

白木香的化学成分与生物活性研究进展

李薇, 梅文莉, 左文健, 王昊, 戴好富^{*}

(中国热带农业科学院热带生物技术研究所, 农业部热带作物生物学与遗传资源利用重点实验室, 海南省黎药资源天然产物研究与利用重点实验室, 海口 571101)

摘要: 白木香(*Aquilaria sinensis*)的化学成分主要包括黄酮、苯甲酮、木脂素、苯丙素、萜类、生物碱、甾体以及其他酚性化合物,一些化学成分具有抗肿瘤、抗菌、抗炎、镇痛、利泄、降糖等生物活性。对近年来从白木香中分离鉴定出的化学成分,以及部分化学成分的生物活性进行了综述,为白木香资源的合理开发利用提供科学依据。

关键词: 白木香; 化学成分; 生物活性; 研究进展

doi: 10.3969/j.issn.1005-3395.2014.02.015

Advances in Chemical Constituents and Biological Activities from *Aquilaria sinensis*

LI Wei, MEI Wen-li, ZUO Wen-jian, WANG Hao, DAI Hao-fu^{*}

(Key Laboratory of Biology and Genetic Resources of Tropical Crops, Ministry of Agriculture, Institute of Tropical Bioscience and Biotechnology, Chinese Academy of Tropical Agricultural Sciences, Hainan Key Laboratory for Research and Development of Natural Products from Li Folk Medicine, Haikou 571101, China)

Abstract: The chemical constituents of *Aquilaria sinensis* mainly include flavonoids, benzophenones, lignans, phenylpropanoids, terpenoids, alkaloids, steroids, phenolic compounds. Some of them have anti-tumor, anti-bacterial, anti-inflammatory, analgesic, and laxative activities. The chemical constituents isolated from *A. sinensis* were reviewed, and the biological activities of some compounds were also introduced. These would provide scientific basis for development and utilization of *A. sinensis*.

Key words: *Aquilaria sinensis*; Chemical constituent; Biological activity; Review

白木香[*Aquilaria sinensis* (Lour.) Gilg.]又名土沉香、牙香树、女儿香、莞香,为瑞香科(Thymelaeaceae)沉香属植物,是我国特有的一种热带亚热带常绿乔木。白木香的主要产地为广东、海南、广西、福建等省区^[1]。自20世纪80年代以来,我国学者就对白木香化学成分进行了研究,主要集中于产香的树脂芯材部位,即沉香。沉香是健康的白木香树受到自然因素(雷劈、火烧、微生物入侵等)或人为因素(砍伤、打洞、接菌等)的作用而渐渐形成的,其

化学成分主要包括倍半萜类和2-(2-苯乙基)色酮类^[2-3]。对白木香的花、果实、果皮、叶、树干等部位的化学成分及生物活性进行研究始于2008年,主要有黄酮、苯甲酮、木脂素、苯丙素、萜类、生物碱、甾体及其他酚性化合物等化学成分,与沉香的化学成分^[3-4]有很大的不同。白木香具有一定的抗肿瘤^[5-8]、抗菌^[9-10]、镇痛抗炎^[11-12]、利泄^[13]、降糖^[14]等功能。本文综述白木香的化学成分及其生物活性的研究进展,为白木香资源的合理开发利用提供科学

收稿日期: 2013-08-21

接受日期: 2013-11-05

基金项目: 公益性行业(农业)科研专项(201303117); 国家科技支撑计划项目(2013BAI11B04); 2012海南省国际科技合作项目(2012-GH001)资助
作者简介: 李薇(1988~),女,硕士研究生,从事天然产物化学研究。E-mail: 339567149@qq.com

* 通讯作者 Corresponding author. E-mail: daihaofu@itbb.org.cn

依据。

1 化学成分研究

对白木香化学成分的研究主要始于2008年,虽然起步较晚,但仍然取得了较大的进展。目前已从白木香中分离得到116个化合物,包括黄酮类、苯甲酮类、吡酮类、木脂素类、苯丙素类、萜类、甾体类、生物碱类、简单酚类以及其它类型。

1.1 黄酮类

黄酮类成分在白木香的叶、果实以及树干中均有分布,是白木香中一类主要的成分,目前已从白木香中分离鉴定出31个黄酮类化合物(图1和表1:化合物1~31,下同)。据报道,其中黄酮苷白木香苷A₁(12)和aquisiflavoside(22)有一氧化氮(NO)抑制活性^[15~16],5-O-methylapigenin 7-O-β-D-glucoside(21)有抗炎活性^[12]。

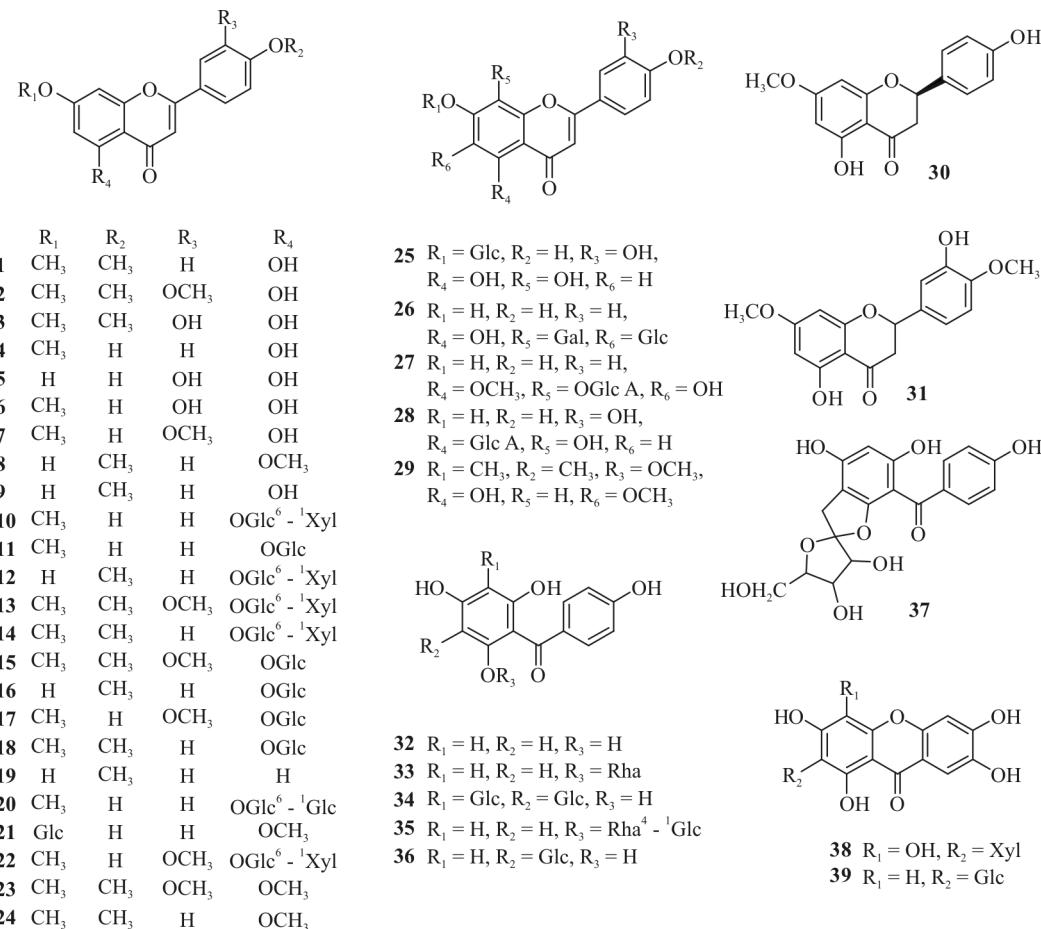


图1 化合物1~39的结构

Fig. 1 Structures of compounds 1~39

1.2 苯甲酮类

苯甲酮类化合物在白木香中相对较少,目前仅从白木香叶中分离得到6个苯甲酮类化合物(32~37)^[7,12~13,17],其中鸢尾酚酮(32)有抑制中性粒细胞呼吸爆发的作用^[12]。

