

# 苦参生物活性研究进展\*

张宏利<sup>1</sup>, 张跃进<sup>2</sup>, 韩崇选<sup>1</sup>, 杨学军<sup>1</sup>, 王明春<sup>1</sup>, 杨清娥<sup>1</sup>, 高锦明<sup>2</sup>

(1 西北农林科技大学 林学院, 陕西 杨凌 712100; 2 西北农林科技大学 生命科学学院, 陕西 杨凌 712100)

**[摘要]** 苦参的活性成分主要是生物碱和黄酮类化合物。许多研究发现, 苦参在医疗方面具有抗肿瘤活性及抗肝损伤、抗溃疡、抗生育、抗炎抑菌、抗心率失常、抗病毒和治疗慢性肝炎等作用; 在农业上, 苦参对多种病虫害具有毒杀和抑制作用, 并具有杀鼠活性。文章对以上研究进行了综述, 并指出了苦参今后的研究方向。

**[关键词]** 苦参; 生物活性; 杀虫活性; 杀菌活性; 杀鼠活性

**[中图分类号]** R282.710.5; S482

**[文献标识码]** A

**[文章编号]** 1671-9387(2004)05-0031-07

苦参(*Sophora flavescens* Ait) 为豆科槐属植物, 是我国历史悠久的传统药物之一, 据文字记载, 已有 2000 多年的药用历史。苦参根具有清热、除湿、祛风、杀虫、利尿等功效; 种子可明目; 全草煎汁为杀虫剂, 内服可健胃、驱虫及治赤痢等症<sup>[1]</sup>。据《中国有毒植物》记载, 苦参根和种子有毒。人中毒后出现以神经系统为主的症状, 表现为流涎、呼吸和脉搏加速、步态不稳, 严重者惊厥, 或因呼吸抑制而死亡<sup>[2]</sup>。近几年, 对苦参化学成分和生物活性的研究不断深入, 现将国内外对苦参生物活性方面的研究现状总结如下。

## 1 药理活性

### 1.1 抗肿瘤活性

目前的研究表明, 肿瘤的发生和发展不仅是肿瘤细胞增殖和分化异常所致, 而且还是肿瘤细胞异常凋亡的结果<sup>[3]</sup>。因此, 抑制肿瘤细胞增殖, 诱导肿瘤细胞分化和凋亡, 对临床治疗肿瘤有一定的指导意义。近几年的研究表明, 苦参对恶性葡萄胎、绒癌、子宫癌、埃氏腹水瘤和淋巴内癌细胞都有不同程度的抑制和消灭作用, 苦参碱对肿瘤细胞具有选择性杀伤作用, 还能通过改变细胞核酸的分子序列, 抑制肿瘤的生长, 而且这种影响是广泛的、多部位的<sup>[4]</sup>。邱慧颖等人<sup>[5]</sup>的研究表明, 用苦参碱治疗各种晚期癌肿, 能减轻症状, 延长存活期, 且不破坏正常白细胞的产生, 甚至能升高白细胞, 提高机体抵抗力, 这是许多治疗药物难以达到的。钱学敏等人<sup>[6]</sup>报道, 一

定浓度的氧化苦参碱有抑制人肝癌细胞 SMMC-7721 增殖的作用, 而苦参碱能有效抑制人成纤维肉瘤(HT1080)细胞的增殖, IC<sub>50</sub>值为 350 μg/mL<sup>[7]</sup>。陈伟忠等人<sup>[8]</sup>对苦参碱在抗肿瘤机制方面的研究也进行过报道。概括起来其抗肿瘤活性主要表现在以下几个方面。

1.1.1 抑制肿瘤细胞增殖 苦参碱能有效抑制人肝癌细胞株 HepG<sub>2</sub> 的增殖。MTT 试验显示, 苦参碱对 HepG<sub>2</sub> 抑制作用有时间剂量依赖性。随着作用时间延长和药物浓度的增加, HepG<sub>2</sub> 细胞存活率明显降低, 细胞 DNA 合成亦相应降低。病理学研究表明, 苦参碱可干扰或破坏细胞的脂肪代谢, 表明苦参碱可抑制肝癌 HepG<sub>2</sub> 细胞的增殖, 并具有直接杀伤作用<sup>[9]</sup>。其作用机制是苦参碱抑制部分肿瘤细胞从 G 期进入 S 期, 从而抑制其增殖<sup>[10]</sup>。

1.1.2 诱导肿瘤细胞分化和凋亡 近期的研究表明, 苦参碱对 K562 细胞的分化作用随浓度的增加而增加, 一定浓度的苦参碱对 K562 细胞具有一定的诱导分化效应<sup>[10]</sup>, 这一结果为临床探索中药非杀伤性治疗白血病打下了良好的基础<sup>[11]</sup>。张燕军等人<sup>[12]</sup>用 30 mg/L 的苦参碱处理 SMMC-7211 细胞, 6 d 后发现, 苦参碱可降低 SMMC-7211 细胞的恶性程度, 并使其趋向正常细胞; 张百红等人<sup>[13]</sup>研究发现, 苦参碱对体外培养的 SGC-7901 细胞增殖有抑制作用, 提出一定浓度的苦参碱具有诱导人胃癌 SGC-7901 细胞凋亡的作用, 而诱发 SGC-7901 细胞

\* [收稿日期] 2003-04-22

[基金项目] 国家“十五”科技攻关项目(2001BA509B07-2-02); 国家林业局重点项目(2002-20)

