

- 响的研究[J]. 华西药理学杂志, 1995, 10(3): 147-149.
- [19] 车镇涛, 宗玉英. 离子色谱法测定常用药食两用中药材中的二氧化硫含量[J]. 中药材, 2006, 29(5): 444-446
- [20] 王兆基, 关锡耀, 汪洁, 等. 中药材中二氧化硫的含量测定[J]. 中草药, 2000, 31(2): 97-99
- [21] 吴卫平, 张磊, 李洁, 等. 食品中二氧化硫残留快速检测方法的研究[J]. 上海预防医学杂志, 2006, 18(9): 470-471
- [22] 陈琴鸣, 周海燕, 吴迎春, 等. 改良 Monier-Williams 法测定药材中 SO_2 的残留量[J]. 中草药, 2005, 36(9): 1407-1409
- [23] 赵花荣, 温树敏, 冯雅琪, 等. 用傅里叶变换红外光谱法鉴别菊花中硫磺残留[J]. 光谱学与光谱分析, 2007, 27(6): 1110-1112
- [24] 冯学, 杨连菊, 格小光. 中药材使用硫磺熏蒸方法探源[J]. 湖南中医药大学学报, 2007, 27(S1): 374-376

半枝莲的研究进展

郑永红, 韦晓瑜, 龙继红*

(国家中药品种保护审评委员会办公室, 北京 100810)

摘要: 半枝莲为唇形科植物半枝莲 *Scutellaria barbata* 的干燥全草, 其主要活性成分为黄酮类、多糖和挥发性物质, 具有抗氧化、抗病原微生物、增强免疫、抗肿瘤等多种药理活性。为了更深入的研究半枝莲, 对半枝莲的提取方法、化学成分及药理作用进行综述。

关键词: 半枝莲; 抗氧化; 抗肿瘤

中图分类号: R284.1

文献标识码: A

文章编号: 0253-2670(2010)08-1406-03

Advances in studies on *Scutellariae Barbatae Herba*

ZHENG Yong-hong, WEI Xiao-yu, LONG Ji-hong

(National Committee on the Assessment of the Protected Traditional Chinese Medicinal Products, Beijing 100810, China)

Key words: *Scutellariae Barbatae Herba*; antioxidant activity; antitumor activity

半枝莲为唇形科植物半枝莲 *Scutellaria barbata* Don 的干燥全草, 味辛、苦, 性寒, 归肺、肝、肾经, 具有清热解毒、化瘀利尿的功效^[1]。近年来对于半枝莲的研究多集中在抗肿瘤方面, 为进一步对半枝莲开展研究, 本文对其提取方法、化学成分和药理作用研究概况进行综述。

1 提取方法

半枝莲的主要有效成分为黄酮类、多糖和挥发性物质, 因此在优选半枝莲的提取工艺过程中, 常以这些成分为考察指标。目前, 半枝莲的提取方法主要有乙醇回流提取、超临界萃取、微波提取、水提取等。

1.1 乙醇回流提取: 刘君焱等^[2]以野黄芩苷和总黄酮为考察指标, 用黄金分割法和等距法筛选提取半枝莲所需的乙醇浓度范围, 以正交试验验证, 得出半枝莲的最佳提取工艺为 15 倍量 70% 乙醇回流提取 3 次, 每次 1 h。邱多隆等^[3]以浸膏得率、总黄酮和野黄芩苷提取率为评价指标, 选择乙醇浓度、乙醇用量、提取时间为考察因素, 利用正交试验确定了醇提半枝莲的最佳工艺条件为 75% 乙醇 10 倍量提取 2 h, 共提取 2 次。浸膏得率为 13.6%, 总黄酮和野黄芩苷提取率分别为 91.7% 和 78.4%。袁崇均等^[4]采用正交试验法, 以总黄酮量为指标, 对乙醇用量、提取时间、提取次数 3 个因素进行考察, 优选出半枝莲的最佳提取工艺为用 4 倍量的 70% 乙醇回流提取 3 次, 每次 1 h。

1.2 超临界萃取: 杨顺利^[5]用正交试验优化超临界 CO_2 萃取半枝莲挥发性成分的提取方法, 以出油率为指标时, 半枝莲超临界萃取最佳提取工艺: 萃取温度为 50℃, 压力为 30 MPa, 时间为 130 min; 以挥发油中甾体化合物为指标时, 优选出最佳工艺条件为萃取温度 52℃, 压力 30 MPa, 时间 170 min。

