



TCM Series of Active Components

Anti-inflammatory Active Components in TCM

中药药理活性成分丛书

中药抗炎 活性成分

周家驹 谢桂荣 严新建◎编著

科学出版社



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

中药抗炎活性成分 / 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 978-7-03-033836-5

I. 中… II. ①周… ②谢… ③严… III. 抗炎剂-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 043774 号

责任编辑: 戚东桂 何海青/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>

骏杰印刷厂印刷

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 1/4

字数: 882 000

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当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 2248 种中药原植物及其同属植物的小分子活性成分 1182 种。全书引用参考文献 1046 篇，文献收集年代至 2004 年。

在这 1182 种中药活性成分当中，每种至少有一条抗炎活性数据。为了反映其活性谱的全貌，当同时还有其他种类药理活性时也一并收集。

发炎是具有血管系统的活体组织对有害刺激、损伤或感染所产生的防御性反应，反应的过程是发生一系列生理和病理事件，这些事件是由炎症介质和炎症细胞的相互作用而精密调节的。无论中医还是西医，一致把发炎的症状综合表达为红、肿、热、痛，这是一个难得的两个医药系统有高度共识的例子。

近几十年来，在分子和细胞水平上，人们对发炎过程的理解大大加深了，发现了许多研发慢性炎症药物的靶标，发现了大量作用于特定靶标的炎症介质，包括前列腺素(PG)、白三烯(LT)、细胞因子、趋化因子、黏附分子等。这些炎症介质导致来自肥大细胞、嗜碱粒细胞等其他炎症介质在当地释放，进而导致中性粒细胞等白细胞被吸引到发炎部位。细胞因子是一组多功能的物质，涉及发炎过程的许多阶段，形成细胞内信使分子的动态网络，可以调控各种生理和病理情况。一般把细胞因子分为作用相反的两类：致炎细胞因子(iNOS, COX-2, IL-1 β , TNF- α , IL-6, IL-18 等)作用于发炎的初始阶段和发展扩大阶段；抗炎细胞因子(IL-10, TGF- β 等)则进行相反的调节。

很多源于植物的活性成分有重要的抗炎活性，为了开发新的抗炎药物，特别是处理慢性炎症，例如风湿、哮喘、动脉粥样硬化、阿尔茨海默症等。人们十分关注把天然产物中抗炎成分的作用和细胞因子及细胞内的信号调节联系起来的途径。这些途径主要有：

1. 花生四烯酸途径 膜脂类物质在磷脂酶 A₂ 作用下生成花生四烯酸，再通过三条路径代谢：一是通过环氧合酶(COX-2)代谢生成前列腺素和血栓素(TX)；二是通过 5-脂氧合酶(5-LOX)代谢生成白三烯；第三条途径有两个支路，分别通过脂氧合酶 15-LOX 和 12-LOX 代谢生成羟基二十碳四烯酸 12-HETE 和 15-HETE。抑制磷脂酶 A₂ 可降低花生四烯酸的释放及其代谢产物的合成，甾体抗炎药就是通过抑制磷脂酶 A₂ 的活性，从而抑制花生四烯酸的代谢产物(如 PG、TX、LT)的生成而产生强烈的抗炎效果。抑制 COX-2、5-LOX、15-LOX 和 12-LOX 也都能达到抑制炎症的目的，阿司匹林和传统非甾体抗炎药(NSAIDs)抑制 COX-2，但对脂氧合酶无抑制作用。

2. 一氧化氮相关途径 一氧化氮由多种涉及免疫和炎症响应的细胞所合成，涉及的主要酶是诱导型氮氧化物合酶(iNOS)，它诱导高水平的持续的一氧化氮合成。在慢性炎症中，抑制一氧化氮的释放是有益的，因而 iNOS 是一类关键的致炎细胞因子。

