

萹蓄的化学成分及药理作用研究进展

徐燕¹, 李曼曼¹, 刘增辉², 王海燕¹, 蒋家月¹

(1. 安徽农业大学教育部和农业部茶叶生物化学与生物技术重点实验室, 合肥 230036;

2. 安徽省医学科学研究所, 合肥 230061)

摘要: 萹蓄为常用中药, 具有清热利尿、解毒驱虫、消炎、止泻等功效。现代药理研究也证明其具有利尿、降压、抑菌、抗氧化和保肝等作用。迄今为止, 萹蓄中已分离鉴定的化合物主要是黄酮类、酚酸类化合物, 其次是苯丙素类、生物碱类、醌类、糖类化合物等, 此外, 萹蓄中还含有丰富的氨基酸和人体必需的常量和微量元素等。查阅了近40年的萹蓄文献资料, 对其化学成分和药理作用进行系统、全面的综述, 为其进一步开发利用提供参考。

关键词: 萹蓄; 黄酮类化合物; 酚酸类化合物; 药理作用

中图分类号: Q949.95

文献标识码: A

文章编号: 1672-352X(2012)05-0812-04

Research progress in chemical constituents and pharmacological activities of *Polygonum aviculare* L.

XU Yan¹, LI Man-man¹, LIU Zeng-hui², WANG Hai-yan¹, JIANG Jia-yue¹

(1. Key Laboratory of Tea Biochemistry and Biotechnology, Ministry of Education and Agriculture,

Anhui Agricultural University, Hefei 230036;

2. Anhui Academy of Medical Sciences, Hefei 230061)

Abstract: *Polygonum aviculare* L. is a traditional Chinese medicine and commonly used in folkloric medicine. Modern pharmacological studies have proven that it has diuresis, hypotensive and antimicrobial activities, anti-lipid peroxidation and liver protective effects and so on. Many compounds have been isolated from *P. aviculare* L., and they are flavonoids, phenolic acids, phenylpropanoids, alkaloids, quinones, saccharides. *P. aviculare* L. also has essential elements of the human body and amino acids. This paper reviews research progress in the chemical constituents and pharmacological activities of *P. aviculare* L. to provide references for further development and its utilization.

Key words: *Polygonum aviculare* L.; flavonoids; phenolic acids; pharmacological activities

萹蓄为蓼科(Polygonaceae)蓼属一年生或多年生草本植物(*Polygonum aviculare* L.)的干燥地上部分^[1], 又名萹竹、粉节草、乌蓼、地萹蓄、道生草等, 生于山坡、田野、路旁等处, 全国各地均有分布。萹蓄始载于《神农本草经》, 性微寒、味苦、归膀胱、大肠经。《本草纲目》中载, 用于“治霍乱、黄疸、利小便及小儿疝病”。《滇南本草》载: “利小便, 治五淋白浊、热淋、瘀精, 开关窍。”其全草入药, 具有清热利尿、解毒驱虫、消炎、止泻等功效。现民间广泛用其治疗泌尿系统的感染、结石及肾炎等疾病^[2]。萹蓄中含有多种化学成分如黄

酮类、酚酸类、苯丙素类、糖类、氨基酸以及多种常量和微量元素等, 现代药理研究也证明其有利尿、降压、抑菌、抗氧化和保肝等药理作用。为了萹蓄的进一步开发应用, 本文对其化学成分及药理作用的研究进展进行系统、全面的综述。

1 化学成分

1.1 黄酮类化合物

从萹蓄中分离得到的黄酮类化合物有山柰酚(kaempferol,1)、槲皮素(quercetin,2)、杨梅素(myricetin,3)^[3]、木犀草素(luteolin, 4)^[4]、tetra-O-

