



云南民族大学学报(自然科学版)  
*Journal of Yunnan Minzu University(Natural Sciences Edition)*  
ISSN 1672-8513,CN 53-1192/N

## 《云南民族大学学报(自然科学版)》网络首发论文

题目: 金荞麦的化学成分及  $\alpha$ -葡萄糖苷酶抑制活性研究  
作者: 原文毅, 赵霞, 杨凤仙  
收稿日期: 2025-01-02  
网络首发日期: 2025-03-27  
引用格式: 原文毅, 赵霞, 杨凤仙. 金荞麦的化学成分及  $\alpha$ -葡萄糖苷酶抑制活性研究 [J/OL]. 云南民族大学学报(自然科学版).  
<https://link.cnki.net/urlid/53.1192.N.20250326.1709.011>



**网络首发:** 在编辑部工作流程中, 稿件从录用到出版要经历录用定稿、排版定稿、整期汇编定稿等阶段。录用定稿指内容已经确定, 且通过同行评议、主编终审同意刊用的稿件。排版定稿指录用定稿按照期刊特定版式(包括网络呈现版式)排版后的稿件, 可暂不确定出版年、卷、期和页码。整期汇编定稿指出版年、卷、期、页码均已确定的印刷或数字出版的整期汇编稿件。录用定稿网络首发稿件内容必须符合《出版管理条例》和《期刊出版管理规定》的有关规定; 学术研究成果具有创新性、科学性和先进性, 符合编辑部对刊文的录用要求, 不存在学术不端行为及其他侵权行为; 稿件内容应基本符合国家有关书刊编辑、出版的技术标准, 正确使用和统一规范语言文字、符号、数字、外文字母、法定计量单位及地图标注等。为确保录用定稿网络首发的严肃性, 录用定稿一经发布, 不得修改论文题目、作者、机构名称和学术内容, 只可基于编辑规范进行少量文字的修改。

**出版确认:** 纸质期刊编辑部通过与《中国学术期刊(光盘版)》电子杂志社有限公司签约, 在《中国学术期刊(网络版)》出版传播平台上创办与纸质期刊内容一致的网络版, 以单篇或整期出版形式, 在印刷出版之前刊发论文的录用定稿、排版定稿、整期汇编定稿。因为《中国学术期刊(网络版)》是国家新闻出版广电总局批准的网络连续型出版物(ISSN 2096-4188, CN 11-6037/Z), 所以签约期刊的网络版上网络首发论文视为正式出版。

收稿日期：2025-01-02.

基金项目：国家自然科学基金（32301271）。

作者简介：原文毅（1997-），男，硕士研究生。主要从事植物化学研究。E-mail：y676401247@163.com

通信作者：杨凤仙（1990-），女，博士，助理研究员。主要从事药物化学研究。E-mail：yangfengxian@xtbg.ac.cn

# 金荞麦的化学成分及 $\alpha$ -葡萄糖苷酶抑制活性研究

原文毅<sup>1·2</sup>, 赵霞<sup>1</sup>, 杨凤仙<sup>1</sup>

(1.中国科学院西双版纳热带植物园 中国科学院热带植物资源可持续利用重点实验室, 云南 昆明 650223;

2.中国科学院大学 生命科学学院, 北京 100049)

**摘要：**为研究金荞麦的粗提物及单体化合物的  $\alpha$ -葡萄糖苷酶抑制活性, 用不同溶剂对金荞麦乙醇浸膏进行萃取并对不同萃取部位的  $\alpha$ -葡萄糖苷酶抑制活性进行评估, 再利用多种色谱技术对具有显著  $\alpha$ -葡萄糖苷酶抑制活性的正丁醇部位进行分离和纯化, 从中分离得到 11 个化合物, 运用现代波谱技术进行解析, 鉴定出化合物的结构为木犀草素 (**1**)、马钱苷酸 (**2**)、橙皮苷 (**3**)、(-)-表儿茶素 (**4**)、(+)-儿茶素 (**5**)、槲皮素 (**6**)、山奈酚 (**7**)、芦丁 (**8**)、香叶木素 (**9**)、虎杖苷 (**10**)、 $\alpha$ -三联噻吩 (**11**)。其中, 化合物 **2**、**3**、**10**、**11** 为首次从金荞麦中分离得到。化合物 **1**、**4**、**5**、**6** 具有显著的  $\alpha$ -葡萄糖苷酶抑制活性, 其  $IC_{50}$  值分别为 ( $6.91 \pm 0.38$ )、( $14.93 \pm 0.35$ )、( $15.06 \pm 0.25$ )、( $7.04 \pm 2.62$ )  $\mu\text{mol/L}$ 。

