

香附化学成分及药理作用研究进展^①

黄凯玲¹, 肖刚^{2②}, 黄建红³, 王慧¹, 潘鑫⁴

1. 右江民族医学院临床学院, 广西 百色 533000;
2. 右江民族医学院药学院, 广西 百色 533000;
3. 右江民族医学院检验学院, 广西 百色 533000;
4. 右江民族医学院护理学院, 广西 百色 533000

摘要: 香附具有疏肝理气, 调经止痛之功效。现代研究发现香附化学成分复杂, 药理作用广泛。本文对香附的现代化学成分及药理作用研究状况进行综述, 为香附进一步开发和利用提供理论参考。

关键词: 香附; 化学成分; 药理作用

中图分类号: R284.2

文献标识码: A

文章编号: 1001-5817(2014)03-0491-02

doi:10.3969/j.issn.1001-5817.2014.03.096

据2010年《中国药典》记载香附是莎草科植物莎草 *Cyperus rotundus* L. 的干燥根茎。秋季采挖, 去除胡须, 沸水煮或蒸后晒干, 或燎后直接晒干。香附辛、微苦、微甘, 平。归肝、脾、三焦经。有疏肝解郁, 理气宽中, 调经止痛功效。用于肝郁气滞, 胸胁胀痛, 疝气疼痛, 乳房胀痛, 脾胃气滞, 脘腹痞闷, 胀满疼痛, 月经不调, 经闭痛经^[1]。现代研究发现香附化学成分复杂, 药理作用广泛。作者就香附的化学成分及药理作用研究现状进行综述, 以期为深入研究开发香附资源提供理论参考。

1 化学成分

香附主要含有挥发油类成分, 其他化学成分还有黄酮类、糖类、三萜类等, 香附化学成分复杂, 结构多样。

1.1 挥发油类 挥发油是香附的最主要成分之一, 迄今已从香附挥发油中分离出了140多种成分, 主要包括多种单萜、倍半萜及其氧化物等。

1.1.1 萜类化合物 其中单萜类成分包括 α -蒎烯、 β -蒎烯、蒎烯、柠檬烯、 α -紫罗兰酮、桉叶素等。倍半萜类化合物有桉烷型倍半萜、丁香烷型倍半萜、愈创木烷型倍半萜、广藿香烷型倍半萜、杜松烷型倍半萜、胡椒烷型倍半萜及单环型倍半萜七种。香附挥发油的主要成分是桉烷型倍半萜中的 α -香附酮和 α -香附烯, 占香附挥发油相对含量的28.85%^[2]。

1.1.2 其他成分 香附挥发油其他的一些化学成分还有, 蒎酮、香附醇酮、马兜铃酸、白菴烯、广藿香烯酮等。

1.2 黄酮类 黄锁义等^[3]对香附总黄酮提取研究结果显示香附中总黄酮的含量为0.1864 mg/ml, 回收率为102.7%, 可见香附中总黄酮的纯度和产率均较高。徐燕等^[4]采用色谱技术对香附乙醇提取物的乙酸乙酯部位进行分离纯化得到9个黄酮类化合物, 其中包括4个单黄酮和5个双黄酮, 分别鉴定为: 山柰酚、木犀草素、槲皮素、西黄松黄酮、穗花杉双黄酮、去甲基银杏双黄酮、银杏双黄酮、异银杏双黄酮、金松双黄酮。

1.3 糖类 温东婷等^[5]用10倍香附量95% (体积分数) 的乙醇浸提液(四次合并) 浓缩成浸膏, 硅胶柱分离, 以石油醚、甲醇和氯仿洗脱, 甲醇洗脱部分为蔗糖, 香附中还有葡萄糖淀粉、果糖等糖类化合物^[6]。

