

DOI:10.3969/j.issn.1000-9760.2017.04.005

苦荞麦化学成分 药理作用及体内代谢研究进展*

任 强

(济宁医学院药学院,日照 276826)

摘 要 苦荞麦 [*Fagopyrum tataricum*(L.) Gaertn] 中的化学成分因具有降血糖、降血脂以及抗氧化等药理作用。本文通过 CNKI、Science Direct、John Wiley、Springer Link 等数据库进行文献检索,并对国内外文献进行研究与分析,对苦荞麦植物中黄酮类、甾体类、萜类、有机酸类等结构类型化学成分、药理作用以及体内代谢方面研究进展进行了较全面的综述,为进一步合理利用苦荞麦植物提供有价值的参考。

关键词 苦荞麦;化学成分;生物活性

中图分类号:R282.4 文献标识码:A 文章编号:1000-9760(2017)08-251-05

To research progress in chemical constituents and biological activities of *Fagopyrum tataricum*(L.) Gaertn

REN Qiang

(School of Pharmacy, Jining Medical University, Rizhao 276826, China)

Abstract: The tartary buckwheat is commonly used for the treatment of lowering blood sugar, lowering blood lipid and antioxidation. By means of analysis the reported literatures from CNKI, Science Direct, John Wiley, Springer Link database, flavonoid, triterpenoid and polysaccharide of this plant, biological activities and metabolism in vivo have been reviewed in this paper. It is applied to make a further exploration.

Keywords: Tartary buckwheat; Chemical composition; Biological activity

苦荞麦 [*Fagopyrum tataricum*(L.) Gaertn] 又名鞑靼荞麦,是蓼科荞麦属一年生草本植物。作为一种药食同源植物,具有降血糖、降血脂以及抗氧化等作用^[1]。在《本草纲目》中记载:“苦荞麦,性味苦、平、寒。有益气力,续精神,利耳目,降气,宽肠,健胃的作用”。同时苦荞麦也是一种具有丰富营养价值的小宗杂粮,具有独特的食疗和保健功能。苦荞麦源于我国,具有丰富的资源,我国有食用苦荞麦的习惯,被开发成各种具有营养和保健功能的食品。例如,苦荞麦维夫饼干、麦片、挂面、苦荞麦茶、冲剂以及糖尿病食疗粉等。糖尿病患者使用苦荞麦食品可以降低餐后血糖水平,使血糖保持在正常水平。民间常用苦荞麦来治疗糖尿病,具有较好的降血糖、降血脂作用。本文从化学成分、药

理作用和体内代谢 3 个方面的研究进展进行综述。

1 苦荞麦中的化学成分

经文献检索,关于化学成分研究表明主要含有:黄酮类、糖苷类、有机酸类、甾体类、萜类等成分。

1.1 黄酮类

黄酮类化合物主要是黄酮醇及其苷类,主要成分是芦丁^[2]、槲皮素^[2]、山奈酚^[2]、山奈酚-3-O-芸香糖苷^[2]、异山奈酚^[3]、槲皮素-3-β-D-芸香糖-3'-O-β-葡萄糖苷^[4]、槲皮苷^[5]、荭草素^[6]、异荭草素^[6]、牡荆素^[6]、异牡荆素^[6]。在苦荞麦植物中共发现 11 个黄酮类化合物,其中黄酮苷元 6 个,黄酮氧苷 5 个,黄酮碳苷 4 个,结构式如图 1 所示。

1.2 酚类化合物

目前发现苦荞麦植物中的酚类物质有 4 个,分别为:表儿茶素^[7-8]、儿茶素^[9]、矢车菊素-3-O-葡萄

* [基金项目] 山东省自然科学基金资助项目(ZR2015HL124);山东省医药卫生科技发展计划项目(2014WS0508)

