

第一章 緒 言

近十幾年來，癌症一直居國人死亡率之首，其中尤以肝癌、肺癌及鼻咽癌為本土高發性癌症⁽¹⁾。長期以來，臨床醫師及醫學研究人員一直期望能找出有效的癌症治療方法，而治療癌症之最佳對策是使這群快速分裂繁殖的細胞不再生長，甚至死亡。檢討目前癌症的治療方法，如放射線處理、化學藥物治療等，對患者的傷害性副作用極大，且治癒的效果並不理想。因此，研發新的方法及尋找有專一性之藥物，抑制癌細胞的生長及轉移，促進癌細胞死亡，並使正常細胞的傷害降至最低，是非常重要的癌病醫學研究方向。

根據調查報告指出，由於現今使用於治療癌症之方法，作用成效有限，病人死亡率高居不下，因此國內多數癌症患者均有服用中藥之行為。雖然有研究證實某些中藥具有增進免疫系統之功能，對服用者或許有某種程度之幫助，但癌症患者中仍有因不當使用中藥造成肝腎功能破壞，加速病情惡化，這都是由於中藥未能給予科學化研究所造成之不幸後果。因此，中藥科學化之研究已成為生物醫學界重要之研究方向⁽²⁾。目前許多學者致力尋找中藥中有效之抗癌成分，探討其抗癌能力，並追蹤其制癌之分子機轉，期能找到穩定、有效、無不良副作用之中藥成分來治療癌症。

一般正常細胞若轉變成為惡性腫瘤細胞，必須具有兩種能力，一為不受正常生理條件控制，可大量增殖。二在成長的腫瘤塊中長出新血管，提供繁殖存活所需之養分^(3,4,5)。血管主要由內皮細胞形成，內皮細胞單層管狀排列即形成血管。血管流通全身各部位，可將血液中之養分送達標的細胞，並且有防止血液中大分子物質滲透到組織中之功能，具有選擇性障壁的作用⁽⁶⁾。因此，在腫瘤生長的過程中若無新血管生成，則腫瘤細胞無法獲得充足之養分，腫瘤生長就會受到抑制，不足以造成致命的威脅⁽⁷⁾。因此，抑制新血管生成之方法，為近年來研發抗癌藥物的重要方向之一。^(8,9)

中藥黃芩(*Scutellariae Radix*)為唇形科(*Labiatae*)植物黃芩 *Scutellaria baicalensis* GEORGI 之乾燥根。始載於神農本草經^(10,11)草部中品之藥物，本經⁽¹²⁾、別錄⁽¹³⁾、陶注⁽¹⁴⁾、新修⁽¹⁵⁾、開寶⁽¹⁶⁾、嘉祐⁽¹⁷⁾、圖經⁽¹⁸⁾、證類^(19,20)、大觀⁽²¹⁾、綱目^(22,23)等歷代諸家本草均有紹述，植物名實圖考長編⁽²⁴⁾、本草蒙筌⁽²⁵⁾、本草新編⁽²⁶⁾、得配本草⁽²⁷⁾及本經逢原⁽²⁸⁾等明、清近代本草也多有詳述。本經記載：「主諸熱黃疸、腸澼洩痢、逐水、下血閉、惡瘡疽蝕、火瘍」⁽¹⁰⁾。有清熱燥濕，瀉火解毒，止血，安胎的功能，用於濕熱，暑溫，胸悶嘔惡，濕熱痞滿，瀉痢，黃疸，肺熱咳嗽，高熱煩渴，血熱吐衄，熱淋崩漏，目赤腫痛，癰腫瘡毒，胎動不安。近年來藥理學研究證明，黃芩有抗微生物作用、抗炎作用、改變免疫功能之作用、降低血壓

和利尿作用、降血脂作用、抗血小板凝聚作用、抗氧化作用、中樞神經系統輕度鎮靜作用與保肝作用等活性^(29,30)，並有報導指出黃芩有抗腫瘤之作用⁽³¹⁾。黃芩中的主要化學成分為黃酮類(flavonoids)化合物，已經確定結構的有四十餘種，主要活性成分有黃芩素(baicalein)、黃芩素苷(baicalin)、白楊素(chrysin)、木蝴蝶素(oroxylin)、去甲漢黃芩素(norwogonin)、漢黃芩素(wogonin)、漢黃芩素苷(wogonoside)等^(32,33)。

黃芩的主要活性成分之一的黃芩素屬配醣體成分，黃芩素進入消化道後，會被腸內微生物分解為黃芩素方能被吸收⁽³⁴⁾。文獻中有關口服大柴胡湯和小柴胡湯（含黃芩）的結果顯示，黃芩服入人體後在血漿中之主要代謝物為 baicalein 6-O-sulfate 和 baicalein 7-glucuronide（為 baicalin），可經由腎臟及泌尿系統排出體外⁽³⁵⁾。抗癌中草藥書中曾經指出在小白鼠體內，給予黃芩生藥，具有抑制小白鼠子宮頸癌、肉瘤、淋巴肉瘤之作用⁽³⁶⁾。黃芩醚提取物對小鼠白血病 L1210 細胞有細胞毒作用⁽³⁷⁾。Matsuzaki 等人之研究發現⁽³⁸⁾，以黃芩素處理培養之人類肝癌細胞，可抑制肝癌細胞之生長及促進肝癌細胞之凋亡。Huang 等人之報告說明了，黃芩素可抑制血管平滑肌細胞之生長⁽³⁹⁾。由這些前人的研究結果，我們推論中藥黃芩抑制腫瘤的作用，可能是因其中所含的黃芩素及黃芩素苷，可抑制腫瘤生長，毒殺腫瘤細胞或抑制血管形成之作用。

在實驗室中我們以黃芩素處理培養的老鼠心臟內皮細胞，發現處理

黃芩素後，內皮細胞生長明顯受抑制。因此本論文主要之研究方向，在探討中藥黃芩中有抑癌作用及抑制細胞生長之化學物質黃芩素對內皮細胞生長、移位之分子機轉，及對血管生成之影響。由於細胞的生長是依照細胞週期的一定順序進行；當細胞受到生長激素 autocrine、paracrine 及 endocrine 的刺激，就會促進其進入細胞週期進行分裂⁽⁴⁰⁾。因此，我們進一步分析細胞週期之變化，結果顯示 Baicalein 處理，可使細胞週期停滯在 G1 及 G2/M 期，S 期之細胞有明顯減少之趨勢。因為細胞週期的進行需要不同的蛋白質激酶(cyclin-dependent kinases；簡稱 Cdk)參與，蛋白質激酶必須和細胞週期調節蛋白(cyclins)結合成複合物(CDK-cyclin complex)，並經正確位置的磷酸化後才具有激酶的活性⁽⁴¹⁾。此外，CDKs 的活性亦受到蛋白質激酶抑制分子(CDK inhibitors；簡稱 CKIs)⁽⁴²⁾及其他腫瘤抑制分子(tumour-suppressors)如 p53 的調控⁽⁴³⁾。因此在本研究進行的過程中，我們分析黃芩素對調控細胞週期基因之影響，結果發現 Cdk1、Cdk2、cyclin A 及 cyclin D2 等基因蛋白質表現及其相關激酶活性均有明顯下降之趨勢，基因蛋白 p15^{INK4B}，p21^{CIP1/WAF1}，p53 和 cyclin E proteins 有增加之影響。然而，對於 cyclins D1, D3, A or B, Cdk3, Cdk4, p16^{INK4A}，p27^{KIP1}，pRb1 proteins 在老鼠內皮細胞沒有明顯影響。由本研究之結果我們可以推論黃芩素之所以能抑制老鼠心肌內皮細胞之生長，主要原因是使可促進細胞生長之分子，如 Cdk1、Cdk2、cyclin

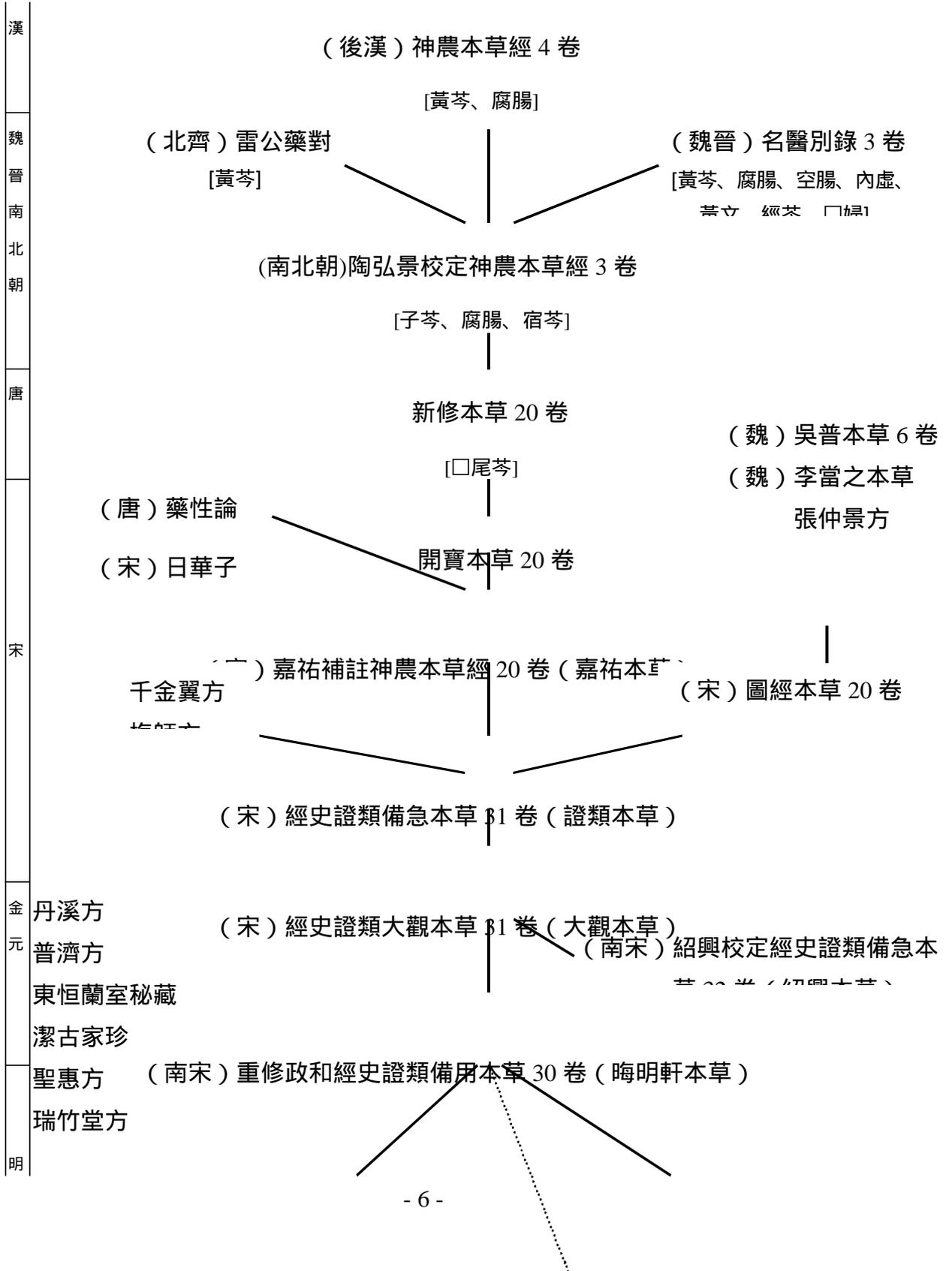
A 及 cyclin D2 等之表現受到抑制，降低了週期調控激□之活性，為 p53-dependent 影響下使內皮細胞之生長減緩甚至停滯。

