



TCM Series of Active Components

Multitargets Active Components in TCM

中药药理活性成分丛书

多靶标的中药 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

Multitargets Active Components in TCM

中药药理活性成分丛书

多靶标的中药活性成分

周家驹 谢桂荣 严新建 编著

湖北工业大学图书馆



01302735



R284/28

科学出版社

北京

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

多靶标的中药活性成分 / 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 978-7-03-033808-2

I. 多… II. ①周…②谢…③严… III. 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 041546 号

责任编辑: 戚东桂 郑 红 / 责任校对: 宋玲玲

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: 20 1/2

字数: 658 000

定价: 98.00 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

周家驹

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, 在本丛书中, 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顺序号。读者可根据这些顺序号从正文后面的“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

在中药现代化研究中,一个最重要的研究方向就是系统地诠释中药系统的科学性和作用机制,包括系统地阐明中药系统的物质基础。当前,这方面的研究还只是处于提出和尝试新的研究方法的探索阶段。无论人们尝试何种新的方法,都需要系统的中药活性成分数据作为研究的基础数据,特别是常用中药的活性成分数据。我们专门编写这本《多靶标的中药活性成分》就是为中药现代化研究提供一组核心基础数据。

本书收集了来自 2377 种中药原植物及其同属植物的小分子活性成分 558 种。全书引用参考文献 1026 篇,文献收集年代至 2004 年。

在这 558 种中药活性成分当中,每一种都有多种药理活性,都是多靶标的中药活性成分。值得注意的是,在大多数情况下,这些多靶标的中药活性成分同时也有多种原植物的来源。下文中我们简称这些多靶标、多来源的活性成分为“多靶多源成分”。下面给出一些经过归纳、整理的各主要结构类别的多靶多源成分实例。

一、生物碱中多靶多源成分实例

1. 小檗碱 (21) 有下列药理活性:细胞毒 (P_{388} 、9L、6 种食管癌细胞)、抗微生物、抗菌(变异链球菌、核粒梭形杆菌)、抗炎、退热剂、增加缺氧的耐受性、抗原生动物、扩张血管、松弛血管平滑肌、抗高血压、降血糖、局部麻醉、催眠(延长戊巴比妥睡眠时间)、镇静、止痛、激动肾上腺素能 α_1 -和 α_2 -受体、利胆、抗腹泻、兴奋平滑肌(子宫、膀胱、胃肠道和支气管)、减少兔眼节点内压。

在下列 30 种常用的中药原植物中,小檗碱的含量在 0.12%~8.77%,如防己 0.15%、长矩延胡索 0.12%、灰绿延胡索 0.16%、川滇十大功劳木 0.43%、湖北十大功劳木 0.19%、细柄十大功劳木 0.23%、小果十大功劳木 0.48%、细叶功劳木 0.48%、华南功劳木 0.14%、宽苞十大功劳 0.30%、十大功劳木 0.38%、大叶唐松草 0.46%、狭序唐松草 0.21%、少齿小檗 0.32%、置疑小檗 0.60%、望春玉兰 0.14%、硬水黄连 0.28%、金丝马尾连 1.16%、马尾连 1.25%、黄柏 1.27%、鲜黄小檗 1.28%、城口十大功劳 1.67%、黄皮树 3.65%、短萼黄连 5.31%、古蔺野连 4.82%、黄连 5.92%、三角叶黄连 4.39%、云南黄连 8.10%、线萼黄连 8.39%、峨眉野黄连 8.77%。可以看出,小檗碱在许多常用中药中都是一种常量多靶标活性组分。

2. 白屈菜红碱 (28) 有下列药理活性:抗肿瘤(人头颈鳞状细胞癌 SQ-20B)、细胞毒(GI-101A 乳腺癌细胞、MCF7 细胞、PC3 人前列腺癌细胞、AGS 胃癌细胞、人鳞片细胞癌、氧化磷酸化解偶联)、抗细菌、抗真菌、抗病毒、抗炎、止痛、抗高血压、镇静(延长睡眠时间)、抑制剂蛋白激酶 C、引起流产(低剂量引起麻痹、高剂量时致死)、抑制转氨酶、毒素(神经肌肉毒性、抑制心脏)。白屈菜红碱在中药博落回中的含量为 8.97%。