1.3 微波萃取: 金海燕等^[6]利用紫外光谱在线监控, 通过正交试验优化微波萃取半枝莲中野黄芩苷的条件, 对甲醇浓度、微波照射功率、微波萃取时间和萃取剂流速进行优选, 得到较优条件为 60% 的甲醇作为萃取剂, 微波照射功率 80 W, 微波萃取 7 min, 萃取剂体积流量 0.6 mL/min。

1.4 水提取: 孔明礼等^[7]分别采用单因素与正交试验, 对提取温度、提取时间、提取次数和料液比 4 个影响半枝莲多糖提取的因素进行优选, 得到最佳提取工艺: 提取温度为 60℃, 加入 20 倍水提取 2 h, 连续提取 4 次。马维坤等^[8]同样采用单因素与正交试验的方法, 对提取时间、提取温度、提取次数、固液比进行优选, 得到最佳提取工艺为 100℃水提取 3 次, 每次 3 h, 固液比 1:14。

2 化学成分

2.1 黄酮类成分: 王英锋等^[9]从半枝莲中分离到野黄芩苷(scutellarin)、野黄芩素(scutellarein)、汉黄芩素(wogonin)、红花素(carthamidin)、异红花素(isocarthamidin)、4-羟基汉黄芩素(4-hydroxywogonin)、芹菜素(apigenin)、木犀草素(luteolin)

* 收稿日期: 2010-01-12

等黄酮类化合物。王文蜀等^[10]从半枝莲中分离得到了芹菜素-7-O-葡萄糖醛酸乙酯、芹菜素-7-O-β-葡萄糖苷、芹菜素-7-O-新陈皮糖苷等黄酮类化合物。王艳萍等^[11]利用高效液相色谱与电喷雾质谱联用技术对半枝莲醋酸乙酯组分进行分离,得到了柚皮素(naringenin)等黄酮类化合物。肖海涛等^[12]从半枝莲中分离出5,7,4'-三羟基-8-甲氧基黄酮、5,7,4'-三羟基-6-甲氧基黄酮、5,7,4'-三羟基黄酮、5,4'-二羟基-6,7,3',5'-四甲氧基黄酮、5-羟基-4'-甲氧基黄酮-7-O-α-L-鼠李糖基-(1,6)-β-D-吡喃葡萄糖苷5个黄酮类成分。仲浩等^[13]从半枝莲中分离出10个黄酮类成分,其中槲皮素、木犀草素-7-O-β-D-葡萄糖苷为首次从该植物中分离得到。

2.2 挥发性成分:张福维等^[14]用蒸馏-萃取法提取半枝莲的挥发性成分,从中鉴定出35种化合物,占挥发油总量的87.45%。其中酮类化合物8种,醛类化合物7种,醇类化合物5种,酚类化合物1种,酸类化合物3种,烯炔类化合物2种,烷烃类化合物6种,其他化合物3种,主要成分有己醛、呋喃甲醛、2-己烯醛、3-己烯-1-醇、1-己醇、苯甲醛、1-辛烯-3-醇、2-戊基呋喃、1-甲基-4-(1-甲基乙基)-环己酮、苯甲醇、苯乙醛、苯乙醇、2,3-二氢苯并呋喃、3-苯基-2-丙烯醛、2-羟基-4-甲氧基苯甲醛、麝香草酚、二甲氧基-4-(2-丙烯基)苯、丁香烯、2-羟基-4-甲氧基苯乙酮、十二酸、氧化石竹烯、十七烷、十四酸、十八烷、十六酸、二十烷、2,6,10,15-四甲基十七烷。杨顺利^[15]采用超临界CO₂萃取技术对半枝莲中的挥发油成分进行了研究,发现半枝莲中除含高级脂肪酸及其酯类外,还含有大量的甾族化合物,主要成分有6,10,14-三甲基-2-十五烷酮、十六酸、叶绿醇、油酸、十八酸、菜油甾醇、豆甾醇、β-谷甾醇、9,19-环羊毛甾-24-烯-3-醇、豆甾-4-烯-3-酮。

