)后面用方括弧给出其余的拉丁学名(异名)。对于同一化学成分有多种植物来源的, 种类较少时随机排序; 种类较多时按照植物中文名拼音排序, 以便于读者查找。无论何种排序方式, 其先后都不表示其重要性的顺序。当不给出该化合物存在的植物部位时, 表示其存在的植物部位和该种中药的药用部位相同, 当需要给出其采样部位以及分离产率时, 表示在括弧中。对于没有中文名称的植物以及只有中文属名而无中文种名或是不确定种的植物, 依照其名称的不完整和不确定程度排列在有完整中文名的植物后面。最后要指出的是, 在本从书中, 第一次对 700 多种常见中药原植物的重要活性成分给出了用可靠分析方法测定的含量数据, 这些系统收集的含量数据有重要的科学意义和应用价值。

12. 参考文献 在小标题【文献】后面给出参考文献的序号。读者可根据这些序号从正文后面的“参考文献”部分查到原始文献的信息, 包括第一作者、期刊名称、卷、期、页号及年代等。参考文献采用两种方式标注。首先是对每一个活性化合物入口, 都在最后列出全部参考文献的编号。对那些近些年来发表的数据, 则同时在文中具体数据条目处再增加用方括弧表示的上标, 以便于读者查阅。

13. 化学结构式 化学结构及其类别是本书的核心信息, 其立体化学信息一般根据最新的文献。所有的化学结构式都和相对分子质量及分子式数据进行过一致性检验。

14. 五个索引 在本丛书各分册的正文后面都给出了五个索引, 索引中的编号是化合物的编号, 而不是页码。读者可通过这些化合物编号来定位、查找有关化合物的详细信息。

导 言

本书收集了来自 2648 种中药原植物及其同属植物的小分子活性成分 1063 种,每一种都至少有一条消化、呼吸系统相关活性数据。全书引用参考文献 949 篇,文献收集年代至 2005 年。1063 种活性成分中,生物碱 315 种,萜类化合物 227 种,黄酮类化合物 154 种,芳香化合物 149 种。当一个化合物同时还有其他种类药理活性时也一并收集,以反映其活性谱的全貌。

由于目前从中药原植物中分离的活性成分的活性谱很不均匀,对各类活性物质进行全面分析的条件尚不具备,我们这里只是举一些实例说明从本书查找信息、发现关系、寻找线索的一些方法。

有利胆活性的中药常量成分

临床使用的利胆药有苯丙醇、羟甲香豆素、羟甲烟胺、亮菌甲素等,大多是结构简单的小分子,主要功能是促进胆汁分泌。这里假定我们关注从天然产物出发研制利胆新药,希望找出一些有利胆活性的中药常量成分。从化合物药理活性索引中查得利胆剂条目下有 42 个化合物,顺序浏览本书正文,观察这些化合物的类别、结构、活性和在原植物中的定量含量数据,可得到下面的结果:共找到有利胆活性的中药常量成分 12 个,包括:

(1) 萜类化合物土木香内酯(375)在总状土木香根中平均含量 2.02% (此处平均含量指不同产地多批样本的平均含量,下同)。

(2) 黄酮类化合物中有利胆活性的常量成分包括在黄芩根中平均含量 1.85% 的黄芩素(556),在黄芩根中平均含量 13.1% 的黄芩苷(557),在杨梅树皮中含量 5.59% 的杨梅树皮素鼠李糖苷(639)。

(3) 甾族化合物中的去氧胆酸(704)在牛黄中平均含量 1.65%。

(4) 单碳环化合物绿原酸(745)在金银花花蕾中平均含量 3.21%,在北京石韦叶中含量 1.64%。

(5) 芳香化合物没食子酸(793)在诃子果实中含量 1.04%。桂皮酸(818)在安息香树脂中含量 16.9%。芒果苷(864)在光石韦叶含量 11.4%,是已经用来治疗肝炎的藏茵陈的主要有效成分。姜黄素(895)在姜黄干燥根茎中 10 产地平均含量 1.87%,已被提出作为发展新抗炎药的先导化合物,六氢姜黄素(897)的动物活体实验也证实有利胆活性。

(6) 香豆素类化合物 6,7-二甲氧基香豆素(968)在结构上和临床胆道扩张药物亮菌甲素相近,在茵陈蒿地上部分含量范围是 2.0%~2.6%。

(7) 木脂体类化合物五味子醇 A (1040)在五味子干燥成熟果实中的平均含量为 4.39%。

有保肝活性的中药常量成分

采用和上一节相同的数据采集和分析方法,共找到有保肝活性的中药常量成分 14 个,包括:

