

# 臺灣產崗脂麻(*Helicteres angustifolia* L.) 之藥理活性評估

盧國樑<sup>1,4</sup> 王繼平<sup>2</sup> 何禮剛<sup>3</sup> 張永勳<sup>1</sup>

<sup>1</sup> 中國醫藥學院 中國藥學研究所

<sup>2</sup> 臺中榮總 醫研部

台中

<sup>3</sup> 國立陽明大學 藥理學科暨藥理學研究所

台北

<sup>4</sup> 中華醫事學院

台南

(2000年3月30日受理, 2000年5月19日收校訂稿, 2000年5月19日接受刊載)

崗脂麻 (*Helicteres angustifolia* L.) 為梧桐科 (Sterculiaceae) 植物, 其根在臺灣市場品中以其消腫解毒之功, 應用於喉痛、扁桃腺炎而常被當成山豆根來使用。實驗結果顯示其甲醇粗抽物對小鼠口服給藥之致死量 ( $LD_{50}$ ) 為 2.54 g/kg。並發現其甲醇粗抽物及其不同有機溶媒萃取層對 A-549、HT-29、KB-16 及 P-388 等四種癌細胞均有明顯之抑制作用, 以乙酸乙酯萃取層 (Ha-E) 對 HT-29 之作用最強。對發炎細胞之作用, 甲醇粗抽物及各萃取層對 fMPLP 所誘發嗜中性白血球的去顆粒作用中, 對  $\beta$ -glucuronidase 釋出具顯著之抑制作用 ( $P < 0.01$ ) ; 乙酸乙酯及正丁醇萃取層 (Ha-B) 之  $IC_{50}$  分別為 16.7 及 56.3  $\mu$ g/ml 此二層萃取物對 lysozyme 之釋出亦具抑制作用。以 compound 48/80 誘發肥滿細胞去顆粒作用中, 二氯甲烷萃取層 (Ha-C) 在 10  $\mu$ g/ml 之濃度, 正丁醇萃取層 (Ha-B) 及水層 (Ha-W) 在 30  $\mu$ g/ml 之濃度時, 對 histamine 釋出有抑制作用, 但對  $\beta$ -glucuronidase 之釋出則無抑制作用。

關鍵詞：抗發炎試驗, 細胞毒性試驗, 崗脂麻。

## 前 言

據本研究室之前所進行一系列臺灣市售易誤用、混用中藥品種調查研究中，發現崗脂麻 (*Helicteres angustifolia* L.; 以下簡稱 Ha) 之根亦被當山豆根 (*Sophora Subprosprata Radix*) 來使用<sup>1-3</sup>。崗脂麻為梧桐科 (*Sterculiaceae*) 山芝麻屬 (*Helicteres*) 植物，在臺灣僅此一種<sup>4</sup>，生於平野山麓、丘陵之耕餘地，荒地草叢、路旁、墓地內多見，為小灌木<sup>4,5</sup>。又稱為山茶米、茶米粕。具有清熱解毒功能，常用於感冒發熱、扁桃腺炎、咽喉炎、腮腺炎、皮膚濕疹、痔瘡<sup>6,7</sup>。始載於生草藥性備要，自清代即為「廣東涼茶」的主要原料<sup>8</sup>。在植物成分分析研究中發現，主要含有 triterpenoid、naphthoquinone、sesquiterpene 及 flavonoid glycoside 等類<sup>9-12</sup>。但在文獻上未見崗脂麻之相關藥理活性研究報導。因此，本研究針對崗脂麻根之甲醇粗抽物及各有機溶媒萃取層進行細胞毒性及抗發炎、抗過敏等活性之評估。

## 實驗材料與方法

### 一、原植物之採集及鑑定

民國八十六年九月於臺中縣大度山採得崗脂麻鮮品，經本所邱技正年永老師鑑定無誤。並於同年十月向南投縣竹山鎮山友青草行購得崗脂麻根之乾燥藥材 10 公斤。該批藥材經生藥組織切片，並與原植物鮮品比對確認為崗脂麻後，始進行本研究。

