

苦苣菜属植物化学成分与药理作用研究进展

夏正祥¹, 唐中艳², 梁敬钰³, 王新宏^{1*}

(1. 上海中医药大学中药学院, 上海 201203; 2. 上海市闵行区医疗急救中心, 上海 201100;
3. 中国药科大学, 南京 210009)

[摘要] 通过中国科学院上海药物研究所图书数据库平台查阅国内外有关苦苣菜属植物的化学成分与药理作用的报道。对菊科苦苣菜属植物的化学成分及其药理作用研究的内容进行文献整理和分析。苦苣菜属的化学成分较为复杂, 研究主要集中在倍半萜内酯及其苷类成分, 药理活性的研究主要集中在抗肿瘤和抗氧化的作用上, 该属一些植物已作为保健食品。作者对近 20 年国内外报道该属成分的化学结构、主要生物活性及其在植物中的分布进行了归纳, 以期为该属植物的深入研究和开发提供一定参考依据。

[关键词] 苦苣菜属; 菊科; 倍半萜内酯; 化学成分; 药理

[中图分类号] R284.1, 285 **[文献标识码]** A **[文章编号]** 1005-9903(2012)14-0300-07

Progress on Chemical and Pharmacological Studies of Genus *Sonchus*

XIA Zheng-xiang¹, TANG Zhong-yan², LIANG Jing-yu³, WANG Xin-hong^{1*}

(1. School of Pharmacy Traditional Chinese Medicine of Shanghai, Shanghai 201203, China;
2. Minhang Bistrict First Aid Center, Shanghai 201100, China;
3. China Pharmaceutical University, Nanjing 210009, China)

[Abstract] We search data on chemical constituents and pharmacological effects of the genus *Sonchus* in recent years by the CAS Shanghai institute of materia database platform. The chemical constituents and pharmacological activities of the genus *Sonchus* were reviewed and analyzed. The chemical constituents of the genus *Sonchus* is more complex, so the current research focuses on sesquiterpene lactones and sesquiterpene lactone Glycosides. Its pharmacological research is now mainly in their antitumor and antioxidant effect. Now some plants from this genus have used as health food. This paper sums up the chemical structure, the main bio-activity and the distribution of chemical constituents according to the research on this genus over the last 20 years, hoping to give references for the further research and development of this genus.

[Key words] *Sonchus*; Compositae; sesquiterpene lactones; chemical constituents; pharmacology

苦苣菜属 *Sonchus* 为菊科 Compositae 草本植物。全属约有 50 种, 主要分布于欧洲、亚洲和非洲。在我国有 8 种, 他们分别为: 花叶滇苦菜 *S. asper*、沼生苦苣菜 *S. palustris*、苦苣菜 *S. oleraceus*、南苦苣菜 *S. lingiancus*、苣荬菜 *S. arvensis*、全

叶苦苣菜 *S. transcaspicus*、长裂苦苣 *S. brachyotus*、短裂苦苣菜 *S. uliginosus*^[1]。苦苣菜属植物在我国药用历史悠久, 早期的药学专著《神农本草经》和李时珍《本草纲目》都有记载, 其性味苦寒, 具有清热解毒, 消肿排脓, 凉血化瘀, 消食和胃, 清肺止咳, 益肝利尿之功效, 用于治疗急性痢疾、肠炎、痔疮肿瘤等症, 还具有抗肿瘤作用, 它们当中有些长期被作为我国民间传统中药^[2]。药材名苣荬菜, 来源于菊科苦苣菜属多年生草本植物苣荬菜 *S. arvensis* 的干燥幼嫩全草。又名北败酱作为败酱草的地方习用品在临床应用历史悠久, 曾收载于《中国药典》1977 年版^[3]。近几年来苦苣菜属植物受到国际保健食品界的重视, 并从中开发出多种保健食品。作

[收稿日期] 20120227(034)

[第一作者] 夏正祥, 博士, 讲师, 从事天然活性成分研究及新药开发, Tel: 021-51322201, E-mail: xzx5380537@163.com

[通讯作者] * 王新宏, 教授, 博导, 从事中药质量控制研究, Tel: 021-51322184, E-mail: wangxinh6020@126.com

为一类有很好药用价值前景的经济植物,许多科技工作者对它们的化学成分和生物活性进行了较为广泛的研究。本文对该属植物研究进行了综述。

1 化学成分

苦苣菜属植物化学成分的研究主要集中在倍半萜内酯及其苷类化合物,从该属中发现的新化合物以桉叶环-12,6 α -内酯骨架为主,近年发现了结构新颖的奎宁酸酯。其他骨架的倍半萜,黄酮,甾体和多酚类成分发现新化合物的概率较低。表明倍半萜内酯特别是桉叶环-12,6 α -内酯为该属的特征性成分,在苦苣菜属中植物中广泛分布,因此该类化合物在苦苣菜属植物化学分类学上具有重要意义。

