8(3): 753-759.
[80] XU F J, PING Y, MA J, et al. Comb-shaped copolymers composed of hydroxypropyl cellulose backbones and cationic poly((2-dimethyl amino)ethyl methacrylate) side chains for gene delivery [J]. Bioconjug Chem, 2009, 20(8): 1449-1458.
[81] KUROSAKI T, KITAHARA T, FUMOTO S, et al. Chondroitin sulfate capsule system for efficient and secure gene delivery [J]. J Pharm Pharm Sci, 2010, 13(3): 351-361.
[82] PATHAK A, KUMAR P, CHUTTANI K, et al. Gene expression, biodistribution, and pharmacoscintigraphic evaluation of chondroitin sulfate-PEI nanoconstructs mediated tumor gene therapy [J]. ACS Nano, 2009, 3(6): 1493-1505.
[83] LIU P, GOU M, YI T, et al. Efficient inhibition of an intraperitoneal xenograft model of human ovarian cancer by HSulf-1 gene delivered by biodegradable cationic heparin-polyethyleneimine nanogels [J]. Oncol Rep, 2012, 27(2): 363-370.

收稿日期：2014-07-11

中药豨莶草的化学成分及其药理作用研究进展

滕天立，徐世芳，陈峰阳，李晓誉，高丽娟，叶益萍*(浙江省医学科学院药物研究所，天然药物化学研究实验室，杭州 310000)

摘要：目的 探讨菊科植物豨莶草化学成分及其近年来药理作用研究进展。**方法** 检索、整理、归纳国内外有关豨莶草化学成分及其药理作用研究文献。**结果与结论** 豨莶草主要含有二萜类、倍半萜类、黄酮类等化学成分，豨莶草提取物及化学成分具有抗炎镇痛、抗过敏、心血管保护等生物活性。

关键词：豨莶草；化学成分；药理作用；二萜类；倍半萜类；抗炎；抗过敏；抗血栓
中图分类号：R285.5 **文献标志码：**A **文章编号：**1007-7693(2015)02-0250-011
DOI: 10.13748/j.cnki.issn1007-7693.2015.02.030

Research Progress in Chemical Constituents and Pharmacological Activities of Siegesbeckiae Herba

TENG Tianli, XU Shifang, CHEN Fengyang, LI Xiaoyu, GAO Lijuan, YE Yiping*(*Natural Medicine Research Laboratory, Institute of Materia Medica, Zhejiang Academy of Medical Sciences, Hangzhou 310000, China*)

ABSTRACT: OBJECTIVE To discuss the advance on chemical constituents and pharmacological effects of Siegesbeckiae Herba. **METHODS** The literatures about chemical constituents and pharmacological effects of Siegesbeckiae Herba were searched, collected and summarized. **RESULTS & CONCLUSION** The main chemical constituents of Siegesbeckiae Herba consist of diterpenes, sesquiterpenes, flavonoids. The extracts and chemical constituents of Siegesbeckiae Herba have anti-inflammatory and analgesic, anti-allergic and cardiovascular protection biological activities.

KEY WORDS: Siegesbeckiae Herba; constituents; pharmacological activities; diterpenes; sesquiterpenes; anti-inflammatory; anti-allergic; antithrombotic

豨莶草为常用中药，始载于唐代《新修本草》，别名有肥猪草、肥猪菜、粘苍子、粘糊菜、黄花仔、粘不扎、珠草等。中国药典 2010 年版收载中药豨莶草为菊科植物豨莶 *Siegesbeckia orientalis* L.、腺梗豨莶 *Siegesbeckia pubescens* Makino 或毛梗豨莶 *Siegesbeckia glabrescens* Makino 的干燥地上部分，具有祛风湿、利关节、解毒之功效。其单味制剂豨莶丸收入中国药典 2010 年版，主要用于风湿痹痛、筋骨无力、腰膝酸软、四肢麻痹、半身不遂、风湿湿疮。豨莶草常用于复方制剂，如莶桐丸用于治疗风湿性关节炎，复方豨莶草胶囊用于治疗痛风性关节炎。由于豨莶草的临床应用广泛，国内外学者对豨莶草进行了较深入的化学、药理学研究，笔者对其 3 种原植物的化学成分、药理作用进行了综述。

1 豨莶草的化学成分研究

豨莶草化学成分的研究已有几十年，但大多集中于其醇提取部分的化学成分研究。豨莶草中主要含有二萜类、倍半萜类、黄酮类等成分，3 种原植物所含成分类似，其中二萜及其苷类成分被

基金项目：浙江省中医药科技项目(2014ZB026)
作者简介：滕天立，男，硕士生 Tel: (0571)88215624 E-mail: tianli_sky@163.com *通信作者：叶益萍，女，博士，研究员 Tel: (0571)88215624 E-mail: yeyiping2005@163.com

认为是豨莶草最主要的活性成分。

1.1 二萜类

豨莶(*Siegesbeckia orientalis* L.)中的二萜类成分分为海松烯型二萜类、贝壳杉烷型二萜类和链状二萜类，见表 1 和图 1~3。豨莶中二萜类成分豨莶苷(darutoside，P-2)及其苷元豨莶苦味三醇(darutigenol，P-1)最早由法国人 Diara 分离得到[1]，后又报道[2]从中得到豨莶甲素(orienta-lin A，P-7)、豨莶乙素(orientalin B，P-8)等二萜类成分，此外还有部分链状二萜类成分[3]：19-乙酰基-12-酮基-10,11-二氢栊牛儿基橙花醇(19-acetoxy-12-*oxo*-10,11-dihydrogeranylnero-l，G-1)、19-乙酰基-15-过氧氢-12-酮基-13,14*E*-去氢-10,11,14,15-四氢栊牛儿基橙花醇(19-acetoxy-15-hydroperoxy-12-oxo-13,14*E*-dehydro- 10,11,14,15-tetrahydrogeranylnerol，G-2)、19-乙酰基-15-羟基-12-酮基-13,14*E*-去氢-10,11,14,15-四氢栊牛儿基橙花醇(19-acetoxy-15-hydroxy-12-*oxo*-13,14*E*-dehydro-10,11,14,15-tetrahydrogeranylnerol，G-3)。最近报道[4]从豨莶中分离到 7*β*-羟基豨莶精醇(7*β*-hydroxydarutigenol，P-22)、9*β*-羟基豨莶精醇(9*β*-hydroxy-darutigenol，P-23)、16-*O*-乙酰基豨莶精醇(16-*O*-acetyldarutigenol，P-24)、15,16-二-*O*-乙酰基豨莶苷(15,16-di-*O*-acetyldarutoside，P-25)、16-*O*-乙酰基豨莶苷(16-*O*-acetyldarutosi-de，P-26)、对映-14*β*,16-环氧-8-海松烯-2*α*,15*α*,19-三醇(ent-14*β*,16-epoxy-8-pimar-ene-2*α*,15*α*,19-triol，P-34)、对映-14*β*,16-环氧-8-海松烯-3*β*,15*α*-二醇(ent-14*β*,16-epoxy-8-pimarene-3*β*,15*α*-diol，P-37)等新化合物。

腺梗豨莶(*Siegesbeckia pubescens* Makino)中的二萜类成分也主要分为海松烯型和贝壳烷型，除豨莶苷、豨莶苦味四醇外，还有腺梗豨莶甲苷(pubeside A，P-9)、腺梗豨莶乙苷(pubeside B，P-10)、腺梗豨莶丙苷(pubeside C，P-11)、腺梗豨莶丁苷(pubeside D，P-12)、大花酸(grandifloric acid，K-1)、豨莶醇(siegesbeckiol，K-4)、豨莶酸(siegesbeckic acid，K-12)等[5-6]，见表 1、图 1~3。近年来报道的新二萜类成分[7]：对映-2*β*,15,16-三羟基海松烷-8(14)-烯-19-羧酸(ent-2*β*,15,16-trihydroxypimar-8(14)-en-19-oic acid，P-27)、对映-16-乙酰基-3*α*,15-二羟基-14*α*-过氧氢海松烷-7-烯-3*α*-*O*-*β*-吡喃葡萄糖苷(ent-16-acetoxy-3*α*,15-dihydroxy-14*α*-hydroperox-ypimar-7-en-3*α*-*O*-*β*-glucopyranoside，P-29)、对映-3*α*,15,16-三羟基海松烷-8(14)-烯-15,16-丙酮合物(ent-3*α*,15,16-trihydroxypimar-8(14)-en-15,16-acetonide，P-32)、对映-3*α*,15,16-三羟基海松烷-8(14)-烯-3*α*-*O*-*β*-吡喃葡糖苷-15,16-丙酮化合物(ent-3*α*,15,16-tri-hydroxypimar-8(14)-en-3*α*-*O*-*β*-glucopyranoside-15,16-acetonide，P-33)4 个海松烷型二萜类，以及对映-18-乙酰基-17-羟基-16*β*H-贝壳杉烷-19-羧酸(ent-18-acetoxy-17-hydroxy-16*β*H-kau-ran-19-oic acid，K-15)、对映-18-乙酰基-17-异丁酰基-16*β*H-贝壳杉烷-19-羧酸(ent-18-acetoxy-17-isobutyryloxy-16*β*H-kauran-19-oic acid，K-16)、对映-18-乙酰基-16*α*,17-二羟基贝壳杉烷-19-羧酸(ent-18-acetoxy-16*α*,17-dihydroxykauran-19-oic acid，K-17)、对映-18-乙酰基-16*α*-羟基-17-异丁酰基贝壳杉烷-19-羧酸(ent-18-acetoxy-16*α*-hydroxy-17-isobutyryloxykauran-19-oic acid，K-18)等 4 个贝壳杉烷型二萜类。谢可辉等[8]分离得到海松烷型新化合物对映-16-去甲-3-酮基-海松烷-8(14)-烯-15-醛(ent-16-nor-3-oxo-pimar-8(14)-en-15-al，P-38)。