[作者简介] 张宏利(1962-), 男, 陕西临潼人, 副研究员, 主要从事鼠害治理工作。

凋亡的主要诱因是苦参碱降低了细胞间的粘连性<sup>[14]</sup>。

有学者发现,大部分肿瘤有端粒酶活性表达,而正常细胞(除生殖细胞外)没有端粒酶活性表达,不能无限分裂,因而端粒酶有可能成为肿瘤治疗的突破口<sup>[15]</sup>。最近一些研究探讨了不同浓度的苦参碱对 K-562 细胞端粒酶活性的抑制作用,发现苦参碱能显著降低 K-562 细胞端粒酶的活性,同时伴随着细胞的明显分化<sup>[11]</sup>;张百红等人<sup>[16]</sup>发现,苦参碱可以通过下调 BCL-2 原癌基因的表达而诱导肿瘤细胞的凋亡。

1.1.3 抑制肿瘤转移 CD44 分子是粘附分子家族中的一员,它所编码的是细胞表面的一组跨膜糖蛋白。目前已发现有 16 种 CD44 分子的变异异构体,即 CD44V,一些肿瘤转移的过程中往往伴有 CD44 表达的上调<sup>[17]</sup>。Emak 等人<sup>[18]</sup>认为,CD44V6 的表达有助于肿瘤细胞获得转移潜能。林洪生等人<sup>[19]</sup>的研究表明,苦参碱可减少 CD44 粘附因子的表达,抑制肿瘤细胞与内皮细胞的粘附,阻止肿瘤的转移。

### 1.2 对治疗慢性肝炎、肝损伤及抗肝纤维化的作用

苦参素的主要成分为氧化苦参碱,是从苦参根中提取出的一种生物碱。在临床上具有免疫调节、保护肝细胞及抗病毒的作用。对慢性肝炎病人,用苦参素治疗 3 个月,其 HbeAg, HBV DAN 阴转率达到 42.9% 和 46.4%,其作用机制是苦参素能够抑制 HBV DAN 的复制及表达<sup>[20]</sup>。因此,苦参素在慢性乙型肝炎的治疗中具有一定的价值。肿瘤坏死因子  $\alpha$ (TNF $\alpha$ ) 主要来源于单核细胞,它能激活多种炎症细胞<sup>[21]</sup>,在肝脏有炎症损伤时,也可来源于炎症区的肝细胞,并可直接损伤肝细胞,增强炎症活动度,加重对肝组织的损伤<sup>[22]</sup>。韩家文<sup>[23]</sup>等人报道,苦参素能有效抑制单核巨噬细胞的功能。甘乐文<sup>[24]</sup>等报道,苦参素对 CCl<sub>4</sub> 引起的大鼠慢性肝损伤具有一定的防护作用。用 CCl<sub>4</sub> 造成大鼠慢性肝损伤的病理过程与人类慢性肝炎向肝硬化发展的病理过程相类似<sup>[25]</sup>,因此,苦参素有可能治愈人类肝损伤,防止慢性肝炎向肝硬化发展。氧化苦参碱对急性肝损伤也具有保护作用<sup>[26]</sup>。

刘天灯<sup>[27]</sup>报道,苦参素能有效降低血液中 HA(血清透明质酸)、PCIII(III型前胶原)、ALT(丙氨酸转移酶)和 TBL(总胆红素)的含量,改善临床症状,减轻炎性细胞浸润及肝细胞坏死,具有抗肝纤维化的作用。陈伟忠等<sup>[28]</sup>发现,苦参碱能显著减轻大

鼠肝细胞坏死,保护肝细胞,降低不同试验阶段大鼠血清中 ALT 及 HA 的含量,有效防治肝的纤维化。

### 1.3 对心血管系统的作用

1.3.1 抗心率失常作用 张宝恒等人<sup>[29]</sup>报道,200  $\mu\text{mol/L}$  的苦参碱能显著减慢离体大鼠右心房的自发频率,拮抗异丙肾上腺素诱发的心率加快;给家兔静脉注射 30 mg/kg 氧化苦参碱,能缩短异丙肾上腺素诱发的心率失常的恢复时间;静脉注射 42 mg/kg 的槐果碱,能对抗氯化钙诱发的小鼠室性心率失常和乌头碱诱发的大鼠心率失常;静脉注射 20 mg/kg 的槐胺碱,能对抗乌头碱和氯化钙所致的大鼠心率失常;静脉注射槐定碱,可预防或治疗乌头碱诱发的大鼠心率失常<sup>[30]</sup>;而苦参碱对大鼠有明显的抗心率失常作用<sup>[31]</sup>。可见,苦参碱具有广谱的抗实验性心率失常作用。王继光等<sup>[32]</sup>报道,苦参总黄酮同样具有抗心率失常作用。

1.3.2 对其他心血管系统疾病的作用 静脉注射槐果碱,对麻醉大鼠具有快速、恒定的降压作用,降压作用随剂量的增加而增加;灌胃给药 30 mg/kg,亦能降低肾性高血压大鼠的血压。槐果碱和槐定碱可使冷血动物的末梢及内脏血管引起收缩<sup>[33]</sup>。据刘桂荣等<sup>[34]</sup>报道,苦参碱具有降血脂、对抗脑垂体后叶素引起的冠状血管收缩和增加流量、保护心肌缺血的作用,并能增强心肌收缩力;苦参总碱对兔、大鼠等动物的心脏有明显的抑制作用,可使心肌收缩力减弱,心输出量减少等<sup>[35]</sup>。李青等<sup>[36]</sup>用多种实验动物研究了氧化苦参碱的强心作用,结果表明,氧化苦参碱能明显增加正常离体蟾蜍的心肌收缩力和心输出量,强心的同时不增加心率,并能显著增加戊巴比妥钠和低钙离子体心衰模型的心肌收缩。

