

中药白头翁的药材、化学成分和药理作用的研究

舒莹, 韩广轩, 刘文庸, 张卫东, 徐一新, 陈海生(第二军医大学药学院天然药化教研室, 上海 200433)

摘要: 本文综述了中药白头翁的药材、化学成分和药理作用的研究概况, 对今后的研究方向提出了建议, 并对白头翁的开发前景进行了展望。

关键词: 白头翁; 药材; 化学成分; 临床作用

中图分类号: R284

文章标识码: B

文章编号: 1006-0111(2000)06-0387-03

中药白头翁始载于《神农本草经》, 列为下品, 是常用中药。具有清热解毒、凉血止痢、燥湿杀虫的功效^[1]。临床上主要用于治疗细菌性痢疾、阿米巴痢疾、妇科阴道炎等。现代研究认为白头翁除了抗菌和抗病原虫作用外, 还具有抗癌、杀精、治疗内毒素血症等作用。目前国内外对白头翁的研究正方兴未艾, 为了便于今后对该中药的深入研究和新药开发, 本文就白头翁的药材、化学成分和药理作用的研究作一综述。

1 药材研究

《中国药典》(一部) 1995版收载的白头翁系毛茛科植物白头翁 *Pulsatilla chinensis* (Bunge) Regel 的干燥根。据品种考证, 这是我国最早应用的白头翁正品, 也是目前全国最常用的白头翁药材^[1]。《中华本草》记载的目前市场上在应用的白头翁原植物还有毛茛科的细叶白头翁 *Pulsatilla turczaninowii* Kryl. et Serg.、蒙古白头翁 *Pulsatilla ambigua* Turcz. ex Pritz.、兴安白头翁 *Pulsatilla dahurica* (Fisch. ex DC.) Spreng.、朝鲜白头翁 *Pulsatilla cernua* (Thunb.) Bercht. et Opiz. 和钟萼白头翁 *Pulsatilla campanella* Fisch. ex Regel。

由于原植物来源较为复杂, 目前白头翁药材混淆品较多, 各地正使用混淆品种达 30 余种之多。科研人员曾对白头翁与两种常见混淆品漏芦 *Rhaponticum uniflorum* DC.) 和大伙草 *Anemone tomentosa* (Maxim) Pei 的性状鉴别和显微鉴别作了初步研究^[2]。在根形、表面颜色、断面、周皮脱落性、韧皮纤维排列、韧皮部与木质部颜色、初生木质部辐射棱、有否分泌道等方面

均显示不同的特点和明显特征, 为白头翁的真伪鉴别提供了重要依据。

科研人员还将云南的西南白头翁 *Pulsatilla millifolium* (Hemsl. et Wils.) Ulbr. 与白头翁作了理化鉴别^[3], 结果两者的薄层色谱、紫外吸收光谱和一阶导数光谱均存在显著差异, 可作为两者的鉴别特征。在云南地区西南白头翁能否真正代替白头翁入药还需进一步考证研究。

目前认为白头翁的化学成分主要为三萜皂苷。科研人员以双糖三萜皂苷为对照品用分光光度法对不同采收期白头翁的根及茎叶总皂苷分别进行测定^[4], 结果表明根内总皂苷含量高于茎叶, 且开花前期含量最高。所以在早春 3~5 月采挖药材品质较好。而在茎叶中含有 3% 左右的三萜皂苷, 可作为扩大白头翁药用资源的重要依据。

2 化学成分

白头翁的化学成分研究始于 60 年代初, 共分得了约 14 种成分, 主要为皂苷和内酯等成分。其中包括白头翁皂苷 A^[5] (也被命名为 A₃^[6])、B^[10]、C (也被命名为 B₄^[6])、D (pulchinenoside A、B、C、D)^[7]、皂苷 1 (saponin 1)、皂苷 2 (saponin 2)^[8,9]、白桦酯酸 (betulinic acid)、白桦脂酸-3-O- α -L-阿拉伯吡喃糖苷 (betulinic acid-3-O- α -L-arabinopyranoside)、3-氧代白桦脂酸 (3-oxobetulinic acid)、胡萝卜苷 (daucosterol)^[10]、原白头翁素 (protoanemonin)^[11]、白头翁素 (anemonin)、白头翁灵 (okinalin, C₃₂H₆₄O₂)、白头翁英 (okinalin, C₄H₆O₂)^[12]。近来科研人员主要从事对白头翁以 23-二羟

