

## 白木香果皮化学成分及其生物活性研究

张兴<sup>1,2</sup>, 陶美华<sup>2</sup>, 陈玉婵<sup>2</sup>, 高晓霞<sup>1</sup>, 谭毓治<sup>1\*</sup>, 章卫民<sup>2\*</sup>

1. 广东药学院药科学院, 广东 广州 510006

2. 广东省微生物研究所 广东省菌种保藏与应用重点实验室 广东省微生物应用新技术公共实验室 广东省华南应用微生物重点实验室-省部共建国家重点实验室培育基地, 广东 广州 510070

**摘要:** 目的 研究白木香 *Aquilaria sinensis* 果皮的化学成分及其细胞毒性与抗菌活性。方法 采用正、反相硅胶柱、凝胶柱和薄层制备等色谱技术和重结晶进行分离纯化, 通过波谱分析进行结构鉴定; 以神经胶质瘤细胞 SF-268、乳腺癌细胞 MCF-7、大细胞肺癌细胞 NCI-H460、肝癌细胞 HepG-2 为供试细胞株, 采用 SRB 染色法对化合物进行体外细胞毒活性研究; 以金黄色葡萄球菌和大肠杆菌为供试菌株, 采用刃天青染色法对化合物进行体外抗菌活性研究。结果 从白木香果皮中分离到 10 个化合物, 经波谱数据分析分别鉴定为 isorhamnetin 3-O-(6''-O-(Z)-p-coumaroyl)-β-D-glucopyranoside (1)、buddlenoid A (2)、7-甲氧基-4'-羟基异黄酮 (3)、木犀草素 (4)、反式对香豆酸乙酯 (5)、木香炔内酯 (6)、表木栓醇 (7)、豆甾醇 (8)、对羟基苯甲酸甲酯 (9)、邻苯二酚 (10)。结论 化合物 1~3、5、6、9、10 为首次从该植物中分离得到, 化合物 1~3、5、6 为首次从沉香属植物中分离得到; 其中化合物 6 对上述 4 种肿瘤细胞株表现出较好的抑制作用, 化合物 1、4 对金黄色葡萄球菌和大肠杆菌具有一定的抗菌活性。

**关键词:** 白木香; 7-甲氧基-4'-羟基异黄酮; 木香炔内酯; 细胞毒活性; 抗菌活性

中图分类号: R284.1 文献标志码: A 文章编号: 0253-2670(2013)10-1248-05

DOI: 10.7501/j.issn.0253-2670.2013.10.007

## Chemical constituents from pericarps of *Aquilaria sinensis* and their biological activities

ZHANG Xing<sup>1,2</sup>, TAO Mei-hua<sup>2</sup>, CHEN Yu-chan<sup>2</sup>, GAO Xiao-xia<sup>1</sup>, TAN Yu-zhi<sup>1</sup>, ZHANG Wei-min<sup>2</sup>

1. College of Pharmacy, Guangdong Pharmaceutical University, Guangzhou 510006, China

2. State Key Laboratory of Applied Microbiology Ministry-Guangdong Province Jointly Breeding Base, South China, Guangdong Open Laboratory of Applied Microbiology, Guangdong Provincial Key Laboratory of Microbial Culture Collection and Application, Guangdong Institute of Microbiology, Guangzhou 510070, China

**Abstract: Objective** To study the chemical constituents from the pericarps of *Aquilaria sinensis* and their cytotoxic and antibacterial activities. **Methods** The compounds were isolated by various chromatographic methods (silica gel, reverse silica gel, Sephadex LH-20, preparative TLC, and so on) and recrystallization. Their structures were identified by extensive analysis of the spectroscopic data. The cytotoxic effects of these compounds on neuroglioma SF-268, breast cancer MCF-7, large cell lung cancer NCI-H460, and hepatoma carcinoma HepG-2 cell lines were observed *in vitro* by SRB staining, and the antibacterial effects of these compounds on *Staphylococcus aureus* and *Escherichia coli* were observed *in vitro* by Resazurin staining method. **Results** Ten compounds were isolated from the pericarps of *A. sinensis* and identified as isorhamnetin 3-O-(6''-O-(Z)-p-coumaroyl)-β-D-glucopyranoside (1), buddlenoid A (2), 7-methoxy-4'-hydroxyisoflavone (3), luteolin (4), trans-p-coumaric acid ethyl ester (5), costunolide (6), epifriedelanol (7), stigmasterol (8), p-hydroxybenzoate (9), and pyrocatechol (10). **Conclusion** Compounds 1—3, 5, 6, 9, and 10 are first isolated from the plant and compounds 1—3, 5, and 6 are isolated from the plants of genus *Aquilaria* Lam. for the first time. Compound 6 exhibits the significant cytotoxic activities against the above four cell lines and compounds 1 and 4 show some antibacterial activities against *S. aureus* and *E. coli*.

