



TCM Series of Active Components

Enzyme Inhibitors in TCM

中药药理活性成分丛书

中药活性成分中的 酶抑制剂

周家驹 谢桂荣 严新建◎编著

科学出版社



TCM Series of Active Components

Enzyme Inhibitors in TCM

中药药理活性成分丛书

**中药活性成分中的
酶抑制剂**

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

中药活性成分中的酶抑制剂 / 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 978-7-03-033856-3

I. 中… II. ①周… ②谢… ③严… III. 酶-抑制剂-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 044715 号

责任编辑: 戚东桂 郑 红/责任校对: 钟 洋

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: 22 3/4

字数: 740 000

定价: 108.00 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中含有的几百种多靶标、多来源的活性成分,对此给出直观的事实证据。

和前述的工具书《中药原植物化学成分集》、《中药大全》相比,在信息内容收集和数据结构编排两方面,这套丛书又有一些新的重要进展。

在内容上,一是对所有近 8000 种活性成分都给出了明确详尽的结构类型,这是我们过去未曾做到的;二是对 700 多种常见中药活性成分都收集、整理,给出了在原植物中的含量数据,这些定量含量信息是系统阐明中药物质基础的基础数据;三是对《中药抗癌活性成分》和《中药抗寄生虫活性成分》这两个分册收集补充了 2010 年的最新数据。

在编排格式上,我们期望兼顾该套丛书的工具性和可读性两个方面,力求做到既具备工具书有便于进行各种途径检索查找的功能,又适合读者像阅读一般专业书那样进行顺畅的阅读。

在作为工具书时，每个分册正文后面的 5 个索引将起到重要作用。例如，从任一药理活性条目查找有关活性成分；从中药原植物的中文名称或拉丁学名查找其全部有关化学成分；从化合物中文或英文名称查找其结构、结构类型、天然来源、药理活性及其他相关信息等。

作为一般书籍，本丛书各分册也具有良好的可读性，因为各分册正文是按照结构类型划分章节的。例如，读者期望了解有抗癌作用的黄酮类化合物的情况，直接阅读《中药抗癌活性成分》第 3 章即可。因为只有化合物的结构是和各种性质密切相关的，按照结构类型划分章节就保证了书中位置相近者，其内容一定密切相关。

总之，同时实现上述两种属性的具体措施是：一方面以结构为“纲”划分章节，以活性为“目”详述各自的属性，便于读者把握结构和活性关系的总体特征，起到纲举目张的作用；另一方面，利用编者长期从事计算机化学和科学数据库研究，有构建化学信息体系的经验，编制了完整的索引集，实现了除结构检索以外的几乎所有类型的信息检索功能。最后，对于复杂纷纭的药理活性数据，建立并实现了一整套简单明确、易于掌握使用的规范化的方法，例如，200 多种癌细胞的 CCC 规范化代码。连同我们过去长期以来积累形成的用简化拉丁双名法表示中药原植物，用结构类型和立体化学分子结构图直观地表示化合物结构特征，用规范化格式精炼地定性或定量表达药理活性的方法等，对相关学科的核心信息全面实现了科学、精炼的表述。

期望这套《中药药理活性成分丛书》能以其简洁明快的表达方式向广大医药界、科学界及社会各界读者提供当前中药植物、化学、药理现代研究发展的总体概况，并对人们思考、探索、研究和实践“中药现代化”这一重大科学命题有所裨益。倘能如此，编者幸甚。

是为自序。

中国科学院过程工程研究所



2012 年 1 月于北京

体 例 说 明

本书正文是按照“结构为纲，活性为目”的格式框架编写的。我们以《天然产物字典》(Chapman & Hall, 1994)为基本依据，同时参照天然产物化学和中草药化学的相关书籍，建立了适用于中药化学信息的三层次结构类型表达体系。

该结构表达体系包括十三大类，在本丛书中，每一个大的类别各自成章。各章内容分别为生物碱、萜类、黄酮类、甾族化合物、脂肪族天然产物、聚酮化合物、含氧杂环、简单芳香化合物、多环芳香化合物、苯并呋喃和苯并吡喃类、香豆素类、木脂体和鞣质。对每一大类，又根据分子骨架结构特征或生源关系分为若干小类，各自成节。最后，对于数量巨大、结构类型繁多的生物碱和萜类化合物（以及少数脂肪族和芳香族天然产物），在每一小类中再细分为若干具体类型。这个三层次结构表达体系的优点是科学实用，简繁得当，容易掌握。对于研究或了解成千上万种天然产物的结构和活性的关系，能起到提纲挈领的作用，有时甚至有一目了然的效果。浏览本丛书任一分册的目录，就可以了解该结构表达体系的具体内容，在此不再赘述。

如果说上述的结构表达体系是“纲”，下面介绍的本书正文中的每一种化合物及其各种属性就是“目”，在英文写作的数据库和其他信息表达体系中称为“入口(entry)”。对每一个化合物入口，按顺序最多给出13项数据：分册中的化合物代码、英文名称、中文名称、英文别名、CAS登录号、分子式、相对分子质量、物理化学性质、结构类别、药理活性、天然来源、参考文献和该化合物的化学结构式。其中，化合物代码、英文名称、分子式、相对分子质量、结构类别、药理活性、天然来源、参考文献和结构式各项是必须有数据的非空项目，其他几项是根据原始文献尽量给出的可选项。应该指出，在看似复杂纷纭的诸多类别信息中，分子结构及其类型，规范化的药理活性，以及用中文名和拉丁名“捆绑”表达的天然来源这三项是最有价值的核心信息。

1. 化合物代码 即本分册正文中化合物的顺序号，用黑体给出，是一个非空项。在后面的五个索引中，也都是用化合物代码来代表化合物，从索引中查到化合物代码之后，就可方便地从正文部分查到该化合物的全部信息。

2. 化合物英文名 化合物英文名用黑体给出，首字母大写，是一个非空项。前缀中所用的 α -, β -, γ -, δ -, ϵ -, ξ -, ψ -……(+), (-), ($\pm$), *dl*-, *D*-, *L*-, *R*-, *S*-, *cis*-, *trans*-, *Z*-, *E*-, Δ (双键符号); *o*-, *m*-, *p*-, *O*-, *N*-, *S*-, *sec*-, *ter*-, *ent*-, *meso*-, *rel*-等符号均为斜体。但 *iso*-, *epi*-, *abeo*-, *seco*-, *nor*-等用正体。对极少数没有英文名的化合物，采用了一种可以自解释其原始参考文献来源的英文名称代码。

3. 化合物中文名 化合物中文名用黑体给出。对英文原始文献中的化合物没有中文名的，大部分都根据通用的规则给出了中文试用名。这些由本书编者给出的化合物中文名都加了星号标记*。

4. 化合物英文学名或别名 对多数化合物，本书只给出一个英文名，部分常见化合物给出了英文别名。

5. CAS 登录号 本书只对部分化合物给出了CAS登录号，表达在方括弧中。

6. 分子式 在化合物分子式中，各元素按国际上通用的Hill规则排序。

7. 相对分子质量 化合物相对分子质量表达在分子式之后的圆括弧中, 小数点后取两位数字。

8. 物理化学性质 收集的物理化学性质包括晶形、熔点、沸点、旋光等。

9. 结构类别 是一个非空项。用上述三层次结构表达体系的最后一个层次的结构类型表达, 在小标题【类型】后面给出。

10. 药理活性 是一个非空项。对每一入口化合物的药理活性实验数据, 在小标题【活性】后面给出。同一化合物有多项药理活性时, 各项数据平行排列, 用分号隔开。来自不同原始文献的同种药理活性数据一般不予合并。各项活性数据的出现先后顺序是随机的, 并不表示其重要性的顺序, 只有毒性数据 LD_{50} 等统一规定放最后。在每一项药理活性数据中, 按照下面的规范化的格式进行细节的描述: 药理项目名称 (关于该项药理性质的进一步描述, 实验对象, 定量活性数据, 对照物, 定量活性数据, 关于作用机制等的补充描述)。对于发表了实验数据但是未发现明显活性甚至没有活性的数据, 同样作为有价值的科学实验数据加以收集, 因此, 数据收集范围不仅包括活性成分, 也包括少量无活性成分, 这些无活性结果的表达格式是“活性条目+实验无活性”。这样的格式保证了在活性索引中无活性结果紧随在同一条目有活性结果之后, 便于读者查找相关信息。

11. 天然来源 对每一个化合物的中药原植物信息, 在小标题【来源】后面给出。在本书中, 绝大多数情况下天然来源是指原植物, 也有极少数情况下是动物或其他生物。为方便读者确认原植物物种, 对该化合物的每一种天然来源原植物都同时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里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顺序号。读者可根据这些顺序号从正文后面的“参考文献”部分查到原始文献的信息, 包括第一作者、期刊名称、卷、期、页号及年代等。参考文献采用两种方式标注。首先是对每一个活性化合物入口, 都在最后列出全部参考文献的编号。对那些近些年来发表的数据, 则同时在文中具体数据条目处再增加用方括弧表示的上标, 以便于读者查阅。

13. 化学结构式 化学结构及其类别是本书的核心信息。其立体化学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 1855 种中药原植物及其同属植物的小分子活性成分 973 种,都是某种酶的抑制剂。全书引用参考文献 975 篇,文献收集年代至 2004 年。

为了反映这 973 种中药活性成分的活性谱全貌,除酶的抑制活性外,当该成分同时还有其他药理活性时也一并收集。

酶是有高效、特异生物催化作用的蛋白,在细胞和生物体内种类繁多,各司其职,无处不在。我们收集中药活性成分中的各种酶抑制剂编成一册,是期望在分子水平上对天然产物中酶抑制剂的药理研究现状有一个总体的认识(加上对细胞因子研究现状的总体的认识),为逐步建立一个在细胞和分子水平上能研究生物信号网络的实验资料平台作一些准备。

和其他类型的药理活性一样,迄今为止,人们对酶抑制剂的研究是很不均衡的,只对少数类别做过较详细的研究。在本丛书其他分册中的导言部分,作为实例叙述过的酶抑制剂有:①有抗癌活性的拓扑异构酶抑制剂和芳化酶抑制剂;②有抗 AIDS 活性的反转录酶抑制剂和蛋白酶抑制剂;③有抗炎活性的磷脂酶 A₂ 抑制剂、环氧合酶抑制剂、5-脂氧合酶抑制剂、15-脂氧合酶抑制剂和 12-脂氧合酶抑制剂;④作为有正性肌力作用和扩张血管作用的抗心衰药物的 cAMP 磷酸二酯酶抑制剂;⑤有抗抑郁活性的单胺氧化酶抑制剂和治疗阿尔茨海默病的中枢胆碱酯酶抑制剂;⑥有抗哮喘活性的磷酸二酯酶选择性抑制剂。

下文概述几种数据较为丰富的酶抑制剂。

防治糖尿病性白内障的醛糖还原酶抑制剂

醛糖还原酶是多元醇途径的关键酶,催化葡萄糖还原为山梨糖醇,山梨糖醇在细胞内积累使人容易发生糖尿病性白内障并发症。醛糖还原酶抑制剂能阻止过多糖醇的生成,维持晶状体内正常渗透压和生理功能,是防治糖尿病性白内障的药物。

本书收集的有醛糖还原酶抑制活性的化合物数量较多,反映了该体系受到人们较多的关注,其中 IC₅₀ 值小于 1μmol/L 的高活性醛糖还原酶抑制剂有 2"-乙酰基槲皮苷(360, IC₅₀ = 0.04μmol/L)、5,6,7,3',4'-五羟基-3-甲氧基黄酮(499, IC₅₀ = 0.058μmol/L)、丹参醇 A(225, IC₅₀ = 0.1μmol/L)、6-羟基木犀草素(389, IC₅₀ = 0.2μmol/L)、木犀草素(397, IC₅₀ = 0.45μmol/L)、异甘草苷(586, IC₅₀ = 0.72μmol/L)、刺槐苷(358, IC₅₀ = 0.75μmol/L)、杨梅苷 IV(446, IC₅₀ = 0.79μmol/L)、5,6,3',4'-四羟基-3,7-二甲氧基黄酮(523)、木犀草素-7-芸香糖苷(399)、丹参酚酸 A(811)、木犀草素-7-O-葡萄糖苷(378)和忍冬苦苷(396)。

防治糖尿病的 α-葡萄糖苷酶抑制剂

糖尿病和生活方式有密切关系,能触发很多并发症。在小肠中的 α-葡萄糖苷酶复合物涉及糖的吸收,其抑制剂限制碳水化合物的吸收,能抑制饭后高血糖,因此是防治糖尿病的候选化

