



TCM Series of Active Components

Active Components on Cardiocerebro-vascular System in TCM

中药药理活性成分丛书

中药影响心脑血管系统 活性成分

周家驹 谢桂荣 严新建◎编著

科学出版社





中国医药出版社

中药影响心脑血管系统 活性成分

主编：王健 副主编：王健 王健

中国医药出版社



TCM Series of Active Components

Active Components on Cardiocerebro-vascular System in TCM

中药药理活性成分丛书

中药影响心脑血管系统 活性成分

周家驹 谢桂荣 严新建 编著

科 学 出 版 社

北 京

内 容 简 介

本书共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

中药影响心脑血管系统活性成分 / 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 978-7-03-033845-7

I. 中… II. ①周… ②谢… ③严… III. ①心脏血管疾病-中药材-生物活性-中药化学成分 ②脑血管疾病-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 043688 号

责任编辑: 戚东桂 康丽涛/责任校对: 林青梅

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>

竣工印刷厂印刷

科学出版社编务公司排版制作

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: 27 1/2

字数: 895 000

定价: 138.00 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

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

本书收集了来自 2631 种中药原植物及其同属植物的小分子活性成分 1134 种, 每种至少有一条心脑血管系统相关活性数据。全书引用参考文献 1079 篇, 文献收集年代至 2005 年。1134 种活性成分中, 生物碱 379 种, 萜类化合物 228 种, 黄酮类化合物 128 种, 芳香化合物 125 种, 甾族化合物 86 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。

主要的心脑血管药物类别有: 用于抗心衰的强心苷和血管紧张素转化酶抑制剂, 用于抗心衰、抗高血压的利尿药, 用于抗心衰、抗高血压和抗心律失常的肾上腺素 β 受体阻滞剂, 有广泛适应证谱的钙通道阻滞剂, 以及抗心律失常药、血管扩张药和防治心绞痛的药物等。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, 不具备对各类心脑血管系统活性物质进行全面分析的条件, 我们这里只是举例说明从本书查找信息发现关系的一些方法。

1. 中药强心活性成分的结构分布分析 强心苷是一类治疗心力衰竭的药物, 还有一些其他结构类型的强心剂。从本书“化合物药理活性索引”中的“强心”、“强心剂”和“正性肌力作用”条目中可得到有关化合物的编号名单, 据此名单顺序查阅正文, 就可得到下面的结构分布结果:

(1) 生物碱类强心剂有异喹啉类 *L*-箭毒碱(13)、吡咯烷大环内酯类美丽猪屎豆碱(124)、噻嗪定类槐定碱(225)、酰胺类阿魏酰基酪胺(249)和 5 个甾醇类生物碱番茄碱糖苷(292)、茄啶(294)、环常绿黄杨碱 D(298)、克默森茄碱(300)和垂茄碱(301), 主要集中于甾醇生物碱。

(2) 萜类强心剂有茨烷型单萜樟脑(395)、桉烷型倍半萜牛蒡素 A(410)、杜松烷型倍半萜 α -古巴烯(412), 5 个柯桉树烷型二萜卡山定(467)、卡山因(468)、考明碱(469)、格木胺(470)和几内亚格木碱(471), 以及齐墩果烷型三萜齐墩果酸(564)和乌苏烷型三萜冬青三萜苷 A(591), 主要集中于柯桉树烷型二萜。

(3) 强心甾内酯类活性成分是结构类似的最大的一组, 包括 741~772 号的 32 个化合物, 其中有洋地黄毒苷(748)、地高辛(749)、哇巴因(765)、毒毛旋花子苷 K(766)等人们熟知的成分, 也有许多不十分熟悉的成分。

(4) 773~778 号化合物都是蟾酥内酯类强心活性成分, 包括蟾酥灵(773)、蟾蜍毒(774)、华蟾蜍毒基(775)、华蟾蜍毒它灵(776)、嚏根草苷(777)和脂蟾毒配基(778)。