1.1 倍半萜内酯 对于苦苣菜属植物化学成分的研究主要集中在倍半萜内酯和苷类化合物。以桉叶环-12,6 α -内酯最为常见,其母核可修饰的位点较少,如:3,4位,11,13位和4,14位碳成双键,近些年来发现的新化合物多以水溶性的苷类为主,1位和14位碳较为活泼,多被羟基氧化,羟基易与植物中存在较多的糖或者对羟基(甲氧基)苯甲酸反应生成苷或者酯的新化合物。如在1,14位的羟基被葡萄糖苷化的糖,在1,14位的羟基和对羟基(甲氧基)苯甲酸反应形成酯的新化合物。韩益丰^[4]从产自甘肃的全叶苦苣菜 *S. transcaspicus* 发现新的细胞毒活性的倍半萜苷(1,2,3,6);张占欣^[7]从产自山西的短裂苦苣菜 *S. uliginosus* 中发现新

的倍半萜的苷元及其酯的新化合物(4,5,7);徐杨军对产自甘肃的苦苣菜 *S. arvensis* 进行植物化学研究,发现了新的抗氧化的倍半萜酯(10)和已经报道过的苷^[5];笔者从产自湖南的苦苣菜 *S. arvensis* 进行了化学成分研究,发现了大陆植物中较为少见的磺酸酯的新倍半萜内酯(13)、新的苷(9,11,12)和稀有的乙酰化的苷元(8)^[5,24],并对其抗菌活性进行了测试,发现磺酸酯衍生物活性增加,体内代谢产物中也往往有磺酸化酶,植物和动物体内存在着同样的生物酶,提示磺酸化可为天然产物的结构修饰的一个重要方向。值得注意的是尽管徐杨军和笔者都对 *S. arvensis* 进行了化学成分研究,但是发现的代谢产物不一样,可能由于产地、环境、气候不一样,说明植物中的活性成分随着产地而有所区别。在国外,日本学者对该属植物研究较多,如 Shigeru S^[11]对产自巴基斯坦的花叶滇苦苣菜 *S. asper* 进行了研究,发现了一系列的桉叶环-12,6 α -内酯苷 sonchuside D-I(18-22,26-28);Toshi M^[12]对苦苣菜 *S. oleraceus* 研究发现了桉叶环-12,6 α -内酯苷 sonchuside C 和 D(23,25);但是由于可修饰位点相对较少,近年来从该属植物中发现该骨架类型的新化合物的研究率越来越少。由于桉叶环-12,6 α -内酯化合物活性显著,研究较为活跃。对该属的倍半萜苷类化合物总结如表1。

表1 新化合物来源

来源	化合物
<i>S. transcaspicus</i>	1,2,6,12 ^[4]
<i>S. arvensis</i>	8,9 ^[24] ; 11,13 ^[5] ; 3,10,33-35 ^[6] ; 36-37 ^[14] ; 38-42 ^[15] ; 43-46 ^[16] ; 47-48 ^[17] ; 51-53 ^[19] ; 54-55,56-65 ^[20]
<i>S. uliginosus</i>	4,5,7 ^[7]
<i>S. macrocarpus</i>	14,15 ^[9] ; 16-17 ^[10]
<i>S. asper</i>	18-22,26-28 ^[11] ; 31-32 ^[13]
<i>S. oleraceus</i>	23,25,29,30,67 ^[12] ; 49-50 ^[18] ; 58 ^[23] ; 68 ^[21] ; 64-67 ^[23]
<i>S. tuberiferinevent</i>	24 ^[8]

为方便该类型化合物的结构鉴定,对其波谱规律总结如下,¹H-NMR在确定取代基位置、立体构型等方面提供极其重要的信息。¹H-NMR谱图的峰形和偶合常数能够直观地确定1,6,8位取代基的构型。总结文献如下。

①14角甲基为单峰,化学位移在 δ 0.60~1.00,13位甲基为双峰, J 大约各为7 Hz,化学位移在 δ 0.90~1.20,15位大多为不饱和烯甲基质子,为单峰,化学位移在 δ 1.00~1.30。

②对于A/B环反式耦合的化合物,若1位有 β 氧取代基,则H-1的化学位移在 δ 3.30~4.90,大多呈dd四重峰, J 值大约各为7和10 Hz,这是因为H_{1 α} 与H_{2 β} 为反式直立键 $J_{1\alpha,2\beta}=10$ Hz,而 $J_{1\beta,2\alpha}=7$ Hz。若1位有 α 氧取代基,则H-1的化学位移要相应地在低场些,在 δ 3.40~5.50,同样是dd峰,但只有一个 J 值, $J_{1\alpha,2\beta}=J_{1\beta,2\alpha}=3$ Hz。

