

- Physiol*, 2002, 128(4): 1346-1358.
- [16] Gao A G, Hakimi S M, Mittanck C A, *et al.* Fungal pathogen protection in potato by expression of a plant defensin peptide [J]. *Nat Biotechnol*, 2000, 18(12): 1307-1310.
- [17] Zhang X H, Guo D J, Zhang L M, *et al.* The research on the expression of rabbit defensin(NP-1) gene in transgenic tomato [J]. *Acta Genet Sin* (遗传学报), 2000, 27(11): 953-958.
- [18] Fu R Z, Peng Y F, Cao G C, *et al.* Expression of rabbit defensin NP-1 gene in transgenic tobacco plants and its activity against bacterial wilt [J]. *Chin Sci Bull* (科学通报), 1998, 43(18): 1544-1550.
- [19] Zhang X H, Guo D J, Li W B, *et al.* Construction of transgenic tomato containing NP-1 gene through agrobacterium-mediated activity against *Fusarium oxysprum* [J]. *High Technol Lett*, 2000, 6(3): 76-79.
- [20] Hristova K, Selsted M E, White S H. Critical role of lipid composition in membrane permeabilization by rabbit neutrophil defensins [J]. *J Bio Chem*, 1997, 272(39): 24224-24233.
- [21] Cary J W, Ajasekaran K, Jaynes J M, *et al.* Transgenic expression of a gene encoding a synthetic antimicrobial peptide results in inhibition of fungal growth *in vitro* and in planta [J]. *Plant Sci*, 2000, 154: 171-181.
- [22] Osusky M, Zhou G, Osuka L, *et al.* Transgenic plants expressing cationic peptide chimeras exhibit broad-spectrum resistance to phytopathogens [J]. *Nat Biotechnol*, 2000, 18: 1162-1166.
- [23] Zhang J, Sun X, Zheng X. Construction of cecropin B and D double gene expression vector and transformation of patchouli (*Pogostemon cablin* Benth.) [J]. *Chin J Tropical Crops* (热带作物学报), 1997, 18(1): 50-57.
- [24] Hancock R E W, Lehrer R. Cationic peptides: a new source of antibiotics [J]. *Trends Biotechnol*, 1998, 16: 82-88.

槐属植物生物碱化学成分及药理作用研究进展

洪 阁, 刘培勋

(中国医学科学院 中国协和医科大学放射医学研究所, 天津 300192)

摘 要:从槐属植物中分离出的生物碱主要为喹诺里西啶类,少数为双哌啶类和其他类。槐属植物所含生物碱具有广泛的生理活性,如抗癌、抗微生物、抗心律失常、抗溃疡、抗辐射、抑制中枢神经系统和免疫功能等。现对近年来槐属植物生物碱的化学成分及药理作用的研究概况进行综述。

关键词:槐属;生物碱;化学成分;药理作用

中图分类号:R282.71

文献标识码:A

文章编号:0253-2670(2005)05-0783-06

Advances in studies on alkaloid constituents and their pharmacological effect in plants of *Sophora* Linn.

HONG Ge, LIU Pei-xun

(Institute of Radiation Medicine, Chinese Academy of Medical Sciences and Peking Union Medical College, Tianjin 300192, China)

Key words: *Sophora* Linn.; alkaloids; chemical constituent; pharmacological effect

槐属(*Sophora* Linn.)最早出现于1737年Linnaeus的《植物志属》一书,属于豆科蝶形花亚科,多为乔木、灌木和稀草本,目前已由当初记载的6种发展为90多种。槐属植物主要分布于温带和亚热带地区,我国南北各地约30多种。从多种槐属植物的花、叶、籽、根中可以提取到具有药用价值的生物碱、黄酮、酚、苷、萜以及少量的有机酸、甾体、糖、氨基酸等,而其中的生物碱具有抗癌、抗微生物、抗心律失常、抗溃疡、抗辐射、抑制中枢神经系统和免疫功能等多方面生理活性,因此对其生物碱化学成分及药理作用的研究引起了药学界的高度重视。本文依据近几年发表在国内外学术期刊上的文献资料,对槐属植物生物碱化学成分及药理活性进行综述。

1 槐属植物中生物碱成分

槐属植物普遍含有生物碱,总生物碱的质量分数一般在1%~2.5%,苦豆子中总生物碱的质量分数高达6.11%~8.03%,种子中约为8.11%^[1]。槐属植物所含生物碱主要为喹诺里西啶类,极少数为双哌啶类和其他类。

1.1 喹诺里西啶类(quinuolizidine):槐属植物生物碱大都具有2个稠环哌啶共用一个氮原子的基本结构,属于喹诺里西啶类生物碱。槐属是喹诺里西啶类生物碱研究最多的属,不完全统计生物碱种类多达70种。