二、萜类中多靶多源成分实例

1. 齐墩果酸 (239) 有下列药理活性:抗肿瘤 (S_{180})、引导细胞凋亡 (HL-60)、细胞毒

(HL-60、MCF7、Bel7402、BGC823、HeLa、A2780、K562、B16 (F-10)、SK-MEL-2、PC3、LOX-IMVI、A549、L₁₂₁₀)、抗结核(结核分枝杆菌)、抗炎、抗氧化(超氧化物阴离子清除剂)、抗疟原虫(恶性疟原虫 FcB1)、抗锥虫、强心、利尿、降血糖、抑制丙氨酸氨基转氨酶、减少毛细血管渗透性、促进肝细胞修复和再生、抑制血小板聚集、选择性抑制 COX-2、拮抗转化生长因子- β_1 (此结果建议 TGF- β_1 拮抗活性至少部分地是猫须草治疗肾病的原因)。

在下列 15 种常用中药原植物中, 齐墩果酸的含量在 0.2%~10.8%, 是一种常量多靶标活性组分, 如平车前 0.204%、车前 0.227%、夏枯草 0.233%、石楠 0.653%、柿叶 0.430%、土当归 0.42%、冬凌草 0.466%、秋木瓜 1.03%、牛膝 1.23%、槲寄生 1.49%、白花蛇舌草 1.68%、连翘 2.28%、樺木 3.31%、辽东樺木 4.98%、女贞子 10.79%。

2. 熊果酸 (252) 有下列药理活性: 抗肿瘤(鼠腹水癌)、细胞毒(KB、Hep3B、Colon205、HeLa、HONE-1、HT29)、抗菌(多种葡萄球菌、革兰阳性菌、革兰阴性菌、酵母菌、大肠杆菌、枯草杆菌)、抗结核(结核分枝杆菌)、抗 HIV、抗炎、退热、选择性抑制 COX-2、降低血清转氨酶、抗锥虫、刺激黏液素释放(可能用于治疗慢性气管病)、抑制血小板聚集、抗风湿、抗糖尿病、抗溃疡、降血脂、抗动脉粥样硬化、抗惊厥、拮抗转化生长因子- β_1 (此结果建议 TGF- β_1 拮抗活性至少部分地是猫须草治疗肾病的原因)、糖皮质激素样作用(增加肝糖原, 降低心肌和横纹肌糖原)。

在下列 17 种常用中药原植物中, 熊果酸的含量在 0.2%~3.0%, 是一种常量多靶标活性组分, 如白花蛇舌草 0.21%、马鞭草 0.23%、山茱萸 0.26%、平车前 0.28%、车前 0.97%、冬凌草 0.41%、枸骨叶 0.96%、湖北山楂 0.46%、山楂 0.44%、野山楂 0.40%、枇杷叶 0.68%、柿叶 0.78%、锁阳 0.78%、夏枯草 0.78%、石楠 1.50%、红花鹿蹄草 2.06%、皱叶鹿蹄草 3.00%。

三、黄酮类多靶多源成分实例

1. 金丝桃苷 (304) 有下列药理活性: 抗菌(嗜麦芽假单胞菌)、抗炎、抗氧化(DPPH 清除剂、cDNA 微阵列研究、人胃癌细胞 SNU-668、上调 50 种基因、下调许多其他基因、许多基因和氧化机制有关)、止痛、镇咳、抑制醛糖还原酶、抑制血管紧张素转化酶(ACE)、抑制剂中性肽链内切酶(NEP)。

金丝桃苷存在于蓼科樺木属、胡桃属的许多植物中。在下列 22 种常用中药原植物中, 金丝桃苷的含量在 0.1%~1.23%, 是一种常量多靶标活性组分, 如弯萼金丝桃 0.10%、川滇金丝桃 0.46%、近无柄金丝桃 0.720%、遍地金 0.43%、察隅遍地金 0.35%、挺茎遍地金 0.90%、朝鲜淫羊藿 0.13%、地耳草 0.504%、地榆 0.13%、贯叶连翘 1.01%、荷叶 0.72%、黄海棠 0.102%、黄蜀葵花 1.23%、款冬花 0.28%、罗布麻 0.98%、满山红 0.42%、毛山楂 0.17%、无毛山楂 0.32%、三白草 0.35%、扬子小连翘 0.46%、元宝草 0.21%、照山白 0.72%。

