

假马齿苋中新三萜 Bacosine 的止痛作用

玄参科的假马齿苋 *Bacopa monnieri* L. 是印度草药中有名的安神和增进记忆的药物。经多种试验和临床证实,其粗提物和其中的生物碱、皂甙和三萜成分,确有一定影响精神、抗焦虑和促进智力的作用。作者报道从该植物的地上部分,分得1个新的三萜类化合物:羽扇-20(29) 烯-3 α 羟基-27 酸,命名为 bacosine,并研究了它的止痛作用(图1)。

试验用 Wistar 大鼠和 Swiss 小鼠,经腹腔给以 bacosine 的蒸馏水溶液 25 mg/kg,以等量的生理盐水为对照。用机械、化学和加热等致痛模型,进行

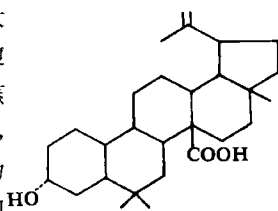


图1 bacosine 的结构

了镇痛效果试验。机械致痛用尾夹,化学用醋酸所致的尾巴扭动;加热致痛则用热板法。结果 bacosine 对机械致痛无镇痛作用,动物都试图尽快将加在尾部的夹子除掉。对醋酸和热板所致的痛觉则有显著的止痛作用。对戊巴比妥诱导的睡眠时间,爬杆中的条件回避反应,自发行活动性和氟哌啶醇所致的僵住症等则都无影响。说明本品并无中枢神经作用。

bacosine 的急性毒性试验,曾用到腹腔注射 300 mg/kg 的剂量,观察 48 h,未见有何不良反应。

由于纳洛酮能拮抗本品的止痛作用,而本品又能增强吗啡的止痛作用,故认为本品可能和鸦片能机制有关。

(史玉俊摘译)

[Fitoterapia 1997,68(4):361]

13 位烷基取代原小檗碱季铵盐类的 抗菌活性

曾研究了某些小檗碱 9 位和 13 位烷基取代衍生物的抗菌活性。作者现报道了 13 位含不同烷基侧链小檗碱和掌叶防己碱(palmatine)衍生物抗革氏阳性菌、阴性菌和抗真菌的活性。

采用醛与二氢小檗碱或掌叶防己碱在 20% 醋

酸中反应制得相应的 13-烷基(己基、丁基、丙基或乙基)取代的小檗碱和掌叶防己碱衍生物。抗菌研究针对两种不同的金黄色葡萄球菌(S1、S2)、大肠杆菌和白色念珠菌。

研究表明所试的化合物对革氏阳性菌金黄色葡萄球菌的活性远强于对革氏阴性菌和真菌的活性。13 位烷基取代小檗碱和掌叶防己碱的抗菌活性随取代碳链的增长而增大。在上述衍生物中,A 环的 C₂-和 C₃-连有亚甲二氧基的 13 烷基取代小檗碱衍生物比连有甲氧基的相应掌叶防己碱衍生物的抗革氏阳性菌的活性强。13-己基衍生物对所试菌株活性最强,其中 13-己基小檗碱是临床药用小檗碱对 S1、S2 活性的 64 倍和 128 倍,同样 13-己基掌叶防己碱对 S1、S2 的活性分别是掌叶防己碱活性的 128 倍和 32 倍。同卡那霉素相比,13-己基小檗碱对 S1 的活性强 8 倍,对 S2 的活性相等,而 13-己基掌叶防己碱的活性则增强了 4 倍。

13-己基小檗碱和 13-己基掌叶防己碱对于抑制金黄色葡萄球菌的生长有很高的选择性,它们对大肠杆菌和白色念珠菌的抑制活性很低,作者认为对上述活性衍生物的体内效应需作进一步评价。

(陆 阳摘译 陈泽乃校)

[Planta Med 1997,63(3):196]

从长叶哥纳香分得一个新的 番荔枝乙酰精宁化合物

在新抗癌剂研究中,从长叶哥纳香 *Goniotalamus gardneri* Hook. f. et Thoms. 的根中分到1个新的单四氢呋喃乙酰精宁化合物,命名为长叶哥纳香素(gardnerin),C₃₅H₆₄O₈,无色无定形粉末,mp 65℃~68℃, [α]_D²⁵+18.15°(c, 0.14, CH₃OH)。化学结构是通过 NMR 和 MS 光谱以及化学衍生物确定的。绝对构型是用其 per-Mos-her 酯分析解决的。

长叶哥纳香素有细胞毒活性,对人鼻咽癌(KB)、人结肠癌(HCT-8)和人肝癌(Bel 7402)细胞的 IC₅₀ 分别为 5.1、4.3 和 4.6 μmol/L。

(陈笔岫摘译 江纪武校)

[Chin Chem Lett 1997,8(11):97]