methylscutellarein (5, 6, 7, 4'-tetramethoxy flavanone, 5)^[5]、5,7-二羟基-6-甲氧基黄酮(5, 7-dihydroxy-6-methoxyflavane, 6)、白杨黄素(chrysin, 5,7-二羟基黄酮, 5, 7-dihydroxy flavane, 7)、5, 7-二甲氧基-4'-羟基黄酮(5, 7-dimethoxy-4'-hydroxyflavane, 8)^[6]、香橙素(aromadendrin, 9)^[7]、betmidin(10)^[8]、杨梅树皮苷(myricitrin, 11)、胡桃宁(juglanin, 12)^[3]、篇蓄苷(avicularin, 13)^[3, 9]、槲皮苷(querce-trin, 14)、黄芪苷(astragaln, 15)、槲皮素-3-O-甘露糖苷(querce-trin-3-O-mannopyranoside, 16)^[10]、liquiritin (liquiritigenin-4'-O-β-D-glucopyranoside, 17)、cinaro-side (luteolin-7-O-β-D-glucopyranoside, 18)^[11]、5-羟基-3'-甲氧基双氢黄酮-7-O-芸香糖甙(5-hydroxy-3'-methoxy-flavanone-7-O-rutinoside, 19)^[6]、des-manthin-1 (20)^[12]、5,3'-dihydroxy-4'-O-angeloxy-flavone-7-O-β-D-glucopyranoside (21)、luteolin-5-O-β-D-glucopyranoside (22)、querce-trin-3-O-β-D-glucopyranoside (23)、牡荆素(vitexin, 24)^[13]、桑色素-7-O-β-D-葡萄糖甙(morin-7-O-β-D-glucoside, 25)^[6]、异牡荆素(iso-vitexin, 26)、campherol-3-arabinoside (27)、鼠李素-3-半乳糖苷(rhamnetin-3-galactoside, 28)和金丝桃苷(hyperoside, quercetin-3-galactoside, 29)^[4]。

1.2 酚酸类化合物

从篇蓄中分离得到的有机酸有咖啡酸(caffeic acid, 30)、阿魏酸(ferulic acid, 31)、芥子酸(sinapic acid, 32)、对-香豆酸(p-coumaric acid, 33)、香草酸(vanillic acid, 34)、丁香酸(syringic acid, 35)、对羟基苯甲酸(p-hydroxybenzoic acid, 36)、对羟基苯乙酸(p-hydroxy-phenylacetic acid, 37)、龙胆酸(gentisic acid, 38)、原儿茶酸(protocatechuic acid, 39)、没食子酸(gallic acid, 40)、水杨酸(salicylic acid, 41)、草木犀酸(melilotic acid, 42)、绿原酸(chlorogenic acid, 43)、表没食子酸(ellagic acid, 44)^[14]、右旋儿茶酚(d-catechol, 45)、草酸(oxalic acid, 46)、硅酸(silicic acid, 47)^[15]、tachioside(48)和 isotachioside(49)^[16]。

1.3 苯丙素类化合物

从篇蓄中分离得到的苯丙素类化合物有: 丁香脂素(syringaresinol, 50)^[12]、aviculin(51)^[8]、伞形酮(umbelliferone, 52)和东莨菪素(scopoletin, 53)^[17]。

1.4 生物碱类化合物

从篇蓄中分离得到 2 个生物碱类化合物: panicudine (6-hydroxy-11-deoxy-13-dehydrohetisane, 54)^[18]和糙叶败酱碱(patriscabritine, 55)^[7]。

1.5 醌类化合物

从篇蓄中分离得到 1 个新的醌类化合物:

6-methoxyplumbagin(56)^[5]。

1.6 萜类及甾醇类化合物

从篇蓄中分离得到萜类和甾醇类化合物: loliolide(57)^[12]、齐墩果酸 oleanolic acid(58)^[5]、β-谷甾醇(β-sitosterol, 59)和 β-胡萝卜苷(β-daucosterol, 60)^[10]。

郑旭东等^[19]采用 GC-MS-DC 联用方法鉴定和测定了采自甘肃庆阳的乌藜挥发油成分, 共鉴定出 35 个成分, 其主要成分为 α-蒎酮、芳樟醇、匙叶桉油烯醇、蒎烯等。

1.7 其他类化合物

1.7.1 糖类 篇蓄中含有葡萄糖、果糖、蔗糖^[15]、阿拉伯糖和水溶性多糖等^[20-22]。

1.7.2 氨基酸 篇蓄中含有 16 种氨基酸, 其中有 6 种是必需氨基酸, 分别为蛋氨酸(methionine)、脯氨酸(proline)、丝氨酸(serine)、苏氨酸(threonine)、酪氨酸(tyrosine)、苯丙氨酸(phenylalanine)^[23]。于兆海等首次从篇蓄中分离得到色氨酸^[16]。

1.7.3 微量元素 篇蓄中含有丰富的人体必需的常量和微量元素如 Ca、Fe、Cu、Zn、Mn、Mg、Na、K 等, 具有较高的药用价值, 篇蓄的抗炎或消炎功效与之有关^[24]。

