

哥纳香内酯的细胞毒作用和电镜下的细胞死亡情况

哥纳香内酯(goniothalamine, 5-羟基-7-苯基-2,6-二烯庚酸内酯)为一个有生物活性的苯乙炔吡喃酮衍生物。曾从多种哥纳香属植物中分得。此化合物具有较强的致胚胎毒和致畸作用,并在盐水虾和 9 KB 细胞系试验中呈强力的细胞毒作用。作者报道该化合物对 HeLa 子宫颈癌, PANC-1 胰腺癌, HGC-27 胃癌和 MCF-7 乳腺癌细胞以及非癌性的小鼠 3T3 纤维细胞进行了细胞毒活性的测定,并在扫描和透射电镜下观察了细胞死亡的情况。

细胞毒试验结果表明哥纳香内酯对所有上述各细胞系都显较高的毒性。其 CD_{50} 分别为 1、3、0.7、1 和 1 $\mu\text{g/mL}$ 。对生长最快的 HGC-27,毒性最大,对 PANC-1 则较差。在细胞生长较慢的静止条件下,细胞毒性较低,可见其对分裂生长中的细胞毒性较大。

用扫描和透射电镜观察细胞死亡情况,大体上可见线粒体基质呈肿胀的絮凝稠密状,这是细胞死亡的最初现象。还可见细胞核肿胀,沿核膜染色质呈不规则的聚集和线粒体膜破裂。这种细胞坏死过程中产生的膜不连续性,增加了膜的渗透性,最终使细胞膜完全崩溃。这是膜活性物质破坏细胞膜所共有的特性,也说明哥纳香内酯细胞毒性的作用机理。

(史玉俊摘译)

[Planta Med 1997, 63(1):81]

从楝树得印楝素型细胞毒 柠檬苦素类化合物

从楝树 *Melia azedarach* L. 新鲜根皮分到 4 个新的柠檬苦素:1-惕各酰-3,20-二乙酰-11-甲氧基楝果宁(I), 3-惕各酰-1,20-二乙酰-11-甲氧基楝果宁(II), 1-肉桂酰-3-羟基-11-甲氧基楝果宁(III)和 1-去氧-3-甲基丙炔酰-11-甲氧基楝果宁(IV),以及已知物 1-肉桂酰-3-乙酰-11-甲氧基楝果宁(V)。它们的结构是通过光谱确定的。这 5 个柠檬苦素类化合物对小鼠淋巴细胞白血病(P_{388})的细胞毒活性(IC_{50} , $\mu\text{g/mL}$)分别为:100、48.0、1.5、47.9 和 10.5。

结构式如图 1。

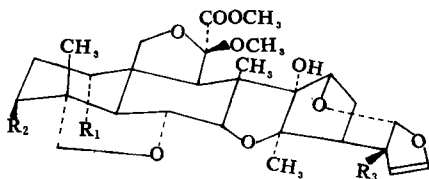


图 1 柠檬苦素类化合物的结构

I $R_1 = \text{OTig}, R_2 = R_3 = \text{OCOCH}_3$

II $R_1 = R_3 = \text{OCOCH}_3, R_2 = \text{OTig}$

III $R_1 = \text{OCin}, R_2 = R_3 = \text{OH}$

IV $R_1 = \text{H}, R_2 = \text{OCOC}(\text{CH}_2) = \text{CH}_2, R_3 = \text{OH}$

V $R_1 = \text{OCin}, R_2 = \text{OCOCH}_3, R_3 = \text{OH}$

(陈笔岫摘译 江纪武校)

[Phytochemistry 1996, 42(3):209]

赤芍和白芍商品药材的比较研究

赤芍 *Paeonia veitchii* Lynch 和白芍 *P. lactiflora* Pall. 为毛茛科芍药属植物,其根为传统的中药材,前者具有清热、活血化瘀功效;而后者具有补血、镇痛等作用。现已从中分到 8 种有效成分:没食子酸、羟基芍药甙(oxypaeoniflorin, OPF)、白芍药甙(aibiflorin, AF)、芍药甙(paeoniflorin)、苯甲酸、五没食子酰葡萄糖、丹皮酚(paeonol)和苯甲酰白芍药甙。从不同产地采集的药材有效成分含量相差很大,因此对各种市售药材进行比较研究就极为重要。作者从台湾不同药店收集了 37 种药材,经生药鉴定分为白芍和赤芍两个品种,并用 HPLC 法测定上述 8 种有效成分的含量。

取芍药根粗粉 1.0 g,用 50%乙醇(7 mL)重复提取,离心 3 次,合并提取液,过滤,加入内标液二羟肉桂酸 5 mL,并稀释至 50 mL。取 20 μL 进行 HPLC 测定(C_{18} 反相柱,磷酸缓冲液和 CH_3CN 梯度洗脱)。

结果显示,白芍药材中有效成分含量均高于赤芍,在所有药材中生物活性成分芍药甙的含量是最高的(白芍中占总量的 54%~65%;赤芍中占 72%)。白芍根无论有无外皮,AF/OPF>1(去皮根平均为 4.59;有皮根平均 4.74)。而有皮赤芍根中 AF/OPF<1(平均 0.09)。但白芍药材(有或无根皮)中苯甲酸含量极低,一般也不能检出丹皮酚,与赤芍药材有明显特征性差异。白芍药材中除苯甲酸和白