



华夏英才基金学术文库

季宇彬 主编

天然药物有效成分 药理与应用



科学出版社

www.sciencep.com



华夏英才基金学术文库

天然药物有效成分药理与应用

季宇彬 主编

科学出版社

北京

内 容 简 介

本书详尽、系统地归纳和总结了国内外对天然药物有效成分的研究进展,将传统的天然药物药理作用和临床应用与其有效成分有机地结合起来,从而为天然药物的有效成分与其作用机理的相关性研究提供了思路,为天然药物的现代化研究奠定了理论和方法学基础。

本书对百余种天然药物有效成分的国内外研究进行了综合和分析,按 CAS、异名、化学名、结构式、分子式与相对分子质量、来源、理化性质、药理作用、临床应用等项编写,体现了天然药物有效成分在提取、分离、纯化、鉴定、药理、临床等方面的研究进展。

本书可供从事天然药物研究或对天然药物有浓厚兴趣的临床、教学、科研工作者以及医药院校高年级学生参考。

图书在版编目(CIP)数据

天然药物有效成分药理与应用/季宇彬主编. —北京:科学出版社,2007
(华夏英才基金学术文库)
ISBN 978-7-03-018350-7

I. 天… II. 季… III. 中药学:药理学 IV. R285

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2007)第 085558 号

责任编辑:杨 震 黄 海 / 责任校对:宋玲玲
责任印制:钱玉芬 / 封面设计:陈 敬

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>

新 蕾 印 刷 厂 印 刷

科学出版社发行 各地新华书店经销

*

2007 年 7 月 第 一 版 开本:A4(890×1240)

2007 年 7 月第一次印刷 印张:55

印数:1—2 000

字数:1 837 000

定价:168.00 元

(如有印装质量问题,我社负责调换〈环伟〉)

前 言

国家在十一五规划中,明确提出“支持中医药事业发展,培育现代中药产业”,这促进了我国中医药事业向更高、更新、更深入的层次发展。此外,随着化学药品毒副作用的日益显现,一个“回归自然”、“重视天然药物”的热潮正在兴起,人们利用有效的天然药物替代一些化学药品,已成为国际医药的普遍动向和趋势,给中医药走向世界带来契机,为开拓中医药国际贸易提供了良好的机遇。近10年来,国内外学者围绕天然药物有效成分的研究做了大量有意义的基础工作,发表了无数篇有价值的论文,为天然药物的深入研究和发 展做出了巨大的贡献。作为药学工作者,编者感到有责任将这些科研信息汇集成册,给广大从事药学工作的同仁们提供较系统的、信息量足的、有参考价值的、易于查阅的参考资料。

本书详尽、系统地归纳和总结了国内外对天然药物有效成分的研究进展,注重有关利用现代科学方法和先进的技术手段研究其药理作用的文献报道。本书将传统的天然药物的药理作用和临床应用与其有效成分有机的结合起来,从而为天然药物的有效成分与其作用机理的相关性研究提供了思路,为天然药物的现代化研究奠定了理论和方法学基础。

华夏英才基金为本书的出版提供了巨大的支持,在此表示诚挚的谢意。由于编著者水平有限,书中定有错漏之处,尚祈广大读者指正!

编 者

2006年6月于哈尔滨

目 录

单体成分

相思子碱	3	香柑内酯	89
乌头碱	3	岩白菜素	89
猕猴桃碱	6	鸡豆黄素 A	91
苍术烯内酯甲	7	没药醇	92
仙鹤草内脂	7	巴西木素	93
仙鹤草酚	8	抗痢鸦胆子苷 B	93
茜素	10	马钱子碱	94
芦荟大黄素	11	咖啡酸	96
γ -氨基丁酸	13	咖啡因	98
扁桃苷	15	红厚壳内酯	100
穿心莲内酯	17	喜树碱	101
桉木毒素	18	斑蝥素	106
茴香脑	20	辣椒素	109
白芷素	21	番木瓜碱	114
山茛菪碱	22	长春花碱	115
樟柳碱	36	千金藤素	116
芹菜苷元	38	菊萜	118
山小桔碱	40	白屈菜碱	119
熊果苷	40	氯原酸	120
马兜铃酸	41	川芎嗪	123
假紫草素	44	柠檬醛	142
芳香堆心菊素	45	薏苡酯	143
槟榔碱	45	薏苡素	144
青蒿素	48	去甲秋水仙碱	145
青蒿琥酯	51	秋水仙碱	146
细辛醚	55	铃兰毒苷	151
落新妇苷	57	黄麻苷 A	153
阿托品	58	延胡索甲素	154
黄芩苷元	68	马桑内酯	155
黄芩苷	70	金链花猪屎豆碱	156
小檗胺	73	侧厚壳桂碱	157
小檗碱	78	葫芦素 B	158
甜菜碱	87	葫芦素 D	159