2 药理作用

2.1 利尿作用

篇蓄煎剂给大鼠皮下注射 1、5 g·kg⁻¹ 或口服 20 g·kg⁻¹ 时均能产生显著的利尿作用^[25], 篇蓄煎剂 20 g·kg⁻¹ 灌胃大白鼠呈现明显的利尿作用, 并在研究发现其利尿作用主要是由于所含钾盐所致, 也可能有其它利尿成分参加^[26]。

篇蓄苷 0.5 mg·kg⁻¹ 给麻醉犬静脉注射有明显的利尿作用, 3 mg·kg⁻¹ 给大鼠灌胃或皮下注射均有显著的利尿作用, 且其强度与剂量成正比^[27]。

2.2 抑菌和杀螨虫作用

浓度为 25% 的全草煎剂对弗莱氏 VI 型痢疾杆菌和会莱氏痢疾杆菌皆有抑制作用。1:10 浓度的煎剂对须疮癣菌、毛羊状小芽胞菌有抑制作用。40% 水煎剂对葡萄球菌、绿脓杆菌、皮肤真菌均有抑制作用^[3]。

篇蓄的水、丙酮、氯仿、乙醇提取物对革兰氏阳性菌和阴性菌均有抑制作用, 其氯仿提取物抑菌活性更好, 除白色念珠菌外可抑制所有已试验的细菌和真菌。并研究从篇蓄中分离得到的 panicudine 对副伤寒沙门(氏)菌、枯草杆菌、伤寒杆菌金黄色葡萄球菌的 MIC(最小抑菌浓度)和 MBC(最小杀菌

浓度)^[18]。蒺藜提取物还具有显著的杀满虫作用,具有化学农药高效的特点,对朱砂叶螨有多个作用位点,无抗药性^[33]。

2.3 抗肝纤维化作用

用蒺藜甲醇提取物处理胆管结扎和煎断的诱发肝纤维化小鼠可显著地降低小鼠血清中天冬氨酸转氨酶(AST)、丙氨酸转氨酶 (ALT)、磷酸酯酶 (ALP)的水平($P<0.01$),小鼠肝脏中羟脯氨酸的含量也减少到原来的40% ($P<0.01$)。蒺藜甲醇提取物具有显著的抗小鼠肝纤维化作用^[28]。

2.4 抗氧化作用和保肝作用

蒺藜乙醇提取物冻干粉可清除超氧阴离子自由基、羟基自由基和抗脂质过氧化,具有抗氧化作用^[29]。从蒺藜乙酸乙酯部分分离得到蒺藜苷和胡桃苷两个活性成分可显著地抑制酒精中毒小鼠肝的脂质过氧化,蒺藜苷的抑制作用更强;蒺藜苷还可降低 CCl_4 诱导的小鼠肝毒性的s-GOT和s-LDH的水平,具有显著的肝脏保护作用;另外蒺藜苷还可降低 α -萘异硫氰酸酯(ANIT)诱导胆红素水平。因此蒺藜苷对 CCl_4 和ANIT诱导小鼠肝损伤有保护作用^[30]。

2.5 对血小板的聚集作用

蒺藜中的牡荆素和鼠李素-3-半乳糖苷对人血小板聚集有抑制作用;蒺藜中的木犀草素对人血小板聚集因实验条件的不同,具有抑制或加强作用^[4]。

2.6 降压作用

蒺藜的浸剂、煎剂或乙醇提取液给猫、兔、狗静脉注射,均有降压作用。蒺藜苷给麻醉犬静脉注射有降压作用,但持续时间短,且易产生耐受性^[2]。

2.7 抗癌作用

蒺藜中的槲皮素和杨梅皮素对多种致癌物如苯并芘、黄曲霉等有抑制作用;其中槲皮素对多种恶性肿瘤细胞如白血病细胞、人乳腺癌细胞等均有抑制生长作用^[31-32]。

3 讨论

蒺藜作为我国的一种传统常用中药,具有分布广、适生性强、资源丰富等特点,不仅含有丰富的化学成分,而且具有诸多的药理作用,是一种值得进一步研究和开发的药材。目前蒺藜的化学成分研究多集中在黄酮类、酚酸类成分,其他类成分研究的较少,蒺藜药理作用的研究主要集中在提取物的活性研究上,单体成分的活性研究较少。在蒺藜药理作用的进一步研究中,应注重从提取物、有效组分和成分单体3个层次着手,借助高通量筛选、细胞模型和动物模型等阐述蒺藜及其复方的物质基础

