

鳄嘴花的化学成分及药理作用研究进展[△]

王 瑶*,钟希文#,张文霞(广州中医药大学附属中山市中医院,广东 中山 528400)

中图分类号 R284;R285 文献标志码 A 文章编号 1001-0408(2016)01-0108-04
DOI 10.6039/j.issn.1001-0408.2016.01.35

摘要 目的:为进一步合理开发利用和研究鳄嘴花提供参考。方法:以“*Clinacanthus nutans*”“鳄嘴花”“忧遁草”“青箭”“化学成分”“药理作用”等为关键词,组合检索1970年1月—2015年7月的PubMed、中国知网、万方、维普等数据库中有关鳄嘴花化学成分及药理作用的研究成果,并主要对鳄嘴花的药理作用进行整理。结果:共查阅到相关文献94篇,其中有效文献33篇。目前从鳄嘴花中分离鉴定的化合物包括甾醇类、三萜类、黄酮碳苷、含硫糖苷、脑苷类、叶绿素类、megastigmanes、benzenoids及生物碱类等,其具有抗病毒、抗氧化、抗肿瘤、抗炎、抗菌及免疫调节等广泛的药理作用,且毒理研究表明其无毒副作用或毒副作用小。结论:由于鳄嘴花药理作用的多重性及其民间用药历史的悠久性,随着研究者对其化学成分及药理作用研究的深入,其作为药物应用将具有广阔的前景。

关键词 鳄嘴花;化学成分;药理作用;研究进展

鳄嘴花[*Clinacanthus nutans* (N.L.Burman) Lindau],为爵床科(Acanthaceae)鳄嘴花属植物,以全株或叶片入药,又名忧遁草、沙巴蛇草、青箭、柔刺草、扭序花、竹节黄、竹叶青、竹儿王、小接骨、刺黄等^[1]。其主产于中国南部至西南部地区以及马来西亚、印度尼西亚、泰国等国家。鳄嘴花临床药用较少,民间用药较多,其药用价值一直未被重视,直至2011年马来西亚某淋巴瘤末期患者服用鳄嘴花康复后,鳄嘴花的药用价值很快引起了世界各地医药科研工作者的广泛关注。笔者以“*Clinacanthus nutans*”“鳄嘴花”“忧遁草”“青箭”“化学成分”“药理作用”等为关键词,组合检索1970年1月—2015年7月的PubMed、中国知网、万方、维普等数据库中有关鳄嘴花化学成分及药理作用的研究成果,并主要对鳄嘴花药理作用进行整理、综述。结果共检索到相关文献94篇,其中有效文献33篇。现对鳄嘴花的民间用药、化学成分及近些年的药理作用研究综述如下。

1 民间药用历史

鳄嘴花最早作为药物,以正名鳄嘴花载于《广西药用植物名录》,曰“调经、去瘀、消肿、止痛。治跌打骨折、贫血、黄疸、风湿”。此后地方本草专著《广东省惠阳地区中草药》《梧州地区中草药》《广西本草选编》《广西民族药简编》《西双版纳傣药志》及全国性大型中药专著《全国中草药汇编》《中华本草》《中药大辞典》《中华药海》等均有记载。各专著对鳄嘴花功能主治记载基本相同,主要功能为清热解毒、利湿、散瘀消肿、活血调经、止痛;主治黄疸、肝炎腹水、月经不调、跌打肿痛、骨折、风湿痹痛等。但所载性味相差甚远,《广西本草选编》:“味微涩,性凉”;《西双版纳傣药志》:“味微甜,性微温”;《中华本草》《中药大辞典》:“微苦、淡,性凉”;《中华药海》:“甘,平”。而归经方面,仅见于《中华药海》:“入肝、脾、肾经。”均有待于进一步研究。