### 二、提取與分離

崗脂麻根以甲醇於室溫下浸泡一週後過濾，重覆三次此抽取步驟，合併三次濾液，減壓濃縮得到根部甲醇粗抽物 650 g (Ha-M)，抽出率為 6.5 %。取甲醇粗抽物，加入蒸餾水使之成懸浮液，再以正己烷萃取三次，萃取液合併減壓濃縮至乾，得正己烷層 (Fr. Ha-H, 45 g)，同上法再將水層依序增加極性以二氯甲烷、乙酸乙酯、水飽合之正丁醇萃取之，得二氯甲烷層 (Fr. Ha-C, 105 g)，乙酸乙酯層 (Fr. Ha-E, 14 g)，正丁醇層 (Fr. Ha-B, 195 g)，餘者為水層 (Fr. Ha-W, 284 g)。

### 三、實驗動物

ICR 系雄性鼯鼠，乃購自行政院國科會國家實驗動物繁殖及研究中心，飼養於中國醫藥學院動物中心；室溫維持 22~24°C，光照週期 12 小時，自由飲水並餵食標準飼料，體重 20~25 公克。雄性 SD 大鼠則飼養於台中榮總醫研大樓的動物中心，體重 250~300 公克。

#### 四、急性毒性試驗

採 Litchfield and Wilcoxon 之方法<sup>13</sup>，使用體重 20~25g 之雄性鼯鼠，經口服給予崗脂麻根之甲醇粗抽物 1.5、3.0、4.5 g/kg，鼯鼠數量為每組 10 隻，進行鼯鼠急性毒性實驗。給予藥物後連續觀察 72 小時，記錄其中毒及死亡之情形，求得鼯鼠之致死量 (LD<sub>50</sub>) 及其 95 % 可信度。

#### 五、細胞毒性試驗

利用 MTT 分析方法<sup>14</sup>，於 96 孔培養皿中加入測試之抽取物 20  $\mu$ l，(每孔中最終濃度為 0.5、5、50  $\mu$ g/ml 三種各種濃度重覆三次)再於每孔中加入 180  $\mu$ l 細胞 (約 100~2500 個細胞)，將此培養二至十天後，將細胞以 PBS 洗二次，再於每孔中加入 MTT 50  $\mu$ l (1 mg/ml)，將此培養皿置於 37°C，5 % CO<sub>2</sub> 培養箱中靜置四小時後，再於每孔中加入 DMSO 溶解藍色沉澱。利用 Multiscan reader 讀取波長 540 nm 之吸光度，並計算其有效劑量 (ED<sub>50</sub>)。

根據美國 NCI 之準則粗抽物之 ED<sub>50</sub>  $\leq$  20  $\mu$ g/ml，純物質之 ED<sub>50</sub>  $\leq$  4  $\mu$ g/ml，則視為具有抗腫瘤之活性。本實驗所使用之癌細胞如下：(1) KB-16：人類喉癌細胞，以 DMEM (GIBCO) 為培養基，外加 10 % 胎牛血清 (FCS)。(2) P-388：老鼠血癌細胞，以 Fisher's medium 培養，外加 10 % 胎牛血清。(3) A-549：人類肺癌細胞，以 RPMI 1640 (GIMCO) 為培養基，外加 10 % 胎牛血清，2 mM glutamine，1 mM sodium pyruvate and 50 mM mercaptoethanol。(4) HT-29：人類腸癌細胞，以 alpha MEM (GIBCO) 為培養基，外加 10 % 胎牛血清。

#### 六、對發炎細胞之作用

##### (一)嗜中性白血球去顆粒作用試驗

大鼠麻醉後，由腹腔動脈抽血，經 dextran 混合靜置，Ficoll-Hypaque 離心，低張溶液使紅血球溶血，將細胞清洗並懸浮成每毫升  $1 \times 10^7$  細胞<sup>15</sup>。將此細胞懸浮液與 fMLP 作用後，離心取上清液，並測其中所含的  $\beta$ -glucuronidase 量，利用分光光度計 550 nm 下測之<sup>16</sup>。另一方面利用 *Micrococcus lysodeikticus* 細胞為受質，在分光光度計 450 nm 下測 lysozyme<sup>17</sup>。