**Key words:** *Aquilaria sinensis* (Lour.) Gilg; 7-methoxy-4'-hydroxyisoflavone; costunolide; cytotoxic activity; antibacterial activity

收稿日期: 2012-11-28

基金项目: 国家自然科学基金项目(81203006); 广东省中国科学院全面战略合作项目(2011B090300078); 广东省科技计划项目(2012A030100014)

作者简介: 张兴(1988—), 男, 在读硕士研究生, 研究方向为新药筛选与作用机制研究。Tel: 13760881837 E-mail: zhangxing0615@yahoo.com.cn

\*通信作者 章卫民 Tel: (020)37656321 E-mail: wmzhang58@qq.com

谭毓治 Tel: 13016091497 E-mail: tanyuzhi@163.com

白木香 *Aquilaria sinensis* (Lour.) Gilg, 别名土沉香、女儿香、莞香, 为瑞香科 (Thymelaeaceae) 沉香属 *Aquilaria* Lam. 植物, 是一种热带、亚热带常绿乔木<sup>[1]</sup>, 主产于海南、广东、广西、台湾、福建等地<sup>[2]</sup>。当白木香树干受到创伤或真菌刺激的情况下可分泌出一种气味芬芳的防御性黑色树脂, 称为国产沉香, 是广东道地药材“十大广药”之一。沉香具有行气止痛、温中止呕、纳气平喘的功效, 用于治疗胸腹胀闷疼痛、胃寒呕吐呃逆、肾虚气逆喘急等症<sup>[3]</sup>。本课题组在前期研究中发现白木香果皮提取物具有明显的抗菌、抗肿瘤活性<sup>[4-5]</sup>。为进一步明确白木香果皮的活性成分, 本实验对白木香果皮化学成分进行研究, 从中分离得到 10 个化合物, 分别鉴定为 isorhamnetin 3-*O*-(6''-*O*-(*Z*)-*p*-coumaroyl)- $\beta$ -*D*-glucopyranoside (**1**)、buddlenoid A (**2**)、7-甲氧基-4'-羟基异黄酮 (7-methoxy-4'-hydroxyisoflavone, **3**)、木犀草素 (luteolin, **4**)、反式对香豆酸乙酯 (*trans-p*-coumaric acid ethyl ester, **5**)、木香炔内酯 (costunolide, **6**)、表木栓醇 (epifriedelanol, **7**)、豆甾醇 (stigmasterol, **8**)、对羟基苯甲酸甲酯 (*p*-hydroxybenzoate, **9**)、邻苯二酚 (pyrocatechol, **10**)。化合物 **1**~**3**、**5**、**6**、**9**、**10** 为首次从该植物中分离得到, 化合物 **1**~**3**、**5**、**6** 为首次从沉香属植物中分离得到。对化合物进行细胞毒性和抗菌活性测试, 为开发利用白木香果皮, 发掘新的白木香药用资源奠定基础。

### 1 仪器与材料

核磁共振波谱仪, Bruker 公司; RE-2000 型旋转蒸发器, 上海亚荣生化仪器厂; 超净工作台, 上海恒益科技有限公司。柱色谱硅胶, 青岛海洋化工厂; GF254 高效薄层硅胶板, Merck 公司; C<sub>18</sub> 反相硅胶 (40~75  $\mu$ m), Fuji Silysia Chemical Ltd.; 凝胶 Sephadex LH-20 (18~110  $\mu$ m), Amersham Biosciences 公司; 溶剂及试剂均为分析纯, 购自广州化学试剂厂。

白木香果实由广东省信宜市珍稀沉香发展有限公司提供, 经广东药学院中药学院严寒静副教授鉴定为白木香 *Aquilaria sinensis* (Lour.) Gilg 的果实。果实置于室内阴干, 将种子从果实中去除后即果皮。标本保存于广东省微生物研究所。

