



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



*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

北京

## 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>

**中国科学院印刷厂** 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

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”的阶段性成果,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

A stylized Chinese signature in black ink, reading '周家驹' (Zhou Jiarong).

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，在本从书中，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、苯并咪唑和苯并吡喃类、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  $\alpha$ -,  $\beta$ -,  $\gamma$ -,  $\delta$ -,  $\varepsilon$ -,  $\zeta$ -,  $\psi$ -...(+), (-), ( $\pm$ ), *dl*-, *D*-, *L*-, *R*-, *S*-; *cis*-, *trans*-, *Z*-, *E*-;  $\Delta$  (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<sub>50</sub> 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“星号”。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 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 $\beta$ , TNF- $\alpha$ , 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- $\beta$  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 A<sub>2</sub> 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 A<sub>2</sub> 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 A<sub>2</sub> 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物(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- $\kappa$ B 途径 核转录因子- $\kappa$ 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 B<sub>4</sub>-诱导的移行, IC<sub>50</sub> 值为 1~5μg/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, IC<sub>50</sub> 分别为 101ng/mL 和 190ng/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 IC<sub>50</sub> 值为 1μmol/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 IC<sub>50</sub> 值为 5μmol/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 IC<sub>50</sub> 为 56nmol/L; 能降低人单核细胞和巨噬细胞中 TNF-α 和 IL-1β 的生成, 其 IC<sub>50</sub> 为 30~100nmol/L; 是 NF-κB 抑制剂, IC<sub>50</sub> 为 0.27μmol/L; 也是 NO 生成抑制剂, IC<sub>50</sub> 为 0.23μmol/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 IC<sub>50</sub> 值分别为 56nmol/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 TNF- $\alpha$  和 IL-6 的释放, 其 IC<sub>50</sub> 值均为 1 $\mu$ 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 IFN- $\gamma$  刺激的巨噬细胞中 TNF- $\alpha$ 、IL-6 和 IL-12 的生成, 其 IC<sub>50</sub> < 2 $\mu$ 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 NF- $\kappa$ B 抑制剂, 其 IC<sub>50</sub> 值为 2.5 $\mu$ 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 NF- $\kappa$ B 抑制剂, 其 IC<sub>50</sub> 值分别为 2.5 和 2.7 $\mu$ 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 TNF- $\alpha$  诱导的 VCAM-1 的表达; 减少肿瘤坏死因子 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 IFN- $\gamma$  刺激的 TNF- $\alpha$  和 IL-1 $\beta$  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 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 TNF- $\alpha$  和 IL-1 $\beta$  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 TNF- $\alpha$  和 IL-6 的释放, 其 IC<sub>50</sub><1 $\mu$ 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-1 $\beta$  诱导的 PGE<sub>2</sub> 的产生, 其 IC<sub>50</sub> 值小于 4 $\mu$ mol/L; 32 $\mu$ mol/L 降低巨噬细胞中 IL-1 $\alpha$ , IL-1 $\beta$ , 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<sub>2</sub> 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 TNF- $\alpha$ 、IL-1 $\beta$  和 IL-6 的生成; 抑制 NO 和 PGE<sub>2</sub> 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- $\kappa$ 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 苜基异喹啉生物碱/1 双苜基异喹啉生物碱/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]菲啶生物碱/5 吗啡生物碱/6	
1.2 喹啉类生物碱	6
喹啉生物碱/6 咪喃并喹啉生物碱/7 吡啶酮类生物碱/8	
1.3 喹啉类生物碱	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
吡啶并咪唑类生物碱/11 阿枯米林类生物碱/11 $\beta$ -咪唑类生物碱/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
腈和异腈类生物碱/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 莰烷型单萜/40 蒎烷型单萜/41 薷烷型单萜/42	
2.2 倍半萜	43

金合欢烷型倍半萜/43 没药烷型倍半萜/43 榄香烷型倍半萜/45 大牻牛儿烷型倍半萜/45 蛇麻烷型倍半萜/48 桉烷型倍半萜/49 三去甲桉烷型倍半萜/51 沉香呔喃桉烷型倍半萜/52 去甲杜松烷型倍半萜/55 去甲愈创木烷型倍半萜/55 双愈创木烷型倍半萜/55 移愈创木烷型倍半萜/56 愈创木烷型倍半萜/56 伪愈创木烷型倍半萜/60 木防己苦烷型倍半萜/62 苍耳烷型倍半萜/62 Silphinane 烷型倍半萜/62 Silphiperfoliane 型倍半萜/62 杂类倍半萜/63 开环Prezizaane 烷型倍半萜/63 香树烷型倍半萜/63 雅槛蓝烷型倍半萜/64 Carabrane 烷型倍半萜/65 异柯母烷型倍半萜/65 Modhephane 烷型倍半萜/65 单端孢菌烷型倍半萜/65	
2.3 二萜 .....	66
半日花烷型二萜/66 克罗烷型二萜/67 松香烷型二萜/69 开环松香烷型二萜/70 降、高松香烷型二萜/71 移松香烷型二萜/74 海松烷型二萜/74 重排海松烷型二萜/76 异海松烷型二萜/78 罗汉松烷型二萜/84 贝壳杉烷型二萜/84 瑞香烷型二萜/86 巴豆烷型二萜/87 二环杂类二萜/88 杂类二萜/88 木藜芦毒烷型二萜/89 10,15-环植烷型二萜/89 Cyathane 烷型二萜/89 香豌豆烷型二萜/89	
2.4 三萜 .....	90
羊毛甾烷型三萜/90 环羊毛甾烷型三萜/92 甘遂烷型三萜/96 葫芦烷型三萜/96 达玛烷型三萜/97 大戟烷型三萜/103 裂环四去甲三萜/104 苦木素类去甲三萜/104 羽扇豆烷型三萜/105 齐墩果烷型三萜/106 去甲齐墩果烷型三萜/118 Multiflorane 烷型三萜/118 无羁萜烷型三萜/118 乌苏烷型三萜/120 杂类三萜/124 山柑子烷型三萜/124 蒲公英赛烷型三萜/127	
2.5 局部萜 .....	128
局部萜/128 阿朴类胡萝卜素/129	
3. 黄酮类 .....	130
3.1 黄酮类 .....	130
3.2 二氢黄酮类 .....	141
3.3 双二氢黄酮类 .....	146
3.4 黄酮醇类 .....	146
3.5 二氢黄酮醇类 .....	160
3.6 双二氢黄酮醇类 .....	163
3.7 异黄酮类 .....	163
3.8 黄烷-3-醇类 .....	166
3.9 双黄烷-3-醇类 .....	168
3.10 异黄烷类 .....	169
3.11 查耳酮类 .....	169
3.12 二氢查耳酮类 .....	172
3.13 噢啉类 .....	175
3.14 双黄酮类 .....	175
4. 甾族化合物 .....	177
4.1 孕甾烷类甾族化合物 .....	177

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
<b>5.</b>	<b>脂肪族天然产物</b>	<b>183</b>
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
<b>6.</b>	<b>含氧杂环</b>	<b>196</b>
6.1	2-吡喃酮类	196
6.2	4-吡喃酮类	197
6.3	$\beta$ -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
<b>7.</b>	<b>简单芳香化合物</b>	<b>200</b>
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
<b>8. 多环芳香化合物</b>	<b>239</b>
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	
<b>9. 苯并呋喃和苯并吡喃类</b>	<b>245</b>
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
<b>10. 香豆素类</b>	<b>252</b>
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
<b>11. 木脂体</b>	<b>264</b>
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
<b>12. 鞣质</b>	<b>280</b>
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



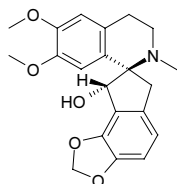
# 1. 生物碱

## 1.1 异喹啉类生物碱

### 异喹啉生物碱

#### 1 Fumaricine 蓝堇辛

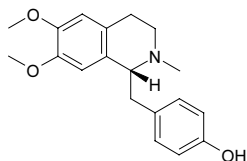
[24181-77-9]  $C_{21}H_{23}NO_5$  (369.42). 【类型】异喹啉生物碱. 【活性】用于治疗皮肤病、肝病和炎症 (使用源植物药用球果紫堇). 【来源】药用球果紫堇 *Fumaria officinalis*. 【文献】170.



### 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 causicum*, 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.

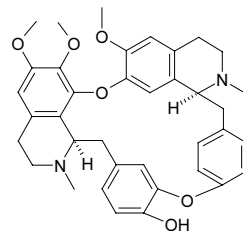


### 双苄基异喹啉生物碱

#### 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

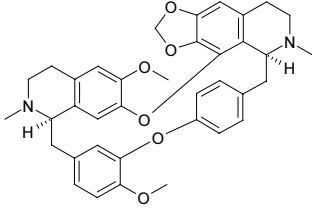
生物碱. 【活性】抗肿瘤; 抗心律失常; 抗心肌缺血; 解痉; 抗结核 (结核分枝杆菌); 免疫增强; 增加白细胞; 抑制心肌收缩性; 抗高血压; 调节药物免疫学伤害 (鼠); 血管松弛剂 (松弛肾小管动脉条, 兔, *in vitro*); 血管扩张剂; 减慢心率. 【来源】白药子 *Stephania cepharantha*, 瓣蕊唐松草 *Thalictrum petaloideum* (根: 含量 < 0.001%)<sup>[1025]</sup>, 大叶唐松草 *Thalictrum faberi* (根: 含量 < 0.001%)<sup>[1025]</sup>, 华南功劳木 *Mahonia japonica*, 金丝马尾连 *Thalictrum glandulosissimum* (根: 含量 < 0.001%)<sup>[1025]</sup>, 马尾连 (多叶唐松草) *Thalictrum foliolosum* (根: 含量 < 0.001%)<sup>[1025]</sup>, 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%)<sup>[1025]</sup>, 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%)<sup>[1025]</sup>, 鲜黄小檗 *Berberis diaphana* (根、茎: 平均含量 = 0.440%)<sup>[1025]</sup>, 小果唐松草 *Thalictrum microgynum* (根: 含量 = 0.08%)<sup>[1025]</sup>, 烟锅草 *Thalictrum thunbergii* (根: 含量 = 0.03%)<sup>[1025]</sup>, 硬水黄连 (短梗箭头唐松草) *Thalictrum simplex* [Syn. *Thalictrum simplex* var. *brevipes*] (根: 含量 = 0.01%)<sup>[1025]</sup>, 置疑小檗 *Berberis dubia* (根、茎: 平均含量 = 0.396%)<sup>[1025]</sup>. 【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)

