

## 三七皂苷元的乙酰化结构修饰及活性研究<sup>\*</sup>

郭巍怡<sup>1</sup>, 段文越<sup>1</sup>, 邹澄<sup>1△</sup>, 赵庆<sup>2</sup>, 杨为民<sup>1</sup>, 陈晨<sup>1</sup>, 李瑞<sup>1</sup>, 黄丽<sup>1</sup>

(1. 昆明医科大学药学院暨云南省天然药物药理重点实验室, 云南 昆明 650500;

2. 云南中医学院中药学院, 云南 昆明 650500)

**摘要:** **目的** 研究三七总皂苷酸水解后得到的酰化产物的化学成分及其药理活性, 期望从中发现有活性的物质。**方法** 酸性条件下水解三七总皂苷得到酰化产物, 利用硅胶柱色谱和重结晶方法分离纯化, 通过核磁共振技术对酰化产物的结构进行鉴定, 并研究上述产物的抗肿瘤活性和血管舒张活性。**结果** 酸水解后, 分离纯化得到 7 个酰化产物, 其中 3 个化合物具有一定的抗肿瘤活性, 1 个化合物具有一定的舒张大鼠脑血管活性。**结论** 三七皂苷元的酰化衍生物具有一定的药理活性, 值得进一步研究。

**关键词:** 三七总皂苷; 酸水解; 酰化产物; 抗肿瘤活性; 血管舒张活性

**中图分类号:** R284.1

**文献标志码:** A

**文章编号:** 1000-2723(2017)03-0078-05

**DOI:** 10.19288/j.cnki.issn.1000-2723.2017.03.019

三七(*Panax notoginseng* (Burk) F.H.Chen)为五加科人参属植物, 常以干燥的根入药, 主产于云南、广西, 是我国传统珍贵药材, 也是名药“云南白药”的主要成分<sup>[1]</sup>。三七对血液和造血系统、心血管系统、脑血管系统、神经系统、免疫系统和物质代谢等多方面均具有活性, 同时还具有抗肿瘤、抗衰老和抗氧化的作用<sup>[2-10]</sup>。目前以三七为配方进入《国家基本药物目录》和《国家中药保护品种目录》的制剂达 20 余种<sup>[11]</sup>。

三七总皂苷是三七根部主要有效成分之一, 其中单体皂苷多为达玛烷型 20(S)-原人参二醇型和 20(S)-原人参三醇型, 以人参皂苷 Rg1 和人参皂苷 Rb1 为主<sup>[12]</sup>。现代药理研究表明, 其抗肿瘤活性构效关系规律为: 苷元>单糖苷>二糖苷>三糖苷>四糖苷, 原人参二醇型>原人参三醇型<sup>[13]</sup>。并且三七的研究主要集中在皂苷部分, 对苷元的研究相对较少, 因此本文采用酸水解法水解三七总皂苷, 共得到 7 个三七皂苷元的酰化产物, 分别为: 20(R)-3, 6-二乙酰化人参三醇(1); 20(R)-3-乙酰化人参二醇(2); 20(R)-3-乙酰化人参三醇(3); 20(R)-6-乙酰化人参三醇(4); 20(R)-3, 6, 12-三乙酰化原人参三醇(5); 20(R)-3-乙酰化原人参二醇(6); 20(S)-3, 6, 12-三乙酰化原人参三醇(7)。其中化合物 3、6、7 对细胞周期分裂蛋白 25B 有一定的抑制能力, 化合物 2 有一定的舒张大鼠脑血管活性。

### 1 实验仪器与材料

#### 1.1 仪器

FA2004 电子天平(上海瞬宇恒平科学仪器有限公司), BUCHI R-200 旋转蒸发仪, KQ-100 型超声清洗器(昆山市超声仪器有限公司), ML-902 型定时恒温磁力搅拌器(上海浦江分析仪器厂), SHZ-D 循环水式真空泵(巩义市裕华仪器有限公司), Bruker AV III-500 型核磁共振波谱仪(波谱数据由中国科学院昆明植物研究所测试中心测定)。

