

提名 2026 年度云南省科学技术奖项目公示

一、项目名称：天然吲哚生物碱新颖结构、功能及新药临床前研究

二、提名者及提名等级

提名者：中国科学院昆明分院

提名等级：云南省自然科学奖一等奖

三、项目简介

吲哚生物碱结构多样丰富、生物活性广泛，是新药先导化合物发掘的核心类型，对创新药物研发具有重要战略意义。该项目在国家杰出青年科学基金、科技部重大新药创制等项目的支持下，立足云南植物资源多样性优势，聚焦吲哚生物碱，完成植物资源收集、新颖结构挖掘、功能活性筛选、新药研发的全链条技术路线，开展系统性、创新性研究，构建了“资源-结构-活性-新药”创新体系，实现了从基础研究到新药创制的成果转移转化，为天然产物高效开发利用提供了全新理论范式与技术支撑。

（1）富含吲哚生物碱药用植物资源样本库和组分库构建，筑牢创新研究根基。项目团队集成吲哚生物碱快速识别方法，依托云南生物多样性核心区优势，融合书籍记载、文献调研和民族植物学调研方法，收集夹竹桃科、茜草科及马钱科植物样本 620 余个，并构建植物资源库。创新采用“类群定向划段富集法”，获得 2100 余个精制组分库，为系统筛选抗肿瘤、抗菌、抗病毒等新药分子提供了规模可观、化学多样性丰富的物质保障。

（2）新颖骨架挖掘推动天然产物化学创新发展。系统开展了灯

台树、大叶糖胶树等 38 种植物的吲哚生物碱研究，分离鉴定吲哚生物碱 1657 个，新颖结构 368 个，新颖骨架 42 个（涉及 66 个化合物）。其中 15 个新骨架被 *Natural Products Reports* 列为“Hot off the press”热点分子。吲哚生物碱结构的多样性研究，引起国际有机化学家的高度关注和追踪研究，20 余个新颖生物碱被多个国家的科研团队采用不同合成途径完成多次全合成，相关工作发表于 *Angew. Chem. Int. Ed.*、*J. Am. Chem. Soc.* 等顶尖期刊，推动天然产物合成新方法与药物化学学科发展。

（3）系列先导化合物的发现，为新药创制提供重要的分子模板。通过体外筛选和体内验证，挖掘抗炎镇痛、抗菌、抗肿瘤等先导活性化合物 80 余个。其中 normavacurine-21-one、16-formyl-5-methoxystriactamine、picralinal、tubotaiwine（40 mg/kg）对小鼠炎症肿胀的抑制率超过 80%，远优于阿司匹林（200 mg/kg）的，且后三个成分为 COX-2/5-LOX 双重抑制剂；Erchinines A-B、20-Z-alschomine、vallesamine 和 Nareline 对枯草杆菌或绿脓杆菌的 MIC 值为 0.78 $\mu\text{g/mL}$ ，优于阳性药物黄连素和黄藤素。白坚木碱型吲哚生物碱具有显著的细胞毒活性（ $\text{IC}_{50} < 1\mu\text{M}$ ），其中 tabersonine、11-methoxytabersonine 对白血病的 IC_{50} 值在 0.2-0.7 μM ，远优于药性药物顺铂（ $\text{IC}_{50} = 1.5\mu\text{M}$ ）

（4）全链条新药研发突破，实现基础研究向临床应用的关键跨越。以吲哚生物碱结构特征及民族传统医药知识为双重线索，系统阐明傣药灯台叶生物碱止咳、平喘、抗炎、祛痰和免疫调节等药理药效、作用机制，完成成药性评价，获 CFDA 颁发的《药物临床试验批件》（灯台叶碱及胶囊），在此基础上，完成创新药物的药代动力学和临床适应症研究，全面筑牢临床试验开展的基础，为临床试验的开展奠

定基础，实现了从基础研究到临床应用的关键跨越，为民族医药的现代化研发提供了典范。

基于上述成果，共发表SCI论文148篇，其中15篇 *Organic Letters* (Nature Index 刊物)；20 篇代表作总影响因子 97.3，他引 930 次，8 篇代表作总影响因子 49.8，他引 425 次，获得 CFDA 颁发的临床批件 2 个。项目负责人入选获国家杰出青年科学基金、中组部“万人计划”、科技部“中青年科技创新领军人才”、云南省“云岭英才”等称号，享国务院政府特殊津贴。团队成员入选“兴滇英才”和“中青年后备人才”7 人次，培养硕博硕士研究生 17 人，1 人获中科院优秀博士论文。本项目成果入选国家自然科学基金委《2012 年度报告》和中国科学院科技报国 70 载创新成果。项目构建“资源-结构-活性-新药”创新体系，为天然产物新药创制提供全新思路与技术范式，有力支撑云南省创新药物研发和生物医药产业发展。

