

# 透骨草类中药化学成分的研究进展

马晶, 王洋<sup>\*</sup> (东北林业大学生命科学学院, 黑龙江哈尔滨 150040)

**摘要** 对透骨草的同名异构现象、植物来源作详细的阐述, 尤其是对 6 种常用中药透骨草的原植物化学成分进行全面而系统的综述。

**关键词** 透骨草; 来源; 化学成分; 进展

**中图分类号** S567.23<sup>+</sup>9 **文献标识码** A **文章编号** 0517-6611(2009)10-04485-02

## Research Progress on Chemical Composition of Traditional Chinese Medicine in Tougucao

MA Jing et al (Life Science College, Northeast Forestry University, Harbin, Heilongjiang 150040)

**Abstract** Tougucao is a common traditional Chinese medicine and widely used in China. Because its sources are complex and confusedly used in clinic, this study discusses homonymy isomeric phenomenon and plant sources of Tougucao, especially comprehensively and systematically summarizing the chemical compositions of 6 common original plant of Tougucao.

**Key words** Tougucao; Source; Chemical composition; Progress

透骨草为中医外科常用中药, 具有祛风除湿、舒筋活血止痛之功效, 常用于风湿痹痛、筋骨挛缩、寒湿脚气、疮痍肿毒等症。透骨草的植物来源比较复杂, 如《本草原始》所记载的透骨草为大戟科植物地构叶(*Speranskia tuberculata* (Bge.) Baill.), 称为“珍珠透骨草”; 《本草纲目拾遗》和《灵秘丹药笺》中将凤仙花(*Impatiens balsamina* L.) 称为“凤仙透骨草”; 《医学指南》中的透骨草系指毛茛科铁线莲属植物, 称为“铁线透骨草”; 《唐本草》中称为“羊角透骨草”的是紫葳科植物角蒿(*Incarvillea sinensis*); 《东北药植志》中的透骨草为豆科植物山野豌豆(*Vicia amoena* Fisch.), 称为“东北透骨草”; 《滇南本草》中将杜鹃花科植物滇白珠(*Gaultheria yunnanensis* (Franch.) Rehd.) 的茎叶称为“小透骨草”等。

张国栋对透骨草的同名异构现象进行了研究, 认为东北透骨草、珍珠透骨草、凤仙透骨草、羊角透骨草、铁线透骨草为主要应用的种类<sup>[1]</sup>。迟玉明等对透骨草的原植物进行了文献统计, 共计有 20 科 42 种 5 变种植物作为透骨草使用; 对透骨草的商品调查结果显示, 有 12 科 16 种植物在全国不同地区作为透骨草的商品药材流通, 其中较常用的为地构叶、凤仙花, 其次为角蒿、黄花铁线莲(*Clematis intricata* Bge.)、细叶铁线莲(*Clematis aethusaefolia* Turcz.)、山野豌豆、广布野豌豆(*Vicia cracca* L.) 和杜鹃花科滇白珠等<sup>[2-3]</sup>。透骨草的种类和植物来源均很复杂, 化学成分存在较大差异, 笔者对常用透骨草的化学成分及药理活性研究进展进行了综述, 为透骨草在临床上正确使用提供参考。

### 1 珍珠透骨草的化学成分

珍珠透骨草为大戟科地构叶属植物地构叶, 干燥地上部分药用。范云柏等对其化学成分进行了研究, 从地构叶地上部分中分离得到 9 个化合物, 根据理化性质及波谱特征鉴定其结构为软脂酸、 $\beta$ -谷甾醇、三十烷醇、香草酸、阿魏酸、单萜类化合物、对香豆酸、胸腺嘧啶和尿嘧啶<sup>[3]</sup>。中草药的消炎镇痛作用通常与其有效成分的免疫及抗氧化作用有关, 范云柏等将分离得到的一些化合物进行了免疫和抗氧化活性筛选, 结果表明, 阿魏酸对维生素 C 和  $Fe^{2+}$ /半胱氨酸诱导的肝微粒体脂质过氧化有较强的抑制活性, 香草酸对维生素诱导