葫芦素 E	160	泽兰氯内酯醋酸酯	226
葫芦素 II a	162	泽兰氧化氯内酯	227
葫芦素 II b	163	线叶泽兰素	228
姜黄素	164	泽兰内酯	228
姜黄醇	172	月见草油	229
姜黄二酮	173	防己诺林碱	234
大青苷	174	阿魏酸	235
丹参素	174	无羁萜-3 β -醇	237
瑞香素	179	无羁萜	238
蝙蝠葛碱	182	岩藻固醇	238
去乙酰鞣乌头碱	187	富马酸	239
去乙酰刺乌头碱	188	加兰他敏	240
癸酰乙醛	188	没食子酸	240
脱水穿心莲内酯	189	天麻素	241
大蒜素	190	钩吻碱	243
双香豆素	197	染料木素	243
薯蓣皂苷	198	龙胆碱	244
黄常山碱甲	200	龙胆苦苷	246
黄常山碱乙	201	6-姜辣醇	246
黄常山碱丙	203	银杏酸	247
大豆黄素	204	人参皂苷 Rb ₁	248
地高辛	205	人参皂苷 Rg ₁	251
二羟栲利酸	207	人参皂苷 Rb ₂	255
羊角拗苷	208	人参皂苷 Rc	256
杜宾定	209	人参皂苷 Rd	257
埃贝母碱	210	人参皂苷 Re	259
酸藤子素	210	人参皂苷 Rf	260
大黄素	211	海罂粟碱	261
麻黄碱	216	谷胱甘肽	262
麻黄噁唑酮	218	甘草次酸	263
麦角胺	219	甘草酸	267
麦角生碱	220	甘草皂苷	273
糖芥灵	220	格尼迪木灵	277
七叶树内酯	221	棉苷	278
七叶树苷	222	棉酚	279
乙氧基白屈菜红碱	223	禾草碱	284
乙氧基血根碱	224	愈创木萘	285
桉油精	224	海南粗榧新碱	286
桉双烯酮	225	钩果草苷	286
β -桉叶醇	225	哈林通碱	287

海牙亭	290	边缘绵马酚	346
堆心菊素	291	苦参碱	347
天芥菜碱	292	薄荷醇	349
黄白糖芥苷	292	N-甲基酪胺	350
苏木素	294	欧瑞香素	351
橙皮苷	294	葛雌素	352
和乌胺	296	唇软珊瑚胆甾烷	352
水蛭素	297	柔毛地胆亭	353
粗毛豚草素	298	柔毛地胆宁	354
高哈林通碱	299	单猪屎豆碱	354
和厚朴酚	301	吗啡	356
10-羟基喜树碱	303	桑色素	359
次乌头碱	304	麝香酮	360
金丝桃苷	305	杨梅黄素	362
鹅膏氨酸	307	柚皮苷元	363
靛玉红	308	柚皮苷	364
异土木香内酯	312	甲基莲心碱	365
异补骨脂酮	313	黄夹次苷乙	369
异欧前胡素	314	川陈皮素	370
异粉防己碱	314	黄小檗碱	371
异三叶木防己碱	315	齐墩果酸	372
药根碱	316	橄榄苦苷	375
山柰苷	317	冬凌草甲素	376
山柰酚	318	蛇床子素	379
蝎毒	320	芍药苷	382
抗坏血酸	324	牡丹酚	383
益母草碱	326	三七二醇苷	386
莲心碱	327	罂粟碱	388
柠檬油素	329	浙贝母碱	390
甘草苷	331	黄夹次苷甲	391
山梗菜碱	331	前胡素	391
蛇麻酮	333	β -蒎烯	393
木樨草素	334	白藜芦醇葡萄糖苷	393
石蒜胺	336	扁蒴藤素	397
石蒜碱	337	鬼臼毒素	398
石吊兰素	339	胡椒碱	399
木兰箭毒碱	341	槲皮素	400
厚朴酚	341	黄柏碱	403
木兰脂素	344	假石蒜碱	403
芒果素	344	奎尼丁	404

