



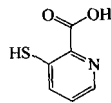


## 烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids) Q29

### Q290601 3-巯基吡啶甲酸

【其他名】3-mercaptopycolinic acid.

【CAS 登录号】14623-54-2。



【分子式】 $C_6H_5NO_2S$ 。

【分子量】155.18。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【理化性质】mp 183.5℃ 分解, 橙黄色棱柱体(水)。

【来源中药】<sup>8166</sup>白斑角鲨:肉<sup>[1]</sup>。

【药理作用】

代谢

大鼠近端肾小管, 0.5 mmol/L 时, 降低乳酸酯 23%<sup>[1]</sup>。

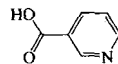
抑制糖原生成

大鼠, 体外, 0.1 mmol/L 时灌注, 抑制糖原生成<sup>[2]</sup>。

### Q290602 烟酸

【其他名】niacin; nicotinic acid.

【CAS 登录号】59-67-6。



【分子式】 $C_6H_5NO_2$ 。

【分子量】123.11。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>0115</sup>钝顶螺旋藻:藻体<sup>[1]</sup>; <sup>0143</sup>甘紫菜:藻体<sup>[2]</sup>; <sup>0143</sup>坛紫菜:藻体<sup>[3]</sup>; <sup>0143</sup>条斑紫菜:藻体<sup>[4]</sup>; <sup>0170</sup>亚香棒虫草:菌核及子座<sup>[5]</sup>; <sup>0174</sup>冬虫夏草:菌核及子座<sup>[5]</sup>; <sup>0271</sup>点柄乳牛肝菌:子实体<sup>[6]</sup>; <sup>0271</sup>褐环乳牛肝菌:子实体<sup>[7]</sup>; <sup>0999</sup>榆树:果实<sup>[8]</sup>; <sup>2315</sup>青菜:叶<sup>[9]</sup>; <sup>2321</sup>芜菁甘蓝:根<sup>[10]</sup>; <sup>2322</sup>塌棵菜:茎、叶<sup>[9]</sup>; <sup>2572</sup>杏:果实<sup>[11]</sup>; <sup>2804</sup>单瓣缬丝花:果实<sup>[12]</sup>; <sup>2804</sup>缬丝花:果实<sup>[13]</sup>; <sup>2815</sup>腺毛莓:果实<sup>[14]</sup>; <sup>2828</sup>单瓣缬丝花:果实<sup>[14]</sup>; <sup>2843</sup>托盘:果实<sup>[14]</sup>; <sup>2851</sup>高粱泡:果实<sup>[14]</sup>; <sup>3182</sup>大豆:黑色种子<sup>[15]</sup>; <sup>3194</sup>大豆:糊状食品; <sup>3274</sup>天蓝苜蓿:地上部分<sup>[16]</sup>; <sup>3463</sup>赤小豆:种子<sup>[17]</sup>; <sup>3533</sup>五月茶:全草<sup>[18]</sup>; <sup>3718</sup>柚:外层果皮<sup>[19]</sup>; <sup>4208</sup>无刺枣:果实<sup>[20]</sup>; <sup>4522</sup>鸡蛋果:果实<sup>[21]</sup>; <sup>4536</sup>番木瓜:果实<sup>[22]</sup>; <sup>4566</sup>冬瓜:果实<sup>[23]</sup>; <sup>4569</sup>冬瓜:外层果皮<sup>[24]</sup>; <sup>5027</sup>白参:根<sup>[25]</sup>; <sup>5027</sup>鲜人参:根<sup>[25]</sup>; <sup>5077</sup>东当归:根<sup>[26]</sup>; <sup>5084</sup>朝鲜当归:根<sup>[27]</sup>; <sup>5092</sup>当归:根<sup>[28]</sup>; <sup>5157</sup>欧当归:根<sup>[29]</sup>; <sup>6264</sup>枸杞:果实<sup>[30]</sup>; <sup>6264</sup>宁夏枸杞:果实<sup>[31]</sup>; <sup>6650</sup>党参:根<sup>[32]</sup>; <sup>7133</sup>韭:种子<sup>[33]</sup>; <sup>7141</sup>知母:地上部分<sup>[34]</sup>; <sup>7276</sup>参薯:

块茎<sup>[35]</sup>; <sup>7285</sup>甘薯:块茎<sup>[36]</sup>; <sup>7620</sup>海芋:根茎或茎<sup>[35]</sup>; <sup>7640</sup>芋:根茎<sup>[35]</sup>; <sup>7931</sup>海蜇:口腕部<sup>[37]</sup>; <sup>7958</sup>中国圆田螺:全体<sup>[38]</sup>; <sup>8032</sup>中国对虾:肉<sup>[39]</sup>; <sup>8034</sup>日本沼虾:全体或肉<sup>[40]</sup>; <sup>8048</sup>日本螯蟹:肉及血<sup>[41]</sup>; <sup>8048</sup>中华绒螯蟹:可食部分<sup>[42]</sup>; <sup>8094</sup>原蚕蛾:蚕蛾<sup>[43]</sup>; <sup>8163</sup>黑鳍基齿鲨:肝<sup>[44]</sup>; <sup>8193</sup>勒鱼:肉<sup>[45]</sup>; <sup>8194</sup>鲟鱼:肉或全体<sup>[46]</sup>; <sup>8197</sup>大马哈鱼:肉<sup>[45]</sup>; <sup>8199</sup>水晶鱼:全体<sup>[47]</sup>; <sup>8206</sup>鲫鱼:肉<sup>[48]</sup>; <sup>8214</sup>鲢鱼:肉<sup>[49]</sup>; <sup>8217</sup>鲤鱼:肌肉<sup>[50]</sup>; <sup>8231</sup>翘嘴红鲌:肉<sup>[51]</sup>; <sup>8234</sup>鲢鱼:全鱼<sup>[52]</sup>; <sup>8237</sup>青鱼:肉<sup>[53]</sup>; <sup>8251</sup>泥鳅:全体<sup>[54]</sup>; <sup>8268</sup>鳊鱼:肉<sup>[55]</sup>; <sup>8287</sup>鳙鱼:全鱼<sup>[56]</sup>; <sup>8295</sup>鲈鱼:肉<sup>[57]</sup>; <sup>8296</sup>鳊鱼:肉<sup>[58]</sup>; <sup>8307</sup>石首鱼:肉<sup>[59]</sup>; <sup>8318</sup>带鱼:肉、鳞、油<sup>[60]</sup>; <sup>8328</sup>鳢鱼:食部<sup>[61]</sup>; <sup>8484</sup>白鸭:肉<sup>[62]</sup>; <sup>8492</sup>白鸭:卵<sup>[63]</sup>; <sup>8551</sup>原鸡:肉<sup>[64]</sup>; <sup>8552</sup>家鸡:肉<sup>[65]</sup>; <sup>8559</sup>家鸡:肝脏<sup>[66]</sup>; <sup>8562</sup>家鸡:蛋清<sup>[67]</sup>; <sup>8564</sup>家鸡:蛋黄<sup>[68]</sup>; <sup>8666</sup>人乳汁:乳汁<sup>[69]</sup>; <sup>8860</sup>马鹿:幼角<sup>[70]</sup>; <sup>8860</sup>梅花鹿:幼角<sup>[71]</sup>; <sup>8901</sup>黄牛:骨髓<sup>[72]</sup>; <sup>8906</sup>黄牛:脑<sup>[73]</sup>; <sup>8912</sup>黄牛:肺<sup>[74]</sup>; <sup>8913</sup>黄牛:胃<sup>[75]</sup>; <sup>8916</sup>黄牛:肝脏<sup>[75]</sup>; <sup>8920</sup>黄牛:肾脏<sup>[75]</sup>; <sup>8924</sup>母牛:乳汁<sup>[74]</sup>; <sup>8927</sup>水牛:牛乳制成的食用脂肪或水牛的胎盘<sup>[76]</sup>; <sup>8936</sup>绵羊:肉<sup>[77]</sup>; <sup>8939</sup>山羊:肉<sup>[77]</sup>; <sup>8942</sup>绵羊:脑髓<sup>[78]</sup>; <sup>8942</sup>山羊:脑髓<sup>[78]</sup>; <sup>8945</sup>绵羊:肺<sup>[79]</sup>; <sup>8945</sup>山羊:肺<sup>[79]</sup>; <sup>8946</sup>绵羊:心脏<sup>[77]</sup>; <sup>8946</sup>山羊:心脏<sup>[77]</sup>; <sup>8947</sup>绵羊:胃<sup>[80]</sup>; <sup>8947</sup>山羊:胃<sup>[80]</sup>; <sup>8949</sup>绵羊:肝<sup>[81]</sup>; <sup>8949</sup>山羊:肝<sup>[81]</sup>; <sup>8953</sup>绵羊:肾<sup>[80]</sup>; <sup>8953</sup>山羊:肾<sup>[80]</sup>; <sup>8957</sup>绵羊:乳汁<sup>[80]</sup>; <sup>8957</sup>山羊:乳汁<sup>[80]</sup>。

【药理作用】

影响代谢

人, 2 500 mg 时, 增加前列腺素  $E_2$  ( $PGE_2$ ) 合成至 185%、血栓烷 (TX)  $B_2$  合成至 165%、白三烯 (LT)  $E_4$  合成至 175%<sup>[1]</sup>。

人全血液, 10~1 000  $\mu\text{mol/L}$  时, 剂量依赖性增加 A 23187 刺激  $PGE_2$  合成; 增加  $TxB_2$  和  $LTE_4$  合成<sup>[1]</sup>。

蛋白质活化

Wistar 大鼠附睾脂肪细胞膜, 0.01~1 000  $\mu\text{mol/L}$  时, 比 2-Cl- $N^6$ -环戊基腺苷 (CCPA) 促进<sup>35</sup>S- $\gamma$ -硫代三磷酸鸟苷 (GTP- $\gamma$ S) 与膜结合至更高的最大水平; CCPA 存在下, 标题物进一步增加<sup>35</sup>S-GTP- $\gamma$ S 结合; 标题物 + CCPA、标题物单用时,  $EC_{50}$  分别为 2.52、1.20  $\mu\text{mol/L}$ ; 100  $\mu\text{mol/L}$  时, 促进<sup>35</sup>S-GTP- $\gamma$ S 与膜结合; 标题物、CCPA 的  $K_d$  分别为 0.64、0.92 nmol/L; 标题物或 CCPA 存在下, GDT 可将<sup>35</sup>S-GTP- $\gamma$ S 基础结合降至更低水平; 二磷酸鸟苷 (GDP) 浓度为 1~10  $\mu\text{mol/L}$  时, 观察到基态水平以上的结合最大增加<sup>[2]</sup>。

