

其他

具类辣素结构乙酰胺的合成及其抑菌、抑藻性能

王璇, 姜晓辉*, 于良民, 朱立伟

(中国海洋大学 海洋化学理论与工程技术教育部重点实验室, 山东 青岛 266100)

摘要: 以取代芳香烃和 *N*-羟甲基乙酰胺为原料, 采用傅-克烷基化反应设计合成了 7 种具类辣素结构乙酰胺化合物(I~VII)。利用 IR 和 ¹HNMR 对其结构进行了表征。以大肠杆菌和金黄色葡萄球菌为受试菌评价了其抑菌活性, 以三角褐指藻、中肋骨条藻和旋链角毛藻为受试藻评价了其抑藻活性。结果表明: 7 种化合物对 2 种菌和 3 种藻均具有较好的抑制作用, 其中以 3-乙酰胺甲基-4-肉桂苯酚(VII)的抑制作用最好, 最小抑菌浓度可达到 0.0625 g/L, 且质量浓度为 3 g/L 时抑菌率与抑藻率均超过 90%。

关键词: 辣素; 类辣素结构乙酰胺; 抑菌性; 抑藻性

中图分类号: 0000 文献标识码: A 文章编号: 1003-5214(2019)03-0534-07

Synthesis, Bacteriostatic Activity and Anti-alga Capability of Acetamide Containing Capsaicin Moieties

WANG Xuan, JIANG Xiao-hui*, YU Liang-min, ZHU Li-wei

(Key Laboratory of Marine Chemistry Theory and Technology, Ministry of Education, Ocean University of China, Qingdao 266100, Shandong, China)

Abstract: Seven kind of new acetamide compounds containing capsaicin moieties (I~VII) were synthesized from aromatic hydrocarbons with *N*-hydroxymethylacetamide via Friedel-Crafts alkylation reaction and characterized by IR and ¹HNMR. Their bacteriostatic activities were evaluated by *Escherichia coli* and *Staphylococcus aureus*. Their algal inhibition activities against *Phaeodactylum cornutum*, *Skeletonema costatum* and *Chaetoceros curviusetus* were also evaluated. The results showed that all of compounds exhibited good inhibition effects against two kinds of bacteria and three kinds of algae. In particular, compound VII (*N*-[2-hydroxy-5-(1-methyl-1-phenyl-ethyl)-benzyl]-acetamide) had the best inhibition effect. The minimal antibacterial concentration was 0.0625 g/L, and both bacteriostatic rate and alga growth inhibition rate were over 90% at 3 g/L.

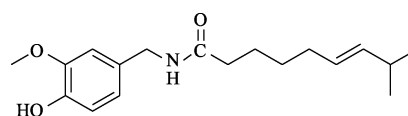
Key words: capsaicin; acetamide containing capsaicin moieties; antibacterial activity; anti-alga capability

Foundation items: Special Fund for Basic Scientific Research Business Fees of Central Universities (201562026); Aoshan Talents Cultivation Program Supported by Qingdao National Laboratory for Marine Science and Technology (2017ASTCP-OS02)

开发和利用海洋资源已经成为 21 世纪的主流, 但在人类的开发和利用过程中, 问题也随之而至, 如码头、渔具、船体等都附着大量的海洋污损生物, 不仅为航运安全带来隐患, 也大大增加了成本消耗。含有机锡防污剂的传统防污涂料能够有效地预防海洋生物的附着, 但有机锡防污剂会严重危害海洋生态环境和人体健康, 因此, 寻求高效能、环境友好、

使用寿命较长的新型防污剂来替代传统的防污剂成为当务之急^[1-2]。

辣素是植物辣椒中引起辛辣味的主要物质, 是一种稳定的生物碱, 结构式如下所示。



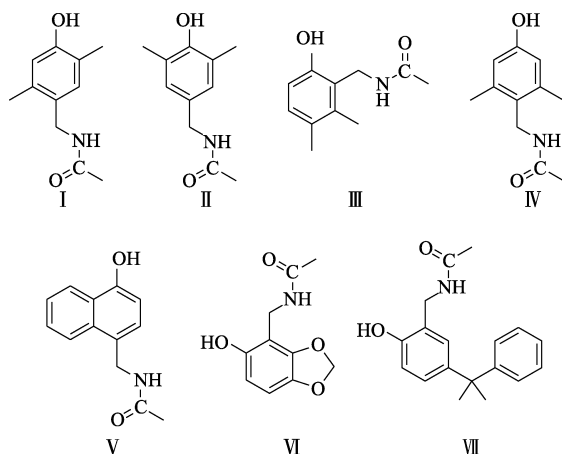
收稿日期: 2018-08-06; 定用日期: 2018-11-08; DOI: 10.13550/j.jxhg.20180579

基金项目: 中央高校基本科研业务费专项资金(201562026); 青岛海洋科学与技术国家实验室“鳌山人才”培养计划项目(2017ASTCP-OS02)

作者简介: 王璇(1992—), 女, 硕士生。联系人: 姜晓辉(1978—), 女, 高级工程师, E-mail: 278155816@qq.com。

辣素具有镇痛^[3-5]、抗癌^[6-10]、消炎^[11-12]、抗菌^[13]及抗藻^[14]等活性, 它作为一种天然植物提取物, 有着良好的应用前景, 可广泛应用于医学、药物、日用及船业等领域^[14]。研究发现, 辣素还具有良好的防污性能, 在含量较少时即可表现出良好的防污性能^[15]。然而, 天然辣素获取过程工艺复杂、成本高, 通过设计简单的方法合成出与辣素的活性、环境特性相似的辣素衍生物作为防污剂显得尤为重要^[16]。

