

研究简报

我校研制的棉酚在 1995 年美国召开的 发明家年会上荣获年会大奖

张大煜

(食品学院)

发现棉酚可用作男性节育药已为时很久,但由于服用此药物后会产生低血钾肌无力症状,致使这个药迟迟未能推广。近年来,我校坚持不断研究提高此药品的质量和纯度,配合国内以中国科学院上海药物研究所为主的许多研究单位作临床试验,结果表明棉酚已可作为有效的、安全的男性避孕药而几乎无副作用。

1995 年 9 月在美国加州召开的发明家年会和新产品展示会上,我校研制的棉酚作为男性避孕药荣获年会大奖。

1 棉酚的性质及其“毒性”

1.1 棉酚的性质

棉酚是存在于棉籽仁的色腺体内的一种色素,它是一种天然化合物,分子式为 $C_{30}H_{30}O_8$, 分子量为 518. 化学名称为 2,2'[8-甲酰基-1,6,7-三羟基-5-异丙基-3-甲基]联苯。

纯净的棉酚为黄色固体,溶于甲醇、乙醇、异丙醇、乙醚、丙酮、氯仿等有机溶剂,微溶于环己烷及高沸点的石油醚,不溶于低沸点的石油醚及水。加热时熔化并分解。因在不同的溶剂中重结晶而使制得的纯棉酚具有不同的熔点。棉酚无臭,遇光、热易变质。和苯胺反应生成稳定的二苯胺棉酚;和低分子脂肪酸形成络合物;可形成稳定的二脲、二脲及 2,4-二硝基苯脲;作为多元酚可生成酯类及醚类化合物。

1.2 棉酚的“毒性”

由于动物食用棉籽仁后会产生中毒症状甚至死亡而公认为棉籽有毒,且系棉酚造成。实验发现棉籽仁中所含色腺体毒性比纯棉酚更强,而毒性比色腺体更大的是棉籽绿色素。棉酚的 LD_{50} 为 2570mg/kg 体重;棉籽色腺体的 LD_{50} 为 1120mg/kg 体重;棉籽绿色素的 LD_{50} 为 660mg/kg 体重。

收稿日期: 1995-11-09

2 棉酚在医药上的功用

1981年我国卫生部在无锡召开了第二次全国棉酚工作会议,把棉酚课题列为“六五”国家重大科技项目。我校被指定为醋酸棉标准样品的供应者。多年来我校不断钻研改进制取和精制工艺,把提高棉酚质量、纯度放在首位,在和中国科学院上海药物研究所等单位密切合作下,现经国内外万人以上临床试验获得反馈信息:服用我校提供的醋酸棉酚能有效地、安全地实现男性避孕而无副作用,基本上攻克了服用棉酚产生低血钾肌无力症的难题。服用棉酚会产生副作用可能与其中的杂质有关,事实证明,棉酚精制品的纯度越高,服用后产生的“毒性”及副作用就越小。我校醋酸棉酚的纯度已由97%~98%提高到99%以上,当从文献中查阅到类棉酚色素特别是棉籽绿色素毒性比棉粉大3倍时,用特别的方法对绿色素进行分离。制成的醋酸棉酚产品色泽浅黄且具光泽。通过紫外分光光度计及核磁共振仪分析检测,严格质量把关。

美国以洛克菲勒基金会为首的国际医学组织高度重视我国学者有关棉酚作男性避孕药的研究,洛氏基金会人口科学处主任 Sheldon J. Segal 先生所著《Gossypol A Potential Contraceptive for Men》一书中,有多篇论文及电子显微镜的图片揭示了棉酚的避孕作用。Sheldon J. Segal 说:“自从开发妇女口服避孕药以来,人们也致力于开发抑制男性生育力的合适药物,为此曾使用过多种抗代谢的药物和类固醇激素。但此类药物严格说来,是难以用作今后的男性避孕药,因为服后均会引起周身不适的副反应。当开发一种可逆的、安全的、男性避孕药的各种通道看来都已堵塞时,中国学者发现的天然化合物棉酚却既可抑制精子的产生又可减少精子的成活率”。并认为中国学者发现的棉酚将成为未来最有可能的、有效的、安全的、可逆的男性避孕药。以洛氏基金会为首的国际医学组织加紧了有关棉酚药物的研究。

最近的研究又多次发现棉酚可用作抗肿瘤药物,我国学者通过临床试验证实对胃癌有效率为63.4%,对肺癌有效率为50.1%,对肝癌有效率为48.1%。这个结果也被吉林大学分子生物系和上海药物研究所及上海细胞所的学者的研究所证实:棉酚对一些癌症,特别是消化道的癌症病人有疗效。美国南部地区研究中心(SRRC)的著名学者 P. J. Hron 曾报道棉酚可用作南美锥虫病的有效抑制剂,对此病以前并无有效措施。他还报道过棉酚对人体胰腺癌有抑制作用和可杀死90%的黑色素瘤和结肠癌细胞。也有报道棉酚可治疗白血病以延长病人的生命。使用棉酚作抗癌药物时几乎不会损伤正常人体细胞和几乎不产生副作用。