

# 天麻活性成分及药理作用研究概况

任擎宇, 商学良\*

华北理工大学心理与精神卫生学院, 唐山 063210

**摘要:**天麻作为兰科天麻属植物, 主要含有天麻素、天麻多糖、天麻昔元和巴利森昔等多种活性成分, 具有保护血管、保护神经元、抗氧化、镇静、镇痛等多种药理作用。目前, 天麻活性成分的提取方法主要包括: 水煮醇沉法、热回流提取法、酶提取法和微波提取法等。天麻所具有的广泛生物学特性使其在医药、食品以及护肤品等领域, 均具有较高的研究和应用价值。本文对目前有关天麻活性成分提取、药理作用研究、产品开发等报道做出归纳、总结, 旨在为后续研究开发提供科学依据。

**关键词:**天麻; 活性成分; 药理作用; 研究概况

中图分类号: R961.1

文献标识码: A

文章编号: 1001-6880(2021) Suppl-0178-04

DOI: 10.16333/j.1001-6880.2021.S.024

## Overview on the active components and pharmacological effects of *Gastrodia elata* Bl.

REN Qing-yu, SHANG Xue-liang\*

School of Psychology and Mental Health, North China University of Science and Technology, Tangshan 063210, China

**Abstract:** It has been reported that *Gastrodia elata* Bl. contains gastrodin, *G. elata* polysaccharide, gastrodigenin, parishin B and other active ingredients, which have many pharmacological effects such as protecting blood vessels, protecting neurons, antioxidation, sedation and analgesia. The methods of active components extraction of *G. elata* mainly include alcohol precipitation, heat reflux extraction, enzyme hydrolysis and microwave-assisted extraction. *G. elata* has important research values and practical significance in the fields of medicine, food and skin care product for its broad biological characteristics. The research situation of active components extraction, pharmacological effects and product development of *G. elata* in recent years was reviewed in order to provide scientific basis for the further study and development.

**Key words:** *Gastrodia elata* Bl.; active ingredient; pharmacological action; general situation of research

天麻(*Gastrodia elata* Bl.)又名赤箭、独摇芝、合离草、白龙皮、离母, 性甘味平, 其药用部位为其地下根块茎, 入药历史悠久, 是我国名贵且常用的中药材之一。天麻为兰科天麻属多年腐生草本植物, 植株可达两米, 根块茎肥厚, 呈椭圆形或近哑铃形, 生长于湿润的灌木林下或肥沃的土壤上, 在中国、尼泊尔、不丹等地均有广泛分布。据明代医药学家李时珍在《本草纲目》中记载, 天麻具有平肝熄风、祛风止痛的功效。近些年的研究发现, 天麻还具有保护

血管和神经元、抗氧化和镇静的作用, 且毒副作用很低<sup>[1]</sup>。因此, 关于天麻的研究越来越受到国内外学者的关注和探讨<sup>[2]</sup>。本文对已经发表的文献中有关天麻活性成分提取、药理作用及开发利用价值的研究文章进行归纳、总结, 旨在为今后对天麻进行深入开发和临床应用研究提供帮助。

### 1 主要活性成分提取研究

国内外学者对天麻的研究显示: 天麻的主要化学成分为酚类化合物, 如天麻素(也称天麻昔)、对羟基苯甲醇、香兰素等, 其中, 天麻素是天麻的主要活性成分。另一种重要化学成分为有机酸类, 主要为巴利森昔类化合物, 它具有显著的抗衰老<sup>[3]</sup>、抗癌等生物活性<sup>[4]</sup>。除此之外, 天麻中还含有氨基酸类、甾体类、多糖类及多肽类等其他多种成分<sup>[5]</sup>。

收稿日期: 2020-07-30 接受日期: 2020-08-19

基金项目: 河北省科技研发计划重点项目(19227115D); 河北省自然科学基金青年基金(C2019209478); 河北省卫生计生委办公室医学科学研究课题计划(20191097)