毛梗豨莶(*Siegesbeckia glabrescens* Makino)中二萜类成分也含有豨莶苷及其苷元豨莶苦味三醇、豨莶苦味醇酸，另还有豨莶新苷(neodarutoside，P-3)[9]，见表 1 和图 1~2。后来傅宏征等[10]又从中分离得到对映-18-羟基-贝壳杉烷-16-烯-19-羧酸(ent-18-hydroxy-kauran-16-en-19-oic acid，K-2)、对映贝壳杉烷-16*β*,17,18-三醇(ent-kauran-16*β*,17,18-triol，K-5)、对映贝壳杉烷-16*β*,17-二羟基-19-羧酸(ent-16*β*,17-dihydroxykauran-19-oic acid，K-8)。

1.2 倍半萜类

豨莶草中分离得到的倍半萜相对二萜类要少，比较早报道的化合物[11-12]orientalide (S-1)，后来又发现 orientalide 1b (S-2)、orientalide 4a (S-3)。目前已经从豨莶中分离得到的该类化合物有 9*β*-羟基-8*β*-异丁酰基木香烯内酯(9*β*-hydroxy-8*β*-isobutyryloxycostunolide，S-5)、9*β*-羟基-8*β*-甲基丙烯酰基氧基木香烯内酯(9*β*-hydroxy-8*β*-methacrcryloyloxycostunoli-de，S-6)、14-羟基-8*β*-异丁酰基木香烯内酯(14-hydroxy-8*β*-isobutyryl-oxycostunolide，S-7)、8*β*-异丁酰基-14-醛基-木香烯内酯(8*β*-isobutyryloxy-14-al-costunolide，S-8)、9*β*,14-二羟基-8*β*-异丁酰基木香烯内酯(9*β*,14-dihydroxy-8*β*-isobutyryloxycostunolide，S-9)等十几

表 1 豨莶草中二萜类成分

Tab. 1 Diterpenes from Siegesbeckiae Herba

分类	编号	化合物名称	存在的原植物	文献
海松烯型二萜类	P-1	豨莶精醇(darutigenol)	*Siegesbeckia glabrescens*	[12]
	P-2	豨莶苷(darutoside)	*Siegesbeckia pubescens*	[12]
	P-3	豨莶新苷(neodarutoside)	*Siegesbeckia glabrescens*	[9]
	P-4	12-羟基奇任醇(12-hydroxykirenol)	*Siegesbeckia pubescens*	[23]
	P-5	2-酮基-16-乙酰基奇任醇(2-keto-16-acetyloxykirenol)	*Siegesbeckia pubescens*	[23]
	P-6	奇任醇(kirenol,2*α*,15, 16,19-tetrahydroxypimar-8(14)-ene)	*Siegesbeckia pubescens*	[6]
	P-7	豨莶甲素(orientalin A)	*Siegesbeckia orientalis*	[2]
	P-8	豨莶乙素(orientalin B)	*Siegesbeckia orientalis*	[2]
	P-9	腺梗豨莶甲苷(pubeside A)	*Siegesbeckia pubescens*	[5]
	P-10	腺梗豨莶乙苷(pubeside B)	*Siegesbeckia pubescens*	[5]
	P-11	腺梗豨莶丙苷(pubeside C)	*Siegesbeckia pubescens*	[5]
	P-12	腺梗豨莶丁苷(pubeside D)	*Siegesbeckia pubescens*	[5]
	P-13	对映-2*β*,15,16-三羟基海松烷-8(14)-烯[ent-2*β*,15,16-trihydroxy-pimar-8(14)-ene]	*Siegesbeckia orientalis*	[3]
	P-14	对映-15,16-二羟基-2-酮基-海松烷-8(14)-烯[ent-15,16-dihydroxy-2-oxo-pimar-8(14)-ene]	*Siegesbeckia orientalis*	[3]
	P-15	对映-15,16,18-三羟基-2-酮基-海松烷-8(14)-烯 [ent-15,16,18-trihydroxy-2-oxo-pimar-8(14)-ene]	*Siegesbeckia orientalis*	[3]
	P-16	对映-2*α*,15,16,19-四羟基海松烷-8(14)-烯[ent-2*α*,15,16,19-tetrahydroxypimar-8(14)-ene]	*Siegesbeckia orientalis*	[24]
	P-17	对映-15-酮基-2*β*,16,19-三羟基海松烷-8(14)-烯 [ent-15-oxo-2*β*,16,19-trihydroxypimar-8(14)-ene]	*Siegesbeckia orientalis*	[24]
	P-18	对映-2-酮基-15,16-二羟基海松烷-8(14)-烯-16-*O*-*β*-吡喃葡糖苷 [ent-2-oxo-15,16-dihydroxypimar-8(14)-en-16-*O*-*β*-glucopyranoside]	*Siegesbeckia orientalis*	[24]
	P-19	对映-2-酮基-15,16,19-三羟基海松烷-8(14)-烯 [ent-2-oxo-15,16,19-trihydroxypimar-8(14)-ene]	*Siegesbeckia orientalis*	[24]
	P-20	对映-2-酮基-3*β*,15,16-三羟基海松烷-8(14)-烯-3-*O*-*β*-吡喃葡糖糖苷 [ent-2-oxo-3*β*,15,16-trihydroxypimar-8(14)-en-3-*O*-*β*-glucopyranoside]	*Siegesbeckia orientalis*	[24]
	P-21	对映-2*β*,15,16,19-四羟基海松烷-8(14)-烯-19-*O*-*β*-吡喃葡萄糖苷 [ent-2*β*,15,16,19-tetrahydroxypimar-8(14)-en-19-*O*-*β*-glucopyranoside]	*Siegesbeckia orientalis*	[24]
	P-22	7*β*-羟基豨莶精醇(7*β*-hydroxydarutigenol)	*Siegesbeckia orientalis*	[4]
	P-23	9*β*-羟基豨莶精醇(9*β*-hydroxydarutigenol)	*Siegesbeckia orientalis*	[4]
	P-24	16-*O*-乙酰基豨莶精醇(16-*O*-acetyldarutigenol)	*Siegesbeckia orientalis*	[4]
	P-25	15,16-二-*O*-乙酰基豨莶苷(15,16-di-*O*-acetyldarutoside)	*Siegesbeckia orientalis*	[4]
	P-26	16-*O*-乙酰基豨莶苷(16-*O*-acetyldarutoside)	*Siegesbeckia orientalis*	[4]
	P-27	对映-2*β*,15,16-三羟基海松烷-8(14)-烯-19-羧酸 [ent-2*β*,15,16-trihydroxypimar-8(14)-en-19-oic acid]	*Siegesbeckia pubescens*	[7]
	P-28	hythiemoside B	*Siegesbecikia orientalis*	[25]
	P-29	对映-16-乙酰基-3*α*,15-二羟基-14*α*-过氧氢海松烷-7-烯-3*α*-*O*-*β*-吡喃葡萄糖苷 (ent-16-acetoxy-3*α*,15-dihydroxy-14*α*-hydroperoxypimar-7-en-3*α*-*O*-*β*-gluco-pyranoside)	*Siegesbeckia pubescens*	[7]
	P-30	奇任醇丙酮合物(2*α*,15,16,19-tetrahydroxypimar-8(14)-ene-15-acetonide)	*Siegesbeckia pubescens*	[26]
	P-31	腺梗豨莶戊苷(pubeside E)	*Siegesbeckia pubescens*	[5]
	P-32	对映-3*α*,15,16-三羟基海松烷-8(14)-烯-15,16-丙酮合物 [ent-3*α*,15,16-trihydroxypimar-8(14)-en-15,16-acetonide]	*Siegesbeckia pubescens*	[7]
	P-33	对映-3*α*,15,16-三羟基海松烷-8(14)-烯-3*α*-*O*-*β*-吡喃葡糖苷-15,16-丙酮化合物 [ent-3*α*,15,16-trihydroxypimar-8(14)-en-3*α*-*O*-*β*-glucopyranoside-15,16-acetonide]	*Siegesbeckia pubescens*	[7]
	P-34	对映-14*β*,16-环氧-8-海松烯-2*α*,15*α*,19-三醇(ent-14*β*,16-epoxy-8-pimar-ene-2*α*,15*α*,19-triol)	*Siegesbeckia orientalis*	[4]
	P-35	对映-12*α*,16-环氧-2*β*,15*α*,19-三羟基海松烷-8(14)-烯 (ent-12*α*,16-epoxy-2*β*,15*α*,19-trihydroxypimar-8(14)-ene)	*Siegesbeckia orientalis*	[24]
	P-36	对映-12*α*,16-环氧-2*β*,15*α*,19-三羟基海松烷-8-烯 (ent-12*α*,16-epoxy-2*β*,15*α*,19-trihydroxypimar-8-ene)	*Siegesbeckia orientalis*	[24]
	P-37	对映-14*β*,16-环氧-8-海松烯-3*β*,15*α*-二醇(ent-14*β*,16-epoxy-8-pimar-ene-3*β*,15*α*-diol)	*Siegesbeckia orientalis*	[4]
	P-38	对映-16-去甲-3-酮基-海松烷-8(14)-烯-15-醛[ent-16-nor-3-oxo-pimar-8(14)-en-15-al]	*Siegesbeckia pubescens*	[8]

