

## 祛風濕藥

### 祛風濕藥概述

- 祛除風濕、解除痺痛為主要功效的藥物。
- 均能祛風散寒除濕，部分藥能舒筋活絡、止痛、強筋骨。
- 分為祛風濕散寒藥、祛風濕清熱藥和祛風濕強筋骨藥三類。
- 臨床主要用於治療痺證。

### 痺證

- 病因
  - 機體正氣不足時感受風寒濕邪，流注經絡關節，
  - 感受風濕熱之邪，或風寒濕邪外侵，郁久化熱，以致風濕熱邪痺阻經絡關節。
  - 痰濁瘀血、脾失運化、七情郁結、氣滯血瘀、阻止脈絡。
  - 痺證的發病部位主要在肌肉、經絡、關節。
- 主要臨床表現：骨、關節、韌帶、滑囊、筋脈疼痛，關節腫脹、變形、運動障礙，
- 臨床特徵類似現代醫學的結締組織疾病、自身免疫性疾病、骨與骨關節病及軟組織疾病等，如風濕熱、風濕性關節炎、類風濕性關節炎、硬皮病、系統性紅斑狼瘡、強直性脊柱炎、慢性纖維組織炎等，
- 機體免疫功能異常、內分泌功能紊亂以及感染是該類疾病的主要發病因素。

### 祛風濕藥主要藥理作用

### 抗發炎

- 對多種實驗性慢性炎症模型均有不同程度的抑制作用。
- 秦艽、獨活、雷公藤、五加皮、防己、稀莖草、臭梧桐和有效成分：
  - 明顯抑制角叉菜膠、雞蛋清、甲醛所致大鼠急性足腫脹和二甲苯所致小鼠急性耳廓腫脹，使腫脹度減輕，
  - 抑制醋酸所致小鼠腹腔毛細血管通透性增高和組織胺所致大鼠毛細血管通透性增加，從而使炎性滲出減少。
- 五加皮、雷公藤：
  - 顯著抑制大鼠炎性棉球肉芽的增生，使肉芽重量減輕。
- 雷公藤、五加皮、防己：
  - 對佐劑性關節炎有明顯抑制作用。

### 具抗發炎作用的主要有效成分

- 秦艽鹼甲、
- 清風藤鹼、
- 粉防己鹼、
- 甲氧基歐芹酚、
- 雷公藤總苷、
- 雷公藤內酯。

- 秦艽、五加皮和雷公藤及其有效成分的抗發炎作用與興奮腦下垂體-腎上腺皮質系統功能有關。
- 秦艽鹼甲的抗發炎作用在切除腦下垂體或用麻醉藥抑制中樞後消失：
  - 可能透過興奮下視丘一腦下垂體，使ACTH分泌增多，從而增強腎上腺皮質功能，使腎上腺皮質激素合成釋放增加而產生抗發炎作用。
- 粉防己鹼：
  - 直接作用於腎上腺，產生促皮質激素樣作用。
  - 抑制炎症細胞磷脂酶A2(Phospholipase A2)的活性，從而減少炎症介質的產生和釋放。
- 雷公藤內酯、雷公藤甲素可明顯抑制紅血球膜破裂，雷公藤紅素抑制細胞釋放PGE2，均與其抗發炎作用有關。

## 2. 鎮痛

- 川烏、青風藤、獨活、秦艽、五加皮、防己：
  - 可提高動物熱刺激、電刺激、化學刺激所致的痛閾，
  - 可減少1%醋酸所致小鼠扭體次數。
- 青風藤鹼和烏頭鹼的鎮痛部位在中樞神經系統，可能與去甲腎上腺素能系統或阿片能系統有關。

## 3. 對免疫功能的影響

- 雷公藤、五加皮、獨活、稀莖草、青風藤對機體免疫功能有明顯抑制作用。
- 雷公藤成分雷公藤總苷、雷公藤甲素、雷公藤紅素、雷公藤內酯等，對非特异性免疫功能及特异性免疫功能均有明顯抑制作用。
  - 雷公藤甲素能抑制NK細胞活性，並能抑制抗體形成細胞的產生。
  - 雷公藤總苷可部分抑制非同種移植時抗宿主反應。
  - 雷公藤使類風濕性關節炎病患血清中IgG、IgA和IgM濃度明顯下降。
- 粉防己鹼能顯著抑制PHA、ConA等誘導的人外周血淋巴細胞轉化，也能抑制抗體形成，其免疫抑制作用可能與鈣通道阻滯有關。
- 對免疫功能有促進作用成分，
  - 細柱五加總皂苷和多糖可提升小鼠網狀內皮系統的吞噬功能和小鼠血清抗體滴度。