\* 通信作者 Tel: 86-315-8805977; E-mail: shangxuelianghao@126.com

## 1.1 天麻素成分提取研究

天麻素(gastrodin)即对羟基苯甲醇- $\beta$ -D 葡萄糖吡喃糖苷,又名天麻苷,外观为白色针状或棱柱状结晶,易溶于甲醇、乙醇和水,若用苦杏仁酶水解,可得到对羟甲基苯醇苷。目前的研究认为,天麻素是天麻最主要的活性成分,具有安眠镇定、抗炎和抗痫等作用<sup>[6]</sup>。同时,天麻素在调节心脑血管功能、增强机体免疫力方面也起到一定作用,因此其含量的高低是评价天麻品质的重要指标。

目前关于天麻素活性成分的提取,主要有传统浸泡提取法、热回流提取法、酶提取法<sup>[7]</sup>等,但由于这些方法渗漉时间长、提取效率低,研究学者们将关注点逐渐转移到新兴的提取方法——微波提取法。微波具有选择性高、加热效率高且穿透力强等特点,相对于传统方法来说,微波提取法操作简单、提取效率高且时间短等优势。提取流程为,取天麻根块茎粉碎过筛,在 50 °C 环境下干燥两个小时后,加入适量的乙醇溶液并置于三颈烧瓶中,计算重量。在浸泡 6 h 后,将其置于常压微波合成工作站中进行微波提取,然后用乙醇补充损失的溶剂重量,摇匀后再过滤,将滤渣按照上述步骤重复提取,合并多次提取液,减压浓缩后过微孔滤膜,可得天麻素溶液<sup>[8]</sup>。

## 1.2 天麻多糖成分提取研究

天麻多糖(*G. elata* polysaccharide, GEP),其糖链主要结构为  $\alpha$ -吡喃型 D-葡萄糖,是一种以葡萄糖为主要构成成分的多组分多糖,含有木吡喃糖、吡喃葡萄糖等单糖。天麻多糖是天麻的主要活性成分之一,平均含量为 13.33%,含量高且具有增强免疫力、清除自由基、抗病毒、提高记忆力等药理作用<sup>[9]</sup>。天麻多糖是天麻中一类外观呈白色粉末状固体,溶于水,但不溶于甲醇、乙醇、丙酮等有机溶剂的多糖活性成分。

传统的天麻多糖提取方法通常为水煮醇沉法。取天麻粉末加入蒸馏水中进行水浴两次,浓缩后加入 Sevage 试液(氯仿:正丁醇=3:1)并去除蛋白,再次浓缩后加入乙醇溶液中,放入冰箱静置后离心沉淀,最后水溶醇沉,过滤干燥<sup>[10]</sup>。用此方法的天麻多糖提取率约为 4%。超声波提取是一种新型中药材提取技术,具有高效、省时、操作简单等优点。将天麻碾碎过筛,按照 1:30 料液比加入 80% 的乙醇,应用超声浸提去除天麻中多余的单糖、低聚糖等成分,过滤晾干后粉碎成粉末至锥形瓶内,按 1:25 料液比加入去离子水,超声提取后将溶液定容过

滤<sup>[11]</sup>。实验结果表明,天麻多糖最高效的超声波提取工艺参数为:在 44 °C 的温度下,按照 1:23 的料液比提取时间 45 min,此条件下的天麻多糖提取率可高达 31.2%<sup>[12]</sup>。

## 1.3 天麻苷元成分提取研究

天麻苷元化学名为 4-羟基苯甲醇(4-hydroxybenzylalcohol,4-HBA),即对羟基苯甲醇,为天麻中的一类酚类化合物,具有镇静、抗氧化、抗惊厥、神经保护等功能,同时对肿瘤血管的生成和生长方面也可起到抑制作用<sup>[13]</sup>。

相对于天麻素和天麻多糖来说,关于天麻苷元的提取测定研究相对较少。目前主要的提取方法为超声波提取法。将天麻磨成粉末,置于浓度为 50% 甲醇的水溶液试管中,超声处理 30 min 后混匀再处理 30 min。倒入 EP 管中离心处理,取上清液过滤后进行碱水解,将其与 NaOH 溶液混合,在 80 °C 环境温度进行水解 2 h,再加入 500  $\mu$ L 酶溶液用缓冲液进行酶水解,并在 50 °C 环境温度中高速震荡,即可将提取物中的总天麻素水解成天麻苷元<sup>[14]</sup>。