2.3 多糖类成分:孔明礼等^[7]从半枝莲分离得到4种多糖,分别命名为SPS I、SPS II、SPS III、SPS IV。孟延发等^[15]从半枝莲中分离得到均一性多糖SPS4,并经完全水解后通过纸色谱及气相色谱分析,确定糖基的组成及物质的量比为鼠李糖:岩藻糖:阿拉伯糖:木糖:甘露糖:葡萄糖:半乳糖=0.22:0.26:1.0:0.09:0.51:1.82:2.09。许益民等^[16]从半枝莲中分离得到半枝莲多糖SBP,经分析确定其糖基的组成及物质的量比为鼠李糖:阿拉伯糖:木糖:甘露糖:半乳糖:葡萄糖=1.14:1.50:0.20:0.75:1.0:2.18。王志远等^[17]从半枝莲中分离得到酸性多糖SBPs,经GG-MS分析其单糖组成及物质的量比为鼠李糖:岩藻糖:阿拉伯糖:木糖:甘露糖:葡萄糖:半乳糖=1:100:0.13:0.80:0.10:0.34:0.56:3.04。

2.4 其他:从半枝莲中分离到的其他成分还有半枝莲二萜^[18]、半枝莲内酯、半枝莲碱A^[19]、半枝莲酸^[20]、半枝莲碱B(scutebabin B)^[21]等。

3 药理作用

3.1 抗氧化作用:杨容等^[22]通过测定半枝莲中黄酮类化合物提取液对羟基自由基的清除率和与2,6-二叔丁基对甲酚(BHT)还原能力来研究半枝莲黄酮提取液的抗氧化活性。研究结果表明,半枝莲中黄酮类化合物具有较好的清除羟基

自由基的能力,其还原能力可与人工合成抗氧化剂BHT相媲美。余建清等^[23]以3种自由基生成体系诱导的红细胞膜脂质过氧化为模型,测定半枝莲总黄酮对脂质过氧化的抑制作用。结果表明半枝莲总黄酮对黄嘌呤-黄嘌呤氧化酶系统、H₂O₂及UV照射3种方法引起的细胞膜脂质过氧化均有抑制作用,其作用呈剂量依赖性。经测定,半枝莲酸性多糖SBPs清除O₂^{·-}和·OH作用明显,IC₅₀分别为800.00、90.42 μg/mL^[17]。

3.2 抗病原微生物作用:Yoichi等^[24]研究发现,从半枝莲中提取的两种黄酮类化合物木犀草素和芹菜素对青霉素耐药的金黄色葡萄球菌有杀伤作用。李继扬等^[25]通过体外细胞试验和体内运动试验,发现半枝莲总黄酮提取物具有很强的抗流感病毒活性,并且能有效减少流感病毒感染后的肺病变面积。

3.3 增强免疫活性作用:张秀娟等^[26]通过动物移植性肿瘤试验观察半枝莲多糖对小鼠体内肿瘤细胞生长和免疫器官胸腺、脾指数的影响,结果表明半枝莲多糖在体内对S₁₈₀肉瘤的生长有一定的抑制作用,能够增强免疫器官的质量和S₁₈₀荷瘤小鼠T淋巴细胞百分数,认为半枝莲多糖通过增强荷瘤小鼠的免疫功能而达到抗肿瘤的效果。代志军等^[27]通过观察荷瘤小鼠瘤质量、体质量、胸腺指数和脾指数,并检测各组淋巴细胞增殖活性、NK细胞活性及脾细胞IL-2分泌量研究半枝莲提取物对小鼠H₂₂移植瘤的影响。发现半枝莲提取物可明显抑制H₂₂移植瘤的生长,改善荷瘤小鼠的免疫功能。马维坤等^[8]采用环磷酸胺复制方法构建免疫抑制小鼠动物模型,考察半枝莲粗多糖对小鼠免疫功能的影响。结果表明半枝莲多糖具有一定的免疫活性。

3.4 抗肿瘤作用:王刚等^[28]采用小鼠腋下接种肿瘤细胞法测定了半枝莲醇提物的抗肿瘤活性,表明半枝莲醇提物对移植性肿瘤具有显著的抑制作用,并有较好的剂量依赖关系。谢珞琨等^[29]研究表明半枝莲乙醇提取物能明显抑制人髓系白血病K562细胞增殖,其抑制作用具有一定的浓度依赖性。徐敏等^[30]研究了半枝莲黄酮类化合物A06对内皮细胞小管形成和内皮细胞迁移的影响,以及对HeLa细胞血管内皮生长因子(VEGF)和NO表达的影响,结果表明,半枝莲黄酮类化合物A06能抑制内皮细胞小管样结构形成和肿瘤细胞培养液刺激下的内皮细胞迁移,其作用机制可能与抑制肿瘤细胞分泌VEGF、NO这些血管生成促进因子有关。石扬等^[31]发现野黄芩苷具有明显抑制体外培养乳腺癌MCF-7细胞增殖及侵袭的作用。张妮娜等^[32]发现半枝莲能有效抑制肿瘤血管生成,其机制可能与阻断内皮细胞迁移、下调VEGF蛋白表达有关。林敬明等^[33]通过实验发现半枝莲可抑制QGY-7701细胞增殖,可能与激活Bcl-2基因家族抑癌基因、诱导肿瘤细胞凋亡、阻滞细胞周期有关。代志军等^[34]研究表明半枝莲对大鼠实验性肝癌形成具有一定的抑制作用,并能改善肝功能的各项指标。

