

木犀属植物化学成分及药理作用研究进展

唐伟卓, 赵余庆*

沈阳药科大学中药学院, 辽宁 沈阳 110016

摘要: 木犀属植物共约30种, 分布于亚洲东南部和美洲, 我国共产25种及3变种(占世界的82.76%), 是世界木犀属植物的分布中心。桂花(木犀)作为木犀属主要的代表物种和研究对象, 在我国园艺和食品领域拥有悠久的应用历史。在药用方面, 桂花主要用作止痛剂, 治疗胃气痛。但目前对桂花和木犀属植物的化学成分研究并不多。为了进一步开发桂花及木犀属植物资源的药用价值, 对木犀属植物的主要化学成分和药理作用进行综述, 以期为其深入研究提供参考。

关键词: 桂花; 木犀属; 环烯醚萜类; 木脂素类; 止痛剂

中图分类号: R282.71 **文献标志码:** A **文章编号:** 0253-2670(2014)04-0590-13

DOI: 10.7501/j.issn.0253-2670.2014.04.025

Research progress on chemical constituents of plants from *Osmanthus* L. and their pharmacology

TANG Wei-zhuo, ZHAO Yu-qing

School of Chinese Materia Medica, Shenyang Pharmaceutical University, Shenyang 110016, China

Key words: *Osmanthus fragrans* (Thunb.) Lour.; *Osmanthus* L.; iridoids; lignans; analgesic

《中国植物志》记载木犀属 *Osmanthus* L. 植物共约30种, 主要分布于亚洲东南部和美洲, 我国作为世界木犀属植物的分布中心, 共产25种及3变种(占世界的82.76%)。桂花 *Osmanthus fragrans* (Thunb.) Lour. 又名木犀, 作为木犀属植物的典型代表物种, 为我国的十大传统名花之一, 既是著名的香料植物, 也是优良的园林绿化树种, 主要分布在南岭以北至秦岭淮河以南, 北至山东半岛等地。由于桂花栽培历史悠久, 在此过程中经人们长期杂交、人工选择和气候环境的影响, 产生了种内性状多样性, 形成了丰富的品种资源。最新文献统计, 我国有桂花品种157种^[1]。

目前, 国内对木犀属植物化学成分的研究报道并不多, 且多数集中在桂花。此外还有少量关于野桂花 *O. yunnanensis* (Franch.) P. S. Green 和石山桂花种 *O. fordii* Hemsley 化学成分研究的报道。其中, 桂花由于在我国分布广泛且品种繁多, 吸引了大量的研究者对其进行研究。但是现阶段对其研究主要集中在资源、品种、栽培、发育、芳香性等传统领域^[2], 涉及非芳香性成分的化学及其药理活性方面研究十分有限。

国外对木犀属植物的研究主要集中在桂花。20世纪八九十年代, 日本学者对产自日本的不同桂花品种刺桂 *O. ilicifolius* Hassk、桂花、银桂 *O. asiaticus* Nakai、丹桂 *O. fragrans* var. *aurantiacus* Makino 以及齿叶木犀 *O. fortunei* Carr. 的化学成分进行了系统研究, 积累了大量的文献资料。近年来, 随着分离、纯化技术手段的发展, 后续日本和韩国学者对这些桂花品种的化学成分研究进行了适当补充。而其他国家由于缺少种质资源, 多数品种都是采用引进再培育方式, 信息有限, 所以对桂花和木犀属植物的研究报道较少(非亚洲国家仅见法国学者对法属桂花品种 *O. austrocaledonica* Vieill 和 *O. cymosus* Guillaumin 进行过报道)。本文就木犀属植物化学成分及其药理作用研究进展进行综述。

1 化学成分

迄今为止, 从桂花及木犀属植物中共分离得到了128个非芳香性化合物, 主要类型包括环烯醚萜类、苯丙素类、木质素类、酚酸类以及部分甾醇和生物碱类。本文主要对这些化学成分的来源和分离部位进行综述, 以期为该属植物的化学成分研究提供参考。

收稿日期: 2013-04-20

*通信作者 赵余庆, 男, 博士生导师。Tel: (024)23986521 E-mail: zyq4885@126.com

1.1 环烯醚萜类及其衍生物

环烯醚萜类化合物为臭蚁二醛的缩醛衍生物，是木犀属植物代表性成分。其结构是含有环戊烷结构单元的环状单萜，多以苷的形式存在，并且主要是C-1羟基与葡萄糖结合成的单糖苷，苷元多具有10个碳原子，常有双键存在。此外，羟甲基、环酮、环氧醚、羧基及羧酸甲酯结构为该类化合物衍生变化的主要形式。目前，从木犀属植物中分离得到的环烯醚萜类化合物共有23个，占总数的18%。其分布、来源见表1，结构式见图1。

1.2 木脂素及其衍生物

木脂素是一类由苯丙素类氧化聚合而成的产物，通常多是二聚物，少数为多聚物。二聚体通常是两分子苯丙素类化合物通过侧链 β 碳原子C-8-C-8'连接而成。分子中含氧活性基团往往形成1个或2个四氢呋喃环或内酯环构成不同的亚类型结构。此外，一个苯丙素的脂肪烃基碳与另一分子苯

环或苯基相连接构成的新木脂素类(neolignans)化合物在木犀属中也比较常见。目前，从木犀属中分离得到的木脂素类化合物共有43个，占总数的34%。其分布、来源见表2，结构式见图2。

1.3 苯丙素及其衍生物

苯丙素类(phenylpropanoids)化合物在木犀属植物中主要是以对羟基苯乙醇酯或苷的形式存在。目前，从木犀属植物中分离得到的苯丙素及其衍生物共有24个，占总数的18%。其分布、来源见表3，结构式见图3。

1.4 黄酮、酚酸类及其衍生物

黄酮和酚酸类是木犀属植物中的另两类成分，它们构成了该属植物具有显著抗氧化活性的物质基础。黄酮类物质可以通过竞争性或非竞争性方式抑制酪氨酸酶的活性，从而发挥抗氧化作用；酚酸类物质则是通过发挥拮抗体内氧化应激水平来实现抗氧化作用。目前，从木犀属植物中分离得到了一系

表1 木犀属植物中环烯醚萜类成分

Table 1 Iridoids from plants of *Osmanthus* L.

序号	化合物名称	来源	部位	参考文献
1	10-acetoxyligustroside	木犀	叶	3
2	女贞苷(ligustroside)	齿叶木犀	叶	4
3	10-hydroxyligustroside	齿叶木犀	叶	4
4	橄榄苦苷(oleuropein)	齿叶木犀	叶	4
5	10-hydroxyoleuropein	齿叶木犀	叶	4
6	secologanoside-7-methyl ester	银桂	树皮	5
7	8-表金银花苷(8-epikingiside)	银桂	树皮	5
8	木犀榄苷二甲酯(oleoside dimethyl ester)	银桂	树皮	5
9	10-hydroxyoleoside dimethyl ester	银桂	树皮	5
10	10-hydroxyoleoside-11-methyl ester	银桂	树皮	5
11	austrosmoside	法国桂花	地上部分	6
12	10-acetoxyoleoside dimethyl ester	刺桂	叶	7
13	7- β -D-glucopyranosyl-11-methyleoleoside	刺桂	叶	7
14	ilicifolioside A	刺桂	叶	8
15	ilicifolioside B	刺桂	叶	8
16	demethyl 10-acetoxyligustroside	丹桂	叶	9
17	demethyl 10-acetoxyisoligustroside	丹桂	叶	9
18	3'-O- β -D-glucopyranosyl ligustroside	刺桂	叶	10
19	3'-O- β -D-glucopyranosyl-10-acetoxyligustroside	刺桂	叶	10
20	3'-O- β -D-glucopyranosy loleuropein	刺桂	叶	10
21	3'-O- β -D-glucopyranosyl-10-acetoxyole-uropaein	刺桂	叶	10
22	3'-O- β -D-glucopyranosyl-10-hydroxyligustroside	刺桂	叶	10
23	(8E)-ligustroside	丹桂	花	11