### 1.4 对中枢神经系统的作用

苦参能明显抑制小鼠的自发活动,能拮抗苯丙胺和咖啡因的中枢兴奋作用,增强戊巴比妥钠及水合氯醛的中枢抑制作用。槐果碱、苦参碱、槐胺碱及槐定碱均能不同程度升高大鼠纹状体及前脑边缘区的多巴胺代谢物——二羟苯乙胺(DOPAC)和高香草酸(HVA)的含量。槐果碱还能降低纹状体中多巴胺含量,将其注入延髓能明显升高脑内的 cAMP(环腺苷酸)<sup>[34]</sup>。蒋袁絮等人<sup>[37]</sup>用经典的药理试验方法证实,氧化苦参碱具有明显的镇静、催眠等中枢神经抑制作用。耿群美等<sup>[38]</sup>的药理试验表明,苦参碱与氧化苦参碱有类似安定的作用,对中枢均有抑制作用,并与脑中递质  $\gamma$ -氨基丁酸和甘氨酸含量增加有关,作用随剂量增加而增强。

### 1.5 对免疫系统的活性作用

苦参中的生物碱——苦参碱、氧化苦参碱、槐果碱、槐胺碱及槐定碱均为免疫抑制剂,对T细胞介导的免疫反应有不同程度的抑制效应,对依赖T细胞的抗致敏红细胞(SRBC)有抗体反应,苦参碱、氧化苦参碱、槐胺碱均具有明显的抑制效应。氧化苦参碱对小鼠脾T、B淋巴细胞和细胞因子呈双向调节作用,即高浓度(1 mg/mL)呈不同程度的抑制效应,而低浓度(10~5 mg/mL)则有明显的增强效应,较高浓度时与分裂霉素对淋巴细胞的作用呈协同作用<sup>[34]</sup>。

### 1.6 抗溃疡作用

盐酸乙醇溃疡作用模型试验结果表明,口服25, 50 mg/kg的苦参酮,能抑制盐酸乙醇诱发的溃疡,且苦参酮对盐酸乙醇溃疡的抑制作用是通过胃粘膜直接进行的<sup>[34]</sup>。王清华等人<sup>[39]</sup>用苦参和其他几种中草药合用治疗外阴溃疡也取得了显著的疗效。

### 1.7 抗炎抑菌作用

苦参有抗炎抑菌作用,对痢疾杆菌、金色葡萄球菌、维白痢沙门氏杆菌均有显著的抑制作用,对瑾色毛癣菌等十多种皮肤真菌亦有不同程度的抑制作用<sup>[40]</sup>。肌肉注射苦参碱,能明显对抗由巴豆油诱发的耳壳炎症,长期给药,其作用随剂量增加而增强;苦参还对大鼠后肢因角叉菜胶诱发的炎症及因小鼠腹腔注射冰醋酸诱发的渗出性炎症有明显的抑制作用<sup>[41]</sup>。苦参还具有抗原虫活性,对致病性皮肤真菌有抑制作用,可用于治疗黄鳃皮肤打印病和鲤鱼竖鳞病;与百部合用可治甲鱼疥癬、毛霉病等<sup>[42]</sup>。李洪敏等人<sup>[43]</sup>采用二倍梯度稀释法研究苦参碱对结核杆菌的作用,结果表明苦参碱对结核杆菌有较强的抑制作用,最低抑菌浓度为10 mg/L,但杀菌效果较弱。张耀龙<sup>[44]</sup>报道,苦参碱能抑制角朊细胞增殖,并有抗炎和调节免疫的作用,临床上用于治疗银屑病32例,总有效率达87.5%,尤其对早期病人疗效更好,对病期长、皮损厚、面积较大者也能起到减少鳞屑,使皮肤变薄和稳定病情的作用。

现已知苦参抗菌的主要活性成分是苦参碱、氧化苦参碱、槐定碱、三叶豆檀甙和高丽槐素<sup>[4]</sup>。

### 1.8 抗病毒活性

陈婷婷等<sup>[45]</sup>报道,苦参总碱浓度在0.000 2~3.125 g/mL时,可产生明显的抗柯萨奇B病毒(CVB)活性,且作用与药物浓度存在剂量依赖关系。刘晶星等<sup>[46]</sup>以纯化的CVB作为病毒蛋白质对照,研究其作用机理,结果表明纯化苦参总碱抗

CVB的作用机理是不影响病毒的吸附,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。杨志伟等人<sup>[47]</sup>的研究表明,苦参总碱在体外有明显抗CVB<sub>3</sub>(柯萨奇B组3型病毒)的作用。叶明等人<sup>[48]</sup>报道,苦参碱具有抗乙肝病毒的作用,可用于乙型肝炎的临床治疗。

### 1.9 对细菌脂多糖所致的小鼠死亡有抑制作用

苦参碱可有效抑制细菌脂多糖导致的小鼠死亡。腹腔注射LPS(细菌脂多糖)10 mg/kg后,小鼠出现竖毛、呼吸急促、大小便失禁等症状,大部分在12~18 h内死亡;而预先口服不同剂量的苦参碱后,可有效抑制LPS的致死毒性,且呈现显著的量效关系<sup>[49]</sup>。