合物。

本书收集的活性较高 α -葡萄糖苷酶抑制剂有来自佩兰的内消旋三羟基哌啶(82, $IC_{50} = 3.70\mu\text{mol/L}$)和三羟基哌啶(83, $IC_{50} = 1.88\mu\text{mol/L}$); 来自半边莲的半边莲碱 A(46, $IC_{50} = 6.7\mu\text{mol/L}$)和半边莲碱 B(47, $IC_{50} = 9.3\mu\text{mol/L}$); 来自喀麦隆药用植物 *Oriciopsis glaberrima* 的欧瑞西吡啶酮 C(41, $IC_{50} = 56\mu\text{mol/L}$)、欧瑞西吡啶酮 F(42, $IC_{50} = 34\mu\text{mol/L}$)和 1,3,5-三羟基-4-异戊烯基吡啶酮(43, $IC_{50} = 17\mu\text{mol/L}$); 来自云南菟丝子的类型VI的 α -葡萄糖苷酶抑制剂, 包括 7'-(3',4'-二羟基苯基)-N-[(4-甲氧基苯基)乙基]丙烯酰胺(88, $IC_{50} = 104\mu\text{mol/L}$)、7'-(4'-羟基,3'-甲氧基苯基)-N-[(4-丁基苯基)乙基]丙烯酰胺(90, $IC_{50} = 45.67\mu\text{mol/L}$)、2-(3-羟基-4-甲氧基苯基)-3,5-二羟基-7-O- β -D-吡喃葡萄糖苷-4H-1-苯并吡喃-4-酮(470, $IC_{50} = 0.24\text{mmol/L}$)和 6,7-二甲氧基-2H-1-苯并吡喃-2-酮(879, $IC_{50} = 0.44\text{mmol/L}$); 来自假连翘叶的 7-O- α -D-吡喃葡萄糖基-3,5-二羟基-3'-(4"-乙酰氧基-3"-甲基丁基)-6,4'-二甲氧基黄酮(469, $IC_{50} = 65.5\mu\text{mol/L}$)和(-)-6 β -羟基-5 β ,8 β ,9 β ,10 α -克罗-3,13-二烯-16,15-内酯-18-酸(218, $IC_{50} = 578\mu\text{mol/L}$); 来自桑实的 3 β ,6-外型-二羟基去甲茛菪烷(52, $IC_{50} = 33\text{mmol/L}$)、2 α ,3 β ,4 α -三羟基去甲茛菪烷(53, $IC_{50} = 15\text{mmol/L}$)、2 α ,3 β ,6-外型-三羟基去甲茛菪烷(54, $IC_{50} = 25\text{mmol/L}$)和来自桑枝的法哥明(79, $IC_{50} = 15\text{mmol/L}$, 对糖尿病小鼠有显著的降血糖作用); 来自车前等植物的 6-羟基木犀草素(389, $IC_{50} = 29\mu\text{mol/L}$), 来自黄花蒿的 5,6,7,3',4'-五羟基-3-甲氧基黄酮(499, $IC_{50} = 31\mu\text{mol/L}$); 常作为标准对照物的去氧野尻霉素(76, $IC_{50} = 0.3\text{mmol/L}$)。

降压的血管紧张素转化酶(ACE)抑制剂

ACE 抑制剂是竞争性抑制剂, 导致无生理活性的血管紧张素 I 不能转换为有生理活性的血管紧张素 II, 血管紧张素 II 水平降低后血管平滑肌舒张、血压下降, 故临床上 ACE 抑制剂是降压药物。本书收集的有灵芝中的高活性 ACE 抑制剂灵芝-8-烯酸 F(273), 其 IC_{50} 值为 4.7 $\mu\text{mol/L}$, 平贝母和其他贝母中的 ACE 抑制剂浙贝甲素(116)、贝母宁碱(117)和贝母辛碱(139), 其 IC_{50} 值在 165 $\mu\text{mol/L}$ ~527 $\mu\text{mol/L}$; 红筷子中的槲皮素-3-O-(6"-没食子酰基)-半乳糖苷(507)、槲皮素-3-O-葡萄糖醛酸苷(512)和 Oenothrin B(961), 其 IC_{50} 值分别为 160 $\mu\text{mol/L}$ 、200 $\mu\text{mol/L}$ 和 250 $\mu\text{mol/L}$; 另外, 异槲皮苷(473)和金丝桃苷(471)也都是 ACE 抑制剂。

黄嘌呤氧化酶抑制剂

黄嘌呤氧化酶 Xanthine oxidase(XO)是核苷酸的分解代谢酶, 催化次黄嘌呤为黄嘌呤再氧化为尿酸, 增加氧自由基 O_2^- 超氧阴离子的产生, 导致内皮功能障碍。XO 抑制剂能改善心衰病人的血管内皮功能, 降低氧化应激标志物丙二醛, 用于高尿酸血症、痛风、血液恶性肿瘤和心衰。

本书收集的活性较高的黄嘌呤氧化酶抑制剂有槲皮素-4'-O- β -D-吡喃葡萄糖-6"-没食子酸盐(508, $IC_{50} = 1.3\mu\text{mol/L}$)、槲皮素-4'-葡萄糖苷(511, $IC_{50} = 1.3\mu\text{mol/L}$)、木犀草素-4'-O-葡萄糖苷(398, $IC_{50} = 2.0\mu\text{mol/L}$)、异马钱子碱氮氧化物(73, $IC_{50} = 13.3\mu\text{mol/L}$)、金圣草(黄)素(375,

IC₅₀ = 14.0 μmol/L)、3-(3,4-二羟基苯基)-2-丙酸(Z,E)-2-(3,4-二羟基苯基)乙烯基酯(740, IC₅₀ = 0.021 μg/mL)、3-(3,4-二羟基苯基)-2-丙酸(Z,E)-2-(3,5-二羟基苯基)乙烯基酯(741, IC₅₀ = 0.124 μg/mL)、1,2,3,6-四-O-没食子酰-β-D-葡萄糖(968, IC₅₀ = 0.63 μg/mL)、黄芩素(372, 作用强)、汉黄芩素(422, 作用强)、原矢车菊素 C₁-3,3',3''-三-O-没食子酸酯(970, 同时也是过氧化阴离子清除剂)。

抑制黑色素生物合成的酪氨酸酶抑制剂

酪氨酸酶 Tyrosinase (EC 1.14.18.1)是一种多功能的含铜的酶,广泛存在于动植物中,它催化氧化各种单酚、邻二酚和邻醌,是黑色素生物合成过程中的关键酶。因此,酪氨酸酶抑制剂在临床用于处理某些与色素沉着过多有关的皮肤病,也用于化妆品工业。

本书收集的活性较高的酪氨酸酶抑制剂有:①来自苦参的系列化合物苦参查耳酮(587, IC₅₀ = 0.6 μmol/L; IC₅₀ = 1.1 μmol/L)、苦参酮(439, IC₅₀ = 1.3 μmol/L)、去甲苦参醇(404, IC₅₀ = 2.1 μmol/L)、苦参醇(394, IC₅₀ = 10.6 μmol/L)、苦参新醇 N(538, IC₅₀ = 21 μmol/L)、苦参醇 A(533, IC₅₀ = 36.9 μmol/L)、苦参新醇 M(537, IC₅₀ = 37.5 μmol/L)、苦参新醇 B(440, IC₅₀ = 38.3 μmol/L)、苦参新醇 H(534, IC₅₀ = 40.0 μmol/L)、苦参新醇 L(536, IC₅₀ = 43.3 μmol/L)、苦参黄烷酮 G(456, IC₅₀ = 44.7 μmol/L)和苦参新醇 E(441, IC₅₀ = 55.4 μmol/L);②来自高黄绿桑的高黄绿桑素(796, IC₅₀ = 1.3 μmol/L);③来自漆斑菌属 *Myrothecium* sp. 的 6-正-戊基-α-吡喃酮(694, IC₅₀ = 0.8 μmol/L)和漆斑菌酮 A(91, IC₅₀ = 6.6 μmol/L);④来自阿富汗杜鹃花等植物的 8'-表-黄花菜木脂素 A(947, IC₅₀ = 1.33 μmol/L)、黄花菜木脂素 C(877, IC₅₀ = 15.7 μmol/L)和黄花菜木脂素 A(876, IC₅₀ = 18.7 μmol/L);⑤来自分枝珀菊的 2β(2S)-羟基-7(E)-三十三烯酸甲酯(652, IC₅₀ = 1.36 μmol/L)和 2β(2S)-O-β-D-吡喃半乳糖基-7(E)-三十三烯酸甲酯(651, IC₅₀ = 11.7 μmol/L);⑥来自肾叶天竺葵和阿富汗杜鹃花的 5,6,7-三甲氧基香豆素(887, IC₅₀ = 8.7 μmol/L);⑦含羞草碱(152, IC₅₀ = 3.68 μmol/L)和麴酸(695, IC₅₀ = 7.7 μmol/L; IC₅₀ = 11.3 μmol/L)常用做标准对照物;⑧来自异叶假繁缕的假繁缕素 F(157, IC₅₀ = 50 μmol/L)、假繁缕素 C(155, IC₅₀ = 63 μmol/L)和假繁缕素 G(158, IC₅₀ = 75 μmol/L)。

此外,数据较为丰富的酶抑制剂还有蛋白激酶 C 抑制剂、Na⁺,K⁺-ATP 酶抑制剂、NADH 氧化酶抑制剂、β-己糖胺酶抑制剂、5α-还原酶抑制剂、黄质氧化酶抑制剂、β-氨基己糖苷酶抑制剂和胰脂肪酶抑制剂等。

目 录

1. 生物碱	1
1.1 异喹啉类生物碱	1
异喹啉生物碱/1 双苄基异喹啉生物碱/1 阿朴啡生物碱/2 原小檗碱生物碱/3 苯并[c]	
菲啶生物碱/4	
1.2 喹啉类生物碱	7
喹啉生物碱/7 呋喃并喹啉生物碱/8 吡喃并喹啉生物碱/8 吲哚酮类生物碱/8	
1.3 喹唑啉类生物碱	9
1.4 吡咯烷类生物碱	9
吡咯烷生物碱/9 吲哚里西定生物碱/10 莨菪烷类生物碱/10 多吡咯类生物碱(维生素	
B ₁₂ 类)/11	
1.5 吲哚类生物碱	11
异吲哚类生物碱/11 环色胺类生物碱/11 β -咔啉类生物碱/12 麦角类生物碱/13 吲哚	
-1,5-二氮杂萘酮类生物碱/13 育亨宾类生物碱/14 吴茱萸类生物碱/14 马钱子类生物	
碱/14	
1.6 吡啶和哌啶类生物碱	14
吡啶生物碱/14 哌啶生物碱/15 金鸡纳类生物碱/16 一叶萩碱类生物碱/16 石松碱类	
生物碱/16	
1.7 酰胺类生物碱	17
酰胺类生物碱/17	
1.8 石蒜科生物碱	19
加兰他敏类生物碱/19 网球花定生物碱/19 水仙花碱类生物碱/20 石蒜碱类生物碱/21	
1.9 甾醇生物碱	22
Cerveratrum 类甾醇生物碱/22 Conanine 类甾醇生物碱/24 Spirosolane 甾醇生物碱/24	
孕甾烷类甾醇生物碱/25 Buxus 类甾醇生物碱/26 Jerveratrum 类甾醇生物碱/28 杂类甾	
醇生物碱/28	
1.10 萜类生物碱	28
单萜类生物碱/28 C ₁₉ -二萜类生物碱/29	
1.11 其他生物碱	29
嘌呤类生物碱/29 嘧啶类生物碱/30 杂类生物碱/31	
1.12 氨基酸和环肽	31
氨基酸/31 环肽类/31	
2. 萜类	34
2.1 单萜	34
环烯醚类单萜/34 薄荷烷型单萜/34 环己烷型单萜/35 蒎烷型单萜/36	
2.2 倍半萜	37
金合欢烷型倍半萜/37 蛇麻烷型倍半萜/37 桉烷型倍半萜/38 三去甲桉烷型倍半萜/39	

去甲杜松烷型倍半萜/39 石竹烷型倍半萜/40 愈创木烷型倍半萜/40 Silphiperfoliane 型 倍半萜/41 香树烷型倍半萜/41 雅槛蓝烷型倍半萜/42 柏木烷型倍半萜/43	
2.3 二萜	43
半日花烷型二萜/43 克罗烷型二萜/44 松香烷型二萜/45 开环松香烷型二萜/45 降、 高松香烷型二萜/46 海松烷型二萜/48 异海松烷型二萜/48 贝壳杉烷型二萜/49 西柏 烷型二萜/50 假白榄烷型二萜/50 巴豆烷型二萜/52 二环杂类二萜/53 杂类二萜/54 Rosane 烷型二萜/54 曼西烷型二萜/54	
2.4 三萜	55
羊毛甾烷型三萜/55 环羊毛甾烷型三萜/59 葫芦烷型三萜/59 达玛烷型三萜/59 大戟 烷型三萜/62 裂环四去甲三萜/63 苦木素类去甲三萜/63 羽扇豆烷型三萜/63 齐墩果 烷型三萜/65 移齐墩果烷型三萜/73 乌苏烷型三萜/73 山柑子烷型三萜/76 蒲公英赛 烷型三萜/77 原萜烷型三萜/77 芒柄花烷型三萜/78	
2.5 四萜和局部萜	78
局部萜/78 阿朴类胡萝卜素/79	
3. 黄酮类	80
3.1 黄酮类	80
3.2 二氢黄酮类	97
3.3 黄酮醇类	105
3.4 二氢黄酮醇类	128
3.5 双二氢黄酮醇类	131
3.6 异黄酮类	132
3.7 二氢异黄酮类	135
3.8 高异黄酮类	135
3.9 黄烷类	136
3.10 双黄烷类	136
3.11 黄烷-3-醇类	136
3.12 双黄烷-3-醇类	139
3.13 异黄烷类	140
3.14 查耳酮类	140
3.15 双查耳酮类	143
3.16 二氢查耳酮类	144
3.17 噢啞类	145
3.18 双黄酮类	145
3.19 花青素类	148
4. 甾族化合物	149
4.1 孕甾烷类甾族化合物	149
4.2 胆烷酸类甾族化合物	149
4.3 胆甾烷类甾族化合物	149
4.4 螺甾烷类甾族化合物	150