鳄嘴花在中国民间应用呈现出一定的地域性,不同地区用于治疗疾病的侧重点不同。在云南,鳄嘴花为傣族民族药,傣医用于续筋接骨、治疗跌打损伤及强壮补骨;在华南(广东、

广西)地区,鳄嘴花作为野生蔬菜,药食同用,常用于治疗肝炎及肝炎腹水、风湿痹痛、月经不调、跌打肿痛、骨折及钩端螺旋体病。如《广东省惠阳地区中草药》记载:“竹叶青30g,水煎服,治急慢性肝炎”;《梧州地区中草药》:“竹儿王60g,茵陈、山栀各30g,水煎服,治急性黄疸型肝炎。竹儿王30g,茅根60g,栀子15g,紫珠草30g,水煎服,治钩端螺旋体病初期”等。鳄嘴花在不同国家用于治疗疾病种类也相差甚远,其中马来西亚用其治疗各种癌症,包括淋巴瘤、肝癌、肺癌、肾癌、乳癌、鼻咽癌、子宫癌、卵巢癌、血癌、脑癌、前列腺癌等;印度尼西亚用其治疗各种肾炎、肾萎缩、肾衰竭及肾结石;而泰国则用其治疗疱疹、湿疹、皮疹、虫及蛇咬伤,并已被列为泰国基本卫生保健药用植物。

2 化学成分

鳄嘴花含有多种不同类型的化合物,主要包括甾醇类及三萜类(豆甾醇、 β -谷甾醇、羽扇豆醇、白桦脂醇、 β -胡萝卜苷)^[2-4],黄酮碳苷类(牡荆草素、异牡荆草素、shaftoside、异粟米素-7-*O*- β -D-吡喃葡萄糖苷、红草素、异红草素、肥皂草苷)^[4-5],含硫糖苷类(*clinacoside A*、*clinacoside B*、*clinacoside C*及*cycloclinacoside A1*等)^[6-8],叶绿素类(13^2 -hydroxy-(13^2 -*S*)-chlorophyll b、 13^2 -hydroxy-(13^2 -*R*)-chlorophyll b、 13^2 -hydroxy-(13^2 -*S*)-phaeophytin b、 13^2 -hydroxy-(13^2 -*R*)-phaeophytin b、 13^2 -hydroxy-(13^2 -*S*)-phaeophytin a、 13^2 -hydroxy-(13^2 -*R*)-phaeophytin a、purpurin 18 phytol ester、phaeophorbide a)^[9-10],以及其他化合物[脑苷类(cerebrosides)、单乙酰代单半乳糖基丙三醇^[11](monoacylmonogalactosylglycerol)、megastigmanes(黑麦草内酯)、3- β -hydroxy-5 α ,6 α -epoxy-7-megastimen-9-one、3- α -hydroxy-4,7-megastigmadien-9-one、benzenoids(ethyl-trans-3-(4-hydroxyphenyl)prop-2-enoate)、ethyl-cis-3-(4-hydroxyphenyl)prop-2-enoate、4-hydroxyacetophenone、4-hydroxybenzaldehyde、生物碱类化合物(吡啶-3-甲醛)^[8]],尚含化合物^[12]*n*-pentadecanol、eicosane、1-nonadecene、heptadecane、dibutyl phthalate、*n*-tetracosanol-1、heneicosane、behenic alcohol、1-heptacosanol、1,2-benzenedicarboxylic acid、mono(2-ethylhexyl) ester、nonadecyl heptafluorobutyrate、eicosyl trifluoroacetate、1,2-benzenedicarboxylic acid、dinonyl ester、phthalic acid、dodecyl nonylester。此外还含大量人体必需氨基酸、脂肪酸^[13]、微量元素及矿物质^[9]。

3 药理作用

[△] 基金项目:广东省建设中医药强省立项不资助科研课题(No.20142150)

* 硕士研究生。研究方向:新药开发与中药药理。E-mail:wy7026@sina.cn

通信作者:主任中药师,硕士生导师。研究方向:新药开发与中药药理。电话:0760-88815106。E-mail:zsxw@163.com

鳄嘴花为泰国传统草药,早期因其抗炎^[14]及抗病毒^[15]作用显著而被人所熟知。随后因某淋巴瘤患者服用鳄嘴花后康复,其抗氧化及对癌细胞的毒性作用逐渐被挖掘出来^[14]。

3.1 抗炎

Wanikiat P等^[14]发现鳄嘴花甲醇提取物能有效抑制角叉菜胶致大鼠足爪肿胀及苯丙炔酸乙酯致大鼠耳肿胀,并呈显著的剂量依赖关系,且可显著抑制炎症组织中髓过氧化物酶(MPO)活性,从而表明其抗炎作用机制为抑制中性粒细胞迁移,但对中性粒细胞生存力及凋亡无影响。Tu SF等^[17]将收集到的人类中性粒细胞采用聚蔗糖离心法和葡聚糖沉积法,通过已知的程序评估超氧化阴离子的产生和弹性蛋白酶的释放作用研究抗炎效果,结果显示,鳄嘴花乙醇提取物10 μg/ml对弹性蛋白酶释放的抑制作用最强为68.33%。