供试肿瘤细胞株为神经胶质瘤细胞 SF-268、乳腺癌细胞 MCF-7、大细胞肺癌细胞 NCI-H460 和肝癌细胞 HepG-2; 供试细菌为金黄色葡萄球菌

*Staphylococcus aureus* 和大肠杆菌 *Escherichia coli*, 以上肿瘤细胞株和菌株均来源于广东省微生物研究所菌种保藏中心。

### 2 提取与分离

白木香果皮 10 kg, 粉碎, 用工业酒精浸泡提取 3 次, 减压浓缩得醇提取物 1.2 kg, 将醇提物用水混悬, 依次用石油醚、醋酸乙酯萃取。取醋酸乙酯部分 167.9 g 用正相硅胶柱色谱分离, 以石油醚-醋酸乙酯、氯仿-甲醇梯度洗脱, 得到 133 个流分。其中 Fr. 43~45 有白色沉淀析出, 用甲醇反复洗涤得到化合物 **7** (11.3 mg); 经 TLC 检测, 合并 Fr. 26~36, 经 Sephadex LH-20 色谱、薄层制备分离得到化合物 **5** (4.0 mg); Fr. 46~52 经反相硅胶柱、Sephadex LH-20 分离得到化合物 **8** (23.5 mg)、**9** (12.2 mg)、**6** (13.7 mg); Fr. 53~66 经反相硅胶柱、制备薄层色谱和 Sephadex LH-20 色谱分离得到化合物 **3** (30.2 mg)、**4** (7.9 mg)、**10** (3.1 mg); Fr. 118~133 经制备薄层色谱和 Sephadex LH-20 色谱, 分离得到化合物 **1** (7.4 mg)、**2** (20.1 mg)。

### 3 结构鉴定

化合物 **1**: 黄色粉末。ESI-MS  $m/z$ : 625 [M+H]<sup>+</sup>, <sup>1</sup>H-NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$ : 7.86 (1H, d,  $J$  = 2.0 Hz, H-2'), 7.56 (1H, dd,  $J$  = 8.5, 2.1 Hz, H-6'), 7.39 (1H, d,  $J$  = 16.0 Hz, H-7'''), 7.32 (1H, d,  $J$  = 8.6 Hz, H-2'''), 7.32 (1H, d,  $J$  = 8.6 Hz, H-6'''), 6.82 (1H, d,  $J$  = 8.5 Hz, H-5'), 6.81 (1H, d,  $J$  = 8.6 Hz, H-3'''), 6.81 (1H, d,  $J$  = 8.6 Hz, H-5'''), 6.07 (1H, d,  $J$  = 16.0 Hz, H-8'''), 5.26 (1H, d,  $J$  = 7.4 Hz, H-1''), 3.89 (3H, s, -OCH<sub>3</sub>); <sup>13</sup>C-NMR (125 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$ : 178.3 (C-4), 169.8 (C-9'''), 168.3 (C-7), 162.2 (C-5), 160.8 (C-4'''), 158.2 (C-2), 157.8 (C-9), 150.4 (C-4'), 147.8 (C-3'), 146.2 (C-7'''), 134.7 (C-3), 133.3 (C-6'''), 130.7 (C-2'''), 126.5 (C-1'''), 123.3 (C-6'), 122.5 (C-1'), 116.4 (C-8'''), 115.5 (C-5'), 115.2 (C-3'''), 114.1 (C-5'''), 113.7 (C-2'), 104.0 (C-10), 103.9 (C-1''), 95.4 (C-6), 95.4 (C-8), 77.6 (C-2''), 75.4 (C-3''), 75.4 (C-5''), 71.3 (C-4''), 63.8 (C-6''), 56.1 (3'-OCH<sub>3</sub>)。以上数据与文献报道基本一致<sup>[6]</sup>, 故化合物 **1** 鉴定为 isorhamnetin 3-*O*-(6''-*O*-(*Z*)-*p*-coumaroyl)- $\beta$ -*D*-glucopyranoside。

化合物 **2**: 黄色粉末。ESI-MS  $m/z$ : 593 [M-H]<sup>-</sup>, <sup>1</sup>H-NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$ : 7.98 (2H, d,  $J$  = 8.9 Hz, H-2', 6'), 7.41 (1H, d,  $J$  = 15.9 Hz, H-7'''), 7.31 (2H, d,  $J$  = 8.9 Hz, H-2''', 6'''), 6.81 (2H, d,  $J$  = 8.1 Hz,