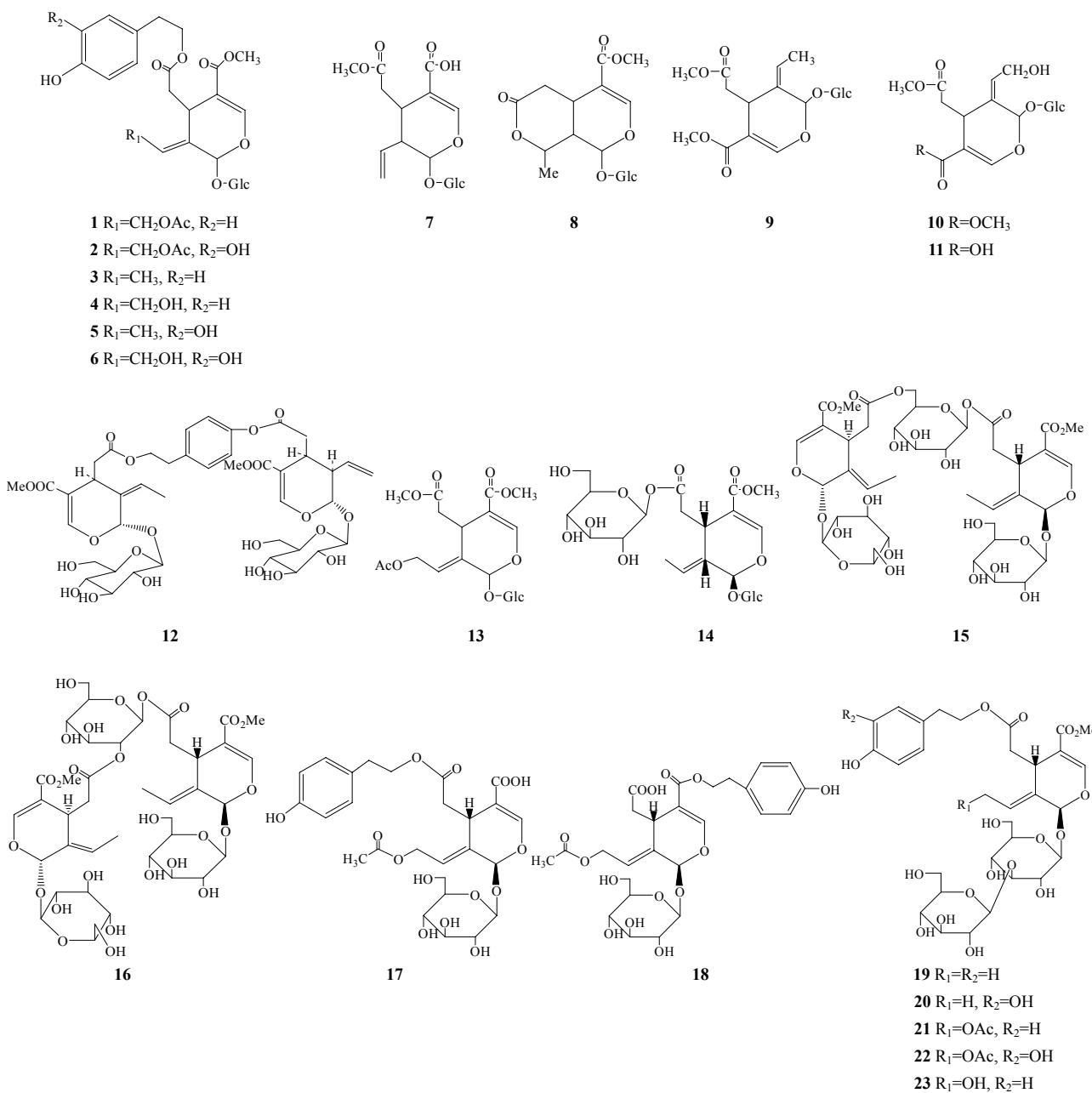


图1 木犀属植物中环烯醚萜类成分的结构

Fig. 1 Structures of iridoids from plants of *Osmanthus* L.

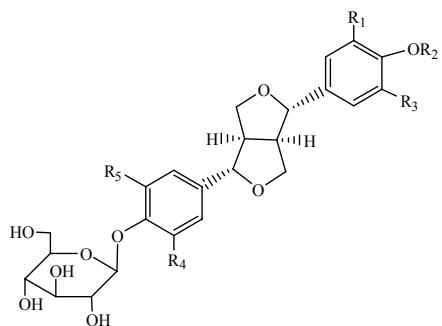
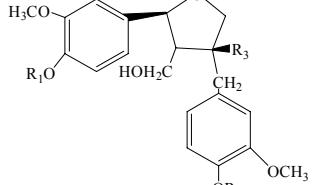
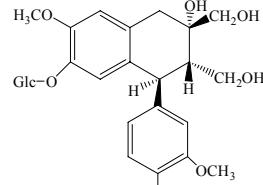
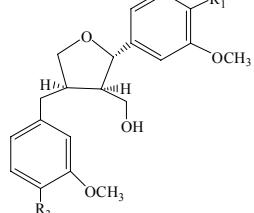
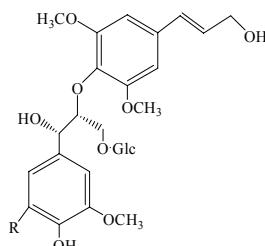
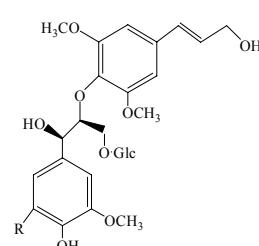
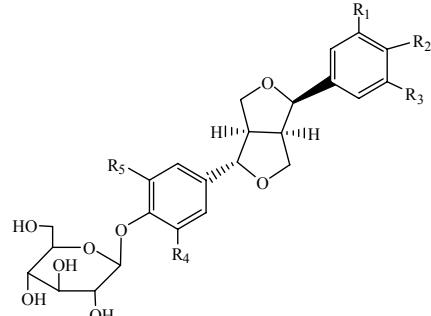
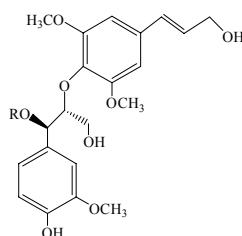
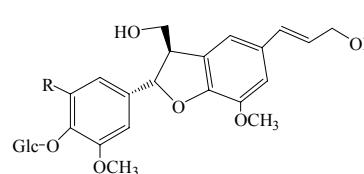
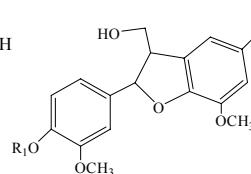
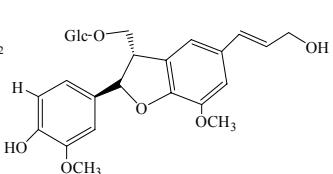
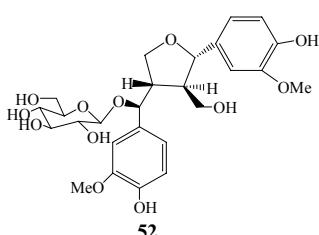
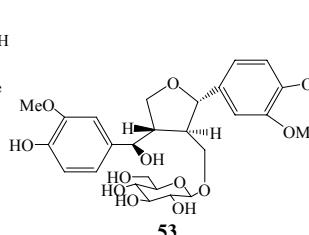
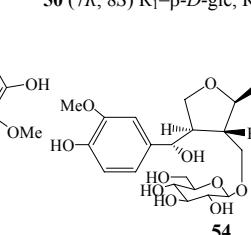
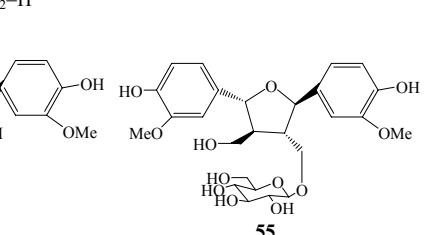
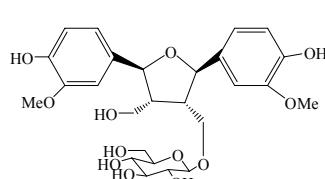
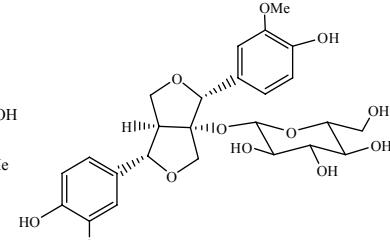
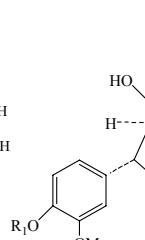
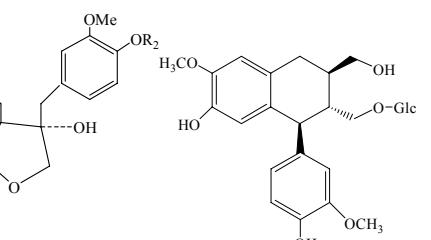
表2 木犀属植物中木脂素类成分

