

从亚马孙河藤本植物 *Doliocarpus dentatus* 中分离出杀利什曼原虫的三萜和木脂体类

皮肤利什曼病(cutaneous leishmaniasis)是南美热带地区,尤其是亚马孙河森林中的一种原虫病。*Doliocarpus* 属藤本植物广泛生长在亚马孙河地区,该植物液汁可用以解渴,苏里南的土著黑人则用其茎粉治疗利什曼溃疡。在法属圭亚那的巴斯德研究院和法国科学研究院合作发展部(ORSTOM)已开展研究该植物提取物的杀利什曼原虫活性。作者首次报道从该属植物 *D. dentatus* 中分得的三萜和木脂体在体外具有杀亚马孙利什曼原虫无鞭毛体的活性。

植物原料 *D. dentatus* (Aublet) Standly 的干茎粉 1000g 用石油醚脱脂,提取液浓缩过滤得 2g 纯晶体。脱脂后的茎用二氯甲烷在索氏器提取 60h,真空抽干提取液得 4.72g 残余物,经柱层析分离得 5 种质量分别为 60、62、60、8.6、9.6mg 的无定形物或无色晶体。经鉴定 3 个三萜类为桦木酸(betulinic acid)、桦木醛(betunaldehyde)和桦木醇(betulin);木脂体为(+)-松脂酚[(+)-pinoresinol]、(+)-medioresinol 和(-)-lirioresinol B。

杀利什曼原虫试验包括:无鞭毛体的分离,腹膜巨噬细胞的制取,被测物对巨噬细胞的毒性测定,被测物对巨噬细胞被无鞭毛体感染的抑制作用和溶剂毒性试验。

随着该植物二氯甲烷提取液浓度的增加,无鞭毛体对巨噬细胞的感染率降低。当桦木醛的剂量为 60 μ g/ml 时,无鞭毛体的存活率只有 12%,但对巨噬细胞有毒性作用;而(+)-medioresinol 和(-)-lirioresinol B 在同剂量下,无鞭毛体的存活率为 40%,且两者对巨噬细胞产生毒性的剂量要在 125 μ g/ml 以上。用麦格鲁明锡酸盐作同样试验,当加入的剂量为 300 μ g/ml 时,无鞭毛体的存活率仅为 3%,而它对巨噬细胞产生毒性的剂量要高于 600 μ g/ml。已知 Furofuran 型木脂体有多种生物活性,它的重要作用

之一是在参照物相同剂量下,能抑制 cAMP 磷酸二酯酶。cAMP 代谢过程的探索可作为杀利什曼原虫药的一种可能的作用方式。

(钮因尧摘译 陈泽乃校)

[Phytother Res 1996,10:1]

从茜草中分离出抑制人肝癌细胞株分泌 HBsAg 的化合物

感染乙型肝炎病毒(HBV)通常引起急、慢性肝炎,若 40 岁以上的男性感染 HBV 则很有可能引发原发性肝癌。虽然用免疫方法在某种程度上可防治 HBV 的感染,但并不能完全解决问题,仍需要寻找治疗 HBV 感染的新药物。资料表明人肝癌细胞株(Hep 3B)可持续分泌乙型肝炎表面抗原(HBsAg),因此可用它作为从天然植物中快速筛选抗 HBV 药物的评价方法。

茜草 *Rubia cordifolia* L. 是一传统的中草药,具有抗癌和其它作用。作者发现茜草根的甲醇提取物的氯仿部分可抑制 Hep 3B 细胞分泌 HBsAg,并从中分离出 3 个已知的萘氢醌化合物:furomollugin、mollugin 和 rubilactone。前两个化合物可强烈地抑制 Hep 3B 细胞株分泌 HBsAg,其 IC₅₀均为 2.0 μ g/ml,而对细胞株的活性无影响,因为用它们处理过的细胞株仍显活力,并在其后 48h 的培养时间内可继续分裂增殖,并不显示细胞毒性。

作者在分离出上述 3 个化合物的基础上又合成出 9 个衍生物,通过对它们的构效分析得出如下结论:C₆ 位上的一OH 对其生物活性影响重大,若换成 -OCH₃,则该化合物不能抑制细胞株分泌 HBsAg; C₆ 位上若被大基团如一OCH₂Ph 取代,则可增强其抑制活性。另外,吡喃和呋喃环对其生物活性也有重要的影响。

(高连用摘译 刘昌孝校)

[J Nat Prod 1996,59(3):330]