

Thành phần hóa học và hoạt tính ức chế enzyme α -glucosidase của thân cây Chóp mao (*Salacia chinensis* L.)

Dương Thị Thanh Trúc¹, Đặng Hoàng Phú¹, Lê Hữu Thọ^{1,*}, Đỗ Văn Nhật Trường¹, Nguyễn Xuân Hải¹, Nguyễn Minh Hoàng², Nguyễn Thị Thanh Mai¹, Nguyễn Trung Nhân¹



Use your smartphone to scan this QR code and download this article

TÓM TẮT

Cây Chóp mao là loài cây bụi, có tên khoa học là *Salacia chinensis*, thuộc họ Dây gối (Celastraceae). Thân cây loài này được sử dụng như một vị thuốc dân gian để điều trị bệnh đái tháo đường, viêm thấp khớp, đau lưng, giúp điều hòa kinh nguyệt... Mẫu bột khô thân cây Chóp mao, được thu hái tại tỉnh Phú Yên và trích nóng với dung môi methanol thu được được cao chiết methanol. Tiến hành phân tán hoàn toàn cao methanol vào nước và chiết lỏng-lỏng lần lượt với các dung môi *n*-hexane, CHCl₃ và EtOAc thu được các cao phân đoạn *n*-hexane, CHCl₃, EtOAc và nước. Sắc ký cột nhiều lần trên cao phân đoạn CHCl₃ của loài này đã phân lập được bốn hợp chất tinh khiết là 3-oxolup-20(29)-en-30-al (**1**), betulin-3-caffeate (**2**), 2-(4-hydroxy-3,5-dimethoxyphenyl)ethanol (**3**) và acetosyringone (**4**). Cấu trúc hóa học của các hợp chất này đã được xác định dựa vào phân tích dữ liệu phổ cộng hưởng từ hạt nhân 1D, 2D-NMR, kết hợp với so sánh tài liệu tham khảo. Nghiên cứu hoạt tính ức chế enzyme α -glucosidase của các hợp chất phân lập cho thấy tất cả bốn hợp chất **1-4** đều thể hiện khả năng ức chế enzyme α -glucosidase tại nồng độ thử nghiệm 100 μ M với phần trăm ức chế (I) lần lượt là $9,5 \pm 1,3$, $70,89 \pm 0,25$, $44,2 \pm 1,6$ và $6,7 \pm 1,7$ %. Trong đó, hợp chất betulin-3-caffeate (**2**) và 2-(4-hydroxy-3,5-dimethoxyphenyl)ethanol (**3**) có hoạt tính ức chế enzyme α -glucosidase với giá trị IC₅₀ lần lượt là 69,7 và 152,0 μ M, mạnh hơn chất đối chứng dương acarbose (IC₅₀ = 214,5 μ M).

Từ khoá: Chóp mao, *Salacia chinensis*, α -glucosidase

MỞ ĐẦU

Cây Chóp mao có tên khoa học là *Salacia chinensis* L., phân bố ở Ấn Độ, Myanmar, Trung Quốc, Thái Lan, Malaysia, Indonesia, Philippin, Nhật Bản, Hàn Quốc, Việt Nam^{1,2}. Ở nước ta cây mọc tự nhiên rải rác ở rừng thứ sinh, rừng thưa thuộc các vùng trung du các tỉnh Quảng Bình, Quảng Trị, Thừa Thiên Huế, Ninh Thuận, Đồng Nai, Phú Yên¹. Đây là loài cây bụi cao từ 2-3 m, nhánh không lông. Lá có phiến thon rộng, dài 5-10 cm, dai, không lông, gân phụ 6-8 cặp và bìa có răng nhỏ. Hoa mọc ở nách lá, có mùi thơm, cọng 5-6 mm, cánh hoa màu vàng cao 3 mm, đĩa mật cao, tiểu nhụy 3, noãn sào 3 buồng, 2 noãn, phi quả màu đen, cao 1 cm và hạt đơn³.

Trong dân gian, cây được sử dụng trong một số bài thuốc để điều trị đái tháo đường, viêm khớp, phong thấp, đau lưng, mỏi cơ, giúp điều hòa kinh nguyệt, lợi kinh, làm lạc thai, trị đau kinh nguyệt³. Các nghiên cứu trước đây cho thấy thành phần hóa học của cây Chóp mao rất đa dạng bao gồm các hợp chất triterpenoid, sesquiterpenoid, flavonoid, lignan, polyphenol... Các hợp chất này có hoạt tính sinh học như làm giảm đường huyết trong máu, gây độc một số dòng tế

bào ung thư MCF7, LU, HepG2 và KB. Đặc biệt, loài cây này chứa các hợp chất thiosugar sulfonium sulfate có hoạt tính ức chế enzyme α -glucosidase mạnh^{1,4-7}. Cây Chóp mao có thành phần hóa học và hoạt tính sinh học, tuy nhiên ở nước ta chưa có quan tâm nghiên cứu nhiều đến loài này mà chỉ sử dụng trong y học dân gian ở một số địa phương. Do đó chúng tôi thực hiện nghiên cứu thành phần hóa học của thân cây Chóp mao nhằm góp phần cung cấp thêm thông tin để bổ sung vào bộ dữ liệu cơ sở về cây cỏ Việt Nam.