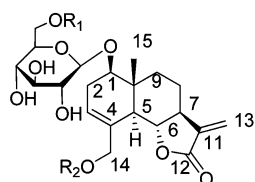
③6位上的羟基与12位羧基成五元环内酯,则H-6的

化学位移和裂分常数可以判断其取代基的构型,同时可以判断H-7的构型。对于B/C环反式耦合的化合物而言,若H-6的化学位移在 δ 3.60~4.60,6 β -H为三重峰(严格地讲应是dd峰,因偶合常数非常接近,重叠为三重峰,这是ABX系统中X部分的信号 $J_{5\alpha,6\beta}=J_{6\beta,7\alpha}=11$ Hz,即H-6显然有二个反位邻居H-5和H-7。这说明,在这种情况下6位取代为 α 构型。

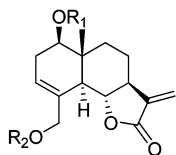
④对带有两个环外亚甲基的化合物, $\Delta^{11(13)}$ 烯氢的化学位移一般比 $\Delta^{4(15)}$ 在低场。一般情况下, $\Delta^{11(13)}$ 的 δ 6.00~6.50(d, $J=3$ Hz),和5.40~6.00(d, $J=3$ Hz)(α,β -饱和和- γ -内酯; $\Delta^{4(15)}$ 的 δ 4.40~5.00(d, $J=1$ Hz)和4.70~5.40(d, $J=1$ Hz)。

经过查阅该属的植物化学研究,将近些年分离得到新倍半萜化合物总结如图1~4。

此外,其他类型的倍半萜在苦苣菜属植物中较少,主要有 β -紫罗兰酮苷,愈创木烷型和吉马烷等类型。如Zeinab

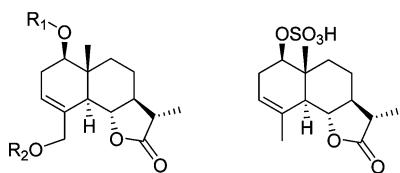


	R ₁	R ₂
1	H	<i>p</i> -HOC ₆ H ₄ CH ₂ COO-
2	<i>p</i> -HOC ₆ H ₄ CH ₂ COO-	<i>p</i> -HOC ₆ H ₄ CH ₂ COO-
3	<i>p</i> -HOC ₆ H ₄ CH ₂ COO-	<i>p</i> -MeOC ₆ H ₄ CH ₂ COO-



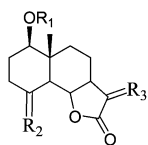
	R ₁	R ₂
4	H	H
5	H	<i>p</i> -HOC ₆ H ₄ CH ₂ COO-
6	H	<i>p</i> -MeOC ₆ H ₄ CH ₂ COO-

图 1 化合物 1~6 分子结构式



	R ₁	R ₂
7	H	H
8	Ac	Ac
9	H	Glc
10	H	<i>p</i> -HOC ₆ H ₄ CH ₂ COO-
11	<i>p</i> -HOC ₆ H ₄ CH ₂ COO-	Glc
12	Glc	H

图 2 化合物 7~13 分子结构式



	R ₁	R ₂	R ₃
14	H	H, CH ₂ OH	CH ₂
15	H	H, CH ₂ OH	CH ₃
16	H	H, α -CH ₂ OH	CH ₃
17	H	H, α -CHO	H, α -CH ₃
18	Glc	H, α -CHO	CH ₂
19	Glc	H, α -CH ₂ OH	CH ₂
20	Glc	H, α -CHO	H, α -CH ₃
21	Glc	H, α -CH ₂ OH	H, α -CH ₃
22	H	H, α -CH ₂ O-Glc	H, α -CH ₃
23	Glc	CH ₂	CH ₂

图 3 化合物 14~23 分子结构式

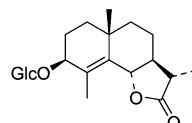
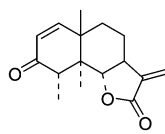
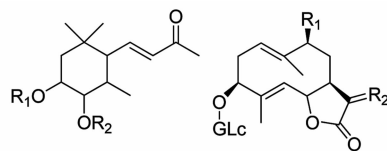


图 4 化合物 24~25 分子结构式

倍半萜内酯苷 picrisides B-C (29-30) 和愈创木烷内酯苷 Glucozaluzanin C (33), Macroclinside (34), Crepidiaside (35); 埃及学者^[13] Amr M. Helal 对产自埃及的花叶滇苦菜 *S. asper* 研究发现结构新颖的吉马烷吡喃烷倍半萜内酯苷 (31-32)。见图 5~7。



	R ₁	R ₂	R ₁	R ₂
26	H	Glc	29	H
27	H	Glc—Api	30	<i>p</i> -OMeC ₆ H ₄ COO-
28	Glc	H		H, α -Me
				CH ₂