3. 核转录因子- κ B 途径 核转录因子- κ B 是普遍存在的一种对复杂现象的调节给予响应的蛋白，在某些生理和病理条件下对控制细胞信号起着关键性的作用。

4. 细胞因子网络调节器。

5. 趋化因子途径 趋化因子是特殊类型白细胞的化学引诱剂，对其聚集到炎症部位很重要，包括 IL-8、eotaxin、GRO、CINC-1、RANTES 等。

6. 黏附分子途径。

寻找有双重抑制活性的中药成分

临床使用的利克飞龙是一种能抑制 COX-2 和 5-LOX 的双重抑制抗炎药。我们从本书化合物药理活性索引出发, 分别总结得出 COX-2、5-LOX、12-LOX、15-LOX 四种酶的抑制剂名单, 进而找到四种新的有双重抑制活性的成分, 两种是中药成分, 两种是其他天然产物。

1. 桑色素(638)是 5-LOX 和 COX-2 两者的抑制剂, 是来源于桑叶、桑枝、桑白皮等中药的黄酮醇类化合物, 即 3, 5, 7, 2', 4'-五羟基黄酮。

2. 黄酮类化合物木犀草素(590)是 15-LOX 和 COX-2 两者的抑制剂, 1832 年首次由淡黄木犀草中分离, 现在知道存在于豆科、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, 被建议作为研发治哮喘新药的先导化合物。

3. 丁内酯类化合物 Protolichesterinic acid(807)和未氯化缩酚酸环醚类化合物 Lobaric acid(813)是 5-LOX 和 12-LOX 的抑制剂, 前者源于冰岛衣, 后者源于珊瑚枝。

作为网络调节器的高活性抗炎成分

如果一种抗炎物质是作为细胞因子网络调节器而发挥作用的, 那就意味着它是一个多靶标的多重调节系统, 这正是近些年来药物作用机制研究中的一项重大成果, 对今后的新药研究有深远意义。我们从化合物药理活性索引中的“细胞因子网络调节器”条目中的化合物名单出发, 可挑选出下面 9 组 12 个化合物作为采用网络调节机制的高活性抗炎成分的重要示例:

1. 汉防己乙素(5)和粉防己碱(7)能预防整合蛋白介导的中性粒细胞黏附和 fMLP-或白三烯 B₄-诱导的移行, IC₅₀ 值为 1~5 μg/mL。汉防己乙素在防己干燥根中的平均含量为 0.76%, 粉防己碱在蝙蝠葛根茎中的平均含量为 0.99%, 在防己干燥根中的平均含量为 1.92%, 都是常量的活性组分。

2. 环烯醚类单萜桃叶珊瑚苷(138)能防止肥大细胞中 TNF-α 和 IL-6 的产生, IC₅₀ 分别为 101 ng/mL 和 190 ng/mL, 机制为阻断 NF-κB 活化。该化合物在其原植物长叶车前中的平均含量为 0.59%, 在车前中的平均含量为 1.26%, 在杜仲叶中的平均含量为 1.89%, 在平车前中的平均含量为 0.99%, 是常量的活性组分。

3. 源于木香根、云南含笑的原萜型倍半萜类化合物瑞诺木烯内酯(221)能以浓度依赖方式抑制大鼠肾上皮细胞脂多糖刺激的细胞因子诱导的中性粒细胞趋化吸引剂 1(CINC-1)的形成, 其 IC₅₀ 值为 1 μmol/L。

4. 源于春藤、忍冬藤、洋常春藤等植物的 α-常春藤皂苷(499)是齐墩果烷型三萜, 能防止脂多糖刺激的 RAW264.7 巨噬细胞中 TNF-α 的产生, 其 IC₅₀ 值为 5 μmol/L。

5. 源于粗毛南蛇藤、高梅缨瓣根、黑蔓、雷公藤、美洲南蛇藤、南蛇藤根的南蛇藤素(526)是无羧萜烷型三萜。该化合物有多重途径的抗炎活性: 能抑制人单核细胞中脂多糖刺激的 IL-1β 生成, 平均 IC₅₀ 为 56 nmol/L; 能降低人单核细胞和巨噬细胞中 TNF-α 和 IL-1β 的生成, 其 IC₅₀ 为 30~100 nmol/L; 是 NF-κB 抑制剂, IC₅₀ 为 0.27 μmol/L; 也是 NO 生成抑制剂, IC₅₀ 为 0.23 μmol/L。