Wistar 大鼠脾膜, 促进<sup>35</sup>S-GTP- $\gamma$ S 与膜结合; 其对<sup>35</sup>S-GTP- $\gamma$ S 结合的促进作用约比不含 NaCl (247 nmol/L) 时强 6 倍<sup>[2]</sup>; 促进<sup>35</sup>S-GTP- $\gamma$ S 与膜结合;  $EC_{50}$  = 237 nmol/L<sup>[2]</sup>。

Wistar 大鼠细胞膜, 促进<sup>35</sup>S-GTP- $\gamma$ S 与膜结合; 脂肪细胞、脾细胞的  $EC_{50}$  分别为 1.42、0.703  $\mu\text{mol/L}$ ; 1 mol/L 时, 促进<sup>35</sup>S-GTP- $\gamma$ S 与附睾脂肪细胞和脾膜结合; 不影响<sup>35</sup>S-GTP- $\gamma$ S 与来自前脑、肝、肾、睾丸、心、肺的膜结合<sup>[2]</sup>。

Wistar 大鼠脂肪细胞膜, 促进<sup>35</sup>S-GTP- $\gamma$ S 与膜结合; 百日咳毒素预处理膜, 可减少标题物对<sup>35</sup>S-GTP- $\gamma$ S 结合

的促进作用,结合率降至对照膜的 24.5%;该作用不受血管紧张素受体拮抗剂影响;100  $\mu\text{mol/L}$  时,促进  $^{35}\text{S}$ -GTP $\gamma\text{S}$  与所有试验部位的膜结合(2~3倍);附睾、腹部、肾中活化 G 蛋白的  $EC_{50}$  分别为 1.05、1.32、1.61  $\mu\text{mol/L}$  [2]。

#### 对类花生酸类物质生成的影响

人,2500 mg 时,使 11-脱氢血栓烷  $B_2$  排泄增加 2.6 倍,  $LTE_4$  排泄增加 2 倍,对 2,3-二去甲-6-酮-前列腺素  $F_{1\alpha}$  排泄有影响 [3]。

#### 降血脂

高胆固醇雄性 Sprague-Dawley 大鼠,100~400 mg/kg 口服时,对降血脂无作用,对高密度脂蛋白胆固醇水平有作用 [4]。

雄性 Sprague-Dawley 大鼠,0.5~1.00 mmol/kg 时,对乙醇和饮食诱发高三酰甘油血症的活性,对屈立通表面活性剂高脂血症的作用;1 mmol/kg 口服时,引起血清未酯化脂肪酸和三酰甘油减少 [5]。

#### 结合

Wistar 大鼠脾膜,抑制  $^3\text{H}$ -标题物的结合;  $K_i = 33.0 \text{ nmol/L}$ ;  $\text{MgCl}_2$  存在下的膜亲和力没有区别 ( $K_d = 25.5 \text{ nmol/L}$ ),但最大结合能力显著增高;20 nmol/L 时,与膜结合;该结合可被 GTP $\gamma\text{S}$  逐步抑制;10、100  $\mu\text{mol/L}$  GTP $\gamma\text{S}$  时,标题物的结合亲和力分别为 53.3、64.4 nmol/L,对照组为 35.8 nmol/L;介质中加 1 mol/L  $\text{MgCl}_2$  对结合无影响;该结合是鸟嘌呤核苷酸敏感性的;GTP $\gamma\text{S}$  比 GDP $\gamma\text{S}$  更有效地抑制标题物的结合;CHAPS 的撤除或 1 mol/L  $\text{MgCl}_2$  的加入对结合无影响;百日咳毒素预处理标题物使结合率降至对照组水平的 84.3%;NaCl 存在下,标题物的结合率降至对照组水平的 77.3% [2]。

Wistar 大鼠细胞膜,与脂肪细胞和脾膜的单分子结合是可饱和的;脂肪细胞、脾细胞的  $K_d$  分别为 43.5、22.8 nmol/L;20 nmol/L 时,与脾膜结合;与前脑、肝、肾、睾丸、心、肺的膜无显著的集合;脾中  $K_d = 12.3 \text{ nmol/L}$  [2]。

Wistar 大鼠脂肪细胞膜,20 nmol/L 时,与所有定位试验的膜结合 [2]。

#### 抗高血糖

Wistar 大鼠,  $^{14}\text{C}$  进入胆固醇与进入琥珀酸的 (C/S) 比率为 0.18,24 h 给药 (80 mg/kg) 组的唾液 C/S 比率是对照组的 1/5 [6]。

#### 抗菌

Freundii 柠檬酸杆菌属,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 12 mm [7]。

肺炎克雷白菌鼻亚种菌,  $MIC = 10 \text{ mg/L}$  [7]。

棒状杆菌 DIPHTHERIAE,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 12 mm [7]。

棒状杆菌 HOFMANNII,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 16 mm [7]。

鲍氏志贺菌,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 15 mm [7]。

表皮葡萄球菌,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 12 mm [7]。

肠杆菌产气菌,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 10 mm [7]。

肠杆菌属 COLOACAE,500 mg/L 时,抑菌圈直径为

10 mm [7]。

大肠杆菌,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 10 mm [7]。

单核细胞增生利斯特菌,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 12 mm [7]。

弗氏痢疾杆菌,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 12 mm [7]。

干燥棒状杆菌,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 12 mm [7]。

鸡白痢沙门菌,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 13 mm [7]。

鸡沙门菌,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 10 mm [7]。

金黄色葡萄球菌,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 10 mm [7]。

痢疾志贺菌,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 15 mm [7]。

绵羊李斯特杆菌,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 12 mm [7]。

普通变形菌,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 10 mm [7]。

奇异变形菌,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 10 mm [7]。

伤寒沙门菌,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 18 mm [7]。

伤寒沙门菌 PARA A,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 12 mm [7]。

伤寒沙门菌 PARA B,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 10 mm [7]。

嗜水气单胞菌,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 10 mm [7]。

鼠伤寒沙门菌,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 11 mm [7]。

炭疽芽胞杆菌,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 12 mm [7]。

乙酸钙不动杆菌,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 12 mm [7]。

黏质沙雷菌,500 mg/L 时,抑菌圈直径为 16 mm [7]。

#### 抗血脂

LEWIS 大鼠,40~200 mg/kg 十二指肠内给药时,诱导血清中总胆固醇 (CHOL) 及三酰甘油的水平呈剂量依赖性下降 [8]。

SABRA 大鼠,40 mg/kg 十二指肠内给药时,诱导 HDL/CHOL 比值显著上升,上升率为 16.5%,对血清中 CHOL、三酰甘油、HDL 水平没有显著影响 [8]。

Wistar 大鼠,抗硬化性质;与对照组比较,减少 CHOL、三酰甘油、脂蛋白 [9]。

#### 抗原生动

梨型四膜虫,对数生长级细胞比稳态生长期细胞对它更敏感,1 mol/L 时在指数生长期有长时间暂停;  $LC_{100} = 4.8 \sim 5.0 \text{ mol/L}$  [10]。

#### 抗真菌

黄曲霉 NRRL6541,250  $\mu\text{g}/\text{皿}$ ,失活 [11]。

轮枝样镰刀菌 NRRL25457,250  $\mu\text{g}/\text{皿}$ ,48 h 有 30 mm 抑菌圈 [11]。

#### 抗致突变

鼠伤寒沙门菌 TA98, < 10  $\mu\text{mol}/\text{碟}$  时,最高浓度的抑制率为 16.3% [12]。

#### 摄取

PRC-CMV 载体转染的 MDA-MB231 细胞,7  $\mu\text{mol/L}$  时,摄取系数为 29.2  $\mu\text{l}/\text{mg}$  [13]。

大鼠 MCT1 转染的 MDA-MB231 细胞,7  $\mu\text{mol/L}$  时,摄取系数为 36.8  $\mu\text{l}/\text{mg}$  [13]。

#### 受体结合活性

鼠 B82 细胞系 (HM2-B10) 表达人  $M_2$  受体,

100  $\mu\text{mol/L}$  时,抑制 $^3\text{H}-(-)-N$ -甲基-3-奎宁环基二苯乙醇酸盐(MQNB)与受体的结合 < 40%<sup>[14]</sup>。

#### 转运

CACO-2 细胞,相对渗透率为 112.3%<sup>[15]</sup>。

SKH-hr-1 无毛小鼠腹部皮,288 mmol/L 时,通量为 0.097 0  $\mu\text{mol}/(\text{cm}^2 \cdot \text{h})$ ,总体渗透率系数为 93.3  $\text{nm}^2/\text{s}$ <sup>[16]</sup>。

兔肠刷状缘膜小泡囊,普伐他汀抑制药物的初始吸收率,从 282 pmol/(mg · 10 s) 至 64.9 pmol/(mg · 10 s)<sup>[17]</sup>。

#### 升高体温

Wistar 大鼠,10mg/kg 时,注射标题物后 15 min 和 30 min,稍微增加结肠温度,正常大鼠分别增加 0.73℃ 和 0.83℃,链脲霉素-糖尿病大鼠分别增加 0.53℃ 和 0.62℃<sup>[18]</sup>。

#### 保护细胞

人单核白细胞,体外,分析表明实验后第 1 个 4 h 被测定化合物微弱抑制阻断诱发的细胞凋亡;实验后 12 h 无作用<sup>[19]</sup>。

#### 细胞毒性

海虾, $LC_{50} > 1\ 000\ \text{mg/L}$ <sup>[7]</sup>。

#### 药物相互作用

CACO-2 细胞,抑制阿伐他汀的顶端至基底外侧的渗透性约 21%,其表观渗透率 PappAB 为  $28.4 \times 10^6 \sim 22.4 \times 10^6\ \text{cm}^2/\text{s}$ <sup>[20]</sup>。

#### 抑制摄取

人肠上皮 CACO-2 细胞,20 mmol/L 时,轻度抑制摄取<sup>[21]</sup>。

#### 【毒性】

##### 急毒

大鼠,无报道,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 4\ \text{g/kg}$ <sup>[1]</sup>;皮下注射,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 5\ \text{g/kg}$ <sup>[2]</sup>;口服,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 7\ \text{g/kg}$ <sup>[2]</sup>;腹腔注射,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 730\ \text{mg/kg}$ <sup>[3]</sup>;静注,对癫痫发作影响, $LDLo = 3\ 500\ \text{mg/kg}$ <sup>[4]</sup>。

