

雷 公 藤 (综述)

太原制药厂 梁克军

雷公藤在我国药用已久,《本草纲目拾遗》、《植物名实图考》均有记述。主要用为医药、农药、杀虫药。最近, S. M. Kupchan等人^[1]从雷公藤根中分离出三个二萜的环氧化合物, 试验表明: 有显著的抗白血病作用与细胞毒样作用。

雷公藤 (*Tripterygium wilfordii* Hook. f.) 为卫矛科植物, 在我国分布于长江流域以南各省、区及西南地区。生于山地林内阴湿处。有很多别名: 昆明山海棠* (植物名实图考)、菜虫药、黄腊藤 (中国高等植物图鉴第二册)、蝗虫药、断肠草、红柴根、黄藤草 (中国药用植物图鉴)。《本草纲目拾遗》记载^[2]: 雷公藤生山阴脚下, 叶似三角枫, 一名霹雳木、方胜板、倒金钩、烙铁草、倒挂紫金钩、河白草、犁尖草、括耙草、板扛归、蒸龙草、震龙根等。采之毒鱼, 凡蚌螺亦死, 其性最烈。以其草烟熏蚕子则不生, 养蚕家忌之。

综合文献记述^[2], 雷公藤的药用, 大致为以下几个方面: 一、清热解毒, 用于治疗黄白疸、喉痹、乳痈、阴囊肿大、鱼口便毒、瘰癧、发背疔疮、坐板疮、毒蛇伤等。二、接筋骨、祛瘀, 用于跌打损伤。三、消积、消肿, 用于腹胀水肿、痞积、食积、产后遍身浮肿。四、亦治疗疟疾、翻胃噎膈、吐血、便血等。从以上推测, 雷公藤治疗的噎膈、腹胀、便血等, 可能为肿瘤引起的症状。

雷公藤的根、茎、叶均有毒, 可用为农药与杀虫药^[3]^[4], 对昆虫有胃毒及触杀效能。它的水及乙醇浸出物, 均有杀星毛虫、卷叶虫之效; 用乙醚提取得到的一种有毒物质能杀死家蚕; 雷公藤的水煎液, 对金黄色葡萄球菌有明显的抑制作用^[5]。

关于雷公藤的化学成份, 已有不少研究:

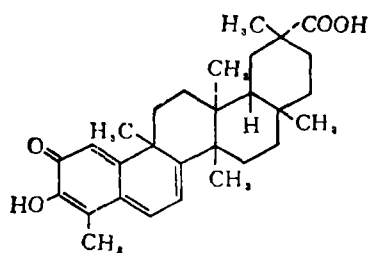
雷公藤以石油醚提取^[6]^[7], 分离得到一个红色立方结晶, 称作雷公藤红 (Tripterin, 或 Celastrol, $C_{28}H_{38}O_4$, I), 熔点: 195°C (分解), 石油醚提取后的残渣, 继以醇提取分离得到卫矛醇 (Dulcitol, $C_6H_{14}O_6$, II), 葡萄糖、果糖。



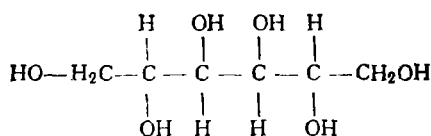
雷 公 藤

• 据中国高等植物图鉴第686页载: 昆明山海棠 *T. hypoglaucom* (Levl.) Hutch. 与本种主要区别为叶背有白粉。

— 编 者



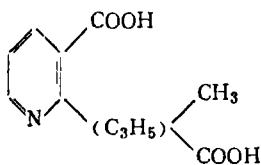
I



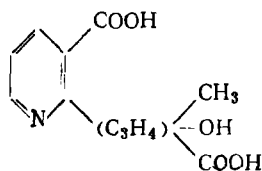
I

雷公藤根含的生物碱〔8~12〕可依下法提取得到：取粉碎、干燥的雷公藤（在北美采集）根粉3公斤，用1200毫升10%的氨水湿润，混匀，密闭放置数小时，用乙醚提取至完全，收集乙醚提取液，浓缩到500毫升，冷却，用稀盐酸提取几次，合并酸提取液，搅拌，微热，赶去溶解的乙醚，冷却，加入过剩的氨水。有沉淀析出，过滤，水洗、真空干燥、得粗生物碱混合物14.5克，熔点：163~170°C。

粗生物碱混合物，经分离与反复层析，可分得五个生物碱，即：维尔佛定(Wilfordine $C_{43}H_{49}O_{18}N$)熔点175~176°C, $[\alpha]_D^{25} + 12^\circ$ (丙酮)；维尔佛精(Wilforgine $C_{41}H_{47}O_{18}N$)熔点211°C, $[\alpha]_D^{25} + 25^\circ$ (丙酮)；维尔佛甙(Wiflorine $C_{43}H_{49}O_{18}N$)，熔点169~170°C, $[\alpha]_D^{25} + 30^\circ$ (丙酮)；维尔佛春(Wilfortrine $C_{41}H_{47}O_{20}N$) 熔点237.5~238°C, $[\alpha]_D^{25} + 10^\circ$ (丙酮)；维尔佛金(Wilforzine $C_{41}H_{47}O_{17}N$)熔点177~178°C, $[\alpha]_D^{25} 6^\circ$ (丙酮)。把这些生物碱，分别皂化时〔13〕，从维尔佛精、维尔佛甙、维尔佛金的皂化产物中可分离得到雷公藤酸(Wilfordic acid $C_{11}H_{13}NO_4$, II) 熔点：195~196°C。从维尔佛定，维