奎宁	407	土的宁	486
莱菔素	409	琥珀酸	488
鹿蹄草素	411	獐牙菜苷	489
柔毛地胆素	412	獐牙菜苦素	490
原儿茶醛	413	对羟福林	491
原儿茶酸	414	丹参醌 II A	492
土大黄苷	416	鸢尾种苷	496
大黄酸	417	鸢尾种苷元	497
补骨脂素	420	细叶堆心菊素	497
钩藤碱	422	四氢鸭脚木碱	498
刺槐苷	425	四氢大麻酚	499
蔊菜素	426	延胡索乙素 (消旋体)	500
冬凌草素	427	粉防己碱	502
冬凌草乙素	430	箭头唐松草碱	509
葛根素	431	茶碱	509
芦丁	437	塔斯品碱	512
红花黄色素	439	番茄碱	513
柴胡皂苷 A	442	毛红厚壳内酯 A	514
柴胡皂苷 D	443	毛红厚壳内酯 B	514
血根碱	445	川楝素	515
滨蒿内酯	446	小麦黄素	516
甲醚香豆素	448	三叶木防己碱	517
东莨菪碱	449	雷公藤内酯	517
芝麻素	457	块茎葛素	519
西贝母碱	459	郁金香灵	520
知母皂苷元	460	杜廷	520
五味子素	461	娃儿藤碱	521
γ -五味子素	464	熊去氧胆酸	522
一叶秋碱	466	熊果酸	524
紫草素	469	松萝酸	525
青藤碱	470	香草醛	527
水飞蓟素	473	敌克冬种碱	528
β -谷甾醇	477	长春碱	529
茄碱	478	醛基长春碱	530
澳洲茄胺	479	牡荆素	534
槐果碱	480	维生素 E	534
槐苷	482	醉茄内酯 D	535
千金藤碱	483	花椒毒素	536
毒毛旋花子苷 K	484	芫花酯甲	537

总 成 分

阿魏酸钠	541	枸杞子多糖	612
百合多糖	547	钩藤总碱	617
白花前胡总香豆素	549	广枣总黄酮	618
白芍总苷	549	海带多糖	621
豹皮樟总黄酮	556	海地瓜多糖	626
白术多糖	557	黄花倒水莲总皂苷	626
草澄茄挥发油	559	海參多糖	627
蓖麻毒蛋白	562	海藻多糖	628
波叶大黄多糖	565	何首乌多糖	631
侧柏总黄酮	567	褐藻多糖	632
茶叶多糖	567	褐藻酸钠	634
柴胡多糖	568	黑木耳多糖	636
柴胡总皂苷	569	红花苷	637
长春花总碱	572	红毛五加总苷	638
车前子多糖	575	红景天素	639
穿心莲根总黄酮	575	红芪多糖	640
穿心莲总内酯	576	猴菇多糖	645
刺参多糖	578	猴头多糖	646
刺五加多糖	579	槲寄生总苷	647
刺五加总苷	581	槲寄生总碱	648
刺苋根皂苷	581	槲寄生多糖	649
虫草多糖	582	虎眼万年青多糖	650
大黄多糖	588	黄精多糖	652
大蒜多糖	589	黄芪多糖	655
大枣多糖	591	黄芪总苷	661
丹皮多糖	594	黄蜀葵花总黄酮	665
丹皮总苷	595	黄芩花总黄酮	666
丹参酮	596	灰树花多糖	667
胆酸	598	姬松茸多糖	671
当归多糖	599	积雪草总苷	676
党参多糖	602	蒺藜皂苷	678
毒藜碱	604	绞股蓝总苷	680
凤尾菇多糖	605	金针菇多糖	687
佛手多糖	605	荆芥挥发油	689
茯苓多糖	606	桔梗皂苷	689
葛根黄豆苷元	608	苦参总碱	691
葛根总黄酮	610	昆布多糖	693