6. 源于桫欏木、加那利美登木的扁蒴藤素(528)和着色酮(529), 同为无羧萜烷型三萜类化合物, 能抑制人单核细胞中脂多糖刺激的 IL-1β 生成, 其 IC₅₀ 值分别为 56 nmol/L 和

58nmol/L。

7. 槲皮素(642)和染料木素(670)能抑制巨噬细胞 RAW264.7 中脂多糖刺激的 $\text{TNF-}\alpha$ 和 IL-6 的释放, 其 IC_{50} 值均为 $1\mu\text{mol/L}$ 。

8. 源于酸浆、苦蕒的睡茄内酯类甾族化合物酸浆苦味素 B(726)能抑制脂多糖和 $\text{IFN-}\gamma$ 刺激的巨噬细胞中 $\text{TNF-}\alpha$ 、IL-6 和 IL-12 的生成, 其 $\text{IC}_{50} < 2\mu\text{g/mL}$ 。

9. 源于三白草、鱼腥草的木脂体类化合物马纳萨亭 A(1116)是核转录因子 $\text{NF-}\kappa\text{B}$ 抑制剂, 其 IC_{50} 值为 $2.5\mu\text{mol/L}$, 还能抑制细胞间黏附分子 ICAM-1 的表达, 其 MIC 值为 1.0nmol/L 。

黏附分子途径

1. 源于三白草、鱼腥草的木脂体类化合物马纳萨亭 A(1116)和马纳萨亭 B(1117)能以很低的浓度抑制 PMA 诱导的细胞间黏附分子-1(ICAM-1)表达, 其 MIC 值分别为 1.0 和 5.5nmol/L , 它们同时还是高活性的核转录因子 $\text{NF-}\kappa\text{B}$ 抑制剂, 其 IC_{50} 值分别为 2.5 和 $2.7\mu\text{mol/L}$ 。

2. 1-苯并吡喃类化合物氧化苏木精(1029)的抗炎机制是减少血管细胞黏附因子 VCAM-1 的表达, 已经从多方面得以证实: 减少高血脂新西兰兔大动脉的 VCAM-1 的表达; 减少人脐带静脉内皮细胞中 $\text{TNF-}\alpha$ 诱导的 VCAM-1 的表达; 减少肿瘤坏死因子 $\text{TNF-}\alpha$ 诱导的血管细胞黏附因子 VCAM-1 和单核细胞趋化蛋白 MCP-1 水平的上升, 减少人脐带静脉内皮细胞中氧化的低密度脂蛋白上升以及减少腹膜巨噬细胞中脂多糖加 $\text{IFN-}\gamma$ 刺激的 $\text{TNF-}\alpha$ 和 IL- 1β 的生成; 减少细胞表面黏附分子的表达, 导致抑制 THP-1 单核细胞到 $\text{TNF-}\alpha$ 刺激的人脐带静脉内皮细胞的黏附。

3. 源自脚骨脆属 *Casearia guianensis* 的一组克罗烷型二萜类化合物脚骨脆醇 A(310)、脚骨脆醇 B(311)、脚骨脆酮 A(312)和脚骨脆酮 B(313)都能降低人单核细胞 THP-1 中细胞间黏附分子-1(ICAM-1)和血管细胞黏附因子-1(VCAM-1)的表达, 从而达到抗炎效果。

