

中药苦参的化学成分与药理研究

侯凯¹, 单丽梅², 王玉珉¹ (1. 包头市第四医院, 包头 014030; 2. 包头市第二医院, 包头 014040)

苦参(*Sophora flauescens* Ait)系药用豆科槐属植物苦参的干燥根,性寒味苦,入心、脾、肾、三经,具有清热、除湿、杀虫之功效。本品始载于我国最早的药学文献《神农本草经》,列为中品,谓其“主心腹积气,微痼积聚”,能“安五脏,定志益精”。《本草经百种录》称“此认味治也,苦入心寒除火,故苦参专治心经之火”。近年来,国内外医学界对苦参研究活跃,做了大量工作,现结合研究情况将其化学成分与药理研究现状作一综述。

1 化学成分

苦参含有多种生物碱和黄酮类物质。生物碱主要有苦参碱(Martrine),氧化苦参(Oxymarfrine),羟基苦参碱(Sophoranal),1-臭豆碱(1-Anugyrin),1-甲基金雀花碱(1-Methyleytisin),1-野靛叶碱(1-Baptitolin),1-槐根碱(1-Sophouerpin)等;以苦参碱和氧化苦参碱为主。黄酮类主要有苦参酮(Kurarinon),去甲苦参酮(Norkuraninon),异苦参酮(Isokurarinon),苦参啶(Kurardin),苦参醇(Kurarinol),三叶豆攘槐苷(Trifolirhigin),异脱水淫羊藿素(Isoanhyaroicaritin)等。

2 药理研究

2.1 抗寄生虫作用

目前苦参已作为治疗滴虫性阴道炎、泌尿系感染、包括淋菌性尿道炎等的首选药物,其疗效确切,另有报道用于治疗血丝虫病引起的乳糜尿显效^[1],均表明了苦参有抗滴虫、淋病双球菌、血丝虫等寄生虫的作用。另外苦参能抑制蓝化贾第鞭毛虫^[2]。

2.2 抗病原体作用

2.2.1 抗病毒

2.2.1.1 抗肝炎病毒。用其成分苦参碱治疗乙型肝炎,结果表明:对促进 HbsAg 和 HbeAg 转阴,促使肝功能恢复正常有显著疗效。

2.2.1.2 苦参碱有抗柯萨奇病毒的显著作用,苦参总碱抗柯萨奇 B 病毒的作用机理是不影响病毒吸附,穿入,但它能进入细胞内影响病毒的生物合成,主要表现为抑制病毒蛋白

质的合成^[3]。苦参总碱有效成分还对柯萨奇 Bbm 病毒感染的 Hela 细胞有保护作用^[4]。

2.2.2 抑菌

2.2.2.1 苦参总黄酮、苦参总生物碱、氧化苦参碱每片圆形滤纸(直径 12cm)浸渍药物浓度在 128mg 时,对金黄色葡萄球菌有抑制作用,苦参乙醇提取物在每片浸渍的药物浓度为 60mg 时,对金黄色葡萄球菌有抑制作用^[5]。

2.2.2.2 抗皮肤真菌:古今大量的临床运用表明,用苦参治疗体癣、股癣、手足癣等有很好的疗效。通过试管内抑菌试验,证实了苦参对常见的多种皮肤癣菌有较好的抑制作用。

2.2.2.3 抗痢疾杆菌等:目前已通过大量的临床报道证实了苦参有确切的抗痢疾杆菌及沙门氏菌属的作用。

2.2.2.4 抗结合杆菌:《备急方》记载,苦参“治瘰癧”贝润浦医师用苦参配伍生牛膝,用于经抗痨药物治疗无效的 5 例结核性淋巴结炎,3 例治愈,1 例有效,提示苦参有抗结合杆菌的作用^[6]。

2.3 对心血管系统的作用

用蟾蜍、家兔、大鼠等多种动物实验证明苦参对心血管系统有以下作用:

2.3.1 抗心律失常:大量的临床运用及实验结果表明,苦参有肯定的抗心律失常作用。目前苦参已作为治疗各类心律失常,尤其是快速心律的主要药物。苦参的抗心律失常的作用机理是多方面的:其苦参碱能减低心脏的异位节律性,并有某种对抗?受体的作用;氧化苦参碱能减慢右心房的自动节律。槐果碱能对抗室性心律失常。另外,用苦参等治疗房颤取效也似乎显示了苦参具有强心药物样作用。

2.3.2 扩血管作用,苦参能扩张冠状动脉,增加冠状动脉血流量,能扩张离体兔的肾及耳血管,但对后肢血管无明显影响。

2.3.3 有一定程度的降压作用。

2.3.4 能延长小白鼠在常压下的耐缺氧时间。

2.4 对呼吸系统的作用

苦参碱注射于实验动物,发现能引起中枢性呼吸抑制。临床报道在哮喘发作期用苦参煎剂口服,可控制哮喘的发作^[7],证实苦参有平喘作用。

2.5 对消化系统作用

苦参碱减少巨噬细胞分泌 IL-1, IL-2 和 TNF^[8],具有防治中毒性肝炎及慢性肝炎的作用,苦参碱有防治四氯化碳诱发的肝纤维化的作用,能显著减轻肝细胞变性,坏死及肝纤维组织的形成,同时降低不同实验阶段血清谷丙转氨酶,透明质酸酶和肝组织羟脯氨酸含量,推测苦参碱可能通过抑制单核-巨噬细胞,枯否细胞分泌 TNF 等细胞因子而达到防治肝纤维化的作用^[9]。苦参碱能有效对抗胃粘膜损伤,对盐酸、乙醇、消炎痛等引起的肾粘膜损伤有明显保护作用^[10]。

