

21世纪高职高专教材

供中药学和药学类专业用

# 中药药理学

南京中医药大学 方泰惠  
广州中医药大学 吴清和 主编

科学出版社

北京

## 内 容 简 介

本书是“21世纪高职高专教材”之一。全书共分19章,第1章重点讲述中药药性理论的现代研究及其历史发展、影响中药药理作用的因素等基本理论和知识,介绍中药药理作用的特点、中药复方药理、中药药理研究思路。第2~19章按中药学传统分类法分类,每章包括概述和常用药两部分,重点介绍与各类中药功效相关的药理作用、常用单味药的主要化学成分、药理作用、现代应用及不良反应等内容。

本书突出高等职业技术特点,坚持体现“三基”(基本理论、基本知识、基本技能)教学,注重教学内容的科学性和实用性。可供高职高专职业技术教育、成人教育中药学和药学类专业学生使用,也可作为临床医师和药师的自学参考书。

### 图书在版编目(CIP)数据

中药药理学/方泰惠,吴清和主编. —北京:科学出版社,2005.8  
21世纪高职高专教材·供中药学和药学类专业用  
ISBN 7-03-016010-X

I. 中… II. ①方…②吴… III. 中药学;药理学-高等学校;技术学校-教材 IV. R285

中国版本图书馆CIP数据核字(2005)第084196号

责任编辑:方 霞 / 责任校对:钟 洋  
责任印制:刘士平 / 封面设计:卢秋红 宋广通

版权所有,违者必究。未经本社许可,数字图书馆不得使用

**科学出版社**出版

北京东黄城根北街16号

邮政编码:100717

<http://www.sciencep.com>

印刷

科学出版社发行 各地新华书店经销

\*

2005年8月第 一 版 开本:850×1168 1/16

2005年8月第一次印刷 印张:13

印数:1—4 000 字数:300 000

定价:24.00元

(如有印装质量问题,我社负责调换〈环伟〉)

# 《中药药理学》编委会

- 主 编 方泰惠 吴清和  
副主编 孙建宁 彭代银 孟宪丽  
编 委 (按姓氏笔画排序)
- 于 梅 (江西中医学院)  
马 骏 (甘肃中医学院)  
王树荣 (山东中医药大学)  
方泰惠 (南京中医药大学)  
田先翔 (湖北中医学院)  
孙建宁 (北京中医药大学)  
许 立 (南京中医药大学)  
李丽静 (长春中医学院)  
吴清和 (广州中医药大学)  
吴符火 (福建中医学院)  
张仲一 (天津中医学院)  
苗明三 (河南中医学院)  
林 青 (云南中医学院)  
林国彪 (广西中医学院)  
孟宪丽 (成都中医药大学)  
荣向路 (广州中医药大学)  
侯建平 (陕西中医学院)  
彭代银 (安徽中医学院)  
程嘉艺 (辽宁中医学院)  
曾 嵘 (湖南中医学院)  
谢金鲜 (广西中医学院)

# 前 言

中药药理学是以中医药基本理论为指导,运用现代科学方法,研究中药和机体相互作用及作用规律的一门学科。它是中药专业的一门专业课,也是中医专业的一门专业基础课。本书是 21 世纪高职高专(中药学和药学类专业用)系列教材之一,是依据高职高专学生的知识结构和学习特点,由全国中医药高等院校联合编写的。

近年来,随着我国中医药事业发展的日新月异,社会对卫生职业教育和专业人才的需求也提出了新的、更高的要求。为适应 21 世纪中医药高等职业教育的需求,本教材的编写坚持“贴近学生、贴近社会、贴近岗位”的基本原则,在保证教材的科学性、思想性的同时,体现实用性、可读性和创新性,以利于学生系统掌握基本理论、基本知识和基本技能,为学生知识、能力、素质协调发展创造条件。为此,经过严格遴选,我们组织了一支以专家为主导,以在教学第一线、具有丰富教学实践经验的中青年教师为骨干的编写队伍,并实行主编负责制,以确保教材质量。

本教材共分十九章。第 1 章重点讲述中药药性理论的现代研究、影响中药药理作用的因素等基本理论和知识,以及中药药理作用的特点。第 2 ~ 19 章按中药学传统分类法分类,每章包括概述和常用药两部分,重点介绍与各类中药功效相关的药理作用,常用单味药的主要化学成分、药理作用、现代应用及不良反应等。通过课堂讲授,学生能够熟悉中药基本理论和知识的现代科学内涵;掌握与常用中药功效主治相关的药理作用和现代应用;熟悉中药药理作用的机理和物质基础;了解中药药理学研究的成就和现状。

本书可供高职高专中药学、中药制药学、药学、药物制剂学、临床中药学、中药药理学、中药资源与鉴定学等药学类专业学生作为教材使用,也可作为成人教育学生、在岗人员、执业资格考试人员及其他中医药人员的培训教材或学习参考书。

本教材希望在继承的基础上有所创新,但因经验不足,编写水平所限和时间仓促,难免存在许多问题,甚至错误之处,敬请广大教师和学生在使用过程中给予批评指正。

《中药药理学》编委会  
2005 年 6 月 21 日

# 目 录

## 前言

第1章 总论	(1)	山豆根	(42)
第1节 中药药理学的研究内容和学科任务	(1)	第4章 泻下药	(46)
一、中药药理学的基本概念及其研究内容	(1)	第1节 概述	(46)
二、中药药理学学科任务	(2)	第2节 常用药物	(48)
第2节 中药药理学发展简史	(2)	大黄	(48)
第3节 中药药性理论的现代研究	(3)	芒硝	(51)
一、中药的四性(四气)	(3)	番泻叶	(52)
二、中药的五味	(5)	第5章 祛风湿药	(55)
三、中药的升降浮沉	(6)	第1节 概述	(55)
四、中药的归经	(6)	第2节 常用药物	(57)
五、中药的有毒和无毒	(7)	雷公藤	(57)
六、中药的配伍与禁忌	(9)	防己	(60)
第4节 影响中药药理作用的因素	(11)	秦艽	(61)
一、药物因素	(11)	第6章 芳香化湿药	(64)
二、机体因素	(14)	第1节 概述	(64)
三、环境因素	(15)	第2节 常用药物	(65)
第2章 解表药	(17)	厚朴	(65)
第1节 概述	(17)	广藿香	(67)
第2节 常用药物	(19)	苍术	(68)
麻黄	(19)	第7章 利水渗湿药	(71)
桂枝	(21)	第1节 概述	(71)
柴胡	(22)	第2节 常用药物	(72)
葛根	(23)	茯苓	(72)
第3章 清热药	(26)	泽泻	(73)
第1节 概述	(26)	茵陈蒿	(74)
第2节 常用药物	(28)	第8章 温里药	(77)
黄芩	(28)	第1节 概述	(77)
黄连	(31)	第2节 常用药物	(79)
苦参	(34)	附子	(79)
金银花	(36)	干姜	(81)
大青叶	(38)	肉桂	(82)
板蓝根	(39)	第9章 理气药	(85)
穿心莲	(40)	第1节 概述	(85)
		第2节 常用药物	(87)
		枳实(枳壳)	(87)
		陈皮	(88)

木香 .....	(90)	第2节 常用药物 .....	(143)
香附 .....	(91)	天麻 .....	(143)
<b>第10章 消食药</b> .....	(94)	钩藤 .....	(145)
第1节 概述 .....	(94)	地龙 .....	(147)
第2节 常用药物 .....	(95)	罗布麻 .....	(149)
山楂 .....	(95)	<b>第16章 开窍药</b> .....	(152)
神曲 .....	(98)	第1节 概述 .....	(152)
鸡内金 .....	(99)	第2节 常用药物 .....	(153)
<b>第11章 止血药</b> .....	(101)	麝香 .....	(153)
第1节 概述 .....	(101)	石菖蒲 .....	(155)
第2节 常用药物 .....	(103)	冰片 .....	(157)
三七 .....	(103)	蟾酥 .....	(159)
蒲黄 .....	(106)	<b>第17章 补虚药</b> .....	(163)
<b>第12章 活血化瘀药</b> .....	(108)	第1节 概述 .....	(163)
第1节 概述 .....	(108)	第2节 常用药物 .....	(166)
第2节 常用药物 .....	(110)	人参 .....	(166)
川芎 .....	(110)	党参 .....	(168)
丹参 .....	(112)	黄芪 .....	(169)
益母草 .....	(115)	白术 .....	(170)
延胡索 .....	(116)	甘草 .....	(171)
马钱子 .....	(117)	当归 .....	(172)
斑蝥 .....	(118)	熟地黄 .....	(173)
红花 .....	(119)	何首乌 .....	(174)
莪术 .....	(120)	白芍 .....	(175)
水蛭 .....	(122)	北沙参 .....	(175)
银杏叶 .....	(123)	枸杞子 .....	(176)
<b>第13章 化痰止咳平喘药</b> .....	(127)	麦冬 .....	(177)
第1节 概述 .....	(127)	鹿茸 .....	(177)
第2节 常用药物 .....	(128)	淫羊藿 .....	(178)
半夏 .....	(128)	冬虫夏草 .....	(179)
桔梗 .....	(131)	<b>第18章 收涩药</b> .....	(182)
苦杏仁 .....	(132)	第1节 概述 .....	(182)
天南星 .....	(134)	第2节 常用药物 .....	(184)
<b>第14章 安神药</b> .....	(137)	五味子 .....	(184)
第1节 概述 .....	(137)	罂粟壳 .....	(186)
第2节 常用药物 .....	(138)	<b>第19章 外用药和驱虫药</b> .....	(189)
酸枣仁 .....	(138)	第1节 外用药 .....	(189)
朱砂 .....	(140)	第2节 驱虫药 .....	(191)
<b>第15章 平肝熄风药</b> .....	(142)	《中药药理学》教学基本要求 .....	(193)
第1节 概述 .....	(142)	参考文献 .....	(198)

# 第 1 章

## 总 论



### 学 习 要 求

1. 掌握中药药理学的基本概念和研究内容。
2. 掌握现代研究对中药四性、五味、归经、七情的认识。
3. 熟悉中药药理学的学科任务和学科性质。
4. 熟悉现代研究对中药配伍规律、不良反应和妊娠禁忌的认识。
5. 熟悉中药药理作用的主要因素及药物因素。
6. 了解中药药理学的发展史。
7. 了解中药的升降沉浮和十八反、十九畏的现代研究。
8. 了解机体因素和环境因素对中药药理作用的影响。

## 第 1 节 中药药理学研究内容和学科任务

### 一、中药药理学的基本概念及其研究内容

中药药理学(pharmacology of traditional chinese medicine)是以中医药基本理论为指导,运用现代科学方法,研究中药和机体(包括病原体)相互作用及其作用规律的一门学科。

中药药理学研究内容包括两个部分。中药效应动力学(pharmacodynamics of TCM),简称中药药效学,研究中药对机体的作用规律,包括中药的药理作用、作用机理、作用的物质基础和不良反应。中药代谢动力学(pharmacokinetics of TCM),简称中药药动学,研究机体对中药的处理,即中药或其化学成分在体内的吸收、分布、代谢和排泄过程及其变化规律。

中药药理学属于实验性学科,其基本知识内容主要来源于科学实验,通过实验观察,科学地处理数据,分析药物与机体相互的作用及规律。

## 二、中药药理学学科任务

中药药理学是中药学的重要组成部分,是从现代科学角度认识和阐述中医药理论,中药作用原理的重要学科,是沟通传统中医药与现代医药,指导中药在临床合理安全应用的一门基础学科,其主要任务有以下几点。

第一,阐明和发展中医药理论。中医药理论是在数千年的临床实践中总结和发展起来的,有着其独特的理论体系。研究和揭示中医药理论的内涵、中药防治疾病的科学原理及其物质基础,是丰富和发展中医药理论,促进中药现代化的主要手段。对中药及其方剂的药理学研究,是阐明中医药理论科学本质的一条重要途径。