4.5 麦角甾烷类 (非睡茄内酯) 甾族化合物	153
4.6 睡茄内酯类甾族化合物	153
4.7 豆甾烷类甾族化合物	155
4.8 维生素 D ₃ 代谢物类	157
5. 脂肪族天然产物	158
5.1 链状化合物	158
饱和直链酯/158 直链烯酸/158 直链烯酯/159 饱和直链酸/159 饱和直链醇/160	
5.2 炔类化合物	161
炔类化合物(炔醇类)/161 炔类化合物(炔酮类)/161	
5.3 单碳环化合物	161
5.4 酰基甘油类	162
5.5 鞘胺醇类	163
5.6 长链芳香系统	163
5.7 含硫化合物	166
6. 聚酮化合物	167
6.1 番荔枝乙酰精宁类	167
7. 含氧杂环	168
7.1 2-吡喃酮类	168
7.2 4-吡喃酮类	168
7.3 吡喃类	168
7.4 呋喃类	169
7.5 丁内酯类	169
7.6 戊内酯类	169
7.7 大环内酯类	169
7.8 未氯化缩酚(羧)酸环醚	170
8. 简单芳香化合物	171
8.1 简单苯衍生物	171
8.2 苯丙烯类	178
8.3 酰基间苯三酚类	189
8.4 双咕吨酮类	190
8.5 咕吨酮类	191
8.6 联苯类	192
8.7 联苄类	193
8.8 芪类	193
8.9 芪聚合物类	198
8.10 二苯醚类	199
8.11 二芳丙烷类	199
8.12 二芳庚烷类	200

9. 多环芳香化合物	205
9.1 萘和萘醌类	205
萘类/205 1-吡喃并萘醌类/205	
9.2 蒽和蒽醌类	205
蒽醌类/205	
9.3 菲类	206
菲类/206 1,4-菲醌类/207	
10. 苯并呋喃和苯并吡喃类	208
10.1 苯并呋喃类	208
10.2 1-苯并吡喃类	209
10.3 吡喃并-1-苯并吡喃类	210
11. 香豆素类	212
11.1 香豆素类	212
11.2 双香豆素类	216
11.3 呋喃并香豆素类	216
11.4 吡喃并香豆素类	218
11.5 双异香豆素	219
12. 木脂体	221
12.1 木脂体	221
12.2 萘基类木脂体	228
12.3 二苯并环辛二烯木脂体	228
12.4 环丁烷型木脂体	230
12.5 新木脂体	230
13. 鞣质	232
13.1 没食子酯鞣质	232
13.2 黄酮鞣质	236
13.3 间苯三酚鞣质	237
参考文献	238
化合物药理活性索引	249
化合物中文名称索引	266
化合物英文名称索引	280
植物中文名称及活性成分索引	298
植物拉丁学名及活性成分索引	323
附录 1 缩写和符号表	345
附录 2 癌细胞代码	348

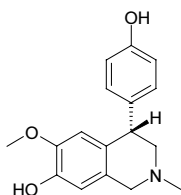
1. 生物碱

1.1 异喹啉类生物碱

异喹啉生物碱

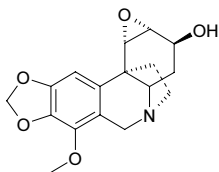
1 Cherylline

$C_{17}H_{19}NO_3$ (285.35). 【类型】 异喹啉生物碱. 【活性】 AChE 抑制剂 [$IC_{50} = (211 \pm 10) \mu\text{mol/L}$, 对照加兰他敏, $IC_{50} = (1.9 \pm 0.2) \mu\text{mol/L}$]^[824]. 【来源】 灌木文殊兰 * *Crinum macowanii* (鳞茎), 文殊兰属 *Crinum moorei*. 【文献】 602, 824.



2 Crinamidine 文殊兰米定碱*

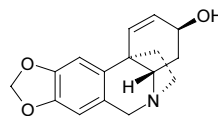
$C_{17}H_{19}NO_5$ (317.34). 【类型】 异喹啉生物碱. 【活性】 AChE 抑制剂 [$IC_{50} = (300 \pm 27) \mu\text{mol/L}$, 对照加兰他敏, $IC_{50} = (1.9 \pm 0.2) \mu\text{mol/L}$]^[824]. 【来源】 文殊兰属 *Crinum moorei*. 【文献】 824.



3 (+)-Crinine (+)-文殊兰碱 (条纹碱)

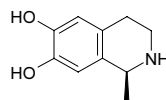
(+)-Vittatine $C_{16}H_{17}NO_3$ (271.32). mp 207~208°C (升华). 【类型】 异喹啉生物碱. 【活性】 AChE 抑制剂 [$IC_{50} = (461 \pm 14) \mu\text{mol/L}$, 对照加兰他敏, $IC_{50} = (1.9 \pm 0.2) \mu\text{mol/L}$]^[824]; 抗菌 (金黄色葡萄球菌, IZD=19mm, MIC=63 $\mu\text{g/mL}$; 大肠杆菌, IZD=22mm)^[581]; 抗真菌 (白色念珠菌, IZD = 17mm, MIC = 31 $\mu\text{g/mL}$)^[581]. 【来源】 孤挺花 *Amaryllis belladonna* (鳞茎), 石蒜 *Lycoris radiata* [Syn. *Amaryllis radiata*], 文殊兰属

Crinum moorei. 【文献】 5, 581, 824.



4 (-)-Salsolinol 猪毛菜酚

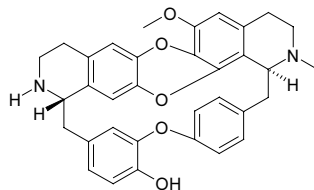
$C_{10}H_{13}NO_2$ (179.22). 不稳定氢溴化物, 奶油色细小棱柱状晶体 (乙醇-乙醚), mp 195~198°C. 【类型】 异喹啉生物碱. 【活性】 止痛; 升高血压和提高心率 (大鼠, iv); 单胺氧化酶抑制剂; 神经肌肉阻断作用; 刺激心房 (豚鼠, *in vitro*). 【来源】 粉芭蕉 *Musa paradisiaca*, 可可 *Theobroma cacao*, 牛心番荔枝 *Annona reticulata*, 乌头 *Aconitum carmichaeli*. 【文献】 148.



双苄基异喹啉生物碱

5 Cocsoline 防己索林*

$C_{34}H_{32}N_2O_5$ (548.64). 白色无定形粉末, $[\alpha]_D^{25} = +205^\circ$ ($c = 0.15$, 甲醇). 【类型】 双苄基异喹啉生物碱. 【活性】 AChE 抑制剂 [*in vitro*, $IC_{50} = (47.5 \pm 1.5) \mu\text{mol/L}$, 对照加兰他敏, $IC_{50} = (0.5 \pm 0.001) \mu\text{mol/L}$]^[613]. 【来源】 垂木防己 *Cocculus pendulus*. 【文献】 613.

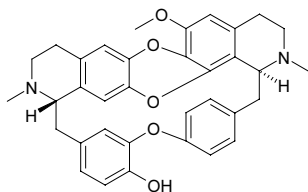


6 Cocsuline 防己苏林*

$C_{35}H_{34}N_2O_5$ (562.67). 黄色无定形粉末, $[\alpha]_D^{25} = +275^\circ$ ($c = 0.30$, 甲醇). 【类型】 双苄基异喹啉生物碱. 【活性】 AChE 抑制剂 [*in vitro*, $IC_{50} = (100.0 \pm 1.2) \mu\text{mol/L}$,

对照加兰他敏, $IC_{50} = (0.5 \pm 0.001) \mu\text{mol/L}$ [613].

【来源】垂木防己 *Cocculus pendulus*. 【文献】613.

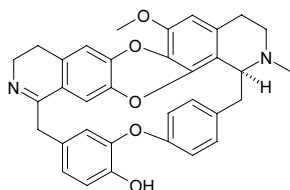


7 1,2-Dehydroapateline

$C_{34}H_{30}N_2O_5$ (546.63). 黄色无定形粉末, $[\alpha]_D^{25} = +128^\circ$ ($c = 0.42$, 甲醇). 【类型】双苄基异喹啉生物碱.

【活性】AChE 抑制剂 [*in vitro*, $IC_{50} = (116.5 \pm 2.5) \mu\text{mol/L}$, 对照加兰他敏, $IC_{50} = (0.5 \pm 0.0) \mu\text{mol/L}$] [613].

【来源】垂木防己 *Cocculus pendulus*. 【文献】613.

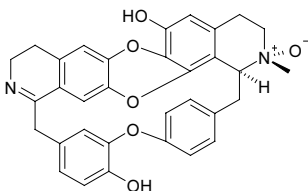


8 Kurramine-2'- α -N-oxide

$C_{33}H_{28}N_2O_6$ (548.60). 黄色无定形粉末, $[\alpha]_D^{25} = +50^\circ$ ($c = 0.012$, 甲醇). 【类型】双苄基异喹啉生物碱.

【活性】AChE 抑制剂 [*in vitro*, $IC_{50} = (150.0 \pm 2.5) \mu\text{mol/L}$, 对照加兰他敏, $IC_{50} = (0.5 \pm 0.001) \mu\text{mol/L}$] [613]. 【来源】垂木防己 *Cocculus pendulus*.

【文献】613.

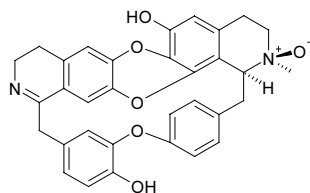


9 Kurramine-2'- β -N-oxide

$C_{33}H_{28}N_2O_6$ (548.60). 黄色无定形粉末, $[\alpha]_D^{25} = +60^\circ$ ($c = 0.01$, 甲醇). 【类型】双苄基异喹啉生物碱.

【活性】AChE 抑制剂 [*in vitro*, $IC_{50} = (10.0 \pm 0.5) \mu\text{mol/L}$, 对照加兰他敏, $IC_{50} = (0.5 \pm 0.001) \mu\text{mol/L}$] [613]. 【来源】垂木防己 *Cocculus pendulus*.

【文献】613.

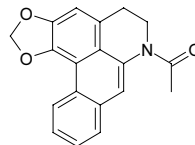


阿朴啡生物碱

10 N-Acetyldehydroanonaie N-乙酰基去氢番荔枝碱

$C_{19}H_{15}NO_3$ (305.34). 【类型】阿朴啡生物碱.

【活性】血小板聚集抑制剂; DNA 拓扑异构酶抑制剂; 抗菌; 细胞毒. 【来源】野花椒叶 *Zanthoxylum simulans*. 【文献】397.

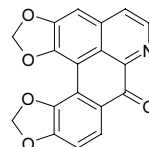


11 Hernandonine

$C_{18}H_{19}NO_5$ (319.28). 【类型】阿朴啡生物碱.

【活性】抗 HIV-1 (人免疫缺损病毒-1 整合酶抑制剂, $IC_{50} = 16.3 \mu\text{mol/L}$, 阳性对照苏拉明, $IC_{50} = 2.4 \mu\text{mol/L}$) [662].

【来源】鼎湖钓樟 *Lindera chunii* (根). 【文献】662.



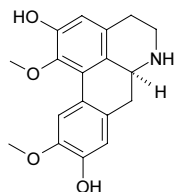
12 Lauroitsine 木姜子碱 ((+)-去甲包尔定)

(+)-Norboldine [5890-18-6] $C_{18}H_{19}NO_4$ (313.36). 淡棕色无定形粉末, mp $113 \sim 115^\circ\text{C}$, $138 \sim 140^\circ\text{C}$, $[\alpha]_D = +101^\circ$ ($c = 0.69$, 乙醇). 【类型】阿朴啡生物碱.

【活性】抗菌 (金黄色葡萄球菌, MIC = $250 \mu\text{g/mL}$); 抗疟疾 (恶性疟原虫 D₂, $IC_{50} = 1240 \text{ ng/mL}$; W₂, $IC_{50} = 1680 \text{ ng/mL}$); 抗 HIV-1 (人免疫缺损病毒-1 整合酶抑制剂, $IC_{50} = 7.7 \mu\text{mol/L}$; 阳性对照苏拉明, $IC_{50} = 2.4 \mu\text{mol/L}$) [662]; 抗疟疾 (杀疟原虫, *Plasmodium falciparum* PoW, $IC_{50} = 3.1 \mu\text{g/mL}$; *Plasmodium falciparum* Dd2, $IC_{50} = 5.4 \mu\text{g/mL}$).

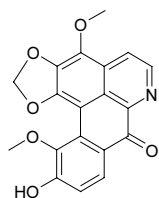
【来源】澄茄子 *Litsea cubeba*, 钓樟根皮 *Lindera*

umbellata [Syn. *Lindera erythrocarpa*], 乌药 *Lindera strychnifolia* [Syn. *Lindera aggregata*], 樟木 *Cinnamomum camphora*, 鼎湖钓樟 *Lindera chunii* (根), 少花西帕木* *Siparuna pauciflora*. 【文献】 5, 160, 245, 521, 662.



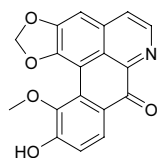
13 Lindechunine A 鼎湖钓樟宁 A*

$C_{19}H_{13}NO_6$ (351.32). 黄色粉末, $[\alpha]_D^{26} = 0^\circ$ ($c = 0.1$, 甲醇). 【类型】 阿朴啡生物碱. 【活性】 抗 HIV-1 (人免疫缺损病毒-1 整合酶抑制剂, $IC_{50} = 21.1 \mu\text{mol/L}$, 阳性对照苏拉明, $IC_{50} = 2.4 \mu\text{mol/L}$)^[662]. 【来源】 鼎湖钓樟 *Lindera chunii* (根). 【文献】 662.



14 7-Oxohernangerine 7-酮莲叶酮碱*

$C_{18}H_{11}NO_5$ (321.29). 【类型】 阿朴啡生物碱. 【活性】 抗 HIV-1 (人免疫缺损病毒-1 整合酶抑制剂, $IC_{50} = 18.2 \mu\text{mol/L}$, 阳性对照苏拉明, $IC_{50} = 2.4 \mu\text{mol/L}$)^[662]. 【来源】 鼎湖钓樟 *Lindera chunii* (根). 【文献】 662.