3.2 抗病毒

在泰国,鳄嘴花作为民间传统药材常用于治疗疱疹等疾病,很多药效学研究已证明鳄嘴花抗单纯疱疹病毒有其独特之处^[16-17],然而亦有阴性结果的报道^[15]。尽管如此,临床将鳄嘴花用于治疗生殖器疱疹及带状疱疹均取得了满意效果^[18]。

3.2.1 抗1型单纯疱疹病毒(HSV-1) Thongchai S等^[16]通过在Vero细胞中蚀斑减少试验,研究鳄嘴花乙酸乙酯粗提取物对HSV-1F的抑制作用,结果显示仅在感染前表现出抑制作用且呈时间依赖性。其抑制作用的方式在感染前可阻止病毒的吸附和渗入。Sakdarat S等^[19]研究鳄嘴花氯仿提取物对HSV-1F抑制活性作用,结果显示在病毒进入宿主细胞前,其可影响病毒颗粒包络结构及病毒表面糖蛋白,从而阻止病毒的吸附及侵入。Kunsorn P等^[17]研究发现,鳄嘴花正己烷提取物的抗HSV-1作用优于甲醇提取物。

3.2.2 抗2型单纯疱疹病毒(HSV-2) 现有研究结果对鳄嘴花抗2型单纯疱疹病毒作用存有争议。Kunsorn P等^[17]研究发现鳄嘴花提取物有抗HSV-2作用,且正己烷提取物以及二氯甲烷提取物的抗HSV-2作用强于甲醇提取物。Vachirayonstien T等^[20]指出在被病毒感染前,鳄嘴花对HSV-2具有极为显著的杀灭或抑制作用,其作用机制可能为鳄嘴花与病毒表面的某些分子相互作用而成。而Yoosook C等^[15]研究却表明鳄嘴花甲醇提取物并未显现出对HSV-2的抑制作用。至于具体是否对HSV-2具有抑制作用,有待医药学者进一步探索。

3.2.3 抗水痘-带状疱疹病毒(VZV) Thawaranantha D等^[21]采用DNA杂交技术及空斑减数试验法研究鳄嘴花体外抗VZV作用,并在治疗前、治疗后及病毒灭活3个不同时期初步研究了鳄嘴花抗VZV作用机制,结果提示鳄嘴花提取物抗VZV活性可能基于其对病毒的直接作用。

3.2.4 抗2型登革热病毒(DV2) Sittiso S等^[22]研究鳄嘴花在A549细胞中对DV2的抑制作用,并通过研究对比DV2在化合物中孵育前后的抗病毒活性,结果表明只有化合物phacophorbide a可抑制其孵育后的2型登革热病毒RNA及蛋白质的生成,且对孵育前的DV2无抑制作用。Tu SF等^[18]研究鳄嘴花提取物对2型登革热病毒的抑制作用,结果其表现出中等的抗登革热病毒活性作用。

3.2.5 抗人乳头瘤病毒(HPV) Sookmai W等^[23]对鳄嘴花中3种化合物136B、136C、136D进行了抗人乳头瘤16假病毒(HPV-16PsVs)感染研究,研究结果指出化合物136C和136D在病毒感染早期,能够阻止人乳头瘤病毒颗粒与宿主细胞受体的直接结合,并能阻止HPV-16 PsVs细胞的内摄。

3.3 抗菌

目前对鳄嘴花的抗白色念珠菌作用存在两种对立的观点:Choonharuangdej S等^[24]在“泰国草药体外抗白色念珠菌”一文中,报道鳄嘴花对白色念珠菌无抑制作用;而Arullappan S等^[25]的研究却表明鳄嘴花乙酸乙酯提取物对蜡样芽胞杆菌*Bacillus cereus*、白色念珠菌*Candida albicans*有抑制作用,其中抗蜡样芽胞杆菌的效果是最好的,其次在1.39 mg/ml时还具有抗白色念珠菌作用。

