

## 黄槿化学成分和药理活性研究进展

张小坡<sup>1,2</sup>, 裴月湖<sup>3</sup>, 张俊清<sup>1</sup>, 许旭东<sup>2</sup>, 谭银丰<sup>1</sup>, 康胜利<sup>1</sup>, 刘明生<sup>4\*</sup>

1. 海南医学院 药学院, 海南 海口 571101
2. 中国医学科学院 北京协和医学院 药用植物研究所, 北京 100193
3. 沈阳药科大学 中药学院, 辽宁 沈阳 110016
4. 海南省南药黎药研究院, 海南 海口 571101

**摘要:** 黄槿为《全国中草药汇编》记载的两种半红树植物之一, 具有清热解毒的功效, 在海南黎族聚集地区作为药物使用。有关黄槿的化学成分研究起始于 20 世纪 60 年代, 至今从中分离得到了大量的三萜、黄酮、倍半萜和酰胺类化合物, 其中木栓烷型三萜和高度氧化的倍半萜类成分是该药用植物的特征性成分。药理研究主要集中在抗炎、抗肿瘤和抗氧化活性。现就该植物的化学成分和药理活性研究进展进行综述, 为其进一步开发提供科学依据。

**关键词:** 黄槿; 半红树; 三萜; 黄酮; 倍半萜; 抗炎; 抗肿瘤

中图分类号: R282.71 文献标志码: A 文章编号: 1674-5515(2011)06-0434-05

## Research progress in chemical constituents of *Hibiscus tiliaceus* and their pharmacological activities

ZHANG Xiao-po<sup>1,2</sup>, PEI Yue-hu<sup>3</sup>, ZHANG Jun-qing<sup>1</sup>, XU Xu-dong<sup>2</sup>, TAN Yin-feng<sup>1</sup>, KANG Sheng-li<sup>1</sup>, LIU Ming-sheng<sup>4</sup>

1. School of Pharmaceutical Science, Hainan Medical University, Haikou 571101, China
2. Institute of Medicinal Plant Development, Chinese Academy of Medical Sciences and Peking Union Medical College, Beijing 100193, China
3. College of Traditional Chinese Materia Medica, Shenyang Pharmaceutical University, Shenyang 110016, China
4. Hainan Provincial Institute of South and Li Medicine Development, Haikou 571101, China

**Abstract:** *Hibiscus tiliaceus* is one of the two semi-mangrove plants recorded in the influential book of *Assemble of Nationwide Chinese Herbal Medicine*. *H. tiliaceus* possesses the obvious inhibitory effects on inflammation and pain and was used by Li people as medicines in Hainan. Studies on chemical constituents of the medicinal plant were carried out from 1960 to nowadays, and triterpenoids, flavonoids, sesquiterpenoids, etc. have been obtained. Pharmacological activities in chemical constituents of *H. tiliaceus* are anti-inflammation, anti-tumour, and antioxidant. This review deals with the chemical constituents and their pharmacological activities of the Li medicine, in order to provide basis for the further development of this medicinal plant.

**Key words:** *Hibiscus tiliaceus* L.; semi-mangrove plants; triterpenoids; flavonoids; sesquiterpenoids; anti-inflammation; anti-tumor

黄槿 *Hibiscus tiliaceus* L. 为锦葵科木槿属半红树植物 (semi-mangrove plants), 又名黄木槿、披黄、铜麻、山加半、港麻、海麻 (海南), 分布于中国、越南、柬埔寨、缅甸、印度、印度尼西亚、马来西亚、菲律宾及老挝等热带地区, 我国主产于台湾、广东、福建等省<sup>[1]</sup>, 海南地区也有分布, 主要生长在沿海岸的平地上、港湾或潮水能到达的河岸上及

栽植于各地村庄。据《全国中草药汇编》记载, 黄槿具有清热止咳、解毒消肿等功效, 在海南黎族聚集地区被黎族作为药物用于毒蛇咬伤、痈疮肿毒、支气管炎等<sup>[2]</sup>。现代药理学研究表明, 黄槿具有抗炎、抗氧化、抗癌等活性。20 世纪 60 年代国外学者对该植物进行化学成分的研究, 2006 年以后国内学者才开始对产自台湾和海南的黄槿化学成分进行

收稿日期: 2011-07-01

基金项目: 海南省教育厅项目 (Hjkj2011-34)

作者简介: 张小坡 (1982—), 男, 河北石家庄人, 讲师, 博士, 主要从事天然产物化学研究, E-mail: xiaopozhang@yahoo.com

\*通讯作者 刘明生 (1960—), 男, 内蒙古人, 教授, 博士, 主要从事南药黎药研究与开发, E-mail: mingsliu2002@yahoo.com.