Table 2 Lignans from plants of *Osmanthus* L.

序号	化合物名称	来源	部位	参考文献
24	鹅掌楸苷 (liriodendrin)	齿叶木犀	叶	4
25	(+)-medioresinol-di-D-glucoside	齿叶木犀	叶	4
26	(+)-pinoresinol- β -D-glucopyranoside	齿叶木犀	叶	4
27	连翘苷 (phillyrin)	木犀	叶	3
28	isoeucommuin A	银桂	叶	12
29	(-)-olivil-4"-O- β -D-glucopyranoside	银桂	叶	12
30	lariciresinol-4'-O- β -D-gluoside	银桂	树皮	13

续表2

序号	化合物名称	来源	部位	参考文献
31	lariciresinol-4-O-β-D-glucoside	银桂	树皮	13
32	(+)-cyclo-olivil-6-O-β-D-glucoside	银桂	树皮	14
33	(7R, 8S, 7'R, 8'S)-neo-olivil-9'-O-β-D-glucoside	银桂	树皮	14
34	conicaoside	刺桂	叶	7
35	(7S, 8R)- <i>erythro</i> -guaiacylglycerol-β-O-4'-sinapylether-9-O-β-D-glucoside	刺桂	叶	15
36	(7S, 8R)- <i>erythro</i> -syringylglycerol-β-O-4'-sinapylether-9-O-β-D-glucoside	刺桂	叶	15
37	(7R, 8S)- <i>erythro</i> -guaiacylglycerol-β-O-4'-sinapylether-9-O-β-D-glucoside	刺桂	叶	15
38	(7R, 8S)- <i>erythro</i> -syringylglycerol-β-O-4'-sinapylether-9-O-β-D-glucoside	刺桂	叶	15
39	(+)-syringaresinol-4-O-β-D-glucoside	刺桂	叶	16
40	(+)-syringaresinol-4, 4'-O-di-β-D-glucoside	刺桂	叶	16
41	(+)-medioresinol4, 4'-O-di-β-D-glucoside	刺桂	叶	16
42	(+)-medioresinol4-O-β-D-glucoside	刺桂	叶	16
43	(+)-pinoresinol-4, 4'-O-di-β-D-glucoside	刺桂	叶	16
44	(+)-epipinoresinol-4-O-β-D-glucoside	刺桂	叶	16
45	(7R, 8R)-threoguaiaacylglycerol-8-O-4'-sinapylether-7-O-β-D-glucopyranoside	刺桂	叶	17
46	(7S, 8R)-5-methoxydehydrodiconiferyl alcohol 4-O-β-D-glucopyranoside	刺桂	叶	17
47	(7S, 8R)-dehydronitroferylalcohol-4-O-β-D-glucopyranoside	刺桂	叶	17
48	(7S, 8R)-dihydrodehydrodiconiferylalcohol-9'-O-β-D-glucopyranoside	刺桂	叶	17
49	(7S, 8R)-dihydrodehydrodiconiferylalcohol-4-O-β-D-glucopyranoside	刺桂	叶	17
50	(7R, 8S)-dihydrodehydrodiconiferylalcohol-4-O-β-D-glucopyranoside	刺桂	叶	17
51	(7S, 8R)-dehydronitroferylalcohol-9-O-β-D-glucopyranoside	丹桂	叶	18
52	tanegoside A	丹桂	叶	18
53	(7S, 8R, 7'R, 8'S)-4, 9, 4', 7'-tetrahydroxy-3, 3'-dimethoxy-7, 9'-epoxylignan-9-O-β-D-glucopyranoside	丹桂	叶	18
54	(7R, 8S, 7'S, 8'R)-4, 9, 4', 7'-tetrahydroxy-3, 3'-dimethoxy-7, 9'-epoxylignan-9-O-β-D-glucopyranoside	丹桂	叶	18
55	(7R, 8S, 7'R, 8'S)-4, 9, 4', 9'-tetrahydroxy-3, 3'-dimethoxy-7, 7'-epoxylignan-9-O-β-D-glucopyranoside	丹桂	叶	18
56	rel-(7R, 8S, 7'S, 8'R)-4, 9, 4', 9'-tetrahydroxy-3, 3'-dimethoxy-7, 7'-epoxylignan-9-O-β-D-glucopyranoside	丹桂	叶	18
57	(+)-8-hydroxypinoresinol-8-O-β-D-glucopyranoside	丹桂	叶	18
58	(-)-olivil-4-O-β-D-glucopyranoside	丹桂	叶	18
59	(-)-olivil-4'-O-β-D-glucopyranoside	丹桂	叶	18
60	(+)-isolariciresinol-9'-O-β-D-glucoside	丹桂	叶	18
61	(+)-isolariciresinol-6-O-β-D-glucoside	丹桂	叶	18
62	(7R, 7'R, 8R, 8'R)-8-hydroxypinoresinol-8-O-β-D-glucopyranoside 4'-methyl ether	丹桂	花	19
63	连翘脂素 [(+)-phillygenin]	丹桂	花	19
64	连翘脂素 [(-)-phillygenin]	丹桂	花	19
65	紫杉脂素 (taxiresinol)	丹桂	花	19
66	橄榄脂素 [(-)-olivil]	丹桂	花	19

