

由表1可见,宁夏的药用盐生植物主要集中于菊科(9种)、豆科(7种)、藜科(6种)和蒺藜科(4种),其余大多数科仅含有1~2个种。其中已被人工选育栽培成功,作为药用的有草麻黄、甘草和宁夏枸杞。药用价值高、资源丰富具备开发潜力的约10种(白刺、小果白刺、毛瓣白刺、黑果枸杞、怪柳、二色补血草、苦马豆、苦豆子、沙枣、马蔺)。药用价值高但濒于灭绝的有4种(罗布麻、盐生肉苁蓉、黄花补血草、野生宁夏枸杞)。

### 3 宁夏药用盐生植物资源的开发利用

调查表明,在宁夏大面积的盐碱地上,分布着一些极具开发潜力的药用植物,这些种类不仅分布广泛,而且具有较丰富的蕴藏量,另外还有些种类濒于灭绝,亟待进行挽救和保护。对于这些野生药用盐生植物资源要做到合理利用,获得经济、生态和社会效益的和谐统一,可从以下几个方面来考虑。

3.1 加强资源的调查:要充分有效的利用野生盐生药用植物资源,首先要了解其资源状况,特别是加强对资源蕴藏量、分布和年产量的调查,从而为合理采收和利用提供理论基础。

3.2 引种驯化一些药用盐生植物:在宁夏引黄灌区具有不同程度盐碱化和次生盐碱化的土地上,引种药用盐生植物,经过人工驯化,使之能在盐碱化土地上正常生长发育。这项措施既可开发利用药用盐生植物资源,又能治理盐碱化土地。目前,宁夏已经引种成功的有宁夏枸杞、甘草、草麻黄等。

3.3 保护种质资源:种质资源是能够繁殖后代并保持稳定的遗传性状的(动)植物材料的总称。宁夏有丰富的药用盐生植物资源,它们既有一定的经济用途,又有很高的耐盐能力,是非常宝贵的天然种质基因库。如将其抗盐基因转入不抗盐

的作物上,使之成为抗盐的转基因植物,从而提高作物的抗性和产量。

3.4 加强对濒危药用盐生植物资源的栽培技术和方法的研究,对其进行扩大培养繁殖。

3.5 综合利用:有些药用盐生植物具有多方面的用途。如黄花补血草、二色补血草不仅具有活血、补血的药用价值,而且是盐碱地绿化的好材料。它们花繁色艳,花枝长,保鲜时间久,是理想的切花材料。同时还具有不凋谢的干膜质花萼,也是极好的干花花材,因而具有良好的发展前景和开发利用价值。白刺果实不仅有很高的药用价值,而且其果实还可用于提取珍稀的玫瑰红色素,满足国内外食品工业的需求。另外其嫩枝、叶是很好的牧草,果核可榨油,也是盐碱地绿化树种。在开发利用野生盐生药用植物的过程中,如果能注意到这些盐生药用植物用途的多样性,进行全面的开发利用,必会取得最大的收益。

### References:

- [1] Wang Z Q. *Saline-alkali Soil in China* (中国盐碱土壤) [M]. Beijing: Science Press, 1993.
- [2] Zhao K F, Li F Z. *Halophytes in China* (中国盐生植物) [M]. Beijing: Beijing Science and Technology Press, 1999.
- [3] Fan Z L, Ma Y J, Ma Y J. Salinized soils and their improvement and utilization in West China [J]. *Arid Zone Res* (干旱区研究), 2001, 18(3): 1-6.
- [4] Wang Y M. *Exploitation and Renovation Study on Country Soils in Underdevelopment Regions*. (不发达地区国土开发整治研究) [M]. Yinchuan: Ningxia People's Publishing House, 1994.
- [5] Ma D Z, Liu H L. *Flora Ningxiaensis* (宁夏植物志) [M]. Yinchuan: Ningxia People's Publishing House, 1988.
- [6] Xing S R. *Ningxia Chinese Traditional Medicine Annuals* (宁夏中药志) [M]. Yinchuan: Ningxia People's Publishing House, 1991.

