

酶解吸收,无需取出,大大方便了使用者。此外,通过体内外释放试验,证明其有缓释作用。因此,该明胶海绵栓是一种长效、安全、使用方便的制剂。

### 6.3 控释阴道用胶囊

《中国药典》2005 版收载有妇炎净胶囊阴道给药系统,内含中等释药速度的颗粒和缓释小丸,明胶胶囊外包有速释包衣。

### 6.4 生物黏附性阴道片

有人已研制出甲硝唑的生物黏附片,黏附基质为改性淀粉。将患者随机分成两组,一组给以含甲硝唑 100mg 的阴道生物黏附片,另一组给以含安慰剂的阴道片,运用双盲法同时给以口服甲硝唑片的第 3 组患者进行比较。1 周后,甲硝唑生物黏附片的用量虽只有口服量的 1/7070,但对细菌性阴道炎的治愈率与口服甲硝唑片大致相同。

### 7 结语

粘膜给药拓宽了许多药物的给药途径,也为一些因口服活性低或注射半衰期短而落选的新药提供了解决途径。愈来愈多的药物被发现可以通过粘膜吸收,从而也产生了许多新剂型。特别是一些药物经粘膜吸收避免了首过效应,提高了生物利用度,达到局部或全身治疗的目的。同时粘膜给药有一定的靶向作用,给药方法较简单,患者易于接受。

### 参考文献:

[1] 冯丽莉,胡杰,黄华,等.银杏叶提取物掩盖方法筛选及口腔崩解

片制备[J].沈阳药科大学学报,2005,22(6):406.

- [2] 刘梅,崔光华.口腔速释片的进展及前景[J].中国药学杂志,2001,36(9):580.
- [3] 范琦,蒋心惠,袁岚,等. UV 法测定甲硝唑口颊片的含量[J].儿科药理学杂志,2006,12(4):43.
- [4] 王忠良,钱士明.心安宁滴鼻剂预处理对大鼠心肌缺血实验研究[J].中国中医基础医学杂志,2007,13(1):32.
- [5] Martin E. Nasal absorption of dihydroergotamine from liquid and powder formulations in rabbits [J]. JPharm Sci,2006,86(7):802-807.
- [6] 崔福德.药剂学[M].第五版.北京:人民卫生出版社,2006.361.
- [7] Witschi C. In vitro evaluation of microparticles and polymer gels for use as nasal platforms for protein delivery [J]. Pharm Research,2007,16(3):382-390.
- [8] 黄亚东,项琪,姚崇舜,等.载朱油滴鼻剂研制及抗病毒作用的实验研究[J].中药材,2007,30(3):342.
- [9] Antti A. Patient satisfaction with Easyhaler compared with other inhalation systems in the treatment of asthma: A meta-analysis [J]. Current Ther Research,2005,(61):61-73.
- [10] 陆彬.药物新剂型与新技术[M].第2版.北京:人民卫生出版社,2005.606.
- [11] 于西全,杨中东,吴燕,等.前列中空栓的制备及质量控制[J].中国中药杂志,2004,29(12):1136.
- [12] 王明丽,蒋军,王莉英.直肠给药新制剂的研究进展[J].药学与临床研究,2007,21(5):228.
- [13] 刘运德,王津生.三种剂型麦迪霉素兔体内的血药浓度测定[J].天津药学,2001,13(3):352.
- [14] 陈圣洁,陈志红.栓剂新剂型的研究概况[J].医学理论与实践,2006,21(10):316.
- [15] 徐子猷,陈纪岳,李巧云,等.复方蛇床子明胶海绵阴道栓剂的实验研究[J].中国医院药学杂志,2005,14(9):387.