### 1.10 抗生育作用

杜俊杰等人<sup>[50]</sup>用苦参碱进行体外杀精子效力试验,结果表明苦参碱使精子瞬间失活的最低有效浓度为0.85~3.15 g/L,与国外杀精子剂比较,苦参碱的有效杀精浓度强于TS-88,稍弱于NP-10。黄自明等<sup>[51]</sup>报道,苦参碱体外抑精活性存在明显的量效关系,低浓度时可使精子运动受抑制,随着浓度的提高,抑制作用逐渐增强,形态学观察发现苦参碱对精子有致死作用。药敏试验表明,苦参碱不抑制乳酸杆菌的生长、繁衍,不干扰阴道的菌群环境。

### 1.11 抗过敏和平喘作用

鲍淑娟等人<sup>[52]</sup>报道,氧化苦参碱能抑制IgE和由抗原引起的肥大细胞释放组织胺,但不改变Pa细胞的cAMP水平,说明氧化苦参碱有抗过敏作用;对大鼠、豚鼠的离体气管、回肠平滑肌在有Ca<sup>2+</sup>和无Ca<sup>2+</sup>的情况下,苦参碱均能明显地对抗组织胺、乙酰胆碱和氯化钡兴奋气管平滑肌和肠平滑肌的作用,在无Ca<sup>2+</sup>的情况下,这种对抗作用更为明显。可见,苦参具有平喘作用,临床上已用来治疗支气管哮喘及喘息型气管炎。

### 1.12 药理上的其他活性作用

苦参还有利尿、镇静、镇痛解热的作用,而且苦参中的其他一些成分,如金雀碱、臭豆碱有兴奋呼吸的作用,白金雀花碱有兴奋子宫的作用<sup>[53]</sup>。白音夫等<sup>[54]</sup>报道,苦参中的黄酮酮类化合物对盐酸、乙酸、消炎痛引起的胃粘膜损伤有明显的保护作用,苦参碱也具有这种作用。徐三强<sup>[55]</sup>报道,苦参素能快速杀死HIV-1病毒,从而具有防治艾滋病的作用。章顺意等<sup>[56]</sup>报道,苦参具有抗阴道滴虫的活性。辛顺妹等<sup>[57]</sup>报道,苦参碱具有止泻的作用。另外,用苦参碱滴鼻液治疗变应性鼻炎,疗效显著,且苦参碱滴鼻

液对鼻粘膜无刺激性<sup>[58]</sup>。

## 2 在植物保护方面的活性作用

### 2.1 杀虫活性

苦参在农业上作为杀虫剂使用,在我国历史上已有不少记载,李时珍的《本草纲目》中记载的杀虫植物中就有苦参。20世纪40年代,华南农业大学赵善欢教授便开始了苦参在农业上的应用调查研究,称黔桂农民长期用苦参杀虫<sup>[39]</sup>。另据报道<sup>[59]</sup>,苦参防治农业和卫生害虫的对象非常广,包括甘蓝蚜、棉蚜、红蜘蛛、棉叶跳虫、菜青虫、烟青虫、猿叶虫、桑磷、野蚕、三化螟、稻飞虱、叶蝉、粘虫、地老虎、蚜虫、软体害虫及各种毛虫等。

曲学刚<sup>[60]</sup>用苦参素防治苹果树蚜虫的试验结果表明,喷施苦参素植物杀虫剂1000倍液不会产生药害,在施药后1d蚜虫减退率为84.1%,校正防效为85.4%;施药后3d蚜虫减退率为98.7%,防效也提高到99%;施药后5d蚜虫数有回升现象,但防效仍为98%以上,防治效果优于氧化乐果,且苦参杀虫剂不含化学药剂成分,对果园无污染,无残留,在果树生产上有广阔的应用前景。曾明森等<sup>[61]</sup>用苦参素防治茶尺蠖的结果表明,用苦参素500倍液与1000倍液防治3~4龄茶尺蠖幼虫效果良好,防治后1~7d,防效均达95%以上,两者无显著差异,且防效均与对照农药杀灭菊酯2000倍液相当,与室内试验一致,表现出了强烈的触杀作用;用苦参素500倍液防治茶小绿叶蝉,防治后1和3d的效果分别为80.8%和69.1%,1000倍液的防治效果分别为74.1%和64.7%,防治效果均优于对照农药高效氯氟菊酯2000倍液的防效。郑方强等<sup>[62]</sup>用2g/L的蚜螨敌水剂(有效成分为苦参碱)和3g/L的绿灵水剂(有效成分为苦参碱)进行防治韭蛆及杀虫研究,结果表明,这2种植物杀虫剂均表现出很好的杀虫效果,在总体效果上与辛硫磷相当,用500,800和1000倍液,试虫在9~12d内全部死亡;大田试验表明,这2种苦参碱杀虫剂在施药后7d的防效分别为92.42%和88.82%,14d之内能将被害率控制在3%以下;室内研究表明,苦参碱对韭蛆的消化系统、神经系统和内分泌系统均能产生明显的影响。用3.8g/L的苦参碱防治菜青虫、菜蚜的药效试验表明,其1000倍,1500倍和2000倍药液在施药后3,5,7d对菜青虫的防效均达100%,对菜蚜的防效也优于菜田常用药剂敌杀死的防效<sup>[63]</sup>。孙光忠等<sup>[64]</sup>用1g/L的氧化苦参碱水剂1800mL/hm<sup>2</sup>防治菜