## 禹州漏芦化学成分及药理活性的研究进展

汪毅,李铎\*,张鹏

(沈阳药科大学天然药物研究室,辽宁沈阳 110016)

禹州漏芦为菊科蓝刺头属植物蓝刺头 *Echinops latifolius* Tausch 及华东蓝刺头 *E. grijisii* Hance 的干燥根,具有清热解毒、排脓止血、消痈下乳的功效,为《中华人民共和国药典》(后称药典)收载品种。此前,禹州漏芦(蓝刺头)曾与漏芦属祁州漏芦 *Rhaponticum uniflorum* (L.) DC. 一起作为漏芦收载于药典中。近年的研究已证明两者的化学成分及疗效各不相同,因此药典1995年版将祁州漏芦称漏芦,禹州漏芦另列作为独立品种。禹州漏芦一般用于治疗疮痍脓肿、皮肤热毒和乳汁不通等症。研究证明禹州漏芦中含有大量的

噻吩类化合物,这种化合物具有显著的抗肿瘤、抗病毒等多种药理活性。根据近年来的研究报道,笔者对禹州漏芦的化学成分及药理活性等方面做一综述,为深入研究开发该中药及指导中医师选用药材提供参考。

### 1 化学成分

目前为止对禹州漏芦化学成分的研究主要集中于其脂溶性成分,从中分离鉴定了噻吩类、挥发油类、三萜类及甾体类等成分。

1.1 噻吩类:噻吩类化合物为禹州漏芦中主要的脂溶性成

收稿日期:2004-05-13

作者简介:汪毅(1978—),男,辽宁沈阳人,2002年毕业于沈阳药科大学,为天然药物化学专业研究生。

\*通讯作者 Tel:(024)23843711-3588 E-mail:lixian@mail.sy.ln.cn

分,这些化合物通常具有 1~3 个噻吩环,环与环之间通过  $\alpha$ -碳原子相连,且大多具有含取代基的侧链。噻吩类化合物在植物中常与多炔类化合物并存,有人认为它们是通过多炔类化合物与硫化氢作用形成的加成产物。目前为止,从蓝刺头中分离鉴定的噻吩类化合物有:5-(丁烯-3-炔-1)-联噻吩(I)、 $\alpha$ -三联噻吩(II)、卡多帕亭(III)、2-(戊二炔-1,3)-5-(3,4-二羟基丁炔-1)噻吩(IV)和 5-(3,4-二羟基丁炔-1)-联噻吩(V)<sup>[1]</sup>。从华东蓝刺头中分离鉴定的有:5-(4-O-异戊酰基丁炔-1)-联噻吩(VI)、5-(丁烯-3-炔-1)-联噻吩、异卡多帕亭(VII)、卡多帕亭、 $\alpha$ -三联噻吩、5-(3,4-二羟基丁炔-1)-联噻吩<sup>[2]</sup>、5-乙酰基联噻吩(VIII)、5-(3,4-二乙酰氧基丁炔-1)-联噻吩(K)、5-(3-乙酰氧基-4-异戊酰氧基丁炔-1)-联噻吩(X)、5-(3-羟基-4-异戊酰氧基丁炔-1)-联噻吩(XI)、5-(3-羟基-4-乙酰氧基丁炔-1)-联噻吩(XII)、5-(4-羟基丁炔-1)-联噻吩(XIII)、2-(3,4-二乙酰氧基丁炔-1)-5-(丙炔-1)噻吩(XIV)、2-(3,4-二羟基丁炔-1)-5-(丙炔-1)噻吩(XV)<sup>[3]</sup>、echinothiophene(XVI)<sup>[4]</sup>、echinoyne thiophene(XVII)、5,5''-二氯- $\alpha$ -三联噻吩(XVIII)、5-氯- $\alpha$ -三联噻吩(XIX)、5-乙酰基- $\alpha$ -三联噻吩(XX)、5-羟基- $\alpha$ -三联噻吩(XXI)<sup>[5]</sup>。化合物 I~XXI 结构见图 1。