人,男性,口服,凝血因子改变,血小板计数改变, $TDL0 = 2\ 571\ \text{mg/kg}$ (90d-I)<sup>[5]</sup>;口服,视野改变,效果,无特殊说明, $TDL0 = 31\ 200\ \text{mg/kg}$ (78w-I)<sup>[6]</sup>;静注,心输出量,肺,胸腔,发绀,呼吸抑制, $TDL0 = 357\ \mu\text{g/kg}$ <sup>[7]</sup>;口服,恶心或呕吐,出汗,代谢性酸中毒, $TDL0 = 9\ 713\ \text{mg/kg}$ (58w-I)<sup>[8]</sup>。

兔,口服,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 4\ 550\ \text{mg/kg}$ <sup>[3]</sup>。

小鼠,皮下注射,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 3\ 500\ \text{mg/kg}$ <sup>[3]</sup>;腹腔注射,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 358\ \text{mg/kg}$ <sup>[3]</sup>;口服,改变运动活动,肺,胸腔,其他改变, $LD_{50} = 3\ 720\ \text{mg/kg}$ <sup>[9]</sup>;无报道,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 4\ \text{g/kg}$ <sup>[10]</sup>;静注,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 5\ \text{g/kg}$ <sup>[11]</sup>。

雄性小鼠, $LD_{50} = 1\ 120\ \text{mg/kg}$ ,作用意义不大<sup>[12]</sup>。

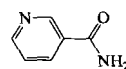
豚鼠,静注,对癫痫发作影响, $LDLo = 3\ 500\ \text{mg/kg}$ <sup>[4]</sup>。

Q290603

## 维生素 B3

【其他名】antipellagra factor; niacinamide; nicosan 2; nicotinamide; nicotinamide; nicotinic acid amide; pp-factor; vitamin B3; vitamin pp; 维生素 pp; 烟酰胺。

【CAS 登录号】98-92-0。



【分子式】 $\text{C}_6\text{H}_6\text{N}_2\text{O}$ 。

【分子量】122.13。

【类型】烟酸衍生的生物碱(nicotinic acid derived alkaloids)。

【理化性质】mp 129 ~ 130℃, bp<sub>0.0005</sub> 150 ~ 160℃,  $pK_a$  3.33 (20℃), 针状体(苯), log P -0.21 (计算值)。

【来源中药】<sup>0115</sup>钝顶螺旋藻:藻体<sup>[1]</sup>; <sup>0122</sup>蛋白核小球藻:藻体<sup>[2]</sup>; <sup>0170</sup>亚香棒虫草:菌核及子座<sup>[3]</sup>; <sup>0174</sup>冬虫夏草:菌核及子座<sup>[3]</sup>; <sup>0240</sup>假蜜环菌:子实体<sup>[4]</sup>; <sup>0253</sup>糙皮侧耳:子实体<sup>[5]</sup>; <sup>2815</sup>腺毛莓:果实<sup>[6]</sup>; <sup>2828</sup>单瓣缢丝花:果实<sup>[6]</sup>; <sup>2851</sup>高粱泡:果实<sup>[6]</sup>; <sup>5033</sup>人参:果实<sup>[7]</sup>; <sup>7119</sup>葱:鳞茎<sup>[8]</sup>; <sup>7138</sup>斑纹芦荟:叶<sup>[9]</sup>; <sup>7141</sup>蒺藜:地上部分<sup>[10]</sup>; <sup>7309</sup>番红花:花<sup>[11]</sup>; <sup>7594</sup>椰子:种子; <sup>7652</sup>虎掌:块茎<sup>[12]</sup>; <sup>8158</sup>海盘车:全体<sup>[13]</sup>。

#### 【药理作用】

##### DNA 损伤

野生型菌株大肠杆菌 WP-2 及其突变体 PoLa 和 RecA,无 DNA 损伤活性<sup>[1]</sup>。

##### 酶抑制

海兔环化酶, $K_i = 500\ \mu\text{mol/L}$ <sup>[2]</sup>。

##### 化学保护

Sprague-Dawley 大鼠肝细胞,体外,浓度 10  $\mu\text{mol/kg}$  时无作用<sup>[3]</sup>。

##### 抗菌

黑根霉、金黄色葡萄球菌、离体海产细菌、米曲霉、爪哇毛霉菌,无活性<sup>[4]</sup>。

肺炎克雷白菌、普通变形菌、铜绿假单胞菌、黏质沙雷菌,抑制生长,0 mm<sup>[4]</sup>。

枯草芽胞杆菌、大肠杆菌,抑制生长,0 mm<sup>[4]</sup>。

##### 抗糖尿病

BB 大鼠,200 mg/kg 格列美脲治疗时糖尿病发病率为 42%,对照组为 60%;结合烟酰胺治疗时,糖尿病发病率为 28%,对照组为 60%<sup>[5]</sup>。

##### 胚胎毒性

小鼠,腹部注射,500 mg/kg,防止 6-氨基烟酰胺、烷基尿、6-硫嘌呤的毒性<sup>[6]</sup>。

##### 保护细胞

人单核白细胞,体外分析表明,实验后第一个 4 h 时,0.3 mmol/L 标题物对阻断诱发的细胞凋亡有效;6 h 和 12 h 之间部分保护作用;12 h 无作用<sup>[7]</sup>。

**药物相互作用**

B10. GD 小鼠岛细胞,完全阻止降低细胞内烟酰胺腺嘌呤二核苷酸水平,确普盐诱发为 62%<sup>[8]</sup>。

**【毒性】****基因毒性**

仓鼠卵巢,姐妹染色单体交换,5 mmol/L<sup>[1]</sup>。

大鼠肝,DNA 抑制,20 mmol/L<sup>[2]</sup>。

人淋巴细胞,姐妹染色单体交换,10 mmol/L<sup>[3]</sup>。

鼠伤寒沙门菌,微生物突变,5 mg/皿<sup>[4]</sup>。

**急毒**

大鼠,皮下注射,肺,胸腔,或呼吸-其他改变, $LD_{50} = 1\ 680\ \text{mg/kg}$ <sup>[5]</sup>;口服,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 3\ 500\ \text{mg/kg}$ <sup>[6]</sup>。

未指定种类,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 2\ 500\ \text{mg/kg}$ <sup>[7]</sup>。

小鼠,皮下注射,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 2\ \text{g/kg}$ <sup>[8]</sup>;腹腔注射,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 2\ 050\ \text{mg/kg}$ <sup>[9]</sup>;口服,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 2\ 500\ \text{mg/kg}$ <sup>[10]</sup>。

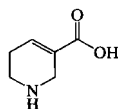
**生殖毒性**

大鼠卵巢,体液分析,25 mg/kg<sup>[1]</sup>。

**Q290604 去甲基槟榔次碱**

【其他名】3-tetrahydronicotinic acid; guvacine。

【CAS 登录号】498-96-4。



【分子式】 $C_6H_9NO_2$ 。

【分子量】127.14。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【理化性质】mp 293 ~ 295°C 分解(271 ~ 272°C)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔:种子<sup>[1]</sup>。

【药理作用】

**拮抗**

爪蟾卵母细胞,减少甘氨酸诱发电流, $IC_{50} \approx 2.2\ \text{mmol/L}$ <sup>[1]</sup>。

**输运**

大鼠脑突触小体, $IC_{50} = 12\ \mu\text{mol/L}$ <sup>[2]</sup>。

培养小鼠皮质神经元, $IC_{50} = 32\ \mu\text{mol/L}$ <sup>[2]</sup>。

培养小鼠皮质星形胶质, $IC_{50} = 29\ \mu\text{mol/L}$ <sup>[2]</sup>。

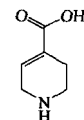
**Q290605 异去甲基槟榔次碱**

【其他名】isoguvacine。

【CAS 登录号】64603-90-3。

【分子式】 $C_6H_9NO_2$ 。

【分子量】127.14。



【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【理化性质】mp 220°C,  $pK_{a1} 3.6$ ,  $pK_{a2} 9.8$ 。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔:种子<sup>[1]</sup>。

【药理作用】

**促效**

Wistar 大鼠脊髓背侧角,1 ~ 100  $\mu\text{mol/L}$  时,异去甲基槟榔次碱浓度依赖性地降低 GABA 的第二刺激响应/第一刺激响应比率<sup>[1]</sup>。

爪蟾卵母细胞表达的人 GABA<sub>A</sub> 受体, $EC_{50} = 20\ \mu\text{mol/L}$ <sup>[2]</sup>。

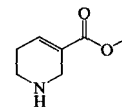
**拮抗**

爪蟾卵母细胞,减少甘氨酸诱发电流, $IC_{50} \approx 0.46\ \mu\text{mol/L}$ <sup>[3]</sup>。

**Q290701 去甲基槟榔碱**

【其他名】guvacoline; norarecoline。

【CAS 登录号】495-19-2。



【分子式】 $C_7H_{11}NO_2$ 。

【分子量】141.17。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【理化性质】mp 27°C,  $bp_{13.5} 114^\circ\text{C}$ 。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔:种子<sup>[1]</sup>。

【药理作用】

**胆碱能受体激动剂**

大鼠颈上神经节,体外, $EC_{50} \geq 2\ 700\ \text{nmol/L}$ <sup>[1]</sup>。

豚鼠回肠,体外, $EC_{50} = 620\ \text{nmol/L}$ <sup>[1]</sup>。

豚鼠左心房,体外, $EC_{50} = 370\ \text{nmol/L}$ <sup>[1]</sup>。

**神经保护**

大鼠突触小体,体外,增加<sup>3</sup>H- $\gamma$ -氨基丁酸摄取<sup>[2]</sup>。

**受体结合**

作为毒蕈碱配体用,用放射配体法评测其结合亲和性<sup>[3]</sup>。

大鼠皮质,体外,毒蕈碱配体<sup>[4]</sup>。

**受体结合活性**

毒蕈碱乙酰胆碱受体 mAChR,体外与大鼠皮质组织结合活性;氚标记三元拮抗配体二苯羟乙酸-3-喹吖啶酯(QNB), $IC_{50} = 10\ 500\ \text{nmol/L}$ ;氚标记四元拮抗配体 CMD, $IC_{50} = 50\ \text{nmol/L}$ <sup>[5]</sup>。

