



TCM Series of Active Components

Active Components on Nervous System in TCM

中药药理活性成分丛书

中药影响神经系统 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

中药影响神经系统活性成分 / 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 978-7-03-033838-9

I. 中… II. ①周… ②谢… ③严… III. 神经系统疾病—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 043788 号

责任编辑: 戚东桂 康丽涛/责任校对: 刘小梅

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: 21

字数: 673 000

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 2240 种中药原植物及其同属植物的小分子活性成分 864 种，每一种都至少有一条神经系统相关活性数据。全书引用参考文献 714 篇，文献收集年代至 2005 年。864 种活性成分中，生物碱 391 种，萜类化合物 163 种，黄酮类化合物 53 种，芳香化合物 96 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。

主要作用于中枢神经系统的药物类别有：镇静催眠和抗焦虑药、抗癫痫药、抗惊厥药、抗中枢退行性病变药、镇痛药、抗抑郁症药、抗精神病药、中枢兴奋药和益智药等。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，尚不具备对各类神经系统活性物质进行全面的系统分析的条件，这里只举例说明从本书查找信息发现关系的一些方法。

1. 中枢镇静活性成分的结构分布

从“化合物药理活性索引”的“中枢神经系统活性”和“中枢镇静”条目中的化合物名单，顺序阅读整理有关数据，可以得出中枢镇静活性成分主要分布在下列结构类别中：

(1) 异喹啉和喹啉类生物碱有花瓣狮足草碱(16)、唐松草舒平(35)、木防己胺(36)、木防己碱(37)、木瓣树碱(52)、奥可梯木种碱(53)、威尔士绿绒蒿定碱(60)、黄柏碱(62)、白屈菜碱(69)、蒂巴因(76)、加锡弥罗果碱(95)、山油柑西定(96)、茵芋碱(103)。

(2) 吡咯烷类生物碱有异钩藤碱(125)、娃儿藤碱(127)、百部碱(128)、可卡因(134)、巴豆酰莨菪碱(139)。

(3) 吲哚类生物碱有长春日定(191)、去甲氧利血平(194)、近山马茶碱(201)、去氢钩藤碱(217)、柯诺辛碱 B(219)、硬毛钩藤碱(221)、长春林碱(230)。

(4) 吡啶和哌啶类生物碱有槟榔次碱(233)、苦豆碱(238)、多花羽扇豆碱(242)。

(5) 萜类化合物有桉叶醇厚朴酚(436)、白木香醇(437)、缬草萜烯酸(443)、沉香雅槛蓝醇(470)、沉香螺醇(473)、锦紫苏醇(479)、丹参新酮(490)、二密腺桉木素(530)。

(6) 木脂体类化合物异落叶松醇(839)、柄果脂素(848)、单爵麻脂苷(852)、五味子醇 A(857)、和厚朴酚(860)。

2. 抗抑郁的单胺氧化酶抑制剂

临床应用的抗抑郁药有三环类、四环类、抑制 5-羟色胺再摄取的抗抑郁药、单胺氧化酶(MAO)抑制剂和中药贯叶金丝桃的提取物五类。我们只对单胺氧化酶抑制剂和叶金丝桃及同属植物做一些分析。由观察检索结果可知，本书中收集有单胺氧化酶抑制活性的成分近 40 种，但有定量 IC_{50} 数据的只有 15 种， $IC_{50} < 40 \mu\text{mol/L}$ 的高活性化合物只有胡椒碱(267)、二氢丹参酮 I(489)、5-羟基黄烷酮(574)、查耳酮类(602)、二氢吡喃酮类化合物(796)、四棱角毛壳菌素 D(771)、东莨菪素(800)等 7 种。这一结果看来可能和此类抗抑郁药适应证有限，和其他药物之间可能发生不良相互作用，应用受到限制，因而研究兴趣不高有关。

3. 金丝桃属植物的抗抑郁成分

藤黄科植物贯叶金丝桃 *Hypericum perforatum* 的浸膏是重要的抗抑郁药，对脑细胞再摄取

5-羟色胺、去甲肾上腺素、多巴胺等都有明显抑制作用。这里对有关原植物的抗抑郁成分做一扼要分析。根据化合物药理活性索引、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,查找有关条目中的化合物名单,结合正文内容就可得到抗抑郁活性成分在金丝桃属植物及其他植物中的分布的有关信息如下:

(1) 根据化合物药理活性索引,得到有药理实验证实的抗抑郁成分有苯丙氨酸(388)、色氨酸(389)、酰基间苯三酚类贯叶连翘素(724)、咕吨酮类异芒果苷(731)、蒽醌类金丝桃素(760)、木脂体类卧爵床脂定 A(856)六种。除两种氨基酸外,分别属于结构上差别较大的酰基间苯三酚类、咕吨酮类、蒽醌类和木脂体类。提示我们在研究抗抑郁活性时应同时注意这些不同的结构类型。

(2) 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,总结得知大部分金丝桃属植物(包括黄海棠、弯萼金丝桃、挺茎遍地金、地耳草、扬子小连翘、元宝草、展萼金丝桃、贯叶金丝桃、近无柄金丝桃、遍地金等)都含有三类化合物。一是酰基间苯三酚类贯叶连翘素,二是蒽醌类金丝桃素,这两类都已证实是抗抑郁活性成分。第三类是槲皮素及其糖苷金丝桃苷,目前尚未收集到是否有抗抑郁活性的证据。

(3) 抗抑郁成分咕吨酮类异芒果苷(731)在多种石韦属植物中含量可观:光石韦干燥叶中含 7.84%,庐山石韦干燥叶平均含 0.16%,拟光石韦干燥叶中含 0.17%,石韦干燥叶中含 0.01%~0.24%,有柄石韦干燥叶平均含 0.011%,知母干燥根茎 8 产地平均含 1.17%,特别值得注意。同时,已经证实有中枢镇静活性的芒果苷(732)在结构上和异芒果苷很相似,只是糖和糖苷连接位置稍有不同,在多种石韦属植物中含量也很可观。

(4) 最后,在金丝桃属多种植物中的人参黄酮苷(584)已经发现是神经保护剂,因有广泛分布和活性相近也值得注意。

4. 搜寻高活性中枢胆碱酯酶抑制剂

阿尔茨海默症(AD)是中枢神经系统退行性疾病,主要症状是记忆障碍、认知功能缺失和痴呆。其病因认为和中枢乙酰胆碱水平降低有关,故中枢胆碱酯酶抑制剂是有效的阿尔茨海默症药物。目前临床治疗药物有他克林、多奈哌齐、石杉碱 A、加兰他敏等。作为 AD 治疗药物的条件是:能穿过血-脑屏障,对中枢 AChE 选择性强而对周围组织中的 BChE 作用弱,毒性低以利长期用药。

从本书化合物药理活性索引检索“AChE 抑制剂”和“胆碱酯酶抑制剂”条目,可得近百个 AChE 抑制剂的数据集。其中包括了早年使用的毒扁豆碱(158),在我国投入使用的石杉碱 A(255)和近年来推荐用于轻、中度阿尔茨海默症的加兰他敏(271)。为了从这近百个化合物中寻找开发抗 AD 新药先导物的初步候选物,我们逐个观察其定量活性数据 IC_{50} 值,删去 $IC_{50} \geq 100 \mu\text{mol/L}$ 的中低活性化合物,再删去抑制周边组织 BChE 活性高于抑制中枢 AChE 活性的化合物,最后得到下列 8 组初步候选物,提供进一步研究:

(1) 石蒜碱类生物碱 1-O-乙酰基石蒜碱(285), IC_{50} 值为 $0.96 \mu\text{mol/L}$ 。

(2) 双苄基异喹啉生物碱防己索林(21)和 Kurramine-2'- β -N-oxide(31), IC_{50} 值分别为 $48 \mu\text{mol/L}$ 和 $10 \mu\text{mol/L}$ 。

(3) 降松香烷型二萜隐丹参酮(488)和二氢丹参酮 I(489)均为高活性化合物, IC_{50} 值分别为 $7.0 \mu\text{mol/L}$ 和 $1.0 \mu\text{mol/L}$ 。

(4) 异海松烷型二萜化合物(493)的 TLC 生物自显影试验 MA 值为 $0.5 \mu\text{g}$; 化合物(494)的

MA 值为 $0.2\mu\text{g}$ 。

(5) 甾族化合物白薇属苷 B(607)是可逆和非竞争性的 AChE 抑制剂, IC_{50} 值为 $3.6\mu\text{mol/L}$, 同时进行了白鼠抗失忆模型药理实验: 口服剂量 1.0mg/kg 时, 能改善由东莨菪碱引起的记忆损伤, 可能对减轻记忆损伤有医疗价值。

(6) 睡茄内酯类甾族化合物(625)作为 AChE 抑制剂的 IC_{50} 值为 $63\mu\text{mol/L}$, 作为 BChE 抑制剂的 IC_{50} 值为 $124\mu\text{mol/L}$, 对中枢胆碱酯酶有选择性。