续表 1

分类	编号	化合物名称	存在的原植物	文献
贝壳杉烷型二萜类	K-1	大花酸(grandifloric acid)	*Siegesbeckia pubescens.*	[6]
	K-2	18-羟基-贝壳杉烷-16-烯-19-羧酸(18-hydroxy- kauran-16-en-19-oic acid)	*Siegesbeckia glabrescens*	[10]
	K-3	对映-16*β*-17-二羟基贝壳杉烷-19-羧酸-16*β*-17-丙酮合物 (ent-16*β*,17-dihydroxykauran -19-oic acid-16*β*,17-acetonide)	*Siegesbeckia pubescens*	[26]
	K-4	豨莶醇(siegesbeckiol)	*Siegesbeckia pubescens*	[6]
	K-5	对映贝壳杉烷-16*β*,17,18-三醇(ent-kauran-16*β*,17,18-triol)	*Siegesbeckia glabrescens*	[10]
	K-6	对映-16*β*,17,18-三羟基贝壳杉烷-19-羧酸(ent-16*β*,17,18-trihydroxy-kauran-19-oic acid)	*Siegesbeckia pubescens*	[27]
	K-7	腺梗豨莶苷(siegesbeckioside)	*Siegesbeckia pubescens*	[6]
	K-8	对映-16*β*,17-二羟基贝壳杉烷-19-羧酸(ent-16*β*,17-dihydroxykauran-19-oic acid)	*Siegesbeckia glabrescens*	[10]
	K-9	对映贝壳杉烷-19*β*,17-二醇(ent-kauran-19*β*,17-diol)	*Siegesbeckia glabrescens*	[16],[26]
	K-10	16*α*H-豨莶甲醚酸(16*α*H-siegesmethyletheric acid)	*Siegesbeckia pubescens*	[17],[26]
	K-11	对映-16*α*H,17-羟基贝壳杉烷-19-羧酸 (ent-16*α*H,17-hydroxykauran-19-oic acid)	*Siegesbeckia pubescens*	[6]
	K-12	豨莶酸(siegesbeckic acid)	*Siegesbeckia pubescens*	[6]
	K-13	豨莶脂酸(siegesesteric acid)	*Siegesbeckia orientalis*	[18]
	K-14	豨莶乙醚酸(siegesetheric acid)	*Siegesbeckia orientalis*	[18]
	K-15	对映-18-乙酰基-17-羟基-16*β*H-贝壳杉烷-19-羧酸 (ent-18-acetoxy-17-hydroxy-16*β*H-kauran-19-oic acid)	*Siegesbeckia pubescens*	[7]
	K-16	对映-18-乙酰基-17-异丁酰基-16*β*H-贝壳杉烷-19-羧酸 (ent-18-acetoxy-17-isobutyryloxy-16*β*H-kauran-19-oic acid)	*Siegesbeckia pubescens*	[7]
	K-17	对映-18-乙酰基-16*α*,17-二羟基贝壳杉烷-19-羧酸 (ent-18-acetoxy-16*α*,17-dihydroxykauran-19-oic acid)	*Siegesbeckia pubescens*	[7]
	K-18	对映-18-乙酰基-16*α*-羟基-17-异丁酰基贝壳杉烷-19-羧酸 (ent-18-acetoxy-16*α*-hydroxy-17-isobutyryloxykauran-19-oic acid)	*Siegesbeckia pubescens*	[7]
	K-19	对映-16*β*H,17-异丁酰基-贝壳杉烷-19-羧酸 (ent-16*β*H,17-isobutyryloxy-kauran-19-oic acid)	*Siegesbeckia glabrescens*	[28]
	K-20	对映-16*β*H,17-乙酰基-18-异丁酰基-贝壳杉烷-19 羧酸 (ent-16*β*H,17-acetoxy-18-isobutyryloxy-kauran-19-oic acid)	*Siegesbeckia glabrescens*	[28]
	K-21	对映-16*β*H,17-羟基-贝壳杉烷-19-羧酸(ent-16*β*H,17-hydroxy-kauran-19-oic acid)	*Siegesbeckia glabrescens*	[28]
链状二萜类	G-1	19-乙酰基-12-酮基-10,11-二氢栊牛儿基橙花醇 (19-acetoxy-12-oxo-10,11-dihydrogeranylnerol)	*Siegesbeckia orientalis*	[3]
	G-2	19-乙酰基-15-过氧氢-12-酮基-13,14E-去氢-10,11,14,15-四氢栊牛儿基橙花醇 (19-acetoxy-15-hydroperoxy-12-oxo-13,14E-dehydro-10,11,14,15-tetrahydr-ogeranylnerol)	*Siegesbeckia orientalis*	[3]
	G-3	19-乙酰基-15-羟基-12-酮基-13,14E-去氢-10,11,14,15-四氢栊牛儿基橙花醇 (19-acetoxy-15-hydroxy-12-oxo-13,14E-dehydro-10,11,14,15-tetrahydrogera-nylnerol)	*Siegesbeckia orientalis*	[3]

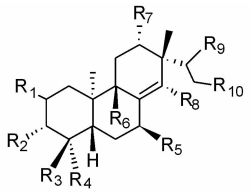
个内酯类化合物[3]，见表 2 和图 4。最近，Li 等[13]从毛梗豨莶中分离得到一个新的倍半萜类化合物 2-丙烯酸,2-甲基-2,3,3a,4,5,8,9,10,11,11*a*-十氢-6,10-二(羟甲基)-3-亚甲基-2-酮基环癸[b]呋喃-4-基酯(2-propenoic acid, 2-methyl-2,3,3a,4,5,8,9,10,11,11*a*-decahydro-6,10-bis(hydroxymethyl)-3-methylene- 2-oxocyclodeca[b]furan-4-yl ester，S-18)。

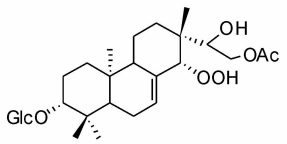
1.3 黄酮类[2,14-15]

豨莶草中黄酮类成分比较少，主要有槲皮素(quercetin，Q-1)、3,7-二甲基槲皮素(3,7-dimethylquercetin，Q-2)、3,4'-*O*-二甲基槲皮素(3,4'-*O*-dimethylquercetin，Q-3)、3-*O*-甲基槲皮素(3-*O*-methylquercetin，Q-4)、3,7,4'-*O*-三甲基槲皮素(3,7,4'-*O*-trimethylquercetin，Q-5)，见表 3 和图 5。

1.4 其他类[10,14,16-22]