喹诺里西啶类生物碱按结构可分为6类:苦参碱型、金雀花碱型、鹰爪豆碱型、羽扇豆碱型、苏苦西碱型、苦豆碱型(表1~6,图1~6)。

1.2 双哌啶类(dipiperidines):见表7及图7。

1.3 其他类型:见表8及图8。

收稿日期:2004-09-02

作者简介:洪 阁(1980—),男,河北省石家庄市人,中国医学科学院中国协和医科大学放射医学研究所2002级硕士研究生,研究方向为天然产物化学。Tel:(022)85683042 E-mail:hongge6688@yahoo.com.cn

表 1 苦参碱型生物碱
Table 1 Matrine type alkaloids

名 称	植物来源	取代基的位置						参考文献
		母核	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	
9α-羟基苦参碱	苦参、大果槐、白刺花	I	OH	H	H			2~4
13α-羟基苦参碱	白刺花	I	H	OH	H			4
14β-羟基苦参碱	苦豆子、越南槐、白刺花	I	H	H	OH			3,5,6
苦参碱	苦豆子、砂生槐、苦参、越南槐、白刺花、细叶槐	I	H	H	H			2,3,5~8
氧化苦参碱	苦豆子、黄叶槐、苦参、大果槐、越南槐、白刺花	I	H	H	H	O		2~4,6,9
3α-羟基槐定碱	苦豆子	I	OH	H	H	H		1
5α,9α-二羟基苦参碱	苦参	I	H	OH	OH	H		2
14β-羟基槐定碱	白刺花	I	H	H	H	OH		3
氧化槐定碱	苦豆子、越南槐	I	H	H	H	H	O	6,9
槐醇	苦参、大果槐、槐、越南槐	I	H	OH	H	H		2,4,6
氧化槐醇	苦参、越南槐	I	H	OH	H	H	O	2,6
槐定碱	苦豆子、苦参、越南槐、白刺花、砂生槐、 <i>S. prodanii</i> *	I	H	H	H	H		2~7
9α-羟基槐果碱	苦参、白刺花	II	OH	H				2,3
9α-羟基氧化槐果碱	苦参	II	OH	H	O			2
12β-羟基槐果碱	苦豆子、白刺花	II	H	OH				3,5
氧化槐果碱	苦豆子、苦参、绒毛槐、越南槐、白刺花、 <i>S. lupinoides</i> *	II	H	H	O			1~4,6
槐果碱	苦豆子、苦参、越南槐、白刺花、 <i>S. lupinoides</i> *, <i>S. prodanii</i> *	II	H	H				2~6
9α-羟基槐胺碱	苦参	IV	OH					2
槐胺碱	苦豆子、苦参、越南槐、白刺花	IV	H					2,3,5,6
13,14-去氧槐醇	越南槐	V	OH					6
异槐果碱	苦豆子、苦参	V	H					1,2
5,17-去氢氧化苦参碱	越南槐	VI						6
7α-羟基槐胺碱	苦豆子	VII						5
△ ⁷ -去氢槐胺碱	苦参	VIII						2
7,11-去氢苦参碱	苦参、越南槐	IX						2,6
表苦参碱	苦参、越南槐	X						2,6
异苦参碱	苦参	XI						2
拉马宁碱	苦豆子、苦参、越南槐	X II						4,6,9
新槐胺碱	苦豆子	X III						1

* 不是原产于我国的槐属植物,下表同
* Not original plants of *Sophora* Linn. from China, following tables are same