H-3', 5'), 6.79 (2H, d,  $J = 8.1$  Hz, H-3'', 5''), 6.09 (1H, d,  $J = 16.0$  Hz, H-8''), 5.19 (1H, d,  $J = 7.4$  Hz, H-1'');  $^{13}\text{C-NMR}$  (125 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$ : 178.6 (C-4), 168.4 (C-9''), 162.3 (C-5), 161.1 (C-4'), 160.8 (C-4''), 159.5 (C-7), 158.5 (C-9), 158.1 (C-2), 146.1 (C-7''), 134.7 (C-3), 131.7 (C-2'', 6''), 130.6 (C-2', 6'), 126.5 (C-1''), 122.2 (C-1'), 116.3 (C-3'', 5''), 115.5 (C-3', 5'), 114.2 (C-8''), 104.4 (C-6), 103.8 (C-1''), 100.2 (C-10), 94.9 (C-8), 77.5 (C-3''), 75.2 (C-2'', 5''), 71.2 (C-4''), 63.9 (C-6''). 以上数据与文献报道基本一致<sup>[7]</sup>, 故化合物 **2** 鉴定为 buddlenoid A。

化合物 **3**: 白色粉末。ESI-MS  $m/z$ : 267  $[\text{M}-\text{H}]^-$ ,  $^1\text{H-NMR}$  (500 MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$ : 8.38 (1H, s, H-2), 8.02 (1H, d,  $J = 9.1$  Hz, H-5), 7.39 (2H, d,  $J = 8.9$  Hz, H-2', 6'), 7.16 (1H, d,  $J = 2.4$  Hz, H-8), 7.08 (1H, dd,  $J = 8.9, 2.4$  Hz, H-6), 6.81 (2H, d,  $J = 8.9$  Hz, H-3', 5'), 3.89 (3H, s,  $-\text{OCH}_3$ );  $^{13}\text{C-NMR}$  (125 MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$ : 176.1 (C-4), 165.1 (C-7), 158.8 (C-4'), 158.6 (C-9), 154.5 (C-2), 131.4 (C-2', 6'), 128.3 (C-5), 125.1 (C-3), 123.7 (C-1'), 118.9 (C-10), 116.3 (C-3', 5'), 116.1 (C-6), 101.9 (C-8), 57.5 ( $-\text{OCH}_3$ )。以上数据与文献报道基本一致<sup>[8]</sup>, 故化合物 **3** 鉴定为 7-甲氧基-4'-羟基异黄酮。

化合物 **4**: 黄色粉末。ESI-MS  $m/z$ : 287  $[\text{M}+\text{H}]^+$ ,  $^1\text{H-NMR}$  (500 MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$ : 7.34 (1H, s, H-2'), 7.33 (1H, d,  $J = 8.2$  Hz, H-6'), 6.87 (1H, d,  $J = 8.2$  Hz, H-5'), 6.45 (1H, s, H-3), 6.32 (1H, s, H-8), 6.11 (1H, s, H-6);  $^{13}\text{C-NMR}$  (125 MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$ : 181.9 (C-4), 169.1 (C-7), 164.5 (C-2), 161.5 (C-9), 158.3 (C-5), 150.5 (C-4'), 145.9 (C-3'), 121.9 (C-6'), 118.8 (C-1'), 115.5 (C-5'), 112.4 (C-2'), 102.6 (C-10), 101.8 (C-3), 100.2 (C-6), 94.7 (C-8)。以上数据与文献报道基本一致<sup>[9]</sup>, 故化合物 **4** 鉴定为木犀草素。

化合物 **5**: 无色晶体。ESI-MS  $m/z$ : 191  $[\text{M}-\text{H}]^-$ ,  $^1\text{H-NMR}$  (500 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 7.64 (1H, d,  $J = 15.9$  Hz, H-3), 7.44 (2H, d,  $J = 8.5$  Hz, H-2', 6'), 6.84 (2H, d,  $J = 8.5$  Hz, H-3', 5'), 6.31 (1H, d,  $J = 15.9$  Hz, H-2), 4.26 (2H, q,  $J = 7.1$  Hz, H-1''), 1.34 (3H, t,  $J = 7.1$  Hz, H-2'');  $^{13}\text{C-NMR}$  (125 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 168.4 (C-1), 158.6 (C-4'), 145.3 (C-3), 130.8 (C-2', 6'), 128.1 (C-1'), 116.8 (C-2), 116.6 (C-3', 5'), 61.3 ( $-\text{OCH}_2$ ), 15.2 ( $-\text{CH}_3$ )。以上数据与文献报道基本一致<sup>[10]</sup>, 故化合物 **5** 鉴定为反式对香豆酸乙酯。