(7) 咕吨酮类化合物雏菊叶龙胆酮(726)、去甲雏菊叶龙胆酮(733)、去甲当药苷(734)和当药苷(736)都是 AChE 抑制剂, 其最低有效抑制浓度 MIC 值分别为 $0.01\mu\text{g}$ 、 $0.04\mu\text{g}$ 、 $0.50\mu\text{g}$ 和 $0.08\mu\text{g}$ (对照物加兰它敏的 MIC 值为 $0.01\mu\text{g}$)。

(8) 呋喃并香豆素类化合物异欧前胡内酯(809), 印度楹梲素(811), 紫花前胡苷(812), 花椒毒素(816)和日本前胡醇(818)都是活性较高的中枢胆碱酯酶抑制剂, 其 IC_{50} 值分别为 $69\mu\text{mol/L}$ 、 $67\mu\text{mol/L}$ 、 $68\mu\text{mol/L}$ 、 $54\mu\text{mol/L}$ 和 $28\mu\text{mol/L}$ 。

总之, 根据活性成分索引、植物成分索引中有关条目的化合物名单, 结合正文内容就可对本书进行专题阅读、资料整理、数据统计等工作, 得到较完整的综合信息。

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/2 双苄基异喹啉生物碱/3 阿朴啡生物碱/8 前阿朴啡生物碱/12 原小檗碱生物碱/12 前阿片碱类生物碱/17 苯并[c]菲啶生物碱/18 吗啡生物碱/19 2-苯并[c]呋喃酮异喹啉类生物碱/20 三尖杉生物碱/21 刺桐生物碱/21	
1.2 喹啉类生物碱	22
喹啉生物碱/22 呋喃并喹啉生物碱/23 吡啶酮类生物碱/25	
1.3 喹唑啉类生物碱	25
1.4 吡咯烷类生物碱	25
吡咯烷士定生物碱/25 吡咯烷士定生物碱(大环内酯)/26 咧哌里西定生物碱/28 菲并咧哌里西定生物碱/29 百部碱类生物碱/29 莨菪烷类生物碱/29 多吡咯类生物碱(胆汁色素类)/31 松叶菊碱类生物碱/32	
1.5 咧哌类生物碱	32
简单咧哌生物碱/32 咔唑类生物碱/34 环色胺类生物碱/34 色胺类生物碱/35 Hasubanan 类生物碱/35 阿枯米辛类生物碱/35 Vallesaman 类生物碱/37 钩吻类生物碱/37 β -咔琳类生物碱/38 麦角类生物碱/38 类阿吗碱类生物碱/40 洪达木类生物碱/41 育亨宾类生物碱/41 蛇根精类生物碱/43 老刺木碱类生物碱/44 吴茱萸类生物碱/44 马钱子类生物碱/45 Iboga 类生物碱/45 Akageran 类生物碱/45 柯楠碱类生物碱/46 阿吗灵类生物碱/48 咧哌杂类生物碱/49	
1.6 吡啶和哌啶类生物碱	49
吡啶生物碱/49 喹啉定生物碱/50 哌啶生物碱/52 一叶萩碱类生物碱/53 石松碱类生物碱/53 杷碱类生物碱/54 异杷碱类生物碱/54	
1.7 有机胺和酰胺类生物碱	54
有机胺类生物碱(酪胺类)/54 有机胺类生物碱(尿素类)/54 酰胺类生物碱/54 麻黄类生物碱/56 秋水仙碱类生物碱/56	
1.8 石蒜科生物碱	57
加兰他敏类生物碱/57 网球花定生物碱/57 水仙花碱类生物碱/58 石蒜碱类生物碱/59	
1.9 甾醇生物碱	60
Cerveratrum 类甾醇生物碱/60 Conanine 类甾醇生物碱/62 Spirosolane 甾醇生物碱/62 孕甾烷类甾醇生物碱/63 Buxus 类甾醇生物碱/65 Salamandra 类甾醇生物碱/67	
1.10 萜类生物碱	67
单萜类生物碱/67 C_{19} -二萜类生物碱/68 C_{20} -二萜阿替新类生物碱/73	
1.11 其他生物碱	74

