

栀子苷元与三羟甲基氨基甲烷的反应*

赵庆¹, 王皎¹, 邹澄^{2Δ}, 郑健³, 张荣平², 郝小江⁴

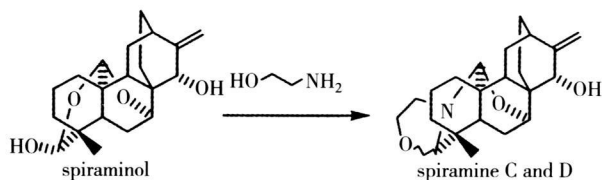
(1 云南中医学院中药学院, 云南昆明 650200; 2 昆明医学院药学院, 云南昆明 650031; 3 江西省科学院生物资源研究所, 江西南昌 330029; 4 中国科学院昆明植物研究所植物化学与西部植物资源持续利用国家重点实验室, 云南昆明 650204)

摘要: 以栀子苷为原料, 栀子苷元为关键中间体, 与三羟甲基氨基甲烷通过曼尼希反应仿生合成绣线菊碱的类似物, 同时证明栀子苷是组合化学研究的一个理想起始原料。

关键词: 栀子苷元; 三羟甲基氨基甲烷; 绣线菊碱; 仿生合成

中图分类号: Q946 文献标识码: A 文章编号: 1000-2723(2007)03-0037-01

郝小江等系统研究了粉花绣线菊各变种的二萜生物碱, 这些生物碱发现有抗 PAF 的活性, 其中 spiramin C 和 D 可以用 spiraminol 通过曼尼希反应仿生合成^[1]。绣线菊碱有活性, 相应二萜无活性, 说明生物碱中的吡啶烷结构是关键。



单萜环烯醚萜与 spiraminol 类似, 隐含戊二醛结构, 具备与氨基醇反应的潜力。我们研究了几种典型的含单萜环烯醚萜的植物^[2-4], 以期合成绣线菊碱的类似物。栀子 (*Gardenia jasminoides*) 被证明是比青叶胆 (*Svertia mileensis*) 更好的起始原料, 因为栀子苷含量高, 比獐牙菜苷容易分离, 栀子苷元也比獐牙菜苷元稳定。栀子苷元与三羟甲基氨基甲烷反应成功完成, 为合成绣线菊碱类似物提供了新途径。栀子苷元也被证明是组合化学的适当起始原料, 符合丰产易得的要求^[5]。

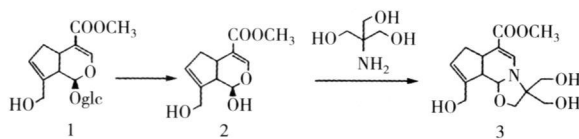


表 1 化合物 1, 2, 3 的 ¹³C NMR 数据

C	1	2	3
1	101.1 (d)	97.6 (d)	92.0 (d)
3	152.3 (d)	153.6 (d)	139.6 (d)
4	111.9 (s)	111.1 (s)	100.7 (s)
5	35.6 (d)	37.1 (d)	38.7 (d)
6	39.1 (t)	39.4 (t)	40.5 (t)
7	126.8 (d)	126.7 (d)	127.3 (d)
8	145.3 (s)	146.6 (s)	146.4 (s)
9	47.0 (d)	48.4 (d)	47.1 (d)
10	60.8 (t)	61.4 (t)	61.5 (t)
CO	167.7 (s)	168.0 (s)	171.0 (s)
OCH ₃	51.1 (q)	51.0 (q)	51.2 (q)
Glc-1	97.8 (d)		
-2	74.9 (d)		
-3	78.7 (d)		
-4	71.5 (d)		
-5	78.4 (d)		
-6	62.6 (t)		
Tris-1			71.9 (t)
-2			66.5 (s)
-3			64.6 (t)
-4			62.2 (t)

溶剂: 1, 氘代吡啶; 2, 氘代吡啶; 3, 氘代甲醇

(下转第 44 页)

* 基金项目: 云南省应用基础研究计划面上项目 (2006C0045M) 资助

收稿日期: 2006-12-29

作者简介: 赵庆 (1969~), 男, 云南广南人, 副教授, 主要从事植物化学、分析化学的研究工作。Δ 通讯作者。

医学院学报, 2003, (26) 4: 25-26

版社, 2000: 35-39

[3] 李晓萍. 走近中药——海马 [M]. 北京: 科学技术出

(编辑: 李平)

Yi Xuzhen's Experience in Treating Gynecological Diseases with Insect Drugs

JN Feng-li LN Qing

(Yunnan College of TCM, Kunming Yunnan 650204 China)

ABSTRACT: Yi Xuzhen the guide for the famous national experts of TCM listed in the second group is national honorary expert of TCM, gynecological expert in Yunnan province. Her medicine used to treat gynecological disease is special, especially insects listed in her prescriptions frequently.

And the effect is obvious. Leech is used to clear the blood stasis to cure the diseases such as Concretions. Centipede can be used to stop pregnancy and other concretions. Hippocampus can be used to warm the kidney, regulate Qi and activate blood and treat oligomenorrhea and amenorrhea. earth worm can be used to make the channels smooth, so it can be used to treat adnexitis. pangolin can be used to soften the hard, expel the sclerosis and prevent the pain, which can be used to treat breast sclerosis. In treating the gynecological diseases, the insect drugs properly use in the prescriptions can have great effect.

KEY WORDS Yi Xuzhen, Insect Drugs, Gynecological Diseases

(上接第 37 页)

[参考文献]

[1] 郝小江, 聂磊, 孙航, 等. 粉花绣线菊复合群的化学分类研究 [J]. 云南植物研究, 1997, 19 (3): 297-303.

[2] 赵庆, 邹澄, 梁宁珈, 等. 青叶胆 xanthone 的分离鉴定与獐牙菜苷昔元的制备 [J]. 中国民族民间医药杂志, 2004, 299-300.

[3] 洪鑫, 赵庆, 邹澄, 等. 甲基龙胆苦昔元的制备 [J].

中国民族民间医药杂志, 2004, 354-355

[4] 唐传劲, 赵庆, 邹澄, 等. 栀子苷简易分离纯化方法 [J]. 中国民族民间医药杂志, 2005, 360-361.

[5] 邹澄, 赵庆, 郝小江, 等. 丰产易得天然产物结构改造值得重视 [J]. 中国民族民间医药杂志, 2004, 135-137.

(编辑: 迟越)

Reaction of Genipin and TRISZHAO Qing¹, WANG Jiao¹, ZOU Cheng², ZHENG Jian³,ZHANG Rong-ping², HAO Xiao-jiang⁴

(1 Faculty of Pharmacy, College of TCM, Yunnan Kunming 650200; 2 School of Pharmaceutical Sciences, Kunming Medical College, Yunnan Kunming 650031; 3 Institute of Biological Resources, Jiangxi Academy of Sciences, Jiangxi Nanchang 330029; 4 State Key Laboratory of Phytochemistry and Plant Resources in West China, Kunming Institute of Botany, The Chinese Academy of Sciences, Yunnan Kunming 650204)

ABSTRACT: Genipin was reacted with tris (hydroxymethyl) amine via Mannich reaction by using geniposide as starting material. Geniposide was proved to be a good starting material for combinatorial chemistry.

KEY WORDS Genipin, TRIS, Spiranes, Bimimetic synthesis