## 綜述

- 與祛除風濕、解除痺痛功效相關的藥理作用：
  - 抗發炎、鎮痛、抑制機體免疫功能，從而改善痺證的臨床症狀，延緩病程的發展。

## 秦艽

- 龍胆科植物秦艽*Gentiana macrophylla* Pall.、麻花秦艽*G. straminea* Maxim.、粗莖秦艽*G. crassicaulis* Duthie ex Burk或小秦艽*G. dahurica* Fisch.的乾燥根。
- 主要成分：
  - 龍胆苦苷(gentiopicroside)，在提取過程中遇氨轉變成生物鹼，有秦艽鹼甲(即龍胆鹼gentianine)、秦艽鹼乙(即龍胆次鹼gentianine)、秦艽鹼丙(gentianal)。
  - 揮發油和糖類。
- 味辛、苦、平，性微寒。歸胃、肝、胆經。

## 與功效主治相關的藥理作用

- 功效：祛風濕，清濕熱，止痺痛，
- 主治：風濕痺痛，筋脈拘攣，骨節酸痛，骨蒸潮熱，小兒療積發熱。
- 神農本草經：主寒熱邪氣，寒濕風痺肢節痛，下水利小便。
- 名醫別錄：療風，無問久新，通身攣急。

### (1) 抗發炎

- 秦艽水提取物、醇提取物灌胃給藥：
  - 明顯抑制角叉菜膠所致大鼠足趾腫脹，
  - 明顯抑制巴豆油引起的小鼠耳腫脹，
  - 醇提物比水提物作用稍強。
- 粗莖秦艽的抗發炎作用較強。
- 抗發炎的主要有效成分為秦艽鹼甲，90 mg/kg腹腔注射對大鼠甲醛性關節炎的抑制作用強度與水楊酸鈉200 mg/kg相似。
- 染料滲出法研究顯示，大鼠腹腔注射秦艽鹼甲能明顯降低因注射蛋清而引起的毛細血管通透性增高。

#### - 秦艽鹼甲：

- 能使大鼠腎上腺內維生素C含量明顯下降，維生素C為合成腎上腺皮質激素的前體之一，其含量的下降說明皮質激素的合成增多。
  - 對於切除腦下垂體或戊巴比妥鈉麻醉的大鼠則該作用消失，
- 表明秦艽鹼甲抗發炎作用是透過興奮下視丘-腦下垂體，使ACTH分泌增多，從而增強腎上腺皮質功能實現的。
- 側鏈上的雙鍵是抗發炎作用必要的架構，加氫飽和後則無抗發炎作用。

### (2) 鎮痛

- 秦艽水提物和醇提物口服給藥：
  - 明顯抑制腹腔注射醋酸所致小鼠扭體反應，且隨劑量增加，鎮痛作用增強，最高抑制率達54.9%。
- 秦艽及秦艽鹼甲：
  - 可明顯降低熱板或光熱刺激所致小鼠和大鼠的疼痛反應，使痛閾提升，但作用持續時間短暫，
  - 與延胡索和草烏配伍可增強其鎮痛作用。

- 3) 抗過敏：秦艽鹼甲能明顯減輕豚鼠因組織胺噴霧引起的哮喘、抽搐，對組織胺所致的豚鼠休克有保護作用，並能對抗組織胺和乙醯膽鹼引起的豚鼠離體回腸收縮作用。
- 4) 秦艽鹼甲鎮靜、解熱：
  - 1) 小劑量有鎮靜作用，能顯著延長戊巴比妥鈉所致大鼠、小鼠的睡眠時間，
  - 2) 但較大劑量可引起小鼠中樞興奮，最後導致麻痺而死亡。
  - 3) 對酵母所致大鼠發熱有解熱作用。