#### 1.2 试剂

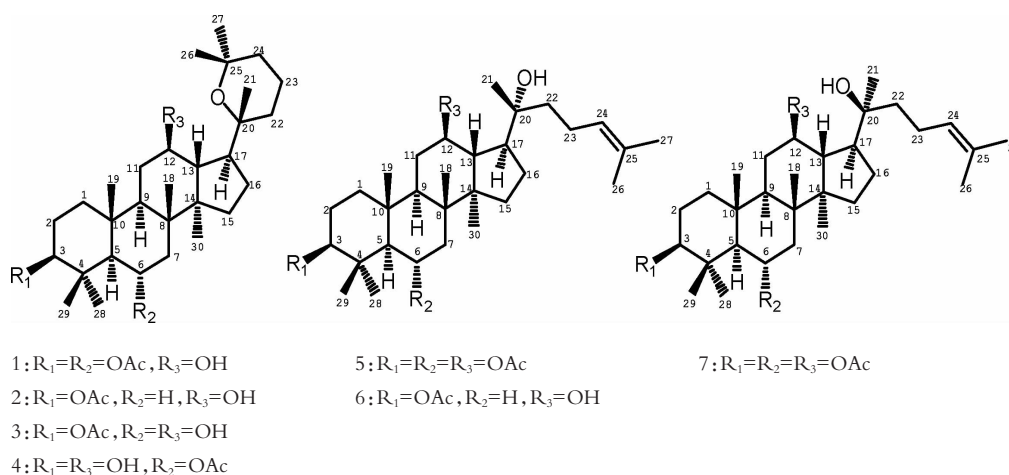
三七总皂苷购于昆明仁科商贸有限公司, 符合 2010 版国家药典标准。分析纯试剂如石油醚等购于上海晶纯生化科技股份有限公司和上海泰坦科技股份有限公司。高效硅胶 GF254(默克), 硅胶 GF254(青岛海洋化工厂), 正相柱色谱用硅胶(40~45μm)(青岛海洋化工厂)。

<sup>\*</sup> 基金项目: 国家自然科学基金(81160388)

收稿日期: 2017-04-28

作者简介: 郭巍怡(1993-), 女, 内蒙古兴安人, 在读硕士研究生, 主要从事天然药物化学研究。

△通信作者: 邹澄, E-mail: zouchengkm@126.com



## 2 方法

采用文献[14]中所用方法,称取三七总皂苷 1kg,每 100g 三七总皂苷中缓慢加入 36.5%浓盐酸 500mL,在室温条件下,置于带有磁力搅拌器的装置中搅拌 24h 后,减压抽滤得到固体粗产物 450g。固体粗产物(450g)经正相硅胶柱(6.0kg, 12×150cm)层析,石油醚—乙酸乙酯(10:0→10:1→5:1→5:2→5:3→5:4→5:5→0:10, v/v)梯度洗脱,硅胶 TLC 检测合并相同流分,得到 8 个流分(I—VIII)。流分 IV 和流分 V 经反复硅胶柱层析(石油醚—乙酸乙酯系统)和丙酮重结晶方法处理后得到化合物 1—7。

## 3 产物的波谱数据

化合物 1: 白色粉末, 分子式为  $C_{34}H_{56}O_6$ ,  $^1H-NMR$  ( $CDCl_3$ , 500 MHz) 谱:  $\delta$  5.34 (1H, m, H-6), 4.45 (1H, dd,  $J=5.0, 11.5$  Hz, H-3), 3.53 (1H, m, H-12), 2.05 (3H, br.s, H-3'), 2.03 (3H, br.s, H-6'), 1.26 (3H, br.s, H-28), 1.21 (3H, br.s, H-21), 1.17 (3H, br.s, H-26), 1.11 (3H, br.s, H-27), 1.02 (3H, br.s, H-18), 1.01 (3H, br.s, H-29), 0.91 (3H, br.s, H-19), 0.89 (3H, br.s, H-30)。

