

· 综述 ·

湖北海棠叶的应用历史与研究现状[△]

陈雅林, 谭哲谔, 彭勇*

(中国医学科学院北京协和医学院药用植物研究所, 北京 100193)

[摘要] 湖北海棠叶是我国别样茶的一种, 在民间有悠久的历史。现代研究表明, 湖北海棠叶含有丰富的黄酮类、多酚类成分, 具有降血糖、降血脂、调节脂质代谢、抗氧化、抗菌消炎等多种药理活性。本文通过查阅中外文献, 对湖北海棠叶的应用历史、植物形态、地理分布、化学成分和药理活性进行综述, 为其系统研究和深入开发提供参考。

[关键词] 湖北海棠叶; 别样茶; 应用历史; 化学成分; 药理活性

Traditional Uses and Modern Research of Leaves of *Malus hupehensis* (Pamp.) Rehd

CHEN Yalin, TAN Zhexu, PENG Yong*

(Institute of Medicinal Plant Development, Chinese Academy of Medical Sciences,
Peking Union Medical College, Beijing 100193, China)

[Abstract] *Malus hupehensis* (Pamp.) Rehd, a kind of non-camellia tea with a long history, is widely distributed throughout southern China. Modern research shows that the leaves of *M. hupehensis* contains chemical constituents such as flavonoids, polyphenols, etc. Extracts from the leaves also have hypoglycemic, reduce blood lipid, anti-oxidation and antimicrobial effects. This review summarized the traditional uses, plant morphology, geographical distribution, chemical constituents and pharmacological effects of *M. hupehensis* leaves, provided evidences for system research and in-depth development.

[Keywords] *Malus hupehensis* (Pamp.) Rehd; non-camellia tea; applied history; chemical constituents; pharmacological effects

doi:10.13313/j.issn.1673-4890.2017.10.030

湖北海棠 *Malus hupehensis* (Pamp.) Rehd 为蔷薇科(Rosaceae)苹果属(*Malus Mill.*)落叶乔木, 嫩叶可做茶饮, 名花红茶, 是别样茶之一, 在我国有400多年的应用历史^[1]。湖北海棠叶有消积化滞、和胃健脾的功能, 是湖北、四川等地区夏季常备的消暑凉茶。本文对湖北海棠叶的应用历史、分布范围和研究现状进行详细介绍。

1 应用历史

湖北海棠在我国分布广泛, 资源丰富, 有多种别称, 如: 茶海棠、野海棠、小石枣、野花红、秋子、棠梨子等。《新华本草纲要》中记载, 其具有消积化滞、和胃健脾的功能^[2]。主治食积停滞、消化不良、痢疾、疝积等症。

湖北海棠叶在湖北、四川、湖南等地区常用, 尤其是在鄂西地区, 是夏季家家户户常备的消暑凉茶。四川地区多产茶, 在当地相较于这些传统意义上的茶, 湖北海棠叶是一种更为平民化的饮料, 原因就在于其资源丰富, 价廉易得。《武汉市志》中载: “武汉人喜好喝茶, 于是, 小商贩在夏秋摆摊卖凉茶, 商店设茶桶为顾客供茶, 善堂搭棚施茶, 供行人解渴消暑, 此类所沏多为档次不高的花红茶^[3]。”土家族常用湖北海棠叶待客, 茶水过夜不馊。土家族之间至今流传着“药王昏死茶露醒”的传说。该茶露即为湖北海棠叶的上的露水。

花红茶制作方法简单, 于端午节采摘叶片后, 洗净、晾干即可泡茶饮用。湖北海棠茶色棕红清亮、口感清冽甘甜, 通常用沸水在陶壶中冲泡,

[△] [基金项目] 中国医学科学院医学与健康科技创新工程经费资助(2016-I2M-2-003)

* [通信作者] 彭勇, 研究员, 博士生导师, 研究方向: 中药资源学, 保健食品研发及中药信息学研究; Tel: (010) 57833166, E-mail: ypeng@implad.ac.cn

