

黄连

自然之药，化学之魅

作者：廖宇欣，黄琪琪；Email: 2768539938@qq.com

引言

黄连 (*Coptis chinensis* Franch.) 作为中国传统医学的重要药材，因其丰富的生物活性成分而备受关注。早在《长沙药解》^[1] 中，黄连便被记载为“味苦，性寒”，具备清心退热、泻火除烦的独特功效。《本草纲目》^[2] 更将其列为上品，充分体现了其在中药体系中的崇高地位。此外，《珍珠囊》^[3] 详细论述了黄连的多重药用价值，强调其在泻心火、去湿热、治疗外部炎症及止血等方面的广泛应用。然而，鉴于其药效强烈，传统中医亦提醒胃虚或脾虚患者在使用时需谨慎。

近年来，黄连因其主要活性成分小檗碱 (berberine) 的卓越药理特性而脱颖而出，展现出抗菌、抗炎、降血糖及抗肿瘤等多重作用^[4]。这些生物活性不仅巩固了黄连在传统医学中的应用基础，也为其在现代药物开发中开辟了广阔的前景。

本文旨在深入探讨黄连的植物学特征、化学成分与药理作用三个方面。通过深入剖析黄连在天然药物与现代药物研发之间所发挥的桥梁作用，期望为天然药物的科学研究提供全新的视角，并推动其在医药领域的创新与应用。

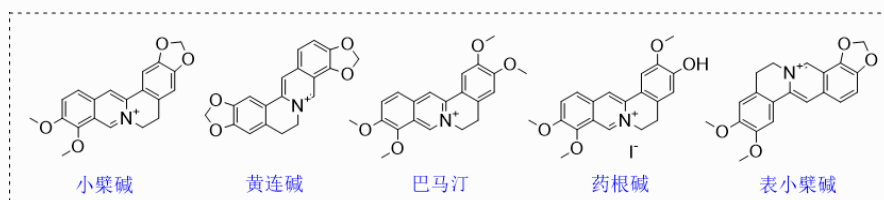
一、黄连的植物学特征

黄连（图1），隶属于毛茛科黄连属，是一种具有显著药用价值的多年生草本植物。其生长于中国四川、湖北、贵州等地的高山湿润森林环境中，因其独特的生长习性与卓越的药理效用而在中医药学中享有崇高地位^[5]。黄连植株矮小，通常高度在10~30 cm之间，根茎粗短结实，外皮黄褐色，断面鲜黄，散发出极强的苦味，源于其中丰富的生物碱成分。黄连叶片多基生，呈坚韧的纸质卵状三角形，三全裂且边缘布满锐利的锯齿，增添了植物外观的独特美感，亦展示出其在自然环境中的高度适应性。长而柔韧的叶柄为植株提供了良好支撑，使其能在多变的自然条件下稳固生长。黄连的花期通常在4~5月，花小而呈黄绿色，萼片较大且呈辐射对称，有助于吸引传粉昆虫。其果实为蓇葖果，种子小巧光滑，通常在7-8月成熟，通过果实开裂来传播^[6]。

在中医药学中，黄连根茎被视为其药效的核心所在。经过采摘和炮制，黄连根茎成为一种珍贵的中药材，享有“味连”、“川连”和“鸡爪连”等称谓，反映了其在不同地域的广泛分布和中医对其药效特性的深刻理解^[7]。黄连