1.3 吡酮类

目前在白木香中只报道了两个吡酮类化合物: aquilarixanthone(38)^[17]和芒果苷(39)^[12,17]。据报道芒果苷(39)有抑制中性粒细胞呼吸爆发的作用^[12]。

1.4 木脂素类

木脂素类成分在白木香未结香的树干部位有较为广泛的分布,目前已从白木香中分离得到21个木脂素类化合物^[18~21],且具有多种骨架类型,如四氢呋喃类(图2和表1:化合物40~52)、联苯四氢萘类(化合物53~54)、苯骈呋喃类(化合物55)、降木脂素(化合物56)^[20]及4个其他类木脂素(化合

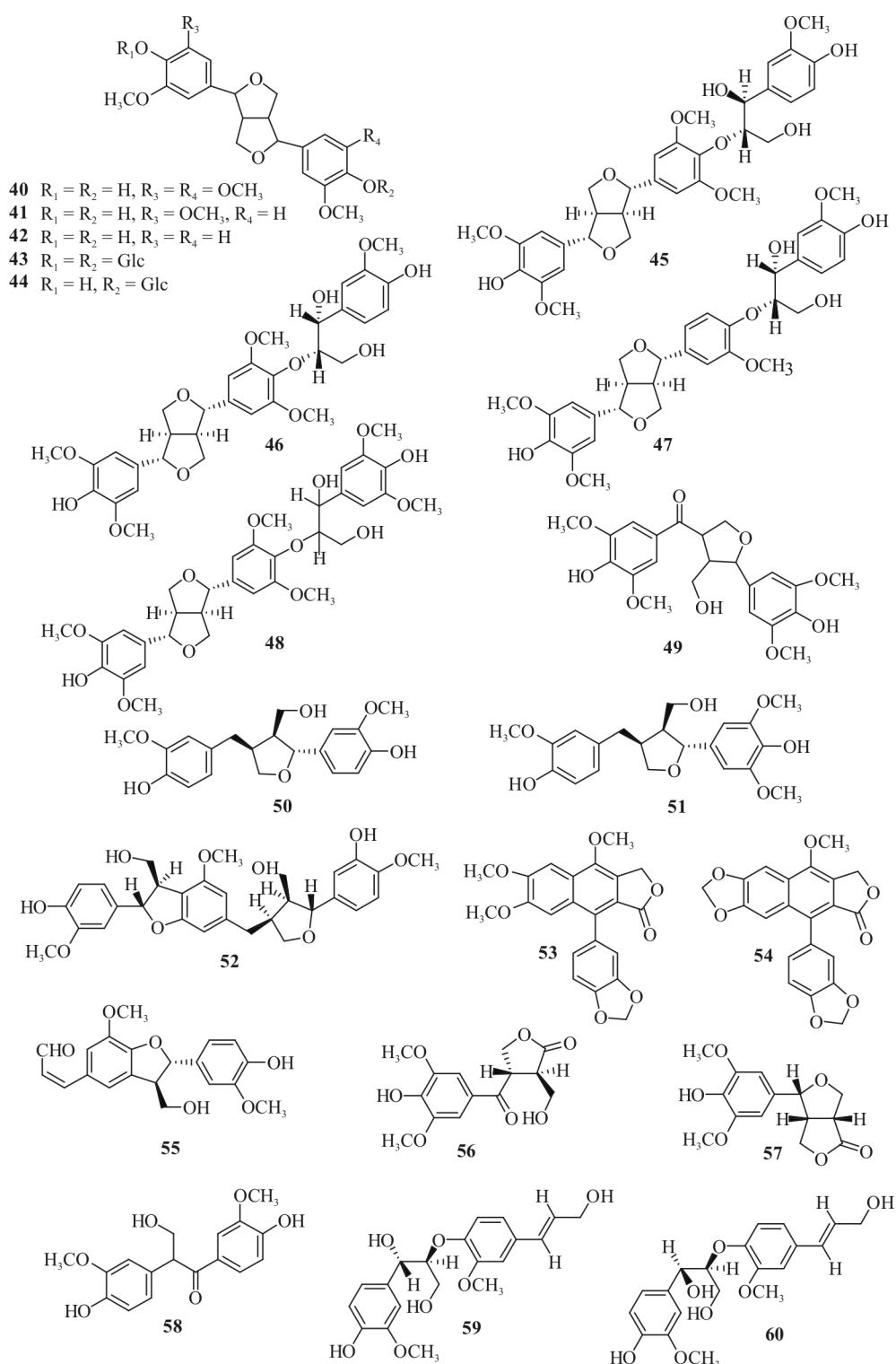


图 2 化合物 40~60 的结构

Fig. 2 Structures of compounds 40~60

物 57~60)。其中化合物 40~48 属于双四氢呋喃类,而化合物 45~48 是倍半木脂素,这也是首次从瑞香科植物中分离得到的倍半木脂素类化合物^[21]。

1.5 苯丙素与简单酚性化合物

从白木香中分离得到了 5 个苯丙素类化合物(图 3 和表 1: 61~65)^[18~19,22]和 8 个简单酚性化合物(66~73)^[7,23~24]。

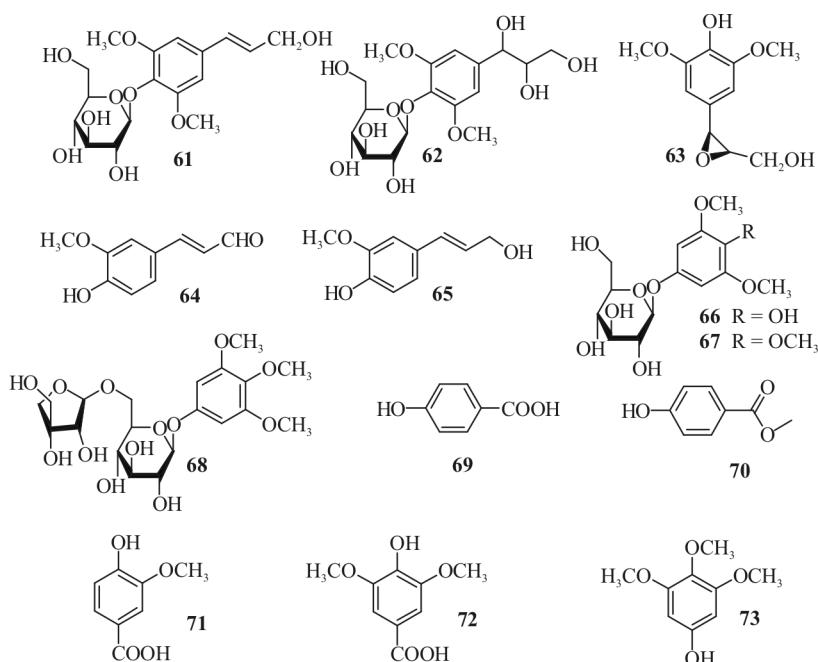


图 3 化合物 61~73 的结构

Fig. 3 Structures of compounds 61~73

1.6 菲类

目前从白木香中分离得到的菲类成分有倍半菲、二菲及三菲,没有单菲类成分。彭可等^[25]从白木香树干中分离得到 1 个降倍半菲(aquilarin B, 74)(图 4 和表 1)。二菲类成分有 5 个(化合物 75~79)^[25~26],其中化合物 76~79 为丹参酮类化合物,丹参酮类化合物具有抗肿瘤、抗菌消炎、抗过敏、调节组织修复与再生、抗脂质过氧化和清除自由基等多种药理活性^[27]。三菲类成分有 19 个(化合物 80~98)^[8,21,25~26,28]。其中化合物 80~86 为葫芦烷型四环三菲,是从白木香果实及树干中分离得到的,葫芦烷型四环三菲有保肝^[29~30]、抗炎^[31]、抗肿瘤^[32]、提高免疫力^[33~34]、抗生育^[35~36]及昆虫拒食^[37]等作用;化合物 87~89 是从叶子中分离得到的四环三菲^[28];化合物 90~98 为五环三菲,均是从白木香叶中分离得到,五环三菲具有抗肿瘤^[38~40]、抗炎抗菌^[41~43]、护肝^[44]、抗 HIV^[45~48]等作用。