放凉饮用。因三片叶子就可以泡一壶茶，又名“三皮罐”。

2 湖北海棠植物分布范围

湖北海棠具无融合生殖特性，抗病、抗逆性强，与主栽品种嫁接亲合性强且具有一定的矮化效应，是常见的苹果砧木^[4]。老枝紫色至紫褐色。叶片卵形至卵状椭圆形，边缘有细锐锯齿，常呈紫红色；托

叶线状披针形，早落。伞房花序，具花4~6朵，花直径3.5~4 cm。果实椭圆形或近球形，直径约1 cm，黄绿色稍带红晕。花期4~5月^[5]，有较强的观赏价值，是园艺常用品种。

生于海拔50~2900 m的山坡或山谷丛林中。广泛分布于黄河以南的湖北、四川、江西等地^[6]，其中湖北鄂西地区较为集中，有大面积天然原生湖北海棠林存在^[7]。见图1。



图1 我国湖北海棠资源分布图

3 化学成分

湖北海棠叶中富含黄酮类、多酚类、蛋白质和多种人体必需的微量元素，且不含咖啡因^[8]。

目前从湖北海棠叶中已分离鉴定出20种化合物，其中双黄酮类化合物3个，二氢查尔酮类化合物4个，黄酮类化合物及其苷类7个，其他类化合物6个^[9]。见表1。

表1 湖北海棠叶中的主要化学成分

序号	中文名称	英文名称	参考文献
1	齐墩果酸	oleanolic acid	[9]
2	熊果酸	ursolic acid	[9]
3	β -胡萝卜苷	β -daucosterol	[9]
4	β -谷甾醇	β -sitosterol	[9]

表1(续)

序号	中文名称	英文名称	参考文献
5	根皮苷	phloridzin	[10]
6	刺槐素	acacetin	[9]
7	根皮素	phloretin	[11]
8	白杨素	chrysin	[9]
9	扁蓄苷	avicularin	[11]
10	槲皮素	quercetin	[10]
11	5, 7-二羟基色原酮-7-O-葡萄糖苷	5, 7-dihydroxychromone-7-O-glucoside	[9]
12	3-羟基-根皮苷	3-hydroxy-phloridzin	[11]
13	槲皮素-3-O-β-D-葡萄糖苷	quercetin-3-O-β-D-glucopyranoside	[9]
14	木犀草素-5-O-β-D-葡萄糖苷	luteolin-5-O-β-D-glucopyranoside	[9]
15	山奈酚-3-O-β-D-葡萄糖苷	kaempferol-3-O-β-D-glucoside	[11]
16		phloretin-2', 4'-di-O-β-D-glucopyranoside	[9]
17	表松脂酚	epipinoresino	[9]
18		(P)-phloridzin-(I-5, II-3')-phloretin-4'-O-glucoside	[12]
19		(M)-phloridzin-(I-5, II-3')-phloretin-4'-O-glucoside	[12]
20		Phloridzin-(I-4, O, II-2')-luteolin-5-O-glucoside	[12]

3.1 黄酮类物质

根皮苷是二氢查耳酮苷类物质, 在自然界中存在很少, 被称为“少数黄酮类”^[13], 是一种甜味较高的天然非糖甜味剂, 并且能够显著降低血糖水平^[14-15], 对于糖尿病患者是一种理想的糖类替代品。根皮苷存在于苹果属多种植物中, 是苹果属中的主要酚类成分。湖北海棠叶中, 含有大量的根皮苷, 并且易于提纯, 可作为提取根皮苷的原料^[16]。实验结果表明, 高海拔地区生长的海棠叶中, 根皮苷含量要明显高于低海拔生长的海棠, 含量变化范围为 5.57% ~ 8.27%^[17]。

多年来, 研究学者对湖北海棠叶的黄酮类提取方法进行了多方位的研究。王耀峰等^[18]使用乙醇浸提法提取湖北海棠叶中的黄酮类物质, 最佳工艺参数为 50 倍量 50% 乙醇, 60 °C 下浸提 4 h。李四海等^[19]采用熵权法优选湖北海棠叶中总黄酮的提取工艺, 以浸膏得率、总黄酮及根皮苷含量为综合评价指标, 最佳提取工艺为 10 倍量 70% 乙醇回流提取 3 次, 每次 1 h。王幸等^[20]对总黄酮含量、根皮苷含量和出膏率三者为指标进行综合评价, 最佳提取工艺确定为 8 倍量 70% 乙醇提取 3 次, 每次 1 h。测得总黄酮质量分数为 18.63%, 根皮苷质量分数为 6.90%。乔孟等^[21]利用响应面法对超声波辅助提取湖北海棠叶中总黄酮的工艺进行优化, 确定最佳工