糖苷^[10]、矢车菊素-3-O-芸香糖苷^[10], 结构式如图 2 所示。

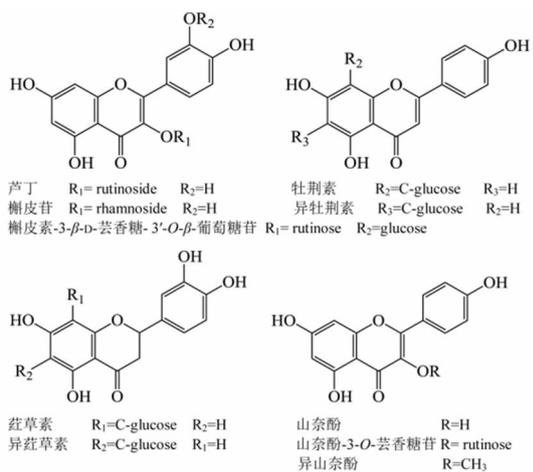


图 1 苦荞麦植物中黄酮类化合物结构式

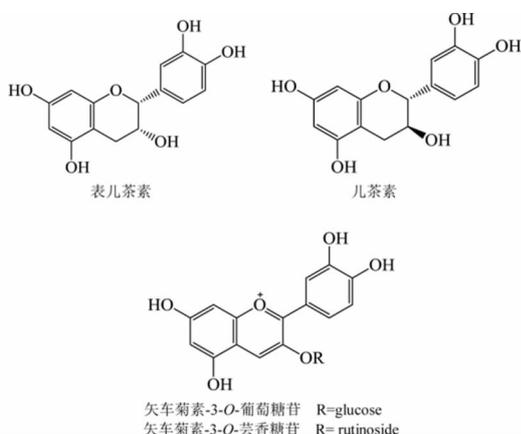


图 2 苦荞麦植物中酚类化合物结构式

1.3 甾体类化合物

甾体类化合物是以环戊烷并多氢菲为母核衍生的一类化合物, 主要包括 C₂₁ 甾类、强心苷类、甾体皂苷类、植物甾醇类、昆虫变态激素以及胆汁酸类。目前苦荞麦中已报道的 5 个甾体化合物主要是 C₂₁ 甾。主要包括: β-谷甾醇^[3]、过氧化麦角甾醇^[3]、胡萝卜甾醇^[3]、β-谷甾醇棕榈酸酯^[11]、豆甾-4-烯-3,6-二酮^[11], 结构式如图 3 所示。

1.4 萜类化合物

萜类化合物是由异戊二烯或异戊烷以各种方式连接而成的一类化合物, 苦荞麦植物中目前发现 1 个萜类化合物为乌苏酸^[7,12], 结构式如图 4 所示。

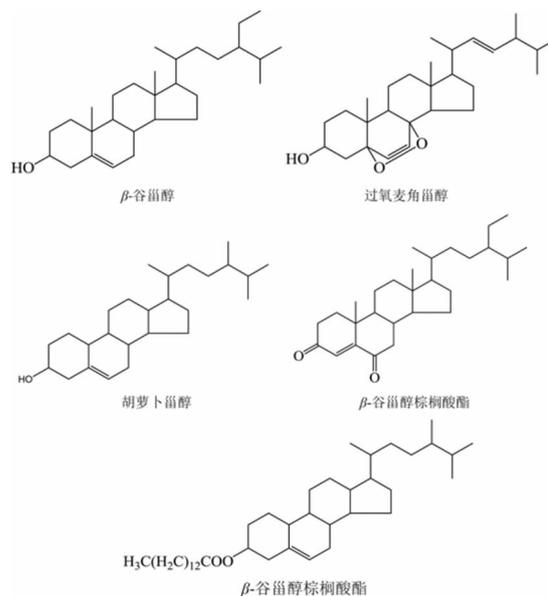


图 3 苦荞麦植物中甾体类化合物结构式

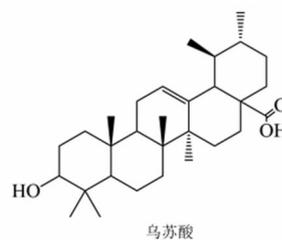


图 4 苦荞麦植物中萜类化合物结构式

1.5 糖苷类化合物

糖苷类化合物是以蔗糖为母核取代有不同数量的香豆酰基和阿魏酰基而形成的一类化合物, 苦荞麦植物中目前发现糖苷类化合物有 9 个, 分别为 Taroside^[9]、Tatarisides A^[13]、Tatarisides B^[13]、Tatarisides C^[13]、Tatarisides D^[13]、Tatarisides E^[13]、Tatarisides F^[13]、Tatarisides G^[13]、diboside A^[13], 结构式如图 5 所示。