**24** $R_1=R_3=R_4=OCH_3$, $R_2=\text{glc}$, $R_5=OCH_3$ **25** $R_1=H$, $R_2=\text{glc}$, $R_3=R_4=R_5=OCH_3$ **26** $R_1=R_5=OCH_3$, $R_2=R_3=R_4=H$ **27** $R_1=R_4=H$, $R_2=CH_3$, $R_3=R_5=OCH_3$ **28** $R_1=R_3=R_4=OCH_3$, $R_2=R_5=H$ **39** $R_1=R_3=R_4=R_5=OCH_3$, $R_2=H$ **40** $R_1=R_3=R_4=R_5=OCH_3$, $R_2=\text{glc}$ **41** $R_1=H$, $R_2=\text{glc}$, $R_3=R_4=R_5=OCH_3$ **42** $R_1=R_2=H$, $R_3=R_4=R_5=OCH_3$ **43** $R_1=R_5=H$, $R_2=\text{glc}$, $R_3=R_4=OCH_3$ **29** $R_1=H$, $R_2=\beta-D\text{-glc}$, $R_3=OH$ **30** $R_1=\beta-D\text{-glc}$, $R_2=R_3=H$ **31** $R_1=R_3=H$, $R_2=\beta-D\text{-glc}$ **32****33** $R_1=H$, $R_2=H$, $R_3=O-\beta-D\text{-glcp}$ **34** $R_1=O-\beta-D\text{-glcp}$, $R_2=OCH_3$, $R_3=OH$ **35** $R=H$ **36** $R=OCH_3$ **44** $R_1=R_2=R_5=H$, $R_3=R_4=OCH_3$ **45** $R=\beta-D\text{-glc}$ **46** (*7S, 8R*) $R=OCH_3$ **47** (*7S, 8R*) $R=H$ **48** (*7S, 8R*) $R_1=H$, $R_2=\beta-D\text{-glc}$ **49** (*7S, 8R*) $R_1=\beta-D\text{-glc}$, $R_2=H$ **50** (*7R, 8S*) $R_1=\beta-D\text{-glc}$, $R_2=H$ **51****52****53****54****55****56****57****58** $R_1=\beta-D\text{-glc}$, $R_2=H$ **59** $R_1=H$, $R_2=\beta-D\text{-glc}$

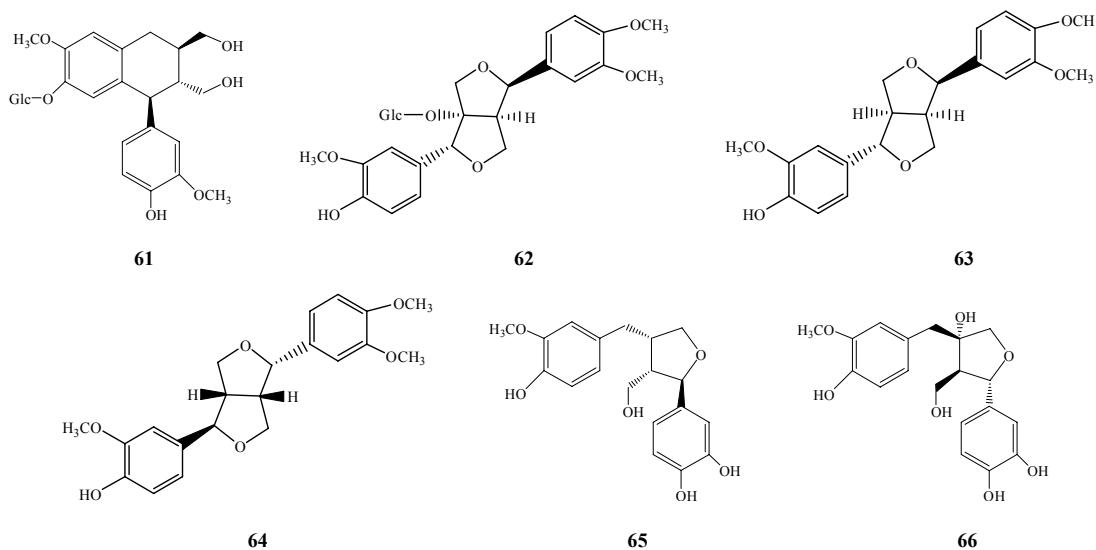


图2 木犀属植物中木脂素类成分的结构
Fig. 2 Structures of lignans from plants of *Osmanthus* L.

表3 木犀属植物中苯丙素类成分

Table 3 Phenylpropanoids from plants of *Osmanthus* L.

序号	化合物名称	来源	部位	参考文献
67	acteoside	齿叶木犀	叶	4
68	cis-acteoside	齿叶木犀	叶	4
69	米团花苷 (leucosceptoside A)	齿叶木犀	叶	4
70	osmanthuside A	丹桂	叶	20
71	osmanthuside B	丹桂	叶	20
72	osmanthuside C	丹桂	叶	20
73	osmanthuside B ₆	银桂	叶	21
74	osmanthuside E	银桂	叶	21
75	osmanthuside D	银桂	叶	21
76	decaffeoylecteoside	银桂	叶	22
77	methoxyhydroquinone-4-O-β-D-apiosyl-(1→6)-β-D-glucopyranoside	银桂	叶	22
78	2-hydroxy-4-(2-hydroxyethyl) phenyl-6-O-trans-feruloyl-28β-D-glucopyranoside	银桂	叶	22
79	2-hydroxy-5-(2-hydroxyethyl) phenyl-β-D-glucopyranoside	银桂	叶	23
80	4-(2, 3-dihydroxypropyl)-2, 6-dimethoxyphenyl-β-D-glucopyranoside	银桂	叶	23
81	D-threo-guaiacylglycerol-7-O-β-D-glucoside	银桂	叶	23
82	osmanthuside H	银桂	树皮	24
83	osmanthuside I	银桂	树皮	24
84	osmanthuside J	银桂	树皮	24
85	sinapylalcohol-1, 3'-di-O-β-D-glucoside	银桂	树皮	14
86	coniferylalcohol-1, 3'-di-O-β-D-glucoside	银桂	树皮	14
87	丁香苷 (syringin)	银桂	树皮	14
88	松柏苷 (coniferin)	银桂	树皮	14
89	guaiacylglycerol-4-O-β-D-glucoside	银桂	树皮	14
90	6'-O-β-(E)-cinnamoylverbascoside	法国桂花	地上部分	6