II



IV

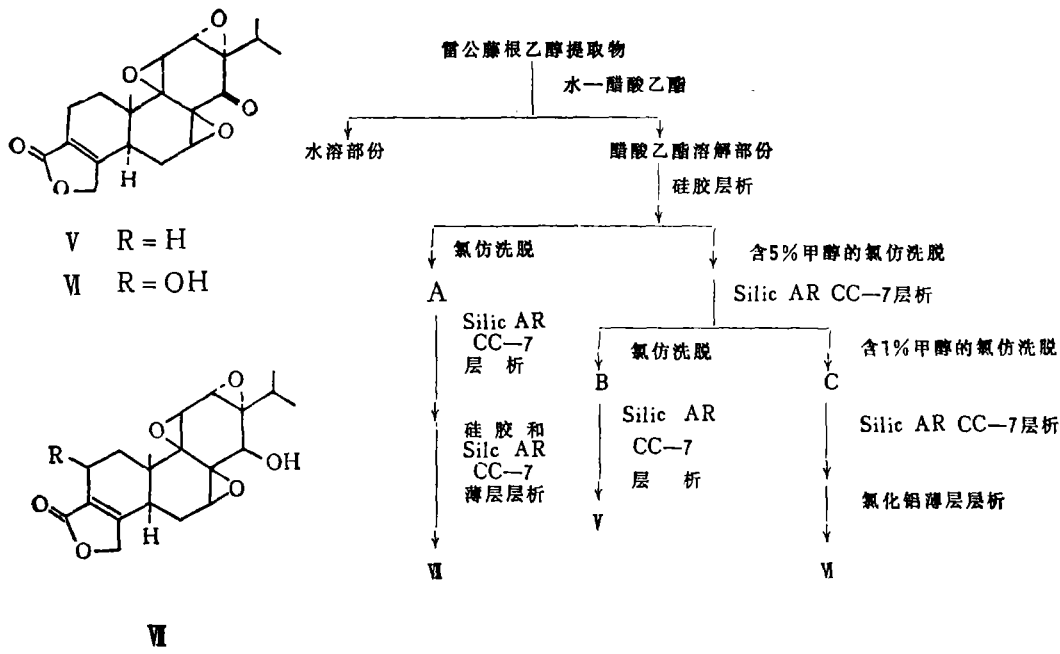
尔佛春的皂化产物中可分得羟基雷公藤酸(Hydroxywilfordic acid $C_{11}H_{13}NO_5$, IV)，熔点：178~179°C。

最近，S. M. Kupchan等人，用雷公藤（采自我国台湾省）根的醇提取物，进行抗肿瘤实验，发现在小鼠中，对白血病L₁₂₁₀和P₃₈₈有明显的抗肿瘤活性。在体外实验中，对人鼻咽癌，有抑制作用，进而从雷公藤的醇提取物中，分得三个二萜环氧化合物，即：triptolide、tripdiolide、triptonide。动物实验表明：triptolide、tripdiolide、在小鼠中，剂量为0.1毫克/公斤，对白血病L₁₂₁₀，P₃₈₈有明显的抗肿瘤活性。在体外实验中，对实验室培养的人鼻咽癌，ED₅₀为：10⁻³~10⁻⁴ 微克/毫升。它们的抗肿瘤作用与其分子中具有环氧基，不饱和和内酯基有关。

triptolide、tripdiolide、triptonide 可依表1所示的方法分离。揣普托里得(triptolide $C_{20}H_{24}O_6$, V)，收率0.001%，熔点：226~227°C, $[\alpha]_D^{25} \sim 154^\circ$ (C 0.369, 二氯甲烷)；揣普代奥里得(tripdiolide $C_{20}H_{24}O_7$, VI)，收率0.001%，熔点：210~211°C, $[\alpha]_D^{25} -138^\circ$ (C 0.139, 二氯甲烷)；揣普托尼得(triptonide $C_{20}H_{22}O_6$, VII)，收率0.001%，

熔点: 251~252°C, $[\alpha]_D^{25} -175^\circ$ (C 0.148, 二氯甲烷)。

表1: 环氧二萜化合物分离示意图



参 考 文 献

[1] S. M. Kupchan etc.: Triptolide and Triptidiolide, Novel Antileukemic Diterpenoid Triepoxides from Tripterygium Wilfordii. J. Amer. chem. Soc. 94(20), 7194, 1972.

[2] 赵学敏; 本草纲目拾遗, 卷七, 藤部。

[3] 许植方等; 化学世界, 1957; 102~5.

[4] R. C. Roark; C. A. 42(8): 2721, 1948.

[5] H. Zanyin Gaw etc.: Survey of Chinese Drugs for Present of Antibacterial Substances, Science 110, 11—12, 1949.

[6] 赵承顺等; C. A. 31 (4): 1161, 1937.

[7] M. S. Schechter, J. Amer. chem. Soc. 64 (1), 182, 1942.

[8] Fred Acree, Jr. etc.; Wilfordine, an insecticidal Alkaloid from Tripterygium Wilfordii Hook, J. Amer. chem. Soc. 72 (4), 1608, 1950.

[9] M. Beroza, J. Amer. chem. Soc. 73 (8), 3656, 1951.

[10] ibid 74 (6), 1585, 1952.

[11] ibid 75 (1), 44, 1953.

[12] ibid 75 (9), 2136, 1953.

[13] M. Beroza; J. org. chem. 28 (12), 3562, 1963.