本實驗之結果，顯示黃芩□元除了可抑制內皮細胞之生長及影響血管之形成。進一步我們探討黃芩□元對內皮細胞移位之作用，結果發現黃芩□元可以影響到內皮細胞的移位，因此使用 Matrigel 在 in vitro 情況下，發現黃芩□元的確可以抑制細胞的移位；但是在預處理黃芩□元的情況下發現，內皮細胞的移位與血管形成能力，確有很大的不同。所以我們也初步探討了與移位以及附著能力，發現在黃芩□元存在的狀態下，的確可以抑制內皮細胞的吸附能力；反觀在預處理下卻使得內皮細胞附著能力增加，可是在長時間後並無統計上的意義。因而我們也觀察黃芩□元對內皮細胞內 actin 之變化，發現黃芩□元可使內皮細胞形成 stress fiber 環繞在細胞周圍，並在長時間後形成稀疏長條狀。由此結果我們可以推論黃芩□元可能具有影響抑制腫瘤細胞新血管形成之作用，進而抑制腫瘤之生長。但是在黃芩□元處理後，是否會增加新生血管的形成，尚待我們將進一步探討黃芩□元對癌細胞之作用及利用動物模式探討黃芩□元臨床應用於癌症治療之可行性。

第二章 總 論

第一節 黃芩之本草學考察

壹、 黃芩之本草系統圖



—
清

(明) 本草綱目 52 卷

本草綱目彙精要 42 卷
說文解字注

(明) 本草蒙筌

(清) 本草從新

(清) 本草備要

植物名實圖考長編 22 卷

(清) 本經逢原

(清) 得配本草

(清) 植物名實圖考 38 卷

貳、黃芩之本草考察

一、藥名之考訂

黃芩之名，首先著錄於本經草部中品，隨後之別錄、集注、新修、開寶、嘉祐、藥性論、日華子、圖經、證類、大觀、紹興、重修政和、精要、綱目、圖考⁽⁴⁴⁾及長編等歷代諸家皆沿用原植物黃芩為正名；明、清近代本草亦因襲之，雖有其他同屬類別植物，如向天盞、馬牙半支、狗牙半支、藍花黃芩等，但其處方應用，仍以黃芩為正名。

黃芩之名義，據綱目釋名時珍曰：芩，說文作葢，謂其色黃也。或云：芩者黔也，黔乃黃黑之色也。乃明指黃芩因其藥用部位之宿根，為金黃色至黃黑之色之意也。長編另引說文解字注：葢，黃葢也。本

草經、廣雅皆作黃芩，今藥中黃芩也。從艸，金聲，巨今切，七部。芩，艸也。均為正名作名詞之解釋。至於其別名，本經、別錄、集注、綱目等皆有腐腸，別錄、新修別名，更有空腸、內虛、黃文、經芩、□婦、子芩、宿芩及豚尾芩等名，而吳普本草又有印頭、妒婦、虹勝別名；於陶弘景集注本草經曰：黃芩圓者名子芩，為勝；破者名宿芩，其腹中皆爛，故名腐腸。惟取深色堅實者為好，俗方多用，道家不須。至綱目釋名又有條芩、鼠尾芩之別名。時珍釋名曰：宿芩乃舊根，多中空，外黃內黑，即今所謂片芩，故又有腐腸、妒婦諸名。妒婦心黯，故以比之。子芩乃新根、幼根，多內實，即今所謂條芩。或云西芩多中空而色黯，北芩多內實而深黃。以上對黃芩之別名之詮釋，有以生長期長者之宿芩，中心多腐爛，古人認為莖中空與實效用不一樣，黃芩之中枯而飄者瀉肺火、清肌表之熱；若藥材頭部具扭曲的縱皺紋或不規則的網紋，如印頭狀；虹勝以根彎色雜如虹狀，其說法不一，均有不同之別名之意義與象徵，如鼠尾芩、□尾芩亦然。

黃芩尚有其他別名，如記事珠：一名苦督郵，督郵是漢代官名，管理事情很多。黃芩味苦，治療範圍廣，因喻為督郵。廣雅：一名蓮盾、□□，博雅釋為黃芩⁽⁴⁵⁾。迄現今之東北藥植誌：一名元芩、土金茶根。中藥大辭典：一名空心草、一名土金茶。茶，藥的意思，土金，指脾肺。脾、肺兩經用藥之意。中藥志及北方各省、河北、內蒙古、山東、

黑龍江、遼寧等地：一名山茶根、一名黃金條根、一名黃芩茶、香水水草等。概與上述敘述之含意雷同，不再敘述。

據文獻並綜如上述，黃芩之名稱，歷代諸家本草概指該植物之根供藥用，昔以原植物為名，後皆以商品為名，枯芩即腐芩，即別名中之腐腸、空腸、內虛、經芩、□婦、印頭、虹勝、宿芩、片芩、鼠尾芩及豚尾芩等；子芩、條芩指根中心實密的根條；其中北芩即產於東北者，元芩即指原藥材，西芩即產於陝西者，總稱黃芩乃指色黃莖或黃文，或明指黃芩因其藥用部位之宿根，為金黃色至黃黑色之意也。

二、型態、種類及產地

本經、別錄、集注等未載黃芩之形態，迄唐新修本草曰：葉細長，兩葉相對，叢生。亦有獨莖者，大實亦好。爾後開寶、嘉祐亦未載形態，至圖經本草曰：苗長尺餘，莖幹麤如著，葉從地四面作叢生，類紫草，高一尺許，亦有獨莖者，葉細長，青色，兩面相對，六月開花，紫色；根黃如知母麤細，長四、五寸。圖經又引吳普本草云：二月生，赤黃葉，兩兩四四相值，其莖空中或方圓，高三、四尺，四月花紫紅赤，五月實黑，根黃，與今所著小異。明指其品種至少有二種。

長編引小雅：呦呦鹿鳴，食野之芩。傳曰：芩，艸也。復引陸璣云：芩艸，莖如釵股，葉如竹，蔓生澤中下地鹹處，為艸，嘉賓牛馬皆喜

食之。按如陸說，則非黃芩藥也。許君黃葢字從金聲，詩野芩字從今聲，截然分別，他書亂之，非也。毛詩音義引說文云蒿也，以別於毛公之艸也，甚為可據。但訓蒿則與第二章不別，且說文當以芩與蒿篆類廁，恐是一本作蒿屬，釋文也字或屬字之誤。又按集□、類篇皆云□、□、芩三字同，魚音切，菜名，似蒜，生水中。攷字林、齊民要術皆云□似蒜，生水中，此則別是一物。從艸，今聲，巨今切，七部。復引詩曰：食野之芩。圖考引圖經及吳普本草具載形狀，而大同微異，今入藥以細者為良。

綜觀黃芩之形態，再參考圖經、大觀、重修政和、品彙精要、綱目及本草備要諸藥圖，有耀州黃芩、潞州黃芩等之各種藥圖，由其習性、叢生、草本、葉、花、果實及水生叢蔓、莖方之形態等、可推定為唇形科 Labiatae 植物之黃芩屬 *Scutellaria* 植物無疑。（詳附圖本草圖一、二）⁽⁴⁶⁾。並得以確知黃芩之品種為數不少，有供食用之□、□如蒜之古名，亦有供藥用之芩，即黃芩。總之供藥用之主品，自古迄今，



仍以黃芩 *Scutellariae baicalensis* GEORGI 為正品，餘皆為類似藥材之代

用品。

本草圖一

本草圖二

關於黃芩之產地，別錄曰：生秭歸川谷及冤句。陶注則延伸秭歸屬建平郡，今第一出彭城、鬱州亦有之。而唐本注則言今出宜州、鄜州、涇州者佳，□州者，大實亦好，名□尾芩也。秭歸乃今湖北省秭歸縣；冤句乃今山東省荷澤縣；彭城乃今之江蘇省銅山縣；鬱州乃今之江蘇省灌云縣；宜州乃今之湖北省宜昌；鄜州乃今之陝西省鄜縣；涇州乃今之甘肅省涇縣；□州乃今之山東省莘縣。迄圖經本草曰：今川蜀、河東、近郡皆有之，復從耀州黃芩、潞州黃芩二圖，可知宋時名產地在四川、陝西、及河東各地，耀州乃今之遼寧省海城縣西南六十里地，潞州乃今之山西省長治縣。迄本草蒙筌曰：所產尚彭城，屬江蘇。而圖考吳其濬曰：黃芩以秭歸產者，後世多用條芩，滇南多有，土醫不取他取也。由此可知明清近代雲南、滇等地產者亦供藥用。

綜如上述，黃芩之產地，主要分布於山東、山西、陝西、湖北、江蘇、甘肅、四川、遼寧及雲南等地，今東北、內蒙古、河北、河南、

雲南、貴州、吉林亦產，可知其產地遍及東北、黃河流域、長江流域及西南等地。而上述產於山東、山西、陝西道地藥材的黃芩，原植物為今商品常用的正品黃芩 *Scutellaria baicalensis* GEORGI.