雷公藤红素	695	树舌多糖	796
雷公藤总苷	696	石斛多糖	798
金樱子多糖	699	石杉碱	799
灵芝多糖	700	石杉碱甲	800
芦荟多糖	705	酸枣仁总皂苷	802
麦冬多糖	708	娑罗子总皂苷	802
南瓜多糖	709	天花粉蛋白	804
人参多糖	711	土鳖虫总生物碱	807
女贞子多糖	718	乌龙茶多糖	808
牛膝多糖	720	无花果多糖	808
米糠多糖	721	五味子多糖	810
鹿茸多糖	722	西洋参茎叶总皂苷	812
魔芋多糖	723	锡生藤碱	815
麦饭石	724	夏天无总碱	816
牛磺酸	728	仙人掌多糖	817
牛心朴子多糖	740	香菇多糖	819
茜草总蒽醌	740	延胡索总碱	822
人参根总皂苷	741	羊栖菜多糖	823
人参花总皂苷	747	洋金花总碱	826
人参茎叶总皂苷	748	异银杏双黄酮	829
人参子皂苷	755	薏苡内酯	829
人参总皂苷	756	薏苡仁多糖	830
肉苁蓉多糖	763	淫羊藿多糖	831
箬叶多糖	765	淫羊藿总黄酮	833
三角帆蚌多糖	767	银耳多糖	835
三七人参三醇苷	767	银杏多糖	836
三七总皂苷	771	银杏叶总黄酮	839
沙棘油	781	云芝多糖	840
沙棘总黄酮	783	藻酸双酯钠	841
沙苑子总黄酮	787	中华鳖多糖	847
山药多糖	787	猪苓多糖	847
山楂总黄酮	790	紫菜多糖	852
山茱萸多糖	791	紫草多糖	853
商陆多糖	793	中文索引	854
参芦头总皂苷	794	英文索引	863

单体成分

Abrine

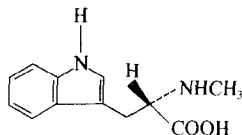
相思子碱

【CAS】 67525-2-4

【异名】 N-甲基色氨酸, 相思豆碱

【化学名】 L-Tryptophan

【结构式】



【分子式与相对分子质量】 $C_{12}H_{14}N_2O_2$; 218.25

【理化性质】 棱柱状结晶(水), 熔点 295°C (分解), $[\alpha]_D^{21} + 44^{\circ}$ 。0.28g 溶于 10mL 0.5mol/L 盐酸, 1g 溶于约 100mL 甲醇, 略微溶于水, 不溶于乙醚, 溶于稀酸和碱。盐酸盐 ($C_{12}H_{14}N_2O_2 \cdot \text{HCl}$), 针状结晶, 熔点 222°C , 溶于水。UV λ_{max} ($\log \epsilon$): 220 (4.46), 280 (3.79), 290 (3.73)^[1]。

【来源】 豆科植物相思子 *Abrus precatorius* L. 种子。

【药理作用】

1. 抗菌作用

相思子碱可以抑制金黄色葡萄球菌, 大肠杆菌, 甲、乙副伤寒杆菌。相思子碱腹腔注射可以抑制小鼠由葡萄球菌毒素引起的炎症反应^[2]。

2. 抗肿瘤作用

相思子碱具有一定抗肿瘤作用, 有实验结果表明, 相思子碱对小鼠 S_{180} , EAC, L_{615} 有抑制作用。可抑制瘤体的生长, 延长荷瘤小鼠的生存时间^[2]。

3. 其他作用

相思子碱 1 : 500 浓度可以抑制羊血球的溶解。

参考文献

[1] 于德泉, 陈未名, 姜达衡. 鸡骨草化学成分的研究. 药学报, 1962, 9 (7): 424

[2] 国家医药管理局中草药情报中心站编. 植物药有效成分手册. 北京: 人民卫生出版社, 1986

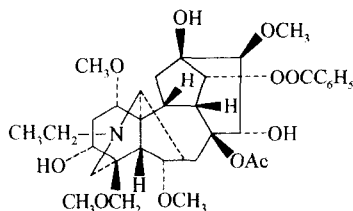
Aconitine

乌头碱

【CAS】 302-27-2

【化学名】 Aconitane-3, 8, 13, 14, 15-Pentol, 20-ethyl-1, 6, 16-trimethoxy-4-(methoxymethyl)-, 8-acetate 14-benzoate (1α , 3α , 6α , 14α , 15α , 16β)

【结构式】



【分子式与相对分子质量】 $C_{34}H_{47}O_{10}N$; 645.72

【理化性质】 六方片状结晶，熔点 204℃， $[\alpha]_D^{25} + 17.3^\circ$ 。易溶于氯仿、苯、无水乙醇及乙醚，难溶于水，微溶于石油醚。

【来源】 毛茛科植物乌头 *Acoitum carmichaeli* Debx. 块根，短柄乌头 *A. brachypodum* Diels 块根，乌头 *A. chinense* Paxt. 根。