目前已用药理手段和方法,开展了对温热药、寒凉药等中药的实验和临床研究,探讨了中药四气五味、归经等药性理论实质;应用相关方药分别研究了血瘀证、表证等证及活血祛瘀、扶正培本、清热解毒、通里攻下等治则的科学内涵,已初步建立了相关中医药理论的现代科学概念。

第二,指导临床合理安全用药。通过中药药理研究,认识中药的药效作用、作用机理、物质基础、不良反应以及中药复方的配伍机制等,使医务人员能更准确、合理安全地处方遣药,提高临床疗效。

第三,中药新药的研究和开发。药理学研究是筛选和评价中药新药有效性、安全性的主要技术手段,在新药的申报中为临床前研究提供药效学和毒理学资料。

第四,促进中西医结合的发展。中医和西医有着为人类健康事业服务的共同目标,中药药理学是中西医结合的产物,与中西医结合学科的发展共进。同时,中药药理的发展,也将促进中医药的现代化和国际化。

作为一门基础学科,中药药理学与多种学科联系密切,学习中药药理学必须有中医学、中药学、西医基础学科以及临床学科相关知识基础,才能在学习中融会贯通、推陈出新。

## 第 2 节 中药药理学发展简史

中药的起源和中药学的发展经历了几千年的发展历史,已经建立了完整的理论体系,具有丰富的知识内涵。自成书于东西汉年间的《神农本草经》面世以后,历代有许多相关专著传承下来。但是,用现代科学的理论和方法去研究中药的作用、作用机理和物质基础等,则始于 20 世纪 20 年代。

1923 年,我国学者陈克恢等率先对麻黄进行了化学成分和药理作用的研究,发现麻黄的主要化学成分麻黄碱具有拟肾上腺素作用。研究成果发表后,在国内外医药界引起了巨大的震动和反响,从而揭开了中药药理发展的历史画页,形成了中药药理研究的第一轮高潮。至 1949 年,相继对当归、草乌、延胡索、防己、浙贝母、川贝母、黄花夹竹桃、三七、川芎等中药进行了研究。这一开创性时期的研究主要沿袭植物药的研究模式,即从天然药材中提取其化学成分,通过筛选研究确定其药效和有效成分。因此,研究结果与中医药理论相脱离,与中药的临床应用和生产实际结合不紧。

第二个时期大约在 20 世纪 50~80 年代,中华人民共和国成立以后,在国家和行业部门的指导和支持下,建立了从中央到地方各省市的中医中药研究机构和各级中医医院,使中药药理研究进入了一个新的阶段。对众多中药品种进行了广泛而比较系统的研究,取得了显著的成就。主要体

现在如下几个方面:

(1) 初步揭示了常用中药药理作用,包括与功效主治相关的药理作用。如解表药的发汗抗炎作用、清热解毒药的抗病原微生物作用等;以及传统未有记载的药理作用,如枳实、青皮等含有对羟福林(幸福林)成分,静脉注射具有心血管活性等。

(2) 发现和确定了许多中药的有效成分。如小檗碱、苦参碱、川芎嗪、丹参酮、青蒿素、葛根黄酮、麝香酮等。

(3) 对防治呼吸系统、心血管系统、神经系统疾病以及感染和肿瘤等常见病多发病的中药进行了探索,发现和开发了抗肿瘤药莜术、苡仁、长春新碱,抗心绞痛、冠心病药丹参、川芎注射液,抗疟疾药青蒿素等临床有效的中药新药。

(4) 对中药的四气五味、炮制机理等药性理论及在中医辨证的理论进行了探索。如通过补肾方剂补肾丸的药理研究,一方面揭示了肾气丸对垂体-肾上腺轴、甲状腺轴、性腺轴的兴奋作用,对机体免疫功能、心血管功能和代谢紊乱的调整作用;另一方面,证明了肾阳虚与机体内分泌功能、免疫功能低下密切相关。

(5) 开始注意中药复方的研究,对四君子汤、生脉散等经典方剂进行了相关研究。

这段时期的研究注重与中医药理论及中药临床应用的联系,所取得的成就极大地推动了中医药事业的发展。

进入20世纪90年代后,中药药理的发展更为迅速。在研究内容上,不仅注意单味中药及有效成分的研究,更重视中药复方药理作用、中药药动学、中药不良反应等方面的研究,逐步建立了相关研究思路和方法体系。在复方研究中,进一步明确中药复方药理作用多层次、多靶点的概念,强调中药复方作用的多效性,药理学和药物化学密切结合,通过整体复方的分离提取寻找有效部位或单体。在中药药动学方面已积累了有关中药成分结构生物转化的生物学基础知识,初步建立了一些中药成分和中药复方药物代谢的研究模型和分析方法,为研究中药成分的体内过程与药效和毒理作用的相关性提供了理论基础和方法学。此外,在中药药理研究中现代生物技术不断被应用,许多研究已深入到细胞水平,分子水平,基因、蛋白质水平。

经过70余年的发展,中药药理学已积累了完整的基本理论和知识,作为一门年轻的学科,还需要在今后很长的一段时间里,不断探索和完善。

## 第3节 中药药性理论的现代研究

中药药性理论是中医药理论中,关于中药的作用性质、功能和运用规律的理论,是中药理论的核心,也是临床在辨证立法的基础上遣药处方的重要依据。中药药性理论主要包括四性(四气)、五味、归经、升降浮沉,以及有毒和无毒。

### 一、中药的四性(四气)

中药的四性(四气)是指中药的寒、热、温、凉四种不同的功能,它反映药物作用于机体后产生的反应趋向。在临床治疗时,通常根据机体寒热的辨证选择相应属性的药物。一般而言,寒性或凉性的药物,具有清热、凉血、泻火、清虚热、滋阴等功效,能减轻或消除热证;热性或温性的药物,具有祛寒、温里、助阳等功效,能减轻或消除寒证。

关于中药四性的现代研究,主要从对中枢神经系统、自主神经系统、内分泌系统、基础代谢功

能等的影响进行研究。

### (一) 对中枢神经系统功能的影响

寒凉药大多具有抗惊厥、解热、镇痛等中枢抑制作用,而温热药具有中枢兴奋作用。

热证病人常见有中枢神经系统的兴奋,表现为情绪激动、语言声粗,小儿高热时甚至可致惊厥。相反,寒证病人常有精神倦怠、安静、声高不亢,表现为中枢受抑状态,热证病人经寒凉药物或寒证病人经温热药物治疗后,可明显改善包括中枢神经系统症状在内的多种临床症状。

在动物实验研究中,应用寒凉药(黄连、黄柏、生石膏等)或温热药(附子、干姜、肉桂等),造成寒证或热证模型的动物,可见到类似于寒证或热证病人的中枢神经系统功能的异常变化,和脑内神经递质含量的相应变化。

在寒证模型动物上,可观察到痛阈值和惊厥阈值升高,脑内神经递质去甲肾上腺素(NA)和多巴胺(DA)含量降低,而5-羟色胺(5-HT)含量升高。应用温热中药后,则可使动物脑内参与合成儿茶酚胺的多巴胺 $\beta$ -羟化酶活性增加,NA、DA含量升高。

在热证模型动物上,则有痛阈值和惊厥阈值降低,脑内NA和DA含量升高,而5-HT含量的降低。应用寒性药后,NA合成减少,而5-HT含量增加。表明温热或寒凉药物可通过影响神经递质,调节中枢神经的兴奋性。

### (二) 对自主神经系统功能的影响

寒证、阳虚或热证、阴虚病人常有自主神经功能紊乱的症状,以及自主神经系统相应神经递质、受体和信号传导物质的异常。寒证或阳虚病人自主神经功能偏低,表现为副交感-M受体-cGMP系统亢进,唾液分泌量多、心率减慢、体温偏低、血压偏低、呼吸频率减慢,尿中cGMP的排出量明显高于正常人。而热证或阴虚病人自主神经功能偏高,表现则相反,病人的交感神经 $\beta$ 受体-cAMP系统的功能偏高,尿中或血中cAMP占优势,cAMP/cGMP比值增高。

研究显示热性药可提高自主神经功能活动,增强交感神经 $\beta$ 受体-cAMP系统,而寒性药可降低自主神经功能,增强副交感神经-M受体-cGMP系统,两类药物可通过影响自主神经的递质、受体以及环核苷酸水平,调整自主神经功能,纠正机体寒热的不平衡,达到治疗目的。对寒证、热证病人分别应用温热药和寒凉药为主的方剂治疗后,随着症状的好转,其自主神经功能和cAMP/cGMP比值也逐渐转向正常化。

在相应证型的模型动物上,也观察到不同药性药物对自主神经功能紊乱的调整作用。如寒证的动物,可见体温降低、心率减慢等自主神经功能的下降,同时,有交感神经递质合成代谢的下降,尿中代谢产物排出量减少、血浆中和肾上腺内多巴胺 $\beta$ -羟化酶活性降低,用温热性药物或方药治疗后能纠正上述自主神经功能的低下。在阴虚证模型大鼠脑、肾 $\beta$ 受体的最大结合点位数值均显著升高,M受体的变化与 $\beta$ 受体变化相反。滋阴药知母等均可使阴虚证模型动物升高的 $\beta$ 受体的最大结合点位数值降低,而使降低的M受体最大结合点位数值升高,呈现调节作用。

### (三) 对内分泌系统功能的影响

中药四性可明显影响机体的内分泌系统功能。对甲状腺、肾上腺皮质、性腺等内分泌系统功能的异常,温热药有增强作用,而寒凉药表现为抑制。

研究显示,寒凉药可使模型动物血清 $T_3$ 、 $T_4$ 、促甲状腺素(TSH)、促黄体生成素(LH)含量降低,尿中17-羟皮质类固醇(17-OHCS)下降,动物动情周期延长,对亢进的垂体轴系统呈抑制作用。

温热药可使模型动物血清 TSH、17-OHCS 和性激素含量增加,尿中 17-OHCS 排出增多,对低下的垂体轴系统呈兴奋作用。药物作用有表现为对外周器官的作用,有的表现为对中枢的作用。

在用地塞米松造成的大鼠下丘脑-垂体-肾上腺皮质轴抑制模型中,大鼠血浆皮质酮及子宫细胞浆中雌激素受体的含量均降低,用温热药(附子、肉桂、肉苁蓉等)治疗后,血浆皮质酮和血浆雌二醇含量明显增高,子宫细胞浆中雌激素受体的含量,接近正常水平,雌二醇与雌激素受体的亲和力提高,说明温热药附子、肉桂对下丘脑-垂体-肾上腺皮质轴受抑大鼠的肾上腺皮质激素、性激素(雌激素)水平、子宫雌激素受体及雌二醇与受体的亲和力等异常改变具有保护和治疗作用。

#### (四) 对基础代谢的影响

临床研究表明,寒证或阳虚证病人基础代谢偏低,热证或阴虚证病人基础代谢偏高。寒凉药或温热药可通过影响垂体-甲状腺轴功能和细胞膜钠泵( $\text{Na}^+$ ,  $\text{K}^+$ -ATP 酶)活性,而纠正热证(阴虚证)或寒证(阳虚证)异常的能量代谢。

寒凉药或温热药物或方剂可通过作用于垂体-甲状腺轴,调整阴虚证或阳虚证病人及动物血清  $\text{T}_3$  和  $\text{T}_4$  含量,纠正体温变化。

细胞膜钠泵活性与热证(阴虚证)或寒证(阳虚证)异常的能量代谢有密切关系。温热药可通过兴奋红细胞膜钠泵活性,提高细胞储能和供能物质 ATP 含量,纠正寒证(阳虚证)病人的能量不足。相反,寒凉药都具有抑制红细胞膜钠泵活性的作用,可抑制热证(阴虚证)病人的产热。知母的主要有效成分知母菝葜苷元,地黄的主要有效成分地黄梓醇,都具有抑制细胞膜钠泵的作用。