基- Δ 20(29)-羽扇豆烯-28-酸和白桦脂酸为母核的化合物的分离鉴定。

对其它品种的白头翁的化学成分的研究也有报道, 朝鲜白头翁含威灵仙表二糖皂苷(CP_{3a}), 威灵仙二糖皂苷(CP₂), 皂苷 II 及皂苷

III。钟萼白头翁含白头翁苷(pulsatilloside) A、B、C、D, 牡丹草苷(leontoside) A、B、D, 驴蹄草苷(calcoside) D, 威岩仙皂苷(cauloside) D、F 等。现将白头翁的主要化学成分结构列于下表 1:

表1 白头翁的主要化学成分结构

名称	结构式	
白头翁皂苷 A(A ₃)		A: R ₁ = β -L-rha-(1 \rightarrow 2)- β -L-ara-
白头翁皂苷 B		R ₂ = H-
白头翁皂苷 C(B ₄)		B: R ₁ = β -L-ara-
		R ₂ = β -L-rha-(1 \rightarrow 4)- β -D-glc-(1 \rightarrow 6)- β -D-glc-
白桦脂酸		C: R ₁ = β -L-ara-(1 \rightarrow 2)- α -L-ara-
白桦脂酸-3-O- α -L-阿拉伯吡喃糖苷		R ₂ = α -L-rha-(1 \rightarrow 4)- β -D-glc-(1 \rightarrow 6)- β -D-glc-
伯吡喃糖苷		Betulinic acid: R ₁ = R ₂ = H-
		Betulinic acid 3-O- α -L-arabinopyranoside: R ₁ = ara-
		R ₂ = H-
皂苷 1		1: R ₁ = β -D-glc-(1 \rightarrow 6)- β -D-glc-
皂苷 2		2: R ₁ = α -L-rha-(1 \rightarrow 4)- β -D-glc-(1 \rightarrow 6)- β -D-glc-
胡萝卜苷		
原白头翁素		
白头翁素		

3 药理作用

国内外对白头翁的药理活性进行了大量的研究, 白头翁主要具有抗菌、抗阿米巴和其它病原体的作用, 还可抑制巨噬细胞分泌 IL-6, 另外还有关于抗癌和杀精的报道。白头翁多以复方白头翁汤用于临床, 治疗急性肾盂肾炎、溃疡性结肠炎及伪膜性肠炎、血管性神经性头痛、急性盆腔脓肿、病毒性角膜炎、阴道炎等^[13]。现综述如下:

3.1 抗菌作用

白头翁鲜汁, 煎剂(0.5~1.0g 生药/ml)、乙醇提取物(0.5~1.0g 生药/ml)等在试管内均有明显的抗菌作用, 以对金黄色葡萄球菌、绿脓杆菌等最为敏感; 对痢疾杆菌、枯草杆菌、伤寒杆菌等也有较明显的抑制作用^[14]。

3.2 抗阿米巴原虫作用

体外实验白头翁煎剂于 1:60, 白头翁皂苷于 1:500 浓度下均能抑制阿米巴的繁殖。煎剂

于 1:40, 皂苷于 1:200 时能完全抑制阿米巴原虫生长^[14]。

3.3 对其它病原体的抑制作用

白头翁 60% 乙醇浸膏或水煎剂液于 5% 浓度下 5min 即可杀死阴道滴虫。白头翁及其复方对皮肤真菌、酵母菌、锥虫、白色念珠菌等均有抑制作用。白头翁素还具有很强的杀真菌作用。白头翁对小白鼠流感病毒感染有轻微抑制作用^[14]。

3.4 抑制巨噬细胞分泌 IL-6 作用

白头翁对细菌脂多糖(LPS)刺激巨噬细胞分泌 IL-6 有明显抑制作用,且随培养时间的延长而增强,可减轻机体过度炎症反应和全身性损伤,有助于治疗内毒素血症^[15]。

3.5 抗癌作用

白头翁曾被报道对肺部鳞癌、黑色素瘤有一定疗效,但临床一般不作重要抗癌中草药使用。科研人员在体外抗肿瘤药物筛选时发现白头翁水提取液(PWE)和醇提取液(PAE)对 7721、HeLa、MKN-45 细胞株均有较强的抑制作用,2mg/ml 左右 PWE 即可产生非常显著抑制肿瘤细胞的作用,并提出白头翁抗肿瘤作用主要是通过其直接作用于肿瘤细胞所致^[16]。