化合物 **6**: 无色晶体。ESI-MS  $m/z$ : 231  $[\text{M}-\text{H}]^-$ ,  $^1\text{H-NMR}$  (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$ : 6.17 (1H, d,  $J = 3.6$  Hz, H-13a), 5.63 (1H, d,  $J = 3.6$  Hz, H-13b), 4.79 (1H, d,  $J = 9.9$  Hz, H-5), 4.72 (1H, dd,  $J = 10.5, 8.5$  Hz, H-1), 1.71 (3H, d,  $J = 1.3$  Hz, H-15), 1.45 (3H, s, H-14);  $^{13}\text{C-NMR}$  (125 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$ : 172.3 (C-12), 142.2 (C-11), 141.6 (C-4), 137.9 (C-10), 128.1 (C-5), 127.4 (C-1), 119.7 (C-13), 83.3 (C-6), 51.1 (C-7), 41.6 (C-3), 39.8 (C-9), 28.5 (C-2), 26.6 (C-8), 16.9 (C-15), 15.9 (C-14)。以上数据与文献报道基本一致<sup>[11]</sup>, 故化合物 **6** 鉴定为木香烯内酯。

化合物 **7**: 白色粉末。ESI-MS  $m/z$ : 427  $[\text{M}-\text{H}]^-$ ,  $^1\text{H-NMR}$  (500 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 3.74 (1H, brs, H-OH), 1.17 (3H, s, H-28), 0.98 (3H, s, H-27), 0.97 (6H, s, H-26, 29), 0.96 (3H, s, H-23), 0.94 (3H, s, H-30), 0.94 (3H, s, H-25), 0.86 (3H, s, H-24);  $^{13}\text{C-NMR}$  (125 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 72.8 (C-3), 61.3 (C-10), 53.2 (C-8), 49.2 (C-4), 42.8 (C-18), 41.7 (C-14), 39.7 (C-22), 39.3 (C-6), 38.4 (C-13), 37.8 (C-9), 37.1 (C-16), 36.1 (C-11), 35.6 (C-19), 35.3 (C-29), 35.2 (C-2), 35.0 (C-5), 32.8 (C-21), 32.3 (C-15), 32.1 (C-30), 31.8 (C-28), 30.6 (C-12), 30.0 (C-17), 28.2 (C-20), 20.1 (C-27), 18.7 (C-25), 18.3 (C-7), 17.6 (C-26), 16.4 (C-1), 15.8 (C-24), 11.6 (C-23)。以上数据与文献报道基本一致<sup>[12]</sup>, 故鉴定化合物 **7** 为表木栓醇。

化合物 **8**: 白色针晶。 $^1\text{H-NMR}$  (500 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 5.35 (1H, d,  $J = 5.0$  Hz, H-6), 5.15 (1H, dd,  $J = 15.2, 7.8$  Hz, H-22), 5.02 (1H, dd,  $J = 15.2, 7.8$  Hz, H-23), 3.50 (1H, m, H-3), 1.01 (3H, d,  $J = 6.8$  Hz, H-21), 0.85 (3H, d,  $J = 6.5$  Hz, H-29), 0.83 (3H, d,  $J = 7.0$  Hz, H-26), 0.81 (3H, d,  $J = 7.5$  Hz, H-27), 0.79 (3H, s, H-19), 0.71 (3H, s, H-18);  $^{13}\text{C-NMR}$  (125 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 140.7 (C-5), 138.3 (C-22), 129.3 (C-23), 121.7 (C-6), 71.7 (C-3), 56.9 (C-17), 55.9 (C-14), 51.2 (C-24), 50.2 (C-9), 42.3 (C-13), 42.2 (C-20), 40.5 (C-12), 39.7 (C-4), 37.3 (C-10), 36.5 (C-8), 31.9 (C-25), 31.9 (C-7), 31.8 (C-2), 31.6 (C-1), 28.9 (C-16), 25.4 (C-28), 24.4 (C-15), 21.2 (C-11), 21.1 (C-21), 21.1 (C-27), 19.4 (C-19), 19.0 (C-26), 12.3 (C-29), 12.1 (C-18)。以上数据与文献报道一致<sup>[13]</sup>, 故鉴定化合物 **8** 为豆甾醇。