三、性味、藥能及主治

1. 性味與歸經

黃芩之性味，本經曰：「味苦，平」；別錄曰：「大寒，無毒」；藥性論曰：「味苦，甘」；桐君、雷公云：「苦，無毒」；又李當之曰：「小溫」；珍珠囊曰：「可升可降，陰也」。

黃芩之歸經，好古曰：「氣寒，味微苦而甘，陰中微陽，入手太陰血分」；元素曰：「氣涼，味苦、甘，氣厚味薄，浮而升，陽中陰也，入手少陽、陽明經。酒炒則上行」；綱目曰：「得酒，上行。入手少陰、陽明，手足太陰、少陽六經」；品彙精要曰：「氣薄味厚，陰中微陽。行手太陰經，陽明經」；又雷公炮製藥性解曰：「入肺、大腸、膀胱、膽四經」；主治秘要曰：「性涼，味苦、甘，氣厚味薄，浮而降，陽中陰也」；醫學啟源曰：「氣寒，味微苦」。

綜如上述，黃芩之性味主為 味苦平，性寒。歸肺、心、肝、膽、大腸經。

2. 藥能及主治

黃芩之藥能及主治，本經曰：「諸熱黃疸，腸澼洩痢，逐水，下血閉，治惡瘡，疽蝕，火瘍。」別錄曰：「療痰熱胃中熱，小腹絞痛，消穀，利小腸，女子血閉，淋露下血，小兒腹痛。子主治腸澼膿血。」雷公藥對曰：「得厚朴、黃連，止腹痛。得五味子、牡蒙、牡礪，令人有子。得黃耆、白斂、赤小豆，療鼠口。山茱萸、龍骨，為之使。」藥性論曰：「治熱毒，骨蒸，寒熱往來，腸胃不利，破擁氣，治五淋，令人宣暢，去關節煩悶，解熱渴，治熱腹中疝痛，心腹監脹。」日華子曰：「下氣，主天行熱疾，疔瘡排膿，治乳癰發背。」元素曰：「涼心，治肺中濕熱，瀉肺火上逆，療上熱，目中腫赤，瘀血壅盛，上部積血，補膀胱寒水，安胎，養陰退陽。」綱目曰：「治風熱濕熱頭疼，奔豚熱痛，火咳，肺痿喉腥，諸失血。得酒，上行。得豬膽汁，除肝膽火。得柴胡，退寒熱。得芍藥，治下痢。得桑白皮，瀉肺火。得白朮，安胎。」張潔古曰：「下痢膿血，腹痛後重，身熱久不能止者，與芍藥、甘草同用之；凡諸瘡痛不可忍者，宜芩、連苦寒之藥，詳上下分身梢及引經藥用之。」朱丹溪曰：「凡去上焦濕熱，須以酒洗過用；片芩瀉肺火，須用桑白皮佐之。」珍珠囊曰：「酒炒上頸，主上部積血。除陽有餘，涼心去熱，通寒格。」湯液本草引張潔古曰：「利胸中氣，消隔上痰。」滇南本草曰：「上

行瀉肺火，下行瀉膀胱火。治男子五淋，女子暴崩，調經安胎。清熱，胎中有火熱不安，清胎熱，除六經實火實熱。所謂實火可瀉，黃芩是也，熱症多用之。」雷公炮製藥性解曰：「主崩淋熱疽，痛痢惡瘡，解毒收口，去翳明目。」湯液本草引陶弘景曰：「治奔豚，臍下熱痛。」本草正曰：「枯者清上焦之火，消痰利氣，定喘嗽，止失血，退往來寒熱，風熱濕熱，頭痛，解瘟疫，清咽，療肺痿肺癰，乳癰發背，尤怯肌表之熱，故治斑疹、鼠口，瘡瘍，赤眼；實者涼下焦之熱，能除赤痢，熱蓄膀胱，五淋澀痛，大腸閉結，便血，漏血。」科學的民間藥草云：「為解熱劑，煎成濃縮液，外洗創口，有防腐作用。」藥品化義曰：「同枳實、厚朴，能消穀食。」赤水玄珠曰：「黃芩得連翹則消毒。」本經逢原曰：「同黑參，治喉間腥臭。」本草經解曰：「同白芍、甘草，名黃芩湯，治濕熱腸痛及瀉痢；同白芍、甘草、半夏，治吐瀉；同白芍、麥冬、白朮，治胎動不安內熱。」得配本草曰：「配人參為末，治小兒驚啼，配白芷、細芩，治眉眶痛。」

綜如上述，黃芩主以清熱瀉火、解毒生用，治上部熱證酒炒用，豬膽汁炒可瀉肝膽火，炒炭用於止血。枯芩輕虛，多用於上焦之火，子芩重實，多用於下焦之熱。

因此可知黃芩為清熱藥，藥性寒涼，主要用於各種熱證的治療。

諸如面紅、眼赤、神昏、譫語、躁狂、瘡瘍、紅腫熱痛、出血、大便乾結、小便黃赤、以及舌紅、苔黃脈數等都屬熱象。黃芩本身也屬於清熱燥濕藥，在歷代中藥材中為一重要藥物，也因此黃芩歷代古籍收集之文獻頗為完備，也有見於此，在現代化科學基礎上，更應該用更新的觀念來將其繼續發揚。

四、修治、方用及禁忌之考訂

1. 修治

黃芩之採收，名醫別錄曰：「三月三日採根，陰乾。」相當於春時季節。陶注曰：「惟取深色堅實者為好。」圖經本草曰：「二月八月採根，暴乾用之。」吳普本草云：「四月花紫紅赤，五月實黑，根黃，二月至九月採根。」由此得知，黃芩的採收多以春秋季節為主。

2. 方用及禁忌

黃芩之方用，自張仲景、千金、梅師以來散見於方書中，本草綱目謂「舊三，新一十四」，應用非常廣泛。而雷公藥對曰：「惡蔥實，畏丹砂、牡丹、藜蘆。」圖經本草引千金方云：「久服走及奔馬，近頻有驗，食禁豬肉。」又本草經疏曰：「苦寒能損胃氣而傷脾陰；脾肺虛熱者忌之。故凡中寒作洩，中寒腹痛，肝腎虛而少腹痛，血虛腹痛，

脾虛洩瀉，腎虛溏瀉，脾虛水腫，血枯經閉，氣虛小水不利，肺受寒邪喘咳，及血虛胎不安，陰虛淋露，法並禁用。」本經逢原曰：「若血虛發熱，腎虛挾寒，及妊娠胎寒下墜，脈遲小弱，皆不可用，以其苦寒而伐生發之氣也。」得配本草曰：「痘疹灌漿時，大腸無火，肺氣虛弱，血虛胎動者皆禁用。」

綜如上述，黃芩藥性寒涼，因此脾胃虛寒，少食便溏者禁服。

第二節 黃芩之藥用植物學考察

黃芩為我國傳統常用中藥，應用歷史悠久，並且分佈面積廣大，產量大，用量也多，是全國大宗中藥材之一。除了在本草考察的藥性之外，我們也必須要瞭解在現代所使用之藥材是否與古代使用的為同一植物。其常關係到植物本身所衍生的二次產物是否相同^(47,48)，以提供其主要成分的來源。

黃芩除了在正統中藥中有描述之外，在蒙醫也為常用的藥材，蒙藥名【混欽】，在四部醫典、晶珠本草、藥物名詞對照、蒙藥整典等蒙、藏醫藥文獻中均有記載。為瞭解黃芩植物有哪些來源以及品種，茲分別敘述同屬不同種植物之檢索如下^(49,50)：

- 1.花組成頂生總狀花序
- 2.莖生葉近無柄或具短柄，葉片狹長，長為寬的 2 倍以上邊緣具牙齒狀鋸齒，圓齒至全緣
- 3.莖生葉明顯全緣或近全緣
- 4.莖無腺毛；葉兩面無凹腺點或葉下面有凹腺點
- 5.葉下面有凹腺點

6. 高大草本，高 30~100 cm，莖生葉披針形至線形，長 1.5~5 cm，寬 0.3~1.2 cm，總狀花序在莖及分枝上頂生，因而植株上明顯聚成圓錐花序；花冠藍紫色或紫紅色

.....黃芩 *Scutellaria baicalensis* GEORGI

6. 矮小草本，高 10~20 cm；莖生葉長圓形，長 2~3.4 cm，寬 0.7~1.4 cm；總狀花序頂生，不集成圓錐花序；花冠白色，綠白色至紫藍

.....連翹葉黃芩 *S. hypericifolia* LEVL.

5. 葉下面無凹腺點，葉片卵形或卵狀三角形，長 1.4~4 cm，寬 0.6~1.7 cm，僅下部邊緣有稀疏圓齒；莖弧曲

.....甘肅黃芩 *S. rehderiana* DIEIS

4. 莖有腺毛；葉兩面具多數黃色腺點，葉片披針形或條狀長圓形至條形；花冠黃色或黃白色，下唇常染粉紅斑

.....粘毛黃芩 *S. viscidula* BUNGE

3. 莖生葉多少具圓齒或圓齒狀鋸齒；花冠筒直伸，不呈之字形彎曲

7. 花冠黃白色、黃色至綠黃色，常染紫斑或條紋

.....麗江黃芩 *S. likiangensis* DIELS

7. 花冠紫色或藍紫色；葉常對折

.....滇黃芩 *S. amoena* C. H. WRIGHT

2. 莖生葉明顯具柄，常較寬，長寬幾相等或為寬的兩倍左右，邊緣具缺

刻狀牙齒或淺牙齒，葉面沿脈，葉柄和花序密被白色平展疏毛

.....大黃芩 *S. tenax* W. W. SMITH var. *patentipilosa* (HAND. -MAZZ.) C. Y.

Wu

1. 花全然腋生

8. 根狀莖呈念珠狀，白色，徑達 6 mm；葉片卵圓形或卵狀長

圓形，長 0.8~2.3 cm 寬 0.3~1.3 cm，下面密生腺點

.....念珠根莖黃芩 *S. moniliorrhiza* KOMAROV

8. 根狀莖細長，不呈念珠狀

9. 一年生草本；葉片卵圓形或三角狀卵圓形，長 1.4~4.7 cm，

寬 1.2~3.5 cm，邊緣有淺而鈍的牙齒，下面僅脈上有毛

.....烏蘇里黃芩 *S. pekinensis* MAXIM. var. *ussuriensis*

(REGEL.). HAND. -MAZZ.

