

八月瓜种子的化学成分及其 α -葡萄糖苷酶抑制活性

张正宽¹, 杨斐玉¹, 刘怀琴¹, 徐国波^{1,2}, 朱勤凤^{1,2}, 余玲玲^{1,2}, 廖尚高^{1,2*}

(1. 贵州医科大学药学院, 贵州贵阳 561113)

(2. 贵州省高等学校道地药材慢性病防治工程研究中心, 贵州贵阳 561113)

摘要: 该研究探讨了药食两用八月瓜种子 [*Akebia trifoliata* (Thunb.) Koidz. Seeds] 的化学成分及其 α -葡萄糖苷酶抑制活性。将八月瓜种子经水和95%乙醇提取, 不同极性溶剂萃取后, 分别测试各部位的 α -葡萄糖苷酶抑制活性, 发现95%乙醇提取物的正丁醇部位为 α -葡萄糖苷酶抑制活性部位(IC_{50} 为18.16 $\mu\text{g/mL}$), 采用硅胶柱色谱、HP20SS柱色谱和半制备HPLC等手段对正丁醇部位进行分离纯化。从八月瓜种子正丁醇部位中分离得到14个化合物, 通过与文献波谱数据对比, 分别鉴定为: Hederacholichiside F (1)、Saponin E (2)、Mutong Saponin B (3)、Saponin PJ₁ (4)、Saponin PH (5)、Yuzhizioside IV (6)、Akebia Saponin D (7)、Saponin B (8)、HN-Saponin F (9)、Yuzhizioside IV a (10)、Icariside D (11)、Phenethyl rutinoside (12)、Calceolarioside B (13)和Isoquercitrin (14)。化合物9、10、11、12、14为首次从八月瓜中分离得到。化合物2、7、10、14对 α -葡萄糖苷酶具有一定程度的抑制活性, 其 IC_{50} 分别为17.48、35.62、35.79、44.78 $\mu\text{g/mL}$ 。化合物6、13的抑制活性最为显著, 其 IC_{50} 分别为4.27、2.95 $\mu\text{g/mL}$, 活性优于阳性药阿卡波糖(IC_{50} 为6.02 $\mu\text{g/mL}$)。

关键词: 八月瓜种子; 化学成分; α -葡萄糖苷酶

文章编号: 1673-9078(2024)11-157-165

DOI: 10.13982/j.mfst.1673-9078.2024.11.1252

Chemical Composition and α -Glucosidase Inhibitory Activity of the Seeds of *Akebia trifoliata*

ZHANG Zhengkuan¹, YANG Feiyu¹, LIU Huaiqin¹, XU Guobo^{1,2}, ZHU Qinfeng^{1,2}, YU Lingling^{1,2}, LIAO Shanggao^{1,2*}

(1.School of Pharmacy, Guizhou Medical University, Guiyang 561113, China)(2.University Engineering Research Center for the Prevention and Treatment of Chronic Diseases by Authentic Medicinal Materials in Guizhou Province, Guizhou Medical University, Guiyang 561113, China)

Abstract: In this study, the chemical constituents and α -glucosidase inhibitory activity of medicine and food dual-use *Akebia trifoliata* (Thunb.) Koidz. Seeds were studied. The seeds of *Akebia trifoliata* were extracted with water and 95% ethanol, then extracted with different polar solvents. The α -glucosidase inhibitory activity of each of these extract fractions was determined. It was found that the n-butanol fraction of the 95% ethanol extract could inhibit the active site of the α -glucosidase (IC_{50} was 18.16 $\mu\text{g/mL}$). The n-butanol fraction was separated and purified by silica gel column chromatography, HP20SS column chromatography and semi-preparative HPLC. Fourteen compounds were isolated from

引文格式:

张正宽,杨斐玉,刘怀琴,等.八月瓜种子的化学成分及其 α -葡萄糖苷酶抑制活性[J].现代食品科技,2024,40(11):157-165.

ZHANG Zhengkuan, YANG Feiyu, LIU Huaiqin, et al. Chemical composition and α -glucosidase inhibitory activity of the seeds of *Akebia trifoliata* [J]. Modern Food Science and Technology, 2024, 40(11): 157-165.

收稿日期: 2023-10-19

基金项目: 贵州省高层次创新型人才百层次人才项目(黔科合平台人才[2020]6011-2); 国家自然科学基金项目(U1812403)

作者简介: 张正宽(1997-), 男, 硕士研究生, 研究方向: 天然药物化学成分, E-mail: zhang.dux@qq.com

通讯作者: 廖尚高(1972-), 男, 博士, 教授, 研究方向: 中草药药效物质基础, E-mail: lshangg@163.com

the n-butanol fraction of *Akebia trifoliata* seeds, and after the comparison with the spectral data in the literature, they were identified as Hederacholichiside F (1), Saponin E (2), Mutong Sponin B (3), Saponin PJ₁ (4), Saponin PH (5), Yuzhizioside IV (6), Akebia Saponin D (7), Saponin B (8), HN-Saponin F (9), Yuzhizioside IV a (10), Icariside D (11), Phenethyl rutinoside (12), Calceolariolside B (13) and Isoquercitrin (14). Compounds 9, 10, 11, 12 and 14 were isolated from *Akebia trifoliata* for the first time. Compounds 2, 7, 10 and 14 had certain inhibitory activities against α -glucosidase with IC₅₀ values being 17.48, 35.62, 35.79 and 44.78 μ g/mL, respectively. Compounds 6 and 13 showed the most significant inhibitory activities, with IC₅₀ values being 4.27 μ g/mL and 2.95 μ g/mL, respectively, which were superior to that of acarbose (IC₅₀: 6.02 μ g/mL).

Key words: *Akebia trifoliata* seeds; chemical constituents; α -glucosidase

糖尿病 (Diabetes Mellitus, DM) 是一种以胰岛素分泌缺陷或胰岛素抵抗引起的高血糖为特征的慢性代谢障碍性疾病^[1], 长期高血糖可能会导致痴呆症、糖尿病肾病、视网膜病变等多种并发症和功能障碍^[2-4]。其中 II 型糖尿病 (胰岛素抵抗) 占全球 5.37 亿糖尿病病例的 90%^[5], 而 α -葡萄糖苷酶抑制剂被证明是治疗 II 型糖尿病的一种新颖有效的策略^[6], 因此寻找安全、有效、无毒的天然 α -葡萄糖苷酶抑制剂成为了必然趋势, 而药食两用植物资源也成为食用 α -葡萄糖苷酶抑制剂开发的重要原料。

八月瓜 (*Akebia trifoliata*) 是三叶木通科 (*Akebia trifoliata* (Thunb) Koidz) 木通属 (*Akebia Decne*) 的一种常绿木质藤本植物, 原产地为日本和中国。野生三叶木通主要分布在云南、贵州、湖南、河南一带, 是天然药食同源资源^[7]。八月瓜果实营养丰富, 已在中药中应用 2 000 多年^[8], 具有疏肝理气、活血止痛、散结、利尿等功效^[9], 具有较高的经济价值和医学发展价值。其化学成分主要有萜类及其皂苷、脂肪酸、氨基酸类等^[10,11]。随着八月瓜大量种植的推广, 加之其深加工方式的局限性, 导致种子在榨油后被大量丢弃, 没有得到更好的利用。文献报道八月瓜种子提取物具有非常显著的 α -葡萄糖苷酶抑制活性, 有开发为天然 α -葡萄糖苷酶抑制剂的潜力^[12,13], 但对八月瓜种子对 α -葡萄糖苷酶抑制的活性成分研究鲜见报道。