##### (二)肥滿細胞的去顆粒作用試驗

大鼠經頸部放血後，將含肝素之 Tyrode's 溶液注入鼠腹腔內，按摩並取出腹腔溶液，經 38 % 牛血清蛋白溶液離心，沉澱細胞經清洗後，懸浮成每毫升  $1 \sim 1.5 \times 10^6$  細胞<sup>18</sup>。將此肥滿細胞懸浮液與 compound 48/80 作用，離心後將上清液取出，測其中所含的組織胺。利用 *o*-phthalaldehyde 聚合後以螢光分光光度來測量<sup>19</sup>。另一方面利用 phenolphthalein- $\beta$ -D-glucuronide 作為受質，經由分光光度計測量  $\beta$ -glucuronidase。

## 結 果

### 一、急性毒性試驗

由口服給予小鼠，做崗脂麻根之甲醇粗抽物之急性毒性試驗。結果其致死劑量 ( $LD_{50}$ ) 為 2.54 g/kg，百分之九十五的可信度為 1.87 ~ 3.45 g/kg。

### 二、細胞毒性試驗

結果顯示崗脂麻根之甲醇粗抽物對 A-549、HT-29、KB-16 及 P-388 等四種癌細胞均有明顯抑制作用 ( $ED_{50} < 4 \mu\text{g/ml}$ )，尤以對 P-388 細胞有最低之半數有效劑量，其  $ED_{50}$  為 2.043  $\mu\text{g/ml}$ 。以 *n*-hexane、 $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ 、EtOAc、*n*-BuOH 等溶劑做分配萃取後，除水層外，其餘 Ha-H、Ha-C、Ha-E、及 Ha-B 各溶劑萃取層對四種癌細胞亦具相當程度之細胞毒性作用 (表 1)。其中乙酸乙酯萃取層對 HT-29 之  $ED_{50}$  為 0.581  $\mu\text{g/ml}$  最強。

### 三、對發炎細胞之作用

#### (一)嗜中性白血球去顆粒作用試驗

表 2 顯示，崗脂麻根之甲醇粗抽物，及各有機溶劑萃取層分別在 3 ~ 100  $\mu\text{g/ml}$  之濃度下對 fMLP 誘發嗜中性白血球的去顆粒作用所釋出  $\beta$ -glucuronidase 有顯著抑制作用 ( $p < 0.01$ )。乙酸乙酯層及正丁醇層之半數有效劑量分別為 16.7 及 56.3  $\mu\text{g/ml}$ ，略高於參考藥物 trifluoperazine。此外，乙酸乙酯層在 10  $\mu\text{g/ml}$  及 30  $\mu\text{g/ml}$  之濃度，正丁醇層在 30  $\mu\text{g/ml}$  及 100  $\mu\text{g/ml}$  之濃度時，對 lysozyme 之釋出亦具抑制作用 ( $p < 0.01$ )。

#### (二)肥滿細胞的去顆粒作用試驗

表 3 顯示，崗脂麻根之甲醇粗抽物之二氯甲烷萃取層在 10  $\mu\text{g/ml}$  之濃度，正丁醇萃取層及水層在 30  $\mu\text{g/ml}$  之濃度時，對 compound 48/80 誘發肥滿細胞的去顆粒作用所釋出 histamine 有抑制作用，但對  $\beta$ -glucuronidase 之釋出則無抑制作用。

**Table 1. The  $ED_{50}$  values ( $\mu\text{g/ml}$ ) on the cytotoxic effects of the methanol extract and fractionations of Ha against various cell lines.**

Agent	A-549	HT-29	KB-16	P-388
Ha-M	5.60	3.75	5.99	2.04
Ha-H	5.00	8.79	2.23	1.78
Ha-C	3.83	4.69	3.67	4.34
Ha-E	3.61	0.58	8.81	4.65
Ha-B	18.67	27.36	12.44	13.32
Ha-W	>50	>50	32.94	14.63

1. Data are shown as mean  $\pm$  S.D. ( N=3 )

2. If  $ED_{50} \leq 20 \mu\text{g/ml}$  (crude extract), it has antitumor effect.

**Table 2. The inhibitory activity of the methanol extract and fractionations of Ha against the release of  $\beta$ -glucuronidase and lysozyme on neutrophil degranulation induced by fMLP.**