1.7 龙脑类化合物

从白木香的树干、叶、树皮和果实中分离得到 6 个龙脑类成分(表 1: 化合物 99~104)^[18~19,49~50]。

1.8 生物碱及其它化合物

从白木香中分离得到 7 个生物碱类成分(图 5)

和表 1: 化合物 105~111)^[22,24,49~50];还有 5 个其它类化合物(112~116)^[24,26,49~50]。林峰等^[49]分离得到 6-羟基-2-[2-(4-羟基苯基)乙基]色原酮(113),此化合物是沉香的特征性成分,是首次从白木香植物中分离得到。

2 生物活性研究

2.1 抗菌活性

刘俊等^[9]用滤纸片琼脂扩散法,对用石油醚浸提的白木香种子挥发油进行抗耐甲氧西林金黄色葡萄球菌(MRSA)活性进行测定,结果表明白木香种子挥发油具有弱抗 MRSA 活性。李浩华等^[10]对白木香果皮的三氯甲烷提取物进行抗细菌和真菌的活性测定,结果表明提取物对金黄色葡萄球菌、枯草芽孢杆菌、铜绿假单胞菌有显著抑制作用,而对大肠杆菌则没有抑制效果;对绿色木霉、黑曲霉、黄曲霉也有明显的抑制作用。

2.2 抗肿瘤活性

王红刚等^[7]将白木香叶总提取物的石油醚、乙酸乙酯、正丁醇和水层 4 个部位分别进行抗肿瘤活性筛选,结果表明乙酸乙酯部位具有明显的抑制肿瘤细胞生长的活性,并对小鼠 H22 肝癌的肿瘤生