图 5 化合物 26~30 分子结构式

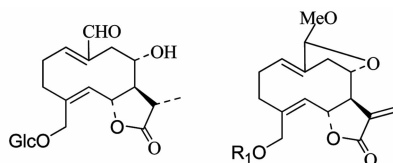


图 6 化合物 31~32 分子结构式

图 6 化合物 31~32 分子结构式

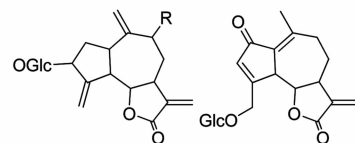


图 7 化合物 33~35 分子结构式

图 7 化合物 33~35 分子结构式

1.2 奎宁酸酯 我国学者许杨军从甘肃产的 *S. arvensis*^[6] 分离得到的 3 个抗氧化的奎宁酸酯 (36-38), 为自然界罕见的对羟基苯乙酸酯类化合物, 代表一类结构新颖的多聚酚类的天然产物, 该发现丰富了该类化合物群, 也促进了该属的植物研究。见图 8。

1.3 黄酮类化合物 黄酮类化合物是苦苣菜属植物中分得到比较多的一类, 因其在自然界广泛分布, 因此研究并不多。我国学者渠桂荣^[14-15, 17] 首先报道 *S. arvensis* 对全草的研究, 利用硅胶柱层析获得了一系列的黄酮类化合物, 洋芹素 (apigenin) (39), 木犀草素-7-*O*- β -D-葡萄糖苷 (40), 金合欢素 (acacetin) (41), 山奈素 (kaempferol) (42), 柯伊利素 (chrysoeriol) (43), 异鼠李素 (isorhamnetin) (44), 槲皮素-3-

M^[10] 对采自巴基斯坦的花叶滇苦菜 *S. asper* 进行了研究, 发现了一系列的 β -紫罗兰酮苷 Sonchuionoside A-C (26-28); Toshi M^[12] 对苦苣菜 *S. oleraceus* 研究发现了吉马烷吡喃烷

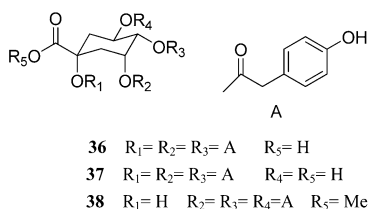
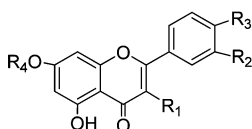


图8 化合物 36~38 分子结构式

O- α -*L*-鼠李糖苷 (kaempferol-3-*O*- α -*L*-rhamnoside) (45) 和山奈酚 3,7-*O*- α -*L*-二鼠李糖苷 (46)。徐燕^[18]从苦苣菜 *S. oleraceus* 中分离得到一系列的黄酮包括芹菜素-7-*O*- β -*D*-葡萄糖醛酸甲酯(47), 芹菜素-7-*O*- β -*D*-葡萄糖醛酸乙酯(48), 芹菜素-7-*O*- β -*D*-葡萄糖醛酸苷。见图9。



	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
39	H	H	OH	H
40	H	OH	OH	Glc
41	H	H	OCH ₃	H
42	OH	H	OH	H
43	H	OCH ₃	OH	H
44	H	OCH ₃	OH	H
45	ORha	OH	OH	H
46	ORha	H	OH	Rha
47	H	H	OH	Glucuronide methylester
48	H	H	OH	Glucuronide ethylester

图9 化合物 39~48 分子结构式

1.4 甘油酸酯类化合物 美国学者 Putul B 等人在对苦苣菜 *S. arvensis* 地上部分的乙醇提取液的研究中,并没有得到预期的倍半萜内酯类化合物,而得到了3个甘油酸酯苷类化合物(49, 50, 51)^[25],笔者也发现了2个甘油酸酯(52, 53)^[24]结构如图10。

1.5 其他类化合物

1.5.1 三萜 该类化合物在自然界分布较广。笔者对 *S. arvensis* 进行了化学成分研究已分离得到的化合物如下^[20,24],主要为齐墩果烷、蒲公英烷三萜。见图11。

1.5.2 甾体 甾体类化合物在自然界分布较广。且在菊科中分布较广,笔者对 *S. arvensis* 进行了化学成分研究已分离得到的化合物如下^[20,24],其骨架包括麦角甾烷、豆甾烷等。见图12。

1.5.3 香豆素 笔者曾从对 *S. Arvensis* 进行了化学成分研究已分离得到的化合物如下(64,65)^[24]。见图13。

1.5.4 糖 Mousa A A 等人从苦苣菜 *S. oleraceus* 的地上部分的甲醇提取液中新的二糖(72)^[21]。见图14。

2 药理活性

2.1 保肝作用 苣菜 *S. arvensis* 花性平、味甘,用于治疗急性黄疸型传染性肝炎。药理研究表明,苣菜水煎液对 CCl₄ 肝损伤有显著保护作用,能够显著对抗 CCl₄ 肝损伤小鼠的 SGPT 升高,升高小鼠的肝糖元含量,缩短其巴比妥钠睡

