

桃仁化学成分与药理活性研究进展

王仁芳^{1,3}, 范令刚², 高文远^{3*}, 张俊英^{1,3}

(1. 天津中医药大学中药学院, 天津 300193; 2. 山东医药技师学院, 山东 泰安 271016;

3. 天津大学药物科学与技术学院, 天津 300072)

摘要: 桃仁又名桃核仁, 含有多种营养成分和生物活性物质, 既是益智食品, 也是传统的活血化瘀中药, 并且临床疗效显著。目前对桃仁的化学成分和药理活性研究不够深入, 已经分得脂肪酸、蛋白质、甾醇及其糖苷类、黄酮类、酚酸类等化合物, 证明其具有抗凝血、抗血栓、预防肝纤维化和增强免疫力等药理作用。综述了近年来对桃仁的化学成分与药理活性研究进展, 为进一步研究和临床应用提供依据。

关键词: 桃仁; 化学成分; 药理活性; 桃仁蛋白; 苦杏仁苷; 抗凝血

中图分类号: R282.71

文献标识码: A

文章编号: 1674-5515(2010)06-0426-04

Advances in research of chemical constituents and pharmacological activities of *Persicae Semen*

WANG Ren-fang^{1,3}, FAN Ling-gang², GAO Wen-yuan³, ZHANG Jun-ying^{1,3}

(1. School of Chinese Medicine, Tianjin University of Traditional Chinese Medicine, Tianjin 300193, China;

2. Shandong Medicine Technician College, Tai'an 271016, China;

3. School of Pharmaceutical Science and Technology, Tianjin University, Tianjin 300072, China)

Abstract: In *Persicae Semen*, there are various nutrients and bioactive compounds. Furthermore, *Persicae Semen* is also a kind of TCM medicinal materials with good clinical effects. At present, research achievements on chemical constituents and pharmacological activities of *Persicae Semen* are not yet very clear and systematic. Till now, many compounds have been separated, including fatty acid, protein, sterols, glycosides, and phenolic acid. Present study has found the pharmacological activities of *Persicae Semen*, including anticoagulation, antithrombotic, liver fibrosis prevention and immunity enhancement. This review introduces the advances in research of chemical constituents and pharmacological activities of *Persicae Semen*, and may provide a reference for the further research.

Key words: *Persicae Semen*; chemical constituent; pharmacological activities; *Persicae Semen* protein; amygdalin; anticoagulation

桃仁又名桃核仁, 来源于蔷薇科(Rosaceae)植物桃 *Prunus persica* (L.) Batsch. 或山桃 *P. davidiana* (Carr.) Franch. 的干燥成熟种子。桃仁功效为活血祛瘀, 润肠通便, 用于经闭、痛经、症瘕痞块、跌扑损伤、肠燥便秘, 为中医活血化瘀要药, 临床功效卓著, 汉族及其他部分少数民族药方中均有应用。在血府逐瘀汤(《医林改错》)、生化汤(《傅青主女科》)、桂枝茯苓丸(《金匮要略》)、桃核承气汤(《伤寒论》)等医家名方中均重用桃仁, 2010年版《中国药典》中以桃仁为主药的中药制剂

有大黄蟪虫丸、中风回春丸、化症回生片、加味生化颗粒、茵香橘核丸、桂枝茯苓丸、桂枝茯苓胶囊、颈复康颗粒、跌打丸、产复康颗粒、金嗓散结丸共11首成方, 其中9首主要功效为活血化瘀。桃仁中的主要化学成分为脂溶性物质、蛋白质、甾醇及其糖苷类、黄酮类、酚酸类等, 其药理作用主要包括抗凝血、抗血栓、预防肝纤维化和增强免疫力等, 其对心脑血管疾病的显著疗效近年来受到广泛关注。就近年来对桃仁的化学成分与药理作用研究进行综述。

* 通讯作者 高文远 Tel: 022-87401895, E-mail: biochemgao@hotmail.com

1 化学成分

桃仁中的脂溶性成分约占桃仁干质量的 50%，蛋白质类成分约占 25%，多糖约占 1.83%^[1]。此外桃仁中还含有氰苷类、甾体类、黄酮类及其糖苷类化合物和微量元素等。目前对桃仁中化学成分的研究较少，特别是对其中的小分子成分，而对已明确的成分缺乏系统研究，仅部分学者对油脂类成分进行过较系统的研究。