## 小茴香化学成分及药理作用的研究进展

付起凤,张艳丽,许树军,杨大宇

(黑龙江中医药大学,黑龙江 哈尔滨 150040)

**摘要:**小茴香被国家卫生部正式确定为“既是药品,又是食品”的极具开发潜力的资源之一,广泛受到人们的关注。因此综述了小茴香药材的化学成分及药理作用的研究进展情况,以便今后对其进行更深入的研究。

**关键词:**小茴香;化学成分;药理作用

**中图分类号:**R282.710.5

**文献标识码:**A

**文章编号:**1002-2406(2008)05-0024-03

小茴香为常用中药,始载于《唐本草》,为伞形科植物茴香(*Foeniculum vulgare* Mill)的干燥成熟果实。秋季果实初熟时采割植株,晒干,打下果实,除去杂质。味辛,性温,具有散寒止痛、理气和胃的功能。用于寒

疝腹痛、睾丸偏坠、痛经、少腹冷痛、脘腹胀痛、食少吐泻及睾丸鞘膜积液等病症。盐小茴香具有暖肾散寒止痛的功效。用于寒疝腹痛、睾丸偏坠、经寒腹痛<sup>[1]</sup>。小茴香的果实又是调味品,而它的茎叶部分也具有香气,可食用;提取的茴香油既可食用,又可药用,还可作为化妆品的香精使用。现就小茴香药材的化学成分及药理作用的研究进展情况综述。

### 1 小茴香的化学成分研究

据研究证实,小茴香药材中主要含脂肪油、挥发油、甾醇及糖苷、氨基酸等,还含有三萜、鞣质、黄酮、强

**作者简介:**付起凤(1965-),女,副教授,硕士研究生,主要从事化学实验教学。

**收稿日期:**2008-05-02

**修回日期:**2008-05-27

心苷、生物碱、皂苷、香豆素、挥发性碱、蒽醌、有机酸等多种类型化合物<sup>[2]</sup>。

1.1 脂肪油 小茴香果实中含脂肪油约18%，其脂肪酸组成中，洋芫荽子酸(Petroselinic acid)占60%、油酸(oleic acid)22%、亚油酸(lioleic acid)14%、棕榈酸(palmitic acid)4%<sup>[3]</sup>。尚含大量的C18的醇(Stearyl Alcohol)、花生酸(arachidic acid)、山嵛酸(Behenic acid)等所成的蜡，豆甾醇(Stigmasterol)、7-羟基香豆精(7-hydroxycoumarin)、6,7-二羟基香豆素(6,7-Dihydroxycoumarin)、齐墩果酸(oleanolic acid)、胆碱和乙酰胆碱等<sup>[4]</sup>。

1.2 挥发油 小茴香果实中含挥发油约3%~6%<sup>[3]</sup>，主要成分为茴香醚(Anethole)50%~60%、爱草脑(Estragole)、小茴香酮(Fenchone)18%~20%<sup>[5]</sup>。尚含 $\alpha$ -烯( $\alpha$ -inene)、 $\beta\gamma\delta\lambda$ -水芹烯( $\beta\gamma\delta\lambda$ -Phellandrene)<sup>[1]</sup>、茨烯(Camphene)、二戊烯(Dipentene)、茴香醛(Anisealdehyde)、茴香酸(Anisic acid)。另含顺式茴香醚(Cis-Anethole)、对聚伞花素(p-Cymene)、东当归酞内脂(ligustilide)和亚丁基苯酞(Butyridenepthalide)<sup>[6]</sup>。据近几年研究显示其中还含有 $\beta$ -蒎烯( $\beta$ -Pinene)、月桂烯(myrcene)、柠檬烯(Limonene)、葑酮(Fenchone)<sup>[7]</sup>、冰片烯(bornene)、1,8-桉叶素(1,8-cineole)<sup>[8]</sup>、反式- $\beta$ -罗勒烯、新别罗勒烯、 $\alpha$ -占巴烯<sup>[9]</sup>、葑醇乙酸乙酯、对甲氧桂皮酸己酯、对甲氧苯基丙酮(p-Methoxyphenylacetone)等成分<sup>[10]</sup>。