2. 山柰酚 (309) 有下列药理活性: 抗 HIV-1(抑制反转录酶<RT>、核糖核酸酶 H、整合酶 IN)、抗菌、抗炎(抑制 IL-5)、镇咳用于治疗气管炎、抗氧化(清除 DPPH、清除超氧化物阴离子)、抑制 Δ^5 -脂加氧酶、抑制碘化甲状腺原氨酸脱碘、抑制醛糖还原酶(可治愈糖尿病型白内障)。

山柰酚存在于十字花科、夹竹桃科、五桠果科、毛茛科、豆科的许多种植物中。在下列 6 种常用中药原植物中, 山柰酚的含量在 0.18%~0.69%, 是一种常量多靶标活性组分, 如白果叶 0.18%、蜂胶 0.67%、红花 0.35%、蒙古黄芪 0.44%、木贼 0.69%、菟丝子 0.198%。

3. 槲皮素 (318) 有下列药理活性: 抗 HIV-1 (抑制反转录酶<RT>、抑制整合酶<IN>)、平喘 (用于治愈慢性支气管炎)、抗菌、抗高血压、抗肝毒、抗炎 (抑制 COX-1、抑制 COX-2、细胞因子网络调节器: 抑制巨噬细胞 RAW264.7 中脂多糖刺激的 TNF- α 和 IL-6 的释放、细胞核因子- κ B 途径、抑制 NO 生成)、抗病毒、扩张冠状动脉 (增加冠脉血流)、镇咳 (祛痰)、抗高血脂、抑制 5-羟色胺、松弛平滑肌、抑制血小板聚集、抑制 3', 5'-cAMP-磷酸二酯酶、抑制脂肪酸合成、抑制醛糖还原酶、抑制蛋白激酶 C、减少毛细血管脆性、抗氧化 (超氧化物阴离子清除、清除 DPPH)、白介素-10 样活性、抑制醛糖还原酶、抑制白细胞弹性蛋白酶 MMP-2/9、抑制 TNF- α 分泌 (RAW264.7 巨噬细胞, 妨碍 JNK/SAPK 及其下游底物 c-Jun、ATF-2、ERK1/2 和 p38 MAPK 的磷酸化和活化); 抑制 AP-1 (活化蛋白-1) 的活化、黄质氧化酶剂。

槲皮素存在于许多植物中, 特别是果实, 如几乎在所有伞形科多种植物中都有发现。在下列 16 种常用中药原植物中, 槲皮素的含量在 0.099%~2.55%, 是一种常量多靶标活性组分, 如白果叶 2.55%、遍地金 0.147%、侧柏叶 0.25%、秤杆升麻 0.095%、蜂胶 0.41%、红花 0.49%、黄海棠 0.1107%、金丝梅 0.6401%、满山红 0.099%、木贼 0.179%、石韦 0.11%、石指甲 0.131%、菟丝子 0.150%、展萼金丝桃 0.1595%、照山白 0.29%、珍珠梅 0.62%。

4. 芦丁 (325) 有下列药理活性: 抗炎 (清除自由基、抑制 COX-2)、抗病毒 (疱疹口腔炎病毒)、抗氧化 (清除超氧化物阴离子、清除 DPPH)、抑制醛糖还原酶、从脂肪肝中除去脂肪、减少毛细血管渗透性和脆性、用于治疗毛细血管疾病、昆虫 *Heliothis zea* 拒食剂、昆虫 *Gastrophysa atrocynea* 吞噬兴奋剂、*Papilio xuthus* 接触排卵刺激剂。

芦丁存在于超过 30 个科的许多植物中, 大部分是双子叶植物。在下列 16 种常用中药原植物中, 芦丁的含量在 0.15%~9.33%, 是一种常量多靶标活性组分, 如醋柳果 0.24%、贯叶连翘 0.31%、红花 1.24%、槐 9.33%、槐角 3.15%、金丝梅 0.27%、苦荞麦 4%、款冬花 2.64%、枋果沙棘 0.27%、美花凤毛菊 0.22%、桑叶 0.36%、小蓟 0.15%、野山楂 0.17%、云南沙棘 0.20%、中国沙棘 0.35%、中亚沙棘 0.39%。