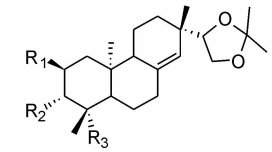
从豨莶草中还分离到甾体、脂肪醇、脂肪酸、香豆素类等，主要有 *β*-谷甾醇(*β*-sitos-terol，O-1)、胡萝卜苷(daucosterol，O-2)、豆甾醇(stigmasterol，O-3)、单棕榈酸甘油酯(glyce-rin monopalmitate，O-4)、花生酸甲酯(methyl arachidate，O-5)、二十一烷醇(heneicosanol，O-6)、二十七烷醇(heptacosanol，O-7)、琥珀酸(succinic acid，O-8)、阿魏酸(ferulic acid，O-9)、丁香醛(syringic aldehyde，O-10)、D-甘露醇(D-mannitol，O-11)、2-氨基-3(4'-羟基-3'-甲氧苯基)-1-丙醇(2-amino-3-(4'-hydroxy-3'-methoxyphenyl)-1-propanol，O-12)、二香草基四氢



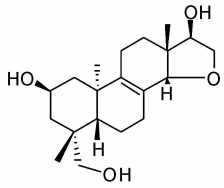


P-29

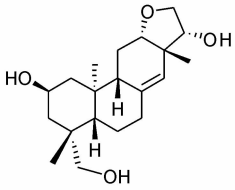
	R_1	R_2	R_3	R_4	R_5	R_6	R_7	R_8	R_9	R_{10}
P-1	H	OH	CH_3	CH_3	H	H	H	H	OH	OH
P-2	H	OGlc	CH_3	CH_3	H	H	H	H	OH	OH
P-3	H	OGlc	CH_3	CH_3	H	H	H	H	OGlc	OH
P-4	OH	H	CH_3	CH_2OH	H	H	OH	H	OH	OH
P-5	=O	H	CH_3	CH_2OH	H	H	H	H	OH	OAc
P-6	βOH	H	CH_3	CH_2OH	H	H	H	H	OH	OH
P-7	OH	H	CH_3	CH_2OH	H	H	H	H	OAc	OH
P-8	OH	H	CH_3	CH_2OH	H	H	H	H	OH	OAc
P-9	OGlc	H	CH_3	CH_3	H	H	H	H	OH	OH
P-10	H	H	CH_3	CH_2OGlc	H	H	H	H	OH	OH
P-11	H	H	CH_3	$CH_2COOGlc$	H	H	H	H	OH	OH
P-12	=O	H	CH_3	CH_2OGlc	H	H	H	H	OH	OH
P-13	βOH	H	CH_3	CH_3	H	H	H	H	OH	OH
P-14	=O	H	CH_3	CH_3	H	H	H	H	OH	OH
P-15	=O	H	CH_2OH	CH_3	H	H	H	H	OH	OH
P-16	αOH	H	CH_3	CH_2OH	H	H	H	H	OH	OH
P-17	βOH	H	CH_3	CH_2OH	H	H	H	H	=O	OH
P-18	=O	H	CH_3	CH_3	H	H	H	H	OH	OGlc
P-19	=O	H	CH_3	CH_2OH	H	H	H	H	OH	OH
P-20	=O	OGlc	CH_3	CH_3	H	H	H	H	OH	OH
P-21	βOH	H	CH_3	CH_2OGlc	H	H	H	H	OH	OH
P-22	H	OH	CH_3	CH_3	OH	H	H	H	OH	OH
P-23	H	OH	CH_3	CH_3	H	OH	H	H	OH	OH
P-24	H	OH	CH_3	CH_3	H	H	H	H	OH	OAc
P-25	H	OGlc	CH_3	CH_3	H	H	H	H	OAc	OAc
P-26	H	OGlc	CH_3	CH_3	H	H	H	H	OH	OAc
P-27	βOH	H	CH_3	COOH	H	H	H	H	OH	OH
P-28	H	OGlc	CH_3	CH_3	H	H	H	H	OAc	OH



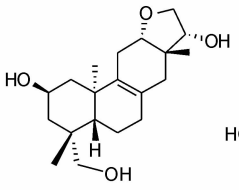
	R_1	R_2	R_3
P-30	OH	H	CH_2OH
P-31	=O	H	CH_2OGlc
P-32	H	OH	CH_3
P-33	H	OGlc	CH_3



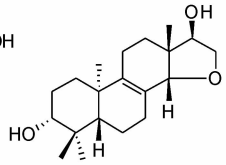
P-34



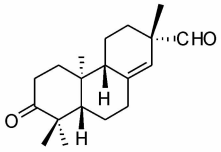
P-35



P-36



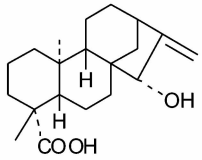
P-37



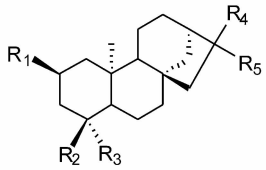
P-38

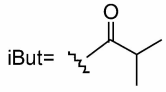
图 1 豨莶草中海松烷型二萜类成分

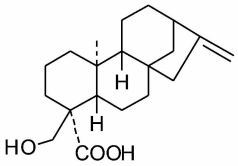
Fig. 1 Pimarenoids from Siegesbeckiae Herba



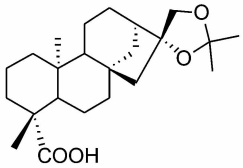
K-1







K-2



K-3

	R_1	R_2	R_3	R_4	R_5
K-4	OH	CH_3	CH_3	CH_2OH	OH
K-5	H	CH_2OH	CH_3	CH_2OH	OH
K-6	H	OH	COOH	CH_2OH	OH
K-7	H	CH_2OGlc	CH_3	CH_2OH	OH
K-8	H	CH_3	COOH	CH_2OH	OH
K-9	H	CH_3	CH_2OH	CH_3	OH
K-10	H	CH_3	COOH	CH_2OMe	αH
K-11	H	CH_3	COOH	CH_2OH	αH
K-12	H	CH_2OH	COOH	CH_2OH	H
K-13	H	$OOCCHMe_2$	COOH	CH_2OAc	H
K-14	H	CH_3	COOH	CH_2OEt	H
K-15	H	CH_2OAc	COOH	CH_2OH	βH
K-16	H	CH_2OAc	COOH	CH_2OiBut	βH
K-17	H	CH_2OAc	COOH	CH_2OH	αOH
K-18	H	CH_2OAc	COOH	CH_2OiBut	αOH
K-19	H	CH_3	COOH	CH_2OiBut	βH
K-20	H	CH_2OiBut	COOH	CH_2OAc	βH
K-21	H	CH_3	COOH	CH_2OH	βH

