

板蓝根和大青叶不同部位的靛蓝、靛玉红含量测定及其部分成分的抗内毒素作用比较(摘要)

张汉明, 张戈, 乔传卓(第二军医大学药学院 200433)

中图分类号: R284

文章编号: 1006-0111(2000)05-0347-01

摘要: 板蓝根和大青叶主要来源于十字花科植物菘蓝(*Isatis indingica* Fort.) 的根和叶, 是我国的常用中药, 具有清热、解毒、凉血的功效。以板蓝根和大青叶为主要原料的制剂在我国应用广泛, 近年来发现板蓝根具有抗内毒素的活性, 临床上可用作抗菌和抗病毒药, 但其制剂的质量控制却一直未能很好解决。通常人们认为菘蓝的根中含有靛蓝和靛玉红, 在评价板蓝根制剂的质量时, 以靛蓝、靛玉红作为板蓝根制剂的质控指标。但也有人认为不应以这两个成分的含量高低作为板蓝根制剂质量的判别标准。还有人认为大青叶叶柄中不含靛蓝和靛玉红。因此, 弄清板蓝根中是否含有靛蓝和靛玉红以及这两种成分究竟存在于植物的哪一部位是较为重要的问题。为此, 我们通过薄层层析法对板蓝根和大青叶药材的根、根茎、叶柄、叶片等部位的氯仿提取液进行了靛蓝、靛玉红的含量测定, 并通过 HPLC 法对菘蓝根和根茎的氯仿提取液中靛蓝、靛玉红的含量进行了含量测定, 并通过 HPLC 法对菘蓝根和根茎的氯仿提取液中靛蓝、靛玉红的含量进行了精密测定。此外, 我们还运用鲎试剂法对靛蓝、靛玉红及板蓝根中所分得的四种有机酸: 苯

甲酸、丁香酸、邻氨基苯甲酸、水杨酸的抗内毒素活性进行了比较。结果表明: 植物菘蓝的根中不含有靛玉红, 根茎中靛蓝、靛玉红的含量分别为: 0.25mg/g 和 0.17mg/g, 叶柄和叶片中也均含有靛蓝和靛玉红。而以往在板蓝根含量测定中所测出的靛蓝和靛玉红的量, 实际上是在其采收和加工过程中混入的根茎和其附带的叶柄残基中所含的靛蓝和靛玉红的量。抗内毒素试验表明: 靛蓝和靛玉红不具有抗内毒素活性, 而板蓝根中所分得的四种有机酸则具有较强的抗内毒素活性, 其中苯甲酸和水杨酸的作用最强, 其最小抗内毒素作用浓度约为: 1.56 μ g/ml, 丁香酸作用最弱, 约为 25 μ g/ml, 邻氨基苯甲酸居中, 约为 12.5 μ g/ml。

通过本实验我们认为: 菘蓝的根中不含有靛蓝和靛玉红, 且两者不具有抗内毒素活性, 从其含量和药理作用的角度考虑, 靛蓝和靛玉红不适宜作为板蓝根制剂用于清热解毒药的质量控制指标, 而丁香酸等四种有机酸可以考虑作为其质控指标, 从而为板蓝根制剂的质量控制指标提供一定的科学依据。

收稿日期: 2000-08-28

酸模属药用植物的资源利用研究概况(摘要)

郑水庆¹, 陈万生¹, 曾明², 乔传卓¹(1. 第二军医大学药学院, 上海 200433; 2. 华东师范大学化学与生命科学院, 上海 200062)

中图分类号: R282.71

文章编号: 1006-0111(2000)05-0347-02

酸模属(*Rumex L.*) 为蓼科第二大属, 全世界约有 150 种, 主产北温带。我国有 26 种, 2 变种, 全国各省区均产。该属多年生草本的根部均可药用, 习称羊蹄类中草药, 又名土大黄、金不换、牛西西等。其中羊蹄药用始载于《神农本草经》, 列为下品。该类中草药在我国民间以止血和治疗疥癣著称, 沿用已久。

1 药用植物资源学研究

该属植物种子的繁殖力较强, 植物的生存适应能力也很强。我国该属植物资源极为丰富, 一些种类则为广布种如酸模 *Rumex acetosa*、皱叶酸模 *R. crispus*、齿果酸模 *R. dentatus* 等。何丽一等记载该属的酸模、羊蹄 *R. japonicus*、巴天酸模 *R. patientia*、尼泊尔酸模 *R. nepalensis*、

钝叶酸模 *R. obtusifolius*、红丝酸模 *R. chalapensis*、皱叶酸模、毛脉酸模 *R. gmelinii*、狭叶酸模 *R. stenophyllus* 等 9 种植物为羊蹄类中草药。此外, 戟叶酸模 *R. hastatus*、齿果酸模等在民间也作“羊蹄”入药。

