

· 信息与文摘 ·

龙葵中的甾族糖苷

在微生物的生长过程中,若受到某些生物活性物质的影响,其菌丝体或分生孢子就会产生形态学上的变异,如卷曲-膨胀-分散过度-形成串珠状或菌丝体生长受阻。Kobayashi 等曾利用这种现象开发了一种新的方法,用以筛选抗真菌和抗肿瘤的物质。用一种致植物病的真菌 *Pyricularia oryzae* P-26 观察供筛选物对此菌菌丝体生长的影响,以判断其有无活性。此法简单易行,在真菌代谢产物的初筛中成功地筛出了诸如 rhizoxin 和 fusareilin A 等化合物。

作者等前曾报道首次采用该法筛选传统中草药中的抗真菌和抗癌物质。迄今为止已用此法筛选了 250 种用于治疗肿瘤的草药。曾从薯蓣科的粉背薯蓣中分得 11 种抗肿瘤活性物质。在继续筛选研究中,又观察到茄科植物龙葵 *Solanum nigrum* 的乙醇提取物中含有颇有希望的抗肿瘤物质。本文报道,按活性跟踪分离,分得 3 个甾族糖苷: β -solamargine(I)、solamargine(II) 和 degalactotigonin(III)。

干燥全草用 75% 乙醇回流提取 3 次。合并蒸除溶媒后,用石油醚除去油脂。提取物溶于水后,经柱层分离,分别用水和 60% 乙醇洗脱。将有活性的部分浓缩成浆状,加水分配后,用正丁醇提取,提取液在硅胶柱上层析,用不同比例的氯仿-甲醇-水洗脱,得 3 个活性部分:

氯仿-甲醇-水(80:20:3.5)部分所得的为一白色粉状物, mp 234 °C~237 °C, $[\alpha]_{\text{D}}^{24} = 84$; 水解得茄解定(solasodine)-葡萄糖和鼠李糖, FAB 质谱表明其确含 2 个糖。其它光谱和 $^1\text{H-NMR}$ 、 $^{13}\text{C-NMR}$ 、HMBC 数据和已知标准物相比,说明其为 β -茄边碱(I)。

氯仿-甲醇-水(70:30:2)部分得化合物 II, 白色粉状物, mp > 300 °C, $[\alpha]_{\text{D}}^{24} = 102$; 光谱和化学鉴定为 solamargine(II), 较 I 多一个鼠李糖。

氯仿-甲醇-水(70:30:4)部分得化合物 III, 白色粉状物, mp 293 °C~296 °C, $[\alpha]_{\text{D}}^{24} = 52$; 经同样鉴定,确定为去半乳糖替告皂苷。

以上 3 个化合物的致 *P. oryzae* 形态变异的最低浓度(MMDC)相应为 63.0, 38.5 和 97.2 $\mu\text{mol/L}$, 和阳性对照灰黄霉素(50 $\mu\text{mol/L}$) 或 fusareilin A(15 $\mu\text{mol/L}$) 相比,只有 II 与之不相上下。对 6 种肿瘤细胞系的细胞毒试验,以鬼白

乙叉苷(VP-16) 为阳性对照,也以化合物 II 为三者中活性强者。而对 PC-3 前列腺癌细胞的 IC₅₀ 尤较 VP-16 为低。

作者等将结果和前在研究粉背薯蓣中的几个皂苷的 *P. oryzae* MMDC 和对 K562 白血病细胞的细胞毒作用相比较,尚难说明这些化合物之间的构效关系,提出 *P. oryzae* 形态变异筛选方法用于寻找抗肿瘤药物时,其预见性尚不很高。

(史玉俊 摘译)

[Hu Ke, et al. Planta Med, 1999, 65(1): 35]

射干中具有毒鱼活性的鸢尾醛型三萜类化合物

射干 *Belamcanda chinensis* (L.) DC 作为传统中药,用于治疗喉部疾病如咳嗽、咽炎等。从其中曾分离得到鸢尾醛(iridal) 及许多异黄酮类化合物,但尚未发现具有毒鱼活性成分。作者对射干的正己烷和甲醇提取物进行了研究,分离得到 11 个鸢尾醛型三萜化合物,其中 6 个为新化合物,其结构通过二维核磁共振和化学沟通方法得到确证。

新鲜植物根茎先用正己烷渗漉提取,得到提取物 2.5 g。原生药接着用甲醇提取,提取物浓缩后分别用乙醚和正丁醇萃取。正己烷和乙醚提取物显示毒鱼活性,其中等忍受限度(TLm) 值分别为 4.6 和 4.2 mg/L。将正己烷提取物通过硅胶柱层析、ODS 柱层析,分离得到 6 个新化合物: 3-O-tetradecanoyl-16-O-acetylisoridogermanal-(IV)、3-O-decanoyl-16-O-acetylisoridogermanal (V)、belachinal (VII)、anhydrobelachinal (IX)、epianhydrobelachinal (X) 和 isoanhydrobelachinal(XI)。

上述 11 个化合物中,III、VII和XII对青鱼(killie) 具有很强的毒性,给药 24 h 后 TLm 为 1.6~3.5 $\mu\text{g/mL}$ 。大多数单环鸢尾醛类化合物没有毒鱼活性,但化合物III却显示活性,而且其乙酰化物活性更强。但是,如果 3 位羟基酯化后活性降低。所以,作者推断该类化合物的毒鱼活性似乎与 3 位的游离羟基的存在有关。这些化合物的 TLm 值与另一活性化合物 buddledin B 相当,而且发现它们对 P₃₈₈ 淋巴细胞具有细胞毒作用。

(常海涛 摘译 史玉俊 校)

[Hideyuki I, et al. J Nat Prod, 1999, 62(1): 89]

《中草药》杂志 2000 年改版启事

为了增加刊物的信息量,进一步与国际接轨,本刊从 2000 年第 1 期开始改为大 16 开本。另外,根据《中草药》杂志第六届编委会编委的建议,为了吸引更多的学术水平高的稿件,从 2000 年第 1 期开始,下列文章将优先发表: 1) 国家自然科学基金项目,国家、省、部级攻关项目,开放实验室研究项目等的优秀论文; 2) 有重要指导性意义或发表后具有广泛引用价值的文章; 3) 有重大发现,发表后准备报奖的文章; 4) 两院院士及博士生导师的文章。以上几类论文,来稿时请附证明材料复印件。