艺为乙醇 67.35%、超声时间 3.2 h、超声功率 162.4 W、料液比 50:1 mL·g⁻¹, 测得湖北海棠叶中总黄酮含量为 12.76%。丁琼等^[10]首次利用离线二维高速逆流色谱法从湖北海棠叶中分离制备 3 种黄酮化合物, 成功从 200 mg 湖北海棠叶乙酸乙酯萃取部位中制备出 25.4 mg 的 3-羟基根皮苷、8.5 mg 的槲皮素、31.3 mg 的根皮苷。郭东艳等^[22]通过星点设计-效应面法, 以总黄酮和根皮苷含量的综合评分为因变量, 优选最佳提取工艺为加入 8 倍量 70% 乙醇回流提取 150 min, 提取 2 次。此外, 采用离线二维高速逆流色谱法(2D HSCCC)结合循环洗脱模式, 从湖北海棠叶的乙酸乙酯提取物中分离纯化黄酮类化合物。溶剂系统选择正己烷-乙酸乙酯-甲醇-水(1:4:0.6:4.4, v·v⁻¹), 分离出的化合物纯度在 95% 以上^[11]。

湖北海棠叶作为根皮苷的生产原料时, 还需综合各方面因素优选出适合大规模生产的提取方法。

3.2 挥发性成分

湖北海棠叶的挥发性成分主要包括烷烃类、酯类、醇类、酮类、烯类、醛类等共 46 种化合物。其中, 可用作香料添加剂的共有 8 种; 可用作医药用途的共有 5 种, 包括香叶基香叶醇、植醇、植酮、香叶基丙酮及左旋樟脑^[23]。要将湖北海棠叶中丰富的挥发类成分用于实际生产, 还需进一步的研究。

3.3 微量元素

湖北海棠叶中含有多种人体必需微量元素,包括铁、锌、锰、锶、铜、铬、钴、硒等。其中,铁的含量高达 $220 \text{ mg} \cdot \text{g}^{-1}$, 并含有大量酸性物质, 铁能与酸性物质结合, 形成有机铁, 便于机体吸收利用^[24]。因此湖北海棠叶可作为补铁的良好来源。

3.4 其他

湖北海棠叶中还含有蛋白质、茶多酚等化学成分。每 100 g 湖北海棠干叶中含蛋白质 10.8 g、茶多酚 5.4 g, 不含咖啡因^[25]。

4 现代药理作用

4.1 降血糖降血脂

糖尿病是一种由遗传因素和环境因素共同作用而导致的慢性全身性代谢性内分泌疾病, 患病人数随着生活水平的提高、人口老龄化、生活方式的改变而迅速增加, 成为影响人类健康和生活质量的重疾病之一, 中国已成为世界糖尿病患者人数最多且发病率增长速度最快的国家。糖尿病临床分型主要包括 1 型和 2 型。其中, 2 型糖尿病(T2DM)患病率最高, 发病机制最为复杂。

湖北海棠是夏日清凉饮料, 解渴消暑作用力强。小鼠实验表明, 湖北海棠叶水煎剂对正常小鼠、肾上腺素及四氧嘧啶致高血糖模型小鼠的血糖均有明显的降低作用, 除去苦味成分鞣质后仍具有明显的降血糖作用。并且作用缓和, 效果持久, 是其清凉解渴的主要药理基础^[26-27]。临床实验表明, 在 2 型糖尿病的治疗中, 湖北海棠叶水煎剂治疗组症状较对照组明显改善^[28]。

黄酮类化合物可能是湖北海棠叶降血糖的有效成分, 根皮苷降血糖作用机制是高效、专一地抑制参与葡萄糖吸收的钠离子葡萄糖关联载体, 从而抑制葡萄糖在肾脏和小肠的吸收, 促进葡萄糖的外排分泌、降低空腹和餐后血糖水平, 并消除或减轻由糖毒性引起的胰岛素抵抗^[29]。