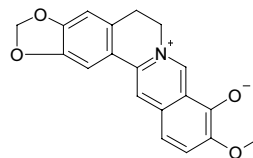
原小檗碱生物碱

15 Berberrubine 小檗红碱

9-Berberoline $C_{19}H_{15}NO_4$ (321.34). 【类型】 原小檗碱生物碱. 【活性】 升高血压; 抗菌; 止血剂; 细胞毒 (P_{388} 白血病、 L_{1210} 白血病、B16 黑素瘤和一些人

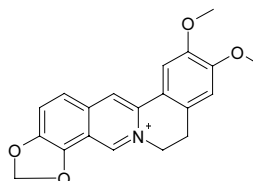
癌细胞)^[903]; 拓扑异构酶 II 抑制剂 (*in vitro*)^[903]; DNA 分裂诱导剂 (特定部位, 浓度依赖方式)^[903].

【来源】 簇刺小檗 *Berberis actinacantha*, 达尔文小檗 *Berberis darwinii*, 绿白天仙藤 *Fibraurea chloroleuca*, 欧洲小檗 *Berberis vulgaris*, 瓦氏小檗* *Berberis valdiviana*, 杂性唐松草 *Thalictrum polygamum*. 【文献】 1, 147, 245, 903.



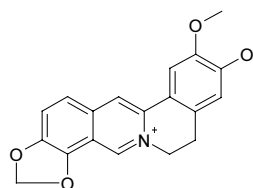
16 Epiberberine 表小檗碱

$C_{20}H_{18}NO_4$ (336.37). 【类型】 原小檗碱生物碱. 【活性】 细胞毒 (拓扑异构酶 I 抑制剂 *in vitro*)^[903]. 【来源】 多花小檗 *Berberis floribunda*, 黄连(味连) *Coptis chinensis* (根茎: 平均含量 = 1.29%)^[960], 南天竹叶 *Nandina domestica*, 三角叶黄连(雅连) *Coptis deltoidea* (根茎: 平均含量 = 0.54%)^[960], 三叶黄连 *Coptis trifolia*. 【文献】 245, 903, 960.



17 Groenlandicine

$C_{19}H_{16}NO_4^+$ (322.34). 【类型】 原小檗碱生物碱. 【活性】 细胞毒 (拓扑异构酶 I 抑制剂 *in vitro*)^[903]. 【来源】 黄连属 *Coptis groenlandica*. 【文献】 245, 903.

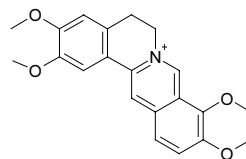


18 Palmatine 巴马汀 (巴马亭, 掌叶防己碱, 黄藤素)

Berbericine $C_{21}H_{22}NO_4^+$ (352.41). mp

198~201℃. 【类型】原小檗碱生物碱. 【活性】止痛; 抗心律失常; 抗菌 (金黄色葡萄球菌和孢子丝菌属, EC = 500μg/mL, 痢疾杆菌、大肠杆菌、β-链球菌属和 12 种霉菌); 抗真菌 (白色念珠菌, EC = 250μg/mL); 抗病毒 (亚洲α-流行性感病毒); 提高心肌收缩力; 胆碱酯酶抑制剂; 抗锥虫 (其碘化物杀 Lewis-锥虫); 减少心肌梗死面积 (兔, *in vivo*, 氯化物 0.75mg/kg, *iv*); LD₅₀ (鼠, *iv*, 硫氰酸盐) = 98μg/kg. 【来源】瓣蕊唐松草 *Thalictrum petaloideum* (根: 含量 < 0.001%)^[960], 长矩延胡索 *Corydalis longicalcarata* (根茎: 含量 = 0.048%)^[960], 城口十大功劳 *Mahonia shenii* (茎: 含量 = 0.33%)^[961], 齿瓣延胡索 *Corydalis remota* [Syn. *Corydalis bulbosa* var. *typica*] (根茎: 含量 = 0.01%)^[960], 川滇十大功劳 *Mahonia veitchiorum* (茎: 含量 = 0.19%)^[961], 大叶唐松草 *Thalictrum faberi* (根: 含量 < 0.001%)^[960], 东北延胡索 *Corydalis ambigua* var. *amurensis* [Syn. *Corydalis ambigua*] (根茎: 含量 = 0.02%)^[960], 烟锅草 *Thalictrum thunbergii* (根: 含量 < 0.001%)^[960], 短萼黄连 *Coptis chinensis* var. *brevise-pala* (根茎: 含量 = 0.65%)^[960], 对叶元胡 *Corydalis ledebouriana* (根茎: 含量 = 0.100%)^[960], 峨嵋野黄连 *Coptis omeiensis* (根茎: 含量 = 1.03%)^[960], 非洲防己 *Jateorhiza palmata*, 古藜野连 *Coptis gulinensis* (根茎: 含量 = 0.88%)^[960], 海松子 *Pinus koraiensis*, 湖北十大功劳 *Mahonia confusa* (茎: 含量 = 0.03%)^[961], 华南功劳木 *Mahonia japonica* (茎: 含量 = 0.19%)^[961], 华南功劳叶 *Mahonia japonica*, 黄柏 (黄檗; 关黄柏) *Phellodendron amurense* (树皮: 6 批样本平均含量 = 0.67%)^[960], 黄连 (味连) *Coptis chinensis* (根茎: 平均含量 = 1.94%)^[960], 黄皮树 *Phellodendron chinense* (树皮: 含量范围 = 0.372%~0.590%)^[957], 黄叶地不容 *Stephania viridiflavens*, 灰绿延胡索 *Corydalis adunca* (根茎: 含量 = 0.026%)^[960], 金果榄 *Tinospora capillipes*, 金丝马尾连 *Thalictrum glandulosissimum* (根: 含量 < 0.001%)^[960], 宽苞十大功劳 *Mahonia eurybracteata* (茎: 3 产地平均含量 = 0.06%)^[961], 马尾连 (多叶唐松草) *Thalictrum foliolosum* (根: 含量 = 0.32%)^[960], 全叶延胡索 *Corydalis repens* (根茎: 含量 = 0.01%)^[960], 日本小檗

Berberis thunbergii, 三角叶黄连 (雅连) *Coptis deltoidea* (根茎: 平均含量 = 0.98%)^[960], 少齿小檗 *Berberis potaninii* (根、茎: 平均含量 = 0.144%)^[960], 十大功劳木 *Mahonia bealei* (茎: 4 产地平均含量 0.11%)^[961], 天仙藤 (黄藤) *Fibraurea recisa* (干燥藤茎: 含量 = 2.71%)^[960], 望春玉兰 *Magnolia biondii* [Syn. *Magnolia fargesii*] (茎: 2 产地平均含量 = 0.19%)^[961], 细柄十大功劳 *Mahonia gracilipes* (茎: 2 产地平均含量 = 0.14%)^[961], 细叶功劳木 *Mahonia fortunei* (茎: 2 产地平均含量 = 0.05%)^[961], 细叶功劳叶 *Mahonia fortunei*, 细叶小檗 *Berberis poiretii*, 狭序唐松草 *Thalictrum atriplex* (根: 含量 < 0.001%)^[960], 夏天无 *Corydalis decumbens* [Syn. *Corydalis amabilis*] (根茎: 含量 = 0.07%)^[960], 鲜黄小檗 *Berberis diaphana* (根、茎: 平均含量 = 0.082%)^[960], 线萼黄连 *Coptis linearisepala* (根茎: 含量 = 0.85%)^[960], 小檗 *Berberis amurensis*, 小果十大功劳 *Mahonia bodinieri* (茎: 含量 = 0.13%)^[961], 小果唐松草 *Thalictrum microgynum* (根: 含量 < 0.001%)^[960], 烟锅草 *Thalictrum thunbergii* (根: 含量 < 0.001%)^[960], 延胡索 *Corydalis yanhusuo* [Syn. *Corydalis turtschaninovii* f. *Yanhusuo*] (根茎: 5 产地平均含量 = 0.080%)^[960], 硬水黄连 (短梗箭头唐松草) *Thalictrum simplex* [Syn. *Thalictrum simplex* var. *brevipes*] (根: 含量 < 0.001%)^[960], 云南黄连 (云连) *Coptis teetoides* [Syn. *Coptis teeta*] (根茎: 平均含量 = 0.69%)^[960], 置疑小檗 *Berberis dubia* (根、茎: 平均含量 = 0.182%)^[960], 存在于许多植物中 (大部分在小檗科多种植物 family Berberidaceae spp. 的小檗属 *Berberis* spp. 和十大功劳属 *Mahonia* spp. 中, 并广泛分布于其他科). 【文献】2, 3, 54, 146, 147, 957, 960, 961.



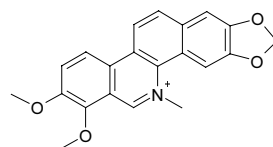
苯并[c]菲啶生物碱

19 Chelerythrine 白屈菜红碱

Toddaline [34316-15-9] C₂₁H₁₈NO₄⁺ (348.38). 【类型】

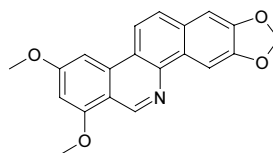
苯并[c]菲啶生物碱。【活性】抗菌；抗真菌；抗病毒；引起流产（豚鼠，低剂量时引起麻痹，高剂量时致死）；毒素（神经肌肉毒性，抑制心脏）；抗 HIV 实验无活性（淋巴细胞 H9，对照 3'-叠氮基-3'-脱氧胸苷， $IC_{50}=500\mu\text{g/mL}$ ， $EC_{50}=0.0317\mu\text{g/mL}$ ， $TI=15800$)^[901]；细胞毒（DNA 插入，氧化磷酸化解偶联）^[245]；转氨酶抑制剂（大鼠肝）^[245]；抗菌抗炎（推荐用于口腔感染）^[245]；抗高血压（鼠、兔和猫）^[245]；止痛^[245]；镇静（延长睡眠时间）^[245]；蛋白激酶 C 抑制剂^[903]；细胞毒 [完全抑制由羟化氯喹(hydroxy 氯喹)和泼尼松(prednisone)诱导的 GI-101A 乳腺癌细胞的生长，阻断由 TPA 或二乙基己烯雌酚 diethylstilbestrol 刺激的 GI-101A 和 HL-60 细胞血管内皮细胞生长因子(VEGF)mRNA；抑制被 thymeleatoxin 刺激的 MCF7 细胞增殖]^[903]；细胞毒（抑制 PC3 人前列腺癌细胞和 AGS 胃癌细胞的增殖）^[903]；细胞毒（一系列抗辐射、抗化学物质的人鳞状细胞癌，引起癌细胞快速凋亡）^[903]；抗肿瘤（裸鼠，抗辐射、抗化学物质，p53 缺乏的人头颈鳞状细胞癌 SQ-20B，明显延迟肿瘤生长且毒性最低）^[903]。【来源】白屈菜 *Chelidonium majus*，博落回 *Macleaya cordata*（全株：含量 = 8.97%^[960]），飞龙掌血 *Toddalia asiatica* [Syn. *Toddalia aculeata*; *Paullinia asiatica*]，荷包牡丹根 *Dicentra spectabilis*，荷青花 *Hylomecon japonica*，罂粟 *Argemone mexicana*，丽春花 *Papaver commutatum* [Syn. *Papaver rhoeas*]，细果角茴香 *Hypecoum leptocarpum*，存在于许多植物中（罂粟科多种植物 family Papaveraceae spp.（罂粟属 *Argemone* spp.，美罂粟属 *Bocconia* spp.，白屈菜属 *Chelidonium* spp.，秃疮花属 *Dicranostigma* spp.，花菱草属 *Eschscholzia* spp.，海罂粟属 *Glaucium* spp.，红乃马草属 *Hunnemannia* spp.，荷青花属 *Hylomecon* spp.，博落回属 *Macleaya* spp.，罂粟属 *Papaver* spp.，血根草属 *Sanguinaria* spp.，人血草属 *Stylophorum* spp.，*Platystemon* spp.，*Stylomecon* spp.），芸香科多种植物 family Rutaceae spp.（崖椒属 *Fagara* spp.，飞龙掌血属 *Toddalia* spp.，花椒属 *Zanthoxylum* spp.），紫堇科多种植物 family Fumariaceae spp.（紫堇属 *Corydalis* spp.，荷包牡丹属 *Dicentra* spp.），无患子科多种植物 family Sapindaceae spp.（蕨叶罂粟属 *Pteridophyllum*

spp.)). 【文献】 5, 146, 245, 901, 903, 960.



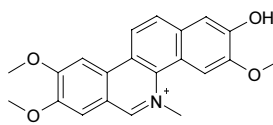
20 7,9-Dimethoxy-2,3-methylenedioxybenzophenanthridine 7,9-二甲氧基-2,3-亚甲基二氧苯并菲次碱

$C_{20}H_{15}NO_4$ (333.35). 【类型】 苯并[c]菲啶生物碱。【活性】血小板聚集抑制剂；DNA 拓扑异构酶抑制剂；抗菌；细胞毒。【来源】 花椒属 *Zanthoxylum* sp. 【文献】 397.



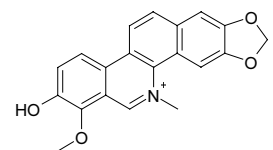
21 Fagaronine 崖椒宁*

$C_{21}H_{20}NO_4$ (350.40). 【类型】 苯并[c]菲啶生物碱。【活性】细胞毒（键合插入小牛胸腺 DNA，对拓扑异构酶 I 和 II 有毒）^[903]。【来源】 崖椒属 *Fagara xanthoxyloides*. 【文献】 245, 903.



