

性器官几乎无影响,可明显增加环磷酰胺造型小鼠的精子数、精子成活率及性腺、性器官的重量^[8]。

4.2 延缓衰老作用:海马的水、醇提取物具有促进小鼠抗应激作用,可增强小鼠的记忆能力,增加小鼠血中的 SOD 含量,降低小鼠肝中的过氧化脂质(LPO)的含量(即降血脂作用),抑制小鼠脑内 MAO-B 活性,及促进血液流变学改变和改善微循环的作用。海马的水、醇提取物具有促进小鼠免疫功能的作用,增加正常小鼠和免疫小鼠的脾重,提高碳粒廓清率和吞噬指数,提高外周血液淋巴细胞 ANAE 阳性百分率,促进血清溶血素抗体的生成,体外实验可提高小鼠脾淋巴细胞增殖^[9,10]。这些实验结果,为海马延缓衰老作用提供重要理论依据。

4.3 抗血栓作用:斑海马具有明显的抗血栓药理作用,能明显抑制大鼠实验性颈动脉血栓和大鼠脑血栓的形成,为海马调气活血功效提供理论依据^[11]。

4.4 镇静作用:大海马、克氏海马、刺海马、三斑海马、日本海马的提取物,对 L 谷氨酸致大鼠神经元钙内流有明显的抑制作用,钙离子进入神经元在兴奋性氨基酸 L 谷氨酸致神经元溃变和坏死过程中起重要作用^[12]。

5 开发前景

5.1 中成药应用:海马作为一种名贵中药材,临床应用十分广泛,常用海马入药,组成复方中药。临床应用较成功的有:治疗男性不育症;用“麝马丸”治关节炎,具活血化瘀作用;用“助阳散”治阳痿症^[13];“天精地液”对补肾壮阳、填精益气有良好疗效。

近期报道,医院用海马入药组成中成药有:安海马粉、海马汤、木香汤、深海龙丸、海马蛤蚧散、麝马丸等。

5.2 保健食品及药品开发应用前景:海马作为一种名贵中药材,在保健食品中开发应用甚广,已有不少由海马组成的保健食品及发明专利。

6 结语

现在,广东中大亿达洲生物科技股份有限公司海马养殖基地以工厂化大规模人工健康养殖海马已获成功,并由“全国科技兴海海水养殖技术中心”批准设立“全国科技兴海海水养殖技术中心汕尾中心”,其研究技术已申报国家发明专利,并审查合格。这样,可持续提供无污染、重金属含量合格的健康优质海马品种,大大促进其在中医药中的广泛应用。

目前,我们已申报筹建海马 GAP 药材基地,并用健康养殖的鲜活海马,研制成功“沁阳春海马胶囊”、“沁阳春海马养生液”、“沁阳春剑南春海马酒”3种保健食品。

由于海马有规模化、工厂化养殖基地,可提供足量无污染健康养殖的鲜活海马,将加速生产高附加值、高新技术含量的保健食品或药品的发展。随着科学的进步,结合海马补肾壮阳、抗应激、延缓衰老等药理作用,应用现代生物技术,提高其深加工生产的水平,发挥其在保健功能食品、新药开发的巨大潜力,其生物医药应用开发的前景是十分广阔的。

参考文献:

- [1] 黄宗国. 中国海洋生物种类与分布 [M]. 北京:海洋出版社, 1994.
- [2] 吕军仪,吴金英,李秉记,等. 大海马在人工养殖条件下的生长速率 [J]. 中国水产科学, 2001, 8(1): 90-94.
- [3] 张朝晖,徐国钧,徐珞珊,等. 海龙科药用动物的理化分析 [J]. 中药材, 1997, 20(3): 140-144.
- [4] 张强,王永利. 尖海龙与日本海马脂肪的提取和分析 [J]. 分析化学, 1996, 24(2): 139-143.
- [5] 许益民,陈建伟,郭成. 海马和海龙中磷脂成分与脂肪酸的分析研究 [J]. 中国海洋药物, 1994, (1): 14-17.
- [6] 王强,张朝晖,臧学新,等. 刺海马化学成分研究 [J]. 中国药科大学学报, 1998, 29(1): 24-25.
- [7] 张朝晖,徐国钧,徐珞珊,等. 海龙类乙醇提取物的激素样作用 [J]. 中药材, 1995, 18(4): 197-199.
- [8] 简裁. 四味汉方药壮阳作用实验研究 [J]. 日本药理学杂志(日), 1959, 55(3): 85.
- [9] 王强,张朝晖,徐国钧. 抗衰老中药海马的化学成分与药理学活性研究 [J]. 实用老年医学, 1997, 11: 44-45.
- [10] 余敏,何耕兴,陈辉,等. 五种海洋生物抗衰老相关活性的实验研究 [J]. 中国海洋药物, 1995, (2): 30-34.
- [11] 许东晖,许实波. 斑海马提取物抗血栓药理研究 [J]. 中药材, 1995, 18(11): 573-574.
- [12] 张朝晖,徐国钧,徐珞珊. 五种海马提取物对 L 谷氨酸致大鼠神经元钙内流的拮抗作用 [J]. 中国海洋药物, 1994, (4): 6-9.
- [13] 朱凌云,张学亮. 助阳散为主治疗阳痿 150例临床观察 [J]. 中医药学报, 1997, 25(3): 23-24.

蓼属植物的化学成分与药理学活性研究进展

巩忠福,杨国林,严作廷,谢家声

(中国农业科学院兰州畜牧与兽药研究所,甘肃 兰州 730050)

摘要:蓼属植物主要含挥发油、黄酮与黄酮苷、萜类、蒽醌、甾类及苷类等多种化学成分,具有杀虫、抗菌、抗肿瘤及抗氧化等多种药理学活性,研究开发前景广阔。

* 收稿日期: 2001-08-15

基金项目:甘肃省自然科学基金项目(ZS981-A21-041-N)

作者简介:巩忠福(1968-),男,陕西户县人,助理研究员,1991年获西北农业大学农学学士学位,1994年获中国农业科学院研究生院中兽医学专业硕士学位,主要从事中药化学及药理研究。 Tel: 0931-2656148 E-mail: zfgong@west163.com

关键词: 蓼属; 化学成分; 药理活性

中图分类号: R282.71

文献标识码: A

文章编号: 0253-2670(2002)01-0082-03

Survey of chemical constituents and bioactivity of *Polygonum L.* plants

GONG Zhong-fu, YANG Guo-lin, YAN Zuo-ting, XIE Jia-sheng

(Lanzhou Institute of Animal Science & Veterinary Pharmacy, Chinese Academy of Agriculture Science, Lanzhou Gansu 730050, China)

Key words *Polygonum L.*; chemical constituents; pharmacological activity

蓼属 (*Polygonum L.*) 是蓼科 (*Polygonaceae*) 的一个大属, 品种繁多, 分布广泛, 仅我国就有百余种之多。蓼属植物药理学活性多样, 是世界各国重要的传统药物资源, 如我国常用的中草药何首乌、虎杖和蒺藜等都源于蓼属植物。近年来研究发现该属植物具有抗微生物、杀虫、抗氧化、抗肿瘤等多种生物活性, 已经显示出巨大的研究和开发潜力。现将近年来有关该属植物化学成分和药理学活性的国内外研究概况作一简述。

1 化学成分

1.1 挥发油成分: 蓼属植物含有多种挥发油成分。Nguyen 等^[1]对越南 *P. odoratum L.* 地上部分的挥发油组分进行了 HPLC-MS 分析, 从中检测到 50 多个化合物, 主要成分为 β -石竹烯、氧化石竹烯和十二烷醛等, 对南澳洲 *P. odotatum L.* 的化学成分研究发现还有癸醛 (decanal)、癸醇 (decanol) 等 17 种挥发油成分^[2]。