9. 多年生草本；葉片披針形或三角狀披針形，長 1.7~3.3 cm，

寬 3~6 cm，邊緣全緣，兩面被較密的毛

.....狹葉黃芩 *S. regeliana* NAKAI

黃芩屬 (*Scutellaria* L.) 植物全世界約有 300 種，我國約 100 種，而主要供藥用者在大陸地區有七種，台灣黃芩藥用者以正統黃芩 *Scutellaria baicalensis* GEORGI 多種植物的根，另外民間次用來源有十三

種。因為黃芩為大宗藥材，台灣現多由大陸進口貿易，所以在此不另做探討而只將其列出。

表一、黃芩的原植物與使用地區

分類	原植物	基源	使用地區
正品	黃芩	<i>Scutellaria baicalenesis</i> GEORGI	全國地區
北黃芩類	黏毛黃芩	<i>S. viscidula</i> BGE.	吉林、內蒙、 山東、河北
	甘肅黃芩	<i>S. rehderiana</i> DIELS	甘肅少量外銷
西南黃芩類	西南黃芩	<i>S. amoena</i> C. H. WRIGHT	雲、貴、四川
	連翹葉黃芩	<i>S. hypericifolia</i> LEVL.	四川西北部
	麗江黃芩	<i>S. likiangensis</i> DIELS	雲南西北部
	大黃芩	<i>S. tenax</i> W. W. SMITH var. <i>patentipilosa</i> (H.-M.)C. Y. Wu	四川白玉縣

臺灣產唇形花科黃芩屬植物之種類與分佈，依照國立台灣大學植物系學者根據外部型態、花粉、小堅果及地理分佈等特徵，可將台灣產黃芩屬 (*Suctellaria* L.) 植物分為 6 種，分別為向天盞 (*S. barbata*)、印度黃芩 (*S. indica*)、布烈氏黃芩 (*S. playfairi*)、台灣黃芩 (*S. taiwanensis*)、田代氏黃芩 (*S. tashiroi*)、和南台灣黃芩 (*S. austrotaiwanensis*)⁽⁵¹⁾。然而為民間藥用植物只有三種，印度黃芩 (*S. indica*)、台灣黃芩 (*S. taiwanensis*)、和田代氏黃芩 (*S. tashiroi*) 另外依據中國醫藥學院 中國藥學研究所 謝博士⁽⁵²⁾對台灣使用之黃芩藥材調查有一些來源皆為民間藥之代用品與混用

品表列如下：

表二、台灣黃芩藥材與代用品來源使用地區

分類	原植物	基源 (Labiatae)	使用地區
主要來源	黃芩	<i>Scutellaria baicalenesis</i> GEORGI 植物根	全國大部分 地區
次要來源	黏毛黃芩	<i>S. viscidula</i> BGE. (黃花黃芩)	吉林、內蒙、 山東、冀
	西南黃芩	<i>S. amoena</i> C. H. WRIGHT (滇黃芩)	雲、貴、川
	甘肅黃芩	<i>S. rehderiana</i> DIELS	甘、陝、山西
	薄葉黃芩	<i>S. ikonnikovi</i> JUZ.	東北至寧夏
	麗江黃芩	<i>S. likiangensis</i> DIELS	雲南西北部
	連翹葉黃芩	<i>S. hypericifolia</i> LEVL. (川黃芩)	四川、西北部
	並頭草	<i>S. scordifolia</i> FISCH (<i>S. galericulata</i> , <i>S. macrantha</i> FISCH) (頭巾黃芩、歧草黃芩)	全國及台灣
	印度黃芩	<i>S. indica</i> LEVL. (耳挖草、立浪草)	華南、台灣
	田代氏黃芩	<i>S. tashiroi</i> HAY	台灣
	呂宋黃芩	<i>S. javanica</i> JUNGH. var. <i>luzonica</i> (ROLF.) KENG (爪哇立浪草)	台灣
	台灣黃芩	<i>S. j. J.</i> var. <i>playfairi</i> (KUDO) HUANG & CHANG	台灣
# 葉有 缺刻者	狗牙半枝連	<i>S. dependens</i> MAXIM. (時有混用者)	台灣
	半枝連	<i>S. rivularis</i> WALL.	台灣

壹、 原植物型態特徵

黃芩來源植物有多種，但供藥用者主要的有 7 種，台灣使用以

Scutellariae baicalensis GEORGI 為主，茲將其植物形態及成分描述如下

(53,54,55,56,57,58) :

黃芩 *Scutellariae baicalensis* GEORGI

東北稱黃芩茶根、土金茶根、小葉茶根、野樹豆花根等；河北張家口稱空心草；內蒙古稱黃水水草。多年生草本，高 30~80 cm。莖鈍四稜形，具細條紋，無毛或被上曲至開展的微柔毛，綠色或常帶紫色；自基部分枝多而細。葉交互對生，無柄或幾無柄，葉片披針形至線狀披針形，長 1.5~4.5 cm，寬 3~12 mm，先端鈍，基部近圓形，全緣，上面深綠色，無毛或微有毛，下面淡綠色，沿中脈被柔毛，密被黑色下陷的腺點。總狀花序頂生或腋生，偏向一側，長 7~15 cm，苞片葉狀，卵圓狀披針形至披針形，長 4~11 mm，近無毛；花萼二唇形，紫綠色，上唇背部有盾狀附屬物，果實增大，膜質；花冠二唇形，藍紫色或紫紅色，上唇盔狀，先端微缺，下唇寬，中裂片三角狀卵圓形，寬 7.5 mm，兩側裂片向上唇靠合，花冠管細，基部驟曲；雄蕊 4，稍露出，藥室裂口有白色髯毛；子房褐色，無毛，4 深裂，生於環狀花盤上，花柱細長，先端微裂。小堅果 4，卵球形，長 1.5 mm，徑 1 mm，黑褐色，有瘤。花期 6~9 月，果期 8~10 月。生於海拔 60~2000 m 的向陽乾燥山坡、荒地上，常見於路邊。分布於東北、內蒙古、河北、河南、山西、陝西、

甘肅、山東等地。(黃芩圖)^(55,59)

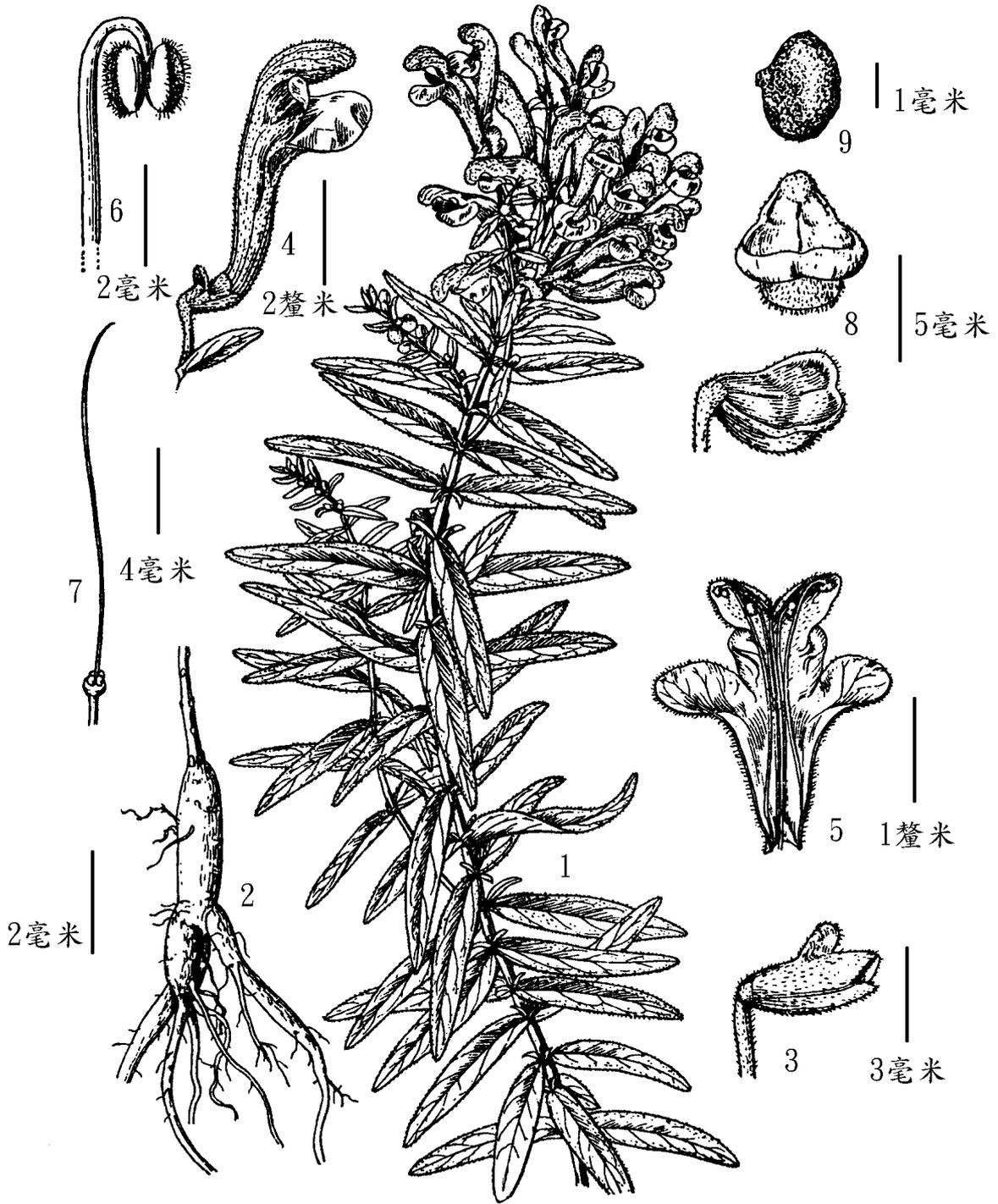
黃芩莖、葉中含量較高的有高山黃芩素 (scutellarin) 約 8.4 %~10.3 %，另含鞣質約 2.5 % 及樹脂，黃芩素 (baicalein)、黃芩素 (baicalin)、漢黃芩素 (wogonoside)、漢黃芩素 (wogonin) 等。黃芩葉含紅花素 (carthamidin)、異紅花素 (isocarthamidin)。黃芩莖、葉在山西民間代茶，習稱黃芩茶⁽⁶⁰⁾。