图 2 豨莶草中贝壳杉烷型二萜类成分

Fig. 2 Kaurenoids from Siegesbeckiae Herba

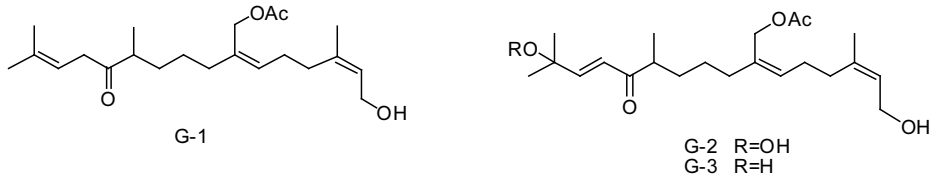


图 3 豨莶草中链状二萜类成分

Fig. 3 Chians diterpenes from Siegesbeckiae Herba

表 2 豨莶草中倍半萜类成分

Tab. 2 Sesquiterpenes from Siegesbeckiae Herba

编号	化合物名称	存在的原植物	文献
S-1	orientalide	*Siegesbeckia orientalis*	[11]
S-2	orientalide 1b	*Siegesbeckia orientalis*	[12]
S-3	orientalide 4a	*Siegesbeckia orientalis*	[12]
S-4	orientin	*Siegesbeckia orientalis*	[26]
S-5	9*β*-羟基-8*β*-异丁酰基木香烯内酯(9*β*-hydroxy-8*β*-isobutyryloxycostunolide)	*Siegesbeckia orientalis*	[3]
S-6	9*β*-羟基-8*β*-甲基丙烯酰基氧基木香烯内酯(9*β*-hydroxy-8*β*-methacrcryloyloxycostunolide)	*Siegesbeckia orientalis*	[3]
S-7	14-羟基-8*β*-异丁酰基木香烯内酯(14-hydroxy-8*β*-isobutyryloxycostunolide)	*Siegesbeckia orientalis*	[3]
S-8	8*β*-异丁酰基-14-醛基-木香烯内酯(8*β*-isobutyryloxy-14-al-costunolide)	*Siegesbeckia orientalis*	[3]
S-9	9*β*,14-二羟基-8*β*-异丁酰基木香烯内酯(9*β*,14-dihydroxy-8*β*-isobutyryloxycostunolide)	*Siegesbeckia orientalis*	[3]
S-10	大根香叶内酯(germacranolide)	*Siegesbeckia orientalis*	[3]
S-11	9*α*,15-二羟基-8*β*-异丁酰基-1-酮基-买兰坡内酯(9*α*,15-dihydroxy-8*β*-isobutyryloxy-14-oxo-melampolide)	*Siegesbeckia orientalis*	[3]
S-12	15-羟基-8*β*-异丁酰基-14-酮基-买兰坡内酯(15-hydroxy-8*β*-isobutyryloxy-14-oxo-melampolide)	*Siegesbeckia orientalis*	[3]
S-13	买兰坡内酯(the melampolide)	*Siegesbeckia orientalis*	[3]
S-14	8*β*-异丁酰基-1*β*,10*α*-环氧木香烯内酯(8*β*-isobutyryloxy-1*β*,10*α*-epoxycostunolide)	*Siegesbeckia orientalis*	[3]
S-15	9*β*-羟基-8*β*-异丁酰基-1*β*,10*α*-环氧木香烯内酯(9*β*-hydroxy-8*β*-isobutyryloxy-1*β*,10*α*-epoxycostunolide)	*Siegesbeckia orientalis*	[3]
S-16	8*β*,9*β*-二羟基-1*β*,10*α*-环氧-11*β*,13-二羟基木香烯内酯(8*β*,9*β*-dihydroxy-1*β*,10*α*-epoxy-11*β*,13-dihydrocostunolide)	*Siegesbeckia orientalis*	[3]
S-17	14-羟基-8*β*-异丁酰基-1*β*,10*α*-环氧木香烯内酯(14-hydroxy-8*β*-isobutyryloxy-1*β*,10*α*-epoxycostunolide)	*Siegesbeckia orientalis*	[3]
S-18	2-丙烯酸,2-甲基-2,3,3*a*,4,5,8,9,10,11,11*a*-十氢-6,10-二(羟甲基)-3-亚甲基-2-酮基环癸[*b*]呋喃-4-基酯{2-propenoic acid,2-methyl-2,3,3*a*,4,5,8,9,10,11,11*a*-decahydro-6,10-bis(hydroxymethyl)-3-methylene-2-oxocyclodeca[b]furan-4-yl ester}	*Siegesbeckia glabrescens*	[13]

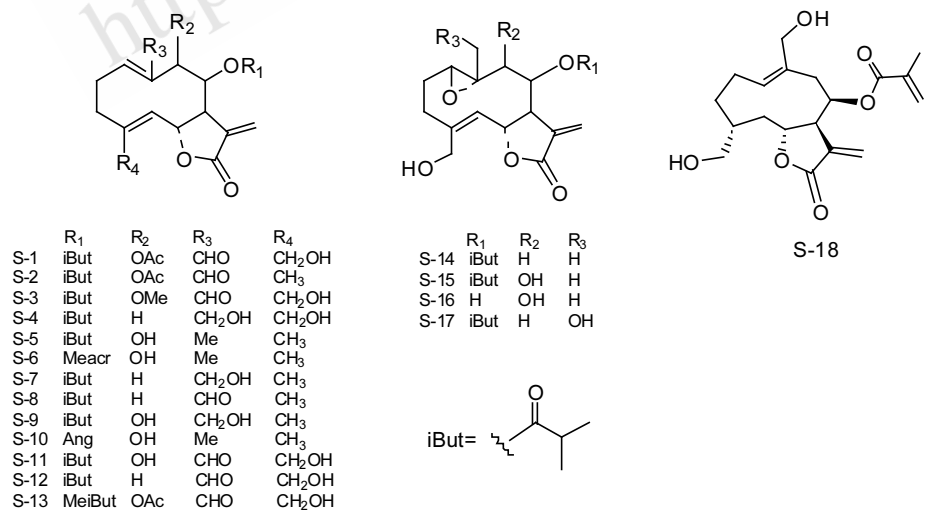


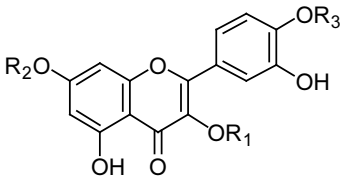
图 4 豨莶草中倍半萜类成分

Fig. 4 Sesquiterpenes from Siegesbeckiae Herba

表 3 豨莶草中黄酮类成分

Tab. 3 Flavonoids from Siegesbeckiae Herba

编号	化合物名称	存在的原植物	文献
Q-1	槲皮素(quercetin)	Siegesbeckia pubescens	[14]
Q-2	3,7-二甲基槲皮素(3,7-dimethylquercetin)	Siegesbeckia orientalis	[2]
Q-3	3,4'-*O*-二甲基槲皮素(3,4'-*O*-dimethylquercetin)	Siegesbeckia glabrescens	[15]
Q-4	3-*O*-甲基槲皮素(3-*O*-methylquercetin)	Siegesbeckia glabrescens	[15]
Q-5	3,7,4'-*O*-三甲基槲皮素(3,7,4'-*O*-trimethylquercetin)	Siegesbeckia glabrescens	[15]



	R_1	R_2	R_3
Q-1	H	H	H
Q-2	CH_3	CH_3	H
Q-3	CH_3	H	CH_3
Q-4	CH_3	H	H
Q-5	CH_3	CH_3	CH_3

图 5 豨莶草中黄酮类成分

Fig. 5 Flavonoids from Siegesbeckiae Herba

呋喃(epoxylignan，O-13)、3',5',*β*-三羟基-3,4,4',*α*-四甲氧基查尔酮(3',5',*β*-trihydroxy-3,4,4',α-tetramethoxy-chalcone，O-14)、(*E*)-3-(3-酮基-1-丁烯基)苯基二甲基氨基甲酸酯((*E*)-3-(3-oxobut-1-enyl)phenyl dimethylcarbamate，O-15)、熊果酸(ursolic acid，O-16)、*N*-(*N*-苯甲酰基-L-苯丙胺酰基)-*O*-乙酰基-L-苯丙氨醇(*N*-(*N*-ben-zoyl-L-pheny-lalany-l)-*O*-actyl-L-phenylalanol，O-17)、二十四碳酸(tetracosa-carbonic acid，O-18)、3-十二烷酰基-2-异丁酰基-4-甲基戊酸(3-dodecanoyloxy-2-isobutyryloxy-4-methylpentanoic acid，O-19)，见表 4。

表 4 豨莶草中其他类化学成分

Tab. 4 Other constituents from Siegesbeckiae Herba

编号	化合物名称	存在的原植物	文献
O-1	*β*-谷甾醇(*β*-sitosterol)	*Siegesbeckia pubescens*	[18]
O-2	胡萝卜苷(daucosterol)	*Siegesbeckia glabrescens*	[10]
O-3	豆甾醇(stigmasterol)	*Siegesbeckia pubescens*	[17]
O-4	单棕榈酸甘油酯(glycerin monopalmitate)	*Siegesbeckia pubescens*	[17]
O-5	花生酸甲酯(methyl arachidate)	*Siegesbeckia orientalis*	[18]
O-6	二十一烷醇(heneicosanol)	*Siegesbeckia orientalis*	[18]
O-7	二十七烷醇(heptacosanol)	*Siegesbeckia glabrescens*	[16]
O-8	琥珀酸(succinic acid)	*Siegesbeckia pubescens*	[17]
O-9	阿魏酸(ferulic acid)	*Siegesbeckia pubescens*	[17]
O-10	丁香醛(syringic aldehyde)	*Siegesbeckia pubescens*	[14]
O-11	*D*-甘露醇(*D*-mannitol)	*Siegesbeckia pubescens*	[14]
O-12	2-氨基-3(3'-羟基-2'-甲氧苯基)-1-丙醇 [2-amino-3-(3'-hydroxy-2'-methoxyphenyl)-1-propanol]	*Siegesbeckia pubescens*	[14]
O-13	二香草基四氢呋喃(epoxylignan)	*Siegesbeckia pubescens*	[14]
O-14	3',5',*β*-三羟基-3,4,4', *α*-四甲氧基查尔酮 (3',5',*β*-trihydroxy-3,4,4',*α*-tetramethoxy -chalcone)	*Siegesbeckia pubescens*	[19]
O-15	(*E*)-3-(3-酮基-1-丁烯基)苯基二甲基氨基甲酸酯 [(*E*)-3-(3-oxobut-1-enyl)phenyl dimethylcarbamate]	*Siegesbeckia pubescens*	[20]
O-16	熊果酸(ursolic acid)	*Siegesbeckia pubescens*	[21]
O-17	*N*-(*N*-苯甲酰基-L-苯丙胺酰基)-*O*-乙酰基-L-苯丙氨醇 [*N*-(*N*-ben-zoyl-L-pheny-lalanyl)-*O*-actyl-L-phenylalanol]	*Siegesbeckia pubescens*	[21]
O-18	二十四碳酸(tetracosa-carbonic acid)	*Siegesbeckia pubescens*	[21]
O-19	3-十二烷酰基-2-异丁酰基-4-甲基戊酸 (3-dodecanoyloxy-2-isobutyryloxy-4-methylpentanoic acid)	*Siegesbeckia glabrescens*	[22]

http://www.chinjmap.com

2 豨莶草及其化学成分的药理作用研究

现代药理实验表明，豨莶草的提取物具有抗炎镇痛、抗血栓、抗过敏、抗菌及抗肿瘤等活性，近十年来对豨莶草提取物及其化学成分的药理作用研究主要集中在免疫抗炎镇痛作用、抗血栓作用等方面，这与豨莶草的功效相一致。