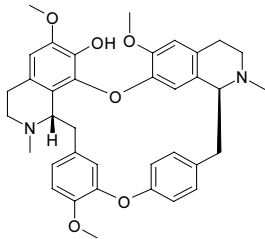
[481-49-2]  $C_{37}H_{38}N_2O_6$  (606.73). 黄色针状晶体 (丙酮-苯), mp 145~155°C,  $[\alpha]_D^{20} = +277^\circ$  ( $c = 2$ , 三氯甲烷), 溶于普通有机溶剂, 不溶于石油醚.<sup>[1024]</sup> 【类型】双苄基异喹啉生物碱. 【活性】抗肿瘤 (HeLa, *in vitro*,  $ED_{50} = 5.5\mu\text{g}/\text{kg}$ ; 人, HeLa-S3, *in vitro*,  $ED_{50} = 7.0\mu\text{g}/\text{kg}$ ; EAC *in*

*vivo*; S<sub>180</sub> *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<sup>+</sup> 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, 4, 5, 6, 1024。



### 5 Fangchinoline 汉防己乙素 (防己诺林碱; 去甲粉防己碱)

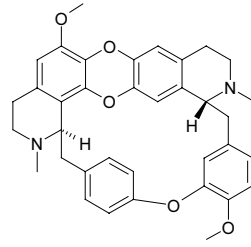
Demethyltetrandrine C<sub>37</sub>H<sub>40</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub> (608.74). mp 237~238°C (丙酮); mp 177~179°C (甲醇)。【类型】双苄基异喹啉生物碱。【活性】细胞毒 (HeLa *in vitro*, ED<sub>50</sub> = 4.1 μg/mL); 抗高血压; 血小板聚集抑制剂 (胶原所致的小血小板聚集); 止痛; 抗炎 (细胞因子网络调节器: 预防整合蛋白介导的中性粒细胞黏附和 fMLP-或 leukotriene B<sub>4</sub>-诱导的移行, IC<sub>50</sub> = 1~5 μg/mL)<sup>[725]</sup>; IL-6 抑制剂 (*in vitro*, IC<sub>50</sub> > 6 μmol/L)<sup>[725]</sup>; LD<sub>50</sub> (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%<sup>[1025]</sup>), 汝兰 *Stephania hernandifolia*。【文献】2, 4, 5, 13, 170, 171, 725, 1022, 1025。



### 6 Isotrilobine 异三叶木防己碱

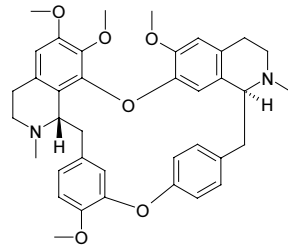
Homotrilobine [26195-62-0] C<sub>36</sub>H<sub>36</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub> (576.70). mp 213~215°C。【类型】双苄基异喹啉生物碱。【活性】抗肿瘤 (HeLa、鼠 EAC、S<sub>180</sub>); 抗炎 (大鼠, 棉塞肉芽肿模型, 角又菜胶引起的足肿胀模型); 抗菌 (六种杆菌和多种球菌, MIC = 7.8~500 μg/mL); 血小板聚集抑制剂。【来源】木防己 *Cocculus trilobus* [Syn. *Cocculus sarmentosus*], 汝兰 *Stephania hernandifolia*。

【文献】6, 170。



### 7 Tetrandrine 粉防己碱 (汉防己碱; 倒地拱素)

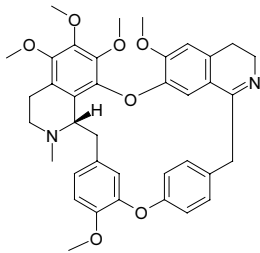
Fanchinin; Hanfangchin A [518-34-3] C<sub>38</sub>H<sub>42</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub> (622.77). mp (±) 257~258°C, mp (+) 217~218°C, [α]<sub>D</sub><sup>26</sup> = +252.4° (三氯甲烷), 溶于乙醇、乙醚、三氯甲烷, 不溶于水、石油醚<sup>[1024]</sup>。【类型】双苄基异喹啉生物碱。【活性】抗肿瘤 (鼠, EAC 和 S<sub>180</sub>, *in vivo*); 止痛; 抗过敏; 抗心律失常 (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 B<sub>4</sub> 诱导的移行, IC<sub>50</sub> = 1~5 μg/mL)<sup>[725]</sup>; IL-6 抑制剂 (*in vitro*, IC<sub>50</sub> > 6 μmol/L)<sup>[725]</sup>; 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%<sup>[1025]</sup>), 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%<sup>[1022]</sup>), 6 产地平均含量 = 1.915%<sup>[1025]</sup>), 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 Thalsimine 箭头唐松草碱

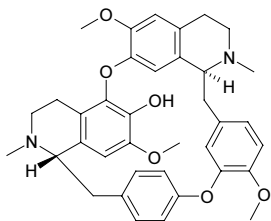
Thalsimine C<sub>38</sub>H<sub>40</sub>N<sub>2</sub>O<sub>7</sub> (636.75). mp 140~142°C。【类型】双苄基异喹啉生物碱。【活性】抗肿瘤 (鼠, 淋巴瘤 NK/CY, 肝细胞瘤 PC-1 和淋巴管肉瘤); 止痛;

抗炎; 抗高血压 (麻醉猫, 1~5mg/kg iv, 血压下降 2.67~10.00kPa); 退热剂 (鼠, 1000mg/kg, sc, 2h 内体温下降 2.5~2.7°C, 18h 内体温下降 5.5~6.0°C); 促醒 (鼠, 昏迷模型, 减少昏迷时间); 镇静 (鼠, 500mg/kg sc, 加强环己巴比妥的催眠效能 2 倍); LD (麻醉猫) = 10mg/kg. 【来源】马尾连 *Thalictrum foliolosum*, 硬水黄连 *Thalictrum simplex* [Syn. *Thalictrum simplex* var. *brevipes*], 缙纹唐松草 *Thalictrum rugosum*. 【文献】5, 6, 170.



### 9 Thalmine 小唐松草碱 II

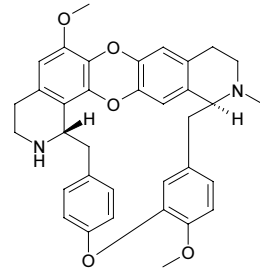
$C_{37}H_{40}N_2O_6$  (608.74). 晶体 (50% 乙醇), mp 140~142°C,  $[\alpha]_D^{25} = +36.1^\circ$  ( $c = 0.92$ , 乙醇). 【类型】双苄基异喹啉生物碱. 【活性】抗肿瘤 (大鼠和小鼠, 腹水淋巴瘤, *in vivo*); 抗炎 (动物试验). 【来源】唐松草属 *Thalictrum* sp. 【文献】170.



### 10 Trilobine 木防己碱

[6138-73-4]  $C_{35}H_{34}N_2O_5$  (562.67). mp 237°C. 【类型】双苄基异喹啉生物碱. 【活性】细胞毒 (HeLa-S3 细胞); 抗高血压; 抗炎; 退热剂 (兔); 止痛 (兔); 中枢镇静; 血小板聚集抑制剂 (大鼠, ADP 诱导的血小板聚集, *in vitro* and *in vivo*); 肌肉松弛剂; 麻痹心脏和骨骼肌 (蛙); 用于治疗高血压和风湿痛; MLD (兔, iv) = 50mg/kg, MLD (兔, sc) = 150mg/kg, MLD (蛙, sc) = 500~100mg/kg, MLD (鼠, sc) = 500~100mg/kg. 【来源】白药子 *Stephania cepharantha*, 衡州乌药 *Cocculus laurifolius*, 木防己 *Cocculus trilobus* [Syn.

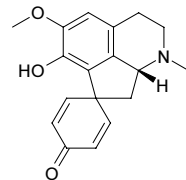
*Cocculus sarmentosus*]. 【文献】4, 170, 171.



### 前阿朴啡生物碱

#### 11 Glaziovine 奥可梯木种碱

[6808-72-6]  $C_{18}H_{19}NO_3$  (297.36). 无色片状晶体 (苯), mp 223°C,  $[\alpha]_D = -45.74^\circ$  ( $c = 0.26$ , 甲醇). 【类型】前阿朴啡生物碱. 【活性】抗肿瘤 (鼻咽癌细胞,  $ED_{50} = 2.6\mu\text{g/mL}$ ); 抗高血压 (大鼠, 5~15mg iv, 1~3h 降低血压 50%~70%); 抗溃疡 (大鼠和豚鼠, 5mg/kg iv); 中枢镇静 (动物, 减轻焦虑); 抗神经紧张和抑郁; 治疗恐惧、焦虑和愁思. 【来源】散花巴豆 *Croton sparsiflorus*, 威尔士绿绒蒿 *Meconopsis cambrica*, 紫番荔枝 *Annona purpurea*. 【文献】170, 172.