四、简单苯衍生物中多靶多源成分实例

1. 原儿茶酸 (415) 有下列药理活性: 抗菌 (白色葡萄球菌、金黄色葡萄球菌、肺炎双球菌、 α -链球菌属、大肠杆菌、铜绿假单胞菌、变形杆菌和流感嗜血杆菌)、抗真菌 (灰分真菌)、抗炎、抗氧化 (清除超氧化物阴离子、清除 DPPH)、减少心肌氧消耗、活化前列腺素合成酶、平喘、镇咳 (祛痰)、抗肝毒。

原儿茶酸存在于许多高等植物中, 如荞麦属、桉木属等。在下列 18 种常用中药原植物中, 原儿茶酸的含量在 0.09%~0.40%, 是一种常量多靶标活性组分, 如甘西鼠尾草 0.34%、黄花鼠尾草 0.46%、戟叶鼠尾草 0.30%、栗色鼠尾草 0.34%、毛地黄鼠尾草 0.14%、三叶鼠尾草 0.15%、革叶猕猴桃 0.34%、华南猕猴桃 0.40%、金花猕猴桃 0.17%、京梨猕猴桃 0.32%、阔叶猕猴桃 0.18%、毛花猕猴桃 0.14%、美味猕猴桃 0.16%、猕猴桃 0.26%、猕猴桃 0.11%、木天蓼 0.31%、南丹参 0.22%、拟丹参 0.09%。

2. 没食子酸 (416) 有下列药理活性: 抗肿瘤 (鼠肺腺瘤)、抗诱变、细胞毒 (氧化剂实验)、抗菌 (金黄色葡萄球菌、八叠球菌属、 α -链球菌、奈瑟球菌属、铜绿假单胞菌、痢疾杆菌、伤寒杆菌和副伤寒杆菌 A; 胡萝卜软腐欧文菌, 金黄色葡萄球菌, 邻居棒状杆菌); 抗真菌 (白色念珠菌, 17 种真菌)、抗病毒 (流行性感病毒)、抗炎、抗氧化 (清除 DPPH)、

收敛(家畜的肠道)、平喘、利胆、抑制胰岛素降解、白介素-10 样活性、抑制细胞生长(对 tsFT210 细胞 G₂/M 期有抑制作用);抑制血管紧张素转化酶(ACE)、抑制中性肽链内切酶 NEP、黄质氧化酶抑制剂、抗过敏。

没食子酸存在于许多植物中,在下列 11 种常用中药原植物中,没食子酸含量在 0.12%~1.13%,是一种常量多靶标活性组分,如甘西鼠尾草 0.340%、大黄 0.282%、掌叶大黄 0.30%、唐古特大黄 0.93%、河套大黄 0.38%、地榆 0.25%、青果 0.216%、山茱萸 0.147%、叶下珠 0.115%、诃子 1.04%、白芍 1.13%。

五、苯丙烯类多靶多源成分实例

1. 洋丁香酚苷(435) 有下列药理活性:抗细胞凋亡(预防神经毒剂 MPP⁺诱导的顺面高尔基体管网状结构(CGN)死亡、抑制乳酸脱氢酶 LDH 的泄漏、改善细胞的生存能力)、细胞毒(L6)、抗炎、抗氧化(清除 DPPH、抗溶血、抑制 Cu²⁺或 AAPH 诱导的低密度脂蛋白过氧化,以藜芦酚活性为 1,相对活性>6.9)、抑制最低程度氧化的 LDL 诱导的分子毒性、升高血压、抑制弹性蛋白酶、抗肝毒、抑制 5-脂加氧酶、抑制醛糖还原酶、抗疟疾、抗利什曼原虫、抗锥虫,洋丁香酚苷存在于许多植物中。在肉苁蓉、杜虹花、密蒙花、小野芝麻中含量较高,即肉苁蓉 0.338%、杜虹花 1.06%、密蒙花 1.26%、小野芝麻 1.17%。

2. 咖啡酸(437) 有下列药理活性:抗细菌、抗真菌、抗病毒、抗炎[抑制 COX-2, 100μmol/L,抑制率为(32±16)%]、止痛、抗氧化剂(清除 DPPH、抑制大鼠红细胞的溶解,对细胞膜有强烈保护作用);抗肝毒、抗溃疡、止血、利胆(促进胆汁分泌)、促进胃液分泌、刺激白细胞生成、兴奋中枢(大鼠)、抑制弹性蛋白酶、保护神经。咖啡酸以游离苷元或糖苷的形式广泛分布于植物界,在一项早期系统研究中,Bate-Smith 发现,他所研究的植物中 66%的双子叶植物和 50%的单子叶植物都含有咖啡酸。已有的定量数据含量在千分之几数量级。

