

辣素及其应用研究进展

杨炳兴, 成国祥*, 邢福保, 马林荣
(天津大学材料科学与工程学院, 天津 300072)

辣素是茄科植物辣椒中引起辛辣味的主要物质, 是稳定的生物碱。辣素在辣椒中的不同部位含量不同, 其含量从大到小依次为胎座、果肉、种子。天然辣椒碱由一系列同类物质所组成, 按其含量高低, 依次为辣椒碱族、二氢辣椒碱族、对甲基辣椒碱族、对甲基辣椒碱烯族、对甲基辣椒碱炔族和对苯甲基辣椒碱族, 各族中又有若干成分, 但彼此结构性质非常相似, 因而在研究、生产中通常不作区别, 统称为辣素或辣椒碱。辣素常态下为白色晶体, 易挥发, 熔点 $64^{\circ}\text{C} \sim 66^{\circ}\text{C}$, 沸点 $210^{\circ}\text{C} \sim 220^{\circ}\text{C}$, 易溶于乙醇、丙酮、乙醚、苯、氯仿等有机溶剂及碱性溶液, 微溶于水 and 二硫化碳。

1 辣素的提纯、制备

1.1 传统方法: 传统的辣素提取方法有温浸法、回流法和索氏提取法。将干辣椒粉碎, 或用有机溶剂水浴温浸(温浸法), 或回流提取(回流法), 或用索氏提取器提取(索氏提取法), 然后趁热滤过, 蒸馏, 萃取提纯, 经正相色谱分离, 再重结晶, 即可得到白色辣素晶体。

1.2 超临界 CO_2 流体萃取法提取辣素: 干辣椒粉碎, 加入超临界 CO_2 流体萃取釜中, 预热、加压成超临界流体后进入萃取釜, 充分萃取, 再减压分离即可得到辣素。

1.3 通过细胞培养获取辣素: Rao^[1]等利用细胞悬浮、固定培养技术, 成功地将原茶儿醛 (protocatechuic aldehyde) 和咖啡酸 (caffeic acid) 经生物转化得到了辣素, 并研究了原茶儿醛和咖啡酸不同加入方式对辣素产量的影响。

2 辣素的药理作用

2.1 对神经作用的机制研究: 辣素对人或动物的神经有刺激作用, 产生疼痛反应和热反应, 但同时又有显著的麻醉止痛效果, 因此被广泛地应用于疼痛机制的研究。P 物质 (substance P) 是一种十一肽, 被公认为是一种重要的传递介质, 能够把疼痛刺激由外周神经传入到脊髓神经和高级中枢神经。辣素的作用机制则包括从 C 型神经纤维 (type C neurones) 中刺激 P 物质的释放^[2]。Yvonne^[3]等研究了体外培养传感神经的 Ca^{2+} 依赖性神经传递释放, 验证了辣素导致神经节内神经肽从鼠的神经中枢释放这一假说, 并发现随着辣素浓度的升高可以提高免疫反应性, 降血钙素基因缩氨酸的释放量。在人与动物感受疼痛的过程中, 香兰素类物质受体 (vanilloid receptor) 被认为扮演了重要的角色。早些时候的证据表明它存在于大脑中, Tamas^[4]等采用辣素进行实验, 对其进行了药理描述。一氧化氮 (NO) 是中枢神经系统信号

传递的重要信息传递分子, Wu^[5]等对鼠的脚部进行辣素皮内注射, 并用蛋白质印迹的方法考察了辣素对 NO 合酶的影响, 发现辣素对鼠体内的两种 NO 合酶均有促进作用。

2.2 抗炎作用: 辣素对由 P 物质和鹿角菜胶引起的炎症有明显的缓解作用。Tseng^[6]等研究了在星形神经中心和星状神经节切除术中, 局部施用辣素对鼠支气管神经性炎症的减轻作用, 并研究了迷走神经和非迷走神经对鼠支气管神经性炎症的影响。