1.6 有机酸类化合物

苦荞麦植物中目前发现有有机酸类化合物有 6 个, 分别为绿原酸^[6]、没食子酸^[8]、阿魏酸^[8]、咖啡酸^[8]、原儿茶酸^[14]、对羟基苯甲酸^[14], 结构式如图 6 所示。

1.7 其他类化合物

目前苦荞麦植物中发现的其他类化合物主要有: 7-羟基香豆素^[7]、蔗糖^[11]、尿嘧啶^[11]、白藜芦醇^[15]、D-手性肌醇^[16]、大黄素^[17], 结构式如图 6 所示。

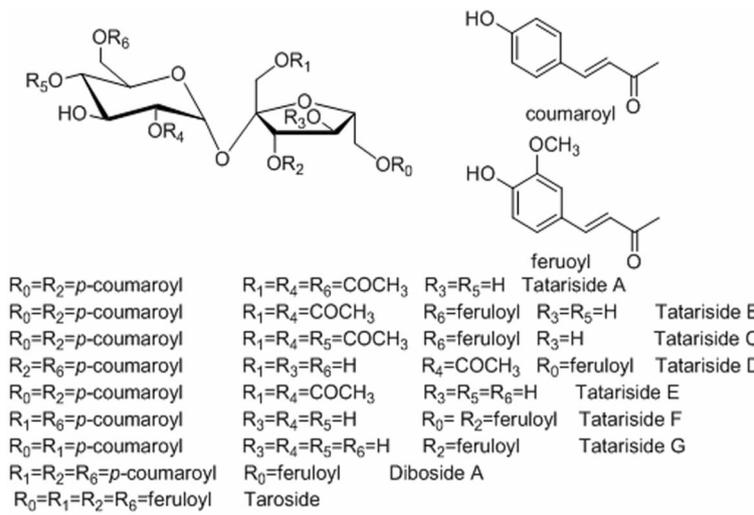


图 5 苦荞麦植物中糖苷类化合物结构式

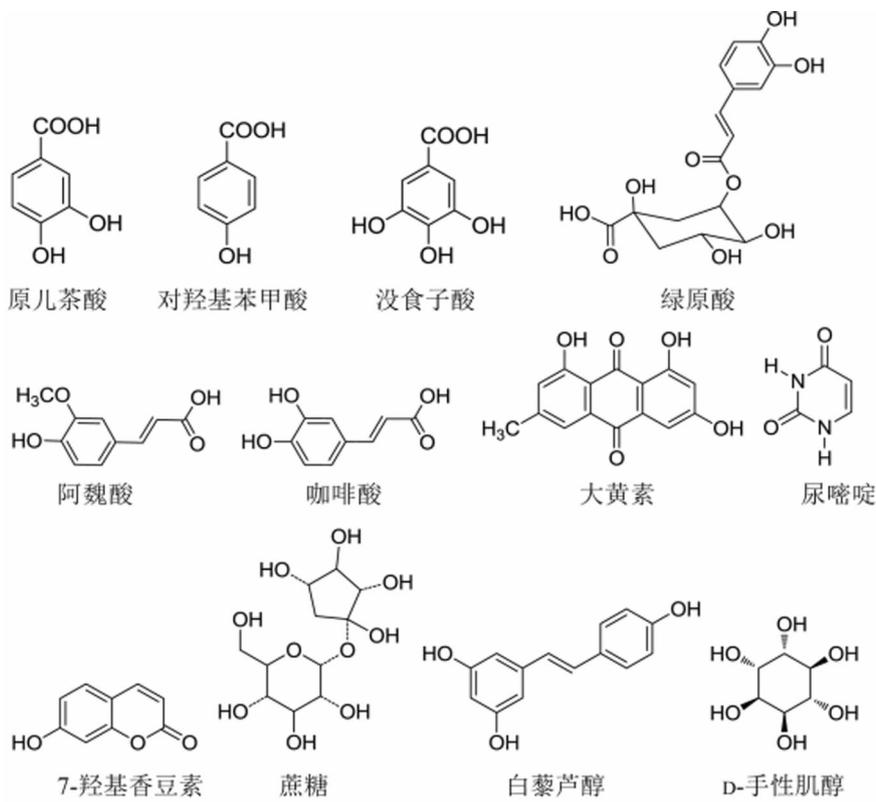


图 6 苦荞麦植物中有机酸和其他类化合物结构式

2 药理作用

2.1 降血糖、降血脂作用

糖尿病是内分泌代谢紊乱引起的一种常见慢性疾病。在我国,由于人民生活水平的提高、饮食结构的改变、工作压力的加大以及一些不健康的生活方式的影响,糖尿病发病率增长迅速。Yao