$^{13}C$  NMR ( $CDCl_3$ , 125 MHz)  $\delta$ : 171.02 (C-1'), 170.22 (C-1''), 80.31 (C-3), 76.62 (C-20), 73.17 (C-25), 70.69 (C-6), 69.65 (C-12), 58.71 (C-5), 54.63 (C-17), 51.04 (C-14), 49.31 (C-9), 48.75 (C-13), 42.53 (C-7), 40.74 (C-8), 39.29 (C-4), 38.19 (C-1), 37.71 (C-10), 36.42 (C-24), 35.70 (C-22), 33.03 (C-26), 31.09 (C-15), 30.35 (C-11), 30.30 (C-28), 27.14 (C-27), 25.11 (C-16), 23.29 (C-2), 22.04 (C-2''), 21.31 (C-2'), 19.41

(C-21), 17.16 (C-30), 17.00 (C-19), 16.84 (C-18), 16.75 (C-23), 将其波谱数据与文献[15]中相关化合物的数据对比基本一致, 鉴定该化合物为 20(R)-3,6-二乙酰化人参三醇。

化合物 2: 白色粉末, 分子式为  $C_{32}H_{54}O_4$ ,  $^1H-NMR$  ( $CDCl_3$ , 500 MHz) 谱:  $\delta$  4.47 (1H, dd,  $J=5.0, 11.5$  Hz, H-3), 3.52 (1H, m, H-12), 2.04 (3H, br.s, H-3'), 1.26 (3H, br.s, H-26), 1.21 (3H, br.s, H-27), 1.17 (3H, br.s, H-21), 0.97 (3H, br.s, H-29), 0.90 (3H, br.s, H-18), 0.87 (3H, br.s, H-19), 0.84 (3H, br.s, H-30)。

$^{13}C$  NMR ( $CDCl_3$ , 125 MHz)  $\delta$ : 171.01 (C-1'), 80.86 (C-3), 76.63 (C-20), 73.08 (C-25), 69.86 (C-12), 55.94 (C-5), 54.71 (C-17), 51.19 (C-14), 49.83 (C-9), 49.14 (C-13), 39.79 (C-8), 38.56 (C-1), 37.84 (C-4), 37.03 (C-10), 36.43 (C-24), 35.73 (C-22), 34.79 (C-7), 33.02 (C-26), 31.11 (C-15), 30.55 (C-11), 27.97 (C-28), 27.12 (C-27), 25.15 (C-16), 23.72 (C-2), 21.33 (C-2'), 19.41 (C-21), 18.19 (C-6), 17.02 (C-30), 16.46 (C-19), 16.27 (C-23), 16.18 (C-18), 将其波谱数据与文献[16]中相关化合物的数据对比基本一致, 鉴定该化合物为 20(R)-3-乙酰化人参二醇。

化合物 3: 白色粉末, 分子式为  $C_{32}H_{54}O_5$ ,  $^1H-NMR$  ( $CDCl_3$ , 500 MHz) 谱:  $\delta$  4.44 (1H, dd,  $J=5.0, 11.5$  Hz, H-3), 3.53 (1H, m, H-12), 2.06 (3H, br.s, H-3'), 1.26 (3H, br.s, H-28), 1.21 (3H, br.s, H-21), 1.17 (3H, br.s, H-26), 1.16 (3H, br.s, H-27), 1.06 (3H, br.s, H-29), 0.95 (3H, br.s, H-19),

0.90 (3H, br.s, H-30)。

$^{13}\text{C}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ , 125 MHz)  $\delta$ : 171.08 (C-1'), 80.67 (C-3), 76.61 (C-20), 73.16 (C-25), 69.73 (C-12), 68.55 (C-6), 61.22 (C-5), 54.66 (C-17), 51.00 (C-14), 49.32 (C-9), 48.78 (C-13), 47.16 (C-7), 40.99 (C-8), 39.05 (C-4), 38.34 (C-10), 38.19 (C-1), 36.42 (C-24), 35.71 (C-22), 33.04 (C-26), 31.10 (C-15), 30.66 (C-28), 30.42 (C-11), 27.14 (C-27), 25.13 (C-16), 23.41 (C-2), 21.35 (C-2'), 19.40 (C-21), 17.26 (C-30), 17.17 (C-19), 17.01 (C-18), 16.58 (C-29), 16.26 (C-23), 将其波谱数据与文献[15]中相关化合物的数据对比基本一致, 鉴定该化合物为 20(R)-3-乙酰化人参三醇。