黃芩一般只藥用其根，東北民間廣泛用其葉作茶飲，有清熱解毒作用，而近年來從黃芩植物中陸續分離出多種成分，而以黃芩素 (baicalein)、黃芩素 (baicalin)、漢黃芩素 (wogonin) 和漢黃芩素 (wogonoside) 為其主要成分，而黃芩屬之藥用植物中如半枝蓮 (*Scutellaria barbata* D. DON)，異色黃芩 (*S. discolor* WALL. EX BENTH.)，地盆草 (*S. discolor* WALL. EX BENTH. var. *hirta* HAND.-MAZZ.)，韓信草 (*S. indica* LINN.)，鈍葉黃芩 (*S. obtusifolia* HEMSL.)，並頭黃芩 (*S. scordifolia* FISCH. Et SCHRANK)，偏花黃芩 (*S. tayloriana* DUNN)，紅莖黃芩 (*S. yunnanensis* LEVEL.)，柳葉黃芩 (*S. yunnanensis* LEVEL. var. *salicifolia* SUN ex C. H. Hu)，紫葳科的木蝴蝶 *Oroxylum indicum* (L.) VENT. 車前科的大車前 *Plantago major* L. 等的植物中都含有不等的上述成分，其全草均有清熱、燥溼、解毒等和黃芩相似的藥效，但未為中醫藥界應用於臨床處方之用，

僅局限於民間青草藥之推廣使用。

貳、 黃芩之採收與加工儲存

於春、秋後莖葉枯黃時，選晴天挖取。將根部附著的莖葉去掉，抖落泥土，曬至半乾，撞去外皮，曬乾或烘乾^(61,62)。黃芩本身並不適用水洗或冷浸，因為冷浸黃芩不能破壞酵素的活性，反而在一定的溫度、濕度下，會使所含黃芩素 (baicalin)、漢黃芩素 (wogonoside) 分別水解或分解為葡萄糖酸和黃芩素元 (baicalein)、漢黃芩素元 (wogonin)，使兩種素的含量減少，而影響質量。Baicalein 為一種鄰位三羥基黃酮，性不穩定，易氧化而變綠色，所以黃芩用冷水浸泡會變為綠色，其品質與藥效都略遜一籌，所以黃芩在採收加工與儲存過程或是相對濕度，都應保持乾燥和低濕度。



黃芩 *Scutellaria baicalensis* GEORGI

- 1.花與枝 2.根 3.花萼側觀 4.花冠側觀與苞片 5.花冠剖面與雄蕊
6.開裂花藥 7.雌蕊 8.成熟果實之花萼 9.小堅果

第三節 黃芩之生藥學與藥理學考察

黃芩 (*Scutellariae Radix*) 為唇形科 (*Labiatae*) 植物黃芩 *Scutellaria baicalensis* GEORGI 之乾燥根，為黃芩的基源植物。由本草考察圖經、吳普等本草對於原植物已經確認無誤，近代所使用之黃芩除了地區所使用之代用品，並無其他偽藥、假藥。

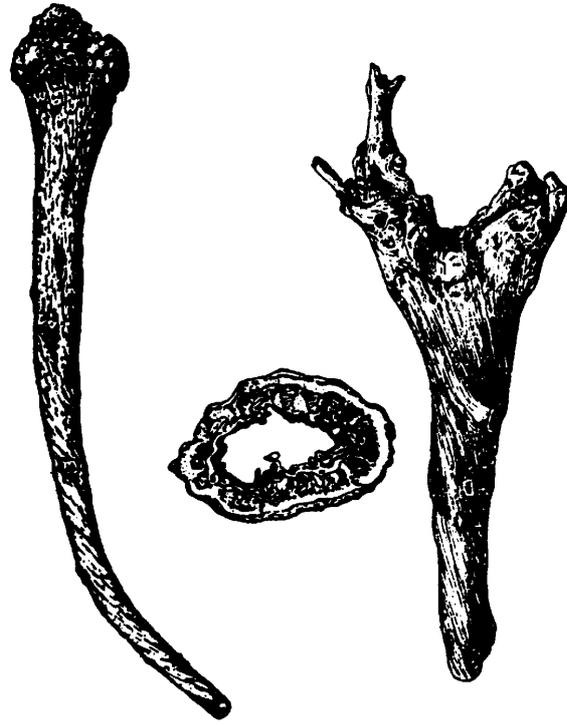
一、黃芩之生藥學

1. 藥材性狀鑑別

黃芩 *Scutellaria baicalensis* GEORGI 根呈圓錐形，多扭曲，長 5~30 cm，直徑 0.5~3 cm。表面棕黃色或深黃色，上部較粗糙，有明顯的縱向皺紋或不規則網紋，具疣狀側根殘痕，頂端有莖痕或殘留莖基。質硬而脆，易折斷，斷面黃色不平坦，新根內部充實，最外層平整的橫斷面呈深黃色。老根從上至下木部均枯朽，中間呈紅棕色，有的枯朽部分已脫落而成中空，留下棕黑色或暗棕色的殘痕或呈腐朽狀，為暗棕色。中空者稱枯芩、片芩，新根充實而質硬稱條芩、子芩。氣微、味苦。以條長、質堅實、色黃者為佳。

飲片為斜切圓形薄片，厚約 1 cm，表面黃色(若為黃綠色，因黃芩

□元氧化而變綠色)，形成層呈明顯環狀排列，棕色。皮部暗黃綠色，木部黃色，導管群明顯，成不連續環狀，中心黃棕色，腐朽狀，有時中空。氣顯著，味苦。（生藥圖一）^(63,64,65,66)



黃芩生藥圖一

2.顯微組織鑑別

黃芩根橫切面，栓皮層多破裂狀或殘留數列，細胞多呈扁平狀、卵圓形、類長方形、類多邊形，4~13層，呈黃棕色，木栓層細胞呈扁平長方形，排列規則，偶見散生石細胞散佈，約7~12層。栓皮層狹窄。韌皮部較寬廣，約佔根直徑的 $\frac{1}{3}$ ，有多數韌皮纖維與石細胞，石細胞多分布於外側，韌皮纖維多分布於內側。韌皮射線寬闊，為10~25列整齊的細胞。形成層明顯多呈環，呈扁平形，切線性排列。木質部約佔根直徑的 $\frac{2}{3}$ ，由導管、木部纖維、木部薄壁細胞、木部柔細胞組成，

木質部成束 6~10 排列，木部射線寬廣而平直，7~25 列薄壁細胞，導管管胞長 88~208 μm ，直徑 16~60 μm ，近原生木部常見裂隙。老根中央有一到數個同心排列的木栓環。本品薄壁細胞含澱粉粒，圓形、橢圓形和不規則形，長徑 4~32 μm ，短徑 4~24 μm ，層紋不易見。臍點呈點狀或人字形，有的不明顯，大多數為單粒，複粒較少，由 2~3 分粒組成。(黃芩根圖)^(67,68)

在麗江黃芩、甘肅黃芩與大黃芩的韌皮部中無石細胞和纖維存在，而黏毛黃芩韌皮部中只有纖維。只有麗江黃芩、甘肅黃芩的木栓形成層不是從中柱鞘發生的，所以在橫切面中可以看到初生皮層。在導管方面，正品為扁平狀，層與層間有木部薄壁細胞存在；黏毛黃芩有扁平狀也有不規則排列；西南黃芩為不規則排列，數目較多；甘肅黃芩呈圓形，在木質部中呈放射狀排列；麗江黃芩與甘肅黃芩相似，導管數目較少；連翹葉黃芩導管佔的比例較大，木部薄壁細胞少，導管群在每個木質束中排成 V 形或條形，而且射線中有石細胞存在；大黃芩與連翹葉黃芩相似，導管數目較密集，茲將各種生藥顯微組織整理如下⁽⁶⁹⁾。