肾阳虚证病人的红细胞膜钠泵活性显著低于正常人,其 ATP 分解产热减少,表现出一系列虚寒症状。用温阳方药(附片、淫羊藿、菟丝子、补骨脂、肉苁蓉等)治疗后,能使红细胞膜钠泵活性明显增高,接近正常人水平。对阳虚证模型动物,温热药淫羊藿亦有促进其钠泵恢复活性的作用。

此外,不同药性的药物,在其他一些方面也有一定的规律,如多数温性药都含有挥发油,寒性药大多含有苷类或生物碱。温热药对免疫功能均有不同程度的增强或调整作用,寒凉药均具有一定的抗感染作用,一些寒凉药有抗肿瘤作用。

## 二、中药的五味

中药五味是指中药所具有辛、甘、酸、苦、咸五种不同的性味。其含义有二:一是具体的药物味道,是味觉器官的直接反应;二是抽象的药物功能味,是中药功能和药效的归类。总的来看,中药的五味是味道和功效的概括和总结。现有研究对中药的五味与其所含的化学成分、药理作用之间的规律性进行了探讨。

### (一) 辛味药

辛味药主要分布于芳香化湿药、开窍药、解表药、祛风湿药和理气药中。辛味药主所含的挥发油,通常与这些药物的主要药理作用相关。常用的 8 种芳香化湿药均为辛味药,其共同的特点都是都含有芳香性挥发油,都有健胃的作用。常用的开窍药中除蟾蜍外也主要含挥发油,具有辛香走窜之性,能使神志昏迷的病人苏醒,能扩张冠脉,有抗心肌缺血、抗心绞痛的作用,与中医“温通开窍”可治心痛的理论相符。

### (二) 酸味药

酸味药又可分为:单酸味、单涩味和酸涩味药。单酸味药主要含有有机酸类成分,单涩味药主要

含鞣质,酸涩药也含有大量的鞣质。如五倍子、诃子、石榴皮鞣质含量都比较高。酸涩药有收敛、固涩、止汗等功效。酸涩药中鞣质与烧伤表面、局部出血组织、胃溃疡面等部位接触后,能与组织蛋白质结合生成不溶于水的化合物(鞣酸蛋白),沉淀或凝固于组织表面形成致密的保护层,有助于局部创面止血、修复愈合,以及免受刺激。显示有止泻、止血、治疗烧伤、促进胃溃疡愈合等多种作用。

### (三) 甘味药

甘味药主要含有糖类、蛋白质、氨基酸、苷类等营养成分。绝大多数的消食药、补益药和养心安神药均为甘味药,甘味药在利尿药、止血药和收涩药中也占有较大的比例。甘味药有补养、缓和、生津养阴之功效。甘味药所含成分能补充营养、强壮人体,增强和调节机体免疫功能,提高抗病能力。

### (四) 苦味药

苦味药中主要含生物碱和苷类。常用的清热燥湿药和攻下药多是苦味药。清热药中的苦寒药黄连、黄芩、黄柏、北豆根、苦参等均含生物碱,皆具有抗菌抗炎解热等作用;栀子、知母等主要含苷类成分,具有抗菌解热利胆等作用。泻下药大黄和番泻叶均含有番泻苷,具有泻下、抗菌和止血作用。值得注意的是,50种有毒中药中有苦味药23种,占有毒中药总数的46%,在中药的五味中占有较高的比例。

### (五) 咸味药

咸味药主要含有碘、钠、钾、钙、镁等无机盐成分,主要分布在化痰药和温肾壮阳药中,多为矿物类和动物类药材。咸味药有软坚、润下、潜阳滋阴的功效,化痰药中的咸味药海藻、昆布等均具有化痰、软坚的功效,如昆布、海藻内服可治疗瘰疬(单纯性甲状腺肿)。温肾壮阳药中有咸味药19种,多为动物药,如鹿茸、紫河车等,具有补肾温阳的功效。

## 三、中药的升降浮沉

中药的升降沉浮是其药效作用的趋向。临床应用中药升降浮沉的性能,纠正失调的脏腑气机,治疗疾病。药物的升降沉浮与药物性味密切相关,升浮的药物,大多具有辛甘味和温热性,沉降的药物大多具有酸、苦、咸味和寒凉性。药物的炮制、配伍、煎煮等都会对药物升降沉浮趋向产生影响。

关于中药升降浮沉理论的现代研究不多,主要是结合药物的药理作用进行分析和观察。如补中益气汤治疗子宫脱垂有效,方中升麻、柴胡协同作用,升阳举陷,表现为兴奋子宫平滑肌。和胃降逆类药物有调整胃肠平滑肌及腺体分泌作用,其中部分不能通过中枢抑制而止吐。宣降肺气类药物有抗病原微生物、抑制变态反应、抗炎、镇咳平喘等作用。下行药物牛膝临床能引月经、结石、小便下行,使大便通利易下,而主要治疗身体下部的疾病;对肺气机上逆所造成的咳喘,可通过沉降气机来平喘。

## 四、中药的归经

归经理论是指中药作用的定位,即药物对机体脏腑经络有选择性作用,而主要对相应脏腑经

络的病变有作用,是药物的作用范围或药物效应的定向、定位。

中医认为每种病证都是脏腑或经络发病的表现,因而某药能治疗某些脏腑经络的病证,就归入某经。如壮阳药全部入肾经。黄连泻心火、除心烦,归心经。黄芩偏于泻肺火、清肺热,归肺经。大黄能泻下,治疗实热、便秘,归大肠经。有的中药归入两经或数经,说明这种中药的治疗作用范围较大。

关于归经实质的现代研究,目前主要有以下几种认识。

1. 归经反应药物药理作用的选择性 中药药理作用与归经之间存在一定的规律性。如抗惊厥中药均入肝经,与中医“诸风掉眩,皆属于肝”相吻合。有泻下作用中药均入大肠经,与大肠为传导之腑相符。有止咳、祛痰、平喘作用的中药基本入肺经。

对大黄的研究显示,大黄或其主要有效成分对机体吸收、同化功能、营养或能量的储存的抑制作用,可作为入胃经的指征;对机体异化作用、能量代谢及组织细胞新生的抑制作用,可作为大黄入脾经的指征;对排便过程的影响,可作为入大肠经的指征;对血流动力学的影响,可作为入肝经的指征;对精神病和昏迷的疗效,可认为是入心包经。

2. 归经反应药物体内过程的选择性 中药的作用是由其有效成分所决定的,对一些中药体内过程的研究,发现其有效成分的体内吸收、分布、排泄各个环节,均与药物的归经密切相关,有效成分在脏器中的分布,与归经所属的脏腑基本相符。

3. 微量元素是归经的物质基础 有研究在分析中药微量元素药理作用的基础上,提出了微量元素的“归经”假说,认为中药有效成分直达病变所在器官,是通过微量元素向病变器官的迁移、富集和亲和运动来实现的。因此,微量元素既是中药的有效成分,又是中药归经的重要物质基础之一。如补肾中药均含较多的锌、锰,而锌、锰与生殖、发育有密切关系,推断补肾药可通过锌、锰归经而达到补肾作用。

4. 归经反应中药对不同器官中环核苷酸的影响 环核苷酸(cAMP、cGMP)是组织脏器中普遍存在,是调节细胞功能的重要物质。许多中药可以通过调节体内环核苷酸含量而起作用,中药对不同组织脏器中环核苷酸水平的影响不同,中药归经所属脏器中环核苷酸含量变化明显。

5. 归经反应中药对受体的选择性 一些中药的有效成分与相应受体有较大的亲和力,这种亲和力的存在是中药归经理论的基础。中药归经就是药物选择性作用于不同受体的结果,如细辛中消旋去甲乌药碱具有兴奋心肌 $\beta_1$ 受体的作用,归心经。

目前,中药归经的研究均有其局限性。要用现代科学知识来阐明中药归经的实质,还需做大量的工作。

## 五、中药的有毒和无毒

中药的有毒、无毒也是药性的组成部分。中药的“毒”的两重含义:一是与药通义,与治通义,是表示药物作用的强弱,其概念是广义的,包括药物的药效作用和毒性作用;二是指对机体的毒性,其概念是狭义的,指中药在应用过程中所产生的不良反应,甚至是对机体的损伤。在本草文献中,均有药物有毒、无毒的记载,以及对药物毒力强弱的分级,如大毒、有毒、小毒等。中药的有毒无毒理论,是长期临床用药实践经验的总结,是中医药理论中,对药物安全性的论述,同中药的四气、五味理论一样,也是指导临床用药的基本原则。

安全性是药物基本要素之一,现代研究,已对中药或其方剂包括毒性反应在内的不良反应,引起不良反应剂量、成分,以及一些中药或其成分的毒性作用机理等方面取得了许多认识。

中药的不良反应按其发生的原因、性质概述如下。

1. 副作用(side reaction) 是指中药在治疗剂量下出现的与用药目的无关的作用,可给病人带来不适或痛苦,但一般危害不大,多为可逆性的变化。中药通常有多种主治功效,当临床用其一种功效时,其他功效产生的作用就可能成为副作用。如大黄兼有泻热通便、活血祛瘀、清热解毒的作用,用其活血祛瘀治疗妇女经闭痛经时,其泻热通便所引起的腹泻便溏就成为副作用;相反,用其泻热通便治疗热结便秘时,活血祛瘀所致妇女月经过多就成为副作用。

2. 毒性反应(toxic reaction) 是指中药由于用药剂量过大,或用药时间过长而对机体所产生的严重功能紊乱或病理性损害,甚至会危及生命。包括急性毒性反应和长期毒性反应。由于中药的成分复杂,其毒性反应表现为多样性,有的作用广泛,累及多个系统(或器官),有的则主要影响某一系统(或器官)。如雷公藤及其许多化学成分,超剂量或长期应用可见有消化、心血管、神经、血液、泌尿生殖等多个组织脏器的损害。人参超量内服可致体温升高,出血,长期服用人参或其制剂,可导致蓄积中毒,表现有恶心呕吐、惊厥抽搐、烦躁不安、发热、血压升高、呼吸急促、眼底出血、昏迷等症状。

中药的毒性作用与其所含成分有关。如马钱子主要毒性成分为土的宁,乌头类药物的主要毒性成分为乌头碱。万年青等中药中的强心苷有洋地黄样的心脏毒性,雷公藤中的雷藤氯内酯主要作用于附睾精子,抑制精子成熟,而引起男性不育。苦杏仁等中含有的苦杏仁苷,经水解为氢氰酸,能抑制细胞呼吸酶,抑制细胞的氧化反应,导致组织窒息。

3. 变态反应(allergy) 又称为过敏反应,是指少数过敏性体质的病人,多次接触某种中药或其成分后所产生的特殊反应。通常与药物的药理作用和用量无关,是难以预料的不良反应。中药引起的变态反应类型多样,常见的有皮疹、药热、哮喘,甚至出现过敏性休克。可引起变态反应的中药达150余种,尤其是中药注射剂最为多见,过敏反应在所有中药药源性疾病中发病率最高,可能与中药成分复杂、有效成分多与大分子物质等因素有关。

4. 后遗作用(after effect) 后遗作用是指停药以后,血浆药物浓度下降至有效水平以下所发生的不良反应。后遗作用持续时间可长可短,有些十分短暂且较容易恢复,如应用苦寒药物后,患者短期内可能会食欲减退、腹中不适。而有些后遗作用则比较持久且不易恢复,如长期大量服用甘草在停药后可发生低血钾、高血压、浮肿、乏力等假性醛固酮增多症。海藻长期服用,可出现甲状腺机能亢进,停药后,症状逐渐减轻。

5. 成瘾性(addiction) 有些中药连续用药一段时间后,病人在精神上或生理上对该药产生依赖,希望能继续给药,如果中断给药会出现一些不适,停药后会出现所谓的戒断症状。如报道有习惯性便秘患者,服用番泻叶一段时间后即产生身体依赖性,停药后出现焦虑不安、颜面潮红发热、体温升高、呼吸频率加快、心率加快、厌食、体重下降、呕吐、腹泻等戒断症状。