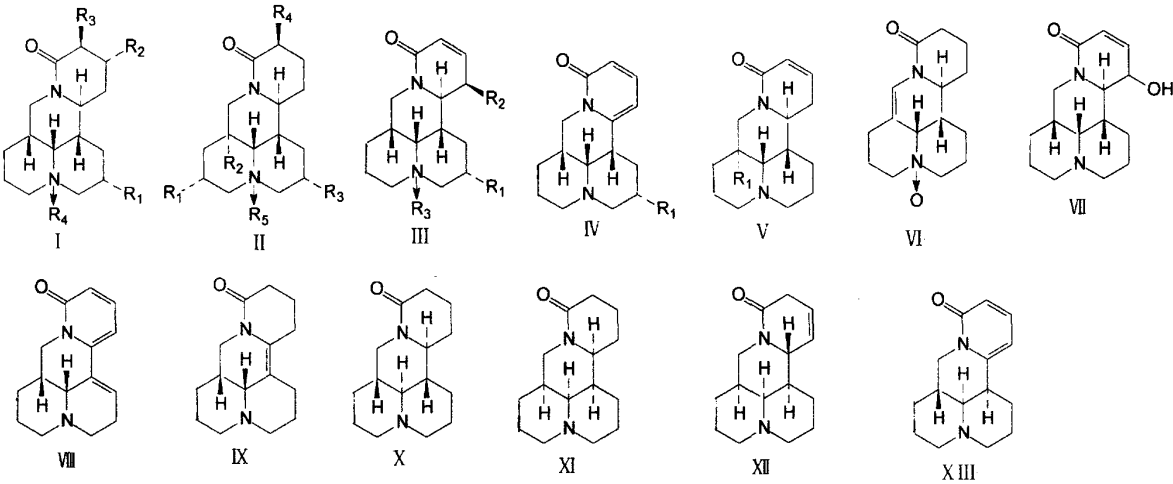


图 1 苦参碱型生物碱的母核
Fig. 1 Skeleton of matrine type alkaloids

2 槐属植物生物碱的药理作用

槐属植物生物碱具有多方面的药理作用,引起了人们的广泛关注。近年来有关其抗肿瘤作用,对心血管系统、中枢神

经系统的作用,对免疫系统的影响,抑菌抗炎作用、抗辐射作用等方面的研究报道日益增多,现对其综述如下。

2.1 抗肿瘤作用

表 2 金雀花碱型生物碱
Table 2 Cytisine type alkaloids

名 称	植物来源	母核	取代基的位置		参考文献
			R ₁	R ₂	
11-烯丙基金雀花碱	黄叶槐、细叶槐、偏花槐*	I	CH ₂ CH=CH ₂	H	8,10
12-羟基金雀花碱	稀见槐*	I	H	OH	4
金雀花碱	苦豆子、黄叶槐、苦参、细叶槐、越南槐、白刺花	I	H	H	1,3,6,8,10,11
N-(2-羟乙基)金雀花碱	苦豆子	I	H	CH ₂ CH ₂ OH	1
N-乙酰基金雀花碱	偏花槐*、绒毛槐、越南槐、稀见槐*	I	H	COCH ₃	4,6
N-乙基金雀花碱	闽槐、大果槐	I	H	CH ₂ CH ₃	4
N-醛基金雀花碱	黄叶槐、翅果槐、偏花槐*、越南槐、稀见槐*	I	H	CHO	4,6,10
N-甲基金雀花碱	苦豆子、黄叶槐、苦参、细叶槐、越南槐、稀见槐*	I	H	CH ₃	1,2,6,8,10
隆皮福林	黄叶槐、苦参、闽槐、翅果槐	I	H	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	2,4,10
sophoraside A	硬脊槐*	II	OH	H	4
sophoraside B	硬脊槐*	II	H	OH	4
11-氧代金雀花碱	偏花槐*	II			4

表 3 鹰爪豆碱型生物碱
Table 3 Sparteine type alkaloids

名 称	植物来源	母核	取代基的位置			参考文献
			R ₁	R ₂	R ₃	
13-羟基鹰爪豆碱	偏花槐*	I	OH			4
17-氧代白金雀花碱	黄叶槐	I	H	O	O	4
白金雀花碱	黄叶槐、苦参、翅果槐、白刺花、稀见槐*、细叶槐	I	H	O		2~4,8,10
鹰爪豆碱	黄叶槐、翅果槐、硬脊槐*、细叶槐、S. lup*	I	H			4,8,10
安那吉碱	苦豆子、黄叶槐、苦参、越南槐、稀见槐*、细叶槐	II	H			2,10,4~6
巴普叶碱	苦豆子、黄叶槐、苦参、四翅槐*、越南槐、稀见槐*	II	OH			2,10,4~6
5,6-去氢白金雀花碱	黄叶槐、翅果槐、偏花槐*、白刺花、稀见槐*、细叶槐	III				3,4,8,10
11,12-去氢鹰爪豆碱	黄叶槐、细叶槐	IV				8,10
sophazrine	硬脊槐*	V				4

表 4 羽扇豆碱型生物碱

Table 4 Lupinine type alkaloids

名 称	植物来源	母核	R ₁	参考文献
9 β-hydroxylam-prolobine	短绒槐	I	OH	4
lamprolobine	黄叶槐、短绒槐	I	H	4
epilamprolobine	黄叶槐、绒毛槐	I		4
epilamprolobin-N-oxide	黄叶槐、绒毛槐	II	O	4
马门碱	黄叶槐、苦参	III		2,4
氧化马门碱	黄叶槐	III	O	4
5-(3'-甲氧羰基丁酰基)-氨基甲基-反唑诺里西啶	绒毛槐	IV		4
pohakuline	黄叶槐	V		4

