

云南省自然科学奖推荐项目公示材料

项目名称：十四种资源植物的化学及生物活性

完成单位：中国科学院昆明植物研究所

主要完成人员：张颖君（中国科学院昆明植物研究所）、许敏（中国科学院昆明植物研究所）、杨崇仁（中国科学院昆明植物研究所）、朱宏涛（中国科学院昆明植物研究所）、王东（中国科学院昆明植物研究所）

推荐单位：中国科学院昆明分院

一、项目简介

针对大戟科、楝科、蓼科、桃金娘科、兰科、冬青科和蛇菰科等 7 科 14 种资源植物，应用天然产物化学、分析化学和生物学等研究手段，系统地开展了西印度醋栗（*Phyllanthus acidus*）、越南叶下珠（*Phyllanthus cochinchinensis*）、余甘子（*Phyllanthus emblica*）、香椿（*Toona sinensis*）、草血竭（*Polygonum paleaceum*）、金荞麦（*Fagopyrum dibotrys*）、泡核桃（*Juglans sigillata*）、青天葵（*Nervilia fordii*）、叶下珠（*Phyllanthus urinaria*）、直干桉（*Eucalyptus maideni*）、多蕊蛇菰（*Balanophora polyandra*）、岗梅根（*Ilex asprella*）、落萼叶下珠（*Phyllanthus flexuosus*）、大蛇菰（*Rhopalocnemis phalloides*）的化学成分及其抗病毒和抗氧化的生物活性研究。发现了结构新颖的天然产物；建立了确定闭花木烷型二萜配糖体绝对构型的新方法；构建了资源植物的小分子化合物库；获得具有显著抗病毒活性和抗氧化活性的天然小分子化合物，为抗病毒创新药物的开发奠定了基础；阐明了香椿、金荞麦、草血竭等民族民间用药的活性成分，为科学用药提供依据。

二、重要科学发现

1. 系统地研究了西印度醋栗、越南叶下珠、余甘子、叶下珠、落萼叶下珠等 5 种叶下珠属药用植物的化学成分。从中共分离鉴定了 382 个化合物，包括新化合物 152 个，结构类型涉及没药烷型倍半萜苷、闭花木烷型二萜苷、单萜苷、四降三萜、木脂素、黄酮、糖酯和酚苷类。在该属植物中发现了一系列高度氧化的降没药烷型倍半萜及其配糖体，这些配糖体连接的糖基，除常见的葡萄糖、木糖和鼠李糖外，还有罕见的 6-去氧葡萄糖、多元醇和氨基葡萄糖。苷元具有通过缩酮形成 5, 6 螺环没药烷型或降没药烷型倍半萜骨架，是自然界中比较少见

的化合物类型。此外，从该属植物中首次发现结构新颖的没药烷型倍半萜苷二聚体以及具有乙炔基取代的闭目花烷型二萜苷和环系重排为 6/6/5/6 新环系的四降三萜类化合物。其中，四降三萜类成分被本领域的权威刊物 *Nature Product Report* 列为热点化合物。

2. 筛选出具有显著抗病毒活性的天然小分子化合物。以单纯疱疹 I 型、II 型病毒 (HSV-1, -2)、柯萨奇病毒 B3 病毒 (CVB3)、乙肝病毒 (HBV)、流感病毒 (N3H2)、手口足病毒 (EV71) 等病毒株为靶标，对叶下珠属植物中分离到的化学成分进行了抗病毒活性测试，发现 7 个化合物的活性显著高于阳对照。构效关系研究发现，C-7 酮基、C-10 羟基、C-13 酯化及 C-13 连接的双糖基是抗病毒活性的必须药效基团。C-10 苯甲酰基是抗病毒活性的助效基团，如果被其它基团取代，其抗病毒活性将减弱。

3. 进一步完善了民族民间药用、食用资源植物的化学成分及生物活性研究。从草血竭、金荞麦、香椿、青天葵、多蕊蛇菰、大蛇菰、泡核桃、直干桉等植物中分离鉴定了 163 个化合物，包括新化合物 25 个。得到一系列结构新颖的萜类、黄酮苷类、含磺酸基三萜皂苷类化合物以及具有显著抗氧化活性的酚类化合物，为民族民间药用和食用资源植物的开发利用提供了科学依据。

4. 优化了资源植物中复杂天然产物化学结构的解析方法。针对闭花木烷型二萜手性中心附近具有苯环发色团的特点，建立了通过量子化学计算模拟圆二色谱 (ECD) 曲线与实验 ECD 谱图进行对照来确定这类二萜配糖体绝对构型的方法，并首次发现糖基的存在可影响二萜骨架构象，进而改变 CD 曲线的形状。