豚鼠回肠,体外,毒蕈碱胆碱能促效, $EC_{50} = 0.3\ \mu\text{mol/L}$ <sup>[6]</sup>。

外周毒蕈碱受体,体外, $^3\text{H}$ -PrBCM 对大鼠脑膜结合, $IC_{50} = 30 \mu\text{mol/L}$ <sup>[6]</sup>。

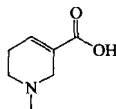
#### 心血管系统作用

大鼠心脑组织,体外,抑制 $^3\text{H}$ -QNB 与大鼠心脑组织的结合, $^3\text{H}$ -PZ 和 $^3\text{H}$ -OXO-M 与大鼠脑组织的结合<sup>[1]</sup>。

#### Q290702 槟榔次碱

【其他名】arecaidin; arecaidine; arecaine。

【CAS 登录号】499-04-7。



【分子式】 $\text{C}_7\text{H}_{11}\text{NO}_2$ 。

【分子量】141.17。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【理化性质】mp 223 ~ 224 $^{\circ}\text{C}$  分解 (无水 232 $^{\circ}\text{C}$  分解),  $\text{p}K_a$  9.07 (25 $^{\circ}\text{C}$ ),  $\log P$  -1.74 (计算值)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔:种子<sup>[1]</sup>。

#### 【药理作用】

##### 受体结合活性

毒蕈碱乙酰胆碱受体 mAChR, 体外与大鼠皮质组织结合活性: 氟标记三元拮抗配体二苯羟乙酸-3-奎宁环酯, $IC_{50} > 1000 \text{ nmol/L}$ ; 氟标记四元拮抗配体 CMD, $IC_{50} > 100 \text{ nmol/L}$ <sup>[1]</sup>。

#### 【毒性】

##### 基因毒性

仓鼠肺,哺乳动物体细胞突变,10 mg/L<sup>[1]</sup>。  
小鼠,姐妹染色单体交换,1 g/kg (5d-1)<sup>[2]</sup>。

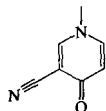
##### 其他毒性

仓鼠肾,形态学转化,2500  $\mu\text{g/L}$ <sup>[1]</sup>。

#### Q290703 石岩枫氰吡酮

【其他名】1,4-dihydro-1-methyl-4-oxo-3-pyridinecarboxonitrile; 1,4-dihydro-1-methyl-4-oxo-nicotinonitrile; 3-cyano-1-methyl-4(1H)-pyridinone; 3-cyano-1-methyl-4-pyridone; mallorepine。

【CAS 登录号】767-98-6。



【分子式】 $\text{C}_7\text{H}_6\text{N}_2\text{O}$ 。

【分子量】134.14。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

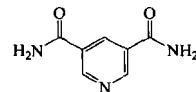
【理化性质】mp 185 ~ 186 $^{\circ}\text{C}$  (179 ~ 181 $^{\circ}\text{C}$ ), 棱柱体 (甲醇)。

【来源中药】<sup>3635</sup> 石岩枫:根、茎、叶<sup>[1]</sup>。

#### Q290704 吡啶二酰胺

【其他名】3,5-pyridinedicarboxamide; dinicotinic amide。

【CAS 登录号】4663-99-4。



【分子式】 $\text{C}_7\text{H}_7\text{N}_3\text{O}_2$ 。

【分子量】165.16。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

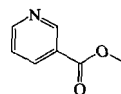
【理化性质】mp 318 ~ 319 $^{\circ}\text{C}$  分解 (310 ~ 311 $^{\circ}\text{C}$ ), 结晶体 + 水 (二甲基甲酰胺)。

【来源中药】<sup>6480</sup> 九头狮子草:全草<sup>[1]</sup>。

#### Q290705 3-哌啶甲酸甲酯

【其他名】3-piperidinecarboxylic acid methyl ester。

【CAS 登录号】93-60-7。



【分子式】 $\text{C}_7\text{H}_7\text{NO}_2$ 。

【分子量】137.14。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【理化性质】mp 38 $^{\circ}\text{C}$ , bp 204 $^{\circ}\text{C}$ , bp<sub>25</sub> 118.5 $^{\circ}\text{C}$ , 结晶体,  $\log P$  0.77 (计算值)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔:种子<sup>[1]</sup>。

#### 【药理作用】

##### 影响代谢

SKH-hr-1 无毛小鼠腹部皮匀浆,0 ~ 40 mmol/L 孵育时, $V_{\text{max}} = 22.1 \text{ nmol}/(\text{min} \cdot \text{mg})$ ,  $K_m = 20.6 \text{ mmol/L}$ <sup>[1]</sup>。

##### 扩张末梢血管

人,10  $\mu\text{l}$  时,标题物诱导真皮血管舒张,平均延滞时间 (LT) 范围为 270 ~ 319 s,最短的 LT 发生在 4 h,最长 LT 发生在白天第 13 小时,有一个单峰<sup>[2]</sup>。

##### 对运输的影响

SKH-hr-1 无毛小鼠腹部皮,0.1 ~ 5000 mmol/L 培养时,标题物流量为 19.6  $\mu\text{mol}/(\text{cm}^2 \cdot \text{h})$ ,烟酸流量为 1.76  $\mu\text{mol}/(\text{cm}^2 \cdot \text{h})$ ,总流量为 21.4  $\mu\text{mol}/(\text{cm}^2 \cdot \text{h})$ ,总渗透系数为  $1.19 \times 10^{-6} \text{ cm}^2/\text{s}$ <sup>[1]</sup>。

离体的灌注猪皮瓣,显著增加五氯苯酚 (PCP) 吸收至 9.82%,并引起 PCP 吸收曲线达到峰值时间大大提前<sup>[3]</sup>。

人,10 ~ 100 mmol/L 时,1 min 后,迅速增加皮肤血流;仅在 100 mmol/L,10 min 后,在透析液中可检测到标题物<sup>[4]</sup>。

入皮肤,500~1 000 mmol/L 时,剂量依赖性地增加渗透,最大渗透时间也呈剂量依赖性增加<sup>[4]</sup>。

### 【毒性】

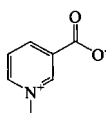
#### 急毒

小鼠,皮下注射,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD > 1 \text{ g/kg}$ <sup>[1]</sup>;非消化道给药,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LDLo = 2 \text{ g/kg}$ <sup>[2]</sup>。

### Q290706 葫芦巴碱

【其他名】trigoneline。

【CAS 登录号】535-83-1。



【分子式】 $C_7H_7NO_2$ 。

【分子量】137.14。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>3142</sup>扁豆:白色成熟种子<sup>[1]</sup>; <sup>3421</sup>葫芦巴:种子<sup>[2]</sup>; <sup>4597</sup>南瓜:果实<sup>[3]</sup>; <sup>4698</sup>使君子:成熟果实<sup>[4]</sup>; <sup>4699</sup>使君子:叶<sup>[5]</sup>; <sup>6398</sup>独脚金:全草<sup>[6]</sup>。

【药理作用】

#### 再生

人神经母细胞瘤细胞 SK-N-SH,体外,30 mmol/L 时,给药 3 d 和 6 d 后,显著增加有神经突起的细胞的百分率;对磷酸神经丝-H 的阳性长轴突的频率更高<sup>[1]</sup>。

#### 致突变

鼠伤寒沙门菌 TA 98,每 1 nmol 的 TA98 回复突变菌落个数为 8 160,每皿的自发性回复突变菌落数为 14~32<sup>[2]</sup>。

【毒性】

#### 基因毒性

鼠伤寒沙门菌,微生物突变,1 mmol/皿<sup>[1]</sup>。

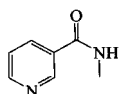
#### 急毒

大鼠,口服,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 5 \text{ g/kg}$ <sup>[2]</sup>;皮下注射,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 5 \text{ g/kg}$ <sup>[3]</sup>。

### Q290707 N'-甲基烟酰胺

【其他名】3-(methylcarbamoyl)pyridine; N'-methylnicotinamide; N-methyl-3-pyridinecarboxamide。

【CAS 登录号】114-33-0。



【分子式】 $C_7H_8N_2O$ 。

【分子量】136.15。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【理化性质】mp 105℃。

【来源中药】<sup>0137</sup>裙带菜:全藻<sup>[1]</sup>。

【药理作用】

#### 影响代谢

Sprague-Dawley 大鼠乳房细胞溶质,2.5 mmol/L 时,不增强乙醇至乙醛的代谢<sup>[1]</sup>。

#### 化学感应

Sprague-Dawley 大鼠,与微粒体馏分解育时,没有检测到 2-肌氨酰胺-cis-1,2-环己二酰胺 (M1),在厌氧条件下,显著增加还原酶活性,M1 生成量为 4.5 nmol/g<sup>[2]</sup>。

#### 拮抗

人胎盘多核体 MICROVILLUS 膜小泡囊,1 mmol/L 时,小囊泡摄取<sup>3</sup>H-西咪替丁减少至对照组的 74%<sup>[3]</sup>。

#### 酶检验

叙利亚金仓鼠肝细胞溶质醛氧化酶,为酶底物测试酶活性,酶活性为 0.35 nmol/(min·mg),而来源于兔和豚鼠对照组的相应酶活性分别为 5.7 nmol/(min·mg) 和 0.94 nmol/(min·mg)<sup>[4]</sup>。

#### 运输调节

LLC-PK<sub>1</sub> 肾上皮细胞系,1 mmol/L 时,不影响任一方向的百草枯摄取,也不影响百草枯的跨细胞基低向顶端流量<sup>[5]</sup>。

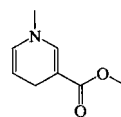
#### 药理学

小鼠脑毛细管内皮细胞, $IC_{50} = 6.0 \sim 6.5 \text{ mmol/L}$ <sup>[6]</sup>。

### Q290801 1,4-二氢-1-甲基-烟酸甲酯

【其他名】1,4-dihydro-1-methyl-3-pyridinecarboxylic acid, methyl ester; 1,4-dihydro-1-methyl-nicotinic acid, methyl ester。

【CAS 登录号】59138-83-9。



【分子式】 $C_8H_{11}NO_2$ 。

【分子量】153.18。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>7582</sup>檳榔:种子<sup>[1]</sup>。