由天然辣素的结构可知, 辣素的活性片段有酚羟基、取代芳香环、酰胺基和含双键的长链烷基, 任何一个片段发生变化都会影响整个化合物的性质^[17]。本文从辣素结构出发, 利用傅-克烷基化反应将天然辣素中的取代芳香环、酚羟基和酰胺基等活性基团构筑到同一分子结构中, 设计合成 7 种具类辣素结构乙酰胺化合物, 结构如下所示。乙酰胺基的引入在提升化合物的抑制活性的同时会降低化合物疏水性, 从而使其易被环境降解, 符合环境友好的设计理念^[18-20]。



1 实验部分

1.1 试剂与仪器

N-羟甲基乙酰胺, AR, 上海亚兴生物医药科技有限公司; 2,5-二甲酚、2,6-二甲酚、3,4-二甲酚、3,5-二甲酚、1-萘酚、芝麻酚、4-肉桂苯酚、无水乙醇、丙酮、石油醚、乙酸乙酯、 CCl_4 、 H_2SO_4 (质量分数 98%)、 AlCl_3 、 NaCl , AR, 国药集团化学试剂有限公司; 营养琼脂、营养肉汤, AR, 北京陆桥技术股份有限公司。

大肠杆菌 (*E. coli*) 和金黄色葡萄球菌 (*S. aureus*) 均来自中国海洋大学生命学院微生物实验室; 三角褐指藻 (*Phaeodactylum tricornutum*)、中肋骨条藻 (*Skeletonema costatum*) 和旋链角毛藻 (*Chaetoceros curvisetus*) 均来自中国海洋大学水产学院藻种室。

AVANCE-III 600 MHz 核磁共振波谱仪, 瑞士布

鲁克公司; AVATAR-360 红外光谱仪, 美国 NICOLET 公司; U-2800 紫外可见分光光度计, 日本 HITACHI 公司; MLS-3750 高压蒸汽灭菌器, 日本三洋电机株式会社; 超净工作台, 苏州净化仪器有限公司; SPX-160B 电热恒温培养箱, 上海福玛实验设备有限公司。

1.2 化合物的合成、提纯与表征

在 250 mL 三口瓶中依次加入 10.69 g (0.12 mol) *N*-羟甲基乙酰胺、12.22 g (0.1 mol) 2,5-二甲酚、10 mL 浓 H_2SO_4 和 100 mL 无水乙醇, 在 35~40 °C 油浴中搅拌反应, 并用薄层色谱法 [展开剂为 *V* (石油醚) : *V* (乙酸乙酯) = 1 : 2] 监控反应 72 h 后结束, 反应结束后会产生大量固体, 减压过滤, 滤饼用去离子水充分洗涤至中性, 即可得产物 I 的粗产物, 用无水乙醇重结晶得纯产物 I。

其他辣素衍生物的合成提纯方法同上, 表征结果如下:

N-(2,5-二甲基-4-羟基苜基)乙酰胺 (I): 白色粉末, 产率 39.96%。IR (KBr), ν/cm^{-1} : 747.76, 1094.75, 1285.23, 1447.93, 1508.35, 1561.79, 1639.24, 2848.28, 2920.31, 3103.87, 3288.21。¹HNMR(DMSO, 600 MHz), δ : 1.82(s, 3H, CH_3), 2.04(s, 3H, CH_3), 2.12(s, 3H, CH_3), 4.06(d, 2H, CH_2), 6.61(s, 1H, PhH), 6.86(s, 1H, PhH), 8.05(s, 1H, NH), 9.16(s, 1H, OH)。

N-(3,5-二甲基-4-羟基苜基)乙酰胺 (II): 白色粉末, 产率 46.41%。IR (KBr), ν/cm^{-1} : 666.42, 1024.10, 1154.37, 1202.56, 1271.84, 1381.78, 1483.43, 1493.22, 1559.45, 1625.75, 1746.23, 2859.19, 2916.42, 3349.40。¹HNMR(DMSO, 600 MHz), δ : 1.83(s, 3H, CH_3), 2.13(s, 6H, CH_3), 4.05(s, 1H, CH_2), 4.06(s, 1H, CH_2), 6.78(s, 2H, PhH), 8.14(s, 1H, OH), 8.24(s, 1H, NH)。

N-(2,3-二甲基-6-羟基苜基)乙酰胺 (III): 白色粉末, 产率 44.72%。IR (KBr), ν/cm^{-1} : 726.25, 1009.55, 1094.75, 1242.69, 1292.25, 1377.45, 1440.96, 1488.98, 1561.79, 1618.33, 2608.95, 2665.49, 2934.25, 3096.90, 3302.15。¹HNMR(DMSO, 600 MHz), δ : 1.85(s, 3H, CH_3), 2.08(s, 3H, CH_3), 2.10(s, 3H, CH_3), 4.08(d, 2H, CH_2), 6.59(s, 1H, PhH), 6.83(s, 1H, PhH), 8.27(s, 1H, NH), 9.27(s, 1H, OH)。

N-(2,6-二甲基-4-羟基苜基)乙酰胺 (IV): 白色粉末, 产率 39.47%。IR (KBr), ν/cm^{-1} : 853.87, 1278.31, 1370.48, 1455.70, 1554.07, 1618.33, 2665.49, 2910.24, 082.96, 3274.27, 3429.95。¹HNMR(DMSO, 600 MHz), δ : 1.81(s, 3H, CH_3), 2.15(s, 3H, CH_3), 2.22(s, 3H, CH_3), 4.13(d, 2H, CH_2), 6.45(s, 1H, PhH), 6.47(s, 1H, PhH), 8.17(s, 1H, NH), 9.66(s, 1H, OH)。

4-乙酰胺甲基-1-萘酚 (V): 灰色粉末, 产率 45.73%。IR (KBr), ν/cm^{-1} : 754.73, 1021.91, 1084.25, 1284.27, 1375.25, 1433.99, 561.79, 1618.33, 1929.69, 2923.80, 3069.06, 3302.15。¹HNMR(DMSO, 600 MHz), δ : 1.91(s, 3H, CH_3), 4.34(d, 2H, CH_2), 7.29(d, *J*=