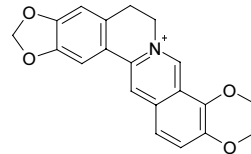
### 原小檗碱生物碱

#### 12 Berberine 小檗碱 (黄连素)

Umbellatine [2086-83-1]  $C_{20}H_{18}NO_4^+$  (336.37). 黄色针状晶体, mp 145°C, 溶于热水、乙醇, 略溶于乙醚、苯、三氯甲烷、丙酮.<sup>[1024]</sup> 【类型】原小檗碱生物碱. 【活性】降血糖; 抗高血压; 肾上腺素能  $\alpha_1$ -和  $\alpha_2$ -受体激动剂; 止痛; 抗腹泻; 抗炎; 抗微生物; 抗原生动物; 退热剂; 利胆剂; 催眠 (延长戊巴比妥睡眠时间); 增加缺氧的耐受性; 局部麻醉剂; 减少兔眼节点内压; 血管扩张剂; 血管平滑肌松弛剂; 平滑肌兴奋剂 (子宫、膀胱、胃肠道和支气管); 镇静; 抗 HIV 实验无活性 (淋巴细胞 H9, 对照 3'-叠氨基-3'-

脱氧胸苷,  $IC_{50} = 500\mu\text{g/mL}$ ,  $EC_{50} = 0.0317\mu\text{g/mL}$ ,  $TI = 15,800$ <sup>[953]</sup>; 抗菌 (口服, 病原体: 变异链球菌,  $MIC = 125\mu\text{g/mL}$ , 对照 Chlorhexidine gluconate,  $MIC = 1.25\mu\text{g/mL}$ ; 核粒梭形杆菌,  $MIC = 15.6\mu\text{g/mL}$ , Chlorhexidine gluconate,  $MIC = 2.5\mu\text{g/mL}$ )<sup>[984]</sup>; 细胞毒 (一些人癌细胞,  $P_{388}$  小鼠白血病细胞, 9L 大鼠神经胶质瘤细胞)<sup>[956]</sup>; 细胞毒 (*in vitro*, 抑制 6 种食管癌细胞的增殖, 浓度依赖方式)<sup>[956]</sup>。【来源】白毛茛 *Hydrastis canadensis* (根), 白屈菜 *Chelidonium majus* (全株: 5 产地平均含量 = 0.017%)<sup>[1025]</sup>, 白药子 *Stephania cepharantha*, 瓣蕊唐松草 *Thalictrum petaloideum* (根: 含量 = 0.07%)<sup>[1025]</sup>, 长矩延胡索 *Corydalis longicalcarata* (根茎: 含量 = 0.122%)<sup>[1025]</sup>, 城口十大功劳 *Mahonia shenii* (茎: 含量 = 1.67%)<sup>[1026]</sup>, 齿瓣延胡索 *Corydalis remota* [Syn. *Corydalis bulbosa* var. *typica*] (根茎: 含量 = 0.01%)<sup>[1025]</sup>, 川滇十大功劳 *Mahonia veitchiorum* (茎: 含量 = 0.43%)<sup>[1026]</sup>, 大叶唐松草 *Thalictrum faberi* (根: 含量 = 0.46%)<sup>[1025]</sup>, 大枣 *Ziziphus jujuba*, 短萼黄连 *Coptis chinensis* var. *brevise-pala* (根茎: 含量 = 5.31%)<sup>[1025]</sup>, 对叶元胡 *Corydalis ledebouriana* (根茎: 含量 = 0.040%)<sup>[1025]</sup>, 峨嵋野黄连 *Coptis omeiensis* (根茎: 含量 = 8.77%)<sup>[1025]</sup>, 防己(粉防己) *Stephania tetrandra* (干燥根: 3 产地平均含量 = 0.152%)<sup>[1025]</sup>, 古蔺野连 *Coptis gulinensis* (根茎: 含量 = 4.82%)<sup>[1025]</sup>, 湖北十大功劳 *Mahonia confusa* (茎: 含量 = 0.19%)<sup>[1026]</sup>, 华南功劳木 *Mahonia japonica* (茎: 含量 = 0.14%)<sup>[1026]</sup>, 黄柏 (黄檗; 关黄柏) *Phellodendron amurense* (树皮: 含量范围 = 0.63%~5.91%)<sup>[1022]</sup>; 含量范围 = 0.68%~2.82%, 平均含量 = 1.27%)<sup>[1025]</sup>, 黄连(味连) *Coptis chinensis* (根茎: 含量范围 = 3.1%~8.4%)<sup>[1022]</sup>, 平均含量 = 5.92%)<sup>[1025]</sup>, 黄皮树(川黄柏) *Phellodendron chinense* (树皮: 7 产地平均含量 = 3.65%)<sup>[1025]</sup>, 灰绿延胡索 *Corydalis adunca* (根茎: 含量 = 0.156%)<sup>[1025]</sup>, 蓟罂粟 *Argemone mexicana*, 金花小檗 *Berberis wilsonae*, 金丝马尾连 *Thalictrum glandulosissimum* (根: 含量 = 1.16%)<sup>[1025]</sup>, 宽苞十大功劳 *Mahonia eurybracteata* (茎: 3 产地平均含量 = 0.30%)<sup>[1026]</sup>, 马尾连(多叶唐松草) *Thalictrum foliolosum* (根: 含量 = 1.25%)<sup>[1025]</sup>, 日本小檗 *Berberis thunbergii*, 三角叶

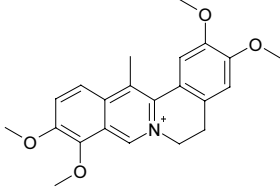
黄连(雅连) *Coptis deltoidea* (根茎: 平均含量 = 4.39%)<sup>[1025]</sup>, 少齿小檗 *Berberis potaninii* (根、茎: 平均含量 = 0.315%)<sup>[1025]</sup>, 十大功劳木 *Mahonia bealei* (茎: 4 产地平均含量 0.38%)<sup>[1026]</sup>, 土黄连 *Berberis julianae*, 望春玉兰 *Magnolia biondii* [Syn. *Magnolia fargesii*] (茎: 2 产地平均含量 = 0.14%)<sup>[1026]</sup>, 细柄十大功劳 *Mahonia gracilipes* (茎: 2 产地平均含量 = 0.23%)<sup>[1026]</sup>, 细叶功劳木 *Mahonia fortunei* (茎: 2 产地平均含量 = 0.48%)<sup>[1026]</sup>, 狭序唐松草 *Thalictrum atriplex* (根: 含量 = 0.21%)<sup>[1025]</sup>, 鲜黄小檗 *Berberis diaphana* (根、茎: 平均含量 = 1.284%)<sup>[1025]</sup>, 线萼黄连 *Coptis linearisepala* (根茎: 含量 = 8.39%)<sup>[1025]</sup>, 小果十大功劳 *Mahonia bodinieri* (茎: 含量 = 0.48%)<sup>[1026]</sup>, 小果唐松草 *Thalictrum microgynum* (根: 含量 < 0.001%)<sup>[1025]</sup>, 烟锅草 *Thalictrum thunbergii* (根: 含量 = 0.11%)<sup>[1025]</sup>, 延胡索(元胡) *Corydalis yanhusuo* [Syn. *Corydalis turtchaninovii* f. *yanhusuo*] (根茎: 3 产地平均含量 = 0.007%)<sup>[1025]</sup>, 硬水黄连(短梗箭头唐松草) *Thalictrum simplex* [Syn. *Thalictrum simplex* var. *brevipes*] (根: 含量 = 0.28%)<sup>[1025]</sup>, 云南黄连(云连) *Coptis teetoides* [Syn. *Coptis teeta*] (根茎: 平均含量 = 8.10%)<sup>[1025]</sup>, 置疑小檗 *Berberis dubia* (根、茎: 平均含量 = 0.595%)<sup>[1025]</sup>。【文献】1, 2, 4, 103, 171, 953, 956, 984, 1022, 1024, 1025, 1026。



### 13 Dehydrocorydaline 去氢紫堇碱 (去氢延胡索甲素; 去氢延胡索碱)

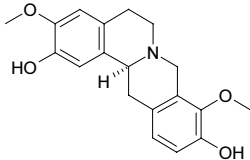
[30045-16-0]  $C_{22}H_{24}NO_4^+$  (366.44)。【类型】原小檗碱生物碱。【活性】冠状动脉扩张剂; 增加冠脉血流; 抗溃疡 (大鼠, sc, 胃溃疡); 抑制胃分泌; 增加缺氧的耐受性 (鼠); 用于治疗冠心病 (延胡索的主要有效成分)。【来源】长矩延胡索 *Corydalis longicalcarata* (根茎: 含量 = 0.025%)<sup>[1025]</sup>, 东北延胡索 *Corydalis ambigua* var. *amurensis* [Syn. *Corydalis ambigua*], 对叶元胡 *Corydalis ledebouriana* (根茎: 含量 = 0.032%)<sup>[1025]</sup>, 灰绿延胡索 *Corydalis adunca* (根

茎: 含量 = 0.069%<sup>[1025]</sup>), 细深山紫堇 *Corydalis pallida* var. *tenuis*, 延胡索 *Corydalis yanhusuo* [Syn. *Corydalis turtchaninovi* f. *yanhusuo*] (根茎: 5 产地平均含量 = 0.152%<sup>[1025]</sup>). 【文献】2, 170, 1025.



#### 14 Stepholidine 光千金藤定碱

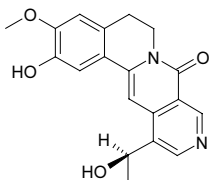
[16562-13-3] C<sub>19</sub>H<sub>21</sub>NO<sub>4</sub> (327.38). mp 126~128°C, 161~163°C. 【类型】原小檗碱生物碱. 【活性】多巴胺受体拮抗剂 (作用强于左旋四氢巴马汀和四氢小檗碱); 多巴胺 D<sub>2</sub> 受体拮抗剂 (大鼠脑腺垂体多巴胺 D<sub>2</sub> 受体); 用于治疗多动性锥体外运动障碍; 解痉 (兔肠、豚鼠肠, *in vitro*); 镇静 (小鼠, 抑制自发性运动, ED<sub>50</sub> = 258mg/kg); 止痛 (小鼠, 醋酸诱导的扭体模型 ED<sub>50</sub> = 223mg/kg, 电刺激模型, 热板模型); 用于治疗血管性头痛及偏头痛; 抗高血压 (犬、大鼠; 用于治疗原发性 I、II 期高血压, 作用较慢但疗效持久); 抗氧化剂 (Fe<sup>2+</sup>/VC、CCl<sub>4</sub>/NADPH 或 Fe<sup>3+</sup>/NADPH 引起的微粒体脂质过氧化, 呈量效关系). 【来源】蝙蝠葛根 *Menispermum dauricum*. 【文献】6, 158, 161, 168, 174, 187, 188.