#### 5) 抗菌：體外試驗表明，

- 秦艽醇浸液對弗氏痢疾桿菌、流感桿菌、金黃色葡萄球菌、志賀氏痢疾桿菌、肺炎桿菌、副傷寒桿菌、霍亂弧菌、炭疽桿菌等有抑制作用。
  - 水浸液(1:3)在試管內對堇色毛癬菌及同心性毛癬菌等皮膚真菌有不同程度的抑制作用。
- 6) 利尿：秦艽水煎劑家兔灌胃給藥有一定利尿作用，並能促進尿酸排泄。

## 2. 其他藥理作用

### (1) 升高血糖

#### 1. 秦艽鹼甲

- 大鼠腹腔給藥，30分鐘後血糖顯著升高，作用維持約3小時，同時肝糖原顯著降低。
- 切除雙側腎上腺後給藥，動物不出現血糖升高作用，
- 說明秦艽鹼甲是透過促進腎上腺素的釋放而產生升高血糖的作用。

### (2) 降血壓

#### - 秦艽鹼甲

- 對麻醉犬、兔靜脈注射有降血壓作用，持續時間較短，同時心率減慢，
- 阿托品及切除迷走神經對其無明顯影響，故與迷走神經無關。

### (3) 保肝、利胆

#### - 龍胆苦苷

- 30-60 mg/kg 連續給藥5天，對小鼠CCI4肝損傷模型和脂多糖/芽孢桿菌(LPS/BCG)肝損傷模型均有保護作用，可使血清ALT和AST降低。
- 在LPS/BCG模型中，腫瘤壞死因子(TNF)隨ALT活性增強而濃度增加，龍胆苦苷治療後，血清中TNF濃度顯著下降，可能為其抗肝損傷作用的原因之一。
- 有利胆作用。

### 綜述

- 與秦艽祛風濕、清濕熱、止痺痛的功效相關的藥理作用為抗發炎、鎮痛、抗過敏、鎮靜解熱、抗菌利尿等作用。
- 主要有效成分是秦艽鹼甲等生物鹼。

### 現代應用

1. 風濕性關節炎和類風濕性關節炎：
  1. 含秦艽鹼甲可減輕疼痛、腫脹。
  2. 臨床常與威靈仙、桑枝、羌活等配伍應用。
2. 流行性腦脊髓膜炎。
3. 肩關節周圍炎。
4. 小兒急性黃疸型傳染性肝炎。

### 不良反應

#### - 秦艽鹼甲：

- 小鼠：
  - 口服LD<sub>50</sub>為480±6.7 mg/kg，
  - 腹腔注射LD<sub>50</sub>為350±12.3 mg/kg。
- 大鼠灌胃420~520 mg/kg，犬灌服2240 mg/kg或靜脈注射80 mg/kg，貓和猴灌服100 mg/kg，每日1次，連續3日，均未發現明顯不良反應。
- 口服治療風濕性關節炎，病患出現噁心、嘔吐，心悸，心率減慢等反應。

### 獨活

- 傘形科植物重齒毛當歸 *Angelica pubescens* Maxim. f. *biserrata* shan et Yuan 的乾燥根。
- 主要化學成分：
  - 香豆素：東莨菪素 (Scopoletin)、二氫歐山芹醇 (columbianetin)、二氫歐山芹醇乙酸酯 (columbianetin)、花椒毒素 (xanthotoxin)、甲氧基歐芹酚 (osthol)、二氫歐山芹素 (columbianadin)、歐芹酚甲醚等。
  - 揮發油：主要成分有 $\alpha$ -蒎烯 ( $\alpha$ -pinene) 和 L-檸檬烯。
  - $\gamma$ -氨基丁酸、當歸酸等。
- 味辛、苦，性微溫。歸腎、膀胱經。

### 與功效主治相關的藥理作用

- 功效：祛風除濕，通痺止痛。
- 主治：風寒濕痺，腰膝疼痛，少陰伏風頭痛。
- 本草求真：獨活……凡因風於足少陰腎經，伏而不出，發為頭痛，則能善搜而治矣，以故兩足濕痺，不能動履，非此莫痊，風毒齒痛，頭眩目暈，非此莫攻。
- 本草正義：獨活氣味雄烈，芳香四溢，故能宣通百脈，調和經絡。