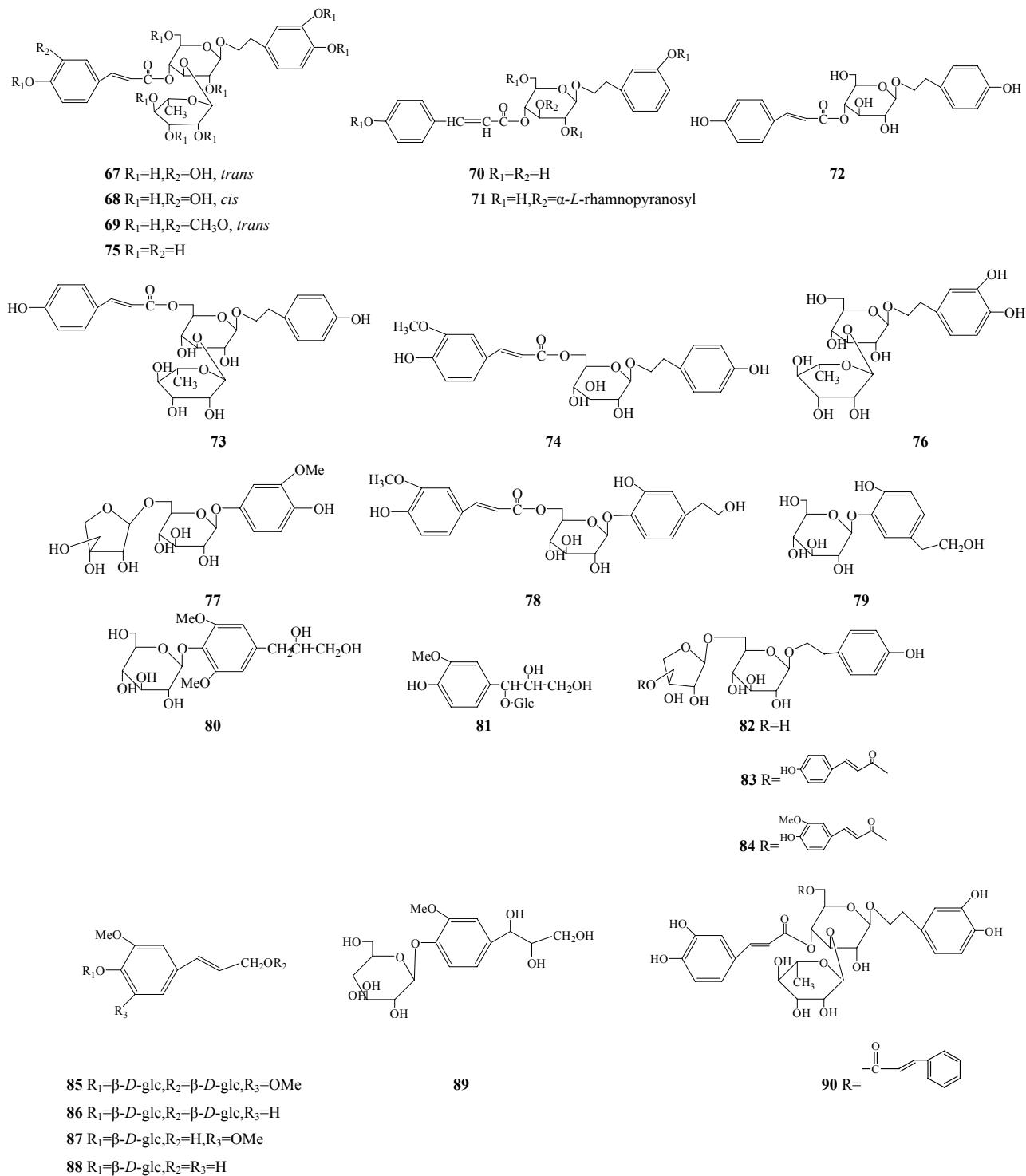


图 3 木犀属植物中苯丙素类化合物成分的结构

Fig. 3 Structures of phenylpropanoids from plants of *Osmanthus* L.

列黄酮和酚酸类物质,它们多是20世纪日本学者在对齿叶木犀和刺桂中环烯醚萜类及木脂素类成分研究的同时被发现,后续学者对木犀属植物中该类成分的研究多是对这些已知成分的重复。目前,从木犀属植物中分得的该类成分总有21个,占总数的

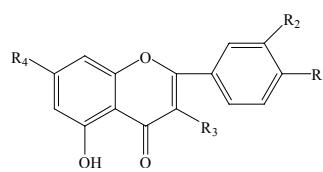
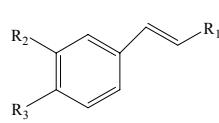
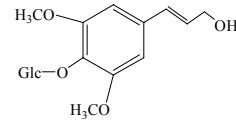
17%。其在该属植物中的来源和分布见表4,结构式见图4。

1.5 挥发性成分

木犀属植物的花都具有很好的芳香性,尤其桂花的浸膏和精油是一种高档的天然香料,被广泛应

表4 木犀属植物中黄酮和酚酸类成分
Table 4 Flavones and polyphenolics from plants of *Osmanthus* L.

序号	化合物名称	来源	部位	参考文献
91	槲皮素 (quercetin)	齿叶木犀	叶	4
92	山柰酚 (kaempferol)	齿叶木犀	叶	4
93	芦丁 (rutin)	齿叶木犀	叶	4
94	nicotoflorin	齿叶木犀	叶	4
95	木犀草素 (luteolin)	齿叶木犀	叶	4
96	luteolin-4'-O-β-D-glucoside	齿叶木犀	叶	4
97	luteolin-7-O-β-D-glucoside	齿叶木犀	叶	4
98	芹菜素 (apigenin)	齿叶木犀	叶	4
99	cosmosii	齿叶木犀	叶	4
100	咖啡酸 (caffein acid)	齿叶木犀	叶	4
101	阿魏酸 (ferulic acid)	齿叶木犀	叶	4
102	3-O-p-coumaroylquinic acid	刺桂	叶	17
103	对香豆酸 (p-coumaric acid)	刺桂	叶	17
104	3, 4-dihydroxyphenethyl acetate	刺桂	叶	17
105	3, 4-dihydroxyphenethyl alcohol	刺桂	叶	17
106	p-hydroxyphenethyl acetate	刺桂	叶	17
107	p-hydroxyphenethyl alcohol	刺桂	叶	17
108	p-hydroxyphenethyl-β-D-glucoside	刺桂	叶	17
109	3, 4-dihydroxyphenethyl-β-D-glucoside	刺桂	叶	17
110	松柏昔 (coniferin)	刺桂	叶	17
111	丁香昔 (syringin)	刺桂	叶	17

91 R₁=R₂=R₃=R₄=OH92 R₁=R₃=R₄=OH, R₂=H93 R₁=R₄=OH, R₂=H, R₃=O-Glc94 R₁=R₄=OH, R₂=H, R₃=O-Rutinoside95 R₁=R₂=R₄=OH, R₃=H96 R₂=R₄=OH, R₃=H, R₁=O-Glc97 R₁=R₂=OH, R₃=H, R₄=O-Glc98 R₁=R₄=OH, R₂=R₃=H99 R₁=R₄=O-Glc, R₂=R₃=H100 R₁=COOH, R₂=R₃=OH101 R₁=COOH, R₂=OCH₃, R₃=OH102 R₁=COO-glucuronicacid, R₂=H, R₃=OH103 R₁=COOH, R₂=H, R₃=OH104 R₁=CH₃COO, R₂=R₃=OH105 R₁=R₂=R₃=OH106 R₁=CH₃COO, R₂=H, R₃=OH107 R₁=R₃=OH, R₂=H108 R₁=CH₃COO, R₂=H, R₃=O-Glc109 R₁=CH₃COO, R₂=OH, R₃=O-Glc110 R₁=CH₂OH, R₂=OCH₃, R₃=O-Glc

111

图4 木犀属植物中黄酮、酚酸类成分的结构

Fig. 4 Structures of flavones and polyphenolics from plants of *Osmanthus* L.

用于食品和香料中。近年来，随着 GC-MS 技术的发展，国内外学者对桂花浸膏、精油的芳香性成分进行了比较详细的分析研究，并从中鉴定了上百种物质，发现其香味成分主要是萜烯类、醇类、紫罗兰酮类和邻苯二甲酸酯类等。Hu 等^[25-26]采用化学计量学方法，运用 GC-MS 技术从桂花中鉴定了 73 种化学成分，从淡黄木犀 *O. fragrans* Lour. var. *thunbergii* Mak. 中鉴定了 52 种化学成分，分别占各自精油的 93.5%、95.6%。Wang 等^[27]则考察了桂花开花不同时期花中芳香性成分的变化，采用顶空固相萃取提取桂花精油，GC-MS 测定其中组分。结果发现，在桂花开花初期，其精油中主要成分为芳樟醇及其氧化物，并且它们的量在初始阶段最高。王呈仲等^[28]采用顶空-气质联用色谱技术分析

了桂花的花及叶中的挥发性成分，一共确定了 47 种组分，其中主要化合物类型为单萜及倍半萜类。刘绍华等^[29]对烟用桂花香精中的成分进行了分析。采用 GC-MS 法从中鉴定出 24 种成分，主要包括 (Z, Z, Z)-9, 12, 15-十八碳三烯-1-醇、棕榈酸和紫罗兰酮，这些成分占总香精成分的 84%。将此香精添加到卷烟中后发现，卷烟的增香作用得到显著改善，具有重要的应用价值。

1.6 其他类

木犀属植物中其他类成分主要包括有机酸、三萜、甾醇和生物碱类。这几类成分在木犀属植物化学成分研究中并不多见，一共只有 17 个，占总数的 13%。其在木犀属植物中的分布、来源见表 5，结构式见图 5。

表 5 木犀属植物中其他类化学成分

Table 5 Other constituents from plants of *Osmanthus* L.