VẬT LIỆU VÀ PHƯƠNG PHÁP

Đối tượng nghiên cứu

Mẫu thân cây Chóp mao được thu hái tại tỉnh Phú Yên vào tháng 04 năm 2017 và được định danh bởi TS. Đặng Lê Anh Tuấn, Khoa Sinh học – Công nghệ Sinh học, Trường Đại học Khoa học Tự nhiên, ĐHQG-HCM. Sau khi thu hái, phơi khô, xay nhỏ thu được 10 kg bột khô. Mẫu thân cây (DMC-1701) được lưu giữ tại Bộ môn Hóa dược, Trường Đại học Khoa học Tự nhiên, ĐHQG-HCM.

¹Khoa Hóa học, Trường Đại học Khoa học Tự nhiên, ĐHQG-HCM, Việt Nam

²Khoa Công nghệ Sinh học, Trường Đại học Mở Thành phố Hồ Chí Minh

Liên hệ

Lê Hữu Thọ, Khoa Hóa học, Trường Đại học Khoa học Tự nhiên, ĐHQG-HCM, Việt Nam

Email: lhtho@hcmus.edu.vn

Lịch sử

- Ngày nhận: 28-2-2021
- Ngày chấp nhận: 29-6-2021
- Ngày đăng: 16-8-2021

DOI: 10.32508/stdjns.v5i3.1031



Bản quyền

© ĐHQG Tp.HCM. Đây là bài báo công bố mở được phát hành theo các điều khoản của the Creative Commons Attribution 4.0 International license.



Trích dẫn bài báo này: Trúc D T T, Phú D H, Thọ L H, Trường D V N, Hải N X, Hoàng N M, Mai N T T, Nhân N T. Thành phần hóa học và hoạt tính ức chế enzyme α -glucosidase của thân cây Chóp mao (*Salacia chinensis* L.). *Sci. Tech. Dev. J. - Nat. Sci.*; 5(3):1422-1428.

Hóa chất và thiết bị

Máy ghi phổ cộng hưởng từ hạt nhân Bruker-500 MHz với dung môi CDCl_3 , CD_3COCD_3 có chứa chất nội chuẩn TMS, silica gel pha thường (Merck), bản mỏng silica gel pha thường (Merck) và các dung môi *n*-hexane, chloroform, ethyl acetate, ethanol và methanol (Schalau, độ tinh khiết >99%).

Chiết xuất và phân lập

Từ 10 kg bột khô thân cây, đun hoàn lưu với MeOH (3 L, 3 h x 3 lần). Dịch trích được thu hồi dung môi dưới áp suất kém, thu được cao thô MeOH (400 g). Cao MeOH được phân tán hoàn toàn vào nước và tiến hành chiết lỏng-lỏng cao MeOH lần lượt với các dung môi *n*-hexane, CHCl_3 và EtOAc thu được các cao phân đoạn *n*-hexane (25 g), cao CHCl_3 (62 g), cao EtOAc (20 g) và cao nước (290 g). Cao CHCl_3 được sắc ký cột pha thường với hệ dung môi *n*-hexane–EtOAc (0–100% EtOAc), thu được 17 phân đoạn được sắc ký cột silica gel pha thường bằng hệ dung môi *n*-hexane– CHCl_3 với độ phân cực tăng dần từ 0–100% CHCl_3 , thu được 6 phân đoạn (LC7.1 – LC7.6). Tiếp tục sắc ký cột silica gel pha thường bằng hệ dung môi *n*-hexane–acetone với độ phân cực tăng dần từ 0–70% acetone phân đoạn LC7.2, (148 mg) thu được hợp chất 1 (2,9 mg). Phân đoạn LC8 (14 g) được sắc ký cột silica gel pha thường bằng hệ dung môi *n*-hexane–EtOAc với độ phân cực tăng dần từ 0–100% EtOAc, thu được 10 phân đoạn (pd. LC8.1 – LC8.10). Phân đoạn LC8.1 (201 mg) được tiếp tục sắc ký cột silica gel pha thường bằng hệ dung môi *n*-hexane– CHCl_3 với độ phân cực tăng dần từ 0–100% CHCl_3 và sắc ký bản mỏng điều chế với hệ dung môi *n*-hexane–EtOAc (9:1) thu được hợp chất 3 (4,3 mg). Phân đoạn LC8.2 (250 mg) được sắc ký cột silica gel pha thường bằng hệ dung môi *n*-hexane–acetone với độ phân cực tăng dần từ 0–70% acetone thu được hợp chất 2 (4,8 mg). Sắc ký cột silica gel pha thường cho phân đoạn LC9 (1,7 g), hệ dung môi CHCl_3 –acetone với độ phân cực tăng dần từ 0–70% acetone thu được 9 phân đoạn từ LC9.1 đến LC9.9. Tiến hành sắc ký cột silica gel pha thường phân đoạn LC9.3 (271 mg) với hệ dung môi *n*-hexane–EtOAc với độ phân cực tăng dần từ 0–100% EtOAc thu được hợp chất 4 (3,5 mg) (Hình 1).