**关键词：**金荞麦; 化学成分; 降糖活性;  $\alpha$ -葡萄糖苷酶

中图分类号：R932 文献标志码：A 文章编号：1672-8513 (XXXX) XX-0001-06

金荞麦 (*Fagopyrum dibotrys* (D.Don) Hara) 又名苦荞头, 是蓼科荞麦属中一种野外保护植物, 主要分布在江苏和陕西等地, 因其具有较高药用价值而被广泛研究。中国古代医学文献中已广泛记载金荞麦, 表明其药用功效早已被古人所认知并投入实用<sup>[1]</sup>。在民间医学实践中, 金荞麦以其清热、利尿、解毒、缓解哮喘和促进脓液排出等作用而被认可, 在治疗急性与慢性支气管炎、哮喘以及某些肺部感染等疾病方面具有着悠久的应用历史<sup>[2]</sup>。以往的化学成分研究表明, 金荞麦化学成分中主要含有丰富的黄酮类化合物, 同时也包含有机酸、花色素缩合性单宁等<sup>[3]</sup>, 现代药理学研究表明金荞麦具有抗氧化、抗肿瘤、抗炎等功能, 其花叶提取物还表现出抗糖尿病的特性<sup>[4]</sup>。在初步研究中发现金荞麦的正丁醇部位具有显著的抑制效果。基于这一发现, 本文进一步对金荞麦正丁醇萃取部位进行细致分离和纯化, 旨在拓展金荞麦化合物种类, 丰富金荞麦中单体化合物的降糖活性研究。

## 1 材料与方法

### 1.1 植物材料

金荞麦购于云南省昆明市官渡区熊阿婆中药材经营部, 标本 (20211001) 现保存于中国科学院西双版纳热带植物园创新药物研究组。

### 1.2 仪器与试剂

核磁共振 (NMR) 仪 (Bruker Avance III 500 MHz、600 MHz, 德国), SQP 型高精度电子天平 (Sartorius, 德国), EYELA 型旋转蒸发仪 (东京理化, 日本), YP5001N 型电子天平 (上海舜宇, 中国), 四元梯度泵 - Waters 2695 型半制备高效液相色谱仪 (Waters, 美国), 旋光仪 (Rudolph, 美国)。

柱色谱用硅胶 (青岛海洋); 乙醇、乙酸乙酯、石油醚、甲醇和二氯甲烷 (工业级, 昆明福海达化), 甲醇 (分析纯, 天津大茂), 甲醇 (色谱纯, 上海星可高); 薄层色谱硅胶板 (GF<sub>254</sub> 型, 青岛海洋), 磷酸盐缓冲液 (PBS) (上海达特希尔), 4-硝基苯-β-D-吡喃葡萄糖苷、α-葡萄糖苷酶 (上海源叶), 阿卡波糖 (上海迈瑞尔)。

### 1.3 实验方法

#### 1.3.1 提取、分离和纯化

晒干粉碎的 20 kg 金荞麦样品, 用体积分数为 90% 的工业乙醇在室温下浸提 4 次 (每次 72 h), 共得到乙醇浸膏 1.3 kg。使用不同溶剂对金荞麦乙醇浸膏分别萃取 3 次, 得到石油醚部位 1.2 g, 乙酸乙酯部位 143.5 g, 正丁醇部位 634.9 g, 水部位 520.4 g。

将正丁醇相的萃取物溶解于水中, 再通过大孔树脂柱进行层析, 采用乙醇水梯度洗脱法 (25%、50%、75%、100%, V/V) 进行洗脱, 最后共分离出 4 个不同组分 (Fr.1 ~ Fr.4)。

Fr.1 (159.5 g) 组分通过 80 ~ 100 目硅胶充分拌样, 经硅胶柱色谱层析 ( $V_{\text{二氯甲烷}} / V_{\text{甲醇}}$ , 20: 1、10: 1、5: 1、1: 1) 梯度洗脱, 洗脱结束后先得到 4 个不同组分, 4 个组分经 TLC 检测后进行合并, 最终得到 2 个组分 (Fr.1-1 和 Fr.1-2), Fr.1-1 (60.4 g) 通过硅胶柱色谱层析, 使用  $V_{\text{二氯甲烷}} / V_{\text{甲醇}} = 10: 1$  作为溶剂进行洗脱, 分离得到化合物 1 (5.2 mg); Fr.1-2 (99.1 g) 的分离: 通过制备 HPLC ( $V_{\text{甲醇}} / V_{\text{水}} = 35: 65$ , 流速 1 mL/min) 洗脱得到 2 (6.2 mg)、3 (7.8 mg)。

Fr.2 (219.4 g) 组分通过 80 ~ 100 目硅胶充分拌样, 经硅胶柱层析 ( $V_{\text{二氯甲烷}} / V_{\text{甲醇}}$ , 20: 1、15: 1、10: 1) 梯度洗脱, 通过 TLC 检测分离为两个组分 (Fr.2-1 和 Fr.2-2), 再经过 Sephadex LH-20, 使用  $V_{\text{二氯甲烷}} / V_{\text{甲醇}} = 1: 1$  作为溶剂进行洗脱, 从 Fr.2-1 (158.2 g) 中分离得到化合物 4 (4.6 mg)、5 (4.8 mg)、6 (6.5 mg), 从 Fr.2-2 (61.2 g) 中分离得到化合物 7 (7.4 mg)。