化合物 4: 白色粉末, 分子式为  $\text{C}_{32}\text{H}_{54}\text{O}_5$ ,  $^1\text{H}$ -NMR ( $\text{CDCl}_3$ , 500 MHz) 谱:  $\delta$  5.34 (1H, m, H-6), 3.52 (1H, m, H-12), 3.18 (1H, dd,  $J=5.0, 11.5$  Hz, H-3), 2.04 (3H, br.s, H-6'), 1.27 (3H, br.s, H-28), 1.21 (3H, br.s, H-21), 1.17 (3H, br.s, H-26), 1.17 (3H, br.s, H-27), 1.11 (3H, br.s, H-18), 0.98 (3H, br.s, H-29), 0.89 (3H, br.s, H-19), 0.83 (3H, br.s, H-30)。

$^{13}\text{C}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ , 125 MHz)  $\delta$ : 170.28 (C-1'), 78.30 (C-19), 76.64 (C-20), 73.16 (C-25), 70.95 (C-6), 69.70 (C-12), 58.68 (C-5), 54.64 (C-17), 51.08 (C-14), 49.39 (C-9), 48.75 (C-13), 42.58 (C-7), 40.78 (C-8), 39.42 (C-4), 38.81 (C-10), 38.56 (C-10), 36.44 (C-24), 35.71 (C-22), 33.04 (C-26), 31.12 (C-15), 30.45 (C-28), 30.36 (C-11), 27.13 (C-27), 27.09 (C-2), 25.13 (C-16), 22.09 (C-2'), 19.41 (C-21), 17.09 (C-30), 17.03 (C-19), 16.83 (C-18), 16.26 (C-23), 15.61 (C-29), 将其波谱数据与文献[15]中相关化合物的数据对比基本一致, 鉴定该化合物为 20(R)-6-乙酰化人参三醇。

化合物 5: 白色粉末, 分子式为  $\text{C}_{36}\text{H}_{58}\text{O}_7$ ,  $^1\text{H}$ -NMR ( $\text{CDCl}_3$ , 500 MHz) 谱:  $\delta$  5.34 (1H, m, H-6), 5.05 (1H, m, H-24), 4.90 (1H, m, H-12), 4.45 (1H, dd,  $J=5.0, 11.5$  Hz, H-3), 2.20 (3H, br.s, H-3'), 2.04 (3H, br.s, H-6'), 1.90 (3H, br.s, H-12'), 1.16 (3H, br.s, H-27), 1.02 (3H, br.s, H-18), 1.00 (3H,

br.s, H-29), 0.95 (3H, br.s, H-19), 0.91 (3H, br.s, H-30)。

$^{13}\text{C}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ , 125 MHz)  $\delta$ : 170.91 (C-1'), 170.50 (C-1''), 170.22 (C-1'''), 137.94 (C-25), 123.48 (C-24), 80.05 (C-3), 73.83 (C-12), 70.95 (C-20), 70.35 (C-6), 58.59 (C-5), 50.80 (C-14), 49.66 (C-17), 49.23 (C-9), 46.46 (C-13), 45.86 (C-22), 42.39, (C-7), 40.84 (C-8), 39.35 (C-4), 38.27 (C-1), 37.74 (C-10), 32.55 (C-26), 32.27 (C-21), 31.94 (C-15), 30.31 (C-28), 28.36 (C-11), 28.14 (C-16), 23.87 (C-2), 23.16 (C-23), 22.02 (C-2''), 21.29 (C-2'''), 21.15 (C-2'), 17.17 (C-27), 16.84 (C-30), 16.80 (C-19), 16.68 (C-18), 12.21 (C-29), 将其波谱数据与文献[17]中相关化合物的数据对比基本一致, 鉴定该化合物为 20(R)-3, 6, 12-三乙酰化原人参三醇。