为明确八月瓜种子中 α -葡萄糖苷酶的抑制活性成分, 本文利用水和 95% 乙醇对八月瓜种子分别提取除油后, 对提取物及其各萃取部位进行 α -葡萄糖苷酶抑制活性筛选, 选取其中 α -葡萄糖苷酶抑制活性最好的 $\varphi=95\%$ 乙醇提取物的正丁醇萃取部位进行化学成分的分离。从中分离鉴定了 14 个化合物, 并对分离得到的单体化合物进行 α -葡萄糖苷酶抑制活性测试, 发现 5 个化合物具有较好的 α -葡萄糖苷酶抑制活性, 这为阐明八月瓜种子的 α -葡萄糖苷酶抑制活性物质基础提供了依据, 为以八月瓜种子为原

料开发天然 α -葡萄糖苷酶抑制剂提供理论基础。

1 材料与方法

1.1 材料

1.1.1 药材来源

八月瓜种子药材采自贵州铜仁, 经贵州医科大学药学院龙庆德副教授鉴定为三叶木通科木通属植物八月瓜 (*Akebia trifoliata*) 的种子, 标本存放于贵州医科大学药学院。

1.1.2 试剂

α -葡萄糖苷酶, 上海麦克林生化科技股份有限公司; 阿卡波糖, 上海源叶生物科技有限公司; 4-硝基苯基- α -D-吡喃葡萄糖苷 (高纯试剂, 纯度 $\geq 98\%$), 北京索莱宝科技有限公司; 磷酸盐缓冲液 (PBS, pH 值为 7.3) 粉末, 北京索莱宝生物科技有限公司; 由本实验室自制溶液; 石油醚 (60~90 $^{\circ}$ C)、乙酸乙酯、正丁醇、甲醇、乙醇、正己烷、异丙醇, 分析纯, 上海泰坦科技股份有限公司; 二氯甲烷、三氯甲烷 (分析纯), 上海申博化工有限公司; 色谱甲醇、色谱乙腈, 上海萨恩化学技术有限公司。

1.1.3 仪器

AVANCE NEO 600 MHz 核磁共振波谱仪, 德国 Bruker 公司; UPLC-IT-TOF 质谱仪, 日本岛津公司; LC3000 制备型高效液相色谱仪, 北京创新通恒科技有限公司; C₁₈ 色谱柱 (10 mm \times 250 mm, 10 μ m), 北京创新通恒科技有限公司; NS4205 制备液相 HPLC 色谱系统, 江苏汉邦科技股份有限公司; Nucifera Si 色谱柱 (10 mm \times 250 mm, 5 μ m), 江苏汉邦科技股份有限公司; EL204 电子天平, 瑞士梅特勒-托利多公司; OSB-2100 旋转蒸发器, 东京理化器械株式会社; 薄层硅胶 GF₂₅₄ 和柱色谱硅胶, 均为青岛海洋化工有限公司; HP20SS, 美国 Fisher Wharton 公司; Sephadex LH-20 葡聚糖凝胶, 瑞士

Pharmacia Biotech 公司; Varioskan LUK 全波长扫描式多功能读数仪、SW-CJ-2D 型超净工作台, 苏州净化设备有限公司。

1.2 方法

1.2.1 提取溶剂和有效组分筛选

八月瓜种子粉碎后分别用水煎煮和 $\varphi=95\%$ 乙醇回流提取 3 次, 每次 2 h, 经过减压浓缩得到提取物。将八月瓜种子的水提取物醇沉后浓缩得到的浸膏与 95% 乙醇提取物浸膏加入适量水混悬后使用石油醚 (60~90 °C) 进行萃取除油, 再将二者分别依次用乙酸乙酯、正丁醇萃取, 萃取后浓缩干燥得乙酸乙酯部位、正丁醇部位及水部位; 对除油后的水提物, 95% 醇提物及其各萃取部位分别进行 α - 葡萄糖苷酶体外抑制活性试验。

1.2.2 提取与分离

八月瓜种子正丁醇部位 100 g, 采用 HP20SS 柱层析, 以甲醇-水 (5%~100%, V/V) 梯度洗脱得 Fr.a~Fr.f。Fr.c (20 g) 经凝胶色谱 (甲醇: 水 = 1:1) 洗脱得到 Fr.c1~Fr.c6; Fr.c2 经反相半制备 HPLC [$\lambda=210/254$ nm, 体积流量 2 mL/min, 乙腈: 水 (26:74)] 洗脱得化合物 5 (9 mg, $t_R=18$ min); Fr.c3 经反相半制备 HPLC [$\lambda=210/254$ nm, 体积流量 2 mL/min, 乙腈: 水 (30:70)] 洗脱得化合物 1 (48 mg, $t_R=28$ min), Fr.c4 经反相半制备 HPLC [$\lambda=210/254$ nm, 体积流量 2 mL/min, 乙腈: 水 (28:72)] 洗脱得化合物 3 (25 mg, $t_R=20$ min) 和化合物 4 (107 mg, $t_R=40$ min); Fr.c5 经反相半制备 HPLC [$\lambda=210/254$ nm, 体积流量 2 mL/min, 乙腈: 水 (35:65)] 洗脱得化合物 2 (260 mg, $t_R=20$ min); Fr.c6 经反相半制备 HPLC [$\lambda=210/254$ nm, 体积流量 2 mL/min, 乙腈: 水 (45:55)] 洗脱得化合物 6 (72 mg, $t_R=13$ min); Fr.d (15 g) 经凝胶色谱 (甲醇: 水 = 1:1) 洗脱得到 Fr.d1~Fr.d5; Fr.d2 经反相半制备 HPLC [$\lambda=210/254$ nm, 体积流量 2 mL/min, 乙腈: 水 (30:70)] 洗脱得化合物 7 (47.8 mg, $t_R=38$ min); Fr.f (28 g) 经凝胶色谱 (甲醇: 水 = 1:1) 洗脱得到 Fr.f1~Fr.f4; Fr.f2 采用正相硅胶二氯甲烷-甲醇 (20:0:0:1) 洗脱, 得到 Fr.f2-1~Fr.f2-6; Fr.f2-1 经反相半制备 HPLC [$\lambda=210/254$ nm, 体积流量 3 mL/min, 乙腈: 水 (83:17)] 洗脱得化合物 11 (13 mg, $t_R=35$ min)、化合物 12 (10 mg, $t_R=35$ min); Fr.f2-2 经反相半制备 HPLC [$\lambda=210/254$ nm, 体积流量 3 mL/min, 甲

醇: 水 (34:66)] 洗脱得化合物 13 (16 mg, $t_R=61$ min)、化合物 14 (7 mg, $t_R=90$ min); Fr.f2-3 经正相半制备 HPLC [$\lambda=210/254$ nm, 体积流量 3 mL/min, 正己烷: 异丙醇 (15:85)] 洗脱得化合物 8 (8 mg, $t_R=30$ min); Fr.f2-5 经反相半制备 HPLC [$\lambda=210/254$ nm, 体积流量 3 mL/min, 乙腈: 水 (36:64)] 洗脱得化合物 9 (33 mg, $t_R=28$ min)、化合物 10 (17 mg, $t_R=35$ min)。