Quy trình thử hoạt tính ức chế enzyme α -glucosidase

Quy trình thử hoạt tính ức chế enzyme α -glucosidase được thực hiện như sau: mẫu được hòa tan trong dung dịch đệm phosphate 0,01 M, pH 7. Thêm 25 mL enzyme α -glucosidase 0,2 U mL⁻¹, lắc đều, ủ trong

5 phút tại nhiệt độ 37⁰C. Tiếp tục thêm 25 mL dung dịch chất nền *p*-nitrophenyl- α -D-glucopyranoside 3 mM và ủ trong 30 phút tại 37⁰C để phản ứng xảy ra. Sau khi ủ, thêm 375 mL Na_2CO_3 0,1 M để ngừng phản ứng. Dung dịch sau đó được đo quang tại bước sóng 401 nm. Mỗi mẫu thử được thực hiện tại 5 nồng độ 250, 100, 50, 25, 10 μM , mỗi nồng độ thực hiện 3 lần. Khả năng ức chế enzyme α -glucosidase được đánh giá thông qua giá trị phần trăm ức chế (I%):

$$I\% = \frac{A_{\text{control}} - A_{\text{sample}}}{A_{\text{control}}} \times 100\%$$

Trong đó:

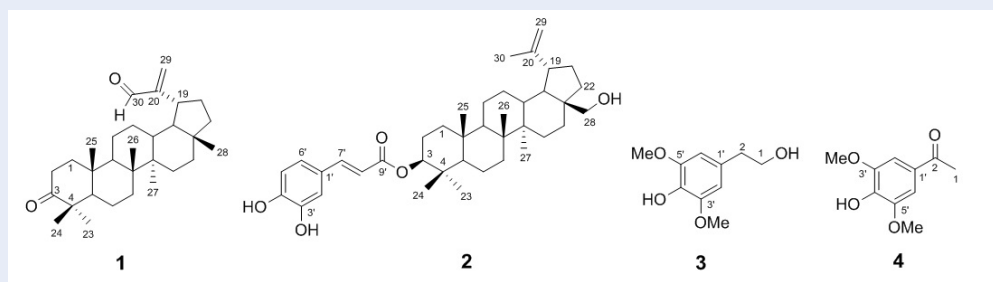
A_{control} : Giá trị mật độ quang của dung dịch không chứa mẫu khảo sát.

A_{sample} : Giá trị mật độ quang của dung dịch chứa mẫu khảo sát.

Dựa trên phần trăm ức chế tại các nồng độ khác nhau của mẫu thử, đánh giá khả năng ức chế enzyme α -glucosidase của mẫu thử thông qua giá trị IC₅₀. Giá trị IC₅₀ được định nghĩa là nồng độ của một mẫu thử mà tại đó nó có thể ức chế được 50% enzyme α -glucosidase. Quy trình sử dụng acarbose là chất đối chứng dương.