小鼠实验表明, 根皮苷能显著降低肥胖小鼠体重, 改善血糖、血脂。其机制可能是根皮苷通过调节 mTOR1C-SREBP-1c 信号通路的表达, 从而抑制 LO2 细胞脂质沉积, 调节脂代谢过程^[30]。

4.2 抗氧化

体外实验表明, 湖北海棠叶有较强的抗氧化活

性。测定新鲜湖北海棠叶的 80% 甲醇提取物的自由基清除活性, IC_{50} 值为 $(0.422 \pm 0.028) \text{ mg} \cdot \text{mL}^{-1}$, 证明湖北海棠叶具有较强的自由基清除能力^[31-32]。同时, 湖北海棠提取物对羟基自由基也有明显的清除作用^[33]。经过传统处理做成花红茶的湖北海棠叶也表现出较强的抗氧化活性, 用自由基清除法和铁离子还原测定法测定, 花红茶的抗氧化性比绿茶好^[34]。

小鼠实验表明, 湖北海棠叶的抗氧化活性与含有大量的黄酮类化合物有关^[35-36]。通过小鼠肝纤维化模型研究湖北海棠叶总黄酮的保肝护肝能力, 结果显示, 湖北海棠叶总黄酮在实验中的高、中、低剂量组均对 CCl_4 致大鼠肝纤维化及日本血吸虫感染引起的肝脏病理变化有明显改善作用, 作用机制与其抗氧化作用有关。湖北海棠叶总黄酮能增强组织抗氧化能力, 保护细胞膜免受损伤, 抑制大鼠血清丙氨酸氨基转移酶、天冬氨酸氨基转移酶和 β_1 -转化生长因子等具有加重肝纤维化程度的生物因子的表达, 减轻肝纤维化程度^[37], 具有一定的保肝护肝能力。

4.3 雌激素样活性

体外实验证明, 湖北海棠总黄酮能够促进成骨细胞增殖, 增加成骨细胞的活性, 降低破骨细胞抗酒石酸酸性磷酸酶的活性^[38]。大鼠实验证明, 湖北海棠总黄酮可以降低去势大鼠骨转换率和骨吸收程度, 对绝经后骨质疏松具有防治作用^[39]。其作用机制与湖北海棠叶总黄酮的植物雌激素活性有关。当体内雌激素缺乏时, 根皮苷与雌激素受体结合, 发挥雌激素作用。

4.4 其他

小鼠实验表明, 湖北海棠叶水煎液具有提高小鼠耐缺氧、耐低温与小鼠运动耐受能力的作用^[40]。湖北海棠叶有较强的抗菌、消炎、抗病毒作用^[41], 有效成分主要为黄酮类化合物, 具有良好的开发应用价值。实验表明, 湖北海棠叶对大肠杆菌及金黄色葡萄球菌有抑制作用。湖北海棠叶水煎剂对体外培养的 HSV-1 病毒的增殖无抑制作用, 但对 HSV-1 病毒感染所致的结膜炎具有良好的治疗效果, 可明显减轻其炎症反应, 减轻组织病理损伤^[42]。

湖北海棠叶的急性毒性、遗传毒性、大鼠 30 d 喂养实验结果均显示, 湖北海棠叶属无毒物质^[43], 可长期饮用。湖北海棠叶已应用于 T2DM 的临床治

疗,无不良反应的报道。

5 讨论与展望

湖北海棠叶是我国的传统天然饮品,在民间有400年以上的应用历史,具有清凉消渴、消积化滞以及和胃健脾的功能,是夏季常用的凉茶。尤其是湖北地区,“三皮罐”是夏季家家户户必备的凉茶。湖北海棠叶已批准为新资源食品原料,值得对其进行深入系统地整理研究。

民间长期的饮用历史、现代临床实验证明,湖北海棠叶无毒副作用,可长期饮用。现代研究表明,湖北海棠叶含有丰富的黄酮类成分,不含咖啡因。其黄酮提取物在降血糖、降血脂、抗氧化方面有很好的潜力,因此长期饮用对慢性疾病有很好的预防保健效果。