2.6 对中枢神经系统的作用

苦参具有显著的中枢镇静作用。以相当于生药 15g/kg 给豚鼠灌胃后,5min 内即出现安静、闭眼、嗜睡、头颈竖毛、呼吸变慢,耿群关等实验研究证明,苦参能增加小鼠脑中 γ -氨基丁酸(GABA)和甘氨酸(GLY)的含量。已知 GABA 是脑内抑制性神经递质,其有镇静、催眠、抗惊厥、稳定精神及肢体活动的作用。GLY 是哺乳类动物脊髓内重要的抑制性神经递质,脊髓前角中润绍细胞为 CLY 能神经元,对运动神经元的活动呈负反馈抑制。苦参的镇静和催眠作用与其能增加脑和脊髓中 GABA 和 GLY 有关。

2.7 对血液系统的作用

实验表明,喂养高脂饲料可引起动物脂类代谢紊乱和血液流变学指标的异常而导致血瘀。苦参碱可以防止或减轻高脂模型动物血液流变学指标的异常变化,对大鼠已增高的血清胆固醇有一定降低作用,对高甘油三酯血症有明显治疗效果。苦参有保护骨髓升高白细胞的作用。

2.8 利尿作用

《长沙药解》“苦参清湿热而通淋涩也”。用苦参煎剂或苦参碱给兔灌服,或用苦参注射于皮下、静脉、腹腔或肌肉注射均有利尿作用。

2.9 免疫抑制作用

苦参对渗出性炎症有明显的抑制作用实验表明,小鼠肌注苦参碱能明显对抗巴豆油诱发的小鼠和大鼠耳壳的炎症,且对抗作用随用量的增加而增强;对角叉菜诱发的大鼠后肢炎症及小鼠腔注射冰醋酸诱发的渗出性炎症,均有明显抑制作用,这一作用与氢化可的松相似,管内试验发现苦参碱能明显对抗血清蛋白的加热变性,对红细胞的溶血现象也有抑制。氧化苦参碱能通过改变细胞内 Ca^{2+} 和 CAMP 的水平,起到免疫抑制作用。

2.10 抗肿瘤作用

苦参碱明显减弱 HeLa 细胞的电泳迁移速度,HeLa 细胞其敏感性高于正常细胞,细胞核是药物作用敏感靶位,苦参碱提高小鼠 TH/TS 比值,加强了 LAK 细胞的免疫效应,提高了肿瘤细胞对 LAK 细胞的敏感性,与苦参碱联用,可促进 LAK 细胞的体内治疗效果^[11]。苦参碱抑制细胞膜上 Na, K-ATP 酶,并激活腺苷酸环化酶,具有抑制肿瘤细胞生长作用。采用血清药理学方法进行离体实验,苦参煎剂及血清均有明显的抗肿瘤活性。苦参对 K562 红白血病细胞系有诱导分化作用,使细胞增殖能力明显下降,使其逆向转正常细胞分化,是非常有希望的治疗肿瘤的非杀伤性方法之一。

2.11 毒性作用

苦参毒性较低,用苦参浸膏给小鼠灌胃后半数致死量为 14.5g/kg。当用量过大时出现流涎、步态不稳、呼吸急促、脉搏增快、兴奋、惊厥,最后可因呼吸停止而死亡。个别病人注射苦参碱后可出现过敏反应,表现为过敏性皮炎,荨麻疹等。

综上所述,苦参是一味功效多样,临床应用广泛的药物。药源丰富,价格便宜,使用方便,值得推广。目前虽在化学成分及药理研究方面取得一些新进展,但对药理作用的认知仍有欠缺,如苦参碱治疗乙型肝炎的疗效可能不是通过提高免疫功能来实现,还有在抗胃粘膜损伤的作用机理方面有待于进一步研究。

参考文献

- [1] 张国权. 安徽中医杂志, 1996, (1): 21.
- [2] 牛奎之. 中国中西医结合杂志, 1995, 15(11): 698.
- [3] 刘晶星, 陈福祥, 陈瞩霞, 等. 上海第二医科大学学报, 1996, 16(3): 183.
- [4] 陈婷婷, 陈曙霞, 刘晶星, 等. 中国实验临床免疫学杂志, 1997: 9(1): 18.
- [5] 楼之岑, 秦波. 常用中药材品种整理和质量研究. 北京医科大学中国协和医科大学联合出版社, 195.
- [6] 晋文. 云南中医中药杂志, 1997, 18(2): 48-50. [7] 东宏. 中医研究, 1996: (2): 46.
- [8] 胡振林, 张俊平, 钱定华, 等. 中国药理学报, 1996, 17(3): 259.
- [9] 陈伟忠, 张俊平, 许肴, 等. 第二军医大学学报, 1996, 17(5): 424.
- [10] 白音夫, 莫日根. 中草药, 1996, 27(12): 729.
- [11] 毛惠生, 刘洪隐, 李川, 等. 中国肿瘤临床, 1996, 23(1): 799.

收稿日期: 2003-03-25