

总状土木香根的保肝作用

菊科植物总状土木香 *Inula racemosa* Hook f. 的根在印度通常用于消除肝脾等脏器的炎症。作者报道其全根和不同溶剂的提取物对 CCl_4 、扑热息痛和利福平等导致的肝损伤所起的保护作用。用已知的保肝药水飞蓟素作对照比较。

供试品及其提取物: (I) 总状土木香根的干燥粉。(II) 粉碎根的石油醚提取物。(III) 石油醚提取后的残余部分再经甲醇提取所得的提取物。(IV) 石油醚和甲醇提取后的残渣, 经水煮所得的水煎煮物。(V) 全根的水煎煮物。

剂量和给药方法: 各供试品和对照品都配成 5% 的阿拉伯胶浆, 管饲给药, 除根粉 I 的剂量为 500 mg/kg 外, 其余均为 100 mg/kg。

生化参数: 分别测定血液谷草转氨酶 (SGOT)、谷丙转氨酶 (SGPT)、碱性磷酸酶 (ALKP)、总胆红素 (TBil) 和直接胆红素 (DBil)。

结果: 各供试品的急性 LD_{50} , 除石油醚提取物 II 为大鼠口服 1.5 g/kg 外, 其余各提取或煎煮物都在 10 g/kg 以上, 毒性甚微。

保肝作用: 全粉 I 和全根水煎煮物 V 对 CCl_4 肝中毒和扑热息痛肝损伤的保肝效果较好。甲醇提取部分 III 对利福平导致的肝损害, 保肝较好。效果都能和对照药水飞蓟素相比拟。保肝作用与提取物的极性有关, 极性较强的保肝作用较好。

(史玉俊摘译)

[Rao K S, et al. Fitoterapia, 1997; 68(6): 510]

新的强心烯内酯——毒见血封喉苷 A

桑科植物见血封喉 *Antiaris toxicaria* (Pres.) Lesch. 的乳汁所制得的镖毒, 用氯仿-甲醇提取, 在生物活性指引下, 经硅胶柱层析和高效液相层析等方法, 分离到 1 个新的强心烯内酯化合物, 命名为毒见血封喉苷 A (toxicarioside A)。经红外、紫外、氢谱、碳谱测定, 确定其结构为见血封喉苷元 (antiarigenin) 的 3-O-(2-O-甲基岩藻糖苷)。为一白色粉末, $\text{C}_{30}\text{H}_{44}\text{O}_{11}$, $[\alpha]_D^{25} + 0.24^\circ$ (c, 0.23, 甲醇)。

本品有抑制 $\text{Na}^+ - \text{K}^+ - \text{ATP}$ 酶的活性, 其活性程度与哇巴因的水平相当。在浓度为 1 $\mu\text{mol/L}$ 时, Km

为 0.7 mmol/L, 哇巴因为 0.9 mmol/L; V_{max} 本品为 11.9 mmol/L, 哇巴因为 16.8 mmol/L。

(陈笔岫摘译 江纪武校)

[Carter C A, et al. Tetrahedron, 1997; 53(40): 13557]

苯丙素苷的选择性细胞毒性和细胞生长抑制作用

苯丙素苷 (phenylpropanoid glycoside) 类化合物具有抗菌和真菌作用, 能抑制 5-脂氧合酶、cAMP 磷酸二酯酶、醛还原酶和蛋白激酶 C (PKC)。PKC 参与细胞增殖和分化, 故一些抑制 PKC 的分子大都具有抗肿瘤活性。作者研究了 5 个苯丙素苷 (I ~ V) 的细胞毒性和细胞生长抑制作用。

苯丙素苷 angorosides A ~ C (I ~ III) 是从玄参属植物 *Scrophularia scopolii* Hoppe 中分得, poliumoside (IV) 是从石蚕属植物 *Teucrium polium* L. 中分得, (+)-syringaresinol-O- β -D-glucopyranoside (V) 是从黄芩属植物 *Scutellaria albidula* L. ssp. *colchica* 中分得。植物来源都是从作者所在地区、土耳其安卡拉附近采集。采用染色排除法, 通过测定 IC_{50} 研究了 I ~ V 对大鼠癌细胞系的作用。

结果显示, 对 dRLh-84 细胞, 化合物 I、IV 和 V 具有显著的细胞毒性, IV 作用最强, IC_{50} 为 50.4 $\mu\text{g/mL}$, 但未见抑制细胞生长的活性。对 HeLa 细胞, I、IV 和 V 具有细胞生长抑制作用, I 和 V 在高浓度 ($> 50 \mu\text{g/mL}$) 具弱的细胞毒性, 对 S180 细胞, I、IV 和 V 在 1 $\mu\text{g/mL}$ ~ 40 $\mu\text{g/mL}$ 表现出细胞生长抑制活性, IV 活性最强, IC_{50} 为 9.1 $\mu\text{g/mL}$, IV 还具有细胞毒性, 其 IC_{50} 为 44 $\mu\text{g/mL}$ 。对 P388/D1 细胞, I、IV 具有细胞生长抑制活性, IC_{50} 分别为 12.7 和 9.8 $\mu\text{g/mL}$ 。I 和 V 具有细胞毒性, I 的 IC_{50} 为 119 $\mu\text{g/mL}$ 。II 和 III 对所试验的癌细胞系在 1 $\mu\text{g/mL}$ ~ 200 $\mu\text{g/mL}$ 浓度下未测出细胞毒性。5 种成分对初级培养的大鼠肝细胞无细胞毒性。

构效关系研究表明, 苯丙素苷的细胞毒性和细胞生长抑制作用主要在于邻二酚羟基系统, 其中一个酚羟基甲基化, 活性即消失, 这可能是甲基化衍生物 II 和 III 完全失去活性的原因。

(华会明摘译 史玉俊校)

[Saracoglu I, et al. Fitoterapia, 1997; 68(5): 434]