❶【图1】黄连的形态（图片来源于百度百科）



❷【图2】黄连中生物碱化合物的结构

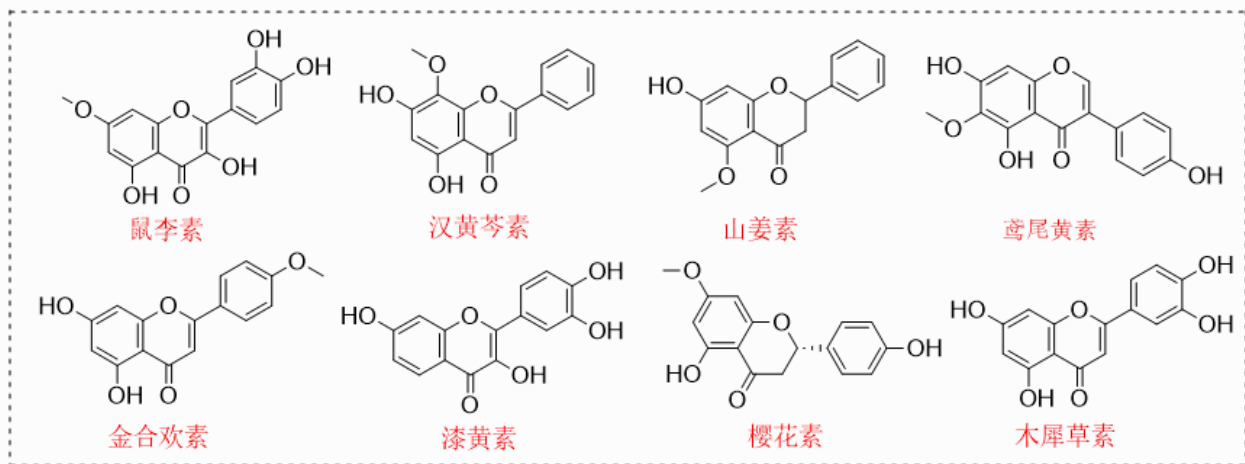
根茎具有清热解毒、燥湿止泻的显著疗效，广泛应用于湿热泻痢、黄疸尿赤、高热烦躁、痈肿疮毒等症的治疗。此外，现代研究表明，黄连具备抗菌消炎、降血糖、调节血脂和抗氧化等多重药理作用，在现代健康管理中也具有重要价值。这一独特的植物作为大自然的恩赐，不仅在传统医药领域中占据不可替代的地位，更为现代健康科学提供了宝贵的天然资源。

二、黄连的化学成分

黄连是一种重要的传统中药，主要以其独特的化学成分而闻名。其有效成分主要包括生物碱、酸性成分、黄酮类及木脂素类等。

2.1 生物碱类

黄连的主要生物碱成分^[8]包括小檗碱（Berberine）、黄连碱（Coptisine）、巴马汀（Palmatine）、药根碱（Jatrorrhizine）和表小檗碱（Epiberberine）等，结构如图2所示。小檗碱是黄连中最具药理活性的成分，其含量通常在2%~6%之间，具有抗菌、抗炎和抗肿瘤等多重生物活性。研究表明^[9]，小檗碱通过调节细胞信号通路，抑制肿瘤细胞增殖，并促进凋亡。小檗碱^[10]具有多种药理作用，例如它有显著的抗菌作用，对痢疾杆菌、大肠杆菌、金黄色葡萄球菌等多种细菌都有抑制作用，这也是黄连在传统医学中用于治疗肠道感染等疾病的原因之一。从化学结构上



①【图3】黄连中黄酮类化合物的结构

看，小檗碱是一种异喹啉生物碱，呈黄色针状结晶。它通过调节细胞信号通路，抑制肿瘤细胞增殖，并促进凋亡，从而发挥其抗肿瘤的生物学活性。

2.2 黄酮类

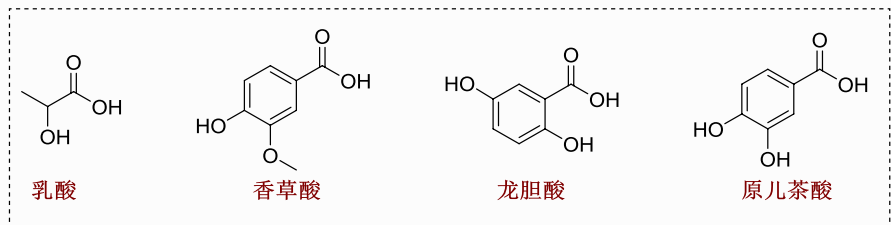
黄连中含有多种黄酮类化合物^[11]，主要包括鼠李素(Rhamnetin)、汉黄芩素(Wogonin)、山姜素(Alpinetin)、鸢尾黄素(Tectorigenin)、金合欢素(Acacetin)等，结构如图3所示。鼠李素^[11]可通过抑制NADPH氧化酶活性，减少超氧阴离子生成，同时激活Nrf2信号通路，提升超氧化物歧化酶(SOD)、谷胱甘肽过氧化物酶(GSH-Px)等抗氧化酶活性，有效清除自由基，减轻氧化应激损伤。汉黄芩素^[13]能抑制炎症细胞中环氧化酶-2(COX-2)和诱导型一氧化氮

合酶(iNOS)表达，减少前列腺素E2(PGE2)与一氧化氮(NO)合成，且阻断MAPK和NF-κB等炎症信号通路活化，降低肿瘤坏死因子-α(TNF-α)、白细胞介素-6(IL-6)等炎症因子释放。

