

牛蒡苷的制备与纯化

王 劲,侯凤飞,康廷国,杨松松,李 程,林雅静*

(辽宁中医学院 中药系,辽宁 沈阳 110032)

牛蒡子为菊科植物牛蒡 *Arctium lappa* L. 的干燥成熟果实。牛蒡子含有木脂素类化合物,主要是牛蒡苷等^[1]。药理研究表明,牛蒡子对多种致病性真菌有不同程度的抑制作用^[2],牛蒡子粗提物具有抗肿瘤作用^[3]。牛蒡苷具有抗肾病变作用^[4],增强机体免疫功能^[5],具有抗补体活性^[6],钙拮抗及抗高血压^[7]等药理作用。

通过对中国商品牛蒡子中牛蒡苷的含量测定^[8],以黑龙江木兰地区的牛蒡子为原料(其牛蒡苷的含量为 7.58%),采用大孔吸附树脂法进行分离、制备。方法简便、省时,适于工业化生产,收率为 9%。在此基础上,欲得到更纯的牛蒡苷,经 HPLC 检测,纯度为 99%,可采用硅胶 H 柱层析,收率为 11%。

1 牛蒡苷的制备

1.1 牛蒡苷的提取:牛蒡子干燥后,磨成粗粉,经石油醚-乙酸乙酯和 80%乙醇依次回流提取,分别回收溶剂,取醇提物部分。将此提取物用水调至一定体积,用正丁醇萃取,回收正丁醇,得正丁醇萃取物,冷冻干燥。

1.2 牛蒡苷的分离:取上述正丁醇萃取物干膏,进行大孔吸附树脂柱层析(干膏与树脂的比例为 1:30)。大孔吸附树脂以乙醇浸泡 24 h 后,湿法装柱,然后用大量的水洗去乙醇,上样。先用水洗至洗脱液无色,然后改用 30%乙醇洗脱至其液无色,回收乙醇后浓缩静置,继而出现灰白色粉末颗粒。

2 牛蒡苷的纯化

灰白色粉末通过硅胶 H 减压柱(干法装柱),以氯仿-甲醇(9:1)洗脱,回收溶剂后,得纯白色结晶

和粉末,经 HPLC 检测纯度为 99%,经 UV-IR、¹H-NMR、¹³C-NMR 检测,数据与文献报道的牛蒡苷一致。

3 讨论

本文采用系统溶剂提取法提取牛蒡苷,杂质少,便于分离。采用大孔吸附树脂法分离牛蒡子苷,不同于以往报道的分离,其特点是方便、快速、成本较低,适于工业化生产。

灰白色粉末颗粒曾采用无水乙醇加热溶解后,趁热过滤,静置,析出白色粉末后,弃去母液,收率为 50%。采用无水乙醇纯化,粉末颜色不佳,一般需反复纯化 2~3 次。不如硅胶 H 减压柱层析纯化效果好。

4 结论

采用大孔吸附树脂法分离制备牛蒡苷,方法简便;采用硅胶 H 减压柱层析法纯化牛蒡苷,纯度好。

参考文献:

- [1] 江苏新医学院. 中药大辞典(上册)[M]. 上海: 上海人民出版社, 1997.
- [2] 中国医学科学院药物研究所, 北京医学院药系, 南京药学院, 等. 中药志(第三册)[M]. 北京: 人民卫生出版社, 1984.
- [3] 佐藤昭彦. 关于生药类抗肿瘤性的研究——牛蒡子的抗肿瘤性[J]. 国外医学-中医中药分册, 1987, 9(2): 111.
- [4] 阎凌霄, 李亚明. 牛蒡子提取物对小鼠免疫功能及血糖的作用[J]. 西北药学杂志, 1993, 8(2): 75.
- [5] 长谷川雅之. 木质素类的药理研究(1)——五味子, 牛蒡子及细辛成分的抗肾病变作用[J]. 国外医学-中医中药分册, 1990, 12(6): 367.
- [6] Gao Y, Kang T G, Zhang X Y. Studies on calcium antagonist action of arctigenin [J]. Chin Tradit Herb Drugs, 2000, 31(10): 758-762.
- [7] Kang T G, Sha M, Kawamura T, et al. Pharmacognostical evaluation of arctii fructus (1): arctiin content in Chinese commercial arctii fructus [J]. Nat Med, 1998, 52(4): 339-342.

* 收稿日期: 2002-01-18

基金项目: 国家“九五”攻关资助项目(96-903-02-01)

作者简介: 王 劲,女,讲师,1993年毕业于辽宁中医学院,获学士学位,1998年获硕士学位,现为本院生药学专业博士研究生,研究方向为中草药活性成分的分离及其新药开发。

* 本院 97 届学生