青虫,施药后3~7d,防效可达99.5%;用药1200和900mL/hm<sup>2</sup>,在施药后3~7d的防效均在94%以上,防治效果非常显著。南京农业专科学校用3.6g/L的苦参碱水剂防治小菜蛾也取得了很好的防治效果<sup>[65]</sup>。张牢牢等<sup>[66]</sup>亦报道,1g/kg苦参生物碱对菜青虫的防治效果为85%~95%,1.5g/kg对粘虫的防效为90%,2g/kg对白菜蚜的防效为100%;并且经分离测定,认为其主要活性成分为苦参碱和槐果碱。郑永权等<sup>[67]</sup>报道,苦参中的黄酮类化合物苦参酮和槐属二氢黄酮G对蚊子具有毒杀活性。

据资料报道<sup>[40]</sup>,苦参的甲醇提取物有较强的杀线虫活性,经生物追踪分离鉴定,证明其杀线虫的活性成分为甲基野靛碱,活性对比试验证明甲基野靛碱的杀线虫活性是臭豆碱的2倍,是野靛碱和尼古丁的50%。据此可以认为,野靛碱型结构具有杀线虫活性,苦参碱的杀线虫活性较差,而苦参碱的不饱和衍生物槐果碱及槐胺碱却有较强的杀线虫活性,其中槐果碱的杀线虫活性最强,因此认为苦参碱型生物碱 $\delta$ 内酰胺环的不饱和程度对杀线虫活性是至关重要的。另外,苦参叶的提取物也具有良好的杀虫活性,通过分离鉴定,其活性成分为苦参碱<sup>[40]</sup>。

### 2.2 杀菌活性

苦参具有较广谱的杀菌活性,除前面所述的抗炎抑菌活性外,在农业生产上,苦参也对多种病菌具有较强的生物活性。冯俊涛等<sup>[68]</sup>用苦参的丙酮提取液(1g/mL)做杀菌试验,以生长速率法测定苦参对番茄灰霉、小麦赤霉、苹果炭疽菌丝生长的抑制作用,抑制率分别为99.2%,93.2%和90.8%;采用孢子萌发法测定其对苹果炭疽菌丝生长的抑制作用,抑制率为87.0%;采用黄瓜子叶法测定其对番茄灰霉病菌的保护作用,效果为89.6%;采用温室盆栽法测定其对小麦白粉病的保护及治疗作用,效果为59.0%。郑永权等<sup>[67]</sup>报道,苦参中的黄酮类化合物苦参酮和槐属二氢黄酮G对金黄色链球菌、表皮葡萄球菌、黑曲霉、葡萄孢、大肠杆菌等10种病菌具有抑菌作用。另据报道<sup>[67]</sup>,苦参酮和槐属二氢黄酮G对金黄色葡萄菌和链球菌等食物传染性细菌有抗菌作用。从苦参中分离并鉴定的黄酮类化合物降苦参酮、苦参酮、苦参醇、5-O-甲基苦参醇C以及L-高丽槐素等对茄属丝核菌、硬柄皮伞、范特波里氏腐霉、瓜果腐霉等草坪致病菌有一定抑制作用<sup>[40]</sup>。

### 2.3 杀鼠活性

张宏利等<sup>[69]</sup>以小白鼠为试鼠,对苦参的不同部位进行了杀鼠活性测定,结果表明,饵料中样品含量

为 20 g/kg 时, 苦参根、茎叶对小白鼠个体的毒杀率分别为 100% 和 50%; 样品含量为 150 g/kg 时分别为 100% 和 20%。以家鸡为试验动物进行的二次中毒试验中, 无家鸡死亡现象。夏瑞心等<sup>[70]</sup>报道, 用苦参制成的植物毒鼠剂对害鼠具有一定的毒杀作用。

### 3 苦参的其他活性

苦参碱是苦参的一种化学成分, 含有像植物内源激素的相似物质, 所以对农作物有刺激生长的作用, 同时亦有抑制真菌的作用<sup>[71]</sup>。近几年, 苦参也用于卫生用品, 如含苦参等 8 种中草药的具有杀菌作用而无副作用的卫生纸, 含苦参等 14 种中草药的具有预防皮肤病功效的香皂, 含苦参的可预防粉刺和可增白的化妆品以及含苦参等多种植物提取液用于治疗脚臭的药液等, 均已申请了专利<sup>[40]</sup>。傅生<sup>[72]</sup>报道, 苦参碱对害虫也具有有效的驱避作用。

王秀满等<sup>[73]</sup>报道, 在育肥猪饲料中添加适量苦参后, 试验组比对照组日采食量提高 6.3%, 日增重提高 16.98%, 饲料报酬提高 9%; 在 60 d 的试验期内, 试验组比对照组平均每头猪增加效益 22.35 元。

### 4 小 结

从以上的总结中可以看出, 在苦参生物活性的研究方面, 前人已做了大量的工作, 且对其活性的研究还在继续。几十年来, 我国在苦参的临床应用方面积累了丰富的经验, 化学成分和药理活性的研究进一步推动临床应用更趋于广泛和深入。作为天然物质的苦参中的有效成分, 在药理上有传统药物无法