2.1 抗炎镇痛作用

2.1.1 奇任醇的抗炎镇痛作用 早在2000年，钱瑞琴等[29]对豨莶草活性部位进行了抗炎镇痛的研究，发现含85%奇任醇(kirenol，P-6)的豨莶草醇提活性部位可减轻佐剂性关节炎(adjuvant arthritis，AA)大鼠踝关节炎症等病理反应，且有较好的镇痛作用。为了进一步阐明奇任醇的抗炎免疫作用，信红岭等[30]建立大鼠AA模型，观察奇任醇的抗炎作用，结果表明奇任醇可抑制AA大鼠的原发性与继发性足肿胀，抑制急、慢性炎症反应，调节机体免疫功能。毕娟等[31]研究表明，奇任醇能降低AA大鼠血清细胞因子白细胞介素-1β(IL-1β)、肿瘤坏死因子-α(TNF-α)、白细胞介素-6(IL-6)的水平，下调滑膜细胞Bcl-2蛋白表达，上调Fas-L蛋白表达，从而起到抑制急慢性炎症的作用。另外从细胞因子等分子机制水平研究表明奇任醇是一个潜在的抗炎镇痛先导化合物[32-35]。

2.1.2 其他化合物的抗炎镇痛作用 Kim等[15]从毛梗豨莶中分离得到4种黄酮类，分别为3,7-*O*-二甲基槲皮素(3,7-*O*-dimethylquercetin，Q-2)、3,4'-*O*-二甲基槲皮素(3,4'-*O*-dimethylquercetin，Q-3)、3-O-甲基槲皮素(3-*O*-methylquercetin，Q-4)和3,7,4'-*O*-槲皮素(3,7,4'-*O*-trimethylquercetin，Q-5)，这4个化合物能通过抑制诱生型一氧化氮合酶mRNA和蛋白的表达，从而抑制小神经胶质细胞产生一氧化氮(NO)。

赵凯华等[36]研究腺梗豨莶甲醇提取物不同溶剂萃取部位对脂多糖(LPS)诱导小鼠单核巨噬细胞RAW 264.7释放NO的影响，结果表明，腺梗豨莶醇提物石油醚及乙酸乙酯萃取部位对活化巨噬细胞释放NO的抑制效果强于正丁醇和水层提取部位。进一步对石油醚部分分离，得到4个化合物，分别为β-谷甾醇(β-sitosterol，O-1)、熊果酸(ursolic acid，O-16)、*N*-(*N*-苯甲酰基-*L*-苯丙胺酰基)-*O*-乙酰基-*L*-苯丙氨醇[*N*-(*N*-ben-zoyl-*L*-pheny-lalanyl)-*O*-actyl-L-phenylalanol，O-17]和二十四碳酸(tetracosa-carbonic acid，O-18)[21]，β-谷甾醇和熊果酸对LPS诱导巨噬细胞释放NO具有明显的抑制活性，熊果酸还对巨噬细胞释放TNF-α具有明显的抑制作用。Park等[37]对从腺梗豨莶中分离得到二萜类化合物对映贝壳杉烷-16αH,17-羟基-19-羧酸(ent-16αH,17-hydroxykauran-19-oic acid，K-11)进行抗炎镇痛研究，发现其主要是通过下调NF-κB结合活性来抑制iNOS、COX-2和TNF-α等炎症因子，从而达到抗炎镇痛效果。Li等[13]从毛梗豨莶分离得到一种新半倍萜内酯2-丙烯酸,2-甲基-2,3,3*a*,4,5,8,9,10,11,11*a*-十氢-6,10-二(羟甲基)-3-亚甲基-2-酮基环癸[b]呋喃-4-基酯{2-propenoicacid,2-methyl-2,3,3a,4,5,8,9,10,11,11*a*-decahydro-6,10-bis(hydroxymethyl)-3-methylene-2-oxocyclodeca[b]furan-4-yl ester，S-18}，它是一个NO和前列腺素E2合成的抑制剂，发现其能减少NO合成酶、环氧化酶-2的蛋白及mRNA水平，也能减弱LPS诱导的NF-κB DNA转移活性。

2.2 抗过敏作用

韩国研究者Kim等[38-39]对豨莶草的水提取物进行了研究，发现抗原刺激前48 h和(或)2 h经口给予腺梗豨莶水提取物100 μg·g^{-1}可明显减弱48 h被动型皮肤过敏反应，与对照组(口服盐水溶液)相比有显著差异。腺梗豨莶水提取物对介导IgE的大鼠腹腔肥大细胞脱颗粒而释放组胺的抑制作用随浓度(1~1 000 mg·mL^{-1})的增强而增强，表明腺梗豨莶水提取物对免疫反应导致的组胺释放有抑制作用。他们后续研究了毛梗豨莶水提取物(SGWP)对小鼠体内和体外IgE产生的影响，结果显示，小鼠口服SGWP水提取物50~1 000 mg·kg^{-1}，2周，可剂量相关地抑制抗原混合物(含卵白蛋白、百日咳博德特菌和明矾)诱导的全身性免疫反应，同时也能剂量相关地抑制血中的IgE产生。白细胞介素-4(IL-4)能诱导鼠和人激活的B细胞产生IgE，而在IL-4和SGWP水提取物(2 mg·mL^{-1})同时存在的LPS刺激的小鼠全脾细胞悬浮液中，提取物明显抑制LPS或LPS+IL-4依赖的IgE的产生，对LPS刺激的脾细胞的增加无影响。SGWP水提取物还抑制LPS或LPS+IL-4诱导的人U266B1细胞产生IgE，且在实验浓度范围内无明显细胞毒性。结果表明，SGWP水提取物通过抑制B细胞中IgE的产生而具有抗过敏活性。

2.3 心血管保护作用

于静等[40]研究了豨莶草水提取醇沉淀部分对

多柔比星致大鼠急性心肌损伤的作用，发现其可能通过抗氧化损伤作用而对多柔比星所致的急性心肌损伤产生保护。

豨莶草具有抗血栓作用早已有报道，俞桂新等[41-42]为了阐明豨莶草抗血栓有效组分，对其进行了系统的筛选和分析，最后确定豨莶草抗血栓组分为腺梗豨莶乙酸乙酯部分，且活性成分中奇任醇的含量>10%，说明豨莶草抗血栓组分主要为二萜类。

汪建平等[43]对腺梗豨莶中分离得到的一种贝壳杉烷型二萜类化合物对映贝壳杉烷-16*β*,17-二羟基-19-酸(ent-16*β*,17-dihydroxykauran-19-oic acid，K-8，DDKA)，并对其分别进行了体内和体外的抗凝血、抗血栓实验。体内实验表明，DDKA 显著减小动静脉旁路血栓重量，同时能增加血浆中 cAMP 的水平。静脉连续注射给药 DDKA 5 d 后，大鼠体内 PT 和 APTT 延长。体外实验表明，DDKA 能显著抑制多种竞争性刺激引起的大鼠血小板聚集，同时提高 ADP 激动的血小板中 cAMP 的水平。结果表明，DDKA 可能通过调节 cAMP 水平，从而起到抗血栓抗凝血的作用。