1.2.3 α -葡萄糖苷酶的抑制活性测试

参考文献^[14]方法并稍作调整: 在 37 °C 下, 采用 96 孔板, 首先加入 100 μ L 的样品溶液, 用 PBS 缓冲液 (pH 值 7.3) 进行二倍稀释后温育 5 min, 再加入 50 μ L 酶溶液 (反应浓度为 0.05 U/mL), 37 °C 温育 30 min 后加入 50 μ L 4- 硝基苯基- α -D- 吡喃葡萄糖苷 (反应浓度为 500 μ mol/L) 启动反应。立即检测 405 nm 下的吸光度值作为 0 min 时数据; 37 °C 温育 30 min 后, 检测温育 30 min 时吸光度值。取该值与温育 0 min 时 OD 值的差值 (ΔOD) 作为最终检测结果; 以 PBS 缓冲液 (pH 值 7.3) 为空白样品, 同法检测空白样品的 OD 值。并按如下公式, 计算样品的抑制率。

$$R = \frac{A}{B} \times 100\% \quad (1)$$

式中:

R — α - 葡萄糖苷酶抑制率, %;

A —试验样品 ΔOD 平均值;

B —空白样品 ΔOD 平均值。

1.2.4 数据分析

计算样品对 α - 葡萄糖苷酶抑制率为 50% 时的药物浓度, 即 IC_{50} , 实验所有数据以平均值 \pm 标准误差表示, 每组进行 3 次平行实验。采用 Tukey 单因素方差分析 ($P < 0.05$), 采用 Graphpad prism 8.0 软件进行数据处理。

2 结果与讨论

2.1 提取溶剂和有效组分的确定

对八月瓜种子的水提取物和 $\varphi=95\%$ 乙醇提取物及其二者的各萃取部位进行 α - 葡萄糖苷酶抑制活性筛选, 活性结果 (表 1) 表明, 经活性比较发现 $\varphi=95\%$ 乙醇提取物中正丁醇部位的抑制活性最为显著, 其 IC_{50} 为 18.16 μ g/mL。提示 $\varphi=95\%$ 乙醇提取物正丁醇部位为八月瓜种子抑制 α - 葡萄糖苷酶的活性部位。

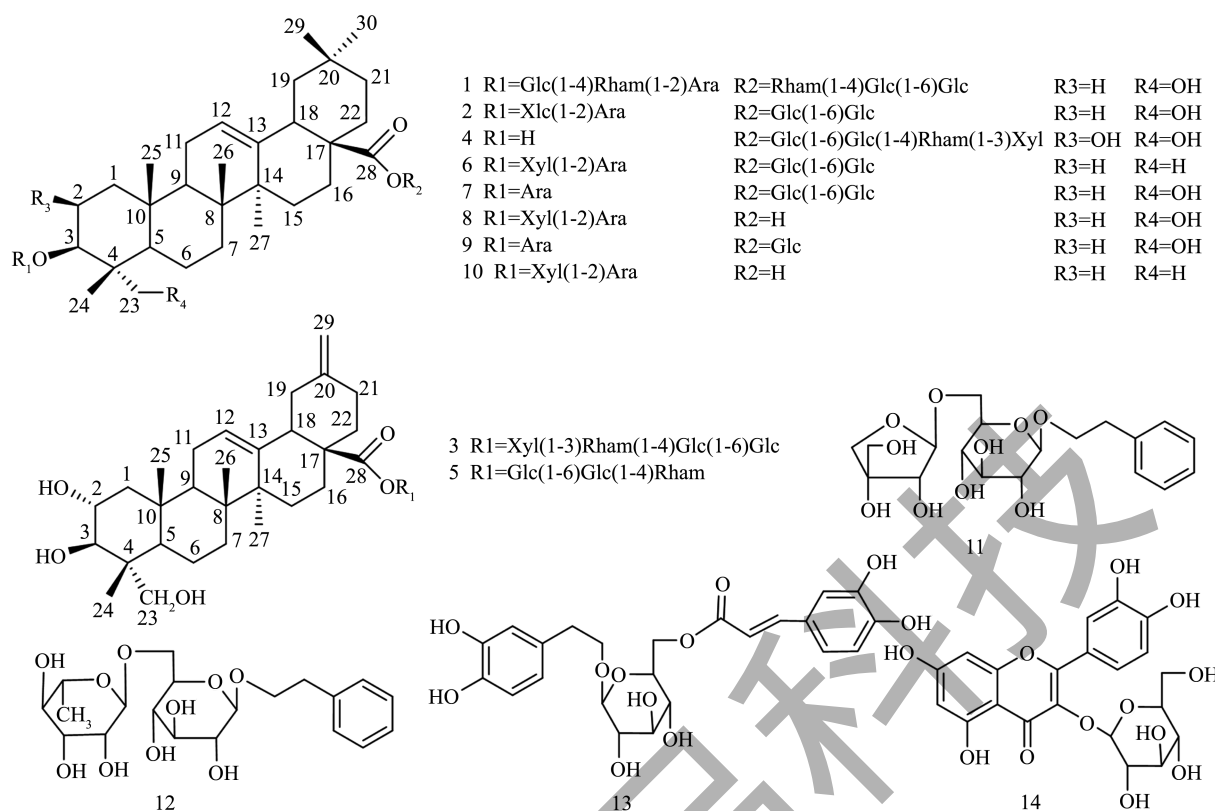


图 1 化合物 1~14 的化学结构

Fig.1 Chemical structures of compounds 1~14

罗宗洪等^[12]对八月瓜果皮和种子进行 α -葡萄糖苷酶的活性抑制研究，其研究表明八月瓜果皮提取物和种子提取物的 IC_{50} 值分别为14.15和15.54 $\mu\text{g/mL}$ 。与本实验提取物活性相当。故本文选取活性更为突出的 $\varphi=95\%$ 乙醇提取物的正丁醇萃取部位开展活性成分研究，以期明确提取物中活性成分的同时，为该提取物的开发利用奠定基础。

表 1 各部位对 α -葡萄糖苷酶的半数抑制率

Table 1 The half inhibition rate of each part on α -glucosidase ($x \pm s, n=3$)

序号	样品名称	$IC_{50}/(\mu\text{g/mL})$
1	水提取物	66.75 \pm 5.03
2	水提 - 乙酸乙酯萃取部位	67.40 \pm 4.47
3	水提 - 正丁醇萃取部位	52.07 \pm 3.23
4	水提 - 水部位	>500
5	95% 乙醇提取物	60.61 \pm 4.52
6	醇提 - 乙酸乙酯萃取部位	93.84 \pm 7.38
7	醇提 - 正丁醇萃取部位	18.16 \pm 1.52
8	醇提 - 水部位	>500