1.1 脂肪酸类

桃仁中含有复杂的脂肪酸类成分，可分为棕榈酸、硬脂酸、油酸、亚油酸 4 种，其中不饱和脂肪酸（油酸和亚油酸）的量为 85%~93%^[2-7]。也有研究显示，桃仁中油酸和亚油酸的平均总量达 93.06%^[2]，姜波等^[5]的分析结果是桃仁中不饱和脂肪酸的量为 92.44%；芮和恺等^[7]研究显示，桃仁中的脂溶性成分主要由长链脂肪酸组成，且不饱和脂肪酸占 43.5%。裴瑾等^[3]通过 GC-MC 分析，得出桃仁脂溶性成分中的饱和脂肪酸主要为庚酸、辛酸和十六碳酸，不饱和脂肪酸主要为 9-十六碳烯酸、9, 12-十八碳二烯酸、9, 17-十八碳二烯酸和 9-十八碳烯酸的结果。不同研究显示，桃仁中脂溶性成分的组成及含量有一定差异，裴瑾等^[2-3]研究发现桃仁中不饱和脂肪酸油酸、亚油酸的平均总量为 93.06%，而姜波^[5]等研究发现桃仁中棕榈酸为 6.20%、硬脂酸为 1.9%、油酸为 74.53%、亚油酸为 17.9%。此外，Da Silva 等^[6]还对桃仁中的油酸和棕榈酸成分进行了 ¹H-NMR 和 ¹³C-NMR 研究，从化学结构上阐明了桃仁油的特性，从而证明了其可作为食品添加剂。

1.2 苷类

桃仁中含有氰苷^[8-13]，其中苦杏仁苷的量为 1.5%~3%，还含有微量的野樱苷^[14]。

1.3 甾醇及其糖苷

采用 GC 和 GC-MS 等技术分析显示，桃仁中的不皂化物以甾醇为主，如在杨晓静等^[15]的研究中，鉴定了豆甾烯醇乙酸酯、 β -谷甾醇乙酸酯、菜油甾醇乙酸酯、豆甾醇乙酸酯和燕麦甾醇乙酸酯等 5 个甾醇乙酸酯，以及羽扇醇乙酸酯、24-亚甲基环阿屯烷醇乙酸酯 2 个三萜醇乙酸酯化合物。另外桃仁中还含有 24-亚甲基环木菠萝烷醇、柠檬甾二烯醇、7-去氢燕麦甾醇、 β -谷甾醇、菜油甾醇、 β -谷甾醇-3-O- β -D-吡喃葡萄糖苷、菜油甾醇-3-O- β -D-吡喃葡萄糖苷、 β -谷甾醇-3-O- β -D-(6-O-棕榈酰基)吡喃葡萄糖苷、 β -

谷甾醇-3-O- β -D-(6-O-油酰基)吡喃葡萄糖苷、菜油甾醇-3-O- β -D-(6-O-棕榈酰基)吡喃葡萄糖苷、菜油甾醇-3-O- β -D-(6-O-油酰基)吡喃葡萄糖苷等。

1.4 黄酮及其糖苷

桃仁中黄酮及其糖苷主要有 (+)-儿茶酚、柚皮素、洋李苷、山柰酚及其葡萄糖苷、二氢山柰酚、槲皮素葡萄糖苷等。

1.5 蛋白质和氨基酸

桃仁中含有包括相对分子质量为 2.13×10^4 的白色蛋白 PR-A、PR-B 在内的多种蛋白质。还含有丝氨酸、苏氨酸、甘氨酸、谷氨酸等 16 种常见氨基酸和 γ -氨基丁酸、L-色氨酸^[16]。

1.6 其他成分

桃仁中含有大量挥发性成分^[17-19]，主要为苯甲醛，占总挥发油的 57.068%；另外还含有壬酸、2-甲基-己醛、2-戊基-呋喃、十三碳烷等。桃仁中还含有 K、Na、Ca、Zn、Fe、Mn、Mg 等 12 种微量元素^[16]，以及多种维生素类成分。