Fr.3 (158.7 g) 组分和 Fr.4 (97.3 g) 组分经 TLC 与 HPLC 检测后进行合并, 经硅胶柱层析 ( $V_{\text{乙酸乙酯}} / V_{\text{石油醚}}$ , 20: 1、10: 1、5: 1、1: 1) 梯度洗脱, 通过 TLC 检测分离出 2 个组分 (Fr.3-1 和 Fr.3-2)。Fr.3-1 (87.1 g) 的分离: 经 Sephadex LH-20, 使用  $V_{\text{二氯甲烷}} / V_{\text{甲醇}} = 1: 1$  作为溶剂进行洗脱, 通过硅胶柱色谱层析, 使用  $V_{\text{二氯甲烷}} / V_{\text{甲醇}} = 30: 1$  作为溶剂进行洗脱, 最终分离得到化合物 8 (19.4 mg)、9 (5.3 mg); Fr.3-2 (168.9 g) 的分离: 通过硅胶柱色谱层析, 使用  $V_{\text{二氯甲烷}} / V_{\text{甲醇}} = 15: 1$  作为溶剂进行洗脱, 最终分离得到化合物 10 (12.6 mg)、11 (9.4 mg)。

#### 1.3.2 α-葡萄糖苷酶抑制活性实验

参照文献 [5] 的方法, 选择以阿卡波糖为阳性对照; 80 μL 的 PBS、10 μL 的测试化合物样品和 50 μL 的 α-葡萄糖苷酶溶液作为样品组 (A<sub>1</sub>); 由 130 μL 的 PBS 和 10 μL 的测试化合物样品组成样品对照组 (A<sub>2</sub>); 90 μL 的 PBS 和 50 μL 的 α-葡萄糖苷酶溶液组成阴性对照组 (A<sub>3</sub>); 140 μL 的 PBS 组成空白对照组 (A<sub>4</sub>)。

实验在 96 孔板中进行, 每个实验组别均设有三组重复。在 37.5°C 预孵育 15 min。预孵育后, 向各孔添加 40 μL 的底物 pNPG, 同样在 37.5°C 条件下孵育 30min。反应终止时, 向各孔添加 20 μL 的 Na<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> 溶液。最终, 在 405 nm 的波长处检测, 利用酶标仪测定每孔的吸光度值 (A)。通过 Prism 7.0 软件计算得到半数抑制浓度 (IC<sub>50</sub>) 值, α-葡萄糖苷酶抑制活性计算公式如下:

$$\alpha - \text{葡萄糖苷酶抑制率}(\%) = \left[ 1 - \frac{(A1-A2)}{(A3-A4)} \right] \times 100\%. \quad (1)$$

## 2 实验结果

### 2.1 结构鉴定

通过质谱和 NMR 等谱学数据分析及与文献对比鉴定了以下 11 个化合物。

**化合物 1** 黄色粉末, ESI-MS (*m/z*) 285 [M - H]<sup>-</sup>, C<sub>15</sub>H<sub>10</sub>O<sub>6</sub>; <sup>1</sup>H NMR (600 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.32 (2H, m, H-2', H-6'), 6.84 (1H, d, *J* = 8.7 Hz, H-5'), 6.42 (1H, s, H-3), 6.28 (1H, d, *J* = 2.3 Hz, H-8), 6.10 (1H, d, *J* = 2.3 Hz, H-6); <sup>13</sup>C NMR (150 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 182.9 (C-4), 171.8 (C-7), 165.9 (C-2), 162.9 (C-5), 159.9 (C-9), 152.3 (C-4'), 147.6 (C-3'), 123.3 (C-6'), 120.3 (C-1'), 117.0 (C-5'), 113.8 (C-2'), 103.6 (C-10), 103.1 (C-3), 102.2 (C-6), 97.0 (C-8)。以上 <sup>1</sup>H NMR 和 <sup>13</sup>C NMR 数据与文献 [6] 报道基本一致, 确定该化合物为木犀草素。

**化合物 2** 白色粉末, [*a*]<sub>D</sub><sup>20</sup> -43.04 (*c* 0.18, CH<sub>3</sub>OH), ESI-MS (*m/z*) 375 [M - H]<sup>-</sup>, C<sub>16</sub>H<sub>24</sub>O<sub>10</sub>; <sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.38 (1H, s, H-3), 5.27 (1H, d, *J* = 4.4 Hz, H-1), 4.66 (1H, d, *J* = 6.6 Hz, H-1'), 4.05 (1H, t, *J* = 3.8 Hz, H-7), 3.90 (1H, dd, *J* = 10.0, 1.5 Hz, H-7), 3.67 (1H, dd, *J* = 10.0, 4.8 Hz, H-6'), 3.26 ~ 3.39 (3H, m, H-3', H-4', H-5'), 3.20 (1H, m, H-2'), 3.10 (1H, m, H-5), 2.22 (1H, m, H-6a), 2.01 (1H, m, H-9), 1.90 (1H, m, H-8), 1.69 (1H, m, H-6b), 1.11 (3H, d, *J* = 5.9 Hz, H-10); <sup>13</sup>C NMR (125 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 171.3 (C-11), 152.1 (C-3), 114.5 (C-4), 100.2 (C-1'), 97.7 (C-1), 78.5 (C-5'), 78.2 (C-3'), 75.3 (C-7), 74.9 (C-2'), 71.7 (C-4'), 62.9 (C-6'), 46.7 (C-9), 42.8 (C-6), 42.3 (C-8), 32.3 (C-5), 13.6 (C-10)。以上 <sup>1</sup>H NMR 和 <sup>13</sup>C NMR 数据与文献 [7] 报道基本一致, 确定该化合物为马钱苷酸。