化合物 6: 白色粉末, 分子式为  $\text{C}_{32}\text{H}_{54}\text{O}_4$ ,  $^1\text{H}$ -NMR ( $\text{CDCl}_3$ , 500 MHz) 谱:  $\delta$  5.15 (1H, m, H-24), 4.48 (1H, dd,  $J=5.0, 11.5$  Hz, H-3), 3.61 (1H, m, H-12), 2.04 (3H, br.s, H-3'), 1.14 (3H, br.s, H-27), 0.99 (3H, br.s, H-29), 0.91 (3H, br.s, H-19), 0.89 (3H, br.s, H-30)。

$^{13}\text{C}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ , 125 MHz)  $\delta$ : 171.03 (C-1'), 132.37 (C-25), 124.47 (C-24), 80.80 (C-3), 70.71 (C-12), 55.93 (C-5), 51.60 (C-14), 49.91 (C-17), 49.86 (C-9), 48.59 (C-13), 42.24 (C-22), 39.76 (C-8), 38.61 (C-1), 37.86 (C-4), 37.02 (C-10), 34.70 (C-7), 31.15 (C-15), 27.99 (C-28), 26.35 (C-16), 25.79 (C-26), 23.67 (C-2), 22.04 (C-23), 21.91 (C-21), 21.34 (C-2'), 18.17 (C-6), 17.78 (C-27), 17.08 (C-30), 16.49 (C-19), 16.19 (C-18), 15.65 (C-29), 将其波谱数据与文献[17]中相关化合物的数据对比基本一致, 鉴定该化合物为 20(R)-3-乙酰化原人参二醇。

化合物 7: 白色粉末, 分子式为  $\text{C}_{36}\text{H}_{58}\text{O}_7$ ,  $^1\text{H}$ -NMR ( $\text{CDCl}_3$ , 500 MHz) 谱:  $\delta$  5.34 (1H, m, H-6), 5.08 (1H, m, H-24), 4.92 (1H, m, H-12), 4.45 (1H, dd,  $J=5.0, 11.5$  Hz, H-3), 2.16 (3H, br.s, H-3'), 2.04 (3H, br.s, H-6'), 1.89 (3H, br.s, H-12'), 1.20 (3H, br.s, H-28), 1.16 (3H, br.s, H-27), 1.02 (3H, br.s, H-18), 1.00 (3H, br.s, H-29), 0.95 (3H, br.s,

H-19), 0.90 (3H, br.s, H-30)。

$^{13}\text{C}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ , 125 MHz)  $\delta$ : 170.91 (C-1'), 170.49 (C-1''), 170.23 (C-1'''), 137.48 (C-25), 124.45 (C-24), 80.05 (C-3), 73.85 (C-12), 70.95 (C-20), 70.36 (C-6), 58.58 (C-5), 50.80 (C-14), 49.66 (C-17), 49.24 (C-9), 46.46 (C-13), 43.63 (C-22), 42.39 (C-7), 40.84 (C-8), 39.35 (C-4), 38.26 (C-1), 37.73 (C-10), 31.94 (C-15), 30.31 (C-26), 29.28 (C-21), 29.20 (C-28), 28.38 (C-11), 28.13 (C-16), 23.16 (C-2), 23.01 (C-23), 22.02 (C-2''), 21.29 (C-2'''), 21.13 (C-2'), 17.17 (C-27), 16.84 (C-30), 16.80 (C-19), 16.67 (C-18), 12.20 (C-29), 将其波谱数据与文献[17]中相关化合物的数据对比基本一致, 鉴定该化合物为 20(S)-3,6,12-三乙酰化原人参三醇。

#### 4 药理活性研究

细胞周期分裂蛋白 25B (cell division cycle 25 homolog B, CDC25B) 是 CDC25 磷酸酯酶家族的一员。CDC25B 具有原癌基因性质, 能够激活细胞周期蛋白依赖激酶 CDC2, 是有丝分裂的必需物质, 因此寻找特异高效的抑制剂为癌症研究提供了新的工具和手段。此部分活性测试在国家新药筛选中心进行, 采用荧光底物 OMFP, 经 CDC25B 去磷酸化后得到的产物 OMF 在被 485nm 激发光激发后可发射出波长为 535nm 的可检测的荧光信号, 从而观察酶的活性变化以及化合物对其的抑制情况。测试结果表明化合物 3、6、7 对细胞周期分裂蛋白 25B 具有一定的抑制活性。结果如表 1 所示。