8.4 Hz, 1H, PhH), 7.36(d, $J=7.80$ Hz, 1H, PhH), 7.45(m, 2H, PhH), 7.80(m, 1H, PhH), 8.20(m, 1H, PhH), 9.15(s, 1H, NH), 10.44 (s, 1H, OH)。

2-乙酰胺甲基-芝麻酚(VI): 白色粉末, 产率 48.41%。IR (KBr), ν/cm^{-1} : 747.76, 931.33, 1038.21, 1179.17, 1221.77, 1292.25, 1442.51, 1490.53, 1561.79, 1632.27, 2687.95, 2920.31, 3103.87, 3295.18。¹HNMR(DMSO, 600 MHz), δ : 1.85(s, 3H, CH₃), 4.06(d, 2H, CH₂), 5.87(s, 2H, CH₂), 6.47(s, 1H, PhH), 6.65(s, 1H, PhH), 8.33(t, $J=5.40$ Hz, 1H, NH), 9.48(s, 1H, OH)。

2-乙酰胺甲基-4-肉桂苯酚(VII): 淡黄色粉末, 产率 69.52%。IR (KBr), ν/cm^{-1} : 705.16, 1038.21, 1235.71, 1447.73, 1505.25, 1547.07, 1660.93, 2304.56, 2375.04, 2856.80, 2927.28, 3323.84, 3741.31。¹HNMR(DMSO, 600 MHz), δ : 1.58(s, 6H, CH₃), 1.82(s, 3H, CH₃), 4.12(d, 2H, CH₂), 6.70(d, $J=8.40$ Hz, 1H, PhH), 6.89(m, 1H, PhH), 6.99(d, $J=2.40$ Hz, 1H, PhH), 7.14(t, $J=6.60$ Hz, 1H, PhH), 7.18(s, 1H, PhH), 7.20(d, $J=1.20$ Hz, 1H, PhH), 7.24(s, 1H, PhH), 7.25(d, $J=7.80$ Hz, 1H, PhH), 8.31(t, $J=5.40$ Hz, 1H, NH), 9.51(s, 1H, OH)。

1.3 生物活性测试

作为高活性环保型抑制剂, 辣素具有良好的抑菌和抑藻功能, 是一种可以有效抑制海洋污损生物附着与生长的活性物质^[16]。本文选取自然界常见的大肠杆菌、金黄色葡萄球菌、三角褐指藻、中肋骨条藻和旋链角毛藻为受试微生物对化合物的生物活性进行了测试。

1.3.1 抑菌性测试

1.3.1.1 培养基及菌悬液的制备

称取 33 g 营养琼脂于 1 L 的蒸馏水中搅拌至完全溶解, 121 °C 高温杀菌 10 min, 待冷却至 50 °C 制成固体培养基待用。称取 19 g 营养肉汤于 1 L 蒸馏水中摇晃至充分溶解, 121 °C 高温杀菌 10 min, 冷却至室温制成液体培养基待用。使用前经紫外灯充分照射, 以确保实验的无菌条件。

将大肠杆菌和金黄色葡萄球菌置于 37 °C 下充分活化, 用接种环刮取斜面培养基上活化的新鲜菌株接种到无菌液体培养基中, 培养 24 h。

1.3.1.2 最小抑菌浓度的测定

采用二倍稀释法, 将反应生成的 7 种类辣素结构乙酰胺化合物配成初始质量浓度为 2 g/L 的丙酮溶液, 用无菌液体培养基按等体积依次进行两倍稀释, 且以不添加化合物的丙酮溶液为对照组, 混合均匀后, 分别向每个试管中加入 200 μL 的菌悬液放入恒温 37 °C 环境下振荡培养 24 h, 在两种菌的最大吸收波长处依次测定每支试管中菌液的吸光度值, 绘制化合物浓度-吸光度值曲线, 即可得各化合物的最小抑菌浓度 (MIC)^[21-22]。

1.3.1.3 抑菌率测定

采用稀释涂布平板法, 将一定量质量浓度为 3 g/L 的化合物丙酮溶液加入到含稀释新鲜菌液的试管中, 37 °C 下培养 18 h, 之后将培养样品的菌液用无菌生理盐水依次稀释 10 倍, 混合均匀, 吸取 200 μL 于固体培养基上, 并用三角涂布棒均匀涂布于固体培养基表面至菌液完全被固体培养基吸收, 每个样品的每个浓度重复实验 3 次, 37 °C 下恒温培养 18 h, 计算活菌数 C , 以不添加化合物的试管为对照样, 计算活菌数 B , 并根据下式计算抑菌率^[23-24]:

$$R/\%=(1-C/B)\times 100$$

式中: R 为抑菌率, %; C 为处理菌生长量, 个; B 为对照菌生长量, 个。

1.3.2 抑制海藻生长活性实验

以三角褐指藻、中肋骨条藻和旋链角毛藻为受试藻种, 将经过玻璃砂芯漏斗过滤的海水高温杀菌后作为培养液, 按表 1 配方配成营养液, pH=8.0 \pm 0.1。将接种后的藻种置于光照强度为 4000 lux、光暗比为 12:12、温度为 20 °C 的人工气候箱内培养^[25]。

表 1 营养液配方

Table 1 Formula of the nutrient solution

藻类	体积分数/%				
	维生素	硝酸钠	硅酸钠	痕量元素	磷酸钠
容量 (mL/L 海水)	0.5	1.0	1.0	0.5	1.0

1.3.2.1 藻液吸光值-浓度线性关系的测定

利用紫外分光光度计全波长扫描得到藻液的最大吸收波长后, 将培养到指数生长期的藻液用培养液稀释成不同吸光值的藻液, 充分摇匀, 并在最大吸收波长处测量各稀释藻液的吸光值。用血球计数板计数得到不同稀释藻液的藻细胞个数, 并作出吸光值-藻液浓度曲线, 得出线性回归方程^[26]。