4. 秋水仙碱(83)能抑制 $\text{TNF-}\alpha$ 和 IL- 1β 刺激的人脐带静脉内皮细胞血管细胞黏附因子-1(VCAM-1)的诱导。

5. 木犀草素(590)的复合抗炎作用机制中也包括了明显降低鼠肝中脂多糖刺激的 ICAM-1 的表达。

提出的几个先导化合物

1. 木犀草素(590)能抑制巨噬细胞 RAW264.7 中脂多糖刺激的 $\text{TNF-}\alpha$ 和 IL-6 的释放, 其 $\text{IC}_{50} < 1\mu\text{mol/L}$; 还能处理气管支气管狭窄和支气管高反应性, 降低 IL-4 和 IL-5 水平, 被建议作为治疗哮喘病新药的先导研发化合物。

2. 川陈皮素(594)能抑制人滑液纤维原细胞中 IL- 1β 诱导的 PGE_2 的产生, 其 IC_{50} 值小于 $4\mu\text{mol/L}$; $32\mu\text{mol/L}$ 降低巨噬细胞中 IL- 1α , IL- 1β , $\text{TNF-}\alpha$ 和 IL-6 mRNAs 的表达, 还能有效抑制兔滑液纤维原细胞中 PGE_2 和 proMMP-9 的产生, 被建议作为研发新的抗炎或免疫调节药物的先导化合物。

3. 丹皮酚(843)是简单的苯衍生物, 以浓度依赖方式抑制致炎细胞因子 $\text{TNF-}\alpha$ 、IL- 1β 和 IL-6 的生成; 抑制 NO 和 PGE_2 的过量产生。丹皮酚在牡丹干燥根皮中的平均含量为 1.44%, 在徐长卿根中的平均含量为 1.43%, 是发展新抗炎药物的候选化合物。

4. 姜黄素(973)的临床前报告已经建议用来治疗关节炎、胰腺炎, 特别是动脉硬化症和 Alzheimer 病。这是对慢性炎症治疗药物在分子和细胞水平上的深入研究取得的重大

进展。其作用机制包括抑制巨噬细胞活化、脂加氧酶、环加氧酶 2、花生四烯酸途径生成的代谢产物等。也有关于核转录因子- κ B 途径的研究、阻断 NO 生成和 iNOS 酶活性的报告。

包括多重靶标的多重调节的网络调节机制正在给人们以越来越深刻的印象。

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/1 前阿朴啡生物碱/3	
原小檗碱生物碱/3 吐根碱类生物碱/5 苯并[c]菲啉生物碱/5 吗啡生物碱/6	
1.2 喹啉类生物碱	6
喹啉生物碱/6 呋喃并喹啉生物碱/7 吡啶酮类生物碱/8	
1.3 喹唑啉类生物碱	8
1.4 吡咯烷类生物碱	9
吡咯烷生物碱/9 吡咯烷士定生物碱/9 吡咯烷士定生物碱(大环内酯)/9 吲哚里西定生物碱/10 菲并吲哚里西定生物碱/10 莨菪烷类生物碱/10	
1.5 吲哚类生物碱	11
咔唑类生物碱/11 吡啶并咔唑类生物碱/11 阿枯米林类生物碱/11 β -咔啉类生物碱/11	
麦角类生物碱/11 Strictosidine 类生物碱/12 类阿吗碱类生物碱/12 老刺木碱类生物碱/14	
吴茱萸类生物碱/14 白坚木属生物碱/15	
1.6 吡啶和哌啶类生物碱	15
吡啶生物碱/15 喹啉定生物碱/15 石松碱类生物碱/17	
1.7 有机胺和酰胺类生物碱	17
酰胺类生物碱/17 秋水仙碱类生物碱/19	
1.8 甾醇生物碱	20
Spirosolane 甾醇生物碱/20 孕甾烷类甾醇生物碱/20	
1.9 萜类生物碱	21
单萜类生物碱/21 大环倍半萜类生物碱/22 C_{19} -二萜类生物碱/23 C_{20} -二萜阿替新类生物碱/25	
1.10 其他生物碱	25
脒和异脒类生物碱/25 嘌呤类生物碱/26 咪唑类生物碱/27 嘧啶类生物碱/28 噁唑类生物碱/28 马兜铃内酰胺类生物碱/28 马兜铃酸类生物碱/29 杂类生物碱/29	
1.11 氨基酸和环肽	29
氨基酸/29 环肽类/30 柄形肽类/32	
2. 萜类	33
2.1 单萜	33
环烯醚类单萜/33 开环环烯醚类单萜/36 薄荷烷型单萜/37 环己烷型单萜/39 蒎烷型单萜/40 蒎烷型单萜/41 薷烷型单萜/42	
2.2 倍半萜	43

