

苜基异喹啉和菲类生物碱的 抗血小板和血管舒张作用

在寻找具有抗血小板和血管扩张作用植物的有效成分中,发现荷苞牡丹碱(dicentrine)和芒籽宁(atherosperminine)等具有此种活性。为此,对存在于台湾的番荔枝和樟科植物中的衡州乌药碱(dl-coclaurine, VI)、N-去甲杏黄罂粟碱[1-(+)-N-norremepavine, VII]和木兰箭毒碱 I [d-(+)-magnocurarine I, VIII]等 9 种天然产物和稍加以结构改造的衍生物进行了抗血小板聚集(Pa)和血管舒张(Va)作用的测试。结果高氯酸芒籽宁(XV)和碘磺芒籽宁(XVI)的抗 Pa 活性最高,在 100 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 浓度时即能抗二磷酸腺苷(ADP)、花生四烯酸(AA)、胶原和血小板激活因子(PAF)引起的 Pa。N-甲基衡州乌药碱(I)、羟胺木番荔枝碱(xylopine hydroxylamine, XVIII)和芒籽宁氮氧化物(XIX)能抗 AA 和胶原引起的 Pa,对 ADP 和 PAF 引起的 Pa 则无效。VI 能完全抗 AA 引起的 Pa,次甲基荷苞牡丹碱(XVII)则能抗胶原引起的 Pa, VIII 能抗 PAF 引起的 Pa。其它有的稍有微弱的作用,而有的则完全无作用。由此总结出:在试测的 20 个生物碱中,菲类抗 Pa 活性较苜基异喹啉类强。这些生物碱的旋光活性并不影响其抗 Pa 活性。结构中某些含氧的侧链若被甲氧基取代或进一步氮氧化后,抗 Pa 活性就削弱。用大鼠胸主动脉环标本测得 XV 和 XIX 能完全抑制高钾和去甲肾上腺素(NE)引起的 Va, XVII 能抑制 NE 引起的 Va,但对高钾引起的 Va 则较差。去甲杏黄罂粟碱高氯酸 II、I、XVI 和 XVIII 能部分或轻微抑制高钾引起的 Va,但对 NE 引起的 Va 则无效。1-(+)-半日花素[1-(+)-laudanine, IV]和次甲海罂粟碱氮氧化物(glaucine methine N-oxide, XX)能部分抑制 NE 引起的 Va 而对高钾引起的 Va 无效。

(史玉俊摘译)

[J Nat Prod 1996, 59(5):531]

两种软体珊瑚中的细胞毒化合物

在研究海洋生物活性物质中,软体珊瑚 *Sinu-*

laria gibberosa (Si) 和 *Sarcophyton trocheliophorum* (Sa) 的氯仿提取物对 A549(人肺腺癌)、HT-29(人结肠癌)、KB(人表皮癌)和 P₃₈₈(鼠淋巴细胞白血病)细胞培养物有明显的细胞毒活性。现报道以细胞毒为导向,从上述两种软珊瑚中分离到新的细胞毒化合物。

两种珊瑚于台湾近 Kenting 深 12m 处采集。提取前冷冻保存。将 Si 切成片,先后以甲醇、丙酮、氯仿制成匀浆。真空除去溶剂。残渣以氯仿-水分配提取。氯仿提取物进行柱层析,以氯仿、氯仿-甲醇梯度洗脱。氯仿-甲醇洗脱液(9:1)含有 cembranoids I~IV。此部分洗脱液再经硅胶 G 柱层析,以正己烷-乙酸乙酯、氯仿-丙酮或乙酸乙酯-正己烷-氯仿作洗脱溶媒提纯。

软体珊瑚 Sa 按上述作同样处理,经切片、制匀浆、除有机溶媒、分配提取、柱层析,氯仿-甲醇液(19:1)含 cembranoids V~VII。V 经葡聚糖凝胶 LH-20 柱层析,以正己烷-二氯甲烷作洗脱溶媒提纯。VI、VII 经硅胶 G 柱层析,以正己烷-丙酮(4:1)和正己烷-乙酸乙酯(6:1)为洗脱溶媒提纯。经光谱和化学方法确定了化合物 I~VII 的结构。

I 为 11,12-epoxy-1(E),3(E),7(E)-cembratrien-15-ol, $\text{C}_{20}\text{H}_{32}\text{O}_2$, 无色油状物, $[\alpha]_{\text{D}}^{25} - 8.6^\circ(\text{c}, 0.17, \text{CHCl}_3)$; II 为 3,4,11,12-diepoxy-15-methoxy-1(E),7(E)-cembradiene, $\text{C}_{21}\text{H}_{34}\text{O}_3$, 无色棱晶, $\text{mp} 98^\circ\text{C} \sim 100^\circ\text{C}$, $[\alpha]_{\text{D}}^{25} + 138.9^\circ(\text{c}, 0.024, \text{CHCl}_3)$; III 为 1(E),3(E),7(E),11(E)-cembrate-triene-14,15-diol, $\text{C}_{20}\text{H}_{32}\text{O}_2$, 无色油状物, $[\alpha]_{\text{D}}^{25} + 59.1^\circ(\text{c}, 0.015, \text{CHCl}_3)$; IV 为 3,14-epoxy-1(E),7(E),11(E)-cembratriene-14,15-diol, $\text{C}_{20}\text{H}_{32}\text{O}_3$, 无色油状物, $[\alpha]_{\text{D}}^{25} - 10.6^\circ(\text{c}, 0.24, \text{CHCl}_3)$; V 为 7 β ,8 α -dihydroxydepoxy sarcophine, $\text{C}_{20}\text{H}_{30}\text{O}_4$, 无色棱晶, $\text{mp} 143^\circ\text{C} \sim 145^\circ\text{C}$, $[\alpha]_{\text{D}}^{25} + 106^\circ(\text{c}, 0.024, \text{CHCl}_3)$; VI 为 sarcophine, 黄色针晶, $\text{mp} 130^\circ\text{C} \sim 132^\circ\text{C}$, $[\alpha]_{\text{D}}^{25} + 96.7^\circ(\text{c}, 0.01, \text{CHCl}_3)$; VII 为 16-deoxysarcophine, 无色针晶, $\text{mp} 76^\circ\text{C} \sim 77^\circ\text{C}$, $[\alpha]_{\text{D}}^{25} + 150^\circ(\text{c}, 0.1, \text{MeOH})$ 。

(朱晓蕙摘译 刘湘校)

[J Nat Prod 1996, 59(6):595]