3.4 抗肿瘤

王贤儿等^[1]总结认为鳄嘴花中所含的多种化学成分具有抗肿瘤作用。Yong YK等^[12]的研究显示,鳄嘴花氯仿提取物(100 μg/ml)抗人红白血病细胞株K-562[抑制率(91.28 ± 0.03)%]和淋巴瘤细胞株Raji[抑制率(88.97 ± 1.07)%]细胞增殖作用最强,对肝癌细胞株HepG2、肺癌细胞株NCL-H23、胃癌细胞株SNU-1、宫颈癌细胞株Hela、结肠癌细胞株LS-174T细胞的增殖抑制作用呈剂量依赖关系,对神经母细胞瘤细胞株IMR32细胞的增殖无抑制作用;其水及甲醇提取物作用微弱。刘旭等^[26]研究鳄嘴花正丁醇提取物对小鼠Heps肝癌的抑制作用,实验显示正丁醇提取物高剂量组荷瘤小鼠的生存期明显延长,生命延长率达54.8%,提示其抗肿瘤作用良好。

3.5 抗氧化

近年来,国内外学者研究发现,鳄嘴花中不少成分具有显著的抗氧化及清除自由基的活性。Pannangpetch P等^[27]研究鳄嘴花乙醇提取物体外抗氧化活性及对偶氮二异丁基二盐酸盐(AAPH)诱发的大鼠红细胞氧化性溶血的保护作用,结果表明鳄嘴花提取物可清除1-二苯基-2-三硝基苯肼自由基,且可显著抑制由佛波酯(PMA)诱导的大鼠巨噬细胞过氧化物的产生,并可有效地抑制上述的溶血作用。Yong YK等^[12]研究了鳄嘴花提取物对自由基的清除作用,其中氯仿提取物对1,1-二苯基-2-三硝基苯肼自由基除力最强;水萃取物对一氧化氮自由基清除力较强,并呈剂量依赖关系;而对过氧化氢自由基的清除各萃取物作用均较差。Yuann JMP等^[28]研究表明,鳄嘴花总酚含量及超氧化物歧化酶(SOD)活性均不及绿茶,但以核黄素光化学法测定质粒超螺旋DNA完整性的保护效果上,鳄嘴花较绿茶更好。Arullappan S等^[25]研究鳄嘴花石油醚、乙酸乙酯及甲醇提取物的抗氧化作用,结果显示4.0 mg/ml石油醚叶提取物清除自由基能力高达82%,10 mg/ml甲醇茎提取物清除自由基能力为70%。Ghasemzadeh A等^[29]研究发现生长6个月的鳄嘴花抗氧化活性更高。

3.6 免疫调节

涂淑芬等^[7-8]研究鳄嘴花地上部分95%乙醇提取物正己烷、80%乙醇、正丁醇及水层4个萃取部位对免疫功能的影响,结果发现80%乙醇萃取物具有显著的免疫调节活性。随后进行的免疫调节试验结果显示,质量浓度为0.1 μg/ml的80%乙醇提取物表现出γ-干扰素正向调节作用,而高质量浓度(100 μg/ml)的80%乙醇提取物则表现出γ-干扰素负向调节作用。

3.7 其他作用

鳄嘴花乙醇提取物对离体大鼠膀胱有抑制收缩作用,且茎的作用优于叶的作用^[30]。在泰国及马来西亚,鳄嘴花还用于治疗蛇咬伤。

4 毒理研究^[31-33]

急性毒性实验表明,小鼠灌胃给予1.8 g/kg(相当于生药量7.52 g/kg)鳄嘴花叶甲醇提取物,小鼠未见死亡及不良反应,其半数致死量(LD₅₀)大于1.8 g/kg,给药组小鼠与对照组小鼠(给予同等剂量的蒸馏水)的离体器官质量无明显差异。亚急性

毒性实验结果显示, 鳄嘴花甲醇提取物并未对大鼠造成死亡及任何不利影响。可见, 鳄嘴花用作药物治疗疾病有着明显的优势, 无毒副作用或毒副作用较小。

5 临床应用

Kongkaew C 等^[18]将鳄嘴花用于临床治疗生殖器疱疹及带状疱疹, 其中治疗生殖器疱疹效果与阿昔洛韦相当, 治疗带状疱疹7 d痊愈率为78.57%。抗肿瘤作用及其他药理作用临床尚未见集中报道, 但民间许多肿瘤患者已有使用且效果良好, 故有待进一步研究以探索鳄嘴花治疗恶性肿瘤的临床应用前景。