2 化学成分研究

该属植物主含蒽醌类化合物, 如大黄酚、大黄素、大黄素甲醚、大黄酸、大黄酚蒽酮、大黄素蒽酮等。日本学者小谷功等从羊蹄根中分得酸模素, 该化合物具有较强的抗真菌作用和抗氧化作用。王振月等从毛脉酸模根中分得白藜芦醇和白藜芦醇甙。此外该属植物尚含有鞣质、咖啡酸、没食子酸、原儿茶酸等化合物。

3 药理作用和临床应用研究

酸模属药用植物的传统功效为止血、治疗疥癣等疾病,现代药理研究表明其具有抗真菌、抗肿瘤、抗病毒和抗氧化等作用。

我国酸模属药用植物种类较多,资源也极为丰富。因此有必要对该类植物的开发利用作一系统研究。

收稿日期:2000-08-28

抗癌植物—红豆杉(摘要)

王 昊, 茹贤, 秦路平(第二军医大学药学院, 上海 200433)

中图分类号:R282.71

文章编号:1006-0111(2000)05-0348-01

1 资源状况

红豆杉属(*Taxus*)全世界共有12种,主要分布在北半球和亚热带地区。我国有4种1变种。它们是:中国红豆杉、云南红豆杉、西藏红豆杉、东北红豆杉及变种南方红豆杉。

2 药用成分

通过几年的研究,现已从国内外各种红豆杉的枝叶、树皮、根、针叶中分离出紫杉烷二萜化合物221个。其中最主要的是紫杉醇。各种成分在植物体的不同部位、不同植物体中的含量分布各有不同。实验指出,紫杉醇在红豆杉的深绿色针叶中含量较高(0.0075%),而在黄色针叶中含量较低(0.001%)。10-deacetyl baccatin III和baccatin III的存在状况为:不同部位差异较大,须根中较高,树皮、根皮中次之,且与树龄有关。研究表明,海拔2500-3500米的高寒地带,阴、冷、湿的环境中生长的红豆杉中紫杉醇的含量最高。

3 药理作用

红豆杉的药理作用主要体现在紫杉类化合物上,特别是紫杉醇。紫杉醇的第一适应症是作为晚期转移性卵巢癌的二线用药;第二适应症是用于难治的转移性乳腺癌。另外它对食道癌和头颈部癌也有一定的治疗效果,近来又发现其有抗疟活性。另外,研究发现,紫杉烷二萜化合物有抗乙型肝炎病毒的作用;红豆杉醇对与HIV相关的卡波济氏肉瘤有疗效;红豆杉中另一种成分紫杉特尔和其它药联合治疗非小细胞肺癌也有一定疗效。

4 化学合成

对红豆杉中各种有效成分,特别是紫杉醇的合成,经历了分离提取、全合成、半合成和生物合成的过程。Nicolau等用双环二醇酯为原料成功地全合成了紫杉醇。与此同时Holon报道了另一种全合成紫杉醇的方法,总产率为4%~5%。紫杉醇半合成的主要原料为10-去乙酰baccatin III。Potier等以此为原料经过一系列反应得到紫杉醇的类似物Taxotere,它的生物活性优于紫杉醇且

水溶性好,易制成制剂。这几种方法的普遍不足是得率较低,不适于大量生产。

5 组织细胞培养

通过组织培养、农杆菌转化、真菌提取和克隆等方法生产紫杉醇。在红豆杉细胞培养的研究中,甘烦远等发现云南红豆杉细胞在发酵罐中生长速率达到12g/L,紫杉醇含量为0.119%,约为成年树皮中含量的12倍,为栽培植株的40倍。通过筛选高产细胞系,优化培养条件,设计合适的生物反应器和新的培养技术等综合性的研究,紫杉醇含量在近两年迅速提高。用发根农杆菌A4诱导短叶红豆杉形成的毛状根培养物具生长速度快,合成紫杉醇能力强等特性,具有很强的开发前景。用红豆杉植物的内寄生真菌生产紫杉醇是近年来研究的方向。现已发现两种真菌可生产紫杉醇,分别为:短叶红豆杉内寄生真菌*Taxomyces andreanae*和喜玛拉雅山脉西藏红豆杉内皮中的小孢盘多毛孢*Pestalotiopsis microspora*。后者在培养物中紫杉醇的积聚量每升可达微克水平,在实际应用中作为首选。克隆是近年来研究的最大热点。利用红豆杉细胞大规模培养生产紫杉醇的关键是要有高产、稳定的细胞克隆系。研究表明,悬浮培养10~15天的材料,用看护培养或双层培养最适于细胞克隆生长。

6 资源保护

由于紫杉醇日益受到人们的重视,对红豆杉树皮原料的需求与日俱增。长此以往,必然会导致资源枯竭。所以对红豆杉植物资源的保护刻不容缓。红豆杉属植物生长极为缓慢,野生资源的自然增长永远不能满足需要,寻求人工获得红豆杉资源的途径显得越来越重要。

综上所述,红豆杉做为一种新的抗癌植物越来越受到人们的重视,相信在不久的将来,它的资源供给方式会更多、更成熟,红豆杉一定会成为抗癌植物家族中不可缺少的一部分,为人类作出更大的贡献。

收稿日期:2000-08-28