### 吐根碱类生物碱

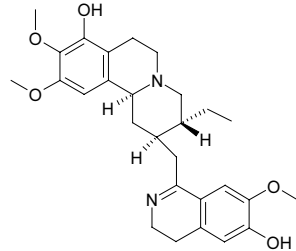
#### 15 Alamarine 八角枫碱

[77156-18-4] C<sub>19</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub> (338.37). 【类型】吐根碱类生物碱. 【活性】用于治疗麻风病; 皮炎抑制剂. 【来源】安哥拉八角枫 *Alangium lamarckii*. 【文献】170.



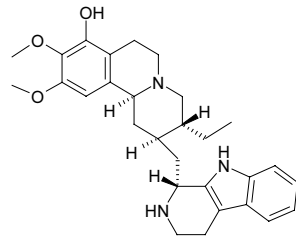
#### 16 Alangicine 八角枫辛

[16531-04-7] C<sub>28</sub>H<sub>36</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub> (480.61). 【类型】吐根碱类生物碱. 【活性】用于治疗麻风病; 皮炎抑制剂. 【来源】安哥拉八角枫 *Alangium lamarckii*. 【文献】170.



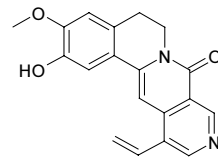
#### 17 Alangimarckine 八角枫马京

[13849-53-1] C<sub>29</sub>H<sub>37</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub> (475.64). 【类型】吐根碱类生物碱. 【活性】用于治疗麻风病; 皮炎抑制剂. 【来源】安哥拉八角枫 *Alangium lamarckii*. 【文献】170.



#### 18 Alangimarine 印八角枫林碱

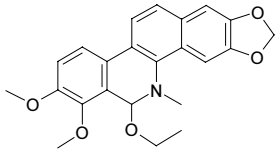
[77156-16-2] C<sub>19</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>3</sub> (320.35). 【类型】吐根碱类生物碱. 【活性】用于治疗麻风病; 皮炎抑制剂. 【来源】安哥拉八角枫 *Alangium lamarckii*. 【文献】170.



### 苯并[c]菲啶生物碱

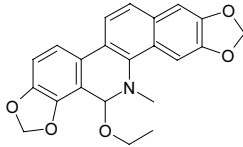
#### 19 Ethoxychelerythrine 乙氧基白屈菜红碱

C<sub>23</sub>H<sub>23</sub>NO<sub>5</sub> (393.44). 白色片状晶体 (碱性无水乙醇), mp 207~208°C. 【类型】苯并[c]菲啶生物碱. 【活性】细胞毒 (Ehrlich 腹水癌细胞)<sup>[956]</sup>; 抗肿瘤 (子宫颈癌, 甲状腺癌); 抗菌; 抗炎 (用于治疗宫颈炎). 【来源】博落回 *Macleaya cordata*. 【文献】170, 956.



### 20 Ethoxysanguinarine 乙氧基血根碱

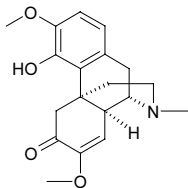
$C_{22}H_{19}NO_5$  (377.40). 白色片状晶体 (氨性无水乙醇), mp 210~211°C. 【类型】苯并[c]菲啶生物碱. 【活性】抗肿瘤 (子宫颈癌、甲状腺癌); 抗菌; 抗炎 (用于治疗子宫颈炎). 【来源】博落回 *Macleaya cordata*. 【文献】170.



## 吗啡生物碱

### 21 Sinomenine 防己碱 (青藤碱)

Coculine [115-53-7]  $C_{19}H_{23}NO_4$  (329.40). mp 162°C. 【类型】吗啡生物碱. 【活性】止痛 (鼠, 兔); 抗心律失常 (豚鼠心房 *in vitro*); 抗炎 (大鼠, 甲醇或蛋清所致关节炎模型); 镇咳 (鼠、猫); 抑制肠平滑肌 (*in vitro*); 抗高血压 (犬、猫和大鼠, iv 和 orl); 负变时作用; 释放组胺;  $LD_{50}$  (鼠, orl) = 580mg/kg,  $LD_{50}$  (鼠, sc) = 535 mg/kg,  $LD_{50}$  (鼠, ip) = 285mg/kg,  $LD_{50}$  (犬, orl) = 45 mg/kg,  $LD_{50}$  (猴子, orl) = 95mg/kg. 【来源】蝙蝠葛 *Menispermum dauricum*, 蝙蝠葛根 *Menispermum dauricum* (根茎: 平均含量 = 0.107%<sup>[1025]</sup>), 青风藤 *Sinomenium acutum* (茎: 含量 = 0.81%)<sup>[1022]</sup>. 【文献】4, 6, 170, 1022, 1025.

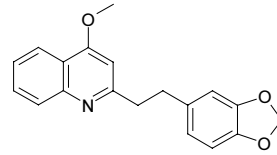


## 1.2 喹啉类生物碱

### 喹啉生物碱

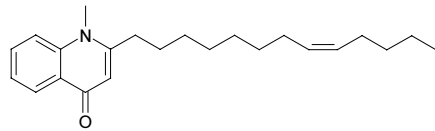
#### 22 Cusparine 桔枳碱

[529-92-0]  $C_{19}H_{17}NO_3$  (307.35). 【类型】喹啉生物碱. 【活性】抗疟疾; 退热剂; 抗腹泻; 解痉. 【来源】安古斯图腊树 *Galipea officinalis*. 【文献】170.



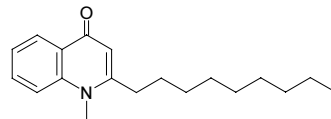
#### 23 Evocarpine 吴茱萸卡平碱

[15266-38-3]  $C_{23}H_{33}NO$  (339.53). 注: evocarpine 是混合物, 后面的结构是其中的主要成分. 【类型】喹啉生物碱. 【活性】二酰甘油酰基转移酶 DGAT 抑制剂 ( $IC_{50}$  = 8.1 $\mu$ g/mL)<sup>[860]</sup>; 白三烯生物合成抑制剂 (人多型核粒细胞,  $IC_{50}$  = 14.6 $\mu$ mol/L, 对照 Zileuton,  $IC_{50}$  = 10.4 $\mu$ mol/L)<sup>[890]</sup>. 【来源】吴茱萸 *Evodia rutaecarpa* (果实). 【文献】2, 860, 890.



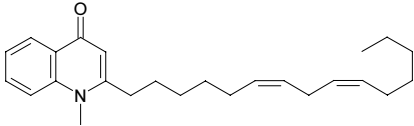
#### 24 1-Methyl-2-nonyl-4(1H)-quinolone 1-甲基-2-壬基-4(1H)-喹诺酮

$C_{19}H_{27}NO$  (285.43). 【类型】喹啉生物碱. 【活性】白三烯生物合成抑制剂 (人多型核粒细胞,  $IC_{50}$  = 12.1  $\mu$ mol/L, 对照 Zileuton,  $IC_{50}$  = 10.4 $\mu$ mol/L)<sup>[890]</sup>. 【来源】吴茱萸 *Evodia rutaecarpa*. 【文献】266, 890.



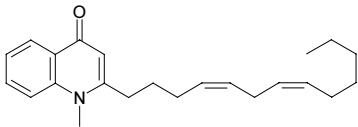
**25 1-Methyl-2-[(6Z,9Z)-6,9-pentadecadienyl]-4(1H)-quinolone** 1-甲基-2-[(6Z,9Z)-6,9-十五碳二烯基]-4(1H)-喹诺酮

$C_{25}H_{35}NO$  (365.56). 【类型】喹啉生物碱. 【活性】白三烯生物合成抑制剂 (人多型核粒细胞,  $IC_{50} = 12.3 \mu\text{mol/L}$ , 对照 Zileuton,  $IC_{50} = 10.4 \mu\text{mol/L}$ )<sup>[890]</sup>. 【来源】吴茱萸 *Evodia rutaecarpa*. 【文献】2, 183, 890.



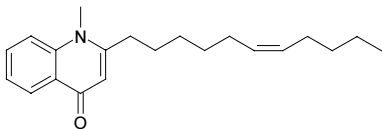
**26 1-Methyl-2-(4Z,7Z)-4,7-tridecadienyl-4(1H)-quinolinone** 1-甲基-2-(4Z,7Z)-4,7-十三碳二烯-4(1H)-喹诺酮\*

$C_{23}H_{31}NO$  (337.51). 【类型】喹啉生物碱. 【活性】白三烯生物合成抑制剂 (人多型核粒细胞,  $IC_{50} = 10.1 \mu\text{mol/L}$ , 对照 Zileuton,  $IC_{50} = 10.4 \mu\text{mol/L}$ )<sup>[890]</sup>. 【来源】吴茱萸 *Evodia rutaecarpa*. 【文献】2, 183, 890.



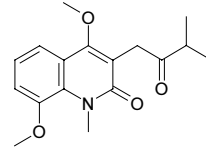
**27 1-Methyl-2-[(Z)-6-undecenyl]-4(1H)-quinolone** 1-甲基-2-[(Z)-6-十一碳烯基]-4(1H)-喹诺酮

$C_{21}H_{29}NO$  (311.47). 【类型】喹啉生物碱. 【活性】白三烯生物合成抑制剂 (人多型核粒细胞,  $IC_{50} = 10.0 \mu\text{mol/L}$ , 对照 Zileuton,  $IC_{50} = 10.4 \mu\text{mol/L}$ )<sup>[890]</sup>. 【来源】吴茱萸 *Evodia rutaecarpa*. 【文献】2, 183, 890.



