

率^[17], 例如以 PEG-6000 为载体, 用熔融法将其制成固体分散物并压制成片, 比较了共熔物和齐墩果酸片的溶解度和片子的溶出速率, 结果表明共熔物体的溶出速率比原 OA 有很大提高。溶解度也提高到 162.87 μg/ml, 大大提高了 OA 的生物利用度。

5 展望

OA 作为抗肝炎药物已上市多年, 并取得一致好评, 根据 OA 的促免疫作用, 在抗 HIV 方面的研究也已开展起来, OA 对 AIDS 的防治可能有一定作用。OA 的降糖作用优于传统药物小檗碱, 而且副作用小, 相信 OA 在降血脂的领域内将占据一席之地, OA 的研究开发具有非常大的潜力, 相信在不久的将来, OA 将在药学领域大放异彩。

参考文献:

- [1] 张登科. 35 种植物的齐墩果酸含量比较 [J]. 中药材, 1989, 12(12): 19.
- [2] 中国科学院中国植物志编委会. 中国植物志 [M]. 54 卷. 北京: 科学出版社, 1978: 150.
- [3] 韩德伟. 齐墩果酸防治实验性肝硬变发生的研究 [J]. 中医杂志, 1981, 22(3): 217.
- [4] 冀春萱. 齐墩果酸对急性实验性肝损伤的防治作用 [J]. 山西医药杂志, 1980, 12(6): 5.

- [5] 孙燕. 齐墩果酸的促免疫作用 [J]. 中国临床病理科杂志, 1988, (1): 26.
- [6] 任骏. 齐墩果酸对前列腺素及环核苷酸的影响 [J]. 中国药理学通报, 1991, 7(3): 179.
- [7] 戴岳. 齐墩果酸对免疫系统及 I 型变态反应的影响 [J]. 中国药理学报, 1989, 10(4): 381.
- [8] 戴岳. 齐墩果酸对变态反应的抑制作用 [J]. 中国药理学报, 1988, 9(6): 562.
- [9] 区戎英. 齐墩果酸治疗病毒性肝炎 [J]. 广州医药, 1981, (3): 41.
- [10] 李丽庆. 齐墩果酸治疗恶性肿瘤病人的临床 II 期研究 [J]. 中国肿瘤临床, 1992(6): 412.
- [11] 段纯厚. 用正交实验法优选辽东木提取齐墩果酸工艺研究 [J]. 中药材, 1994, 17(1): 30.
- [12] 李开泉. 正交法优选木齐墩果酸的提取工艺 [J]. 中成药, 1992, 14(1): 9.
- [13] 张林麟. 从云南木提取齐墩果酸的工艺研究 [J]. 中国中药杂志, 1989, 14(1): 42.
- [14] 吴玖涵. 用超临界流体色谱法测定怀牛膝及其制剂中齐墩果酸的含量 [J]. 药学学报, 1992, 27(9): 690.
- [15] 赵争胜. 齐墩果酸钠盐的制备及其溶解度 [J]. 中成药, 1991, (8): 32.
- [16] 孙淑英. 齐墩果酸滴丸剂的制备 [J]. 沈阳药学院学报, 1992, 9(2): 125.
- [17] 徐晓阳. 用固体分散法提高齐墩果酸片溶出速率 [J]. 黑龙江医药, 1997, 10(6): 343.

收稿日期: 2000-10-12

铁刀木化学成分的研究进展

吕泰省, 易杨华, 周大铮(第二军医大学药学院海洋药物研究中心, 上海 200433)

摘要: 本文综述了铁刀木的化学成分研究近况, 并对从中分得主要成分的化学结构进行了综述。

关键词: 豆科; 铁刀木; 化学成分

中图分类号: R284 文献标识码: A 文章编号: 1006-0111(2001)02-0107-04

铁刀木 (*Cassia siamea* Lam.) 为豆科决明属植物, 分布于我国的广东、海南、广西、云南、台湾等地。印度、缅甸、泰国等也有广泛分布。民间常用其治疗风湿性关节炎、痞满腹胀、肠胃病、脚扭伤等。国外学者曾对其化学成分进行了研究, 并从不同部分中分离得到了 30 多个化合物。为了合理开发铁刀木的药用资源, 本文将铁刀木的化学成分研究情况综述如下。

