

姜黄类化合物对氧自由基损害的表皮细胞的保护作用

姜科植物姜黄 *Curcuma longa* L. 的芳香成分姜黄素(curcumin)是一种天然的橙黄染料和良好的脂质过氧化抑制剂。作者应用次黄嘌呤/黄嘌呤氧化酶(HX/XO)诱导人角化细胞和四唑硝基蓝(NBT)还原产生局部超氧化物检查姜黄类化合物对角质化细胞的保护作用。

试验所用姜黄类化合物是姜黄根茎的天然成分姜黄素、脱甲氧姜黄素和双脱甲氧姜黄素的混合物(各成分比为 55:31:14)。试验以姜黄素纯品比较活性,以 Silybin 试剂(已知的保护皮肤免受自由基损害的试剂)作为阳性对照。试验结果显示,受 HX/XO 损害可导致 49% 的角质化细胞死亡。当加入低浓度的姜黄类化合物(浓度为 0.32、1.25 和 5 $\mu\text{g/mL}$)后可分别使细胞存活率增加 13%、18% 和 22%,而此浓度的姜黄类化合物对细胞无毒性。

研究表明,姜黄类化合物可抑制 NBT 的还原,对照标准曲线,反应开始后 10 min,药物浓度为 5.00 和 1.25 $\mu\text{g/mL}$ 时反应活性下降 87%;药物浓度为 0.325 $\mu\text{g/mL}$ 时反应活性下降 75%。姜黄素纯品的作用不如姜黄类化合物,这揭示混合物中各化合物之间有协同作用。Silybin 试剂(酚性抗氧化剂)对 NBT 还原也有强抑制作用。抑制超氧化物的生成从而降低 H_2O_2 引起的细胞毒性,可能是姜黄类化合物对人角质化细胞起保护作用的原因之一。

(姚丽莉摘译 陆 阳校)

[Planta Med 1997,63(3):265]

苦参中异戊二烯型类黄酮对磷脂酶 C_n 的抑制作用

磷脂酶 C(PLC)能将细胞膜上的二磷酸磷脂酰肌醇(PIP_2)水解成第二信使二酰甘油及三磷酸肌醇,在细胞间信号传导及细胞增殖方面起重要作用。PLC 抑制剂有望成为细胞生长抑制剂及研究细胞间信号传导机理的有效试剂。作者通过测定 IC_{50} ,比较研究了从苦参 *Sophora flavescens* 根中分得的 11 种异戊二烯型类黄酮 sophoraflavone G(I),kurarinone(II),kushenol B(VI),kushenol E(X),kushenol H(IV),kushenol K(V),kushenol L(X),kushenol M(VII),kushenol N(III),kosamol A(VIII)

及 kuraridin(XI)对 PLC_n 的抑制作用,并与其它 4 种常见类黄酮:本犀草素,槲皮素,橙皮甙,染料木素的抑制作用作了比较。

上述 4 种常见类黄酮对 PLC_n 的抑制作用很弱, IC_{50} 皆大于 $250 \times 10^{-6} \text{ mol/L}$,而上述 11 种异戊二烯型类黄酮则具有较强的抑制作用,除化合物 VI 外($\text{IC}_{50} > 5.3 \times 10^{-4} \text{ mol/L}$), IC_{50} 在 $7.5 \times 10^{-6} \sim 35 \times 10^{-6} \text{ mol/L}$,其中化合物 VI 活性最强, IC_{50} 为 $7.5 \times 10^{-6} \text{ mol/L}$ 。构效关系研究表明:3 位存在 -OH 将明显降低此类化合物的活性,此 -OH 的构型与活性有关, C_8 存在拉凡杜基(lavanduly)则对活性强度非常重要。化合物 I、VI、XI 与目前报道的仅有的 4 种 PLC 抑制剂的活性相当,预示其具有良好的应用前景。异戊二烯型类黄酮具有强烈的活性,对它们在细胞间信号传导的途径需要作更深入的研究。

(张 敏摘译 陆 阳校)

[Planta Med 1997,63(3):266]

紫珠草属植物 *Alhanna orientalis* 中的抗病毒黄酮类化合物

紫草科紫珠草属植物 *Alhanna orientalis* (L.) Boiss. 为多年生草本植物,分布在整个阿拉伯地区和西奈半岛的南部,在当地用于治疗咽喉痛。

从沙特阿拉伯采集的该植物的乙醇提取物表现出良好的抗柯萨奇(Coxsackie)病毒作用。生物导向测定分离得到具有上述生物活性的 6 个已知的 3-甲氧基黄酮,它们是:茨非醇 3,7-二甲醚(kumatakenin, I),茨非醇 3,4'-二甲醚(ermanin, II),6-甲氧基茨非醇 3,7-二甲醚(penduletin, III),6-甲氧基槲皮素 3,3'-二甲醚(jaceidin, IV),6-甲氧基茨非醇 3-甲醚(V)和茨非醇 3-甲醚(isokaempferide, VI)。

干燥的植物地上部分(2 kg)用乙醇提取,蒸干提取物(246.7 g),部分提取物(40 g)进行 C_{18} 柱层析,以甲醇-水的混合物洗脱,活性组分通过硅胶 60 柱进一步纯化,以氯仿-丙酮(0~10%)梯度洗脱得到化合物(I)13 mg,(II)33 mg,(III)8.4 mg,(IV)10.9 mg,(V)40.6 mg 和 VI 30 mg。

以柯萨奇病毒 B3 感染的 Vero 细胞试验 I~VI 的抗病毒活性, IC_{50} 分别是 6、1.2、<2、<2、3.4 和 0.94 $\mu\text{g/mL}$,阳性对照物为氯喹($\text{IC}_{50} = 10 \mu\text{g/mL}$)。

(沈 嘉摘译 冰 华校)

[Planta Med 1997,63(4):384]