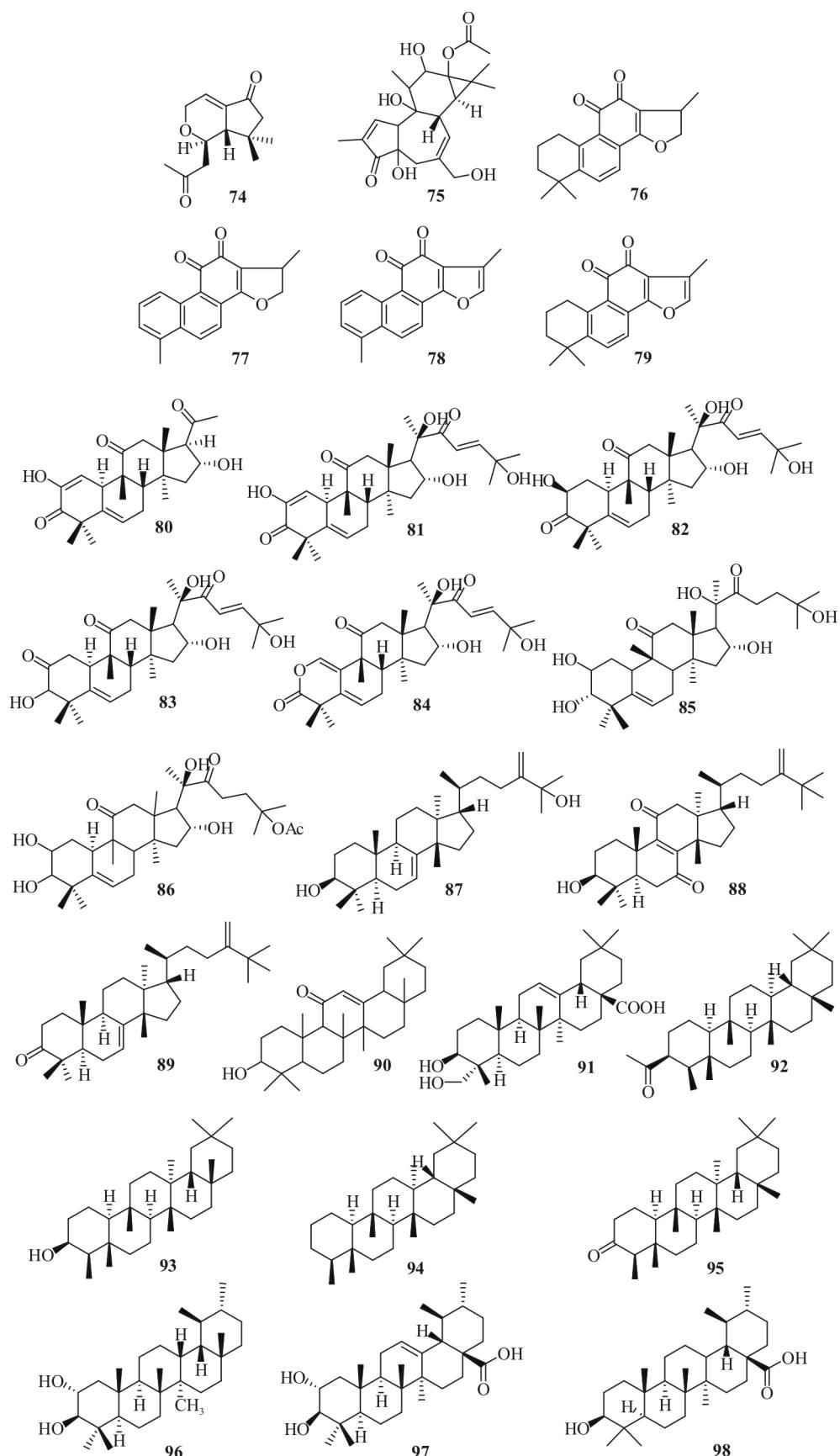


图 4 化合物 74~98 的结构

Fig. 4 Structures of compounds 74–98

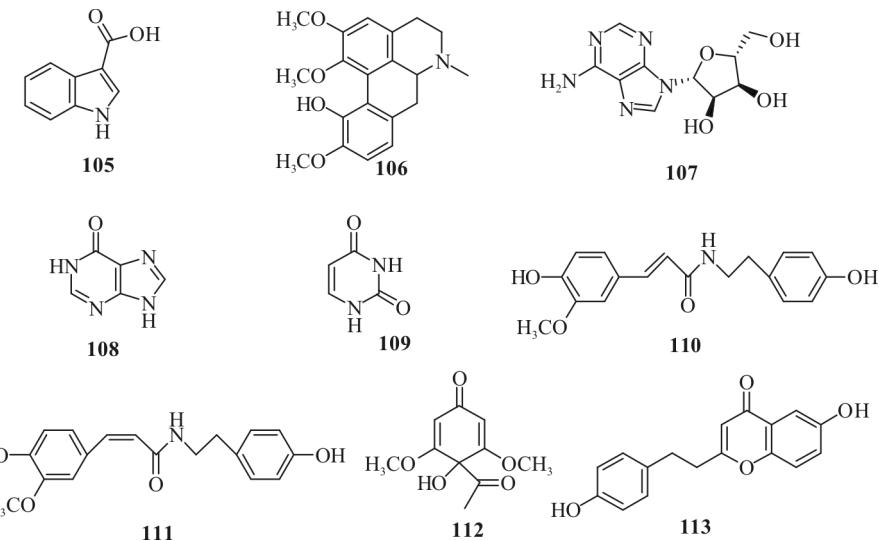


图5 化合物 105~113 的结构

Fig. 5 Structures of compounds 105 – 113

表1 白木香中的化合物

Table 1 Compounds isolated from *Aquilaria sinensis*

编号 No.	化合物 Compound	分子式 Formula	分子量 Molecular weight	部位 Part	文献 Reference
1	5-羟基-7,4'-二甲氧基黄酮 5-Hydroxyl-7,4'-dimethoxyflavone	C ₁₇ H ₁₄ O ₅	298	叶、树干	[7,22–23,50–52]
2	5-羟基-7,3',4'-三甲氧基黄酮 Luteolin-7,3',4'-trimethyl	C ₁₈ H ₁₆ O ₆	328	叶、树干、树皮	[7,15,23,50–52]
3	5,3'-二羟基-7,4'-二甲氧基黄酮 5,3'-Hydroxyl-7,4'-dimethoxyflavone	C ₁₇ H ₁₄ O ₆	314	叶、树皮、树干	[7,23,51–52]
4	莞花素 Genkwanin	C ₁₆ H ₁₂ O ₅	284	叶、树干、果实	[7,12,22–23,49–53]
5	木犀草素 Luteolin	C ₁₅ H ₁₀ O ₆	286	叶	[7,12,22,52]
6	羟基莞花素 3'-Hydroxygenkwanin	C ₁₆ H ₁₂ O ₆	300	叶、树干	[7,12,15,52]
7	5,4'-二羟基-7,3'-二甲氧基黄酮 5,4'-Hydroxyl-7,3'-dimethoxyflavone	C ₁₇ H ₁₄ O ₆	314	叶、果实、树干	[49–51]
8	7-羟基-5,4'-二甲氧基黄酮 7-Hydroxyl-5,4'-dimethoxyflavone	C ₁₇ H ₁₄ O ₅	298	叶	[50]
9	金合欢素 Acacetin	C ₁₆ H ₁₂ O ₅	284	叶、树干	[15,22]
10	莞花苷 Vuankanin	C ₂₇ H ₃₀ O ₁₄	578	叶、果实	[22,53]
11	莞花素-5-O-β-D-吡喃葡萄糖苷 Genkwanin-5-O-β-D-glucopyranoside	C ₂₂ H ₂₂ O ₁₀	446	叶、果实	[22,53]
12	白木香苷 A1 Aquilarinatoside A1	C ₂₇ H ₃₀ O ₁₄	578	树干	[15]
13	Lethedioside A	C ₂₉ H ₃₄ O ₁₅	622	树干	[15]
14	7,4'-二甲氧基洋芹素-5-O-木糖葡萄糖苷 7,4'-Dimethylapigenin-5-O-xylosylglucoside	C ₂₈ H ₃₂ O ₁₄	592	叶、树干	[12,15]
15	Lethedioside A	C ₂₄ H ₂₆ O ₁₁	490	树干	[15]
16	7-羟基-4'-甲氧基-5-O-葡萄糖黄酮苷 7-Hydroxyl-4',methyl-5-O-glucosideflavonoid	C ₂₂ H ₂₂ O ₁₀	446	树干	[15]
17	7,3'-二甲氧基-4'-羟基-5-O-葡萄糖黄酮苷 7,3'-Dimethyl-4'-hydroxyl-5-O-gluco-sideflavonoid	C ₂₃ H ₂₄ O ₁₁	476	树干	[15]
18	7,4'-二甲氧基-5-O-葡萄糖黄酮苷 7,4'-Dimethyl-5-O-glucosideflavonoid	C ₂₃ H ₂₄ O ₁₀	460	树干	[15]
19	芒柄花素 Formononetin	C ₁₆ H ₁₂ O ₄	268	树干	[15]
20	南莞素 Wikstroemin	C ₂₈ H ₃₂ O ₁₅	608	果实	[53]
21	7-β-D-glucoside of 5-O-methylapigenin	C ₂₂ H ₂₂ O ₁₀	446	叶	[12]
22	Aquisiflavoside	C ₂₈ H ₃₂ O ₁₅	608	叶	[16]

续表(Continued)

编号 No.	化合物 Compound	分子式 Formula	分子量 Molecular weight	部位 Part	文献 Reference
23	5,7,3',4'-四甲氧基黄酮 5,7,3',4'-Tetramethoxyflavone	C ₁₉ H ₁₈ O ₆	342	叶	[28]
24	5,7,4'-三甲氧基黄酮 5,7,4'-Trimethoxy-flavone	C ₁₈ H ₁₆ O ₅	312	叶	[28]
25	高次衣草素-7-O-β-D-吡喃葡萄糖苷 Hypolaetin-7-O-β-D-glucopyranoside	C ₂₁ H ₂₀ O ₁₂	464	叶	[22]
26	8-C-β-D-半乳糖基异牡荆素 8-C-β-D-Galactopyranosylisovitexin	C ₂₇ H ₃₀ O ₁₅	594	叶	[22]
27	Aquilarisin	C ₂₂ H ₂₀ O ₁₃	492	叶	[17]
28	Hhypolaetin 5-O-β-D-glucuronopyranoside	C ₂₁ H ₁₈ O ₁₃	478	叶	[17]
29	5-羟基-3,4',6,7-四甲氧基黄酮 5-Hydroxyl-3,4',6,7-tetramethoxyflavone	C ₁₉ H ₁₈ O ₇	358	叶	[28]
30	樱花素 Sakuranetin	C ₁₆ H ₁₄ O ₅	286	树干	[19]
31	桃昔元 Persicogenin	C ₁₇ H ₁₆ O ₆	316	树皮	[23]
32	鸢尾酚酮 Iriflophenone	C ₁₃ H ₁₀ O ₅	246	叶	[12]
33	2-O-α-L-鼠李糖-4,6,4'-三羟基二苯甲酮 2-O-α-L-Rhamnopyranosyl-4,6,4'-trihydroxybenzophenone	C ₁₉ H ₂₀ O ₉	392	叶	[7,13,17]
34	鸢尾酚酮3,5-C-β-D-葡萄糖苷 Iriflophenone 3,5-C-β-D-glucoside	C ₂₅ H ₃₀ O ₁₅	570	叶	[13] [17]
35	Aquilarisinin	C ₂₅ H ₃₀ O ₁₄	554	叶	[17]
36	鸢尾酚酮3-C-β-D-葡萄糖苷 Iriflophenone 3-C-β-D-glucoside	C ₁₉ H ₂₀ O ₁₀	408	叶	[17]
37	Aquilarinoside A	C ₁₉ H ₁₈ O ₉	390	叶	[12]
38	Aquilarixanthone	C ₁₈ H ₁₆ O ₁₁	408	叶	[17]
39	芒果苷 Mangiferin	C ₁₉ H ₁₈ O ₁₁	422	叶、果实	[12,17,53]
40	(+)-丁香树脂酚 (+)-Syringaresinol	C ₂₂ H ₂₆ O ₈	418	树干、树皮	[18,21,23]
41	(-)-杜仲树脂酚 (-)-Medioresinol	C ₂₁ H ₂₄ O ₇	388	树干	[21]
42	(-)-松脂素 (-)-Pinoresinol	C ₂₀ H ₂₂ O ₆	358	树干	[21]
43	丁香脂双葡萄糖苷 Syringaresinol-4,4'-di-O-β-D-glucopyranoside	C ₃₄ H ₄₆ O ₁₈	742	树干	[18]
44	无梗五加苷 B Syringaresinol-4'-O-β-D-glucopyranoside	C ₂₈ H ₃₆ O ₁₃	580	树干	[18]
45	Erythro-buddlenol C	C ₃₂ H ₃₈ O ₁₂	614	树干	[21]
46	Threo-buddlenol C	C ₃₂ H ₃₈ O ₁₂	614	树干	[21]
47	Thero-ficusesquilignan A	C ₃₁ H ₃₆ O ₁₁	584	树干	[21]
48	(±)-Bbuddlenol D	C ₃₃ H ₄₀ O ₁₃	644	树干	[21]
49	刺五加酮 Ciwujiatone	C ₂₂ H ₂₆ O ₉	434	树干	[18,21]
50	(+)-落叶松脂醇 Lariciresinol	C ₂₀ H ₂₄ O ₆	360	树干	[20]
51	5'-甲氧基落叶松脂醇 5'-Methoxylariciresinol	C ₂₁ H ₂₆ O ₇	390	树干	[21]
52	Herpetin	C ₃₀ H ₃₄ O ₉	538	树干	[21]
53	爵床脂素A Justicidin A	C ₂₂ H ₁₈ O ₇	394	树干	[18]
54	Justicidin F	C ₂₁ H ₁₄ O ₇	378	树干	[18]
55	Balanophonin	C ₂₀ H ₂₀ O ₆	356	树干	[20]
56	Aquilarin A	C ₁₄ H ₁₆ O ₇	296	树干	[20]
57	Curuilignan D	C ₁₄ H ₁₆ O ₆	280	树干	[18,21]
58	Evofolin B	C ₁₇ H ₁₈ O ₆	318	树干	[19]
59	Erythro-guaiacylglycerol-β-coniferyl ether	C ₂₀ H ₂₄ O ₇	376	树干	[21]
60	Threo-guaiacylglycerol-β-coniferyl ether	C ₂₀ H ₂₄ O ₇	376	树干	[21]
61	丁香素 Syringin	C ₁₇ H ₂₄ O ₉	372	树干	[18]

