

中药葛根的研究进展

保定地区卫生学校(保定 071000) 石昌顺*

摘要 就葛根的资源调查、不同生长季节对葛根素含量的影响、炮制、药代动力学、药理与临床及制剂6个方面,综述近4年来葛根的研究进展。

葛根始载于《神农本草经》,列为中品,原名葛,历代本草均有记载,今为常用生药。功效为解表退热、生津止渴、透疹。近年来葛根的应用有所扩大。现从资源调查、炮制、药理、临床及制剂等方面作一概述。

1 资源调查

葛根属植物在我国共约10种,经考查^[1],其中与药用葛根有关的共7种;对6种葛根测定了总黄酮、葛根素及大豆甙等异黄酮的含量。结果总黄酮含量野葛根最高,依次是粉葛、峨嵋葛、越南葛、三裂叶葛、云南葛根。在液相色谱中。野葛和粉葛以葛根素的色谱为主,峨嵋葛的主要峰是葛根素和大豆甙,越南葛、三裂叶葛及云南葛根主要峰是大豆甙,其中云南葛各种成分含量均低,且毒性大。顾志平等^[2]调查发现,野葛根分布广,资源多,总黄酮含量高达7.6%,峨嵋葛、三裂叶葛及云南葛含量分别是1.70%、1.58%、0.5%。云南葛根有毒不可混入商品葛根中使用。目前,作为商品流通的葛根主要是野葛根,其次是粉葛根。据报道^[4],对中国华南产粉葛根、日本产及韩国产野葛根三者的甲醇提取物的含量进行了实验比较。其结果,中国产粉葛根含3.6%,而日产和韩产的野葛根约含14%。中国产的粉葛根所含的异黄酮和三萜类与日产和韩产的野葛根也有明显差别。按所含成分的量判断,日产、韩产的野葛根品质为优。

2 不同生长季节对葛根素含量的影响

仲英等^[5]以山东益都产的葛根为原料,用高效液相色谱法进行了不同生长季节葛根素的含量与其质量变化的研究,结果表明,6月份采集的葛根素含量高达3.5%,8月份含量最低,为0.4%。

3 炮制

葛根传统的炮制方法多用煨法,目前以葛根黄酮含量为指标,采用正交设计法对麸烘制葛根的烘制温度,烘制时间及麸用量3因素进行了实验研究^[6],结果,用麸量是0.4g/g,160℃烘制40min工艺最佳。麸烘制法可代替传统的煨法。于少军^[7]对葛根炮制前后的水浸物、醇浸物,总黄酮及10种无机元素进行了比较,结果表明,上述成分的含量发生了变化,水煎液中的有效成分总黄酮含量炮制品高于生品。

4 药代动力学

金昔陆等^[8,9]用反相高效液相色谱荧光检测法研究了葛根素在大鼠、狗体内的药代动力学,结果符合三室开放模型。给37名志愿者单次静脉注射葛根素5mg/kg的药代动力学,符合二室开放模型。

5 药理与临床

5.1 心血管作用:段重高等^[10]用激光普勒血流仪研究了葛根素对正常金地鼠脑微循环的影响及实验性脑微循环障碍的作用。研究结果表明,葛根素无论对正常金地鼠脑微循环还是对局

*Address: Shi Changshun, Baoding District Health School, Baoding

部滴加去甲肾上腺素引起的微循环障碍都有明显的改善作用，主要表现为增加微血管运动的振幅，提高局部微血流量。为葛根能防治脑血管病提供了理论依据。杨国君^[11]证明，葛根素能明显缓解PGF_{1a}心绞痛，改善缺血心电图，降低心肌耗氧量。葛根的另一有效成分有利葛根甙元^[12]可使狗的左心室做功指数降低14.3%，使冠状血管阻力下降，冠脉流量增加，有利于改善缺血心肌氧的供需平衡。亦有明显抗心律失常作用。

5.2 对记忆的影响：刘干中等^[13]用小鼠跳台法和大鼠操作式条件反射法观察了葛根醇提物及总黄酮对动物学习记忆功能的影响。结果，两者均能对抗东莨菪碱所致的小鼠记忆获得障碍和40%乙醇所致的记忆再障碍，葛根醇提物尚能对抗东莨菪碱所致的大鼠操作式条件反射的抑制。研究发现，东莨菪碱能降低小鼠大脑皮层和海马乙酰胆碱含量，并降低海马乙酰胆碱转移酶活性。上述作用提示：这可能是葛根能改善学习记忆作用的机制之一。

5.3 对白血病细胞及黑色素瘤细胞的影响：大豆甙元^[14,15]可抑制白血病细胞HL—60的增殖，使细胞由原始的早幼粒阶段发育为趋向成熟的中幼粒、晚幼粒以及成熟的杆状粒、分叶核细胞。实验证明大豆甙元对HL—60细胞周期移行G₁期阻断作用，是HL—60细胞分化的诱导剂。但是大豆甙元单独处理HL—60细胞，对细胞的诱导作用较弱，当大豆甙元与乳香的有效成分Bc-4联合应用时，对HL—60细胞的生长有明显抑制和分化诱导作用。大豆甙元^[16]在10~20μg/ml浓度范围内能够明显抑制黑色素瘤B₁₆细胞的增殖，受药物作用4d的B₁₆细胞，克隆形成能力及体内成瘤能力明显降低，其原理是大豆甙元能明显改变B₁₆细胞的形成，诱导小鼠黑色素瘤B₁₆细胞的分化。