6. 特殊毒性 特殊毒性包括致畸、致癌和致突变作用和生殖毒性。目前已发现有52种中草药及植物含有促癌物质。如千里光含有的千里光生物碱,槟榔中的水解槟榔碱,细辛、桂皮、八角茴香中含有的黄樟素,都有致癌活性。有些中药本身可能没有直接的致癌作用,但当它与其他有致癌作用的药物合用时,则可增强致癌物质的致癌作用,使肿瘤的发生率显著增高,如巴豆中所含的巴豆油。

板蓝根、雷公藤甲素、石菖蒲中的 $\alpha$ -细辛醚、大黄中的蒽醌类等可引起骨髓细胞染色体畸变数明显增加,提示可能对染色体有损伤。

有些中药可能影响胚胎的正常生长发育,导致胎儿畸形,而有致畸作用。制半夏和生半夏导致妊娠家兔死胎显著增加,胎儿体重显著下降,证明了“半夏动胎”的说法。百合、桃仁、杏仁、郁李

仁、苦参等也有类似的致畸作用。

许多中药还有生殖毒性。青蒿素和青蒿琥钠可引起流产和促进胚胎吸收,莪术中的萜类和倍半萜类、牡丹皮中的丹皮酚有抗早孕作用,川牛膝有抗早、晚期妊娠作用。其他如阿魏、冰片、麝香酮、天花粉蛋白、合欢总苷等或通过影响胎盘滋养层细胞,或通过影响性激素对生殖产生影响。

中药的应用有其自身的特点,中药中许多药物有不同的品种、炮制形式,而现代研究显示,炮制对药物的毒性成分、毒性作用有明显的影响,并且中药通常是辨证配伍用药,又有不同的制剂形式,这些因素都会对药物的毒性产生影响,因此关于中药毒性的研究还需遵循中医药理论和中药应用实际,作进一步的探讨。

## 六、中药的配伍与禁忌

配伍是中医用药的特点,中药通过配伍,组成方剂,是临床用药的主要形式。中药配伍后,药物之间产生相互作用,药物配伍前的功能发生变化。配伍理论就是对药物配伍所产生的药物相互作用的认识,是通过经验积累而逐步上升为理论的。其内容主要包括配伍规律、七情、十八反、十九畏和妊娠禁忌。

中药配伍的目的是通过两种以上药物配合应用,来增强药物的疗效,减低不良反应或毒性。从现代研究来看,中药配伍理论的内容主要是中药配伍的客观规律,以及由此而产生的对中药相互作用的认识。

### (一) 七情

七情是中药配伍的基本内容,包括单行、相须、相使、相畏、相杀、相恶、相反。是指中药配伍后药物的相互关系,即药理或毒理作用所产生的七种变化类型,总体上可分为协同和拮抗。

单行,是单味药物的应用,选用一种针对性强的药物即能获得疗效。

相须,是两种性能功效相似的药物联合应用,可相互增加疗效。如清热泻火的石膏、知母均能退热,石膏退热快,但作用弱而短暂,知母退热缓,但作用强而持久,两者合用,退热快且作用强而持久。黄连与连翘同用,对金黄色葡萄球菌的抑菌力比单用黄连强6倍以上。

相使,是两种性能功效不同的药物联合应用,能互相促进提高疗效。如补气的黄芪与祛湿的茯苓合用,能相互增强补气利尿的功能,增强利尿作用。

相畏,是一种药物制约另一种药的性能或抑制另一种药物的毒性或作用强度。如截疟七宝散中,常山有抗疟作用,但有较严重的恶心、呕吐等消化道反应,散剂中伍用槟榔,不影响常山的抗疟作用,却可使呕吐反应减少3~4倍,说明截疟七宝散中,常山通过槟榔的相畏,抑制了呕吐反应。

相杀,即一种药物能够减轻或消除另一药物的不良反应或毒性。如绿豆能杀巴豆毒,防风能杀砒霜毒。

相恶,是指两种药物合用后,相互影响而使药物的作用降低甚至消失。如黄芩能减低生姜的温性。在白虎加人参汤中,知母、人参都有降血糖作用,但两药合用却使降血糖作用减弱甚至消失。

相反,即两种药物合用后,可产生毒性反应或副作用。如甘草反芫花,实验证明,甘草与芫花合用 $LD_{50}$ 减小,毒性增大。

因此,相须、相使配伍,在药效上发挥了增效协同作用,相畏、相杀配伍通过拮抗,能减低或消除不良反应或毒性,这几种类型是临床配伍用药的目的;相恶配伍在药效上产生拮抗作用;相反配

伍则出现较多的不良反应或增强毒性,这两种类型是指药物之间的不良相互作用,在临床用药中必须注意。

## (二) 配伍规律

中药的配伍规律是以七情理论所表达的药物配伍关系为基础,讨论各种配伍中药物相互作用的规律。涉及中药的四气五味、升降沉浮、归经引经,以及临床辨证、治则治法等众多中医药理论知识,内容复杂而广泛。现代研究从下列几个方面作了探讨。

1. 中药配伍的化学研究 化学成分是中药作用的物质基础,中药配伍前后化学成分的变化是配伍规律的一个重要体现。

中药配伍的协同或拮抗的作用并非单味药化学成分的简单相加。在制剂过程中,由于温度、pH、煎煮时间等原因,使方剂中的一些成分发生物理的和化学的变化,导致成分溶出率改变、原有的某些成分消失或是产生新的化合物,从而表现出减毒、增效甚至产生单味药不具备的药理活性。

甘草常与各种中药配伍使用,其所含的甘草酸及黄酮类成分可与中药中的生物碱结合成难溶性盐。甘草与附子、马钱子等配伍,由于沉淀效应而降低了有毒中药的毒性,起到减毒、缓解药性的作用。石决明与决明子共煎时,石决明有助溶作用,使方中蒽醌的溶出率明显提高。在生脉散合煎液中发现并分离鉴定了人参、麦冬、五味子三药不含的化学成分5-甲羟基-乙糠醛(5-HMF),具有抗氧化和抗心肌缺血的药理活性。

另外,方药剂量与比例的变化,也会有伴随药理效应变化的化学成分改变。临床将白术和枳实同用时,2:1配伍在于补,用于脾虚气滞,而1:2配伍在于消,用于气滞水停。白术和枳实以不同比例配伍(2:1和1:2)的定量分析表明,白术中有效成分苍术酮的氢化产物羟基苍术酮的含量随枳实的比例增大而减小。黄连与吴茱萸不同比例配伍后,黄连中盐酸小檗碱的损失率与吴茱萸的配伍剂量呈线性相关,提示需要一个适当比例,才可以既发挥吴茱萸的反佐作用,又不阻碍黄连的清热作用。

2. 中药配伍的药代动力学研究 对中药配伍后化学成分在体内的吸收、代谢、排泄过程,运用药代动力学定性、定量的分析,也发现中药配伍的变化在药代动力学中有所体现。丹参与川芎配伍会减少川芎嗪的吸收、分布和生物利用度。川芎配伍芍药明显影响血清中阿魏酸的吸收、分布和排泄。

现代研究表明,药物在体内,可通过与血浆蛋白结合、经药物代谢酶代谢、经肾脏排泄等途径发生相互作用,而影响药物的药理或毒理作用。已有研究显示甘草及其部分有效成分、黄酮及黄酮衍生物、呋喃香豆素化合物、贯叶连翘和丹参的有效成分等均可诱导或抑制药物代谢酶,如细胞色素P450等。

3. 中药配伍的药理研究 药理作用或效应是临床药物治疗的基础,许多在药理研究所证实中药的配伍主要是提高药效作用,降低不良反应。

源于乌头汤的川乌与白芍是寒热配伍的常用传统药对之一,临床治疗风湿痹证。方中两药皆有止痛之功,但又各有所长。两药配伍对动物的镇痛作用均较单味药更强,镇痛持续时间亦显著延长。黄连为历代医家常用的中药,在含黄连的方剂中,约有20%~60%属黄连与黄芩配伍,黄连中的小檗碱可破坏葡萄糖-6-磷酸脱氢酶(G-6PD)缺乏者的红细胞,引起严重的溶血性黄疸。黄连配伍黄芩对大鼠离体红细胞渗透性的研究发现,黄芩可以显著拮抗较高浓度的黄连对体外红细胞脆性的影响,提示该两药配伍可适当减少不良反应的发生。

### (三) 十八反、十九畏

十八反、十九畏在近代及现代主要作为配伍禁忌,是中医药理论中专门讨论药物不良相互作用的内容,充分体现中医药对用药安全性的重视。

十八反、十九畏历来作为中药配伍禁忌,但同时又有许多相反药对临床应用的记载,近代实验研究结果也存在着相互矛盾的情况。

目前较为一致的看法是:①十八反、十九畏不是绝对禁忌。在古籍配方中反、畏药物同用的例子屡见不鲜,如治疗瘰疬的海藻玉壶汤中海藻与甘草同用,女金丹中含肉桂与赤石脂,甘遂半夏汤中甘遂与甘草伍用。②十八反、十九畏的理论在特定条件下是正确的,在不同剂量、病理状态等条件下,可产生不同程度的毒性增强或不利于治疗的作用,如制川乌和半夏配伍,对正常动物的毒性无明显增强作用,但可使脾虚小鼠心律失常加重。白藜和乌头伍用,白藜的抑菌作用成倍减弱。③十八反、十九畏中包括许多药物组对,各组对其有专药性,独具特点,因此,没有一个组对可以作为全部的代表,不能以个别的反、畏配伍的实验结果就否定十八反、十九畏的理论。应通过系统研究,作出确切判断。④在现有认识条件下,十八反、十九畏中药对的临床应用必须谨慎,在特定病理生理状态时,有的组对必须禁忌使用,其适应证必须严格挑选。

### (四) 妊娠禁忌

妊娠禁忌药的理论是药性理论中具有特色的部分,反映了中医对妊娠期用药安全性的认识。

妊娠禁忌的药物种类较多,包括堕胎药物,和可能不利于妊娠过程、不利于胎儿、孕妇、不利于产程的药物。在禁忌的程度上又分为禁用、忌用和慎用。禁用药:大多毒性较大、泻下作用强烈或有子宫收缩作用的药物,如水银、巴豆、乌头、益母草等。忌用药:包括一般活血祛瘀通经的药物,如红花、水蛭、肉桂、麝香等。慎用药包括一些辛温香窜药、消导药、利尿药,如桂枝、半夏、大黄、车前子等。

对妊娠禁忌药物,尽管从古时到现代研究都存在有争论,但现代临床和实验研究显示有终止妊娠的药物大多数是妊娠禁忌药。包括芫花、半夏、冰片、雷公藤等。并且发现半夏使大鼠阴道出血率、胚胎病死率增高。冰片、麝香等对子宫有兴奋作用,尤其对妊娠子宫作用更为明显。大黄中的大黄素、半夏等成分有致突变、致畸胎作用。

## 第4节 影响中药药理作用的因素

影响中药药理作用的因素,是中药药理学研究中首先要注意的问题。影响中药药理作用的因素,主要有三大因素:药物因素、机体因素和环境因素。

### 一、药物因素

药物是影响中药药理作用的首要因素,国家为此从中药种植、加工、开发、生产等制定了统一的标准(GAP、GLP、GCP、GMP),以保证中药的质量。

1. 品种 中药品种繁多,历代本草不断增加,《神农本草经》记载365种,《本草纲目》1892种,到了现代,《中药大辞典》增加到5767种,《中华药海》已达8488种。

中药品种复杂是影响疗效的一个重要因素。据统计,一个药名源于一种药材与一个药名来源

多种药材的比例大约是3:1,即临床常用的四百多种药材中,有1/4是复杂品种。

(1) 一个药名来源于不同种属的药物:如紫花地丁来源于堇菜科、豆科、罂粟科、龙胆草科等4科8种,木通来源于马兜铃科、木通科、毛茛科等3科7种,威灵仙来源于毛茛科、百合科、菊科、金粟兰科等4科15种。