及作用机理。蒺藜资源丰富,其提取物对细菌和真菌显示较好的抑菌作用,从中开发出抑菌的天然药物或农药将是今后的一个研究方向;另外,蒺藜中含有丰富的黄酮类成分,黄酮类化合物是天然的抗氧化剂,可开发为药物,或食品、化妆品等的添加剂,应用前景广阔。

参考文献:

- [1] 中华人民共和国卫生部药典委员会. 中国药典(一部)[S]. 北京: 化学工业出版社, 2010: 314.
- [2] 国家中医药管理局中华本草编委会. 中华本草(6卷)[M]. 上海: 上海科技出版社, 1999, 2: 639, 1286.
- [3] 许福泉, 刘红兵, 罗建光, 等. 蒺藜化学成分及其归经药性初探[J]. 中国海洋大学学报, 2010, 40(3): 101-104.
- [4] Panosyan A. G, Barikyan M L., Grigoryan R T, et al. The effect of *Polygonum aviculare* L. flavonoids on platelet aggregation [J]. Khimiko-Farmatsevticheskii Zhurnal, 1986, 20(2): 190-194.
- [5] Al-Hazimi H M A, Haque S N. A new naphthoquinone from *Polygonum aviculare*[J]. Natural Product Letters, 2002, 16(2): 115-118.
- [6] 郑旭东, 苏跃增, 沈序维, 等. 庆阳乌蓼中黄酮类化合物的研究[J]. 西北师范大学学报:自然科学版, 1999, 35(2): 47-49.
- [7] 陈晓虎. 蒺藜的抗肿瘤活性成分研究[D]. 上海: 复旦大学, 2004.
- [8] Kim H J, Woo E R, Park H. A novel lignan and flavonoids from *Polygonum aviculare*[J]. Journal of Natural Products, 1994, 57(5): 581-586.
- [9] Ohta T. The glycosides of *Polygonum aviculare* L. var. *buxifolium* Ledeb[J]. Z Physiol Chem, 1940, 263: 221-223.
- [10] 陈晓虎, 陈道峰. 蒺藜的化学成分研究[J]. 中国中药杂志, 2004, 29(9): 918-919.
- [11] Yunuskhodzhaeva N A, Eshbakova K A, Abdullabekova V N. Flavonoid composition of the herb *Polygonum aviculare* [J]. Chemistry of Natural Compounds, 2010, 46(5): 803.
- [12] 赵爱华, 赵勤实, 林中文, 等. 蒺藜的化学成分研究[J]. 天然产物研究与开发, 2002, 14(5): 29-32.
- [13] Sun L P, Zheng S Z, Wang J X, et al. The flavonoids from *Polygonum aviculare*[J]. Indian Journal of Chemistry, Section B: Organic Chemistry Including Medicinal Chemistry, 2002, 41B(6): 319-320.
- [14] Swiatek L, Dombrowicz E. Phenolic acids in medicinal plant drugs of *Polygonum* species[J]. Farm Pol, 1988, 43(7/8): 420-423.
- [15] Haverland F. *Polygonum aviculare*-the knotgrass: a botanical-chemical pharmaceutical reworking [J]. Pharmazie, 1963, 18: 59-87.
- [16] 于兆海, 孙结. 蒺藜的化学成分研究[J]. 中草药, 2002, 33(6): 498-499.
- [17] Khvorost P P. Flavonoids of *Polygonum aviculare*[J]. Khimiya Prirodnykh Soedinenii, 1980, 6: 840
- [18] Salama H M H, Marraiki N. Antimicrobial activity and phytochemical analysis of *Polygonum aviculare* L. (*Polygonaceae*), naturally growing in Egypt [J]. Saudi Journal