1.3.2.2 化合物对藻类生长活性的抑制作用

取一定量质量浓度为 3 g/L 的化合物溶液处于指数生长阶段的藻液中, 配成一定浓度的受试化合物藻液, 并定时检测锥形瓶中藻液的吸光值, 由吸光值-藻液浓度的线性关系计算藻液浓度, 进而绘制时间-吸光值-藻液浓度曲线, 以测定合成化合物对海藻生长的抑制性^[27-28]。

2 结果与讨论

2.1 化合物单体的表征

以化合物 I 为例进行结构的解析。

由化合物 I 的红外光谱数据可知, 在 3288.21 cm^{-1} 处出现 N—H 的伸缩振动吸收峰, 在 3103.87 cm^{-1} 处出现苯环中 C—H 的伸缩振动吸收峰, 在 2920.31 cm^{-1} 处出现 O—H 的伸缩振动吸收峰, 在 2848.28 cm^{-1} 处

出现(亚)甲基中 C—H 的伸缩振动吸收峰, 在 1639.24 cm^{-1} 处出现仲酰胺 I 带羰基伸缩振动吸收峰, 在 1447.93 、 1508.35 和 1561.79 cm^{-1} 处出现苯环骨架的伸缩振动吸收峰, 在 1285.23 cm^{-1} 处出现酚羟基中 C—O 的伸缩振动吸收峰, 在 1094.75 cm^{-1} 处出现了 C—N 的伸缩振动吸收峰, 在 747.76 cm^{-1} 处出现苯环中 C—H 的面外弯曲振动吸收峰。

由化合物 I 的共振氢谱数据可知, 除去溶剂峰对积分值的影响, 各峰的归属都很容易确定。甲基氢的化学位移为 1.82、2.04 和 2.12, 亚甲基氢的化学位移为 4.06, 苯环上氢的化学位移分别为 6.61 和 6.86, 酰胺上氢的化学位移为 8.05, 酚羟基氢的化学位移 9.16。由红外光谱和核磁氢谱的数据与预期基团所归属的化学位移相符可以得出, *N*-(2,5-二甲基-4-羟基苄基)乙酰胺 (I) 已成功制备。

2.2 化合物的生物活性测试结果

2.2.1 抑菌性测试

以能够抑制细菌生长和繁殖的最低药物浓度即最小抑菌浓度为依据, 化合物对大肠杆菌与金黄色葡萄球菌的最小抑制浓度测试结果如图 1、2 和表 2 所示。

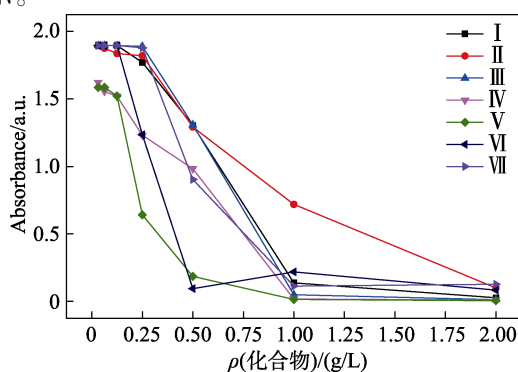


图 1 化合物对大肠杆菌的抑制活性

Fig. 1 Antibacterial activity of compounds against *E. coli*

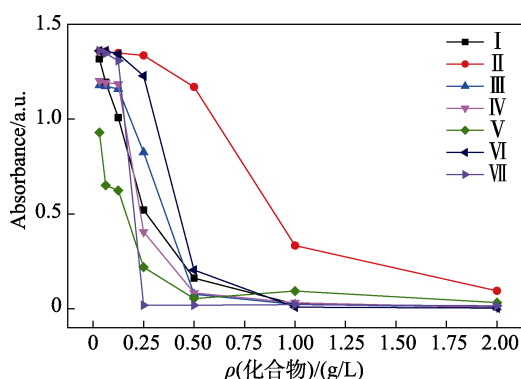


图 2 化合物对金黄色葡萄球菌的抑制活性

Fig. 2 Antibacterial activity of compounds against *S. aureus*

由图 1、2 和表 2 可知, 随着浓度的增加, 化合物抑制效果逐渐增强, 且 7 种类辣素结构乙酰胺化合物对两种菌的抑制作用类似, 该现象可能与化合物的结构有关。各种化合物对大肠杆菌的抑制效果

由强到弱依次为: $V > IV \approx II \approx I > III \approx VI \approx VII$ 。对金黄色葡萄球菌的抑制效果由强到弱依次为: $V > I \approx II \approx III \approx IV \approx VII > VI$ 。其中含有两个苯环结构萘环类衍生物 V 的抑菌能力均优于其他的化合物, 最小抑菌浓度可达到 0.0313 g/L 。

表 2 化合物的最小抑菌浓度

Table 2 Minimum inhibitory concentration of compounds

化合物	最小抑菌浓度/(g/L)	
	大肠杆菌	金黄色葡萄球菌
I	0.0625	0.0625
II	0.0625	0.0625
III	0.2500	0.0625
IV	0.0625	0.0625
V	0.0313	0.0313
VI	0.2500	0.1250
VII	0.2500	0.0625

7 种类辣素结构乙酰胺化合物对大肠杆菌和金黄色葡萄球菌表现出良好的抑制作用, 为进一步探究其抑菌活性, 就化合物对菌类的抑制率进行了测定, 结果见表 3。抑菌率的测定采用稀释涂布平板法, 因此以产物 I 与 VII 对大肠杆菌的抑制实验为例展示不同浓度下化合物对大肠杆菌的平板效果图, 如图 3 所示。