1.3 甾醇及糖苷 小茴香果实中主要含植物甾醇基- $\beta$ -呋喃果糖苷(phytosteryl- $\beta$ -fructofuranoside)、谷甾醇(Sitosterol)、豆甾醇(Stigmasterol)、 $\Delta^7$ -豆甾烯醇( $\Delta^7$ -stigmastanol)、菜油甾醇(Campesterol)<sup>[2,3]</sup>。

1.4 氨基酸 小茴香果实中含主要含谷氨酸(Glutamic acid)、谷酰胺(Glutamine)、天门冬氨酸(Aspartic acid)、天门冬酸(Asparagine)、脯氨酸(Proline)、精氨酸(Arginine)、丙氨酸(Alanine)及 $\gamma$ -氨基丁酸( $\gamma$ -Aminobutyric acid)<sup>[2,11]</sup>。

1.5 其它 小茴香果实中还含有丰富的维生素E、维生素B<sub>1</sub>、维生素B<sub>2</sub>、核黄素及胡萝卜素，且微量元素Fe、Cu、Zn、Mn、Se的含量也很高<sup>[11]</sup>。

## 2 小茴香药理活性的研究

现代药理研究证明，小茴香具有显著的抑菌、调节胃肠机能、利尿等作用，同时还具有利胆、保肝、促肾、抗癌、抗突变及性激素样等作用。

2.1 抑菌作用 高莉<sup>[12]</sup>等对小茴香挥发油的抑菌作用做了研究，结果表明，所选4种菌种的生长均明显受

到了抑制，其中，对金黄色葡萄球菌抑制作用最强，其次是枯草芽孢杆菌和变形杆菌，大肠杆菌最差。研究结果还发现，样品用乙醚稀释后能加强其抑菌作用。

钟瑞敏<sup>[13]</sup>等对小茴香籽精油的抗菌活性进行了研究。对受试的7种食源性致病菌和2种腐败性真菌，小茴香籽精油表现出优良的广谱性抗菌活性，其中黑曲霉和副溶血性嗜盐菌对该精油最为敏感，最小抑菌量(MIC)分别小于0.004%和0.015%(体积分数)。

马强<sup>[14]</sup>等采用超声波法提取了小茴香挥发油，并将挥发油应用到农业的常见28种致病真菌上，研究其抗菌活性。结果表明，小茴香挥发油具有较好的杀菌抑菌效果。

据冈崎<sup>[15]</sup>等报道，小茴香油对真菌、孢子、鸟型结核菌、金黄色葡萄球菌等有灭菌作用。

2.2 调节胃肠机能作用 小茴香油能降低胃的张力，随后又刺激而使其蠕动正常化，缩短排空时间。对肠则增进张力及蠕动，因而促进气体的排出。有时兴奋后蠕动又降低，因而有助于缓解痉挛、减轻疼痛<sup>[3]</sup>。

曾有研究人员用小茴香精油类对动物肠管运动的影响作了一系列研究，发现小茴香对兔肠的蠕动有促进作用，即使摘去肠管也有收缩作用。以后又有研究人员用小鼠离体肠管、豚鼠回肠及鹌鹑离体直肠作为研究对象进行实验，也均证实了小茴香油有增强肠的收缩作用及促进肠的蠕动作用<sup>[15]</sup>。

2.3 利胆作用 山原<sup>[15]</sup>等报道小茴香有利胆作用，其作用表现为伴随着胆汁固体成分增加促进胆汁分泌。

2.4 保肝作用 Gershbein<sup>[15]</sup>研究用小茴香精油处理大鼠的肝看其对肝再生度的影响。结果，对部分肝摘除的大鼠，小茴香油治疗10天，组织的再生度增加，肝重量与对照组比较明显增加。

甘子明<sup>[16]</sup>等观察了中药小茴香对大鼠肝纤维化的预防作用，其结论为中药小茴香具有抑制大鼠肝脏炎症、保护肝细胞、促进纤维化肝脏中胶原降解及逆转肝纤维化的作用。