KẾT QUẢ VÀ THẢO LUẬN

Hợp chất 1 có màu trắng, tan tốt trong dung môi CHCl_3 . Sắc ký lớp mỏng pha thường với hệ dung môi giải ly *n*-hexane–acetone (8:2) cho vết tròn, hiện vết với thuốc thử H_2SO_4 10%, hơi nóng cho vết màu nâu. Phổ ¹H-NMR (500 MHz, CDCl_3) của hợp chất 1 cho tín hiệu các proton của 6 nhóm methyl đặc trưng của khung lupane [d_H 1,07 (3H, s, H-23), 1,05 (3H, s, H-26), 1,02 (3H, s, H-24), 0,93 (3H, s, H-27), 0,92 (3H, s, H-25) và 0,83 (3H, s, H-28)], 2 proton olefin [d_H 6,28 (1H, brs, H-29a) và 5,91 (1H, brs, H-29b)], 1 proton aldehyde [d_H 9,51 (1H, s, H-30)] cùng nhiều proton methyl và methylene tại vị trí [δ_H 1,00 – 2,49]. Phổ ¹³C-NMR (125 MHz, CDCl_3) của hợp chất 1 có tín hiệu cộng hưởng của 30 carbon tương ứng với các carbon khung lup-3-one. Ở vùng từ trường cao xuất hiện các tín hiệu của 6 carbon methyl [d_C 26,8 (C-23), 21,2 (C-24), 17,9 (C-28), 15,9 (C-26), 16,0 (C-25) và 14,5 (C-27)], cùng với các tín hiệu carbon methine và methylene ở vị trí [δ_C 21,6 – 49,8]. Ở vùng từ trường thấp có sự xuất hiện tín hiệu của 2 carbon olefin [δ_C 157,7 (C-20) và 133,4 (C-29)], một carbon carbonyl aldehyde [δ_C 195,2 (C-30)] và một carbon carbonyl ketone [δ_C 217,9 (C-3)] (Bảng 1). Phân tích phổ HSQC và HMBC của hợp chất 1 cho phép xác định nhóm carbon carbonyl ketone tại vị trí C-3 thông qua tương quan HMBC giữa các proton H-24, H-23 và H-2 với carbon C-3; nhóm aldehyde tại vị trí C-20 thông qua tương quan HMBC của proton olefin H-29

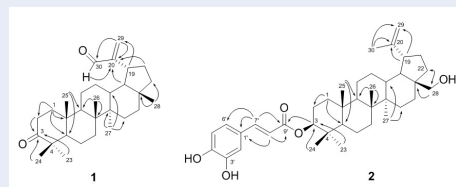


Hình 1: Cấu trúc các hợp chất được phân lập từ thân cây Chóp mao (*Salacia chinensis* L.)

với carbon carbonyl aldehyde C-30 và carbon olefin C-20, proton nhóm aldehyde H-30 với carbon C-20. Từ các dữ liệu phổ 1D, 2D-NMR kết hợp so sánh tài liệu tham khảo⁸, cấu trúc của hợp chất **1** được đề nghị là 3-oxolup-20(29)-en-30-al.

Hợp chất **2** ở dạng bột màu trắng, tan tốt trong dung môi acetone. Sắc kí lớp mỏng pha thường với hệ dung môi giải ly *n*-hexane-CHCl₃-acetone (8:1:1), hiện vết với thuốc thử H₂SO₄ 10%, hơi nóng cho vết màu nâu. Phổ ¹H NMR (500 MHz, acetone-*d*₆) của hợp chất **2** xuất hiện tín hiệu các proton của 6 nhóm methyl đặc trưng của khung lupane [*d*_H 1,70 (3H, s, H-30), 1,08 (3H, s, H-24), 1,05 (3H, s, H-27), 0,93 (3H, s, H-25), 0,92 (3H, s, H-26) và 0,89 (3H, s, H-23)], 2 proton olefin [*d*_H 4,71 (1H, dd, *J* = 2,2; 1,6 Hz, H-29a) và 4,57 (1H, dd, *J* = 2,2; 1,2 Hz, H-29b)], 1 proton oxymethine [*d*_H 4,55 (1H, dd, *J* = 10,0; 5,5 Hz, H-3)], 2 proton oxymethylene [*d*_H 3,75 (1H, d, *J* = 10,3 Hz, H-28a) và 3,30 (1H, d, *J* = 10,3 Hz, H-28b)], cùng nhiều proton methyl và methylene tại vị trí [*δ*_H 0,92 – 2,47]. Ở vùng trường thấp của hợp chất **2** xuất hiện các xuất hiện tín hiệu của nhóm *trans*-caffeoyl, bao gồm 2 proton olefin ghép *trans* [*δ*_H 7,55 (1H, d, *J* = 15,5, H-7') và 6,29 (d, 15,5, H-8')], 3 proton thơm thơm ghép cặp với nhau hệ *ABX* [*δ*_H 7,16 (1H, d, *J* = 2,2, H-2'), 7,05 (1H, dd, *J* = 8,2; 2,2 Hz, H-6'), 6,87 (1H, d, *J* = 8,2 Hz, H-5')]. Phổ ¹³C NMR (125 MHz, acetone-*d*₆) của hợp chất **2** xuất hiện tín hiệu cộng hưởng của 39 carbon. Ở vùng từ trường cao xuất hiện các tín hiệu của 6 carbon methyl [*d*_C 27,9 (C-23), 19,3 (C-30), 17,1 (C-25), 16,6 (C-26), 16,5 (C-24) và 15,2 (C-27)] và các tín hiệu carbon methine và methylene ở vị trí [*δ*_C 21,7 – 49,6]. Ở vùng từ trường thấp có sự xuất hiện tín hiệu 2 carbon olefin [*d*_C 151,7 (C-20) và 110,0 (C-29)], 1 carbon oxymethine [*d*_C 81,0 (C-3)], 1 carbon oxymethylene [*d*_C 59,8 (C-28)], cùng với các tín hiệu của nhóm *trans*-caffeoyl gồm carbon carbonyl ester [*δ*_C 167,2 (C-9')], 2 carbon olefin [*δ*_C 145,3 (C-7') và 116,4 (C-8')], 6 carbon thơm [*δ*_C 116,3 – 146,4] (Bảng 1). Dữ liệu phổ HSQC và HMBC của