3.6 杀精子作用

科研人员通过体外杀精子研究发现白头翁皂苷使精子瞬间失活的最低有效浓度为 0.73mg/ml。杀精效果比萘烯基苯氧聚乙氧乙醇(TS-88)强,而稍弱于壬基苯氧聚乙氧乙醇(NP-10)^[17]。随着对其杀精子机理、临床应用效果及安全性方面的进一步研究,白头翁皂苷可望成为一种理想的阴道杀精子药。

4 展望

白头翁为一常用中药,我国资源较丰富,但是白头翁来源较多,各地入药药材不同,品种较混乱,疗效也有差异,给白头翁的用药规范带来一定的困难。建议通过显微鉴别、比较 DNA 指纹图谱及药理药效和活性成分的研究,选择优良品种进行药材的规范化生产与使用(GAP),这样有利于保证白头翁药材使用的安全有效。虽然科研人员对白头翁的化学成分进行了一定

研究,但应该充分利用最新的活性作用靶点进行活性跟踪研究。对于新发现的抗癌、杀精子、抑制巨噬细胞分泌 IL-6 等作用的活性部位及单体进行跟踪筛选,另外还须在作用机理方面进行更深入系统的研究。这样不仅保证了原料的规范,而且对白头翁的化学与药理结合进行研究,为进一步的新药开发及中药现代化提供了科学依据。

参考文献:

- [1] 国家中医药管理局《中华本草》编委会. 中华本草(上册)[M]. 上海: 科学技术出版社. 1998, 538.
- [2] 李广民. 中药白头翁及常见混淆品的性状鉴别和显微鉴别的研究[J]. 陕西中药. 1990, 11(1): 35.
- [3] 李德勋, 廖仲祥. 白头翁与西南白头翁的理化鉴别[J]. 基层中药杂志. 1999, 13(2): 34.
- [4] 周素娣, 王旭敏, 陈春明. 不同采收期对白头翁中总皂苷含量的影响[J]. 中药新药与临床药理. 1998, 9(1): 45.
- [5] 叶文才, 赵守训, 刘静涵. 中药白头翁化学成分的研究(I)[J]. 中国药科大学学报. 1990, 21(5): 264.
- [6] 陈文佩, 林强, 陈玲, 等. 中药白头翁的皂苷 IV. 主皂苷 B4 和 A3 结构的研究[J]. 化学学报. 1990, 48: 501.
- [7] 吴振洁, 丁林生, 赵守训. 中药白头翁的苷类成分[J]. 中国药科大学学报. 1991, 22(1): 57.
- [8] 叶文才, 赵守训, 张振华, 等. 中药白头翁化学成分的研究(III)[J]. 中国药科大学学报. 1991, 26(6): 337.
- [9] 缪振春, 冯锐, 叶文才, 等. 中药白头翁化学成份的核磁共振研究[J]. 有机化学. 1992, 12(6): 610.
- [10] 吴振洁, 丁林生, 赵守训. 中药白头翁的苷类成分[J]. 中国药科大学学报. 1991, 22(5): 265.
- [11] 上海药物研究所. 中草药有效成分的提取和分离[M]. 上海: 人民出版社. 1977, 228.
- [12] 江苏新医学院. 中药大辞典(上册)[M]. 上海: 科学技术出版社. 1977, 705.
- [13] 黄燕. 白头翁汤的成分分析和临床应用[J]. 中成药. 1995, 17(3): 35-36.
- [14] 王本祥. 新编中药学辞典[M]. 天津: 科学技术出版社. 1996, 361.
- [15] 富光华, 许锋, 鲁焕章. 六味中药对内毒素刺激巨噬细胞分泌 IL-6 的影响[J]. 中草药. 1997, 28(3): 166.
- [16] 蔡鹰, 唐永明, 梁秉文. 白头翁体外抗肿瘤实验研究[J]. 中草药. 1999, 30(6): 441.
- [17] 慕慧, 杜俊杰. 白头翁皂苷体外杀精效果研究[J]. 西北药学杂志. 1996, 11(3): 119.