表 3 化合物的抑菌率

Table 3 Antibacterial rate of compounds

化合物	抑菌率/%	
	大肠杆菌	金黄色葡萄球菌
I	71.18	93.4
II	80.96	60.8
III	68.22	79.46
IV	82.12	68.2
V	37.21	61.49
VI	86.25	58.09
VII	93.21	96.31

由表 3 和图 3 可以看出, 7 种化合物均具有一定的抑菌作用, 且结构相似的化合物的抑菌效果相近。化合物中的取代芳香环、酚羟基及乙酰胺基团等活性基团通过改变细胞膜的通透性, 使菌细胞产生损伤, 进而导致细菌不能正常生长乃至死亡以达到抑菌的效果。7 种化合物中以化合物 VII 的抑菌性最好, 化合物 VII 含有两个苯环, 且两个苯环的电荷密度为 -0.663 , 其余 6 种化合物苯环的电荷密度分别为 -0.274 、 -0.295 、 0.232 、 -0.187 、 -0.482 、 0.092 , 一般疏水基团越多及负电荷越高的化合物抑菌效果越好。

2.2.2 抑藻性测试

由全波长扫描可知三角褐指藻、中肋骨条藻和旋链角毛藻的最大吸收波长分别为 683 、 682 和 685 nm 。利用血球计数板计数法测量不同吸光值藻液的浓度, 将藻液吸光值与浓度的数据进行线性模拟得图 4。

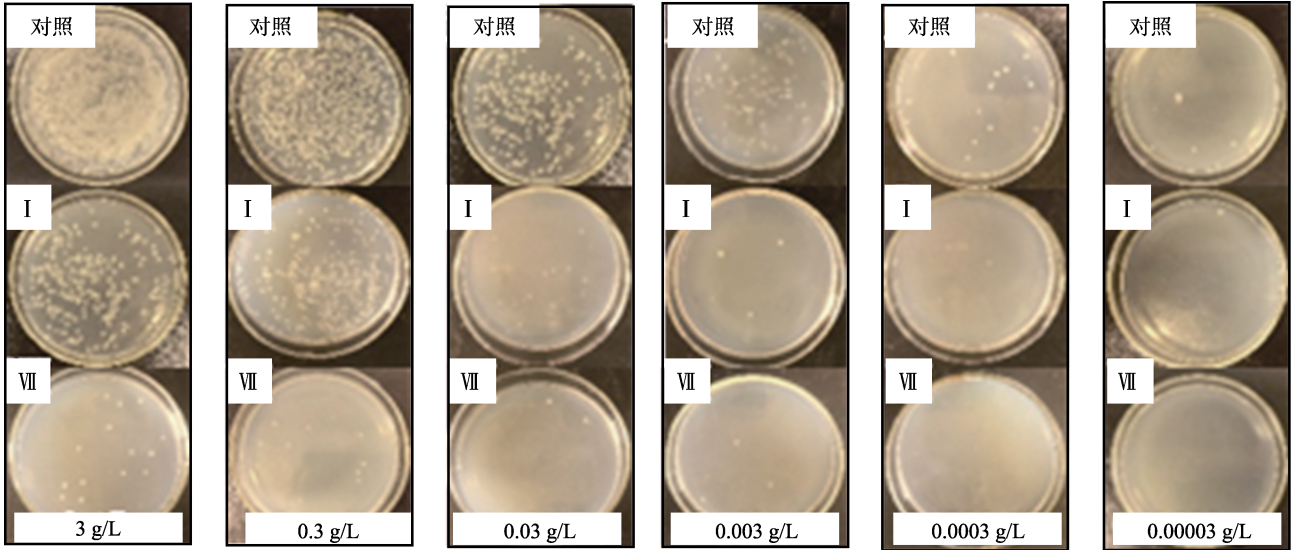


图 3 不同浓度产物 I 与 VII 对大肠杆菌的抑制作用

Fig. 3 Inhibition effect of compounds I and VII with different concentration against *E. Coli*

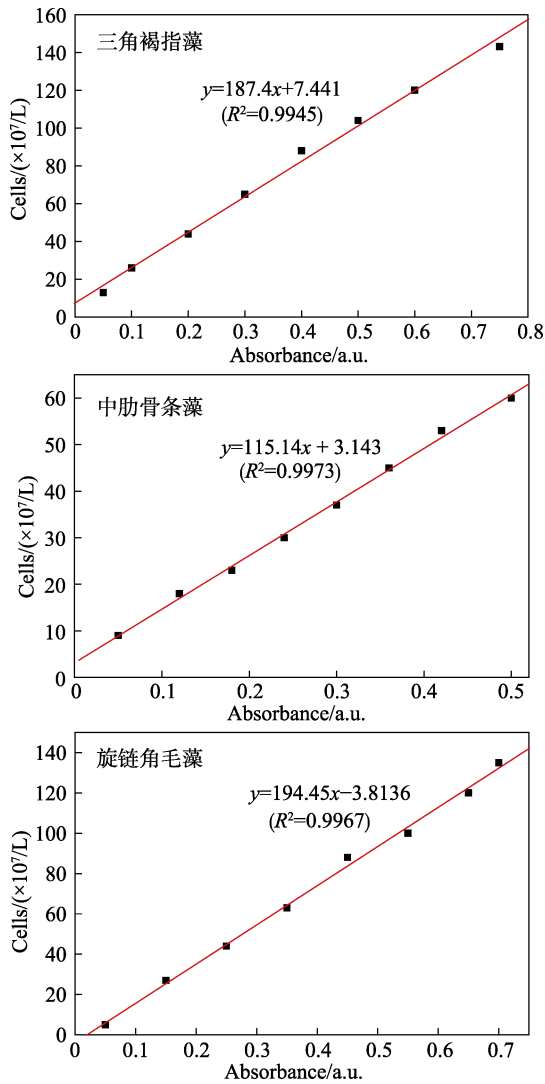
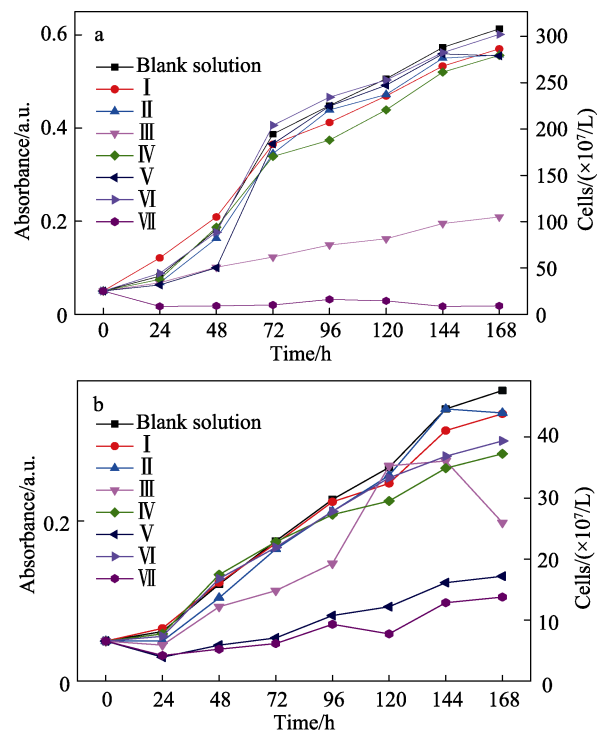