22 Isofagaridine 异花椒啶

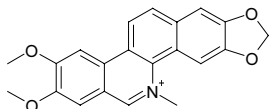
$C_{20}H_{16}NO_4^+$ (334.35). 【类型】 苯并[c]菲啶生物碱。【活性】血小板聚集抑制剂；DNA 异构酶抑制剂；抗菌；细胞毒。【来源】入地金牛（两面针）*Zanthoxylum nitidum*，花椒属 *Zanthoxylum* sp. 【文献】 147, 397.



23 Nitidine 两面针碱（光叶花椒碱）

[76872-57-7] $C_{21}H_{18}NO_4^+$ (348.38). mp 215~218 °C. 【类型】 苯并[c]菲啶生物碱。【活性】抗肿瘤 [鼠 P_{388} , 4mg/(kg·d)，生命延长率 = 109%；鼠 L_{1210} , 4mg/(kg·d)，生命延长率 = 36%；其毒性谱不适合于

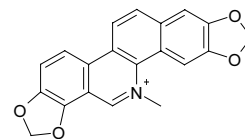
临床应用]; 反转录酶抑制剂 (致癌物质 RNA 病毒); 抗肿瘤 (鼠, L₁₂₁₀ 白血病、P₃₈₈ 白血病、Lewis 肺癌和 B16 黑素瘤)^[903]; 抗肿瘤 (延长接种 Ehrlich 腹水癌小鼠的生命, 减小有丝分裂指数和癌细胞尺寸, 抑制肿瘤中 DNA 和 RNA 的合成)^[903]; 抗肿瘤 (氯化物临床用于治疗慢性中幼粒细胞白血病)^[903]; 细胞毒 (插入键合小牛胸腺 DNA, 对拓扑异构酶 I 和 II 有毒)^[903]; 拓扑异构酶抑制剂 (强烈地稳定拓扑异构酶 I 和 DNA 之间形成的共价二元络合物)^[903]。【来源】栲叶花椒 *Zanthoxylum ailanthoides*, 栲叶花椒皮 *Zanthoxylum ailanthoides*, 栲叶花椒根 *Zanthoxylum ailanthoides*, 刺壳花椒 *Zanthoxylum echinocarpum*, 大叶臭花椒 *Zanthoxylum myriacanthum*, 大叶花椒 *Zanthoxylum dissitum*, 大叶花椒根 *Zanthoxylum dissitum*, 花椒 *Zanthoxylum bungeanum*, 花椒筋 *Zanthoxylum cuspidatum*, 黄心花椒 *Zanthoxylum flavum*, 美国刺椒 *Zanthoxylum clava-hercules*, 美洲花椒 *Zanthoxylum americanum* [Syn. *Xanthoxylum americanum*], 入地金牛 (两面针) *Zanthoxylum nitidum* (干燥根: 含量 = 0.15%^[960]), 鹰不泊 *Zanthoxylum avicennae*。【文献】3, 4, 5, 146, 147, 245, 903, 957, 960。



24 Sanguinarine 血根碱

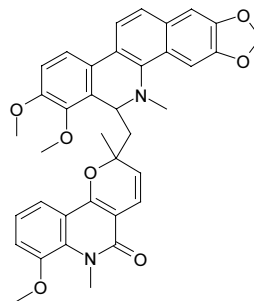
ψ -Cheiranthrine [2447-54-3] C₂₀H₁₄NO₄ (332.34). mp 242~243 °C (分解)。【类型】苯并[c]菲啶生物碱。【活性】蛋白激酶 A 抑制剂 (大鼠肝蛋白激酶 A 的催化作用亚基, IC₅₀ = 6 μmol/L)^[903]; 蛋白激酶 C 抑制剂 (IC₅₀ > 200 μmol/L)^[903]; 细胞毒 (人角化细胞, 抑制细胞生长, IC₅₀ = 0.2 μmol/L)^[903]; 细胞毒 (在低于人表皮角化细胞正常浓度下降低 A431 人表皮癌细胞依赖于浓度的生存能力, 用来处理 A431 人表皮癌细胞导致细胞凋亡, 但在正常的角化细胞中不形成 DNA 梯式)^[903]; 细胞毒 (和小牛胸腺 DNA 相互作用, 改变其二级序列)^[903]; 抗 HIV 实验无活性 (淋巴细胞 H9, 对照 3'-叠氮基-3'-脱氧胸苷, IC₅₀ = 500 μg/mL, EC₅₀ = 0.0317 μg/mL, TI = 15800)^[901]。【来源】白屈

菜 *Chelidonium majus*, 博落回 *Macleaya cordata* (全株: 含量 = 5.69%^[960]), 荷包牡丹根 *Dicentra spectabilis*, 荷青花 *Hylomecon japonica*, 薊罂粟 *Argemone mexicana*, 菊花黄连 *Corydalis pallida*, 丽春花 *Papaver commutatum* [Syn. *Papaver rhoeas*], 美洲血根草 *Sanguinaria canadensis*, 细果角茴香 *Hypecoum leptocarpum*, 阿片 *Papaver somniferum*, 药用球果紫堇 *Fumaria officinalis*, 异样荷包牡丹* *Dicentra peregrina*, 罂粟 *Papaver somniferum*, 罂粟壳 *Papaver somniferum*, 紫花鱼灯草 *Corydalis incisa*。【文献】3, 5, 146, 901, 903, 960。



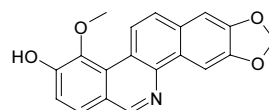
25 Simulanoquinoline 野花椒喹啉*

[155416-22-1] C₃₇H₃₄N₂O₇ (618.69)。【类型】苯并[c]菲啶生物碱。【活性】血小板聚集抑制剂; DNA 异构酶抑制剂; 抗菌; 细胞毒。【来源】野花椒根 *Zanthoxylum simulans*。【文献】397。



26 Zanthoxyline 花椒木精

C₁₉H₁₃NO₄ (319.32)。【类型】苯并[c]菲啶生物碱。【活性】血小板聚集抑制剂; DNA 异构酶抑制剂; 抗菌; 细胞毒。【来源】花椒属 *Zanthoxylum* sp. 【文献】397。

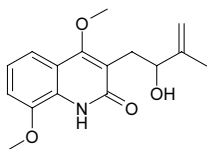


1.2 喹啉类生物碱

喹啉生物碱

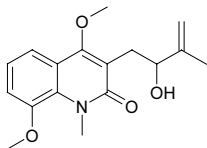
27 Acutifolidin 尖叶花椒定

[145237-08-7] $C_{16}H_{19}NO_4$ (289.33). 【类型】喹啉生物碱. 【活性】血小板聚集抑制剂; DNA 拓扑异构酶抑制剂; 抗菌; 细胞毒. 【来源】尖叶花椒 *Zanthoxylum acutifolium*. 【文献】397.



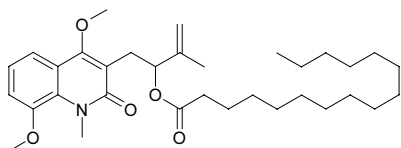
28 Acutifolin 尖叶花椒灵

[145237-07-6] $C_{17}H_{21}NO_4$ (303.36). 【类型】喹啉生物碱. 【活性】血小板聚集抑制剂; DNA 拓扑异构酶抑制剂; 抗菌; 细胞毒. 【来源】尖叶花椒 *Zanthoxylum acutifolium*. 【文献】397.



29 Acutifolin palmitate 尖叶花椒灵棕榈酸酯

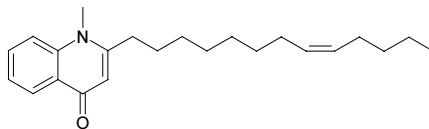
$C_{33}H_{55}NO_5$ (541.78). 【类型】喹啉生物碱. 【活性】血小板聚集抑制剂; DNA 异构酶抑制剂; 抗菌; 细胞毒. 【来源】尖叶花椒 *Zanthoxylum acutifolium*. 【文献】397.



30 Evocarpine 吴茱萸卡平碱

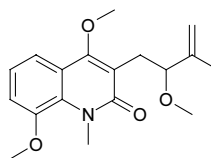
[15266-38-3] $C_{23}H_{33}NO$ (339.53). 注: Evocarpine 是混合物, 后面的结构是其中的主要成分. 【类型】喹啉生物碱. 【活性】甘油二酯酰基转移酶 DGAT 抑制剂 ($IC_{50} = 8.1\mu g/mL$)^[820]; 白三烯生物合成抑制剂 (人多型核粒细胞, $IC_{50} = 14.6\mu mol/L$, 对照 Zileuton,

$IC_{50} = 10.4\mu mol/L$)^[851]. 【来源】吴茱萸 *Evodia rutaecarpa* (果实). 【文献】2, 820, 851.



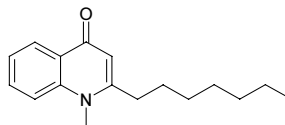
31 O-Methylacutifolin O-甲基尖叶花椒灵*

$C_{18}H_{23}NO_4$ (317.39). 【类型】喹啉生物碱. 【活性】血小板聚集抑制剂; DNA 异构酶抑制剂; 抗菌; 细胞毒. 【来源】花椒属 *Zanthoxylum* sp. 【文献】397.



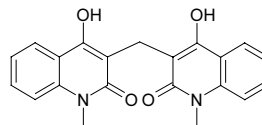
32 Schinifoline 青椒碱

N-methyl-2-heptyl-4(1*H*)-quinolone [80554-58-1] $C_{17}H_{23}NO$ (257.38). 白色针状晶体 (己烷:三氯甲烷 = 7:3), mp 81~82°C. 【类型】喹啉生物碱. 【活性】细胞毒; 抗菌 (革兰阳性菌); 血小板聚集抑制剂; DNA 异构酶抑制剂. 【来源】花椒 *Zanthoxylum bungeanum* (干燥成熟果皮: 含量 = 0.007%^[960]), 青椒 *Zanthoxylum schinifolium* (干燥成熟果皮: 含量 = 0.047%^[960]). 【文献】27, 147, 397, 960.



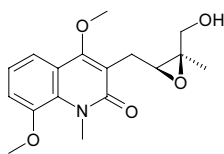
33 Zanthobisquinolone 花椒双喹诺酮

$C_{21}H_{18}N_2O_4$ (362.39). 【类型】喹啉生物碱. 【活性】血小板聚集抑制剂; DNA 异构酶抑制剂; 抗菌; 细胞毒. 【来源】花椒属 *Zanthoxylum* sp. 【文献】397.



34 Zascanol epoxide 花椒醇环氧化物

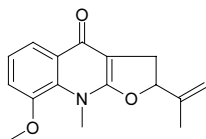
$C_{17}H_{21}NO_5$ (319.36). 【类型】喹啉生物碱. 【活性】血小板聚集抑制剂; DNA 异构酶抑制剂; 抗菌; 细胞毒. 【来源】花椒属 *Zanthoxylum* sp. 【文献】397.



呋喃并喹啉生物碱

35 Neocutifolin 新尖叶花椒灵*

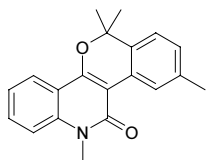
$C_{16}H_{17}NO_3$ (271.32). 【类型】呋喃并喹啉生物碱. 【活性】血小板聚集抑制剂; DNA 异构酶抑制剂; 抗菌; 细胞毒. 【来源】花椒属 *Zanthoxylum* sp. 【文献】397.



吡喃并喹啉生物碱

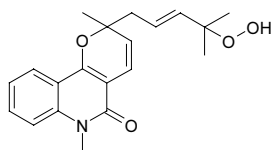
36 Benzosimuline

[198336-58-2] $C_{20}H_{19}NO_2$ (305.38). 无色油状物. 【类型】吡喃并喹啉生物碱. 【活性】血小板聚集抑制剂 (兔, 凝血酶、花生四烯酸、胶原和 PAF 引起的血小板聚集, $EC = 100\mu g/mL$); DNA 异构酶抑制剂; 细胞毒 (高活性). 【来源】野花椒叶 *Zanthoxylum simulans*. 【文献】203, 397.



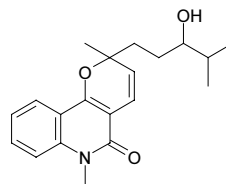
37 Peroxysimulenoline

$C_{20}H_{23}NO_4$ (341.41). 【类型】吡喃并喹啉生物碱. 【活性】血小板聚集抑制剂; DNA 异构酶抑制剂; 抗菌; 细胞毒. 【来源】花椒属 *Zanthoxylum* sp. 【文献】397.



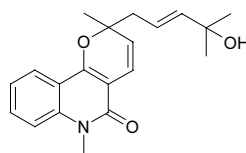
38 Simulansine 野花椒新*

[176520-66-4] $C_{20}H_{25}NO_3$ (327.43). 【类型】吡喃并喹啉生物碱. 【活性】血小板聚集抑制剂; DNA 异构酶抑制剂; 抗菌; 细胞毒. 【来源】野花椒根 *Zanthoxylum simulans*. 【文献】397.



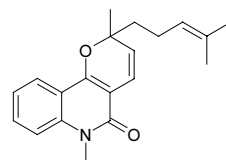
39 Simulenoline 野花椒烯醇*

$C_{20}H_{23}NO_3$ (325.41). 【类型】吡喃并喹啉生物碱. 【活性】血小板聚集抑制剂; DNA 异构酶抑制剂; 抗菌; 细胞毒. 【来源】野花椒根 *Zanthoxylum simulans*. 【文献】397.