腈和异腈类生物碱/74 嘌呤类生物碱/74 咪唑类生物碱/75 嘧啶类生物碱/75 噻唑类生物碱/75 丽春花碱类生物碱/75 马兜铃内酰胺类生物碱/75 双环杂类生物碱/75 杂类生物碱/76 多胺类生物碱/77 河豚毒素类生物碱/77	
1.12 氨基酸和肽类	78
氨基酸/78 肽类/79 柄形肽类/79	
2. 萜类	80
2.1 单萜	80
链状单萜/80 环烯醚类单萜/80 开环环烯醚类单萜/84 薄荷烷型单萜/85 侧柏烷型单萜/87 环戊烷型单萜/88 环己烷型单萜/88 莰烷型单萜/88 蒎烷型单萜/89 葑烷型单萜/89	
2.2 倍半萜	89
大牻牛儿烷型倍半萜/89 桉烷型倍半萜/90 沉香呋喃桉烷型倍半萜/91 杜松烷型倍半萜/91 双杜松烷型倍半萜/91 环戊烷型倍半萜/91 石竹烷型倍半萜/92 移愈创木烷型倍半萜/92 愈创木烷型倍半萜/92 伪愈创木烷型倍半萜/93 木防己苦烷型倍半萜/93 Silphiperfoliane 型倍半萜/94 杂类倍半萜/94 开环 Prezizaane 烷型倍半萜/94 雅檣蓝烷型倍半萜/96 螺岩兰草烷型倍半萜/96 柏木烷型倍半萜/97 Carabrane 烷型倍半萜/97 雪松烷型倍半萜/97	
2.3 二萜	97
半日花烷型二萜/97 克罗烷型二萜/98 松香烷型二萜/99 降、高松香烷型二萜/99 异海松烷型二萜/101 柯桉树烷型二萜/101 假白榄烷型二萜/102 瑞香烷型二萜/102 巴豆烷型二萜/102 二环杂类二萜/102 杂类二萜/103 木藜芦毒烷型二萜/103 10,15-环植烷型二萜/103 Cyathane 烷型二萜/103	
2.4 三萜	104
羊毛甾烷型三萜/104 环羊毛甾烷型三萜/105 葫芦烷型三萜/105 达玛烷型三萜/106 完整四去甲三萜/110 苦木素类去甲三萜/111 羽扇豆烷型三萜/111 齐墩果烷型三萜/111 无羁萜烷型三萜/112 乌苏烷型三萜/113 芒柄花烷型三萜/115	
2.5 四萜和局部萜	115
四萜/115 局部萜/116	
3. 黄酮类	117
3.1 黄酮类	117
3.2 二氢黄酮类	123
3.3 黄酮醇类	124
3.4 二氢黄酮醇类	130
3.5 双二氢黄酮醇类	131
3.6 异黄酮类	131
3.7 黄烷类	132
3.8 黄烷-3-醇类	132
3.9 查耳酮类	135
3.10 双查耳酮类	136

3.11 二氢查耳酮类	136
4. 甾族化合物	137
4.1 孕甾烷类甾族化合物	137
4.2 强心甾内酯类甾族化合物	138
4.3 蟾酥内酯类甾族化合物	139
4.4 胆烷酸类甾族化合物	139
4.5 胆甾烷类甾族化合物	140
4.6 呋甾烷类甾族化合物	140
4.7 睡茄内酯类甾族化合物	140
5. 脂肪族天然产物	144
5.1 链状化合物	144
直链烯烃/144 支链烯酯/144 饱和直链酸/144 饱和支链醇/145 饱和环酮/145	
5.2 炔类化合物	145
炔类化合物(炔醇类)/145	
5.3 长链芳香系统	146
5.4 含硫化合物	146
5.5 含硒化合物	147
6. 含氧杂环	148
6.1 2-吡喃酮类	148
6.2 4-吡喃酮类	148
6.3 吡喃类	149
6.4 β -内酯类	149
6.5 丁内酯类	149
6.6 戊内酯类	151
6.7 桉油精类	151
7. 简单芳香化合物	152
7.1 简单苯衍生物	152
7.2 苯丙烯类	157
7.3 酰基间苯三酚类	167
7.4 咕吨酮类	168
7.5 联苯类	171
7.6 芪类	171
7.7 二芳戊烷类	171
7.8 二芳庚烷类	172
7.9 含硫芳香化合物	174
8. 多环芳香化合物	175