图 4 三角褐指藻、中肋骨条藻和旋链角毛藻藻液的吸光度值-浓度工作曲线

Fig. 4 Working curves between absorbance and concentration of *Phaeodactylumtricornutum*, *Skeletonemacostatum* and *Chaetocerscurvisetus*

在藻的最大波长处测定不同时间对应的藻液吸光度，得到辣素化合物对藻类生长的抑制曲线，并且根据藻液吸光度值-浓度工作曲线与第 7 d 的抑藻数据计算得出抑藻率，如图 5 和表 4 所示。

由图 4、5 和表 4 可知，藻液吸光值与浓度呈线性相关，且 7 种类辣素结构乙酰胺均具有一定的抑藻活性。化合物对藻类活性的抑制作用表现为，抑制初期会降低其生长活性，随着时间的推移，藻细胞会逐渐死亡，达到较好的抑藻效果，并表现出持久的抑藻性。其中以化合物 V 和 VII 的抑藻性最好，质量浓度在 3 g/L 时抑藻率可达到 95% 以上。化合物 V 和 VII 的取代芳香环多于其他化合物，疏水性和



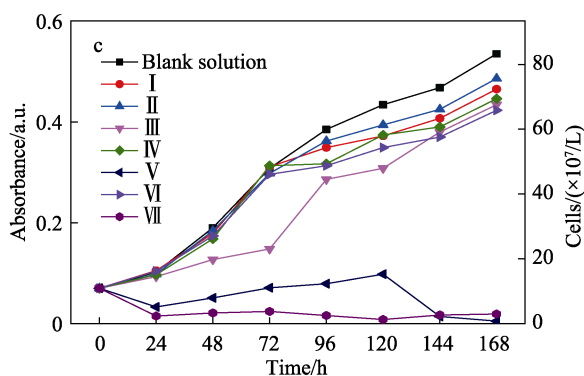


图 5 化合物对三角褐指藻 (a)、中肋骨条藻 (b) 和旋链角毛藻 (c) 生长的抑制曲线

Fig. 5 Inhibition curves of compounds on *Phaeodactylum tricornutum* (a), *Skeletonema costatum* (b) and *Chaetoceros curvisetus* (c)

表 4 化合物对藻类生长的抑制率

Table 4 Inhibition rate of compounds against algae growth

化合物	抑制率 (7 d) /%		
	三角褐指藻	中肋骨条藻	旋链角毛藻
I	6.98	7.94	13.03
II	9.08	7.65	9.19
III	65.97	45.59	18.80
IV	9.25	21.76	16.67
V	9.42	63.82	99.13
VI	1.92	17.35	20.94
VII	97.03	71.18	96.37

极性较大, 且苯环电荷密度高于其他化合物, 因此增强了其抑藻性。化合物 I、II、III、IV 和 VI 次之, 但由于 I、II、III 和 IV 的苯环上的取代基为链较短的甲基, 较强的亲水性加强了对藻细胞膜的透过性, 亦使其呈现出较好的抑藻性。化合物 VI 中苯环的电荷密度较小, 但氧的电负性较强, 电荷密度高, 因而它也具有一定抑藻功能。以上化合物的结构特点使其较容易进入藻细胞内损坏细胞器的结构功能, 从而导致藻细胞逐渐消失, 表现出一定的抑藻性。

3 结论

本文以 *N*-羟甲基乙酰胺与 7 种取代芳香烃为原料, 通过傅-克烷基化反应成功合成出 7 种新的类辣素结构的乙酰胺衍生物, 使取代芳香烃具有了辣素的活性结构。以合成的 7 种化合物为受试化合物, 以 2 种菌和 3 种藻为受试生物进行抑菌和抑藻性能的测试。实验结果表明, 7 种化合物都具有良好的抑菌性和抑藻性, 其中以 V 与 VII 的抑制作用最好, 在质量浓度为 3 g/L 时化合物 V 与 VII 的抑藻率可超过 95%, 化合物 VII 的抑藻率亦在 90% 以上, 为后续作为防污剂的应用奠定了基础。

参考文献:

- [1] Gao M X, Li J Y, Nie C B, *et al.* Design, synthesis and biological evaluation of novel hydrogen sulfide releasing capsaicin derivatives[J]. *Bioorganic & Medicinal Chemistry*, 2018, 26: 2632-2639.
- [2] Yu Xiaolin (于晓琳), Yu Liangmin (于良民), Jiang Xiaohui (姜晓辉). Synthesis, bacteriostatic activity and antifouling capability of acrylamides containing capsaicin moieties[J]. *Chinese Journal of Applied Chemistry (应用化学)*, 2014, 31(5): 594-599.
- [3] O'Neill J, Brock C, Olesen A E, *et al.* Unravelling the mystery of capsaicin: A tool to understand and treat pain[J]. *Pharmacological Reviews*, 2012, 64(4): 939-971.
- [4] Jin Yong (金涌), Li Jun (李俊), Yao Hongwei (姚宏伟), *et al.* Antiinflammatory and analgesic effects of extract of capsicum[J]. *Acta Universitatis Medicinalis Anhui (安徽医药大学学报)*, 2001, 36(6): 430-431.
- [5] Jiang Xiayun (江霞云), Ma Fengsen (马凤森), Wu Xiaojuan (吴小娟). Study of capsaicin emulgel on *in vitro* transdermal permeation, analgesic actions, and irritation[J]. *Chinese Traditional and Herbal Drugs (中草药)*, 2018, 49(7): 1569-1575.
- [6] Inés D L. Effect of capsaicin on prostate cancer cells[J]. *Future Oncology*, 2010, 6(10): 1545-1550.
- [7] Thoennissen N H, O'Kelly J, Lu D, *et al.* Capsaicin causes cell-cycle arrest and apoptosis in ER-positive and -negative breast cancer cells by modulating the EGFR/HER-2 pathway[J]. *Oncogene*, 2010, 29: 285-296.
- [8] Xie Zhiqin (谢智钦), Li Hongxia (李弘夏), Tang Caixi (唐才喜), *et al.* Capsaicin induces apoptosis in HepG2 cells through ROS activation[J]. *China Cancer (中国肿瘤)*, 2018, 27(6): 470-475.
- [9] Bode A M, Dong Z G. The two faces of capsaicin[J]. *Cancer Research*, 2011, 71(8): 2809-2814.
- [10] Bley K, Boorman G, Mohammad B, *et al.* A comprehensive review of the carcinogenic and anticarcinogenic potential of capsaicin[J]. *Toxicologic Pathology*, 2012, 40: 847-873.
- [11] Lee E J, Jeon M S, Kim B D, *et al.* Capsiate inhibits ultraviolet B-induced skin inflammation by inhibiting Src family kinases and epidermal growth factor receptor signaling[J]. *Free Radical Biology & Medicine*, 2010, 48: 1133-1143.
- [12] Frydas S, Varvara G, Murmura G, *et al.* Impact of capsaicin on mast cell inflammation[J]. *International Journal of Immunopathology and Pharmacology*, 2013, 26(3): 597-600.
- [13] Pan Yongping (潘永萍), Jiang Xiaohui (姜晓辉), Yu Liangmin (于良民). Synthesis of benzamide derivatives containing capsaicin with active structure and their bacteriostatic activity and antifouling capability[J]. *Fine Chemicals (精细化工)*, 2014, 31(1): 7-11.
- [14] Zhang Xiaochun (张晓春), Yu Liangmin (于良民), Jiang Xiaohui (姜晓辉). Synthesis, bacteriostatic and anti-alga capability of monomers and polymers containing capsaicin[J]. *Materials Review B: Research Paper (材料导报 B: 研究篇)*, 2018, 32(1): 194-202.
- [15] Zheng Shaojun (郑绍军), Wang Yu (王瑜), Zhu Rui (朱瑞), *et al.* Recent research progress of synthetic substances as antifoulants[J]. *Journal of Chinese Society for Corrosion and Protection (中国腐蚀与防护学报)*, 2016, 36(5): 390-397.
- [16] Zhang Ran (张然), Li Biao (李彪), Wei Yong (韦勇), *et al.* Study on the antimicrobial activity of natural capsaicin on some phytopathogen[J]. *Hubei Agricultural Science (湖北农业科学)*, 2018, 57(8): 66-69.
- [17] Jiang Xiaohui (姜晓辉), Pan Yongping (潘永萍), Cong Weiwei (丛

- 魏巍), *et al.* Synthesis, bacteriostatic activity and antifouling capability of dibenzamides containing capsaicin moiety[J]. Periodical of Ocean University of China (中国海洋大学学报), 2018, 48(2): 79-84.
- [18] Han Yongping (韩永萍), Gong Ping (龚平), Li Keyi (李可意). Study on antibacterial activity of phenol hydroxyl from *N*-aryl Schiff COS derivatives[J]. Food & Machinery (食品与机械), 2015, 31(1): 127-131.
- [19] Pernak J, Rogoza J, Mirska I. Synthesis and antimicrobial activities of new pyridinium and benzimidazolium chlorides[J]. European Journal of Medicinal Chemistry, 2001, 36(4): 313-320.
- [20] Bodor N. Soft drugs. 1. Liable quaternary ammonium salts as soft antimicrobials[J]. Journal of Medicinal Chemistry, 1980, 23(50): 469-474.
- [21] Klancnik A, Piskernik S, Jersek B, *et al.* Evaluation of diffusion and dilution methods to determine the antibacterial activity of plant extracts[J]. Journal of Microbiological Methods, 2010, 81(2): 121-126.
- [22] Sun Haijing (孙海静), Gao Xueli (高学理), Wang Jian (王剑), *et al.* Preparation and characterization of antifouling and bacteriostatic polyamide nanofiltration membrane[J]. Periodical of Ocean University of China (中国海洋大学学报), 2017, 47(5): 88-93.
- [23] Wang Xue (王雪), Xu Jia (徐佳), Jiang Yuye (蒋钰烨), *et al.* Preparation and properties of new antibacterial polysulfone ultrafiltration membranes[J]. Chemical Journal of Chinese Universities (高等学校化学学报), 2012, 33(9): 2129-2134.
- [24] Zhang Yunling (张云玲), Zheng Yimin (郑一敏), Hu Shaonan (胡少南), *et al.* Anti-Helicobacter pylori effect of 6-gingerol *in vitro*[J]. Modern Food Science and Technology (现代食品科技), 2013, 29(6): 1259-1305.
- [25] Feng Wen (冯文), Wang Xianghui (王向辉), Song Huangwang (宋煌旺), *et al.* Syntheses and QSAR study on anti-algae activities of benzisothiazolin-3-one derivatives[J]. Chemistry (化学通报), 2017, 80(12): 1133-1147.
- [26] Wang Jin (汪瑾), Du Mingyong (杜明勇), Yu Yufeng (于玉凤), *et al.* The inhibitory effect of plant extracts on *Microcystis aeruginosa* and its algal inhibiting characteristics[J]. Journal of Nanjing Agricultural University (南京农业大学学报), 2014, 37(4): 91-94.
- [27] Zhong Yunxiao (钟云霄), Tang Zhongen (汤仲恩), Yu Guangwei (余光伟), *et al.* Growth inhibition of blue-green algae by submerged macrophytes culture solutions with existence of the low level of copper ion[J]. Ecology and Environmental Sciences (生态环境学报), 2012, 21(9): 1594-1598.
- [28] Xu Huanzhi (徐焕志), Yu Liangmin (于良民), Li Changcheng (李昌诚), *et al.* Synthesis of acrylamides containing capsaicin derivative moiety and their growth inhibition against *Nitzschia closterium*[J]. Chinese Journal of Applied Chemistry (应用化学), 2007, 24(8): 911-916.