4.2 强心甙内酯类甙族化合物	177
4.3 胆烷酸类甙族化合物	178
4.4 螺甙烷类甙族化合物	178
4.5 睡茄内酯类甙族化合物	178
4.6 豆甙烷类甙族化合物	179
4.7 雌甙烷类甙族化合物	182
4.8 雄甙烷类甙族化合物	182
5. 脂肪族天然产物	183
5.1 链状化合物	183
直链烯酸/183 直链烯酯/184 支链烯醇酯/184 支链烯酸/185 支链烯酯/185 饱和 直链酸/185 饱和直链双酮/187 饱和直链醇酸/187	
5.2 炔类化合物	187
炔类化合物(炔醇类)/187	
5.3 单碳环化合物	189
5.4 酰基甘油类	191
5.5 长链芳香系统	192
5.6 含硫化合物	194
5.7 含硒化合物	195
6. 含氧杂环	196
6.1 2-吡喃酮类	196
6.2 4-吡喃酮类	197
6.3 β -内酯类	197
6.4 丁内酯类	197
6.5 戊内酯类	198
6.6 桉油精类	199
6.7 未氯化缩酚(羧)酸环醚	199
6.8 未氯化缩酚(羧)酸二聚体	199
7. 简单芳香化合物	200
7.1 简单苯衍生物	200
7.2 苯丙烯类	210
7.3 酰基间苯三酚类	223
7.4 咕吨酮类	228
7.5 联苯类	229
7.6 联苄类	229
7.7 芪类	230
7.8 芪聚合物类	234
7.9 二苯醚类	235
7.10 二芳丙烷类	235

7.11 二芳庚烷类	235
7.12 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
萘类/239 萘醌类/239	
8.2 蒽和蒽醌类	241
蒽醌类/241	
8.3 菲类	243
菲类/243 1,4-菲醌类/244	
9. 苯并呋喃和苯并吡喃类	245
9.1 苯并呋喃类	245
9.2 1-苯并吡喃类	247
9.3 呋喃并-1-苯并吡喃类	249
9.4 吡喃并-2-苯并吡喃类	251
10. 香豆素类	252
10.1 香豆素类	252
10.2 双香豆素类	257
10.3 呋喃并香豆素类	257
10.4 吡喃并香豆素类	261
10.5 异香豆素	263
11. 木脂体	264
11.1 木脂体	264
11.2 萘基类木脂体	273
11.3 二苯并环辛二烯木脂体	274
11.4 环丁烷型木脂体	276
11.5 新木脂体	276
12. 鞣质	280
12.1 没食子酯鞣质	280
12.2 黄酮鞣质	283
12.3 间苯三酚鞣质	284
参考文献	285
化合物药理活性索引	297
化合物中文名称索引	318
化合物英文名称索引	335
植物中文名称及活性成分索引	356

植物拉丁学名及活性成分索引	386
附录 1 缩写和符号表	412
附录 2 癌细胞代码	415

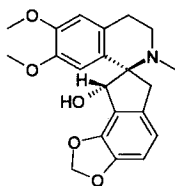
1. 生物碱

1.1 异喹啉类生物碱

异喹啉生物碱

1 Fumaricine 蓝堇辛

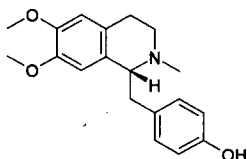
[24181-77-9] $C_{21}H_{23}NO_5$ (369.42). 【类型】异喹啉生物碱. 【活性】用于治疗皮肤病、肝病和炎症 (使用源植物药用球果紫堇). 【来源】药用球果紫堇 *Fumaria officinalis*. 【文献】170.