序号	化合物名称	来源	部位	参考文献
112	齐墩果酸 (oleanoic acid)	齿叶木犀	叶	4
113	乌苏酸 (ursolic acid)	刺桂	叶	17
114	β-谷甾醇 (β-sitosterol)	刺桂	叶	17
115	β-sitosteryl-β-D-glucoside	刺桂	叶	17
116	α-香树脂醇 (α-amyrine)	法国桂花	叶	30
117	β-香树脂醇 (β-amyrine)	法国桂花	叶	30
118	桦木醇 (betulin)	法国桂花	叶	30
119	熊果醇 (uvaol)	法国桂花	叶	30
120	胡萝卜苷 (daucosterol)	丹桂	花	31
121	岩皂甾醇 (fucosterol)	丹桂	花	31
122	24-ethylcholesta-4, 24(28)-dien-3, 6-dione	丹桂	花	31
123	jasminine	法国桂花	地上部分	6
124	dihydrojasminine	法国桂花	地上部分	6
125	austrodimerine	法国桂花	地上部分	6
126	4-methyl-5, 5-[(1-methyltrimethylene)-di-]-methylnicotinate	法国桂花	地上部分	6
127	4, 4-bis-methyl-5, 5-[(1-methyltrimethylene)-di-]-methylnicotinate	法国桂花	地上部分	6
128	4-hydroxy-phenyl-5-ethyl-3-methoxycarbonyl-4-pyridinylacetate	法国桂花	地上部分	6

2 药理作用

环烯醚萜类、木脂素类和黄酮类具有广泛的生命活性，它们大量存在于桂花及木犀属植物中，但是目前关于桂花及木犀属植物单体化学成分的药理作用报道却并不多，已报道的多数集中在抗氧化活

性方面。

2.1 抗氧化

现阶段，化学合成抗氧化剂（如 BHA 等）由于具有一定的副作用，其应用受到了一定的限制。因此，从自然界中获取天然抗氧化剂成为研究热点。

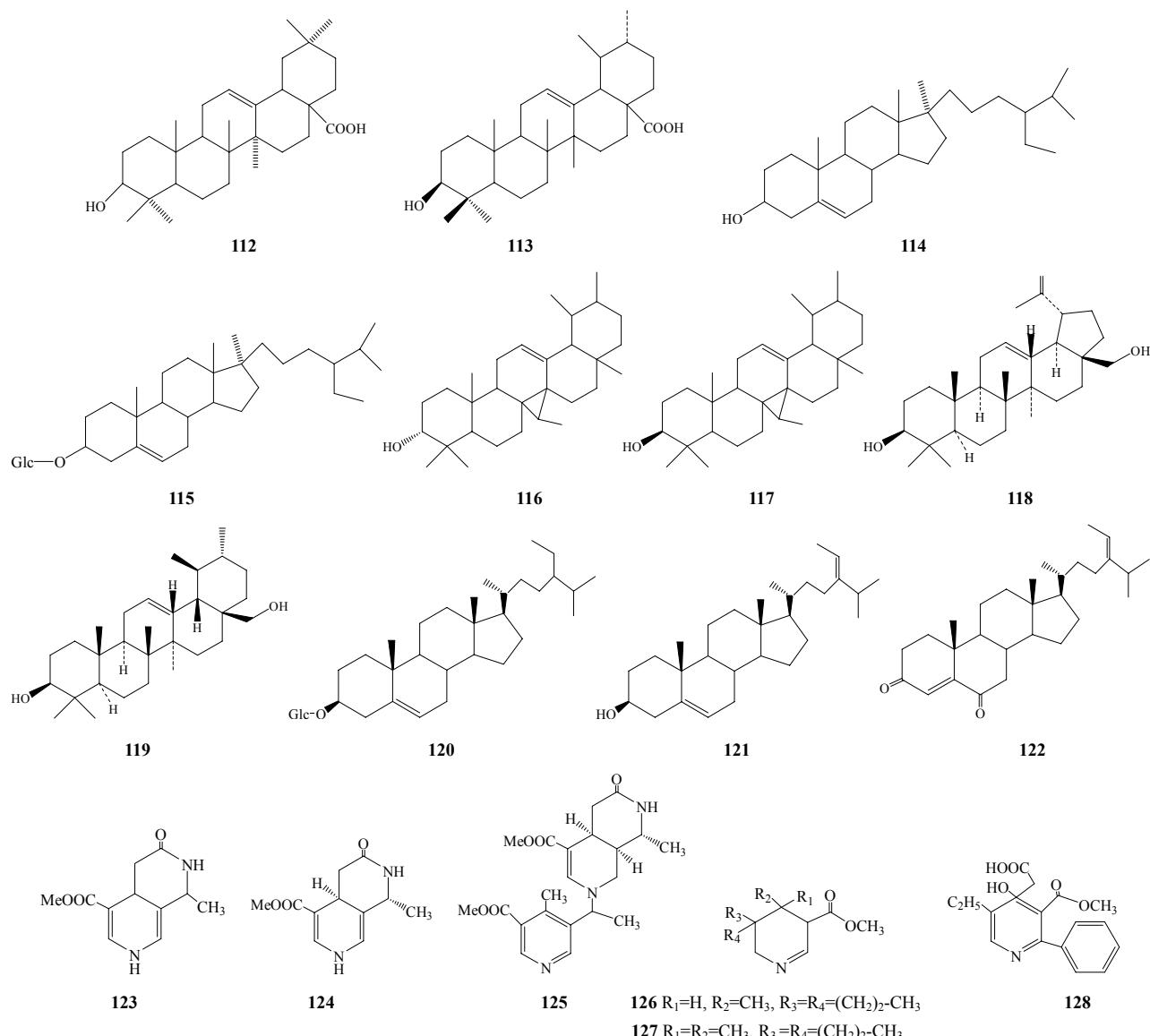


图 5 木犀属植物中其他类化学成分的结构

Fig. 5 Structures of other constituents from plants of *Osmanthus* L.

天然抗氧化剂作用机制主要体现在清除自由基、降低氧化应激水平、抑制酪氨酸酶活性以及与金属离子螯合等方面。

Pan 等^[32]和 Huang 等^[33]考察了桂花籽中色素类成分的自由基清除作用, 结果发现红色素具有显著的清除能力, 当其质量浓度为 0.03 μg/mL 时, 清除率可以达到 92.3%。Wu 等^[34]考察了桂花丙酮提取物对黑素原生成的抑制作用和抗酪氨酸酶活性, 结果发现桂花提取物剂量依赖性地抑制这两种物质的生成。

田成^[35]对桂花果实中的多酚进行研究, 发现在同样的质量浓度下, 桂花果实多酚的还原能力明显高于对照品维生素 C, 其对亚硝酸根离子和羟基自

由基的最大清除率可达 65.4% 和 96.3%, 同时桂花果实多酚还对猪油表现出较好的抗氧化作用。潘英明等^[36]对桂花种子皮中的黑色素进行研究时发现, 经多步纯化得到的黑色素能够显著抑制蛋黄的脂质过氧化作用, 其 IC₅₀ 值为 0.135 mg/mL, 同时还发现了这种天然黑色素中含有丰富的酚酸类成分 (1 mg 天然色素中总酚酸的量相当于 12.5 mg 邻苯二酚)。