## 1.4 巴利森苷成分提取研究

巴利森苷类化合物是以天麻素及其衍生物与柠檬酸在不同羧基位点通过酯键缩合的一类化合物,属于柠檬酸酯类,根据缩合的位置和数量,可衍生出不同的衍生物,如巴利森苷 B、巴利森苷 C 等。日本研究人员 Taguchi 等<sup>[15]</sup> 1981 年首次在天麻中发现了巴利森苷及其衍生物的存在。

由于巴利森苷分子中含有糖且极性偏大,基于这种生物活性,它的提取多采用浓度 70% 左右的甲醇水,再用脱脂、柱层析、制备色谱等手段分离制备。Xiao 等<sup>[16]</sup> 发明了更高效的巴利森苷成分提取技术,其程序为,将天麻水提物用 20% 乙醇溶解后上 HPD-100 树脂柱,先用乙醇水洗脱除杂后,再用 20% 乙醇溶液洗脱得到初步分离物。然后将分离物用水溶解后用  $C_{18}$  柱再次进行分离,应用甲醇和醋酸水两相体系进行洗脱,将流出的不同组分进行收集,浓缩后即得巴利森苷及不同衍生物组分<sup>[17]</sup>。

## 2 药理作用研究

### 2.1 对血管血压的作用

天麻对心脑血管系统的作用主要表现在降低血压方面。高血压病作为诱发心脑血管类疾病的主要危险因素,其发展机制及治疗方案一直被广泛关注。高血压病的产生主要是由于有炎症细胞黏附因子在内皮细胞(endothelial cell, EC)中表达,血管壁发生

炎症反应后引起血管的内皮损伤,通过血流动力学改变,炎性因子造成内皮细胞功能障碍及血管重塑,形成了高血压后进一步诱发心脑血管疾病<sup>[18]</sup>。研究表明,天麻可通过抑制相关炎性因子的分泌,在降低内皮素-1(endothelin-1, ET-1)含量的同时,提高一氧化氮的储备,从而起到保护血管内皮细胞的效果<sup>[19]</sup>。因此,天麻在减轻血管的炎症反应、内皮损伤和改善血液流变学指标等方面起到明显作用,通过降低血管收缩来降低血压和保护血管。

## 2.2 对神经系统的作用

神经元又称神经细胞,是中枢神经系统中最基本的结构和功能单位之一,它具有传导兴奋和感受刺激的功能。外伤、缺氧和感染等因素均会导致神经元的损坏,引起如中风、癫痫等中枢神经系统疾病。天麻作为传统中药材,其提取物可以干预中枢神经系统内的神经递质释放,通过调控 Nrf2/ERK 的表达,影响氧化应激酶以达到保护神经元的目的<sup>[20]</sup>。

Zhang 等<sup>[21]</sup>研究表明,天麻素可以降低皮质神经元受体诱导产生的毒性,通过抑制细胞外谷氨酸水平来改善神经元缺氧,对中风和癫痫患者症状均有改善。另外,天麻素还可以减少沙鼠海马癫痫模型中,氨基丁酸合成酶和氨基丁酸转氨酶的免疫活性,通过抑制分流,使中枢神经系统的抑制性神经递质氨基丁酸浓度提高,从而预防癫痫的发生。

## 2.3 抗氧化的作用

自由基在体内过量堆积后,会攻击细胞膜上不饱和脂肪酸,并促进脂质过氧化物(lipid peroxide, LPO)的生成,产生氧化损伤后使细胞和神经受损。大量的过氧化物在体内堆积,会使细胞正常的生理活性受阻,引发机体病变和衰老,是阿尔兹海默病、帕金森病和心脑血管疾病的共同诱因之一。研究表明,天麻提取物可以升高大鼠血清及肝脏中超氧化物歧化酶水平,降低 LPO 含量,有效清除体内自由基<sup>[22]</sup>。此外,Chen 等<sup>[23]</sup>通过实验证明,天麻中提取的天麻多糖在清除超氧阴离子自由基和羟基自由基方面,效果明显,具有抗氧化作用。

## 2.4 其他作用

天麻作为一种传统的名贵中药材,还在镇静催眠、抗菌和提高免疫力等方面发挥较好的药理作用。天麻中天麻素,作为主要活性物质,可以在神经系统中发挥镇静催眠作用,且不产生药物依赖性<sup>[24]</sup>。天麻中分泌的抗真菌蛋白(antifungal protein, GAFF),