8.1 萘和萘醌类	175
吡喃并萘类/175 萘醌类/175 1-吡喃并萘醌类/175	
8.2 蒽和蒽醌类	175
蒽醌类/175	
8.3 菲类	177
菲类/177	
9. 苯并呋喃和苯并吡喃类	179
9.1 苯并呋喃类	179
9.2 异苯并呋喃类	180
9.3 1-苯并吡喃类	180
9.4 吡喃并-1-苯并吡喃类	181
9.5 呋喃并-1-苯并吡喃类	182
9.6 吡喃并-2-苯并吡喃类	182
10. 香豆素类	183
10.1 香豆素类	183
10.2 呋喃并香豆素类	188
10.3 吡喃并香豆素类	191
11. 木脂体	195
11.1 木脂体	195
11.2 萘基类木脂体	199
11.3 二苯并环辛二烯木脂体	200
11.4 新木脂体	200
12. 鞣质	202
12.1 没食子酯鞣质	202
参考文献	203
化合物药理活性索引	212
化合物中文名称索引	229
化合物英文名称索引	242
植物中文名称及活性成分索引	258
植物拉丁学名及活性成分索引	287
附录 1 缩写和符号表	313
附录 2 癌细胞代码	316

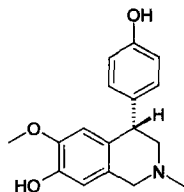
1. 生物碱

1.1 异喹啉类生物碱

异喹啉生物碱

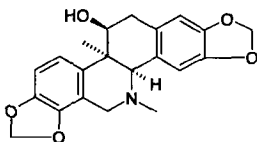
1 Cherylline

$C_{17}H_{19}NO_3$ (285.35). 【类型】异喹啉生物碱. 【活性】AChE 抑制剂 [$IC_{50} = (211 \pm 10) \mu\text{mol/L}$, 对照加兰他敏, $IC_{50} = (1.9 \pm 0.2) \mu\text{mol/L}$]^[587]. 【来源】灌木文殊兰* *Crinum macowanii* (鳞茎), 文殊兰属 *Crinum moorei*. 【文献】410, 587.



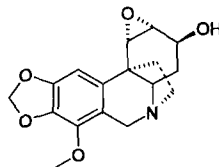
2 Corynoline 紫堇醇灵碱 (紫堇灵)

[18797-79-0] $C_{21}H_{21}NO_5$ (367.41). mp 216~217°C. 【类型】异喹啉生物碱. 【活性】抗螺旋体; 镇静 (作用显著, 用其硫酸盐). 【来源】尖距紫堇 *Corydalis suaveolens* [Syn. *Corydalis shearerii*], 苦地丁 *Corydalis bungeana* (带根全株: 8 产地含量范围 = 0.051%~0.261%, 平均含量 = 0.150%^[699]), 紫花鱼灯草 *Corydalis incisa*. 【文献】5, 138, 696, 699.



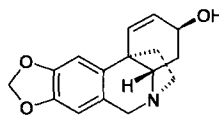
3 Crinamidine 文殊兰米定碱*

$C_{17}H_{19}NO_5$ (317.34). 【类型】异喹啉生物碱. 【活性】AChE 抑制剂 [$IC_{50} = (300 \pm 27) \mu\text{mol/L}$, 对照加兰他敏, $IC_{50} = (1.9 \pm 0.2) \mu\text{mol/L}$]^[587]. 【来源】文殊兰属 *Crinum moorei*. 【文献】587.



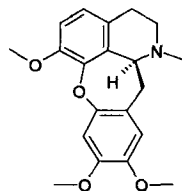
4 (+)-Crinine (+)-文殊兰碱 (条纹碱)

(+)-Vittatine $C_{16}H_{17}NO_3$ (271.32). mp 207~208°C (升华). 【类型】异喹啉生物碱. 【活性】AChE 抑制剂 [$IC_{50} = (461 \pm 14) \mu\text{mol/L}$, 对照加兰他敏, $IC_{50} = (1.9 \pm 0.2) \mu\text{mol/L}$]^[587]; 抗菌 (金黄色葡萄球菌, IZD = 19mm, MIC = 63 $\mu\text{g/mL}$; 大肠杆菌, IZD = 22mm)^[395]; 抗真菌 (白念珠菌, IZD = 17mm, MIC = 31 $\mu\text{g/mL}$)^[395]. 【来源】孤挺花 *Amaryllis belladonna* (鳞茎), 石蒜 *Lycoris radiata* [Syn. *Amaryllis radiata*], 文殊兰属 *Crinum moorei*. 【文献】5, 395, 587.