40 Zanthosimuline 花椒精

[155416-20-9] $C_{20}H_{23}NO_2$ (309.41). 油状物, $[\alpha]_D = +7^\circ$ ($c = 0.1$, 三氯甲烷). 【类型】吡喃并喹啉生物碱. 【活性】细胞毒 ($ED_{50} = 5.2 \sim 30.4\mu mol/L$); 血小板聚集抑制剂; DNA 异构酶抑制剂. 【来源】野花椒叶 *Zanthoxylum simulans*, 花椒 *Zanthoxylum bungeanum*. 【文献】194, 204, 397.

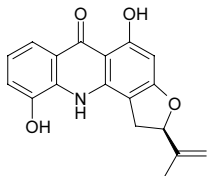


吡啶酮类生物碱

41 Oriciacridone C 欧瑞西吡啶酮 C*

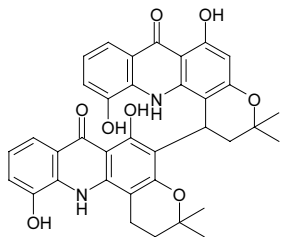
$C_{18}H_{15}NO_4$ (309.32). 黄色针晶 (甲醇), mp $253 \sim 254^\circ C$, $[\alpha]_D^{25} = +21.8^\circ$ ($c = 0.39$, 甲醇). 【类型】吡啶酮类生物碱. 【活性】 α -葡萄糖苷酶抑制剂 [$IC_{50} = (56 \pm 5)\mu mol/L$, 对照去氧野尻霉素, $IC_{50} = (330 \pm$

8) $\mu\text{mol/L}$]; 抗氧化剂 [DPPH 清除剂, $\text{IC}_{50} = (60.79 \pm 1.23)\mu\text{mol/L}$, 对照丁基羟基茴香醚, $\text{IC}_{50} = (44.20 \pm 0.02)\mu\text{mol/L}$]. 【来源】 *Oriopsis glaberrima* (茎皮: 产率 = 0.00075% 干重). 【文献】 263.



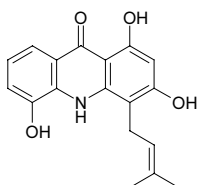
42 Oriciacridone F 欧瑞西吡啶酮 F*

$\text{C}_{36}\text{H}_{32}\text{N}_2\text{O}_8$ (620.67). 黄色粉末 (甲醇), mp 187~189 $^{\circ}\text{C}$, $[\alpha]_{\text{D}}^{25} = +35.6^{\circ}$ ($c = 0.62$, 甲醇). 【类型】 吡啶酮类生物碱. 【活性】 α -葡萄糖苷酶抑制剂 [$\text{IC}_{50} = (34 \pm 17)\mu\text{mol/L}$, 对照去氧野尻霉素, $\text{IC}_{50} = (330 \pm 8)\mu\text{mol/L}$]; 抗氧化剂 [DPPH 清除剂, $\text{IC}_{50} = (482 \pm 2)\mu\text{mol/L}$, 对照丁基羟基茴香醚, $\text{IC}_{50} = (44.20 \pm 0.02)\mu\text{mol/L}$]. 【来源】 *Oriopsis glaberrima* (茎皮: 产率 = 0.00075% 干重). 【文献】 263.



43 1,3,5-Trihydroxy-4- γ -prenylacridone 1,3,5-三羟基-4-异戊烯基吡啶酮*

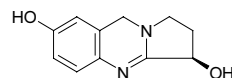
1,3,5-Trihydroxy-4-(γ -dimethylallyl)acridone $\text{C}_{18}\text{H}_{17}\text{NO}_4$ (311.34). 黄色粉末 (甲醇), mp 250 $^{\circ}\text{C}$, $[\alpha]_{\text{D}}^{25} = +51.6^{\circ}$ ($c = 0.62$, 甲醇). 【类型】 吡啶酮类生物碱. 【活性】 α -葡萄糖苷酶抑制剂 [$\text{IC}_{50} = (17 \pm 1)\mu\text{mol/L}$, 对照去氧野尻霉素, $\text{IC}_{50} = (330 \pm 8)\mu\text{mol/L}$]; 抗氧化剂 [DPPH 清除剂, $\text{IC}_{50} = (119 \pm 4)\mu\text{mol/L}$, 对照丁基羟基茴香醚, $\text{IC}_{50} = (44.20 \pm 0.02)\mu\text{mol/L}$]. 【来源】 *Oriopsis glaberrima* (茎皮: 产率 = 0.00063% 干重). 【文献】 263.



1.3 喹唑啉类生物碱

44 Vasicinol 鸭嘴花醇碱

[5081-51-6] $\text{C}_{11}\text{H}_{12}\text{N}_2\text{O}_2$ (204.23). mp 260 $^{\circ}\text{C}$. 【类型】 喹唑啉类生物碱. 【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】 5, 146.

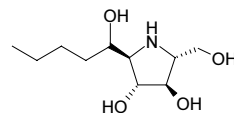


1.4 吡咯烷类生物碱

吡咯烷生物碱

45 6-C-Butyl-DMDP

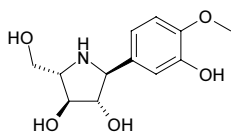
6-C-Butyl derivative of 2R,5R-bis(hydroxymethyl)-3R,4R-dihydroxypyrrolidine $\text{C}_{10}\text{H}_{21}\text{NO}_4$ (219.28). $[\alpha]_{\text{D}} = +174.3^{\circ}$ ($c = 0.32$, 水). 【类型】 吡咯烷生物碱. 【活性】 多种酶的抑制剂 (α -葡萄糖苷酶: 稻米中的, $\text{IC}_{50} > 1000\mu\text{mol/L}$, 参照物 DMDP, $\text{IC}_{50} = 300\mu\text{mol/L}$; 酵母中的, $\text{IC}_{50} > 1000\mu\text{mol/L}$, 参照物 DMDP, $\text{IC}_{50} = 3.6\mu\text{mol/L}$; 大鼠肠麦芽糖酶, $\text{IC}_{50} > 1000\mu\text{mol/L}$, 参照物 DMDP, $\text{IC}_{50} = 290\mu\text{mol/L}$; β -葡萄糖苷酶, 杏仁中的, $\text{IC}_{50} = 68\mu\text{mol/L}$, 参照物 DMDP, $\text{IC}_{50} = 13\mu\text{mol/L}$; β -半乳糖苷酶, 牛肝中的, $\text{IC}_{50} = 390\mu\text{mol/L}$, 参照物 DMDP, $\text{IC}_{50} = 2.2\mu\text{mol/L}$; 海藻糖酶, 猪肾中的, $\text{IC}_{50} > 1000\mu\text{mol/L}$, 参照物 DMDP, $\text{IC}_{50} = 200\mu\text{mol/L}$; 淀粉葡萄糖苷酶, 黑曲霉菌中的, $\text{IC}_{50} = 40\mu\text{mol/L}$, 参照物 DMDP, $\text{IC}_{50} = 19\mu\text{mol/L}$)^[589]. 【来源】 日本三叶沙参 *Adenophora triphylla* var. *japonica* (鲜全株). 【文献】 589.



46 Radicamine A 半边莲碱 A*

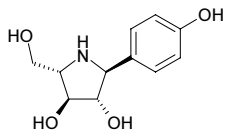
(2S,3S,4S,5S)-2-Hydroxymethyl-3,4-dihydroxy-5-(3-hy

droxy-4-methoxyphenyl)-pyrrolidine $C_{12}H_{17}NO_5$ (255.27). 暗黄色油状物, $[\alpha]_D^{25} = +43.7^\circ$ ($c = 0.13$, 水). 【类型】吡咯烷生物碱. 【活性】 α -葡萄糖苷酶抑制剂 ($IC_{50} = 6.7\mu\text{mol/L}$, 对照 DMDP, $IC_{50} = 4.9\mu\text{mol/L}$)^[635]. 【来源】半边莲 *Lobelia chinensis* [Syn. *Lobelia radicans*]. 【文献】635.



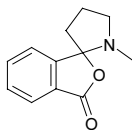
47 Radicamine B 半边莲碱 B*

(2*S*,3*S*,4*S*,5*S*)-2-Hydroxymethyl-3,4-dihydroxy-5-(4-hydroxyphenyl)-pyrrolidine $C_{11}H_{15}NO_4$ (225.25). 暗黄色油状物, $[\alpha]_D^{25} = +72.0^\circ$ ($c = 0.10$, 水). 【类型】吡咯烷生物碱. 【活性】 α -葡萄糖苷酶抑制剂 ($IC_{50} = 9.3\mu\text{mol/L}$, 对照 DMDP, $IC_{50} = 4.9\mu\text{mol/L}$)^[635]. 【来源】半边莲 *Lobelia chinensis* [Syn. *Lobelia radicans*]. 【文献】635.



48 Shihunine 石斛宁碱

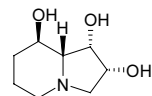
[4031-12-3] $C_{12}H_{13}NO_2$ (203.24). mp 79°C . 【类型】吡咯烷生物碱. 【活性】 Na^+, K^+ -ATP 酶抑制剂 (大鼠肾脏微粒体, 强作用). 【来源】美花石斛 *Dendrobium loddigesii*. 【文献】5, 25.



吲哚里西定生物碱

49 Swainsonine 苦马豆素

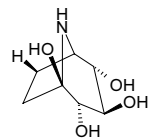
$C_8H_{15}NO_3$ (173.22). 【类型】吲哚里西定生物碱. 【活性】 α -甘露糖苷酶抑制剂^[448]; 毒素 (家畜)^[448]; 抗肿瘤 (活性明显)^[448]. 【来源】淡黄苦马豆* *Swainsonia luteola*, 灰白苦马豆* *Swainsonia canescens*, 山羊豆叶苦马豆 *Swainsonia galegifolia*. 【文献】146, 448.



莨菪烷类生物碱

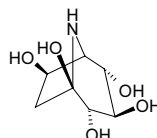
50 Calystegine B₂ 打碗花素 B₂

Nortropanoline $C_7H_{13}NO_4$ (175.19). 【类型】莨菪烷类生物碱. 【活性】乳糖酶抑制剂 (海藻糖酶抑制剂)^[420]. 【来源】桑枝 *Morus alba*, 桑属 *Morus* sp. 【文献】396, 420.



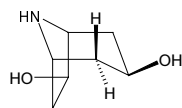
51 Calystegine C₁ 打碗花素 C₁

$C_7H_{13}NO_5$ (191.19). 【类型】莨菪烷类生物碱. 【活性】乳糖酶抑制剂 (海藻糖酶抑制剂)^[420]. 【来源】桑属 *Morus* sp. 【文献】420.



52 3 β ,6-*exo*-Dihydroxynortropane 3 β ,6-外型-二羟基去甲莨菪烷*

$C_7H_{13}NO_2$ (143.19). 无色粉末, $[\alpha]_D^{25} = -1.3^\circ$ ($c = 0.60$, 水). 【类型】莨菪烷类生物碱. 【活性】 α -葡萄糖苷酶抑制剂 ($IC_{50} = 33\text{mmol/L}$, 对照 1-Deoxynojirimycin, $IC_{50} = 0.98\text{mmol/L}$, Fagomine, $IC_{50} = 15\text{mmol/L}$)^[642]. 【来源】桑实 *Morus alba*. 【文献】642.

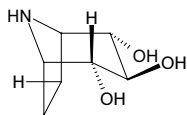


53 2 α ,3 β ,4 α -Trihydroxynortropane 2 α ,3 β ,4 α -三羟基去甲莨菪烷*

$C_7H_{13}NO_3$ (159.19). 无色粉末, $[\alpha]_D^{25} = 0^\circ$ ($c = 0.40$, 水). 【类型】莨菪烷类生物碱. 【活性】 α -葡萄糖苷酶抑制剂 ($IC_{50} = 15\text{mmol/L}$, 对照 1-Deoxynojirimycin,

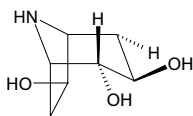
$IC_{50} = 0.98\text{mmol/L}$, Fagoming, $IC_{50} = 15\text{mmol/L}$)^[642].

【来源】桑实 *Morus alba*. 【文献】642.



54 2α,3β,6-*exo*-Trihydroxynortropane 2α,3β,6-外型-三羟基去甲莨菪烷*

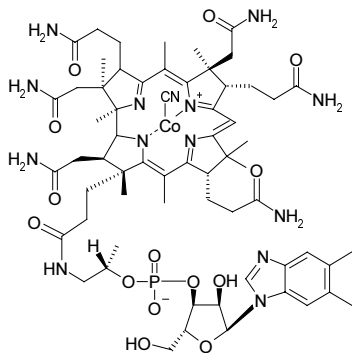
$C_7H_{13}NO_3$ (159.19). 无色粉末, $[\alpha]_D^{25} = -27.3^\circ$ ($c = 0.55$, 水). 【类型】莨菪烷类生物碱. 【活性】 α -葡萄糖苷酶抑制剂 ($IC_{50} = 25\text{mmol/L}$, 对照 1-Deoxyojirimucin, $IC_{50}=0.98\text{mmol/L}$, Fagoming, $IC_{50}=15\text{mmol/L}$)^[642]. 【来源】桑实 *Morus alba*. 【文献】642.