2 药理作用

2.1 抗血栓、抗凝血、预防心肌梗死和肝纤维化等

桃仁的水提物能预防肝纤维化的形成^[20-22]，对肝脏的过氧化损伤也有较好的防护作用。汪宁等^[23]的研究发现，桃仁的醋酸乙酯和乙醇提取物均能缩短二磷酸腺苷（ADP）诱导的血小板聚集所致肺栓塞引起的呼吸喘促时间，且醋酸乙酯提取物有显著的抗血栓作用。桃仁石油醚提取物可能对心肌缺血损伤有改善作用，并对急性心肌梗死有较好的防治作用^[24]。另外，从桃仁中分离的三油酸甘油酯具有抗凝血活性。总之，桃仁的抗凝血、抗血栓、预防肝纤维化等作用，对肝脏过氧化损伤具良好的防护作用，对心肌缺血损伤和脑部血管活性有改善作用，对急性心肌梗死有较好的防治作用，这在一定程度上印证了桃仁的活血化瘀传统功效。

2.2 提高免疫力和抗肿瘤

桃仁水提物对机体的免疫功能有良好的增强作用^[24]。近年来许多学者^[25-31]对桃仁中的总蛋白或单一蛋白质成分进行了大量药理研究，结果表明，桃仁蛋白无急性和长期毒性。桃仁蛋白具有提高免疫力和抗肿瘤的作用。王亚贤等^[27]和吕跃山等^[29]的研究表明桃仁蛋白的免疫调节作用是通过降低血清中 IL-2、IL-4 两种细胞因子的水平来实现的。桃仁蛋白还具有显著的抗肿瘤作用，该作用是通过增强

树突抗原递呈功能与影响相关基因的表达来实现的;也有研究表明桃仁蛋白 A 通过抑制细胞周期蛋白 B1,使肿瘤细胞分裂停留于 G₂ 期,从而抑制肿瘤细胞的增殖以实现抗肿瘤作用的,还可以抑制组织蛋白酶 D 的表达,从而抑制肿瘤浸润转移;还有研究显示桃仁蛋白的抗肿瘤作用是通过提高 IL-2、IL-4 水平来实现的。

桃仁蛋白为桃仁中的大分子物质,药理活性主要为增强免疫力和抗肿瘤,还具有抗炎作用,且其对免疫系统与对肿瘤的影响之间或许存在一定的相关性^[27-28, 30-33]。从目前研究可见,桃仁蛋白有很高的研究、开发价值,其药理活性有待深入研究。

2.3 抗炎、抗氧化

桃仁的水提物还具有一定的抗炎作用,桃仁蛋白对炎症引起的血管通透性亢进具有抑制作用。有研究者通过对桃仁中多糖的研究发现,桃仁多糖对·OH⁻和·O₂[·]均有一定的抑制作用,在同等浓度下对·O₂[·]的清除率明显高于对·OH⁻的清除率^[4, 34]。

3 小结

桃仁是祖国医学活血化瘀药物,为常用中药,药理活性明确,临床疗效确切,已广泛应用于成方制剂中。由于桃仁的化学成分较复杂,目前国内外对其化学成分、药理作用的尝试性研究报道不少,但均不够深入和系统。大多数基础及临床研究采用的桃仁制剂是粗制剂(如水煎液),具体作用的物质基础及活血化瘀作用机制仍不清楚,近几年才出现对其蛋白质、脂类、多糖和小分子成分的药理作用研究,但是还不够广泛与深入,很多方面研究还存在较大分歧。因此,今后应采用现代科学技术手段对桃仁化学成分与药理活性进行更深入、更系统的探讨,明确桃仁中的各种成分,特别是极有可能具有活血化瘀功效的小分子类物质,以期阐明桃仁药理活性作用的物质基础及对桃仁的全面开发打下良好的基础。

随着对桃仁有效化学成分的进一步深入分析和研究,桃仁在药理、临床及其他多种领域的作用将日渐凸显,对其开发和利用必将具有广阔的市场前景,并产生显著的经济效益。

参考文献

- [1] 王亮,姜波,王喜春,等.桃仁中多糖的提取工艺研究[J].时珍国医国药,2009,20(2):271-272.
- [2] 裴瑾,颜永刚,万德光.桃仁中脂肪酸的含量分析研究[J].

中药材,2009,32(6):908-910.