的肝微粒体脂质过氧化也有较好的抑制作用<sup>[3]</sup>。从以上结果可知, 地构叶抗炎止痛作用可能与其含有有机酸成分有关。

李冲等利用柱色谱分离, MS、IR、NMR 等方法鉴定化合物结构, 从地构叶全草中分离得到 2 个化合物, 鉴定为 18-羟基-迈诺醇和  $\beta$ -谷甾醇<sup>[4]</sup>。

### 2 凤仙透骨草的化学成分

凤仙透骨草来源于凤仙花科凤仙花属植物凤仙花。凤仙花民间应用广泛, 有镇痛消炎、祛风湿、治甲癣等功效。其主要药理活性为抗过敏、抗炎、抗真菌等。有关试验结果表明, 凤仙花提取物中具有同时拮抗组胺 H1 受体和 PAF 受体成分, 有较好的抗急、慢性过敏作用; 提取物中还含有一定量抗炎和抗菌作用的有效成分<sup>[5]</sup>。

迄今为止, 从凤仙花的花、果皮、种子、茎、根中分离得到多类化合物, 包括黄酮、萘醌、甾醇、多肽等, 其中黄酮、香豆素、萘醌为主要成分, 且为凤仙花主要药理作用的物质基础。Lin 等采用毛细管电泳(电化学检测器)从凤仙花的粉色花瓣中分离出山奈酚及其衍生物, 包括山奈酚、山奈酚-3-葡萄糖苷、山奈酚-3-芸香糖苷、山奈酚-3-鼠李糖基双葡萄糖苷和山奈酚-3-p-对羟基桂皮酸葡萄糖苷<sup>[6]</sup>。从凤仙花的地上部分得到 5 $\alpha$ -还原酶抑制剂二-(2-羟基-1,4-萘醌-3-)-乙烷(impatienol)<sup>[7]</sup>, 5 $\alpha$ -还原酶抑制剂是一类重要的治疗良性前列腺增生、男性秃顶、女性多毛等症状的药物。从果皮中得到具有抗痒作用的双萘呋喃-7, 12-酮类化合物 Balsaminone A、B, 该类化合物极少能从天然产物中得到<sup>[8]</sup>。Oku 等通过反复硅胶柱和凝胶柱 Sephadex LH-20 层析得到 impatienolate 和 balsaminolate<sup>[9]</sup>, 并首次报道了凤仙花中的新萘醌类化合物具有选择性抑制 COX-2 作用, 从而具有抗炎作用。Yang 等从凤仙花地上部分分离出抗微生物系列化合物, 2-甲氧基-1,4-萘醌(MNQ1)对 12 种细菌(革兰氏阳性、阴性菌)和 8 种真菌链中的 5 种革兰氏阳性菌、2 种革兰氏阴性菌和 8 种真菌链均有很好的抑制效果, 其中革兰氏阴性菌 *Aeromonas salmonicida* A449 对 MNQ1 尤其敏感, HPLC 法分析证明传统药汤中有足够量的 MNQ1 存在从而起到抑制细菌的作用<sup>[10]</sup>。

胡喜兰等从新疆凤仙花的乙醇提取物中得到豆甾醇、山奈酚、山奈酚葡萄糖苷、山奈酚葡萄糖鼠李糖苷等 4 个化合物<sup>[11]</sup>, 这 4 个化合物均为首次从国产凤仙花中分离得到。其

**作者简介** 马晶(1983-), 女, 黑龙江哈尔滨人, 硕士研究生, 研究方向: 植物次生代谢产物。\* 通讯作者。

**收稿日期** 2009-01-19

中豆甾醇、山奈酚等具有抗菌、消炎、抗癌等生理活性。

### 3 铁线透骨草的化学成分

毛茛科铁线莲属黄花铁线莲和细叶铁线莲是铁线透骨草的主要植物来源。铁线莲属植物的化学成分研究有较多报道,日本和俄罗斯学者从铁线莲属植物中发现的化学成分主要有皂苷、香豆素、黄酮、花色苷、生物碱,其中皂苷类化合物最多。宋志宏等在1994年首次从黄花铁线莲的地上部分分离得到5个化合物,用光谱法鉴定其结构为东莨菪碱、咖啡酸、肌醇、三十烷醇、 $\beta$ -谷甾醇<sup>[12]</sup>。1996年又从其中分离得到7个化合物,用波谱方法鉴定了结构,分别是硬脂酸乙酯(ethyl stearate)、正二十六烷醇(1-hexacosanol)、咖啡酸乙酯(caffeic acid ethyl ester)、clematoside S、huzhangoside B、kalopanax-saponin B和5-羟基-4-氧化-戊酸(5-hydroxy 4-oxopentanoic acid),其中后3个化合物为三萜皂苷<sup>[13]</sup>。