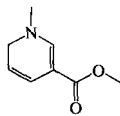
### Q290802 1,6-二氢-1-甲基-烟酸甲酯

【其他名】1,6-dihydro-1-methyl-3-pyridinecarboxylic acid, methyl ester; 1,6-dihydro-1-methyl-nicotinic acid, methyl ester。

【CAS 登录号】90087-14-2。

【分子式】 $C_8H_{11}NO_2$ 。





【分子量】153.18。

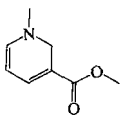
【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔: 种子<sup>[1]</sup>。

#### Q290803 1,2-二氢-1-甲基烟酸甲酯

【其他名】1,2-dihydro-1-methyl-3-pyridinecarboxylic acid, methyl ester; 1,2-dihydro-1-methyl-nicotinic acid, methyl ester。

【CAS 登录号】19355~19-2。



【分子式】 $C_8H_{11}NO_2$ 。

【分子量】153.18。

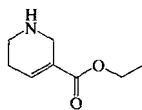
【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔: 种子<sup>[1]</sup>。

#### Q290804 去甲基槟榔次碱乙酯

【其他名】1,2,5,6-tetrahydro-3-pyridinecarboxylic acid, ethyl ester; 1,2,5,6-tetrahydro-nicotinic acid, ethyl ester; guvacine ethyl ester。

【CAS 登录号】18513-76-3。



【分子式】 $C_8H_{13}NO_2$ 。

【分子量】155.19。

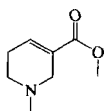
【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔: 种子<sup>[1]</sup>。

#### Q290805 槟榔碱

【其他名】arecoline。

【CAS 登录号】63-75-2。



【分子式】 $C_8H_{13}NO_2$ 。

【分子量】155.19。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【理化性质】 $bp_{17}$  94℃,  $bp_7$  74℃,  $pK_a$  7.64 (25℃), 液体,  $\log P$  1.05 (计算值)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔: 叶<sup>[1]</sup>; <sup>7582</sup> 槟榔: 种子<sup>[2]</sup>。

【药理作用】

促效

NIH 3T3 细胞, 在毒蕈碱  $M_1$  和  $M_4$  受体转染的细胞中更多的诱导响应<sup>[1]</sup>。

Sprague-Dawley 大鼠, 0.01~1 000  $\mu\text{mol/L}$  时, 刺激腺苷基环化酶活性; 作用是浓度依赖性和可饱和的; 标的物微克分子范围内显现  $EC_{50}$ <sup>[2]</sup>。

中国仓鼠卵巢细胞, 影响环磷酸腺苷 (cAMP) 合成,  $pEC_{50}$  = 3.94~5.38<sup>[3]</sup>。

对瞳孔直径的影响

F344 大鼠, 0.3% 或更高的槟榔碱引起瞳孔缩小<sup>[5]</sup>。

检测姐妹染色单体交换

瑞士白化小鼠, 20~60 mg/kg 时诱导姐妹染色单体交换 (SCE) 频率, 丁硫氨酸亚砷胺处理增加其诱导 SCE, 谷胱甘肽 (GSH) 处理对其诱导 SCE 无显著作用<sup>[6]</sup>。

抗菌

大肠杆菌 DSM498、枯草芽胞杆菌 DSM347, LB 介质, 37℃, 光密度测定, 浓度 10 mmol/L 时无作用<sup>[4]</sup>。

抗原生动物

布氏锥虫 TC221,  $ED_{50}$  = 145  $\mu\text{mol/L}$ <sup>[7]</sup>;  $MIC$  = 783  $\mu\text{mol/L}$ <sup>[7]</sup>。

刚果锥虫 STIB 910,  $ED_{50}$  = 28  $\mu\text{mol/L}$ <sup>[7]</sup>  $MIC$  = 500  $\mu\text{mol/L}$ <sup>[7]</sup>。

酶抑制

AMV 逆转录酶,  $IC_{50}$  > 10 mmol/L<sup>[4]</sup>。

Wistar 大鼠肝脏微粒体, 微弱抑制 UDP-葡萄糖苷酸 (基) 转移酶对酚酞的活性, 不影响其对 4-硝基酚的活性<sup>[8]</sup>。

酶诱导

瑞士白化小鼠, 20 mg/kg 时, 显著增加叶绿酸诱导谷胱甘肽-S-转移酶 (GST) 和酸可溶巯基 (SH) 水平<sup>[9]</sup>。

受体结合活性

hm2 受体转染的 COS7 细胞, hm2 野生型、Glu 突变、Asn 突变受体的  $K_{app}$  分别为 (3.3 ± 0.3)、(31.5 ± 0.8)、(605.7 ± 63.0)  $\mu\text{mol/L}$ <sup>[10]</sup>。

草地黏虫细胞膜 mAChR m1 亚型,  $pK_i$  = 4.55; 草地黏虫细胞膜 mAChR m2 亚型,  $pK_i$  = 4.76; 草地黏虫细胞膜 mAChR m3 亚型,  $pK_i$  = 4.11; 草地黏虫细胞膜 mAChR m4 亚型,  $pK_i$  = 4.14; 草地黏虫细胞膜 mAChR m5 亚型,  $pK_i$  = 4.83<sup>[11]</sup>。

大鼠大脑前皮质匀浆, PZ/OXO-M 结合率表明电位毒蕈碱胆碱能拮抗性是 250,  $pK_i$  = 8.1<sup>[12]</sup>。

大鼠脑,  $IC_{50}$  = 77 nmol/L<sup>[13]</sup>。

大鼠前脑匀浆, PZ/OXO-M 结合率表明电位毒蕈碱胆碱能拮抗性是 250,  $pK_i$  = 5.7<sup>[12]</sup>。

猪脑膜,  $IC_{50}$  = 5.7  $\mu\text{mol/L}$ <sup>[4]</sup>。

细胞毒性

人类黏膜纤维母细胞, 0.1~1.6 mmol/L 时, 剂量

和时间依赖性减少细胞存活率;0.8 mmol/L时,24 h后约45%细胞死亡;细胞内GSH水平呈剂量依赖性衰竭<sup>[14]</sup>。

人口腔黏膜纤维母细胞,0.2 mmol/L和0.4 mmol/L时,以剂量依赖方式降低细胞存活率分别至62.6%和37.6%<sup>[15]</sup>。

人髓样白血病HL-60细胞, $ED_{50} = 697 \mu\text{mol/L}$ <sup>[7]</sup>;  $MIC = 1110 \mu\text{mol/L}$ <sup>[7]</sup>。

#### 抑制传导物质释放

Wistar大鼠,体内,10  $\mu\text{mol/L}$ 浓度灌流时,对海马体乙酰胆碱水平无显著影响<sup>[16]</sup>。

#### 镇痛

豚鼠回肠,体外,尼古丁结合, $K_1 = 0.224 \mu\text{mol/L}$ ,  $ED_{50} = 0.3 \mu\text{mol/L}$ <sup>[17]</sup>。

小鼠,体内,热板试验, $MAD = 1 \mu\text{g}$ ,效能为99%<sup>[17]</sup>。

#### 致突变

瑞士白化小鼠,诱导染色体畸变(等点染色单体和染色单体破裂),丁硫氨酸亚砷胺处理增加对染色体畸变的诱导,GST处理减少其诱导<sup>[6]</sup>。

#### 【毒性】

##### 毒性试验

小鼠,微核试验,80 mg/kg<sup>[11]</sup>。

##### 基因毒性

仓鼠肺,哺乳动物体细胞突变,5 mg/L<sup>[2]</sup>。

人细胞,DNA损伤,20  $\mu\text{g}/\text{管}$ <sup>[3]</sup>;DNA抑制,339  $\mu\text{mol/L}$ <sup>[2]</sup>。

鼠伤寒沙门菌,微生物突变,20  $\mu\text{mol}/\text{皿}$ <sup>[4]</sup>。

小鼠,非常规DNA合成,20 mg/kg<sup>[5]</sup>;姐妹染色单体交换,100 mg/kg(5d-I)<sup>[11]</sup>。

##### 急毒

大鼠,口服,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 2500 \text{ mg/kg}$ <sup>[6]</sup>;腹腔注射,流泪,对癫痫发作影响,收缩(离体组织), $LD_{50} = 40 \text{ mg/kg}$ <sup>[7]</sup>。

犬,皮下注射,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 5 \text{ mg/kg}$ <sup>[8]</sup>;无报道,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LDLo = 5 \text{ mg/kg}$ <sup>[9]</sup>。

小鼠,腹腔注射,营养代谢与总代谢-体温降低, $LD_{50} = 190 \text{ mg/kg}$ <sup>[10]</sup>;静注,嗜睡(全身性活动压抑),对癫痫发作影响,兴奋作用, $LD_{50} = 36 \text{ mg/kg}$ <sup>[11]</sup>;口服,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 550 \text{ mg/kg}$ <sup>[6]</sup>;无报道,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LDLo = 100 \text{ mg/kg}$ <sup>[9]</sup>。

##### 生殖毒性

仓鼠卵巢,微核试验,200 nmol/L<sup>[12]</sup>。

小鼠,精子形态学,20 mg/kg<sup>[13]</sup>。

##### 遗传毒性

小鼠,细胞遗传学分析,100 mg/kg(10d-C)<sup>[14]</sup>。

##### 致癌

仓鼠,皮肤给药,根据RTECS标准,肿瘤, $TDL_o = 2698 \text{ mg/kg}(65w-I)$ <sup>[15]</sup>。

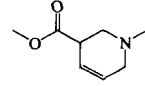
##### 其他毒性

仓鼠肾,形态学转化,2500  $\mu\text{g/L}$ <sup>[2]</sup>。

### Q290806 1,2,3,6-四氢-1-甲基-3-吡啶甲酸甲酯

【其他名】1,2,3,6-tetrahydro-1-methyl-3-pyridinecarboxylic acid, methyl ester。

【CAS登录号】86447-15-6。



【分子式】 $C_8H_{13}NO_2$ 。

【分子量】155.19。

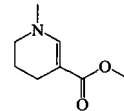
【类型】烟酸衍生的生物碱(nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔:种子<sup>[1]</sup>。

### Q290807 1,4,5,6-四氢-1-甲基-烟酸甲酯

【其他名】1,4,5,6-tetrahydro-1-methyl-3-pyridinecarboxylic acid, methyl ester; 1,4,5,6-tetrahydro-1-methyl-nicotinic acid, methyl ester; methyl 1,4,5,6-tetrahydro-1-methylnicotinate; methyl 1-methyl-1,4,5,6-tetrahydro-3-pyridine-3-carboxylate。