续表(Continued)

编号 No.	化合物 Compound	分子式 Formula	分子量 Molecular weight	部位 Part	文献 Reference
62	4-(1,2,3-三羟基丙基)-2,6-二甲氧基苯-1- <i>O</i> - β -D-葡萄糖苷 4-(1,2,3-Trihydroxypropyl)-2,6-dimethoxyphenyl-1- <i>O</i> - β -D-glucopyranoside	C ₁₇ H ₂₆ O ₁₁	406	叶	[22]
63	4-[3'-(Hydroxymethyl)oxiran-2'-yl]-2,6-dimethoxyphenol	C ₁₁ H ₁₄ O ₅	226	树干	[19]
64	松伯醛 Coniferyl aldehyde	C ₁₀ H ₁₀ O ₃	178	树干	[19]
65	松伯醇 Coniferyl alcohol	C ₁₀ H ₁₂ O ₃	180	树干	[21]
66	4-羟基-3,5-二甲氧基酚苷 Koaburaside	C ₁₄ H ₂₀ O ₉	332	树干	[18]
67	3,4,5-三甲氧基苯基-1- <i>O</i> - β -D-吡喃葡萄糖苷 3,4,5-Trimethoxyphenyl-1- <i>O</i> - β -D-glucopyranoside	C ₁₅ H ₂₂ O ₉	346	树干	[18]
68	3,4,5-三甲氧基苯基-1- <i>O</i> - β -D-吡喃芹糖-(1"→6')- β -D-吡喃葡萄糖苷 3,4,5-Trimethoxyphenyl-1- <i>O</i> - β -D-apiofuranosyl-(1"→6') glucopyranoside	C ₂₀ H ₃₀ O ₁₃	478	树干	[18]
69	对羟基苯甲酸 5-Hydroxybenzoic acid	C ₇ H ₆ O ₃	138	叶	[7,50]
70	羟基苯甲酸酯 Methylparaben	C ₈ H ₈ O ₃	152	树皮	[22]
71	香草酸 Vanillic acid	C ₈ H ₈ O ₄	168	树干	[24]
72	紫丁香酸 Syringic acid	C ₉ H ₁₀ O ₅	198	树干	[24]
73	3,4,5-三甲氧基苯酚 3,4,5-Trimethoxyphenol	C ₉ H ₁₂ O ₄	184	树干	[21]
74	Aquilarin B	C ₁₃ H ₁₈ O ₃	222	树干	[25]
75	Phorbol 13-acetate	C ₂₂ H ₃₀ O ₇	406	树干	[25]
76	隐丹参酮 Cryptotanshinone	C ₁₉ H ₂₀ O ₃	296	叶	[26]
77	二氢丹参酮I Dhydrotanshinone I	C ₁₈ H ₁₄ O ₃	278	叶	[26]
78	丹参酮I Tanshinone I	C ₁₈ H ₁₂ O ₃	276	叶	[26]
79	丹参酮II A Tanshinone II A	C ₁₉ H ₁₈ O ₃	294	叶	[26]
80	葫芦苦素I Hexanorcucurbitacin I	C ₂₄ H ₃₂ O ₅	400	果实	[8]
81	葫芦素I Cucurbitacin I	C ₃₀ H ₄₂ O ₇	514	果实	[8]
82	葫芦素D Cucurbitacin D	C ₃₀ H ₄₄ O ₇	516	果实	[8]
83	异葫芦素D Isocucurbitacin D	C ₃₀ H ₄₄ O ₇	516	果实	[8]
84	新葫芦素B Neocucurbitacin B	C ₂₉ H ₄₀ O ₇	500	果实	[8]
85	双氢葫芦素F Dihydrocucurbitacin F	C ₃₀ H ₄₈ O ₇	520	树干	[25]
86	雪胆甲素 Cucurbitacin	C ₃₂ H ₅₀ O ₈	562	树干	[21]
87	Aquilacallane A	C ₃₁ H ₅₂ O ₂	456	叶	[28]
88	Aquilacallane B	C ₃₂ H ₅₀ O ₃	482	叶	[28]
89	24-Methylene-25-methyltirucall-7-en-3-one	C ₃₂ H ₅₂ O	452	叶	[28]
90	11-oxo- β -Amyrin	C ₃₀ H ₄₈ O ₂	440	叶	[28]
91	常春藤皂苷元 Hederagenin	C ₃₀ H ₄₈ O ₄	472	叶	[28]
92	3 β -Acetoxyfriedelane	C ₃₂ H ₅₄ O	454	叶	[28]
93	表木栓醇 Epifriedelanol	C ₃₀ H ₅₂ O	428	叶	[50]
94	木栓烷 Friedelan	C ₃₀ H ₅₂	412	叶	[50]
95	木栓酮 Friedelin	C ₃₀ H ₅₀ O	426	叶	[50]
96	2 α -羟基熊果烷 2 α -Hydroxyursane	C ₃₀ H ₅₀ O ₂	444	叶	[26]
97	2 α -羟基熊果酸 2 α -Hydroxyursolic acid	C ₃₀ H ₄₈ O ₄	472	叶	[26]
98	熊果酸 Ursolic acid	C ₃₀ H ₅₀ O ₃	458	叶	[28]
99	7-Ketositosterol	C ₂₉ H ₄₈ O ₂	428	树干	[18]

续表(Continued)

编号 No.	化合物 Compound	分子式 Formula	分子量 Molecular weight	部位 Part	文献 Reference
100	7-oxo-5,6-Dihydrostigmasterol	C ₂₉ H ₄₈ O ₂	428	树干	[18]
101	β-谷甾醇 β-Sitosterol	C ₂₉ H ₅₀ O	414	叶、树干、 树皮、果实	[7,19,23,49]
102	胡萝卜苷 Daucosterol	C ₃₅ H ₆₀ O ₆	576	叶、果实	[7,49]
103	(3β,5α,8α,22E,24R)-5,8-桥二氢麦角甾-6,22-二烯-3-醇 (3β,5α,8α,22E,24R)-5,8-Epidioxyergosta-6,22-dien-3-ol	C ₂₈ H ₄₄ O ₃	428	树干	[19]
104	α-豆甾醇 α-Sitosterol	C ₂₉ H ₄₈ O	412	叶	[50]
105	3-吲哚甲酸 Indolyl-3-carboxylic acid	C ₉ H ₇ NO ₂	161	果实	[49]
106	异紫堇啡碱 Isocorydine	C ₂₀ H ₂₃ NO ₄	341	叶	[50]
107	腺苷 Adenosine	C ₁₀ H ₁₃ N ₅ O ₄	267	叶	[22]
108	次黄嘌呤 Hypoxanthine	C ₅ H ₄ N ₄ O	136	叶	[22]
109	尿嘧啶 Uracil	C ₄ H ₄ N ₂ O ₂	112	叶	[22]
110	N-反式-对羟基苯乙基阿魏酰胺 N-trans-Feruloyltyramine	C ₁₈ H ₁₉ NO ₄	313	树干	[24]
111	N-顺式-对羟基苯乙基阿魏酰胺 N-cis-Feruloyltyramine	C ₁₈ H ₁₉ NO ₄	313	树干	[24]
112	4-Acetyl-3,5-dimethoxy-p-quinal	C ₁₀ H ₁₂ O ₅	212	树干	[24]
113	6-羟基-2-[2-(4-羟基苯基)乙基]色原酮 6-Hydroxy-2-[2-(4-hydroxyphenyl)ethyl]	C ₁₇ H ₁₄ O ₄	282	果实	[49]
114	二十六烷酸 Hexacosanic acid	C ₂₆ H ₅₂ O ₂	396	叶	[26]
115	正三十二(烷)醇 Triacontenoic	C ₃₂ H ₆₆ O	466	叶	[26]
116	正三十一烷 Hentriacontane	C ₃₁ H ₆₄	436	叶	[26]