(2) 一个药名来源于同一种属不同品种:如蔷薇科的杏仁、有苦杏仁、甜杏仁之分;马尾黄连来源于毛茛科的多种唐松草,其中金黄色、有苦味,小檗碱含量高的比较好,如多叶唐松草、贝加尔唐松草,可视为正品,没有苦味,不是金黄色的不宜做马尾黄连使用。

由于品种混淆,来源不同,化学成分有差异,药理作用亦有很大的不同。如大黄致泻的主要成分是结合型蒽苷,掌叶大黄、唐古特大黄等正品大黄中,结合型蒽苷含量高,泻下作用明显。而其他混杂品种如华北、天山等大黄中因其含量低,泻下作用差。从测定其泻下作用的半数有效量( $ED_{50}$ )来看,正品大黄 $ED_{50}$ 与混杂品种大黄的 $ED_{50}$ 相差10多倍。金钱草按记载有十科14种之多,其利胆、利尿作用均有不同程度的差异。如江西金钱草利尿作用明显,但无利胆作用;四川金钱草利胆作用显著,但无利尿作用;而广东金钱草却既有利胆又有利尿作用,可见品种对化学成分,对药理作用有重要影响。

但同为正品青蒿,药理作用也有差异,菊科黄花蒿含有青蒿素,有抗疟作用,而同种同属的另一植物青蒿不含青蒿素,无抗疟作用。

2. 产地 中药大多来源于天然的植物和动物,各自生长分布的区域性很强。不同地区的土壤、气候、日照、雨量等自然环境条件有差异,对动植物的生长发育有着不同程度的影响。同一味中药,产地不同,质量就有差异。如长白山的野山参,东北各省及朝鲜、日本的园参,不但含人参总皂苷的量不同,而且不同皂苷含量也不一样。由于产地不同,其药理作用有差别,如潞党参的降体温作用及抗角叉菜胶所致肿胀作用显著;板党参有一定的镇痛作用;而文党参镇痛作用显著。许多名贵药材,都有特定的产地。故历史上早已形成了“道地药材”的概念。如川贝母、川附子、川黄连、浙贝母、怀山药、怀地黄、怀牛膝、潞党参、云茯苓、云木香以及藏红花、牡丹皮;又如甘肃的当归,宁夏的枸杞子,云南的三七,山西的黄芪等,都是历史悠久、享有盛名的道地药材。可见,中药产地明显地影响着有效成分及其含量,同时又影响着药理作用。

3. 采收 中药品质的优劣,与采收季节密切相关。植物的根、茎、叶、花、果实、种子或全株的生长和成熟期各不相同,其中有效成分的含量有明显差异。故中药材的采收时节也就随入药部位的不同而异。8月采收的人参,其人参皂苷的含量为1月采收的人参皂苷含量的3倍以上。薄荷在其开花盛期采收,挥发油含量最高,发汗、解热作用最佳。可见药物采收时间对药品的质量有重要的影响。此外,多年生植物根类药材的品质还同植物生长期限有关。通常认为人参、何首乌等药材以生长年限长者为好。但并非所有药材都是如此,如以亳白芍为例,其芍药苷的含量以2年生者最高,随生长期的延长,芍药苷的含量逐年下降。4年生的含量不到2年生的含量的一半。

一般来说,根茎类药材宜在晚秋季节地上部分枯萎或春初发芽前收获,此时植物生长缓慢,根及根茎中储藏的各种营养物质丰富,有效成分的含量最高,如党参、葛根、天花粉、大黄等。叶类、全草类药材以花前盛叶期或花盛开期采收最好,如臭梧桐、薄荷、益母草等。花类药材多半是在花含苞欲放或初开时采收,如槐花、金银花等,有少数花宜在花盛开时采摘,如菊花、旋覆花等。果实、种子类药一般在充分成熟后采收,如瓜蒌、枸杞等,此时其中营养物质、有效成分含量相对较高,也有少数如青皮应在未成熟时采收。树皮类药如厚朴、杜仲、川楝皮宜在春或夏初剥取,此时树汁多。根皮类药及藤本类药如牡丹皮、忍冬藤、红藤以秋末冬初采收为宜。

4. 储藏 储藏保管的条件对中药质量的优劣,有着直接的影响。一般认为,影响药材变质的

因素有以下几点:①湿度:相对湿度75%以上,药材含水量11%以上时,含淀粉、黏液质、糖类等成分较多的药材及炭炒焦炒药材易吸收空气中的水分而变质;②温度:室温25℃以上时,含糖类及黏液质成分的药材易变质发霉生虫,脂肪易酸化,挥发油易逸去;③日照:日光照射会使某些药物变色而影响质量;④虫蛀:含淀粉、蛋白质、糖类药材易虫蛀;⑤真菌:温度过高,湿度过大时,真菌孢子散落药材表面,使药材有效成分发生变化,霉坏;⑥时间:药材储存时间过长,有效成分会因氧化而降低。如在日照、高温(40~60℃)、高湿(相对湿度在75%以上)的条件下储存6个月的刺五加,其所含的丁香苷几乎完全损失。供提取小檗碱的原料药三棵针,在见光和避光的条件下存放3年后,其小檗碱的含量分别降低54.1%和39.83%。说明随着储藏时间的延长,其有效成分获得率逐渐降低。可见,中药的保管和储藏,是影响中药质量、药理作用和临床疗效的重要因素之一。

5. 炮制 中药的加工炮制,会使中药的质和量发生极大的变化,而影响其药理作用。中药的加工炮制,中医积累了丰富的经验。注重中药的传统炮制,或是改善其炮制方法,是保证其药理作用的关键。炮制影响中药的常见作用有以下几点。

(1) 消除或降低药物毒性或副作用:对于有毒性或副作用的中药,为保证临床用药的安全有效,可经过炮制而降低其毒性或副作用,如附子中含有多种乌头碱,对心脏有毒性,可引起心律不齐,经蒸煮炮制后,乌头碱水解生成乌头原碱,毒性大减,而附子中具强心作用的消旋去甲乌药碱,耐热而未被破坏,故经炮制后的熟附子,毒性降低而仍保留其强心作用。生半夏可致呕吐,其所含苷元对胃黏膜有强烈刺激性;而姜半夏却有镇吐作用,其镇吐成分为葡萄糖醛的衍生物及一种水溶性苷,没有刺激性。何首乌为补血药,生品中结合的蒽醌衍生物,具泻下作用,经炮制后的制首乌结合型蒽醌衍生物水解,含量减少,而游离蒽醌衍生物和糖的含量明显增加,故补益作用增强而泻下作用降低。

(2) 增强疗效:炮制可改变药物有效成分的组成、含量和理化性状,甚至产生新的化学成分,因而药理作用也随之改变。延胡索的镇痛主要成分是生物碱,水煎溶出量很少,经醋炮制后生物碱与醋酸结合成溶于水的醋酸盐,水煎液中,生物碱的溶出量增加,因此醋制能提高延胡索的镇痛作用。生大黄主要含泻下作用的结合型蒽苷,经炮制成熟大黄之后,结合型蒽苷减少,而抗菌成分游离型蒽苷含量增加,故生大黄泻下作用强,而熟大黄则抗菌作用增强,泻下作用减弱。生晒参炮制成红参后,其单体可发生变化,使生晒参原来没有的人参炔三醇、人参皂苷Rg<sub>2</sub>等五种特殊成分出现在红参中。

(3) 利于保持药效稳定:一些中药中含有破坏其有效成分的酶,如不经炮制,有效成分将会被破坏而失效。苦杏仁炮制后,抑制了其所含苦杏仁酶酶的活性,使药理活性成分苦杏仁苷分解减少。

6. 剂型和制剂 选择适宜的剂型和优良的制剂工艺,是中药药理作用的保证。《神农本草经》:“药性有宜丸者,艺不同和给药途径不同等,常影响机体对药物的吸收及血药浓度,而影响其药理作用。许多中药或古方制成片剂、冲剂、注射剂等广泛用于临床,提高疗效并扩大应用范围。如参脉注射液、川芎嗪注射液、丹参注射液等,疗效高于生脉散及丹参、川芎的口服制剂。枳实、青皮的水煎液口服,未见有升高血压的记载,制成注射液,却表现有升血压作用,用于防治休克。灌肠给药的制剂,使药物通过肠壁进入血流,对治疗高热、肾衰竭、肠炎、痢疾、盆腔炎等多种疾病的效果较口服药疗效高,作用快。现代的中药制剂,具有更高的要求,国家为此制定了药品生产标准,以保证制剂的质量和药效。随着药事业和制药工业的发展,中药剂型有了很大的改进,中药软胶囊、气雾剂、膜剂、栓剂等新剂型已广泛应用于临床。但这些剂型及其工艺的变更,势必影响中药的药理作用,因此,与质量研究相结合的制备工艺研究,是中药制剂保持其药理作用的保证。

工艺不合理,会影响中药制剂的疗效。如有些含有以挥发性有效成分为主的处方,采用水煎煮较长时间的提取方法,使挥发油成分大量逸失,如桂皮酚醛、丹皮酚等。又如有些药味中的主要成分遇热不稳定,如长时间加热提取、浓缩、干燥、会使有效成分遭到破坏,影响疗效。因此,工艺制备研究是中药研究中的重要组成部分。

7. 剂量、煎煮方法和条件 中药的用药剂量通常对药效作用有很大的影响。一般而言,量小则疗效小,量大则效力大,但剂量过大可能出现副作用或中毒症状。如活血化瘀类药,量小则行气活血,量大则活血化瘀,甚至破血逐瘀。人参皂苷小剂量可兴奋中枢,而大剂量则抑制。

另一方面,一些药物用量的不同,还会出现药效作用的不同,甚至出现相反的作用。如黄芩小剂量能降压、利尿,大剂量则有升压、抗利尿的作用。甘草,小剂量有调和诸药功能,中剂量则能清热解毒,大剂量则用于解毒和治疗腹痛转筋等。

中药大多数是天然植物药,故按合成药那样严格规定最小有效量、极量、最小中毒量及半数致死量等往往是困难的。所以常用剂量的确定,以临床疗效及药理毒理研究作为参考依据。为了保证用药安全,处方用量应遵照《药典》规定的范围应用。

传统中药最常用的剂型是水煮煎汤,对汤剂煎煮的方法历来十分重视。药物煎煮的方法常影响煎液中活性成分的含量和药效。煎煮所用水量的多少,火候的大小及时间的长短等,都会直接影响药物有效成分的溶出和药效的发挥。不同性质、质地的药物及不同的用药目的,煎煮的方法和条件都应不同。大黄 10 种不同煎煮方法对泻下作用和抑菌作用的比较显示,大黄后下和加酒浸泡过夜,然后短时煎煮,其蒽苷溶出率最高,泻下作用最强,随着煎煮时间延长,蒽苷转变成苷元,泻下作用减弱,抗感染作用增强。一般而言,解表药如薄荷、紫苏等煎煮的火力要大,时间要短;补益药如人参、当归等煎煮的火力要小,时间稍长;化石、矿石类药如龙骨、牡蛎等应先煎久煎;芳香性药物如豆蔻、砂仁等入汤剂宜后下。

此外,药物的分煎、合煎也对药效有影响。桂枝汤分煎、合煎对药效的影响研究发现,抗流感病毒性肺炎、抗炎、镇痛等作用,合煎优于分煎。说明复方中药的共同煎煮和各药分别煎煮后混合使用,在某些药物的药效上是有区别的。

煎煮方法除影响药物有效成分的溶出外,药物在共煎的过程中还可能有新的成分产生。如将生脉散合煎,从合煎液中分离得到一个新的活性成分,与该方药效直接相关。

8. 其他 中药之间不同的配伍及中西药物在临床上的联合应用,均可因药物间的相互作用,而影响到药物的药理作用。

## 二、机体因素

机体对中药的反应,往往随着生理状况和病理状况的不同而不同,所以机体因素也是影响中药药理作用的重要因素。

1. 生理状况 包括体质、年龄、性别、情志、遗传、种族等,对中药药理作用的发挥均有一定影响。机体对药物反应的个体差异,如高敏性、耐受性等,也见于中药应用之中。

年龄不同对药物的反应也不同。如婴幼儿处于发育阶段,各系统各器官尚未发育完善,而对药物的耐受性较差,用药量应相对减少;而老年人的肝肾等器官、神经、内分泌、免疫等系统功能减退,而往往会影响药物有效成分的吸收、代谢、排泄和药理作用的发挥,其用药量往往相对增大。同时老年人体质多虚弱,祛邪攻泻之品,又不宜多用;而幼儿稚阳之体,又不可峻补。