(5) 此外还有螺甾烷类甾族化合物纤细薯蓣皂苷(794), 呋甾烷类甾族化合物铃兰苦苷(805)、含硫化合物牛磺酸(852)、咕吨酮类异芒果苷(934)均为强心剂。

2. 有血脂调节活性成分的结构-活性关系分析 血脂调节药分为降胆固醇药和降三酰甘油药两类。从已发表的研究结果看, 大部分是降胆固醇的研究。从本书“化合物药理活性索引”中, 查出下列 3 个条目: “减少血清中的胆固醇”、“减少血清中的胆固醇和三酰甘油”和“降血脂”后, 即可结合正文内容进行下面的结构活性相关分析。读者应该已经注意到, 本书正文是以一个结构分类系统对化合物进行分类排序的, 属于同一类的化合物都是相邻的。换言之, 化合物编号相连或相近者, 就是同一类化合物。这样的表达系统为读者进行结构活性相关分析提

供了极大的便利。我们仅以血脂调节活性作为一个例子对此加以说明。经过综合分析整理,可以得出:

(1) 达玛烷型三萜化合物泽泻醇 A(524)、泽泻醇 A 单乙酸酯(525)、泽泻醇 B 单乙酸酯(527)、泽泻醇 C 单乙酸酯(528), 人参皂苷 Rb₁(529)和人参皂苷 Rb₂(530)都有减少血清中胆固醇的活性, 这一组实验结果和中药传统用法中泽泻和人参都是长期应用的降血脂的主要单方相一致。

(2) 齐墩果烷型三萜茶花皂苷 A(557)、甘草酸(560)、丝石竹皂苷(561)、柴胡皂苷 A(571)、柴胡皂苷 D(573)、无患子属皂苷 A(574)、大豆皂苷 A₁(584)、大豆皂苷 A₂(585), 和乌苏烷型三萜熊果酸(595)都有降血脂活性, 甘草酸还可以减少三酰甘油在肝内的沉积。

(3) 黄酮类化合物黄芩素(614)、木犀草素(630)、汉黄芩素(649), 黄酮醇类异鼠李素(669)、槲皮素(684), 异黄酮类鸡豆黄素 A(696)、刺芒柄花素(701)、染料木素(702)、红车轴草素(705), 樱黄素(706), 黄烷-3-醇类表儿茶素(714), 双黄酮类白果素(729), 银杏双黄酮(730)均为降血脂化合物。

(4) 胆烷酸类甾族化合物鹅去氧胆酸(779)、熊去氧胆酸(782), 螺甾烷类甾族化合物薯蓣皂苷元(792)、罗斯考皂苷元(800), 豆甾烷类甾族化合物岩藻甾醇(811)、 β -谷甾醇(814)、豆甾醇(820)都有降胆固醇活性。

(5) 吡喃并香豆素类北美芹素(1071)、齿阿米定(1073)、二氢沙米丁(1064)都能减少血清中的胆固醇。

(6) 已证实同时减少血清中的胆固醇和三酰甘油的活性成分有乌苏烷型三萜野蔷薇葡萄糖酯(594)、黄酮类木犀草素(630)、异黄酮类染料木素(702)和胆烷酸类甾族化合物熊去氧胆酸(782)。

(7) 二芳庚烷类六氢姜黄素(958)有降血脂活性, 这和其原植物是常用传统降血脂中药单方姜黄相一致。

(8) 抑制胆固醇生物合成的活性成分有半日花烷型二萜多尼非砂仁二醛(446)、羊毛甾烷型三萜灵芝酸 R(515)、灵芝酸 S(516), 杂类三萜新南五味子酸 A(596)、新南五味子酸 B(597)、新南五味子酸 C(598), 直链烯酸蓖麻油酸(822)。