6 结语

通过整理国内外关于鳄嘴花化学成分及药理作用方面的文献, 发现鳄嘴花营养价值丰富、民间用药历史悠久、具有较高的药用价值。目前, 鳄嘴花相关研究多见于泰国、马来西亚, 主要集中于化学成分及抗病毒、抗氧化、抗炎作用的研究, 对抗肿瘤方面的研究相对较少; 而我国相关报道更少, 且临床未见应用。众所周知, 肿瘤已成为危害人类健康的一大杀手, 其病死率仅次于心血管疾病, 且呈逐年上升趋势。现有的化学合成药物虽然抗肿瘤作用确切、疗效显著, 但不良反应大、长期应用易产生耐药性。鉴于中草药治疗疾病具有毒副作用小、靶点多的优势, 期待鳄嘴花在抗肿瘤及其他领域有更深入的研究和发展。

参考文献

[1] 王贤儿, 钟希文, 张文霞, 等. 基于忧遁草化学成分研究分析其抗肿瘤作用[J]. 中国药房, 2013, 24(43): 4 104.

[2] Dampawan P, Huntrakul C, Reutrakul V. Constituents of *Clinacanthus nutans* and the crystal structure of LUP- 20 (29)-ene-3-one[J]. *J Sci Soc Thailand*, 1977, 3(1): 14.

[3] 林级田, 李惠敏, 余竞光. 藤药扭序花化学成分的研究[J]. 中草药, 1983, 14(8): 1.

[4] 易博, 徐文彤, 邓盾, 等. 鳄嘴花叶氨基酸和微量元素分析及其化学成分研究[J]. 解放军药学报, 2012, 28(5): 396.

[5] Teshima K, Kaneko T, Ohtani K, et al. C-glycosyl flavones from *Clinacanthus nutans*[J]. *Natural Medicines*, 1997, 51(6): 557.

[6] Teshima K, Kaneko T, Ohtani K, et al. Sulfur-containing glucosides from *Clinacanthus nutans*[J]. *Phytochemistry*, 1998, 48(5): 831.

[7] 涂淑芬. 青箭化学成分及免疫调节活性之研究[D]. 高雄: 高雄医学大学天然药物研究所, 2012.

[8] Tu SF, Liu RH, Cheng YB, et al. Chemical constituents and bioactivities of *Clinacanthus nutans* aerial parts[J]. *Molecules*, 2014, 19(12): 20 382.

[9] Dechatiwongse Na Ayudhya T, Sakdarat S, Shuyprom A, et al. Chemical constituents of the leaves of *Clinacanthus nutans* Lindau[J]. *Thai Journal of Phytopharmacy*, 2001, 8(1): 1.

[10] Sakdarat S, Shuyprom A, Dechatiwongse Na Ayudhya T, et al. Chemical composition investigation of the *Clinacanthus nutans* Lindau leaves[J]. *Thai Journal of Phytopharmacy*, 2008, 13(2): 13.

[11] Tuntiwachwuttikul P, Pootaeng-on Y, Phansa P, et al. Ce-

rebrosides and a monoacylmonogalactosylglycerol from *Clinacanthus nutans*[J]. *Chem Pharm Bull*, 2004, 52(1): 27.

[12] Yong YK, Tan JJ, Teh SS, et al. *Clinacanthus nutans* extracts are antioxidant with antiproliferative effect on cultured human cancer cell lines[J]. *Evid Based Complement Alternat Med*, 2013, doi: 10.1155/2013/462751.

[13] 郭巨先, 杨暹. 华南主要野生蔬菜的脂肪酸成分分析[J]. 中国野生植物资源, 2004, 23(2): 47.

[14] Wanikiat P, Panthong A, Sujayanon P, et al. The anti-inflammatory effects and the inhibition of neutrophil responsiveness by *Barleria lupulina* and *Clinacanthus nutans* extracts[J]. *J Ethnopharmacol*, 2008, 116(2): 234.

[15] Yoosook C, Panpisutchai Y, Chaichana S, et al. Evaluation of anti-HSV-2 activities of *Barleria lupulina* and *Clinacanthus nutans*[J]. *J Ethnopharmacol*, 1999, 67(2): 179.

[16] Thongchai S, Ekalaksananan T, Pientong C, et al. Anti-herpes simplex virus type 1 activity of crude ethyl acetate extract derived from leaves of *Clinacanthus nutans* Lindau [J]. *J Sci Technol MSU*, 2008, 27(4): 319.