表 1 化合物对细胞周期分裂蛋白 25B 的抑制活性

| 化合物编号 | 浓度                         | 类型          | 单位      | 结果    |
|-------|----------------------------|-------------|---------|-------|
| 1     | 20 $\mu\text{g}/\text{mL}$ | %Inhibition | Percent | 4.71  |
| 2     | 20 $\mu\text{g}/\text{mL}$ | %Inhibition | Percent | 30.39 |
| 3     | 20 $\mu\text{g}/\text{mL}$ | %Inhibition | Percent | 69.26 |
| 4     | 20 $\mu\text{g}/\text{mL}$ | %Inhibition | Percent | 31.75 |
| 5     | 20 $\mu\text{g}/\text{mL}$ | %Inhibition | Percent | 42.01 |
| 6     | 20 $\mu\text{g}/\text{mL}$ | %Inhibition | Percent | 95.86 |
| 7     | 20 $\mu\text{g}/\text{mL}$ | %Inhibition | Percent | 84.36 |

注: 抑制率 %Inhibition 大于 50 时, 认为有一定程度的抑制活性

血管舒张活性在昆明医科大学进行, 利用 Wire Myograph System DMT 血管张力测定仪, 检测 7 个化

合物对大鼠脑基底动脉 BA 的血管张力的影响, 结果显示化合物 2 具有一定的舒张血管的活性, 结果如表 2 所示。

表 2 化合物对大鼠脑基底动脉 BA 的血管舒张活性

| 化合物编号 | 加样终浓度 ( $\mu\text{M}$ ) | 相对张力值 (% of 60mM $\text{K}^+$ ) |
|-------|-------------------------|---------------------------------|
| 1     | 400                     | 75.30                           |
| 2     | 400                     | 49.58                           |
| 3     | 400                     | 79.16                           |
| 4     | 400                     | 89.97                           |
| 5     | 400                     | 86.86                           |
| 6     | 400                     | 80.81                           |
| 7     | 400                     | 65.57                           |

注: 相对张力值小于 50% 时, 认为有一定程度的血管舒张活性

#### 5 结果与讨论

酰化产物常作为药物的中间体, 而且引入乙酰基有利于提高药物的疗效、降低药物的毒性、改变异味、增强水溶性等<sup>[18]</sup>。本文通过水解三七总皂苷得到的 7 个酰化产物, 其药理活性表明: 这些化合物中化合物 3、6、7 对细胞周期分裂蛋白 25B 有一定的抑制活性, 化合物 2 还具有一定程度的舒张大鼠脑血管作用, 为深入研究抗肿瘤活性和血管舒张作用提供了理论基础。三七总皂苷丰产易得, 酸水解三七总皂苷得到系列酰化产物为进一步研究三七的药理活性和三七的深入开发提供了物质基础<sup>[19]</sup>。

#### 参考文献:

- [1] 杨志刚, 陈阿琴, 俞颂东. 三七药理研究新进展[J]. 上海中医药杂志, 2005, 39(4): 59-62.
- [2] 刘东平, 杨军, 丁丹. 三七及其有效成分对血液系统的药理活性研究概况 [J]. 中医药信息, 2012, 29(4): 172-174.
- [3] 徐辉. 三七总皂苷对心血管系统的影响及作用机制 [J]. 现代中西医结合杂志, 2006, 15(19): 2720-2722.
- [4] 俞恩珠. 三七总皂苷对心脑血管系统的药理作用 [J]. 浙江中西医结合杂志, 2000, 10(4): 253-254.
- [5] 苏萍, 王蕾, 杜仕静, 等. 三七皂苷对神经系统疾病药理作用机制研究进展 [J]. 中国中药杂志, 2014, 39(23): 4516-4521.
- [6] 杨志刚. 中药三七对神经系统和免疫系统的影响 [J]. 中国药房, 2008, 19(18): 1424-1426.
- [7] 陈艳进, 王宇光, 马增春, 等. 三七总皂苷对大鼠肝脏