(1) 甘草酸(487)能减少三酰甘油在肝中的沉积,在甘草根和根茎中 14 产地平均含量 5.92%,在光果甘草根和根茎中的平均含量 4.22%。

(2) 人参皂苷 Rb₁(455)、Rc、Rd、Re、Rg₁(458~461)能抑制巨噬细胞活化,抑制 sALT 和 sAST 水平的升高,在人参根茎中的含量分别为 0.88%、0.47%、0.16%、0.57%和 0.46%。

(3) 獐牙菜苷(346)在毛獐牙菜全株中含量为 1.71%。

(4) 厚朴酚(832)以及和厚朴酚(1048)能抑制 tBH 诱导的脂类过氧化,抑制解毒剂谷胱甘肽 GSH 的排空,抑制细胞乳酸脱氢酶,天冬氨酸转氨酶泄漏和细胞死亡,在厚朴树皮中的平均含量分别为 4.96%和 4.61%。

(5) 杨梅树皮素鼠李糖苷(639)在杨梅树皮中的含量为 5.59%。

(6) 二苯乙烯苷(887)在何首乌中的平均含量为 3.47%。

(7) 姜黄素(895)在姜黄 10 产地平均含量为 1.87%。

(8) 许多中药原植物中的常见成分齐墩果酸(496)和熊果酸(534)也都有保肝作用。

抗胃溃疡的中药常量成分

采用和上一节相同的数据采集和分析方法,共找到抗胃溃疡的中药常量成分 10 个,包括:

(1) (+)-儿茶素(687) 孩儿茶树干干燥煎膏 8 产地含量范围 11.6%~21.0%;平均含量 17.2%。

(2) 龙胆碱(269)在粗茎秦艽干燥根中含量为 0.41%,在达乌里秦艽干燥根中含量为 0.89%,在管花秦艽干燥根中含量为 0.19%,在麻花艽干燥根中含量为 0.52%,在秦艽干燥根中含量为 1.43%。

(3) 甜叶菊苷(426)在甜叶菊干燥叶中平均含量为 9.66%。

(4) 甘草次酸(486)在甘草根和根茎中平均含量为 4.93%。

(5) 琥珀酸(739)山楂果实平均含量 1.55%。

(6) 厚朴酚(832)在厚朴树皮中的含量为 4.96%。

(7) 倒捻子亭(869)在倒捻子未成熟果实产率为 2.32%干重。

(8) 存在于许多植物中的具有多重来源、多重活性的熊果酸(534)、芹菜苷元(550)和咖啡酸(815)等也都是抗胃溃疡的中药成分。

基于抗炎机制的抗哮喘新药研发

近些年来,人们对哮喘的认识有重要进展,认识到哮喘不只是可逆性支气管痉挛,更是由多种炎症细胞和炎症介质通过细胞因子体系调节的一种慢性、持续性的炎症。其中气道炎症导致气道阻塞和高反应性是哮喘发病的中心环节。炎症细胞包括肥大细胞、嗜酸粒细胞、巨噬细胞、T-淋巴细胞等,炎症介质有组胺、白三烯、前列腺素、血小板激活因子、肿瘤坏死因子、白介素等。这大大拓宽了人们的眼界,从众多的抗炎活性物质中寻找新的平喘药物。目前临床使用的平喘药有 β 肾上腺素受体激动剂、磷酸二酯酶抑制剂(茶碱等甲基黄嘌呤类化合物)、色酮类(色甘酸钠等,作用为抑制肥大细胞释放介质,逆转中性粒细胞功能性活动增高,抑制

化学趋化肽对炎症细胞的激活作用等)和白三烯受体拮抗剂等,从中可以看出基于抗炎机制的药物有很大发展。

体内体外诸多实验证据表明,各种有抗炎活性的植物成分是通过调节细胞因子体系而发挥作用的。由本书化合物药理活性索引出发,浏览抗炎活性物质名单,就得到治哮喘新药的先导化合物木犀草素(579)的有关信息。木犀草素从结构上看只是一个“平常的”黄酮类化合物,实际上它除具有细胞毒、抗过敏、解痉、抗菌、抗真菌、抗 HIV、抗病毒、镇咳、祛痰、免疫增强、抗高血脂等多种活性外,还是值得关注的细胞因子网络调节器:木犀草素抑制巨噬细胞 RAW264.7 中脂多糖刺激的 $\text{TNF-}\alpha$ 和 IL-6 的释放, $\text{IC}_{50} < 1\mu\text{mol/L}$; 明显降低脂多糖刺激的 ICAM-1 的表达; 是 NO 生成抑制剂和中等活性的 COX-2 抑制剂; 特别是用来处理气道支气管狭窄和支气管高反应性,降低 IL-4 和 IL-5 水平而被建议作为研发治哮喘病新药的先导化合物。木犀草素自 1832 年首次由淡黄木犀草分离以来,已经发现存在于豆科、木犀草科、大戟科、伞形科、玄参科、菊科、半日花科和西番莲科的许多植物当中,有丰富的植物来源。木犀草素在金银花花蕾中的含量范围是 0.45%~5.18%,在菊花干燥头状花序中的 24 产地平均含量是 0.056%,在狼把草全株中平均含量是 0.17%,在芫花干燥花蕾中的 19 产地平均含量是 0.048%。