多吡咯类生物碱(维生素 B₁₂ 类)

55 Vitamin B₁₂ 维生素 B₁₂

5,6-Dimethylbenzimidazolyl cyanocobamide [68-19-9] $C_{63}H_{88}CoN_{14}O_{14}P$ (1355.40). 【类型】多吡咯类生物碱(维生素 B₁₂ 类). 【活性】辅酶. 【来源】莼 *Brasenia schreberi*, 醋柳果 *Hippophae rhamnoides*, 当归 *Angelica sinensis*, 冬虫夏草 *Cordyceps sinensis*, 黑大豆 *Glycine max*, 孔石莼 *Ulva pertusa*, 裙带菜 *Undaria pinnatifida*, 人参 *Panax ginseng* [Syn. *Panax schinseng*]. 【文献】2, 146, 245.

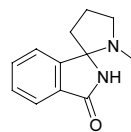


1.5 吲哚类生物碱

异吲哚类生物碱

56 Shihunidine 石斛宁定碱

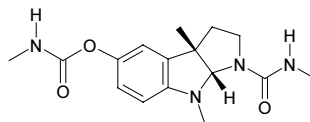
[135626-84-5] $C_{12}H_{14}N_2O$ (202.26). 无色柱状晶体(苯), mp 173~174°C, $[\alpha]_D^{22} = 0^\circ$. 【类型】异吲哚类生物碱. 【活性】 Na^+, K^+ -ATP 酶抑制剂(大鼠肾脏微粒体, 强作用). 【来源】美花石斛 *Dendrobium loddigesii*. 【文献】25.



环色胺类生物碱

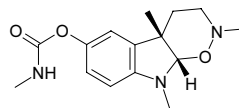
57 Eseramine 毒扁豆胺

[6091-57-2] $C_{16}H_{22}N_4O_3$ (318.38). 【类型】环色胺类生物碱. 【活性】胆碱酯酶抑制剂. 【来源】毒扁豆 *Physostigma venenosum*. 【文献】146.



58 Eseridine 毒扁豆定

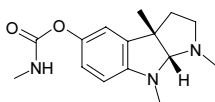
Geneserine [25573-43-7] $C_{15}H_{21}N_3O_3$ (291.35). 【类型】环色胺类生物碱. 【活性】胆碱酯酶抑制剂. 【来源】毒扁豆 *Physostigma venenosum*. 【文献】146.



59 Eserine 毒扁豆碱(依色林)

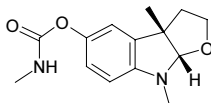
Physostigmine; Cogmine; Physostol [57-47-6] $C_{15}H_{21}N_3O_2$ (275.35). 不规则棱柱状晶体(乙醚或苯), mp 105~106°C, $[\alpha]_D^{17} = -76^\circ$ ($c = 1.3$, 三氯甲烷), $[\alpha]_D^{25} = -120^\circ$ (苯), 溶于乙醇、苯、三氯甲烷, 微溶于水.^[959] 【类型】环色胺类生物碱. 【活性】BChE 抑制剂 [$IC_{50}=(0.04\pm0.0001)\mu\text{mol/L}$ ^[436], $IC_{50}=(0.857$

± 0.008) $\mu\text{mol/L}$ [660], $\text{IC}_{50} = (0.875 \pm 0.008) \mu\text{mol/L}$ [874]; BChE 抑制剂 [马血清 BChE, $\text{IC}_{50} = (0.857 \pm 0.008) \mu\text{mol/L}$ [667]; AChE 抑制剂 [$\text{IC}_{50} = (0.41 \pm 0.001) \mu\text{mol/L}$ [660], $\text{IC}_{50} = (0.041 \pm 0.001) \mu\text{mol/L}$ [874]; AChE 抑制剂 [电鳗 AChE, $\text{IC}_{50} = (0.041 \pm 0.001) \mu\text{mol/L}$ [667]; 解毒剂 (抗胆碱药中毒); 用于治疗青光眼 (0.2%~0.5%) 和肌肉麻痹 [146]; 治疗阿尔茨海默病 (AD) 的药物; LD_{50} (鼠, ip) = 2.5 mg/kg [146]。【来源】毒扁豆 *Physostigma venenosum* (1864 年首次从该植物中分离 [959], 1969 年 R.K.Hill 等从该植物中分离 [958])。【文献】146, 436, 660, 667, 874, 958, 959。



60 Physovenine 囊毒碱

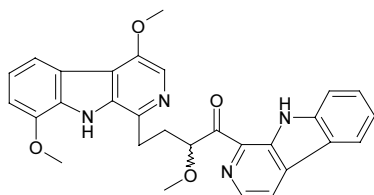
[6091-05-5] $\text{C}_{14}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_3$ (262.31). mp 123°C , $[\alpha]_{\text{D}}^{22} = -92^\circ$ (乙醇)。【类型】环色胺类生物碱。【活性】胆碱酯酶抑制剂; 类似毒扁豆碱样作用; 缩瞳剂 (强)。【来源】毒扁豆 *Physostigma venenosum*。【文献】146, 245。



β -咔啉类生物碱

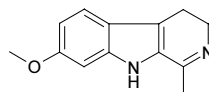
61 1-(β -Carbolin-1-yl)-4-(4,8-dimethoxy- β -carbolin-1-yl)-2-methoxy-butan-1-one 1-(β -1-咔啉基)-4-(4,8-二甲氧基- β -1-咔啉基)-2-甲氧基-1-丁酮 (苦木西碱 C)

Picrasidine C [88142-61-4] $\text{C}_{29}\text{H}_{26}\text{N}_4\text{O}_4$ (494.55). 淡黄色颗粒状晶体 (甲醇)。【类型】 β -咔啉类生物碱。【活性】cAMP 磷酸二酯酶抑制剂 (*in vitro*, $\text{IC}_{50} = 51 \mu\text{mol/L}$)。【来源】苦树皮 *Picrasma quassioides* [Syn. *Picrasma ailanthoides*]。【文献】9, 179, 188, 222, 245。



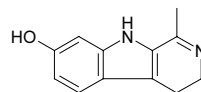
62 Harmaline 哈马灵

4,9-Dihydro-7-methoxy-1-methyl-3H-pyrido[3,4-b]indole; Harmidine; Dihydroharmine [304-21-2] $\text{C}_{13}\text{H}_{14}\text{N}_2\text{O}$ (214.27). 斜方形柱状晶体 (甲醇), 斜方八面体状晶体 (乙醇), mp $229\sim 231^\circ\text{C}$, 略溶于水、乙醚, 溶于乙醇。[959] 【类型】 β -咔啉类生物碱 【活性】中枢神经系统活性 (兴奋大脑皮层、脊髓以及引起幻觉、震颤和阵发性惊厥); 横纹肌兴奋剂 (高剂量); 减慢心率 (蛙心脏 *in vitro* EC = 1:25000); 单胺氧化酶抑制剂; 肠道平滑肌松弛剂 (小肠, 低剂量); 兴奋脑桥 (引起四肢痉挛和僵硬)。【来源】骆驼蓬 *Peganum harmala*, 鸡蛋果 *Passiflora edulis*, 粉红色西番莲 *Passiflora incarnata*, 骆驼蓬子 *Peganum harmala*。【文献】5, 146, 245, 959。



63 Harmalol 哈马酚

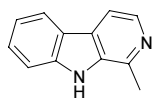
[525-57-5] $\text{C}_{12}\text{H}_{12}\text{N}_2\text{O}$ (200.24). 三水合物为红色针状晶体 (乙醇水溶液), 无水物 mp 212°C (分解)。【类型】 β -咔啉类生物碱 【活性】抗高血压; 引起中枢神经系统渐进性麻痹 (动物试验); 抑制活性钠转移 (膀胱中); 单胺氧化酶抑制剂; Na^+, K^+ -ATP 酶抑制剂; 减慢心率和提高心肌收缩力 (麻醉犬, 氯化物)。【来源】骆驼蓬 *Peganum harmala*, 鸡蛋果 *Passiflora edulis*。【文献】148, 245。



64 Harman 哈尔满

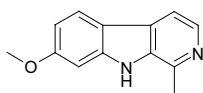
[486-84-0] $\text{C}_{12}\text{H}_{10}\text{N}_2$ (182.23). mp $237\sim 238^\circ\text{C}$, mp 228°C 。【类型】 β -咔啉类生物碱 【活性】抗真菌 (趾间发癣菌, MIC = $1.6\sim 200.0 \mu\text{g/mL}$); 对神经系统有双向作用 (低剂量时为运动抑制剂, 高剂量时引起惊厥); 抑制活性钠转移 (蛙, 膀胱); Na^+, K^+ -ATP 酶抑制剂 (蛙肾); 植物生长调节剂; 子宫兴奋剂。【来源】刺蒺藜 *Tribulus terrestris*, 醋柳果 *Hippophae rhamnoides*, 粉红色西番莲 *Passiflora incarnata*, 钩藤 *Uncaria rhynchophylla* [Syn. *Nauclea*

rhynchophylla], 鸡蛋果 *Passiflora edulis*, 硫球蛇根草 *Ophiorrhiza liukuensis* (全株), 日本蛇根草 *Ophiorrhiza japonica*, 沙枣 *Elaeagnus angustifolia*, 远志 *Polygala tenuifolia*, 珠子树 *Symplocos racemosa*, 东方钩藤* *Uncaria orientalis*, 多脉钩藤* *Uncaria nervosa*, 厚叶钩藤* *Uncaria callophylla*, 绵毛钩藤* *Uncaria lanosa*, 婆罗洲钩藤* *Uncaria borneensis*, 浅灰钩藤* *Uncaria canescens*, 酸钩藤* *Uncaria acida*, 椭圆钩藤 *Uncaria elliptica*, 狭钩藤 *Uncaria attenuata*, 钩藤属 *Uncaria barbata*, 存在于许多植物中。【文献】 2, 96, 146, 727, 895.



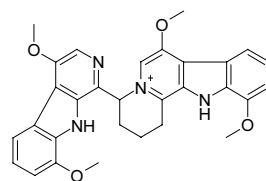
65 Harmine 哈尔明

Banisterine; Leucuharmine; Telepathine; Yageine [442-51-3] $C_{13}H_{12}N_2O$ (212.25). 晶体, mp 257~259°C, mp 264~265°C. 【类型】 β -咔啉类生物碱 【活性】 心血管活性 (麻醉犬, 使用其氯化物, 减慢心率, 增加输出血压、主动脉血流和心肌收缩性); 致幻剂 (大剂量); 抑制子宫收缩; 单胺氧化酶抑制剂 (人); 中枢兴奋剂; 抗锥虫。【来源】 刺蒺藜 *Tribulus terrestris*, 鸡蛋果 *Passiflora edulis*, 骆驼蓬 *Peganum harmala*, 骆驼蓬子 *Peganum harmala*, 沙枣 *Elaeagnus angustifolia*, 山油麻 *Trema dielsiana*, 香唐松草 *Thalictrum foetidum*。【文献】 3, 5, 146, 147, 245.



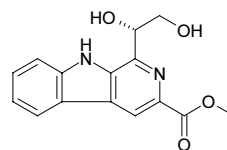
66 Kumujansine B 苦木碱 B (苦木西碱 S)

Picrasidine S [112503-87-4] $C_{30}H_{29}N_4O_4^+$ (509.59). 淡黄色颗粒状晶体, mp 270°C (分解); 淡黄色针状晶体 (甲醇), mp 215~217°C (分解)。【类型】 β -咔啉类生物碱 【活性】 cAMP 磷酸二酯酶抑制剂 (*in vitro*, 盐酸盐 $IC_{50} = 30\mu\text{mol/L}$)。【来源】 苦树皮 *Picrasma quassioides* [Syn. *Picrasma ailanthoides*]。【文献】 19, 182, 245.



67 Dichotomine C 银柴胡碱 C*

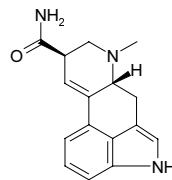
$C_{15}H_{14}N_2O_4$ (286.29). 黄色粉末, $[\alpha]_D^{27} = -16.6^\circ$ ($c = 0.50$, 甲醇)。【类型】 β -咔啉类生物碱。【活性】 β -己糖胺酶释放抑制剂 (RBL-2H3 细胞, $IC_{50} = 62\mu\text{mol/L}$)^[795]; TNF- α 释放抑制剂 (RBL-2H3 细胞, 抗原 IgE 介导的, $IC_{50} = 19\mu\text{mol/L}$)^[795]; IL-4 释放抑制剂 (RBL-2H3 细胞, 抗原 IgE 介导的, $IC_{50} = 15\mu\text{mol/L}$)^[795]。【来源】 银柴胡 *Stellaria dichotoma* var. *lanceolata* (根: 产率 = 0.0016% 干重)。【文献】 795.



麦角类生物碱

68 Lysergamide 麦角酰胺

$C_{16}H_{17}N_3O$ (267.33). 棱柱状晶体 (甲醇), mp 242°C (分解)。【类型】 麦角类生物碱。【活性】 5-羟色胺抑制剂; 致幻剂; 胆碱酯酶抑制剂 (人血清); 中枢兴奋剂 (引起狂躁); 毒素 (怀孕小鼠的胚胎)。【来源】 青紫牵牛 *Ipomoea violacea*, 三色牵牛 *Ipomoea tricolor*, 银叶薯* *Ipomoea argyrophylla*。【文献】 146.

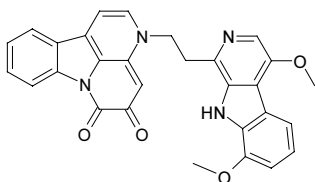


吲哚-1,5-二氮杂萘酮类生物碱

69 Picrasidine M 苦木西碱 M

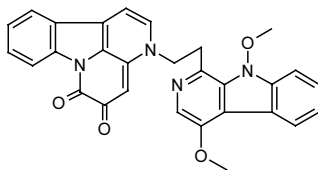
[99964-79-1] $C_{29}H_{22}N_4O_4$ (490.52). 桔红色针状晶体 (二甲基硫化物), mp 294~295°C (分解)。【类型】 吲

咪-1,5-二氮杂萘酮类生物碱。【活性】cAMP 磷酸二酯酶抑制剂 (*in vitro*, $IC_{50} = 96\mu\text{mol/L}$)。【来源】苦树皮 *Picrasma quassioides* [Syn. *Picrasma ailanthoides*]。【文献】9, 180, 182, 222.