长有一定的抑制作用。杨懋勋等^[6]分别用甲醇、乙醇、70%丙酮和蒸馏水对野生白木香叶片进行提取,结果表明有机溶剂提取物有显著的抑制细胞增殖活性;进一步用石油醚、乙酸乙酯、正丁醇进行分级萃取,各部位分别用MTT法进行抑制前列腺癌细胞增殖活性测试,结果表明多个部位有良好的抗癌活性;同时还证实野生白木香叶片提取物的抗癌活性远远大于栽培样品;另外,实验还表明野生和栽培白木香叶片提取物均具有较好的清除亚硝酸根作用,说明白木香叶片在防癌方面有良好的开发利用前景。徐维娜等^[5]用MTT法检测,表明白木香果皮提取物对人乳腺癌细胞(MCF-7)的增殖具有显著的抑制作用。梅文莉等^[8]报道白木香果实中的三萜类化合物葫芦苦素I(80)、葫芦素I(81)、异葫芦素D(83)和新葫芦素B(84)均对人慢性髓原白血病细胞(K562)、人胃癌细胞(SGC-7901)和肝癌细胞(SMMC-7721)具有细胞毒活性。Cheng等^[28]报道5,7,4'-三甲氧基黄酮(24)对人髓细胞性白血病(HL-60)细胞和肺癌(A-549)细胞株有弱的细胞毒活性。

2.3 镇痛和抗炎作用

周敏华等^[11]采用各种伤害性刺激和炎症相关的实验模型,证实白木香叶提取物存在显著的镇痛和抗炎作用,民间俗用于减轻某些外伤等疾病的痛苦和炎症性疾病的治疗。中性粒细胞是一种通过呼吸爆发参与杀菌宿主防御系统的细胞,其呼吸爆发在免疫炎症过程中起着关键的作用。戚进等^[12]以中性粒细胞呼吸爆破试验为模型,结果表明从白木香叶中分离得到的木犀草素(5)、羟基芫花素(6)、7-β-D-glucoside of 5-O-methylapigenin(21)、鸢尾酚酮(32)、芒果苷(39)和 aquilarioside A(37)对中性粒细胞呼吸爆发有显著的抑制活性,从而具有一定的抗炎作用。

2.4 利泻活性

Hara等^[13]报道了白木香叶丙酮提取物与传统泻药塞纳具有类似利泻功效,而不引起严重的痢疾等副作用。同时,从丙酮提取物中分离鉴定出的主要成分芫花素5-O-茜黄樱草糖苷即芫花苷(10),能经由乙酰胆碱受体介导加强回肠的自发运动并引

起收缩。

2.5 降糖作用

姜珊等^[14]采用白木香叶 95% 乙醇提取物对 *db/db* 2 型糖尿病小鼠进行灌胃给药实验, 其具有降低 *db/db* 2 小鼠空腹血糖和糖化血红蛋白水平、改善糖耐量的作用。有研究表明白木香叶 95% 乙醇提取物可能是通过激活腺苷酸活化蛋白激酶(AMPK), 起到改善胰岛素抵抗, 降低血糖的作用, 并且提取物并未引起动物体重增加的副作用, 为寻找除噻唑烷二酮之外的治疗与肥胖相关糖尿病的药物提供了新选择。冯洁等^[17]报道白木香叶 70% 乙醇提取的乙酸乙酯萃取物对 α -葡萄糖苷酶活性具有抑制作用, 从而具有一定的降血糖作用。

2.6 清除自由基活性

路晶晶等^[52]还对从白木香叶中分离得到的洋芹素-7,4'-二甲醚(1)、5-羟基-7,3',4'-三甲氧基黄酮(2)、木犀草素-7,4'-二甲醚(3)、芫花素(4)、木犀草素(5)和羟基芫花素(6)等 6 种黄酮类化合物进行了清除 O_2^- 、 H_2O_2 和 $\cdot OH$ 自由基活性研究, 发现其具有良好的清除自由基活性, 可能为白木香叶的主要抗氧化活性成分。

2.7 其它活性

陈东等^[15]从白木香中分离得到 7 个 5-*O*-黄酮苷化合物: 白木香苷 A₁(12)、lethedioside A(13)、7,4'-二甲氧基洋芹素-5-*O*-木糖葡萄糖苷(14)、lethedioside A(15)、7-羟基-4'-甲氧基-5-*O*-葡萄糖黄酮苷(16)、7,3'-二甲氧基-4'-羟基-5-*O*-葡萄糖黄酮苷(17)和 7,4'-二甲氧基-5-*O*-葡萄糖黄酮苷(18), 活性测试结果表明, 这些化合物具有抑制 LPS 诱导巨噬细胞生成 NO 活性。Yang 等^[16]分离得到 1 个新的黄酮苷 aquisiflavoside(22), 它对 RAW264.7 巨噬细胞系中脂多糖诱导生成的 NO 表现出有效的抑制活性。此外, Noro 等^[54]报道了木犀草素和芹菜素具有很强的抑制黄嘌呤氧化酶的活性; 杨小凤等^[55]还报道了芫花素具有良好的杀虫效果, 且对人畜无害。

3 结语

白木香含树脂的芯材即为沉香, 由于沉香作为

香料和药材的用量很大, 长期对白木香的大量砍伐导致白木香的野生资源濒临枯竭。白木香在 1987 年被列为国家珍稀濒危三级保护植物, 1999 年又被国务院批准为国家二级重点保护野生珍稀濒危植物^[1]。近年来白木香的人工种植面积也越来越大, 因此, 加强对白木香种子、叶、果实、果皮、树干等各部位的化学成分和生物活性研究, 不仅可以进一步明确其药理活性成分, 还可以促进白木香的综合利用, 对白木香资源的充分开发提供一定的参考依据。在白木香中鉴定的化学成分主要有黄酮、苯甲酮、木脂素、萜类、生物碱、甾体及一些简单酚性化合物等; 而其含树脂的芯材沉香的主要化学成分则是倍半萜和 2-(2-苯乙基)色原酮类^[2], 可见, 白木香与沉香的化学成分是有明显不同的, 二者成分上的差别可用于区别白木香与沉香, 也为更好的评价沉香的品质提供了一定的参考依据。

参考文献

- [1] Fu L G. China Plant Red Data Book: Rare and Endangered Plants [M]. Beijing: China Science and Technology Press, 1992: 670–671.
- [2] 傅立国. 中国植物红皮书: 稀有濒危植物 [M]. 北京: 中国科技出版社, 1992: 670–671.
- [3] Yang J S. Review of the chemical constituents isolated from chenxiang [J]. Nat Prod Res Dev, 1996, 10(1): 99–103.
- [4] 杨骏山. 沉香化学成分的研究概况 [J]. 天然产物研究与开发, 1996, 10(1): 99–103.
- [5] Neaf R. The volatile and semi-volatile constituents of agarwood, the infected heartwood of *Aquilaria* species: A review [J]. Flavour Fragr J, 2011, 26(2): 73–87.
- [6] Chen H Q, Wei J H, Yang J S, et al. Chemical constituents of agarwood originating from the endemic genus *Aquilaria* plants [J]. Chem Biodiv, 2012, 9(2): 236–250.
- [7] Xu W N, Gao X X, Guo X L, et al. Study on volatile components from peel of *Aquilaria sinensis* and the anti-tumor activity [J]. J Chin Med Mat, 2010, 33(11): 1736–1740.
- [8] 徐维娜, 高晓霞, 郭晓玲, 等. 白木香果皮挥发性成分及抗肿瘤活性的研究 [J]. 中药材, 2010, 33(11): 1736–1740.
- [9] Yang M X, Chen H R. Study on antitumor activity of leaves of *Aquilaria sinensis* [C]// Abstracts for 2011 Chinese Medicinal Chemistry Symposium. Beijing: Chinese Pharmaceutical Association, 2011: 230–230.
- [10] 杨懋勋, 陈河如. 土沉香(白木香)叶片抗肿瘤活性成分的研究 [C]// 2011年全国药物化学学术会议论文摘要集. 北京: 中国药学会, 2011: 230–230.
- [11] Wang H G, Zhou M H, Lu J J, et al. Antitumor constituents from the leaves of *Aquilaria sinensis* (Lour.) Gilg. [J]. Chem Ind For