基于抑制磷酸二酯酶的抗哮喘新药研发

临床抗哮喘的磷酸二酯酶抑制剂药物主要是茶碱(285, 1,3-二甲基黄嘌呤)类的支气管平滑肌松弛剂。这是一类控制哮喘的最古老的药物,现因疗效有限,只用于其他方式难控制的情况。然而,近年来基于对 PDE 选择性抑制剂的深入研究又提出了由此研发抗哮喘新药的可能性。由本书化合物药理活性索引中的“cAMP 磷酸二酯酶抑制剂”条目中可查到 20 种中药活性成分。由“PDE 异构酶选择性抑制剂”条目中可查到槲皮素-3-甲醚(654)。一共是 21 种。其中 IC_{50} 值小于 $150\mu\text{mol/L}$ 的高活性成分有:苦参酮(603), $\text{IC}_{50} = 25\mu\text{mol/L}$, 桑素(583), $\text{IC}_{50} = 38\mu\text{mol/L}$, 汉黄芩苷(596), $\text{IC}_{50} = 42\mu\text{mol/L}$, 木犀草素葡萄糖苷(580), $\text{IC}_{50} = 79\mu\text{mol/L}$, 槲皮素葡萄糖苷(653), $\text{IC}_{50} = 100\mu\text{mol/L}$, 连翘脂苷 A (827), $\text{IC}_{50} = 110\mu\text{mol/L}$, 连翘脂苷 C (828)已用于治疗哮喘和变应性疾病,槲皮素-3-甲醚(3-MQ, 654)抑制 PDE 亚型 3, $\text{IC}_{50} = 1.6\mu\text{mol/L}$, 黄芩素(556), 抑制 PDE 亚型 4, $\text{IC}_{50} = 10\mu\text{mol/L}$ 。槲皮素-3-甲醚是来源于台中鼠李、鹅不食草、黄花蒿、蓟罂粟、仙人掌等中药药用植物的黄酮醇类化合物。先是发现了槲皮素-3-甲醚是 PDE 异构酶亚型 3 的选择性抑制剂,随后在体内、体外两种条件下详细研究了对卵白蛋白诱导的气道超响应的抑制效应,初步结论是有潜力用于处理哮喘而不影响血压的新药的研发。

总之,根据活性成分索引中感兴趣条目的化合物名单,结合顺序查阅正文内容就可以对本书进行专题综合性阅读和资料整理工作,得到关于某一专题的较完整的综合信息。

同样,根据“植物中文名称及活性成分索引”和“植物拉丁学名及活性成分索引”,查找感兴趣条目中的化合物名单,结合查阅正文内容就可以得到关于活性成分在中药药用植物中的分布的有关信息,此处不再赘述。