【药理作用】

1. 抗炎作用

口服、皮下注射或肌肉注射乌头碱均能明显降低大鼠肾上腺内的抗坏血酸的含量，其作用不被戊巴比妥及氯丙嗪阻断。低剂量时能抑制大鼠、小鼠角叉菜胶致足趾浮肿，也能抑制受精鸡胚的浆尿膜上的肉芽形成。30min 前预先口服 0.1mg/kg 乌头碱对角叉菜胶（1%，0.1mL）注射引起的大鼠炎症有预防作用。乌头碱对渗出炎症有抑制作用，其作用长达 5.5h，且同时抑制渗出液中白细胞的渗出^[1]。

2. 免疫抑制

乌头碱对免疫器官和体液免疫均呈抑制作用。它可对 T 细胞及其亚群产生抑制作用，从而影响 B 细胞功能。其最佳免疫抑制作用期为用药后一周左右。

采用流式细胞技术测定乌头碱（ATN）对正常小鼠和皮质酮所致阳虚型小鼠腹腔巨噬细胞（M ϕ ）在干扰素（NF- γ ）诱导下，其表面 Ia 抗原表达的改变。正常小鼠腹腔注射 ATN1.5, 3.0, 6.0 μ g/(kg·d) 7d 后，其 M ϕ 在 300U/L 浓度 NF- γ 的诱导下 Ia 抗原表达明显增强，反映 Ia 抗原表达的荧光强度从对照组的（93.01 $\pm$ 13.30）增强到（108.90 $\pm$ 8.63），（113.01 $\pm$ 12.80）和（113.57 $\pm$ 10.13）（ $p < 0.05$ ）。说明 ATN 能够提高正常小鼠和皮质酮免疫抑制阳虚型小鼠 M ϕ Ia 抗原的表达，从而增强 M ϕ 递呈抗原能力，促进免疫应答反应^[2]。

3. 对心脏的作用

乌头碱对离体与在体蛙的作用是：最初使心率减慢（阿托品可阻断之），随即由于高度刺激了心肌，导致心率突然加快，心收缩率加强，很快出现心率紊乱，心收缩率减弱，心脏收缩如桑椹状，最终心跳停止。以 100mg/L 的乌头碱灌流液作用豚鼠心肌 15min 后，其异常动作电位开始出现，25min 达高峰，可维持 100min。尤其是对心肌细胞动作电位周期 T 值影响显著，给药后 25min，T 值减到加药前周期平均值的 1/5。1.0mg/L 灌流，50%复极化动作电位时限（APD₅₀）及总动作电位时限（APD₁₀₀）显著减少。当加入 0.5g/L 的肌苷液 30min 后，其 T 值、APD₅₀ 及 APD₁₀₀ 均有明显恢复。其治疗量，可使心率减慢、脉搏柔软而弱、血压微降（兴奋迷走中枢）；中毒量可使犬出现心动过速，室性纤维颤动、扑动等心律失常。乌头碱对心脏的作用，部分是由于迷走神经的影响，更主要的是直接对心肌的作用。

（1）致颤作用

乌头碱中毒极易产生心室纤维颤动，有人认为是有心肌兴奋性增高、膜去极化及心肌产生高频异位节律等所致，高浓度钙可抑制之。也有人认为是在胆碱能影响下，冲动波多源性折返的结果。家兔的有窦房结之右心房肌较无窦房结者更易引起心房纤维颤动。乌头碱的致颤作用目前作为研究抗心律不齐药物的一个工具药。

（2）强心作用

乌头碱本身无强心作用，对心脏毒性极强；其水解产物乌头原碱 Aconine 的毒性仅为乌头碱的 1/2 000~1/4 000。有人认为乌头原碱具有强心作用，在离体蛙心可对抗乌头碱引起的心律不齐；仅有微弱的强心作用。结构与活性研究表明：C-14 苯酰氧基是乌头碱致心律失常不可缺少的结构；乌头碱结构改变后可使毒性降低，其毒性强弱与 C-14 苯酰氧基、C-8 乙酰氧基和羟基的多少与位置以及羟基转变为乙酰氧基有关^[3]。

乌头碱是钙调蛋白（CaM）的天然拮抗剂，与酚噻嗪、局部麻醉剂、钙通道阻断剂、长春花生物碱以及粉防己碱和小檗胺等一样，对 CaM 活化的 PDE（环核苷酸磷酸二酯酶）有抑制作用。其 IC₅₀ 值为 1.4 $\times 10^{-4}$ mol/L，即其浓度大于 5 $\times 10^{-5}$ mol/L 时能抑制 CaM 活化的 PDE 活性，反之则不影响。其对 PDE 活性抑制的机制是竞争抑制。反应物保温顺序对其拮抗作用有影响；若将它加入预先一起保温后的 CaM-PDE 体系中，则产生的抑制效果低得多。其拮抗作用主要是因为具有阳离子双亲特性，且有复杂立体构型和七元碳环，有很强的疏水性^[4]。