研究, 分离得到了以三萜类化合物为特征成分的 50 多个化合物, 药理学研究多集中于其提取物的活性, 主要包括抗肿瘤、抗炎和抗氧化 3 个方面。

### 1 化学成分

化学成分研究始于 20 世纪 60 年代, 有国外学者对斯里兰卡、巴西、斐济等地区分布的黄槿茎和皮的化学成分进行研究, 从中分离得到一些糖苷类、倍半萜醌类及三萜类化合物。近年来, 越来越多地开始关注该药用植物的活性成分, Kumar 等<sup>[3]</sup>对黄槿花水提取物中的总黄酮及总酚酸类化合物进行测定。2006 年开始, 国内学者对海南分布的黄槿活性成分进行研究, 从采自海南、台湾的黄槿不同部位中分离得到三萜类、甾体类、黄酮类、苯丙素类及醌类等 50 多个化合物, 其中以三萜类化合物为主<sup>[4-6]</sup>。

#### 1.1 三萜类

目前, 从黄槿中分离得到了 18 个三萜类化合物 (图 1), 包括木栓烷类、齐墩果烷类、羽扇豆烷类等多种类型。2006 年 Li 等<sup>[5]</sup>从采自海南黄槿的茎皮

提取物中分离得到 9 个三萜类化合物, 其中 6 个木栓烷型三萜类化合物, 分别为 3 $\alpha$ -hydroxyfriedelane-2-one (1)、4 $\alpha$ -hydroxyfriedelane-3-one (2)、木栓酮 (3)、表木栓醇 (4)、粉蕊黄杨二醇 A (5)、27-oic acid-3-oxo-28-friedelanoic acid (6), 以及齐墩果酸 (10)、3 $\beta$ -O-(*p*-hydroxy-*Z*-cinnamoyl)oleanolic acid (11)、3 $\beta$ -O-(*p*-hydroxy-*E*-cinnamoyl)oleanolic acid (12), 其中化合物 6 的 27 位甲基被氧化为羧基。冯超等<sup>[6]</sup>从采自海南的黄槿中分离得到 3 个新的 nigrum 型三萜类化合物, 分别为 21*R*-hydroxyl-nigrum-22(29)-en-3-one (13)、21*S*-hydroxynigrum-22(29)-en-3-one (14)、(20*E*)-22-hydroxynigrum-20-en-3-one (15), 以及白桦脂醇 (8)、计曼尼醇 (18)。王忠昭等<sup>[7]</sup>从黄槿的石油醚-醋酸乙酯提取物中分离得到 10 个化合物, 其中有 3 个三萜类化合物, 分别为羽扇豆醇 (7)、粘霉烯醇 (16)、cucurbita-5,23-dien-3 $\beta$ ,25-diol (17)。Pongrod 等<sup>[8]</sup>还从黄槿叶中分离得到了  $\beta$ -香树脂醇 (9)。

