

软珊瑚 *Sinularia flexibilis* 中具有 细胞毒活性的烟草烷二萜

作者等发现台湾产的一种软珊瑚科 *Alcyoniidae* 科的 *Sinularia flexibilis* (Quoy and Gaimard), 其 CH_2Cl_2 提取物对人的 A-549 肺癌、HT-29 结肠癌、KB 表皮癌细胞和鼠类 P388 淋巴细胞白血病都有细胞毒活性。经进一步活性跟踪分离得到 3 个新的烟草烷二萜 sinuflexolide (I)、dihydrosinuflexolide (II) 和 sinuflexibilin (III) (图 1)。

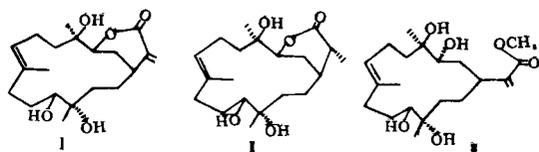


图 1 烟草烷二萜 I ~ III 的结构

I. $\text{C}_{20}\text{H}_{32}\text{O}_5$, 无色棱形物, mp 172 °C ~ 173 °C, $[\alpha]_D^{25} - 8.6^\circ$ (c, 0.17, CHCl_3); II. 为 I 的二氢化合物, $\text{C}_{20}\text{H}_{34}\text{O}_5$, 无色棱形物, mp 165 °C ~ 167 °C, $[\alpha]_D^{25} - 3.8^\circ$ (c, 0.66, MeOH); III. $\text{C}_{21}\text{H}_{36}\text{O}_6$, 为 I 的内酯环开环后形成的甲酯化合物, 无色棱形物, mp 169 °C ~ 170 °C, $[\alpha]_D^{25} - 3.9^\circ$ (c, 0.14, MeOH)。I ~ III 的细胞毒活性见表 1。

表 1 I ~ III 的细胞毒活性 (n=8)

| 化合物 | ED ₅₀ (μg/mL) | | | |
|-----|--------------------------|-------|------|------|
| | A549 | HT-29 | KB | P388 |
| I | 0.68 | 0.39 | 0.46 | 0.16 |
| II | 16.8 | 32.4 | >50 | 3.86 |
| III | 0.72 | 0.22 | 1.73 | 0.27 |

(史玉俊摘译)

[Duh C Y, et al. J Nat Prod, 1998, 61(6): 844]

马耳他海绵 *Agelas oroides* 代谢 产物的抗疟活性和细胞毒作用

海绵 *Agelas oroides* Schmidt 来自马耳他 Rduvil Bies 的 1~3 m 深水中。从中分得 5 个化合物, 经 ¹H、¹³C NMR 等分析, 分别鉴定为 oroidin (I)、2-氟基-4,5-二溴吡咯 (II)、4,5-二溴吡咯-2-羧酸 (III)、4,5-二溴吡咯-2-羧酸甲酯 (IV) 和 4α-甲基-5α-胆甾-8-烯-3β-醇 (V)。I 经单晶 X-衍射晶体结构分析确证其结构, 表明它是以极性空间基团结晶的。

I ~ V 的抗真菌、抗细菌、杀藻、抗疟活性试验结果表明, I ~ V 在 50 μg 水平, 对真菌花药黑粉菌

Ustilago violacea、接合菌 *Mycotypha microspora*、散囊菌 *Eurotium repens*、夹孢镰孢 *Fusarium oxysporum*、细菌巨大芽孢杆菌 *Bacillus megaterium*、大肠杆菌及小球藻 *Chlorella fusca* 无活性。V 对疟原虫 *Plasmodium falciparum* 的 D6 和 W2 的 IC₅₀ 分别为 5.3 和 3.3 μg/mL, 对照物氯喹为 3.8 和 133.4 ng/mL。表明海洋生物的次级代谢产物有可能成为抗疟药。细胞毒性试验结果表明 II 和 V 具中度的细胞毒作用。

(华会明摘译 冰 华校)

[Konig G M, et al. Planta Med, 1998, 64(5): 443]

黑壳楠根中 *d*-荷苞牡丹碱 的抗肿瘤作用

樟科植物黑壳楠 *Lindera megapylla* Hemsl. 是生长于台湾地区的一种常年落叶树。民间用于抗肿瘤和愈合伤口。近年来研究表明, 黑壳楠根的粗提物显示抗肿瘤活性。*d*-荷苞牡丹碱 (*d*-dicentrine) 是从中分得的一种阿朴菲型异喹啉类生物碱。作者对其进行了体内和体外实验, 证实确有抗肿瘤作用。

选用了 21 种人类肿瘤细胞。首先观察对肝癌细胞 HuH-7 的作用。运用锥虫蓝细胞排除计数法 (trypan blue exclusion cell counting method) 来计算细胞成活数, 同时记录细胞分裂时间。发现 *d*-荷苞牡丹碱从给药第 2 天到第 5 天能显著减少肝癌细胞成活数, 使细胞分裂周期延长。同时还能抑制 DNA 和 RNA 的合成, IC₅₀ 值 (μmol/L) 分别为 1.665 ± 0.1476 和 3.735 ± 0.493。

在体外实验中, *d*-荷苞牡丹碱对 21 种肿瘤细胞均表现出较强的细胞毒作用。特别是对食道癌细胞 HCE-6、淋巴瘤细胞 Molt-4、CESS、白血病细胞 K562、HL-60 和肝癌细胞 MS-G2 的作用更强。IC₅₀ 分别为 0.408、2.506、3.110、3.890、4.140 和 3.350 μmol/L。另外 5 μg/mL 的 *d*-荷苞牡丹碱还能显著抑制 HuH-7 和 MS-G2 菌落的形成。

体内实验以 K562 为例, *d*-荷苞牡丹碱可以明显抑制严重结合免疫缺乏症 (SCID) 小鼠的 K562 细胞生长。对照组中 6 只 SCID 小鼠有 5 只出现肿瘤, 给药组中则一只也没有出现。

(常海涛摘译 冰 华校)

[Huang R L, et al. Planta Med, 1998, 64(3): 212]