等^[18]研究发现苦荞麦麸皮 60% 乙醇提取物含有大量的 D-chiro-肌醇,能够降低 KK-Ay 小鼠(II 型糖尿病模型)的血糖水平。苦荞麦麸皮提取物具有降低血清总胆固醇水平,高脂血症大鼠的胆固醇和甘油三酯^[19]。

2.2 抗氧化作用

自由基,化学上也称为“游离基”,是化合物的

分子在光热等外界条件下,共价键发生均裂而形成的具有不成对电子的原子或基团。过量的自由基会对人体的脂质、核酸、蛋白质和糖类生命大分子造成损害,可以引发多种疾病。现代医学研究证明,黄酮类化合物具有抗氧化及清除自由基等生理功能,是天然自由基清除剂。通过对 DPPH 自由基的清除率来分析苦荞麦中总黄酮的抗氧化活性,结果发现丙酮提取物清除率最高^[20]。苦荞麦在萌发过程中其抗氧化活性逐渐增强^[21-22]。另有研究表明苦荞麦叶子经过黑曲霉发酵处理以后,其提取物的抗氧化能力显著提高^[23]。

2.3 抗肿瘤作用

Guo 等^[24]采用 DEAE-凝胶从苦荞麦水提取物中,分离得到一个新的蛋白,代号为 TBWSP31。采用 MTT 法在体外人乳腺癌 Bcap 37 模型上进行筛选试验,作用 48h 和 72h 后,肿瘤细胞抑制率 IC₅₀ 分别为 43.37 μg/ml 和 19.75 μg/ml。

3 体内代谢研究

关于苦荞麦的药物代谢方面研究较少,Zhao 等^[25]研究了大鼠单次经口灌胃不同剂量苦荞麦提取物后血浆中总槲皮素药代动力学特征,采用高效液相色谱-紫外联用检测方法对血浆中总槲皮素进行检测。结果表明,大鼠单次经口灌胃低、中、高 3 个剂量(60、120、240mg/kg)60%乙醇苦荞麦提取物后,血浆中总槲皮素的 C_{max} 值分别为(0.55 ± 0.26)、(1.10 ± 0.53)、(2.05 ± 0.26) μg/ml; T_{max} 的值为(2.33 ± 1.94)、(2.75 ± 3.67)、(2.50 ± 1.82) h; AUC_{0-36h} 的值为(5.29 ± 1.35)、(10.02 ± 4.43)、(22.51 ± 3.05) μg/ml · h。随灌胃剂量的增加大鼠血浆中总槲皮素的 AUC 呈线性增加。任强等^[26]采用大鼠原位肝肠灌流模型对从苦荞麦中分离得到的有效成分酰胺类、黄酮类和糖苷类 3 类化学成分进行代谢产物研究。结果发现糖苷类化合物的代谢转化反应主要包括酯水解的 I 相代谢,酰胺类和黄酮类化合物的代谢反应主要为甲基化、硫酸化和葡萄糖醛酸化的 II 相代谢。

4 结论与展望

苦荞麦含有多种具有药用价值成分,大量研究证明苦荞麦具有降血糖,降血脂的作用。到目前为止,已有文献普遍认为苦荞麦中发挥降糖作用的是黄酮类化合物。我们的前期研究发现苦荞麦中可

能存在其他活性成分,因此有必要对苦荞麦进行更加深入的研究。另外关于苦荞麦的化学成分、分析方法、药理作用以及药代动力学研究报道并不多。今后需深入研究苦荞麦的化学成分和体内代谢产物能够揭示其药效作用的物质基础和作用机制,为合理用药和资源开发利用提供科学依据。

参考文献:

- [1] 中国科学院中国植物志编委会编. 中国植物志[M]. 北京:科学出版社 1999:111-116.
- [2] 朱瑞,卞庆亚,林宏英,等. 苦荞麦种子化学成分研究[J]. 中医药信息,2003,20(3):17-18. DOI:10.3969/j.issn.1002-2406.2003.03.009.
- [3] 包塔娜,周正质,张帆,等. 苦荞麦麸皮的化学成分研究[J]. 天然产物研究与开发,2003,15(2):116-117. DOI:10.3969/j.issn.1001-6880.2003.02.007.
- [4] Jiang S, Liu Q, Xie Y, et al. Separation of five flavonoids from tartary buckwheat (*Fagopyrum tataricum* (L.) Gaertn) grains via off-line two dimensional high-speed counter-current chromatography[J]. Food Chem, 2015, 186: 153-159. DOI: 10.1016/j.foodchem.2014.08.120.
- [5] Fabjan N, Rode J, Kosir IJ, et al. Tartary buckwheat (*Fagopyrum tataricum* Gaertn.) as a source of dietary rutin and quercitrin[J]. J Agric Food Chem, 2003, 51(22):6452-6455. DOI:10.1021/jf034543e.
- [6] Kim SJ, Zaidul IS, Suzuki T, et al. Comparison of phenolic compositions between common and tartary buckwheat (*Fagopyrum*) sprouts[J]. Food Chem, 2008, 110(4):814-820. DOI: 10.1016/j.foodchem.2008.02.050.
- [7] 孙博航,吴雅清,高慧媛,等. 苦荞麦的化学成分[J]. 沈阳药科大学学报,2008,25(7):541-543.
- [8] Kim YK, Li X, Xu H, et al. Production of phenolic compounds in hairy root culture of tartary buckwheat (*Fagopyrum tataricum* Gaertn) [J]. Journal of Crop Science and Biotechnology, 2009, 12(1):53-57. DOI: 10.1007/s12892-009-0075-y.
- [9] Ren Q, Wu C, Ren Y, et al. Characterization and identification of the chemical constituents from tartary buckwheat (*Fagopyrum tataricum* Gaertn) by high performance liquid chromatography/photodiode array detector/linear ion trap FTICR hybrid mass spectrometry[J]. Food Chem, 2013, 136(3-4):1377-1389. DOI: 10.1016/j.foodchem.2012.09.052.
- [10] Seo JM, Arasu MV, Kim YB, et al. Phenylalanine and