表 5 苏苦西碱型生物碱

Table 5 Tsukushinamine type alkaloids

名 称	植物来源	母核	取代基的位置		参考文献
			R ₁	R ₂	
苏苦西碱 A	闽槐	I	CH ₂ CH=CH ₂	H	4
苏苦西碱 B	闽槐	I	H	CH ₂ CH=CH ₂	4
苏苦西碱 C	闽槐	I			4

表 6 苦豆碱型生物碱

Table 6 Aloperine type alkaloids

名 称	植物来源	母核	R ₁	参考文献
烯丙基苦豆碱	苦豆子	I	CH ₂ CH=CH ₂	1
苦豆碱	苦豆子	I	H	1
N-甲基苦豆碱	苦豆子	I	CH ₃	1
11-去氢苦豆碱	苦豆子	II		4

2.1.1 阻止细胞周期进程:苦参碱(0.8 g/L)可以抑制 T 细胞白血病细胞株 JM 的 DNA 合成,造成 G₁ 期阻滞,从而抑制细胞的增殖,同时还可诱导 JM 细胞株的凋亡^[13]。苦参碱(30 mg/L)体外处理人肝癌细胞 SMMC—7721,可同时降低

G₀/G₁ 期和 G₂/M 期 DNA 的量,并使该细胞由 G₀/G₁ 期进入 S 期,造成 S 期细胞堆积,从而促使该细胞分化。氧化苦参碱(0.1~2.5 g/L)有抑制人肝癌细胞 SMMC—7721 增殖的作用,通过阻止细胞进入 S 期,使细胞堆积于 G₀/G₁ 期,从而

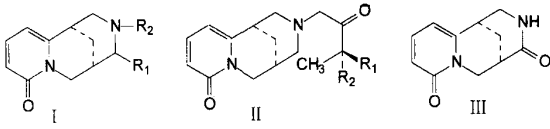


图 2 金雀花碱型生物碱的母核

Fig. 2 Skeleton of cytisine type alkaloids

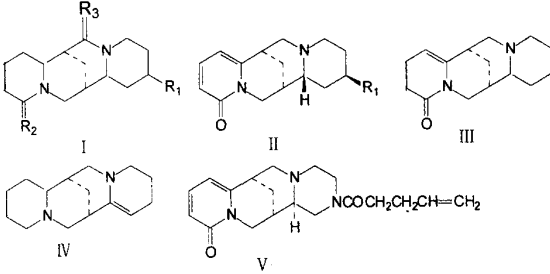


图 3 鹰爪豆碱型生物碱的母核

Fig. 3 Skeleton of sparteine type alkaloids

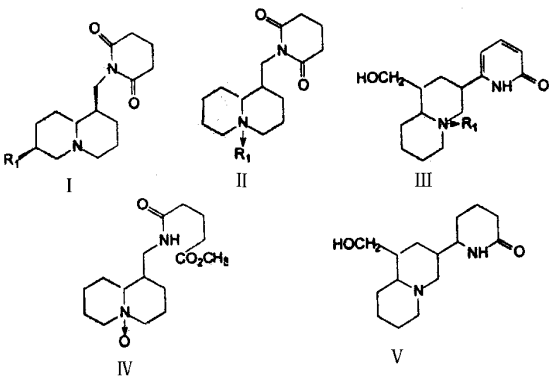


图 4 羽扇豆碱型生物碱的母核

Fig. 4 Skeleton of lupinine type alkaloids

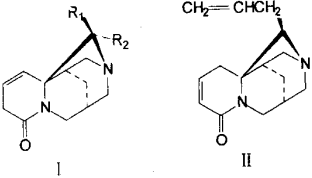


图 5 苏苦西碱型生物碱的母核

Fig. 5 Skeleton of tsukushinamine type alkaloids

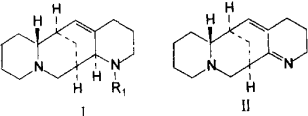


图 6 苦豆碱型生物碱的母核

Fig. 6 Skeleton of aloperine type alkaloids

表 7 双哌啶类生物碱

Table 7 Dipiperidine alkaloids

名 称	植物来源	母核	取代基的位置		参考 文献
			R ₁	R ₂	
异苦拉拉碱	苦参	I	CH ₂ OH	H	2
苦拉拉碱	黄叶槐、苦参	I	H	CH ₂ OH	2, 4
griffithine	硬骨槐*	II			4

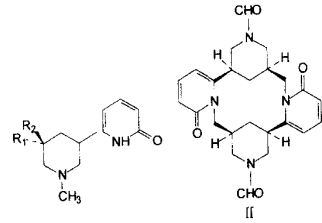


图 7 双哌啶类生物碱的母核

Fig. 7 Skeleton of dipiperidines

表 8 槐属植物中其他类型生物碱

Table 8 Other type alkaloids in plants of *Sophora* Linn.