性别不同对药物的反应也有差异。由于女性在月经、怀孕、分娩、哺乳期时激素水平变动等的

影响,对药物的敏感性也不同。如月经期使用峻泻药及活血化瘀药等,则可导致月经过多或出血不止;孕期使用开窍药、峻泻药等,则可导致流产。如红花、大戟、麝香等能兴奋子宫,甚则引起痉挛;莪术、姜黄、水蛭等能影响孕激素水平;芫花、甘遂、丹皮酚等能影响子宫内胎的营养;半夏有致畸作用等。因此,上述药物当禁用于孕妇。

情志、精神状态等也会影响药物作用的发挥。乐观的患者可以增加对疾病的抗病能力,有利于疾病的治愈和恢复,使用不含活性药物的安慰剂对许多慢性疾病,如神经官能症、高血压、心绞痛等有效率可达30%~50%。相反,忧郁、悲观不愿配合治疗,将会影响药物疗效。因此,在中药临床评价时,为了排除安慰剂作用,往往使用安慰剂对照和双盲法试验。

2. 病理状况 机体所处的病理状况不同,对药物的作用也有影响。如肝病患者的肝脏功能低下,影响药物的生物转化;肾功能低下的患者排泄功能减弱,药物或其代谢产物不易排出体外,都可致蓄积或中毒。黄芩、穿心莲等药物,只对发热病人有解热作用,对正常体温并无影响。玉屏风能使机体低下的免疫功能增强,又能使过亢的免疫功能趋向正常。当归能使痉挛状态的子宫平滑肌舒张,也能使弛张状态的子宫平滑肌收缩力增强,呈现双向调节作用。人参大补元气,补脾益肺,生津安神,适用于气虚证;实证、热证而正气不虚者,用之不但无益,反而有害。

### 三、环境因素

环境因素包括地理条件、气候寒暖、饮食起居、家庭条件等,对人的健康和药物的药理作用都有影响。

中医学历来重视时间因素在疾病发生发展及治疗上的作用。环境有时辰节律,机体的生理活动也随昼夜交替,四时变更而呈现周期性变化。药物的效应和毒副反应也常随之变化而有所差异。雷公藤的乙酸乙酯提取物的急性毒性试验以中午12:00的動物病死率最高,20:00至次晨8:00给药动物病死率最低。药物效应与时间的相关性,与药物在体内的代谢变化有关,而体内的代谢又主要与肝微粒体单氧酶系统有关。研究显示,这些酶的活性具有昼夜节律性变化。因此研究药物的择时使用具有积极意义。

#### 小结

中药药理学是以中医药基本理论为指导,运用现代科学方法,研究中药和机体(包括病原体)相互作用及其作用规律的一门学科。其研究内容包括中药效应动力学和中药代谢动力学。中药药理学是一门实验性学科,其主要任务是阐明和发展中医药理论,指导临床合理安全用药,为中药新药的研究和开发服务和进中西医结合的发展。

中药药性理论是中药的作用性质、功能和运用规律的基本理论。

中药四性的现代研究发现,温热或寒凉药物可通过影响神经递质,调节中枢神经的兴奋性;通过影响自主神经的递质、受体以及环核苷酸水平,调整自主神经功能,纠正机体寒热的不平衡;通过影响甲状腺、肾上腺皮质、性腺等内分泌系统功能,调节机体的功能状态;通过影响垂体-甲状腺轴功能和,而纠正热证(阴虚证)或寒证(阳虚证)异常的能量代谢。一般而言,寒凉药大多具有抗惊厥、解热、镇痛等中枢抑制;降低自主神经功能,增强副交感神经-M受体-cGMP系统;抑制内分泌功能和细胞膜钠泵活性的作用。而温热药具有中枢兴奋,增强交感神经-β受体-cAMP系统,增加内分泌功能和细胞膜钠泵活性的作用。



## 小结

中药所含主要成分及其主要药理作用与中药的五味则相关。中药的归经与中药的药理作用的选择性、体内过程的选择性、作用受体的选择性和微量元素、对不同器官中环核苷酸的影响等方面表现出一定的规律。

中医药对中药的毒性早就有认识,中药或其方剂,存在有包括副作用、毒性反应、变态反应等在内的不良反应,中药的不良反应用与其所含成分有关。

对中药配伍的研究,一方面揭示了“七情”理论的规律,即相须、相使配伍具有增效协同,提高疗效的作用,相畏、相杀配伍则能减低或消除不良反应或毒性,而相恶配伍为药效上相互拮抗;相反配伍则是指临床用药中必须注意的药物之间的不良相互作用。另一方面,揭示了中药配伍后药物作用的改变,与配伍药物的化学成分、药代动力学以及药理学变化相关。

中药药性理论的现代研究还证实了妊娠禁忌的科学性,并对升降沉浮、十八反十九畏也进行了探讨。

影响中药药理作用的主要有药物因素、机体因素、环境因素。药物因素包括药物的品种、产地、采收季节、储藏、炮制、剂型、制剂、剂量及给药途径等;机体因素包括年龄、性别、精神状态、生理状态、病理状态、遗传因素等;环境因素包括气候、时辰、地区、生活条件等。



## 目标检测

1. 中药药理学的定义、内容和任务是什么?
2. 中药药理与西药药理的主要区别是什么?
3. 中药药性包括什么内容?
4. 现代研究在中药四气五味上有哪些发现?
5. 人体阴阳平衡紊乱所致的阴虚、阳虚时,人体有哪些异常表现?应用温热和寒凉药后有什么改变?
6. 中药的不良反应有哪些?
7. 从哪些方面可以反应中药配伍的客观规律?
8. “七情”理论的实质是什么?
9. 影响中药药理作用的因素有哪些?
10. 举例说明炮制对中药药理作用的影响。

## 第 2 章

# 解 表 药



### 学 习 要 求

1. 掌握解表药的主要药理作用。
2. 掌握麻黄与柴胡的主要药理作用及相关的有效成分。
3. 熟悉桂枝与葛根的主要药理作用。
4. 了解细辛、薄荷的主要药理作用。

### 第 1 节 概 述

凡以发散表邪,解除表证为主要功效的药物称为解表药。本类药物多味辛,质轻扬,主入肺、膀胱经,偏行肌表,故解表药一般具有发汗的作用,通过发汗而达到发散表邪、解除表证、控制疾病发展的目的。根据临床适应证的特点,解表药分辛温解表药和辛凉解表药。辛温解表药以发散风寒为主,代表药有麻黄、桂枝、荆芥、防风,代表方有麻黄汤、桂枝汤;辛凉解表药以发散风热为主要功效,代表药有柴胡、葛根、连翘,代表方有银翘散、桑菊饮。表证是指外邪侵犯人体浅表部位(皮肤、肌肉、经络)所致的一类证候群。相当于现代医学的上呼吸道感染及传染病初期的症状。主要表现为恶寒、发热、头痛、无汗或有汗、鼻塞、咳嗽、苔薄白、脉浮等。现代医学认为,上呼吸道感染的主要原因在于机体受到不良因素的影响,抵抗力降低,造成寄生在上呼吸道的病原微生物(细菌、病毒等)乘机侵入黏膜上皮细胞生长繁殖,导致炎症反应而出现诸多临床症状。

解表药的功效与下列药理作用有关:

1. 发汗和促进发汗作用 辛温解表药服用后身体有温热感,属温热性发汗。麻黄及其有效成分麻黄碱、麻黄挥发油能促使实验动物出汗,并且周围环境温度偏高,有助于出汗。古人用辛温解表方剂如麻黄汤等也强调“温服”和“温覆”。桂枝、生姜有促进发汗作用,解表药的发汗作用机制是多环节的:麻黄通过抑制汗腺导管对钠离子的重吸收而促进汗液分泌,该作用与中枢状态、外周神经有关;桂枝、生姜通过扩张血管,促进血液循环而促进发汗。

2. 解热作用 本类药物大多有不同程度的解热作用,使实验性发热动物模型体温降低,以柴

胡作用最显著,桂枝、荆芥、防风、葛根、紫苏、浮萍等均有一定的解热作用。解表药中柴胡挥发油、柴胡皂苷、葛根素、桂皮油、荆芥油等为解热作用有效成分。解表药解热机制是多方面作用的结果:通过发汗,促进发汗而增加散热,通过抗炎,抗病原体等作用而消除病因,促使体温下降。

3. 抗炎作用 呼吸道炎症是表证的常见症状。解表药中大部分有抗炎作用,如柴胡、麻黄、生姜、辛夷等对多种实验性急、慢性炎症有明显的抑制作用,炎症局部红肿热痛缓解。抗炎机制可能与下列因素有关:抑制组胺或其他炎性介质的合成和释放;增强肾上腺皮质的分泌功能;抑制花生四烯酸代谢;消除自由基。

4. 镇痛作用 头痛、周身痛和关节痛是表证的常见症状。本类药物中柴胡、桂枝、细辛、防风、紫苏等对多种动物的实验性疼痛模型均有明显的镇痛作用。部分药物还有镇静作用。

5. 抗病原微生物作用 表证是外邪客表所致,细菌、病毒、寒冷等均可视为外邪。体外实验证明,柴胡、桂枝、紫苏、防风、薄荷、桑叶等对多种细菌,如金黄色葡萄球菌、溶血链球菌、肺炎球菌、伤寒杆菌、痢疾杆菌、大肠杆菌以及某些致病性真菌均有一定的抑制作用;麻黄、桂枝、柴胡、紫苏、菊花等对流感病毒有一定的抑制作用。

6. 对免疫功能的影响 柴胡、苏叶、葛根等在一定剂量下可增强巨噬细胞的吞噬能力,提高机体的抗病能力;促进抗内毒素抗体的生成,加速内毒素的清除。

综上所述,与解表药发散表邪、解除表证功效相关的药理作用为发汗、解热、抗炎、镇痛、抗病原微生物、增强免疫功能等作用。主要有效成分是麻黄碱、麻黄挥发油、柴胡挥发油、柴胡皂苷、葛根素、桂皮油。常用解表药的主要药理作用和用途见表 2-1。

表 2-1 解表药主要药理作用总括表

类别	药物	发汗	解热	抗菌	抗病毒	镇痛	镇静	抗炎	抗过敏	其他作用
辛温 解表药	麻 黄	+	+	+	+	+		+	+	平喘利尿,升血压,兴奋中枢
	桂 枝	+	+	+	+	+	+		+	利尿,强心,扩血管
	细 辛		+	+	+	+	+	+		平喘,祛痰,强心,升压
	生 姜	+			+	+		+	+	止吐,促消化液分泌
	荆 芥		+	+	+	+	+	+	+	止血,抗氧化
	防 风		+	+	+	+	+	+	+	促进免疫功能
	紫 苏		+	+	+	+	+			止咳,祛痰,平喘,止血
	白 芷		+	+			+	+		光敏作用
	苍耳子					+	+			细胞毒作用

续表

类别	药物	发汗	解热	抗菌	抗病毒	镇痛	镇静	抗炎	抗过敏	其他作用
辛凉 解表药	柴胡		+		+	+	+	+	+	保肝、利胆、降脂
	葛根		+				+		+	对心脑血管作用
	薄荷		+	+	+	+	+	+		祛痰、止痒、保肝、利胆
	桑叶		+	+	+	+				祛痰、镇咳
	菊花			+	+	+				降压、增加冠脉血流量
	牛蒡子		+	+			+	+		