2.3 抗癌与致癌作用: 根据文献报道, 辣素对肿瘤有着比较复杂的作用。近年来, 不乏关于预防治疗皮肤癌^[7]、肝癌^[8]等多种癌症的报道, 多方证实辣素具有防癌抗癌作用, 其作用机制一是可以直接加速癌细胞的凋亡, 另外还可以降低体内抗细胞凋亡物质的浓度。同时也有文献报道辣素还有致癌作用。Costa^[9]等研究了其对鼠爪部肿瘤的导致、恶化作用, 指出辣素使感觉神经对 P 物质的分泌达到了最高值, 并将产生胺、组胺, 使 5-HT 的柱状细胞激活; Saurabh^[10]研究了在 Ca^{2+} 离子存在条件下辣素对 DNA 的氧化破坏作用, 从而定性、定量研究了辣素致癌、诱发基因突变的机制。

2.4 对内脏的生理作用: Yamamoto^[11]发现辣素对胃溃疡也有着比较复杂的作用, 一方面辣素会通过影响神经导致溃疡的产生; 但另一方面, 适当的服用辣素又可以改善胃黏膜血液循环而具有抗溃疡作用, 对胃起保护作用。辣素对胃酸的分泌也有促进作用, 并可加强消化系统的蠕动能力, 用于术前和术后的临床病人, 可以减少肠梗塞现象的发生^[12]。

Janos^[13]研究指出, 不同辣素浓度会影响心脏冠动脉的收缩, 导致诸如心率、冠动脉血流量、血量等一系列心脏参数的下降; 同时, 对这一作用的机制进行了详尽的分析。辣素还可以影响动物的排尿动力。将辣素经过鼠和东欧大鼠的膀胱, 检测一系列的排尿动力参数, 如排尿间歇期、排尿压力阈值等, 结果发现辣素使二者的膀胱过度兴奋, 但表现不同, 各参数变化趋势不一致, 其原因可能是由于辣素作用于二者的平滑肌和神经纤维, 其表达方式有所差异^[14]。Gniza^[15]等经研究发现辣素可以使一些动物的膀胱逼尿肌紧张收缩, 但对于小羊羔的逼尿肌却有放松作用。辣素对糖尿病病情亦有改善作用, 其原因可能是因为辣素提高了胰岛素敏感度^[16]。

辣素具有减肥的功效。它可以促进 β 肾上腺素的分泌, 从而加快自由脂肪酸的体内循环, 以影响脂肪在腹部的沉积与代谢^[17]。

* 收稿日期: 2003-02-05

作者简介: 杨炳兴 (1977-), 男, 河北省沧州市人, 硕士, 主要从事生物可降解微囊和纳囊的研究。

* 通讯作者 Tel (022) 27404432 E-mail gxcheng@tju.edu.cn

2.5 其他作用:辣素可引发人体强烈的生理反应,使人产生咳嗽、呕吐、流泪、迷失方向、产生红斑。因而被用于个人防身武器和制服违法者的工具。Christopher^[18]等做了大量的工作确定了此类武器中辣素的最佳用量。

3 结语

辣素作为一种天然植物提取物,有着良好的应用前景,可以广泛地应用于医学、药物、日用、武器等多个领域。我国具有丰富的辣素资源,如何将其有效利用、研究、开发出高附加值产品是亟待解决的问题。

References

- [1] Rao S R, Ravishankar G. Biotransformation of protocatechuic aldehyde and caffeic acid to vanillin and capsaicin in freely suspended and immobilized cell cultures of *Capsicum frutescens* [J]. *J Biotech*, 2000, 76: 137-146.
- [2] Walker R A, McClean G J. The addition of glyceryl-trinitrate to capsaicin cream reduces the thermal allodynia associated with the application of capsaicin alone in humans [J]. *Neurosci Lett*, 2000, 323: 78-80.
- [3] Ulrich-Lai Y M, Flores C M, Harding-Rose C A, *et al.* Capsaicin-evoked release of immunoreactive calcitonin gene-related peptide from rat trigeminal ganglion: evidence for intraganglionic neurotransmission [J]. *Pain*, 2001, 91: 219-226.
- [4] Tamas S, Tamas B, Gonzalez A F, *et al.* Pharmacological characterization of vanilloid receptor located in the brain [J]. *Mol Brain Res*, 2002, 98: 51-57.
- [5] Wu J, Fang L, Lin Q, *et al.* Nitric oxide synthase in spinal cord central sensitization following intradermal injection of capsaicin [J]. *Pain*, 2001, 94: 47-58.
- [6] Tseng W Y, Tsao C F, Ko C C, *et al.* Local capsaicin application to the stellate ganglion and stellatectomy attenuate neurogenic inflammation in rat bronchi [J]. *Autonomic Neurosci: Basic Clin*, 2001, 94: 25-33.
- [7] Han S S, Keum Y S, Seo H J, *et al.* Capsaicin suppresses phorbol ester-induced activation of NF- κ B/Rel and AP-1