hợp chất **2** xuất hiện các tương quan giữa proton H-7' với C-1', C-6' và C-9'; H-8' với C-1', C-9' cho phép xác định có sự hiện diện của một nhóm *trans*-caffeoyl. Nhóm *trans*-caffeoyl này được xác định tại vị trí carbon oxymethine C-3 thông qua tương quan HMBC giữa proton oxymethine H-3 tại *d*_H 4,55 với C-9' tại *d*_C 81,0. Từ các dữ liệu phổ 1D, 2D-NMR, kết hợp so sánh tài liệu tham khảo hợp chất betulin-3-caffeate⁹ cho thấy có sự tương đồng. Vậy hợp chất **2** được đề nghị là betulin-3-caffeate.



Hình 2: Tương quan HMBC (mũi tên) chính của hợp chất **1** và **2**

Bảng 1: Dữ liệu phổ $^1\text{H-NMR}$, $^{13}\text{C-NMR}$ của hợp chất 1 và hợp chất 2

Vị trí	Hợp chất 1 (CDCl_3)		Hợp chất 2 (CD_3COCD_3)	
	δ_H , J (Hz)	δ_C	δ_H , J (Hz)	δ_C
1	1,89 (ddd, 13,2; 7,5; 4,4) 1,30–1,40 (m)	39,8	1,72 (m) 1,07 (m)	39,1
2	2,49 (ddd, 15,6; 9,9; 7,5) 2,39 (ddd, 15,6; 7,6; 4,4)	34,3	1,67 (m)	24,6
3		217,9	4,55 (dd, 10,0; 5,5)	81,0
4		47,5		38,7
5	1,30–1,40 (m)	55,2	0,92 (m)	56,2
6	1,40–1,44 (m)	19,8	1,52 (m)	19,0
7	1,40 (m)	33,8	1,51 (m) 1,44 (m)	34,9
8		40,9		41,8
9	1,30–1,40 (m)	49,8	1,43 (m)	51,2
10		37,0		37,9
11	1,30–1,40 (m)	21,6	1,40 (m); 1,30 (m)	21,7
12	1,00–1,10 (m)	27,8	1,11 (m)	24,6
13	1,64–1,70 (m)	38,0	1,7 (m)	38,2
14		42,9		43,5
15	1,00–1,10 (m)	27,5	1,70 (m); 1,00 (m)	27,9
16	1,40–1,50 (m)	35,5	1,99 (m); 1,37 (m)	30,7
17		43,4		48,7
18	1,64–1,70 (m)	47,5	1,62 (m)	49,6
19	2,77 (m)	47,4	2,47 (dt, 11,0; 5,5)	48,8
20		157,7		151,7
21	2,10–2,20 (m)	32,7	1,99 (m); 1,37 (m)	30,1
22	1,30–1,40 (m)	40,1	1,98 (m); 0,98 (m)	35,0
23	1,07 (s)	26,8	0,89 (s)	27,9
24	1,02 (s)	21,2	1,08 (s)	16,5
25	0,92 (s)	16,0	0,93 (s)	17,1
26	1,05 (s)	15,9	0,92 (s)	16,6
27	0,93 (s)	14,5	1,05 (s)	15,2
28	0,83 (s)	17,9	3,75 (d, 10,3); 3,30 (d, 10,3)	59,8
29	6,28 (brs); 5,91 (brs)	133,4	4,71 (dd, 2,2; 1,6); 4,57 (dd, 2,2; 1,2)	110,0
30	9,51 (s)	195,2	1,70 (s)	19,3
1'				127,7
2'			7,16 (d, 2,2)	115,2
3'				146,4
4'				148,7
5'			6,87 (d, 8,2)	116,3
6'			7,05 (dd, 8,2; 2,2)	122,5
7'			7,55 (d, 15,5)	145,3
8'			6,29 (d, 15,5)	116,4
9'				167,2