2.2 化合物的结构鉴定

化合物 1：白色粉末。ESI-MS: 1381.6 [M-H]⁻。

¹H NMR (600 MHz, Pyridine-*d*₅) δ 6.26 (1H, *s*, Rham-H-1'), 6.23 (1H, *d*, $J = 8.1$ Hz, Glc-H-1), 5.85 (1H, *s*, Rham-H-1), 5.39 (1H, *br s*, H-12), 5.09 (1H, *d*, $J = 8.1$ Hz, Glc'-H-1), 4.97 (2H, *d*, $J = 9.0$ Hz, Ara-H-1, glc''-H-1), 1.69 (3H, *d*, $J = 6.1$ Hz, Rham-H-6), 1.64 (3H, *d*, $J = 6.1$ Hz, Rham'-H-6), 1.16 (3H, *s*, Me-27), 1.10 (3H, *s*, Me-24), 1.09 (3H, *s*, Me-26), 0.96 (3H, *s*, Me-25), 0.86 (3H, *s*, Me-30), 0.85 (3H, *s*, Me-29); ¹³C NMR (150 MHz, Pyridine-*d*₅) δ 39.3 (C-1), 26.6 (C-2), 81.2 (C-3), 43.7 (C-4), 48.0 (C-5), 18.4 (C-6), 32.8 (C-7), 40.1 (C-8), 48.4 (C-9), 37.1 (C-10), 24.1 (C-11), 123.2 (C-12), 144.4 (C-13), 42.4 (C-14), 28.5 (C-15), 23.6 (C-16), 47.3 (C-17), 41.9 (C-18), 46.4 (C-19), 30.9 (C-20), 34.2 (C-21), 33.0 (C-22), 64.1 (C-23), 14.3 (C-24), 16.4 (C-25), 17.8 (C-26), 26.3 (C-27), 176.8 (C-28), 33.4 (C-29), 23.9 (C-30), 95.9 (Glc-1), 75.6 (Glc-2), 78.5 (Glc-3), 71.1 (Glc-4), 76.7 (Glc-5), 69.4 (Glc-6), 104.6 (Glc'-1), 74.1 (Glc'-2), 78.3 (Glc'-3), 79.0 (Glc'-4), 77.4 (Glc'-5), 61.5 (Glc'-6), 102.9 (Rham-1), 72.8 (Rham-2), 73.0 (Rham-3), 74.2 (Rham-4), 70.6 (Rham-5), 18.9 (Rham-6), 105.1 (Ara-1), 76.5 (Ara-2), 75.3 (Ara-3), 80.7 (Ara-4), 65.7 (Ara-5), 101.9 (Rham'-1),

72.5 (Rham'-2), 72.7 (Rham'-3), 74.4 (Rham'-4), 69.9 (Rham'-5), 18.8 (Rham'-6), 107.0 (Glc''-1), 75.7 (Glc''-2), 78.9 (Glc''-3), 71.4 (Glc''-4), 78.8(Glc''-5), 62.7 (Glc''-6)。以上数据与文献^[15]报道基本一致, 故鉴定化合物为 Hederacholichiside F。

化合物 2: 白色粉末。ESI-MS: 1059.2 [M-H]⁻。¹H NMR (600 MHz, Pyridine-*d*₅) δ 6.26 (1H, *d*, *J* = 8.2 Hz, Glc-H-1), 5.41 (1H, *br s*, H-12), 5.10 (1H, *d*, *J* = 6.8 Hz, Ara-H-1), 5.08 (1H, *d*, *J* = 7.2 Hz, Xyl-H-1), 5.04 (1H, *d*, *J* = 7.8 Hz, Glc'-H-1), 3.18(1H, *dd*, *J* = 9.6, 4.0 Hz, H-18), 1.17 (3H, *s*, Me-27), 1.13 (3H, *s*, Me-24), 1.04 (3H, *s*, Me-26), 1.00 (3H, *s*, Me-25), 0.86 (3H, *s*, Me-30), 0.85 (3H, *s*, Me-29); ¹³C NMR (150 MHz, Pyridine-*d*₅) δ 39.2 (C-1), 26.6 (C-2), 81.7 (C-3), 43.9 (C-4), 47.7 (C-5), 18.5 (C-6), 33.2 (C-7), 40.3 (C-8), 48.5 (C-9), 37.2 (C-10), 24.2 (C-11), 123.3 (C-12), 144.5 (C-13), 42.5 (C-14), 28.6 (C-15), 23.7 (C-16), 47.4 (C-17), 42.0 (C-18), 46.5 (C-19), 31.1 (C-20), 34.3 (C-21), 32.9 (C-22), 64.0 (C-23), 13.5 (C-24), 16.6 (C-25), 17.9 (C-26), 26.4 (C-27), 176.9 (C-28), 33.4 (C-29), 24.0 (C-30), 96.0 (Glc-1), 74.4 (Glc-2), 79.1 (Glc-3), 71.3 (Glc-4), 78.3 (Glc-5), 69.7 (Glc-6), 107.2 (Xyl-1), 76.5 (Xyl-2), 78.7 (Xyl-3), 71.4 (Xyl-4), 67.8 (Xyl-5), 104.8 (Ara-1), 74.2 (Ara-2), 82.4 (Ara-3), 69.1 (Ara-4), 66.3 (Ara-5), 105.7 (Glc'-1), 75.5 (Glc'-2), 78.7 (Glc'-3), 71.8 (Glc'-4), 78.8(Glc'-5), 62.9 (Glc'-6)。以上数据与文献^[16]报道基本一致, 故鉴定化合物为 Saponin E。

化合物 3: 白色粉末。ESI-MS: 1073.3 [M-H]⁻。¹H NMR (600 MHz, Pyridine-*d*₅) δ 6.20 (1H, *d*, *J* = 8.1 Hz, Glc-H-1), 5.89 (1H, *s*, Rham-H-1), 5.43 (1H, *br s*, H-12), 5.26 (1H, *d*, *J* = 7.4 Hz, Xyl-H-1), 4.93 (1H, *d*, *J* = 7.7 Hz, Glc'-H-1), 4.72 (1H, *s*, H-29a), 4.64 (1H, *s*, H-29b), 3.09 (1H, *dd*, *J* = 13.6, 5.3 Hz, H-18), 1.67(3H, *d*, *J* = 6.0 Hz, Rham-H-6), 1.13 (3H, *s*, Me-26), 1.12 (3H, *s*, Me-27), 1.10 (3H, *s*, Me-25), 1.07 (3H, *s*, Me-24); ¹³C NMR (150 MHz, Pyridine-*d*₅) δ 47.9 (C-1), 69.2 (C-2), 78.5 (C-3), 44.0 (C-4), 48.2 (C-5), 18.9 (C-6), 33.1 (C-7), 40.4 (C-8), 48.5 (C-9), 38.7 (C-10), 24.3 (C-11), 123.5 (C-12), 143.9 (C-13), 42.5 (C-14), 28.5 (C-15), 23.8 (C-16), 48.2 (C-17), 47.7 (C-18), 42.0 (C-19), 148.7 (C-20), 30.4 (C-21), 38.0 (C-22), 66.7 (C-23), 14.7 (C-24), 17.8 (C-25), 17.9 (C-26), 26.4 (C-27), 176.2 (C-28), 107.7(C-29), 96.1 (Glc-1), 74.2 (Glc-2), 78.8 (Glc-3), 71.4 (Glc-4), 78.2 (Glc-5), 69.7 (Glc-6),

107.7 (Xyl-1), 76.1 (Xyl-2), 79.0 (Xyl-3), 71.2 (Xyl-4), 67.7 (Xyl-5), 105.4 (Glc'-1), 75.8 (Glc'-2), 76.7 (Glc'-3), 77.6 (Glc'-4), 77.5 (Glc'-5), 61.5 (Glc'-6), 102.7 (Rham-1), 72.5 (Rham-2), 83.7 (Rham-3), 73.3 (Rham-4), 70.4 (Rham-5), 18.8 (Rham-6)。以上数据与文献^[17]报道基本一致, 故鉴定化合物为 Mutong Sponin B。