郭娇娇等^[37]和雷明^[38]分别对桂花和桂花果实中的黄酮类成分进行富集, 并进行抗氧化活性研究。结果发现, 桂花总黄酮提取物对 DPPH•自由基的清除能力达到 96%, 显示了较强的抗氧化活性。而桂花果中黄酮类成分对超氧阴离子的抑制率最高可达 82%。靳熙茜等^[39]对提取香料后的桂花残渣中总黄

酮类成分进行提取，并测试了其体外抑制亚油酸氧化活性，发现在添加桂花总黄酮后，亚油酸氧化过程受到明显抑制。王丽梅等^[40]针对桂花总黄酮进行了油脂抗氧化作用研究，选取花生油、大豆油、菜籽油和猪油作为研究对象，采用 Schaal 法考察了桂花总黄酮对不同油脂的抗氧化性能。结果发现，4 种油脂中，桂花总黄酮对菜籽油抗氧化效果最好，并且维生素 C、酒石酸均能协同增加桂花黄酮的抗氧化作用。尹爱武等^[41]首次通过测定小鼠血清超氧化物歧化酶 (SOD)、丙二醛 (MDA) 和谷胱甘肽过氧化物酶 (GSH-Px) 量的变化，研究桂花黄酮在小鼠体内的抗氧化作用。结果发现，桂花黄酮可以显著增加小鼠血清 SOD 和 GSH-Px 活性，降低 MDA 量 (MDA 为机体内脂质过氧化反应产物)，从而在体内表现出抗氧化活性。

张晓璞^[42]也对桂花果肉的乙醇提取物的甲醇萃取部分进行体外抗氧化作用研究，结果发现从中分离得到的苯丙素苷成分红景天苷的抗氧化活性强于人工合成的抗氧化剂 2, 6-二叔丁基-4-甲基苯酚 (BHT)。张俊会^[43]对不同极性部位桂花提取物的体外抗氧化活性进行了研究。结果发现，各组分均能抑制猪油的过氧化，其中中等极性组分可清除超氧阴离子自由基，低极性组分可以抑制线粒体的体外脂质过氧化。

2.2 酶抑制活性

Lee 等^[11]研究了丹桂花中环烯醚萜类化合物对 β -分泌酶的抑制活性，结果表明，该类化合物可以间接调节 APP 水平来发挥抑制作用，可以为丹桂花用于预防和治疗老年痴呆症提供依据。曹乃峰等^[44]对桂花 3 个品种 (桂花贵妃红、晚银桂和窈窕淑女) 的叶、花石油醚提取物的 α -葡萄糖苷酶抑制作用进行了研究。结果发现，这 3 种桂花对该酶均体现了抑制作用，其中贵妃红叶的活性最好，3 个品种的叶提取物抑制酶活性均比对照药阿卡波糖强。这说明，桂花抑制酶活性成分主要存在于叶中，具体是哪一类成分，值得进一步研究。

2.3 抑菌活性

何冬宁等^[45]对桂花叶挥发油中的化学成分进行分析并进行了体外抑菌活性实验。结果发现，桂花叶挥发油 (苯乙醇为其中主要物质) 对大肠杆菌没有抑制作用，而选择性对金黄色葡萄球菌和红酵母有一定的抑制作用。王丽梅等^[46]对桂花中黄酮类成分的抑菌活性进行了研究。结果表明，桂花黄酮

类成分对金黄色葡萄球菌、大肠杆菌、枯草杆菌以及稻瘟病菌均有较好的抑菌效果，并且其效果优于对照品苯甲酸钠，说明桂花黄酮在抑菌方面有较好的应用前景。

2.4 其他活性

Lee 等^[19]考察了从丹桂中分离得到的木脂素类成分对巨噬细胞 RAW 264.7 NO 释放水平的影响。结果发现，连翘昔 (27) 和连翘脂素 (63) 显示了强烈的抑制 NO 释放活性，IC₅₀ 值分别为 18.9、25.5 $\mu\text{mol/L}$ 。此外，Lee 等^[31]首次考察了丹桂中甾醇类成分对结肠癌细胞 HCT-116 的抑制作用，结果发现岩皂甾醇 (121) 的细胞毒活性比广泛使用的上市药物阿霉素强。Lee 等^[47]首次对桂花乙醇提取物的神经保护作用进行了研究，MTT 实验表明其 EC₅₀ 值为 66 $\mu\text{g/mL}$ ，显示出一定的神经保护作用。

3 结语

我国作为木犀属植物的分布中心，对其进行研究具有得天独厚的优势。桂花作为木犀属代表性物种，传统上更多的应用于食品、香料、园艺和观赏领域。随着生物技术的发展和新的桂花资源不断被发现，桂花的品种也在不断增加，对桂花种的分类和研究带来一定的挑战。此外，关于桂花和木犀属植物的药用价值方面的研究并不多（主要是指非芳香性成分的生物活性）。虽然我国传统医药著作对桂花的药用价值作了一定的介绍，但多是民间药用经验的积累，对其药效物质基础和作用机制并不明确。因此，进一步深入研究桂花乃至木犀属植物的化学成分和药理活性，可以为该资源的合理应用提供有价值的参考。

参考文献

- [1] 臧德奎, 向其柏. 桂花品种研究 [J]. 南京林业大学学报: 自然科学版, 2004, 28(增刊): 7-13.
- [2] 叶小梅, 梁如煜, 余义勋. 桂花几个方面的研究进展 [J]. 广东林业科技, 2007, 23(2): 77-80.
- [3] Hirowki I, Kenichiro I, Toshio N, et al. Two new iridoidglucosides fragranp from *Osmantus fragrans* [J]. *Phytochemistry*, 1975, 4: 2029-2032.
- [4] Kikuchi M, Yamauchi Y. Studies on the constituents of *Osmanthus* species. IV. On the components of the leaves of *Osmanthus fortunei* Carr [J]. *Yakugaku Zasshi*, 1985, 105(6): 542-546.
- [5] Sugiyama M, Machida K, Matsuda N, et al. A secoiridoid glycoside from *Osmanthus asiaticus* [J]. *Phytochemistry*, 1993, 34(4): 1169-1170.