1.4 其他成分 香附的化学成分还有三萜类化合物、甾醇类化合物、生物碱及微量元素等化学成分。三萜类化合物有oleanolic acid、3-O-(2-rhamnosylglucosyl) oleanolic acid、 β -sitosterol glucoside等; 甾醇类化合物有22-二烯- 3β -醇、8 α -表二氧-(20S, 22E, 24R)-麦角甾-6等^[6-7]。

2 药理作用

2.1 对子宫的作用 α -香附酮可抑制未孕大鼠离体子宫肌

的自发性收缩, 并可抑制由缩宫素引起的离体子宫肌的收缩, 缓解缩宫素致小鼠子宫的激烈收缩, 其作用呈剂量依赖性, 其作用机制可能与降低子宫平滑肌细胞内的前列腺素的合成与释放有关^[5,8]。另有研究发现在在四物汤的基础上增加香附、延胡索、木香而成的香附四物汤可以有效改善急性血瘀大鼠全血黏度、血沉、红细胞压积, 并能延长活化部分凝血活酶和凝血酶时间, 降低纤维蛋白原至正常水平, 有改善卵巢功能也作用^[9]。实验研究发现香附四物汤对离体培养的卵巢颗粒细胞增殖具有明显的促进作用, 其调节机体性激素生成作用可能与促进卵巢颗粒细胞生长效应相关^[10]。

2.2 对胃肠平滑肌的作用 香附具有抑制胃排空, 促进肠运输的作用^[11]。香附经二氧化碳超临界流体萃取后药渣的5种方法提取液对兔离体肠平滑肌均具有抑制作用, 能降低正常兔离体肠运动频率及张力, 香附对乙酰胆碱作用下离体肠管的张力幅度及频率都有抑制作用^[12]。

2.3 解热镇痛抗炎作用 α -香附酮能降低醋酸致小鼠扭体反应的次数, 但对热刺激致小鼠舔足的痛阈时不能延长, 与中枢镇痛药曲马多实验结果有差异, 推测 α -香附酮镇痛作用可能是通过外周机制^[13]。香附生品和醋制品均可减少福尔马林致痛大鼠模型缩腿、舔爪累计时间, 且醋制品作用更加显著, 其作用可能通过减少脊髓内c-fos蛋白表达, 阻止痛信号传导有关^[14]。香附醇提物、水提物都有较强的镇痛作用, 香附醇提物有较强的解热作用但水提物没有解热作用^[15]。观察香附有有机溶剂系统分离的提取部位对缩宫素所致小鼠痛经模型的影响。结果香附的石油醚、乙酸乙酯部位能明显减少缩宫素所致的小鼠扭体次数, 香附石油醚部位是香附挥发油以外的成分^[16]。利用二氧化碳超临界萃取技术萃取香附有效成分, 研究萃取物镇痛活性, 所得有效成分镇痛活性优于传统方法提取物^[17]。香附挥发油对角叉菜胶和蛋清诱发的大鼠足肿胀有一定程度的抑制作用, 而对二甲苯所致小鼠耳廓肿胀无明显影响^[18]。国外学者提出NO和Q2⁻是诱导炎症性疾病发病的重要因素。Seo等^[19]发现香附根茎甲醇提取物能显著抑制NO和Q2⁻产生, 采用Northern和Western凝胶电泳发现其抗炎作用是通过抑制诱生型一氧化氮合酶(iNOS)mRNA和蛋白表达减少NO的生成有关。

2.4 抗抑郁作用 通过小鼠悬尾实验、强迫游泳实验和开场实验模型, 测试香附95%乙醇提取物及其水提物的抗抑郁活性。证实香附醇提取物具有抗抑郁作用, 且呈现出良好量效关系^[20]。对香附醇提物及其溶剂分级萃取的不同极性部位进行小鼠抗抑郁实验筛选, 并通过反相高效液相色谱法测定小鼠大

① 基金项目: 右江民族医学院自治区级大学生创新训练项目(QJ CX201309)