3. 桂皮酸(438) 有下列药理活性:抗细菌、抗真菌、解痉、利胆、刺激白细胞生成、轻泻药、刺激剂(引起接触性皮炎)、保护神经、抑制弹性蛋白酶。桂皮酸存在于许多植物中。在苏合香、安息香、西藏胡黄连中含量高,如安息香 16.9%、苏合香 7.03%、西藏胡黄连含量范围在 0.53%~1.13%。

4. p-香豆酸(439) 有下列药理活性:细胞毒(P₈₁₅和 P₃₈₈)、抗细菌(革兰阳性菌有金黄色葡萄球菌、表皮葡萄球菌、酿脓链球菌、变异链球菌、粪肠球菌、鹌鸡肠球菌 CDC-42,革兰阴性菌有鼠伤寒沙门菌、大肠杆菌、阴沟肠杆菌、肺炎克雷伯菌、铜绿假单胞菌、创伤弧菌、弗氏枸橼酸杆菌)、抗真菌、抗肝毒、抗高血脂、保护神经、利胆(促进胆汁分泌)。p-香豆酸在许多植物中作为配糖体存在,Bate-Smith 发现他所研究的 48%的双子叶植物和 55%的单子叶植物都含有对-香豆酸。对-香豆酸存在于许多植物中,作为配糖体。

5. 丁香酚(440) 有下列药理活性:抗细菌(金黄色葡萄球菌、肺炎杆菌、大肠埃希菌、志贺痢疾杆菌、变形杆菌)、抗真菌(病原体真菌)、抗氧化、中枢神经系统活性(麻醉、降低血压、抑制呼吸和抗惊厥)、抑制血小板聚集、退热(白介素导致的发热兔,机制为抑制脑内 PG 合成)、抗炎、松弛平滑肌(血管平滑肌、肠平滑肌、离体子宫平滑肌、豚鼠气管平滑肌、豚鼠回肠平滑肌,但能引起大鼠离体膀胱收缩)、抗雄激素(抑制睾酮-5α-还原酶)。丁香酚存在于许多植物中。在丁香和肉豆蔻中的含量高:丁香 12.49%、肉豆蔻 0.456%。

6. 阿魏酸 (441) 有下列药理活性: 抗肿瘤、抗有丝分裂、细胞毒 (COX-1 抑制剂)、抗菌、抗雌激素、抗真菌、抗肝毒、抑制血小板聚集、抗氧化 (清除 DPPH、清除超氧化物阴离子)、抗结核 (结核分枝杆菌)、抑制血小板聚集、保护神经。阿魏酸在植物中有广泛分布, 首次从臭阿魏中分离得到。Bate-Smith 发现, 在所研究的植物中 33% 的双子叶植物和 67% 的单子叶植物都含有阿魏酸。已有的定量数据含量在万分之几到 2%。

六、芪类多靶多源成分实例

藜芦酚 (464) 有下列药理活性: 细胞毒 (抑制 COX-1)、抗致癌活性、抑制 COX-1 和 COX-2、抗菌、抗真菌、抗氧化 (抑制大鼠肝细胞线粒体脂质过氧化、清除 DPPH、清除超氧化物阴离子、抑制脂类过氧化)、抗炎 (细胞核因子- κ B 途径、抑制 iNOS 的表达和 NO 的产生、抑制 COX-1/COX-2、细胞因子网络调节器: 阻断 TNF- α 诱导的 HUVECs 和 THP-1 细胞之间的黏附)、抑制通过 LO 酶途径的前列腺素类化合物、通过抑制 LOX 酶和 COX 酶途径的 K562 细胞细胞凋亡、抗高血脂 (抑制肝损害)、抑制血小板聚集、抗过敏、植物抗毒素。藜芦酚存在于许多植物中, 在虎杖根中的含量为 1.10%。