化合物 **9**: 无色晶体。 $^1\text{H-NMR}$  (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$ : 7.87 (2H, d,  $J = 8.3$  Hz, H-2, 6), 6.84 (2H, d,  $J = 8.3$  Hz, H-3, 5), 3.84 (3H, s, H-8);  $^{13}\text{C-NMR}$

(125 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ: 167.3 (C-7), 162.0 (C-4), 131.4 (C-3, 5), 120.8 (C-2, 6), 114.8 (C-1), 50.9 (C-8)。以上数据与文献报道基本一致<sup>[14]</sup>, 故鉴定化合物 9 为对羟基苯甲酸甲酯。

化合物 10: 白色针晶。<sup>1</sup>H-NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ: 7.72 (2H, d, *J* = 8.5 Hz, H-2, 5), 6.63 (2H, d, *J* = 8.5 Hz, H-3, 4); <sup>13</sup>C-NMR (125 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ: 159.2 (C-1, 6), 130.6 (C-3, 4), 113.5 (C-2, 5)。以上数据与文献报道一致<sup>[15]</sup>, 故鉴定化合物 10 为邻苯二酚。

#### 4 生物活性筛选

以顺铂为阳性对照, 利用 SRB 法<sup>[16]</sup>测定化合

物 1~7 对 4 种肿瘤细胞株的抑制率。结果表明, 化合物 6 对 4 种肿瘤细胞的增殖均有明显的抑制作用, 在 100 μmol/L 浓度下的抑制率达 75% 以上。因此进一步测定了该化合物对肿瘤细胞株的 IC<sub>50</sub> 值, 结果对 4 种肿瘤细胞株 SF-268、MCF-7、NCI-H460 和 HepG-2 的 IC<sub>50</sub> 值分别为 5.6、12.6、2.9、19.5 μmol/L。结果见表 1。

采用刃天青染色法<sup>[17]</sup>, 测定了化合物 1~7 在 500 μmol/L 浓度下对金黄色葡萄球菌和大肠杆菌的抑制率, 结果化合物 1、4 表现出一定的抗菌活性, 抑制率达 78% 以上。结果见表 2。

表 1 化合物 6 对 4 种肿瘤细胞株的 IC<sub>50</sub> 值 ( $\bar{x} \pm s$ , *n* = 3)

Table 1 IC<sub>50</sub> values of compound 6 against four tumor cell lines ( $\bar{x} \pm s$ , *n* = 3)

化合物	IC <sub>50</sub> / (μmol·L <sup>-1</sup> )			
	SF-268	MCF-7	NCI-H460	HepG-2
6	5.6±0.3	12.6±0.2	2.9±0.5	19.5±1.1
顺铂	5.2±0.6	4.1±0.1	1.9±0.8	2.7±0.2

表 2 化合物 1~7 的抗菌作用 ( $\bar{x} \pm s$ , *n* = 3)

Table 2 Inhibitory rates of compounds 1—7 against two kinds of bacteria ( $\bar{x} \pm s$ , *n* = 3)

菌株	抑菌率/%						
	1	2	3	4	5	6	7
金黄色葡萄球菌	95.7±0.5	7.8±1.2	15.5±0.7	92.1±0.7	1.8±0.6	3.4±0.2	5.9±1.5
大肠杆菌	97.8±0.4	23.3±0.4	14.4±0.1	78.4±0.2	29.2±1.8	4.2±0.3	2.9±0.4

#### 5 讨论

木香烯内酯为中药木香的有效成分。研究表明, 木香烯内酯在 100 μmol/L 的浓度下对 6 种肿瘤细胞株 MDA-MB-435s、PC3、A549、HL-60、SGC 7901 和 K562 均有较强的抑制作用, 抑制率大都在 70%~90%<sup>[18]</sup>, 本研究也表明木香烯内酯具有明显的细胞毒活性。此外, 木香烯内酯能抑制 B16 小鼠黑色素瘤细胞, 且对磷酸二酯酶抑制剂 (IBMX) 诱导的黑色素生成有抑制作用; 其还具有解痉、松弛平滑肌、抑制溃疡发生等多种药理作用<sup>[19]</sup>。