目前,市场上湖北海棠叶的产品形式主要为茶叶、罐装茶饮料,随着国民生活水平不断地提高,对保健品的要求也进一步提高,成分明确、机制清楚的保健品是目前市场上最需要的。总之,系统地研究湖北海棠叶,制定质量标准,不只局限于传统别样茶饮品的范围,开发功能成分明确、作用机制明确的保健食品或药品,是未来湖北海棠叶的发展方向。

参考文献

- [1] 《中华本草》编委会. 中华本草[M]. 上海:上海科学技术出版社,1999.
- [2] 江苏省植物研究所. 新华本草纲要:第三册[M]. 上海:上海科学技术出版社,1990.
- [3] 武汉地方志编纂委员会. 武汉市志·社会志·民俗篇[M]. 湖北:武汉大学出版社,1997.
- [4] 张靖国,胡红菊,徐育海,等. 部分湖北海棠种质的鉴定及亲缘关系分析[J]. 华中农业大学学报,2009,28(6):736-740.
- [5] 中国植物志编辑委员会. 中国植物志:第36卷[M]. 科学出版社,1974.
- [6] 魏要武,向俊,匡仁亮,等. 湖北海棠植物资源研究进展[J]. 园艺与种苗,2012(8):37-40.
- [7] 联合考察组. 鄂西神农架湖北海棠资源考察简报[J]. 作物品种资源,1984(2):23-24.
- [8] 陈琳琳,吴瑞斌,刘连芬,等. 湖北海棠的研究进展及应用前景[J]. 北方园艺,2013(16):217-221.
- [9] 王姝麒. 四种药用植物和一种真菌的化学成分及生物活性研究[D]. 济南:山东大学,2011.
- [10] 丁琼,任达兵,秦燕华,等. 离线二维高速逆流色谱分离制备湖北海棠叶中的黄酮化合物[J]. 江西化工,2014(1):115-121.
- [11] Liu Q,Zeng H,Jiang S,et al. Separation of polyphenols from leaves of *Malus hupehensis* (Pamp.) Rehder by off-line two-dimensional High Speed Counter-Current Chromatography combined with recycling elution mode[J]. Food Chemistry,2015,186:139-145.
- [12] Wang S Q,Zhu X F,Wang X N,et al. Flavonoids from *Malus hupehensis* and their cardioprotective effects against doxorubicin-induced toxicity in H9c2 cells[J]. Phytochemistry,2013,87:119-125.
- [13] Ehrenkranz J R,Lewis N G,Kahn C R,et al. Phlorizin:a review[J]. Diabetes Metab Res Rev,2005,21(1):31-38.
- [14] Wang J,Chung M H,Xue B,et al. Estrogenic and Antiestrogenic Activities of Phloridzin [J]. Biological and Pharmaceutical Bulletin,2010,33(4):592-597.
- [15] Wang S Q,Han X Z,Li X,et al. Flavonoids from *Dracopcephalum tanguticum* and their cardioprotective effects against doxorubicin-induced toxicity in H9c2 cells[J]. Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 2010, 20 (22): 6411-6415.
- [16] 李艳,黎开燕. 湖北海棠的化学成分和药理活性研究进展[J]. 中国实验方剂学杂志,2016,22(2):226-229.
- [17] 方荣,杨茜,李莉,等. 湖北海棠中根皮苷含量测定[J]. 食品科技,2008(6):195-196.
- [18] 王耀峰,官智勇,方敏. 湖北海棠叶黄酮类物质提取工艺的研究[J]. 武汉工业学院学报,2008(2):12-15.
- [19] 李四海,高建德,陈建国,等. 嫡权法优选湖北海棠叶中总黄酮提取工艺[J]. 中国实验方剂学杂志,2012,18(23):56-58.
- [20] 王幸,师延琼,覃鸿恩,等. 多指标综合评价法优选湖北海棠叶中总黄酮提取工艺[J]. 中国实验方剂学杂志,2012,18(13):46-49.
- [21] 乔孟,屈晓清,丁之恩. 响应面法优化超声波辅助提取湖北海棠叶中总黄酮工艺[J]. 食品科学,2013,34(2):143-147.
- [22] 郭东艳,王幸,唐志书,等. 星点设计-效应面法优选湖北海棠叶总黄酮的提取工艺[J]. 医学研究杂志,2014,43(1):23-27.
- [23] 王宵,杜业云,杨志斌,等. 湖北海棠叶挥发性成分的DTD-GC/MS分析[J]. 湖北林业科技,2015,44(6):28-31.
- [24] 张占伟,王春玲,王鹏,等. 湖北海棠的微量元素测定[J]. 基层中药杂志,2000,14(2):10.
- [25] 刘良忠,丁士勇,汤丽娜. 湖北海棠叶茶饮料及其稳定性研究[J]. 湖北农学院学报,2004,24(4):326-327.