【CAS登录号】3284-32-0。



【分子式】 $C_8H_{13}NO_2$ 。

【分子量】155.19。

【类型】烟酸衍生的生物碱(nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔:种子<sup>[1]</sup>。

#### 【药理作用】

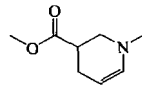
##### 抑制化学防护

对于头胎泌乳受损小鼠,剂量0.6 mg/d时,增加生物活化物种的水平,谷胱甘肽巯基转移酶/还原型谷胱甘肽(GST/GSH)结合解毒作用的效果不大<sup>[1]</sup>。

### Q290808 1,2,3,4-四氢-1-甲基-3-吡啶甲酸甲酯

【其他名】1,2,3,4-tetrahydro-1-methyl-3-pyridinecarboxylic acid, methyl ester。

【CAS登录号】251547-88-3。



【分子式】 $C_8H_{13}NO_2$ 。

【分子量】155.19。

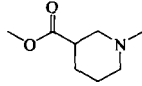
【类型】烟酸衍生的生物碱(nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔:种子<sup>[1]</sup>。

## Q290809 1-甲基3-哌啶甲酸甲酯

【其他名】1-methyl-3-piperidinecarboxylic acid, methyl ester; 1-methylnipecotinic acid methyl ester; dihydroarecaine, methyl ester; dihydroarecoline; methyl 1-methylpiperidine-3-carboxylate; methyl *N*-methylnipecotate。

【CAS 登录号】1690-72-8。



【分子式】 $C_8H_{15}NO_2$ 。

【分子量】157.21。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔: 种子<sup>[1]</sup>。

【药理作用】

拟胆碱作用

小鼠,  $LD_{50} = 2\ 000\ \text{mg/kg}$ ; M-拟胆碱活性:  $ED_{50} = 1\ 100\ \text{mg/kg}$ ; 震颤,  $ED_{50} = 1\ 100\ \text{mg/kg}$ , 唾液分泌过多<sup>[1]</sup>。

【毒性】

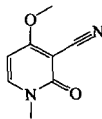
急毒

小鼠, 腹腔注射, 其他(直接)拟副交感神经的药, 震颤, 唾液腺结构或功能改变,  $LD_{50} = 2\ \text{g/kg}$ <sup>[1]</sup>。

## Q29080A 蓖麻碱

【其他名】1,2-dihydro-4-methoxy-1-methyl-2-oxo-3-pyridinecarbonitrile; 3-cyano-4-methoxy-1-methyl-2-pyridone; 4-methoxy-2-oxo-1-methyl-1,2-dihydropyridinonitrile; ricinine。

【CAS 登录号】524-40-3。



【分子式】 $C_8H_8N_2O_2$ 。

【分子量】164.16。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【理化性质】mp 201℃, 小叶状体或棱柱体(水), 可溶于热水。

【来源中药】<sup>3654</sup> 蓖麻: 种子<sup>[1]</sup>; <sup>3656</sup> 蓖麻: 叶<sup>[2]</sup>。

【毒性】

急毒

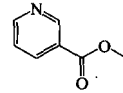
大鼠, 口服, 除致死量外, 未见毒性作用内容报道,  $LDLo = 75\ \text{mg/kg}$ <sup>[1]</sup>。

小鼠, 皮下注射, 对癫痫发作影响,  $LD_{50} = 25\ \text{mg/kg}$ <sup>[2]</sup>。

## Q29080B 3-哌啶甲酸乙酯

【其他名】3-(ethoxycarbonyl)pyridine; 3-carbethoxypyridine; 3-piperidinecarboxylic acid ethyl ester; ethyl 3-pyridinecarboxylate; ethyl nicotinate; ignicut; ignocut; mucotherm; nicaethan; nicotinic acid, ethyl ester; nikethan; nikithan;  $\beta$ -pyridinecarboxylic acid ethyl ester。

【CAS 登录号】614-18-6。



【分子式】 $C_8H_9NO_2$ 。

【分子量】151.16。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【理化性质】mp 126 ~ 127℃ (氯化氢), bp 223 ~ 224℃, 液体。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔: 种子<sup>[1]</sup>。

【药理作用】

影响代谢

SKH-hr-1 无毛小鼠腹部皮匀浆, 0 ~ 15 mmol/L 浓度温孵时,  $V_{\max} = 17.3\ \text{nmol}/(\text{min} \cdot \text{mg})$ ,  $K_m = 4.91\ \text{mmol/L}$ <sup>[1]</sup>。

检验皮渗透

Wistar 大鼠, 皮肤, 6 ~ 244 mmol/L 时, 标题物和其他代谢物 (NA) 累积量在较短延迟时间 (约 15 min) 后, 随时间呈线性增加; 标题物通量随大鼠年龄增加而逐渐减少; 总通量与供体浓度呈线性比例<sup>[2]</sup>; 6 ~ 244 mmol/L 时, 21 d 的胎儿和出生 3 d 的大鼠的代谢物通量几乎处于相同的低水平, 从 3 d 到 50 d 显著增加; 药物通量随大鼠年龄增加而逐渐增加; 所有年龄组大鼠中, 药物和代谢物通量与供体浓度无线性比例<sup>[2]</sup>。

生物转化

Wistar 大鼠, 皮肤给药, 6 ~ 244 mmol/L 时, 水解代谢产物未在磷酸盐缓冲液中出现, 但在皮肤匀浆中产生, 21 d 胎儿的  $V_{\max}$  值低于出生 3 d 的大鼠, 然后从 3 d 到 50 d 显著增加, 最终在 360 d 保持不变,  $K_m$  值几乎恒定<sup>[2]</sup>。

输送

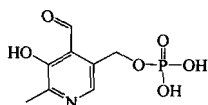
SKH-hr-1 无毛小鼠腹部皮, 6 ~ 244 mmol/L 培养时, 标题物流量为  $10.4\ \text{mmol}/(\text{cm}^2 \cdot \text{h})$ , 烟酸流量为  $1.57\ \text{mmol}/(\text{cm}^2 \cdot \text{h})$ , 总流量为  $12.0\ \text{mmol}/(\text{cm}^2 \cdot \text{h})$ , 总渗透系数为  $1.37 \times 10^{-6}\ \text{cm}^2/\text{s}$ <sup>[1]</sup>。

无毛 WBN/IL-Ht 大鼠腹部皮肤, 145 mmol/ml 时, 虽然在无二异丙基氟磷酸 (DFP) 处理组发现有短暂的延滞时间, 标题物和代谢物浓度随时间线性增加; 标题物和 DFP 合用时, 检测到少量的代谢产物<sup>[3]</sup>。

## Q29080C 二苯锡

【其他名】3-hydroxy-2-methyl-5-[(phosphonoxy)]

methyl]-4-pyridinecarboxaldehyde; codecarboxylase; co-enzyme B6; diphenyltin; hexermin P; pydoxal; pyridoxal 5-(dihydrogen phosphate); pyridoxal 5-monophosphate.  
【CAS 登录号】54-47-7。



【分子式】 $C_8H_9NO_6P$ 。

【分子量】246.13。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【理化性质】mp 140~143℃,  $pK_{a1}$  8.41,  $pK_{a2}$  6.45,  $pK_{a3}$  3.56 (25℃), 粉末或结晶。

【来源中药】<sup>7989</sup> 贻贝:肉<sup>[1]</sup>。

【毒性】

基因毒性

大肠杆菌, DNA 损伤, 50  $\mu\text{mol/L}$ <sup>[1]</sup>。

急毒

大鼠, 口服, 除致死量外, 未见毒性作用内容报道,  $LD_{50} = 5900 \text{ mg/kg}$ <sup>[2]</sup>; 皮下注射, 除致死量外, 未见毒性作用内容报道,  $LD_{50} = 850 \text{ mg/kg}$ <sup>[2]</sup>。

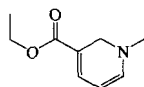
未指定种类, 皮下注射, 除致死量外, 未见毒性作用内容报道,  $LD_{50} = 550 \text{ mg/kg}$ <sup>[3]</sup>; 口服, 除致死量外, 未见毒性作用内容报道,  $LD_{50} > 3 \text{ g/kg}$ <sup>[3]</sup>。

小鼠, 肌注, 安定,  $LD_{50} = 1150 \text{ mg/kg}$ <sup>[4]</sup>; 口服, 除致死量外, 未见毒性作用内容报道,  $LD_{50} = 4640 \text{ mg/kg}$ <sup>[2]</sup>; 静注, 除致死量外, 未见毒性作用内容报道,  $LD_{50} = 530 \text{ mg/kg}$ <sup>[2]</sup>; 皮下注射, 除致死量外, 未见毒性作用内容报道,  $LD_{50} = 870 \text{ mg/kg}$ <sup>[2]</sup>。

#### Q290901 1,2-二氢-1-甲基-3-吡啶甲酸乙酯

【其他名】1,2-dihydro-1-methyl-3-pyridinecarboxylic acid, ethyl ester。

【CAS 登录号】251547-83-8。



【分子式】 $C_9H_{13}NO_2$ 。

【分子量】167.20。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

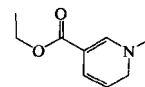
【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔:种子<sup>[1]</sup>。

#### Q290902 1,6-二氢-1-甲基-3-吡啶甲酸乙酯

【其他名】1,6-dihydro-1-methyl-3-pyridinecarboxylic acid, ethyl ester。

【CAS 登录号】251547-85-0。

【分子式】 $C_9H_{13}NO_2$ 。



【分子量】167.20。

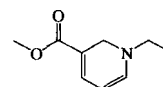
【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔:种子<sup>[1]</sup>。

#### Q290903 1-乙基-1,2-二氢-3-吡啶甲酸甲酯

【其他名】1-ethyl-1,2-dihydro-3-pyridinecarboxylic acid, methyl ester。

【CAS 登录号】251547-84-9。



【分子式】 $C_9H_{13}NO_2$ 。

【分子量】167.20。

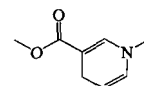
【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔:种子<sup>[1]</sup>。

