



21世纪高职高专教材

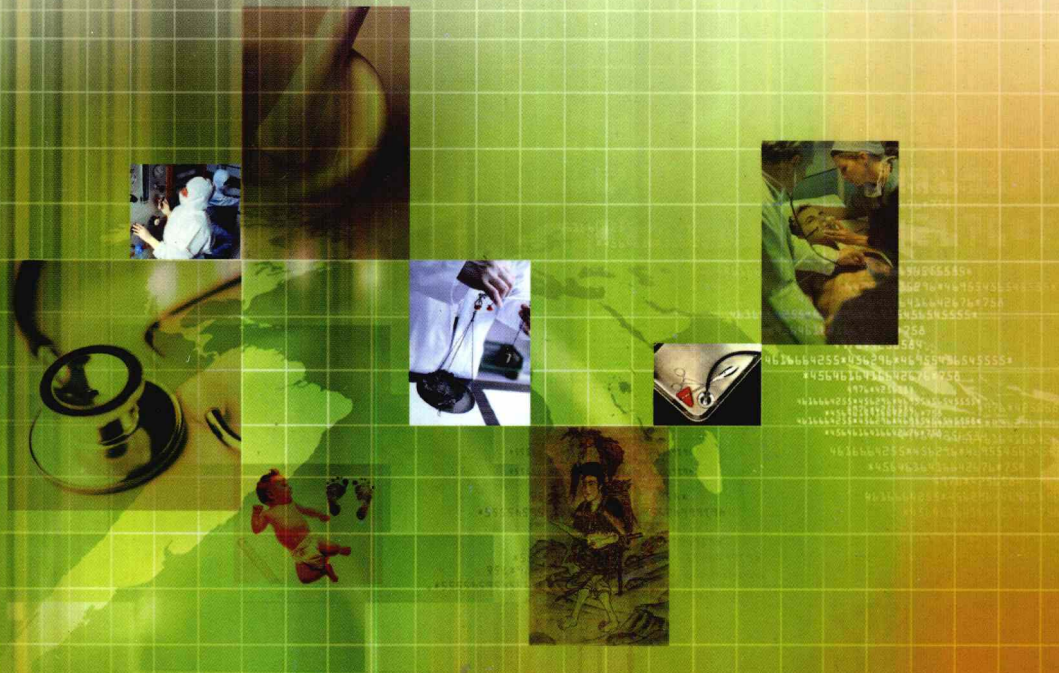
供中药学和药学类专业用

中药药理学

南京中医药大学
广州中医药大学

方泰惠
吴清和

主编 ●



科学出版社
www.sciencepress.com

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>

丽源印刷厂 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〈新欣〉)

《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

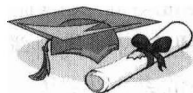
目 录

前言	
第1章 总论	(1)
第1节 中药药理学的研究内容和学科任务	(1)
一、中药药理学的基本概念及其研究内容	(1)
二、中药药理学学科任务	(2)
第2节 中药药理学发展简史	(2)
第3节 中药药性理论的现代研究	(3)
一、中药的四性(四气)	(3)
二、中药的五味	(5)
三、中药的升降浮沉	(6)
四、中药的归经	(6)
五、中药的有毒和无毒	(7)
六、中药的配伍与禁忌	(9)
第4节 影响中药药理作用的因素	(11)
一、药物因素	(11)
二、机体因素	(14)
三、环境因素	(15)
第2章 解表药	(17)
第1节 概述	(17)
第2节 常用药物	(19)
麻黄	(19)
桂枝	(21)
柴胡	(22)
葛根	(23)
第3章 清热药	(26)
第1节 概述	(26)
第2节 常用药物	(28)
黄芩	(28)
黄连	(31)
苦参	(34)
金银花	(36)
大青叶	(38)
板蓝根	(39)
穿心莲	(40)
山豆根	(42)
第4章 泻下药	(46)
第1节 概述	(46)
第2节 常用药物	(48)
大黄	(48)
芒硝	(51)
番泻叶	(52)
第5章 祛风湿药	(55)
第1节 概述	(55)
第2节 常用药物	(57)
雷公藤	(57)
防己	(60)
秦艽	(61)
第6章 芳香化湿药	(64)
第1节 概述	(64)
第2节 常用药物	(65)
厚朴	(65)
广藿香	(67)
苍术	(68)
第7章 利水渗湿药	(71)
第1节 概述	(71)
第2节 常用药物	(72)
茯苓	(72)
泽泻	(73)
茵陈蒿	(74)
第8章 温里药	(77)
第1节 概述	(77)
第2节 常用药物	(79)
附子	(79)
干姜	(81)
肉桂	(82)
第9章 理气药	(85)
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)
第10章 消食药	(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)	第16章 开窍药	(152)
神曲	(98)	第1节 概述	(152)
鸡内金	(99)	第2节 常用药物	(153)
第11章 止血药	(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)	第17章 补虚药	(163)
第12章 活血化瘀药	(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)
第13章 化痰止咳平喘药	(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)	第18章 收涩药	(182)
苦杏仁	(132)	第1节 概述	(182)
天南星	(134)	第2节 常用药物	(184)
第14章 安神药	(137)	五味子	(184)
第1节 概述	(137)	罂粟壳	(186)
第2节 常用药物	(138)	第19章 外用和驱虫药	(189)
酸枣仁	(138)	第1节 外用	(189)
朱砂	(140)	第2节 驱虫药	(191)
第15章 平肝熄风药	(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程,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(辛福林)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莪术、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 β -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- β 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- β 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 β -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 β 受体的最大结合点位数值均显著升高,M受体的变化与 β 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 β 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(Na^+ , 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 T_3 和 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。显示出止泻、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 β_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,是难以预料的不利反应。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 α -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期兔死胎显著增加,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LD₅₀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-甲氧基-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。