[17] Kunsorn P, Ruangrunsi N, Lipipun V, et al. The identities and anti-herpes simplex virus activity of *Clinacanthus nutans* and *Clinacanthus siamensis*[J]. *Asian Pac J Trop Biomed*, 2013, 3(4): 284.

[18] Kongkaew C, Chaiyakunapruk N. Efficacy of *Clinacanthus nutans* extracts in patients with herpes infection: systematic review and meta-analysis of randomised clinical trials[J]. *Complement Ther Med*, 2011, 19(1): 47.

[19] Sakdarat S, Shuyprom A, Pientong C, et al. Bioactive constituents from the leaves of *Clinacanthus nutans* Lindau[J]. *Bioorg Med Chem*, 2009, 17(5): 1 857.

[20] Vachirayonstien T, Promkhatkaew D, Bunjob M, et al. Molecular evaluation of extracellular activity of medicinal herb *Clinacanthus nutans* against herpes simplex virus type-2[J]. *Natural Product Research*, 2010, 24(3): 236.

[21] Thawaranantha D, Balachandra K, Jongtrakulsiri S, et al. In vitro antiviral activity of *Clinacanthus nutans* on varicella-zoster virus[J]. *Siriraj Hosp Gaz*, 1992, 44(4): 285.

[22] Sittiso S, Ekalaksananan T, Pientong C, et al. Effects of compounds from *Clinacanthus nutans* on dengue virus type 2 infection[J]. *Srinagarind Med J*, 2010, 25(Suppl): 272.

[23] Sookmai W, Ekalaksananan T, Pientong C, et al. The anti-papillomavirus infectivity of *Clinacanthus nutans* compounds[J]. *Srinagarind Med J*, 2011, 26(Suppl): 240.

[24] Choonharuangdej S, Amornvit P, Srithavaj T, et al. In vitro anti-Candida effect of thai herbs supplemented in tissue conditioner[J]. *International Medical Journal*, 2014, 21(3): 331.

[25] Arullappan S, Rajamanickam P, Thevar N, et al. In vitro screening of cytotoxic, antimicrobial and antioxidant activities of *Clinacanthus nutans* (acanthaceae) leaf extracts [J]. *Tropical Journal of Pharmaceutical Research*, 2014, 13(9): 1 455.

灯盏细辛的化学成分及其制剂的研究进展

夏 靛*(浙江绿城心血管病医院,杭州 310012)

中图分类号 R284;R283 文献标志码 A 文章编号 1001-0408(2016)01-0111-03

DOI 10.6039/j.issn.1001-0408.2016.01.36

摘要 目的:为进一步研究灯盏细辛新制剂提供参考。方法:以“灯盏细辛”“化学成分”“制剂”“吸收机制”“*Erigeron breviscapus*”“Chemical composition”“Preparation”“Absorption mechanism”等为关键词,组合检索2001年1月—2015年9月在PubMed、Elsevier、Wiley-Blackwell、Springer Link、中国知网、万方、维普等数据库及google中有关灯盏细辛的化学成分及各成分治疗效果局限性、灯盏细辛口服制剂、新的制剂设计思路并进行分析。结果与结论:共查阅到相关文献120篇,其中有效文献43篇。灯盏细辛制剂的主要质控指标为野黄芩苷和总咖啡酸酯,均存在生物利用度低的问题,利用现代药物制剂新技术是提高生物利用度的关键。但采取的新技术如将磷脂复合物与自分散纳米胶束结合来提高脂溶性、细胞水平的自乳化给药系统等新思路都有一定的局限性,需再进一步通过对其释药特性、体内转运过程、吸收动力学、生物利用度和药效进行相关性的系统研究。

关键词 灯盏细辛;化学成分;制剂;进展

灯盏细辛,又称灯盏花、灯盏菊、细辛草、土细辛等,始载于《滇南本草》。其因花似灯盏、根似细辛得名,为菊科植物短葶飞蓬 *Erigeron breviscapus* (Vant.) Hand.-Mazz. 的干燥全草^[1],是苗族、彝族、德昂族等少数民族习用草药,主要分布于云南、广西、贵州等地。功能主治为活血通络止痛、祛风散寒。灯盏细辛及其制剂除了用于缺血性脑血管病和心血管疾病外^[2],对肝炎^[3]、慢性肾小球肾炎^[4-5]、糖尿病^[6-7]、腰椎间盘突出^[8]、慢性阻塞性肺疾病^[9]、恶性肿瘤患者血小板升高^[10]等疾病也有较好的治疗作用。笔者以“灯盏细辛”“化学成分”“制剂”“吸收机制”“*Erigeron breviscapus*”“Chemical composition”“Preparation”“Absorption mechanism”等为关键词,组合检索2001年1月—2015年9月在PubMed、Elsevier、Wiley-Blackwell、Springer Link、中国知网、万方、维普等数据库及google中相关文献。结果,共查阅到相关文献120篇,其中有效文献43篇。现就有关灯盏细辛的化学成分及各成分其治疗效果局限性、灯盏细辛口服制剂、新的制剂设计思路作如下综述,以期为进一步研究灯盏细辛新制剂提供参考。