苄基异喹啉生物碱

2 Armepavine 杏黄罂粟碱

[524-20-9] $C_{19}H_{23}NO_3$ (313.40). mp 148~149°C. 【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 caasicum*, 荷叶 *Nelumbo nucifera*, 莲子 *Nelumbo nucifera*, 欧鼠李 *Rhamnus frangula* [Syn. *Frangula alnus*], 欧洲卫矛 *Euonymus europaeus*, 波斯罂粟 *Papaver persicum*. 【文献】6, 170.

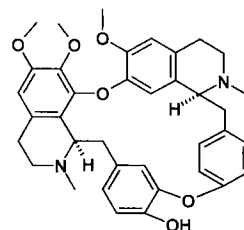


双苄基异喹啉生物碱

3 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%)^[1025], 大叶唐松草 *Thalictrum faberi* (根: 含量 < 0.001%)^[1025], 华南功劳木 *Mahonia japonica*, 金丝马尾连 *Thalictrum glandulosissimum* (根: 含量 < 0.001%)^[1025], 马尾连 (多叶唐松草) *Thalictrum foliolosum* (根: 含量 < 0.001%)^[1025], 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%)^[1025], 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%)^[1025], 鲜黄小檗 *Berberis diaphana* (根、茎: 平均含量 = 0.440%)^[1025], 小果唐松草 *Thalictrum microgynum* (根: 含量 = 0.08%)^[1025], 烟锅草 *Thalictrum thunbergii* (根: 含量 = 0.03%)^[1025], 硬水黄连 (短梗箭头唐松草) *Thalictrum simplex* [Syn. *Thalictrum simplex* var. *brevipes*] (根: 含量 = 0.01%)^[1025], 置疑小檗 *Berberis dubia* (根、茎: 平均含量 = 0.396%)^[1025]. 【文献】1, 2, 4, 5, 171, 1022, 1025.

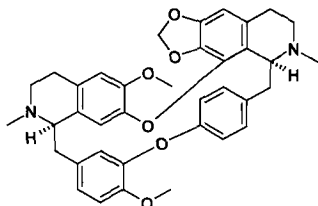


4 Cepharanthine 头花千金藤碱 (顶花防己碱; 金钱吊乌龟碱; 千金藤素; 西法安生)

[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.^[1024] 【类型】双苄基异喹啉生物碱. 【活性】抗肿瘤 (HeLa, *in vitro*, $ED_{50} = 5.5\mu g/kg$; 人, HeLa-S3, *in vitro*, $ED_{50} = 7.0\mu g/kg$; EAC *in*

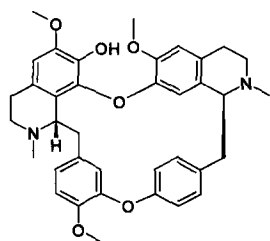
vivo; S₁₈₀ *in vivo*; 抑制 DNA 合成; 活化淋巴结; 抗菌 (结核分枝杆菌); 抑制由溶卵磷脂引起的无核细胞 K⁺ 渗漏; 血小板聚集抑制剂 (胶原引起的小血小板聚集); 抗过敏 (抑制某些过敏性休克); 解毒剂 (解酒精和蛇毒)。