名 称	植物来源	结构	参考文献
tricrotonyltetramine	苦豆子	I	1
尼古丁	苦豆子	II	12

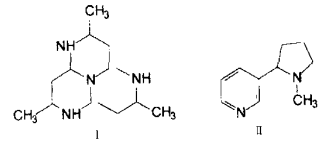


图 8 其他类型生物碱

Fig. 8 Other type alkaloids

抑制了 DNA 的合成^[14]。

2.1.2 影响相关基因的表达:苦参碱(0.1 g/L)处理白血病细胞株 K562,可使抑癌基因 N-ras、p53 mRNA 表达增强,癌基因 c-myc mRNA 表达明显受抑,同时细胞周期蛋白 D (Cyclin D)、细胞周期蛋白依赖性激酶 5(Cdk5)表达增强,从而抑制肿瘤细胞增殖并诱导分化^[15]。

2.1.3 抑制端粒酶活性:端粒酶在细胞永生化和恶性肿瘤的发生中起重要作用。苦参碱(750 mg/L)可抑制其催化亚单位 hTERT 启动子的表达,从而降低人肝癌细胞 HepG₂ 端粒酶活性,起到抑制肿瘤细胞增殖的作用^[16]。

2.1.4 抑制细胞黏附因子的表达:苦参碱(5 mg/L)能抑制人肺巨细胞癌细胞 PG 与内皮细胞黏附后 CD44、CD49 黏附因子的表达,降低内皮细胞的通透性,减轻肿瘤转移^[17]。

2.1.5 抗肿瘤新生血管形成:血管内皮细胞(VEC)的增殖是肿瘤新生血管形成的基础。氧化苦参碱(1.25~10 g/L)可以通过下调增殖期 VEC 相关生长因子的表达,使 VEC 对癌细胞分泌的生长因子的敏感性降低,从而抑制肺癌细胞 SPC-A-1 和胃癌细胞 MNK-45 诱导的 VEC 增殖^[18]。

2.2 对心血管系统的作用

2.2.1 对心脏的影响:槐属植物生物碱具有肯定而显著的抗心律失常作用。苦参总碱、苦参碱、氧化苦参碱、槐果碱、槐定碱、槐胺碱、苦豆碱等均可拮抗乌头碱、哇巴因、BaCl₂、冠脉结扎、氯仿-肾上腺素等诱发的多种室性心律失常。

微量的苦参碱(1~100 μmol/L)可通过作用于 L 型钙通道,剂量依赖性促进豚鼠心室肌细胞外钙内流,延长有效不应期,并对消除折返激动引起的心律失常有一定的疗效^[19]。而另一研究结果却显示,正常剂量的苦参碱(0.01~1 mmol/L)有阻断大鼠心室肌细胞膜上的 L 型钙通道,抑制氯化

钾升高心肌细胞内钙离子浓度的作用,从而作为钙通道阻滞剂,发挥其抗心律失常的作用^[20]。氧化苦参碱能显著增加正常离体蟾蜍心脏、戊巴比妥钠和低钙诱发的离体蟾蜍衰竭心脏的心脏收缩力和心输出量,而对心率无明显影响,且在正常剂量下,对衰竭心脏的作用比正常心脏强,表明其具有显著的强心作用^[21]。槐定碱和氧化槐定碱可减慢整体豚鼠的心率,对抗异丙肾上腺素加快心率的作用,而在离体心肌,它们能使肾上腺素诱发离体心房自律性的浓度降低,表现为加快心率的作用^[22]。

2.2 抗高血压作用:血管紧张素Ⅱ(AngⅡ)是一种活性很高的升血压物质。苦参碱能对抗AngⅡ引起的细胞内钙超载,部分阻断AngⅡ细胞内信息传递途径,抑制AngⅡ引起的血管平滑肌细胞增殖,从而对抗AngⅡ产生的药理作用^[23]。

2.3 对中枢神经系统作用:槐属植物生物碱具有明显的中枢神经抑制作用。苦参碱可通过影响Ca²⁺内流,进而减少NO生成,从而产生中枢镇痛作用^[24]。氧化槐定碱和氧化苦参碱的中枢抑制作用表现为镇静催眠。同剂量下,氧化槐定碱对小鼠自主活动的抑制作用、对阈下剂量戊巴比妥钠的协同作用略强于氧化苦参碱,而氧化苦参碱在延长戊巴比妥钠睡眠时间方面略强于氧化槐定碱,但两者均不具有抗惊厥作用^[25]。通过研究苦参碱、氧化槐果碱、槐定碱、槐胺碱与中枢神经抑制性递质γ-氨基丁酸(GABA)受体之间的作用发现,此类生物碱中枢神经抑制作用不是通过与抑制性受体直接相互作用而产生的,而可能与影响GABA的囊泡储存、再摄取或促进释放,激活合成酶而促进递质合成和代谢有关^[26]。