单细胞水平应用乌头碱可诱发豚鼠和大鼠心律失常，用全细胞膜片钳技术记录乌头碱对酶解法分离的豚鼠和大鼠心肌细胞离子通道的作用。 $1\mu\text{mol/L}$ 乌头碱使大鼠心肌细胞 APD 延长、 I_{Ca}^{-1} 增加、 I_{to} 减少、 I_{k}^{-1} 增加，乌头碱的离子靶点有 APD、 I_{Ca}^{-1} 、 I_{k} 、 I_{to} 和 I_{k}^{-1} ，而最佳靶点应为 APD、 I_{Ca}^{-1} 、 I_{k} 、 I_{to} [5]。

4. 对血管及血压的影响

低剂量乌头碱能抑制醋酸所致小鼠血管通透性增强和组胺所致大鼠血管通透性增强。 0.05mg/kg 乌头碱有一过性降压作用，其作用可因预先注射阿托品或苯海拉明而消除。

5. 对中枢神经系统的影响

乌头碱有抑制小鼠自发活动的倾向并使小鼠正常体温下降 $1.5\sim 2.5^{\circ}\text{C}$ （可使发热及正常动物体温降低）。 $0.1\sim 0.2\text{mg/kg}$ 乌头碱能破坏大鼠电防御性-动物爬杆条件反射，非条件反射亦受轻度破坏，脑各部位含氧量均急剧下降；以 $0.002\mu\text{g/kg}$ 注入家兔第四脑室，可引起麻醉现象。乌头碱能抑制压迫大鼠尾部引起的疼痛和腹腔注射醋酸引起的小鼠扭体反应。皮下注射乌头碱 0.025mg/kg 即有镇痛作用，东莨菪碱可增强其作用； 0.1mg/kg 的镇痛效果较吗啡 6mg/kg 的作用还强，但镇痛指数低。乌头碱皮下注射及脑室注射具有剂量依赖性镇痛作用，而脊髓网膜下腔注射，则不产生镇痛作用。腹腔注射时，利血平、二乙基二硫代氨基甲酸钠和酚苄明能使乌头碱的镇痛作用明显减弱或消失；酚妥拉明、普萘洛尔对其镇痛作用无明显影响。脑室内注射 NE 使其镇痛作用加强，酚苄明、纳洛酮使其镇痛作用显著减弱；酚苄明脊髓蛛网膜下腔注射对其镇痛作用无明显影响。双侧损毁大鼠蓝斑核，其镇痛作用消失。其镇痛作用表现为中枢性，乌头碱还可抑制呼吸中枢，使呼吸变慢，并能反射性引起唾液分泌亢进。

6. 对自主神经系统的影响

乌头碱对大鼠离体回肠的收缩作用能被阿托品阻断，故其作用机制可能是副交感神经兴奋的作用；对乙酰胆碱、组胺及二氯化钡等引起的回肠收缩无影响，而对电刺激副交感神经引起的收缩呈明显抑制作用。

对神经肌肉传导和颈上神经节的影响：乌头碱 0.5mg/kg 静注对间接刺激下的大鼠离体膈肌、猫在体膈前肌和在体颈上神经节均具有先兴奋后抑制的作用。当乌头碱对膈前肌和瞬膜产生抑制时，膈前动脉和舌动脉注射氯化乙酰胆碱 (Ach) 引起的单次收缩与给乌头碱前动脉注射同剂量 Ach 引起的收缩幅度几乎相等，这可能是抑制运动神经和节前交感神经突触前膜的结果。乌头碱对膈肌的抑制作用能被钙离子所拮抗，但不被氯化筒箭毒碱和水杨酸毒扁豆碱拮抗，反能增强 [6]。

7. 局麻

乌头碱能刺激局部皮肤黏膜的感觉神经末梢，先兴奋产生瘙痒与灼热之感，继以麻醉、丧失知觉。乌头碱对神经肌肉接头活动和神经干复合电位首先是阻遏兴奋神经末梢的传导，高浓度下也可使神经干完全丧失兴奋和传导冲动的能力。