Hợp chất **3** là chất bột màu vàng nhạt, tan tốt trong chloroform. Sắc ký lớp mỏng với hệ dung môi *n*-hexane-CHCl₃ (5:5) cho vết tròn, hấp thu bước sóng UV 254 nm, hiện vết với thuốc thử H₂SO₄ 10% hơi nóng, cho vết màu vàng. Phổ ¹H-NMR (500 MHz, CDCl₃) của hợp chất **3** cho thấy có sự hiện diện tín hiệu của 2 proton của vòng thơm có 4 nhóm thế ở vị trí 1, 3, 4, 5 [*d*_H 6,45 (2H, s, H-2', H-6')], 2 nhóm methoxyl [*d*_H 3,88 (6H, s, 3'-OCH₃, 5'-OCH₃)], 1 nhóm oxymethylene [*d*_H 3,83 (2H, t, *J* = 6,5 Hz, H-1)] và 1 nhóm methylene [*d*_H 2,80 (2H, t, *J* = 6,5 Hz, H-2)]. Phổ ¹³C-NMR (125 MHz, CDCl₃) của hợp chất **3** xuất hiện 7 tín hiệu cộng hưởng của 10 carbon bao gồm sáu carbon thơm [δ_C 147,0 (C-4'), 129,6 (C-1'), 133,5 (C-3', C-5'), 105,8 (C-2', C-6')], một carbon oxymethylene [δ_C 63,9 (C-1)], một carbon methylene [δ_C 39,5 (C-2)] và hai carbon methoxyl [δ_C 65,5 (3'-OCH₃, 5'-OCH₃)] (Bảng 2). So sánh dữ liệu phổ 1D-NMR của hợp chất **3** với hợp chất 2-(4-hydroxy-3,5-dimethoxyphenyl)ethanol¹⁰ cho thấy có sự tương đồng. Vậy hợp chất **3** là 2-(4-hydroxy-3,5-dimethoxyphenyl)ethanol.

Hợp chất **4** là chất bột không màu, tan tốt trong dung môi CHCl₃ và acetone. Sắc ký lớp mỏng với hệ dung môi *n*-hexane-CHCl₃ (5:5) cho vết tròn, hấp thu bước sóng UV 254 nm, hiện vết với thuốc thử H₂SO₄ 10% hơi nóng, cho vết màu đen. Phổ ¹H-NMR (500 MHz, acetone-*d*₆) của hợp chất **4** hiện diện tín hiệu của 2 proton thơm có 4 nhóm thế ở vị trí 1, 3, 4, 5 [*d*_H 7,25 (2H, s, H-2', H-6')], 2 nhóm methoxyl [*d*_H 3,96 (6H, s, 3'-OCH₃, 5'-OCH₃)], 1 nhóm methyl [*d*_H 2,57 (3H, s, H-1)]. Phổ ¹³C-NMR (500 MHz, acetone-*d*₆) của hợp chất **4** xuất hiện tín hiệu cộng hưởng của 10 carbon bao gồm 6 carbon thơm [δ_C 146,9 (C-3', C-5'), 141,2 (C-4'), 128,8 (C-1'), 106,0 (C-2',6')], 2 carbon methoxyl [δ_C 56,7 (3'-OCH₃ và 5'-OCH₃)], 1 carbon carbonyl ketone [δ_C 196,6 (C-2)] và 1 carbon methyl [δ_C 26,4 (C-1)] (Bảng 2). So sánh dữ liệu phổ 1D-NMR của hợp chất **4** với hợp chất acetosyringone¹¹ cho thấy có sự tương đồng. Vậy hợp chất **4** là acetosyringone.

Thực hiện thử hoạt tính ức chế enzyme α -glucosidase của các hợp chất phân lập được tại các nồng độ thử nghiệm. Kết quả cho thấy cả bốn hợp chất 3-oxolup-20(29)-en-30-al (**1**), betulin-3-cafeate (**2**), 2-(4-hydroxy-3,5-dimethoxyphenyl)ethanol (**3**) và acetosyringone (**4**) đều có khả năng ức chế enzyme α -glucosidase tại nồng độ thử 100 μ M với phần trăm ức chế (I) lần lượt là 9,5 \pm 1,3, 70,89 \pm 0,25, 44,2 \pm 1,6 và 6,7 \pm 1,7 %. Trong đó, hợp chất **2** và **3** có hoạt tính ức chế enzyme α -glucosidase mạnh với giá trị IC₅₀ lần lượt là 69,7 và 152,0 μ M, mạnh hơn chất đối chứng đường arcarbose (IC₅₀ = 214,5 μ M).

KẾT LUẬN

Từ cao CHCl₃ của thân cây Chóp mao đã phân lập được 4 hợp chất hữu cơ là 3-oxolup-20(29)-en-30-al (**1**), betulin-3-cafeate (**2**), 2-(4-hydroxy-3,5-dimethoxyphenyl)ethanol (**3**), và acetosyringone (**4**). Cấu trúc hóa học của các hợp chất này được xác định dựa vào phân tích phổ NMR kết hợp so sánh tài liệu tham khảo. Nghiên cứu hoạt tính sinh học cho thấy hợp chất betulin-3-cafeate (**2**), 2-(4-hydroxy-3,5-dimethoxyphenyl)ethanol (**3**) có khả năng ức chế enzyme α -glucosidase với giá trị IC₅₀ lần lượt là 69,7 và 152,0 μ M. Nghiên cứu đã bổ sung thêm bằng chứng cho thấy sự hiệu quả của các bài thuốc dân gian có chứa thân cây Chóp mao trong điều trị đái tháo đường.