四、代表性论文专著目录

序号	论文专著 名称/刊名/作者	年卷页码 (xx 年 x 卷 xx 页)	发表时间 (年月 日)	通讯作 者(含共 同)	第一作者 (含共 同)
1	Pharmacological evaluation of Alstonia scholaris: Anti-inflammatory and analgesic effects / <i>Journal of Ethnopharmacology</i> / Jian-Hua Shang, Xiang-Hai Cai, Tao Feng, Yun-Li Zhao, Jing-Kun Wang, Lu-Yong Zhang, Ming Yan, Xiao-Dong Luo	2010, 129 (2), 174-181.	2010.02.26	Luo Xiao-Dong	Shang Jian-Hua
2	Pharmacological evaluation of Alstonia scholaris: Anti-tussive, anti-asthmatic and expectorant activities. / <i>Journal of Ethnopharmacology</i> / Jian-Hua Shang, Xiang-Hai Cai, Yun-Li Zhao, Tao Feng, Xiao-Dong Luo.	2010, 129 (3), 293-298.	2010.04.08	Luo Xiao-Dong	Shang Jian-Hua

3	Melokhanines A-J, Bioactive Monoterpenoid Indole Alkaloids with Diverse Skeletons from <i>Melodinus khasianus</i> . / <i>Journal of Natural Products</i> / ChengGui-Guang, Dan Li, Bo Hou, Xiao-Nian Li, Lu Liu, Ying-Ying Chen, Paul-Keilah Lunga, Afsar Khan, Ya-Ping Liu, Zhi Li Zuo, and Xiao-Dong Luo	2016, 79 (9), 2158-2166.	2016.09.01	Luo Xiao-Dong; Zuo Zhi-Li	Cheng Gui-Guang
4	Melodinines M-U, Cytotoxic Alkaloids from <i>Melodinus suaveolens</i> . / <i>Journal of Natural Products</i> / Ya-Ping Liu, Yan Li, Xiang-Hai Cai, Xing-Yao Li, Ling-Mei Kong, Gui-Guang Cheng, and Xiao-Dong Luo	2012, 75 (2), 220-224.	2012.01.19	Luo Xiao-Dong	Liu Ya-Ping
5	Indole Alkaloids with New Skeleton Activating Neural Stem Cells. / <i>Organic Letters</i> / Xing-Wei Yang, Cui-Ping Yang, Li-Ping Jiang Xu-Jie Qin, Ya-Ping Liu, Qiu-Shuo Shen, Yong-Bin Chen, and	2014, 16 (21), 5808-5811.	2014.10.29	Luo Xiao-Dong; Chen Yong-Bin	Yang Xing-Wei
6	Antibacterial Indole Alkaloids with Complex Heterocycles from <i>Voacanga africana</i> . / <i>Organic Letters</i> / Cai-Feng Ding, Hong-Xia Ma, Jing Yang, Xu-Jie Qin, Guy S. S. Njateng, Hao-Fei Yu, Xin Wei, Ya-Ping Liu, Wan-Yi Huang, Zi-Feng Yang, Xin-Hua Wang, and Xiao-Dong Luo	2018, 20 (9), 2702-2706.	2018.04.20	Luo Xiao-Dong; Wang Xin-Hua	Ding Cai-Feng
7	Melotenine A, a Cytotoxic Monoterpenoid Indole Alkaloid from <i>Melodinus tenuicaudatus</i> . / <i>Organic Letters</i> / Tao Feng, Yan Li, Ya-Ping Liu, Xiang-Hai Cai, Yuan-Yuan Wang, and Xiao-Dong Luo	2011, 13 (14), 3568-3571.	2011.06.21	Luo Xiao-Dong	Feng Tao
8	Nepenthe-Like Indole Alkaloids with Antimicrobial Activity from <i>Ervatamia chinensis</i> . / <i>Organic Letters</i> / Hao-Fei Yu, Xu-Jie Qin, Cai-Feng Ding, Xin Wei, Jing Yang, Jie-Rong Luo, Lu Liu, Afsar Khan, Lan-Chun Zhang, Cheng-Feng Xia, and Xiao-Dong Luo	2018, 20 (13), 4116-4120.	2018.06.21	Luo Xiao-Dong	Yu Hao-Fei

五、主要完成人基本情况

序号	姓名	工作单位	完成单位	职称	职务
1	罗晓东	云南大学	中国科学院昆明植物研究所	研究员	教育部重点室主任
2	程桂广	昆明理工大学	中国科学院昆明植物研究所	教授	无
3	刘亚平	昆明理工大学	中国科学院昆明植物研究所	教授	无
4	赵云丽	云南大学	中国科学院昆明植物研究所	副研究员	无

5	于浩飞	昆明医科大学	中国科学院昆明植物研究所	教授	系主任
6	丁彩凤	昆明医科大学	中国科学院昆明植物研究所	副教授	无
7	冯涛	中南民族大学	中国科学院昆明植物研究所	教授	无