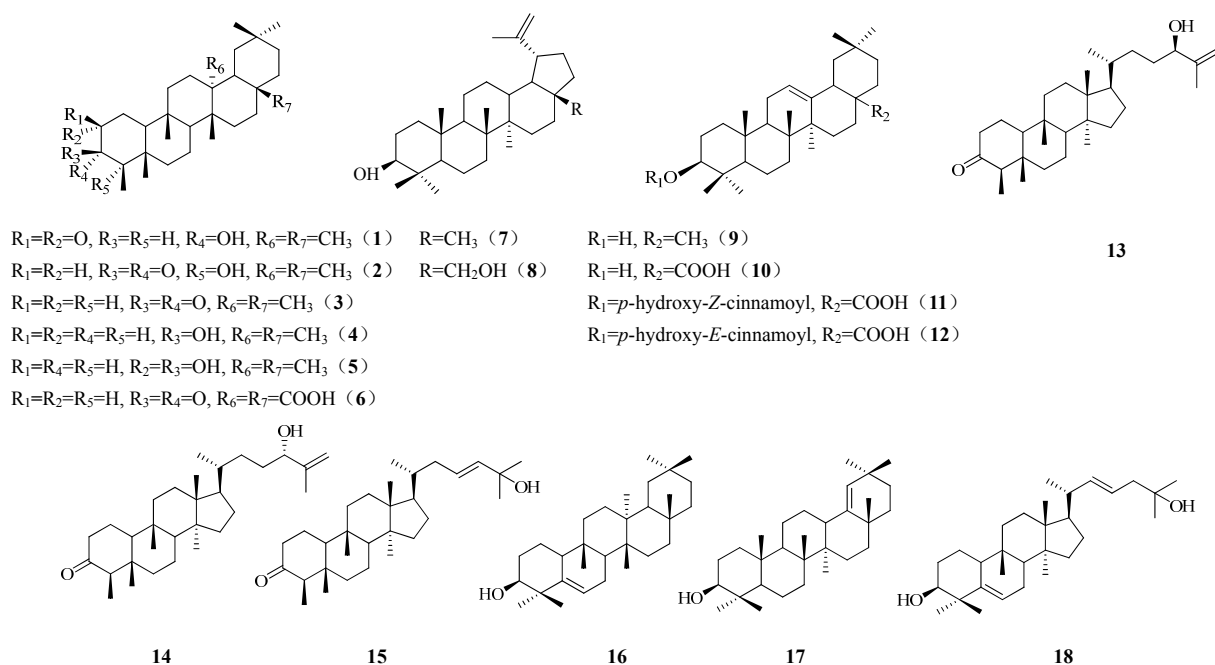


图 1 黄槿中三萜类化合物的结构

Fig. 1 Structures of triterpenoid compounds in *H. tiliaceus*

#### 1.2 倍半萜类

已从黄槿中分离得到了 12 个倍半萜类化合物 (图 2), 这类结构具有高度被氧化的特点。1980 年, Ali 等<sup>[9]</sup>对采自印度的黄槿心材进行分离, 得到 9 个

倍半萜类化合物, 其中 4 个为倍半萜醌类化合物, 分别为 hisbiscocone A (19)、B (20)、C (21)、D (22), 以及 hisbiscoquinone A (23)、B (24)、C (25)、D (26), 拉帕酚 (30), 从其根中离得到 3 个倍半萜醌

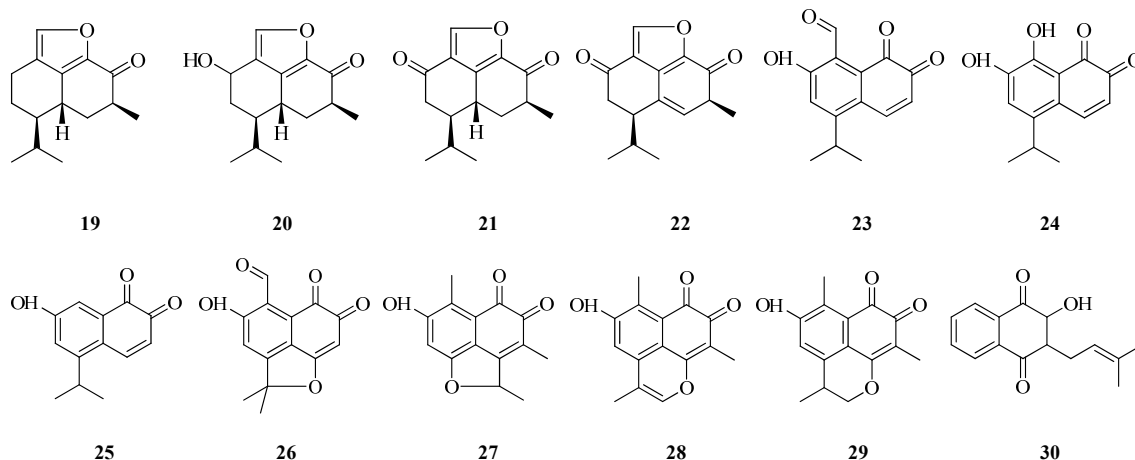


图 2 黄槿中倍半萜类化合物的结构

Fig. 2 Structures of sesquiterpenoid compounds in *H. tiliaceus*

类化合物，分别为 mansonone D (27)、E (28)、F (29)。这些结构属于高度氧化的倍半萜类成分，是木槿属植物特征成分，也一直是木槿属植物研究的热点，其在黄槿的根茎中的量较高，目前尚未从叶子和花中发现。