2.4 抑制肿瘤细胞作用

汪建平等[44]对豨莶乙醇提取物进行抗肿瘤细胞研究，发现豨莶草乙醇提取物乙酸乙酯和正丁醇萃取部位对 HeLa 细胞有较强的体外增殖抑制作用。Jun 等[45]研究表明，毛梗豨莶的水提取物具有诱导乳腺癌细胞凋亡的作用，其凋亡机制主要是通过裂解 MCF-7 和 MDA-MB-231 细胞中的酶原、ATP 酶以及聚合酶。MCF-7 细胞的凋亡可能通过内源性信号通路途径，MDA-MB-231 细胞的凋亡可能通过外源性信号通路途径。Liu 等[20]从腺梗豨莶中分离得到一种新氨基甲酸酯(*E*)-3-(3-酮基-1-丁烯基)苯基二甲基氨基甲酸酯((*E*)-3-(3-oxobut-1-enyl)phenyl dimethylcarbamate，O-15)，并测定该化合物对 A549 人肺癌细胞的细胞毒活性，其 IC_{50} 值为 58 μg·mL^{-1}。

2.5 促进创伤愈合作用[46]

通过研究豨莶甲醇提取物对体外培养的小鼠成纤维细胞增殖活性影响以及对大鼠切除伤的创伤修复作用，发现浓度为 0.5~100 μg·mL^{-1} 的豨莶草提取物对成纤维细胞的增殖作用显著，4%~5%豨莶草甲醇提取物外涂对实验性大鼠皮肤损伤具有显著修复功能，其机制是通过激活成纤维细胞达到修复创伤愈合作用。

2.6 抗菌作用

Kim 等[22]研究发现，毛梗豨莶甲醇提取物对金黄色葡萄球菌有一定的抗菌作用，在活性指导下，从该植物中首次分离并鉴定得到 3-十二烷酰基-2-异丁酰基-4-甲基戊酸(3-dod-ecanoyloxy-2-isobutyryloxy-4-methylpentanoic acid，O-19)，并对其进行了抗革兰氏阳性菌、革兰氏阴性菌和酵母菌的抗菌实验研究，发现该化合物能特异性抗革兰氏阳性菌，且最小抑菌浓度为 3.12~25 μg·mL^{-1}。

2.7 对信号通路的作用

Kim 等[28]的研究表明，毛梗豨莶甲醇提取物在 30 μg·mL^{-1} 时对蛋白酪氨酸磷酸酶(PTP1B 酶)具有抑制作用，进一步对活性部位分离纯化后，得到 3 个化合物对映-16*β*H,17-异丁酰基-贝壳杉烷-19-羧酸(ent-16*β*H,17-isobutyryloxy-kauran-19-oic acid，K-19)、对映-16*β*H,17-乙酰基-18-异丁酰基-贝壳杉烷-19 羧酸(ent-16*β*H,17-acetoxy-18-isobutyryloxy-kauran-19-oic acid，K-20)和对映-16*β*H,17-羟基-贝壳杉烷-19-羧酸(ent-16*β*H,17-hydroxy-kauran-19-oic acid，K-21)，化合物 K-19 和 K-20 对蛋白酪氨酸磷酸酶有抑制作用，IC_{50} 值分别为(8.7±0.9) μmol·L^{-1} 和(30.6±2.1) μmol·L^{-1}，且为非竞争性拮抗化合物，C-17 位发生羟基取代的化合物对蛋白酪氨酸磷酸酶没有抑制作用。

最近有研究发现，奇任醇能够下调脂肪形成转录因子 PPARγ、C/EBPα 和 SREBP-1c，脂质生物合成相关酶 FAS、ACC 以及脂肪细胞因子(脂连素和瘦素)，从而抑制细胞内脂质堆积[47]。

3 展望

豨莶草是我国的常用中药，主要用于类风湿型关节炎和抗血栓作用，在韩国被用于治疗哮喘等过敏性疾病。二萜类及其苷被认为是豨莶草主要抗炎生物活性成分。国内外学者对豨莶草 3 个种植物来源的天然化学结构的研究已经很多，迄今已经分离鉴定 100 余个化合物，但其化学成分的研究集中于其醇提取部分及醇提后极性较小的溶剂萃取部分，而对极性大的部分化学成分研究几乎没有，实际上豨莶草在传统应用及其单味制剂豨莶丸是用水为溶剂进行提取的，因此笔者认为对豨莶草水溶性成分进行研究，可能可以更好地阐明其生物活性物质基础。另外，目前对豨莶草有效成分抗炎镇痛、抗血栓的研究还仅停留在

几个二萜类、黄酮类化合物上，没有进行系统的构效关系研究，因此有必要对豨莶草中几类化合物进行系统的构效关系研究，可以为抗炎镇痛、抗血栓药物的研究开发提供良好的先导化合物。

REFERENCES

[1] CHOU G X, JIN R M, WANG Z T. Preparation method and application of antithrombotic fraction from *Siegesbeckia pubescens*: China, 03117097.8 [P]. 2003-05-23.

[2] XIONG J, MA Y B, XU Y L, et al. The constituents of *Siegesbeckia orientalis* [J]. Nat Product Sci, 1997, 3(1): 14-18.

[3] ZDERO C, BOHLMANN F, KING R M, et al. Sesquiterpene lactones and other constituents from *Siegesbeckia orientalis* and *Guizotia scabra* [J]. Phytochemistry, 1991, 30(5): 1579-1584.

[4] WANG F, CHENG X L, LIU J K, et al. Ent-pimarane diterpenoids from *Siegesbeckia orientalis* and structure revision of a related compound [J]. J Nat Prod, 2009, 72(11): 2005-2008.

[5] XIONG J, JIN Q D, XU Y L, et al. New diterpenoid glucosides from *Siegesbeckia pubescens* [J]. Chin Chem Lett(中国化学快报), 2001, 12(1): 51-54.

[6] XIONG J, MA Y B, XU Y L, et al. Diterpenoids from *Siegesbeckia pubescens* [J]. Phytochemistry, 1992, 31(3): 917-921.

[7] WANG R, CHEN W H, SHI Y P, et al. Ent-kaurane and ent-pimarane diterpenoids from *Siegesbeckia pubescens* [J]. J Nat Prod, 2010, 73(1): 17-21.

[8] XIE K H, WANG J B, YANG R, et al. A new ent-pimarane diterpenoid from *Siegesbeckia pubescens* [J]. J Chin Pharm Sci, 2013, 22(2): 197-200.

[9] DONG X Y, CHEN M, JIN W, et al. Studies on antifertility constituents of *Siegesbeckia glabrescens* Mak [J]. Acta Pharm Sin(药学学报), 1989, 24(11): 833-836.

[10] FU H Z, CAI S Q, FENG R, et al. Chemical constituents of *Siegesbeckia glabrescens*(II) [J]. Chin Pharm J(中国药学杂志), 1998, 33(5): 276-278.

[11] BARUAH R N , SHARMA R P , MADHUSUDANAN K P, et al. A new melampolide from *Siegesheckia orientalis* [J]. Phytochemistry, 1979, 18(6): 991-994.

[12] BARUAH R N , SHARMA R P , THYAGARALAN G, et al . New melampolides and darutigenol from *Siegesheckia orientalis* [J]. Phytochemistry, 1980, 19(2): 323-325.

[13] LI H, KIM J Y, HYEON J, et al. *In vitro* anti-inflammatory activity of a new sesquiterpene lactone isolated from *Siegesbeckia glabrescens* [J]. Phytother Res, 2011, 25(9): 1323-1327.

[14] FU H Z, LI Y S, GUO D A, et al. Studies on chemical constituents of *Siegesbeckia pubescens*(Ⅲ) [J]. Chin Tradit Herb Drugs(中草药), 1999, 30(7): 491-492.

[15] KIM J Y, LIM H J, RYU J H , et al. *In vitro* anti-inflammatory activity of 3-*O*-methyl-flavones isolated from *Siegesbeckia glabrescens* [J]. Bioorg Med Chem Lett, 2008, 18(4): 1511-1514.

[16] FU H Z, LOU Z C, CAI S Q, et al. Studies on chemical constituents of *Siegesbeckia glabrescens* (I) [J]. Chin Pharm J (中国药学杂志), 1998, 33(3): 140-142.

[17] FU H Z, LOU Z C, YANG X W, et al. Studies on chemical constituents of *Siegesbeckia pubescens* (I) [J]. Chin Tradit Herb Drugs(中草药), 1997, 28(5): 259-262.

[18] GUO D A, ZHANG Z G, YE G Q, et al. Studies on liposoluble constituents of *Siegesbeckia orientalis* L. [J]. Acta Pharm Sin(药学学报), 1997, 32(4): 282-285.

[19] CHOU G X, WANG Z T. Study on chemical constituents of Herba Siegesbeckiae [J]. Chin Pharm J(中国药学杂志), 2006, 41(24): 1854-1857.