**28 Orixalone A 臭山羊酮 A\***

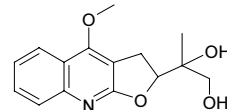
$C_{17}H_{21}NO_4$  (303.36). 无色油状物. 【类型】喹啉生物碱. 【活性】NO 生成抑制剂 (RAW264.7 细胞, 脂多糖 /IFN- $\gamma$  诱导的,  $10 \mu\text{mol/L}$ , 抑制率 = 47.3%,  $50 \mu\text{mol/L}$ , 抑制率 = 54.8%; 在有效浓度时对 RAW 264.7 细胞无明显细胞毒性)<sup>[835]</sup>. 【来源】臭山羊 *Orixa japonica* (茎: 产率 = 0.0031% 干重). 【文献】835.



**喹啉并喹啉生物碱**

**29 Dubinidine 杜宾定**

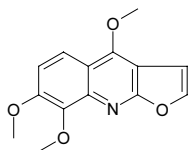
[22964-77-8]  $C_{15}H_{17}NO_4$  (275.31). mp 132~133°C; 硝酸盐: mp 195~196°C; 硝酸盐: mp 176~177°C. 【类型】喹啉并喹啉生物碱. 【活性】抗利尿剂 (2000mg/kg); 镇静 (大鼠和小鼠, 100mg/kg orl); 退热剂 (大鼠和小鼠, 100mg/kg orl). 【来源】大叶芸香草 *Haplophyllum perforatum*. 【文献】170.



**30 Skimmianine 茵芋碱**

$C_{14}H_{13}NO_4$  (259.26). mp 176°C, 注: 通常存在于芸香科 (*Rutaceae*). 【类型】喹啉并喹啉生物碱. 【活性】止痛; 抗惊厥; 退热剂; 中枢镇静; 光毒作用 (啤酒酵母菌、白色念珠菌); 光活抗菌 (金黄色葡萄球菌)<sup>[874]</sup>; 光活抗真菌 (白念珠菌, 弱活性)<sup>[874]</sup>; 光活 DNA 结合活性 (限制酶 Xba I, BciV I, Sal I, Pst I, Sph I 和 Hind III)<sup>[874]</sup>; 细胞毒 ( $P_{388}$  癌细胞株,  $ED_{50} = 2.5 \mu\text{g/mL}$ , 对照光神霉素,  $ED_{50} = 0.06 \mu\text{g/mL}$ ; HT29,  $ED_{50} = 7.2 \mu\text{g/mL}$ , 光神霉素,  $ED_{50} = 0.07 \mu\text{g/mL}$ ; A549,  $ED_{50} = 0.12 \mu\text{g/mL}$ , 光神霉素,  $ED_{50} = 0.08 \mu\text{g/mL}$ )<sup>[979]</sup>;  $LD_{50}$  (小鼠, ip) = 150~250mg/kg. 【来源】白色白鲜\* *Dictamnus albus*, 白鲜皮 *Dictamnus dasycarpus*, 臭草 *Ruta graveolens*, 臭山羊 *Orixa japonica* (茎: 产率 = 0.00061% 干重)<sup>[835]</sup>, 樗叶花椒皮 *Zanthoxylum ailanthoides*, 飞龙掌血 *Toddalia asiatica* [Syn. *Toddalia aculeata*; *Paullinia asiatica*], 枸橘 *Poncirus trifoliata*, 花椒 *Zanthoxylum bungeanum* (干燥成熟果皮: 含量范围 = 0.0025%~0.0071%<sup>[1022]</sup>, 含量 = 0.005%<sup>[1025]</sup>), 花椒根 *Zanthoxylum bungeanum*, 九里香 *Murraya paniculata* [Syn. *Chalcas paniculata*], 青椒 *Zanthoxylum schinifolium* (干燥成熟果皮: 含量范围 = 0.0251%~0.0471%<sup>[1022]</sup>, 含

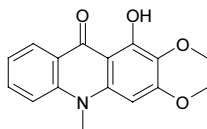
量 = 0.045%<sup>[1025]</sup>), 似肉托果叶蜜茱萸\* *Melicope semecarpifolia*, 香茵芋 *Skimmia japonica*, 茵芋 *Skimmia reevesiana*, 竹叶椒根 *Zanthoxylum planispinum*, *Sarcomelicope glauca*. 【文献】6, 8, 170, 835, 874, 979, 1022, 1025.



## 吡啶酮类生物碱

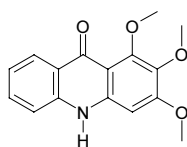
### 31 Arborinine 山小柑碱

[5489-57-6]  $C_{16}H_{15}NO_4$  (285.30). mp 175~176°C. 【类型】吡啶酮类生物碱. 【活性】抗组胺; 抗炎; 解痉. 【来源】臭草 *Ruta graveolens*. 【文献】6, 170.



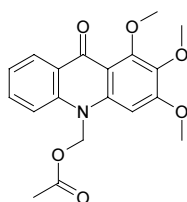
### 32 Toddaliopsin A

1,2,3-Trimethoxyacridone  $C_{16}H_{15}NO_4$  (285.30). 黄色玻璃体. 【类型】吡啶酮类生物碱. 【活性】抗炎 (化学发光方法,  $IC_{50} = 27.3\mu g/mL$ )<sup>[931]</sup>. 【来源】*Toddaliopsis bremekampii* (叶). 【文献】931.



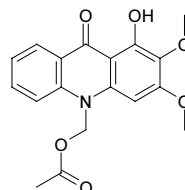
### 33 Toddaliopsin B

1,2,3-Trimethoxy-10-acetoxymethylacridone  $C_{19}H_{19}NO_6$  (357.37). 黄色玻璃体. 【类型】吡啶酮类生物碱. 【活性】抗炎 (化学发光方法,  $IC_{50} = 48.3\mu g/mL$ )<sup>[931]</sup>. 【来源】*Toddaliopsis bremekampii* (叶). 【文献】931.



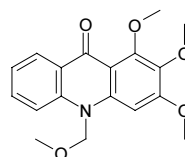
### 34 Toddaliopsin C

1-Hydroxy-2,3-dimethoxy-10-acetoxymethylacridone  $C_{18}H_{17}NO_6$  (343.34). 黄色玻璃体. 【类型】吡啶酮类生物碱. 【活性】抗炎 (化学发光方法,  $IC_{50} = 4.21\mu g/mL$ )<sup>[931]</sup>. 【来源】*Toddaliopsis bremekampii* (叶). 【文献】931.



### 35 Toddaliopsin D

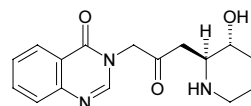
1-2,3-Trimethoxy-10-methoxymethylacridone  $C_{18}H_{19}NO_5$  (329.36). 黄色玻璃体. 【类型】吡啶酮类生物碱. 【活性】抗炎 (化学发光方法,  $IC_{50} = 79.1\mu g/mL$ )<sup>[931]</sup>. 【来源】*Toddaliopsis bremekampii* (叶). 【文献】931.



## 1.3 喹啉类生物碱

### 36 $\beta$ -Dichroine 黄常山碱乙 ( $\beta$ -常山碱)

Febrivugine [24159-07-7]  $C_{16}H_{19}N_3O_3$  (301.35). mp 139~140°C. 【类型】喹啉类生物碱. 【活性】抗疟疾 (阿米巴); 退热剂; 子宫兴奋剂 (麻醉犬 *in vivo*, 怀孕兔或大鼠, *in vitro*); 催吐剂;  $LD_{50}$  (鼠, orl) = 2.5~3.0mg/kg. 【来源】常山 *Dichroa febrifuga*. 【文献】170.

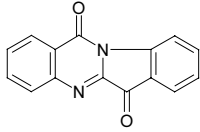


### 37 Tryptanthrine 色胺酮

[13220-57-0]  $C_{15}H_8N_2O_2$  (248.24). 【类型】喹啉类生物碱. 【活性】抗菌 (枯草杆菌, MIC = 25 $\mu g/mL$ , 多种杆菌); 抗真菌 (多种发癣菌, MIC = 3.1 $\mu g/mL$ , 皮真菌); 抗炎 (抑制前列腺素和白三烯的合成; iNOS

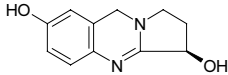


抑制剂)<sup>[873]</sup>。【来源】板蓝根 *Isatis indigotica*, 大青叶 *Isatis indigotica*, 蓼蓝果 *Polygonum tinctorium*, 马蓝根 *Baphicacanthus cusia* [Syn. *Strobilanthes cusia*], 欧州菘蓝 *Isatis tinctoria*, 欧州菘蓝 *Isatis tinctoria* (叶)。【文献】2, 170, 171, 866, 873, 878。



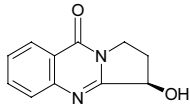
### 38 Vasicinol 鸭嘴花醇碱

[5081-51-6]  $C_{11}H_{12}N_2O_2$  (204.23). mp 260°C. 【类型】喹啉类生物碱。【活性】抗高血压; 降低昆虫生育能力; 抗组胺; 胆碱酯酶抑制剂; 昆虫拒食剂。【来源】大驳骨 *Adhatoda vasica*, 黄花仔 *Sida cordifolia*。【文献】6, 170。



### 39 Vasicinone 鸭嘴花碱酮

*L*-Vasicinone; (*R*)-2,3-Dihydro-3-hydroxy-pyrrolo[2,1-*b*]quinazolin-9(*1H*)-one [486-64-6]  $C_{11}H_{10}N_2O_2$  (202.21). mp (-) 200~201°C, (±) 211~212°C. 【类型】喹啉类生物碱。【活性】抗过敏; 解痉 (豚鼠, 组胺所致支气管收缩)。【来源】大驳骨 *Adhatoda vasica*, 黄花仔 *Sida cordifolia*, 骆驼蒿 *Peganum nigellastrum*, 骆驼蓬 *Peganum harmala*, 骆驼蓬子 *Peganum harmala*。【文献】6, 170。