② 通讯作者, E-mail: xiaogang_7954@163.com

脑额叶皮质中单胺类神经递质含量,对含量变化进行统计分析,以探讨香附抗抑郁作用机制。发现香附醇提取物正丁醇萃取部位和乙酸乙酯萃取部位对“行为绝望”动物模型有较明显的抗抑郁作用,其作用机制可能与调节脑内单胺类神经递质 DA 和 5-HT 的含量有关^[21]。

2.5 降血糖作用 香附降血糖作用国内研究较少,国外学者研究发现,香附根茎乙醇提取物可降低四氧嘧啶糖尿病模型小鼠血糖水平。体外实验发现其对 DPPH(1-苯基-2-苦基胂)有较强的清除能力,并与其降糖作用一致^[22]。香附乙醇提取物能显著抑制体外果糖介导的蛋白质糖基化模型糖终化产物(AGEs)形成及蛋白质的氧化^[23]。

2.6 抑制血小板聚集作用 国外学者对香附乙醇提取物在小鼠体内抗血小板作用进行了研究,发现香附乙醇提取物对胶原、凝血酶或 AA 引起的小血小板聚集有明显的抑制作用^[24]。

2.7 抗氧化作用 肖刚等^[25]的研究证实,从香附中提取的黄酮具有较强的抗氧化活性,而且自由基的清除率与浓度呈明显的量效关系,当黄酮浓度为 0.40 mg/L 时,其对 DPPH· 的清除率为 67.0%,·OH 的清除率为 28.5%,O₂· 的清除率为 25.5%。

2.8 促进离体脂肪组织分解 不同浓度的香附水煎剂灌流大鼠离体脂肪组织,发现其可促进脂肪组织释放游离脂肪酸,药理作用存在剂量效应关系。心得安、元钙液和异搏定可不同程度地阻断香附的作用,说明香附促进脂肪组织释放游离脂肪酸的作用部分经肾上腺素能 β 受体、异搏定敏感的 L 型 Ca²⁺ 通道及外 Ca²⁺ 内流介导^[26]。

3 讨论

香附资源丰富,目前香附化学成分及药理研究大部分还是集中在香附挥发油成分,部分药理活性研究较深入,作用机制也研究较透彻。香附中除挥发油外还含有其他大类成分,比如黄酮类、三萜类、生物碱等,他们的化学结构研究较少,药理活性研究也很少报道。但是三萜类、黄酮类化合物有着非常广泛的药理作用,因此对香附挥发油成分之外的其他化学成分进行研究,并研究其药理作用,应该可以为进一步开发利用香附资源提供理论支持。

参考文献:

- [1] 中国药典委员会. 中华人民共和国药典(一部)[M]. 北京: 中国医药科技出版社, 2010.
- [2] 金晶, 蔡亚玲, 赵钟祥, 等. 香附挥发油提取工艺及主要成分研究[J]. 中药材, 2006, 29(1): 490-492.
- [3] 黄锁义, 罗建华, 张丽丹, 等. 香附总黄酮的超声波提取工艺研究[J]. 时珍国医国药, 2008, 19(1): 141-142.
- [4] 徐燕, 张正竹, 邹忠梅. 香附的化学成分研究[J]. 中国药学杂志, 2010, 45(11): 818-821.
- [5] 温东婷, 张蕊, 陈世忠. 香附化学成分的分离及对未孕大鼠离体子宫肌收缩的影响[J]. 北京大学学报: 医学版, 2003, 35(1): 110-111.
- [6] 徐燕, 李大祥, 凌铁军, 等. 香附化学成分研究进展[J]. 中国实验方剂学杂志, 2010, 16(11): 214-218.
- [7] 段玉峰, 刘成德, 罗永红, 等. 中药及其水煎液中微量元素的测定及浸出率初步研究[J]. 中国药学杂志, 1993, 28(7): 396-399.
- [8] 李志强, 马力扬, 徐敬东, 等. 香附对未孕大鼠离体子宫肌收缩的影响[J]. 西安交通大学学报: 医学版, 2007, 28(4):

399-401.