- LED lights enhance phenolic compound production in Tartary buckwheat sprouts [J]. *Food Chem*, 2015, 177: 204-213. DOI:10. 1016/j. foodchem. 2014. 12. 094.
- [11] 包塔娜, 彭树林, 周正质, 等. 苦荞粉中的化学成分 [J]. *天然产物研究与开发*, 2003, 15 (1): 24-26. DOI: 10. 3969/j. issn. 1001-6880. 2003. 01. 008.
- [12] 汪嘉庆, 王喆星, 黄健, 等. 苦荞麦种子的化学成分 [J]. *沈阳药科大学学报*, 2009, 26 (4): 270-273.
- [13] Zheng C, Hu C, Ma X, et al. Cytotoxic phenylpropanoid glycosides from *Fagopyrum tataricum* (L.) Gaertn [J]. *Food Chem*, 2012, 132 (1): 433-438. DOI: 10. 1016/j. foodchem. 2011. 11. 017.
- [14] Matsui T, Kudo A, Tokuda S, et al. Identification of a new natural vasorelaxant compound, (+)-osbeckic acid, from rutin-free tartary buckwheat extract [J]. *J Agric Food Chem*, 2010, 58 (20): 10876-10879. DOI: 10. 1021/jf1028416.
- [15] Nĕmcová L, Zima J, Barek J, et al. Determination of resveratrol in grains, hulls and leaves of common and tartary buckwheat by HPLC with electrochemical detection at carbon paste electrode [J]. *Food Chemistry*, 2011, 126 (1): 374-378. DOI: 10. 1016/j. foodchem. 2010. 10. 108.
- [16] Yang N, Ren G. Determination of D-chiro-Inositol in tartary buckwheat using high-performance liquid chromatography with an evaporative light-scattering detector [J]. *J Agric Food Chem*, 2008, 56 (3): 757-760. DOI: 10. 1021/jf0717541.
- [17] Wu X, Ge X, Liang S, et al. A Novel Selective Accelerated Solvent Extraction for Effective Separation and Rapid Simultaneous Determination of Six Anthraquinones in Tartary Buckwheat and Its Products by UPLC-DAD [J]. *Food Analytical Methods*, 2014, 8 (5): 1124-1132. DOI: 10. 1007/s12161-014-9976-6.
- [18] Yao Y, Shan F, Bian J, et al. D-chiro-inositol-enriched tartary buckwheat bran extract lowers the blood glucose level in KK-Ay mice [J]. *J Agric Food Chem*, 2008, 56 (21): 10027-10031. DOI: 10. 1021/jf801879m.
- [19] Tomotake H, Kayashita J, Kato N. Hypolipidemic activity of common (*Fagopyrum esculentum* Moench) and tartary (*Fagopyrum tataricum* Gaertn.) buckwheat [J]. *J Sci Food Agric*, 2015, 95 (10): 1963-1967. DOI: 10. 1002/jsfa. 6981.
- [20] 熊双丽, 李安林, 任飞, 等. 苦荞和甜荞麦粉及麦壳中总黄酮的提取和自由基清除活性 [J]. *食品科学*, 2009, 30 (3): 118-122. DOI: 10. 3321/j. issn: 1002-6630. 2009. 03. 025.
- [21] Yiming Z, Hong W, Linlin C, et al. Evolution of nutrient ingredients in tartary buckwheat seeds during germination [J]. *Food Chem*, 2015, 186: 244-248. DOI: 10. 1016/j. foodchem. 2015. 03. 115.
- [22] Zhou X, Hao T, Zhou Y, et al. Relationships between antioxidant compounds and antioxidant activities of tartary buckwheat during germination [J]. *J Food Sci Technol*, 2015, 52 (4): 2458-2463. DOI: 10. 1007/s13197-014-1290-1.
- [23] Zhang XY, Chen J, Li X L, et al. Dynamic changes in antioxidant activity and biochemical composition of tartary buckwheat leaves during *Aspergillus niger* fermentation [J]. *Journal of Functional Foods*, 2017, 32: 375-381. DOI: 10. 1016/j. jff. 2017. 03. 022.
- [24] Guo X, Zhu K, Zhang H, et al. Purification and characterization of the antitumor protein from Chinese tartary buckwheat (*Fagopyrum tataricum* Gaertn.) water-soluble extracts [J]. *J Agric Food Chem*, 2007, 55 (17): 6958-6961. DOI: 10. 1021/jf071032 +.
- [25] Zhao G, Zou L, Wang Z, et al. Pharmacokinetic profile of total quercetin after single oral dose of tartary buckwheat extracts in rats [J]. *J Agric Food Chem*, 2011, 59 (9): 4435-4441. DOI: 10. 1021/jf1049529.
- [26] Ren Q, Li Y, Wu C, et al. Metabolism of secondary metabolites isolated from Tartary buckwheat and its extract [J]. *Food Chem*, 2014, 154: 134-144. DOI: 10. 1016/j. foodchem. 2013. 12. 107.

(收稿日期 2017-07-02)

(本文编辑:石俊强)

(上接第 250 页)

- [39] Fu HJ, Zhou YR, Bao BH, et al. Tryptophan hydroxylase 1 (Tph-1)-targeted bone anabolic agents for osteoporosis [J]. *J Med Chem*, 2014, 57 (11): 4692-4709. DOI: 10. 1021/jm5002293.
- [40] Fu HJ, Zhao Y, Zhou YR, et al. Ursolic acid derivatives as bone anabolic agents targeted to tryptophan hydroxylase 1 (Tph-1) [J]. *Eur J Pharm Sci*, 2015, 76: 33-47. DOI: 10. 1016/j. ejps. 2015. 04. 021.
- [41] Meng Y, Cao J, Tang Y, et al. Synthesis and anti-tumor activity of derivatives of ring A of Ursolic acid [J]. *Chinese Journal of Organic Chemistry*, 2016, 36 (5): 1080. DOI: 10. 6023/cjoc201510034.

(收稿日期 2017-07-03)

(本文编辑:林琳)