比拟的优势, 如在抗肿瘤方面, 苦参碱对肿瘤细胞具有较高的活性, 且对其他正常细胞无副作用。而传统药物如苯丁酸氮芥、顺二氯二氨基铂、阿霉素、长春新碱、五氟尿嘧啶、蓖麻毒素等抗癌药物, 虽都能有效杀死癌细胞, 但同时正常细胞具有毒性, 并且需要较高的使用剂量, 因此常常引起严重的副作用, 极大地影响这些药物的治疗效果<sup>[74]</sup>。可见, 苦参在肿瘤及其他疾病的治疗中大有发展前途, 目前的研究及临床试验报道较多, 而在此方面的产品报道较少, 大多停留在研究阶段, 建议能加强苦参在医疗应用方面的产品研制和开发。

在对苦参化学成分和生物活性的研究中, 所用材料大多为苦参根, 而据张宏利等<sup>[69]</sup>报道, 苦参茎叶也具有较强的生物活性, 因此, 也应重视对苦参茎叶的研究, 进一步提高苦参植物资源的利用率。

按照我国“十五”规划, 甲胺磷、久效磷、对硫磷、甲基对硫磷和氧化乐果等 5 个高毒品种农药的总产量要从 1999 年的 11.77 万 t 削减到 2005 年的 2.33 万 t, 削减 80% 以上<sup>[75]</sup>, 这将为我国发展生物农药提供巨大的市场。苦参在农林业生产中可以防治多种病虫害及鼠害, 并已有几种以苦参为有效成分的农药品种上市, 但与对苦参总体生物活性的研究相比, 其作用还远远未得到发挥, 特别是现在还未见有以苦参活性成分为有效成分的植物性杀鼠药剂的报道。因此, 应进一步扩大苦参在农药上的应用范围, 并对苦参的有效活性成分、结构、构效关系以及防治病虫害和杀鼠的作用机制进行深入研究, 进一步开辟我国植物性农药的新天地。

### [参考文献]

- [1] 西北植物研究所. 黄土高原植物志第二卷[M]. 北京: 中国林业出版社, 1992: 333
- [2] 陈冀胜, 郑 硕. 中国有毒植物[M]. 北京: 科学出版社, 1987: 338
- [3] Golstein P. Controlling cell death[J]. Science, 1999, 275: 1081- 1082
- [4] 苗抗立, 张建中, 董 颖, 等. 苦参的化学成分及药理的研究进展[J]. 天然产物研究与开发, 2001, 13(2): 69- 73
- [5] 邱慧颖, 陈伟忠. 苦参碱的治疗作用[J]. 人民军医, 1999, 42(8): 484- 485
- [6] 钱学敏, 李继强, 罗鸿予, 等. 氧化苦参碱抑制SMMC-7721 细胞增殖的研究[J]. 上海第二军医大学学报, 2002, 22(6): 512- 514
- [7] 姜孟臣, 陈 虹, 张 敏. 苦参碱对人HT1080 细胞系增殖抑制的体外研究[J]. 武警医学院学报, 2002, 11(2): 71- 73
- [8] 陈伟忠, 林 勇, 谢渭芬. 苦参碱抗肿瘤机制的研究进展[J]. 肿瘤学杂志, 2002, 8(1): 4- 6
- [9] 司维柯, 尚桃元, 康格非. 苦参碱对人肝癌细胞 HepG2 的细胞形态影响和相关增殖因素的变化[J]. 第三军医大学学报, 2000, 22(6): 553- 556
- [10] Zhang L P, Jiang J K, Tam J W, et al. Effects of matrine on proliferation and differentiation in K-562 cells[J]. Leuk Res, 2001, 25(9): 793- 800
- [11] 司维柯, 秦建平, 蒋纪恺. 苦参诱导 K562 细胞分化的研究[J]. 中草药, 1997, 28(5): 309- 310
- [12] 张燕军, 夏 天, 赵建斌. 苦参碱对 SMMC-7211 细胞系的诱导分化作用[J]. 第四军医大学学报, 1998, 19(3): 340- 343
- [13] 张百红, 岳红云, 李新民. 苦参碱抗癌作用与诱导肿瘤细胞凋亡[J]. 肿瘤研究与临床, 1999, 11(6): 402- 403

