

葛根

的药理作用 与临床应用

主编 姚崇舜



GEGEN DE
YAOLI ZUOYONG
YU LINCHUANG YINGYONG



人民軍醫出版社

PEOPLE'S MILITARY MEDICAL PRESS

葛根的药理作用与 临床应用

GEGEN DE YAOLI ZUOYONG YU LINCHUANG YINGYONG

主 编 姚崇舜



人民军医出版社

PEOPLE'S MILITARY MEDICAL PRESS

京

图书在版编目(CIP)数据

葛根的药理作用与临床应用/姚崇舜主编. —北京:人民军医出版社, 2014.4

ISBN 978-7-5091-7413-5

I. ①葛… II. ①姚… III. ①葛根—研究 IV. ①R282.71

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2014)第 046099 号

策划编辑:高玉婷 文字编辑:许泽平 黄维佳 责任审读:杜云祥

出版发行:人民军医出版社

经销:新华书店

通信地址:北京市 100036 信箱 188 分箱

邮编:100036

质量反馈电话:(010)51927290;(010)51927283

邮购电话:(010)51927252

策划编辑电话:(010)51927300—8020

网址:www.pmmp.com.cn

印刷:北京天宇星印刷厂 装订:京兰装订有限公司

开本:850mm×1168mm 1/32

印张:7 字数:170 千字

版、印次:2014 年 4 月第 1 版第 1 次印刷

印数:0001—2500

定价:25.00 元

版权所有 侵权必究

购买本社图书,凡有缺、倒、脱页者,本社负责调换



主编简介

姚崇舜,女,1930年6月生,吉林省长春市人。高级工程师。毕业于沈阳药学院。曾任沈阳药科大学科研处制剂研究室主任。在教学工作中先后担任过本科药剂学讲课、实验、生产实习及专题作业等教学工作。自1970年以来曾担任过抗肿瘤药、抗病毒药、烧伤药及妇科药等的研究及攻关项目的研究及开发工作。先后曾发表过抗肿瘤新药——鸦胆子油静脉乳剂的研究及药代动力学的有关报道数篇;抗病毒新药——莪术油葡萄糖注射液的研究及稳定性考察、5-FU乳剂的稳定性考察等论文,并开发出具地方标准及国家级新药的有月见草油口服乳剂、莪术油葡萄糖注射液、洗必泰(氯己定)栓、保妇康栓、鸦胆子油静脉乳及口服乳及安瘤乳等七个新药,广泛用于临床并为厂家创收较大的经济效益。洗必泰(氯己定)栓及安瘤乳曾获沈阳市科技三等奖;鸦胆子油静脉乳曾获广东省及辽宁省科技进步二等奖。于1988年获沈阳市政府有突出贡献的科技、管理人员荣誉证书奖。被选入1996—1997年《国际妇女名人录》。



内 容 提 要

本书介绍了有关葛根种植、采收、生药学特征、提取生产、化学成分、质量控制、营养价值、药理活性、临床应用、传统制剂及新剂型和新制剂、化学结构改造及修饰等方面的最新研究成果和进展,是编者根据多年积累的理论和实践经验,并参考大量相关文献精心编撰而成的,其内容全面、系统、详尽,可作为从事葛根及其制剂的生产经营、临床使用、科学研究的相关人员和中医药院校师生的辅助教材,对相关专业硕士研究生的培养也具有一定的参考价值。



编写人员名单

- 主 编 姚崇舜 沈阳药科大学
- 副 主 编 王淑君 沈阳药科大学
- 孙 进 沈阳药科大学
- 编委会秘书 王文字 辽宁省药物研究院
- 张大威 广东医学院
- 编 者 (以姓氏笔画为序)
- 王文字 辽宁省药械审评与监测中心
- 王丽君 沈阳中海生物技术开发公司
- 王淑君 沈阳药科大学
- 孔令辉 美国新泽西州 08540, 普林斯顿卡内基中心 302, Akros Pharma 公司
- 叶丽卡 广州医科大学附属第二医院
- 史冠君 广州杏林春凉茶有限公司
- 刘均达 解放军第 463 医院
- 汤 洁 中国人民解放军第二〇二医院
- 许 磊 国家知识产权局专利局医药生物发明审查部
- 孙 进 沈阳药科大学
- 张 蜀 广东药学院
- 张大威 广东医学院
- 项 琪 广东暨南大学生物医药研发中心
- 姜铁夫 辽宁蓝天制药有限公司
- 高声传 沈阳军区总医院
- 曾环想 深圳致君制药有限公司