### 1.3 甾体类

冯超等<sup>[10]</sup>从海南采集的黄槿中分离得到 3 个胆甾类化合物胆甾醇 (31)、7 $\alpha$ -羟基胆甾醇 (32)、7 $\beta$ -羟基胆甾醇 (33)。王忠昭等<sup>[7]</sup>从采自海南的黄槿茎枝中分离得到豆甾烷类化合物豆甾醇 (34)、豆甾烷-4-烯-3-酮 (35)、豆甾烷-4,22-二烯-3-酮 (36) (图 3)。

### 1.4 苯丙素、黄酮及酰胺类

Nair 等<sup>[11]</sup>对印度产黄槿花进行了化学成分研究，分离得到了 2 个黄酮苷类成分，分别为 8-羟基-槲皮素-7-O-葡萄糖苷 (37)、8-羟基-槲皮素-3-O-葡萄糖苷 (38)。冯超等<sup>[10]</sup>从黄槿中分离得到 2 个黄

酮类化合物格榄酮 (39)、黄芪苷 (40) 和 2 个苯丙素类化合物丁香树脂素 (41)、松脂醇 (42)。Chen 等<sup>[4]</sup>从台湾产黄槿木材的甲醇提取物中分离得到 1 个香豆素类化合物 hibiscuin (44)、1 个具有细胞毒活性的酰胺类化合物 hibscuamide (47) 以及已知化合物萹苈亭 (43)，*N-trans*-feruloyltyramide (45)，*N-cis*-feruloyltyramide (46) (图 4)。

### 1.5 其他类

Chen 等<sup>[4]</sup>还从黄槿的茎皮、枝叶、花中分离得到丁香酸、香草酸、对羟基苯甲酸、对羟基苯甲醛等化合物。另外，李晓菲等<sup>[12]</sup>采用 GC-MS 分析了黄槿叶中挥发油和脂肪酸类成分，结果从黄槿叶片挥发油中分离并鉴定出吡咯类、呋喃类、酚类、醛酮类、醇类、吡啶类等 54 个化合物，分别占挥发油总量的 6.34%、9.78%、19.32%、25.59%、15.85%、4.06%。从脂肪酸组分中分离到 13 个脂肪酸，其中