### 4 羊角透骨草的化学成分

紫葳科角蒿属角蒿即为羊角透骨草。迟玉明等从1990~2005年陆续从其全草分离得到了多种新的单萜生物碱和大环精胺类生物碱,共发现并分离了18种化合物,有17种化合物为首次发现<sup>[14-17]</sup>。

其中单萜生物碱之一角蒿酯碱(incavillateine),具有很强的镇痛活性,在福尔马林试验中,角蒿酯碱的镇痛活性高于吗啡,且作用机理不同于吗啡,主要是通过 $\mu$ 、 $\kappa$ 和adenosine受体发挥作用<sup>[18]</sup>,角蒿酯碱已成为开发新型非麻醉性镇痛新药的重要先导化合物<sup>[19-20]</sup>。

### 5 小透骨草的化学成分

小透骨草指的是杜鹃花科滇白珠。张治针等首次对滇白珠的根进行了系统的化学成分研究,从根的氯仿提取物中分离得到11个化合物<sup>[21]</sup>,其中7个化合物理化性质和波谱分析分别鉴定为东莨菪素、棕榈酸、胡萝卜苷、(+)-lyoniresinol、3,4,5,-三甲氧基苯甲酸、乙酰丁香酸和(-)-5'-甲氧基异落叶松树脂醇。从滇白珠根的乙酸乙酯活性部位分得10个化合物,为阿魏酸、氯原酸、儿茶素、原花色素A<sub>2</sub>、芦丁、槲皮素、水杨酸、香草酸、2,5-二羟基苯甲酸和原儿茶酸<sup>[22]</sup>。从滇白珠根的石油醚部分分得10个化合物,其中8个化合物分别鉴定为 $\beta$ -乙酰谷甾醇(I)、3 $\beta$ -乙酰基-12,25-二烯-达玛烷(II)、3 $\beta$ -乙酰氧基-20(29)-羽扇烯-28-醛(III)、3 $\beta$ -乙酰齐墩果酸(IV)、 $\beta$ -谷甾醇(V)、熊果酸(VI)、豆甾醇(VII)和3 $\beta$ -羟基-20(29)-羽扇烯-28-醛(VIII)<sup>[23]</sup>。

药理研究初步证明滇白珠乙酸乙酯和正丁醇两部分提取物显著抑制小鼠腹腔毛细血管通透性而具有抗炎作用,对热致疼痛具有明显的镇痛作用。抑菌试验显示滇白珠挥发油具有广谱抑菌活性,滇白珠根挥发油对金黄葡萄球菌、绿脓杆菌、大肠杆菌和变形杆菌均有抑制作用。在已分离鉴定的38个化合物中,14个化合物已知具有生物活性,其中8个具有抗炎活性,3个具有镇痛作用。这些化合物是滇白珠临床疗效的物质基础,可能是其抗炎和镇痛的主要活性成分<sup>[24]</sup>。

### 6 东北透骨草

东北透骨草指的是豆科野豌豆属植物山野豌豆,主要分布于我国东北及华北地区。全草可供药用,东北地区以其做

为中药透骨草使用。为探索其有效成分,魏锋等从山野豌豆全草的乙醇提取物中分离鉴定了6个黄酮类化合物<sup>[25]</sup>,其中1个为新化合物,命名为山野豌豆甙(amoenin),其他5个化合物分别为槲皮素(D<sub>2</sub>)、山奈酚(D<sub>1</sub>)、槲皮素-3-O- $\alpha$ -L-鼠李糖甙(C<sub>1</sub>)、槲皮素-3-O- $\beta$ -D-葡萄糖甙(C<sub>2</sub>)和山奈酚-3,7-O- $\alpha$ -L-二鼠李糖甙(A<sub>2</sub>)。

