

天然药物的研究与应用

史清文 教授

药学院天然药物化学教研室405室

QQ: 46897262 Mobile: 13643389897

<http://202.206.48.73/tryw1/default.asp>



Laboratory of **Natural** Medicinal Chemistry



李力更, 王于方, 史清文,
霍长虹, 吴一兵, 张媛丽

Laboratory of **Natural** Medicinal Chemistry

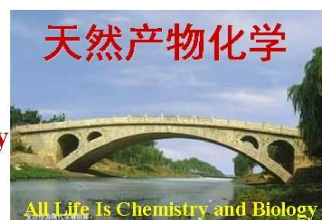


Where Chemistry and Biology Meet ?

天然产物化学

Chemistry

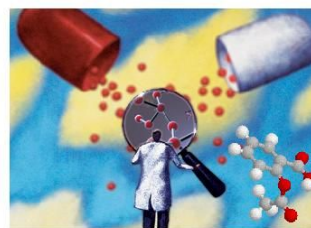
Biology



“药学开创健康生活”



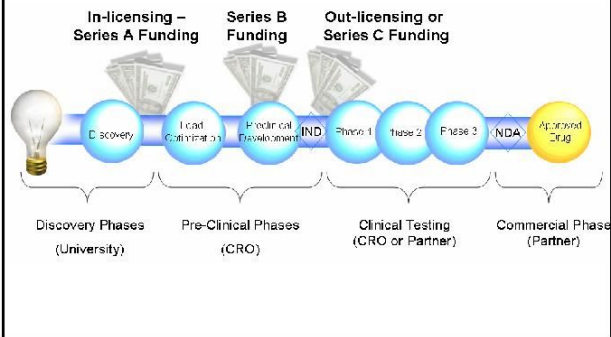
What Is A Medicine ?



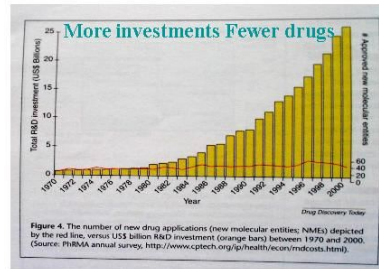
生命是由物质组成的，物质的本质是化学的。机体正常功能的维持是由于体内特定的化学物质间相互反应来完成的。机体的正常生理状态的保持和病理状态的产生都有其物质基础，即是机体内化学反应的平衡或失衡的结果。药物就是通过维持或干预这些化学反应来达到治疗的目的。

A drug is any chemical (Syn. or Nat.) that affects the way our body works.

药物研发—多学科系统工程



1970-2000 间新药投入与产出比较



The costs of drug discovery and drug development continue to **increase at astronomical rates**, yet despite these expenditures, there is a decrease in the number of new medicines introduced into the world market.

天然药物就在我们身边



大蒜 *Allium sativum* L. 不仅具有防癌、抗癌、降低血糖，预防糖尿病、抗菌效果，在控制肥胖方面也具有意想不到的效果。大蒜自古就被当作天然杀菌剂，有“天然抗生素”之称，是人体循环及神经系统的天然强健剂—可降血压护心脑。
《癌症》：大蒜能治疗某些致命脑部癌症。

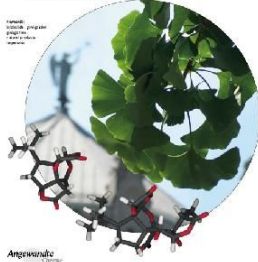
姜黄素 Curcumin



姜黄素是目前受世界各国科学家非常关注的一个药物，也是世界各国花大量人力财力来开发和研究的一个药物。近二十年来，已有约4,500篇有关姜黄素的论文在世界各类科学杂志上发表。2007年，美国NIH批准姜黄素用于对付四个病的临床实验：直肠癌，胰腺癌，老年痴呆和多发性骨髓瘤。随后，乳腺癌和骨关节炎等多种疾病的临床实验也被陆续批准实施。