化合物 4: 白色粉末。ESI-MS: 1090.3 [M-H]⁻。¹H NMR (600 MHz, Pyridine-*d*₅) δ 6.18 (1H, *d*, *J* = 8.0 Hz, Glc-1), 5.83 (1H, *s*, Rham-1), 5.37 (1H, *br s*, H-12), 5.20 (1H, *d*, *J* = 7.4 Hz, Xyl-1), 4.91 (1H, *d*, *J* = 7.6 Hz, Glc'-1), 1.62 (3H, *d*, *J* = 5.8 Hz, Rham-6), 1.10 (3H, *s*, Me-27), 1.09 (3H, *s*, Me-26), 1.06 (3H, *s*, Me-25), 1.02 (3H, *s*, Me-24), 0.83 (3H, *s*, Me-29), 0.83 (3H, *s*, Me-30); ¹³C NMR (150 MHz, Pyridine-*d*₅) δ 47.8 (C-1), 69.0 (C-2), 78.2 (C-3), 43.8 (C-4), 47.9 (C-5), 18.7 (C-6), 34.1 (C-7), 40.1 (C-8), 48.3 (C-9), 38.5 (C-10), 24.1 (C-11), 122.9 (C-12), 144.3 (C-13), 42.3 (C-14), 28.4 (C-15), 23.5 (C-16), 47.1 (C-17), 41.8 (C-18), 46.3 (C-19), 30.9 (C-20), 32.9 (C-21), 32.6 (C-22), 66.5 (C-23), 14.5 (C-24), 17.6 (C-25), 17.7 (C-26), 26.2 (C-27), 176.7 (C-28), 33.3 (C-29), 23.8 (C-30), 107.4 (Xyl-1), 75.8 (Xyl-2), 78.4 (Xyl-3), 70.8 (Xyl-4), 67.4 (Xyl-5), 95.7 (Glc-1), 73.9 (Glc-2), 78.8 (Glc-3), 71.1(Glc-4), 78.1 (Glc-5), 69.3(Glc-6), 105.0 (Glc'-1), 75.6 (Glc'-2), 76.5 (Glc'-3), 77.4 (Glc'-4), 77.3 (Glc'-5), 61.2 (Glc'-6), 102.5 (Rham-1), 72.2 (Rham-2), 83.3 (Rham-3), 73.1 (Rham-4), 70.1(Rham-5), 18.6(Rham-6)。以上数据与文献^[18]报道基本一致, 故鉴定化合物为 Saponin PJ₁。

化合物 5: 白色粉末。ESI-MS: 941.5[M-H]⁻。¹H-NMR (600 MHz, Pyridine-*d*₅) δ : 5.42 (1H, *br s*, H-12), 4.21 (1H, *d*, *J* = 10.8 Hz, H-23a), 3.71 (1H, *d*, *J* = 10.8 Hz, H-23b), 1.07 (3H, *s*, Me-24), 1.10 (3H, *s*, Me-25), 1.13 (3H, *s*, Me-26), 1.11 (3H, *s*, Me-27), 4.69 (1H, *s*, H-29a), 4.67 (1H, *s*, H-29b), 6.20 (1H, *d*, *J* = 7.8 Hz, Glc-H-1), 4.97 (1H, *d*, *J* = 7.8 Hz, Glc'-H-1), 5.87(1H, *br s*, Rham-H-1), 1.71(3H, *d*, *J* = 6.0 Hz, Rham-H-6); ¹³C NMR (150 MHz, Pyridine-*d*₅) δ 47.8 (C-1), 69.2 (C-2), 78.6 (C-3), 44.0 (C-4), 48.2 (C-5), 18.8 (C-6), 33.1 (C-7), 40.4 (C-8), 48.5 (C-9), 38.7 (C-10), 24.3 (C-11), 123.5 (C-12), 143.8 (C-13), 42.5 (C-14), 28.5 (C-15), 23.8 (C-16), 48.2 (C-17), 47.7 (C-18), 41.9 (C-19), 148.7 (C-20), 30.4 (C-21), 38.0 (C-22), 66.7 (C-23), 14.7 (C-24), 17.8 (C-25), 17.9 (C-26),

26.4 (C-27), 176.2 (C-28), 107.7 (C-29), 96.2 (Glc-1), 74.2 (Glc-2), 78.3 (Glc-3), 71.2 (Glc-4), 79.0 (Glc-5), 69.7 (Glc-6), 105.3 (Glc'-1), 75.7 (Glc'-2), 76.9 (Glc'-3), 78.5 (Glc'-4), 77.5 (Glc'-5), 61.7 (Glc'-6), 103.1 (Rham-1), 72.9 (Rham-2), 73.1 (Rham-3), 74.4 (Rham-4), 70.7 (Rham-5), 18.9 (Rham-6)。以上数据与文献^[17]报道基本一致, 故鉴定化合物为 Saponin PH。

化合物 6: 白色粉末。ESI-MS: 1043.5[M-H]⁻。¹H NMR (600 MHz, Pyridine-*d*₅) δ 6.22 (1H, *d*, *J* = 8.1 Hz, Glc-H-1), 5.39 (1H, *s*, H-12), 5.04 (1H, *d*, *J* = 7.0 Hz, Glc'-H-1), 4.84 (1H, *d*, *J* = 5.9 Hz, Ara-H-1), 4.67 (1H, *d*, *J* = 10.8 Hz, Xyl-H-1), 3.61 (1H, *s*, H-3), 3.16 (1H, *dd*, *J* = 13.7, 4.4 Hz, H-18), 1.25 (3H, *s*, Me-27), 1.22 (3H, *s*, Me-26), 1.08 (3H, *s*, Me-25), 1.04 (3H, *s*, Me-24), 0.90 (3H, *s*, Me-23), 0.87 (3H, *s*, Me-29), 0.85 (3H, *s*, Me-30); ¹³C NMR (150 MHz, Pyridine-*d*₅) δ 39.0 (C-1), 26.8 (C-2), 89.1 (C-3), 39.8 (C-4), 56.1 (C-5), 18.7 (C-6), 32.7 (C-7), 40.1 (C-8), 48.3 (C-9), 49.9 (C-10), 23.9 (C-11), 123.1 (C-12), 144.4 (C-13), 42.4 (C-14), 28.1 (C-15), 23.6 (C-16), 47.2 (C-17), 42.3 (C-18), 46.4 (C-19), 41.9 (C-20), 34.2 (C-21), 31.0 (C-22), 28.5 (C-23), 16.6 (C-24), 15.8 (C-25), 17.7 (C-26), 26.3 (C-27), 176.8 (C-28), 33.3 (C-29), 24.0 (C-30), 106.9 (Ara-1), 81.7 (Ara-2), 74.0 (Ara-3), 68.8 (Ara-4), 65.8 (Ara-5), 105.4 (Xyl-1), 76.3 (Xyl-2), 78.5 (Xyl-3), 71.0 (Xyl-4), 67.6 (Xyl-5), 95.9 (Glc-1), 74.0 (Glc-2), 78.5 (Glc-3), 71.2 (Glc-4), 78.1 (Glc-5), 69.5 (Glc-6), 105.3 (Glc'-1), 75.3 (Glc'-2), 78.6 (Glc'-3), 71.6 (Glc'-4), 78.9 (Glc'-5), 62.8 (Glc'-6)。以上数据与文献^[19]报道基本一致, 故鉴定化合物为 Yuzhizioside IV。

化合物 7: 白色粉末。ESI-MS: 927.3[M-H]⁻。¹H NMR (600 MHz, Pyridine-*d*₅) δ 6.25 (1H, *d*, *J* = 8.1 Hz, Ara-H-1), 5.41 (1H, *br s*, H-12), 5.02 (1H, *d*, *J* = 7.7 Hz, Glc-H-1), 4.70 (1H, *d*, *J* = 10.2 Hz, Glc'-H-1), 1.17 (3H, *s*, Me-27), 1.12 (3H, *s*, Me-24), 0.97 (3H, *s*, Me-25), 0.92 (3H, *s*, Me-26), 0.86 (3H, *s*, Me-30), 0.85 (3H, *s*, Me-29); ¹³C NMR (150 MHz, Pyridine-*d*₅) δ 39.1 (C-1), 26.39 (C-2), 82.2 (C-3), 43.8 (C-4), 47.8 (C-5), 18.5 (C-6), 32.8 (C-7), 40.2 (C-8), 48.5 (C-9), 37.2 (C-10), 23.6 (C-11), 123.2 (C-12), 144.4 (C-13), 42.4 (C-14), 28.6 (C-15), 24.1 (C-16), 47.3 (C-17), 41.9 (C-18), 46.5 (C-19), 31.0 (C-20), 34.2 (C-21), 33.1 (C-22), 64.7 (C-23), 13.9 (C-24), 16.5 (C-25), 17.8 (C-26), 26.3 (C-27), 176.8 (C-28), 33.4 (C-29), 23.9 (C-30), 106.9