2.3 酸性成分

黄连中含有多种重要的酸性成分^[14]，包括乳酸(Lactic acid, 图4)、香草酸(Vanillic acid, 图4)、龙胆酸(2,5-Dihydroxybenzoic acid, 图4)、原儿茶酸(Protocatechuic

acid, 图4)和丹参酸甲酯(Methyltanshinonate)等。乳酸可调节细菌微环境的酸碱度，影响细菌的代谢过程，进而抑制细菌生长繁殖；香草酸、龙胆酸和原儿茶酸均具有较强的抗氧化能力，能够直接清除自由基，如超氧阴离子、羟自由基等，还可通过激活细胞内抗氧化酶相关信号通路，提升抗氧化酶活性，丹参酸甲酯则在调节细胞信号传导方面有独特作用，可影响细胞的增殖、分化等过程，这些酸性化



①【图4】部分酸性化合物的结构

合物在黄连的药理效应中发挥着关键作用,尤其在抗菌、抗氧化等方面,能够协同增效,显著提升黄连的整体药理活性^[15]。

2.4 木脂素类

黄连中含有少量木质素类化合物^[16],如开环异落叶松树脂酚(Secoisolariciresinol,图5)、异落叶松脂素(Isolariciresinol,图5)、岩白菜素(Bergenin,图5)、葡萄糖苷(Glucoside)、黄花菜木脂素A(Cleomiscosin A,图5)等。其通过酚羟基^[15]提供氢原子中和自由基的方式与黄酮类化合物鼠李素相同,能阻断自由基链式反应,减少氧化损伤,且开环异落叶松树脂酚激活Keap1-Nrf2-ARE信号通路提升抗氧化酶基因表达类似于鼠李素激活Nrf2信号通路的机制,在肝损伤模型中可降低肝脏组织丙二醛含量,异落叶松脂素可嵌入生

物膜稳定结构,调节细胞内氧化还原平衡,在心血管疾病预防方面能抑制血管内皮细胞凋亡,在保肝护肝和心血管疾病预防方面展现出潜在应用价值,此外在抗炎方面与酸性成分原儿茶酸类似,可通过抑制炎症相关信号通路减少炎症因子释放,为黄连整体药理功效增添助力。

2.5 多糖类

黄连中多糖成分主要包括黄连多糖(Coptis chinensis polysaccharide),它是由多种单糖组成的复杂聚合物。其药理作用包括免疫调节、抗氧化和降血糖等方面^[9]。在免疫调节上,能激活巨噬细胞并刺激淋巴细胞增殖以增强机体免疫功能;抗氧化方面,可清除自由基并提高机体抗氧化酶如超氧化物歧化酶(SOD)、谷胱甘肽过氧化物酶(GSH-Px)等

的活性;降血糖作用表现为调节血糖水平,改善胰岛素抵抗并促进胰岛素分泌。

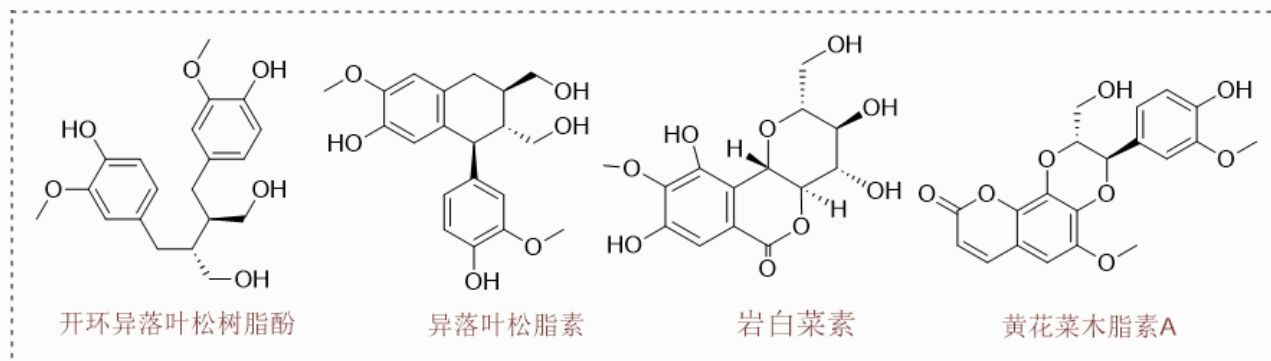
2.6 甾体类

黄连中含有多种甾体类化合物,主要包括植物甾醇,像 β -谷甾醇(β -Sitosterol)等。它具有抗炎、抗氧化、免疫调节和降胆固醇作用。在降胆固醇方面, β -谷甾醇可降低血液中的胆固醇水平。它在肠道内能够与胆固醇竞争吸收位点,减少胆固醇的吸收。当 β -谷甾醇存在时,肠道对胆固醇的吸收效率降低,从而使血液中的胆固醇含量下降。