1.2 黄酮及黄酮苷类: 黄酮、异黄酮及黄酮苷类是蓼属植物最主要的次生代谢产物。较早报道的该类成分有水蓼素 (persicarin) 槲皮素、槲皮苷、槲皮黄素 (quercimeritin)、色酮 (chromones)、查耳酮和二氢黄酮等。Haraguchi 等^[3,4]从水蓼叶中分离到 7,4'-二甲基槲皮素、3'-甲基槲皮素、异槲皮苷、槲皮素-3-磺酸盐、异鼠李黄素 (isorhamnetin)、异鼠李黄素-3,7-二磺酸盐、柘柳黄素-3-葡萄糖苷-7-磺酸盐 (tamarixetin-3-glucoside-7-sulfate)、甲基鼠李黄素 (rhamnazin)、甲基鼠李黄素-3-磺酸盐和异槲皮苷 (isoquercitrin) 等黄酮及黄酮苷类成分。One 等^[5]从 *P. hydropiper* 的细胞培养物中分离出 3 个儿茶素类 (catechins) 成分, 分别鉴定为 catechin、epicatechin、epicatechin-3-O-gallate。Urones 等从 *P. minus* 中分离到 6,7-亚甲基二氧-5,3,4',5'-四甲氧基黄酮和 6,7-4',5'-二亚甲基二氧-3,5,3'-三甲氧基黄酮。Ahmed 等报道首次从辣蓼 *P. flaccidum* Meissn. 中分离到脂酰基黄酮类化合物。郑尚珍等从红蓼 *P. orientale L.* 植株中分离到槲皮素-3-O- α -L-鼠李糖苷、槲皮素-3-O- β -D-葡萄糖苷、芦丁、苜蓿皮素-7-O- α -L-鼠李糖苷和异鼠李素等 5 个黄酮苷类成分, 从种籽中分离出花旗松素-3-O- β -D-葡萄糖苷 (taxifolin-3-O- β -D-glucoside)、山柰素-3-O- α -L-鼠李糖苷 (kaempferol-3-O- α -L-rhamnoside) 和柯伊利素-7-O- β -D-葡萄糖苷 (chrysoeriol-7-O- β -D-glucoside) 等 3 个黄酮苷化合物^[6]。

1.3 萜类成分: 倍半萜类化合物是蓼属植物非常重要的次生代谢产物, 这些化合物大多都具有 drimane 骨架, 如从水蓼及同属其它多种植物中分离出的二醛类成分水蓼二醛

(tadeonal, polygodial)、二醛类成分异水蓼二醛 (isotadeonal) 和 warburganal 等^[7,8]。Jacobsson 等^[9]从 *P. glabrum* 中分离出 4 个具有典型 drimane 骨架的倍半萜化合物, 这 4 个化合物都是 2,3 位两个羟基的羧酸酯化物, 分别鉴定为 α , β -diangeloyloxysodimeninol、 α -angeloyloxy- β -2'-methylbutanoyl-oxyisodimeninol、 α -angeloyloxy- β -2'-methylpentanoyl-oxyisodimeninol 和 α -angeloyloxy- β -2'-methylpentanoyloxyisodimeninol。其他的萜类成分还见 α -檀香萜 (α -santalene) 及其衍生物^[7]。

1.4 甾类成分: Tsai 等^[10]从火炭母 *P. chinense* 的叶子中分离到 25R-螺甾烷-4-烯-3,12-二酮 (25R-spirost-4-ene-3,12-dione)、豆甾-4-烯-3,6-二酮 (stigmast-4-ene-3,6-dione) 和豆甾烷-3,6-二酮 (stigmastane-3,6-dione) 等 3 种抗炎、抗过敏活性的甾类成分。其他甾类成分还见 β -谷甾醇、 β -谷甾醇苷和豆甾醇等。

1.5 蒽醌及蒽醌衍生物: 迄今已从蓼属植物中分离到大黄酚、大黄素、大黄素甲醚 (physcion)、大黄素-1-O-D-葡萄糖苷、大黄素甲醚-1-O-D-葡萄糖苷、蒽醌、蒽醌酸 (anthraflavic acid)、1,5-二羟蒽醌、蒽醌-2-羧酸、2-乙蒽醌、1-氨基蒽醌、2-氨基蒽醌和茜素 (alizarin) 等一大类蒽醌衍生物^[11]。

1.6 其他成分: 蓼属中已见报道的其它化学成分还有芪 (stilbenes) 和芪苷^[12]、苯丙醇苷类^[13]、白花苷 (leucoanthocyanin) 和金丝桃苷 (hyperin) 等。