### (1) 抗發炎

- 甲氧基歐芹酚：
  - 腹腔給藥可抑制角叉菜膠所致大鼠足腫脹，抑制率為63.3%，
  - 50 mg/kg 抑制作用強於10 mg/kg 消炎痛 (indomethacin)。

### (2) 鎮痛、鎮靜

- 小鼠熱板法實驗證明獨活煎劑可明顯提升痛閾。
- 甲氧基歐芹酚腹腔注射可減輕小鼠扭體反應，疼痛抑制百分率為61.2%。
- 獨活煎劑、醇浸膏均表現為鎮靜作用，可使小鼠、大鼠自主活動減少，也可對抗士的寧所致蛙的驚厥作用。
- 當歸酸、傘形花內酯有明顯鎮靜作用，為其鎮靜作用主要有效成分。

### (3) 抑制血小板聚集和抗血栓形成

- 獨活醇提物0.4 g/kg：
  - 可明顯抑制大鼠動靜脈環路血栓的形成，使血栓重量減輕，抑制率為38.4%，
  - 可抑制大鼠體外血栓形成，使血栓重量減輕，血栓長度縮短，並延長特異性血栓形成時間。
- 獨活水浸出物、乙醇浸出物、甲醇浸出物對ADP誘導的大鼠及家兔血小板聚集有明顯抑制作用，
  - 其有效成分為二氫歐山芹醇、二氫歐山芹醇乙酸酯、二氫歐山芹素、歐芹酚甲醚，其抑制率分別在20~50%範圍內。
- 獨活抑制血小板聚集的作用是其抗血栓形成的主要關鍵。

## 2. 其他藥理作用

### (1)對心血管系統作用

- 歐芹酚甲醚：

- 具擴血管、降血壓作用，可使貓動脈血壓降低30%，持續1-2小時。

-  $\gamma$ -氨基丁酸：

- 可對抗多種實驗性心律不整，延遲室性心動過速的發生，降低室性心搏過速的發生率和縮短持續時間。

- 心室肌灌注 $\gamma$ -氨基丁酸後5分鐘，心室肌動作電位的振幅減少，動作電位時程縮短。

- 獨活能抑制血管緊張素II受體(angiotensin II)和 $\alpha$ -腎上腺素受體，可能與其降血壓和抗心律不整作用有關。

2) 抗腫瘤：

1) 東莨菪素對化學物質所致大鼠乳腺腫瘤有抑制作用，

2) 花椒毒素、佛手柑內酯等對艾氏腹水癌細胞有殺滅作用。

3) 解痙作用：獨活揮發油：

1) 對離體豚鼠回腸有解痙作用，可明顯抑制組織胺和乙酰膽鹼所致腸肌痙攣，並且有劑量倚賴性。

2) 對在體和離體大鼠子宮痙攣也有解痙作用。

4) 抗潰瘍、抗菌和提升機體免疫功能的作用。

### 綜述

- 祛風除濕，通痺止痛功效相關的藥理作用為抗發炎、鎮痛、鎮靜作用，

- 舒筋活血，宣通百脈功效與其抑制血小板聚集、抗血栓形成作用有關。

### 現代應用

1. 風濕性關節炎：獨活寄生湯加減治療風濕性。
2. 坐骨神經痛和三叉神經痛：
  1. 獨活寄生湯及其加減方治療。
  2. 循經按摩配合獨活寄生湯可治療三叉神經痛。
3. 腰椎間盤突出症及腰椎骨質疏鬆症。
4. 慢性支氣管炎：獨活紅糖水煎服，治療慢性支氣管炎，有鎮咳平喘作用。
5. 銀屑病。

