

毛喉鞘蕊花的化学成分研究

金岐端 谢显厚 木全章

(中国科学院昆明植物研究所植物化学开放研究实验室 昆明 650204)

摘要 本文报导了,从产于滇东北的毛喉鞘蕊花 (*Coleus forskohlii* Brig) 的根茎中分离到四个二萜化合物,经光谱分析鉴定,其结构分别为1 α , 6 β , 7 α -triacetyl-coleonol-B(1), 1-acetyl-forskolin(2), coleonol-B(3), 和 deacetyl-forskolin(4), 化合物(1)和(2)是首次从该植物中分离到。

关键词 唇形科, 毛喉鞘蕊花, 二萜

毛喉鞘蕊花 (*Coleus forskohlii* Brig) 系唇形科鞘蕊花属植物,产于云南省东北部地区,主要分布在印度,斯里兰卡和尼泊尔等地。早在70年代初,印度学者就从该植物中分离到五个化合物^[1],其中三个有明显的降压和强心作用。接着对该植物的化学成分进行了深入的研究,相继发表了几十篇研究论文。后来由西德 Hoechst 公司对其药理和临床进行了研究。据现在所能查到的文献看,这个药的降压和强心作用是十分肯定的。我们分离到的这四个化合物,经药理验证,也显示了显著的降压和强心作用,它具有较强的正性肌力作用。新近文献报道^[2],它是腺苷酸环化酶的激活剂,也是其它药物的激活剂。因此,这个药已成为当今药学界的宠儿。本文报导的是毛喉鞘蕊花的化学成分研究。我们从该植物中分离到的化合物(1)和(2)为天然产物。经光谱分析和物理

常数测定,化合物(1)与文献^[3]报导的从 Coleonol-B 制备得到的三乙酰化物一致;化合物(2)与文献^[4]所报导的从 Forskolin 制备得到的 1-acetyl-forskolin 一致。从植物的生源角度考虑,同种植物,其化学成分的基本骨架是相同的,但由于两地生态环境的差异,导致结构上发生微小的差异也是可能的。化合物(3)和(4)与印度学者分离到的相同,为已知化合物。

实 验

熔点用微量熔点仪测定,未校正。IR 用 Perkin-Element-577 仪测定。¹H NMR 和 ¹³C NMR 用 AM-400 型仪测定, TMS 为内标。质谱用 Finnigan-4510 型仪测定,薄层层析及柱层析用的硅胶均为青岛海洋化工厂产品。用石油醚-丙酮

原植物由木所李锡文教授鉴定。全部光谱数据由本室物理仪器组测定。印度学者 N. J. De Souza 提供 forskolin 标准品。*开放实验室基金资助课题。

收稿日期, 1990年5月2日

(95:5, 90:10, 80:20, v/v) 展开和洗脱, 薄层用浓硫酸—无水乙醇显色。

毛喉鞘蕊花 (*Coleus forskohlii* Brig) 采自云南省东北地区。称取粉碎的根茎1.3kg, 用酒精加热回流提取3次, 合并提取液, 减压回收溶剂, 得褐色粘稠状物35g, 经硅胶柱层析, 用石油醚—丙酮依次按上述比例洗脱, 合并95:5部分得化合物(1), 90:10部分得化合物(2), 80:20部分得化合物(3)和(4)。

化合物(1)为白色针晶(石油醚—丙酮), 得率0.01% (按原料计, 下同)。mp 204—205°C, $[\alpha]_D^{20} + 35.6^\circ$ (C^{1.05}, CHCl₃)。元素分析, C₂₆H₂₅O₉, 计算值(%): C^{63.18}, H^{7.89}, 实验值(%): C^{62.36}, H^{7.45}。IR_{max}(KBr)cm⁻¹: 3400—2900 (OH), 1745, 1730 (s) (AcO), 1700 (C=O), 1645 1410 (C=C), 1370, 1256 (C—C), 1106。

1050, 986, 920, 810, 750, EI—MS m/z: 494(M⁺), 476 (M⁺—H₂O), 434 (M⁺—AcOH), 374 (M—2×AcOH), 314 (M⁺—3×AcOH), 43(基峰)。¹HNMR (C₅D₅N) δ: 0.99, 1.02, 1.43, 1.57, 1.86 (各3H, s, 5×CH₃), 2.01, 2.05, 2.16 (各3H, s, 3X—COCH₃), 2.75 (1H, d, J=2.5 Hz, C₅—H), 2.55, 3.45 (2H, dd, J=17 Hz, 12—H₂), 5.55 (1H, dd, J=9, 5 Hz, C₁—H), 5.45 (1H, dd, W_{1/2}=10 Hz, 6α—H), 5.60 (1H, d, J=3 Hz, 7α—H), 6.15, 5.15, 4.97 (3H, ABX系统 J_{AB}=1.5 Hz, J_{BK}=10.0 Hz, J_{AX}=17 Hz, —CH=CH₂)。¹³CNMR见表1。

化合物(2)为无色方晶(石油醚—丙酮)得率0.03%。mp 202—203°C,

$[\alpha]_D^{20} + 26.5^\circ$ (C^{1.25}, CHCl₃), 元素分析, C₂₄H₂₃O₈, 计算值(%): C^{63.71}, H^{7.06}, 实测值(%): C^{63.12}, H^{6.06}。IR_{max}(KBr)cm⁻¹: 3400—2950 (OH), 1735, 1720 (AcO), 1700 (C=O), 1645, 1410 (C=C), 1256, 1106 (C—C), 1106,