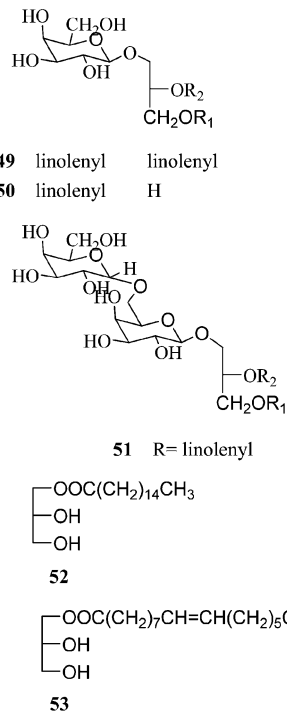


图10 化合物 49~53 分子结构式

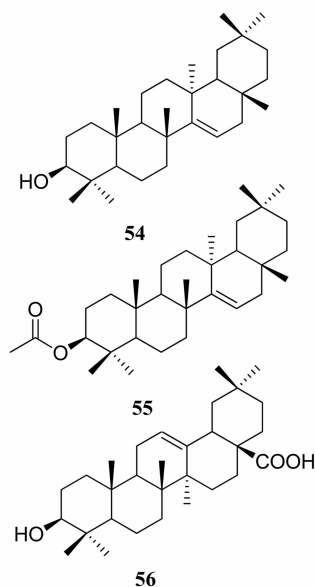


图11 化合物 54~56 分子结构式

眠时间,并有显著的促进小鼠胆汁分泌、促进肝再生作用,从而减轻肝细胞损伤的病理过程。其机制可能是通过对抗脂质过氧化以及提高机体的能量贮备,从而表现出对肝细胞的保护作用^[26]。卢新华对苣菜总黄酮的保肝效应研究发现:用 CCl₄ 肝损伤模型,以 GPT, GOT 为指标,用乙醇所致小鼠肝损伤模型,以 GPT, GSH 为指标,分析苦苣菜总黄酮的保肝效应,发现其能使 CCl₄ 肝损伤所致 GPT, GOT 下降,能使乙醇所致 GPT 值下降,减轻乙醇所致肝 GSH 的耗竭,能明显降低 CCl₄ 所致小鼠肝组织的病理改变,抑制肝脂质过氧化^[27]。1997 年时,许其兴申请的专利为“乙肝转阴散”的中