### 7 结语

全国各地有多种植物被作为透骨草类中药使用,虽然其中大多数植物都具有镇痛、消炎作用,但是每种植物的化学成分和有效成分都有很大的差异,这就造成了临床用药的不确切性和疗效的差异性,故建议透骨草类中药在应用时注明其种类或来源。

尽管对透骨草类中药原植物的化学成分的研究已经取得一些成果,且其中的一些化合物已经证实具有镇痛、消炎等作用,如凤仙花中的新萜醌类化合物具有抗炎作用,角蒿中的角蒿酯碱已成为开发非麻醉性强力镇痛药的重要先导化合物,但相关研究仍不够系统、深入,尤其是多数单体化合物的生物活性仍不清楚。因此,进一步弄清透骨草类中药原植物的化学成分,并完善相关药学研究,不仅对中药的临床使用有指导作用,而且将对我国镇痛及抗炎类新药的研发起到一定的推动作用。

### 参考文献

- [1] 张国栋. 中草药同名异物辨[M]. 长春:吉林人民出版社,1983:4.
- [2] 迟玉明,阎文政,李家实. 透骨草的原植物及商品调查[J]. 中国中药杂志,1990,15(5):262-265.
- [3] 范云柏,赵玉英,李艳梅. 地构叶化学成分的研究[J]. 天然产物研究与开发,1996,8(4):20-23.
- [4] 李冲,张承忠,胡芳娣. 透骨草化学成分研究[J]. 中国中药杂志,2000,25(5):291-292.
- [5] 鞠培俊,孔德云,李晓波. 凤仙花化学成分及药理作用研究进展[J]. 沈阳药科大学学报,2007,5(24):320-324.
- [6] LIN H,ZHAO F P,LIAN S C, et al. Separation of kaempferols in *Impatiens balsamina* flowers by capillary electrophoresis with electrochemical detection[J]. Journal of Chromatography A,2001,909:297-303.
- [7] ISHIGURO K,OKU H,KATO T. Testosterone 5 $\alpha$ reductase inhibitor bis-naphthoquinone derivative from *Impatiens balsamina*[J]. Phytotherapy Research,2000,14:54-56.
- [8] ISHIGURO K,OHIRA Y,OKU H. Antipruritic dinaphthofuran-7,12-dione derivatives from the pericarp of *Impatiens balsamina*[J]. J Nat Prod,1998,61:1126-1129.
- [9] OKU H,ISHIGURO K. Cyclooxygenase-2 inhibitory 1,4-naphthoquinones from *Impatiens balsamina* L. [J]. Biol Pharm Bull,2002,25(5):658-660.
- [10] YANG X L,SUMMERHURST D K,KOVALS F, et al. Isolation of an antimicrobial compound from *Impatiens balsamina* L. using bioassay-guided fractionation[J]. Phytotherapy Research,2001,15:676-680.
- [11] 胡喜兰,朱慧,刘存瑞,等. 凤仙花的化学成分研究[J]. 中成药,2003,25(10):833-834.
- [12] 宋志宏,赵玉英,段京莉. 黄花铁线莲的化学成分研究[J]. 中国中药杂志,1995,20(10):613-614.
- [13] 宋志宏,张建新,李艳梅,等. 黄花铁线莲的化学成分研究(II)[J]. 天然产物研究与开发,1997,9(2):11-15.
- [14] CHI Y M,YAN W M,LI J S. An alkaloid from *Incarvillea sinensis*[J]. Phytochemistry,1990,29:2376-2378.
- [15] CHI Y M,YAN W M,CHEN D C, et al. An alkaloid from *Incarvillea sinensis*[J]. Phytochemistry,1992,31:2930-2932.
- [16] CHI Y M,HASHIMOTO F,YAN W M, et al. Incarvine A, a monoterpene alkaloid from *Incarvillea sinensis*[J]. Phytochemistry,1995,40:353-354.
- [17] CHI Y M,HASHIMOTO F,YAN W M, et al. Five novel macrocyclic spermine alkaloids from *Incarvillea sinensis*[J]. Tetrahedron Letters,1997,38:2713-2716.
- [18] NAKAMURA M,CHI Y M,KINJO J, et al. Two monoterpene alkaloidal

