

· 信息与文摘 ·

帕劳群岛产海绵 *Lendenfeldia chondrodes* 中的环二氧甾醇新化合物

对帕劳群岛产海绵 *Lendenfeldia chondrodes* 进行了研究。海绵样品 1.2 kg 用丙酮提取。提取液减压浓缩后溶于水,用乙酸乙酯萃取。萃取物先用硅胶柱层析, $\text{CHCl}_3\text{-MeOH}$ 梯度洗脱。根据活性跟踪,将有活性的流分再经过 ODS 柱层析, $\text{H}_2\text{O-MeOH}$ 梯度洗脱,最后得到 1 个不易分离的差向异构新环二氧甾醇化合物 I_a 和 I_b 混合物。另外还得到 2 个已知的环二氧甾醇化合物和 3 个二倍半萜成分。对这 6 个化合物进行抗贝壳粘附作用的实验。

将 6 个化合物分别配成 1, 10, 100 $\mu\text{g/L}$ 的 3 个不同浓度试液,然后分别滴在兰貽贝 *Mytilus edulis galloprovincialis* 的软足上,观察兰貽贝的反应。如果其化合物有活性,那么兰貽贝会很快就把软足缩回。计算有反应的兰貽贝的个数。实验结果表明,二倍半萜成分的活性远比环二氧甾醇化合物强,在 3 个环二氧甾醇中,只有 I_a 才显示活性。

(常海涛摘译 史王俊校)

[Yutaka S, *et al.* J Nat Prod, 1999, 62(1): 152]

红豆杉种子中的新紫杉烷类化合物

自从紫杉醇在临床上用于治疗乳腺癌和卵巢癌后,人们一直在寻找这种药物的新来源,并对其进行结构修饰,研究其构效关系。研究发现,许多紫杉烷类化合物可作为半合成

紫杉醇或其同系物的原料。作者对红豆杉 *Taxus chinensis* (Plg) Rehd. 的种子进行了研究,从中分离得到 2 种新紫杉烷类物和 11 种已知的紫杉烷类物。

红豆杉种子的乙醇提取物分别用正己烷和 25% 水-甲醇萃取。萃取物经 Sephadex LH-20 柱层析、硅胶柱层析及反相柱层析分离得到 13 个化合物,其中 2 个新紫杉烷为: I: 2 α -乙酰氧基-2',7-双去乙酰氧基-austrospicatin,白色粉末, $[\alpha]_D^{25}$ 33.7°,其 $^1\text{H NMR}$ 、 $^{13}\text{C NMR}$ 数据与化合物 III (taxuspine Z) 相似,只比 III 多一个乙酰基。运用 Cosy 谱可判定乙酰基连接在 C-2 上。III 乙酰化后生成的化合物与 I 相同,进一步证实了 I 的结构和立体构型(图 1)。

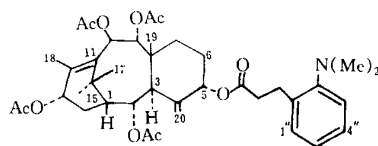


图 1 化合物 I 的结构

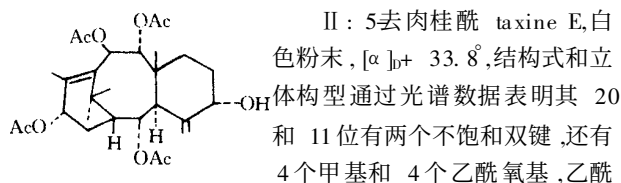


图 2 化合物 II 的结构 II: 5-去肉桂酰 taxine E, 白色粉末, $[\alpha]_D^{25}$ 33.8°, 结构式和立体构型通过光谱数据表明其 20 和 11 位有两个不饱和双键, 还有 4 个甲基和 4 个乙酰氧基, 乙酰化后形成 2 α , 5 α , 9 α , 10 β , 13 α -五乙酰氧基-4(20), 11-紫杉二烯(图 2)。

(常海涛摘译 史王俊校)

[Yin J C, *et al.* J Nat Prod, 1999, 62(1): 149]

名、功能主治,才能保证临床上用药安全有效

2 出库配料

出库配料也是影响制剂质量的重要因素,在出库配料时必须要有两人以上核对。一是核对数量是否准确无误;二是核对防止出错药;三是核对药材的真伪,有无土杂、霉变、虫蛀等。这些环节如不认真就会影响制剂质量。

3 前处理和细配料工序

医院制剂大都用的是饮片,一般不需洗晒、切制及处理,但有的药材肉质强、粘性大、含糖较多,需干燥后才便于粉碎。在干燥时,如采取烘干法需注意温度。如枸杞子、大枣、元肉、熟地等;有的药材含有 Vit C 小分子量的生物碱及易挥发性成分,或含有遇高温易破坏、分解转化的成分,故一般控温在 100℃ 以下,含易挥发性成分控温低于 60℃,或采取真空干燥。在配细料药时,要采取打底套色和等量递增

法混合均匀,如忽视也会影响疗效或引起中毒。

4 制剂工艺

要根据原料药材的性质、所含的有效成分来确定工艺流程,否则,如都采用煮提的方法制备也势必影响质量和药效。

5 库房仓贮条件

仓贮条件差也会影响制剂质量。如库房的通风、温湿度、避光等条件都直接关系药品质量。药品贮存最佳温度 5℃~10℃,相对湿度 65%~70%,否则药品易生虫霉变,颗粒剂易结块等;避光不好,易使含 Vit C 等成分氧化、分解致含量降低,故加强仓贮方面的建设对保证质量也很重要。

中药制剂是中医临床多年经验的结晶,是开发新药的基础,故对中药制剂质量要引起高度重视,消除影响制剂质量的不良因素。

(1999-01-07 收稿)