**化合物 3** 淡黄色粉末, [*a*]<sub>D</sub><sup>20</sup> -76.24 (*c* 0.26, Pyridine), ESI-MS (*m/z*) 609 [M - H]<sup>-</sup>, C<sub>28</sub>H<sub>34</sub>O<sub>15</sub>; <sup>1</sup>H NMR (600 MHz, Pyridine-*d*<sub>5</sub>) δ 12.50 (1H, s, 5-OH), 11.35 (1H, s, 3'-OH), 8.71 (1H, s, H-2'), 7.56 (3H, m, H-2', H-5', H-6'), 6.72 (1H, d, *J* = 2.2 Hz, H-6), 6.62 (1H, d, *J* = 2.2 Hz, H-8), 5.50 (1H, dd, *J* = 12.9, 2.8 Hz, H-2), 5.51 (1H, d, *J* = 4.9 Hz, Rha-1), 4.99 (3H, s, 4'-OCH<sub>3</sub>), 3.74 (1H, d, *J* = 5.4 Hz, Glc-1), 1.78 (3H, d, *J* = 6.2 Hz, Rha-6); <sup>13</sup>C NMR (150 MHz, Pyridine-*d*<sub>5</sub>) δ 197.5 (C-4), 166.6 (C-7), 164.9 (C-5), 164.0 (C-9), 149.5 (C-4'), 148.9 (C-3'), 132.7 (C-1'), 118.5 (C-6'), 115.6 (C-2'), 112.7 (C-5'), 104.8 (C-10), 102.9 (C-1''), 99.7 (C-1''), 96.8 (C-8), 96.6 (C-6), 80.2 (C-2), 80.0 (C-3''), 79.7 (C-5''), 79.4 (C-2''), 77.8 (C-4''), 74.2 (C-3''), 73.0 (C-2''), 71.7 (C-4''), 70.4 (C-5''), 62.2 (C-6''), 56.5 (4'-OCH<sub>3</sub>), 44.1 (C-3), 19.6 (C-6'')。以上 <sup>1</sup>H NMR 和 <sup>13</sup>C NMR 数据与文献 [8] 报道基本一致, 确定该化合物为橙皮苷。

**化合物 4** 棕黄色粉末, [*a*]<sub>D</sub><sup>20</sup> -63.25 (*c* 0.17, CH<sub>3</sub>OH), ESI-MS (*m/z*) 289 [M - H]<sup>-</sup>, C<sub>15</sub>H<sub>14</sub>O<sub>6</sub>; <sup>1</sup>H NMR (500 MHz, DMSO-*d*<sub>6</sub>) δ 9.15 (1H, brs, 5-OH), 8.93 (3H, overlapped, 7-OH, 3'-OH, 5'-OH), 6.89 (1H, d, *J* = 2.0 Hz, H-2'), 6.66 (1H, overlapped, H-5', H-6'), 5.88 (1H, d, *J* = 2.6 Hz, H-6), 5.71 (1H, d, *J* = 2.6 Hz, H-8), 4.73 (1H, s, H-2), 4.66 (1H, brs, 3-OH), 3.99 (1H, brs, H-3), 2.67 (1H, dd, *J*

$\delta$  = 16.4, 4.5 Hz, H-4a), 2.50 (1H, overlapped, H-4b);  $^{13}\text{C}$  NMR (125 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  156.6 (C-9), 156.3 (C-7), 155.8 (C-5), 144.5 (C-3'), 144.4 (C-4'), 130.7 (C-1'), 118.0 (C-5'), 114.5 (C-2'), 113.8 (C-6'), 99.0 (C-10), 95.1 (C-6), 93.9 (C-8), 77.8 (C-2), 65.0 (C-3), 27.9 (C-4)。以上  $^1\text{H}$  NMR 和  $^{13}\text{C}$  NMR 数据与文献 [9] 报道基本一致, 确定该化合物为 (-)-表儿茶素。