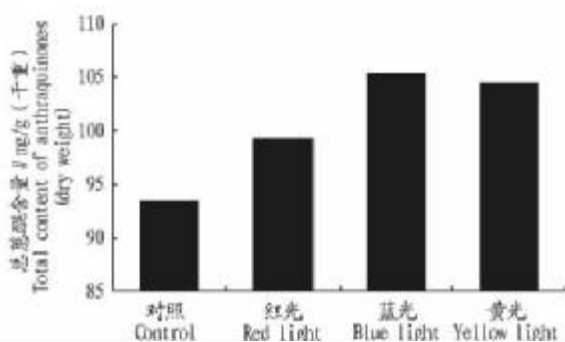


图1 不同光照对总蒽醌含量的影响

Fig.1 Effects of different lights on the total content of anthraquinones

表1 不同光质照射下蒽醌类物质含量(干重)

Table 1 Content of anthraquinones under different light qualities

指标	mg/g			
	对照	红光	蓝光	黄光
Index	Control	Red light	Blue light	Yellow light
芦荟素含量	20.86 a	36.11 b	26.32 c	52.19 d
芦荟大黄素含量	7.97 a	16.34 b	31.36 c	26.25 d
芦荟苦素含量				

注:表中 a、b、c、d 表示在  $P < 0.05$  水平  $t$  检验 ( $n=5$ ) 差异显著。

Note: a, b, c and d indicate the  $t$  test ( $n=5$ ) of significant difference at 0.05 level.

### 3 结论与讨论

光质能显著影响药用植物中药用成分的含量,如红光比蓝光利于长春花生物碱合成<sup>[2]</sup>;蓝光对水母雪莲愈伤组织黄酮合成的促进作用最强,其次是远红光和白光,红光下最低<sup>[3]</sup>。蓝光、绿光、黄光对细胞的生长和强心苷的积累均有促进作用,红光有抑制作用<sup>[4]</sup>。而另一些研究却有不同发现,例如,红膜使根部红景天甙含量提高<sup>[5]</sup>;紫膜和黄膜覆盖下人参皂甙含量明显提高,而深蓝膜下人参皂甙含量明显下降<sup>[6]</sup>;黄色薄膜下茶树的花青素含量高<sup>[7]</sup>,黄色薄膜下茶多酚含量仅次于红薄膜覆盖的含量<sup>[8]</sup>。芦荟中的蒽醌类物质是一类具有重要药用价值的次生代谢物,主要包括芦荟素(aloin)、芦荟大黄素(aloe-emodin)、高那特芦荟素(homonataloin)、芦荟苦素(aloesin E)等<sup>[9-11]</sup>,主要存在于绿

色同化组织中<sup>[12-15]</sup>,具有杀菌、消炎、分解毒素等功效。芦荟药用价值的高低与蒽醌类物质的含量密切相关。该试验结果显示,与白光相比,不同光质处理均有利于芦荟中蒽醌类次生代谢物的积累,蓝光和黄光明显促进木立芦荟中总蒽醌的积累,蓝光的促进作用更为显著,红光的积累作用不明显。黄光对芦荟素的积累最为有利,其次是红光;对于芦荟大黄素的积累作用是:蓝光 > 黄光 > 红光 > 白光。

以上研究结果显示,不同的光质对不同种类次生代谢物的影响存在差异,这可能与植物的代谢类型,次生代谢物的合成途径有关。芦荟中的主要药用成分是芦荟多糖和蒽醌类物质,我国北方芦荟栽培可用蓝膜或红膜覆盖越冬以促进药用成分的积累。