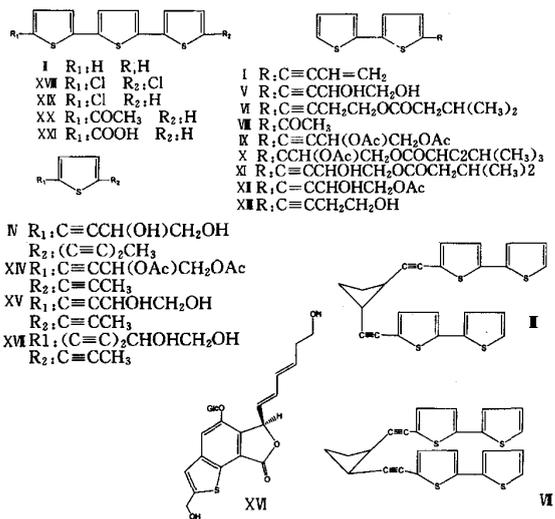


图 1 禹州漏芦噻吩化合物的结构

Fig. 1 Structures of thiophenes from *Radix Echinopsis*

1.2 挥发油类:果德安等<sup>[6]</sup>于 1994 年采用气质联用技术从华东蓝刺头根的挥发油中鉴定了 24 个成分,其中以倍半萜烯为主,另外尚有 2 种脂肪酸、3 种脂肪酸酯和 3 种联噻吩。在鉴定的成分中,以顺式- $\beta$ -金合欢烯的体积分数最高(25.18%),其次为 5-(丁烯-3-炔-1)-联噻吩(19.69%)、 $\beta$ -红没药烯(12.11%)、 $\alpha$ -三联噻吩(8.36%)。

1.3 其他成分:从蓝刺头根中得到的化合物还有卅一烷、蒲公英萜醇乙酸酯、混合脂肪醇、 $\beta$ -谷甾醇、胡萝卜苷<sup>[1]</sup>。从华东蓝刺头根中还得到地榆皂苷-1、蒲公英萜醇乙酸酯、熊果酸、三十烷酸、 $\beta$ -谷甾醇和胡萝卜苷<sup>[7]</sup>。另外,刘玥等<sup>[8]</sup>从华东蓝刺头地上部分分离出齐墩果-3-酮、槲皮素、芦丁、橙皮

苷、木犀草素-7-O- $\beta$ -D-葡萄糖苷、谷甾醇-3-O-葡萄糖苷等 13 种成分。

2 药理活性

2.1 噻吩类化合物的光反应活性:作为一种天然的噻吩类化合物, $\alpha$ -三联噻吩( $\alpha$ -T)及其类似物的结构中含有不饱和和共轭链,具有高消光系数的近紫外吸收及氧的量子产额。这使其具有广泛的光毒活性,对肿瘤细胞及病毒、真菌等各种病原微生物显示出明显的抑制作用。

2.1.1 抗病毒及细胞毒作用:Marles 等<sup>[9]</sup>报道了  $\alpha$ -T 及其 15 个合成衍生物抗病毒的光活性及细胞毒作用。当照射长波紫外光,最小抑制浓度 0.02  $\mu$ mol/L,  $\alpha$ -T 及其大多数衍生物显示出对鼠类细胞巨化病毒及肥大瘤细胞的毒性,如无长波紫外光照射,仅有一个衍生物有抗病毒活性,5 个衍生物有细胞毒性。活性最强的为羧基、羟基及腈基取代物。对噻吩类光毒活性构效关系的研究表明,单线态氧化速度是抗病毒及细胞毒的决定因素。研究结果表明三联噻吩类化合物对病毒传染及癌症显示出强大的光化学治疗作用。Ebermann 等<sup>[10]</sup>也报道了  $\alpha$ -T 具有依赖光的破灭肿瘤细胞作用,提示可作为抗肿瘤的前体药物。

2.1.2 抗 HIV 作用:Hudson 等<sup>[11]</sup>报道了植物中的  $\alpha$ -T 具有依赖长波紫外光的抗 HIV-1 活性。虽然在牛血清存在下活性降低,但在 0.1 mg/mL 的质量浓度下,  $\alpha$ -T 可灭活  $10^4 \sim 10^5$  的病毒传染体。同年又报道了  $\alpha$ -T 合成衍生物的抗 HIV 活性。利用残余病毒导致组织细胞病变的能力及产生的病毒蛋白 p24 来测定各化合物的活性,结果表明  $\alpha$ -T 的活性强于其衍生物,各种侧链的存在使活性降低或完全消失<sup>[12]</sup>。1994 年 Hudson<sup>[13]</sup>对  $\alpha$ -T 及其羧酸衍生物的抗病毒反应参数进行研究,对比在有无血清的条件下各种化合物的抗 HIV 活性。结果显示用于稳定病毒的血清成分可与某些  $\alpha$ -T 的羧酸衍生物进行反应,从而阻碍了它们潜在的抗 HIV 活性。

2.1.3 抗真菌作用:Mares 等<sup>[14]</sup>报道了在紫外光照射下,  $\alpha$ -T 能抑制皮肤真菌 *Microsporium cookei* 的生长。当无长波紫外光照射时,  $\alpha$ -T 累积于液泡中;长波紫外光照射后,  $\alpha$ -T 能损伤细胞核、内质网及线粒体的外膜,并导致质壁分离及细胞自溶,从而推断  $\alpha$ -T 光毒作用的靶点为膜蛋白。1994 年又对 9 个天然或合成的  $\alpha$ -T 衍生物的抗真菌作用进行了研究。当用长波紫外光照射时,它们都显示出较强的抑制真菌生长的活性,并发现 2' 位取代的衍生物活性最强,同时推断长波紫外光照射下  $\alpha$ -T 对内膜的修改为一需氧过程<sup>[15]</sup>。