Drug	( $\mu$ g/ml)	Percent Release			
		$\beta$ -Glucuronidase	(%inh)	Lysozyme	(%inh)
		18.0 $\pm$ 0.8	---	47.9 $\pm$ 1.2	---
Ha-M	(10)	13.0 $\pm$ 1.3**	27.9 $\pm$ 4.2	47.6 $\pm$ 3.8	0.6 $\pm$ 7.8
	(30)	10.1 $\pm$ 0.3**	43.7 $\pm$ 1.9	44.6 $\pm$ 2.3	7.0 $\pm$ 3.3
Ha-H	(10)	14.9 $\pm$ 0.9	17.5 $\pm$ 2.2	54.7 $\pm$ 0.8	-14.3 $\pm$ 4.5
	(30)	10.7 $\pm$ 1.0**	39.9 $\pm$ 8.0	58.5 $\pm$ 0.8	-22.2 $\pm$ 1.4
Ha-C	(3)	12.4 $\pm$ 0.9**	30.9 $\pm$ 3.6	37.8 $\pm$ 3.6	20.3 $\pm$ 2.6
	(10)	9.2 $\pm$ 0.7**	48.3 $\pm$ 3.0	37.6 $\pm$ 4.1	21.5 $\pm$ 2.2
Ha-E	(3)	14.1 $\pm$ 1.1*	21.1 $\pm$ 9.3	40.7 $\pm$ 4.6	14.7 $\pm$ 10.4
	(10)	10.2 $\pm$ 0.4**	43.0 $\pm$ 5.0	31.2 $\pm$ 1.9**	34.8 $\pm$ 4.5
	(30)	5.6 $\pm$ 0.1**	68.6 $\pm$ 1.2	26.5 $\pm$ 2.1**	44.9 $\pm$ 3.2
IC <sub>50</sub>		16.7 $\pm$ 2.9			
Ha-B	(10)	13.1 $\pm$ 1.0**	26.9 $\pm$ 7.2	38.2 $\pm$ 1.4	19.9 $\pm$ 5.2
	(30)	10.6 $\pm$ 0.1**	40.6 $\pm$ 3.4	33.4 $\pm$ 1.4**	30.2 $\pm$ 3.3
	(100)	5.9 $\pm$ 0.4**	67.3 $\pm$ 0.9	30.3 $\pm$ 0.1**	36.7 $\pm$ 1.8
IC <sub>50</sub>		56.3 $\pm$ 4.4			
Ha-W	(30)	12.2 $\pm$ 0.4**	31.2 $\pm$ 1.0	39.3 $\pm$ 2.6	16.6 $\pm$ 3.8
	(100)	9.0 $\pm$ 0.1**	49.6 $\pm$ 1.2	29.0 $\pm$ 1.7**	38.2 $\pm$ 3.4
TEP	(3)	14.9 $\pm$ 0.8	16.8 $\pm$ 2.2	43.8 $\pm$ 5.3	8.9 $\pm$ 1.9
	(10)	9.8 $\pm$ 1.6**	44.9 $\pm$ 8.6	34.7 $\pm$ 6.8	28.0 $\pm$ 6.1
	(30)	2.1 $\pm$ 0.7**	88.7 $\pm$ 2.7	1.5 $\pm$ 2.2**	96.9 $\pm$ 4.1
IC <sub>50</sub>		14.2 $\pm$ 0.7		16.0 $\pm$ 0.9	

1. Data are presented as mean  $\pm$  S.D. ( N=3 )

2. Inducer : 1 $\mu$  M fMLP/ 5 $\mu$  g/ml cytochalasin B.

3. \* p<0.05, \*\* p<0.01.