H. Ozbek<sup>[17]</sup>等人报道，小茴香挥发油对于CCl<sub>4</sub>所引起的小鼠肝脏的毒害能够起到保护作用。

2.5 利尿作用 周世雄等<sup>[18]</sup>探讨了中药小茴香对肝硬化腹水大鼠的利尿作用及其作用机制。中药小茴香对肝硬化腹水大鼠总排尿量有明显的促进作用。

D. Beaux<sup>[19]</sup>等研究显示，给小鼠喂食小茴香的15%乙醇提取物能够明显增加小鼠尿液的排泄量和尿液中钠的含量。

2.6 促渗作用 沈琦<sup>[20]</sup>等研究了小茴香油、茴香醛、茴香脑等对 5-氟脲嘧啶(5-Fu)的促渗作用。采用体外透皮实验方法,用 Valia Chien 水平扩散池为实验装置,测定模型药物 5-Fu 的累积渗透量及渗透系数、增渗倍数,确定其促渗效果的强弱。结果上述药物对 5-Fu 均有一定的促渗作用,增渗倍数分别为 7.14、4.17、9.54。其结论为小茴香油、茴香脑、茴香醛等对 5-Fu 具有一定的促渗作用。

2.7 性激素样作用 Malini T.<sup>[21]</sup>等观察了小茴香的丙酮浸出物对雄雌大鼠的作用。首先,给雄性大鼠喂药 15 天后,发现蛋白浓度在睾丸、输卵管明显减少,同时,在精囊和前列腺增加,并且,这些器官的酸性、碱性磷酸酶活性全部降低(除了血管中的碱性磷酸酶活性没有改变)。对于雄性大鼠,用该浸出物给药 10 天,出现阴道内角化及性周期促进作用。此外,乳腺、输卵管、子宫内膜、子宫肌层重量增加。Ostad N.<sup>[22]</sup>等研究显示,小茴香挥发油对于小鼠子宫平滑肌具有解痉挛的作用。

2.8 抗突变作用 小茴香对  $O_2^-$ 、 $OH^-$  和  $H_2O_2$  等多种活性氧或自由基有不同程度的清除作用。多力坤<sup>[23]</sup>等通过给小鼠喂食小茴香后实验组的染色体畸变率明显降低,表明小茴香是有效的抗突变物质。

2.9 抗癌作用 新加坡国立大学研究人员发现,印度人用来煮咖喱的黑色小茴香香料具有消灭癌细胞的作用<sup>[24]</sup>。实验还证明它可延长患癌动物的寿命,研究人员从实验动物中发现,只要抽取这种学名为“瘤果黑种草”里的一种化学物质,将其注入患癌老鼠的体内,会使癌细胞数量大大减少,且增殖停顿,从而使得老鼠的寿命从一般的 13 天延长到 20 天<sup>[24]</sup>。

Moon<sup>[15]</sup>等证实,由小茴香提取的植物聚多糖,有抗肿瘤作用。

2.10 对中枢系统的影响 小茴香油、茴香脑对青蛙都有中枢麻痹作用,蛙心肌开始稍有兴奋,接着引起麻痹,神经肌肉呈箭毒样麻痹,肌肉自身的兴奋性减弱<sup>[15]</sup>。

2.11 对气管的作用 Boyd<sup>[15]</sup>等将小茴香油溶于 12% 乙醇,灌胃给药时用乌拉坦麻醉豚鼠时,发现气管内液体分泌物增多。因切断胃神经后不产生影响,所以,认为不是通过胃的发射作用而致。

2.12 其它药理作用 小茴香油可作驱风剂,在腹胀时可排除气体,减轻疼痛<sup>[3]</sup>。小茴香酮为樟脑异构体,故有与樟脑相似的某些局部刺激作用<sup>[10]</sup>。Liu<sup>[15]</sup>报道,阿魏酸脂、人参皂苷、茴香脑、肉桂酸盐配合使用能减轻癌药的副作用,此作用与提高机体免疫力有关。