LỜI CẢM ƠN

Nghiên cứu được tài trợ bởi Đại học Quốc gia Thành phố Hồ Chí Minh (ĐHQG-HCM) trong khuôn khổ Chương trình mã số NCM2020-18-01

DANH MỤC CÁC TỪ VIẾT TẮT

¹H-NMR: Phổ cộng hưởng từ hạt nhân của ¹H.
¹³C-NMR: Phổ cộng hưởng từ hạt nhân của ¹³C.
 HSQC: Phổ tương quan hạt nhân giữa ¹³C và ¹H thông qua 1 liên kết.
 HMBC: Phổ tương quan hạt nhân giữa ¹³C và ¹H thông qua 2, 3 liên kết.

XUNG ĐỘT LỢI ÍCH

Các tác giả cam đoan không có bất kỳ xung đột lợi ích nào trong bài nghiên cứu này.

ĐÓNG GÓP CỦA CÁC TÁC GIẢ

Dương Thị Thanh Trúc, Đỗ Văn Nhật Trường chiết xuất cao chiết và phân lập, xác định cấu trúc các hợp chất, Đặng Hoàng Phú, Lê Hữu Thọ viết bản thảo bài báo, Nguyễn Xuân Hải cung cấp mẫu vật và xác định cấu trúc các hợp chất, Lê Hữu Thọ và Nguyễn Minh Hoàng thử hoạt tính ức chế enzyme α -glucosidase, Nguyễn Thị Thanh Mai, Nguyễn Trung Nhân phân bố cục và chỉnh sửa bản thảo chi tiết. Tất cả các tác giả đã đọc và chấp nhận bản thảo cuối cùng.

TÀI LIỆU THAM KHẢO

1. Laikowski MM, Souza MD, Moura S. Genus Salacia: Chemical composition, antidiabetic effect and other bioactivities. The Natural Products Journal. 2015;5(4):220-235; Available from: <https://doi.org/10.2174/2210315505666150930225628>.
2. Paarakh PM, Patil LJ, Thanga SA. Genus Salacia: A Comprehensive review. Journal of Natural Remedies. 2008;8(2):116-131.

Bảng 2: Dữ liệu phổ $^1\text{H-NMR}$, $^{13}\text{C-NMR}$ của hợp chất 3 và 4 trong dung môi CDCl_3

Vị trí	Hợp chất 3		Hợp chất 4	
	δ_H , J (Hz)	δ_C	δ_H , J (Hz)	δ_C
1	3,83 (t, 6,5)	63,9	2,57 (s)	26,4
2	2,80 (t, 6,5)	39,5		196,6
1'		129,6		128,8
2',6'	6,45 (s)	105,8	7,25 (s)	106,0
3',5'		133,5		146,9
4'		147,3		141,2
3'-OCH ₃	3,88 (s)	56,5	3,96 (s)	56,7
5'-OCH ₃				