1 灯盏细辛的化学成分及各成分治疗效果局限性

- [26] 刘旭,郭文洁,黄丹民,等. 鳄嘴花正丁醇提取物对小鼠Heps肝癌的抑制作用[J]. 江苏大学学报:医学版, 2014, 24(3):211.
- [27] Pannangpetch P, Laupattarakasem P, Kukongviriyapan V, et al. Antioxidant activity and protective effect against oxidative hemolysis of *Clinacanthus nutans* (Burm.f) Lindau [J]. *Songklanakarin J Sci Technol*, 2007, 29(Suppl 1): 1.
- [28] Yuann JMP, Wang JS, Jian HL, et al. Effects of *Clinacanthus nutans* (Burm.f) Lindau leaf extracts on protection of plasmid DNA from riboflavin photoreaction[J]. *MC-Transaction on Biotechnology*, 2012, 4(1):45.
- [29] Ghasemzadeh A, Nasiri A, Jaafar HZE, et al. Changes in phytochemical synthesis, chalcone synthase activity and pharmaceutical qualities of sabah snake grass (*Clinacanthus nutans* L) in relation to plant age[J]. *Molecules*, 2014,

灯盏细辛由于在心脑血管疾病方面疗效确切,开发的成药剂型众多,涉及注射剂、颗粒剂、普通片、分散片、胶囊、合剂、滴丸等。灯盏细辛制剂的主要质控指标为野黄芩苷和总咖啡酸酯,两者也为灯盏细辛制剂的主要有效成分。总咖啡酸酯是由1~2分子咖啡酸与1分子奎宁酸缩合而成的咖啡酰奎宁酸,包括1,3-*O*-二咖啡酰奎宁酸和绿原酸等。野黄芩苷、1,3-*O*-二咖啡酰奎宁酸和绿原酸的化学结构式见图1。

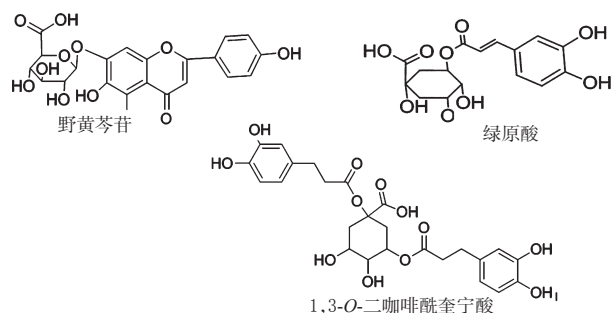


图1 野黄芩苷、1,3-*O*-二咖啡酰奎宁酸和绿原酸的化学结构式

- 19(11):17 632.
- [30] Choy WL, Hwi KK, Dublin N. Effects of *Clinacanthus nutans* and mebeverine hydrochloride on bladder activity [J]. *JMB*, 2011, 8(1):119.
- [31] P' ng XW, Akowuah GA, Chin JH. Acute oral toxicity study of *Clinacanthus nutans* in mice[J]. *IJPSR*, 2012, 3(11):4 202.
- [32] P' ng XW, Akowuah GA, Chin JH. Evaluation of the sub-acute oral toxic effect of methanol extract of *Clinacanthus nutans* leaves in rats[J]. *Journal of Acute Disease*, 2013, 2(1):29.
- [33] Chin JH, Akowuah GA, Sabu MC, et al. Sub-acute (28days) toxicity study of methanol leaves extract of *Clinacanthus nutans* in rats[J]. *Int J Pharm*, 2014, 4(2): 61.

*主管药师。研究方向:药物制剂。电话:0571-88857888-80413。
E-mail: xialiang2015521@163.com

(收稿日期:2015-07-08 修回日期:2015-09-17)
(编辑:余庆华)