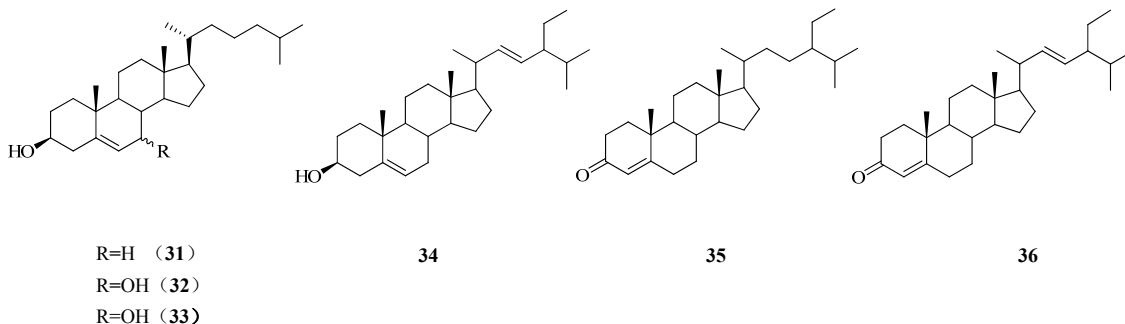


图 3 黄槿中甾体类化合物的结构

Fig. 3 Structures of steroidal compounds in *H. tiliaceus*

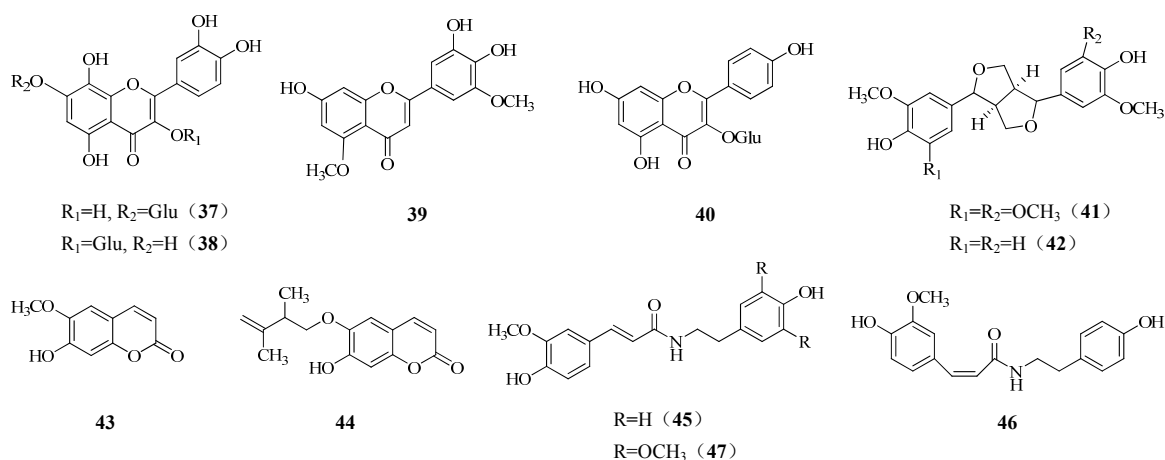


图 4 黄槿中黄酮、木脂素和酰胺类化合物的结构

Fig. 4 Structures of flavanoid, lignan, and amide compounds in *H. tiliaceus*

棕榈酸和亚油酸分别占脂肪酸的 30.11%和 10.11%。

## 2 药理作用

《全国中草药汇编》记载黄槿在民间可作为药用，具有清热解毒、散瘀消肿的疗效<sup>[13]</sup>。现代药理也对其提取物的活性进行了大量研究，证实其提取物具有抗炎、抗肿瘤、抗氧化等活性。

### 2.1 抗炎、镇痛

黄槿的各个部位在民间均作为药用，黄槿叶子用作退烧、平喘、祛痰药；新鲜的黄槿树皮水煎煮后用来治疗痢疾；新鲜的花用来治疗中耳炎等<sup>[9]</sup>。林松文<sup>[14]</sup>用黄槿根二层皮与黄糖同服治愈腮腺炎。Narender 等<sup>[15]</sup>发现印度分布的黄槿叶具有显著的抗炎和镇痛活性。

### 2.2 抗肿瘤

戴好富等<sup>[16]</sup>对 16 种红树植物细胞毒活性筛选时发现，黄槿醋酸乙酯提取物具有明显抑制人宫颈癌细胞生长的活性， $IC_{50}$  为 12.5  $\mu\text{g}/\text{mL}$ 。Chen 等<sup>[4]</sup>报道了黄槿茎和叶的甲醇提取物具有细胞毒活性。Sunilson 等<sup>[17]</sup>通过对 Dalton's ascitic lymphoma 模型小鼠腹腔注射黄槿根提取物，发现其可以明显延长荷瘤小鼠的存活时间，证明黄槿提取物具有抗肿瘤活性。

### 2.3 抗氧化及其他活性

Kumar 等<sup>[3]</sup>在研究印度黄槿的花时发现其水提取物具有显著的抗氧化作用及抑制一氧化氮合酶活性。此外，黄槿树皮混水磨汁可用作利尿剂，民间也有用来治疗木薯中毒<sup>[3]</sup>。

## 3 结语

黄槿的化学成分研究主要集中在石油醚、醋酸乙酯萃取的小极性和中等极性部位，极性大的部位如正丁醇和水层研究较少，这应该是今后研究的重点。药理研究表明，黄槿具有抗炎、细胞毒等活性，但是其活性成分及机制尚不明确，亟待深入研究。尽管对黄槿的药理活性已经进行大量的研究，但大多数只停留在提取物的层面上，而从中分离得到化合物的活性目前还未见有系统报道。后续的研究工作依然应该以抗肿瘤和抗炎活性为主，但应深入到分子水平，尤其重点关注高度氧化的倍半萜类化合物，阐明其机制并研究其构效关系，将为新药开发奠定科学的基础。

## 参考文献

- [1] 中国科学院中国植物志编辑委员会. 中国植物志 [M]. 第 49 卷(2). 北京: 科学出版社, 1984: 66.
- [2] 陈焕镛. 海南植物志 [M]. 第 2 卷. 北京: 科学出版社, 1965: 100.
- [3] Kumar S, Kumar D, Prakash O. Evaluation of antioxidant potential, phenolic and flavonoid contents of *Hibiscus tiliaceus* flowers [J]. *EJEAFChe*, 2008, 7(4): 2863-2871.
- [4] Chen J J, Huang S Y, Dun C Y, et al. A new cytotoxic amide from the stem wood of *Hibiscus tiliaceus* [J]. *Planta Med*, 2006, 72(10): 935-938.
- [5] Li L Y, Huang X S, Sattler I, et al. Structure elucidation of a new friedelane triterpene from the mangrove plant *Hibiscus tiliaceus* [J]. *Magn Reson Chem*, 2006, 44(6): 624-628.