能对真菌侵袭产生抑制作用,这一基因已经通过转基因技术导入到农作物中,以增强它们的抗菌能力。Lu 等<sup>[25]</sup>在动物实验中发现,天麻可以显著增强小鼠体内巨噬细胞的吞噬功能及血清溶菌酶活力,促进机体免疫反应,提高机体免疫力。

## 3 天麻产品的开发研究

随着经济和科技的快速发展,学者们对天麻这类传统中药材的研究也逐渐深入。目前以天麻为原材料生产茶、药酒、食品和护肤品已取得很大进展,同时在临床应用上,也有被加工使用的片剂、胶囊、注射液以及联合其他中药组方的复方产品。

此外,天麻可与针灸、其他药物等联合应用,效果甚佳。半夏白术天麻汤作为祛风通络的传统方剂,联合针灸后可促进脑部血液循环,改善患者血流变及凝血功能,有效治疗急性缺血性脑卒中<sup>[26]</sup>。天麻素联合异丙嗪治疗眩晕症疗效显著,起效时间短、安全性好<sup>[27]</sup>。天麻钩藤饮联合拉贝洛尔治疗重度子痫患者时效果突出,不仅可以治疗妊娠期子痫,还可令血液流变学指标得到改善<sup>[28]</sup>。天麻作为传统的中药材,具有广泛的开发前景和研究价值。

## 4 总结

综上所述,随着研究的深入和技术的发展,天麻的活性成分越来越清晰、提取技术也日趋成熟,愈发高效便捷。同时,天麻的药理作用亦得到证实,它具有保护血管和神经元、抗氧化、抗惊厥等作用,并且在镇静催眠、提高免疫力等方面同样有显著的疗效,与其他药物联合治疗后,临床应用效果显著。

尽管国内外学者已经对天麻提取物进行了许多分离及纯化研究,天麻制剂也在临床方面得到了应用,但关于它的一些药理机制在细胞、分子和基因水平,尚未完全明确,需要进一步探究。鉴于天麻生物活性成分和药理作用的重要性,更需要学者们的深层次研究,以便更好地发挥其应有价值。

## 参考文献

- 1 Matias M, et al. *Gastrodia elata* and epilepsy: rationale and therapeutic potential [J]. *Phytomedicine*, 2016, 23: 1511-1526.
- 2 Liu TR, et al. Research progress and industry development proposals of *Gastrodia elata* Bl [J]. *Mod Tradit Chin Med* (中国现代中药), 2020, 22: 647-651.
- 3 Lin YF, et al. Parishin from *Gastrodia elata* extends the lifespan of yeast via regulation of Sir2/Uth1/TOR signaling pathway [J]. *Oxid Med Cell Longev*, 2016, 2016: 1-11.

