

Epibatidine
地棘蛙素-强镇痛

Cilazapril
Hypertension, congestive heart failure

225 H
225H离子通道阻滞剂-被用作止痛药

Strauss E. *Science*, 1998, 279, 32-33.

天然产物—生活中无处不在

Pederin

Trinervitane
抗菌

Periplanone B
Sexual excitant

白蚁 蟑螂

Molecules that Changed the World

大自然是位神奇的化学家，合成了许许多多形形色色结构复杂的天然产物，它们在人类医学发展史上扮演了非常重要角色，曾诞生了许多影响人类历史进程和命运的重要小分子，**aspirin, morphine, quinine, steroidal contraceptives, digoxin, penicillin, streptomycin, cyclosporin, taxol, vinblastine, ginkgolides, artemisinin and lavastatin and so on**，这些分子说明了天然产物具有巨大的历史作用和未来发展潜力。在现代药物研究中，每一次具有轰动效应的药物的出现一般都伴随着一种新类型天然产物的发现，同时也推动了有机化学和**生命科学的发展**。

Artemisinin Penicillin Streptomycin Lovastatin

Nature Is A Great Architect

Ginkgolide C Ryanodine Azadirachtin Macecrystal Z Morphine Echinopine B

Tetrodotoxin Strychnine Ajmaline Huperzine A Metaphanine Gelsemine Vinigrol Khayasin

Nature, An Excellent Synthetic Chemist

Maitotoxin 刺尾鱼毒素

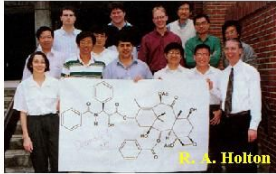
Taxol® (紫杉醇® —最后一道防线)

红豆杉: 希望之树

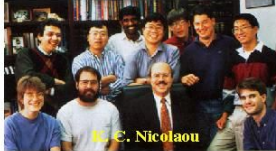
含量 0.004% 1971年
1992年FDA Approved
Ovarian, breast cancers
1994年 \$400 million
2006年 \$4 billion

Nature 1979, 277: 665-667

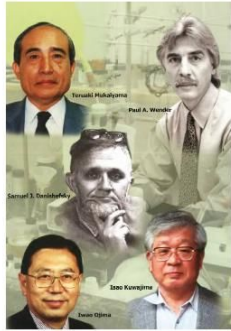
Worldwide Race For Taxol® Synthesis



R. A. Holton



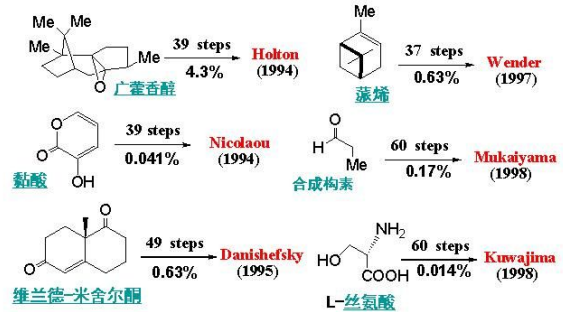
R. E. Nicolaou



Nature, 1994, 367: 630-634.

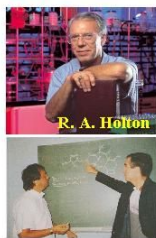
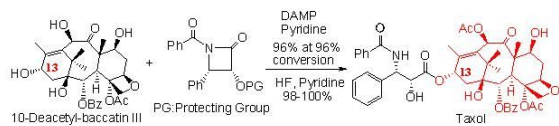
Total Synthesis of Taxol®

1971-Present



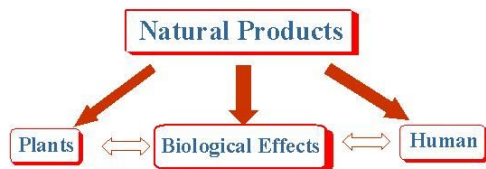
2008年Takahashi (高桥)用了48步收率0.0070%

Semi-Synthesis of Taxol®



Nature, An Excellent Synthetic Chemist

天然药物化学的应用



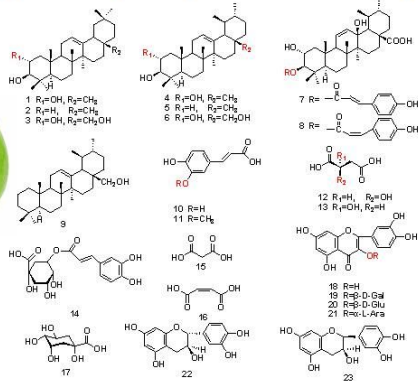
- ◆ 探索植物(中药), 动物, 海洋生物等防病治病的物质基础
- ◆ 发现新药, 寻找先导化合物
- ◆ 促进其他学科的发展—有机化学, 分析化学, 生命科学

Why Drinking Green Tea Could Prevent Cancer?



Jankum, H. *et al.* Why drinking green tea could prevent cancer. *Nature* 1997, 387, 561

Why an apple a day keep the doctor away?

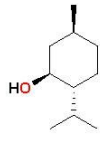


30多年来在云南北部每年都发生几十例甚至更多的不明原因猝死，大多发生在7-9月雨季。

2008年昆明植物所高等真菌化学专家刘吉开研究员和高等真菌分类专家杨祝良研究员进入该项研究。从云南一种新的小白菌 (*Trogia sp.*) 中分离鉴定出了两个新的非蛋白质氨基酸: **2R-氨基-4S-羟基-5-己炔酸**, **2R-氨基-5-己炔酸**, 动物实验证明了其毒性成分。证明该菌是30多年来导致云南不明原因猝死的罪魁祸首。
Science 2010, 329: 132-134



薄荷



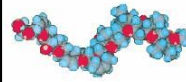
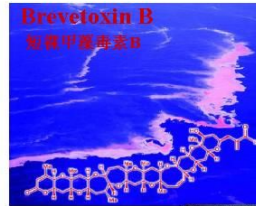
Menthol



Fig. 1. Menthol is included in many different consumer products including (A) chocolate, (B) chewing gum and (C) toothpaste.

Phytochemistry 2013, 96: 15-25

赤潮 Red Tides



2008年在加拿大产生赤潮的硅藻 *Alexandrium tamarense* 中检测出5种石房蛤毒素的类似物。

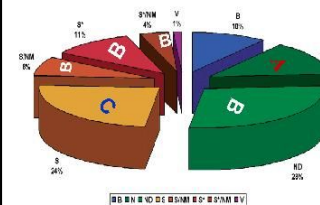
天然药物化学的应用

- ◆ 探索植物(中药), 动物, 海洋生物等防病治病的物质基础
- ◆ 发现新药、寻找新药先导化合物
- ◆ 促进其他学科的发展—生命科学, 有机化学, 分析化学

Nature Is Also the Best Drug Designer
 -----Antibiotics and Anticancer

天然产物在抗肿瘤治疗中起着重要作用

All available anticancer drugs, 1940s-06/2006, by source (N) 175



A直接来源于天然产物的抗肿瘤药物占14%; B以天然产物为先导进行全合成或半合成而形成的抗肿瘤药物占51%,
 二者共占65%。