- Prod, 2008, 28(2): 1–5.
- 王红刚, 周敏华, 路晶晶, 等. 沉香叶抗肿瘤活性化学成分研究 [J]. 林产化学与工业, 2008, 28(2): 1–5.
- [8] Men W L, Lin F, Zuo W J, et al. Cucurbitacins from fruits of *Aquilaria sinensis* [J]. Chin J Nat Med, 2012, 10(3): 234–237.
- [9] Liu J, Mei W L, Cui H B, et al. Study on chemical constituents and anti-bacterial activity of volatile oil from seed of *Aquilaria sinensis* [J]. J Chin Med Mat, 2008, 31(3): 340–342.
- 刘俊, 梅文莉, 崔海滨, 等. 白木香种子挥发油的化学成分及抗菌活性研究 [J]. 中药材, 2008, 31(3): 340–342.
- [10] Li H H, Zhang W M, Gao X X, et al. Study on antimicrobial activity of *Aquilaria sinensis* peel extract [J]. Chin J Exp Trad Med Formul, 2011, 17(7): 100–103.
- 李浩华, 章卫民, 高晓霞, 等. 白木香果皮提取物的抗菌活性 [J]. 中国实验方剂学杂志, 2011, 17(7): 100–103.
- [11] Zhou M H, Wang H G, Suolangjiba, et al. Antinociceptive and anti-inflammatory activities of *Aquilaria sinensis* (Lour.) Gilg. leaves extract [J]. J Ethnopharmacol, 2008, 117(2): 345–350.
- [12] Qi J, Lu J J, Liu J H, et al. Flavonoid and a rare benzophenone glycoside from the leaves of *Aquilaria sinensis* [J]. Chem Pharm Bull, 2009, 57(2): 134–137.
- [13] Hara H, Ise Y, Morimoto N, et al. Laxative effect of agarwood leaves and its mechanism [J]. Biosci Biotechn Biochem, 2008, 72(2): 335–345.
- [14] Jiang S, Jiang Y F, Guan Y F, et al. Effects of 95% ethanol extract of *Aquilaria sinensis* leaves on hyperglycemia in diabetic db/db mice [J]. J Chin Pharm Sci, 2011, 20(6): 609–614.
- [15] Chen D, Bi D, Song Y L, et al. Flavanoids from the stems of *Aquilaria sinensis* [J]. Chin J Nat Med, 2012, 10(4): 287–291.
- [16] Yang X B, Feng J, Yang X W, et al. Aquisiflavoside, a new nitric oxide production inhibitor from the leaves of *Aquilaria sinensis* [J]. J Asian Nat Prod Res, 2012, 14(9): 867–862.
- [17] Feng J, Yang X W, Wang R F, et al. Bio-assay guided isolation and identification of α -glucosidase inhibitors from the leaves of *Aquilaria sinensis* [J]. Phytochemistry, 2011, 72(2/3): 242–247.
- [18] Chen D, Song Y L, Nie C X, et al. Chemical constituents from *Aquilaria sinensis* (Lour.) Gilg. [J]. J Chin Pharm Sci, 2012, 21(1): 88–92.
- [19] Peng K. Study on the secondary metabolites from *Aquilaria sinensis* and the microbial transformation of its endophytic fungi [D]. Haikou: Hainan University, 2010: 30–34.
- 彭可. 白木香次生代谢产物及其内生真菌生物转化作用的研究 [D]. 海口: 海南大学, 2010: 30–34.
- [20] Wang Q H, Peng K, Tan L H, et al. Aquilarin A: A new benzenoid derivative from the fresh stem of *Aquilaria sinensis* [J]. Molecules, 2010, 15(6): 4011–4016.
- [21] Li W, Mei W L, Wang H, et al. Chemical constituents from the stems of *Aquilaria sinensis* [J]. China J Chin Mat Med, 2013, 38(17): 2826–2831.
- 李薇, 梅文莉, 王昊, 等. 白木香树干的化学成分研究 [J]. 中国中药杂志, 2013, 38(17): 2826–2831.
- [22] Feng J, Yang X W. Studies on chemical constituents from the leaves of *Aquilaria sinensis* [J]. China J Chin Mat Med, 2012, 37(2): 230–234.
- 冯洁, 杨秀伟. 白木香叶化学成分的研究 [J]. 中国中药杂志, 2012, 37(2): 230–234.
- [23] Chen C T, Yeh Y T, Chao D, et al. Chemical constituents from the bark of *Aquilaria sinensis* [J]. Chem Nat Comp, 2013, 48(6): 1074–1075.
- [24] Chen C T, Yeh Y T, Chao D, et al. Chemical constituents from the wood of *Aquilaria sinensis* [J]. Chem Nat Comp, 2013, 49(1): 113–114.
- [25] Peng K, Mei W L, Zhao Y X, et al. A novel degraded sesquiterpene from the fresh stem of *Aquilaria sinensis* [J]. J Asian Nat Prod Res, 2011, 13(10): 951–955.
- [26] Feng J, Yang X W. Liposolubility constituents from leaves of *Aquilaria sinensis* [J]. China J Chin Mat Med, 2011, 36(15): 2092–2095.
- 冯洁, 杨秀伟. 白木香脂溶性化学成分研究 [J]. 中国中药杂志, 2011, 36(15): 2092–2095.
- [27] Liu J, Liu Y. Advancement on the pharmacological active constituents of *Salvia miltiorrhiza* [J]. J Liaoning Univ Trad Chin Med, 2010, 12(7): 15–17.
- 刘娟, 刘颖. 丹参药理活性成分研究进展 [J]. 辽宁中医药大学学报, 2012, 12(7): 15–17.
- [28] Cheng J T, Han Y Q, He J, et al. Two new tirucallane triterpenoids from the leaves of *Aquilaria sinensis* [J]. Arch Pharm Res, 2013, 36(9): 1084–1089.
- [29] Yang S J, Chang Y Q, Zheng L H, et al. Protective effects of cucurbitacin B on the acute liver injury induced by CCl_4 [J]. Food Sci, 2005, 26(9): 524–526.
- 杨世杰, 昌友权, 郑丽华, 等. 葫芦素B对四氯化碳致小鼠急性肝损伤的保护作用 [J]. 食品科学, 2005, 26(9): 524–526.
- [30] Wei F H, Qu H G, Wang H, et al. Protective effects of SMVE on the acute alcohol liver injured jaundice [J]. Food Sci, 2005, 26(9): 487–489.
- 魏凤辉, 曲红光, 王红, 等. 葫芦素B对急性酒精性黄疸保护作用的研究 [J]. 食品科学, 2005, 26(9): 487–489.
- [31] Ji H. Cucurbitacin and its pharmacological studies [J]. Foreign Med Sci, 1996, 18(6): 13–14.
- 吉宏. 葫芦素及其药理学研究 [J]. 国外医学: 中医药分册, 1996, 18(6): 13–14.
- [32] Zhang M X, Zhang H L, Sun C Y, et al. *In vitro* and *in vivo* inhibitory effect of cucurbitacin B on the growth of breast cancer cells [J]. J Mod Oncol, 2009, 17(1): 16–19.
- 张美侠, 张洪亮, 孙春艳, 等. 葫芦素B在体内外对乳腺癌细胞的生长抑制作用 [J]. 现代肿瘤医学, 2009, 17(1): 16–19.
- [33] Attard E, Brineat M P, Cuschieri A. Immunomodulatory activity of cucurbitacin E isolated from *ecballium elaterium* [J]. Fitoterapia, 2005, 76(5): 439–441.