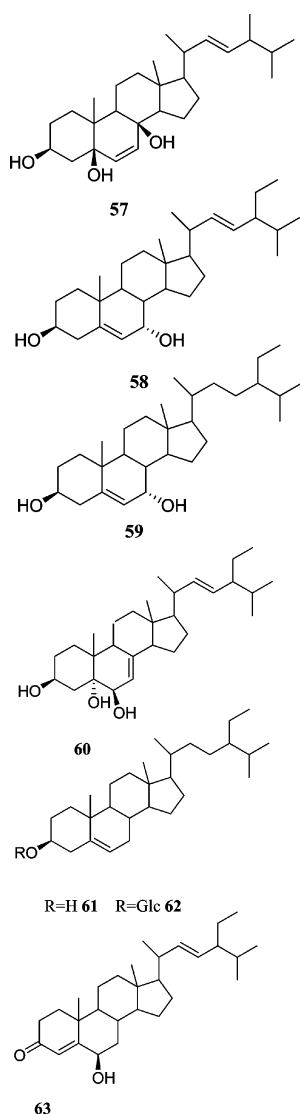


图 12 化合物 57 ~ 63 分子结构式

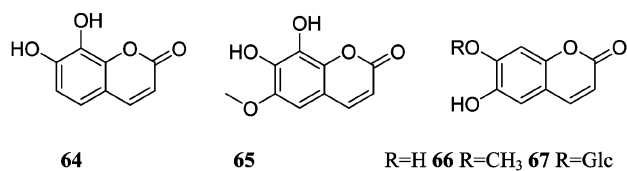


图 13 化合物 64 ~ 67 分子结构式

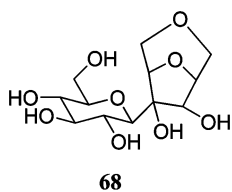


图 14 化合物 68 分子结构式

成药中含有苜蓿菜。专利号为‘9710973’。

2.2 抗肿瘤作用 最新研究 Conforti F 发现苜蓿菜有效成

分对人类癌细胞中有明显的抑制作用^[28]。韩益丰等^[4]对全叶苦苣菜中 4 种新发现的桉烷内酯型倍半萜进行药理实验证明,其中 3 个化合物对大肠埃希菌、变形杆菌有抗菌活性。2 个化合物在体外实验中对 SMMC-7721, HELA 和 B-16 细胞有细胞毒活性。应用美蓝脱色法在试管内测定白血病患者血细胞的脱氢酶活性,苜蓿菜提取液对急性淋巴细胞型白血病、急性及慢性粒细胞型白血病患者白细胞的脱氢酶均有明显的抑制作用,但对前两种患者白细胞的呼吸并无抑制作用^[29]。Hazra 等研究发现,苜蓿菜的乙醇提取物在 300 ~ 700 mg·kg⁻¹ 剂量下给予阿利克腹水瘤小鼠有明显的抑瘤作用。苦苣菜全草含抗肿瘤成分,在小鼠大腿肌肉接种肉瘤 S37 后第 6 日,皮下注射苦苣菜的酸性提取液,6 ~ 48 h 后杀死小鼠,肉眼及显微镜观察,均可看见肉瘤受到明显的抑制。日本学者 Hata KI^[30] 研究发现花叶滇苦菜和苦苣菜的乙醇提取物对小鼠黑素瘤细胞有显著的诱导分化活性。其中的活性成分可能为羽扇豆醇。以多种浓度的羽扇豆醇处理 B162F2 细胞 72 h,测定细胞生长和黑色素含量,发现羽扇豆醇浓度超过 5 μmol·L⁻¹ 时,能促进黑色素生物合成,浓度为 20 μmol·L⁻¹ 时抑制黑色素细胞的增殖;浓度达到 50 μmol·L⁻¹ 时细胞也没有脱离,维持率 > 95%,故羽扇豆醇对 B162F2 细胞的作用不是细胞毒作用而是诱导分化作用。

2.3 心血管系统作用

牟艳玲^[31] 采用常压耐缺氧、饥饿小鼠生存时间、急性心肌缺血模型、电刺激诱发血栓形成模型等实验方法,观察苦苣提取物的心血管药理活性。结果:苦苣提取物灌胃给药 12.5, 6.3 g·kg⁻¹ 均能明显增加小鼠常压下耐缺氧存活时间,能够延长饥饿小鼠的生存时间。3.2 g·kg⁻¹ 可明显降低大鼠血液黏度,延长大鼠体内血栓形成时间。苦苣提取物 3.2, 1.6 g·kg⁻¹ 对由垂体后叶素所致冠状动脉痉挛引起的大鼠急性心肌缺血具有明显的拮抗作用。结论:苦苣菜提取物具有活血化瘀、抗心肌缺血的心血管保护作用。

苜蓿菜水提取液静脉及腹腔注射可降低正常家兔的血压,腹腔注射可对抗肾上腺素的升压作用。对兔耳血管有直接扩张作用。灌胃给药可降低小鼠食饵性及腹腔注射蛋黄乳所致的高胆固醇血症。苜蓿菜可明显缩短由 BaCl₂ 诱发大鼠心律失常持续时间,使 CCl₄ 诱发小鼠室颤发生率低于对照组;有明显对抗肾上腺素诱发心律失常的作用;可延长离体兔左心房不应期,并提示其抗心律失常机制可能是通过阻断 α 受体所致^[32]。

2.4 抗炎作用

卢新华等^[33] 用二甲苯致小鼠耳廓肿胀、腹腔注射醋酸致小鼠腹腔染色剂渗出和角叉菜胶诱导大鼠后足爪肿胀等方法观察苦苣菜提取物的抗炎作用。研究结果认为:苦苣菜提取物具有明显的抗炎作用,该作用与抗氧化和减少炎症细胞因子如 IL-1B, TNF-α 的生成有关。

2.5 抗氧化作用

林敏等^[34] 研究了苦苣菜水提取液对亚硝基和羟基自由基的清除活性以及影响清除亚硝基的因素。结果表明:浸提液对 NO₂-和由 Fenton 反应产生的·OH 均有

很强的清除作用,且在一定浓度范围内随浓度的增大而增强。在一定条件下,提取液对亚硝基和·OH的最大清除率分别可达75.68%和100%。

McDowell A^[35]对*S. oleraceus*的提取物采用细胞抗氧化实验,其抗氧化能力与蓝莓花色苷相当,而对正常的干细胞的毒性小,其质量浓度小于 $100\text{ g}\cdot\text{L}^{-1}$,表明该提取可作为对人身有益的保健品。