70 Picrasidine N 苦木西碱 N

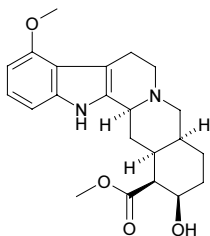
[101219-62-9] $C_{29}H_{22}N_4O_4$ (490.52). 桔红色针状晶体 (三氯甲烷: 甲醇 = 1:1), mp 171~172°C (分解)。【类型】咪唑-1,5-二氮杂萘酮类生物碱。【活性】cAMP 磷酸二酯酶抑制剂 (*in vitro*, $IC_{50} = 2\mu\text{mol/L}$)。【来源】苦树皮 *Picrasma quassioides* [Syn. *Picrasma ailanthoides*]。【文献】9, 181, 182, 222.



育亨宾类生物碱

71 Alstovenine 印度鸭脚树碱

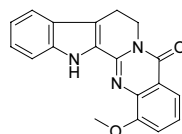
[4837-79-0] $C_{22}H_{28}N_2O_4$ (384.48). 氯化四胺盐: mp 216°C (分解); 苦味酸四胺盐: mp 257~258°C; 游离碱: mp 170~172°C。【类型】育亨宾类生物碱。【活性】单胺氧化酶抑制剂 (低剂量); 中枢兴奋剂 (高剂量)。【来源】印度鸭脚树 *Alstonia venenata*。【文献】16, 146.



吴茱萸类生物碱

72 1-Methoxyrutaecarpine 1-甲氧基吴茱萸次碱

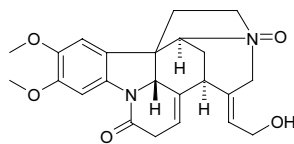
$C_{19}H_{15}N_3O_2$ (317.35)。【类型】吴茱萸类生物碱。【活性】血小板聚集抑制剂; DNA 异构酶抑制剂; 抗菌; 细胞毒。【来源】花椒属 *Zanthoxylum* sp. 【文献】397.



马钱子类生物碱

73 Isobrucine N-oxide 异马钱子碱氮氧化物

[130641-43-9] $C_{23}H_{26}N_2O_5$ (410.47). 白色粉末, $[\alpha]_D^{20} = +34.2^\circ$ ($c = 0.0017$, 甲醇)。【类型】马钱子类生物碱。【活性】细胞毒 (*in vitro*, HeLa, $IC_{50} = 26\mu\text{mol/L}$; K562, $IC_{50} = 15\mu\text{mol/L}$; Hep2, $IC_{50} = 4.3\mu\text{mol/L}$); 抗氧化剂; 抑制游离基引起的对心脏细胞的损害; 自由基清除剂 (抑制超氧化物阴离子的形成, X-XOD, $IC_{50} = 86.5\mu\text{mol/L}$, NADH, $IC_{50} = 8.9\mu\text{mol/L}$); 黄嘌呤氧化酶抑制剂 [$IC_{50} = (13.3 \pm 6.0)\mu\text{mol/L}$]。【来源】马钱子 *Strychnos nux-vomica*。【文献】2, 98, 216, 217, 218.



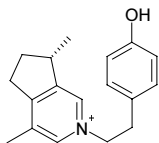
1.6 吡啶和哌啶类生物碱

吡啶生物碱

74 N-(p-Hydroxyphenethyl)actinidine 缬草根定碱 (缬草生物碱 A)

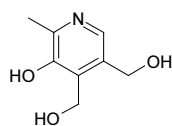
Valerianae alkaloid A [15794-92-0] $C_{18}H_{22}NO^+$ (268.38). mp 201~203°C (分解)。【类型】吡啶生物碱。

【活性】胆碱酯酶抑制剂。【来源】缬草 *Valeriana officinalis*。【文献】5, 146, 147.



75 Pyridoxine 吡哆素

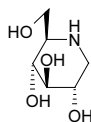
Vitamin B₆ [65-23-6] C₈H₁₁NO₃ (169.18). mp 160°C (升华)。【类型】吡啶生物碱。【活性】预防动脉硬化; 细胞生长的必需物质 (促进蛋白质的生物合成); 某些氨基酸的氨基转移酶、脱羧酶及消旋酶的辅酶; 改善肝炎病人的食欲和症状。【来源】八角茴香 *Illicium verum*, 蜂蜜 *Apis cerana*, 甘蔗 *Saccharum sinensis*, 蘑菇 *Agaricus campestris*, 牛乳 *Bos taurus domesticus*; *Bubalus bubalis*, 玉蜀黍 *Zea mays*。【文献】5, 146.



哌啶生物碱

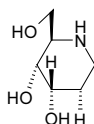
76 1-Deoxynojirimycin 1-去氧野尻霉素*

Moranoline [19130-96-2] C₆H₁₃NO₄ (163.17)。【类型】哌啶生物碱。【活性】α-葡萄糖苷酶抑制剂 (IC₅₀ = 0.3mmol/L)^[640]。【来源】桑枝 *Morus alba*。【文献】396, 640.



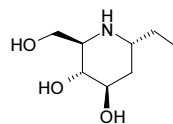
77 3-Epifagomine 3-表法哥明*

C₆H₁₃NO₃ (147.18)。【类型】哌啶生物碱。【活性】乳糖酶抑制剂 (异麦芽糖酶抑制剂)^[420]。【来源】桑白皮 *Morus alba*。【文献】420.



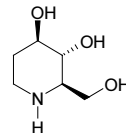
78 α-1-C-Ethyl-fagomine α-1-C-乙基法哥明*

C₈H₁₇NO₃ (175.23)。[α]_D = +45.7° (c = 0.71, 水)。【类型】哌啶生物碱。【活性】多种酶的抑制剂 (α-葡萄糖苷酶: 稻米中的, IC₅₀ = 490μmol/L, 对照 DMDP, IC₅₀ = 300μmol/L; 酵母中的, IC₅₀ > 1000μmol/L, DMDP, IC₅₀ = 3.6μmol/L; 大鼠肠麦芽糖酶, IC₅₀ > 1000μmol/L, DMDP, IC₅₀ = 290μmol/L; β-葡萄糖苷酶, 杏仁中的, IC₅₀ > 1000μmol/L, DMDP, IC₅₀ = 13μmol/L; β-半乳糖苷酶, 牛肝中的, IC₅₀ = 29μmol/L, DMDP, IC₅₀ = 2.2μmol/L; 海藻糖酶, 猪肾中的, IC₅₀ > 1000μmol/L, DMDP, IC₅₀ = 200μmol/L; 淀粉葡萄糖苷酶, 黑曲霉菌中的, IC₅₀ > 1000μmol/L, DMDP, IC₅₀ = 19μmol/L)^[589]。【来源】日本三叶沙参 *Adenophora triphylla* var. *japonica* (鲜全株)。【文献】589.



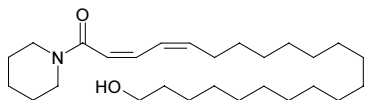
79 Fagomine 法哥明*

3,4-Dihydroxy-2-piperidinemethanol [53185-12-9] C₆H₁₃NO₃ (147.18)。【类型】哌啶生物碱。【活性】降血糖 (对 SIZ 引起的小鼠糖尿病作用显著)^[396]; α-葡萄糖苷酶抑制剂 (IC₅₀ = 15mmol/L)^[642]。【来源】桑枝 *Morus alba*。【文献】396, 642.

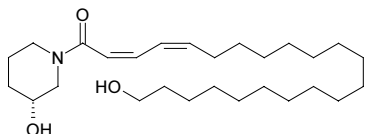


80 Haloxyline A 梭梭因 A*

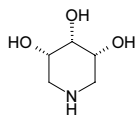
C₂₇H₄₉NO₂ (419.70)。无色晶体, mp 161~162 °C。【类型】哌啶生物碱。【活性】AChE 抑制剂 [*in vitro*, IC₅₀ = (25.3±0.02)μmol/L, 对照加兰他敏, IC₅₀ = (0.5±0.05)μmol/L]^[709]; BChE 抑制剂 [*in vitro*, IC₅₀ = (19.0±0.03)μmol/L, 对照加兰他敏, IC₅₀ = (8.5±0.01)μmol/L]^[709]; 抗真菌 (发癣菌属 *Trichophyton longifusus*、白色念珠菌 *Candida albicans*、黄曲霉菌 *Aspergillus flavus*、小孢子菌属 *Microsporum canis*、平滑球假丝酵母 *Candida glabrata*、串珠镰孢属 *Fusarium solani*)^[709]。【来源】盐角草梭梭* *Haloxylon salicornicum* (全株)。【文献】709.

**81 Haloxyline B 梭梭因 B***

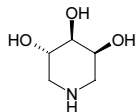
$C_{27}H_{49}NO_3$ (435.70). 无色晶体, mp 142~143 °C. 【类型】哌啶生物碱. 【活性】AChE 抑制剂 [*in vitro*, $IC_{50} = (20.2 \pm 0.01) \mu\text{mol/L}$, 对照加兰他敏, $IC_{50} = (0.5 \pm 0.05) \mu\text{mol/L}$]^[709]; BChE 抑制剂 [*in vitro*, $IC_{50} = (14.7 \pm 0.02) \mu\text{mol/L}$, 对照加兰他敏, $IC_{50} = (8.5 \pm 0.01) \mu\text{mol/L}$]^[709]; 抗真菌 (发癣菌属 *Trichophyton longifusus*、白色念珠菌 *Candida albicans*、黄曲霉菌 *Aspergillus flavus*、小孢子菌属 *Microsporium canis*、平滑球假丝酵母 *Candida glabrata*、串珠镰孢属 *Fusarium solani*)^[709]. 【来源】盐角草梭梭 * *Haloxylon salicornicum* (全株). 【文献】709.



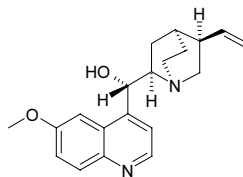
82 Mesotrihydroxypiperidine 内消旋-三羟基哌啶 [172588-13-5] $C_5H_{11}NO_3$ (133.15). 无色油状物, $[\alpha]_D^{20} = \pm 0^\circ$ ($c = 0.3$, 甲醇). 【类型】哌啶生物碱. 【活性】 α -葡萄糖苷酶抑制剂 ($IC_{50} = 3.70 \mu\text{mol/L}$); α -甘露糖苷酶抑制剂 ($IC_{50} = 1.88 \mu\text{mol/L}$). 【来源】佩兰 *Eupatorium fortunei*. 【文献】220.

**83 3β,4β,5α-Trihydroxypiperidine 3β,4β,5α-三羟基哌啶**

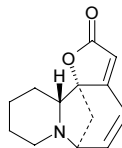
[130114-77-1] $C_5H_{11}NO_3$ (133.15). 无色油状物, $[\alpha]_D^{20} = +66.7^\circ$ ($c = 0.3$, 甲醇). 【类型】哌啶生物碱. 【活性】 α -葡萄糖苷酶抑制剂 ($IC_{50} = 1.88 \mu\text{mol/L}$); β -半乳糖苷酶抑制剂 ($IC_{50} = 3.76 \mu\text{mol/L}$). 【来源】佩兰 *Eupatorium fortunei*. 【文献】220.

**金鸡纳类生物碱****84 Quinidine 奎尼丁**

β -Quinine [56-54-2] $C_{20}H_{24}N_2O_2$ (324.43). mp 174~175 °C (脱水化合物). 【类型】金鸡纳类生物碱. 【活性】CYP2D6 药物代谢酶抑制剂 ($IC_{50} = 0.068 \mu\text{mol/L}$)^[703]; CYP2D6 药物代谢酶抑制剂 (*in vitro*, $IC_{50} = 0.082 \mu\text{mol/L}$)^[808]. 【来源】金鸡勒 *Cinchona ledgeriana*. 【文献】3, 703, 808.

**一叶萩碱类生物碱****85 Securinine 一叶萩碱**

Securinan-11-one [5610-40-2] $C_{13}H_{15}NO_2$ (217.27). 浅黄色晶体, mp 142~143 °C, $[\alpha]_D^{20} = 1042.3^\circ$ (乙醇), 易溶三氯甲烷、乙醇, 微溶于乙醚、丙酮、水.^[959] 【类型】一叶萩碱类生物碱. 【活性】升高血压 (麻醉动物, iv); 提高心肌收缩力 (麻醉动物 iv); 胆碱酯酶抑制剂; 呼吸兴奋剂 (麻醉动物, iv); 中枢兴奋剂; LD_{50} (鼠, iv) = 3.5mg/kg 或 6.3mg/kg, LD_{50} (鼠, ip) = 25mg/kg, LD_{50} (大鼠, ip) = 41mg/kg. 【来源】一叶萩 *Securinega suffruticosa* (1956 年首次从该植物中分离^[959]), 盘状叶下珠 * *Phyllanthus discoides*. 【文献】5, 146, 959.

**石松碱类生物碱****86 Huperzine A 石杉碱 A (卷柏石松碱)**

Selagine $C_{15}H_{18}N_2O$ (242.32). mp 224~226 °C. 【类型】石松碱类生物碱. 【活性】胆碱酯酶抑制剂 (显著活