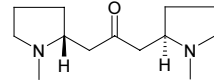
## 1.4 吡咯烷类生物碱

### 吡咯烷生物碱

#### 40 Cuscohygrine 红古豆碱 (古柯液碱; 颠茄定)

Bellaradine; Cuscohygrine [454-14-8]  $C_{13}H_{24}N_2O$  (224.35). bp 169~170°C (23mmHg), 溶于乙醇、乙醚、苯<sup>[1024]</sup>。【类型】吡咯烷生物碱。【活性】抗过敏 (鼠, 2,4-二硝基氟代苯引起的)。【来源】莨菪子 *Hyoscyamus niger*, 毛曼陀罗叶 *Datura innoxia*, 欧曼陀罗根 *Datura stramonium*, 泡囊草 *Physoclaina physaloides*, 赛莨菪 *Anisodus*

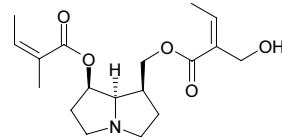
*luridus*, 三分三 *Scopolia acutangula* [Syn. *Anisodus acutangulus*], 藏茄 *Anisodus tanguticus* [Syn. *Scopolia tangutica*], 颠茄 *Atropa belladonna*, 古柯 *Erythroxylum coca*, 棘旋花\* *Convolvulus erinaceus*。【文献】6, 170, 171, 1024。



### 吡咯烷士定生物碱

#### 41 Sarracine 瓶千里光碱

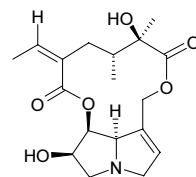
[2492-09-3]  $C_{18}H_{27}NO_5$  (337.42). mp 45~46°C, 51~52°C. 【类型】吡咯烷士定生物碱。【活性】抗高血压; 抗胆碱能的 (抑制乙酰胆碱); 解痉 (减轻豚鼠和大鼠的肠道痉挛); 抗溃疡, 用于治疗胃溃疡 (前苏联曾使用); 对中枢神经系统有双向作用 (先兴奋后抑制)。【来源】大白顶草 *Senecio oryzetorum*, 黄菀 *Senecio nemorensis*, 瓶千里光 *Senecio sarracenicus*, 野生千里光\* *Senecio sylvaticus*。【文献】5, 6, 170。



### 吡咯烷士定生物碱(大环内酯)

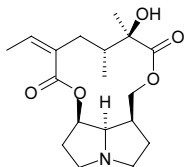
#### 42 Crotalaburnine 野百合宁

Anacrotine [5096-49-1]  $C_{18}H_{25}NO_6$  (351.40). 水合物: 褐色针状晶体 (甲醇, mp 180°C (生泡)。【类型】吡咯烷士定生物碱(大环内酯)。【活性】抗炎 [大鼠, 角叉菜胶或透明质酸酶引起的棉塞肉芽肿模型, 20mg/(kg·d) sc, 6d]。【来源】金链花猪屎豆 *Crotalaria laburnifolia*, 光叶猪屎豆 *Crotalaria incana*, 美洲野百合 *Crotalaria anagyroides*。【文献】172。

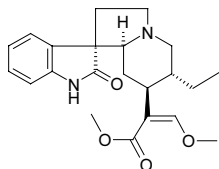


**43 Platyphylline 阔叶千里光碱**

[480-78-4]  $C_{18}H_{27}NO_5$  (337.42). 针状晶体 (水), mp 129°C, mp 124~125°C,  $[\alpha]_D = -56^\circ$  (三氯甲烷),  $[\alpha]_D = -59^\circ$  (甲醇). 【类型】吡咯烷士定生物碱(大环内酯). 【活性】抗胆碱能的; 抗溃疡 (用于治疗消化道溃疡). 【来源】大白顶草 *Senecio oryzetorum*, 大头囊吾 *Ligularia japonica* [Syn. *Arnica japonica*; *Senecio japonica*], 狗舌草 *Tephrosia kirilowii* [Syn. *Senecio integrifolius* var. *fauriei*], 宽叶千里光 *Senecio platyphyllus*, 平滑蜂斗菜\* *Petasites laevigatus*, 贴生千里光\* *Senecio adnatus*, 药用倒提壶 *Cynoglossum officinale*, 千里光属 *Senecio* spp. 【文献】6, 170, 273, 489, 533.

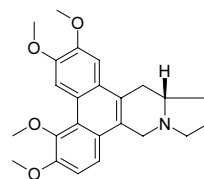
**吲哚里西定生物碱****44 Isorhynchophylline 异钩藤碱**

7-Isorhynchophylline [6859-01-4]  $C_{22}H_{28}N_2O_4$  (384.48). mp 138~141°C,  $[\alpha]_D^{24} = +7.8^\circ$  ( $c = 0.42$ , 三氯甲烷). 【类型】吲哚里西定生物碱. 【活性】抗高血压 (持续); 血管扩张剂 (松弛血管及降低心肌氧消耗); 减慢心率 (麻醉兔, 抑制心脏传导功能); 钙拮抗 (电位依赖性); 免疫增强 (提高吞噬细胞的功能). 【来源】钩藤 *Uncaria rhynchophylla* [Syn. *Nauclea rhynchophylla*] (带钩茎枝: 含量 = 0.049%), 大叶钩藤 *Uncaria macrophylla*, 华钩藤 *Uncaria sinensis*. 【文献】2, 6, 171, 184, 273, 1022.

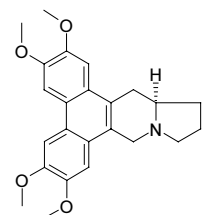
**菲并吲哚里西定生物碱****45 Tylocrebrine 密花娃儿藤碱**

$C_{24}H_{27}NO_4$  (393.49). mp (-) 218~220°C (分解). 【类型】

菲并吲哚里西定生物碱. 【活性】抗肿瘤 (*L*-异娃山藤碱, 腺癌 755, 淋巴管肉瘤, KB, P<sub>388</sub> 和 L<sub>1210</sub>); 抗阿米巴药; 毒素 (人); 发泡剂. 【来源】密花娃儿藤 *Tylophora crebriflora*, 娃儿藤 *Tylophora floribunda*. 【文献】6, 170.

**46 Tylophorine 娃儿藤碱**

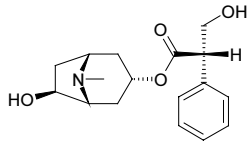
[482-20-2]  $C_{24}H_{27}NO_4$  (393.49). mp 292°C (分解). 【类型】菲并吲哚里西定生物碱. 【活性】抗肿瘤; 抑制蛋白质生物合成; 抗炎 (大鼠, 角叉菜胶引起的足肿胀模型, 棉塞肉芽肿模型); 中枢镇静; 毒素 (对蛙毒性高, 对其他动物毒性低); 用于治疗气管炎和痢疾. 【来源】腐叶榕\* *Ficus septica*, 密花娃儿藤 *Tylophora crebriflora*, 娃儿藤 *Tylophora floribunda*, 药用白前 *Vincetoxicum officinale* [Syn. *Cynanchum vincetoxicum*], 印度娃儿藤 *Tylophora asthmatica* [Syn. *Tylophora indica*]. 【文献】4, 170.

**莨菪烷类生物碱****47 Anisodamine 山莨菪碱**

[17659-49-3]  $C_{17}H_{23}NO_4$  (305.38). mp 84.5~85.5°C. 【类型】莨菪烷类生物碱. 【活性】抗心律失常; 抗胆碱能的; 止痛; 解痉 (血管); 抗溃疡; 血小板聚集抑制剂; 平滑肌松弛剂 (胃、十二指肠、胆道). 【来源】莨菪子(天仙子) *Hyoscyamus niger* (干燥成熟种子: 5产地平均含量 = 0.0447%<sup>[1025]</sup>), 洋金花(白曼陀罗) *Datura metel* (花: 3产地含量范围 = 0.005%~0.027%, 平均含量 = 0.017%<sup>[1025]</sup>), 藏茄(山莨菪) *Anisodamus tanguticus* [Syn. *Scopolia tangutica*] (根: 3产地含量范

围 = 0.036%~0.088%，平均含量 = 0.061%<sup>[1025]</sup>。

【文献】4, 6, 170, 1025。

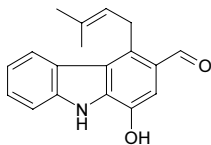


## 1.5 吲哚类生物碱

### 咪唑类生物碱

#### 48 Clausine D 山黄皮碱 D

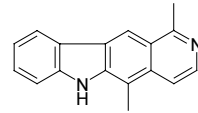
1-Hydroxy-4-(3-methyl-2-butenyl)-9H-carbazole-3-carboxaldehyde [142846-95-5] C<sub>18</sub>H<sub>17</sub>NO<sub>2</sub> (279.34). 【类型】咪唑类生物碱。【活性】血小板聚集抑制剂 (兔, 花生四烯酸诱导的血小板聚集, 1μg/mL, 抑制率 = 53%, IC<sub>50</sub> = 9.0μmol/L, 胶原诱导的血小板聚集, 10μg/mL 抑制率 = 66%, IC<sub>50</sub> = 58.9μmol/L); 抑制血栓素 A<sub>2</sub> 的形成; 解痉 (抑制由 KCl+CaCl<sub>2</sub> 诱导的大鼠主动脉收缩, 抑制率 = 21.5%)。【来源】山黄皮 *Clausena excavata*。【文献】176, 317, 318。



### 吡啶并咪唑类生物碱

#### 49 Olivacine 褐绿白坚木碱

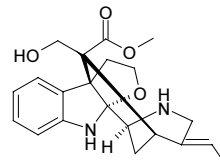
Guatambuine [484-49-1] C<sub>17</sub>H<sub>14</sub>N<sub>2</sub> (246.31). mp 317~325°C. 【类型】吡啶并咪唑类生物碱。【活性】抗肿瘤 (对人肿瘤作用强, 小鼠 L<sub>1210</sub> ip, 25mg/kg 隔日腹腔注射或 50mg/kg 每日腹腔注射, 生命延长率 = 89%~229%); 驱肠虫剂, 抑制蛋白质生物合成 (克氏锥虫, 短膜虫期); 抗风湿剂; 抗溃疡。【来源】白坚木 *Aspidosperma campus-belus*, 褐绿白坚木 *Aspidosperma olivaceum*, 黑白坚木\* *Aspidosperma nigricans*。【文献】5, 170。