【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, 4, 5, 6, 1024。



5 Fangchinoline 汉防己乙素 (防己诺林碱; 去甲粉防己碱)

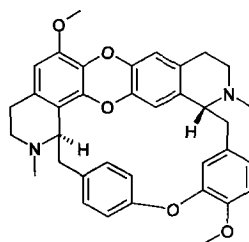
Demethyltetrandrine C₃₇H₄₀N₂O₆ (608.74). mp 237~238°C (丙酮); mp 177~179°C (甲醇)。【类型】双苄基异喹啉生物碱。【活性】细胞毒 (HeLa *in vitro*, ED₅₀ = 4.1 μg/mL); 抗高血压; 血小板聚集抑制剂 (胶原所致的小血小板聚集); 止痛; 抗炎 (细胞因子网络调节器: 预防整合蛋白介导的中性粒细胞黏附和 fMLP-或 leukotriene B₄-诱导的移行, IC₅₀ = 1~5 μg/mL)^[725]; IL-6 抑制剂 (*in vitro*, IC₅₀ > 6 μmol/L)^[725]; LD₅₀ (鼠, ip) ≥ 50 mg/kg; 【来源】防己 (粉防己) *Stephania tetrandra* (干燥根: 6 产地平均含量 = 0.759%^[1025]), 汝兰 *Stephania hernandifolia*。【文献】2, 4, 5, 13, 170, 171, 725, 1022, 1025。



6 Isotrilobine 异三叶木防己碱

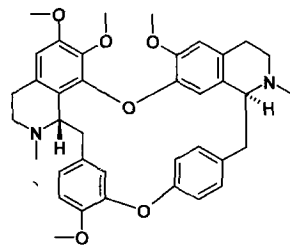
Homotrilobine [26195-62-0] C₃₆H₃₆N₂O₅ (576.70). mp 213~215°C。【类型】双苄基异喹啉生物碱。【活性】抗肿瘤 (HeLa、鼠 EAC、S₁₈₀); 抗炎 (大鼠, 棉塞肉芽肿模型, 角叉菜胶引起的足肿胀模型); 抗菌 (六种杆菌和多种球菌, MIC = 7.8~500 μg/mL); 血小板聚集抑制剂。【来源】木防己 *Cocculus trilobus* [Syn. *Cocculus sarmentosus*], 汝兰 *Stephania hernandifolia*。

【文献】6, 170。



7 Tetrandrine 粉防己碱 (汉防己碱; 倒地拱素)

Fanchinin; Hanfangchin A [518-34-3] C₃₈H₄₂N₂O₆ (622.77). mp (±) 257~258°C, mp (+) 217~218°C, [α]_D²⁶ = +252.4° (三氯甲烷), 溶于乙醇、乙醚、三氯甲烷, 不溶于水、石油醚^[1024]。【类型】双苄基异喹啉生物碱。【活性】抗肿瘤 (鼠, EAC 和 S₁₈₀, *in vivo*); 止痛; 抗过敏; 抗心律失常 (负性肌力作用); 抗菌 (结核分枝杆菌, *in vitro* 和 *in vivo*); 抗炎 (细胞因子网络调节器: 预防整合蛋白介导的中性粒细胞黏附和 fMLP-或白三烯 B₄ 诱导的移行, IC₅₀ = 1~5 μg/mL)^[725]; IL-6 抑制剂 (*in vitro*, IC₅₀ > 6 μmol/L)^[725]; 细胞毒 (HeLa, *in vitro*); 血小板聚集抑制剂 (兔); 抗高血压; 肌肉松弛剂; 用于治疗矽肺。【来源】白药子 *Stephania cepharantha*, 蝙蝠葛根 *Menispermum dauricum* (根茎: 平均含量 = 0.994%^[1025]), 彩纹千金藤* *Stephania discolor*, 防己 (粉防己) *Stephania tetrandra* (干燥根: 含量范围 = 1.187%~3.537%^[1022], 6 产地平均含量 = 1.915%^[1025]), 汉防己 *Aristolochia heterophylla*, 青木香 *Aristolochia debilis* [Syn. *Aristolochia longa*], 锡生藤 *Cissampelos pareira*, 银不换 *Cyclea barbata*。【文献】5, 170, 171, 725, 1022, 1024, 1025。



8 Thalcimine 箭头唐松草碱

Thalsimine C₃₈H₄₀N₂O₇ (636.75). mp 140~142°C。【类型】双苄基异喹啉生物碱。【活性】抗肿瘤 (鼠, 淋巴瘤 NK/CY, 肝细胞瘤 PC-1 和淋巴管肉瘤); 止痛;