2 药理活性

2.1 杀虫活性: 蓼属植物大多都具有杀虫、昆虫拒食、驱避活性。水蓼、蒺藜、辣蓼、异叶蓼 *P. heterophyllum* Lindm.、节蓼 *P. nodosum* Pers.、腋花蓼 *P. plebeium* R. Br.、多穗蓼 *P. polystachyum* Wall. 和扛板归 *P. perfoliatum L.* 等植物的杀虫功效已见广泛的资料记载。*P. acuminatum* 和 *P. punctatum* 在巴西和巴拉圭也被用作传统的杀虫剂治疗畜禽螨病。水蓼中含有的二醛倍半萜类成分 warburganal 和 polygodial 有明显的昆虫拒食活性^[14]。水蓼的乙酸乙酯提取物对 *Spilarrctia obliqua* 和 *Spodeptera litura* 的三期幼虫具有明显的驱避、拒食活性^[15]。*P. glabrum* 是生长于尼罗河岸边的一种多年生草本植物, 在苏丹一直被用作抗蠕虫药物, 由于其含有昆虫驱避活性的倍半萜成分, 因而不受害虫及食草动物 (单峰骆驼除外) 的侵袭。以浸纸法观察了 19 种植物的 20 种提取物对白蛉 *Lutzomyia longipalpis* 的杀虫活性, 结果表明包括 *P. acuminatum* HBK. 和 *P. aviculare L.* 在

内的 5 种提取物显示良好的杀虫活性,以 *P. aviculare* L. 活性最好^[14]。*P. convolvulus* L. 的醇、水提物和蓼科酸模属植物 *Rumex acetosa* L. 的醇提物对白菜毛虫显示强烈的驱避活性。*P. limbatum* 还有一定的灭螺活性,从而对以螺类为中间宿主的疫病防治有意义。据推断该属植物含有的倍半萜类成分的 8,9-二醛基 7,8 位不饱和的 drimane 骨架可能是该类植物具有昆虫驱避活性的化学基础。

2.2 抗微生物活性:体外试验表明,水蓼茎叶中含有的鞣质对痢疾杆菌有一定的抑制作用,水蓼的水提物对部分革兰氏阴性菌有相当的抗菌活性。在中医临床上,水蓼常用于治疗细菌性痢疾、肠疝。*P. glabrum*、*P. bistorta*、*P. equisetiforme* 等其他同属植物的抗菌、抗真菌、抗炎作用也多见报道^[16,17]。

2.3 抗氧化作用:蓼属植物大多具有抗生物膜脂质过氧化和清除体内过多自由基的作用,因此,许多蓼属植物都有抗衰老活性。Haraguchi^[3]等报道了存在于水蓼水溶性组分中的具有抗氧化活性的黄酮苷元和黄酮苷类成分,分别为 7,4'-二甲基槲皮素(a)、3'-甲基槲皮素(b)、槲皮素(c)和黄酮苷类成分异槲皮苷(d),其抗氧化活性依次为 d>a>c>b。Yagi 等^[4]从水蓼中分离出 3 种亲水的黄酮类成分,分别为 3-磺基槲皮素、3,7-二磺基异鼠李素和 7-磺基槲皮素-3-葡萄糖苷,活性试验结果表明这 3 种化合物的抗氧化活性均优于 α -生育酚和槲皮素,槲皮素也优于 α -生育酚。*P. aviculare* L. 的抗脂质氧化及保肝作用也见报道。

2.4 抗肿瘤作用:水蓼对苯并[α]芘、1,6-二硝基芘和 3,9-二硝基荧蒹的致癌变作用呈现一定程度的抑制活性^[19]。*P. cuspidatum* 中含有蒽醌类化合物大黄素,大黄素通过抑制蛋白酪氨酸激酶(PTKs)的活性而起到抗肿瘤的作用^[19]。另外也见蓼属植物抑制蛋白激酶 C(protein kinase C)和 Ca^{2+} ATP 酶活性的报道。

3 结语

绿色无公害必将是未来农药、医药及兽药的主调。蓼属植物具有抗菌、抗氧化、抗肿瘤、杀虫等多种药理学活性,尤其是其突出的杀虫活性和抗氧化活性,这对于新型植物源杀虫剂与抗衰老、抗疲劳天然保健品的研究与开发无疑具有深远的意义。

参考文献:

- [1] Nguyen X D, Le V H, Leclercq P A, et al. Volatile constituents of the aerial parts of Vietnamese *Polygonum odoratum* L. [J]. J Essent Oil Res, 1995, 7(3): 339-340.
- [2] Hunter M V, Brophy J J, Ralph B J, et al. Composition of *Polygonum odoratum* Lour. from southern Australia [J]. J Essent Oil Res, 1997, 9(5): 603-604.
- [3] Haraguchi H, Hashimoto K, Yagi A. Antioxidative substances in leaves of *Polygonum hydropiper* [J]. J Agric Food Chem, 1992, 40(8): 1349-1351.
- [4] Yagi A, Uemura T, Okamura N, et al. Antioxidative sulphated flavonoids in leaves of *Polygonum hydropiper* [J]. Phytochemistry, 1994, 35(4): 885-887.
- [5] Ono K, Nakao M, Toyota M, et al. Catechin production in cultured *Polygonum hydropiper* cells [J]. Phytochemistry, 1998, 49(7): 1935-1939.
- [6] 郑尚珍,王定勇,刘武霞,等. 荜草中的黄酮类化合物 [J]. 西北师范大学学报(自然科学版), 1999, 35(4): 37-41; 42-45.
- [7] Fukuyama Y, Sato T, Miura I, et al. Drimane-type sesquiterpene and norsesquiterpenoids from *Polygonum hydropiper* [J]. Phytochemistry, 1985, 24, 1521-1524.
- [8] Haraguchi H, Matsuda R, Hashimoto K. High-performance liquid chromatographic determination of sesquiterpene dialdehydes and antifungal activity from *Polygonum hydropiper* [J]. J Agric Food Chem, 1993, 41: 5-7.
- [9] Jacobsson U, Muddathir A K. Four biologically active sesquiterpenes of the drimane type isolated from *Polygonum glabrum* [J]. Phytochemistry, 1992, 31(12): 4207-4211.
- [10] Tsai P L, Wang J P, Cheng C W, et al. Constituents and bioactive principles of *Polygonum chinensis* [J]. Phytochemistry, 1998, 49(6): 1663-1666.
- [11] Huang S S, Yeh S F, Hong C Y. Effect of anthraquinone derivatives on lipid peroxidation in rat heart mitochondria: Structure activity relationship [J]. J Nat Prod, 1985, 58: 1365-1371.
- [12] Vastano B C, Chen Y, Zhu N Q, et al. Isolation and identification of stilbenes in two varieties of *Polygonum cuspidatum* [J]. J Agric Food Chem, 2000, 48: 253-256.
- [13] Brown V L, Larson S R, Sneden A T. Vanicosides C-F, new phenylpropanoid glycosides from *Polygonum pensylvanicum* [J]. J Nat Prod, 1998, 61: 762-766.
- [14] Rojas de Arias A, Schmedia-Hirschmann G. Feeding deterrence and insecticidal effects plant extracts on *Lutzomyia longipalpis* [J]. Phytother Res, 1992, 6: 64-67.
- [15] Tripathi A K, Jain D C, Singh S C. Persistency of bioactive fractions of Indian plant extracts on *Polygonum hydropiper* as an insect feeding deterrence [J]. Phytother Res, 1992, 13: 239-241.
- [16] Mao Z, Neeman I. Antimicrobial effects of aqueous plant extracts on the fungi *Microsporium canis* and *Trichophyton rubrum* and three bacterial species [J]. Lett Appl Microbiol, 1998, 26: 61-63.
- [17] Ghazal S A, Abuzarqa M, Mahasned A M. Antimicrobial activity of *Polygonum equisetifolium* extracts and flavonoids [J]. Phytother Res, 1992, 6: 265-269.
- [18] Horikawa K, Mohri T, Tanaka Y, et al. Moderate inhibition of mutagenicity and carcinogenicity of benzo[a]pyrene, 1,6-dinitropyrene and 3,9-dinitrofluoranthene by Chinese medicinal herbs [J]. Mutagenesis (UK), 1994, 9(6): 523-526.
- [19] Jayasuriya H, Koonchanok N M, Geahlen R L, et al. Emodin, a protein tyrosine kinase inhibitor from *Polygonum cuspidatum* [J]. J Nat Prod, 1992, 55(5): 696-698.