前言

葛根为豆科植物野葛 *Pueraria lobata* (Willd.) Ohwi 或甘葛藤 *Pueraria thomsonii* Benth 的干燥根, 别名野葛、鹿藿、黄斤、野扁葛、葛条、葛藤。葛根在我国有悠久的历史, 连葛藤、葛叶、葛花都有应用之法。葛根性凉、气平、味甘, 具有清热、降火、排毒等多种功效。运用现代科学方法进一步分析表明, 葛根中富含多达 13 种异黄酮类物质, 其中的主要成分葛根素对高血压、高血脂、高血糖和心脑血管疾病均有疗效; 葛根具有抗氧化作用, 可改善机体免疫力; 对血糖及血压有双向调节作用, 可改善微循环, 具有提高学习记忆的功能, 有抗肿瘤的作用, 还能降低血液中的乙醇浓度, 有解酒作用等。

近年来, 葛根的相关制剂产品在临床上得到了广泛使用, 特别是葛根素注射液在临床上已被广泛应用于心脑血管系统疾病, 如心绞痛、心肌梗死、心律失常、冠状动脉硬化性心脏病(简称“冠心病”)、心力衰竭、椎-基底动脉供血不足、高黏血症、高血压、脑血栓、脑水肿等; 糖尿病; 眼底疾病, 如视网膜动脉栓塞、单纯性青光眼; 突发性聋; 急性酒精中毒; 拟菊酯类农药中毒及肿瘤的治疗。另外, 与单用法莫替丁、阿莫西林及氧氟沙星相比, 将葛根素与这三种药物联用治疗十二指肠溃疡, 溃疡愈合率有显著提高, 其临床应用潜力不断被开发出来。此外, 鉴于葛根大豆苷元(daidzein)具有增强冠状动脉及外周血管流量、促进脑部微循环、抗氧化活性和抗心肌缺氧等良好作用, 但是葛根大豆苷元是异黄酮结构, 在空间上为平板结构, 联结紧密; 而且, 其在 7 位、4' 位有二酚羟基, 可形成分子间氢键。因此, 由于晶格的排列、氢键的形成等使分子间作用力大, 熔点高, 脂溶性和水溶性均差, 导致难于制备

成注射剂且口服吸收差,生物利用度低。为了提高其临床疗效,对葛根大豆苷元进行结构改造及构效关系的研究正方兴未艾,发现许多具有良好药理活性的葛根大豆苷元衍生物,改变其理化性质,扩大应用范围,同时增强其活性。

本书是编者根据多年积累的理论知识和实践经验,并参考大量相关文献精心编撰而成的,内容全面、系统、详尽,可作为从事葛根及其制剂的生产经营、临床使用、科学研究的相关人员和中医药院校师生的辅助教材,对相关专业硕士研究生的培养也具有一定的参考价值。

最后,衷心感谢参加本书写作的各位同仁,正是由于他们的深刻见解、艰辛劳动和共同努力才使得本书顺利出版。由于编者水平所限,经验不足,书中可能存在错漏之处,恳请读者批评指正。

姚崇舜

2014年1月



目 录

第 1 章 葛根的基原及分布	(1)
一、葛根的本草考证	(1)
二、野生资源的生长环境及其产地分布	(2)
第 2 章 葛根的生物学特点及生药学鉴别	(3)
一、葛根的生长习性及种类	(3)
二、葛根的植物形态及药材性状	(4)
三、葛根的生物学特性	(5)
四、葛根的生药学鉴别	(6)
(一)性状鉴别	(6)
(二)显微鉴别	(6)
(三)理化鉴别	(7)
(四)伪品鉴别	(8)
第 3 章 葛根栽培、采制及加工	(10)
一、葛根的栽培技术	(10)
(一)繁殖方法	(10)
(二)田间管理	(11)
二、葛根的采集和加工方法	(11)
(一)采集	(11)
(二)加工及炮制	(12)
第 4 章 葛根的化学成分研究	(13)
一、葛根的主要化学成分	(13)



(一)葛根的异黄酮类成分	(13)
(二)葛根的三萜及甾体类成分	(14)
(三)葛根的其他化学成分	(15)
二、主要化学成分分析	(16)
(一)葛根中异黄酮类成分的含量分析	(16)
(二)葛根中三萜类化合物的含量分析	(17)
(三)葛根中其他成分的含量分析	(17)
第5章 葛根的营养价值及适用人群	(19)
一、葛根的营养价值、食疗功效及食用建议	(19)
(一)葛根的营养价值	(19)
(二)葛根的食疗功效	(21)
(三)食用建议	(26)
二、葛根的适宜人群	(30)
第6章 葛根的药理活性研究	(31)
一、葛根对心血管系统的作用	(31)
(一)降低血压、减慢心率、降低心肌耗氧量	(31)
(二)抗心律失常作用	(32)
(三)扩张冠状血管作用	(34)
(四)对心肌的作用	(35)
(五)对脑循环的影响	(35)
(六)对微循环的影响	(36)
(七)对血液流变学的影响	(36)
(八)抑制血小板聚集作用	(37)
二、葛根对中枢神经系统的作用	(37)
三、降血糖及降血脂作用	(38)
(一)降血糖作用	(38)
(二)降血脂作用	(39)