目 录

1. 生物碱	1
1.1 异喹啉类生物碱	1
异喹啉生物碱/1 苄基异喹啉生物碱/1 双苄基异喹啉生物碱/2 阿朴啡生物碱/5 原小檗碱生物碱/6 前阿片碱类生物碱/9 吐根碱类生物碱/10 苯并[c]菲啉生物碱/10 吗啡生物碱/11 阿朴啡-苄基异喹啉生物碱/11 2-苯并[c]呋喃酮异喹啉类生物碱/12 刺桐生物碱/12	
1.2 喹啉类生物碱	12
喹啉生物碱/12 呋喃并喹啉生物碱/13 吡啶酮类生物碱/14	
1.3 喹唑啉类生物碱	14
1.4 吡咯烷类生物碱	15
吡咯烷生物碱/15 吡咯烷士定生物碱/16 吡咯烷士定生物碱(大环内酯)/18 吲哚里西定生物碱/19 菲并吲哚里西定生物碱/19 百部碱类生物碱/20 莨菪烷类生物碱/20 多吡咯类生物碱(维生素 B ₁₂ 类)/23	
1.5 吲哚类生物碱	23
简单吲哚生物碱/23 吡啶类生物碱/24 环色胺类生物碱/26 色胺类生物碱/26 Hasubanan 类生物碱/26 阿枯米辛类生物碱/27 长春里宁类生物碱/27 钩吻类生物碱/28 β-咔啉类生物碱/28 麦角类生物碱/29 吲哚-1,5-二氮杂萘酮类生物碱/30 Strictosidine 类生物碱/31 类阿吗碱类生物碱/34 洪达木类生物碱/34 育亨宾类生物碱/35 马钱子类生物碱/35 白坚木属生物碱/35 Iboga 类生物碱/36 Malindan 类生物碱(附: Vallesiachotaman 类生物碱)/36 卡丹宾碱类生物碱/37 柯楠碱类生物碱/38 吲哚杂类生物碱/38	
1.6 吡啶和哌啶类生物碱	38
吡啶生物碱/38 喹啉定生物碱/40 哌啶生物碱/41 一叶萩碱类生物碱/44 石松碱类生物碱/44 异杷碱类生物碱/44	
1.7 有机胺和酰胺类生物碱	44
有机胺类生物碱(胍类)/44 有机胺类生物碱(酪胺类)/45 酰胺类生物碱/45 麻黄类生物碱/47 秋水仙碱类生物碱/49 那碎因类生物碱/49 菲类生物碱/49	
1.8 石蒜科生物碱	50
加兰他敏类生物碱/50 网球花定生物碱/50 石蒜碱类生物碱/50 高石蒜碱生物碱/51	
1.9 甾醇生物碱	51
Cerveratrum 类甾醇生物碱/51 Conanine 类甾醇生物碱/52 Spirosolane 甾醇生物碱/53 孕甾烷类甾醇生物碱/53 茄啉类甾醇生物碱/53 Buxus 类甾醇生物碱/54 Jerveratrum 类甾醇生物碱/55 杂类甾醇生物碱/55	
1.10 萜类生物碱	55
单萜类生物碱/55 C ₁₉ -二萜类生物碱/56 C ₂₀ -二萜阿替新类生物碱/57	
1.11 其他生物碱	57

腈和异腈类生物碱/57 嘌呤类生物碱/58 咪唑类生物碱/59 噁唑类生物碱/59 丽春花碱类生物碱/60 双环杂类生物碱/60 杂类生物碱/60	
1.12 氨基酸和肽类	60
氨基酸/60 肽类/62 柄形肽类/62 鹅膏类生物碱/64	
2. 萜类	65
2.1 单萜	65
链状单萜/65 环烯醚类单萜/65 开环环烯醚类单萜/70 薄荷烷型单萜/72 侧柏烷型单萜/77 环己烷型单萜/77 莰烷型单萜/77 蒎烷型单萜/78	
2.2 倍半萜	79
呾楠金合欢烷型倍半萜/79 大牻牛儿烷型倍半萜/79 桉烷型倍半萜/79 沉香呾喃桉烷型倍半萜/80 开环愈创木烷型倍半萜/81 双愈创木烷型倍半萜/81 愈创木烷型倍半萜/81 去甲伪愈创木烷型倍半萜/82 木防己苦烷型倍半萜/82 杂类倍半萜/82 香树烷型倍半萜/83 雅楹蓝烷型倍半萜/83 雪松烷型倍半萜/83 单端孢菌烷型倍半萜/83	
2.3 二萜	84
半日花烷型二萜/84 克罗烷型二萜/85 降、高松香烷型二萜/85 开环异海松烷型二萜/88 柯桤树烷型二萜/88 贝壳杉烷型二萜/89 去甲贝壳杉烷型二萜/89 西柏烷型二萜/89 瑞香烷型二萜/90 巴豆烷型二萜/90 二环杂类二萜/90 赤霉素二萜/91 木藜芦毒烷型二萜/91 植烷型二萜/91 香豌豆烷型二萜/91	
2.4 三萜	92
羊毛甾烷型三萜/92 环羊毛甾烷型三萜/92 甘遂烷型三萜/92 葫芦烷型三萜/92 达玛烷型三萜/93 裂环四去甲三萜/98 吲哚裂环四去甲三萜/99 苦木素类去甲三萜/99 羽扇豆烷型三萜/100 移羽扇豆烷型三萜/102 齐墩果烷型三萜/102 无羁萜烷型三萜/114 乌苏烷型三萜/115 蒲公英赛烷型三萜/118	
2.5 四萜和局部萜	119
四萜/119 局部萜/119 阿朴类胡萝卜素/120	
3. 黄酮类	121
3.1 黄酮类	121
3.2 二氢黄酮类	135
3.3 黄酮醇类	139
3.4 二氢黄酮醇类	157
3.5 异黄酮类	158
3.6 黄烷-3-醇类	163
3.7 双黄烷-3-醇类	165
3.8 异黄烷类	165
3.9 查耳酮类	166
3.10 二氢查耳酮类	166
3.11 双黄酮类	166

