

大锥香茶菜中新的细胞毒二萜

大锥香茶菜 *Isodon megathyrsus* 采自云南省福贡县。以前曾从该植物中分离出 4 种有细胞毒作用的对映-贝壳杉烯(ent-kaurene)型二萜, 现又从中分离出一种新的细胞毒二萜, 命名为 megathyrin B。现报道它的分离、结构及细胞毒性。

干燥叶(230 g)磨碎, 用甲醇(0.5 L×3)回流提取, 真空浓缩。残余物(3 g)行硅胶(700 g)柱色谱, 先用石油醚(4 L), 后用甲醇氯仿液(10%, 5 L; 20%, 4 L), 最后用甲醇(2.5 L)分别洗脱, 氯仿-甲醇(8:2)部位用氯仿-丙酮(8:2, 2 L)上硅胶(200 g)柱进一步分离, 获得一种由化合物 I (megathyrin B) 和化合物 II (megathyrin A) 组成的复合晶, 命名为 DCIM(28 mg)。将 DCIM(22 mg) 溶解在沸甲醇中, 放置冷却过夜, 使之结晶, 获得化合物 I 针晶(3.5 mg), 即 megathyrin B, 随后作 X-线结晶分析。I 的分子式为 $C_{20}H_{30}O_5$, mp 224 C~226 C。经 1D 和 2D-NMR 及 X-射线作立体化学分析, 其结构为 1 α , 7 β , 11 β , 15 β -四羟基-ent-7 α , 20-环氧-贝壳杉-16-烯(图 1)。

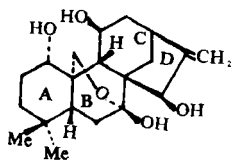


图 1 megathyrin B 的结构

实验结果表明, megathyrin B 在 KB 和 KB-V(± VLB) 细胞株中显示潜在细胞毒作用, ED₅₀ 分别为 0.9, 1.6 和 1.3 μ g/mL。到目前为止, 从大锥香茶菜分得的 5 种二萜(包括 megathyrin B)均具有细胞毒性。

(沈东杰摘译 陈泽乃校)

[Qiu S X, et al. *Planta Med*, 1998, 64:728]

测定植物提取物对细菌 MIC 的一种敏感快速的微量反应板法

琼脂扩散技术虽被广泛用来测定植物提取物的抗菌活性, 但仍存在不少问题, 包括琼脂的种类、盐浓度、孵育温度, 以及抗菌组分的分子大小都会影响所得到的结果。一种用 96-孔微量反应板和四唑(tetrazolium)盐来指示细菌生长的微量稀释法得到了应用。此法快速且效果好, 使用金葡萄球菌、粪肠道球菌等以及来自许多不同品种植物的非水溶性提取物, 这种技术均能给出重复结果, 只需 10~25 μ L 提取物即可测定最小抑制浓度, 区分杀菌和抑菌效果, 并提供一个永久性的结果记录。使用金葡萄球菌和一种风车子属植物毛风车子 *Combretum molle* 提取物进行测试, 这一技术比琼脂扩散技术敏感 32 倍, 且对培养期达 24 h 的受测菌体并不敏感。金葡萄球菌培养物可在冷库内储存至 10 d 而对测试结果几乎没有影响。这种方法对筛选具抗菌活性的植物很有用, 并可用作生物导向以分离植物中的抗菌化合物。用此法对磺胺异唑, 诺氟沙星, 庆大霉素及呋喃妥因等所测得最小抑菌浓度(MIC)值与文献报道值相似, 但用甲氧苄啶和氨苄西林对某些细菌所得到的值则较高。

实验表明, 常用以显示细菌生物活性的四唑盐类中, 经上述几种菌和 30 种以上不同植物测试所得结果, 发现 *p*-iodonitrotetrazolium (INT) 所生成的甲臍(formaza)衍生物最稳定, INT 最低有效浓度为 0.2 mg/mL, 而其他四唑盐如 tetrazolium red (TTC) 和 thiazolyl blue (MTT) 的甲臍衍生物在溶液干后均会褪色。

(陈晓鸣摘译 陈泽乃校)

[Eloff J N. *Planta Med*, 1998, 64:711]

6 钟国跃. 中药材, 1998, 21(3):155
 7 胡世林. 中国地道药材论丛. 北京:中国古籍出版社, 1997:7
 8 马雪梅, 等. 中草药, 1999, 30(增刊):180
 9 马雪梅, 等. 中草药, 1990, 21(9):19
 10 周荣汉. 国外医药-植物药分册, 1998, 13(6):254
 11 段金殿, 等. 中草药, 1999, 30(增刊):17

12 程惠珍, 等. 中国医药情报, 1996, 2(4):225
 13 肖培根. 中国药学杂志, 1997, 32(11):671
 14 刘铁成. 中国药学杂志, 1993, 28(10):579
 15 程惠珍, 等. 中国医药情报, 1998, 4(2):109
 16 刘振武, 等. 天津药学, 1999, 11(3):32

(1999-08-09 收稿)