5 Cularine 桔拉灵

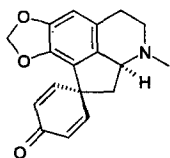
[479-39-0] $C_{20}H_{23}NO_4$ (341.41). 【类型】异喹啉生物碱. 【活性】细胞毒; 提高心肌收缩力; 抗高血压 (兔); 麻醉剂 (兔角膜); 子宫兴奋剂. 【来源】棒状紫堇 *Corydalis claviculata*, 兜状荷包牡丹 *Dicentra cucullaria*, 俄勒冈荷包牡丹 *Dicentra oregana*, 美丽荷包牡丹 *Dicentra formosa*, 缝毛荷包牡丹 *Dicentra eximia*, 瓦氏小檗* *Berberis valdiviana*. 【文献】138.



6 Fugapavine 呋杷文

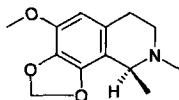
Mecambrine [1093-07-8] $C_{18}H_{17}NO_3$ (295.34). 【类型】异喹啉生物碱. 【活性】升高血压 (动物实验); 减慢心率 (动物实验); 呼吸兴奋剂 (动物实验); 致惊厥

(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】138.



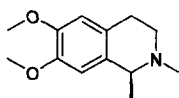
7 Lophophorine 须盘掌碱

[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】138.



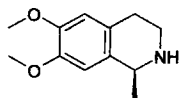
8 Pectenine 卡内精

$C_{13}H_{19}NO_2$ (221.30). 【类型】异喹啉生物碱. 【活性】引起惊厥 (温血动物). 【来源】巨人柱 *Carnegiea gigantea*, 天轮柱属 *Cereus pectenaboriginum*. 【文献】138.



9 Salsolidine 猪毛菜定碱

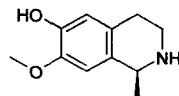
$C_{12}H_{17}NO_2$ (207.26). 片状晶体 (水), mp 69~70°C, $[\alpha]_D = -63^\circ$ (乙醇), 氢氯化物, 白色或淡黄色晶体性粉末, mp 235~236°C, $[\alpha]_D^{18} = -25^\circ$ (水). 【类型】异喹啉生物碱. 【活性】抗高血压 (抑制骨髓中血管舒缩系统); 解痉 (大鼠肠, 氯化钡引起的痉挛); LD_{50} (大鼠, ip) = 300mg/kg. 【来源】猪毛菜 *Salsola collina*. 【文献】138, 140.



10 Salsoline 猪毛菜碱

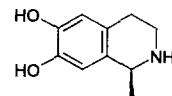
$C_{11}H_{15}NO_2$ (193.25). 禾本黄色针状晶体 (甲醇或乙醇), mp 221°C, $[\alpha]_D^{20} = +34.5^\circ$ ($c = 1$, 0.1mol/L 盐酸).

【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】140.



11 (-)-Salsolinol 猪毛菜酚

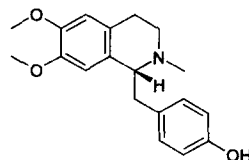
$C_{10}H_{13}NO_2$ (179.22). 不稳定氢溴化物, 奶油色细小棱柱状晶体 (乙醇-乙醚), mp 195~198°C. 【类型】异喹啉生物碱. 【活性】止痛; 升高血压和增加心率 (大鼠, iv); 单胺氧化酶抑制剂; 神经肌肉阻断作用; 刺激心房 (豚鼠, *in vitro*). 【来源】粉芭蕉 *Musa paradisiaca*, 可可 *Theobroma cacao*, 牛心番荔枝 *Annona reticulata*, 乌头 *Aconitum carmichaeli*. 【文献】140.



苄基异喹啉生物碱

12 Armepavine 杏黄罂粟碱

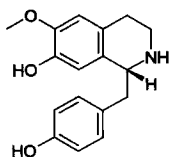
[524-20-9] $C_{19}H_{23}NO_3$ (313.40). mp 148~149°C. 【类型】苄基异喹啉生物碱. 【活性】引起心律不齐; 致惊厥; 刺激剂. 【来源】高加索罂粟 *Papaver caucasicum*, 荷叶 *Nelumbo nucifera*, 莲子 *Nelumbo nucifera*, 欧洲鼠李 *Rhamnus frangula* [Syn. *Frangula alnus*], 欧洲卫矛 *Euonymus europaeus*, 波斯罂粟 *Papaver persicum*. 【文献】5, 138.