- 4 Berek L, et al. Effects of naturally occurring glucosides, salsodine glucosides, ginsenosides and parishin derivatives on multidrug resistance of lymphoma cells and leukocyte functions[J]. *In Vivo*, 2001, 15(2): 151-156.
- 5 Zhu SH, et al. Isolation and identification of main active components of *Gastrodia elata* Blume and the effects of initial processing methods on their contents[J]. *J Hunan Agr Univ; Nat Sci*(湖南农业大学学报:自科版), 2019, 45: 194-198.
- 6 Zhan HD, et al. The rhizome of *Gastrodia elata* Blume-an ethnopharmacological review [J]. *J Ethnopharmacol*, 2016, 189: 361-385.
- 7 Hu AJ, et al. Enzymatic extraction of gastrodin from tuber of *Gastrodia elata* [J]. *Mod Food Sci Technol*(现代食品科技), 2010, 26: 1364-1366.
- 8 Zeng SQ, et al. Microwave-assisted extraction of gastrodin from *Gastrodia elata* and its content determination [J]. *Guangdong Chem Ind*(广东化工), 2019, 46(11): 31-33.
- 9 Ma FW, et al. Extraction and content determination of polysaccharides from Rhizoma *Gastrodiae* of different harvest periods[J]. *Food Res Dev*(食品研究与开发), 2018, 39(22): 47-51.
- 10 Zhang G, et al. Study on the extraction and antioxidant activity of polysaccharides from *Gastrodia elata* Bl[J]. *Agr Dev Equip*(农业开发与装备), 2019(6): 118-119.
- 11 Cheng LJ, et al. Determination of polysaccharide content of *Gastrodia elata* in Zhaotong and optimization of ultra-sound-assisted extraction technology[J]. *J Anhui Agr*(安徽农业科学), 2019, 25(Z1): 28-29.
- 12 Hou MN, et al. Optimization in ultrasonic-assisted extraction process of *Gastrodia elata* Blume polysaccharides from Shaanxi by response surface methodology [J]. *Chem Bioeng*(化学与生物工程), 2018, 35(2): 49-53.
- 13 Kim HJ, et al. Ether fraction of methanol extracts of *Gastrodia elata*, a traditional medicinal herb, protects against kainic acid-induced neuronal damage in the mouse hippocampus [J]. *Neurosci Lett*, 2001, 314(1-2): 65-68.
- 14 Zhu HY, et al. Determination of the contents of gastrodin, 4-hydroxybenzyl alcohol and *Gastrodia* polysaccharides in different processed products of *Gastrodia elata* Bl. f. *glauca* S. Chow[J]. *J Chin Pharm Sci*(中国药学), 2017, 52: 2062-2065.
- 15 Taguchi H, et al. Studies on the constituents of *Gastrodia elata* Blume[J]. *Chem Pharm Bull*, 1981, 29(1): 55-62.
- 16 Xiao HB, et al. Method for simultaneously preparing chemical reference substances of parishin, parishin B and parishin C (同时制备 parishin, parishin B, parishin C 化学对照品的方法): CN 201010566919 [P]. 2011-05-25.
- 17 Ma FW, et al. Research progress on the structure characterization of parishins in *Gastrodiae* Rhizoma [J]. *J Guiyang Univ; Nat Sci*(贵阳学院学报:自科版), 2018, 13(3): 78-85.
- 18 Yang XH, et al. Danhong injection reduces vascular remodeling and up-regulates the kallikrein-kinin system in spontaneously hypertensive rats[J]. *Sci Rep*, 2017, 7(1): 4308.
- 19 Wang HJ, et al. Study on the anti-hypertension of *Gastrodia elata* based on metabonomic technology [J]. *Chin J Integr Tradit West Med*(中国中西医结合杂志), 2020, 40: 324-330.
- 20 Zhang CC, et al. A review on phenolic components in *Gastrodia elata* Blume and its pharmacological effects on the central nervous system[J]. *Pharm Clin Chin Mater Med*(中药药理与临床), 2019, 35(2): 167-174.
- 21 Zhang FY, et al. Research advances of protective effect and mechanism of gastrodin on nervous system[J]. *J Henan Univ Sci Tech; Med Sci*(河南科技大学学报:医学版), 2019, 37: 236-240.
- 22 Sun XF, et al. Research progress of neuroprotective mechanisms of *Gastrodia elata* and its preparation [J]. *China J Chin Mater Med*(中国中药杂志), 2004, 29(4): 8-11.
- 23 Chen C, et al. Extraction, purification and antioxidant activity of polysaccharides from *Gastrodia elata* Bl [J]. *J Clin Pharmacol*(中国临床药理学杂志), 2018, 34: 2203-2206.
- 24 Liu WL, et al. Sedative, hypnotic and anti-convulsant effect of gastrodin injection[J]. *Chin J Trop Agr*(热带农业科学), 2019, 39(9): 51-57.
- 25 Lu YJ, et al. Experimental study on the effect of ginsenoside in enhancing mouse's immune function [J]. *J Intern Med*, 2015, 21: 141-143.
- 26 He F, et al. Clinical effect of Banxia Baizhu Tianma decoction combined with acupuncture and moxibustion on cerebral ischemic stroke[J]. *Clin Res Pract*(临床医学研究与实践), 2020, 5(12): 138-140.
- 27 An JS, et al. Meta-analysis of gastrodin combined with Promethazine on vertigo[J]. *J Emerg Tradit Chin Med*(中国中医急症), 2020, 29(1): 50-53.
- 28 Shi K, et al. Tianma Gouteng Drink combined with Labetalol in the treatment for 45 cases of severe eclampsia[J]. *Western J Tradit Chin Med*(西部中医药), 2019, 32(10): 91-93.