

侧柏中的抗血小板 活化因子 pinusolidic 酸

作者等多年来从事于筛选韩国药用植物中的血小板活化因子(PAF)抑制剂。曾从柏科植物侧柏 *Biota orientalis* (L.) Endl. 中分得 pinusolide 和雪松醇(cedrol)2个化合物。其抑制 PAF 和兔血小板受体结合的 IC_{50} 分别为 2.5×10^{-7} mol/L [(0.87 ± 0.009) μ g/mL] 和 1.3×10^{-5} mol/L [(2.9 ± 0.79) μ g/mL]。又经活性跟踪从该植物的枝叶中分得 pinusolide 的水解物 pinusolidic 酸(Ⅰ, 图1)。

Ⅰ 为无色针状物, $C_{20}H_{28}O_4$, mp 132°C ~ 133°C, $[\alpha]^{23}_D + 54.5^\circ$ (c, 0.1, $CHCl_3$)。作者认为这不是人为的产物, 因为在 $CHCl_3$ 的总提取物和 TLC 上都能测出其存在, 而酸化后的 pinusolide 在同样条件下并不产生此酸。将其溶于乙醚, 用重氮甲烷甲酯化, 得 pinusolide, $C_{21}H_{30}O_4$, 无色针状, mp 80°C ~ 82°C。

Ⅰ 的抗 PAF 的 $IC_{50} = (7.48 \pm 2.11) \mu$ g/mL [(22.5 ± 0.64) μ mol/L], 较其母体约弱 100 倍, 说明其中的酯甲基对抑制 PAF 活性有重要作用。

(史玉俊摘译)

[Yang H O, et al. *Planta Med*, 1998; 64(1): 73]

波尔定碱对小鼠膈膜及离体 骨骼肌肌浆网膜囊泡的作用

波尔多树 *Peumus boldus* Mol. 作为民间植物药主要用于治疗消化及肝胆紊乱, 同时具有保肝抗炎作用。茎叶中主要生物碱波尔定碱(boldine) [(S)-2, 9-二羟基-1, 10-二甲氧基阿朴酚] 能预防脑匀浆自身氧化及红细胞膜脂质过氧化, 干扰大鼠回肠的胆碱能收缩, 松弛大鼠子宫, 拮抗大鼠主动脉 α -肾上腺受体及电势门控 Ca^{2+} 通道, 体内实验显示还具有抗炎退热作用。作者报道波尔定碱对膈膜及离体骨骼肌肌浆网(SR)膜囊泡的作用。

波尔定碱能以剂量依赖方式增强 ryanodine 与 SR 内 Ca^{2+} 释放通道特异结合而产生的单相收缩作用。高浓度波尔定碱(300 μ mol/L)则诱导膈膜产生

双相收缩, 即快速肌强直收缩跟随缓慢产生的单相收缩和收缩抑制。当 SR 内贮存的 Ca^{2+} 完全与 ryanodine 结合后, 上述双相收缩仅保留快速肌强直收缩相。进一步加入 EGTA, 去除细胞外 Ca^{2+} , 则抑制快速肌强直收缩相, 表明上述快慢两相分别由细胞外 Ca^{2+} 内流和细胞内 Ca^{2+} 释放产生。

兔骨骼肌 SR 囊泡用以研究波尔定碱对 Ca^{2+} 释放通道即 ryanodine 受体及 Ca^{2+} 泵(Ca^{2+} -ATP 酶)的作用, Ca^{2+} 释放诱导剂聚赖氨酸(2 μ g/mL)能使囊泡上有效负载的 Ca^{2+} 快速释放, 并被 Ca^{2+} -ATP 酶缓慢吸收。 Ca^{2+} 释放通道特异阻断剂钆红能抑制波尔定碱以剂量依赖方式增强 Ca^{2+} 释放的作用, 这表明波尔定碱通过 SR 上 ryanodine 受体诱导 Ca^{2+} 释放。波尔定碱浓度高达 300 μ mol/L 时并不影响 Ca^{2+} -ATP 酶活性, 还能以剂量依赖方式明显增强 ryanodine 与其受体的结合 ($EC_{50} = 50 \mu$ mol/L), 最大激活浓度为 200 μ mol/L。用大鼠 SR 囊泡也得到了类似结果, 但数据未报道。

综上, 波尔定碱能敏化 ryanodine 受体, 诱导骨骼肌内源性 Ca^{2+} 释放。

(张 敏摘译 陆 阳校)

[Kang Jaw jou, et al. *Planta Med*, 1998; 64(1): 18]

从圭亚那塔皮木得新的细胞毒化合物

漆树科巴西植物圭亚那塔皮木 *Tapirira guianensis* Aubl. 的树皮和叶当地居民用于治疗麻疯、腹泻和梅毒, 作者从其种子的氯仿提取物中分离到 2 个新的具有细胞毒活性的化合物。(Ⅰ): 2-[10(E)-十七烯基]-1, 4-氢醌, $C_{23}H_{38}O_2$, 为蜡状物。(Ⅱ): (4R, 6R)-二羟基-4-[10(E)-十七烯基]-2-环己烯酮, $C_{23}H_{40}O_3$, 透明油状物, $[\alpha]_D + 45.5^\circ$ (c, 0.004, 甲醇)。

Ⅰ 和 Ⅱ 有细胞毒活性, 对下列瘤谱细胞的半数抑制浓度 (IC_{50} , μ g/mL) 分别为: 人乳腺癌(BC1): 1.3 和 4.3; 人肺癌(Lu1): 0.3 和 4.3; 人结肠癌(Col 2): 0.8 和 1.8; 人鼻咽癌(KB): 0.5 和 1.5; 人鼻咽癌(抗长春花碱者, 加长春花碱 1 μ g/mL): 0.5 和 4.1; 人鼻咽癌(抗长春花碱者, 不加长春花碱): 0.5 和 4.1; 人激素依赖前列腺癌(LNCaP): 0.2 和 0.3。

(陈笔岫摘译 江纪武校)

[David J M, et al. *J Nat Prod*, 1998; 64(2): 287]