1 三萜类化合物

1964 年从铁刀木的根皮中分离得到了羽扇豆醇 (luteol) (1), 1966 年从铁刀木的茎皮中分离得到桦木酮 (betulin) (2)、白桦酸 (betulinic acid) (3) 以及羽扇烯酮^[1] (luteone) (4); 1977 年, Varshney I.P. 等从铁刀木的茎皮中分得了齐墩果酸 (oleanolic acid) (5); 1986 年^[4] 从铁刀木的叶

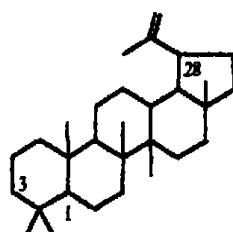
子中分离得到了 cycloart-23-ene-3β, 25-diol (6) 和 friedelin (7), 1992 年从铁刀木的茎皮中分离得到 lipp-2(29)-en-1β, 3β-diol (8)。1994 年从铁刀木的茎皮中分离得到一个三萜皂苷^[8] (9)。

2 蒽醌类化合物

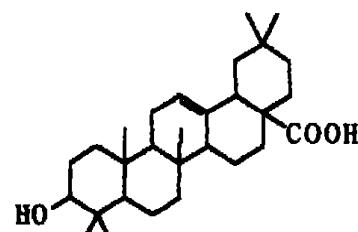
1964 年从铁刀木的根皮中分得了大黄酚 (chrysophanol) (10) 和 cassiamin (11), 从铁刀木的茎皮中分离得到两个双蒽醌^[1], 分别为 cassiamin (12) 和 siameanin (13); 从铁刀木的根皮和茎皮分得了 2 个双蒽醌, 分别为 cassiamin B (14) 和 cassiamin C (15); 1991 年从铁刀木的根中分得了一个芸香糖苷 (16); 1992 年从铁刀木的树干心材中分得了大黄素 (emodin) (17) 及一个新的双蒽醌^[5] (18); 在 1993 年从铁刀木的根中分得 2 个蒽醌的吡喃半乳糖苷^[7] (19) (20); 1994 年^[8] 从铁刀木的茎皮中分得

了大黄素甲醚(physcion) (21); 1994 年从铁刀木的种子

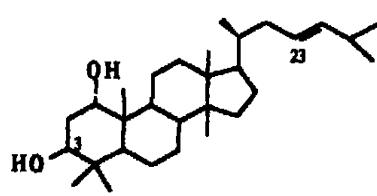
中分得两个蒽醌的糖甙^[9](22)(23)。



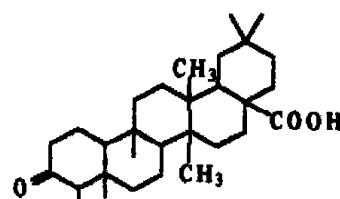
1. 3 β -OH
2. 3 β ,28-OH
3. 3 β -OH 28-COOH
4. 3=O
8. 1 β ,3 β -OH



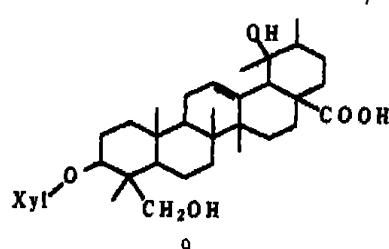
5



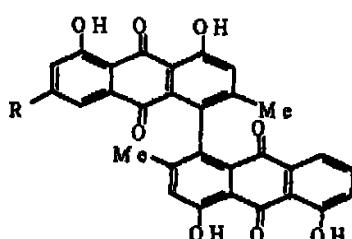
6



7

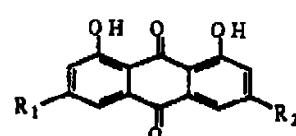
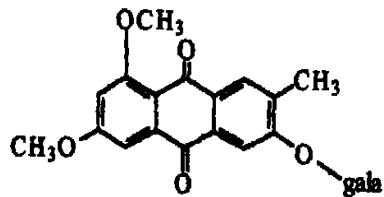