2.4 对免疫系统的影响:7种苦豆子生物碱对小鼠的免疫功能皆有不同程度的抑制作用,抑制效应:槐定碱>槐果碱>苦豆碱、苦参碱、金雀花碱>槐胺碱>氧化苦参碱。苦参碱对小鼠网状内皮系统吞噬功能、迟发型过敏反应、血清溶血素的生成均有抑制作用,但其免疫抑制作用的量效关系比较特别,大剂量组(30 mg/kg)的免疫抑制效果反而比中小剂量组(3~10 mg/kg)差,原因有待于进一步研究^[27]。苦豆碱对小鼠T细胞、B细胞和巨噬细胞的免疫功能活性均有明显的抑制作用,并有降低脾细胞产生白细胞介素2(IL-2)的能力^[28]。

2.5 抑菌抗炎作用:体外实验证明,苦豆子总生物碱、槐定碱、槐胺碱、苦参碱、金雀花碱、氧化苦参碱对大肠杆菌、产气杆菌等5个环境细菌菌株的生长具有明显的抑制作用,且总碱的最低抑菌浓度相当或低于各单体生物碱,但与目前已广泛应用的抗生素相比槐属植物生物碱的最低抑菌浓度偏高,尚需对其体内抑菌活性作进一步研究,以阐明其医药应用价值。

槐属植物生物碱对多种动物实验性炎症有抑制作用。苦参碱滴眼液对家兔实验性眼炎有较好的治疗作用,氧化苦参碱对大鼠急性胰腺炎、大鼠急性内毒素炎症、大鼠结肠炎、小鼠支气管哮喘等具有良好的治疗效果。随着研究的深入,发现槐属植物生物碱的抗炎作用不是通过垂体-肾上腺素系统,而是通过抑制早期炎症细胞因子的释放,影响参与早期炎症反应的白三烯、前列腺素生物合成等方式发挥其作用。

2.6 抗辐射作用:苦豆子总碱对辐射损伤小鼠具有一定的

保护作用,主要表现为促进受照小鼠外周血象的恢复,保护造血组织,促进免疫系统的恢复,防治急性辐射引发的微核畸变。经⁶⁰Co γ射线均匀间断照射后,应用苦豆子总碱的小鼠的损伤程度明显低于对照组,且发现苦豆子总碱对辐射引发的脂质过氧化损伤有良好的抑制作用,说明苦豆子总碱可以减轻亚慢性辐射对小鼠的损伤效应^[29]。此外,氧化苦参碱对辐射导致的胸腺嘧啶核苷酸(5'-TMP)的间接损伤有显著的防护作用。

2.7 抗柯萨奇病毒作用:苦豆子总碱、苦参总碱具有明显的抗柯萨奇CVB₃病毒,抑制细胞病变,保护细胞的作用,这可能与直接灭活游离病毒以及进入细胞内影响病毒的生物合成有关。此外,槐果碱还可以升高CVB₃感染小鼠的干扰素活性,降低肿瘤坏死因子的活性,提高IL-2诱生量,从而起到抗CVB₃的免疫作用^[30]。

2.8 抗肝炎、肝纤维化作用:苦参碱、氧化苦参碱已广泛的应用于临床治疗肝炎和肝纤维化,并取得了良好的疗效。到目前为止,上市药品有苦参碱注射液、氧化苦参碱注射液、苦参素注射液等,无论是单独使用,还是与干扰素、拉米夫定、胸腺肽等联合使用,均在临床上取得了较好的疗效。

3 结语

目前国内外对槐属植物生物碱化学成分的研究较为深入,提取分离得到了以苦参碱、金雀花碱、苦豆碱等为代表的80余种生物碱,并对其中部分生物碱尤其是苦参碱型生物碱药理作用进行了较系统的研究。虽然苦参碱、氧化苦参碱的抗肝炎、肝纤维化产品已开发成功,但槐属植物生物碱仍具有很大的新药研发潜力,其良好的抗肿瘤、抗心律失常作用尤为值得关注。随着药效学研究的不断深入,构效关系研究的开展,槐属植物生物碱必将得到更加充分的开发和利用。

References:

