

天南星的炮制研究

杨中林 茅泳雯¹ 朱 谡²

(中国药科大学中药炮制学教研室, 南京 210009; ¹江苏省职工医科大学药理学教研室,

南京 210029; ²南京小营制药厂, 210018)

摘 要 利用正交实验设计,以口尝麻辣味为指标,筛选天南星(虎掌)最佳炮制条件。通过局部刺激实验比较了天南星生品、药典法炮制品、最佳条件炮制品(通过正交实验优选出的最佳条件炮制品)的刺激性大小。并对天南星的生品、药典法炮制品、最佳条件炮制品进行了定性薄层层析,初步分析其化学组分是否有量和质的变化。实验结果表明天南星的最佳炮制条件为:加白矾 12.5%、加热 100℃、不水漂、加热 4 h,其中加热时间为关键因子;兔眼刺激性实验表明生品与药典法炮制品、最佳条件炮制品之间存在着显著性差异;炮制后天南星中各组分的含量明显降低。

关键词 天南星, 炮制, 麻辣味, 刺激性

天南星是有毒中药,内服须经炮制。口服天南星时,毒性主要表现在对粘膜的刺激性,口尝麻辣味即指其对口腔粘膜的刺激性。为了能有效地消除麻辣味,我们用正交实验设计对天南星的炮制条件进行了优选,对天南星炮制的几种因素及其不同水平以口尝麻辣味为指标,优选出天南星炮制的最佳条件。利用兔眼刺激实验对天南星各种炮制品的刺激性进行了比较。对天南星的各种炮制品进行了定性薄层层析,以了解炮制过程中药材所含成分的影响。优选最佳条件炮制出的天南星,刺激性减小到与药典法炮制品相同的水平,同时既节省了大量的工时及生姜辅料,又减少了非麻辣成分的损失。

1 实验材料

天南星(购自南京市药材公司,经本校生药教研室王旭敏老师鉴定为掌叶半夏 *Pinellia pedatisecta* Schott 的干燥块根)。鲜姜、白矾、硅胶 G(CR, 青岛海洋化工厂)、CMC-Na(上海化学试剂站分装厂)、氨水(AR, 南京化学试剂厂)、无水乙醇(AR, 南京化学试剂厂)、茛

三酮(AR, 上海化学试剂厂)。

新西兰种家兔,体重 2.5~3.0 kg,雌雄兼用。

2 实验内容

2.1 天南星各种炮制样品的制备

2.1.1 天南星生品 按文献^[2]“天南星”项下的规定,将天南星制成饮片。

2.1.2 天南星药典法^[1]炮制品 天南星水漂 8 d,每天换水 2 次,如起白沫,每 100 kg 加白矾 2 kg,泡一日后再换水,至切开口尝微有麻舌感取出。将生姜片、白矾置锅内,加适量水煮沸后,倒入漂好的天南星共煮,至无干心时取出,除去生姜片,晾至四~六成干(每 100 kg 生品用生姜、白矾各 12.5 kg),切成薄片,晾干待用。

2.1.3 天南星最佳条件炮制品 我们采用 $L_9(3)^4$ 正交表,以口尝麻辣味为指标^[3],以炮制辅料、加热温度、水漂时间、加热时间四因素的不同水平组合的天南星炮制品进行考查,以便寻找最佳炮制条件组合,制备出天南星最佳条件炮制品。

Tab 1. The factors and levels of orthogonal designs

Levels	Factors			
	A	B, T, C	C, h	D, h
1	ginger + alum	100	4	4
2	ginger	80	2	3
3	alum	40	0	2

A, supplementary matter, B, heating temperature,

C, time of rinsed in water, D, heating time

按 $L_9(3)^4$ 实验工作安排表炮制出 9 份天南星炮制品(辅料量均为 12.5%),炮制完后捞出天南星,晾至三成干,切成薄片(2~4 mm),于 60℃真空度 0.03 MPa 下烘干备用。