- [6] Benkrief R, Ranarivelo Y, Skaltsounis A L, et al. Monoterpene alkaloids, iridoids and phenylpropanoid glycosides from *Osmanthus austrocaledonica* [J]. *Phytochemistry*, 1998, 47(5): 825-832.
- [7] Sakamoto S, Machida K, Kikuchi M. Studies on constituents of *Osmanthus* species XVII. On the chemical constituents from the leaves of *Osmanthus ilicifolius* [J]. *J Tohoku Pharm Univ*, 2007, 43: 63-67.
- [8] Shigeaki S, Machida K, Kikuchi M. Ilicifoliosides a and b, bis-secoiridoid glycosides from *Osmanthus ilicifolius* [J]. *Heterocycles*, 2007, 74: 937-941.
- [9] Machida K, Yamauchi M, Kikuchi M. Studies on the constituents of *Osmanthus* species. XXII. Two new secoiridoid glycosides from the leaves of *Osmanthus fragrans* Lour. var. *aurantiacus* Makino [J]. *J Tohoku Pharm Univ*, 2009, 56: 33-36.
- [10] Sakamoto S, Machida K, Kikuchi M. Secoiridoid di-glycoside from *Osmanthus ilicifolius* [J]. *Heterocycles*, 2009, 77(1): 557-563.
- [11] Lee D G, Choi J S, Yeon S W, et al. Secoiridoid glycoside from the flowers of *Osmanthus fragrans* var. *aurantiacus* Makino inhibited the activity of β -secretase [J]. *J Korean Soc Appl Biol Chem*, 2010, 53(3): 371-374.
- [12] Sugiyama M, Kikuchi M. Studies on the constituents of *Osmanthus* species. VII. Structures of lignan glycosides from the leaves of *Osmanthus asiaticus* [J]. *Nakai Chem Pharm Bull*, 1991, 39(2): 483-485.
- [13] Sugiyama M, Masao K. Characterization of larinicresinol glucosides from *Osmanthus asiaticus* [J]. *Heterocycles*, 1993, 36(1): 117-121.
- [14] Sugiyama M, Nagayama E, Kikuchi M. Lignan and phenylpropanoid glycosides from *Osmanthus asiaticus* [J]. *Phytochemistry*, 1993, 33(5): 1215-1219.
- [15] Machida K, Sakamoto S, Kikuchi M. Structure elucidation and NMR spectral assignments of four neolignan glycosides with enantiometric aglycones from *Osmanthus ilicifolius* [J]. *Magn Reson Chem*, 2008, 46: 990-994.
- [16] Sakamoto S, Machida K. Lignan glycosides from the leaves of *Osmanthus heterophyllus* [J]. *J Nat Med*, 2008, 62: 362-363.
- [17] Machida K, Sakamoto S. Two new neolignan glycosides from leaves of *Osmanthus heterophyllus* [J]. *J Nat Med*, 2009, 63: 227-231.
- [18] Machida K, Yamauchi M, Kurashina E, et al. Four new lignan glycosides from *Osmanthus fragrans* Lour. var. *aurantiacus* Makino [J]. *Helv Chim Acta*, 2010, 93: 2164-2175.
- [19] Lee D G, Lee S M, Bang M H, et al. Lignans from the flowers of *Osmanthus fragrans* var. *aurantiacus* and their inhibition effect on NO production [J]. *Arch Pharm Res*, 2011, 34(12): 2029-2035.
- [20] Kikuchi M, Yamauchi Y. Isolation and structures of new *p*-coumaroyl glycosides, osmanthuside A, B and C from the leaves of *Osmanthus fragrans* var. *aurantiacus* Makino [J]. *Yakugaku Zasshi*, 1985, 105(4): 411-414.
- [21] Sugiyama M, Kikuchi M. Studies on the constituents of *Osmanthus* species. VI. Structures of phenylpropanoid glycosides from the leaves of *Osmanthus asiaticus* [J]. *Nakai Chem Pharm Bull*, 1990, 38(11): 2953-2955.
- [22] Sugiyama M, Kikuchi M. Phenolic glycosides from *Osmanthus asiaticus* [J]. *Phytochemistry*, 1991, 30(9): 3147-3149.
- [23] Sugiyama M, Kikuchi M. Studies on the constituents of *Osmanthus* species. X. Structures of phenolic glucosides from the leaves of *Osmanthus asiaticus* [J]. *Nakai Chem Pharm Bull*, 1992, 40(2): 325-326.
- [24] Sugiyama M, Kikuchi M. Phenylethanoid glycosides from *Osmanthus asiaticus* [J]. *Phytochemistry*, 1993, 2(6): 1553-1555.
- [25] Hu C D, Liang Y Z, Guo F Q, et al. Determination of essential oil composition from *Osmanthus fragrans* Tea by GC-MS combined with a chemometric resolution method [J]. *Molecules*, 2010, 15: 3683-3693.
- [26] Hu C D, Liang Y Z, Li X R, et al. Essential oil composition of *Osmanthus fragrans* varieties by GC-MS and heuristic evolving latent projections [J]. *Chromatographia*, 2009, 70: 1163-1169.
- [27] Wang L M, Li M T, Jin W W, et al. Variations in the components of *Osmanthus fragrans* Lour. essential oil at different stages of flowering [J]. *Food Chem*, 2009, 114: 233-236.
- [28] 王呈仲, 苏越, 郭寅龙. 顶空-气相色谱-质谱联用分析桂花和叶中挥发性成分 [J]. 有机化学, 2009, 29(6): 948-955.
- [29] 刘绍华, 黄世杰, 胡志忠, 等. 烟用桂花香精的分析及其对卷烟增香作用的研究 [J]. 中草药, 2009, 40(增刊): 109-112.
- [30] Kubba A, Tillequin F, Koch M, et al. Iridoids, lignan, and triterpenes from *Osmanthus cymosus* [J]. *Biochem System Ecol*, 2005, 33: 305-307.
- [31] Lee D G, Park J H, Yoo K H, et al. 24-Ethylcholesta-4, 24(28)-dien-3, 6-dione from *Osmanthus fragrans* var. *aurantiacus* inhibits the growth of human colon cancer cell line, HCT-116 [J]. *Korean Soc Appl Biol Chem*, 2011, 54(2): 206-210.

- [32] Pan Y M, Zhu Z R, Huang Z L, et al. Characterisation and free radical scavenging activities of novel red pigment from *Osmanthus fragrans*' seeds [J]. *Food Chem*, 2009, 112: 909-913.
- [33] Huang S W, Pan Y M, Gan D H, et al. Antioxidant activities and UV-protective properties of melanin from the berry of *Cinnamomum burmannii* and *Osmanthus fragrans* [J]. *Med Chem Res*, 2011, 20: 475-481.
- [34] Wu L C, Chang L H, Chen S H, et al. Antioxidant activity and melanogenesis inhibitory effect of the acetonite extract of *Osmanthus fragrans*: A potential natural and functional food flavor additive [J]. *LWT-Food Sci Technol*, 2009, 42: 1513-1519.
- [35] 田成. 桂花果实多酚的超声波提取及抗氧化活性研究 [J]. 食品科学, 2011(24): 106-110.
- [36] 潘英明, 李海云, 王恒山, 等. 桂花种子皮黑色素总酚含量的测定及其脂质抗氧化活性研究 [J]. 食品研究与开发, 2005, 26(5): 145-148.
- [37] 郭娇娇, 罗佳, 宫智勇. 桂花中总黄酮提取工艺及其抗氧化性活性的研究 [J]. 武汉工业学院学报, 2011, 30(1): 5-8.
- [38] 雷明. 桂花果类黄酮分离纯化工艺及其抗氧化性研究 [J]. 西南大学学报: 自然科学版, 2011, 33(4): 77-82.
- [39] 靳熙茜, 汪海波. 桂花总黄酮提取及其体外抗氧化性能研究 [J]. 粮食与油脂, 2009(11): 42-46.
- [40] 王丽梅, 叶诚, 鄢又玉. 桂花总黄酮对油脂抗氧化作用研究 [J]. 安徽农业科学, 2012, 40(30): 14969-14970.
- [41] 尹爱武, 邓胜国, 高鹏飞, 等. 桂花黄酮抗自由基及体内抗氧化作用研究 [J]. 湖南科技学院学报, 2011, 32(12): 51-54.
- [42] 张晓璞. 虎杖根茎和桂花果肉的抗氧化性活性初探 [D]. 桂林: 广西师范大学, 2008.
- [43] 张俊会. 桂花体外抗氧化活性初探 [J]. 农产品加工·学刊, 2005(3): 73-76.
- [44] 曹乃峰, 李元元, 崔维恒, 等. 桂花(晚银桂、窈窕淑女和贵妃红) α -葡萄糖苷酶抑制活性 [J]. 河南大学学报: 医学版, 2010, 29(1): 13-16.
- [45] 何冬宁, 姜自见, 张文慧, 等. 桂花叶挥发油化学成分分析及其生物活性 [J]. 江苏林业科技, 2008, 35(4): 1-4.
- [46] 王丽梅, 余龙江, 崔永明, 等. 桂花黄酮的提取纯化及抑菌活性研究 [J]. 天然产物研究与开发, 2008, 20(4): 717-720.
- [47] Lee H H, Lin C T, Yang L L. Neuroprotection and free radical scavenging effects of *Osmanthus fragrans* [J]. *J Biomed Sci*, 2007, 14: 819-827.