(9) 查耳酮类胀果甘草查耳酮 B(724)已用于临床治疗高脂血症和其他心血管疾病。

(10) 其他结构类别的降血脂中药成分还有: 生物碱中的山豆根碱(16)、包尔定(45)、长春多灵(197)、烟酸(212)和香薷太生(346), 萜类中的樟烯(399), 直链烯酸类的亚油酸(821), 炔醇类的人参炔三醇(835), 丁内酯类的抗坏血酸(858), 苯丙烯类的 *p*-香豆酸(899)和洋蓟素(900), 芪类的藜芦酚(944), 二芳丙烷类的囊状紫檀苷(953)和环丁烷型木脂体二聚细辛醚(1103)。

3. 钙通道阻滞剂的结构-活性谱分析 钙通道阻滞剂是心血管病的基本药物, 适应证有高血压、原发性肺动脉高压、心绞痛、心肌梗死、室上性心动过速、动脉粥样硬化、脑血管病、周围血管缺血性疾病等。钙通道阻滞剂有三种作用机制: ①阻滞 L 型(持久型)钙通道; ②直接扩张平滑肌血管, 促进血管内皮细胞释放 NO——强效血管扩张剂; ③剂量依赖性抗氧化作用, 主要通过抑制脂质发挥抗氧化作用。从本书“化合物药理活性索引”中的“钙拮抗”和“钙通道阻滞剂”条目可查出 25 个有该种活性的化合物, 进而结合正文可以得到下面诸条值得进一步关注

的信息:

(1) 甲基莲心碱(25)是双苄基异喹啉生物碱, 在 7 产地的莲子心中平均含量为 0.25%。在 10~40 $\mu\text{mol/L}$ 浓度为钙通道阻滞剂, 有舒张血管、抗高血压、抗心律失常、抑制心肌及抑制血小板聚集的活性。

(2) 四氢掌叶防己碱(75)是原小檗碱生物碱, 在夏天无根茎中的含量为 0.18%, 在延胡索根茎 22 产地的含量范围是 0.042%~0.130%。对子宫平滑肌有钙拮抗活性, 抗心律失常活性表现为选择性对抗三氯甲烷、氯化钡、肾上腺素、毒毛旋花子苷 G 等诱发的心律失常, 但不能对抗乌头碱诱发的心律失常。

(3) 来源于唐松草的甲氧基铁线蕨叶碱(85)是阿朴啡-苄基异喹啉生物碱。松弛豚鼠回肠平滑肌的 IC_{50} 值为 2.53 $\mu\text{mol/L}$, 是冠状动脉扩张剂, 能增加豚鼠心脏冠状动脉血流量。

(4) 来源于钩藤的异钩藤碱(126)是吲哚里西定生物碱。在钩藤带钩茎枝中含量为 0.05%。有持续抗高血压、松弛血管及降低心肌氧消耗、减慢麻醉兔心率、电位依赖性钙拮抗等活性。来源于钩藤及多种同属植物的硬毛钩藤碱(203)是柯楠碱类生物碱, 有抗心律失常、钙拮抗和中枢镇静等活性。

(5) 来源于款冬花的款冬花酮(416)是移杜松烷型倍半萜。其钙拮抗的 IC_{50} 值为 1 $\mu\text{g/mL}$ 。

(6) 来源于广藿香的广藿香醇(431)是重排绿叶烷型倍半萜。其钙拮抗的 IC_{50} 值为 47 $\mu\text{mol/L}$, 在广藿香地上部分的含量范围是 0.26%~3.42%。

(7) 来源于灯盏细辛的灯盏细辛苷(616)是黄酮类化合物。除具有钙通道阻滞活性外, 体内、体外实验都表明是缺血或梗死情况下的心肌保护剂, 同时也是钾通道活化剂。

(8) 来源于蛇床子的二氢山芹醇当归酸酯(1049) 是呋喃并香豆素类化合物。抑制大鼠垂体 GH_3 细胞去极化诱导的钙吸收, 强度不低于维拉帕米(异搏定)。在蛇床子成熟种子中 6 产地的平均含量为 0.118%。