3.5 呼吸系统的作用:张春玲等^[35]通过药理实验证明半枝莲中含有的红花素有较强的对抗由组织胺引起的平滑肌收

缩作用,同时还有较好的祛痰作用,是治疗慢性支气管炎的有效成分。

3.6 解热作用:佟继铭等^[36-37]通过实验发现半枝莲水煎剂、野黄芩苷对sc干酵母引起的发热大鼠具有明显的解热作用。

3.7 保肝作用:金燕辛等^[38]通过实验发现复方半枝莲注射液能有效降低小鼠碘溴酞钠在血液中的潴留量,改善小鼠肝脏的排泄功能,对CCl₄所致肝损伤大鼠的血清丙氨酸氨基转移酶(SGPT)有抑制其升高的作用。

3.8 其他:野黄芩苷具有扩张血管引起血压下降的作用,能改善微循环和脑代谢。此外,半枝莲黄酮对去卵巢大鼠的记忆有改善作用^[39]。

4 结语

半枝莲中含有多种化合物,黄酮类成分是其主要的活性成分,具有抗肿瘤、抗氧化、抗菌等多种药理活性。半枝莲在临床上常用于治疗肺癌、消化系统癌症、乳腺癌等。鉴于半枝莲的良好疗效,有必要对半枝莲进行深入研究,为更好地开发和利用传统中药半枝莲提供基础。

参考文献:

- [1] 中国药典[S]. 2005
- [2] 刘君焱,王玉蓉,刘益. 黄金分割法优选半枝莲提取工艺[J]. 中国中药杂志, 2008, 33(8): 896-899
- [3] 邱多隆,刘丽春,刘晔玮,等. 半枝莲提取工艺的研究[J]. 中成药, 2003, 25(7): 530-532
- [4] 袁崇均,王筋,杨红,等. 正交试验法优选半枝莲提取工艺的研究[J]. 华西药学杂志, 2002, 17(2): 112-113.
- [5] 杨顺利. 正交试验优选半枝莲超临界二氧化碳萃取条件研究[J]. 解放军药学报, 2004, 20(1): 46-48
- [6] 金海燕,陈立钢,周秀清,等. 紫外光谱在线监控动态微波辅助萃取半枝莲中的野黄芩苷[J]. 吉林大学学报:理学版, 2009, 47(6): 1313-1317
- [7] 孔明礼,张静. 半枝莲多糖的提取分离及初步结构研究[J]. 中成药, 2008, 30(11): 1694-1697
- [8] 马维坤,仰榴青,吴向阳,等. 半枝莲多糖提取工艺及其免疫活性初步研究[J]. 江苏大学学报:医学版, 2007, 17(4): 315-318
- [9] 王英锋,焦燕,王慧彬,等. 半枝莲中黄酮成分的提取纯化及LG-MS检测[J]. 首都师范大学学报, 2009, 30(5): 32-34
- [10] 王文蜀,周亚伟,叶蕴华,等. 半枝莲中黄酮类化学成分研究[J]. 中国中药杂志, 2004, 29(10): 957-958
- [11] 王艳萍,薛兴亚,张秀莉,等. HPLC/ESI-MS法鉴定半枝莲乙酸乙酯组分中黄酮苷元类化合物[J]. 质谱学报, 2009, 30(3): 129-138
- [12] 肖海涛,李钺. 半枝莲的化学成分[J]. 沈阳药科大学学报, 2006, 23(10): 637-640
- [13] 仲浩,薛晓霞,姚庆强. 半枝莲化学成分的研究[J]. 中草药, 2008, 39(1): 21-23.
- [14] 张福维,回瑞华,侯冬岩. 半枝莲挥发性化学成分分析[J]. 质谱学报, 2009, 30(3): 175-178
- [15] 孟延发,李志孝,工秉峰,等. 半枝莲多糖的研究[J]. 兰州大学学报:自然科学版, 1992, 28(4): 112.
- [16] 许益民,郭立玮,陈建伟. 半枝莲多糖的分离、纯化及其理化性质[J]. 天然产物研究与开发, 1992, 4(1): 1