### 阿枯米林类生物碱

#### 50 Aspidodasycarpine 粗毛果白坚木碱

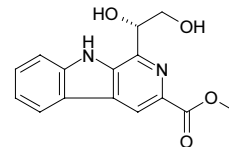
[2744-47-0] C<sub>21</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub> (370.45). 【类型】阿枯米林类生物碱。【活性】退热剂。【来源】粗毛果白坚木 *Aspidosperma dasycarpon*, 尖白坚木\* *Aspidosperma cuspa*。【文献】170。



### β-咪啉类生物碱

#### 51 Dichotomine C 银柴胡碱 C\*

C<sub>15</sub>H<sub>14</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub> (286.29). 黄色粉末, [α]<sub>D</sub><sup>27</sup> = -16.6° (c = 0.50, 甲醇)。【类型】β-咪啉类生物碱。【活性】β-己糖胺酶释放抑制剂 (RBL-2H3 细胞, IC<sub>50</sub> = 62μmol/L)<sup>[830]</sup>; TNF-α 释放抑制剂 (RBL-2H3 细胞, 抗原 IgE 介导的, IC<sub>50</sub> = 19μmol/L)<sup>[830]</sup>; IL-4 释放抑制剂 (RBL-2H3 细胞, 抗原 IgE 介导的, IC<sub>50</sub> = 15μmol/L)<sup>[830]</sup>。【来源】银柴胡 *Stellaria dichotoma* var. *lanceolata* (根: 产率 = 0.0016% 干重)。【文献】830。

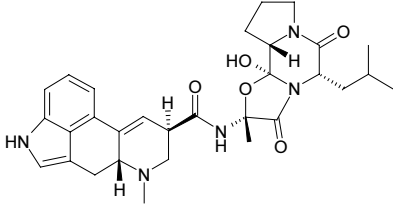


### 麦角类生物碱

#### 52 Ergosine 麦角生碱

[561-94-4] C<sub>30</sub>H<sub>37</sub>N<sub>5</sub>O<sub>5</sub> (547.66). mp 228°C (分解)。【类型】麦角类生物碱。【活性】抗炎 (大鼠, 5-HT 和角叉菜胶引起的足肿胀模型); 5-羟色胺受体阻断剂 (豚鼠子宫 *in vitro*); 肾上腺素能 α-受体阻断剂 (豚鼠

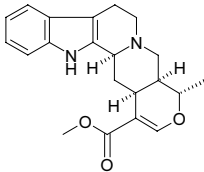
睾丸 *in vitro*); 收缩血管和升高血压 (猫, *iv*); 抗生育药 (大鼠, *sc*); 抑制释放催乳激素; 催产剂 (兔子宫 *iv*, *in vivo*); 类似麦角胺样作用。【来源】麦角 *Claviceps purpurea*。【文献】6, 170。



## Strictosidine 类生物碱

### 53 Tetrahydroalstonine 四氢鸭脚木碱

(3 $\alpha$ )-3,4,5,6-Tetrahydroalstonine C<sub>21</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>3</sub> (352.44). 白色晶体, mp 300~310°C, [ $\alpha$ ]<sub>D</sub><sup>23.2</sup> = -106.77° (*c* = 0.48, 三氯甲烷)。【类型】Strictosidine 类生物碱。【活性】抗菌 (40 种细菌和真菌); 抗炎 (大鼠, 角叉菜胶引起的足肿胀模型, 125mg/kg *orl*); 降血糖 (大鼠, 四氧嘧啶引起的高血糖, 125mg/kg *orl*); 用于治疗脑血栓和动脉粥样硬化; 血管扩张剂 (脑和外周血管)。【来源】长春花 *Catharanthus roseus* [Syn. *Vinca rosea*; *Lochera rosea*], 催吐萝芙木 *Rauvolfia vomitoria*, 象皮木 *Alstonia scholaris*, 羊角棉 *Alstonia mairei*, 有限鸭脚树 *Alstonia restricta*。【文献】4, 163, 170, 171。

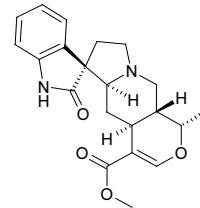


## 类阿吗碱类生物碱

### 54 Isomitraphylline 异帽柱木非灵\*

C<sub>21</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub> (368.44)。【类型】类阿吗碱类生物碱。【活性】免疫刺激剂 (作用机制可能是提高人粒细胞和巨噬细胞的噬菌作用和阻断骨髓细胞增殖)<sup>[940]</sup>。【来源】白钩藤 *Uncaria sessilifructus* [Syn. *Nauclea sessilifructus*], 北越钩藤 *Uncaria homomalla* [Syn. *Uruparia homomalla*; *Uruparia tonkinensis*; *Uruparia*

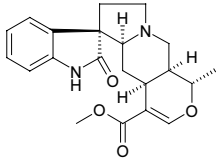
*lanosa* var. *parviflora*], 秘鲁钩藤\* *Uncaria tomentosa*, 长花钩藤\* *Uncaria longiflora*, 东方钩藤\* *Uncaria orientalis*, 短绒毛钩藤\* *Uncaria velutina*, 非洲钩藤\* *Uncaria africana*, 圭亚那钩藤 *Uncaria guianensis*, 厚叶钩藤\* *Uncaria callophylla*, 毛钩藤 *Uncaria hirsuta*, 绵毛钩藤\* *Uncaria lanosa*, 攀枝钩藤 *Uncaria scandens* [Syn. *Nauclea pilosa*; *Uruparia pilosa*; *Uncaria pilosa*], 披针叶钩藤\* *Uncaria lancifolia*, 平滑发亮钩藤\* *Uncaria laevigata*, 椭圆钩藤 *Uncaria elliptica*, 钩藤属 *Uncaria bernaysii*, 钩藤属 *Uncaria perrottetii*, 钩藤属 *Uncaria sterrophylla*。【文献】940。



### 55 Isopteropodine 异翅柄钩藤碱 (钩藤碱 E\*)

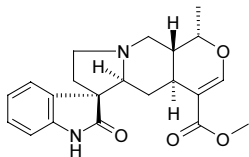
Uncarine E [5171-37-9] C<sub>21</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub> (368.43). mp 204~209°C, [ $\alpha$ ]<sub>D</sub><sup>24</sup> = -85.1° (*c* = 0.554, 三氯甲烷)。【类型】类阿吗碱类生物碱。【活性】细胞毒 (SK-MEL, IC<sub>50</sub> > 50 $\mu$ g/mL, 对照多柔比星(阿霉素), IC<sub>50</sub> < 1.1 $\mu$ g/mL; SK-OV-3, IC<sub>50</sub> > 50 $\mu$ g/mL, 阿霉素, IC<sub>50</sub> = 1.9 $\mu$ g/mL; KB, BT549, Vero, 无活性)<sup>[914]</sup>; 细胞毒 (SK-MEL, KB, BT549, SK-OV-3 和 Vero 细胞株)<sup>[940]</sup>; 细胞毒 (哺乳动物细胞, IC<sub>50</sub> = 17~51 $\mu$ g/mL)<sup>[940]</sup>; 细胞毒及 DNA 损害活性 (RS321 酵母试验, IC<sub>12</sub> = 140 $\mu$ g/mL; RS322 酵母试验, IC<sub>12</sub> = 120 $\mu$ g/mL)<sup>[940]</sup>; 免疫刺激剂 (作用机制可能是提高人粒细胞和巨噬细胞的噬菌作用和阻断骨髓细胞增殖)<sup>[940]</sup>; 中枢神经系统活性 (上调 5-HT<sub>2</sub> 受体和蕈毒碱 M1 受体)<sup>[940]</sup>。【来源】北越钩藤 *Uncaria homomalla* [Syn. *Uruparia homomalla*; *Uruparia tonkinensis*; *Uruparia lanosa* var. *parviflora*], 秘鲁钩藤\* *Uncaria tomentosa*, 长花钩藤\* *Uncaria longiflora*, 东方钩藤\* *Uncaria orientalis*, 短绒毛钩藤\* *Uncaria velutina*, 钩藤 *Uncaria rhynchophylla* [Syn. *Nauclea rhynchophylla*], 圭亚那钩藤 *Uncaria guianensis*, 华钩藤 *Uncaria sinensis*, 绵毛钩藤\* *Uncaria lanosa*, 攀枝钩藤 *Uncaria scandens* [Syn. *Nauclea*

*pilosa*; *Uruparia pilosa*; *Uncaria pilosa*], 平滑发亮钩藤\* *Uncaria laevigata*, 钩藤属 *Uncaria bernaysii*, 钩藤属 *Uncaria donisii*, 钩藤属 *Uncaria roxburghiana*, 钩藤属 *Uncaria sterrophylla*. 【文献】171, 184, 914, 940.