化合物 **5** 棕黄色粉末,  $[\alpha]_{\text{D}}^{20} +14.45$  ( $c$  0.14, CH<sub>3</sub>OH), ESI-MS ( $m/z$ ) 289 [ $\text{M} - \text{H}$ ]<sup>-</sup>, C<sub>15</sub>H<sub>14</sub>O<sub>6</sub>;  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  6.86 (1H, d,  $J$  = 2.3 Hz, H-2'), 6.77 (1H, d,  $J$  = 8.2 Hz, H-5), 6.69 (1H, dd,  $J$  = 8.2, 2.3 Hz, H-6'), 6.01 (1H, d,  $J$  = 2.3 Hz, H-8), 5.88 (1H, d,  $J$  = 2.3 Hz, H-6), 4.60 (1H, d,  $J$  = 7.6 Hz, H-2), 4.01 (1H, m, H-3), 2.90 (1H, dd,  $J$  = 16.2, 5.5 Hz, H-4a), 2.50 (1H, dd,  $J$  = 16.1, 8.2 Hz, H-4b);  $^{13}\text{C}$  NMR (125 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  158.0 (C-7), 157.3 (C-5), 157.1 (C-9), 146.4 (C-4'), 146.4 (C-3'), 132.4 (C-1'), 120.2 (C-6'), 116.2 (C-5'), 115.4 (C-2'), 101.0 (C-10), 96.4 (C-6), 95.6 (C-8), 83.0 (C-2), 68.9 (C-3) 29.0 (C-4)。以上  $^1\text{H}$  NMR 和  $^{13}\text{C}$  NMR 数据与文献 [10] 报道基本一致, 确定该化合物为 (+)-儿茶素。

化合物 **6** 黄色粉末, ESI-MS ( $m/z$ ) 301 [ $\text{M} - \text{H}$ ]<sup>-</sup>, C<sub>15</sub>H<sub>10</sub>O<sub>7</sub>;  $^1\text{H}$  NMR (600 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.81 (1H, d,  $J$  = 2.3 Hz, H-2'), 7.59 (1H, dd,  $J$  = 8.6, 2.3 Hz, H-6'), 6.92 (1H, d,  $J$  = 8.6 Hz, H-5'), 6.38 (1H, d,  $J$  = 2.1 Hz, H-8), 6.17 (1H, d,  $J$  = 2.1 Hz, H-6);  $^{13}\text{C}$  NMR (150 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  177.5 (C-4), 165.7 (C-7), 162.6 (C-8a), 158.3 (C-5), 148.9 (C-4'), 148.1 (C-2), 145.8 (C-3'), 138.3 (C-3), 125.2 (C-1'), 122.0 (C-6'), 116.6 (C-5'), 115.8 (C-2'), 104.4 (C-4), 99.7 (C-6), 93.9 (C-8)。以上  $^1\text{H}$  NMR 和  $^{13}\text{C}$  NMR 数据与文献 [11] 报道基本一致, 确定该化合物为槲皮素。

化合物 **7** 黄色粉末, ESI-MS ( $m/z$ ) 285 [ $\text{M} - \text{H}$ ]<sup>-</sup>, C<sub>15</sub>H<sub>10</sub>O<sub>6</sub>;  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  8.07 (2H, d,  $J$  = 9.0 Hz, H-2', 6'), 6.90 (2H, d,  $J$  = 9.0 Hz, H-3', H-5'), 6.38 (1H, d,  $J$  = 2.1 Hz, H-8), 6.17 (1H, d,  $J$  = 2.1 Hz, H-6);  $^{13}\text{C}$  NMR (125 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  178.2 (C-4), 166.0 (C-7), 163.2 (C-5), 161.1 (C-4'), 158.4 (C-9), 148.2 (C-2), 137.3 (C-3), 130.8 (C-2', 6'), 123.9 (C-1'), 116.4 (C-3', 5'), 104.7 (C-10), 99.4 (C-6), 95.1 (C-8)。以上  $^1\text{H}$  NMR 和  $^{13}\text{C}$  NMR 数据与文献 [12] 报道基本一致, 确定该化合物为山柰酚。

化合物 **8** 白色粉末,  $[\alpha]_{\text{D}}^{20} -38.45$  ( $c$  0.05, Pyridine), ESI-MS ( $m/z$ ) 609 [ $\text{M} - \text{H}$ ]<sup>-</sup>, C<sub>27</sub>H<sub>30</sub>O<sub>16</sub>;  $^1\text{H}$  NMR (600 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.67 (1H, d,  $J$  = 2.2 Hz, H-2'), 7.62 (1H, dd,  $J$  = 8.5, 2.2 Hz, H-6'), 6.87 (1H, d,  $J$  = 8.4 Hz, H-5'), 6.40 (1H, d,  $J$  = 2.1 Hz, H-8), 6.20 (1H, d,  $J$  = 2.1 Hz, H-6), 5.11 (1H, d,  $J$  = 7.7 Hz, H-1''), 4.52 (1H, d,  $J$  = 1.5 Hz, H-1'''), 3.80 (1H, dd,  $J$  = 11.0, 1.4 Hz, H-6a''), 3.63 (1H, dd,  $J$  = 3.4, 1.7 Hz, H-2'''), 3.54 (1H, dd,  $J$  = 9.6, 3.4 Hz, H-3'''), 3.38 ~ 3.46 (3H, overlapped, H-2'', H-3'', H-5'', H-6b''), 3.31 (2H, overlapped, H-5'', H-4'''), 1.12 (1H, d,  $J$  = 6.0 Hz, H-6''');  $^{13}\text{C}$  NMR (150 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  179.6 (C-4), 166.2 (C-7), 163.1 (C-5), 159.5 (C-9), 158.7 (C-2), 150.0 (C-4'), 146.0 (C-3'), 135.8 (C-3), 123.7 (C-1'), 123.3 (C-6'), 117.8 (C-2'), 116.2 (C-5'), 105.6 (C-10), 104.9 (C-1''), 102.6 (C-1'''), 100.1 (C-