七、蒽醌类多靶多源成分实例

1. 大黄酚 (482) 有下列药理活性: 细胞毒 (K562)、抗菌 (α -链球菌、肺炎双球菌、流感杆菌、卡他球菌)、促凝 (刀伤凝固期)、利尿剂、镇咳、麻痹肌肉、刺激神经、促进肠运动。大黄酚存在于许多植物中, 分布非常广泛, 包括决明属、酸模属、大黄属、阿福花属、繆式蓼属等。已有的定量数据含量在千分之几数量级。

2. 大黄素 (483) 有下列药理活性: 抗肿瘤 (B16, BL, EAC)、细胞毒 (Walker、P₃₈₈、L6、Calu1、HeLa、K562、Raji、Vero、Wish、蒽醌上的 1, 3, 8-三羟基对细胞毒活性起重要作用)、利尿剂、抗高血压、抗真菌 (趾间发癣菌, 小孢子菌属)、抗细菌 (金黄色葡萄球菌、大肠杆菌、铜绿假单胞菌、痢疾杆菌、流感杆菌、枯草杆菌、副伤寒杆菌、卡他球菌和 α -链球菌)、抗螺旋体、抗锥虫、抗利什曼原虫、抗疟疾 (恶性疟原虫)、解痉、镇咳、抑制马铃薯花盘冠瘿生长。大黄素存在于许多植物中, 已有的定量数据含量在万分之几数量级。

八、甾族化合物中多靶多源成分实例

1. β -谷甾醇 (374) 有下列药理活性: 抗肿瘤 (鼠 Lewis 肺癌和腺癌 715、大鼠 W₂₅₆)、抗突变、细胞毒 (P₃₈₈、A549、HT29、MCF7、K562、Bowes、T24S)、抗炎、镇咳、抗高血脂 (减少胆固醇)、抑制 12 (S)-脂加氧酶、保护胃、抑制血小板聚集、抑制酪氨酸酶。 β -谷甾醇是高等植物中最常见的甾醇, 存在于许多植物中。已有的定量数据含量在万分之几到千分之几数量级。

2. 豆甾醇 (376) 有下列药理活性: 抗突变、细胞毒 (KB)、抗病毒 (Para3 病毒)、抗疟疾 (恶性疟原虫 K1)、抗利什曼原虫、抗锥虫、抗高血脂、抑制血小板聚集。豆甾醇存在于许多植物中, 已有的定量数据含量在万分之几数量级。

九、脂肪族中多靶多源成分实例

1. 琥珀酸 (381) 有下列药理活性: 抗菌 (金黄色葡萄球菌、卡他球菌、铜绿假单胞菌、

变形杆菌、伤寒杆菌、痢疾杆菌)、抗溃疡、止痛、退热、解毒、抗惊厥、镇静,用于治疗中耳炎、甲沟炎、脓包疮、烧伤感染、化脓性扁桃体炎和肠炎。琥珀酸存在于许多植物中,在山楂中含量较高,如山楂 1.55%、云南山楂 1.58%。

2. 绿原酸 (383) 有下列药理活性:抗肿瘤、细胞毒 (L6、K562)、抗诱变、抗菌、抗病毒、抗氧化 (清除 DPPH)、抗疟疾 (恶性疟原虫)、抗利什曼原虫、抗锥虫、止血 (缩短血凝和出血时间)、利胆 (大鼠)、促进肠运动 (鼠和大鼠)、兴奋中枢、兴奋子宫、刺激白细胞生成、致敏。绿原酸最初从咖啡中分离,存在于许多植物中,包括沙戟属、缬草属、千里光属、阔苞菊属和金丝桃属。在下列 22 种常用中药原植物中,绿原酸含量在 0.15%~4.80%,是一种常量多靶标活性组分,如北京石韦 1.64%、庐山石韦 0.605%、拟光石韦 0.44%、石韦 0.154%、西南石韦 0.711%、有柄石韦 0.66%、毡毛石韦 0.60%、朝鲜淫羊藿 0.25%,杜仲叶的春季叶平均含量 3.42%、秋季叶平均含量 0.65%,华南忍冬 3.97%、细毡毛忍冬 4.80%、腺叶忍冬 2.40%、忍冬藤 1.73%、檫木 2.05%、金银花 3.21%、菊花 0.31%、蒲公英 0.91%、桑叶 1.38%、台湾蒲公英 0.28%、药用蒲公英 0.29%、野菊花 0.23%。