### 56 Mitraphylline 帽柱木非灵

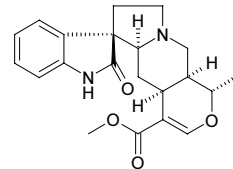
[509-80-8]  $C_{21}H_{24}N_2O_4$  (368.44). 【类型】类阿吗碱类生物碱. 【活性】抗高血压<sup>[170]</sup>; 免疫刺激剂 (作用机制可能是提高人粒细胞和巨噬细胞的噬菌作用和阻断骨髓细胞增殖)<sup>[940]</sup>. 【来源】白钩藤 *Uncaria sessilifructus* [Syn. *Nauclea sessilifructus*], 北越钩藤 *Uncaria homomalla* [Syn. *Uruparia homomalla*; *Uruparia tonkinensis*; *Uruparia lanosa* var. *parvifora*], 秘鲁钩藤\* *Uncaria tomentosa*, 长春花 *Catharanthus roseus* [Syn. *Vinca rosea*; *Lochera rosea*], 长花钩藤\* *Uncaria longiflora*, 川上流弥钩藤\* *Uncaria kawakamii*, 大叶帽柱木 *Mitragyna macrophylla*, 东方钩藤\* *Uncaria orientalis*, 短绒毛钩藤\* *Uncaria velutina*, 儿茶钩藤 *Uncaria gambir*, 非洲钩藤\* *Uncaria africana*, 圭亚那钩藤 *Uncaria guianensis*, 厚叶钩藤\* *Uncaria callophylla*, 毛钩藤 *Uncaria hirsuta*, 绵毛钩藤\* *Uncaria lanosa*, 攀枝钩藤 *Uncaria scandens* [Syn. *Nauclea pilosa*; *Uruparia pilosa*; *Uncaria pilosa*], 披针叶钩藤\* *Uncaria lancifolia*, 平滑发亮钩藤\* *Uncaria laevigata*, 椭圆钩藤 *Uncaria elliptica*, 狭钩藤 *Uncaria attenuata*, 钩藤属 *Uncaria bernaysii*, 钩藤属 *Uncaria perrottetii*, 钩藤属 *Uncaria sterrophylla*, 存在于许多植物中. 【文献】2, 170, 940.



### 57 Pteropodine 翅柄钩藤碱

Uncarine C [5629-60-7]  $C_{21}H_{24}N_2O_4$  (368.43). 白色针

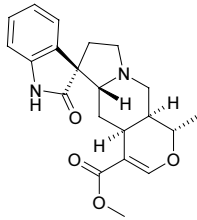
状晶体,  $[\alpha]_D^{17} = -123.8^\circ$  (三氯甲烷). 【类型】类阿吗碱类生物碱. 【活性】提高吞噬细胞的功能 (*in vitro*)<sup>[184]</sup>; 细胞毒 (SK-MEL、KB、BT549、SK-OV-3 和 Vero 细胞株)<sup>[940]</sup>; 细胞毒 (哺乳动物细胞,  $IC_{50} = 17\sim 51\mu\text{g/mL}$ )<sup>[940]</sup>; 细胞毒及 DNA 损害活性 (RS321 酵母试验,  $IC_{12} = 140\mu\text{g/mL}$ ; RS322 酵母试验,  $IC_{12} = 120\mu\text{g/mL}$ )<sup>[940]</sup>; 免疫刺激剂 (作用机制可能是提高人粒细胞和巨噬细胞的噬菌作用和阻断骨髓细胞增殖)<sup>[940]</sup>; 中枢神经系统活性 (上调 5-HT<sub>2</sub> 受体和蕁毒碱 M1 受体)<sup>[940]</sup>. 【来源】北越钩藤 *Uncaria homomalla* [Syn. *Uruparia homomalla*; *Uruparia tonkinensis*; *Uruparia lanosa* var. *parvifora*], 秘鲁钩藤\* *Uncaria tomentosa*, 长花钩藤\* *Uncaria longiflora*, 东方钩藤\* *Uncaria orientalis*, 短绒毛钩藤\* *Uncaria velutina*, 钩藤 *Uncaria rhynchophylla* [Syn. *Nauclea rhynchophylla*], 圭亚那钩藤 *Uncaria guianensis*, 华钩藤 *Uncaria sinensis*, 绵毛钩藤\* *Uncaria lanosa*, 攀枝钩藤 *Uncaria scandens* [Syn. *Nauclea pilosa*; *Uruparia pilosa*; *Uncaria pilosa*], 钩藤属 *Uncaria bernaysii*, 钩藤属 *Uncaria donisii*, 钩藤属 *Uncaria perrottetii*, 钩藤属 *Uncaria roxburghiana*, 钩藤属 *Uncaria sterrophylla*. 【文献】184, 940.



### 58 Uncarine D 钩藤碱 D

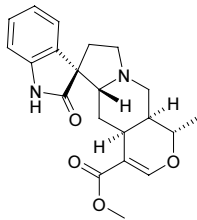
Speciophylline [4697-68-1]  $C_{21}H_{24}N_2O_4$  (368.44). 【类型】类阿吗碱类生物碱. 【活性】细胞毒 (SK-MEL,  $IC_{50} = 30\mu\text{g/mL}$ , 对照阿霉素,  $IC_{50} < 1.1\mu\text{g/mL}$ ; KB,  $IC_{50} = 35\mu\text{g/mL}$ , 阿霉素,  $IC_{50} = 1.7\mu\text{g/mL}$ ; BT549,  $IC_{50} = 34\mu\text{g/mL}$ , 阿霉素,  $IC_{50} = 2.0\mu\text{g/mL}$ ; SK-OV-3,  $IC_{50} = 30\mu\text{g/mL}$ , 阿霉素,  $IC_{50} = 1.9\mu\text{g/mL}$ ; Vero,  $IC_{50} = 39\mu\text{g/mL}$ , 阿霉素,  $IC_{50} > 10\mu\text{g/mL}$ )<sup>[914]</sup>; 细胞毒 (SKMEL、KB、BT549、SK-OV-3 和 Vero 细胞株,  $IC_{50} = 30\sim 40\mu\text{g/mL}$ )<sup>[940]</sup>; 免疫刺激剂 (作用机制可能是提高人粒细胞和巨噬细胞的噬菌作用和阻断骨髓细胞增殖)<sup>[940]</sup>. 【来源】北越钩藤 *Uncaria homomalla* [Syn.

*Uruparia homomalla*; *Uruparia tonkinensis*; *Uruparia lanosa* var. *parviflora*], 秘鲁钩藤\* *Uncaria tomentosa*, 长花钩藤\* *Uncaria longiflora*, 东方钩藤\* *Uncaria orientalis*, 短绒毛钩藤\* *Uncaria velutina*, 圭亚那钩藤 *Uncaria guianensis*, 华钩藤 *Uncaria sinensis*, 绵毛钩藤\* *Uncaria lanosa*, 攀枝钩藤 *Uncaria scandens* [Syn. *Nauclea pilosa*; *Uruparia pilosa*; *Uncaria pilosa*], 平滑发亮钩藤\* *Uncaria laevigata*, 狭钩藤 *Uncaria attenuata*, 钩藤属 *Uncaria bernaysii*, 钩藤属 *Uncaria donisii*, 钩藤属 *Uncaria perrottetii*, 钩藤属 *Uncaria roxburghiana*, 钩藤属 *Uncaria sterrophylla*.  
【文献】914, 940.



**59 Uncarine F 钩藤碱 F**

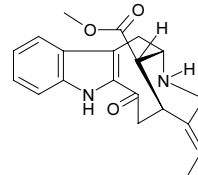
$C_{21}H_{24}N_2O_4$  (368.44). 【类型】类阿吗碱类生物碱。  
【活性】免疫刺激剂 (作用机制可能是提高人粒细胞和巨噬细胞的噬菌作用和阻断骨髓细胞增殖)<sup>[940]</sup>。  
【来源】白钩藤 *Uncaria sessilifructus* [Syn. *Nauclea sessilifructus*], 北越钩藤 *Uncaria homomalla* [Syn. *Uruparia homomalla*; *Uruparia tonkinensis*; *Uruparia lanosa* var. *parviflora*], 长花钩藤\* *Uncaria longiflora*, 东方钩藤\* *Uncaria orientalis*, 短绒毛钩藤\* *Uncaria velutina*, 华钩藤 *Uncaria sinensis*, 绵毛钩藤\* *Uncaria lanosa*, 攀枝钩藤 *Uncaria scandens* [Syn. *Nauclea pilosa*; *Uruparia pilosa*; *Uncaria pilosa*], 钩藤属 *Uncaria bernaysii*, 钩藤属 *Uncaria donisii*, 钩藤属 *Uncaria perrottetii*, 钩藤属 *Uncaria roxburghiana*, 钩藤属 *Uncaria sterrophylla*. 【文献】940.



**老刺木碱类生物碱**

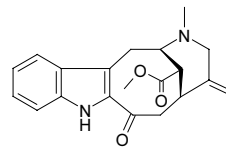
**60 Perivine 派利文碱**

[2673-40-7]  $C_{20}H_{22}N_2O_3$  (338.41). mp 218~221°C (分解)。【类型】老刺木碱类生物碱。【活性】抗高血压; 抗菌 (浓度 1.5%, 对人的 30 种病原菌抑菌实验有效率为 8/30); 止痛; 退热剂; 解痉; 细胞毒 (鼠,  $P_{388}$  *in vitro*,  $ED_{50} = 20\mu\text{g/mL}$ , KB *in vitro*,  $ED_{50} = 70\mu\text{g/mL}$ );  $LD_{50}$  (鼠, orl) = 145.9mg/kg,  $LD_{50}$  (鼠, sc) = 133.4 mg/kg,  $LD_{50}$  (鼠, iv) = 89.6mg/kg。【来源】长春花 *Catharanthus roseus* [Syn. *Vinca rosea*; *Lochera rosea*], 赫尔梯山马茶 *Tabernaemontana holstii*, 约翰司通山马茶 *Tabernaemontana johnstonii*, 纸质山马茶 *Tabernaemontana chartacea*. 【文献】4, 5, 170.



**61 Vobasine 老刺木碱**

[2124-83-0]  $C_{21}H_{24}N_2O_3$  (352.44)。【类型】老刺木碱类生物碱。【活性】止痛; 退热剂。【来源】海南狗牙花 *Ervatamia hainanensis*, 络石藤 *Trachelospermum jasminoides*, 夹竹桃科多种植物 family Apocynaceae spp. 【文献】170, 171.



**吴茱萸类生物碱**

**62 Rutaecarpine 吴茱萸次碱**

[84-26-4]  $C_{18}H_{13}N_3O$  (287.32). 针状晶体 (乙酸乙酯), mp 259.5~260.0°C, 256°C。【类型】吴茱萸类生物碱。【活性】抗高血压 [血管扩张剂, 活化 vanilloid 受体,