(上接第 512 页)

- [6] Tian S L, Jiang P R, Ning P, *et al.* Enhanced adsorption removal of phosphate from water by mixed lanthanum/aluminum pillared montmorillonite[J]. Chemical Engineering Journal, 2009, 151(1/2/3): 141-148.
- [7] Wang Yu (王宇), Gao Baoyu (高宝玉), Yue Wenwen (岳文文), *et al.* Adsorption kinetics of phosphate from aqueous solutions onto modified corn residue[J]. Environmental Science (环境科学), 2008, 29(3): 703-708.
- [8] Keskinan O, Goksu M Z L, Yuceer A, *et al.* Heavy metal adsorption characteristics of a submerged aquatic plant (*Myriophyllum spicatum*) [J]. Process Biochemistry, 2003, 39(2): 179-183.
- [9] Boyd S A, Lee J F, Mortland M M. Attenuating organic contaminant mobility by soil modification[J]. Nature, 1988, 333(6171): 345-347.
- [10] Komadel P. Chemically modified smectites[J]. Clay Miner, 2003, 38(1): 127-138.
- [11] Shen Y H. Preparations of organobentonite using nonionic surfactants[J]. Chemosphere, 2001, 44(5): 989-995.
- [12] Lin S H, Juang R S. Heavy metal removal from water by sorption using surfactant-modified montmorillonite[J]. Journal of Hazardous Materials, 2002, 92(3): 315-326.
- [13] Malakul P, Srinivasan K R, Wang H Y. Metal adsorption and desorption characteristics of surfactant-modified clay complexes[J]. Ind Chem Res, 1998, 37(11): 4296-4301.
- [14] Ren Jianmin (任建敏), Fu Bianhong (傅遍红), Wu Siwei (吴四维). Properties of adsorption of methyl orange onto intercalated CTMA-Bentonite[J]. Journal of Chongqing University (重庆大学学报), 2010, 33(5): 120-124.
- [15] Yu Haiqin (于海琴), Yan Liangguo (闫良国), Xin Xiaodong (辛晓东), *et al.* Synthesis and characterization of CTMAB and PDMDAAC modified organobentonite[J]. Spectroscopy and Spectral Analysis (光谱学与光谱分析), 2011, 31(5): 1393-1396.
- [16] Sun Jie (孙杰), Zhao Xinzheng (赵新正), Zeng Pei (曾沛). Adsorption properties of cationic polyacrylamide modified bentonite for indigo blue[J]. Research of Environmental Sciences (环境科学研究), 2013, 26(9): 1001-1005.
- [17] Ren Haibei (任海贝), Li Mingyu (李明玉). Decoloring performance of compound intercalary organo-bentonite modified with cationic polyacrylamide[J]. Technology of Water Treatment (水处理技术), 2005, 31(12): 13-15.
- [18] Wang T, Zhu J X, Zhu R L, *et al.* Enhancing the sorption capacity of CTMA-bentonite by simultaneous intercalation of cationic polyacrylamide[J]. Journal of Hazardous Materials, 2010, 178(1/2/3): 1078-1084.
- [19] Zhu R L, Wang T, Zhu J X, *et al.* Structural and sorptive characteristics of the cetyltrimethylammonium and polyacrylamide modified bentonite[J]. Chemical Engineering Journal, 2010, 160(1): 220-225.
- [20] Moreno M, Benavente E, Gonzalez G, *et al.* Functionalization of bentonite by intercalation of surfactants[J]. Molecular Crystals and Liquid Crystals, 2006, 448(1): 123-131.
- [21] Chubar N I, Kanibolotskyy V A, Strelko V V, *et al.* Adsorption of phosphate ions on novel inorganic ion exchangers[J]. Colloids and Surfaces A Physicochemical and Engineering Aspects, 2005, 255(1): 55-63.
- [22] Chowdhury S R, Yanful E K. Arsenic and chromium removal by mixed magnetite-maghemite nanoparticles and the effect of phosphate on removal[J]. Journal of Environmental Management, 2010, 91(11): 2238-2247.
- [23] Khenifi A, Bouberka Z, Sekrane F, *et al.* Adsorption study of an industrial dye by an organic clay[J]. Adsorption-journal of the International Adsorption Society, 2007, 13(2): 149-158.