1050, 986, 920, 810, 750, EI—MS m/z: 452(M⁺), 410 (M⁺—AC), 392 (M⁺—H₂O), 364 (M⁺—H₂O—CO), 43 (CH₃CO)。¹HNMR (C₅D₅N) δ: 0.97, 1.03, 1.41, 1.57, 1.75 (各3H, s, 5×CH₃), 2.03, 2.15 (各3H, s, 2X—COCH₃), 2.75 (1H, d, J=2.5 Hz, C₅—H), 2.55, 3.45 (2H, dd, J=17 Hz, 12—H₂), 4.70 (1H, W_{1/2}=10 Hz, 6α—H), 5.45 (1H, dd, J=9, 5 Hz, C₁—H), 5.55 (1H, d, J=3 Hz, 7α—H), 6.15, 5.15, 4.97 (3H, ABX系统, J_{AB}=1.5 Hz, J_{BX}=10.0 Hz, J_{AX}=17 Hz, —CH=CH₂)。

化合物(3), 得率0.05%。物理常数和光谱 (mp 209—10°C, $[\alpha]_D + 2.85^\circ$, IR, NMR (与文献^[1]报导的 Coleonol-B 一致)。

化合物(4), 得率0.001%。物理常数和光谱 (mp 178—80°C, $[\alpha]_D - 6.8^\circ$, IR, NMR 与去酰 forskoliu 的一致)。

参考文献

- [1] Bhat, S. V., Bajwa, B. S., Dörnauer, H., and De Souza, N. J., *Tetrahed. Lett.*, 1669 (1977)。
- [2] Merk E., Pierre, Douglas, J., Pettibone, Michael F. Sugrue, *Life Sciences*,

- 42: 13, 1307 (1988) .
- [3] Tandon, J. B., Prabha
Painuly, Katti, S. B., &
Shyam Singh, Ind. J. Chem.,
238, 67 (1984) .
- [4] Bhat, S. V, Bajwa, B.S.,
Dornauer, H., De Souza, N.
J., J. Chem. Soc., Perkin
Trans I, 767 (1982) .
- [5] Tandon, J. S., Jauhari, P.
K., Singh, R. S. and Dhar,
M. M. Ind. J. Chem., 168,
341 (1978) .

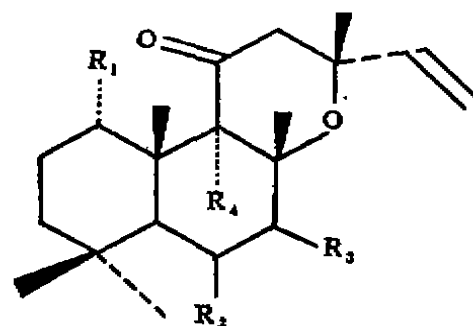


Fig 1. The structure of compounds
1, 2, 3, and 4.

1. $R_1=R_2=R_3=OAc$, $R_4=OH$
2. $R_1=R_3=OAc$, $R_2=R_4=OH$
3. $R_1=R_3=R_4=OH$, $R_2=OAc$
4. $R_1=R_2=R_3=R_4=OH$

STUDY ON THE CHEMICAL CONSTITUENTS FROM COLEUS FORSKOHLII BRIQ

Jin Qiduan, Xie Xianhou, Mu Quanzhang

(Laboratory of Phytochemistry, Kunming Institute of Botany,
Academy of sciences of China, Kunming 650204)

Abstract

We have already isolated from *Coleus forskohlii* Briq. native to south-east of Yunnan four diterpenoid compounds. on the bases of spectral analysis, their structures are identical with 1α , 6β , 7α -triacetyl-coleonol-B(1), 1-acetyl-forskolin(2), coleonol-B(3) and deacetyl-forskolin(4), respectively. Both compound(1) and (2) are found firstly in nature.

Key Words Labiatae, *Coleus forskohlii* Briq, Diterpene

Table 1. ^{13}C NMR Chemical shifts of compound 1,2,3,and 4(in $\text{C}_6\text{D}_6\text{N}$, TMS,Pu

Carbon NO.	1	2	3	4
C-1	73.7	73.2	69.7	69.8
2	43.4	43.2	43.1	43.0
3	42.7	42.5	42.3	43.2
4	32.9	32.5	32.1	32.0
5	49.8	49.7	49.0	49.1
6	75.6	69.3	75.3	69.5
7	75.1	75.8	69.1	70.0
8	81.4	81.2	80.5	80.1
9	82.8	83.0	82.5	82.7
10	36.9	37.1	37.5	37.2
11	206.7	206.1	206.3	206.1
12	49.8	49.2	48.5	49.0
13	75.9	75.2	75.8	75.7
14	147.7	147.1	147.1	147.5
15	110.1	110.0	110.2	110.3
16	30.9	30.3	30.1	30.2
17	27.1	27.3	27.4	27.5
18	21.3	21.0	21.2	21.4
19	20.9	20.5	20.2	20.4
20	18.6	18.7	18.7	18.8
O=C	170.2			
	170.3			
	170.2			
CH ₃	23.5			
	23.1			
	23.5			