2.2 口尝麻辣味实验

2.2.1 样品的制备 从 9 份天南星炮制样品中各取一片形状、大小、厚薄都相近的饮片,每片饮片分成均匀的 2 份,在每块近中心处取 6 mm³ 大的一小块,分给二人做口尝麻辣味实验,取平均值。

2.2.2 口尝麻辣味实验方法 取待口尝的样品,用门齿咀嚼 10 次,舌尖卷住药渣向下唇舔 3 次,吐出药渣,记时为零。从零时起,依次记录起麻、开始疼痛、达到疼痛高峰、疼痛高峰持续、疼痛停止的时间及强度。然后将记录的情况按一定指标量化为分值。每份样品口尝实验后的累积量化分值进行极差分析,找出天南星炮制的最佳因素水平组合。结果如表 2 所示。

Tab 2. Analytical results of factors and levels

Levels	Factors			
	A	B	C	D
1	211.67	287.50	211.67	372.50
2	181.67	260.83	233.33	245.00
3	315.00	260.00	363.33	190.83
Range	133.33	27.50	151.66	181.67

结果表明:消除天南星的麻辣味的最佳炮制条件是 $A_3B_1C_3D_1$,即以白矾为辅料、加热 100℃、不水漂、加热 4 h。影响天南星炮制效

果的关键因素是加热时间,最次要因素是加热的温度。并制备天南星最佳条件炮制品备用。

2.3 局部刺激性实验

为检验天南星各种炮制品刺激性降低的情况,并检验以口尝麻辣味为指标优选天南星炮制的最佳条件是否合理,进行兔眼刺激性实验研究^[4]。

取健康家兔,体重 2.5~3.0 kg,于实验前 24 h 检查两眼,若有眼刺激、眼损伤或角膜损伤的动物不可用。此实验共设 4 组,分别为对照组、天南星生品组、天南星药典法炮制品组和天南星最佳条件炮制品组,每组用 8 只兔眼,分别给 20% 浓度的淀粉混悬液、生品混悬液、药典法炮制品混悬液和最佳条件炮制品混悬液(药粉为 160 目)。实验方法为:轻轻拉开兔的下眼睑,使其离开眼球,将各混悬液用不带针头的 1 ml 注射器滴入眼睑内,每只眼滴入 0.1 ml,轻合眼睑 2 s,以防供试液流出,2 min 后用 20 ml 生理盐水冲洗干净。1 h 后观察眼结膜,以无红肿充血为“-”,有红肿或小水泡为“+”,多个小水泡为“++”,大水泡为“+++”,大面积水泡为“++++”。实验结果用 Ridit 法统计分析(见表 3、表 4)。

生品组平均 ridit = 0.5;药典法炮制品组平均 ridit = 1, 95% 可信限 = 0.204;最佳条件炮制品组平均 ridit = 1, 95% 可信限 = 0.204。

实验结果表明,药典法炮制品组与最佳条件炮制品组的平均 ridit 值均大于生品组的平均 ridit 值,且加上可信限之后,与生品组的平均 ridit 值也无交叉,可以认为药典法炮制品组和最佳条件炮制品的刺激均显著小于生品组($P < 0.01$),药典法炮制组与最佳条件炮制品组之间则无显著性差异。

Tab 3. The results in test of stimulating on rabbit eyes

Degree of stimulations	Groups			Control
	Crude products	Methed A ¹	Method B ²	
Ⅲ	6			
Ⅱ	2			
+				
-		8	8	8

¹processing products on pharmacopoeia; ²processing product on test of excellent factors and levels

2.4 各炮制品的薄层色谱

Tab 4. The results of processed products of the pharmacopoeia and the excellent factors and levels and ridit analysis

Degree of stimulations	Groups			(2) × (4)	(3) × (4)
	Method A ¹	Ridit Method B ²			
(1)	reciprocal (2)	reciprocal (3)	(4)	(5)	(6)
Ⅲ	0	0	0.375	0	0
Ⅱ	0	0	0.875	0	0
+	0	0	1	0	0
+	0	0	1	0	0
-	8	8	1	8	8
Total	8	8		8	8