(9) 人参皂苷 Rb_1 (529)、人参皂苷 Rb_2 (530)、人参皂苷 Rc (531)、大豆皂苷 A_1 (584)、大豆皂苷 A_2 (585)都是同时有降血脂活性的钙通道阻滞剂。

(10) 来源于刺五加、杜仲、柳穿鱼、肉苁蓉、棕盩糙苏的鹅掌楸苷(1087)为一木脂体类化合物。其活性谱包括钙拮抗、血管紧张素转化酶 (ACE) 抑制剂、抗锥虫、抗利什曼、抗恶性疟原虫、抗炎止痛等。

4. 抗心衰 cAMP 磷酸二酯酶抑制剂的结构-活性-来源关系分析 cAMP 磷酸二酯酶抑制剂是有正性肌力作用和扩张血管作用的抗心衰药。从本书“化合物药理活性索引”中, 查出标题为“cAMP 磷酸二酯酶抑制剂”条目下有 49 个化合物, 把这些顺序编号的化合物按照目录中的结构分类顺序“截断分组”, 就得到下面的结构-活性-来源关系的分析结果:

(1) 苦树皮是值得注意的高活性 cAMP 磷酸二酯酶抑制剂的天然来源, 从中分离的吲哚类生物碱苦木西碱 C(151)、苦木西碱 S(156)、苦木西碱 M 和苦木西碱 N(165)都是高活性 cAMP 磷酸二酯酶抑制剂, 其 IC_{50} 值分别为 51 $\mu\text{mol/L}$ 、30 $\mu\text{mol/L}$ 、96 $\mu\text{mol/L}$ 、2 $\mu\text{mol/L}$ 。

(2) 菊科植物俯垂弗劳菊也是值得注意的高活性该抑制剂的天然来源, 从中分离的香树烷型倍半萜弗劳菊二醇(434)抑制 cAMP 磷酸二酯酶的 IC_{50} 值为 5.2 $\mu\text{mol/L}$, 活性高于对照化合物

氯丙嗪(氯丙嗪的 IC_{50} 值为 $10.2\mu\text{mol/L}$)，弗劳菊二醇和牛脑中的钙调蛋白作用并抑制依赖于钙调蛋白的 cAMP 磷酸二酯酶。简单苯衍生物苔色酸甲酯(878)抑制 cAMP 磷酸二酯酶的 IC_{50} 值为 $8.1\mu\text{mol/L}$ 。雅槛蓝烷型倍半萜去氢弗劳菊酸(435)抑制 cAMP 磷酸二酯酶的 IC_{50} 值为 $23.2\mu\text{mol/L}$ 。

(3) 达玛烷型三萜人参皂苷 Rb_1 (529)、 Rb_2 (530)、 Rc (531)和 Rd (532)的 IC_{50} 值分别为 $137\mu\text{mol/L}$ 、 $199\mu\text{mol/L}$ 、 $264\mu\text{mol/L}$ 和 $84\mu\text{mol/L}$ ，都有抑制 cAMP 磷酸二酯酶活性，虽不如前两组化合物高，但它们在人参中的含量分别为 0.88%、0.57%、0.47%和 0.16%，在三七中的含量分别为 4.1%、0.17%、0.23%(竹节三七)和 1.3%，加之有多方面的优良性能，值得关注。

(4) 黄酮类黄芩素(614)抑制特定的 cAMP-PDE4 酶的 IC_{50} 值为 $10\mu\text{mol/L}$ ，在黄芩干燥根中的平均含量为 1.85%。汉黄芩苷(650)抑制 cAMP 磷酸二酯酶活性的 IC_{50} 值为 $42\mu\text{mol/L}$ ，在黄芩干燥根中的平均含量为 2.34%。半支莲素(641)对牛心脏的 IC_{50} 值为 $6\mu\text{mol/L}$ ，也源于黄芩。