8. 体内过程

乌头碱微溶于水，易从黏膜吸收，在消化道及皮肤破损处易于吸收。大鼠食道吸收乌头碱的能力明显强于胃。乌头碱主要由唾液和尿中排出。其吸收和排泄均较快，故发生中毒的时间亦快，且无蓄积作用 [7]。

9. 毒性

乌头碱小鼠皮下注射 LD_{50} 为 $0.295\sim 0.32\text{mg/kg}$ 。日本学者认为小鼠皮下、腹腔、静脉注射及灌胃 LD_{50} 为 0.27mg/kg 、 0.38mg/kg 、 0.12mg/kg 及 0.1mg/kg 。乌头碱口服 0.2mg 即可发生中毒反应， $3\sim 5\text{mg}$ 可致死亡。亦有报道其致死量为 2.5mg 。中毒症状以神经系统和循环系统为主，其次是消化系统症状。尸检可见脑部及全身各器官均有不同程度的出血。乌头碱的毒性概括为：①箭毒样作用，即阻断神经-肌肉接头传导；②乌头碱样作用，表现为心律紊乱、血压下降、体温降低、呼吸抑制、肌肉麻痹和中枢神经功能紊乱等。乌头碱可直接毒害心肌细胞，故其心脏毒的致命性最为严重。本品中毒极易造成心房纤颤。乌头碱在离体心房所引起的纤维颤动，普鲁卡因、抗组胺药、奎宁丁、心得宁等均能抑制之。乌头碱中毒剂量时迷走神经的强烈兴奋作用及对心室肌的直接作用均可引起扭转室速，用利多卡因 $200\sim 250\text{mg/L}$ 静滴时，室速消失，但浓度减低至 100mg/L 时，室性早搏、室速又增多。

【临床应用】

1. 用于心动过速，高血压症

采用小剂量乌头碱治疗心动过速及高血压症效果较好，但易产生中毒反应，较难控制。故现已少用。

2. 研究心律不齐的工具药

利用乌头碱的心室纤颤作用制作心律不齐的模型来研究抗心律不齐药物。

参考文献

- [1] 国家医药管理局中草药情报中心站编. 植物药有效成分手册. 北京: 人民卫生出版社, 1986. 16
- [2] 马建, 陆平等. 乌头碱对小鼠腹腔巨噬细胞 Ia 抗原表达影响的研究. 中国药理学通报, 1997, 13 (4): 341~344
- [3] 周远鹏, 刘文化, 曾贵云. 乌头碱及其类似物的毒性和对心脏收缩功能的影响. 药学报, 1984, 19 (9): 641
- [4] 区耀华等. 乌头碱对依赖钙调蛋白的环核苷酸磷酸二酯酶的拮抗作用. 生物化学和生物物理进展, 1988, 15 (4): 290
- [5] 龚冬梅, 单宏丽等. 哇巴因和乌头碱诱发豚鼠和大鼠心律失常的离子作用靶点. 药学报, 2004, 39 (5): 328~332
- [6] 刘世芸, 张沙沙, 张文兴. 乌头碱对神经肌肉传导和颈上神经节的影响. 中国药理学, 1986, 7 (1): 23
- [7] 孙莹, 张宏桂, 史向国等. 兔体内乌头碱代谢产物研究. 药学报, 2002, 37 (10): 781~783

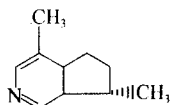
Actinidine

猕猴桃碱

【CAS】 62624-46-8

【化学名】 5H-2-Pyridine, 6, 7-dihydro-4, 7-dimethyl-, (S)-

【结构式】



【分子式与相对分子质量】 $C_{10}H_{13}N$; 147.21

【理化性质】 沸点 $100 \sim 103^{\circ}\text{C}/9\text{mmHg}$, $[\alpha]_{\text{D}}^{22} -7.2^{\circ}$ ($C=17.54$, 氯仿)。苦味酸盐熔点 143°C 。
 $\text{UV}\lambda_{\text{max}}^{\text{EtOH}}$ nm(ϵ): 262(2400)。

【来源】 猕猴桃科植物木天蓼 *Actinidia polygama* (Sieb. et Zucc.) Miq. 枝叶, 猕猴桃 *A. chinensis* Planch. 果实, 软枣猕猴桃 *A. arguta* (Sieb. et Zucc.) Planch. 全草, 败酱科植物缬草 *Valeriana officinalis* L. 根、根茎。