- [3] 裴瑾,颜永刚.桃仁脂肪酸 GC-MS 指纹图谱研究[J].中国中药杂志,2009,34(18):2360-2363.
- [4] 邱蓉丽,李璘.桃仁正品来源品种脂肪油和氨基酸分析与比较[J].中国药师,2008,11(12):1426-1428.
- [5] 姜波,沙吾列,范圣第.桃仁油中脂肪酸的 GC-MS 分析[J].中国油脂,2008,33(11):71-72.
- [6] Da Silva E O, Bathista A L B S, Tavares M L B, et al. ¹³C-NMR study of peach oil [J]. J Sci Food Agric, 2005, 85(13): 2269-2272.
- [7] 芮和恺,季伟良,沈祥龙.桃仁精油的化学成分研究[J].中成药,1992,14(2):33-34.
- [8] 赵耀.桃仁中苦杏仁甙的 HPLC 含量测定[J].中国医药指南,2009,7(17):84-85.
- [9] 潘会朝,秦文红.HPLC 法测定苦杏仁和桃仁中苦杏仁甙的含量[J].世界最新医学信息文摘,2004,(5):1321-1322.
- [10] 王友兰,李红兵,华玉琴.HPLC 法测定桃仁中苦杏仁苷的含量[J].中国药师,2002,5(9):550-551.
- [11] 易骏.3种不同产地桃仁中苦杏仁甙含量测定[J].时珍国医国药,2000,11(7):597-598.
- [12] 钱平,刘志辉,钱芳,等.桃仁定性鉴别与含量测定研究[J].中国药事,2010,(4):351-353.
- [13] 颜永刚,裴瑾,万德光.HPLC 法测定不同产地和品种桃仁中苦杏仁苷[J].中草药,2008,39(9):1415-1416.
- [14] 福田寿之.桃仁成分的研究[J].国外医学:中医中药分册,2003,(5):316.
- [15] 杨晓静,李和.桃仁油不皂化物与脂肪酸成分的分离与分析[J].农业与技术,2005,(1):84-87.
- [16] 张玲,李宝国.桃仁和苦杏仁营养成分比较[J].食品科学,1994,(4):41.
- [17] Mezzomo N, Mileo B R, Friedrich M T, et al. Supercritical fluid extraction of peach (*Prunus persica*) almond oil: Process yield and extract composition [J]. Bioresour Technol, 2010, 101(14): 5622-5632.
- [18] Sanchez-Vicente Y, Cabanas A, Renuncio J A R, et al. Supercritical fluid extraction of peach (*Prunus persica*) seed oil using carbon dioxide and ethanol [J]. J Supercritical Fluids, 2009, 49(2): 167-173.
- [19] Mezzomo N, Martinez J, Ferreira S R S. Supercritical fluid extraction of peach (*Prunus persica*) almond oil: Kinetics, mathematical modeling and scale-up [J]. J Supercritical Fluids, 2009, 51(1): 10-16.
- [20] 张晓平,陈建明.山桃仁水煎提取物对肝纤维化小鼠血清 I、

- II型前胶原的降解作用[J]. 福建中医药, 2002, 33(4): 36-37.
- [21] 徐列明, 刘平. 桃仁提取物抗实验性肝纤维化的作用观察——免疫组化和胶原代谢的研究[J]. 中药药理与临床, 1993, (5): 14-16.
- [22] 徐列明, 薛惠明. 实验性肝纤维化时贮脂细胞的变化及桃仁提取物对其影响[J]. 中西医结合肝病杂志, 1993, (2): 16-18.
- [23] 汪宁, 刘青云. 桃仁不同提取物抗血栓作用的实验研究[J]. 中药材, 2002, (6): 414-415.
- [24] 耿涛, 谢梅林, 彭少平. 桃仁提取物抗大鼠心肌缺血作用的研究[J]. 苏州大学学报: 医学版, 2005, 25(2): 238-240.
- [25] 方新德, 沈培芝. 桃仁的蛋白质活性成分研究[J]. 中药通报, 1986, (11): 677-678.
- [26] 张波, 谭峰, 唐金强, 等. 桃仁蛋白梯度聚丙烯酰胺凝胶电泳的研究[J]. 中草药, 2003, 34(4): 378-379.
- [27] 王亚贤, 王征, 张康, 等. 桃仁总蛋白对小鼠细胞因子IL-4水平的影响[J]. 中医药信息, 2008, (1): 37-38.
- [28] 刘英, 许铁. 桃仁蛋白对树突细胞抗原递呈功能的影响[J]. 辽宁中医杂志, 2007, 34(12): 1810-1811.
- [29] 吕跃山, 王雅贤. 桃仁总蛋白对荷瘤鼠IL-2、IL-4水平的影响[J]. 中医药信息, 2004, 21(4): 60-61.
- [30] 许惠玉, 运晨霞, 王雅贤. 桃仁总蛋白对荷瘤鼠T淋巴细胞亚群及细胞凋亡的影响[J]. 齐齐哈尔医学院学报, 2004, 25(5): 485-487.
- [31] 刘英, 李雅杰, 朱丽影. 用基因芯片研究桃仁蛋白A对小鼠纤维肉瘤基因表达的影响[J]. 中成药, 2004, (5): 308-401.
- [32] 刘英, 张伟兵, 张鹏宇, 等. 炒桃仁总蛋白对TNF- α 、IL-2产生水平的影响[J]. 中医药学报, 2001, 29(4): 50-51.
- [33] 刘英, 李雅杰, 蒲艳春, 等. 桃仁蛋白在小鼠的组织分布研究[J]. 中医药学报, 2008, 36(1): 27.
- [34] 王亮. 桃仁多糖对 $\cdot\text{OH}$ 及 $\cdot\text{O}_2^-$ 的清除研究[J]. 大连民族学院学报, 2009, (1): 96.
- (收稿日期 2010-06-02)