木犀草素是 3', 4', 5, 7-四羟基黄酮类化合物, 主要存在于菊花、金银花等植物中, 具有很高的生物活性。本研究测试了木犀草素对金黄色葡萄球菌和大肠杆菌的抑菌活性, 结果表明其对这 2 种细菌具有一定的抑菌作用。此外, 化合物 isorhamnetin 3-O-(6''-O-(Z)-p-coumaroyl)-β-D-glucopyranoside 对这 2 种细菌也有较好的抑制作用。

近年来, 白木香植物资源的开发与利用越来越

引起人们的重视。本研究结果表明, 白木香果皮化学成分较为丰富, 并具有良好的生物活性, 揭示了白木香果皮的天然活性成分, 为抗肿瘤、抗菌等天然药物的开发及白木香资源的利用提供了新的线索。

#### 参考文献

- [1] 裘树平, 刘仲荃. 中国保护植物 [M]. 上海: 上海科技出版社, 1994.
- [2] 陈树思, 唐为萍. 白木香资源的开发利用 [J]. 韩山师范学院学报, 2003, 24(3): 65-68.
- [3] 中国药典 [S]. 一部. 2010.
- [4] 李浩华, 章卫民, 高晓霞, 等. 白木香果皮提取物抗菌活性的研究 [J]. 中国实验方剂学杂志, 2011, 17(7): 100-103.
- [5] 徐维娜, 高晓霞, 郭晓玲, 等. 白木香果皮挥发性成分及抗肿瘤活性的研究 [J]. 中药材, 2010, 33(11): 1736-1740.
- [6] Sheng J J, Chung H C, Jih H G, et al. Flavonol glycosides and cytotoxic triterpenoids from *Alphitonia philippinecsis* [J]. *J Chin Chem Soc*, 2004, 51(4): 827-834.
- [7] Nshimo C M, Pezzuto J M, Kinghorn A D, et al.

- Cytotoxic constituents of *Muntingia calabura* leaves and stems collected in Thailand [J]. *Int J Pharmacol*, 1993, 31(1): 77-81.
- [8] 陈磊, 刘怡, 梁生旺. 苦参化学成分研究 [J]. 广东药学院学报, 2011, 27(5): 471-473.
- [9] 朱志祥, 赵吉华, 陈海生. 药用狗牙花茎叶部分化学成分 [J]. 第二军医大学学报, 2011, 32(9): 996-999.
- [10] 王刚, 刘劲松, 李红艳, 等. 檫木化学成分研究 [J]. 天然产物研究与开发, 2011, 23(2): 267-269.
- [11] 尹宏权, 齐秀兰, 华会明, 等. 云木香化学成分研究 [J]. 中国药物化学杂志, 2005, 15(4): 217-220.
- [12] 陈爱民, 吴培云, 刘劲松, 等. 紫藤瘤化学成分研究 [J]. 安徽医药, 2012, 16(1): 18-20.
- [13] 陈华国, 李明, 龚小见, 等. 金铁锁化学成分研究 [J]. 中草药, 2010, 41(2): 204-206.
- [14] 徐国熙. 尖裂黄花菜化学成分的研究 [J]. 中草药, 2011, 42(6): 1079-1082.
- [15] 叶冠, 彭华, 范明松, 等. 十齿花化学成分研究 [J]. 中草药, 2008, 39(6): 808-810.
- [16] Skehan P, Storeng R, Scudiero D, *et al.* New colorimetric cytotoxicity assay for anticancer-drug screening [J]. *J Nat Cancer Inst*, 1990, 82(12): 1107-1112.
- [17] 袁高庆, 黎起秦, 秦健, 等. 噻唑蓝法和刃天青法检测植物成分对两种病原细菌的抑菌活性 [J]. 植物保护学报, 2011, 38(4): 306-312.
- [18] 王潞, 赵烽, 何其恩, 等. 18种木香倍半萜对6种人源肿瘤细胞增殖的影响 [J]. 天然产物研究与开发, 2008, 20: 808-812.
- [19] 魏华, 彭勇, 马国需, 等. 木香有效成分及药理作用研究进展 [J]. 中草药, 2012, 43(3): 613-620.