- [6] 冯超. 两种红树林植物黄槿和长梗肖槿化学成分研究 [D]. 青岛: 中国科学院研究生院海洋研究所, 2008.
- [7] 王忠昭, 李俊, 唐旭利, 等. 半红树植物黄槿中的三萜和甾醇成分 [J]. 中国天然药物, 2011, 9 (3): 190-192.
- [8] Pongrod K, Chavasiri W. Chemical constituents of the leaves of *Hibiscus tiliaceus* Linn and their biological activities [A] // 26th Congress on Science & Technology of Thailand [C]. Bangkok: National Research Council of Thailand, 2000: 150.
- [9] Ali S, Singh P, Thomson R H. Naturally occurring quinones. Part 28. Sesquiterpenoid quinones and related compounds from *Hibiscus tiliaceus* [J]. *J Chem Soc Perkin Trans 1*, 1980(1): 257-259.
- [10] 冯超, 李晓明, 田敏卿, 等. 药用红树林植物黄槿的化学成分研究 [J]. 海洋科学, 2008, 32(9): 57-60.
- [11] Nair A G R, Subramanian S S, Swamy M N. Glycosides from the flowers of *Hibiscus tiliaceus* [J]. *J Sci Ind Res*, 1961, 20B: 553-554.
- [12] 李晓菲, 秦培文, 纪丽丽, 等. 黄槿叶片挥发油和脂肪酸的 GC-MS 分析 [J]. 湖北农业科学, 2011, 50(9): 1893-1897.
- [13] 全国中草药汇编编写组. 全国中草药汇编下册 [M]. 第 2 版. 北京: 人民卫生出版社, 1996: 757.
- [14] 林松文. 黄槿治疗流行性腮腺炎 30 例 [J]. 广西中医药, 1987(4): 48.
- [15] Narender, Kumar S, Kumar D, et al. Antinociceptive and anti-inflammatory activity of *Hibiscus tiliaceus* leaves [J]. *Int J Pharmacogn Phytochem Res*, 2009, 1(1): 15-17.
- [16] 戴好富, 梅文莉, 洪葵, 等. 海南 16 种红树植物的肿瘤细胞毒活性筛选 [J]. 中国海洋药物, 2005, 24(6): 44-46.
- [17] Sunilson A J, Mohan S, Mohamed M A, et al. Anti-tumor activity of *Hibiscus tiliaceus* Linn. roots [J]. *Iranian J Pharmacol Ther*, 2008, 7 (1): 123-125.

## SFDA 批准上市的中药品种情况 (9 月 8 日~9 月 19 日)

产品名称	批准文号	注册分类	规格	生产单位	批准日期
人参健脾丸	国药准字 Z20113066	—	8 g/袋	山东仙河药业有限公司	2011-09-19
泌尿宁胶囊	国药准字 Z20113075	—	0.3 g/粒	甘肃省西峰制药有限责任公司	2011-09-19
利胆排石片	国药准字 Z20113067	—	0.35 g/片	广西恒力宝药业有限公司	2011-09-19
疏肝益阳胶囊	国药准字 Z20110030	—	0.25 g/粒	贵州益佰制药股份有限公司	2011-09-13
复方血栓通颗粒	国药准字 Z20113064	8	3 g/袋 (无蔗糖)	广东众生药业股份有限公司	2011-09-13
消炎止咳片	国药准字 Z20113063	11	0.4 g/片	云南希陶绿色药业股份有限公司	2011-09-13
苦胆草片	国药准字 Z20113062	—	0.25 g/片	云南滇中药业有限公司	2011-09-13
松栝丸	国药准字 Z20113065	—	0.2 g/10 丸	湖南继蒙制药有限公司	2011-09-13
丹参口服液	国药准字 Z20113061	—	合剂; 10 mL/支	太极集团重庆涪陵制药厂有限公司	2011-09-08
复方瓜子金颗粒	国药准字 Z20113060	—	5 g/袋 (无蔗糖, 相当于饮片 28 g)	江西滕王阁药业有限公司	2011-09-08