本项目共选取 8 篇代表性论文和 12 篇核心论文进行引证检索，检索结果显示 20 篇论文的总影响因子为 65.581；总引 653 次，他引 550 次。其中，8 篇代表性论文的总影响因子为 34.128；总引 386 次，他引 332 次。

通过该项目，培养博士 7 名，硕士 5 名。1 人晋升为教授，1 人晋升为高级工程师。

三、候选人对项目的贡献

1、张颖君：主持本项目的工作，确定研究方向，提出总体科学构思，凝练关键科学问题，设计研究技术方案，系统研究十四种资源植物的化学和生物活性，综合分析重要基础数据，组织解决关键性学术疑难问题，组织国内外合作研究。

代表性论文 7 和 8 的第一作者；代表性论文 1-6 的通讯（或共同通讯）作者，在该项研究中的工作量占本人工作总量的 80% 以上。

2、许敏：负责项目叶下珠属植物化学部分研究内容的总体构思，研究方案设计，关键科学问题的凝炼，综合分析重要基础数据，组织解决关键性学术疑难问题，指导学生开展实验和论文撰写。代表性论文 1 和 2 共同通讯作者，在该项研究中的工作量占本人工作总量的 70% 以上。

3、杨崇仁：参与项目整体研究方案及国内外合作交流的设计，特别是草血竭、金荞麦、香椿和余甘子研究内容的总体构思，组织解决关键性学术疑难问题，指导学生开展实验和论文撰写。代表性论文 5 和 6 共同通讯作者；代表性论文 1-4 和 7-8 的主要参与者，在该项研究中的工作量占本人工作总量的 50% 以上。

4、朱宏涛：参与研究方案的设计，完成十四种资源植物的收集、样品的提取、活性的初筛及化合物库的完善，指导学生开展实验，整理和撰写成果报告。代表性论文 1 和 2 的主要参与者，在该项研究中的工作量占本人工作总量的 60% 以上。

5、王东：参与研究方案的设计，指导学生开展实验，撰写论文，整理和撰写成果报告。代表性论文 1 和 2 的主要参与者，在该项研究中的工作量占本人工作总量的 60% 以上。

四、代表性论文

(*通讯作者)

1. Jun-Jiang Lv, Shan Yu, Ya-Feng Wang, Dong Wang, Hong-Tao Zhu, Rong-Rong Cheng, Chong-Ren Yang, Min Xu*, Ying-Jun Zhang*. Anti-hepatitis B virus norbisabolane sesquiterpenoids from *Phyllanthus acidus* and the establishment of their absolute configurations using theoretical calculations. *Journal of Organic Chemistry*, 2014, 79(12), 5432-5447
2. Jian-Qiang Zhao, Yan-Ming Wang, Hong-Ping He, Sheng-Hong Li, Xiao-Nian Li, Chong-Ren Yang, Dong Wang, Hong-Tao Zhu, Min Xu*, Ying-Jun Zhang*. Two new highly oxygenated and rearranged limonoids from *Phyllanthus cochinchinensis*. *Organic Letters*, 2013, 15(10), 2414-2417
3. Qing Liu, Ya-Feng Wang, Rong-Jie Chen, Yi-Fei Wang, Chong-Ren Yang, Ying-Jun Zhang*. Anti-coxsackie virus B3 norsesquiterpenoids from the roots of *Phyllanthus emblica*. *Journal*

of Natural Products, 2009, 72 (5): 969-972

4. Kai-Jin Wang, Chong-Ren Yang, Ying-Jun Zhang*. Phenolic antioxidants from the fresh young leaves of *Toona sinensis*. *Food Chemistry*. 2007, 101: 365-371
5. Kai-Jin Wang, Ying-Jun Zhang*, Chong-Ren Yang*. Antioxidant phenolic compounds from rhizomes of *Polygonum paleaceum*. *Journal of Ethnopharmacology*, 2005, 96 (3): 483-487
6. Kai-Jin Wang, Ying-Jun Zhang*, Chong-Ren Yang*. Antioxidant phenolic constituents from *Fagopyrum dibotrys*. *Journal of Ethnopharmacology*, 2005, 99: 259-264
7. Ying-Jun Zhang, Abe T, Tanaka T, Chong-Ren Yang, Kouno I*. Phyllanemblinins A-F, new ellagitannins from *Phyllanthus emblica*. *Journal of Natural Products*, 2001, 64 (12), 1527-1532
8. Ying-Jun Zhang, Tanaka T, Iwamoto Y, Chong-Ren Yang, Kouno I*. Novel norsesquiterpenoids from the roots of *Phyllanthus emblica*. *Journal of Natural Products*, 2000, 63, 1507-1510