### 不良反應

- 大鼠肌注花椒毒素的LD50為160 mg/kg。

- 花椒毒素200-300mg/kg可引起豚鼠肝細胞混濁、脂肪性變及急性出血性壞死、腎臟嚴重充血壞死。

- 獨活煎劑治療氣管炎時，病患曾出現舌麻木、噁心、嘔吐、胃不適等不良反應。

- 獨活中香豆素類化合物為“光活性物質”，進入機體後受到日光或紫外線照射，可使受照射處皮膚發生日光性皮炎，發生紅腫，色素增加，表皮增濃現象。

### 防己

本草正義：名曰防己者，以脾胃已土，喜燥惡濕，濕淫於內，則氣化不行，而水失故道，為腫為瘡，皆已土受邪之病，而此能防堤之，是為古人命名之真義

- 防己科植物粉防己*Stephania tetrandra* Moore的乾燥根。

- 粉防己根含十餘種生物鹼，含量在2.5%以上：

- 粉防己鹼(漢防己甲素tetrandrine)、

- 防己諾林鹼(漢防己乙素demethyltetrandrine)、

- 漢防己丙素、

- 輪環藤酚鹼(cyclanoline)。

- 防己尚含有黃酮苷、酚類、有機酸類等。

- 味苦、辛，性寒。歸膀胱、肺經。

### 與功效主治相關的藥理作用

- 功效：利尿消腫，祛風止痛。
- 用於：水腫香港腳，小便不利，濕疹瘡毒，風濕痺痛。
- 本草求真：辛苦大寒、性險而健、善走下行，長於除濕、通竅、利道，能瀉下焦血分濕熱，乃療風水要藥。

### (1)抗發炎

- 粉防己鹼、防己諾林鹼
  - 皮下注射能明顯減輕大鼠甲醛性關節腫脹，並對家兔耳殼燒傷所致炎性水腫有抑制作用，
- 靜脈注射粉防己鹼可使大鼠背部氣囊角叉菜膠性炎症血管通透性降低，同時中性白血球的游出和 $\beta$ -葡萄糖醛酸酶釋放顯著減少。

### (1)抗發炎

- 體外實驗證明，粉防己鹼能抑制中性白血球的黏附、游走、趨化、吞噬功能。
- 可降低大鼠腎上腺中維生素C含量，也降低末梢血中嗜酸性白血球數，切除腦下垂體後仍有此作用，但切除腎上腺後則上述作用消失，說明粉防己鹼直接作用於腎上腺，使腎上腺皮質功能增強而發揮抗發炎作用。
- 粉防己鹼可透過抑制炎症細胞磷脂A<sub>2</sub>(PLA<sub>2</sub>)的活性，減少炎症介質(Prostaglandin、Leukotriene)、血小板活化因子、氧自由基等的產生和釋放。
- 可被鈣和鈣調素(calmodulin)逆轉。

### (2)免疫抑制和抗過敏

- 粉防己鹼
  - 對細胞免疫和體液免疫均有抑制作用，
  - 體外實驗能顯著抑制PHA、ConA等誘導的人外周血淋巴細胞轉化，對人外周血淋巴細胞培養呈現很強的抑制作用，也能抑制抗體的生成，說明粉防己鹼有免疫抑制作用。
  - 家兔皮下注射能明顯降低蛋清所致過敏性休克的發生率，減輕病理損傷。
  - 對慢反應物質(SRS-A)引起的豚鼠離體氣管條的收縮及組織胺、乙酰膽鹼引起豚鼠喘息反應均有明顯抑制作用，並能抑制天花粉等誘導的大鼠肥大細胞脫顆粒，阻止肥大細胞釋放組織胺。
  - 免疫抑制作用和抗過敏作用與鈣通道的阻滯有關。

### (3)鎮痛

- 熱板法證明防己水煎劑有鎮痛作用，給藥後1.5小時作用明顯，可使痛閾提高59%，作用維持4小時，與川烏合用可使作用持續時間延長至24小時以上。
- 漢防己總鹼及粉防己鹼、漢防己乙素、漢防己丙素均有鎮痛作用，
  - 總鹼的作用最強，為嗎啡的13%。
  - 由刺激小鼠甩尾試驗證明，粉防己鹼的作用強於乙素、丙素。