(Ara-1), 73.4 (Ara-2), 75.4 (Ara-3), 69.6 (Ara-4), 67.3 (Ara-5), 95.9 (Glc-1), 74.2 (Glc-2), 78.9 (Glc-3), 71.1 (Glc-4), 78.7 (Glc-5), 69.9 (Glc-6), 105.5 (Glc'-1), 75.0 (Glc'-2), 78.7 (Glc'-3), 71.7 (Glc'-4), 78.2 (Glc'-5), 62.8 (Glc'-6)。以上数据与文献^[20]报道基本一致, 故鉴定化合物为 Akebia Saponin D。

化合物 8: 白色粉末。ESI-MS: 735.4 [M-H]⁻。¹H NMR (600 MHz, Pyridine-*d*₅) δ 5.48 (1H, *br s*, H-12), 5.11 (1H, *d*, *J* = 6.6 Hz, Ara-H-1), 5.09 (1H, *d*, *J* = 7.1 Hz, Xyl-H-1), 3.29 (1H, *dd*, *J* = 13.8, 3.3 Hz, H-18), 1.23 (3H, *s*, Me-24), 1.03 (3H, *s*, Me-27), 1.03 (3H, *s*, Me-25), 1.00 (3H, *s*, Me-26), 0.96 (3H, *s*, Me-30), 0.93 (3H, *s*, Me-29); ¹³C NMR (150 MHz, Pyridine-*d*₅) δ 39.2 (C-1), 26.6 (C-2), 81.7 (C-3), 44.0 (C-4), 47.7 (C-5), 18.5 (C-6), 33.2 (C-7), 40.1 (C-8), 48.5 (C-9), 37.2 (C-10), 24.1 (C-11), 122.9 (C-12), 145.2 (C-13), 42.5 (C-14), 28.7 (C-15), 24.0 (C-16), 46.9 (C-17), 42.3 (C-18), 46.7 (C-19), 31.3 (C-20), 34.6 (C-21), 33.6 (C-22), 64.0 (C-23), 13.6 (C-24), 16.4 (C-25), 17.8 (C-26), 26.5 (C-27), 180.7 (C-28), 33.6 (C-29), 24.2 (C-30), 107.2 (Ara-1), 82.4 (Ara-2), 74.4 (Ara-3), 69.2 (Ara-4), 66.3 (Ara-5), 104.8 (Xyl-1), 76.6 (Xyl-2), 78.7 (Xyl-3), 71.4 (Xyl-4), 67.8 (Xyl-5)。以上数据与文献^[21]报道基本一致, 故鉴定化合物为 Saponin B。

化合物 9: 白色粉末。ESI-MS: 765.5 [M-H]⁻。¹H NMR (600 MHz, Pyridine-*d*₅) δ 6.31 (1H, *d*, *J* = 8.1 Hz, Glc-H-1), 5.42 (1H, *s*, H-12), 4.96 (1H, *d*, *J* = 7.2 Hz, Ara-H-1), 3.17 (1H, *dd*, *J* = 14.0, 4.6 Hz, H-3), 1.18 (3H, *s*, Me-24), 1.12 (3H, *s*, Me-27), 0.95 (3H, *s*, Me-25), 0.91 (3H, *s*, Me-26), 0.88 (3H, *s*, Me-30), 0.86 (3H, *s*, Me-29); ¹³C NMR (150 MHz, Pyridine-*d*₅) δ 39.1 (C-1), 26.4 (C-2), 82.2 (C-3), 43.8 (C-4), 47.8 (C-5), 18.5 (C-6), 33.1 (C-7), 40.2 (C-8), 48.5 (C-9), 37.2 (C-10), 24.2 (C-11), 123.2 (C-12), 144.4 (C-13), 42.4 (C-14), 28.5 (C-15), 23.7 (C-16), 47.3 (C-17), 42.0 (C-18), 46.4 (C-19), 31.0 (C-20), 34.3 (C-21), 32.8 (C-22), 64.7 (C-23), 13.8 (C-24), 16.5 (C-25), 17.8 (C-26), 26.4 (C-27), 176.8 (C-28), 33.4 (C-29), 23.9 (C-30), 106.9 (Ara-1), 73.4 (Ara-2), 75.0 (Ara-3), 69.9 (Ara-4), 67.3 (Ara-5), 96.0 (Glc-1), 74.4 (Glc-2), 79.2 (Glc-3), 71.4 (Glc-4), 79.6 (Glc-5), 62.5 (Glc-6)。以上数据与文献^[22]报道基本一致, 故鉴定化合物为 HN-Saponin F。

化合物 10: 白色粉末。ESI-MS: 721.3 [M-H]⁻。¹H NMR (600 MHz, Pyridine-*d*₅) δ 5.48 (1H, *br s*, H-12),

5.08 (1H, *d*, *J* = 6.6 Hz, Xyl-H-1), 4.89 (1H, *d*, *J* = 6.0 Hz, Ara-H-1), 3.31 (1H, *dd*, *J* = 13.5, 4.6, H-18), 3.27 (1H, *dd*, *J* = 4.0, 11.9 Hz, H-3), 1.30 (3H, *s*, Me-23), 1.27 (3H, *s*, Me-27), 1.07 (3H, *s*, Me-24), 1.02 (3H, *s*, Me-29), 1.00 (3H, *s*, Me-30), 0.96 (3H, *s*, Me-26), 0.86 (3H, *s*, Me-25); ¹³C NMR (150 MHz, Pyridine-*d*₅) δ 39.12 (C-1), 26.95 (C-2), 89.26 (C-3), 39.98 (C-4), 56.25 (C-5), 18.86 (C-6), 33.57 (C-7), 40.09 (C-8), 48.40 (C-9), 37.38 (C-10), 24.14 (C-11), 122.84 (C-12), 145.23 (C-13), 42.51 (C-14), 28.67 (C-15), 24.16 (C-16), 47.04 (C-17), 42.36 (C-18), 46.85 (C-19), 31.33 (C-20), 34.60 (C-21), 33.55 (C-22), 28.29 (C-23), 16.78 (C-24), 15.86 (C-25), 17.75 (C-26), 26.51 (C-27), 180.72 (C-28), 33.65 (C-29), 24.06 (C-30), 107.12 (Ara-1), 81.94 (Ara-2), 74.17 (Ara-3), 68.99 (Ara-4), 66.01 (Xyl-5), 105.48 (Xyl-1), 76.49 (Xyl-2), 78.70 (Xyl-3), 71.42 (Xyl-4), 67.80 (Xyl-5)。以上数据与文献^[19]报道基本一致, 故鉴定化合物为 Yuzhizioside IVa。