- [26] 王春玲,王鹏,张占伟. 湖北海棠对小鼠血糖的影响[J]. 基层中药杂志,1999,13(2):19-20.
- [27] 王轶. 湖北海棠叶水煎液对高血糖小鼠血糖的影响[J]. 科技风,2009,33(21):244.
- [28] 公丕军,杨明仁,贺可娜,等. 湖北海棠叶治疗2型糖尿病疗效观察[J]. 实用糖尿病杂志,2011,7(4):34-35.
- [29] Dudash Jr J, Zhang X, Zeck R E, et al. Glycosylated dihydrochalcones as potent and selective sodium glucose co-transporter 2 (SGLT2) inhibitors[J]. Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters,2004,14(20):5121-5125.
- [30] 刘华楨. 基于 mTOR/SREBP 信号通路介导根皮苷调控 NAFLD 的机制研究[D]. 广州:广州中医药大学,2015.
- [31] Fenglin H, Ruili L, Bao H, et al. Free radical scavenging activity of extracts prepared from fresh leaves of selected Chinese medicinal plants[J]. Fitoterapia,2004,75(1):14-23.
- [32] 胡丰林,陆瑞利. 蔷薇科一些植物鲜叶提取物清除 DPPH 自由基活性的研究[J]. 植物学通报,2004,21(1):74-78.
- [33] 张宏岐,汪蓂植,邹坤,等. 湖北海棠提取物的体外抗氧化活性研究[J]. 食品科技,2008,33(11):183-186.
- [34] 王冰芳,张学武. 花红茶提取物的抗氧化活性研究[J]. 安徽农业科学,2009,37(35):17685-17686.
- [35] 张欣,费永俊,魏伟,等. 湖北海棠叶中黄酮类化合物抗氧化作用的研究[J]. 农产品加工(学刊),2008(4):38-39.
- [36] 杜幼芹,冯天艳,邓改改,等. 湖北海棠叶总黄酮对日本血吸虫感染小鼠肝纤维化的抑制作用[J]. 中国血吸虫病防治杂志,2011,23(5):551-554.
- [37] 冯天艳,汪蓂植,周继刚,等. 湖北海棠叶总黄酮抗 CCl₄ 所致大鼠肝纤维化作用研究[J]. 中药药理与临床,2012,28(2):72-76.
- [38] 薛冰洁,曹丹,周继刚,等. 湖北海棠总黄酮对成骨细胞增殖分化及破骨细胞活性的影响[J]. 中国中医骨伤科杂志,2011(5):12-14.
- [39] 曹丹,薛冰洁,黄文峰,等. 湖北海棠总黄酮对去势大鼠骨质疏松的影响[J]. 中药药理与临床,2011,27(5):56-59.
- [40] 屈克义,胡汉环,杜远义,等. 湖北海棠叶煎液药效学实验研究[J]. 时珍国医国药,2000,11(2):15-16.
- [41] 汪蓂植,叶建武,余青,等. 湖北海棠抗大蒜病毒活性研究[J]. 安徽农业科学,2008,36(8):3314-3315.
- [42] 李祖铭,孔丽华,余玲,等. 湖北海棠叶水煎剂对 HSV-1 病毒性结膜炎治疗作用[J]. 医药导报,2014,33(7):862-865.
- [43] 郭婕,张天亮,卢连华,等. 湖北海棠的毒性研究[J]. 预防医学论坛,2008,14(11):1004-1008.

(收稿日期 2017-01-17)