### 参考文献

- [1] 侯冬岩,回瑞华,李铁纯. 芦荟的研究进展[J]. 鞍山师范学院学报, 2002,4(3):54-59.
- [2] 郑珍贵,缪红,扬文杰,等. 营养和环境因子对长春花激素自养型细胞生长和吗啡碱生成的影响[J]. 植物学报,1999,41(2):184-189.
- [3] 赵德修,李茂寅,邢建军,等. 光质、光强和光期对水母雪莲愈伤组织生长和黄酮生物合成的影响[J]. 植物生理学报,1999,25(2):127-132.
- [4] 毛学文,陈益. 不同光质对毛地黄叶愈伤组织培养的影响[J]. 生物学杂志,1994,6(6):22-23.
- [5] 阎秀峰,王洋. 光强和光质对野外栽培高山红景天生物量和红景天甙含量的影响[J]. 生态学报,2004,24(4):674-679.
- [6] 王铁生,王化民. 人参光合生理研究Ⅱ不同光质对人参生药,生理特性及人参皂甙含量的影响[J]. 中草药,1989,20(4):30-33.
- [7] 张泽琴,王能彬. 光质对茶树花青素含量的影响[J]. 四川农业大学学报,2002,20(4):337-339.
- [8] 陶汉之. 茶树光合作用与光质的关系[J]. 植物生理学通讯,1989(1):19-23.
- [9] BRICH A J, DONAVAN F W. Barbaloin[J]. Aust J Chem, 1995,8:523-528.
- [10] FRANZ G, GRUN M. Chemistry, occurrence and biosynthesis of C-glycosyl compounds in plants[J]. Planta Medicine, 1983,47:131-140.
- [11] REYNOLDS T. Observations on the phytochemistry of the *Aloe* leaf-exudate compounds[J]. Bot J Linnean Soc, 1985,90:179-199.
- [12] 沈宗根,吕洪飞, GUTTERMAN Y, 等. 芦荟属植物叶内蒽醌类物质的组织化学定位研究[J]. 西北植物学报,2002,22(6):1384-1370.
- [13] 胡正海,沈宗根,李景原. 芦荟属植物叶的结构与蒽醌类物质的关系[J]. 中草药,2001,32(4):347-350.
- [14] SHEN Z G, ELENA CHAUSER VOLFSON, YITZCHAK GUTTERMAN, et al. Anatomy, histochemistry and phytochemistry of leaves in *Aloe vera* var. *chiensis*[J]. Acta Bot Sin, 2001,43(8):780-787.
- [15] 王太霞,李景原,沈宗根,等. 芦荟叶内芦荟素细胞的发育与蒽醌类物质的积累[J]. 实验生物学报,2003,36(5):361-367.
- [16] 王太霞,李景原,沈宗根,等. 芦荟叶内芦荟素细胞的发育与蒽醌类物质的积累[J]. 实验生物学报,2003,36(5):361-367.
- [17] 王太霞,李景原,沈宗根,等. 芦荟叶内芦荟素细胞的发育与蒽醌类物质的积累[J]. 实验生物学报,2003,36(5):361-367.
- [18] 王太霞,李景原,沈宗根,等. 芦荟叶内芦荟素细胞的发育与蒽醌类物质的积累[J]. 实验生物学报,2003,36(5):361-367.
- [19] CHI Y M, NAKAMURA M, ZHAO X Y, et al. A Monoterpene alkaloid from *Incarvillea sinensis* [J]. Chem Pharm Bull, 2005, 53 (9): 1178-1179.
- [20] NAKAMURA M, CHI Y M, YAN W M, et al. Strong antinociceptive effect of incarvillateine, a novel monoterpene alkaloid from *Incarvillea sinensis* [J]. J Nat Prod, 1999, 62: 1293-1294.
- [21] 张治针,果德安,李长龄,等. 滇白珠化学成分的研究(I)[J]. 中草药, 1998,28(8):508-511.
- [22] 张治针,果德安,李长龄,等. 滇白珠化学成分的研究(II)[J]. 中草药, 1998,30(3):167-169.
- [23] 张治针,果德安,李长龄,等. 滇白珠化学成分的研究(III)[J]. 中草药, 1999,30(4):247-250.
- [24] 张治针,果德安,李长龄,等. 滇白珠抗菌抗炎和镇痛活性的实验研究[J]. 西北药学杂志,1994,14(2):60-61.
- [25] 魏锋,阎文政. 山野豌豆黄酮类化学成分的研究[J]. 药学报,1997, 32(10):765-768.

(上接第4486页)

derivatives from *Incarvillea sinensis* [J]. Phytochemistry, 1999, 51:595-597.