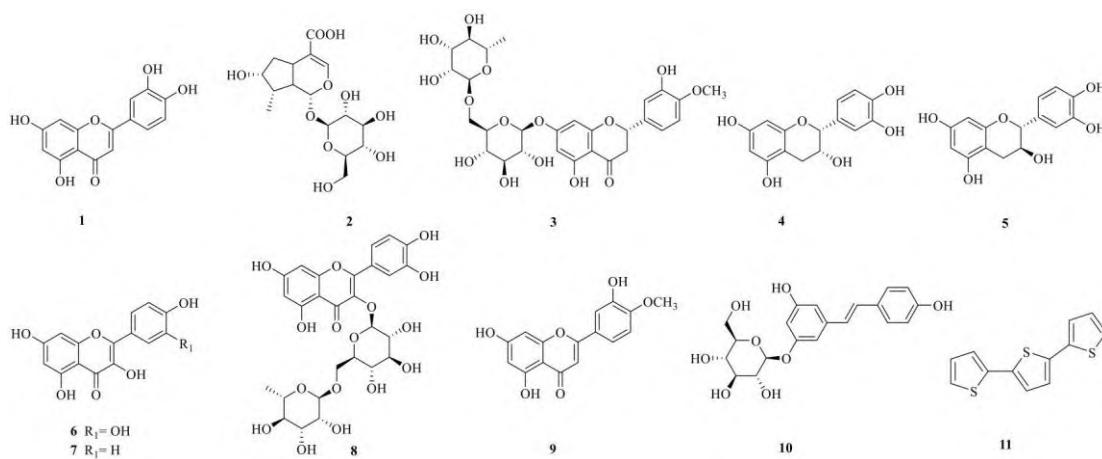
6) , 95.0 (C-8) , 78.3 (C-3") , 77.4 (C-5") , 75.9 (C-2") , 74.0 (C-4'") , 72.5 (C-3'") , 72.2 (C-2'") , 71.5 (C-4") , 70.0 (C-5'") , 68.6 (C-6") , 18.0 (C-6'") 。以上  $^1\text{H}$  NMR 和  $^{13}\text{C}$  NMR 数据与文献 [13] 报道基本一致, 确定该化合物为芦丁。

化合物 **9** 黄色粉末, ESI-MS ( $m/z$ ) 299 [ $\text{M} - \text{H}$ ]  $^-$ ,  $\text{C}_{16}\text{H}_{12}\text{O}_6$ ;  $^1\text{H}$  NMR (600 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  7.48 (1H, dd,  $J = 10.2, 2.7$  Hz, H-6') , 7.37 (1H, d,  $J = 2.7$  Hz, H-2') , 7.06 (1H, d,  $J = 10.3$  Hz, H-5') , 6.56 (1H, s, H-3) , 6.43 (1H, d,  $J = 2.5$  Hz, H-8) , 6.20 (1H, d,  $J = 2.5$  Hz, H-6) , 3.93 (3H, s, 4'-OCH<sub>3</sub>) ;  $^{13}\text{C}$  NMR (150 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  183.8 (C-4) , 166.1 (C-7) , 165.9 (C-5) , 163.2 (C-2) , 159.4 (C-9) , 152.6 (C-4') , 148.2 (C-3') , 125.0 (C-6') , 120.0 (C-1') , 113.9 (C-2') , 112.6 (C-5') , 105.3 (C-10) , 104.4 (C-3) , 100.2 (C-6) , 95.0 (C-8) , 56.5 (4'-OCH<sub>3</sub>) 。以上  $^1\text{H}$  NMR 和  $^{13}\text{C}$  NMR 数据与文献 [14] 报道基本一致, 确定该化合物为香叶木素。