【药理作用】

1. 对中枢神经系统的作用

猕猴桃碱对猫的行为有特异的作用, 如流涎、凝视、舐物、打滚、陶醉状态并丧失敌意、睡眠等, 还可增强苯巴比妥的镇静及催眠作用。

2. 促进唾液分泌

吸入、口服或静脉注射猕猴桃碱均可引起犬或猫的唾液分泌。

3. 降压

静脉注射猕猴桃碱时可引起麻醉兔血压轻度下降, 切断颈迷走神经或注射阿托品后, 此作用即消失。

4. 对性腺的影响

对正常未孕大鼠, 可缩短性周期的休止期, 延长动情期及动情后期, 中止给药可很快恢复正常。卵巢或脑下垂体摘除后, 本品对性腺的作用即消失, 故其作用并非性激素样作用, 而是中枢性的, 特别是通过脑下垂体而实现的^[1]。

5. 抗肿瘤作用

猕猴桃碱能明显抑制肿瘤细胞生长^[2]。

参考文献

- [1] 季宇彬. 中药有效成分药理与应用. 哈尔滨: 黑龙江科学技术出版社, 1995. 4
- [2] 邹益友. 猕猴桃根抑制肿瘤细胞的实验研究. 湖南中医药导报, 1999, 4

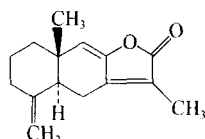
Atractylenolide I

苍术烯内酯甲

【CAS】 73069-13-3

【化学名】 Naphtho[2, 3-b]furan-2(4H)-one, 4a, 5, 6, 7, 8, 8a-hexahydro-3, 8a-dimethyl-5-methylene-, (4aS-trans)-

【结构式】



【分子式与相对分子质量】 $C_{15}H_{18}O_2$; 230.29

【理化性质】 无色针状结晶（正己烷），熔点 $109\sim 110.5^{\circ}\text{C}$ ， $[\alpha]_D^{20} + 222^{\circ}$ （ $C=0.01$ ，甲醇）。MS (m/z): 230 (M^{+}); $IR\lambda_{\text{max}}^{\text{己烷}}$ (cm^{-1}): 1758 ($C=O$), 1640 ($C=C$), 1005 ($C-O-C$), 886 ($C=CH_2$); NMR (CCl_4) δ : 0.92 (3H, s, CH_3), 1.85 (3H, s, CH_3), 4.59 和 4.86 (1H, 各为 br、s、 $C=CH_2$), 5.45 (1H, s, $C=CH$)^[1]。

【来源】 菊科植物东苍术（关苍术）*Atractylodes japonica* Kojdz. ex Kitam. 根茎^[1]。

【药理作用】

1. 抗炎作用

苍术烯内酯甲有抗炎作用。口服 300mg/kg 可抑制醋酸所引起的小鼠血管通透性的增加约 33.7%，对照组口服氨基比林 100mg/kg 可抑制 47.2%。对鸡胚胎肉芽组织的生成，25μg/片剂量可抑制 15.4%，对照组同等剂量的盐酸黄连素则可抑制 69%。在角叉菜胶引起的大白鼠足趾肿胀的试验中口服 400mg/kg 可使其消肿，对照组保泰松剂量则为 100mg/kg^[2]。

2. 抗肿瘤作用

本品对小鼠淋巴肉瘤 L-5187y 细胞有抑制作用，其 IC_{50} 为 80μg/mL。对动物移植性肿瘤 S_{180} 、Lewis 肺癌有抑制作用，其抑制率分别为 48.7%、36.5%^[3]。

【临床应用】

1. 癌症

对胃癌、肝癌有一定疗效，与化疗药合用治疗 37 例，比单独用化疗药有显著性疗效^[3]。

2. 风湿性关节炎

临床对于风湿、类风湿性关节炎有中等疗效。

参考文献

- [1] Endo K, Taguchi T, Taguchi F, et al. Antiinflammatory principles of *Atractylodes* rhizomes. *Chem Pharm Bull* (Tokyo), 1979, 27 (12): 2954
- [2] 国家医药管理局中草药情报中心站编. 植物药有效成分手册. 北京: 人民卫生出版社, 1986: 99
- [3] 贾敏如. 防治恶性肿瘤的天然药物. 成都中医药大学学报, 2002, 25 (2): 27

Agrimolide

仙鹤草内脂

【CAS】 21499-24-1

【异名】 龙芽草内脂, Agrimolide

【化学名】 1H-2-Benzopyran-1-one, 3, 4-dihydro-6, 8-dihydroxy-3-[2-(4-methoxyphenyl) ethyl]-,