三、黄连的功效

3.1 抗菌作用

黄连的抗菌作用主要归因于其多种活性成分的综合效应^[17]。小檗碱(Berberine)作为黄连中的主要抗菌成分之一,



①【图5】部分木脂素类化合物的结构

能够穿透细菌细胞膜，干扰细菌^[18]的代谢过程，特别是影响DNA、RNA及蛋白质的合成，从而抑制细菌的生长和繁殖。研究表明^[15]，小檗碱对多种细菌具有抑制作用，包括痢疾杆菌、大肠杆菌和金黄色葡萄球菌等。除了小檗碱，黄连中的黄连碱（Coptisine）和巴马汀^[19]（Palmatine）也能与细菌的细胞壁和细胞膜发生相互作用，导致细胞壁破裂和细胞膜通透性增加，引发细菌内容物泄漏，进而导致细菌死亡。此外，黄连中的酸性成分^[15]如香草酸（Vanillic acid）和原儿茶酸（Protocatechuic acid）能够抑制与细菌生长和繁殖密切相关的酶活性，如ATP酶和脱氢酶，从而干扰细菌的正常生理机能，阻碍细菌的生长。

3.2 抗炎作用

黄连展现出强大的抑制炎症介质释放和调节机体免疫反应的能力^[20]。黄连可降低白三烯、前列腺素等在炎症反应中起关键作用的介质的生成量，从而有效控制炎症的蔓延与恶化。其所含特定成分还能精准调节免疫细胞的活性及数量，使之趋于平衡状态，进而强化机体应对外界刺激的适应能力，推动炎症反应逐步缓和，防止因免疫反应过度而给

机体组织带来潜在危害。

3.3 抗氧化作用

黄连富含黄酮类和酚酸类化合物，这些天然的抗氧化剂在生物体内发挥着至关重要的作用。它们能够与自由基发生高效反应，将这些高度活跃的分子转化为无害物质，从而有效保护细胞免受自由基的攻击和损害^[21]。此外，黄连中的抗氧化成分还通过维护细胞膜的完整性和稳定性，构筑起一道坚实的防线，防止细胞因氧化应激而遭受结构和功能的破坏。

3.4 抗肿瘤作用

在抗肿瘤方面^[15]，黄连中的小檗碱和黄酮类化合物等具有显著的抗肿瘤活性。它们能够干扰肿瘤细胞的细胞周期，抑制其生长与分裂，同时诱导肿瘤细胞凋亡，促进肿瘤细胞的死亡。此外，黄连中的活性成分还可抑制肿瘤血管生成，切断肿瘤细胞的营养供应，进一步抑制肿瘤的生长和扩散。因此，黄连在肿瘤疾病的预防和治疗中展现出广阔的应用前景。

3.5 心血管保护作用

黄连能够降低血压、降低血脂、抗心律失常，对心血管系统起到全面保护作用^[22]。其心血管

保护成分主要包括小檗碱和黄酮类化合物，这些成分通过扩张血管、抑制血管紧张素转换酶活性和干扰胆固醇合成等途径实现心血管保护作用。因此，黄连在治疗高血压、高血脂和冠心病等心血管疾病中具有显著疗效，为心血管疾病患者提供了新的治疗选择。

3.6 其他药理作用

除了上述主要药理作用外，黄连还表现出抗抑郁、抗焦虑、抗癫痫等药理作用，调节免疫功能，抗过敏及治疗消化系统疾病等多种药理效应^[23]。

结语

黄连作为传统中药材的杰出代表，其价值不可估量。从古老的《神农本草经》记载一路走来，凭借其独特的植物特性、丰富的化学成分，在医药领域展现出强大的功效。生物碱、黄酮等各类成分协同作用，赋予黄连抗菌、抗炎、抗氧化、抗肿瘤、心血管保护等诸多益处，还在神经精神等多方面发挥积极作用。随着研究的深入，黄连必将在未来医学中绽放出更耀眼的光芒，为人类健康做出更大贡献，进一步推动中医药的发展与传承，续写其辉煌篇章。

