



Stilbenoid Trimers and Dimers as Potent Non-Competitive Inhibitors of α -Glucosidase from Rhizomes of *Cyperus rotundus* L.

Shiren DENG, Linbo XIA*, Jiang ZHU, Mingchen CAI, Xin WANG & Xiamin ZHU

*College of Pharmacy, Liaoning University of Traditional Chinese Medicine,
Dalian, Liaoning, 116600, P.R. China*

SUMMARY. Methanolic aqueous extracts of 26 traditional Chinese herbs were tested in screening experiments for α -glucosidase inhibition. The extract of *Cyperus rotundus* L. showed the highest α -glucosidase inhibitory activity. Bioactivity-guided isolation of ethyl acetate fraction of *C. rotundus* extracts afforded 5 stilbenoid trimers, namely (\pm)-(E)-cyperusphenol A (**1**), (E)-mesocyperusphenol A (**2**), cyperusphenol C (**3**), cyperusphenol B (**4**), cyperusphenol D (**5**), as well as 2 stilbenoid dimers, *i.e.*, scirpusin A (**6**) and scirpusin B (**7**). The structure of these compounds was elucidated through HR-MS and NMR data analyses. Compounds **1-7** demonstrated a significantly potent *in vitro* inhibition of α -glucosidase in a dose dependent manner with IC₅₀ values ranging from 1.18 to 21.4 μ M, while IC₅₀ value of reference drug acarbose was 1470 μ M. Kinetic study using the double Lineweaver-Burk plot revealed that all the seven compounds inhibited α -glucosidase in a non-competitive manner compared to acarbose which is a competitive inhibitor.

RESUMEN. Se ensayaron extractos acuosos metanólicos de 26 hierbas tradicionales chinas en experimentos de búsqueda de inhibición de la actividad de α -glucosidasa. El extracto de *Cyperus rotundus* L. mostró la mayor actividad inhibidora. El aislamiento guiado por bioactividad de la fracción de acetato de etilo de los extractos de *C. rotundus* proporcionó 5 trómeros estilbenoides, a saber: (\pm)-(E)-cyperosfenol A (**1**), (E)-mesocitopisfenol A (**2**), cyperusfenol C (**3**), cyperusfenol B (**4**), cyperusfenol D (**5**), así como 2 dímeros estilbenoides, es decir, scirpusina A (**6**) y scirpusina B (**7**). La estructura de estos compuestos se elucidó mediante análisis de HR-MS y RMN. Los compuestos **1-7** demostraron una inhibición *in vitro* de α -glucosidasa significativamente potente de en forma dependiente de la dosis con valores de IC₅₀ que varían de 1,18 a 21,4 μ M, mientras que el valor de CI₅₀ del fármaco de referencia acarbose fue de 1470 μ M. El estudio cinético usando el gráfico de Lineweaver-Burk doble reveló que los siete compuestos inhibieron la α -glucosidasa de manera no competitiva en comparación con la acarbose, que es un inhibidor competitivo.

KEY WORDS: *Cyperus rotundus*, α -glucosidase inhibitor, stilbenoid trimer.

* Author to whom correspondence should be addressed. *E-mail:* xlbwhu@hotmail.com