9

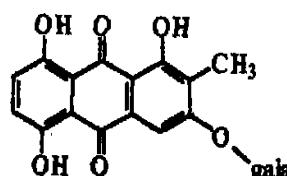


12.R=OH

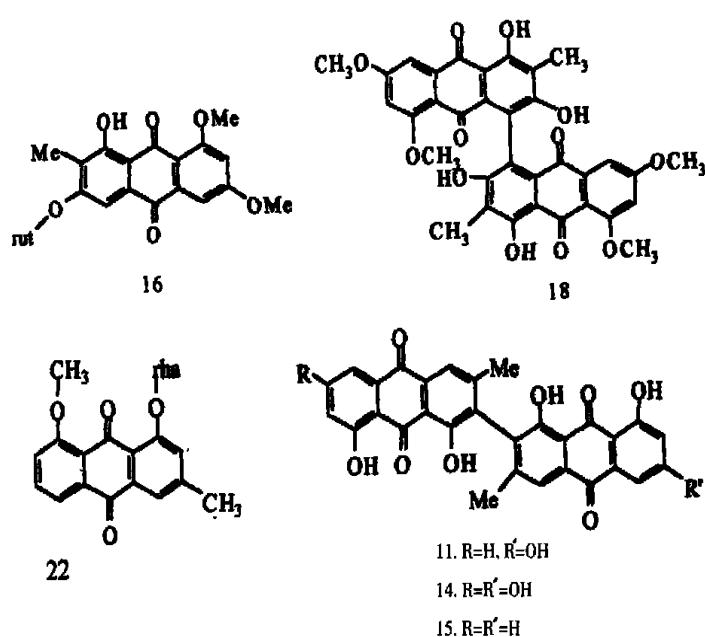
13.R=H

10.R₁=CH₃ R₂=H17.R₁=CH₃ R₂=OH21.R₁=CH₃ R₂=OCH₃

19

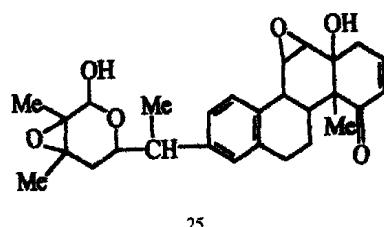


20



3 畴体类化合物

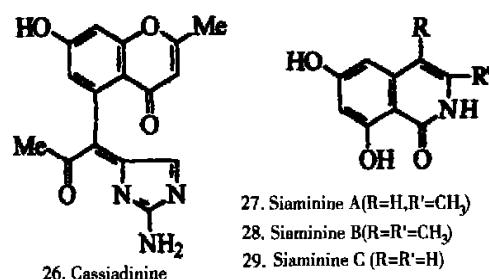
已报道的从铁刀木中分离得到的甾体类化合物有两个,一个是由 β -谷甾醇(24)^[3],另一个命名为 6α ,7 α :22,26:24,25-triepoxy-5,26-dihydroxy-17(13-18)-abeo-5 α -ergosta-2,13,15,17-tetraen-1-one(25)^[6]。