13 D-Cocclaurine D-衡州乌药碱

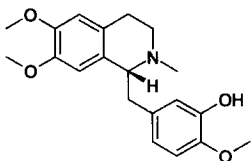
(+)-Cocclaurine [486-39-5] $C_{17}H_{19}NO_3$ (285.35). 泡沫状物, mp 220.0~222.5°C (丙酮), $[\alpha]_D = +45.7^\circ$ ($c = 0.44$, 乙醇). 【类型】苄基异喹啉生物碱. 【活性】神经肌肉阻断作用 (蛙, MIC = 10μg/mL); 镇静. 【来源】衡州乌药 *Cocculus laurifolius*, 银不换 *Cyclea*

barbata. 【文献】5, 149.



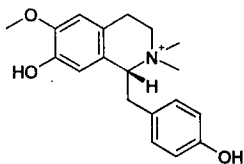
14 Laudanidine 半日花酚碱

[301-21-3] $C_{20}H_{25}NO_4$ (343.43). mp 181~182°C, mp 184~185°C, $[\alpha]_D^{28} = -101^\circ$ (乙醇). 【类型】苄基异喹啉生物碱. 【活性】引起惊厥和麻痹 (高剂量). 【来源】阿片 *Papaver somniferum*. 【文献】5, 193.



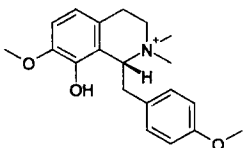
15 Magnocurarine 木兰箭毒碱

[6801-40-7] $C_{19}H_{24}NO_3^+$ (314.41). mp (+)(S) 198~199°C (分解), (-)(R) 199~200°C. 【类型】苄基异喹啉生物碱. 【活性】抗高血压 (麻醉犬、猫、兔); 神经节阻断剂 (具箭毒样作用, 兔, 点头实验, $ED_{50} = 6\text{mg/kg}$); LD_{50} (鼠 ip) = 3mg/kg. 【来源】澄茄子 *Litsea cubeba*, 大叶厚朴 *Magnolia rostrata*, 厚朴 *Magnolia officinalis*, 日本厚朴 *Magnolia obovata*, 武当木兰 *Magnolia sprengeri*. 【文献】2, 3, 5, 127, 138.



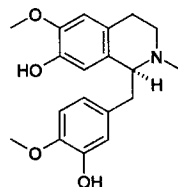
16 Petaline 花瓣狮足草碱

[7354-32-7] $C_{20}H_{26}NO_3^+$ (328.44). 【类型】苄基异喹啉生物碱. 【活性】中枢镇静 (有抗乙酰胆碱活性). 【来源】花瓣狮足草 *Leontice leontopetalum*. 【文献】363.



17 Reticuline 瑞枯灵

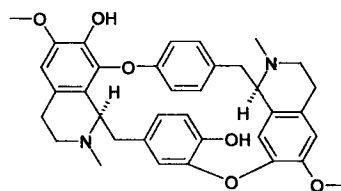
Laudanosoline 4',6-dimethyl ethe [485-19-8] $C_{19}H_{23}NO_4$ (329.40). 淡黄色粉末, mp 146°C, $[\alpha]_D^{16} = +98.4^\circ$ ($c = 0.77$, 乙醇). 【类型】苄基异喹啉生物碱. 【活性】血小板聚集抑制剂 (ADP 和花生四烯酸引起的血小板聚集); 抑制子宫收缩; 神经肌肉阻断作用 (蛙, MIC = 100μg/mL); 促进头发生长. 【来源】番荔枝 *Annona squamosa*, 荷包牡丹根 *Dicentra spectabilis*, 衡州乌药 *Cocculus laurifolius*, 红楠皮 *Machilus thunbergii*, 马尾连 *Thalictrum foliolosum*, 牛心番荔枝 *Annona reticulata*, 罂粟 *Papaver somniferum*, 有钩鹰爪 *Artabotrys uncinatus* (根, 茎, 叶)^[351], 圆滑番荔枝 *Annona glabra*, 樟木 *Cinnamomum camphora*, 紫花鱼灯草 *Corydalis incisa*. 【文献】5, 138, 139, 149, 351.



双苄基异喹啉生物碱

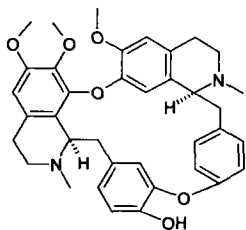
18 L-Bebeerine L-箭毒碱

L-Curine $C_{36}H_{38}N_2O_6$ (594.71). 花状晶体 (甲醇), mp 213°C; mp 221°C (真空); 矩形棱柱状晶体 (苯), 含 1 分子结晶苯, mp 161°C, $[\alpha]_D = -328^\circ$ (吡啶); 无色针状晶体 (甲醇), mp 213~214°C. 【类型】双苄基异喹啉生物碱. 【活性】抗疟疾; 强心剂; 非极化肌肉松弛剂 (甲基碘化物 0.07~0.20mg/kg, 作用持续 30~60min). 【来源】锡生藤 *Cissampelos pareira*, 锦熟黄杨 *Buxus sempervirens*. 【文献】5, 140.