#### Q290904 1-乙基-1,4-二氢-3-吡啶甲酸甲酯

【其他名】1-ethyl-1,4-dihydro-3-pyridinecarboxylic acid, methyl ester。

【CAS 登录号】251547-87-2。



【分子式】 $C_9H_{13}NO_2$ 。

【分子量】167.20。

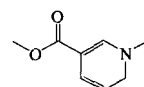
【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔:种子<sup>[1]</sup>。

#### Q290905 1-乙基-1,6-二氢-3-吡啶甲酸甲酯

【其他名】1-ethyl-1,6-dihydro-3-pyridinecarboxylic acid, methyl ester。

【CAS 登录号】251547-86-1。



【分子式】 $C_9H_{13}NO_2$ 。

【分子量】167.20。

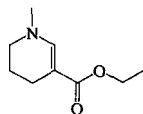
【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔:种子<sup>[1]</sup>。

Q290906 **1,4,5,6-四氢-1-甲基烟酸乙酯**

【其他名】1,4,5,6-tetrahydro-1-methyl-3-pyridinecarboxylic acid, ethyl ester; 1,4,5,6-tetrahydro-1-methyl-nicotinic acid, ethyl ester; ethyl 1,4,5,6-tetrahydro-1-methylnicotinate。

【CAS 登录号】56060-42-5。



【分子式】 $C_9H_{15}NO_2$ 。

【分子量】169.22。

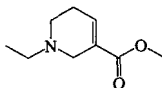
【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔: 种子<sup>[1]</sup>。

Q290907 **1-乙基-1,2,5,6-四氢-烟酸甲酯**

【其他名】1-ethyl-1,2,5,6-tetrahydro-3-pyridinecarboxylic acid, methyl ester; 1-ethyl-1,2,5,6-tetrahydro-nicotinic acid, methyl ester。

【CAS 登录号】101714-89-0。



【分子式】 $C_9H_{15}NO_2$ 。

【分子量】169.22。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔: 种子<sup>[1]</sup>。

【药理作用】

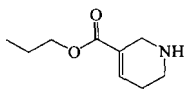
受体结合活性

毒蕈碱乙酰胆碱受体 mAChR, 体外与大鼠皮质组织结合活性: 氟标记三元拮抗配体 QNB,  $IC_{50} = 10\ 500\ \text{nmol/L}$ ; 氟标记四元拮抗配体 CMD,  $IC_{50} = 350\ \text{nmol/L}$ <sup>[1]</sup>。

Q290908 **1,2,5,6-四氢-3-吡啶甲酸丙酯**

【其他名】1,2,5,6-tetrahydro-3-pyridinecarboxylic acid, propyl ester。

【CAS 登录号】251547-78-1。



【分子式】 $C_9H_{15}NO_2$ 。

【分子量】169.22。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

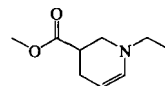
oids)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔: 种子<sup>[1]</sup>。

Q290909 **1-乙基-1,2,3,4-四氢-3-吡啶甲酸甲酯**

【其他名】1-ethyl-1,2,3,4-tetrahydro-3-pyridinecarboxylic acid, methyl ester。

【CAS 登录号】251547-89-4。



【分子式】 $C_9H_{15}NO_2$ 。

【分子量】169.22。

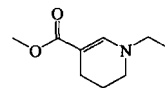
【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔: 种子<sup>[1]</sup>。

Q29090A **1-乙基-1,4,5,6-四氢-3-吡啶甲酸甲酯**

【其他名】1-ethyl-1,4,5,6-tetrahydro-3-pyridinecarboxylic acid, methyl ester。

【CAS 登录号】251547-82-7。



【分子式】 $C_9H_{15}NO_2$ 。

【分子量】169.22。

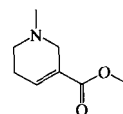
【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔: 种子<sup>[1]</sup>。

Q29090B **高槟榔碱**

【其他名】1,2,5,6-tetrahydro-1-methyl-3-pyridinecarboxylic acid, ethyl ester; arecaidine ethyl ester; homoarecoline。

【CAS 登录号】28125-84-0。



【分子式】 $C_9H_{15}NO_2$ 。

【分子量】169.22。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【理化性质】油状物。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔: 种子<sup>[1]</sup>。

【药理作用】

受体结合活性

大鼠膜匀浆,  $IC_{50} = 5\ \text{nmol/L}$ <sup>[1]</sup>。

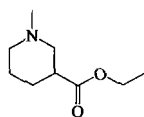
**【毒性】****急毒**

小鼠,静注,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 56 \text{ mg/kg}^{[1]}$ 。

Q29090C **(±)-1-甲基-3-哌啶甲酸乙酯**

**【其他名】** (±)-1-methyl-3-piperidinecarboxylic acid ethyl ester; 1-methyl-nipecotic acid, ethyl ester; ethyl 1-methyl-3-piperidinecarboxylate; ethyl 1-methylnipecotate; ethyl *N*-methylnipecotate。

**【CAS 登录号】** 5166-67-6。



**【分子式】**  $C_9H_{17}NO_2$ 。

**【分子量】** 171.24。

**【类型】** 烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

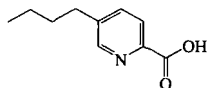
**【理化性质】**  $bp_{11}$  88 ~ 89°C。

**【来源中药】** <sup>7582</sup> 槟榔: 种子<sup>[1]</sup>。

Q291001 **5-丁基-2-吡啶甲酸**

**【其他名】** 5-butylpicolinic acid; amide; fusaric acid。

**【CAS 登录号】** 536-69-6。



**【分子式】**  $C_{10}H_{13}NO_2$ 。

**【分子量】** 179.21。

**【类型】** 烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

**【理化性质】**  $mp$  108 ~ 109°C, 片状物 (汽油), 溶于甲醇、丁醇, 微溶于水,  $\log P$  2.88 (计算值)。

**【来源中药】** <sup>8610</sup> 金丝燕: 巢窝<sup>[1]</sup>。

**【药理作用】****胚胎毒**

CD-1 小鼠,  $NO(A) EC \approx 100 \sim 112.5 \text{ mg}/(\text{kg} \cdot \text{d})^{[1]}$ 。

**抑制白介素-1 $\beta$  生成**

人全血液,  $IC_{50} > 520 \mu\text{mol/L}^{[2]}$ 。

**抑制壳聚糖摄取**

人血液细胞,  $IC_{50} > 520 \mu\text{mol/L}^{[2]}$ 。

**抑制肿瘤坏死因子  $\alpha$  生成**

人全血液,  $IC_{50} > 520 \mu\text{mol/L}^{[2]}$ 。

**抑制植物生长**

番茄, 抑制根、叶、籽伸长生长<sup>[3]</sup>。

**【毒性】****急毒**

大鼠,静注,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 210 \text{ mg/kg}^{[1]}$ ;腹腔注射,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 250 \text{ mg/kg}^{[1]}$ ;皮下注射,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 300 \text{ mg/kg}^{[1]}$ ;口服,嗜睡(全身性活动抑制),自发组无特征性血压降低, $LD_{50} = 480 \text{ mg/kg}^{[1]}$ 。

犬,静注,胃肠-恶心或呕吐, $LD_{50} = 180 \text{ mg/kg}^{[1]}$ ;口服,自发组无特征性血压降低,恶心或呕吐, $LD_{50} = 200 \text{ mg/kg}^{[1]}$ 。

兔,静注,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 150 \text{ mg/kg}^{[1]}$ ;口服,嗜睡(全身性活动抑制),自发组无特征性血压降低, $LD_{50} = 310 \text{ mg/kg}^{[1]}$ 。

小鼠,静注,血管-自发组无特征性血压降低, $LD_{50} = 100 \text{ mg/kg}^{[2]}$ ;皮下注射,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 140 \text{ mg/kg}^{[1]}$ ;口服,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 180 \text{ mg/kg}^{[3]}$ ;腹腔注射,除致死量外,未见毒性作用内容报道, $LD_{50} = 75 \text{ mg/kg}^{[3]}$ 。

**生殖毒性**

小鼠,雌性,受孕后第 7 ~ 15 日,口服,后植入死亡率,活产指数,生长统计(如体重增减百分比), $TDL_0 = 1013 \text{ mg/kg}^{[4]}$ 。

**亚慢性毒性**

Sprague-Dawley 大鼠,单用标题物处理无作用:无协同,累积或拮抗作用;细胞凋亡等其他作用与由喂食 0.025% 或更多串珠镰刀菌培养物(CM)而存在于大鼠肾中或喂食 2.5% CM 大鼠的肝中的烟曲霉毒素引起的作用一致<sup>[5]</sup>。

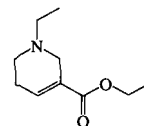
**致死**

CD-1 小鼠, $LD_{100} \geq 137.5 \text{ mg}/(\text{kg} \cdot \text{d})^{[6]}$ 。

Q291002 **1-乙基-1,2,5,6-四氢-3-吡啶甲酸乙酯**

**【其他名】** 1-ethyl-1,2,5,6-tetrahydro-3-pyridinecarboxylic acid ethyl ester。

**【CAS 登录号】** 155394-41-5。



**【分子式】**  $C_{10}H_{17}NO_2$ 。

**【分子量】** 183.25。

**【类型】** 烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

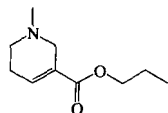
**【来源中药】** <sup>7582</sup> 槟榔: 种子<sup>[1]</sup>。

Q291003 **槟榔碱丙酯**

**【其他名】** 1,2,5,6-tetrahydro-1-methyl-3-pyridinecar-

boxylic acid, propyl ester; 1,2,5,6-tetrahydro-1-methyl-nicotinic acid, propyl ester; arecaidine, propyl ester。

【CAS 登录号】5497-44-9。



【分子式】 $C_{10}H_{17}NO_2$ 。

【分子量】183.25。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔: 种子<sup>[1]</sup>。

【药理作用】

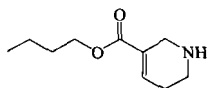
受体结合活性

大鼠膜匀浆,  $IC_{50} = 90 \text{ nmol/L}$ <sup>[1]</sup>。

#### Q291004 1,2,5,6-四氢-3-吡啶甲酸丁酯

【其他名】1,2,5,6-tetrahydro-3-pyridinecarboxylic acid, butyl ester。

【CAS 登录号】251547-79-2。



【分子式】 $C_{10}H_{17}NO_2$ 。

【分子量】183.25。

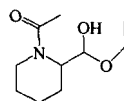
【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔: 种子<sup>[1]</sup>。