4. TEP : trifluoperazine (positive control).

**Table 3. The inhibitory activity of the methanol extract and fractionations of Ha against the release of  $\beta$ -glucuronidase and histamine on mast cell degranulation induced by compound 48/80.**

Drug	( $\mu$ g/ml)	Percent Release			
		$\beta$ -Glucuronidase	(%inh)	Histamine	(%inh)
Control		22.0 $\pm$ 1.1	---	54.2 $\pm$ 1.2	---
Ha-M	(30)	20.8 $\pm$ 0.8	5.4 $\pm$ 3.0	---	---
	(100)	19.5 $\pm$ 1.7	11.2 $\pm$ 7.5	---	---
Ha-H	(10)	21.8 $\pm$ 0.1	0.2 $\pm$ 5.8	48.8 $\pm$ 1.0	9.8 $\pm$ 4.0
	(30)	21.5 $\pm$ 1.7	2.6 $\pm$ 3.6	46.8 $\pm$ 1.8	13.7 $\pm$ 1.5
Ha-C	(3)	22.1 $\pm$ 0.3	-0.5 $\pm$ 3.4	44.9 $\pm$ 1.2	17.2 $\pm$ 0.6
	(10)	19.5 $\pm$ 0.6	11.1 $\pm$ 3.5	40.8 $\pm$ 1.7*	24.8 $\pm$ 1.5
Ha-E	(30)	21.7 $\pm$ 0.3	1.0 $\pm$ 3.9	---	---
	(100)	21.3 $\pm$ 0.9	3.1 $\pm$ 2.7	---	---
Ha-B	(30)	21.7 $\pm$ 0.9	1.3 $\pm$ 3.8	33.6 $\pm$ 1.3**	38.1 $\pm$ 1.3
	(100)	21.1 $\pm$ 0.6	3.7 $\pm$ 3.8	---	---
Ha-W	(30)	21.1 $\pm$ 1.1	4.1 $\pm$ 1.1	37.3 $\pm$ 1.3**	31.1 $\pm$ 2.3
	(100)	21.4 $\pm$ 0.1	2.1 $\pm$ 4.7	---	---
Mepacrine	(10 $\mu$ M)	16.8 $\pm$ 1.5*	23.7 $\pm$ 3.5	45.3 $\pm$ 2.4	16.6 $\pm$ 2.9
	(30 $\mu$ M)	12.4 $\pm$ 1.1**	42.9 $\pm$ 2.9	34.6 $\pm$ 3.6**	35.8 $\pm$ 6.0
	(100 $\mu$ M)	1.3 $\pm$ 0.7**	93.7 $\pm$ 1.9	5.9 $\pm$ 1.3**	88.8 $\pm$ 2.3
IC <sub>50</sub>		42.0 $\pm$ 3.5 $\mu$ M		50.2 $\pm$ 4.5 $\mu$ M	

1. Data are presented as mean  $\pm$  S.D. ( N=3 )

2. Inducer : compound 48/80 (10 $\mu$  g/ml).

3. \* p<0.05, \*\*p<0.01.

4. Mepacrine : positive control.

## 討 論

嗜中性白血球 ( neutrophil ) 及肥大細胞 ( mast cell ) 在發炎、過敏過程中各扮演著重要角色。它們內含有許多顆粒，且具有多種發炎媒介物，當此二種細胞受到刺激活化後，中性白血球會釋放超氧陰離子 ( superoxide anion )、氫氧自由基 ( hydroxy radical ) 及過氧化氫 ( hydrogen peroxide ) 等高度活性氧物種<sup>20</sup>，這些可能與生理疾病之細胞損傷有關；此外中性白血球亦會釋放出 PGs、platelet-activating-factor ( PAF )、leukotrienes、lysozyme、 $\beta$ -glucuronidase 等媒介物<sup>21</sup>，而肥大細胞中會釋出 histamine、serotonin、PGs、 $\beta$ -glucuronidase、 $\beta$ -hexosaminidase、

PAF、lysozomal enzyme 等媒介物<sup>22-23</sup>。其中有些是發炎物質，導致血管擴張、通透性增加、支氣管平滑肌收縮及組織損傷<sup>24-25</sup>，所以與發炎及過敏有密切關係。如果藥物能抑制嗜中性白血球及肥大細胞之活化，或阻止其發炎媒介物的釋出，就能對發炎及過敏症狀加以預防與治療。由本實驗可證明崗脂麻應用於喉痛、扁桃腺炎之功能，但其甲醇粗抽物對小鼠口服給藥之半致死劑量為 2.54 g/kg，顯示其具毒性，使用上宜多注意。