- [14] Cecilian M Whitacer, Nathan A. Factors affecting topotecan-induced programmed cell death: adhesion protects cells from apoptosis and impair cleavage of poly (Aop-Ri-bose) polymerase[J]. *Cancer Res*, 1999, 57: 215
- [15] Dome L S, Look A T. Three molecular determinants of malignant conversion and their potential as therapeutic targets[J]. *Curr Opin Oncol*, 1999, 11: 58- 67
- [16] 张百红, 岳红云, 李新民. 苦参碱对胃癌癌细胞SGC-7901 BCL-2 表达的影响[J]. *中国肿瘤临床与康复*, 2000, 7(3): 34- 35
- [17] Shiratori H, Koshino T, Uesugi M, et al. Acceleration of lung metastasis by up-regulation of CD44 expression in osteosarcoma-derived cell transplanted mice[J]. *Cancer Lett*, 2001, 170(2): 177- 182
- [18] Emmak D, Jennings A T, Kobinson L, et al. Restricted pattern of CD44 variant exon expression in human papillary thyroid carcinoma[J]. *Can Res*, 1996, 56(5): 1037- 1039
- [19] 林洪生, 李树奇, 裴迎霞, 等. 川芎嗪苦参碱对癌细胞与内皮细胞粘附及粘附因子表达的影响[J]. *中国新药杂志*, 1999, 8(6): 384- 386
- [20] 黄祝青, 龚守军, 孙永年, 等. 苦参素治疗慢性乙型肝炎疗效分析[J]. *肝脏*, 2002, 7(1): 67- 68
- [21] Yoshioka K, Kakum S, Arai M, et al. Immunohistochemical studies of intra-hepatic tumour necrosis factor  $\alpha$  in chronic liver disease[J]. *Clin Pathol*, 1990, 43: 298- 302
- [22] González-Amaro R, Gariá-Monzón C, Gariá-Bucy L, et al. Induction of tumour necrosis factor  $\alpha$  production by human hepatocytes in chronic viral hepatitis[J]. *Exp Med*, 1994, 179: 841- 848
- [23] 韩家文, 冯晓君, 白惠卿, 等. 氧化苦参碱对小鼠激活的巨噬细胞吞噬功能的影响[J]. *北京医科大学学报*, 1987, 19(4): 269- 270
- [24] 甘乐文, 王国俊, 李玉莉. 苦参素对大鼠慢性肝损伤的防护作用[J]. *中草药*, 2002, 33(4): 339- 341
- [25] 黄志刚, 翟为溶. 实验性肝纤维化模型及特点[J]. *肝脏*, 1997, 2(1): 51- 55
- [26] 陈缙云, 向文玉, 周国燎, 等. 氧化苦参碱对实验性肝损伤保护作用的观察[J]. *药学通报*, 1983, 18(7): 23- 25
- [27] 刘天灯. 苦参素抗纤维化作用的临床评价[J]. *安徽医药*, 2002, 6(2): 25- 26
- [28] 陈伟忠, 张俊平. 苦参碱对实验大鼠肝纤维化的影响[J]. *中国新药与临床杂志*, 2000, 19(5): 410- 413
- [29] 张宝恒, 孔祥军. 苦参碱的抗心率失常作用[J]. *中国药理学学报*, 1990, 11(3): 253
- [30] 张明发, 沈雅琴. 槐果碱的平喘药理与临床[J]. *新药与临床*, 1989, 8(6): 354- 355
- [31] 黄彩云, 谢世荣, 黄胜英, 等. 苦参碱抗心率失常作用的实验研究[J]. *大连医科大学学报*, 2002, 24(3): 177- 179
- [32] 王继光, 吕高虹. 苦参总黄酮抗实验性心律失常作用的研究[J]. *中药药理与临床*, 2001, 17(5): 13- 14
- [33] 江纪武. 植物药有效成分手册[M]. 北京: 人民卫生出版社, 1986: 701, 796, 981.
- [34] 刘桂荣, 黄万忠, 严仲铠. 苦参的研究概况[J]. *特产研究*, 1993, (4): 35- 38
- [35] 李 燕, 何立人. 苦参碱类生物碱的心血管系统药理研究[J]. *中草药*, 2000, 31(3): 227- 229
- [36] 李 青, 王 进. 氧化苦参碱的强心作用[J]. *沈阳药科大学学报*, 1999, 16(4): 281- 284
- [37] 蒋袁絮, 余建强, 彭建中. 氧化苦参碱对小鼠的中枢抑制作用[J]. *宁夏医学院学报*, 2000, 22(3): 157- 158, 162
- [38] 耿群美, 李兰城, 贾晓英. 苦参碱、氧化苦参碱对小白鼠脑中递质  $\gamma$ -氨基丁酸和甘氨酸含量的影响[J]. *内蒙古医学杂志*, 1993, 13(1): 3- 4
- [39] 王清华, 姜 坤, 李亚莉, 等. 外阴溃疡治验介绍[J]. *福建中医药*, 1991, 22(6): 45- 46
- [40] 郑永权, 姚建仁, 邵向东. 苦参化学成分及农业应用研究概况[J]. *农药科学与管理*, 2000, 21(1): 24- 26
- [41] 沈雅琴, 张明发. 苦参碱型生物碱的平喘药理与临床[J]. *西北药学杂志*, 1989, 4(4): 12
- [42] 林 斌, 钱 蕾. 防治鱼病的几种野生中草药[J]. *福建农业科技*, 1999, (6): 37
- [43] 李洪敏, 冯端浩. 中药苦参碱对结核杆菌的抑制作用[J]. *解放军药科学学报*, 2002, 18(6): 383- 384
- [44] 张耀龙. 苦参碱治疗银屑病临床观察[J]. *河北医学*, 1996, 2(6): 590
- [45] 陈婷婷, 陈曙霞, 刘晶星. 苦参总碱对柯萨奇B 病毒感染的Hela 细胞的保护作用[J]. *中国实验临床免疫学杂志*, 1997, 9(1): 18- 21
- [46] 刘晶星, 陈福祥, 陈曙霞. 苦参总碱抗柯萨奇B 病毒作用机理研究[J]. *上海第二医科大学学报*, 1996, 16(3): 183- 185
- [47] 杨志伟, 周 娅, 曹秀琴. 苦豆总碱、苦参总碱体外抗柯萨奇B<sub>3</sub> 病毒的作用[J]. *宁夏医学杂志*, 2002, 24(12): 707- 710
- [48] 叶 明, 周四光. 苦参碱注射液治疗病毒性肝炎临床疗效的观察[J]. *广东医药*, 1998, 19(12): 962- 963
- [49] 陈 红, 余祥彬, 方传志, 等. 苦参碱对细菌脂多糖体内活性的抑制作用[J]. *海峡医学*, 1999, 11(4): 21- 22
- [50] 杜俊杰, 郭仁兴, 刘胜家. 苦参碱的体外杀精子作用[J]. *西安医科大学学报*, 1996, 17(3): 388- 389
- [51] 黄自明, 任 哲, 冯苏哲. 苦参碱的抗生育活性及对人阴道正常菌群乳酸杆菌的影响[J]. *河南医科大学学报*, 1996, 31(3): 67- 68
- [52] 鲍淑娟, 李淑芳, 周文正. 苦参碱平喘作用机理探讨[J]. *中药药理与临床*, 1995, 11(5): 33- 34
- [53] 赵玉英, 张如意. 苦参化学成分研究概况[J]. *天然产物研究与开发*, 1991, 3(3): 93- 103
- [54] 白音夫, 莫日根. 苦参碱对大鼠实验性胃粘膜损伤的作用[J]. *中草药*, 1996, 27(12): 729- 730
- [55] 徐三强. 苦参防治艾滋病的研究取得突破性进展[J]. *上海医药经济信息*, 1995, (1): 27
- [56] 章顺意, 田光佩. 不同浓度的苦参液抗阴道滴虫的实验研究[J]. *天津中医学院学报*, 1998, 17(1): 39- 40
- [57] 辛顺妹, 马竹卿. 苦参碱的止泻作用研究[J]. *中成药*, 1998, 20(5): 30- 32
- [58] 郑子敏, 晋 玲. 苦参碱的研究及临床应用概况[J]. *右江民族医学院学报*, 2002, 24(6): 908- 909