化合物 11: 无色糖状。ESI-MS: 439.2 [M+Na]⁺。¹H NMR (600 MHz, CD₃OD) δ 7.26 (4H, *d*, *J* = 4.4 Hz, H-2, H-3, H-5, H-6), 7.16~7.19 (1H, *m*, H-4), 5.01 (1H, *d*, *J* = 2.3 Hz, H-1'), 4.29 (1H, *d*, *J* = 7.8 Hz, H-1'), 4.05 (1H, *dd*, *J* = 16.6, 7.9 Hz, H-8a), 3.97 (1H, *dd*, *J* = 11.2, 1.9 Hz, H-6'a), 3.96 (1H, *d*, *J* = 9.7 Hz, H-4''), 3.90 (1H, *d*, *J* = 2.1 Hz, H-2''), 3.73~3.81 (2H, *m*, H-8b, H-4''), 3.60 (1H, *dd*, *J* = 11.2, 6.1 Hz, H-6'b), 3.56 (2H, *s*, H-5''), 3.38~3.43 (1H, *m*, H-5'), 3.32 (1H, *m*, H-3'), 3.25~3.30 (1H, *m*, H-4'), 3.18 (1H, *t*, *J* = 8.5 Hz, H-2'), 2.90~2.98 (2H, *m*, H-7); ¹³C NMR (150 MHz, CD₃OD) δ 140.1 (C-1), 130.0 (C-2,6), 129.4 (C-3,5), 127.2 (C-4), 37.3 (C-7), 71.7 (C-8), 104.4 (C-1'), 75.0 (C-2'), 78.0 (C-3'), 71.8 (C-4'), 76.9 (C-5'), 68.7 (C-6'), 111.0 (C-1''), 78.0 (C-2''), 80.5 (C-3''), 75.1 (C-4''), 65.6 (C-5'')。以上数据与文献^[23]报道基本一致, 故鉴定化合物为 Icariside D。

化合物 12: 无色糖状。ESI-MS: 453.2 [M+Na]⁺。¹H NMR (600 MHz, CD₃OD) δ 7.25~7.27 (4H, *m*, H-2, H-3, H-5, H-6), 7.15~7.19 (1H, *m*, H-4), 4.75 (1H, *br s*, H-1'), 4.29 (1H, *d*, *J* = 7.8 Hz, H-1'), 4.01~4.06 (1H, *m*, H-8a), 3.74~3.79 (1H, *m*, H-8b), 2.91~2.97 (2H, *m*, H-7), 1.25 (1H, *d*, *J* = 6.2 Hz, H-6''); ¹³C NMR (150 MHz, CD₃OD) δ 140.0 (C-1), 130.0 (C-2,6), 129.4 (C-3,5), 127.2 (C-4), 37.3 (C-7), 71.8 (C-8), 104.5 (C-1'), 75.1 (C-2'), 78.1 (C-3'), 71.6 (C-4'), 76.8 (C-5'), 68.1

(C-6'), 102.2 (C-1''), 72.2 (C-2''), 72.4 (C-3''), 74.0 (C-4''), 69.8 (C-5''), 18.0 (C-6'')。以上数据与文献^[24]报道基本一致, 故鉴定化合物为 Phenethyl rutinoside。

化合物 13: 白色粉末。ESI-MS: 479.3 [M+H]⁺。¹H NMR (600 MHz, CD₃OD) δ 7.56 (1H, *d*, *J* = 15.9 Hz, H-7'), 7.03 (1H, *d*, *J* = 1.5 Hz, H-2'), 6.88 (1H, *dd*, *J* = 8.2, 1.6 Hz, H-6'), 6.77 (1H, *d*, *J* = 8.2 Hz, H-5'), 6.67 (1H, *d*, *J* = 1.4 Hz, H-2), 6.63 (1H, *d*, *J* = 8.0 Hz, H-5), 6.53 (1H, *dd*, *J* = 8.0, 1.4 Hz, H-6), 6.29 (1H, *d*, *J* = 15.9 Hz, H-8'), 4.50 (1H, *dd*, *J* = 11.7, 1.4 Hz, H-6''a), 4.31~4.35 (1H, *m*, H-6''b), 3.93~3.98 (1H, *m*, H-8a), 3.68~3.73 (1H, *m*, H-8b), 2.78 (2H, *t*, *J* = 7.6 Hz, H-7); ¹³C NMR (150 MHz, CD₃OD) δ 131.4 (C-1), 117.1 (C-2), 146.1 (C-3), 144.6 (C-4), 116.3 (C-5), 121.3 (C-6), 36.7 (C-7), 72.4 (C-8), 127.7 (C-1'), 115.0 (C-2'), 147.2 (C-3'), 149.6 (C-4'), 116.5 (C-5'), 123.2 (C-6'), 146.8 (C-7'), 114.8 (C-8'), 69.2 (C-9'), 104.5 (C-1''), 75.0 (C-2''), 77.9 (C-3''), 71.7 (C-4''), 75.4 (C-5''), 64.6 (C-6'')。以上数据与文献^[25]报道基本一致, 故鉴定化合物为 Calceolariolside B。

化合物 14: 黄色粉末。ESI-MS: 465.1 [M+H]⁺。¹H NMR (600 MHz, CD₃OD) δ 7.71 (1H, *s*, H-2'), 7.59 (1H, *d*, *J* = 9.6 Hz, H-6'), 6.87 (1H, *d*, *J* = 8.4 Hz, H-5'), 6.39 (1H, *s*, H-8), 6.20 (1H, *s*, H-6), 5.26 (1H, *d*, *J* = 7.7 Hz, H-1''), 3.32~3.73 (6H, *m*, H-2''~H-6''); ¹³C NMR (150 MHz, CD₃OD) δ 158.5 (C-2), 135.6 (C-3), 179.5 (C-4), 163.1 (C-5), 100.0 (C-6), 166.5 (C-7), 94.8 (C-8), 158.9 (C-9), 105.6 (C-10), 123.2 (C-1'), 116.0 (C-2'), 149.9 (C-3'), 145.9 (C-4'), 117.5 (C-5'), 123.1 (C-6'), 104.3 (C-1''), 75.7 (C-2''), 78.1 (C-3''), 71.2 (C-4''), 78.4 (C-5''), 62.5 (C-6'')。以上数据与文献^[26]报道基本一致, 故鉴定化合物为 Isoquercitrin。

2.3 化合物的 α -葡萄糖苷酶抑制活性

活性测试结果(表2)表明, 化合物 6、13 对 α -葡萄糖苷酶具有显著的抑制活性, 其 IC₅₀ 分别为 4.27 μ g/mL、2.95 μ g/mL, 活性优于阳性药阿卡波糖(IC₅₀为 6.02 μ g/mL)。化合物 2、7、10、14 对 α -葡萄糖苷酶具有一定的抑制活性, 其 IC₅₀ 分别为 17.48、35.62、35.79、44.78 μ g/mL。

Ouyang 等^[27]对八月瓜叶子进行化学成分和 α -葡萄糖苷酶抑制活性研究, 发现 Akebiaoside C, 2 α ,3 β -Dihydrox-yolean-13(18)-en-28-oic Acid, Mesembryanthemoidigenic Acid, Gypsogenic Acid,

Akebonoic Acid 五个三萜类化合物在体外表现出显著 α -葡萄糖苷酶抑制活性, IC_{50} 分别为 9.75、8.91、19.82、39.37、3.96 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 。

表 2 各单体化合物对 α -葡萄糖苷酶的半数抑制率

Table 2 The half inhibition rate of compounds 1~14 on α -glucosidase ($x \pm s$, $n=3$)