(5) 来源于苦参的二氢黄酮类苦参酮(654)、苦参新醇 B(655)和苦参新醇 E(656)都是高活性 cAMP 磷酸二酯酶抑制剂，其 IC_{50} 值分别为 $25\mu\text{mol/L}$ 、 $31\mu\text{mol/L}$ 和 $40\mu\text{mol/L}$ 。但目前尚无有关以上化合物含量的数据发表。

(6) 黄酮醇类化合物 3, 5, 7, 3', 4'-五甲氧基黄酮(683)和桑根酮 D (694) 抑制 cAMP 磷酸二酯酶的 IC_{50} 值分别为 $7.1\mu\text{mol/L}$ (大鼠心脏)和 $26\mu\text{mol/L}$ 。

(7) 来源于刺果甘草的异黄酮类化合物 7, 4'-二甲氧基异黄酮(700)的 IC_{50} 值为 $2.3\mu\text{mol/L}$ (大鼠心脏)。来源于木蓝和灰叶根的二氢异黄酮类化合物去氢鱼藤素(712)的 IC_{50} 值为 $6.2\mu\text{mol/L}$ (大鼠心脏)。来源于甘草的香豆素类化合物甘草香豆素(1025)的 IC_{50} 值为 $7\mu\text{mol/L}$ 。目前尚无有关以上三类化合物含量的数据发表。

(8) 苯丙烯类连翘脂苷 A(906)的 IC_{50} 值为 $110\mu\text{mol/L}$ ，活性虽属中等但在原植物中含量较高。在连翘未成熟果实中含量为 1.31%，在连翘成熟果实中含量为 0.64%。

(9) 螺甾烷类甾族化合物山麦冬皂苷 J (801)的 IC_{50} 值为 $103\mu\text{mol/L}$ ，纤细薯蓣皂苷(794)的 IC_{50} 值为 $61\mu\text{mol/L}$ ，新假叶树苷(796)的 IC_{50} 值为 $92\mu\text{mol/L}$ ，有中等活性。

(10) 来源于多种贝母的甾醇生物碱棱砂贝母碱(276)、湖贝甲素(278)、湖贝甲素苷(279)、桃贝母碱 B-3-O- β -D-葡萄糖苷(284)和贝母西定碱(302)都有中等活性，其 IC_{50} 值分别为 $88\mu\text{mol/L}$ 、 $247\mu\text{mol/L}$ 、 $127\mu\text{mol/L}$ 、 $183\mu\text{mol/L}$ 和 $106\mu\text{mol/L}$ 。其中湖贝甲素在湖北贝母鳞茎中的含量测得为 0.082%。