四、葛根的抗氧化作用	(39)
五、葛根的抗肿瘤作用	(41)
六、对糖尿病并发症的作用	(42)
(一)对心血管性并发症的影响	(42)
(二)对糖尿病肾病的影响	(43)
(三)对糖尿病性白内障及视网膜病变的影响	(43)
(四)对周围神经病变的影响	(44)
(五)对其他并发症的影响	(44)
七、抗缺血再灌注损伤作用	(45)
(一)抗脑缺血再灌注损伤	(45)
(二)抗肝缺血再灌注损伤	(45)
(三)抗心肌缺血再灌注损伤	(45)
(四)对机体缺血再灌注损伤的作用	(46)
(五)对兔脊髓缺血再灌注损伤的保护作用	(46)
八、抗炎作用	(47)
九、抗流感作用	(47)
(一)抗病毒作用	(47)
(二)解热作用	(48)
(三)增强免疫力	(48)
十、雌激素样作用	(48)
十一、对学习记忆的影响	(49)
十二、解酒及抗酒精中毒作用	(50)
(一)抑制酒精摄入、减轻戒断症状	(50)
(二)减轻酒精中毒引起的脑组织和肝脏损伤	(51)
十三、其他药理活性	(51)
(一)诱导 CYP ₄₅₀ 作用	(51)
(二)葛根对免疫作用的影响	(51)
(三)增强耐缺氧能力	(52)
(四)促进骨形成	(52)



(五)肝损伤的保护作用	(52)
(六)抗过敏作用	(53)
(七)利尿作用	(53)
(八)抗骨质疏松作用	(53)
(九)葛根素治疗眩晕	(53)
(十)葛根素用于眼科治疗	(54)
(十一)逆转耐药效应	(55)
(十二)治疗突发性聋	(55)
(十三)对抗结核药物性肝炎的作用	(55)
(十四)增强运动能力	(55)
(十五)对脏器的保护作用	(55)
十四、毒性反应	(58)

第7章 葛根的临床应用及不良反应 (59)

一、治疗冠心病心绞痛 (59)

(一)葛根素注射液	(59)
(二)葛根素注射液与丹参酮联用	(60)
(三)葛根素与硝酸甘油注射液联用	(60)
(四)葛根素与洛丁新及生脉注射液联用	(60)
(五)葛根素与辛伐他汀联用	(61)
(六)葛根素注射液与稳心颗粒联用	(61)
(七)葛根素治疗不稳定型心绞痛	(62)
(八)川芎葛根中药制剂	(62)
(九)总结	(63)

二、治疗肺源性心脏病 (63)

(一)葛根素注射液	(63)
(二)葛根素联合肝素	(64)
(三)黄芪联用葛根素	(64)
(四)总结	(65)



三、治疗脑动脉硬化及脑梗死	(65)
(一)脑动脉硬化的治疗	(65)
(二)脑梗死的治疗	(66)
(三)总结	(67)
四、治疗高血压	(68)
(一)治疗原发性高血压	(68)
(二)治疗老年高血压	(68)
(三)治疗妊娠高血压	(69)
(四)围术期葛根素对心肌损伤的保护作用	(70)
(五)对急性高血压脑出血患者神经功能的改善作用	(70)
(六)总结	(71)
五、治疗糖尿病	(72)
(一)糖尿病肾病	(72)
(二)高血压合并糖尿病	(72)
(三)妊娠糖尿病	(73)
(四)湿热证 2 型糖尿病	(73)
(五)常规 2 型糖尿病	(74)
(六)总结	(76)
六、治疗血管神经性头痛	(76)
(一)葛根治疗血管神经性头痛	(76)
(二)葛根全虫汤	(77)
(三)葛根天麻汤	(77)
(四)蝉葛活血汤	(77)
(五)蝉葛芍药汤	(78)
(六)桂枝加葛根汤加味	(78)
(七)柴葛芍药汤配合西药	(79)
(八)总结	(79)
七、治疗病毒性心肌炎	(79)
(一)成人病毒性心肌炎	(79)