化合物 **10** 白色粉末,  $[\alpha]_{D}^{20} -64.18$  ( $c 0.17$ , CH<sub>3</sub>OH), ESI-MS ( $m/z$ ) 389 [ $\text{M} - \text{H}$ ]  $^-$ ,  $\text{C}_{20}\text{H}_{22}\text{O}_8$ ;  $^1\text{H}$  NMR (600 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.37 (2H, d,  $J = 8.6$  Hz, H-2', H-6') , 7.02 (1H, d,  $J = 16.2$  Hz, H- $\beta$ ) , 6.85 (1H, d,  $J = 16.2$  Hz, H- $\alpha$ ) , 6.77 (2H, d,  $J = 8.6$  Hz, H-3', H-5') , 6.79 (2H, m, H-2, H-6) , 6.45 (1H, m, H-4) , 4.88 (1H, s, H-1") , 3.31 ~ 3.73 (6H, m, H-2" ~ H-6") ;  $^{13}\text{C}$  NMR (150 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  160.6 (C-3) , 159.7 (C-4') , 158.6 (C-5) , 141.6 (C-1) , 130.4 (C-1') , 129.1 (C- $\beta$ ) , 128.2 (C-2', 6') , 126.8 (C- $\alpha$ ) , 116.6 (C-3', 5') , 108.5 (C-6) , 107.1 (C-4) , 104.2 (C-2) , 102.5 (C-1") , 78.4 (C-5") , 78.2 (C-3") , 74.9 (C-2") , 72.1 (C-4") , 63.2 (C-6") 。以上  $^1\text{H}$  NMR 和  $^{13}\text{C}$  NMR 数据与文献 [15] 报道基本一致, 确定该化合物为虎杖昔。

化合物 **11** 白色粉末, ESI-MS ( $m/z$ ) 283 [ $\text{M} + \text{Cl}$ ]  $^-$ ,  $\text{C}_{12}\text{H}_8\text{S}_3$ ;  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  7.22 (2H, d,  $J = 5.1$  Hz, H-5) , 7.17 (2H, d,  $J = 3.6$  Hz, H-3) , 7.08 (2H, s, H-3', H-4') , 7.02 (2H, dd,  $J = 5.0, 3.5$  Hz, H-4) ;  $^{13}\text{C}$  NMR (125 MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  137.1 (C-2) , 136.2 (C-2') , 136.2 (C-5') , 128.0 (C-4) , 124.5 (C-5) , 124.3 (C-3') , 124.3 (C-4') , 123.7 (C-3) 。以上  $^1\text{H}$  NMR 和  $^{13}\text{C}$  NMR 数据与文献 [16] 报道基本一致, 确定该化合物为  $\alpha$ -三联噻吩。

化合物 **1** ~ **11** 的结构见图 1。



## 2.2 $\alpha$ -葡萄糖苷酶抑制活性实验结果

本研究首先评估出金荞麦的正丁醇部位具有显著的  $\alpha$ -葡萄糖苷酶抑制活性, IC<sub>50</sub> 值为 (3.87 ± 0.39)  $\mu\text{g}/\text{mL}$ 。通过对化合物 **1**、**4**、**5**、**6** 的  $\alpha$ -葡萄糖苷酶抑制活性进行实验, 最终确定它们的 IC<sub>50</sub> 值分别为 (6.91 ± 0.38)、(14.93 ± 0.35)、(15.06 ± 0.25)、(7.04 ± 2.62)  $\mu\text{mol}/\text{L}$ , 阿卡波糖 IC<sub>50</sub> 值为 (0.009 ± 0.001)  $\mu\text{mol}/\text{L}$ 。

## 3 结语

本文对金荞麦正丁醇部位的化学成分和  $\alpha$ -葡萄糖苷酶抑制活性进行了研究, 得到 11 个化合物, 包括 8 个黄酮、1 个二苯乙烯、1 个环烯醚萜类、1 个噻吩。化合物 **2**、**3**、**10**、**11** 是首次从金荞麦中分离得到, 化合物 **1**、**4**、**5**、**6** 具有显著的  $\alpha$ -葡萄糖苷酶抑制活性。

从结果可以看到, 金荞麦中黄酮类化合物含量较为丰富, 从活性实验结果可以看到, 黄酮苷元类活性大于苷类活性<sup>[17]</sup>; 从化合物 **1**、**4**、**5** 和 **6** 的活性可以看出, 黄酮类的活性强于二氢黄酮类的活性, 并且 **3** 位有无羟基对活性影响较小; 通过对比化合物 **1**、**9** 的活性结果和化合物 **6**、**7** 的活性结果, 可以看出 **B** 环部位的两个未取代羟基对于这类黄酮苷元的糖苷酶活性是必要的。本文首次发现, 金荞麦正丁醇萃取部位含有能够抑制  $\alpha$ -葡萄糖苷酶的黄酮类活性成分。丰富了金荞麦化合物成分, 同时为金荞麦在  $\alpha$ -葡萄糖苷酶抑制剂领域的潜在应用提供了科学支持。