(上接第410页)

- [47] He J, Magnuson B A, Lala G, *et al.* Intact anthocyanins and metabolites in rat urine and plasma after 3 months of anthocyanin supplementation [J]. *Nutr Cancer*, 2006, 54(1): 3-12.
- [48] Ichiyani T, Shida Y, Rahman M M, *et al.* Bioavailability and tissue distribution of anthocyanins in bilberry (*Vaccinium myrtillus* L.) extract in rats [J]. *J Agric Food Chem*, 2006, 54(18): 6578-6587.
- [49] Sakakibara H, Ogawa T, Koyanagi A, *et al.* Distribution and excretion of bilberry anthocyanins in mice [J]. *J Agric Food Chem*, 2009, 57(17): 7681-7686.
- [50] Nurmi T, Mursu J, Heinonen M, *et al.* Metabolism of berry anthocyanins to phenolic acids in humans [J]. *J Agric Food Chem*, 2009, 57(6): 2274-2281.
- [51] Matsunaga N, Chikaraishi Y, Shimazawa M, *et al.* *Vaccinium myrtillus* (bilberry) extracts reduce angiogenesis *in vitro* and *in vivo* [J]. *Evid Based Complement Alternat Med*, 2007, DOI: 10.1093/ecam/new 151.
- [52] Matsunaga N, Tsuruma K, Shimazawa M, *et al.* Inhibitory actions of bilberry anthocyanidins on angiogenesis [J]. *Phytother Res*, 2010, (Suppl 1): S 42-47.
- [53] Ozgurtas T, Aydin I, Tapan S, *et al.* Bilberry inhibits angiogenesis in chick chorioallantoic membrane [J]. *Biofactors*, 2008, 33(3): 161-164.
- [54] Bao L, Yao X S, Yau C C, *et al.* Protective effects of bilberry (*Vaccinium myrtillus* L.) extract on restraint stress-induced liver damage in mice [J]. *J Agric Food Chem*, 2008, 56(17): 7803-7807.
- [55] Bao L, Yao X S, Tsi D, *et al.* Protective effects of bilberry (*Vaccinium myrtillus* L.) extract on KBrO_3 -induced kidney damage in mice [J]. *J Agric Food Chem*, 2008, 56(2): 420-425.
- [56] Mauray A, Milenkovic D, Besson C, *et al.* Atheroprotective effects of bilberry extracts in apo E-deficient mice [J]. *J Agric Food Chem*, 2009, 57(23): 11106-11111.
- [57] Takikawa M, Inoue S, Horio F, *et al.* Dietary anthocyanin-rich bilberry extract ameliorates hyperglycemia and insulin sensitivity via activation of AMP-activated protein kinase in diabetic mice [J]. *J Nutr*, 2010, 140(3): 527-533.
- [58] Drozd J, Anuszevska E. Effect of bilberry fruit aqueous extract and selected antibiotics on immune response in mice [J]. *Acta Pol Pharm*, 2009, 66(2): 181-185.
- [59] Logan A C, Wong C. Chronic fatigue syndrome: oxidative stress and dietary modification [J]. *Altern Med Rev*, 2001, 6(5): 450-459.
- [60] 王艳春, 任旷, 顾饶胜, 等. 越橘中原花青素抑制新生大鼠心肌成纤维细胞增殖及其作用机制[J]. 中草药, 2009, 40(8): 1281-1284.
- [61] 李红珠. 2008年美国植物提取物市场逆势而上, 中国所占的份额反而下降[J]. 现代药物与临床, 2009, 24(5): 310-312.
- (收稿日期 2010-08-13)