十、香豆素类多靶多源成分实例

1. 滨蒿内酯 (500) 有下列药理活性:抗高血压、止痛、平喘 (支气管炎气喘)、抗炎、利胆剂、扩张血管 (扩张冠状动脉) 利尿、雌激素样活性、增加脑血流量、抑制钙活化及释放 (血管平滑肌)、抗肿瘤 (Raji 细胞)、抑制血小板聚集、细胞毒 (KB、Hep3B、Colon205、HeLa)。滨蒿内酯存在于许多植物中,在蒿属中含量较高:黄蒿 0.46%、茵陈蒿含量范围 2.0%~2.6%。

2. 伞形花内酯 (502) 有下列药理活性、抗肿瘤 (Raji 细胞)、细胞毒 (9KB)、抑制 NO 生成 (脂多糖活化的鼠腹膜巨噬细胞)、抑制 AChE、抗高血压、抗细菌 (大肠杆菌和枯草杆菌)、抗真菌 (须发癣菌、红色发癣菌和白色念珠菌)、解痉、镇静。伞形花内酯存在于许多植物中,包括当归属、蒿属、小冠花属、阿魏属、芸香属。已有的定量数据含量在十万分之几数量级。

3. 鞣花酸 (503) 有下列药理活性:止血、兴奋子宫、抗诱变 (芳香碳氢化合物引起的诱变)、抗疟原虫、抑制血管紧张素转化酶 (ACE)、抑制中性肽链内切酶 (NEP)、抗细菌 (胡萝卜软腐欧文菌、金黄色葡萄球菌、邻居棒状杆菌)、抗真菌 (白色念珠菌)、抑制黄质氧化酶。鞣花酸广泛分布于高等植物: Bate-Smith 发现在双子叶植物中有 75 个属都含有鞣花酸。

目 录

1. 生物碱	1
1.1 异喹啉类生物碱	1
异喹啉类生物碱/1 苄基异喹啉类生物碱/1 双苄基异喹啉类生物碱/1 阿朴啡类生物碱/4 原小檗碱类生物碱/6 前阿片碱类生物碱/9 苯并[c]菲啶类生物碱/10 吗啡类生物碱/12 2-苯并[c]呋喃酮异喹啉类生物碱/12	
1.2 喹啉类生物碱	13
呋喃并喹啉类生物碱/13	
1.3 喹唑啉类生物碱	13
1.4 吡咯烷类生物碱	14
吡咯烷类生物碱/14 吡咯烷士定类生物碱/14 吡咯烷士定类生物碱(大环内酯)/14 菲并吲哚里西定类生物碱/14 百部碱类生物碱/15 莨菪烷类生物碱/15	
1.5 吲哚类生物碱	15
吡啶并咔唑类生物碱/15 环色胺类生物碱/16 阿枯米辛类生物碱/16 长春里宁类生物碱/16 Strictosidine 类生物碱/16 类阿吗碱类生物碱/17 洪达木类生物碱/18 育亨宾类生物碱/19 蛇根精类生物碱/19 老刺木碱类生物碱/20 吴茱萸碱类生物碱/20 白坚木属生物碱/21 柯楠碱类生物碱/21 阿吗灵类生物碱/22 吲哚杂类生物碱/22	
1.6 吡啶和哌啶类生物碱	23
吡啶类生物碱/23 喹啉定类生物碱/23 哌啶类生物碱/25 一叶萩碱类生物碱/25	
1.7 有机胺和酰胺类生物碱	25
有机胺类生物碱/25 酰胺类生物碱/26 麻黄类生物碱/27	
1.8 石蒜科生物碱	28
石蒜碱类生物碱/28 水仙环素类生物碱/29	
1.9 甾醇生物碱	29
cerveratrum 类甾醇生物碱/29 Spirosolane 类甾醇生物碱/30 孕甾烷类甾醇生物碱/31 茄啶类甾醇生物碱/31	
1.10 萜类生物碱	31
单萜生物碱/31 大环倍半萜生物碱/32 C ₁₉ -二萜生物碱/32	
1.11 其他生物碱	34
脲和异脲类生物碱/34 嘌呤类生物碱/34 咪唑类生物碱/36 嘧啶类生物碱/36 丽春花碱类生物碱/36 马兜铃内酰胺类生物碱/36 双环杂类生物碱/37 杂类生物碱/37	
1.12 氨基酸和肽类	37
柄形肽类/37	
2. 萜类	39