- 药物代谢酶活性、mRNA 及蛋白表达的影响 [J]. 中国中药杂志, 2014, 39(19): 3824-3828.
- [8] 李元青, 马成杰, 陈信义. 三七活性成分抗肿瘤作用及其免疫学机制初探[J]. 北京中医药大学学报(中医临床版), 2008, 15(1): 17-19.
- [9] 谢甦, 李丽红, 李丽. 三七总皂苷抗衰老的实验研究[J]. 世界中西医结合杂志, 2008, 3(2): 86-88.
- [10] 张嘉麟, 徐文安, 杨荫康, 等. 三七中人参皂甙对老年鼠血液中抗氧化酶活力影响的研究 [J]. 昆明医学院学报, 2000, 21(2): 63-65.
- [11] 夏鹏国, 张顺仓, 梁宗锁, 等. 三七化学成分的研究历程和概况[J]. 中草药, 2014, 45(17): 2564-2570.
- [12] 鲍建才, 刘刚, 丛登立, 等. 三七的化学成分研究进展[J]. 中成药, 2006, 28(2): 246-253.
- [13] 窦德强, 靳玲, 陈英杰. 人参的化学成分及药理活性的研究进展与展望 [J]. 沈阳药科大学学报, 1999, 16(2): 151-156.
- [14] Shibata S, Tanaka O, Ando T, et al. Chemical studies on oriental plant drugs. XIV. Protopanaxadiol, a genuine sapogenin of ginseng saponins[J]. Chem pharm Bull(Tokyo), 1966, 14(6): 595-600.
- [15] 马丽媛, 杨秀伟. 人参茎叶总皂苷酸水解产物化学成分研究[J]. 中草药, 2015, 46(17): 2522-2533.
- [16] 杨延武, 何炳林, 许肖龙, 等. 二维核磁共振波谱归属人参二醇的 NMR 谱线 [J]. 波谱学杂志, 1994, 11(4): 427-429.
- [17] 滕荣伟, 李海舟, 王德祖, 等. 三个原人参二醇型单糖链配糖体的 NMR 信号全指定 [J]. 波谱学杂志, 2000, 17(6): 461-468.
- [18] 张惠珍. 酰化反应对药物的修饰研究[J]. 山东教育学院学报, 2003, 18(2): 75-76.
- [19] 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(3): 135-137.

(编辑:徐建平)

### Acetylation Structure Modification of Sapogenins of *Panax Notoginseng* Saponins and Activity Researches of the Products

GUO Weiyi<sup>1</sup>, DUAN Wenyue<sup>1</sup>, ZOU Cheng<sup>1</sup>, ZHAO Qing<sup>2</sup>, YANG Weimin<sup>1</sup>,  
CHEN Chen<sup>1</sup>, LI Rui<sup>1</sup>, HUANG Li<sup>1</sup>

(1. School of Pharmaceutical Sciences & Yunnan Key Laboratory of Pharmacology for Natural Products,  
Kunming Medical University, Kunming 650500, China;

2. School of Chinese Medicine, Yunnan University of Traditional Chinese Medicine, Kunming 650500, China)

**ABSTRACT: Objective** To study the chemical constituents and pharmacological activities of acylation products of acid hydrolysis of *Panax notoginseng* saponins and to find active substances. **Methods** Under acidic condition, *Panax notoginseng* saponins were hydrolyzed to obtain the acylation products. The compounds were isolated and purified by silica gel column chromatography and recrystallization, and the structures of the acylated products were identified by NMR, and study the antitumor activity and vasodilation activity of the products. **Results** After acid hydrolysis, seven acylated products were obtained, three compounds have some antitumor activity, one compound has some vasodilation of rat brain. **Conclusions** Acylated derivatives of sapogenins of *Panax notoginseng* saponins have certain pharmacological activity and were worthy of further study.

**KEY WORDS:** *Panax notoginseng* saponins; acid hydrolysis; acylate; antitumor activity; vasodilator activity