本實驗亦證實崗脂麻根之甲醇粗抽物及各有機溶媒萃取層對 A-549、HT-29、KB-16 及 P-388 等四種癌細胞均有明顯抑制作用，其中乙酸乙酯萃取層對 HT-29 之 ED<sub>50</sub> 為 0.581 μg/ml 最強，非常具有進一步純化之價值。同時在抗發炎及抗過敏活性方面，乙酸乙酯層及正丁醇層對 fMLP 誘發嗜中性白血球的去顆粒作用所釋出 β-glucuronidase 之釋出具顯著抑制作用，其 IC<sub>50</sub> 分別為 16.7 及 56.3 μg/ml。此外對 lysozyme 之釋出具顯著抑制作用，故可確認崗脂麻之抗發炎活性成分，也值得開發。至於其詳細機轉則需待成分純化後，進一步研究證實。

## 誌 謝

感謝國立中山大學杜昌益教授在細胞毒性試驗之指導與協助。

## 參考資料

1. 甘偉松，臺灣藥用植物誌，第三卷，國立中國醫藥研究所，台北，p. 527，1978。
2. 東丈夫、名越規朗、賴榮祥：山豆根之生藥學研究，中國醫藥學院研究年報，1: 137-147，1970。
3. 蔡敏鈴，臺灣市售山豆根類藥材之生藥學研究，中國醫藥學院碩士論文，中國醫藥學院，中國藥學研究所，台中，1996。
4. 臺灣植物誌，第二版，第三卷，臺灣植物誌第二版編輯委員會，台北，pp. 757-759，1993。
5. 邱年永、張光雄，原色臺灣藥用植物圖鑑(1)，南天書局，台北，p. 104，1987。
6. 徐國鈞，中國藥材學，中國科技出版社，北京，pp. 287-289，1996。
7. 中國醫學科學院藥物研究所，中藥誌(二)，人民衛生出版社，天津，pp. 245-247，1993。
8. 蕭步丹原著，莊兆祥增訂，增訂嶺南採藥錄，現代中醫藥學院，香港，pp. 32-33，1970。
9. 劉衛國、王明時，山芝麻中三個新三 化合物的結構鑑定，藥學學報，20(11): 842-851，1985。
10. Wang M, Liu W. A naphthoquinone from *Helicteres angustifolia*. *Phytochemistry*. 26(2): 578-579, 1987.
11. Chen CM, Chen ZT, Hong YL. A mansonone from *Helicteres angustifolia*. *Phytochemistry*. 29(3): 980-982, 1990.
12. Chen ZT, Lee SW, Chen CM. New flavonoid Glycosides of *Helicteres angustifolia*. *Heterocycles*. 38(6): 1399-1406, 1994.
13. Litchfield JT and Wilcoxon FA. Simplified method of evaluating dose effect experiments. *J Pharmacol Exp Ther*. 96: 99-113, 1949.

14. Mosmann T. Rapid colorimetric assay for cellular growth and survival: application to proliferation and cytotoxicity assays. *J Immunol Methods*. 65: 55-63, 1983.
15. Wang JP, Raung SL, Kuo YH and Teng CM. Daphnoretin-induced respiratory burst in rat neutrophils is, probably mainly through protein kinase C activation. *Eur J Pharmacol*. 288: 341-348, 1995.
16. Barrett AJ. Lysosomes. In: Dingle JT (Ed.): *A Laboratory Handbook*, Amsterdam, Elsevier, pp. 118-120, 1972.
17. Absolom DR. Basic methods for the study of phagocytosis. *Methods Enzymol*. 132: 92-179, 1986.
18. Wang JP, Hsu MF, Ouyang C and Teng CM. Edematous response caused by [Thi<sup>5,8</sup>, D-Phe<sup>7</sup>] bradykinin, a  $\beta_2$  receptor antagonist, is due to mast cell degranulation. *Eur J Pharmacol*. 161: 143-149, 1989.
19. Hgkanson R. and Ronnberg AL. Improved fluorometric assay of histamine. *Analyt Biochem*. 60: 560-567, 1974.
20. Semb AG, Vaage J and Mjos OD. Oxygen free radical producing leukocytes cause functional depression of isolated rat hearts: role of leukotrienes. *J Mol Cell Cardiol*. 22: 555-563, 1990.
21. Weissmann G, Smolen JE and Korchak HM. Release of inflammatory mediators from stimulated neutrophils. *N Engl J Med*. 303: 27-34, 1980.
22. Ishizaka, T., Ishizaka, K. and Tomioka, H., 1972. Release of histamine and slow reacting substance of anaphylaxis (SRS-A) by IgE-anti-IgE reactions on monkey mast cells. *J Immunol*. 108, 53-520, 1972.
23. Austen, K.F. Biologic implications of the structural and functional characteristics of the chemical mediators of immediate type hypersensitivity. *Harvey Lect*. 73, 93-161, 1979.
24. Adams, G.K. and Lichtenstein, L.M. In vitro studies of antigen-induced bronchospasm: effect of antihistamine and SRS-A antagonist on response to sensititized guinea pig and human airways to antigen. *J Immunol*. 122, 555-562, 1979.
25. Schwartz, L.B. and Austen, K.F. Structural and function of the chemical mediators of mast cells. *Prog Allergy*. 34, 271-321, 1984.