## 第2节 常用药物

### 麻 黄

本品为麻黄科植物草麻黄 *Ephedra sinica* Stapf. 中麻黄 *E. intermedia* Schrenk et C. A. Mey. 或木贼麻黄 *E. equisetina* Bge. 的干燥草质茎。主要含多种生物碱和挥发油。生物碱中的主要有效成分为左旋麻黄碱 (*l*-ephedrine), 占生物碱总量的 80% ~ 85%。其次为右旋伪麻黄碱 (*d*-pseudo-ephedrine)。此外尚含有鞣质、黄酮苷、多糖和杂环化合物等。麻黄味辛、微苦, 性温。归肺、膀胱经。

#### 【药理作用】

1. 与功效主治相关的药理作用 麻黄具有发汗解表、宣肺平喘和利尿消肿之功效。主治风寒感冒, 胸闷喘咳, 风水浮肿。

(1) 发汗: 麻黄的发汗作用为几千年临床实践所证实, 麻黄的水煎剂、水溶性提取物、挥发油、麻黄碱、*L*-甲基麻黄碱等均有发汗作用。温热环境有助于发汗, 服用麻黄汤后加以温覆就能使周身出汗, 若不温覆则汗出不多。大鼠静脉注射或口服 *L*-麻黄碱、*L*-甲基麻黄碱, 测得大鼠后肢足跖部放散的水分量增加。麻黄的发汗作用与中枢神经系统机能状态有关, 麻醉状态下或切断坐骨神经时, 发汗作用明显减弱, 而 *M-R* 兴奋药毛果芸香碱的发汗作用则不受影响, 说明两者发汗机理有所差异。麻黄的发汗机理可能是由于其阻碍了汗腺导管对钠离子的重吸收, 而导致汗液分泌增加; 也可能与兴奋中枢的有关部位和外周  $\alpha$  受体有关。

(2) 平喘: 现代医学研究认为哮喘是一种发作性的肺部过敏性疾病, 呼吸道肾上腺素  $\beta_2$  受体功能低下或副交感神经功能亢进是发病的主要原因之一。麻黄碱、伪麻黄碱及麻黄挥发油均是其平喘的有效成分。麻黄碱平喘机理主要是通过以下环节: ①促进肾上腺素能神经和肾上腺髓质嗜铬细胞释放去甲肾上腺素和肾上腺素, 从而间接地发挥拟肾上腺素作用; ②因其化学结构与肾上腺素相似, 亦可与支气管平滑肌上的  $\beta$ -肾上腺素受体和  $\alpha$ -肾上腺素受体结合, 直接产生拟肾上腺素作用。  $\beta$ -肾上腺素受体兴奋, 可松弛支气管平滑肌, 并可阻止过敏介质(如组胺、5-羟色胺、白三烯等)的释放;  $\alpha$ -肾上腺素受体兴奋, 使末梢血管收缩, 有利于支气管黏膜肿胀的减轻, 麻黄碱平喘

作用与肾上腺素相比显效较慢,作用温和而持久,且可口服。

(3) 利尿:麻黄有一定的利尿作用,且以 *D*-伪麻黄碱的作用最明显。给麻醉犬静脉注射 *D*-伪麻黄碱 0.5 ~ 1.0 mg/kg, 家兔静脉注射 *D*-伪麻黄碱 0.2 ~ 1.0 mg/kg, 尿量可增加,作用可持续 30 ~ 60 分钟。利尿作用机理,初步认为是由于其扩张肾血管使肾血流增加,以及阻碍肾小管对钠离子重吸收的结果。

(4) 解热、抗炎:麻黄挥发油对实验性发热动物(兔、大鼠)有解热作用,对正常小鼠体温有降低作用。麻黄水提物、醇提物口服或腹腔注射后,能明显地降低腹腔毛细血管的通透性,抑制鸡胚囊膜肉芽组织的形成,并能抑制由致炎物右旋糖酐、角叉菜胶等引起的炎症反应,抗炎作用有利于上呼吸道炎症的消退。

(5) 抗过敏:麻黄碱能抑制过敏介质(组胺,白三烯)的释放,在免疫实验中发现,其水提物和醇提物能使溶血素明显减少,呈现抗补体作用。

(6) 抗病原微生物:麻黄煎剂和麻黄挥发油对金黄色葡萄球菌,甲、乙型溶血链球菌,流感嗜血杆菌,肺炎双球菌,炭疽杆菌,白喉杆菌,大肠杆菌,奈瑟双球菌等均有不同程度的体外抑制作用。麻黄挥发油对亚甲型流感病毒有明显的抑制作用,对甲型流感病毒 PR<sub>8</sub> 株感染的小鼠有治疗作用。

(7) 镇咳、祛痰:麻黄水提物和麻黄碱给小鼠、豚鼠等灌服,对 SO<sub>2</sub> 和机械刺激所致咳嗽反应均有抑制作用,其镇咳强度约为可待因的 1/20。麻黄挥发油灌胃尚有一定的祛痰作用,能促进气管分泌酚红。

## 2. 其他药理作用

(1) 兴奋中枢神经系统:治疗剂量麻黄碱能兴奋大脑皮质和皮质下中枢,引起精神兴奋、失眠等症状。亦能兴奋中脑、延脑呼吸中枢和血管运动中枢。

(2) 强心、升高血压:麻黄碱因能兴奋肾上腺素能神经和直接兴奋心肌  $\beta_1$  和血管平滑肌  $\alpha_1$  受体而呈现正性肌力、正性频率作用;并能使血管收缩、血压升高。其升压特点是作用缓慢、温和、持久、反复应用易产生快速耐受性。

(3) 抑制肠肌收缩:麻黄碱对离体豚鼠回肠的自发收缩有抑制作用,也能减弱乙酰胆碱和 5-羟色胺的收缩效应。

综上所述,与麻黄发汗解表功效相关的药理作用是发汗、解热、抗病原微生物、抗炎、抗过敏等作用;与宣肺平喘功效相关的药理作用是缓解支气管平滑肌痉挛、减轻黏膜水肿、抗炎、抗过敏、镇咳、祛痰等作用;与消除消肿功效相关的药理作用是利尿、发汗作用。主要有效成分是生物碱。

### 【现代应用】

1. 感冒 以麻黄为主的复方制剂(如麻黄汤、大青龙汤等)常用于治疗感冒和流感等。

2. 支气管哮喘 麻黄碱片剂口服,15 ~ 30 mg/次,45 ~ 90 mg/日,可预防和缓解支气管哮喘。麻黄雾化剂吸入治疗小儿支气管哮喘、哮喘性支气管炎、支气管肺炎 100 例,总有效率达 84%。麻黄膏(麻黄和白胡椒粉 7:3 组成)贴肺俞穴,每日 1 张,共观察小儿咳喘 288 例,总有效率为 96.2%。

3. 防治某些低血压症 麻黄碱皮下注射或肌肉注射 15 ~ 30 mg/次,45 ~ 60 mg/日,可预防腰椎麻醉引起的低血压症等。

4. 鼻塞 由鼻黏膜肿胀(如过敏性鼻炎、鼻黏膜肥厚等)所引起的鼻塞,常用 0.5% ~ 1% 麻黄碱溶液滴鼻,可消除鼻黏膜肿胀。

5. 肾炎 以麻黄为主的方剂(如麻黄连翘赤小豆汤等)对改善肾炎所致的全身浮肿等症状有

一定效果。

此外,应用麻黄治疗皮炎、老年性皮肤瘙痒、小儿遗尿症、阳痿、风湿性关节炎等均有一定疗效。

## 桂 枝

桂枝为樟科植物肉桂 *Cinnamomun cassia* Presl. 的干燥嫩枝。其有效成分为挥发油(桂皮油),含量为 0.43% ~ 1.35%。桂枝味辛、甘,性温。归心、肺、膀胱经。

### 【药理作用】

1. 与功效主治相关的药理作用 桂枝具有发汗解肌,温通经脉,助阳化气,平冲降气之功效。主治风寒感冒,脘腹冷痛,血寒经闭,关节痹痛,痰饮,水肿,心悸。

(1) 扩张血管、促进发汗:桂枝单用发汗力弱,若与麻黄配伍,则发汗力增强。桂皮油能扩张血管,改善血液循环,促使血液流向体表,从而有利于发汗和散热。

(2) 解热、镇痛:桂枝水煎剂及其有效成分桂皮醛、桂皮酸钠可使伤寒、副伤寒菌苗致热的家兔体温降低,其解热作用可能是由于皮肤血管扩张,促进发汗使散热增加所致。近来发现桂皮煎剂灌服,对酵母所致发热大鼠和安痛定所致低体温大鼠均有解热和升温作用,说明桂枝对体温有双向调节作用。桂枝煎剂及桂枝水提取物加总挥发油的混合物给小鼠灌服,对热刺激引起的疼痛反应有明显的抑制作用,并能提高痛阈值。

(3) 抗炎、抗过敏:桂枝煎剂、总挥发油等对角叉菜胶、蛋清、二甲苯等所致急性炎症有明显的抑制作用,且能明显抑制小鼠腹腔毛细血管通透性增加,桂枝总挥发油尚能抑制小鼠棉球肉芽肿。因其挥发油部分由呼吸道排出,对呼吸道炎症有消炎作用。其抗炎机理与抑制组胺生成,前列腺素 E 的合成和释放、清除自由基等有关。桂枝尚能抑制 IgE 所致肥大细胞脱粒释放介质,还能抑制补体活性;总挥发油对过敏性鼻炎模型大鼠佐剂性关节炎有抑制作用,表明桂枝有抗过敏作用。

(4) 抗病原微生物:体外实验证实,桂枝水煎液对金黄色葡萄球菌、伤寒杆菌以及某些常见的致病性真菌都有较强的抑制作用;醇提取物对大肠杆菌、金黄色葡萄球菌、肺炎球菌、炭疽杆菌、霍乱弧菌等也有抑制效果;桂皮油、桂皮醛对变形杆菌、结核杆菌有抑制作用。

2. 其他药理作用 桂枝具有明显的镇静、抗惊厥作用。桂枝的总挥发油、水提取物及其有效成分桂皮醛可使小鼠自主活动减少,使巴比妥类催眠药的催眠作用增强,可对抗苯丙胺所致中枢神经系统过度兴奋,并能延长土的宁所致强直性惊厥的死亡时间,减少烟碱引起的强直性惊厥及死亡的发生率,还可以抑制小鼠的听源性惊厥等。

此外,桂枝有一定的利尿作用;桂枝有效成分桂皮醛有抗肿瘤作用;桂皮醛能促进胃肠蠕动,增强消化功能;桂皮醛在体外对血小板聚集有抑制作用,并有抗凝血酶作用。

综上所述,与桂枝发汗解肌功效相关的药理作用是扩张血管、促进发汗、解热、镇痛、抗炎、抗过敏、抗病原微生物等作用;与桂枝温通经脉功效相关的药理作用是其扩张血管的作用。桂枝主要有效成分是挥发油。

### 【现代应用】

1. 预防流行性感 复方桂枝气雾剂(桂枝加香薷)喷咽喉部,1日2次,观察177例,有一定疗效。

2. 低血压 桂枝、甘草、附子各15g代茶饮,有升压作用。

3. 风湿性关节炎 以桂枝为主,治疗200例肢体痹痛病人,桂枝用量12~20g,根据病情适当

加药,每日1剂,2周为1疗程,有较好疗效。

4. 癫痫 柴胡桂枝汤重用白芍,经治疗433例,疗效较好。

此外,桂枝与有关药物配伍还治疗多种疾病,如治疗冠心病、慢性心功能不全、肾炎、胃十二指肠溃疡、冻疮、心性和肾性水肿、肿瘤等。

## 柴 胡

本品为伞形科植物柴胡 *Bupleurum chinense* DC. 或狭叶柴胡 *Bupleurum scorzonerifolium* Willd. 的干燥根。其成分主要含柴胡皂苷(saikosaponins a、b、c、d 四种),甾醇,挥发油(柴胡醇 bupleurmol、丁香酚、己酸、 $\gamma$ -十一酸内酯、对-甲氧基苯二酮等)等。此外尚含有生物碱、葡萄糖、氨基酸等。柴胡味苦,性微寒。归肝、胆经。

