

苏木心材中的抗补体成分

豆科植物苏木 *Caesalpinia sappan* L. 的干燥心材曾作为消炎止痛中药应用,其提取物具有降胆固醇、镇静和抑制中枢神经等作用。作者等在筛选抗补体药物时发现该植物的甲醇提取物具有抗补体活性。其抑制补体系统的经典溶血途径 IC_{50} 为 $(101 \pm 30) \mu\text{g/mL}$,但对其它非经典途径的抑制能力则较弱,在浓度为 $250 \mu\text{g/mL}$ 时仅达 $(34.7 \pm 15.8)\%$ 。甲醇提取物在水中用己烷和乙酸乙酯分配后,己烷溶解部分的抗补体 IC_{50} 为 $(21 \pm 4) \mu\text{g/mL}$,而乙酸乙酯溶解的部分为 $(72 \pm 40) \mu\text{g/mL}$ 。己烷溶解部分含甾醇混合物,计有油菜甾醇 11.2% ,豆甾醇 18.9% 和 β -谷甾醇 69.9% ,抗补体 IC_{50} 为 $(0.7 \pm 0.02) \mu\text{g/mL}$,约为乙酸乙酯溶解部分中最强的抗补体物 protosappanin E 的 50 倍,和作者从五味子中分得的甾醇混合物相接近。乙酸乙酯溶解部分中有巴西灵 (brazilin)、巴西红 (brazilein) 和 protosappanin A、B 和 E 等,其中以最后的抗补体活性最强, IC_{50} 为 $(88 \pm 6) \mu\text{mol/L}$ 。尽管文献报道巴西红有消炎、抑制晶体内醛糖还原酶和降糖等作用,protosappanin A 和 B 有轻微的镇静作用,但关于它们的抗补体作用,此文乃为首次报道。

(史玉俊摘译)

[Sei Ryatg O h, *et al.* Planta Med, 1998, 64(5): 456]

欧前胡的消炎退热作用

欧前胡 *Peucedanum ostruthium* Koch 为多年生草本植物,主要分布于欧洲中部,民间用其根治疗风湿、发热等多种疾病。欧前胡根经 10% 乙醇渗漉、浓缩、冻干制成粗提物。粗提物经活性导向分离得到主要消炎活性成分 6-(3-羧丁-2-烯基)-7-羟基香豆素。作者研究粗提物和活性成分的消炎活性作用。

粗提物在角叉菜诱导的大鼠足趾肿胀实验中显示明显的剂量依赖性肿胀抑制作用。提取物给药剂量为 10 、 60 、 120 mg/kg , 4 h 后肿胀抑制率分别为 18.0% 、 48.5% 及 57.0% 。消炎活性成分剂量为 30 及 $300 \mu\text{g/kg}$, 肿胀抑制率高达 50.0% 及 61.8% , 而对照物 1 mg/kg 吲哚美沙辛的抑制率为 41.2% 。

兔耳灌注标记前列腺素前体 ^{14}C -花生四烯酸,采用文献所示方法以 TLC 分离后再用液闪法定量测定粗提物及其消炎活性成分对前列腺素 PGL_2 、 PGE_2 、 PGD_2 释放的影响。两者剂量分别为 1.7 及 1.3 mg/mL 时对前列腺素的生物合成具有强烈抑

制作用。

粗提物及其消炎活性成分皆对 5-脂氧酶 (5-LOX) 有抑制作用, IC_{50} 分别为 66 、 $0.25 \mu\text{mol/L}$ 。它们为环氧酶及 5-LOX 的双重抑制剂。不同剂量粗提物 (60 、 300 、 600 mg/kg) 及其消炎活性成分 (50 、 200 、 400 mg/kg) 对体内注入酵母诱发的大鼠体温持续高温状态均起抑制作用。粗提物及其消炎活性成分对此高温状态的最大抑制作用出现在给药后的不同时间,抑制作用均能维持 $6 \sim 7 \text{ h}$ 。粗提物的降体温作用弱于对照物乙酰水杨酸及吲哚美沙辛,而活性成分的作用强于上述对照物。

上述实验结果证实了该植物制剂消炎退热作用的人类医学资料。

(张敏摘译 陆阳校)

[Hiermann A, *et al.* Planta Med, 1998, 64(5): 400]

桦木酸抑制氨肽酶活性

桦木酸 (betulinic acid) 是一种五环三萜类化合物,分布于桦木属植物及其它许多属植物中。以植有人类黑色素瘤的无胸腺小鼠作实验对象,发现桦木酸能抑制肿瘤生长,而本身完全没有毒性,它是通过导致细胞的自然死亡而达到抑制作用的。实验证明,桦木酸是氨肽酶 N (APN) 的抑制剂, IC_{50} 为 $(7.3 \pm 1.4) \mu\text{mol/L}$ 。APN 与细胞外基质的组成有关,抑制了 APN, 就能防止黑色素瘤侵袭基膜。已有报道,许多氨肽酶抑制剂如 bestatin、actinonin、leuhistin、matlystatin 等都能抑制肿瘤细胞的侵袭,从而证明了这种假设。

实验结果表明,桦木酸通过激活金属蛋白酶的活性而导致细胞的自然凋亡,它标志着这一过程的结束,而 APN 的抑制是细胞凋亡的起始步骤。

桦木酸还具有另一种生物活性即抗艾滋病活性。据报道,桦木酸通过抑制病毒-细胞结合过程而防止病毒侵入细胞内。现在尚不清楚在这一过程中是否有 APN 的参与。

总之,桦木酸可以用作一种很有潜力的免疫调节剂和抗癌剂。与常用的一种二肽类 APN 抑制剂 bestatin [IC_{50} 为 $(16.9 \pm 4.1) \mu\text{mol/L}$] 相比,桦木酸具有更好的吸收性和生物利用度。桦木酸能够抑制 APN 可以作为各种不同配基的受体并且参与信息转录过程。

(常海涛摘译 冰华校)

[Matthias F M, *et al.* Planta Med, 1998, 64(7): 655]