- [9] 刘培, 宿树兰, 周卫, 等. 香附四物汤与四物汤对急性血瘀模型大鼠血液流变性及卵巢功能的影响[J]. 中国实验方剂学杂志, 2010, 16(8): 124-127.
- [10] 禹良艳, 华永庆, 刘培, 等. 香附四物汤对大鼠卵巢颗粒细胞增殖的影响及活性部位成分分析[J]. 南京中医药大学学报, 2011, 27(3): 238-242.
- [11] 王贺玲, 李岩, 白苗, 等. 理气中药对鼠胃肠动力的影响[J]. 世界华人消化杂志, 2004, 12(5): 1136-1138.
- [12] 李超, 孙秀梅, 张兆旺, 等. 香附 5 种方法提取液对兔离体肠平滑肌的影响[J]. 时珍国医国药, 2010, 21(1): 27-29.
- [13] 邓远辉, 刘瑜彬, 罗淑文, 等. α-香附酮的分离及其解热镇痛作用研究[J]. 中国新药与临床药理, 2012, 23(6): 620-623.
- [14] 李淑雯, 胡志方. 香附醋制前后对大鼠脊髓 c-fos 蛋白表达的影响[J]. 中药新药与临床药理, 2013, 24(2): 129-131.
- [15] 欧润妹, 邓远辉, 李伟英, 等. 香附不同提取物解热镇痛效应比较[J]. 山东中医杂志, 2004, 23(12): 740-742.
- [16] 夏厚林, 吴希, 董敏, 等. 香附不同提取物对痛经模型的影响[J]. 时珍国医国药, 2006, 17(5): 773-774.
- [17] 陈振华, 宋必卫, 苏香萍, 等. 香附二氧化碳超临界提取工艺及其镇痛活性研究[J]. 医药导报, 2006, 25(3): 192-194.
- [18] 解宇环, 沈映君, 纪广亮, 等. 香附、藿香挥发油抗炎、镇痛、解热作用的实验研究[J]. 四川生理科学杂志, 2005, 27(3): 731.
- [19] Seo WG, Pae HO, Oh GS, et al. Inhibitory effects of methanol extract of *Cyperus rotundus* rhizomes on nitric oxide and superoxide productions by murine macrophage cell line, RAW 264.7 cell[J]. J Ethnopharmacol, 2001, 76(1): 59-64.
- [20] 王君明, 马艳霞, 张蓓, 等. 香附提取物抗抑郁作用研究[J]. 时珍国医国药, 2013, 24(4): 778-781.
- [21] 周中流, 刘永辉. 香附提取物的抗抑郁活性及其作用机制研究[J]. 中国实验方剂学杂志, 2012, 18(7): 191-193.
- [22] Raut NA, Gaikwad NJ. Antidiabetic activity of hydroethanolic extract of *Cyperus I* alloxan induced diabetes in rats[J]. Fitoterapia, 2006, 77(7-8): 585-588.
- [23] Ardestani A, Yadanparast R. *Cyperus rotundus* suppresses ACE formation and protein oxidation in a model of fructose mediated protein glycoxidation[J]. Int J Biol Macromol, 2007, 41(5): 572-578.
- [24] Seo EJ, Lee DU, Kwak JH, et al. Antiplatelet effects of *Cyperus rotundus* and its component (+)-nootkatone[J]. J Ethnopharmacol, 2011, 135(1): 48-54.
- [25] 肖刚, 周琼花, 黄凯玲, 等. 香附黄酮体外抗氧化活性研究[J]. 安徽农业科学, 2012, 40(30): 16117-16119.
- [26] 司金超, 杜建海, 李伟, 等. 香附对大鼠离体脂肪组织释放游离脂肪酸的影响[J]. 中国药理与临床, 2002, 18(5): 30-32.

收稿日期: 2014-03-04