

• 中药与天然药 •

半枝莲化学成分的研究Ⅱ

许凤鸣 王兆全 (安徽省医学科学研究所, 合肥 230061)

李有文 (芜湖张恒春制药厂, 芜湖 241000)

摘要 从半枝莲全草中分得一结晶单体, 经光谱分析鉴定为 5,7,4'-三羟基-8-甲氧基黄酮。

关键词 半枝莲 黄酮 5,7,4'-三羟基-8-甲氧基黄酮

半枝莲别名并头草, 狹叶韩信草, 为唇形科黄芩属植物 *Scutellaria barbata* D. Don 的干燥全草。产华北、华东、中南及西南等地区, 国外亦产, 资源丰富。性味辛、苦、寒。为常用中药, 具有清热解毒、散瘀、止血定痛等功效; 用于治疗癌症、肝炎、咽喉肿痛、肺脓疡、尿道炎、痢疾和毒蛇咬伤等疾病^[1]。为阐明其有效成分, 我们对该植物进行了有效成分的化学研究, 我们曾从半枝莲中分得印黄芩甙(*Scutellarin*)及新型生物碱 *Scutebarbatine A*^[2,3], 现在从其全草的乙醇提取物中又分得一结晶单体, 据其紫外、红外光谱、核磁共振谱及质谱等光谱分析, 鉴定为 5,7,4'-三羟基-8-甲氧基黄酮(4'-羟基汉黄芩素)。该化合物(300μmol)对流感病毒唾液酸酶活性的抑制率为 50%, 其 IC₅₀ 为 55μmol, 比已知的唾液酸酶抑制剂 NeuAc2en (IC₅₀, 220μmol) 的作用强 4 倍。体内、体外实验均证明 5,7,4'-三羟基-8-甲氧基黄酮有明显的抗病毒作用, 该物(33μmol)对流感病毒 A/PR/8/34 有强烈的抑制作用^[4]。

1 仪器与试药: 熔点用 Lets Wetzlar 显微熔点测定仪测定(未校正); 紫外光谱用岛津 UV-240 型仪测定; 红外光谱用岛津 IR-440 型仪测定; ¹H-核磁共振谱用 FX-90Q 型仪测定, 以 DMSO-d₆ 为溶剂, TMS 为内标; 质谱用 JEOL JMS-300 型仪测定; 柱层析及薄层层析用硅胶为青岛海洋化工厂产品; 洗脱剂为不同比例的氯仿-丙酮; 半枝莲采自安徽省肥西县境内, 经安徽中医学院王德群老师鉴定。

2 提取分离: 半枝莲全草粗粉 12kg, 用 90% 乙醇加热回流提取 4 次, 每次 3 小时, 合并提取液, 减压浓缩至适当体积, 用氯仿振摇提取 6 次, 合并氯仿提取液, 用 3% 盐酸振摇, 水洗, 弃水液, 氯仿层用无

水硫酸钠干燥。回收氯仿, 残留物用石油醚(60—90℃)回流脱脂, 回收溶剂得中性部分 129g。将其溶于丙酮, 加适量硅胶拌匀, 挥去丙酮, 研成细粉。装入 1.2kg 硅胶柱上, 依次用仿、氯仿-丙酮递增洗脱, 分瓶收集。硅胶 G 薄层色谱检查, 合并相同流份。从氯仿-丙酮(9:1)流份中分得 5,7,4'-三羟基-8-甲氧基黄酮(800mg)。

3 鉴定: 5,7,4'-三羟基-8-甲氧基黄酮为淡黄色针状结晶(甲醇), 熔点 299—301℃。盐酸镁粉反应呈紫红色, 三氯化铁试液反应呈绿色。

MSm/e (%): 300(M⁺, 56), 286(17), 285(100), 257(26), 167(8), 139(26), 121(4), 119(12), 118(5), 111(6), 69(13)。UVλ_{max}^{MeOH} nm(lge): 274(3.68), 299(3.60), 325(3.66)。IRν_{max}^{KBr} cm⁻¹: 3415(OH), 3150(OH), 1655(C=O), 1605, 1575(芳环 C=C), 1555, 1500, 1435, 1415, 1385, 1355, 1280, 1230, 1180, 1160, 1110, 1010, 980, 940, 840, 655。¹H-NMR(DMSO-d₆)δ: 12.41(1H, S, C₅-OH), 7.92(2H, d, J=8.3Hz, C_{2',6'}-2H), 6.96(2H, d, J=8.3Hz, C_{3',5'}-2H), 6.78(1H, S, C₃-H), 6.28(1H, S, C₆-H), 3.86(3H, S, OCH₃)。

上述光谱数据与文献报道的 5,7,4'-三羟基-8-甲氧基黄酮一致^[5]。两者的薄层色谱斑点 Rf 值相同, 混合熔点不下降。

参 考 文 献

- 1 江苏新医学院。中药大辞典(上册)。上海: 上海科学技术出版社, 1986, 783
- 2 王兆全。半枝莲化学成分的研究简报。中草药, 1981, 12(2): 19

- 3 Zhao Quan WANG, Feng Ming XU, Xian Zhong YAN, et al. Scutebarbatine A, a new neoclerodane-type diterpenoid alkaloid from scutellaria barbata. Chinese Chemical Letters. 1996, 7(4):333-334.
- 4 Takayuki Nagai, Yukinori Miyaichi, Tsuyoshi Tomimori, et al. Inhibition of influenza virus sialidase and anti-influenza virus activity by plant flavonoids. Chem. Pharm. Bull. 1990, 38(5):1329-1332
- 5 Tsuyoshi Tomimori, Yukinori Miyaichi and Haruhisa Kizu. On the flavonoid constituents from the roots of scutellaria baicalensis georgi. I¹. Yakugaku Zasshi, 1982, 102(4):388-391.

收稿日期:1996—12—09