- [1] Yang J X, Yu Z F. Advance on *Sophora alopecuroides* [J]. *Tianjin Pharm* (天津药学), 1998, 10(1): 43-46.
- [2] Zheng Y Q, Yao J R, Shao X D, et al. Review on the constituents and agricultural application of *Sophora flavescens* Ait. [J]. *Pestic Sci Administra* (农药科学与管理), 2000, 21(1): 24-26.
- [3] Xiao P, Kubo H, Komiya H, et al. Lupin alkaloids from seeds of *Sophora viciifolia* [J]. *Phytochemistry*, 1999, 50(1): 189-193.
- [4] Wang X K, Li J S, Yan Y M. A review on lupin alkaloids and their pharmacology of *Sophora* species [J]. *World Phytomed* (国外医药·植物药分册), 1996, 11(1): 9-14.
- [5] Rahman A U, Choudhary M I, Parvez K, et al. Quinolizidine alkaloids from *Sophora alopecuroides* [J]. *J Nat Prod*, 2000, 63(2): 190-192.
- [6] Xiao P, Li J S, Kubo H, et al. (—)-14β-Hydroxymatrine, a new lupine alkaloid from the roots of *Sophora tonkinensis* [J]. *Chem Pharm Bull*, 1996, 44(10): 1951-1955.
- [7] Liu P, Jiang H Y, Shen M L. A new extraction of matrine and sophoridine from *Sophora viciifolia* or *Sophora moorcroftiana* [P]. CN: 1473830. 2004-02-11.
- [8] Kite G C, Pennington R T. Quinolizidine alkaloid status of *Styphnolobium* and *Cladrastis* (Leguminosae) [J]. *Biochem System Ecol*, 2003, 31: 1409-1416.
- [9] Liu B, Li J L, Yuan Y J. Isolation of alkaloids and structure elucidation of lehmanning from seed of *Sophora alopecuroides* [J]. *Chin Tradit Herb Drugs* (中草药), 2001, 32(4): 293-296.
- [10] Banko P C, Cipollini M L, Breton G W, et al. Seed chemistry of *Sophora chrysophylla* (Mamane) in relation to diet specialist avian seed predator *Loxioides bailleui* (Palila) in

- Hawaii [J]. *J Chem Ecol*, 2002, 28(7): 1393-1410.
- [11] Miao K L, Zhang J Z, Dong Y, *et al.* Research progress on the chemical compounds and pharmacology of *Sophora flavescens* [J]. *Nat Prod Res Dev* (天然产物研究与开发), 2000, 13(2): 69-73.
- [12] Zhang L Z, Li J S, Peter H, *et al.* Alkaloids from seeds of *Sophora alopecuroides* [J]. *China J Chin Mater Med* (中国中药杂志), 1997, 22(12): 740-743.
- [13] Feng J L, Huang G S, Zhang Y Q, *et al.* Matrine effects on JM cells by inhibiting proliferation and inducing apoptosis [J]. *China J Chin Mater Med* (中国中药杂志), 2003, 28(5): 437-441.
- [14] Qian X M, Li J Q, Luo H Y, *et al.* Study on proliferation inhibition by oxymatrine on SMMC-7721 cell *in vitro* [J]. *Acta Univ Med Second Shanghai* (上海第二医科大学学报), 2002, 22(6): 512-514.
- [15] Zhang L P, Jiang J K, Joe T. Expression of oncogene and protein regulating cell cycle progression and its significance in leukemia cell line by matrine [J]. *Chin J Clin Oncol* (中国肿瘤临床), 2001, 28(5): 347-350.
- [16] Chen W Z, Zeng X, Lin Y, *et al.* Effect of matrine on cell proliferation and regulation of telomerase activity in hepatoma cells *in vitro* [J]. *J Oncol* (肿瘤学杂志), 2002, 8(3): 168-170.
- [17] Lin H S, Li S Q, Pei Y X, *et al.* Effects of active components of three traditional Chinese medicinal herbs, Chuanqiongqin & Kushenjian, on the adhesion of endothelial cells to cancer cell line (PG), adhesion molecule and permeability of endothelial cells *in vitro* [J]. *Chin New Drugs J* (中国新药杂志), 1999, 8(6): 384-386.
- [18] Wang B, Wang G J, Xu J. Inhibitory effect of oxymatrine on vascular endothelial cell proliferation induced by tumor [J]. *J Pract Oncol* (实用肿瘤杂志), 2000, 15(5): 297-300.
- [19] Ai J, Gao H H, Wang Y, *et al.* Effects of matrine on $[Ca^{2+}]_i$ in single guinea-pig ventricular myocytes [J]. *J Haerbin Med Univ* (哈尔滨医科大学学报), 2000, 34(4): 235-236.
- [20] Li J X, Li L D, Xing J D. Experimental study of matrine's effects on intracellular calcium effects on intracellular cultured myocardial cells of SD rats [J]. *Chin Tradit Pat Med* (中成药), 2002, 24(10): 774-776.
- [21] Li Q, Wang J, Mao X J, *et al.* Studies on the cardiotonic activities of oxymatrine [J]. *J Shenyang Pharm Univ* (沈阳药科大学学报), 1996, 16(4): 281-284.
- [22] Zhang H M, Yan L, Li H Q. Effects of oxysophoridine and sophoridine on heart rate of guinea pigs [J]. *J Ningxia Med Coll* (宁夏医学院学报), 1998, 20(4): 4-5.
- [23] Li Y, He L R, Yang L Z, *et al.* Intervention of matrine on calcium overload in Ang II-induced vascular smooth muscle cells [J]. *J Shanghai Univ Tradit Chin Med* (上海中医药大学学报), 2000, 14(1): 40-42.
- [24] Luo X Y, Zhang X M, Gao W, *et al.* Studies on site of analgesic action of matrine and its mechanism [J]. *Chin Tradit Herb Drugs* (中草药), 2001, 32(1): 41-43.
- [25] Yu J Q, Jiang Y X, Wang L Y, *et al.* The inhibitory effects of oxysophoridine and oxymatrine on central nervous system in mice [J]. *Ningxia Med J* (宁夏医学杂志), 2002, 24(1): 13-15.
- [26] Wang X K, Li J S. The effects of matrine and other 5 *Sophora* alkaloids on GABA_A receptor [J]. *J Beijing Univ Tradit Chin Med* (北京中医药大学学报), 2000, 23: 42-43.
- [27] Pei R J, Xiao L, Fang X P, *et al.* The effects of matrine on mouse immune functions [J]. *Strait Pharm J* (海峡药学), 1998, 10(2): 7-8.
- [28] Li F, Shi Y C, Huang H L, *et al.* Effect of aloperine on the immune cells in mice [J]. *J Bethune Univ Med Sci* (白求恩医科大学学报), 1997, 23(6): 603-605.
- [29] Liang L, Yang Y J, Li X F. Protective effect of *Sophora alopecuroides* on sub-chronic radiation injury in mice [J]. *Pharmacol Clin Chin Mater Med* (中药药理与临床), 2002, 18(4): 16-17.
- [30] Yang Z W, Zhou Y, Cao X Q. Role of Chinese medicine *Sophora alopecuroides* and *Sophora flavescens* alkaloids in anti-coxsackievirus B₃ [J]. *Ningxia Med J* (宁夏医学杂志), 2002, 24(12): 707-710.