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草药用植物中分布的有关信息，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/3 阿朴啡生物碱/10 前阿朴啡生物碱/16 原小檗碱生物碱/17 前阿片碱类生物碱/21 苯并[c]菲啉生物碱/22 吗啡生物碱/23 阿朴啡-苄基异喹啉生物碱/23 2-苯并[c]呋喃酮异喹啉类生物碱/24 刺桐生物碱/24	
1.2 喹啉类生物碱	24
喹啉生物碱/24 呋喃并喹啉生物碱/26 吡喃并喹啉生物碱/27	
1.3 喹啉类生物碱	28
1.4 吡咯烷类生物碱	28
吡咯烷生物碱/28 吡咯烷士定生物碱/29 吡咯烷士定生物碱(大环内酯)/29 吲哚里西定生物碱/30 菲并吲哚里西定生物碱/30 莨菪烷类生物碱/31	
1.5 吲哚类生物碱	32
简单吲哚生物碱/32 吡啶类生物碱/32 吡啶并吡啶类生物碱/33 环色胺类生物碱/34 色胺类生物碱/34 Hasubanan 类生物碱/35 阿枯米辛类生物碱/35 长春里宁类生物碱/35 钩吻类生物碱/35 β -吡啶类生物碱/35 麦角类生物碱/37 吲哚-1,5-二氮杂萘酮类生物碱/38 Strictosidine 类生物碱/38 类阿吗碱类生物碱/38 洪达木类生物碱/40 育亨宾类生物碱/40 蛇根精类生物碱/42 老刺木碱类生物碱/42 吴茱萸类生物碱/43 马钱子类生物碱/44 白坚木属生物碱/44 Iboga 类生物碱/45 卡丹宾碱类生物碱/45 柯楠碱类生物碱/46 阿吗灵类生物碱/47 吲哚杂类生物碱/47	
1.6 吡啶和哌啶类生物碱	47
吡啶生物碱/47 喹啉定生物碱/49 哌啶生物碱/51 金鸡纳类生物碱/52 一叶萩碱类生物碱/52 杷碱类生物碱/52	
1.7 有机胺和酰胺类生物碱	53
有机胺类生物碱(胍类)/53 有机胺类生物碱(酰胺类)/53 有机胺类生物碱(尿素类)/53 酰胺类生物碱/53 麻黄类生物碱/57 秋水仙碱类生物碱/58 那碎因类生物碱/58 菲类生物碱/58	
1.8 石蒜科生物碱	59
加兰他敏类生物碱/59 网球花定生物碱/59 高石蒜碱生物碱/59	
1.9 甾醇生物碱	60
Cerveratrum 类甾醇生物碱/60 Spirosolane 甾醇生物碱/62 孕甾烷类甾醇生物碱/63 茄啉类甾醇生物碱/64 Buxus 类甾醇生物碱/64 Jerveratrum 类甾醇生物碱/65 Solanidine 类甾醇生物碱/65 杂类甾醇生物碱/65 Salamandra 类甾醇生物碱/65	
1.10 萜类生物碱	66
单萜类生物碱/66 C ₁₉ -二萜类生物碱/66 C ₂₀ -二萜阿替新类生物碱/70	
1.11 其他生物碱	72

腈和异腈类生物碱/72 嘌呤类生物碱/73 咪唑类生物碱/74 嘧啶类生物碱/75 噻唑类生物碱/75 马兜铃内酰胺类生物碱/75 马兜铃酸类生物碱/76 杂类生物碱/77 多胺类生物碱/78	
1.12 氨基酸和环肽	79
氨基酸/79 柄形肽类/80	
2. 萜类	81
2.1 单萜	81
环烯醚类单萜/81 开环环烯醚类单萜/83 薄荷烷型单萜/83 环己烷型单萜/84 莰烷型单萜/84 蒎烷型单萜/85 双环杂类单萜/85	
2.2 倍半萜	86
大牻牛儿烷型倍半萜/86 蛇麻烷型倍半萜/86 桉烷型倍半萜/87 沉香呋喃桉烷型倍半萜/88 杜松烷型倍半萜/88 移杜松烷型倍半萜/88 石竹烷型倍半萜/89 愈创木烷型倍半萜/89 伪愈创木烷型倍半萜/91 木防己苦烷型倍半萜/91 重排绿叶烷型倍半萜/92 杂类倍半萜/92 香树烷型倍半萜/92 雅桤蓝烷型倍半萜/92 蜂斗菜烷型倍半萜/93 雪松烷型倍半萜/94 长叶松烷型倍半萜/95 单端孢菌烷型倍半萜/95	
2.3 二萜	95
半日花烷型二萜/95 克罗烷型二萜/96 松香烷型二萜/96 降、高松香烷型二萜/97 柯桧树烷型二萜/99 贝壳杉烷型二萜/100 去甲贝壳杉烷型二萜/103 西柏烷型二萜/103 瑞香烷型二萜/104 二环杂类二萜/105 四环杂类二萜/106 木藜芦毒烷型二萜/108 10,15-环植烷型二萜/108 壳梭孢烷型二萜/108 Rosane 烷型二萜/108	
2.4 三萜	108
羊毛甾烷型三萜/108 环羊毛甾烷型三萜/109 葫芦烷型三萜/110 达玛烷型三萜/110 大戟烷型三萜/115 裂环四去甲三萜/115 苦木素类去甲三萜/115 开环羽扇豆烷型三萜/116 羽扇豆烷型三萜/116 齐墩果烷型三萜/117 乌苏烷型三萜/130 杂类三萜/133 山柑子烷型三萜/133	
2.5 四萜和局部萜	134
四萜/134 局部萜/134 Megastigmane 去甲萜/135 阿朴类胡萝卜素/135	
3. 黄酮类	136
3.1 黄酮类	136
3.2 二氢黄酮类	149
3.3 黄酮醇类	151
3.4 二氢黄酮醇类	164
3.5 双二氢黄酮醇类	165
3.6 异黄酮类	166
3.7 二氢异黄酮类	170
3.8 黄烷-3-醇类	170
3.9 异黄烷类	172
3.10 查耳酮类	173
3.11 二氢查耳酮类	174