3 小结和展望

苦苣菜属植物,其生命力强尤其在冬季不枯萎,易于生长,适合于大规模栽培种植,有很大的开发应用前景。

倍半萜内酯类化合物不仅为苦苣菜属一类重要的活性成分,而且在苦苣菜属植物化学。

分类学具有重要的意义。该属存在着含量较多的桉叶烯内酯和少量的吉马烷内酯和愈创木烷内酯。倍半萜内酯的生合成研究表明,三类倍半萜内酯有着共同的生合成的前体吉马烷内酯,三种骨架的倍半萜内酯的共存于苦苣菜属进一步证明其生合成途径的结论。此外这三类骨架的倍半萜内酯还在菊科的蒲公英属*Taraxacum*,苦苣菜属*Ixeris*,莴苣属*Lactuca*等,从植物化学分类学角度进一步证明了其亲缘关系,均为菊科的菊苣族Lactuceae。

倍半萜内酯化合物在菊科中广泛分布,约有400余种。这些倍半萜内酯多具有抑制肿瘤效果,尤其在抗疟作用意义重大。我国科学家屠呦呦发明的青蒿素就是从菊科植物中药黄花蒿中提取出来。

苦苣菜属植物中的苦苣菜*S. oleraceus*,苣荬菜*S. arvensis*作为一种中药材,已在临床上使用,国内外有大量有关的化学和生物的报道文献以及相关的专利,但是还未从中开发出理想的新药,药效学的物质基础还不够明确,可从以下几个方面开始研究:①以临床应用的生物活性为指导,进行相关的药物活性研究,进行导向分离,追踪活性部位和成分。②对于所获取的化合物,通过化学结构修饰和生物转化研究,以期获取毒性低、活性强的成分。③开展药物代谢动力学的研究,并对活性成分进行深入研究。

[参考文献]

[1] 中国科学院《中国植物志》编辑委员会. 中国植物志[M]. 北京:科学出版社,1997:66.

[2] 中国中医研究院中药研究所. 全国中草药名鉴[M]. 北京:人民卫生出版社,1996:797.

[3] 肖培根. 新编中药志. 第三卷[M]. 北京:化学工业出版社,2002:55261.

[4] Han Y F, Zhang Q, Gao K, et al. New sesquiterpenes from *Sonchus transcaspicus* [J]. *Planta Medica*, 2005, 71(6): 543.

[5] Xia Z X, Qu W, Lu H Y, et al. Sesquiterpene lactones from *Sonchus arvensis* L. and their antibacterial activity against *Streptococcus mutans* ATCC 25175 [J]. *Fitoterapia*, 2010, 81(4): 424.

[6] Xu Y J, Sun S B, Sun L M, et al. Quinic acid esters and sesquiterpenes from *Sonchus arvensis* [J]. *Food Chemistry*, 2008, 111(1): 92.

[7] Zhang Z X, Xie W D, Li P L, et al. Sesquiterpenoids and phenylpropane derivatives from *Sonchus uliginosus* [J]. *Helvetica Chimica Acta*, 2006, 89(12): 2927.

[8] Bermejo B J, Bretón J L, Fajardo M, et al. Terpenoids from the *sonchus*. VI. Tuberiferine from *Sonchus tuberifersvent* [J]. *Tetrahedron Letters*, 1967, 36(8): 3475.

[9] Zeinab M, Sawsan E M, Masduoa A, et al. Sesquiterpene lactones from *Sonchus macrocarpus* [J]. *Phytochemistry*, 1984, 23(5): 1105.

[10] Zeinab M, Sawsan E M, Masouda A, et al. Two eudesmanolides from *Sonchus macrocarpus* [J]. *Phytochemistry*, 1983, 22(5): 1290.

[11] Shigeru S, Toshio M, Akira U, et al. Sesquiterpene lactoneglycosides and ionone derivative glycosides from *Sonchus asper* [J]. *Phytochemistry*, 1989, 28(12): 3399.

[12] Toshi M, Seigo F. Studies on sesquiterpene glycosides from *Sonchus oleraceus* L. [J]. *Chem Pharm Bull*, 1987, 35(7): 2869.

[13] Amr M H, Norio N, Hesham E A, et al, Sesquiterpene lactone glucosides from *Sonchus asper* [J]. *Phytochemistry*, 2000,53(4): 473.

[14] 渠桂荣,王素贤,吴立军,等. 裂叶苣荬菜化学成分的研究[J]. 中国中药杂志,1993, 18(2): 101.

[15] 渠桂荣,刘建,李新新,等. 裂叶苣荬菜黄酮成分的研究[J]. 中草药,1995, 26(5): 233.

[16] 蒋雷,姚庆强,解砚英,苣荬菜化学成分的研究[J]. 食品与药品,2009, 11(3): 27.

[17] 渠桂荣,李新新,刘建,等. 裂叶苣荬菜黄酮苷成分的研究[J]. 中国中药杂志,1996, 21(5): 292.

[18] 徐燕,梁敬钰. 苦苣菜的化学成分[J]. 中国药科大学学报,2005, 36(5): 411.

[19] Putul B, Nabin C. A monoacyl galactosylglycerol from *Sonchus arvensis* [J]. *Phytochemistry*, 1983, 22: 1741.