- of Biological Sciences, 2010, 17: 57-63.
- [19] 郑旭东, 胡浩斌, 郑尚珍, 等. 庆阳乌蓼挥发油成分的研究[J]. 西北师范大学学报:自然科学版, 1999, 35(3): 68-70.
- [20] Yakovlev A I, Churilov G I. Polysaccharides of *Polygonum aviculare*[J]. Khimiya Prirodnykh Soedinenii, 1978, 6: 795-796.
- [21] Yakovlev A I, Churilov G I, Ginak A I. Polysaccharide composition of *Polygonum aviculare* [J]. Khimiya Prirodnykh Soedinenii, 1985, 5: 619-622.
- [22] Yunuskhodzhaeva, N A, Abdullabekova V N, Kurbanova A D. Polysaccharide composition of *Polygonum hydro-piperis* and *P. aviculare* [J]. Chemistry of Natural Compounds, 2006, 42(5): 600-601.
- [23] Denisenko O N, Mazulin A V, Kaloshina N A. Amino acid content of species in the genera *Pyrus* L. and *Polygonum* L.[J]. Farmatsevtichnii Zhurnal (Kiev), 1990, 5: 71-72.
- [24] 阿布来提·都热西提. 中草药蓄中 8 种常量及微量元素的分析[J]. 微量元素与健康研究, 2009, 26(3): 29-31.
- [25] 黄厚聘, 程才. 篇蓄的利尿作用[J]. 贵阳医学院学报, 1963: 36.
- [26] 吕向华. 中药苍术、篇蓄、芫花及车前子煎剂利用作用的初步观察[J]. 药学报, 1966, 13(6): 454-458.
- [27] 李蕴山, 傅绍萱, 韩锐, 等. 广寄生昔之利尿作用[J]. 药学报, 1959, 7(1): 1-5.
- [28] Nan J X, Park E J, Kim H J, et al. Antifibrotic effects of the methanol extract of *Polygonum aviculare* in fibrotic rats induced by bile duct ligation and scission [J]. Biological & Pharmaceutical Bulletin, 2000, 23(2): 240-243.
- [29] Hsu C Y. Antioxidant activity of extract from *Polygonum aviculare* L.[J]. Biological Research, 2006, 39(2): 281-288.
- [30] Choi H J, Kim N J, Kim J W, et al. Anti-lipid peroxidation and liver protective effects of *Polygonum aviculare* L.[J]. Saengyak Hakhoechi, 1997, 28(3): 117-123.
- [31] 雪石. 黄酮类化合物的抗肿瘤活性[J]. 外医学药学分册, 1995, 22: 92-96.
- [32] Cassady J M. Natural product as a source of potential cancer chemotherapeutic and chemopreventive agents [J]. J Nat Prod, 1990, 53: 23-41
- [33] 王有年, 师光禄, 段碧华. 一种篇蓄提取物及其制备方法和用途[P]. 101579002, 2009-11-18.

本刊外聘编委 朱军教授

朱军, 男, 汉族, 江苏宿迁人, 1949年5月生, 1969年1月参加工作, 1986年5月加入中国共产党。美国北卡罗来纳州立大学统计系和遗传系毕业, 研究生学历, 统计学和遗传学博士, 教授。

1969年1月至1973年9月在安徽省蒙城县插队。1973年9月至1976年9月在安徽农学院农学系农学专业学习。1976年9月至1979年9月任安徽省蒙城县楚村区农技站技术员。1979年9月至1982年9月在浙江农业大学农学系农学专业学习, 获硕士学位。1982年9月至1998年9月在浙江农业大学任教, 其中1986年6月至1989年6月在美国密西西比州立大学农学系、美国北卡罗来纳州立大学统计系和遗传系学习, 获统计学和遗传学专业博士, 1989年6月至1990年7月在美国北卡罗来纳州立大学统计系做博士后研究。1991年7月晋升教授, 1993年12月任博士生导师。1994年9月至1998年9月任浙江农业大学副校长。1999年7月任浙江大学农业与生物技术学院院长。2005年2月任浙江大学党委常委、副校长。

中国数学学会生物数学学会副理事长, 中国农学会农业应用数学分学会理事长, 浙江省遗传学会副理事长, 国家自然科学基金委员会生命科学部遗传学评审组成员, 农业部教学指导委员作物学科组成员。《生物数学学报》编委, 《中国棉花学报》编委。先后主持了3项国家自然科学基金项目、1项国家教委跨世纪优秀人才专项基金项目、1项国家自然科学基金重大项目子课题、2项浙江省自然科学基金和1项棉花育种国家攻关项目。至今已在国外发表论文37篇(其中SCI检索的25篇), 国内核心刊物发表论文50余篇(其中国家学会一级刊物28篇)。有4篇论文获浙江省自然科学优秀论文一等奖。主持的《作物数量性状遗传分析新方法的研究》获1994年国家教委科技进步二等奖。