¹processing products on pharmacopoeia; ²processing products on test

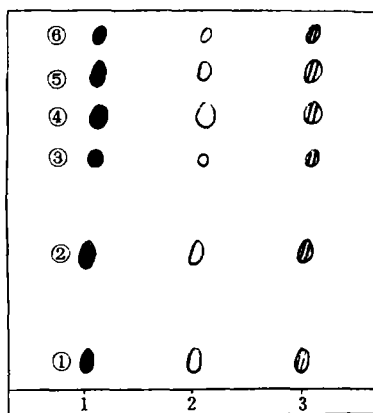


Fig 1. TLC of processing products of *Pnelia pedatisecta* Schott
1. crude product, 2. processing product on Pharmacopoeia, 3. processing product on test. $R_{f1}=0.175$, $R_{f2}=0.425$, $R_{f3}=0.725$, $R_{f4}=0.7$, $R_{f5}=0.775$, $R_{f6}=0.863$

从薄层色谱结果看,天南星各炮制品所含化合物的组分基本相同,但含量差异较大。药典法炮制品的点样量最大,但是板上斑点颜色最浅;生品点样量最少,但色斑颜色最深;可能经炮制后药材中的成分有所损失,而

将天南星的生品、药典法炮制品、最佳条件炮制品分别制成 2 g/ml 浓度的水浸液;上样量分别为 2, 15, 9 μ l;分别点样于硅胶 G-CMC-Na 板上,以无水乙醇 17% 氢氧化铵 (4 : 1.5) 液展开;展距为 15 cm;取出后喷 0.2% 茚三酮乙醇溶液,在 90 $^{\circ}$ C 烘箱内烘 10 min,板面可见深浅不同的棕色斑点。结果如图 1。

以药典法炮制品损失最大,这可能与其水漂时间过长有关。

3 结果及讨论

我们以口尝麻辣味为指标,采用正交实验设计,优选出天南星以加 12.5% 的白矾辅料、加热 100 $^{\circ}$ C、不水漂、加热 4 h 为最佳炮制条件。其中加热时间为关键因子,加热温度为最次要因子。兔眼刺激性实验表明,天南星的生品与药典法炮制品,最佳条件炮制品之间存在着显著性差异 (ridit 检验, $P < 0.01$)。同时可以看出麻辣味的强度和刺激性强度之间存在着平行关系。从我们采用的薄层色谱条件及其结果看出:天南星各炮制品所含化合物的组分没有什么差别,只是各组分的量有很大差别,其中生品中所含化合物组分的量最高,而药典法炮制品的含量最低,估计水漂是各组分含量降低的重要原因。

参考文献

- 1 中华人民共和国卫生部药典委员会. 中华人民共和国药典:一部. 广州:广东科技出版社,1995. 44
- 2 徐楚江,叶定江,傅宝庆等. 中药炮制学. 上海科学技术出版社,1985. 163
- 3 杨守业,何 民,皮晓霞. 天南星不同炮制法对饮片毒性的影响. 中成药,1991,13(2):16
- 4 秦彩玲,胡世林,刘君英等. 有毒中药天南星的安全性和药理活性的研究. 中草药,1994,25(10):527

Study on Processing of *Pinellia pedatisecta* Schott

Yang Zhonglin, ¹Mao Yongwen, ²Zhu Mi

Department of Processing of Traditional Chinese Medicine, China Pharmaceutical University, Nanjing 210009; ¹Jiangsu Staff Medical University, Nanjing, 210029; ²Nanjing Xiaoying Pharmaceutical Factory, 210018

Abstract This paper presents screening out the best conditions in processing *Pinellia pedatisecta* Schott (PPS) by testing in orthogonal designs. Hot and tingle taste was demerited in the baked products. The results indicated that the excellent factors and levels are added 12.5% alum, 100℃, 4 h and need not rinse with water. The temperature is the key factor; *Pinellia pedatisecta* Schott, processed products in the pharmacopoeia and processed products in the excellent factors and levels have remarkable difference in testing of stimulating rabbit eyes; Processed products have remarkable difference in chemical composition.

Key words *Pinellia pedatisecta* Schott; Processed products; Taste of hot and tingle