4 生物碱类化合物

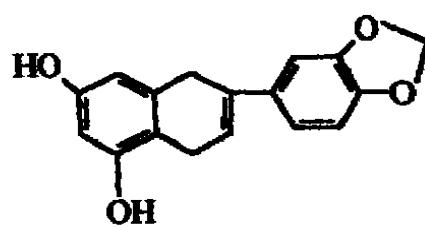
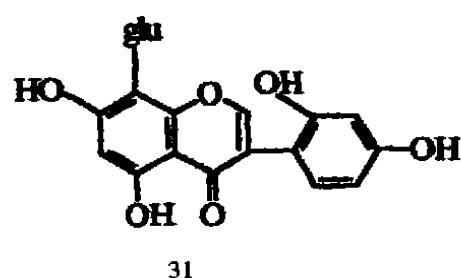
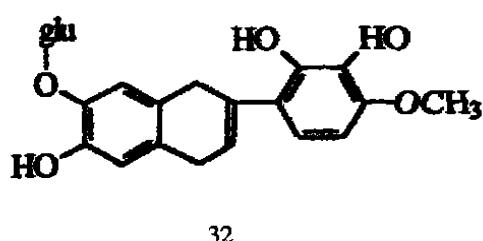
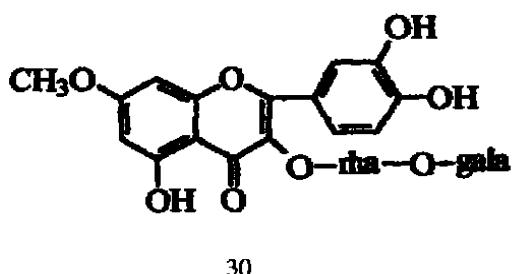
1984年从铁刀木的叶子中分得了3个异喹诺酮类生物碱,分别命名为Siaminine A(27), Siaminine B(28), Siaminine C(29);在1986年从铁刀木的叶子

中分得了一个新的色酮生物碱^[4],命名为Cassiadinine(26)。



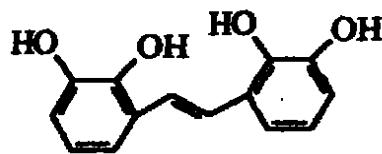
5 黄酮类化合物

从铁刀木中分离得到的黄酮类化合物多为苷类,其中有一个类黄酮苷(30),一个异黄酮的碳苷(31)和一个新黄酮苷(32),1998年Jogi^[13]等报道从铁刀木的叶子中分得含亚甲二氧基的黄酮(33)。

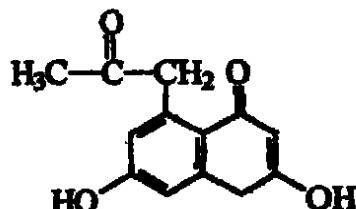


6 其它类型的化合物

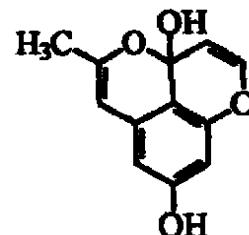
已报道的铁刀木的化学成分中,还有 $2,2'$, $3,3'$ -四羟基二苯乙烯(34),Barakol(35)^[12],5-乙酰甲



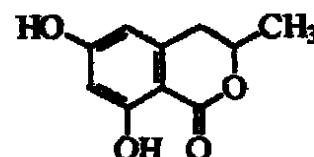
34



36



35



37

在以上所综述的37个化合物中,化合物3具有抗癌及抗HIV病毒的活性^[10];化合物5除有保肝作用外,还具有抗肿瘤活性^[11];化合物25具有杀虫活性^[12];化合物35具有抗焦虑及镇静作用^[12]。作者发现铁刀木树干粗提物中含有大量的蒽酮类化合物,这类化合物具有多种生物活性,目前正在进一步的研究。

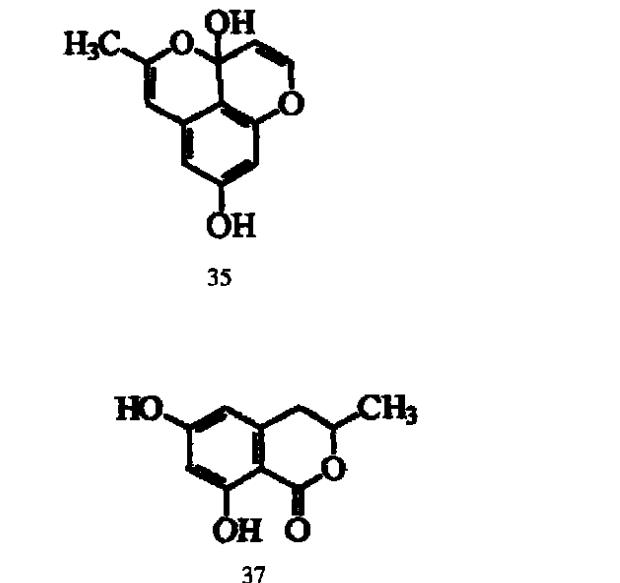
参考文献:

- [1] Chatterjee A, Bhattacharjee SR. New dianthraquinone from *Cassia siamea* [J]. J Indian chem. Soc, 1964, 41(6): 415.
- [2] Arom S, Degmann H, Tiwari RD, et al. New chromone from *Cassia siamea* [J]. Tetrahedron, 1971, 27(5): 981.
- [3] Varshney IP, Raj P. Chemical investigation of *Cassia siamea* flower and bark [J]. J. Indian chem. Soc, 1977, 54(5): 548.
- [4] Biswas KM, Mallik H. Cassiadimine, a chromone alkaloid and a dihydroisocoumarin from *Cassia siamea* [J]. Phytochemistry, 1986, 25(7): 1727.
- [5] Singh V, Singh J, Shama JP. Anthraquinones from heartwood of *Cassia siamea* [J]. Phytochemistry, 1992, 31(6): 2176.

(上接第116页)

- [18] Morris WT. Ceftriaxone is more effective than gentamicin/metronidazole prophylaxis in reducing wound and urinary tract infections after bowel operations [J]. Dis Colon Rectum, 1993, 36: 826.
- [19] Hall JC, Carter MJ. Antibiotic prophylaxis in cardiac operations [J]. Ann Thorac Surg, 1993, 56: 916.
- [20] Luke M, Iversen J, Sondergaard J, et al. Ceftriaxone vs. ampicillin + metronidazole as prophylaxis against infections after clean-contaminated abdominal surgery [J]. Eur J Surg, 1991, 157: 45.

基-7-羟基-2-甲基色酮(36)^[4]和6-羟基蜂蜜曲菌素(37)^[4]等。



- [6] Srivastava C, Siddiqui IR, Singh J, et al. An aht feedant and insecticidal steroid and a new hydroxyketone from *Cassia siamea* bark [J]. J Indian Chem. Soc, 1992, 69(2): 111.
- [7] Tripathi AK, Gupta KR, Singh J. Anthraquinone galatosides from the roots of *Cassia siamea* [J]. Fitoterapia, 1993, 64(1): 63.
- [8] Singh HJ, Agrawal B. New triterpenoid glycoside and anthraquinones from *Cassia siamea* [J]. Int. J. Pharmacogn, 1994, 32(1): 65.
- [9] Abdallah OM, Darwish FMM, El-Sayad SM. Anthraquinones from *Cassia siamea* Lam [J]. Bull. Fac. Pharm (Cairo Univ.), 1994, 32(3): 391.
- [10] Yoshiki K, Fumio H, Cosentino L. M, et al. Betulinic acid and dihydrobetulinic acid derivatives as potent anti-HIV agents [J]. J. Med. Chem, 1996, 39(5): 1016.
- [11] 陶朝阳,易杨华,林厚文,等.雪胆根抗肿瘤活性成分研究[J].第二军医大学学报,1999,20(5):337.
- [12] Thongsard W, Dechapunya C, Barakol. A potential anxiolytic extracted from *Cassia siamea* [J]. Pharmacol. Biochem. Behav, 1996, 53(3): 753.
- [13] Jogi S, Chinmoyee D. A methylenedioxy flavone from *Cassia siamea* Orient [J]. J. Chem, 1998, 14(1): 157.

收稿日期:2000-12-25

- [21] Hjortrup A, Moesgaard F, Jensen F, et al. Antibiotic prophylaxis in high risk biliary surgery: one dose of ceftriaxone compared with two doses of cefuroxime [J]. Eur J Surg, 1991, 157: 403.
- [22] Gulberg V, Deibert P, Ochs A, et al. Prevention of infections complications after transjugular intrahepatic portosystemic shunt in cirrhotic patients with a single dose of ceftriaxone [J]. Hepato-Gastroenterology, 1999, 46: 1126.
- [23] Lumley JW. Single dose ceftriaxone as prophylaxis for sepsis in colorectal surgery [J]. Aust N Z J Surg, 1992, 62: 292.

收稿日期:2000-11-14