3.藥材生藥性狀與顯微特徵檢索表

1. 韌皮部有石細胞及纖維分佈

2. 韌皮部僅有纖維，無石細胞分佈..... 黏毛黃芩

2. 韌皮部既有纖維又有石細胞分佈

3. 老根木質部不枯朽..... 西南黃芩

3. 老根木質部枯朽

4. 木部射線中有石細胞散在..... 連翹葉黃芩

4. 木部射線中無石細胞存在..... 黃芩

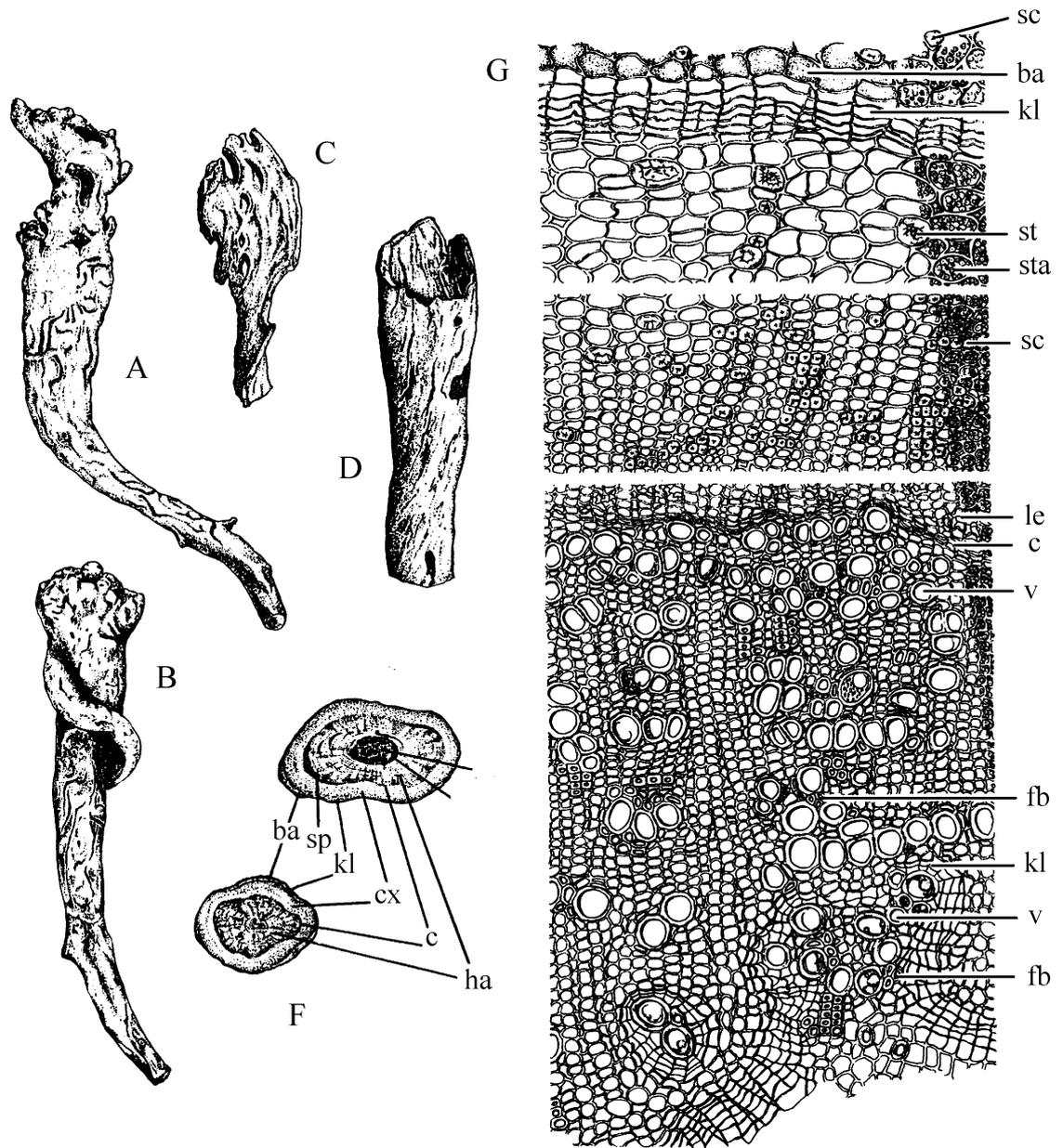
1. 韌皮部無石細胞及纖維分佈

2. 韌皮部直達木栓層、無皮層..... 展毛韌黃芩

2. 韌皮部不達木栓層、有皮層

3. 皮層中有石細胞及纖維存在..... 甘肅黃芩

3. 皮層中無石細胞及纖維存在..... 麗江黃芩

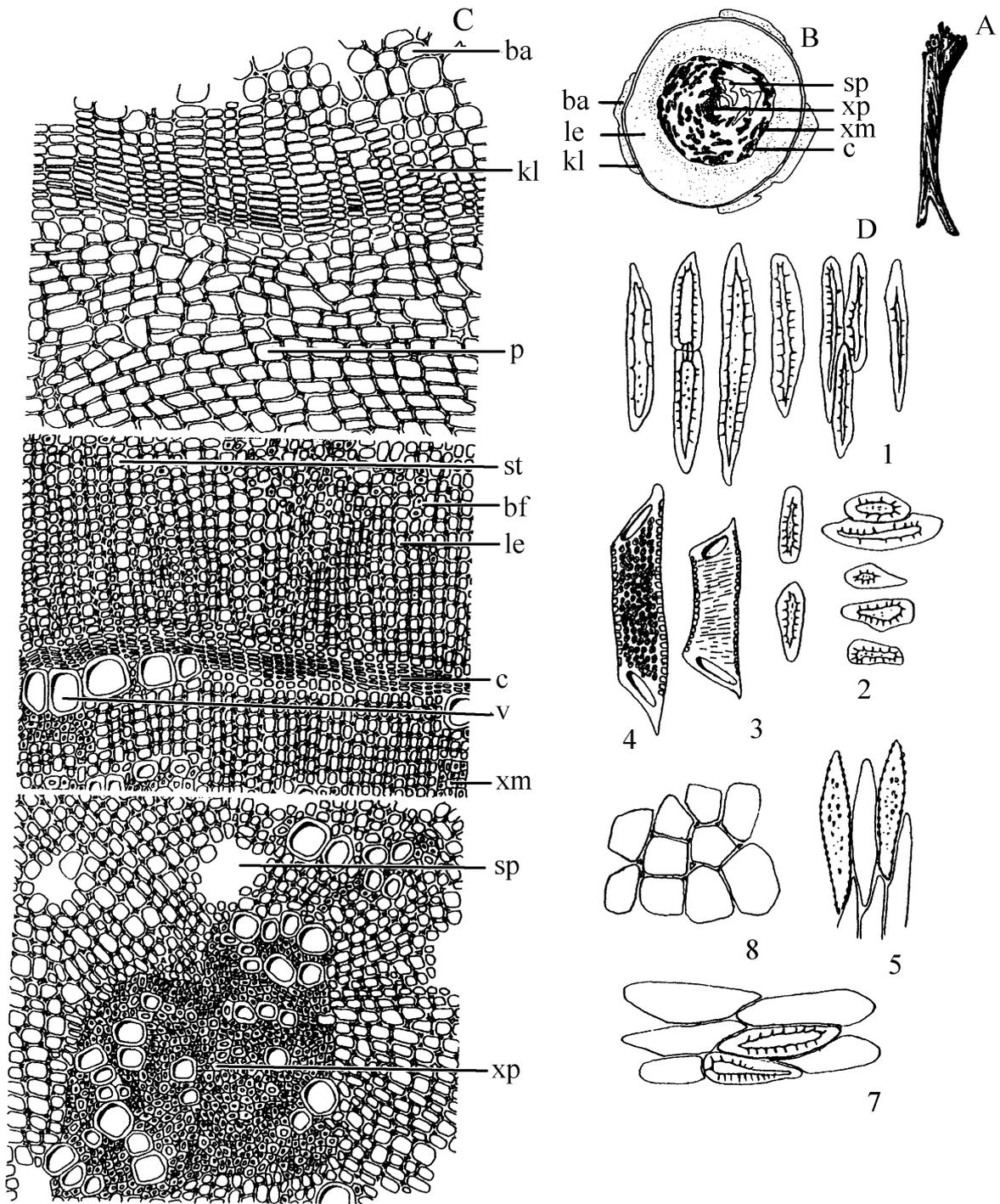


黃芩根 *Scutellariae Radix*

Scutellaria baicalensis GEORGI (Labiatae)

A. B. C. D. 外形圖

E. F. 切面圖



黃芩根 *Scutellariae Radix*
Scutellaria baicalensis GEORGI

A. 外形圖 0.5× B. 略圖 7× C. 組織圖 150×
 D. 解離要素 220×

1. 韌皮纖維及木部纖維 2. 石細胞 3. 網紋導管 4. 有緣孔紋導管
5. 韌皮薄壁細胞 6. 木栓細胞 7. 韌皮纖維與韌皮薄壁細胞

二、黃芩之化學成分

1. 根含黃酮類化合物

(1) 黃酮類

黃芩素元(baicalein)、黃芩素 (baicalin)、白楊素(chrysin)、木蝴蝶素(千層紙素)即木蝴蝶素 A (oroxilin, oroxilin A)、漢黃芩素元(wogonin)、漢黃芩素(wogonoside)、黃芩黃酮 (skullcapflavone) 等。

(2) 二氫黃酮類

二氫木蝴蝶素 A (dihydrooroxilin A)、二氫黃芩素 (dihydro baicalin) 等。

(3) 查爾酮類

7,2',6' -三羟基-5-甲氧基查爾酮

(7,2',6' -trihydroxy-5-methoxychalcone)、2,6,2',4' -四羟基-6' -甲氧基查爾酮 (2,6,2',4' -tetrahydroxy-6' -methoxychalcone)。

(4) 二氫黃酮醇類

3,5,7,2',6' -五羟基二氫黃酮醇 (3,5,7,2',6' -pentahydroxyflavonol)

(5) 黃酮醇類

3,5,7,2',6' -五羟基黃酮醇 (3,5,7,2',6' -pentahydroxyflavonol)。

2. 苯乙酸葡萄糖類

2-(3- β -4-甲氧基苯基)-乙基-1-O- β -L-鼠李糖基(1 \rightarrow 3)- β -D-(4-阿魏基)-葡萄糖 (2-(3-hydroxy-4-methoxyPhenyl) ethyl-1-O- β -L-rhamnosyl(1 \rightarrow 3)- β -D-(4-feruloyl) glucoside)

3. 氨基酸類

含有 14 種氨基酸，其中脯氨酸 (proline) 含量最高，約占 80 %。

4. 揮發油類

揮發油中含有多種類、酸、酮、酚、內酯、醛、醚等成分，其中苯乙酮 (acetophenone)、(E)-4-苯基-3-丁烯-2-酮 ((E)-4-phenyl-3-buten-2-one)、1-苯基-1,3-丁二酮 (1-phenyl-1,3-butanedion) 棕櫚酸 (palmitic acid) 和油酸 (oleic acid) 含量較高。

5. 其他

地上部分含兩種黃酮 carthamidin、isocarthamidin。另含葡萄糖 (glucose)、蔗糖 (sucrose)、少量的菜油甾醇 (campesterol)、左旋聖草素 (eriodictyol)、半枝蓮種素 (rivularin)、 β -谷甾醇 (β -sitosterol)、豆甾醇 (stigmasterol) 等⁽⁷⁰⁾。

三、黃芩中主要成分提取分離

黃芩中的主要化學成分為黃酮類化合物，已經確定結構的有三十餘種，黃芩的抗菌有效成分以黃酮類化合物黃芩素為主，約 4.0 %~5.2 %。黃芩素進入消化道後，會被腸內微生物分解為黃芩素元方能被吸收，文獻中有關口服大柴胡湯和小柴胡湯（含黃芩）的結果顯示，在人體血漿中分析證實其主要代謝物為 baicalein 6-O-sulfate 和 baicalein 7-glucuronide (為 baicalin)，在本研究中探討黃芩對 in vitro 的影響，所以將其主要化學成分提取分離方法簡介如提取圖(圖一)。(71,72,73)

四、黃芩素之結構與性質

1.化學名與異名

5,6,7-trihydroxy-2-phenyl-4H-1-benzopyran-4-one

(5,6,7-三羟基-2-苯基-4H-1-苯並吡喃-4-酮)

5,6,7-trihydroxyflavone

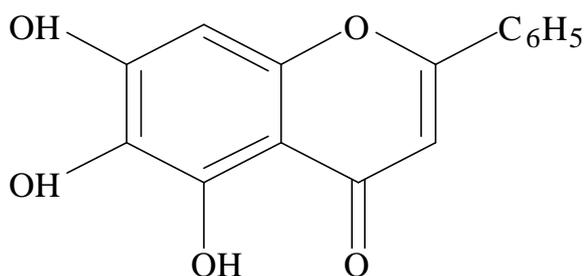
又稱為 Baicalein、三羟基黄酮、黃芩素元、黃芩素元、黃芩素、

、黃芩黃素、noroxylin

2.結構式

3. 分子式及

mol. wt.