### 【药理作用】

1. 和功效主治相关的药理作用 柴胡具有透表泄热、疏肝解郁、升举阳气之功效。主治感冒发热,寒热往来,胸胁胀痛,月经不调。

(1) 解热降温:柴胡的煎剂、注射液、醇浸膏、挥发油、粗皂苷等制剂对伤寒、副伤寒疫苗、大肠杆菌液、发酵牛奶、酵母液及内生性致热源等引起的动物实验性发热,均有明显的解热作用,且能使正常动物的体温降低。解热的主要成分和主要有效部位是柴胡皂苷和挥发油。由于柴胡总挥发油部位毒性低、解热效果好,已作为注射液广泛应用于临床。

(2) 抗炎:柴胡的有效成分柴胡皂苷和挥发油腹腔注射对角叉菜胶所引起的大鼠足肿胀有明显的抑制作用,柴胡皂苷对正常或去肾上腺大鼠5-羟色胺、组胺、巴豆油和醋酸所致的鼠足跖和踝关节肿胀均有明显的抑制作用,并能抑制白细胞游走和抑制致炎物组胺的释放。

柴胡的抗炎机理比较复杂,柴胡皂苷能兴奋腺垂体分泌肾上腺皮质激素(ACTH),刺激肾上腺引起皮质激素的合成和分泌。此外,尚对炎症过程的许多环节如渗出、毛细血管通透性增加、炎症介质的释放、白细胞游走、结缔组织增生都有一定的抑制作用。

(3) 抗病原微生物:体外实验证实,柴胡对金黄色葡萄球菌、溶血性链球菌、霍乱弧菌、结核杆菌、钩端螺旋体有一定的抑制作用;对流感病毒有较强的抑制作用;尚可抑制肝炎病毒、牛痘病毒,对抗I型脊髓灰质炎病毒导致细胞突变的作用。柴胡注射液治疗单纯疱疹病毒性角膜炎有效,对流行性出血热病毒有一定作用。实验性病毒性肺炎小鼠灌服柴胡水提取物,可显著降低肺指数和病死率。

(4) 镇静、镇痛、镇咳:柴胡煎剂、总皂苷对中枢神经系统有明显的抑制作用,可使动物的自发活动减少,条件反射抑制,延长巴比妥类药物的睡眠时间,拮抗中枢兴奋剂(苯丙胺、咖啡因等)的作用。正常人服用柴胡粗制剂后也可出现嗜睡等中枢抑制现象。

柴胡煎剂、柴胡皂苷对多种实验性疼痛模型动物(小鼠尾压刺激法、热板法、醋酸扭体法等)呈现镇痛作用,可提高实验动物的痛阈。

柴胡、柴胡粗皂苷、柴胡皂苷元、柴胡总皂苷均有较好的镇咳作用。柴胡总皂苷的镇咳强度略低于可待因。

(5) 促进免疫功能:柴胡多糖、柴胡水提取物(高分子组分)等能促进免疫功能。柴胡多糖可增强巨噬细胞吞噬功能,增强自然杀伤细胞的功能,提高病毒特异抗体滴度,提高淋巴细胞转化率和皮肤迟发型超敏反应。

(6) 保肝、利胆、降血脂:柴胡、柴胡皂苷对多种原因(四氯化碳、乙醇、伤寒疫苗、卵黄、D-半乳

糖胺及 $\alpha$ -萘硫氰酸酯等)所致动物实验性肝损伤有一定的保护作用,能使血清丙氨酸转氨酶(ALT)和门冬氨酸转氨酶(AST)的活性降低,肝糖元和肝蛋白含量增加,肝细胞的损伤减轻,能促进肝功能恢复。柴胡的保肝机制与多环节有关:柴胡皂苷对生物膜(如线粒体膜)有直接保护作用;柴胡皂苷能促进脑垂体分泌ACTH,进而升高血浆皮质醇,并能拮抗外源性垂体激素对肾上腺的萎缩作用,提高机体对非特异性刺激的抵抗力。

柴胡水浸剂和煎剂有明显的利胆作用,能使实验动物胆汁排出量增加,使胆汁中的胆酸、胆色素和胆固醇浓度降低。醋炙柴胡利胆作用最强。利胆成分可能是所含的黄酮类物质。

柴胡对正常动物的血脂水平无明显影响,但柴胡皂苷能使实验性高脂血症动物的胆固醇、三酰甘油和磷脂水平降低,其中以三酰甘油的降低尤为显著,柴胡降血脂作用可抑制脂肪肝的形成和发展。柴胡能加速 $^{14}\text{C}$ -胆固醇及其代谢产物从粪便排泄,可能是影响脂质代谢的主要环节。

(7) 对内脏平滑肌的作用:柴胡总皂苷可明显增强乙酰胆碱对豚鼠、家兔离体肠肌的收缩作用,而其复方制剂又可对抗乙酰胆碱、氯化钡、组胺等所致的肠肌痉挛。柴胡粗皂苷、柴胡多糖对多种实验性胃黏膜损伤模型有保护作用。

综上所述,与柴胡和解表里功效相关的药理作用是解热、抗病原微生物、抗炎、促进免疫功能作用;与柴胡疏肝解郁功效相关的药理作用是保肝、利胆、降血脂、镇静、镇痛作用;与柴胡升举阳气功效相关的药理作用是对内脏平滑肌的兴奋作用。主要有效成分是柴胡皂苷、挥发油和多糖。

### 【现代应用】

1. 发热 柴胡注射液、柴胡口服液、柴胡糖浆对普通感冒、流感、肺炎、支气管炎、扁桃体炎、疟疾等引起的发热均有较好的解热作用,柴胡注射液给小儿滴鼻解热疗效高。

2. 病毒性肝炎 柴胡注射液或复方柴胡制剂(如小柴胡汤)治疗急慢性肝炎,对改善症状,回缩肝脾,恢复肝功能有较好效果。

3. 高脂血症 柴胡注射液肌内注射可明显降低三酰甘油。

4. 流行性腮腺炎 柴胡注射液肌内注射疗效较好。

5. 咳嗽 柴胡、柴胡注射液、柴胡镇咳片治疗感冒、急慢性支气管炎、肺炎所致的咳嗽有效。

此外,柴胡及柴胡注射液对单孢病毒性角膜炎,急性胰腺炎,多形红斑,扁平疣,寻常疣等均有一定疗效。

## 葛 根

本品为豆科植物野葛 *Pueraria lobata* (Willd.) Ohwi. 或甘葛藤 *P. thomsonii* Benth. 的干燥根。其成分主要为黄酮类化合物,含量为0.06%~12.30%,有大豆苷(daidzin, 黄豆苷)、大豆苷元(daidzein, 黄豆素)、葛根素(puerarin)等。葛根味甘、辛,性凉。归脾、胃经。

### 【药理作用】

1. 与功效主治相关的药理作用 葛根具有升阳解肌、透疹止泻、除烦止渴之功效。主治外感发热头痛,项背强痛,口渴,麻疹不透,热痢,泄泻。

(1) 解热:葛根煎剂、乙醇浸膏、葛根素等对实验性发热动物均有解热作用,其所含黄酮类物质是其解热作用的成分。其解热机制可能与扩张皮肤血管、促进血液循环而增加散热有关。

(2) 降血糖、降血脂:葛根煎剂有轻度降血糖作用。葛根素给四氧嘧啶性高血糖小鼠灌胃,可使血糖降低,并能改善糖耐量;葛根素注射给药可明显降低血清胆固醇。对大鼠饮酒所致血清载脂蛋白 $\text{A}_1$ ( $\text{APOA}_1$ )降低及三酰甘油升高,葛根口服液有显著对抗作用。

2. 其他药理作用:葛根具有良好的活血通脉功效,为治疗心脑血管系统疾病的常用药物。

(1) 抗心肌缺血:葛根素有类似 $\beta$ 受体阻断剂作用,给麻醉犬静脉注射后,可使心率明显减慢,心输出量减少;能使正常和痉挛状态的冠脉扩张,增加冠脉血流量;改善心电图缺血反应。葛根黄酮能对抗垂体后叶素引发的动物心肌缺血,对缺血心肌及缺血再灌注心肌有保护作用,可减少心肌乳酸生成,降低耗氧量和肌酸激酶释放量,保护心肌超微结构。

(2) 抗心律失常:葛根乙醇提取物、黄豆苷元灌胃后能明显对抗氯化钡、乌头碱所致大鼠心律失常,预防氯化钙所致的大鼠心室纤颤,并减少氯仿所致小鼠室颤发生率,缩短大鼠结扎冠脉后室颤发作时间。葛根素灌胃及静脉注射能明显对抗乌头碱、氯化钡所致心律失常,静脉注射后可明显延长心肌动作电位时程及有效不应期。葛根素静脉注射能显著对抗氯仿-肾上腺素诱发的兔心律失常,提高哇巴因所致豚鼠室性期前收缩、室性心动过速的阈值,对室颤阈值也有提高作用。葛根抗心律失常机制可能通过影响心肌细胞膜对 $K^+$ 、 $Na^+$ 、 $Ca^{2+}$ 的通透性,进而降低心肌兴奋性、自律性及传导性,也与 $\beta$ 受体阻断效应有关。

(3) 扩张外周血管、降低血压:葛根素、葛根总黄酮静脉注射后,对犬外周血管具有一定的扩张作用,可引起血压下降,对高血压模型大鼠也有降压作用。葛根素、大豆苷元能降低血浆肾素和血管紧张素水平,减少血浆儿茶酚胺含量。其降压机制可能与 $\beta$ 受体阻断效应和抑制肾素-血管紧张素系统有关。

(4) 扩张脑血管、改善脑循环:葛根总黄酮、葛根素给麻醉犬注射用药可使脑血管扩张,脑血流量增加,脑循环改善。葛根能减弱乙酰甲胆碱所致的脑内动脉扩张和去甲肾上腺素所致的脑动脉血管收缩,使处于异常状态的脑血管功能恢复至正常水平。葛根素静脉注射对去甲肾上腺素引起的微循环障碍具有对抗作用,可加快血流速度。

(5) 改善血液流变性和抗血栓形成:动物灌服葛根总黄酮能降低全血黏度和血小板黏附率。葛根素能抑制二磷酸腺苷(ADP)诱导的人及动物血小板聚集。明显抑制ADP诱导的体内血栓形成。

此外,葛根总黄酮、葛根素有抗氧化作用;葛根总黄酮、葛根素、大豆苷元、多糖等显示有抗实验性肿瘤的作用。

综上所述,与葛根解肌退热、除烦止渴功效相关的作用是扩张血管、促进血液循环、解热、降血糖、降血脂等;其对心脑血管系统等作用则反应活血通脉功效。葛根主要有效成分是葛根黄酮。

### 【现代应用】

1. 偏头痛 葛根片口服有效。

2. 突发性耳聋 口服葛根片或葛根乙醇提取物片,葛根总黄酮肌内注射或葛根素静脉注射均有较好效果。

3. 冠心病、心绞痛 可静脉滴注或静脉注射葛根素。葛根片或葛根复方制剂口服,有较好治疗效果。

4. 原发性高血压 用葛根片治疗伴有项强劲痛的原发性高血压,可明显改善症状。

5. 感冒、头痛、发热 常用葛根复方制剂(如葛根汤、桂枝加葛根汤等)。

6. 麻疹初起、发热、疹出不畅 用升麻葛根汤治疗。

此外,葛根素对糖尿病、脑血栓形成、青光眼、视神经损伤。葛根及其复方制剂对颈椎病、软组织损伤等均有一定的治疗效果。

### 【制剂与用法】

1. 盐酸麻黄碱片剂 口服,25mg/次,3次/日。注射剂:皮下或肌内注射,15~30mg/次。极量:口服、皮下或肌内注射,60mg/次,150mg/日。滴鼻剂:成人用1%浓度,每侧3~4滴/次,