(二) 小儿病毒性心肌炎	(83)
(三) 总结	(86)
八、治疗迟发性运动障碍	(87)
(一) 消迟汤	(87)
(二) 桂枝加葛根汤	(87)
(三) 总结	(88)
九、治疗变态反应性皮肤病	(88)
(一) 变态反应性皮肤病	(88)
(二) 其他皮肤病	(88)
(三) 总结	(89)
十、痛风性关节炎	(89)
(一) 葛蚕木瓜汤	(90)
(二) 祛痛消风汤	(90)
(三) 总结	(90)
十一、治疗耳聋	(90)
(一) 神经性聋	(90)
(二) 突发性聋	(91)
(三) 总结	(93)
十二、其他疾病	(93)
(一) 代谢综合征	(93)
(二) 下肢外伤性水肿	(94)
(三) 帕金森综合征	(94)
(四) 慢性咽炎	(95)
(五) 小儿腹泻	(95)
(六) 小儿胃肠型流感	(95)
(七) 颈肩腰腿痛	(96)
(八) 卒中先兆征	(96)
(九) 原发性骨质疏松症	(97)
十三、不良反应	(97)



(一) 葛根素不良反应临床表现	(97)
(二) 葛根素不良反应相关因素	(103)
(三) 葛根素不良反应预防	(103)
(四) 总结	(104)
 第 8 章 葛根传统制剂及其应用	(106)
一、葛根单方制剂	(106)
二、葛根复方制剂	(107)
(一) 汤剂	(107)
(二) 散剂	(117)
(三) 颗粒剂、冲剂	(126)
(四) 片剂	(130)
(五) 胶囊剂	(138)
(六) 合剂、糖浆剂等口服液体制剂	(143)
(七) 丸剂	(147)
(八) 经皮给药制剂	(155)
三、葛花制剂	(156)
 第 9 章 药物新剂型及新技术在葛根研究中的应用 ...	(158)
一、现代中药药物新技术和新剂型与中药制剂现代化 ...	(158)
二、葛根素类新剂型研究进展	(159)
(一) 葛根素注射剂	(159)
(二) 葛根素片剂	(161)
(三) 葛根素滴丸	(162)
(四) 葛根素微乳	(163)
(五) 葛根素磷脂复合物胶囊	(165)
(六) 葛根素磷脂复合物口服制剂	(165)
(七) 葛根素眼用制剂	(166)
(八) 葛根素- β -环糊精包合物	(168)



(九)葛根素固体分散体	(168)
(十)葛根素纳米粒	(168)
(十一)葛根素脂质体	(169)
(十二)葛根素非离子表面活性剂囊泡	(170)
(十三)葛根素胶束	(170)
三、葛根黄酮制剂	(170)
(一)葛根黄酮胶囊	(170)
(二)葛根总黄酮骨架缓释片	(171)
(三)葛根黄酮滴丸	(172)
(四)葛根黄酮微丸	(172)
四、葛根大豆苷元的结构改造	(172)
大豆苷元的合成方法	(172)
 第 10 章 葛根有效成分药动学研究	(175)
一、葛根素的药动学研究	(175)
(一)葛根素在体内的吸收	(175)
(二)葛根素在体内的分布	(176)
(三)葛根素在体内的代谢	(176)
(四)葛根素在体内的排泄	(177)
(五)葛根素的药动学参数	(178)
(六)药物相互作用	(179)
二、大豆苷元的药动学研究	(179)
(一)大豆苷元在体内的吸收	(179)
(二)大豆苷元在体内的分布	(180)
(三)大豆苷元在体内的代谢和排泄	(181)
(四)大豆苷元的药动学参数	(181)
三、葛根单方制剂药动学	(182)
(一)葛根单方制剂	(182)
(二)葛根总黄酮制剂	(183)



(三) 葛根素类制剂	(185)
(四) 大豆苷元制剂	(193)
第 11 章 葛根在复方制剂中的药动学	(194)
一、葛根在复方血塞通滴丸中的药动学	(194)
(一) 体内过程	(194)
(二) 药动学	(194)
二、葛根在复方脑得生片中的药动学	(195)
(一) 体内过程	(195)
(二) 药动学	(195)
三、葛根在葛根芩连汤中的药动学	(195)
四、葛根在金森脑泰注射液(CBN)中的药动学	(197)
(一) 体内过程	(197)
(二) 药动学	(198)
五、葛根在柴葛口服液中的药动学	(198)
六、葛根在丹灯通脑胶囊中的药动学	(199)
(一) 体内过程	(199)
(二) 药动学	(199)
七、葛根在梓葛冻干粉针中的药动学	(200)
附录 葛根相关已授权的专利	(202)
编后记	(206)