## 参考文献:

- [1] 康继宏, 宁光, 吴家睿, 等. 中国糖尿病防治研究的现状和挑战 [J]. 转化医学研究 (电子版), 2012, 2 (3) : 1-24.
- [2] 肖瑞希, 陈华国, 周欣. 植物多糖降血糖作用及机制研究进展 [J]. 食品科学, 2019, 40 (11) : 254-260.
- [3] 周桃桃, 郭兆安. 糖尿病肾病发病机制研究进展 [J]. 现代中西医结合杂志, 2021, 30 (34) : 3872-3876.
- [4] 李蕾, 孙美利, 张舒媛, 等. 近十年金荞麦化学成分及药理活性研究进展 [J]. 中医药导报, 2015, 21 (4) : 46-48.
- [5] CHEN X L, ZHANG K, ZHAO X, et al. Triterpenoids from *Kochiae Fructus*: glucose uptake in 3T3-L1 adipocytes and  $\alpha$ -glucosidase inhibition, in silico molecular docking [J]. International Journal of Molecular Sciences, 2023, 24 (3) : 2454.
- [6] 钱一鑫, 康冀川, 何珺, 等. 牡蒿内生真菌 *Pestalotiopsis uvicola* GMH31 固体发酵产物的分离鉴定 [J]. 天然产物研究与开发, 2016, 28 (11) : 1732-1735.
- [7] MUANGROM W, BACHER M, BERGER A, et al. A novel tryptophan-derived alkaloid and other constituents from *Guettarda speciosa* (Rubiaceae: Cinchonoideae - Guettardeae) [J]. Biochemical Systematics and Ecology, 2021, 95: 104239.
- [8] 郭小平, 沈立姿, 郭贻龙. 井边草黄酮类成分及其抗肿瘤活性研究 [J]. 中成药, 2022, 44 (5) : 1484-1489.
- [9] HOLZWARTH M, TRENDEL J M, ALBRECHT P, et al. Cyclic peroxides derived from the marine sponge *Plakortis simplex* [J]. Journal of Natural Products, 2005, 68 (5) : 759-761.
- [10] ZHAO J, ZHOU X W, CHEN X B, et al.  $\alpha$ -Glucosidase inhibitory constituents from *Toona sinensis* [J]. Chemistry of Natural Compounds, 2009, 45: 244-246.
- [11] LIU Y, ZONG T, WANG M, et al. Chemical constituents from the whole plant of *Odontites vulgaris Moench* and their chemotaxonomic significance [J]. Biochemical Systematics and Ecology, 2024, 112: 104764.
- [12] LI Y L, LI J, WANG N L, et al. Flavonoids and a new polyacetylene from *Bidens parviflora* Willd [J]. Molecules, 2008, 13 (8) : 1931-1941.
- [13] 赵建军, 李战国, 丁茜, 等. 大发表的化学成分研究 [J]. 中草药, 2024, 55 (7) : 2152-2159.

- [14] TRA N T, HOA N T T, LINH N T T, et al. Flavonoids from *Alpinia vietnamica*, and their cytotoxic, antioxidative, and  $\alpha$ -glucosidase inhibitory activities [J]. Vietnam Journal of Chemistry, 2024, 62 (1) : 98-102.
- [15] 张雅婷, 黄薇, 任熙, 等. 塔黄抗炎活性成分研究 [J]. 云南民族大学学报(自然科学版), 2023, 32 (6) : 682-686.
- [16] XU L W, WANG G Y, SHI Y P. Chemical constituents from *Tagetes erecta* flowers [J]. Chemistry of Natural Compounds, 2011, 47 (2) : 281-283.
- [17] 李永丽, 王海美, 波拉提·马卡比力, 等. 西伯利亚白刺叶化学成分及其抑制  $\alpha$ -葡萄糖苷酶活性的研究 [J]. 中南药学, 2021, 19 (5) : 827-830.

## Chemical constituents from *Fagopyrum dibotrys* and their $\alpha$ -glucosidase inhibitory activity

YUAN Wen-yi<sup>1,2</sup>, ZHAO Xia<sup>1</sup>, YANG Feng-xian<sup>1</sup>

(1.CAS Key Laboratory of Tropical Plant Resource and Sustainable Use, Xishuangbanna Tropical Botanical Garden, Chinese Academy of Sciences, Kunming 650223, China; 2.College of Life Sciences, University of Chinese Academy of Sciences, Beijing 100049, China)

**Abstract:** In order to study the  $\alpha$ -glucosidase inhibitory activity of the crude extract and monomeric compounds of *Fagopyrum dibotrys*, the ethanol extract of *Fagopyrum dibotrys* was extracted with different solvents and the  $\alpha$ -glucosidase inhibitory activity of different extraction parts was evaluated. Then, a variety of chromatographic techniques were used to separate and purify the n-butanol fraction with significant  $\alpha$ -glucosidase inhibitory activity. Eleven compounds were isolated and analyzed by modern spectroscopic techniques. The structure of the compound was identified as luteolin (1), loganin acid (2), hesperidin (3), (-)-epicatechin (4), (+)-catechin (5), quercetin (6), kaempferol (7), rutin (8), diosmetin (9), polydatin (10),  $\alpha$ -terthiophene (11). Among them, compounds 2, 3, 10 and 11 were isolated from *Fagopyrum dibotrys* for the first time. Compounds 1, 4, 5 and 6 exhibited significant  $\alpha$ -glucosidase inhibitory activities with IC<sub>50</sub> values of (6.91 ± 0.38), (14.93 ± 0.35), (15.06 ± 0.25) and (7.04 ± 2.62)  $\mu$ mol/L, respectively.

**Key words:** *Fagopyrum dibotrys*; chemical constituents; hypoglycemic activity;  $\alpha$ -glucosidase