- [59] 中国土农药志编辑委员会. 中国土农药志[M]. 北京: 科学出版社, 1959: 65- 67.
- [60] 曲学刚. 用苦参素植物杀虫剂防治苹果树蚜试验[J]. 北方果树, 1996, (3): 18.
- [61] 曾明森, 吴光远, 王庆森, 等. 苦参素防治茶尺蠖茶小绿叶蝉试验初报[J]. 茶叶科学技术, 2001, (1): 12- 14.
- [62] 郑方强, 刘忠德. 无公害杀虫剂防治韭蛆的药效试验及苦参碱杀虫作用的研究[J]. 农药, 2002, 41(6): 26- 28.
- [63] 郁伟, 李铁军, 顾绘, 等. 0.38% 苦参碱对菜青虫、菜蚜的药效试验[J]. 蔬菜, 2000, (6): 26.
- [64] 孙光忠, 彭超美. 氧化苦参碱防治菜青虫药效试验[J]. 长江蔬菜, 2000, (3): 19- 20.
- [65] 南京农业专科学校科研办. 生物农药——0.36% 的苦参碱水剂防治小菜蛾药效实验初报[J]. 南京农专学报, 2001, (2): 24, 86.
- [66] 张牢牢, 张淑梅. 植物农药苦参碱的研究[J]. 农药, 1997, 36(5): 26- 27.
- [67] 郑永权, 姚建仁, 邵向东. 苦参杀虫抑菌活性成分研究[J]. 农药学报, 1999, 1(3): 91- 93.
- [68] 冯俊涛, 祝木金, 于平儒, 等. 西北地区植物源杀菌剂初步筛选[J]. 西北农林科技大学学报(自然科学版), 2002, 30(6): 129- 133.
- [69] 张宏利, 韩崇选, 杨学军, 等. 苦参杀鼠活性的研究[J]. 西北农业学报, 2003, (4): 111- 114.
- [70] 夏瑞心, 巩向日. 我国森林鼠害防治对策[J]. 辽宁林业科技, 1997, (6): 47- 51.
- [71] 郭长合. 苦参在农药中的研究与应用[J]. 农药科学与管理, 2001, 22(4): 27- 28.
- [72] 傅生. 新型生物农药——清源暴牌0.6% 苦参碱水剂[J]. 农业科技与信息, 2002, (4): 24.
- [73] 王秀满, 边金刚, 宁淑兰, 等. 饲料中添加苦参对育肥猪增重效果的影响[J]. 畜牧与兽医, 2002, 34(7): 16.
- [74] 马萼. 治疗新剂型药物——导向药物[J]. 医药信息, 1995, 8(增刊): 29- 30.
- [75] 徐汉虹, 张志祥, 查友贵. 中国植物性农药开发前景[J]. 农药, 2003, 42(30): 1- 10.

## Advances in the research on bioactivity of *Sophora flavescens*

ZHANG Hong-li<sup>1</sup>, ZHANG Yue-jin<sup>2</sup>, HAN Chong-xuan<sup>1</sup>, YANG Xue-jun<sup>1</sup>,  
Wang Ming-chun<sup>1</sup>, YANG Qing-e<sup>1</sup>, GAO Jin-ming<sup>2</sup>

(1 College of Forestry, Northwest Sci-Tech University of Agriculture and Forestry, Yangling, Shaanxi 712100, China;

2 College of Life Sciences, Northwest Sci-Tech University of Agriculture and Forestry, Yangling, Shaanxi 712100, China)

**Abstract:** In the review we summarize the research progress on bioactivity of *Sophora flavescens* in recent years. The main active compounds are alkaloids and flavonoids. Study has shown that *Sophora flavescens*, which is Chinese traditional medicine, has antitumor, antiabscess, antiproliferative, antiarrhythmic and antiviral activities, and in agriculture, it could poison and control many plant diseases and insect pests, and possesses activity of killing rat. The direction for the future application research was also suggested.

**Key words:** *Sophora flavescens* Ait.; bioactivity; antipest activity; antiviral activity; activity for rat control