19 Berbamine 小檗胺

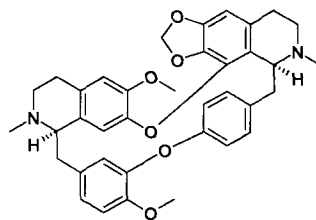
[478-61-5] $C_{37}H_{40}N_2O_6$ (608.74). 【类型】双苄基异喹啉生物碱。【活性】抗肿瘤; 抗心律失常; 抗心肌缺血; 解痉; 抗结核 (结核分枝杆菌); 免疫增强; 增加白细胞; 抑制心肌收缩性; 抗高血压; 调节药物免疫学伤害 (鼠); 血管松弛剂 (松弛肾小管动脉条, 兔, *in vitro*); 血管扩张剂; 减慢心率。【来源】白药子 *Stephania cepharantha*, 瓣蕊唐松草 *Thalictrum petaloideum* (根: 含量 < 0.001%)^[699], 大叶唐松草 *Thalictrum faberi* (根: 含量 < 0.001%)^[699], 华南功劳木 *Mahonia japonica*, 金丝马尾连 *Thalictrum glandulosissimum* (根: 含量 < 0.001%)^[699], 马尾连 (多叶唐松草) *Thalictrum foliolosum* (根: 含量 < 0.001%)^[699], 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%)^[699], 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%)^[699], 鲜黄小檗 *Berberis diaphana* (根、茎: 平均含量 = 0.440%)^[699], 小果唐松草 *Thalictrum microgyum* (根: 含量 = 0.08%)^[699], 烟锅草 *Thalictrum thunbergii* (根: 含量 = 0.03%)^[699], 硬水黄连 (短梗箭头唐松草) *Thalictrum simplex* [Syn. *Thalictrum simplex* var. *brevipes*] (根: 含量 = 0.01%)^[699], 置疑小檗 *Berberis dubia* (根、茎: 平均含量 = 0.396%)^[699]。【文献】1, 2, 3, 4, 139, 696, 699。



20 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)

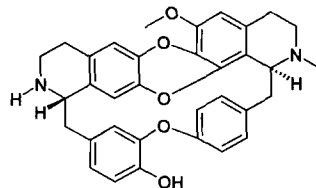
[481-49-2] $C_{37}H_{38}N_2O_6$ (606.73). 黄色针状晶体 (丙酮-苯), mp 145~155°C, $[\alpha]_D^{20} = +277^\circ$ ($c = 2$, 三氯甲烷), 溶于普通有机溶剂, 不溶于石油醚。^[698] 【类型】双苄基异喹啉生物碱。【活性】抗肿瘤 (HeLa, *in vitro*, $ED_{50} = 5.5\mu\text{g/kg}$; 人, HeLa-S3, *in vitro*, $ED_{50} = 7.0\mu\text{g/kg}$;

EAC *in vivo*; S_{180} *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, 698。



21 Cocsoline 防己索林*

$C_{34}H_{32}N_2O_5$ (548.64). 白色无定形粉末, $[\alpha]_D^{25} = +205^\circ$ ($c = 0.15$, 甲醇)。【类型】双苄基异喹啉生物碱。【活性】AChE 抑制剂 [*in vitro*, $IC_{50} = (47.5 \pm 1.5)\mu\text{mol/L}$, 对照加兰他敏, $IC_{50} = (0.5 \pm 0.001)\mu\text{mol/L}$]^[412]。【来源】垂木防己 *Cocculus pendulus*。【文献】412。



22 Cocsuline 防己苏林*

$C_{35}H_{34}N_2O_5$ (562.67). 黄色无定形粉末, $[\alpha]_D^{25} = +275^\circ$ ($c = 0.30$, 甲醇)。【类型】双苄基异喹啉生物碱。【活性】AChE 抑制剂 [*in vitro*, $IC_{50} = (100.0 \pm 1.2)\mu\text{mol/L}$, 对照加兰他敏, $IC_{50} = (0.5 \pm 0.001)\mu\text{mol/L}$]^[412]。【来源】垂木防己 *Cocculus pendulus*。【文献】412。

