

云南山竹子中的抗疟咕吨酮

藤黄科的云南山竹子 *Garcinia cowa* Roxb 盛产于泰国,其树皮为传统的退热药。作者等在从天然产物中寻找抗疟药的工作中,曾发现其树皮的乙醇提取物在试管试验中能抑制恶性疟原虫 *Plasmodium falciparum* 的生长。进一步从中分到 1 个新的咕吨酮: 7-O-甲基-garcinone E (I) 和 4 个已知咕吨酮: cowanin (II)、cowanol (III)、cowaxanthone (IV) 和 β 糠子素 (β -man gostin (V)), 见图 1。

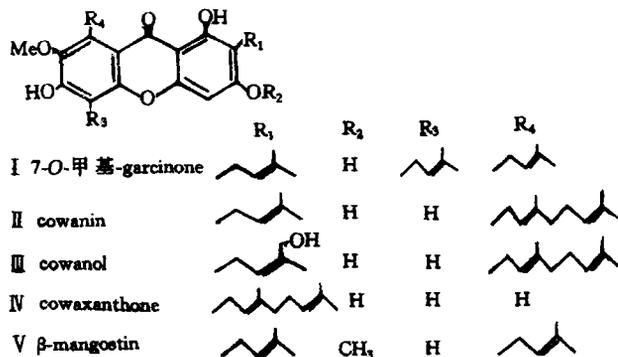


图 1 云南山竹子中的咕吨酮化合物的结构
I 的结构曾在文献(Likhitwitayawuid K. Phytochemistry, 1997, 45:1299)中作了报道。其它 4 个已知咕吨酮前仅给出了部分的 ¹HNMR 数据。本文补充了全部的 ¹HNMR 和 ¹³CNMR 数据。

化合物 I ~ V 都有一定的抗疟活性,其 IC₅₀ 约在 1.50 ~ 3.00 μ g/mL 之间,和乙胺嘧啶的 IC₅₀ (2.80 μ g/mL) 很接近,但较氯喹的 IC₅₀ (0.03 μ g/mL) 则弱得多。

(史玉俊摘译)

[Likhitwitayawuid K, et al. Planta Med, 1998, 64:70]

茄中的翠雀素对人纤维肉瘤 HT-1080 侵袭的体外抑制作用

蔬菜对人类的健康是有益的,其中的一些微量

成分尚具有抗癌作用。癌细胞可以转移是癌症致命性的重要原因之一,它首先侵袭邻近的器官,并通过血管的渗透对其它的器官造成危害。作者认为,某些蔬菜能预防癌症是因为它能抑制癌细胞转移。在研究高度转移性的人纤维肉瘤细胞 HT-1080 的侵袭试验中,发现茄 *Solanum melongena* L. var. *marunasu* Hara. 的水提取物具有较强的抑制作用。

将茄果肉和皮分别切成小片,加入蒸馏水,搅成匀浆,过滤,滤液冷冻干燥。得到的粉末供试验用,发现茄的水提取物能抑制 HT-1080 对再组基膜 (re constituted basement membrane) MG 的侵袭,但并不影响正常细胞的生长,也不会影响肿瘤细胞向 MG 转移并粘附在其上。而且,茄皮的活性比其果肉的强,表明主要的有效成分是在皮中。对皮的提取物进行反相高效液相色谱层析,得到 A ~ D 4 个流分,只有 D 流分可以抑制 HT-1080 的侵袭。经过鉴定,D 为翠雀素 (delphinidin),是一种黄烷类化合物,化学名为 3,5,7-三羟基-2(3,4,5-三羟基苯基)-1,4 苯并吡喃的氯鎓盐 (图 1)。

实验表明,翠雀素能抑制 HT-1080 对 MG 的侵袭,呈剂量依赖性关系,不影响正常细胞的生长。翠雀素在茄皮提取物中的含量只有 0.10%,但比较 10 μ g 皮提取物和 10 ng 翠雀素的抑制百分率,分别为 56% 和 51%,这表明翠雀素确是抑制活性的主要物质。

HT-1080 分泌产生的基质金属蛋白酶 (MMPs) 能降解 FITC 标识的 IV 型胶原。翠雀素则能抑制 MMPs 的溶胶原作用。它在剂量

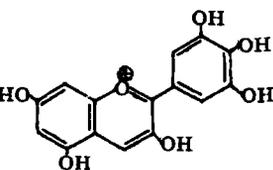


图 1 翠雀素的结构

为 10 ~ 100 μ g/mL 的抑制作用能达到 20% ~ 30%。所以,作者认为翠雀素的抑制 HT-1080 侵袭的活性可能与它能防止胶原溶解的作用有关。

(常海涛摘译 史玉俊校)

[Nagase H, et al. Planta Med, 1998, 64(3):216]

7 钟 扬,等. 数量分类的方法和程序. 武汉:武汉大学出版社,1990:1
8 徐克学. 数量分类学. 北京:科学出版社,1994:1
9 Whittaker R H. 植物群落排序(王伯恭译). 北京:科学出版社,1986:1

10 夏 泉,等. In: 裴盛基,等主编. 应用民族植物学. 昆明:云南民族出版社,1998:101

(1998-11-30 收稿)