- [34] Yang K, Zheng G. Advances in the pharmacological study of cucurbitacin BE [J]. *Int J Trad Chin Med*, 2006, 28(1): 27–29.
杨凯, 郑刚. 葫芦素BE的药理作用研究进展 [J]. 国际中医中药杂志, 2006, 28(1): 27–29.
- [35] Liu Y J, Liu W Q. Pharmacological and clinical application of cucurbitacins [J]. *Chin Trad Herb Drugs*, 1992, 23(11): 605–608.
刘颖菊, 刘文清. 葫芦素的药理与临床应用 [J]. 中草药, 1992, 23(11): 605–608.
- [36] Ling B, Xiang Y L, Dong Y Z, et al. Oviposition and feeding activity of cucurbitacin B against *Liriomyza sativae* Blachard [J]. *Nat Prod Res Dev*, 2006, 18(1): 29–32.
凌冰, 向亚林, 董易之, 等. 葫芦素B对美洲斑潜蝇成虫产卵和取食的抑制作用研究 [J]. 天然产物研究与开发, 2006, 18(1): 29–32.
- [37] Xiang Y L, Ling B, Wang G C, et al. Antifeeding activity of cucurbitane triterpenoid from *Momordica charantia* leaves to *Plutella xylostella* [J]. *J S China Agri Univ*, 2009, 30(3): 13–17.
向亚林, 凌冰, 王国才, 等. 苦瓜茎叶中葫芦烷三萜化合物对小菜蛾幼虫的拒食作用 [J]. 华南农业大学学报, 2009, 30(3): 13–17.
- [38] Huang J, Sun Y, Lu S X, et al. Experimental study on apoptosis induced by ursolic acid isolated from *Asparagus* in HL-60 cells [J]. *Chin J Integr Trad West Med*, 1999, 19(5): 296–298.
黄镜, 孙燕, 陆士新, 等. 芦笋有效成分熊果酸诱导HL-60细胞凋亡的实验研究 [J]. 中国中西医结合杂志, 1999, 19(5): 296–298.
- [39] Zhang Q P, Xie L K, Deng T, et al. Ursolic acid enhances apoptosis in K562 cells [J]. *Basic Clin Med*, 2004, 24(4): 414–417.
张秋平, 谢珞琨, 邓涛, 等. 熊果酸促进K562细胞凋亡 [J]. 基础医学与临床, 2004, 24(4): 414–417.
- [40] Fan M W, Wang Q, Bian Z, et al. Effect of ursolic acid on the human tongue squamous carcinoma cell line TSCCa and possible mechanism [J]. *Med J Wuhan Univ*, 2004, 25(1): 1–3.
樊明文, 王茜, 边专, 等. 熊果酸对人舌鳞癌细胞株TSCCa的抑制作用及其机制探讨 [J]. 武汉大学学报: 医学版, 2004, 25(1): 1–3.
- [41] Bernard P, Scior T, Didier B, et al. Ethnopharmacology and bioinformatic combination for leads discovery: Application to phospholipase A₂ inhibitors [J]. *Phytochemistry*, 2001, 58(6): 865–874.
- [42] Ismaili H, Sosa S, Brkic D, et al. Topical anti-inflammatory activity of extracts and compounds from *Thymus broussonettii* [J]. *J Pharmacol*, 2002, 54(8): 1137–1140.
- [43] Tao Z M, Ding L S, Peng S L, et al. Triterpenes from *Rubus parkeri* root [J]. *Chin Trad Herb Drugs*, 2002, 33(2): 99–101.
陶正明, 丁立生, 彭树林, 等. 乌泡子根的三萜成分 [J]. 中草药, 2002, 33(2): 99–101.
- [44] Tian L T, Ma L, Du N S. Survey of pharmacology of aleanolic acid [J]. *China J Chin Mat Med*, 2002, 27(12): 884–886,901.
田丽婷, 马龙, 堵年生. 齐墩果酸的药理作用研究概况 [J]. 中国中药杂志, 2002, 27(12): 884–886,901.
- [45] Quéré L, Wenger T, Schramm H J. Triterpenes as potential dimerization inhibitors of HIV-1 protease [J]. *Biochem Biophys Res Commun*, 1996, 227(2): 484–488.
- [46] Kashiwada Y, Nagao T, Hashimoto A, et al. Anti-AIDS agents: 38. Anti-HIV activity of 3-O-acyl ursolic acid derivatives [J]. *J Nat Prod*, 2002, 63(12): 1619–1622.
- [47] Miao K L, Zhang X K, Dong Y. Studies on triterpenoids constituents of *Tripterygium wilfordii* Hook. f. [J]. *Nat Prod Res Dev*, 2000, 12(4): 1–7.
苗抗立, 张晓康, 董颖. 雷公藤根皮三萜成分研究 [J]. 天然产物研究与开发, 2000, 12(4): 1–7.
- [48] Chen K, Shi Q, Yoshiki K, et al. Anti-AIDS agents: 61. Salaspermic acid, an anti-HIV principle from *Tripterygium wilfordii*, and the structure-activity correlation with its related compounds [J]. *J Nat Prod*, 1992, 55(3): 483–489.
- [49] Lin F, Mei W L, Zuo W J, et al. Studies on chemical constituents from fruits of *Aquilaria sinensis* [J]. *J Trop Subtrop Bot*, 2012, 20(1): 89–91.
林峰, 梅文莉, 左文健, 等. 白木香果实化学成分研究 [J]. 热带亚热带植物学报, 2012, 20(1): 89–91.
- [50] Nie C X, Song Y L, Chen D, et al. Studies on chemical constituents of leaves of *Aquilaria sinensis* [J]. *China J Chin Mat Med*, 2009, 34(7): 858–860.
聂春晓, 宋月林, 陈东, 等. 白木香叶化学成分的研究 [J]. 中国中药杂志, 2009, 34(7): 858–860.
- [51] Peng K, Mei W L, Wu J, et al. Flavones from the stem of *Aquilaria sinensis* [J]. *J Trop Subtrop Bot*, 2010, 18(1): 97–100.
彭可, 梅文莉, 吴娇, 等. 白木香树干中的黄酮类成分 [J]. 热带亚热带植物学报, 2010, 18(1): 97–100.
- [52] Lu J J, Qi J, Zhu D N, et al. Antioxidant activity and structure-activity relationship of the flavones from the leaves of *Aquilaria sinensis* [J]. *Chin J Nat Med*, 2008, 6(6): 456–460.
路晶晶, 戚进, 朱丹妮, 等. 白木香叶中黄酮类成分结构与抗氧化功能的相关性研究 [J]. 中国天然药物, 2008, 6(6): 456–460.
- [53] Liang X, Cao X P, Zhong H M, et al. Flavonoids from fruit of *Aquilaria sinensis* [J]. *J Qingdao Univ Sci Techn (Nat Sci)*, 2012, 33(6): 584–586.
梁鑫, 曹现平, 钟惠民. 白木香果实中的黄酮类成分 [J]. 青岛科技大学学报: 自然科学版, 2012, 33(6): 584–586.
- [54] Noro T, Oda Y, Miyase T, et al. Inhibitors of xanthine oxidase from the flowers and buds of *Daphne genkwa* [J]. *Chem Pharm Bull*, 1983, 31(11): 3984–3987.
- [55] Yang X F, Liu C X, Wang Q F, et al. Extraction of effective component as insecticide from *Daphne genkwa* Sieb. et Zucc. [J]. *Chem Res Appl*, 2002, 14(5): 601–602.
杨小凤, 刘长欣, 王秋芬, 等. 芫花中芫花素的提取工艺与杀虫试验 [J]. 化学研究与应用, 2002, 14(5): 601–602.