- [17] 王志远,戴玲,朱业云,等. 半枝莲酸性多糖 SBPs 的纯化、性质及抗氧化活性研究[J]. 中草药, 2009, 40(5): 728-731
- [18] 木津治久. 半枝莲的二萜类成分研究[J]. 国外医学:中医中药分册, 1988, 10(1): 53
- [19] Wang Z Q, Xu F M. Studies on the constituents of *Scutellaria barbata* [J]. *Chin Chem Lett*, 1996, 7(4): 333
- [20] Kuo Y H. Scutellaric acid, a oleanane-type diterpenoid from the roots of *Scutellaria rivularis* [J]. *Chem Pharm Bull*, 1988, 36(9): 3619-3621
- [21] 涂琪顺,蔡光明,何群,等. HPLC法测定半枝莲中二萜类生物碱 scutebarbatine B [J]. 中草药, 2008, 39(2): 280-282
- [22] 杨容,王志,习洋,等. 中药半枝莲中黄酮类化合物的抗氧化活性[J]. 河北大学学报:自然科学版, 2007, 27(5): 489-492
- [23] 余建清,杨惠斌,廖志雄,等. 半枝莲总黄酮对红细胞膜脂质过氧化损伤的保护作用[J]. 中国药师, 2005, 8(11): 897-899
- [24] Yoichi S, Shino S, Takako N, et al. Phytochemical flavones isolated from *Scutellaria barbata* and antibacterial activity against methicillin-resistant *Staphylococcus aureus* [J]. *Ethnopharmacol*, 2000, 72: 483-488
- [25] 李继扬,李幸慰,黄海,等. 半枝莲总黄酮及其在制备抗流感病毒药物中的用途[P]. 中国: 200710047257. 2 2007-10-19
- [26] 张秀娟,杨姗姗. 半枝莲多糖体内抗肿瘤及其免疫调节作用的实验研究[J]. 亚太传统医药, 2008, 4(2): 54-56
- [27] 代志军,刘小旭,汤薇,等. 半枝莲提取物对H22荷瘤小鼠免疫功能的影响及其抑瘤作用[J]. 南方医科大学学报, 2008, 28(10): 1835-1837.
- [28] 王刚,董玫,刘秀书,等. 半枝莲醇提物抗肿瘤活性的研究[J]. 现代中西医结合杂志, 2004, 13(9): 1141-1142
- [29] 谢琨琨,邓涛,张秋萍,等. 半枝莲提取物诱导白血病K562细胞凋亡[J]. 武汉大学学报:医学版, 2004, 25(2): 115-117
- [30] 徐敏,卜平,李瑶瑶. 半枝莲黄酮类化合物对体外肿瘤血管生成的影响[J]. 世界华人消化杂志, 2007, 15(20): 2215-2219
- [31] 石扬,周志愉,程流剑,等. 半枝莲中野黄芩对乳腺癌MCF-7细胞增殖及侵袭能力的影响[J]. 江西医学院学报, 2009, 49(10): 12-14
- [32] 张妮娜,卜平,朱海杭,等. 半枝莲抑制肿瘤血管生成的作用及其机制研究[J]. 癌症, 2005, 24(12): 1459-1463
- [33] 林敬明,刘煜,罗荣城,等. 半枝莲抑制人肝癌QGY-7701细胞增殖研究[J]. 南方医科大学学报, 2006, 26(5): 591-593
- [34] 代志军,王西京,纪宗正,等. 半枝莲提取物对DEN诱发大鼠肝癌的抑制作用[J]. 中药材, 2009, 32(4): 568-571
- [35] 张春玲,胡峻峰,曲江斌,等. Ames试验检测几种中草药及绿茶的抗诱变作用[J]. 卫生毒理学杂志, 2002, 16(1): 66
- [36] 佟继铭,陈光辉,高巍,等. 半枝莲的解热作用实验研究[J]. 中国民族民间医药杂志, 1999, 38(3): 166-167
- [37] 佟继铭,刘玉玲,陈光辉,等. 野黄芩苷的解热作用研究[J]. 承德医学院学报, 1999, 16(2): 101-103
- [38] 金燕辛,卞益民,徐晓梅. 复方半枝莲注射液药效学实验研究[J]. 首都医药, 2000, 7(9): 32
- [39] 郝玉玲,董永彩,缪红,等. 半枝莲黄酮对去卵巢大鼠障碍的改善作用[C]. 2008年全国抗衰老与老年痴呆学术会议论文集, 2008