序号	样品名称	$IC_{50}/(\mu\text{g}/\text{mL})$
1	Hederacholichiside F	>500
2	Saponin E	17.48 \pm 0.98
3	Mutong Sponin B	>500
4	Saponin PJ ₁	>500
5	Saponin PH	>500
6	Yuzhizioside IV	4.27 \pm 0.30
7	Akebia Saponin D	35.62 \pm 0.91
8	Saponin B	>500
9	HN-Saponin F	>500
10	Yuzhizioside IVa	35.79 \pm 0.68
11	Icariside D	>500
12	Phenethyl rutinoside	>500
13	Calceolariolside B	2.95 \pm 0.51
14	Isoquercitrin	44.78 \pm 3.46
15	阿卡波糖	6.02 \pm 0.31

与本研究结果共同提示八月瓜中三萜及其皂苷类成分可能为其抑制 α -葡萄糖苷酶的主要活性成分, 对抑制或减缓糖尿病的出现具有积极的作用。

3 结论

本实验研究了八月瓜种子的化学成分及其 α -葡萄糖苷酶活性抑制能力。从八月瓜种子水提物和 $\varphi=95\%$ 乙醇提取物的各萃取部位中发现乙醇提取物的正丁醇萃取部位为 α -葡萄糖苷酶活性抑制部位。从活性部位中分离得到 14 个化合物, 其中多为三萜皂苷类化合物, 提示八月瓜种子中三萜及其皂苷类为主要成分。通过体外 α -葡萄糖苷酶活性抑制测试, 化合物 2、7、10、14 对 α -葡萄糖苷酶具有一定程度的抑制活性, 化合物 6、13 的抑制活性最为显著, 其 IC_{50} 分别为 4.27、2.95 $\mu\text{g}/\text{mL}$, 活性优于阳性药阿卡波糖 (IC_{50} 为 6.02 $\mu\text{g}/\text{mL}$), 为八月瓜种子中 α -葡萄糖苷酶抑制活性物质, 后续可继续探究其作用机制。该研究丰富了八月瓜种子的化学成分, 为八月瓜种子作为天然 α -葡萄糖苷酶抑制剂的来源提供科学依据, 为后续以八月瓜种子为原料开发食用 α -葡萄糖苷酶抑制剂提供理论基础。

参考文献

- [1] BERBUDI A, RAHNADIKA N, TJAHLADI A I, et al. Type 2 Diabetes and its impact on the immune system [J]. Current Diabetes Reviews, 2020, 16(5): 442-449.
- [2] PAPPACHAN J M, FERNANDEZ C J, CHACKO E C. Diabetes and antidiabetic drugs [J]. Molecular Aspects of Medicine, 2019, 66: 3-12.
- [3] HOLT RIG, DEVRIES JH, HESS-FISCHL A, et al. The management of type 1 diabetes in adults. A consensus report by the American Diabetes Association (ADA) and the European Association for the Study of Diabetes (EASD) [J]. Diabetologia, 2021, 64(12): 2609-2652.
- [4] TSOUTSOUKI J, WUNNA W, CHOWDHURY A, et al. Advances in the management of diabetes: therapies for type 2 diabetes [J]. Postgraduate Medical Journal, 2020, 96(1140): 610-618.
- [5] KHALAJI A, BEHNOUSH A H, SAEEDIAN B, et al. Endocan in prediabetes, Diabetes, and Diabetes-related complications: a systematic review and meta-analysis [J]. Diabetol Metab Syndr, 2023, 15(1): 102.
- [6] AGRAWAL N, SHARMA M, SINGH S, et al. Recent advances of α -Glucosidase inhibitors: a comprehensive review [J]. Current Topics in Medicinal Chemistry, 2022, 22(25): 2069-2086.
- [7] 中国科学院《中国植物志》委员会.中国植物志 (第29卷) [M]北京:科学出版社,2001.
- [8] WANG L, DENG H G, QU X F, et al. Determining the impact of key climatic factors on geographic distribution of wild Akebia trifoliata [J]. Ecological Indicators, 2020, 112(6): 106093.
- [9] 国家药典委员会.中华人民共和国药典[M].北京:中国医药科技出版社,2020.
- [10] 周向文,王艳,王娜.预知子的化学成分和药理作用研究进展[J].中南药学,2021,19(4):691-696.
- [11] MACIAG D, DOBROWOLSKA E, SHARAFAN M, et al. Akebia quinata and Akebia trifoliata-a review of phytochemical composition, ethnopharmacological approaches and biological studies [J]. Journal of Ethnopharmacology, 2021, 280: 114486.
- [12] 罗宗洪,蔡圣宝,易俊洁.八月瓜的化学组成、抗氧化性及 α -葡萄糖苷酶活性抑制研究[J].食品与发酵工业, 2020,46(1):130-135.
- [13] JIANG Y, WU Y, YIN H, et al. Metabolic and bioactive comparative analyses reveal the mechanisms of color changes in Akebia trifoliata (Thunb.) Koidz fruit [J]. Scientia Horticulturae, 2022, 295: 110819.
- [14] MA S C, BUT P H, OOI E C, et al. Antiviral amentoflavone from Selaginella sinensis [J]. Biological and Pharmaceutical Bulletin, 2001, 24 (3): 311-312.

- [15] WEI Y, CHEN T, WANG S, et al. Separation of a new triterpenoid saponin together with six known ones from *Clematis tangutica* (Maxim.) Korsh and evaluation of their cytotoxic activities [J]. *Natural Product Research*, 2023, 37(3): 375-382.
- [16] 马双成,陈德昌,赵淑杰. 蒺藜子皂甙IV的结构[J]. *药学报*, 1994, 29(4): 285-289.
- [17] GAO H, WANG Z. Triterpenoid saponins and phenylethanoid glycosides from stem of *Akebia trifoliata* var. *australis* [J]. *Phytochemistry*, 2006, 67(24): 2697-2705.
- [18] 高慧敏,王智民. 白木通中一个新的三萜皂苷类化合物[J]. *药学报*, 2006, 41(9): 835-839.
- [19] 梁小飞,赵媛媛,刘小照,等. 太白榉木的化学成分分离鉴定[J]. *中国实验方剂学杂志*, 2018, 24(20): 56-61.
- [20] 王玉梅,王倩,张倩,等. 红毛七的皂苷成分研究[J]. *中南药学*, 2016, 14(1): 12-15.
- [21] 王啸洋,吴君,皇甫龙韬,等. 小花草玉梅的三萜皂苷成分鉴定及抗肿瘤活性研究[J]. *中国药房*, 2022, 33(5): 602-610.
- [22] 刘渝,汤海峰,王玉梅,等. 红毛七中一个新的羽扇豆烷型三萜皂苷[J]. *中南药学*, 2021, 19(11): 2263-2268.
- [23] 张旋,俞桂新. 黄花败酱化学成分研究[J]. *天然产物研究与开发*, 2020, 32(5): 783-791.
- [24] KIL HW, RHO T, YOON KD. Phytochemical study of Aerial parts of *lea asiatica* [J]. *Molecules*, 2019, 24(9): 1733.
- [25] 陈梦莹,李钦,韩晶晶,等. 老翘的化学成分研究[J]. *天然产物研究与开发*, 2020, 32(12): 2066-2072, 2093.
- [26] 王玉萍,史波林,刘琚琪,等. 花椒果皮正丁醇部分化学成分研究[J]. *中草药*, 2023, 54(5): 1353-1361.
- [27] OUYANG JK, DONG LM, XU QL, et al. Triterpenoids with α -glucosidase inhibitory activity and cytotoxic activity from the leaves of *Akebia trifoliata* [J]. *RSC Advances*, 2018, 8(70): 40483-40489.