5.4 眼科应用：葛根素纯品对48例50只眼睛视网膜动脉阻塞的患者进行治疗，其结果，除3例3眼无效外，其余47眼视功能均有提高^[17]。

6 制剂

葛根素在水中的溶解度较低，目前用于临床的葛根注射液的配方中，只有加入高浓度的丙二醇才能达到该注射剂要求的药物浓度，这样使药物的粘稠度较大，成本增加。初步认为，赖氨酸、精氨酸、烟酰胺、PVP等可作为葛根注射剂处方设计的助溶添加剂^[18]。葛根素注射剂无致突、致畸作用^[19]。

目前作为商品流通的葛根主要是野葛和粉葛，但越南葛、三裂叶葛，峨眉葛主要含大豆甙。大豆甙元有明显抗心律失常作用，并且能分化HL—60细胞和B₁₆细胞。初步认为，可将越南葛、三裂叶葛，峨眉葛提取大豆甙，再使其分解为大豆甙元，这样可使我国葛根的药用资源扩大。

参 考 文 献

- 1 冯瑞芝，等。中国药学杂志，1993，28（5），273
- 2 顾志平，等。中药材，1993，16（8）：13
- 3 仲 耘。中药材，1992，15（2）：18
- 4 野原稔弘，他。现代东洋医学（日），1992，13（3）：79
- 5 仲 英，等。中草药，1992，23（6）：294
- 6 王和平，等。中成药，1991，13（6）：20
- 7 于少军。中国中药杂志，1992，17（9）：534
- 8 金昔陆，等。中国药理学报，1992，13（3）：284
- 9 金昔陆，等。中国临床药理学杂志，1991，7（2）：115
- 10 段重高，等。中华医学杂志，1991，71（9）：516
- 11 杨国君。中西医结合杂志，1990，10（2）：82
- 12 周远鹏。中国药理学与毒理学杂志，1990，4（3）：229

（下转第500页）

荜茇挥发油的成分分析

中国药科大学(南京 210009) 吴知行 杨尚军 巴图仑 周建明 吉宁 余品华

荜茇为胡椒科植物 *Piper longum* L. 的未成熟的果穗。产于印尼、菲律宾、越南,我国云南有野生,海南岛有栽培。本品能温中散寒,下气止痛,治疗胃肠虚寒疼痛,头痛,龋齿痛等。果实含胡椒碱及挥发油,但挥发油的组成未见详细报道[1]。现用GC及GC-MS对荜茇的挥发油作了分析,以了解其化学组成。

1 材料和仪器

荜茇由广州市药品检验所提供。

仪器为GC-14A(岛津)及5988A GC-MS联用仪(惠普)。

2 实验方法

2.1 挥发油的提取:用水蒸汽蒸馏法提取荜茇挥发油,溶于乙醚,以无水 Na_2SO_4 脱水,低温挥去乙醚,得含少量乙醚的挥发油。

2.2 挥发油的成分分析:用CBP1(25m×0.2mm)弹性石英毛细管柱,在GC-MS系统上对挥发油进行分离和鉴定。载气为高纯氮气,柱前压 $103.422 \times 10^3 \text{Pa}$,进样方式:分流进样(分流比66:1),进样口温度:250°C,柱温:60°C(5min)1°C/min
————→110°C(5min) —————→ 150°C
3°C/min
(20min) —————→290°C(100min),质谱分辨率1000,离子源温度250°C,电离方式EI,

电子能量70eV,采用PBM系统wiley谱库检索。用峰面积归一化法测定相对含量。

3 结果与讨论

作出荜茇挥发油的GC-MS联用总离子流图和质谱图,对24种成分的图谱进行检索并与标准图谱[2,3]对照,并能符合质谱裂解规律,才初步确定其结构,其结果如下:3,7-二甲基-1,3,6-辛三烯(0.04%)、苯乙酮(0.14%)、芳樟醇(0.26%),1,7,7-三甲基-双环[2,2,1]-2-庚醇(0.07%)、6-十三磷烯(0.22%)、十三烷(1.62%), δ -榄香烯(0.16%)、 α -荜澄茄油烯(0.48%),(-)- β -榄香烯(0.94%)、顺-丁香烯(0.50%)、 β -芹子烯(5.29%)、 β -金合欢烯(1.71%)、 β -荜澄茄油烯(4.14%)、 α -姜烯(8.91%)、十五烷(10.60%)、金合欢烯(0.48%)、 α -律草烯(2.29%)、顺式十氢化萘(1.20%)、(-)-lepidozenol(2.27%)、1-十七烯(8.14%)、十七烯(14.20%)、十七烷(12.10%)、1-十九烯(1.52%)、十九烷(1.17%)。

致谢:广州市药检所赠给荜茇生药,中国医学科学院药用植物资源开发所赠给对照样品。

参 考 文 献

- 1 南京药学院《中草药学》编写组. 中草药. 中册. 南京:江苏人民出版社,1976. 94
- 2 Heller S R, et al. EPA/NIH Mass Spectral Data Base. Vol 1~4. Washington: U. S Government Printing Office, 1978
- 3 Stenhagen E, et al. Registry of Mass Spectral Data. Vol 1~4. New York: John Wiley and Sons, 1974

(1993-03-05收稿)

(上接第497页)

- 13 刘干中,等. 中药药理与临床, 1990, 6(6):18
- 14 焦鹭,等. 中华血液学杂志, 1990, 11(2): 83
- 15 景永奎. 药学报, 1993, 28(1): 11
- 16 景永奎,等. 中国药理学与毒理学杂志, 1992, 6(4): 278
- 17 各万章. 实用眼科杂志, 1990, 8(1): 9
- 18 王成,等. 中国药理学杂志, 1993, 18(3): 181
- 19 史纪兰. 中国药理学与毒理学杂志, 1992, 6(2): 223

(1994-01-25收稿)