4. 甾族化合物	167
4.1 孕甾烷类甾族化合物	167
4.2 强心甾内酯类甾族化合物	167
4.3 蟾酥内酯类甾族化合物	167
4.4 胆烷酸类甾族化合物	168
4.5 胆甾烷类甾族化合物	169
4.6 螺甾烷类甾族化合物	169
4.7 呋甾烷类甾族化合物	172
4.8 麦角甾烷类(非睡茄内酯)甾族化合物	172
4.9 豆甾烷类甾族化合物	173
4.10 雌甾烷类甾族化合物	176
4.11 雄甾烷类甾族化合物	176
4.12 维生素 D ₃ 代谢物类	177
5. 脂肪族天然产物	178
5.1 链状化合物	178
直链烯酸/178 支链烯酯/178 饱和直链酸/178 饱和直链双酮/179	
5.2 炔类化合物	179
炔类化合物(炔醇类)/179 炔类化合物(炔酸类)/180	
5.3 单碳环化合物	180
5.4 鞘胺醇类	181
5.5 长链芳香系统	181
5.6 含硫化合物	183
5.7 含硒化合物	185
6. 含氧杂环	186
6.1 2-吡喃酮类	186
6.2 4-吡喃酮类	186
6.3 丁内酯类	186
6.4 大环内酯类	187
6.5 桉油精类	188
7. 简单芳香化合物	189
7.1 简单苯衍生物	189
7.2 苯丙烯类	196
7.3 酰基间苯三酚类	208
7.4 咕吨酮类	209
7.5 芪类	215
7.6 芪聚合物类	217
7.7 二苯醚类	218
7.8 二芳丙烷类	218

7.9 二芳庚烷类	218
8. 多环芳香化合物	221
8.1 萘和萘醌类	221
萘类/221 吡喃并萘类/221 萘醌类/221	
8.2 蒽和蒽醌类	222
蒽类/222 蒽醌类/223	
9. 苯并呋喃和苯并吡喃类	228
9.1 苯并呋喃类	228
9.2 1-苯并吡喃类	229
9.3 吡喃并-1-苯并吡喃类	229
9.4 呋喃并-1-苯并吡喃类	230
9.5 2-苯并吡喃类	231
10. 香豆素类	232
10.1 香豆素类	232
10.2 双香豆素类	237
10.3 呋喃并香豆素类	237
10.4 吡喃并香豆素类	241
10.5 异香豆素	242
11. 木脂体	244
11.1 木脂体	244
11.2 二苯并环辛二烯木脂体	252
11.3 新木脂体	256
12. 鞣质	258
12.1 没食子酯鞣质	258
13. 糖类	261
13.1 糖类	261
参考文献	262
化合物药理活性索引	273
化合物中文名称索引	294
化合物英文名称索引	310
植物中文名称及活性成分索引	330
植物拉丁学名及活性成分索引	365
附录 1 缩写和符号表	395
附录 2 癌细胞代码	398

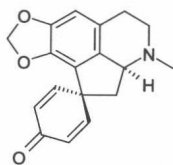
1. 生物碱

1.1 异喹啉类生物碱

异喹啉生物碱

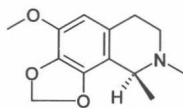
1 Fugapavine 呋杷文

Mecambrine [1093-07-8] $C_{18}H_{17}NO_3$ (295.34). 【类型】异喹啉生物碱. 【活性】升高血压 (动物实验); 减慢心率 (动物实验); 呼吸兴奋剂 (动物实验); 致惊厥 (高剂量); LD_{50} (鼠) = 4.1mg/kg. 【来源】长果罂粟 *Papaver dubium*, 威尔士绿绒蒿 *Meconopsis cambrica*, 一现罂粟* *Papaver fugax*. 【文献】167.



2 Lophophorine 须盘掌碱

[17627-78-0] $C_{13}H_{17}NO_3$ (235.29). 油状物, bp 140~145°C (0.05mmHg), $[\alpha]_D^{25} = -47.3^\circ$ (三氯甲烷). 【类型】异喹啉生物碱. 【活性】致惊厥; 呼吸兴奋剂; LD_{50} (兔, iv) = 15~20mg/kg. 【来源】暗绿龙舌兰 *Lophophora williamsii*. 【文献】167.

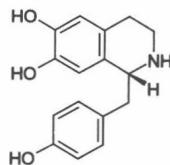


苄基异喹啉生物碱

3 Demethylcoclaurine 去甲乌药碱 (去甲衡州乌药碱)

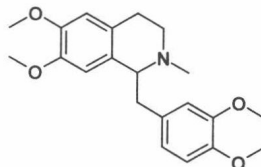
Higenamine [5843-65-2] $C_{16}H_{17}NO_3$ (271.32). mp 260~262°C. 【类型】苄基异喹啉生物碱. 【活性】提高心脏能动性; 用于治疗慢性心律不齐; 冠状脑和周边血管扩张剂; 提高心率; 平喘 (豚鼠, 组胺引起的哮喘, 支气管平滑肌松弛剂). 【来源】附子 *Aconitum carmichaeli*, 莲子 *Nelumbo nucifera*, 小叶买麻藤

Gnetum parvifolium [Syn. *Gnetum indicum*], 日本乌头 *Aconitum japonicum*, 乌头 *Aconitum carmichaeli*. 【文献】2, 3, 167, 247, 929.