大高良姜辛辣成分的结构与活性研究及其应用

蔡明招, 卢志毅

(华南理工大学 化学科学学院, 广东 广州 510640)

大高良姜为姜科良姜属植物大高良姜 *Alpinia galanga* (L.) Willd. 的根茎, 又名大良姜。大高良姜是生长在东南亚地区的一种多年生草本植物, 其花为白色的有芳香性气味的大串花。市面上有几种混淆品: 一种是高良姜 *A. officinarum* Hance, 它是生长在中国的一种多年生的天然草本植物, 广东省徐闻县有专门的种植基地, 其花是白色的具有玫瑰叶纹的锥状花序; 另外还有益智 *A. oxyphylla* Miq.、草豆蔻 *A. katsumadai* Hayata 和距花山姜 *A. calcarata* Rosc.。大高良姜根茎的外表和味道与生姜有很大的不同, 它的表皮呈淡棕红色, 水分含量少, 纤维含量高, 具有较淡的木质花香, 以及特殊的辛辣香味。在很多亚洲国家, 大高良姜的根部用作调味料, 在中国和泰国, 它还用作胃药。大高良姜精油还应用在食品工业上, 作为食品和饮料的特别添加剂。

近年来, 国外对大高良姜根部精油的研究日渐增多, 国

内研究则很少, 仅有几篇有关大高良姜的研究报道^[1]。大高良姜根茎的主要辛辣成分是 1'-乙酰氧基胡椒酚乙酸酯 (1'-acetoxychavicol acetate)^[1], 是一种具有独特的辛辣感觉的物质^[2], 具有抗肿瘤^[3,4]、抗细菌^[5]、抗真菌^[6]、抗溃疡^[7]、抗氧化^[8]、抗炎^[9]等生物活性。它在水溶液中不能稳定存在, 会发生水解和异构化反应^[2]。1'-乙酰氧基胡椒酚乙酸酯最近还被应用在饮料、甜食、调味品和个人护理品上。

1 结构与活性

1'-乙酰氧基胡椒酚乙酸酯的结构(图1)中含有一个烯丙基乙酸结构、一个羧基和一个苯基结构, 它们的存在对其活性有很大的影响。例如, 烯丙基乙酸结构对 1'-乙酰氧基胡椒酚乙酸酯的稳定性就有很大的影响, 使其在水溶液中不稳定, 可以发生水解反应和其他反应。

若将 1'-乙酰氧基胡椒酚乙酸酯的水溶液回流 2 h 后,