分子量

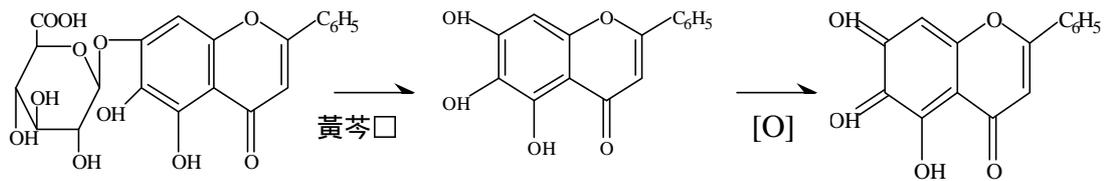
$C_{15}H_{10}O_5$;

270.24。

$C_{15}H_{10}O_5=270.24$

4. 物質性質

經由乙醇再結晶為黃色針狀結晶，分解點為 mp. 264~265 ，UV_{max}(ethanol) : 324, 276 nm ; (log ϵ : 4.18,4.42) ，可溶於乙醇 (alcohol)、甲醇 (methanol)、乙醚 (ether)、丙酮 (acetone)、乙酸乙酯 (ethyl acetate) 和熱冰醋酸 (hot glacial acetic acid) ，微溶於氯仿 (chloroform)、硝基苯 (nitrobenzene) ，幾乎不溶於水 (water)。溶於稀氫氧化鈉 (dil. NaOH) 呈綠棕色 (greenish-brown) ，濃硫酸 (conc. H₂SO₄) 呈黃色並且有綠色螢光 (green fluorescence)。易被氧化轉為 quinone 類衍生物而呈綠色。(如圖所示)^(74,75)



黃芩素(黃色)

Baicalin

黃芩素元(黃色)

Baicalein

綠色

五、黃芩之藥理作用考察

1. 抗微生物作用

黃芩煎劑在體外對葡萄球菌、溶血性鏈球菌(,) 白喉桿菌、傷寒桿菌和霍亂弧菌有較強的抑菌作用,黃芩水浸膏中抑制金黃色葡萄球菌的成分為黃芩素元,漢黃芩素的抑菌作用不明顯。對青黴素已產生抗藥性的葡萄球菌也有抑制作用。在體外對狗小芽胞菌、莖色毛癬菌、許蘭黃癬菌及其蒙古變種、足趾發癬菌、同心性毛癬菌、鐵銹色毛癬菌有抑制作用。^(76,77,78,79,80,81,82,83)

黃芩煎劑與流感病毒 PR8 株混合後給小鼠滴鼻,存活時間亦較長,如小鼠先用病毒滴鼻,再用黃芩煎劑滴鼻並飲用黃芩煎劑亦有同樣效果⁽⁸⁴⁾。在體外,漢黃芩素元和黃芩素元抑制唾液酸酶的作用比漢黃芩素元葡萄糖醛酸和黃芩素強,體外試劑對乙型肝炎病毒 DNA 複製有抑制作用⁽⁸⁵⁾。炮炙後之作用不同,其原理可能經由蒸、煮使

破壞，而不致影響有效成分的作用所致。

依據我國古代醫籍記載黃芩治諸熱黃疸、腸澀泄痢、天行熱疾、乳癰、發背、熱毒、肺火、膀胱火、六經實火、實熱、斑疹瘡瘍、赤眼、熱蓄膀胱 等來看⁽⁸⁶⁾，黃芩早被用於多種傳染病、腸道感染、皮膚軟組織感染、尿路感染等各種感染性疾病，其與現今發現黃芩的廣效抗菌譜結果相符。在直指方中指出「柴胡退熱，.....散火之標；黃芩之退熱，折火之本也。」與用抗菌作用而致發熱症狀消退的理念一致。

2. 抗炎和抗過敏反應作用

小鼠灌服黃芩甲醇提取物，黃芩□元對腹腔注射乙酸誘發的血管滲透性增加有劑量依賴性抑制作用；對化合物 48/80 (Sigma 生產之一種化合物) 引起的足腫灌服黃芩□元有明顯抑制作用，但療效不及□□美辛(indomethacine)。

黃芩□元不溶於水，其兩個水溶性衍生物黃芩□元-6-磷酸二鈉 (BPS) 及黃芩□元-6-硫酸二鈉 (BBS)，對大鼠被動皮膚過敏反應 (PCA) 有抑制作用，對離體豚鼠腸管及氣管 Schultz-Dale 過敏性收縮反應均有抑制作用；對大鼠反向皮膚過敏反應 (RCA) 有抑制作用，也抑制 Forssman 皮膚血管炎，但對 Arthus' phenomenon 反應無明顯

影響⁽⁷⁶⁾，且以 BPS > BBS⁽⁸²⁾。黃芩素及 BPS 結構上與抗過敏藥色甘酸二鈉 (DSCG) 有共通 chromone 骨架，但 DSCG 為雙色酮類，黃芩素及 BPS 為單色酮類，DSCG 對反應素 (Reagin) 抗體傳導的過敏反應有高度特異性，對於非反應素 (non-reagin) 抗體傳導的過敏反應幾無作用，BPS 則不僅抑制反應素抗體傳導的過敏反應。一般認為 DSCG 分子中兩個色酮核間有一定距離，可結合於反應素抗體功能位置上，而不適合於非反應素抗體，但單色酮的黃芩素或 BPS 可以兩個分子結合於這兩種抗體上。豚鼠腹腔注射黃芩素對被動性全身過敏反應 (PSA) 有明顯抑制作用，可降低死亡率、推遲死亡時間和減輕症狀，對小鼠 PSA 也有輕度療效；對豚鼠 PCA 也有明顯抑制作用。對 PSA 和 PCA 的療效，黃芩素均強於黃芩素。黃芩素對致敏豚鼠離體回腸與離體氣管由抗原產生的收縮有明顯抑制作用，即對於實驗性氣喘有效，黃芩素的作用強於黃芩素。故其活性構造，在 baicalein 的部份。^(77,85)

黃芩素在體外對大鼠腹腔多核白細胞 (5-HETE, 系脂氧酶催化的產物) 合成有抑制作用，比抑制 (HHT, 系環氧酶催化的產物) 合成要強。黃芩素對血小板脂氧酶活性與黃芩素之具選擇性抑制作用強，相差達 6917 倍。

由以上實驗說明黃芩素與黃芩素元均有抗過敏反應作用⁽⁸⁷⁾，如果

與麻黃鹼合用對實驗性哮喘有協同作用，抗過敏強度 黃芩□元 > 黃芩□，抑制組織胺皮膚反應程度 黃芩□元 > 黃芩□ = 蘆丁 > 甲基橙皮□，是抑制抗原體結合後的過敏介質釋放以及與鬆弛平滑肌作用有關。此外，黃芩□元能抑制由同種與異種抗體引起的被動過敏反應，有發展成為新的抗過敏反應藥物。民間有用黃芩配伍地龍或麻黃治哮喘的經驗，而古方白果定喘湯中也用黃芩。也有用黃芩□元來治療慢性濕疹，其與抗菌和抗過敏作用有關。⁽⁸⁰⁾

3. 降低血壓和利尿作用

麻醉犬靜注黃芩浸劑，血壓明顯下降，灌服黃芩浸劑或醇提物亦有顯著降壓作用，切斷迷走神經或靜注阿托品(atropine)對降壓無影響，黃芩浸劑亦無抗腎上腺素和神經節阻斷作用，但在離體兔耳、離體兔腎及後肢血管灌流試驗均有明顯血管擴張作用。慢性腎性高血壓犬灌服黃芩浸劑，可使血壓下降，心率變慢，可能與黃芩□阻斷兒茶酚胺類(catecholamines)物質的受體有關。

黃芩的降血壓原理一般認為係直接擴張血管^(78,81)，由本實驗發現黃芩□元對內皮細胞具抑制生長之作用。也可能作用於血管感受器，反射性地引起血壓下降。在研究黃芩均證明有利尿作用，以黃芩□元之作用最明顯，尿量增多同時，血壓也隨之下降。黃芩的緩

下與利尿作用可以確認，其利尿作用的強度為 baicalein > wogonin > baicalin 之順序^(77,80,82,84)。高血壓在中醫為新的名詞，但對於高血壓常見的頭痛、胸悶、煩躁等熱性症狀的治療，有著豐富的經驗。如李東垣以小清空膏，既治與高血壓引起的頭痛相似之少陽頭痛，亦治太陽頭痛，而少陽頭痛與高血壓疾病引起的頭痛相似，這可能與其降壓鎮靜作用有關。

4. 降血脂作用

黃芩素可降低血清甘油三酯；對乙醇引起的高血脂大鼠，可降低肝總膽固醇、游離膽固醇及甘油三酯含量。黃芩素能增加血清 HDL-ch 含量。口服黃芩素尚可降低肝臟中甘油三酯，但均不降低肝內膽固醇。對促皮質激素(ACTH)誘導的脂肪分解，黃芩素 有抑制作用，但黃芩素和黃芩素元則有興奮作用。口服黃芩素或黃芩素元可降低肝中總膽固醇、游離膽固醇和甘油三酯，黃芩素元可增加血清高密度脂蛋白膽固醇。在體外，漢黃芩素、黃芩素、黃芩素元均可抑制去甲腎上腺素(norepinephrine)對大鼠離體脂肪組織促進脂肪分解的作用。^(88,89,90)

5. 抗血小板聚集和抗凝作用

在體外多種黃芩成分，黃芩素、漢黃芩素、木蝴蝶素 A、黃芩黃酮 和白楊素均可抑制膠原產生的大鼠血小板聚集，黃芩素有抑制 ADP (adenosine diphosphate) 及花生四烯酸(arachidonic acid) 誘導產生的血小板聚集，亦可抑制由凝血素(thrombin)誘導的由纖維蛋白原(fibrinogen)轉化為纖維蛋白(fibrin)的轉變^(91,92,93)。大鼠灌服黃芩素，對內毒素誘發的實驗性彌散性血管內凝血(DIC)，可防止血小板和纖維蛋白原的降低。