来自植物的抗凝血化合物

Chemistry and Biology of Terpene Diterpenes from *Ginkgo biloba*
Estelle S. Schraga and Jeff M. Stauder

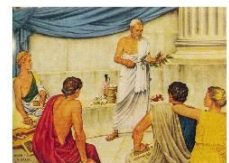


银杏 (*Ginkgo biloba*)

药物源于草

药—治病之草也 **Medicine - therapeutic herbs**

远古时代，人类祖先们就根据生活经验从自然界寻找被称为“药”的一类天然物质来缓解和解除人们所受头疼感冒等疾病的折磨。这种来自天然的能治病的“物质”被称之为“天然药物”并流传下来，当今世界上无论哪个民族至今还有不少仍在使用流传了几千年的“天然药物”。大概200多年前人们开始探索其中的有效成分，并诞生了“天然药物化学”。100多年前才诞生了现在的“西药”。



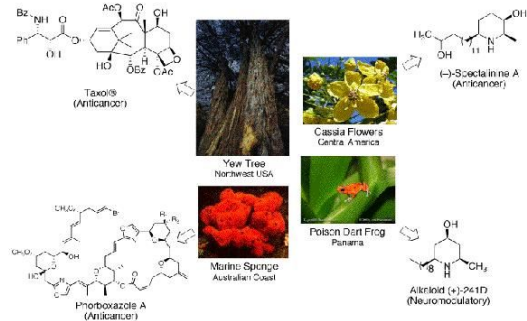
天然药物化学



200 Years ago

天然药物化学

Medicinal Natural Product Chemistry



生物一级、二级代谢及其代谢产物

1. 一级代谢 (Primary Metabolism) — 生物化学
2. 二级代谢产物 (Secondary Metabolites) 以一级代谢产生的代谢产物为原料(或前体), 经不同途径进一步合成的过程叫二级代谢 (Secondary Metabolism)。二级代谢产生结构千变万化、千奇百怪、绚丽多姿的化学物质称为二级代谢产物-天然产物。

3. 二级代谢产物的作用

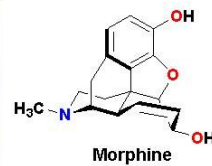
1) 维持植物的特性与特征

2) 重要的药物资源

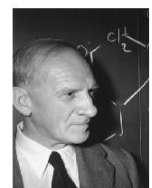
Competitive advantage through neighbor and chemical ecological functions-Defense, Attack and Signalling



“快乐的植物”与“吗啡”(Morphine)



Dose-control Medicine

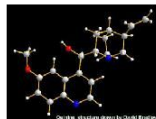
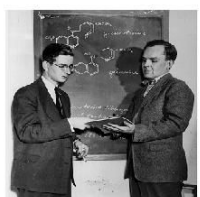
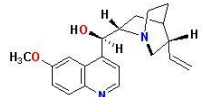


Robert Robinson 1947

吗啡于1805年分离得到(标志着天然药物化学的诞生), 分子结构直到1925年才由牛津大学的Sir Robert Robinson (1886-1975) 通过一系列的降解实验得出。1955年X-衍射证实。吗啡的人工合成于1952年被美国罗切斯特大学的Marshall D. Gates首先实现(JACS 1952, 74, 1109)。大名鼎鼎的海洛因就是由吗啡衍生而来的, 比吗啡毒性更强更具有成瘾性的产物—二乙酰吗啡。

奎宁 Quinine

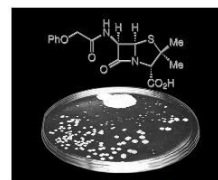
一个意外成就一个翻天覆地的发现



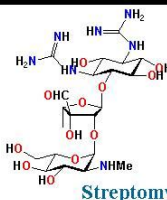
Quinine isolated in 1820 Structure in 1908. 1944 Total Synthesis Woodward in 27 years old and got Nobel Prize in 1965.

完全改变了人类与传染病生死搏斗的历史

微生物代谢物



Alexander Fleming 1945 NP



Streptomycin



S. A. Waksman 1952 NP