参考文献

- [1] 滕磊, 柴宇琪, 忻耀杰, 等. 基于《长沙药解》探析黄芩、黄连和黄柏的临床效用之别[J]. 上海中医药大学学报, 2018, 32(2): 7-10.
- [2] 张帅. 基于引经报使理论的《本草纲目》中24味引经药特点研究[D]. 保定: 河北大学, 2024.
- [3] 黄延芳, 谭剑文. 苦寒论究[J]. 中国民间疗法, 2016, 24(7): 6-7.
- [4] 杨周颖. 黄连降血糖活性成分及其制备方法研究[D]. 北京: 中国科学院大学, 2020.
- [5] 辜天琪, 任毅. 黄连属(毛茛科)花的形态发生[J]. 植物学通报, 2007, 24(1): 80-86.
- [6] 宋金雨. 鲜黄连生长发育节律、种子破眠及PEG胁迫抗旱评价[D]. 哈尔滨: 东北林业大学, 2021.
- [7] 罗沙. 川黄连药用根茎与非药用须根异喹啉生物碱成分评价和药效初探[D]. 成都: 西南交通大学, 2021.
- [8] 宁浩辰. 干姜对黄连中五种主要生物碱药代动力学的影响[D]. 哈尔滨: 哈尔滨商业大学, 2015.
- [9] 胡亚琴, 汪佳佳, 吴昊, 等. 小檗碱调节ERK/NF- κ B信号通路改善高糖诱导的系膜细胞异常增殖[J]. 安徽医科大学学报, 2021, 56(5): 671-675.
- [10] 蔡晴, 刘小萍, 李彩霞, 等. 中药成分小檗碱及其衍生物的抗真菌作用进展[J]. 中国真菌学杂志, 2024, 19(1): 79-82.
- [11] 古丽娜尔·夏依马尔旦. 黄连中总黄酮含量测定及提取工艺的研究[J]. 新疆师范大学学报(自然科学版), 2010, 29(1): 75-78.
- [12] 金能智, 齐燕姣, 杨娟, 等. 鼠李素和鼠李素-3-O-葡萄糖苷抗氧化活性的计算研究[J]. 科技创新导报, 2016, 13(36): 79-80, 82.
- [13] 张海丽, 游雷鸣, 刘慧, 等. 汉黄芩素对LPS和ATP联合诱导的巨噬细胞炎症反应的抑制作用[J]. 中国免疫学杂志, 2019, 35(9): 1059-1063.
- [14] 李学刚, 叶小利. 一种从黄连中提取阿魏酸和绿原酸等酸性成分的方法: 中国, 201010514629[P]. 2024-12-15.
- [15] 刘晓龙, 李春燕, 肖先, 等. 黄连主要活性成分及药理作用研究进展[J]. 新乡医学院学报, 2023, 40(8): 784-790.
- [16] 刘宽庆, 张以恒. 木质素的生物降解和生物利用[J/OL]. 合成生物学, 1-14[2024-10-30].
- [17] 姚姗姗, 刘静茹, 陈静, 等. 基于网络药理学探究中药黄连抗菌作用机制[J]. 中国畜牧兽医, 2020, 47(5): 1593-1601.
- [18] 丁阳平. 小檗碱衍生物设计、合成及生理活性研究[D]. 重庆: 西南大学, 2011.
- [19] 徐曦, 陈双扣, 王瑜, 等. 基于网络药理学、分子对接及分子动力学研究巴马汀抗菌作用机制[J]. 中国新药与临床杂志, 2024, 43(8): 627-635.
- [20] 揭珊珊, 孙慧娟, 刘建鑫, 等. 黄连解毒汤调控炎症免疫抗类风湿性关节炎机制[J]. 中国实验方剂学杂志, 2022, 28(13): 28-33.
- [21] 杨澄, 仇熙, 孔令东. 黄连炮制品清除氧自由基和抗脂质过氧化作用[J]. 南京大学学报(自然科学版), 2001, 37(5): 659-663.
- [22] 叶路亮, 金华, 何彦虎, 等. 黄连素治疗心血管疾病研究概况[J]. 中医药临床杂志, 2023, 35(1): 174-178.
- [23] 董伟, 顾卫霞, 唐小伟, 等. 黄连素联合利培酮治疗对精神分裂症患者内分泌激素、氧化应激程度的影响[J]. 海南医学院学报, 2017, 23(13): 1870-1873.