2.1.4 杀虫作用:天然噻吩类化合物对细菌、酵母菌、昆虫及各种实验微生物均产生光毒活性,有较明显的杀虫作用。Nivsarkar 等<sup>[16]</sup>报道了  $\alpha$ -T 的杀蚊作用。研究发现在长波紫外光照射下,  $\alpha$ -T 能显著抑制伊蚊属 *Aedes aegypti* L. 幼虫肛门菌褶上的过氧化物歧化酶(SOD),而 SOD 能促进幼虫从 1 龄到 4 龄的生长发育。Sharma 等<sup>[17]</sup>研究了  $\alpha$ -T 分别在避光、日光灯照射及长波紫外光照射条件下的杀蚊能力。在 3 种条件下,  $\alpha$ -T 对按蚊幼虫(4 龄)的半致死浓度(LC<sub>50</sub>)分别为 0.154、0.092、0.011 mg/L,对库蚊幼虫的 LC<sub>50</sub>分别为

0.129、0.097、0.022 mg/L。这一结果提示天然噻吩类化合物作为可进行生物降解、有利于生态保护的新型杀虫剂的可能性。

2.2 保肝作用:Lin<sup>[18]</sup>报道了蓝刺头及华东蓝刺头有明显的保肝作用,能改善CCl<sub>4</sub>所致的大鼠肝坏死和肝功能紊乱。进一步研究中利用肝脏切片的组织病理学改善水平及ALT、AST标准证明了华东蓝刺头根中的保肝活性成分主要集中在正丁醇萃取部分及水层<sup>[19]</sup>。

2.3 抗炎作用:Lin<sup>[20]</sup>报道了蓝刺头及华东蓝刺头根的抗炎活性,发现华东蓝刺头甲醇提取物中正己烷萃取部分(100、300 mg/kg)、氯仿萃取部分(30、100、300 mg/kg)及醋酸乙酯萃取部分(30、100、300 mg/kg)能明显改善角叉菜胶所致的小鼠足部肿胀。研究证明华东蓝刺头抗炎成分集中于氯仿萃取部分,且活性强于吡啶美辛。另外,Cho<sup>[21]</sup>对华东蓝刺头中的噻吩类化合物进行了抗炎、抗病毒及作为免疫调节剂的研究,并于1995年获得专利。

### 3 结语

禹州漏芦是一种传统中药,在民间广泛作为漏芦使用。但现代科学研究已证明禹州漏芦与漏芦的化学成分与药理活性明显不同。噻吩类化合物是禹州漏芦中主要的脂溶性成分。作为菊科植物中特有的天然产物,噻吩类化合物已显示出对癌症及病毒性感染等多种恶性疾病的光化学治疗潜力。目前对禹州漏芦,特别是蓝刺头的研究还很少,其化学成分及药理活性值得进一步研究。综上所述,禹州漏芦是一种重要的药用资源,开发利用的潜力巨大,应对其进行更广泛、更系统的研究,使之得以合理应用。

### References:

- [1] Lu H C, Wang S X, Zhu T R. Studies on the chemical constituents of *Radix Echinopsis* [J]. *Chin Tradit Herb Drugs* (中草药), 1989, 20(11): 2-5.
- [2] Guo D A, Cui Y J, Lou Z C, et al. Studies on the chemical constituents of *Echinops grijisii* (I) [J]. *Chin Tradit Herb Drugs* (中草药), 1992, 23(1): 3-5.
- [3] Lin Y L, Huang R L, Kuo Y H, et al. Thiophenes from *Echinops grijisii* Hance [J]. *Chin Pharm J* (中国药学杂志), 1995, 51(3): 201-211.
- [4] Kazuo K, Jia Z H, Tamotsu N, et al. Echinothiophene, a novel benzothiophene glycoside from the roots of *Echinops grijisii* [J]. *Org Lett*, 1999, 1(2): 197-198.