2.1	单萜	39
	环烯醚类单萜/39 开环环烯醚类单萜/41 薄荷烷型单萜/42 侧柏烷型单萜/43 蒎烷型单萜/43	
2.2	倍半萜	45
	没药烷型倍半萜/45 榄香烷型倍半萜/45 大牻牛儿烷型倍半萜/46 蛇麻烷型倍半萜/46 桉烷型倍半萜/46 杜松烷型倍半萜/47 移杜松烷型倍半萜/47 愈创木烷型倍半萜/48 伪愈创木烷型倍半萜/48 木防己苦烷型倍半萜/48 重排绿叶烷型倍半萜/48 开环Prezizaane 烷型倍半萜/49 香树烷型倍半萜/49 雅檯蓝烷型倍半萜/49	
2.3	二萜	50
	半日花烷型二萜/50 松香烷型二萜/50 去甲松香烷型二萜/51 移松香烷型二萜/53 海松烷型二萜/53 异海松烷型二萜/54 贝壳杉烷型二萜/55 假白榄烷型二萜/56 瑞香烷型二萜/56 巴豆烷型二萜/56 紫杉烷型二萜/57 杂类二萜/58	
2.4	三萜	59
	环羊毛甾烷型三萜/59 达玛烷型三萜/59 裂环四去甲三萜/63 苦木素类去甲三萜/64 羽扇豆烷型三萜/64 齐墩果烷型三萜/67 无羁萜烷型三萜/74 乌苏烷型三萜/75 山柑子烷型三萜/76	
2.5	四萜和局部萜	76
	四萜/76 局部萜/77 Megastigmane 去甲萜/78	
3.	黄酮类	79
3.1	黄酮类	79
3.2	二氢黄酮类	89
3.3	黄酮醇类	92
3.4	二氢黄酮醇类	106
3.5	异黄酮类	108
3.6	二氢异黄酮类	111
3.7	黄烷-3-醇类	112
3.8	异黄烷类	114
3.9	查耳酮类	115
3.10	噢哢类	116
3.11	双黄酮类	116
4.	甾族化合物	118
4.1	强心甾内酯类	118
4.2	胆甾烷类	118
4.3	螺甾烷类	119
4.4	睡茄内酯类	119
4.5	豆甾烷类	120
4.6	蟾酥内酯类	124
4.7	雄甾烷类	124

5. 脂肪族天然产物	125
5.1 链状化合物	125
5.2 单碳环化合物	126
5.3 长链芳香系统	128
5.4 含硫化合物	129
6. 聚酮化合物	131
6.1 番荔枝乙酰精宁类	131
7. 含氧杂环	133
7.1 2-吡喃酮类	133
7.2 β 内酯类	133
7.3 丁内酯类	133
7.4 戊内酯类	134
7.5 螺缩酮类	135
7.6 桉油精类	135
8. 简单芳香化合物	136
8.1 简单苯衍生物	136
8.2 苯丙烯类	142
8.3 酰基间苯三酚类	152
8.4 咕吨酮类	153
8.5 芪类	154
8.6 芪聚合物类	156
8.7 其他二芳基化合物	157
二芳丙烷类/157 二芳庚烷类/157	
9. 多环芳香化合物	159
9.1 萘和萘醌类	159
萘醌类/159	
9.2 蒽和蒽醌类	160
蒽类/160 蒽醌类/160	
10. 苯并呋喃和苯并吡喃类	164
10.1 苯并呋喃类	164
10.2 呋喃并-1-苯并吡喃类	165
11. 香豆素类	167
11.1 香豆素类	167
11.2 双香豆素类	171
11.3 呋喃并香豆素类	171
11.4 吡喃并香豆素类	174

12. 木脂体和鞣质	177
12.1 木脂体	177
12.2 萘基类木脂体	184
12.3 二苯并环辛二烯木脂体	184
12.4 新木脂体	185
13. 鞣质	186
13.1 没食子酯鞣质	186
13.2 黄酮鞣质	188
参考文献	189
化合物药理活性索引	201
化合物中文名称索引	223
化合物英文名称索引	233
植物中文名称及活性成分索引	245
植物拉丁学名及活性成分索引	276
附录 1 缩写和符号表	304
附录 2 癌细胞代码	308