3.12 双黄酮类	174
3.13 花青素类	176
4. 甾族化合物	177
4.1 孕甾烷类甾族化合物	177
4.2 强心甾内酯类甾族化合物	178
4.3 蟾酥内酯类甾族化合物	184
4.4 胆烷酸类甾族化合物	185
4.5 胆甾烷类甾族化合物	186
4.6 螺甾烷类甾族化合物	187
4.7 呋甾烷类甾族化合物	191
4.8 豆甾烷类甾族化合物	192
5. 脂肪族天然产物	200
5.1 链状化合物	200
直链烯酸/200 直链烯酯/200 支链烯醛/201 饱和直链酸/201 饱和直链醇/202 饱和 直链醇酸/203 饱和环酮/203	
5.2 炔类化合物	203
炔类化合物(炔醇类)/203 炔类化合物(炔酮类)/203	
5.3 单碳环化合物	204
5.4 酰基甘油类	205
5.5 鞘胺醇类	206
5.6 长链芳香系统	206
5.7 含硫化合物	207
5.8 硝基化合物	208
5.9 含硒化合物	208
6. 含氧杂环	209
6.1 4-吡喃酮类	209
6.2 丁内酯类	209
6.3 戊内酯类	210
6.4 大环内酯类	211
7. 简单芳香化合物	212
7.1 简单苯衍生物	212
7.2 苯丙烯类	219
7.3 酰基间苯三酚类	231
7.4 咕吨酮类	231
7.5 联苄类	233
7.6 芪类	233
7.7 二芳丙烷类	236
7.8 二芳戊烷类	237
7.9 二芳庚烷类	238

7.10 含硫芳香化合物	238
8. 多环芳香化合物	239
8.1 萘和萘醌类	239
萘醌类/239 1-吡喃并萘醌类/242	
8.2 蒽和蒽醌类	243
蒽醌类/243	
8.3 菲类	245
菲类/245	
9. 苯并呋喃和苯并吡喃类	247
9.1 苯并呋喃类	247
9.2 1-苯并吡喃类	247
9.3 吡喃并-1-苯并吡喃类	248
9.4 呋喃并-1-苯并吡喃类	249
9.5 吡喃并-2-苯并吡喃类	249
10. 香豆素类	251
10.1 香豆素类	251
10.2 双香豆素类	260
10.3 呋喃并香豆素类	260
10.4 吡喃并香豆素类	265
11. 木脂体	268
11.1 木脂体	268
11.2 二苯并环辛二烯木脂体	273
11.3 环丁烷型木脂体	274
11.4 新木脂体	274
12. 鞣质	277
12.1 没食子酯鞣质	277
12.2 间苯三酚鞣质	280
参考文献	282
化合物药理活性索引	295
化合物中文名称索引	316
化合物英文名称索引	333
植物中文名称及活性成分索引	353
植物拉丁学名及活性成分索引	388
附录 1 缩写和符号表	418
附录 2 癌细胞代码	421