- [5] Liu Y, Ye M, Guo H Z, et al. New thiophenes from *Echinops grijisii* [J]. *J Asian Nat Prod*, 2002, 4(3): 175-178.
- [6] Guo D A, Lou Z C, Liu Z A. Studies on the naphthc constituents in the roots of *Echinops grijisii* [J]. *China J Chin Mater Med* (中国中药杂志), 1994, 19(2): 100-101.
- [7] Guo D A, Lou Z C, Gao C Y, et al. Studies on the chemical constituents of *Echinops grijisii* (II) [J]. *Chin Tradit Herb Drugs* (中草药), 1992, 23(10): 512-514.
- [8] Liu Y, Ye G, Cui Y J, et al. Studies on the chemical constituents of the up-terra parts of *Echinops grijisii* [J]. *Chin Tradit Herb Drugs* (中草药), 2002, 33(1): 18-20.
- [9] Marles R J, Hudson J B, Graham E A, et al. Structure-activity studies of photoactivated antiviral and cytotoxic tricyclic thiophenes [J]. *Photochem Photobiol*, 1992, 56(4): 479-487.
- [10] Ebermann R, Alth G, Kreitner M, et al. Natural products derived from plants as potential drugs for the photodynamic destruction of tumor cells [J]. *J Photochem Photobiol B*, 1996, 36(2): 95-97.
- [11] Hudson J B, Harris L, Teeple A, et al. The anti-HIV activity of the phytochemical  $\alpha$ -terthienyl [J]. *Antiviral Res*, 1993, 20(1): 33-43.
- [12] Hudson J B, Harris L, Marles R J, et al. The anti-HIV activities of photoactive terthiophenes [J]. *Photochem Photobiol*, 1993, 58(2): 246-250.
- [13] Hudson J B, Graham E A, Towers G H. Antiviral assays on phytochemicals: the influence of reaction parameters [J]. *Planta Med*, 1994, 60(4): 329-332.
- [14] Mares D, Fasulo M P, Bruni A. Ultraviolet-mediated antimycotic activity of  $\alpha$ -terthienyl on *Microsporum cookie* [J]. *J Med Vet Mycol*, 1990, 28(6): 469-477.
- [15] Mares D, Romagnoli C, Rossi R, et al. Antifungal activity of some 2, 2', 5', 2-terthiophene derivatives [J]. *Mycoses*, 1994, 37(9-10): 377-383.
- [16] Nivsarkar M, Kumar G P, Laloraya M, et al. Superoxide dismutase in the anal gills of the mosquito larvae of *Aedes aegypti*: its inhibition by  $\alpha$ -terthienyl [J]. *Arch Insect Biochem Physiol*, 1991, 16(4): 249-255.
- [17] Sharma A, Goel H C. Some naturally occurring phytophototoxins for mosquito control [J]. *Indian J Exp Biol*, 1994, 32(10): 745-751.
- [18] Lin C C, Yen M H, Chiu H F, et al. The pharmacological and pathological studies on Taiwan folk medicine (N): The effects of *Echinops grijisii* and *E. latifolius* [J]. *Am J Chin Med*, 1990, 18(3-4): 113-120.
- [19] Lin C C, Lin C H. Pharmacological and pathological studies on Taiwan folk medicine (K): The hepatoprotective effect of the methanolic extract from *Echinops grijisii* [J]. *Am J Chin Med*, 1993, 21(1): 33-44.
- [20] Lin C C, Lin C H, Chiu H F, et al. The pharmacological and pathological studies on Taiwan folk medicine (W): The anti-inflammatory effect of *Echinops grijisii* [J]. *Am J Chin Med*, 1992, 20(2): 127-134.
- [21] Cho K, Ryw M, Chin K, et al. Thiophene compounds as antiviral, anti-inflammatory and immunoregulatory agents [P]. JP: 9502665, 1995-01-06.

## 何首乌的生物学及化学成分研究进展

廖海民<sup>1,2</sup>, 胡正海<sup>1\*</sup>

(1. 西北大学生命科学学院, 陕西 西安 710069; 2. 贵州大学生物与环境学院, 贵州 贵阳 550025)

何首乌又称首乌、赤首乌,为蓼科植物何首乌 *Polygonum multiflorum* Thunb. 的干燥块根。主产于我国四

川、湖南、贵州、河南等省区,生于灌木丛中、山脚阴处或石隙中。何首乌具有补肝肾、益精血、乌须发、强筋骨之功效,是滋

收稿日期: 2004-07-07

作者简介: 廖海民(1965—),男,湖南省湘乡市人,副教授,在读博士,研究方向为结构植物学,主持省级课题2项,参加国家课题3项,省级课题10多项,发表论文20余篇。 E-mail: hmliao65@tom.com

\* 通讯作者 Tel: (029)88302684