[20] LIU J, CHEN R, NIE Y, et al. A new carbamate with cytotoxic activity from the aerial parts of *Siegesbeckia pubescens* [J]. Chin J Nat Med, 2012, 10(1): 13-15.

[21] ZHAO K H, LIU K, ZHAO F. Active constituents from *Siegesbeckia pubescens* [J]. Asia-Pacific Tradit Med(亚太传统医药), 2012, 8(2): 40-42.

[22] KIM Y S, KIM H, JUNG E, et al. A novel antibacterial compound from *Siegesbeckia glabrescens* [J]. Molecules, 2012, 17(11): 12469-12477.

[23] FU H Z, FENG R, DU Z H, et al. Studies on chemical constituents of *Siegesbeckia pubescens* (II) [J]. Chin Tradit Herb Drugs(中草药), 1997, 28 (6): 327-327.

[24] XIANG Y, ZHANG H, FAN C Q, et al. Novel diterpenoids and diterpenoid glycosides from *Siegesbeckia orientalis* [J]. J Nat Prod, 2004, 67(9): 1517-1521.

[25] GIANG P M, SON P T, OTSUKAT H. Ent-pimarane-type diterpenoids from *Siegesbeckia orientalis* L [J]. Chen Pharm Bull, 2005, 53(2): 232-234.

[26] XU Y L, XIONG J, JIN Q D, et al. Research advancement of Siegesbeckiae [J]. Nat Prod Res Dev(天然产物研究与开发), 2001, 13(5): 80-85.

[27] GAO H, LI P Y, LI D K, et al. Studies on chemical constituents of *Siegesbeckia pubescens* (IV) [J]. Chin Tradit Herb Drugs(中草药), 2002, 33(6): 495-496.

[28] KIM S, NA M, OH H, et al. PTP1B inhibitory activity of kaurane diterpenes isolated from *Siegesbeckia glabrescens* [J]. J Enzyme Inhib Med Chem, 2006, 21(4): 379-383.

[29] QIAN R Q, ZHANG C Y, FU H Z, et al. Study on therapeutic mechanism of anti-rheumatism action of Herba Siegesbeckiae [J]. Chin J Integr Tradit Chin West Med(中国中西医结合杂志), 2000, 20(3): 192-195.

[30] XIN H L, BIN J, LIU M, et al. Experimental study on anti-inflammatory and immune-regulating effect of kirenol [J]. Chin Tradit Herb Drugs(中草药), 2005, 36(6): 866-870.

[31] BI J, XIN H L, GAO Z F, et al. Effect of kirenol on cytokines in serum and apoptosis proteins expression in synoviocytes of adjuvant arthritis rats [J]. Chin Tradit Herb Drugs(中草药), 2007, 38(8): 1207-1210.

[32] WANG J P, ZHOU Y M, YE Y J, et al. Topical anti-inflammatory and analgesic activity of kirenol isolated from *Siegesbeckia orientalis* [J]. J Ethnopharmacol, 2011, 137(3): 1089-1094.

[33] WANG J P, RUAN J L, CAI Y L, et al. Anti-inflammatory and analgesic activity of topical administration of *Siegesbeckia pubescens* [J]. Pak J Pharm Sci, 2008, 21(2): 89-91.

[34] LUA Y, XIAO J, WU Z W, et al. Kirenol exerts a potent anti-arthritic effect in collagen-induced arthritis by modifying the T cells balance [J]. Phytomedicine, 2012, 19(10): 882-889.

[35] WANG Z M, ZHU S G, WU Z W, et al. Kirenol up-regulates nuclear Annexin-1 which interacts with NF-κB to attenuate synovial inflammation of collagen-induced arthritis in rats [J]. J Ethnopharmacol, 2011, 137(1): 774-782.

[36] ZHAO K H, ZHAO F, LIU K. Inhibitory effect of extract of Siegesbeckia pubescens on NO production in LPS-activated macrophage [J]. J Yantai Univ(Nat Sci Eng Ed)(烟台大学学

报：自然科学与工程版), 2009, 22(2): 137-140.
[37] PARK H J, KIM I T, WON J H, et al. Anti-inflammatory activities of ent-16αH, 17-hydroxy-kauran-19-oic acid isolated from the roots of *Siegesbeckia pubescens* are due to the inhibition of iNOS and COX-2 expression in RAW 264.7 macrophages via NF-κB inactivation [J]. Eur J Pharmacol, 2007, 558(1-3): 185-193.
[38] KIM H M. Effects of *Siegesbeckia pubescens* on immediate hypersensitivity reaction [J]. Am J Chin Med, 1997, 25(2): 163-167.
[39] KIM H M, LEE J H, WON J H, et al. Inhibitory effect on immunoglobulin E production *in vivo* and *in vitro* by *Siegesbeckia glabrescens* [J]. Phytother Res, 2001, 15(7): 572-576.
[40] YU J, WANG Q, SU S W, et al. Protective role of Herba Siegesbeckiae extracts against doxorubicin-induced acute cardiac injury in rats [J]. Her Med(医药导报), 2013, 32(7): 843-847.
[41] CHOU G X, JIN R M, WANG Z T, et al. Study on antithrombotic fraction of Herba Siegesbeckiae [J]. Acta Univ Tradit Med Sin Pharmacol Shanghai(上海中医药大学学报), 2005, 19(3): 39-41.
[42] CHOU G X, JIN R M, WANG Z T, et al. Study on antithrombotic fraction of Herba Siegesbeckiae [J]. J Chin Med Mater(中药材), 2006, 29(3): 235-237.
[43] WANG J P, XU H X, WU Y X, et al. Ent-16*β*,17-dihydroxy-kauran-19-oic acid, a kaurane diterpene acid from *Siegesbeckia pubescens*, presents antiplatelet and antithrombotic effects in rats [J]. Phytomedicine, 2011, 18(10): 873-878.
[44] WANG J P, LUO Q, RUAN J L, et al. Effect of *Siegesbeckia orientalis* L. on cervical cancer Hela cell *in vitro* [J]. Her Med(医药导报), 2009, 28(1): 45-46.
[45] JUN S Y, CHOI Y H, SHIN H M. *Siegesbeckia glabrescens* induces apoptosis with different pathways in human MCF-7 and MDA-MB-231 breast carcinoma cells [J]. Oncol Report, 2006, 15(6): 1461-1467.
[46] WANG J P, RUAN J L, CAI Y L, et al. *In vitro* and *in vivo* evaluation of the wound healing properties of *Siegesbeckia pubescens* [J]. J Ethnopharmacol, 2011, 134(3): 1033-1038.
[47] KIM M B, SONG Y, KIM C, et al. Kirenol inhibits adipogenesis through activation of the Wnt/*β*-catenin signaling pathway in 3T3-L1 adipocytes [J]. Biochem Biophys Res Commun, 2014, 445(2): 433-438.

收稿日期：2014-06-06

《中国现代应用药学》2015 年征订启事

《中国现代应用药学》创刊于 1984 年，是由中国药学会主办，中国科协主管，国内外公开发行的国家级综合性药学科技期刊。本刊为中国科技论文统计源期刊(中国科技核心期刊)，中国科学引文数据库入选期刊，并被美国《化学文摘》(CA)、《国际药学文摘》(IPA)、《剑桥科学文摘(自然科学)》(SCA)、《乌利希期刊指南》(Ulrich PD)、《日本科学技术振兴机构中国文献数据库》(JST)等国际重要检索系统收录。

本刊栏目涵盖面广，设有专家论点、论著、临床、药事管理、药物警戒与综述，内容包括药理、中药与天然药物、药剂、药物化学、药物分析与检验以及医院药学等，能全方位、多角度地反映国内药学领域的最新进展，是国内广大医药工作者发表科研成果、交流信息、更新知识的重要学术平台，也是发布药品及相关领域产品广告的重点专业期刊媒体。目前全球机构用户达 3304 个，国际个人读者分布在 20 个国家和地区。

本刊为月刊，每月 28 日出刊，大 16 开本，铜版纸精美印刷，每期订价 30.00 元，全年 360.00 元，国内统一刊号：CN 33-1210/R，国际标准出版物编号：ISSN 1007-7693，国内邮发代号：32-67，国外发行：中国国际图书贸易总公司，国外发行代号：M4698，欢迎广大读者向本刊编辑部或当地邮局订阅。

编辑部地址：浙江省杭州市文一西路 1500 号，海创园科创中心 6 号楼 4 单元 1301 室，邮编：311121，电话：0571-87297398，传真：0571-87245809，E-mail：xdyd@chinajournal.net.cn，http://www.chinjmap.com。