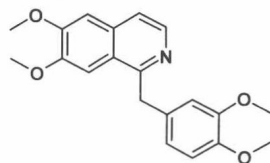
4 Laudanosine 劳丹素

[2688-77-9] $C_{21}H_{27}NO_4$ (357.45). mp (+) 89°C. 【类型】苄基异喹啉生物碱. 【活性】剧毒剂 (毒性很强, 强制性痉挛活性). 【来源】罂粟 *Papaver somniferum*, 阿片 *Papaver somniferum*. 【文献】5, 167.



5 Papaverine 罂粟碱 (帕帕非林; 6,7-二甲氧基-1-藜芦基异喹啉)

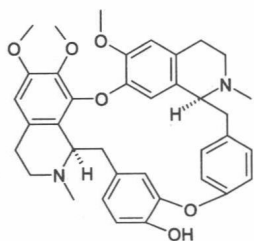
6,7-Dimethoxy-1-veratrylisoquinoline [58-74-2] $C_{20}H_{21}NO_4$ (339.39). 针状晶体, mp 147~148°C, 溶于乙醇丙酮热苯, 微溶于水.^[931] 【类型】苄基异喹啉生物碱. 【活性】抗肿瘤; 镇咳; 利胆剂; 血小板聚集抑制剂; 平滑肌松弛剂 (人, 犬); 肠道平滑肌松弛剂 [*in vitro*, 大鼠回肠, 1μg/mL, 松弛效应 = (28.6±7.3)%, $P<0.05$]^[798]; LD_{50} (鼠, iv) = 46.3mg/kg, LD_{50} (大鼠, orl) = 750mg/kg, LD_{50} (鼠, orl) = 528mg/kg. 【来源】白花罂粟 *Papaver album*, 白药子 *Stephania cepharantha*, 阿片 *Papaver somniferum* (未成熟蒴果中的乳汁干燥物: 含量范围 = 0.8%~1.0%)^[931], 印度萝芙木 *Rauwolfia serpentina*, 罂粟 *Papaver somniferum*, 罂粟壳 *Papaver somniferum*. 【文献】3, 4, 5, 167, 798, 931.



双苄基异喹啉生物碱

6 Berbamine 小檗胺

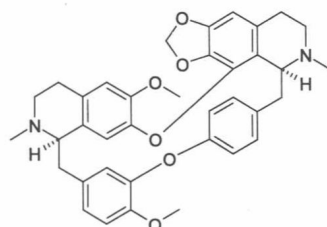
[478-61-5] $C_{37}H_{40}N_2O_6$ (608.74). 【类型】双苄基异喹啉生物碱. 【活性】抗肿瘤; 抗心律失常; 抗心肌缺血; 解痉; 抗结核 (结核分枝杆菌); 免疫增强; 增加白细胞; 抑制心肌收缩性; 抗高血压; 调节药物免疫学伤害 (鼠); 血管松弛剂 (松弛肾小管动脉条, 兔, *in vitro*); 血管扩张剂; 减慢心率. 【来源】白药子 *Stephania cepharantha*, 瓣蕊唐松草 *Thalictrum petaloideum* (根: 含量 < 0.001%)^[932], 大叶唐松草 *Thalictrum faberi* (根: 含量 < 0.001%)^[932], 华南功劳木 *Mahonia japonica*, 金丝马尾连 *Thalictrum glandulosissimum* (根: 含量 < 0.001%)^[932], 马尾连 (多叶唐松草) *Thalictrum foliolosum* (根: 含量 < 0.001%)^[932], 欧洲小檗 *Berberis vulgaris*, 日本小檗 *Berberis thunbergii*, 少齿小檗 *Berberis potaninii* (根、茎: 平均含量 = 1.665%)^[932], 台湾千金藤 *Stephania sasakii*, 细叶功劳木 *Mahonia fortunei*, 狭序唐松草 *Thalictrum atriplex* (根: 含量 < 0.001%)^[932], 鲜黄小檗 *Berberis diaphana* (根、茎: 平均含量 = 0.440%)^[932], 小果唐松草 *Thalictrum microgynum* (根: 含量 = 0.08%)^[932], 烟锅草 *Thalictrum thunbergii* (根: 含量 = 0.03%)^[932], 硬水黄连 (短梗箭头唐松草) *Thalictrum simplex* [Syn. *Thalictrum simplex* var. *brevipes*] (根: 含量 = 0.01%)^[932], 置疑小檗 *Berberis dubia* (根、茎: 平均含量 = 0.396%)^[932]. 【文献】1, 2, 3, 4, 168, 929, 932.