#### Q291005 1-乙酰基-2-哌啶甲酸乙酯

【其他名】1-acetyl-2-piperidinecarboxylic acid, ethyl ester。

【CAS 登录号】70841-77-9。



【分子式】 $C_{10}H_{19}NO_3$ 。

【分子量】201.26。

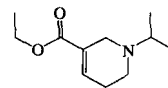
【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>7137</sup> 斑纹芦荟: 凝胶<sup>[1]</sup>。

#### Q291101 1,2,5,6-四氢-1-丙基-3-吡啶甲酸乙酯

【其他名】1,2,5,6-tetrahydro-1-propyl-3-pyridinecarboxylic acid, ethyl ester。

【CAS 登录号】251547-81-6。



【分子式】 $C_{11}H_{19}NO_2$ 。

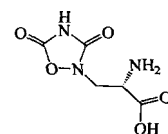
【分子量】197.27。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>7582</sup> 槟榔: 种子<sup>[1]</sup>。

#### Q291201 N-甲基烟酸内盐

【其他名】nicotinic acid methylbetaine。



【分子式】 $C_{12}H_{16}N_2O_4$ 。

【分子量】252.27。

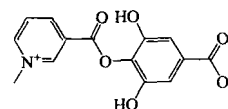
【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>4699</sup> 使君子: 叶<sup>[1]</sup>。

#### Q291401 相思豆碱

【其他名】preparatorine。

【CAS 登录号】36675-57-7。



【分子式】 $C_{14}H_{11}NO_6$ 。

【分子量】289.24。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

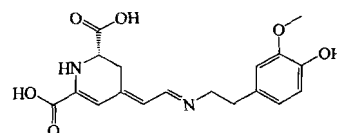
【理化性质】mp 218 ~ 220℃, 针状体 (甲醇)。

【来源中药】<sup>2926</sup> 相思子: 成熟种子<sup>[1]</sup>。

#### Q291801 (2S,4E)-1,2,3,4-四氢-4-[(2E)-[[2-(4-羟基-3-甲氧基苯基)乙基]亚胺基]乙叉]-2,6-吡啶二甲酸

【其他名】(2S,4E)-1,2,3,4-tetrahydro-4-[(2E)-[[2-(4-hydroxy-3-methoxyphenyl)ethyl]imino]ethylidene]-2,6-pyridinedicarboxylic acid。

【CAS 登录号】370078-59-4。

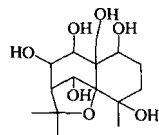


【分子式】 $C_{18}H_{20}N_2O_6$ 。

【分子量】360.36。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

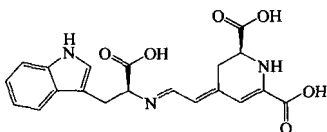
【来源中药】<sup>1501</sup> 青葙: 种子<sup>[1]</sup>。



Q292001 色氨酸-甜菜黄质

【其他名】(2*S*,4*E*)-4-[(2*E*)-2-[(1*S*)-1-carboxy-2-(1*H*-indol-3-yl)ethyl]imino]ethylidene]-1,2,3,4-tetrahydro-2,6-pyridinedicarboxylic acid; tryptophan-βetaxanthin。

【CAS 登录号】370078-76-5。



【分子式】 $C_{20}H_{19}N_3O_6$ 。

【分子量】397.38。

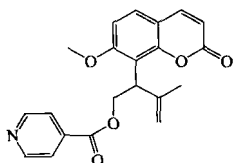
【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>1501</sup> 青葙: 种子<sup>[1]</sup>。

Q292101 异长叶九里香醇烟酸酯

【其他名】isomurralonginol nicotinate。

【CAS 登录号】112606-77-6。



【分子式】 $C_{21}H_{19}NO_5$ 。

【分子量】365.37。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【理化性质】黄色油状体。

【来源中药】<sup>3770</sup> 九里香: 茎叶<sup>[1]</sup>。

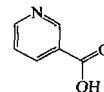
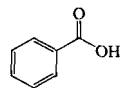
Q292801 黑蔓碱 A

【其他名】3-pyridinecarboxylic acid, 5(or 6)-ester with octahydro-5a-(hydroxymethyl)-2,2,9-trimethyl-2*H*-3,9a-methano-1-benzoxepin-4,5,6,9,10-pentol 6(or 5)-benzoate; tripterregeline A。

【CAS 登录号】128385-39-7。

【分子式】 $C_{28}H_{33}NO_9$ 。

【分子量】527.55。



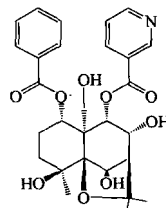
【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>4133</sup> 东北雷公藤: 茎皮<sup>[1]</sup>。

Q292901 黑蔓碱 B

【其他名】tripterregeline B。

【CAS 登录号】128197-56-8。



【分子式】 $C_{29}H_{37}NO_9$ 。

【分子量】543.60。

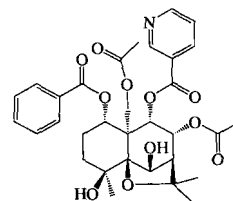
【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>4133</sup> 东北雷公藤: 茎皮<sup>[1]</sup>。

Q293201 黑蔓碱 C

【其他名】3-pyridinecarboxylic acid, 5(or 6)-ester with 5a-[(acetyloxy)methyl]octahydro-2,2,9-trimethyl-2*H*-3,9a-methano-1-benzoxepin-4,5,6,9,10-pentol 4-acetate 6(or 5)-benzoate; tripterregeline C。

【CAS 登录号】128197-58-0。



【分子式】 $C_{32}H_{37}NO_{11}$ 。

【分子量】611.63。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。



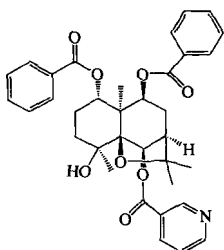
loids)。

【来源中药】<sup>4133</sup> 东北雷公藤: 茎皮<sup>[1]</sup>。

Q293501 黑萼定碱

【其他名】regelidine。

【CAS 登录号】114542-54-0。



【分子式】 $C_{35}H_{37}NO_8$ 。

【分子量】599.66。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

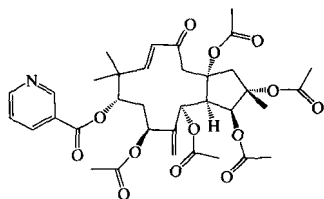
【理化性质】mp 292~294℃, 棱柱体 (氯仿)。

【来源中药】<sup>4132</sup> 昆明山海棠: 根<sup>[1]</sup>; <sup>4133</sup> 东北雷公藤: 根<sup>[2]</sup>; <sup>4134</sup> 雷公藤: 发根<sup>[3]</sup>; <sup>4134</sup> 雷公藤: 根木质部<sup>[4]</sup>。

Q293502 3-吡啶甲酸, (2R, 3R, 3aS, 4R, 6R, 8R, 10E, 13aR)-2, 3, 4, 6, 13a-五(乙酰氧基)-2, 3, 3a, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 12, 13, 13a-十二氢-2, 9, 9-三甲基-5-甲叉-13-酮-1H-环戊烷并环十二碳烯-8-基酯

【其他名】3-pyridinecarboxylic acid, (2R, 3R, 3aS, 4R, 6R, 8R, 10E, 13aR)-2, 3, 4, 6, 13a-pentakis(acetyloxy)-2, 3, 3a, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 12, 13, 13a-dodecahydro-2, 9, 9-trimethyl-5-methylene-13-oxo-1H-cyclopentacyclododecen-8-yl ester。

【CAS 登录号】220941-16-2。



【分子式】 $C_{35}H_{43}NO_{13}$ 。

【分子量】685.70。

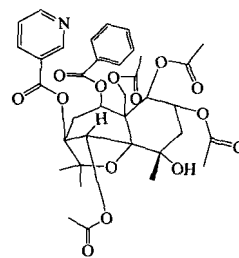
【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>3575</sup> 飞扬草: 带根全草<sup>[1]</sup>。

Q293601 3-吡啶甲酸, (3R, 4R, 5R, 5aS, 6R, 7S, 9S, 9aS, 10R)-6, 7, 10-三(乙酰氧基)-5a-[(乙酰氧基)甲基]-5-(苯甲酰氧)八氢-9-羟基-2, 2, 9-三甲基-2H-3, 9a-甲桥-1-苯并咪庚英-4-基酯

【其他名】3-pyridinecarboxylic acid, (3R, 4R, 5R, 5aS, 6R, 7S, 9S, 9aS, 10R)-6, 7, 10-tris(acetyloxy)-5a-[(acetyloxy)methyl]-5-(benzoyloxy)octahydro-9-hydroxy-2, 2, 9-trimethyl-2H-3, 9a-methano-1-benzoxepin-4-yl ester。

【CAS 登录号】339151-92-7。



【分子式】 $C_{36}H_{41}NO_{14}$ 。

【分子量】711.70。

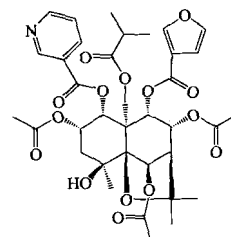
【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【来源中药】<sup>4134</sup> 雷公藤: 根木质部<sup>[1]</sup>。

Q293602 3-吡啶甲酸, (3R, 4R, 5R, 5aS, 6R, 7S, 9S, 9aS, 10R)-4, 7, 10-三(乙酰氧基)-5-[(3-咪喃基羰基)氧]八氢-9-羟基-2, 2, 9-三甲基-5a-[(2-甲基-1-羰基丙氧基)甲基]-2H-3, 9a-甲桥-1-苯并咪庚英-6-基酯

【其他名】3-pyridinecarboxylic acid, (3R, 4R, 5R, 5aS, 6R, 7S, 9S, 9aS, 10R)-4, 7, 10-tris(acetyloxy)-5-[(3-furanylcarbonyl)oxy]octahydro-9-hydroxy-2, 2, 9-trimethyl-5a-[(2-methyl-1-oxopropoxy)methyl]-2H-3, 9a-methano-1-benzoxepin-6-yl ester。

【CAS 登录号】864179-26-0。



【分子式】 $C_{36}H_{43}NO_{15}$ 。

【分子量】729.74。

【类型】烟酸衍生的生物碱 (nicotinic acid derived alkaloids)。

【理化性质】 $[\alpha]_D^{25} +9.2$  (c 1.2, 甲醇), 无定形粉末。