J Chin Med 11(3): 143-151, 2000

## EVALUATION OF THE PHARMACOLOGICAL EFFECTS ON *HELICTERES ANGUSTIFOLIA* L. IN TAIWAN

Kuo-Liang Lu<sup>1,4</sup>, Jih-Pyang Wang<sup>2</sup>, Li-Kang Ho<sup>3</sup> and Yuan-Shiun Chang<sup>1</sup>

<sup>1</sup>*Institute of Chinese Pharmaceutical Sciences, China Medical College,*

<sup>2</sup>*Department of Education and Research, Taichung Veterans General Hospital,  
Taichung, Taiwan*

<sup>3</sup>*Department and Institute of Pharmacology, National Yang-Ming University,  
Taipei, Taiwan*

<sup>4</sup>*Chung Hwa Institute of Technology,  
Tainan, Taiwan*

( Received 30<sup>th</sup> March 2000, revised Ms received 19<sup>th</sup> May 2000, accepted 19<sup>th</sup> May 2000 )

*Helicteres angustifolia* L., family of Sterculiaceae, is a folk medicine commonly adulterated or substituted as Shan-Don-Gen (*Sophora Subprosprata Radix*) in Taiwan market. Due to analgesic, antipyretic, cytotoxic and anti-inflammatory effects, it has been used to treat swelling, sorethroat and acute pharyngitis. The present study showed that the LD<sub>50</sub> of the methanol extract of the root of this plant on mice was 2.54 g/kg (p.o.). The crude methanol extract and its fractions partitioned by *n*-hexane, chloroform, ethyl acetate, *n*-butanol and water exhibited marked cytotoxic effect against A-549, HT-29, KB-16, and P-388 cell lines, respectively. Among them, the ED<sub>50</sub> of the EtOAc layer was 0.581 µg/ml against HT-29 cell line.

The crude methanol extract and fractions also showed significant inhibitory effects against β-glucuronidase release on neutrophil degranulation induced by fMLP. Fractions of ethyl acetate and *n*-butanol layer showed the best anti-inflammatory effect with IC<sub>50</sub> of 16.7 and 56.3 µg/ml, respectively. They also showed similar inhibitory effects against lysozyme release in this experiment.

In the mast cell degranulation induced by compound 48/80 experiments, chloroform layer at 10 µg/ml, EtOAc and water layer at 30 µg/ml, exhibited remarkable antiallergic effect against histamine release, but they did not show the effects on the release of β-glucuronidase.

**Key words:** Cytotoxic effect, Anti-inflammatory effect, *Helicteres angustifolia* L.

---

**Correspondence to:** Dr. Yuan-Shiun Chang, Institute of Chinese Pharmaceutical Sciences, China Medical College, 91, Hsueh Shih Road, Taichung 404, Taiwan. Tel : 886-4-205-7153, Fax : 886-4-206-0248.e-mail: [yschang@mail.cmc.edu.tw](mailto:yschang@mail.cmc.edu.tw)