7 Cepharanthine 头花千金藤碱 (顶花防己碱; 金钱吊乌龟碱; 千金藤素; 西法安生)

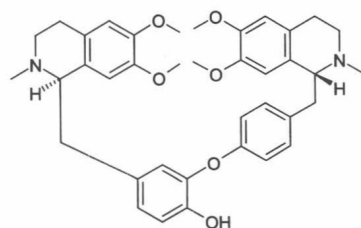
[481-49-2] $C_{37}H_{38}N_2O_6$ (606.73). 黄色针状晶体 (丙酮-苯), mp 145~155°C, $[\alpha]_D^{20} = +277^\circ$ ($c = 2$, 三氯甲烷), 溶于普通有机溶剂, 不溶于石油醚.^[931] 【类型】双苄

基异喹啉生物碱. 【活性】抗肿瘤 (HeLa, *in vitro*, $ED_{50} = 5.5\mu\text{g/kg}$; 人, HeLa-S3, *in vitro*, $ED_{50} = 7.0\mu\text{g/kg}$; EAC *in vivo*; S₁₈₀ *in vivo*; 抑制 DNA 合成); 活化淋巴结; 抗菌 (结核分枝杆菌); 抑制由溶血卵磷脂引起的无核细胞 K^+ 渗漏; 血小板聚集抑制剂 (胶原引起的血小板聚集); 抗过敏 (抑制某些过敏性休克); 解毒剂 (解酒精和蛇毒). 【来源】白药子 *Stephania cepharantha*, 地不容 *Stephania delavayi* [Syn. *Stephania epigaea*], 台湾千金藤 *Stephania sasakii*. 【文献】1, 3, 4, 5, 931.



8 Dauricine 山豆根碱

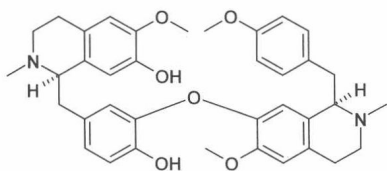
[524-17-4] $C_{38}H_{44}N_2O_6$ (624.78). mp 115°C. 【类型】双苄基异喹啉生物碱. 【活性】止痛; 抗心律失常; 抗炎; 抗高血压; 血小板聚集抑制剂 (由 ADP、肾上腺素、胶原和花生四烯酸引起的血小板聚集, *in vitro* 和 *in vivo*); 抑制小肠收缩 (兔, *in vitro*) 和减少腹部张力 (*in vivo*); 降血脂 (减少血清中的胆固醇); LD (猫, iv) = 30mg/kg; LD₅₀ (鼠, ip) = 6mg/kg. 【来源】蝙蝠葛根 *Menispermum dauricum*, 美国蝙蝠葛 *Menispermum canadense*. 【文献】3, 5, 167, 929.



9 Isoliensinine 异莲心碱

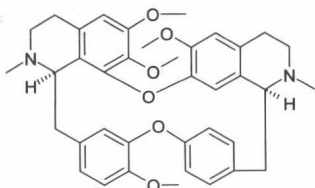
[6817-41-0] $C_{37}H_{42}N_2O_6$ (610.76). 油状物, $[\alpha]_D^{22} = +49.3^\circ$ (丙酮), $[\alpha]_D^{29} = -43.3^\circ$ (三氯甲烷). 【类型】双苄基异喹啉生物碱. 【活性】肺纤维化抑制剂 [BLM-诱导的, 作用明显, 可能是由于其抗氧化和(或)抗炎作用以及抑制 BLM-诱导的 TNF- α 和 TGF- β_1 的过

量表达]^[822]。【来源】莲子心 *Nelumbo nucifera* (成熟种子中的干燥幼叶和胚根: 7 产地平均含量 = 0.125%^[932])。【文献】5, 247, 822, 932。



