

昆明植物所在单萆唛生物碱研究中取得进展

作者：writer 来源：中国科学院

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/6519.html>

本文仅供学习交流之用，版权归原作者所有，请勿用于商业用途！

昆明植物所在单萆唛生物碱研究中取得进展。单萆唛生物碱具有结构复杂、成药率高的特点，一直是天然药物化学研究的热点。迄今已报道该类生物碱约3000个，其中应用于临床药物有数十个，如长春碱类、喜树碱类、奎宁碱类、土的宁碱类、玫瑰树碱类等。我国西南尤其云南是单萆唛生物碱植物资源最丰富的地区，是生物碱研究的宝贵资源。中国科学院昆明植物研究所植物化学与西部植物资源持续利用国家重点实验室云南特色植物资源的利用与开发团队蔡祥海研究组一直致力于单萆唛生物碱的研究，近期取得新进展。

研究团队对药用狗牙花(*Tabernaemontana bovina*)的茎和叶进行系统的生物碱成分研究。博士研究生吴静采用HPLC-UV导向分离，从其茎中发现4个独特共轭系统的单萆唛生物碱taberbovines A-D，具有6/6/5/6/5环系结构特征(图1)。该类生物碱的结构通过核磁共振、X-单晶衍射、计算圆二色谱和核磁共振谱等确定，并对其可能的生源途径进行推测(图2)。该研究成果以Four yellow monoterpenoid quinoline alkaloids from the stem of *Tabernaemontana bovina* 为题发表在Organic Letters(2019, 21, 4554-4558)上。

一般认为单萆唛生物碱唯一前体是1分子色氨(tryptamine)和1分子裂环马钱子苷(secologanin)缩合产生的异胡豆苷(strictosidine)。课题组曾在2011年从盆架树中发现由色氨与裂环马钱子苷以1:2的比例缩合形成的alstroline A(Org. Lett. 2011, 13, 3568)。而在最近的研究中，博士研究生郁阳从药用狗牙花叶中发现生物碱tabernabovine A，该分子是色氨酸与裂环马钱子苷以2:1的比例缩合而来的(图3)。上述研究结果共支撑了单萆唛生物碱生源的多样性。同时还发现新颖骨架的生物碱tabernabovine B和C。Tabernabovine B是由多个桥环形成的笼状型化合物；Tabernabovine C是骨架重排的氧化唛生物碱。上述生物碱结构也得到了核磁谱图、X-单晶衍射、计算圆二色谱和核磁共振谱等支持，同时对tabernabovine B和C的生源过程进行推测(图4、5)。以上研究成果以Tabernabovines A – C: three monoterpenoid indole alkaloids from the leaves of *Tabernaemontana bovina* 为题也发表在Organic Letters(2019, 21, 5938-5942)上。

此外，博士研究生石宝宝在对海南狗牙花(*T. bufalina*)研究中发现78个生物碱。值得一提的是化合物apparicine对黄嘌呤氧化酶具有很强的抑制作用($IC_{50} = 0.65 \mu M$)(图6)，与痛风一线药物别嘌醇活性相当($IC_{50} = 0.60 \mu M$)。研究成果以Alkaloids isolated from *Tabernaemontana bufalina* display xanthine oxidase inhibitory activity 为题发表在Phytochemistry(2019, 166, 50-60)上。