6. 抗氧化作用

大鼠灌服黃芩素在大白鼠肝臟微粒(liver microsomes)試驗中，藉由 baicalein 與鐵形成錯合物使腹腔注射 FeCl₂-抗壞血酸-ADP 混合物產生的脂質過氧化物(lipid peroxidation)減少；在體外，由 FeCl₂-抗壞血酸和還原型輔酶 I 脫氫酶(NADPH-ADP)產生的脂質過氧化物也有抑制作用^(70,85)。而形成葡萄糖醛酸基的黃酮活性大於相應之黃芩素，所以黃芩素比黃芩素元有明顯清除自由基作用，並呈量效關係，也可對抗氧自由基對人血紅蛋白的氧化破壞，並可抑制氧自由基誘發的脂質過氧化，表明可做臨床試驗的抗氧化劑。^(94,95,96)

7. 對中樞神經系統的作用

家兔靜注黃芩浸劑 1g/kg 有輕度鎮靜作用, 500 ~1000 mg/kg 則有顯著鎮靜作用, 其對小鼠防禦性條件反射可使陽性反射時間延長, 而對非條件反射及分化無影響, 說明黃芩可加強皮層抑制過程。兔服黃芩煎劑後, 其含黃芩血清對兔單核細胞 DNA 蛋白質合成及 Ca^{2+} 內流均有明顯抑制作用, 可使陽性條件反射的形成減慢, 提示其可能抑制內生致熱原的產生。因此, 此作用也可能是導致高血壓患者服用黃芩製劑後自覺症狀顯著好轉的原因之一。

黃芩 \square 和黃芩 \square 元有抗乙酰膽鹼作用, 並且也能對抗毛果芸香鹼引起的腸運動增強, 切斷迷走神經而不影響其作用。對別錄中所記載的小腹絞痛, 其可能對平滑肌本身有直接鬆弛作用。

8. 抗癌作用

黃芩 \square 元對人體肝細胞瘤有抑制瘤細胞生長及其 DNA 合成作用($IC_{50} = 50 \mu g/ml$)^(38,97)

9. 其他作用

大鼠腹腔注射黃芩甲醇提取物, 對 - \square 基異硫氰酸鹽(ANIT)誘發的肝損害有保護作用, 可使升高的血清丙氨酸轉氨 \square 、總膽紅素和直接膽紅素降低; 對於四氯化碳引起的小鼠肝損傷有明顯的保護

作用⁽⁸⁰⁾，黃芩素可在體內水解析出黃芩素元與葡萄糖醛酸：
 $C_{21}H_{18}O_{11} + H_2O \rightarrow C_{15}H_{10}O_5 + C_6H_{10}O_7$ ；葡萄糖醛酸是已知的解毒、保
肝藥物，黃芩素元經由實驗證明，也有較弱的解毒作用，故有保肝
作用⁽⁹⁸⁾。在體外黃芩素元對大鼠腦蛋白激酶 C (PKC) 為抑制作用。

10. 體內過程

在家兔靜脈注射黃芩素元 50mg/kg 得其 $T_{1/2}$ 為 $72.35 \pm 2.45 \mu$
g/ml，在 2~50mg/kg 劑量範圍內呈線性關係。肌肉注射等量約 20 分
鐘到達血中最高濃度 $4.163 \pm 0.37 \mu$ g/ml；生體可用率為 68% 比黃芩
素 89.27% 低，較 Wogonin 高。口服劑量之生體可用率僅為 29% 與
黃芩素 22~36% 相近，可見在給藥過程中以注射為佳⁽⁹⁹⁾。而人口服
黃芩素 2000 mg，尿排洩速度峰時(T_c): 9 小時，尿排洩速度峰值(C_T):
 6.6μ g/hr，腎排洩率 4%， $T_{1/2}$ 5.6 小時。⁽¹⁰⁰⁾

第四節 細胞週期(cell cycle)與細胞週期之調控

細胞由一個增殖成兩個的過程稱為細胞分裂，而兩次細胞分裂所須的時間為一個細胞週期(cell cycle)，一般劃分成 G₁、S、G₂ 以及 M 四時期。在此過程中，許多細胞生理現象的產生有其一定的順序，以真核細胞為例子，DNA 合成必須要先完成，細胞才會進行有絲分裂；紡錘絲必須要先形成，染色體才會分開到兩極。細胞對這些事件發生的順序有極嚴格的調控，以避免因 DNA 未複製完成就進行細胞分裂，而導致細胞死亡⁽¹⁰¹⁾。

目前知道細胞內存有許多檢查點(checkpoint)，這些檢查站可以感應到先期事件是否已完成，然後再決定是否讓後期事件發生。在細胞週期中有兩個檢查點被研究得比較清楚，一是在 G₁ 期，另一個是在 G₂/M 交界處。在 G₁ 期的檢查點可以感應到細胞生長的條件是否適合細胞增殖，來決定細胞該進入 S 期或停留在 G₁ 期。而 G₂/M 期的檢查點則可以感應到 DNA 合成是否已完成，來決定細胞是否可以進入 M 期^(102,103)。

除了這些檢查點外，最近利用遺傳方法陸續找到許多調節細胞週期的檢查點，包括調控 DNA 損壞造成細胞停頓在 G₁ 期、微管束無法聚合而停頓在 M 期前期(prophase)的檢查點。這些證據顯示，細胞週期的調控是一種回餽控制方式，經由各種不同的檢查點來確保細胞週期內各事件發生之順序^(104,105)。

細胞週期的調節極為精確而又複雜，這些調控主要是靠細胞週期調節酵素來執行。細胞週期的調節中心是由一群蛋白激酶執行，這些激酶只有與 cyclins 結合時才有活性，稱為 Cdk 激酶 (cyclin dependent kinase; Cdk) 不同的 Cdk 激酶分別參與細胞週期中不同檢查點的調節。Cdk 激酶的活性除受 cyclins 活化外，也受其本身磷酸化的調控。以 Cdk2 為例子，磷酸化在其 Thr-160 的位置，會增加它與 cyclins 間的親和性，同時也會造成結構上的變化，使 Cdk 激酶的活性中心曝露出來。當 cyclins 結合到 Thr-160 已被磷酸化的 Cdk2 激酶時，其激酶活性被完全活化⁽¹⁰⁶⁾。磷酸化對 Cdk 激酶活性的影響除了正調節外也有負調節。以 Cdk1 (又稱 p34^{cdc2} 激酶) 為例，磷酸化在其 Thr-14 及 Tyr-15 的位置則抑制其酵素活性⁽¹⁰⁷⁾。

cyclins 是另一類的細胞週期調節酵素，其主要功能是調控 Cdk 激酶的活性。cyclins 依其作用點可區分成兩大類：一類是 G1 cyclins 包括 cyclin D 及 cyclin E 其主要作用點是在 DNA 合成之前。另一類則是 G2 cyclins，主要為 cyclin B，作用點是在 DNA 合成之後。所有 cyclins 蛋白都有一段由 150 個氨基酸所組成的區域，這區域是它與 Cdk 結合的位置，形成之複合體其受質專一性亦不相同。

Cdk4-cyclin D 激酶：主要功能是調控細胞通過 G1 期的 R 點 (restriction point, R point)。G1 期的 R 點是決定細胞能否進入 S 期的一個重要調控點。Cdk4-cyclin D 激酶複合體只有在細胞到達 R 點時形成，當細胞進入 S 期

後便分開⁽¹⁰⁸⁾。Cdk4-cyclin D 激酶經由調節 Rb 蛋白的活性來調控細胞週期的運轉。

Cdk2-cyclinE 激酶：哺乳類動物細胞中尚有一類 G1 cyclin，cyclin E 它的功能和啟動 DNA 合成有關。當細胞通過 R 點以後，cyclin E 很快地與 Cdk2 結合，然後活化 Cdk2 激酶活性，引發 DNA 合成。Cdk2-cyclinE 激酶活性是許多細胞生長負調節者共同的作用目標。這些負調節者經由抑制其活性，使細胞停留在 G1 期⁽¹⁰⁹⁾。目前知道 TGF- β 會誘發一類分子量 21 kD 的 Cdk2 激酶抑制蛋白 p21^{Cip1} 與之結合抑制其活性，而阻止細胞進入 S 期⁽¹¹⁰⁾。

Cdk2-cyclin A 激酶：當細胞開始進行 DNA 合成時，cyclin E 就被分解掉，取而代之的是 cyclin A 與 Cdk2 激酶複合體的形成。此激酶活性是讓細胞 DNA 合成得以持續下去的原動力，其會磷酸化而活化 DNA 解開酶(helicase)，此酵素活性對 DNA 複製極為重要。此外，細胞內 cyclin A 的量和細胞生長情況有關。許多癌細胞中，cyclin A 的表現量較正常細胞多⁽¹¹¹⁾。

Cdc2-cyclin B 激酶：調控細胞進行有絲分裂最主要的酵素。當細胞由 G2 期進入 M 期時，須要 Cdc2-cyclin B 激酶被活化。而有絲分裂結束後，cyclin B 必須被分解，細胞才會離開 M 期⁽¹¹²⁾。在細胞週期中，其活性大部份時候是被抑制住的。這種抑制是因 weel/nik1 激酶磷酸化在 cdc2

Tyr-15 的位置所造成。當 DNA 複製完成，細胞處於 G2/M 期交界，此時其被去磷酸化而活化，然後由細胞質轉移到細胞核中，催化一連串的反應，導致細胞進行有絲分裂。若細胞內 cyclin B 無法被分解，則細胞雖可以進入 M 期。但卻無法離開 M 期的 metaphase 期⁽¹¹³⁾。

除了 Cdk 激酶及 cyclin 外，最近發現一群 Cdk 激酶的抑制蛋白也參與細胞週期的調控。這些 Cdk 激酶抑制蛋白包括 p21^{Cip1}、p27^{Kip1}、p16^{INK4}、p15^{INK4B} 等蛋白，分別在不同細胞中及不同的訊息傳遞路徑中，調控 Cdk 激酶的活性。如細胞因紫外光照射而造成 DNA 損壞時，會經由細胞內 p53 蛋白誘發 p21^{Cip1} 的表現，進而抑制 cyclin D/Cdk4 複合體激酶活性，使細胞生長停頓在 G1 期⁽⁴²⁾。此外，TGF- β 抑制細胞生長的調控方式則是經由誘發 p27^{Kip1} 的表現來抑制 cyclin E/Cdk2 複合體激酶活性，造成細胞生長停頓在細胞週期的 G1 期⁽¹¹⁴⁾。

本論文發現 baicalein 會抑制內皮細胞的生長，其抑制作用是誘使細胞生長停頓在細胞週期的 G1 及 G2/M 期，而 S 期之細胞有明顯減少之趨勢