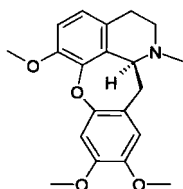
1. 生物碱

1.1 异喹啉类生物碱

异喹啉生物碱

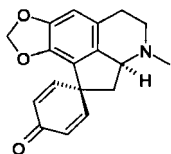
1 Cularine 桔拉灵

[479-39-0] $C_{20}H_{23}NO_4$ (341.41). 【类型】异喹啉生物碱. 【活性】细胞毒; 提高心肌收缩力; 抗高血压(兔); 麻醉剂(兔角膜); 子宫兴奋剂. 【来源】棒状紫堇 *Corydalis claviculata*, 兜状荷包牡丹 *Dicentra cucullaria*, 俄勒冈荷包牡丹 *Dicentra oregana*, 美丽荷包牡丹 *Dicentra formosa*, 缙毛荷包牡丹 *Dicentra eximia*, 瓦氏小檗* *Berberis valdiviana*. 【文献】182.



2 Fugapavine 呋杷文

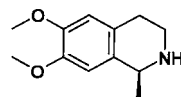
Mecambrine [1093-07-8] $C_{18}H_{17}NO_3$ (295.34). 【类型】异喹啉生物碱. 【活性】升高血压(动物实验); 减慢心率(动物实验); 呼吸兴奋剂(动物实验); 致惊厥(高剂量); LD_{50} (鼠) = 4.1mg/kg. 【来源】长果罂粟 *Papaver dubium*, 威尔士绿绒蒿 *Meconopsis cambrica*, 一现罂粟* *Papaver fugax*. 【文献】182.



3 Salsolidine 猪毛菜定碱

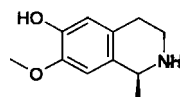
$C_{12}H_{17}NO_2$ (207.26). 片状晶体(水), mp 69~70℃, $[\alpha]_D^{20} = -63^\circ$ (乙醇), 氢氯化物, 白色或淡黄色晶体性粉末, mp 235~236℃, $[\alpha]_D^{18} = -25^\circ$ (水). 【类型】异喹啉生物碱. 【活性】抗高血压(抑制骨髓中血管舒

缩系统); 解痉(大鼠肠, 氯化钡引起的痉挛); LD_{50} (大鼠, ip) = 300mg/kg. 【来源】猪毛菜 *Salsola collina*. 【文献】182, 184.



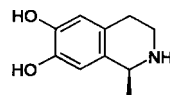
4 Salsoline 猪毛菜碱

$C_{11}H_{15}NO_2$ (193.25). 禾本黄色针状晶体(甲醇或乙醇), mp 221℃, $[\alpha]_D^{20} = +34.5^\circ$ ($c = 1$, 0.1mol/L 盐酸). 【类型】异喹啉生物碱. 【活性】止痛; 抗高血压(抑制骨髓中血管舒缩系统); 增加缺氧的耐受性(鼠); LD_{50} (鼠, iv) = 140mg/kg. 【来源】猪毛菜 *Salsola collina*. 【文献】184.



5 (-)-Salsolinol 猪毛菜酚

$C_{10}H_{13}NO_2$ (179.22). 不稳定氢溴化物, 奶油色细小棱柱状晶体(乙醇-乙醚), mp 195~198℃. 【类型】异喹啉生物碱. 【活性】止痛; 升高血压和增加心率(大鼠, iv); 单胺氧化酶抑制剂; 神经肌肉阻断作用; 刺激心房(豚鼠, *in vitro*). 【来源】粉芭蕉 *Musa paradisiaca*, 可可 *Theobroma cacao*, 牛心番荔枝 *Annona reticulata*, 乌头 *Aconitum carmichaeli*. 【文献】184.



苄基异喹啉生物碱

6 Armepavine 杏黄罂粟碱

[524-20-9] $C_{19}H_{23}NO_3$ (313.40). mp 148~149℃. 【类型】苄基异喹啉生物碱. 【活性】引起心律不齐; 致惊厥; 刺激剂. 【来源】高加索罂粟 *Papaver*