10 Isotetrandrine 异粉防己碱

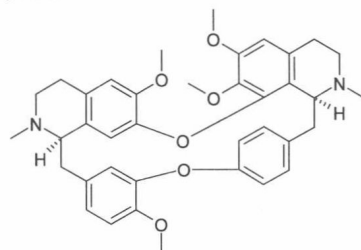
[477-57-6] $C_{38}H_{42}N_2O_6$ (622.77). mp 182°C. 【类型】双苄基异喹啉生物碱。【活性】细胞毒 (KB); 抗菌 (金黄色葡萄球菌和铜绿假单胞菌, MIC = 100 μ g/mL); 抗炎; 抗菌 (结核分枝杆菌, 动物试验); LD₅₀ (鼠, ip) = 160mg/kg, LD₅₀ (大鼠, ip) = 2700mg/kg, LD₅₀ (大鼠, orl) = 6400mg/kg. 【来源】白药子 *Stephania cepharantha*, 瓣蕊唐松草 *Thalictrum petaloideum* (根: 含量 < 0.001%)^[932], 大叶唐松草 *Thalictrum faberi* (根: 含量 < 0.001%)^[932], 华南功劳木 *Mahonia japonica*, 华南功劳叶 *Mahonia japonica*, 华南功劳子 *Mahonia japonica*, 金丝马尾连 *Thalictrum glandulosissimum* (根: 含量 < 0.001%)^[932], 马尾连(多叶唐松草) *Thalictrum foliolosum* (根: 含量 < 0.001%)^[932], 日本小檗 *Berberis thunbergii*, 狭序唐松草 *Thalictrum atriplex* (根: 含量 < 0.001%)^[932], 香唐松草 *Thalictrum foetidum*, 小果唐松草 *Thalictrum microgynum* (根: 含量 < 0.001%)^[932], 烟锅草 *Thalictrum thunbergii* (根: 含量 < 0.001%)^[932], 银不换 *Cyclea barbata*, 硬水黄连(短梗箭头唐松草) *Thalictrum simplex* [Syn. *Thalictrum simplex* var. *brevipes*] (根: 含量 = 0.35%)^[932]。【文献】5, 167, 932。



11 Obaberine 黄小檗碱

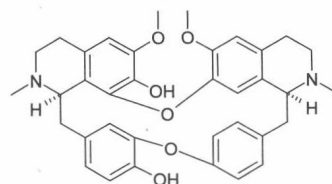
[1263-80-5] $C_{38}H_{42}N_2O_6$ (622.77). mp 139~140°C. 【类型】双苄基异喹啉生物碱。【活性】抗高血压 (犬, 2mg/kg, 降低血压 5.3328kPa); 抗菌 (金黄色葡萄球

菌和包皮垢分枝杆菌, MIC = 1mg/mL; 结核分枝杆菌无血清时的有效浓度 = 7.8 μ g/mL, 有血清时的有效浓度 = 62.5 μ g/mL); 抗真菌 (白色念珠菌, MIC = 1mg/mL); 抗锥虫; 抗病毒 (流行性感冒病毒, 1mg/mL)。【来源】黄小檗 *Berberis tschonoskiana*, 匍匐十大功劳 *Mahonia repens*, 三蕊莲桂 *Dehaasia triandra*, 透明唐松草* *Thalictrum lucidum*, 狭叶唐松草 *Thalictrum incisum*, 小唐松草 *Thalictrum minus*。【文献】3, 167。



12 (+)-Obamegine (+)-黄小檗树碱 (千金藤福灵)

[479-37-8] $C_{36}H_{38}N_2O_6$ (594.71). 无色针状晶体 (乙醚), mp 164~166°C, [α]_D¹¹ = +98.9° (c = 0.2022, 甲醇)。【类型】双苄基异喹啉生物碱。【活性】线粒体呼吸链复合物 I 抑制剂 [IC₅₀ = (1.41±0.13) μ mol/L, Rolliniastatin-1, IC₅₀ = (0.6±0.04)nmol/L, 鱼藤酮, IC₅₀ = (5.10±0.90)nmol/L]^[788]; 抗高血压 (犬, 0.5、1.0 和 2.0mg/kg 剂量, 分别降低血压 7.71、8.65 和 9.98kPa); 抗菌 (金黄色葡萄球菌、大肠杆菌、鸡沙门菌和肺炎杆菌, MIC = 100 μ g/mL; 包皮垢分枝杆菌, MIC = 50 μ g/mL); 抗真菌 (白色念珠菌, MIC = 100 μ g/mL)。【来源】哥伦比亚木瓣树* *Xylopia columbiana* (果实), 黄根树 *Xanthorrhiza simplicissima*, 黄小檗 *Berberis tschonoskiana*, 匍匐十大功劳 *Mahonia repens*, 千金藤 *Stephania japonica*, 透明唐松草* *Thalictrum lucidum*, 绉纹唐松草 *Thalictrum rugosum*。【文献】5, 169, 788。



13 Oxycanthine 刺檗碱 (尖刺碱)

Oxycanthine; 6,6',7-Trimethoxy-2,2'-dimethyloxyacanthan-12'-ol [548-40-3] $C_{37}H_{40}N_2O_6$ (608.74). 晶体 (石