- Sellamuthu PS, Arulselvan P, Muniappan BP, Fakurazi S, Kandasamy M. Mangiferin from *Salacia chinensis* prevents oxidative stress and protects pancreatic β -Cells in streptozotocin-Induced diabetic rats. *Journal of Medicinal Food*. 2013;16(8):719-727;PMID: 23957355. Available from: <https://doi.org/10.1089/jmf.2012.2480>.
- Yoshikaway M, Pongpiriyadacha Y, Kishi A, Kageura T, Wang T, Morikawa T, Matsuda H. Biological activities of *Salacia chinensis* originating in Thailand: the quality evaluation guided by α -glucosidase Inhibitory activity. *The Pharmaceutical Society of Japan*. 2003;123(10):871-880;PMID: 14577333. Available from: <https://doi.org/10.1248/yakushi.123.871>.
- Nakamura S, Zhang Y, Matsuda H, Ninomiya K, Muraoka O, Yoshikawa M. Chemical structures and hepatoprotective effects of constituents from the leaves of *Salacia chinensis*. *Chemical and Pharmaceutical Bulletin*, 2011;59(8):1020-1028;PMID: 21804248. Available from: <https://doi.org/10.1248/cpb.59.1020>.
- Nakamura S, Zhang Y, Pongpiriyadacha Y, Wang T, Matsuda H, Yoshikawa M. Megastigmane glycoside from the leaves of *Salacia chinensis*. *Heterocycles*. 2008;75(1): 131-143;Available from: <https://doi.org/10.3987/COM-07-11193>.
- Kobayashi M, Akaki J, Yamaguchi Y, Yamasaki H, Ninomiya K, Pongpiriyadacha Y, Yoshikawa M, Muraoka O, Morikawa T. *Salacia chinensis* stem extract and its thiosugar sulfonium constituent, neokotalanol, improves HbA1c levels in ob/ob mice. *Journal of Natural Medicines*. 2019;73(3):584-588;PMID: 31028661. Available from: <https://doi.org/10.1007/s11418-019-01311-w>.
- Silva SR, Barbosa RCA, Duarte LP, Filho SAV. Lupane pentacyclic triterpenes isolated from stems and branches of *Maytenus imbricata* (Celastraceae). *Helvetica Chimica Acta*. 2005;88:1102-1109;Available from: <https://doi.org/10.1002/hlca.200590081>.
- Patra A, Chaudhuri SK, Panda SK. Betulin-3-caffeate from *Quercus suber*. *13C NMR spectra of some lupenes*. *Journal of Natural Products*.1988;51(7):217-220;Available from: <https://doi.org/10.1021/np50056a004>.
- Yang F, Lian G, Yu B. Synthesis of raphanuside, an unusual oxathiane-fused thioglucoside isolated from the seeds of *Raphanus sativus* L. *Carbohydrate Research*. 2010;345(2):309-314;PMID: 20004368. Available from: <https://doi.org/10.1016/j.carres.2009.11.020>.
- Ren H, Zhai H, Zhang Y, Jin Y, Omori S. Isolation of acetosyringone and cinnamic acids from straw soda cooking black liquor simplified synthesis of hydroxyacetophenones. *Cellulose Chemistry and Technology*. 2013;47(3,4):219-229;.

Chemical constituents and their α -glucosidase inhibitory activity of the stem of *Salacia chinensis* L.

Truc Thanh Thi Duong¹, Phu Hoang Dang¹, Tho Huu Le^{1,*}, Truong Nhat Van Do¹, Hai Xuan Nguyen¹, Hoang Minh Nguyen², Mai Thanh Thi Nguyen¹, Nhan Trung Nguyen¹



Use your smartphone to scan this QR code and download this article

ABSTRACT

Salacia chinensis L., known as "Chop mao" in Vietnam, is a climbing shrub belonging to the Celastraceae family. The stem of *S. chinensis* L. is used as a traditional medicine to treat of diabetes, rheumatoid arthritis, back pain, and regulate menstruation... The dried powdered stem of *S. chinensis* L. was collected in Phu Yen province and was extracted with methanol to yield the methanol extract. The methanol extract was suspended in H₂O and partitioned successively with-hexane, CHCl₃, EtOAc to obtain -hexane, CHCl₃, EtOAc, and H₂O fractions, respectively. The CHCl₃ fraction was subjected to a series of chromatographic separation to afford four compounds, including 3-oxolup-20(29)-en-30-al (**1**), betulin-3-caffeate (**2**), 2-(4-hydroxy-3,5-dimethoxyphenyl)ethanol (**3**), and acetosyringone (**4**). Their structures were elucidated on the basis of the spectroscopic analysis and comparison with literature data. The isolated compounds were tested for their α -glucosidase inhibitory activity. The result showed that all compounds (**1–4**) possessed α -glucosidase inhibitory activity at the testing concentration of 100 μ M with the percent inhibition values of 9.5 ± 1.3 , 70.89 ± 0.25 , 44.2 ± 1.6 , and 6.7 ± 1.7 %, respectively. In addition, betulin-3-caffeate (**2**) and 2-(4-hydroxy-3,5-dimethoxyphenyl)ethanol (**3**) showed more potent α -glucosidase inhibitory activity, with IC₅₀ values of 69.7 and 152.0 μ M, respectively, than that of the positive control acarbose (IC₅₀ = 214.5 μ M).

Key words: Chop mao, *Salacia chinensis*, α -glucosidase

¹Faculty of Chemistry, University of Science, VNU-HCM, Vietnam

²Faculty of Biotechnology, Ho Chi Minh City Open University

Correspondence

Tho Huu Le, Faculty of Chemistry, University of Science, VNU-HCM, Vietnam

Email: lhtho@hcmus.edu.vn

History

- Received: 28-2-2021
- Accepted: 29-6-2021
- Published: 16-8-2021

DOI : 10.32508/stdjns.v5i3.1031



Copyright

© VNU-HCM Press. This is an open-access article distributed under the terms of the Creative Commons Attribution 4.0 International license.



Cite this article : Duong T T T, Dang P H, Le T H, Do T N V, Nguyen H X, Nguyen H M, Nguyen M T T, Nguyen N T. **Chemical constituents and their α -glucosidase inhibitory activity of the stem of *Salacia chinensis* L.** . *Sci. Tech. Dev. J. - Nat. Sci.*; 5(3):1422-1428.