## 参考文献:

- [1] 国家药典委员会. 中华人民共和国药典[M]. 北京: 化学工业出版社, 2005. 32.
- [2] 阴健. 中药现代研究与临床应用[M]. 北京: 中医古籍出版社, 1997. 14.
- [3] 江苏新医学院. 中药大辞典[M]. 下册. 上海: 上海人民出版社, 1985. 1592.
- [4] 聂凌云, 吴孜涵. 小茴香的质量分析研究进展[J]. 解放军药学报, 2001, 17(4): 198-200.
- [5] 中国医学科学院药植所. 药物所. 中药志[M]. 北京: 人民卫生出版社, 1959. 17.
- [6] 陈耀祖, 李兆林, 薛敦渊, 等. 闪蒸-毛细管气相色谱/质谱法分析中草药的挥发性成分[J]. 高等学校化学学报, 1985, 6(12): 1075.
- [7] 赵淑平. 小茴香挥发油的成分[J]. 植物学报, 1991, 33(1): 82-84.
- [8] 孙景琦. 小茴香果实挥发油化学成分的研究[J]. 内蒙古农牧学报, 1993, 14(1): 45-48.
- [9] 吴孜涵, 聂凌云, 刘云, 等. 气相色谱-质谱法分析不同产地的小茴香药材挥发油成分[J]. 药物分析杂志, 2001, 21(6): 415-418.
- [10] 刘密新, 汪伟. 小茴香挥发油的成分分析[J]. 中草药, 1997, 28(1): 14.
- [11] 冯秀华. 小茴香果实营养价值研究[J]. 内蒙古农业学院学报, 1994, 15(2): 39-42.
- [12] 高莉, 斯拉甫·艾白, 韩阳花. 小茴香挥发油化学成分及抑菌作用的研究[J]. 中国民族医药杂志, 2007, (12): 67-68.
- [13] 钟瑞敏, 肖仔君, 张振明, 等. 小茴香籽精油成分及其抗菌活性研究[J]. 林产化学与工业, 2007, 27(6): 36-40.
- [14] 马强, 何璐, 王玉龙, 等. 小茴香挥发油超声波提取工艺优化及抗菌活性研究[J]. 安徽农业科学, 2007, 35(7): 1912-1913.
- [15] 陈立国. 小茴香的药理作用[J]. 中草药, 1989, 20(7): 41-42.
- [16] 甘子明, 方志远. 中药小茴香对大鼠肝纤维化的预防作用[J]. 新疆医科大学学报, 2004, 27(6): 566-569.
- [17] H. Ozbek. Hepatoprotective effect of foeniculum vulgare essential oil [J]. Fitoterapia, 2003, (74): 317-319.
- [18] 周世雄, 甘子明, 张力, 等. 中药小茴香对肝硬化腹水大鼠利尿作用机制实验研究[J]. 新疆医科大学学报, 2007, 30(1): 30-32.
- [19] D. Beaux. Diuretic action of hydroalcohol extracts of foeniculum vulgare var dulce (D. C.) roots in ratsP [J]. hytotherapy research, 1997, (11): 320-322.
- [20] 沈琦, 徐莲英. 小茴香对 5-氟脲嘧啶的促渗作用研究[J]. 中成药, 2001, 23(7): 7-9.
- [21] Malini T. Effect of foeniculum vulgare Mill. seed extract on the genital organs of male and female rats [J]. Indian journal of physiology and pharmacology, 1985, (29): 21-26.
- [22] Ostad N. Evaluation of impact Foeniculum vulgare variety dulce on inhibiting the contractions of rats uterus induced by oxytocin and prostaglandin E2 [J]. Barij essence pamphlet, 2000, (1): 27-29.
- [23] 多力坤·买买提玉素甫, 王德萍, 艾合买提, 等. 小茴香和洋茴香抗突变作用的初步研究[J]. 中国公共卫生, 2001, 17(7): 647.
- [24] 新加坡国立大学. 小茴香、穿心莲、平卧菊可抗癌[J]. 东南亚纵横, 2000, (1): 38.