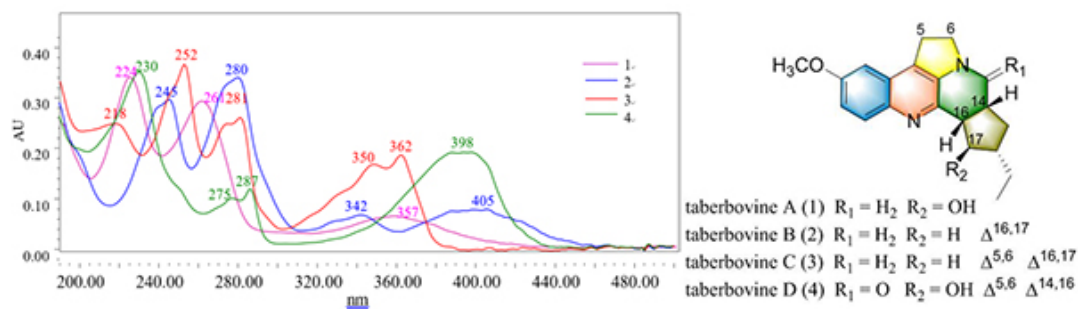


图1 Taberbovines A-D结构及其紫外图谱

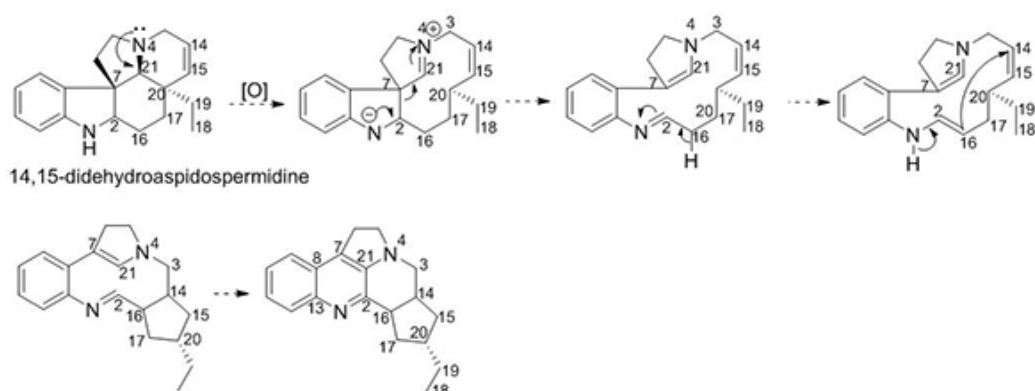


图2 Taberbovines A-D骨架可能的生源途径

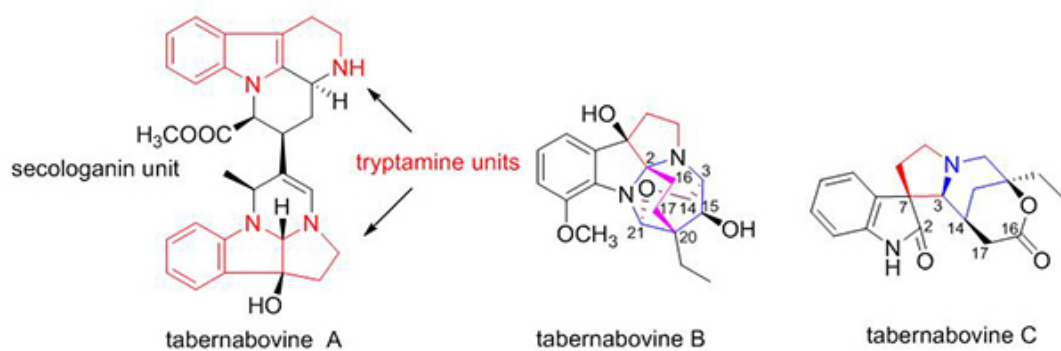


图3 tabernabovines A-D结构式

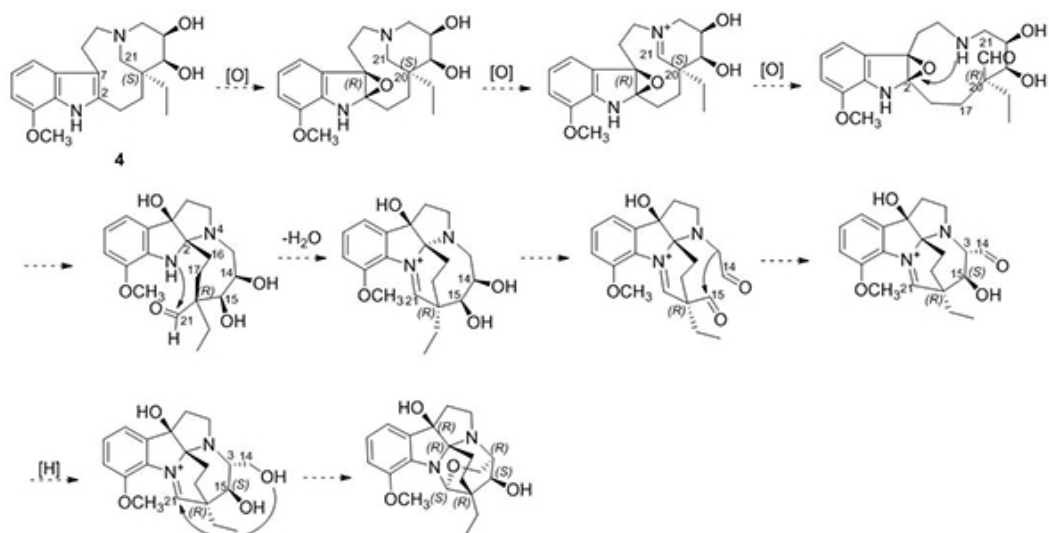


图4 Taberbovine B可能的生源途径

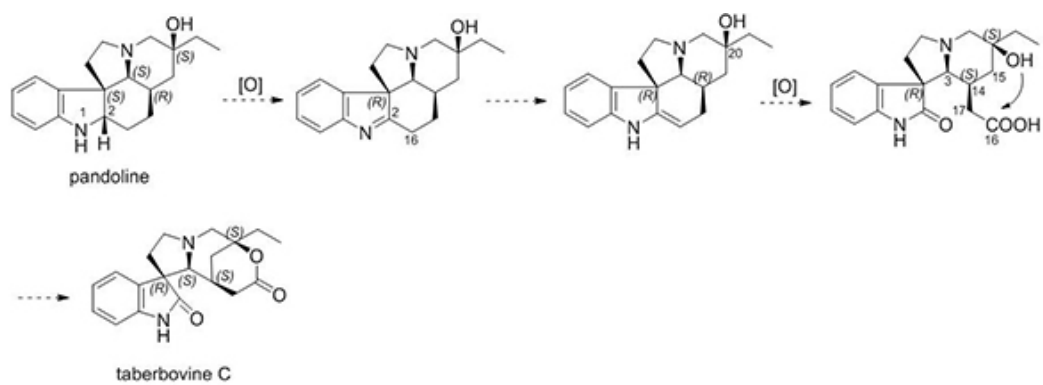


图5 Taberbovine C可能的生源途径

图6 Apparicine抑制黄嘌呤氧化酶 (1N5X) 的分子模拟

更多 科学进展 请访问 <https://www.iikx.com/news/progress/>

本文版权归原作者所有，请勿用于商业用途，[爱科学iikx.com](https://www.iikx.com)转发