transcription factors in mouse epidermis [J]. *Cancer Lett*, 2001, 164: 119-126.

- [8] Jung M Y, Kang H J, Moon A. Capsaicin-induced apoptosis in SK-Hep-1 hepatocarcinoma cells involves Bcl-2 downregulation and caspase-3 activation [J]. *Cancer Lett*, 2001, 165: 139-145.
- [9] Costa S K P, Esquisatto L C M, Camargo E, *et al.* Comparative effect of phoneutria nigiventer spider venom and capsaicin on the rat paw edema [J]. *Life Sci*, 2001, 1573-1585.
- [10] Singh S, Asad S F, Ahmad A, *et al.* Oxidative DNA damage by capsaicin and dihydrocapsaicin in the presence of Cu (II) [J]. *Cancer Lett*, 2001, 169: 139-146.
- [11] Yamamoto H, Horie S, Uchida M, *et al.* Effects of vanilloid receptor agonists and antagonists on gastric antral ulcers in rats [J]. *Europ J Pharm*, 2001, 432: 203-210.
- [12] Zittel T, Meile T. Preoperative intraluminal application of capsaicin increases postoperative gastric and colonic motility in rats [J]. *J Gastrointestinal Surg*, 2001, 5: 503-513.
- [13] Szolcsanyi J, Oroszi G, Nemeth J, *et al.* Functional and biochemical evidence for capsaicin-induced neural endothelin release in isolated working rat heart [J]. *Europ J Pharm*, 2001, 419: 215-221.
- [14] Lecci A, Carini F, Tramontana M, *et al.* Urodynamic effects induced by intravesical capsaicin in rats and hamsters [J]. *Autonomic Neurosci: Basic Clin*, 2001, 91: 37-46.
- [15] Bartocci C, Evandri M G, Tucci P, *et al.* Interactions between Δ -9THC and capsaicin on isolated lamb bladder detrusor [J]. *IL Farmaco*, 2001, 56: 349-351.
- [16] Park B J, Park J H, Kageyama H, *et al.* Effect of capsaicin on glucose metabolism in diabetic rats [J]. *Diabetes Res Clin Prac*, 2000, 50(9) Suppl 1: 395.
- [17] Yoshioka M, Sc M, Matsuo T, *et al.* Effects of capsaicin in abdominal fat and serum free-fatty acids in exercise-trained rats [J]. *Nutr Res*, 2000, 20(7): 1040-1045.
- [18] Reilly C A, Crouch D J, Yost G S, *et al.* Determination of capsaicin, dihydrocapsaicin, and nonivamide in self-defense weapons by liquid chromatography-mass spectrometry and liquid chromatography-mass spectrometry and liquid chromatography-tandem mass spectrometry [J]. *J Chromatogr A*, 2001, 912: 259-267.

《中药材》杂志 2004年征订

《中药材》杂志是经国家科委和新闻出版署批准出版的国内外公开发行的国家级中药科技学术刊物。由国家药品监督管理局主管,国家药品监督管理局中药材信息中心站主办。

大 16开本, 80~96页, 月刊, 2004年不加价, 每期定价仍为 12.5元, 全年(12期)定价 150元。现已开始订阅, 请订户填好订阅回单并通过邮局或银行直接汇款至《中药材》杂志编辑部。

地 址: 广州市中山二路 24号中粤大厦 11楼

邮政编码: 510080

电 话: (020) 87665465

电 传: (020) 87756221

开户银行: 交通银行广州分行东山支行

帐 号: 161690010149008703

收款单位: 中药材编辑部