[20] 夏正祥,梁敬钰. 苣荬菜的甾体和酚类化学成分[J]. 中国天然药物,2010,8(4): 267.

[21] Mousa A A, Hazimi A. A novel discachaxide from *Sonchus oleraceus* [J]. *Orient J Chem*, 1990, 6(3): 205.

[22] 胡佩卓,邹传宗,祝英. 苦苣菜脂溶性化学成分[J]. 西北植物学报,2005, 25(6): 1234.

[23] 冯锁民,鲁会侠,杨金玉. 苦苣菜化学成分研究[J]. 西北药学杂志,1998, 13(3): 1081.

干法制粒技术在中药浸膏粉制粒过程中应用

董德云^{*}, 臧深², 金日显¹, 李霞¹, 潘海军¹

(1. 中国中医科学院实验药厂, 北京 100700; 2. 中国中医科学院中药研究所, 北京 100700)

[摘要] 引用26篇参考文献,对国内外干法制粒技术的发展状况进行归纳。通过采集模型药品样本,建立颗粒得率的标准回归方程,应用多元线性回归分析方法考察浸膏粉的休止角、压缩度、黏聚力、含水量等物理性质和制粒工艺中的送料速度、滚轮转速、滚轮压力等参数与颗粒剂得率的相关关系。针对成形率低的物料,以一次成形率为考察指标,正交试验筛选辅料配比;结合干法制粒机技术参数,从统计学角度系统分析影响中药浸膏粉干法制粒的可行性与高效性的主要因素,为干压制粒技术在中药品种中的应用提供参考。

[关键词] 干法制粒; 回归方程; 正交实验; 节能环保

[中图分类号] R283.6 **[文献标识码]** A **[文章编号]** 1005-9903(2012)14-0306-04

Application of Dry Granulation Technology in Granulation Process of Extract Powder from Chinese Traditional Medicine

DONG De-yun^{*}, ZANG Chen², JIN Ri-xian¹, LI Xia¹, PAN Hai-jun¹

(1. Experiment Drug Factory, China Academy of Chinese Medical Sciences, Beijing 100700, China;
2. Institute of Chinese Materia Medicine, China Academy of Chinese Medical Sciences, Beijing 100700, China)

[Abstract] This article referred to 26 references, to summarized development of dry granulation technology at home and abroad. Standard regression equation of yield of particle was established by collecting model drug

[收稿日期] 20120418(009)

[通讯作者] * 董德云,副主任技师,从事制药机械研究,Tel:010-84036439,E-mail:baihu468@sohu.com

- [24] Xia Z X, Yao J C, Liang J Y. Two new sesquiterpene lactones from *Sonchus arvensis* [J]. Chemistry Natural Compounds, 2012, 48(1):47.
- [25] Putul B, Nabin C. A monoacyl galactosylglycerol from *Sonchus arvensis* [J]. Phytochemistry, 1983, 22(8): 1741.
- [26] 郭月英,周晓荣,范文哲,等.裂叶苦苣菜保肝作用的研究[J].沈阳药学院学报,1994,11(4):278.
- [27] 卢新华,陈虎云,戴俊,等.苦苣菜总黄酮对实验性肝损伤的保护作用[J].中国现代医学杂志,2002,12(3):8.
- [28] Conforti F, Ioele G, Statti G A, et al. Antiproliferative activity against human tumor cell lines and toxicity test on Mediterranean dietary plants[J]. Food and Chemical Toxicology, 2008, 46(10):3325.
- [29] 中国医学科学院药用植物资源开发研究所等.中药志[M].2版.北京:人民卫生出版社,1988:731.
- [30] Hata K, Ishikawa K, Hori K, et al. Differentiation-inducing activity of lupeol, a lupane-type triterpene from Chinese dandelion root (Hokouei-kon), on a mouse melanoma cell line [J]. Biol Pharm Bull, 2000, 23(8):962.
- [31] 牟艳玲,解砚英,周玲,等.苦苣菜提取物的心血管保护作用研究[J].中国临床药理学与治疗学,2007,12(11):1241.
- [32] 张洪民,渠桂荣,吴立军.裂叶苦苣菜研究进展[J].中草药,1997,28(11):691.
- [33] 卢新华,唐伟军,谢应桂.苦苣菜提取物抗炎作用的实验研究[J].中国新医药科技,2006,13(4):240.
- [34] 林敏,安红钢,白俊杰,等.苦苣菜提取液对亚硝基及·OH清除活性的研究[J].中国野生植物资源,2008,27(4):53.
- [35] Mc Dowell A, Thompson S, Stark M, et al. Antioxidant activity of puha (*Sonchus oleraceus* L.) as assessed by the cellular antioxidant activity (CAA) assay [J]. Phytother Res, 2011, 25(12):1876.

[责任编辑 邹晓翠]