### 1. 對心血管系統作用

### (1) 抑制心臟和抗心律不整：

- 1) 粉防己鹼：
  - 1) 在貓右心室乳頭肌或豚鼠左心房標本上均可引起心肌收縮力下降，左心室內壓最大變化速率也下降，
  - 2) 麻醉犬靜脈注射可明顯降低心肌收縮性能和幫浦功能，減慢心率，作用與戊脈安相似。
  - 3) 能對抗烏頭鹼、哇巴因、氯仿等所致動物心律不整，對竇房傳導功能和自律性有抑制作用。
  - 4) 負性肌力作用與抗心律不整作用是由於抑制了心肌細胞外鈣內流和細胞內鈣釋放所致。

- 2) 降血壓：粉防己鹼：
  - 1) 對麻醉貓、家兔灌胃和注射給藥均有顯著降血壓作用，並伴有心率減慢，
  - 2) 其降血壓作用主要是透過擴張血管，為選擇性阻滯慢通道鈣內流所致。
- 3) 抗心肌缺血：粉防己鹼
  - 擴張冠狀動脈，增加冠脈血流量，可對抗腦下垂體後葉素引起的大鼠冠脈痙攣，使冠狀動脈結扎犬的心臟損傷程度減輕，損傷範圍減小，使梗塞區心肌釋放入血的肌酸磷酸激酶顯著減少，表現出明顯的抗心肌缺血作用。
  - 其擴張冠脈的作用為對血管的直接作用。

### (2) 抗肝纖維化

- 粉防己鹼：
  - 對CCl<sub>4</sub>誘導的大鼠肝纖維化有良好的防治作用，可顯著改善肝功能，減輕肝臟病理性損傷，治療組大鼠血清轉氨酶活性降低，血清前膠原、血清及肝透明質酸酶含量降低，肝內膠原沈積減少。
  - 防治肝纖維化的機理在於抑制儲脂細胞的增殖及轉化，減少膠原在肝組織中沈積。

### (3) 防治矽肺

- 粉防己鹼：
  - 可使大鼠實驗性矽肺模型肺內陽性物明顯減少，肺泡間隔蛋白多糖螢光強度減弱。
  - 矽結內膠原纖維及蛋白多糖鬆解斷裂，矽結節中心填充物減少。
  - 矽肺組織膠原積聚是由石英粉塵引起膠原基因的表達增強所致，粉防己鹼直接或間接抑制膠原基因的轉錄，從而減少病變組織中膠原蛋白的合成。

- 4) 抗腫瘤：粉防己鹼：
  - 1) 體外實驗對L<sub>7712</sub>和S<sub>180</sub>癌細胞DNA、RNA合成有很強的直接抑制作用，
  - 2) 對人體肝癌細胞的抑制作用具有劑量倚賴關係，並可增強其他抗癌藥的作用，明顯提高柔紅霉素及高三尖杉酯鹼對耐藥白血病細胞的細胞毒作用。
- 5) 粉防己鹼還具有肌肉鬆弛、抗菌、抗阿米巴原蟲等作用。

### 綜述

- 利水消腫，祛風止痛之功效，主要與抗發炎、鎮痛、免疫抑制和抗過敏等藥理作用有關。
- 還具有抗心律不整、降血壓、抗心肌缺血、抗肝纖維化、防治矽肺、抗腫瘤等作用。
- 粉防己鹼是其主要有效成分。

### 現代應用

1. 高血壓病。
2. 心絞痛。
3. 矽肺。
4. 神經性疼痛：粉防己鹼對腰散神經根炎、椎間盤合並神經根炎、三叉神經痛等均有療效。
5. 慢性肝病及肝纖維化：肝纖維化病人口服粉防己鹼，肝臟I、III型膠原纖維明顯減輕。

### 不良反應

- 粉防己鹼小鼠的LD50：
  - 靜脈注射為 $37.5 \pm 3.6$  mg/kg;
  - 腹腔注射為280mg/kg。
- 漢防己乙素：
  - 皮下注射的LD50為397 mg/kg，
  - 大鼠20mg/kg連續給藥21天，大部分動物的肝、腎和腎上腺均出現不同程度的細胞變性、壞死。
- 粉防己鹼：
  - 靜脈注射可引起注射部位疼痛，大劑量出現血紅蛋白尿、頭暈、噁心、呼吸緊迫。
  - 連續服用7-8個月，個別病患出現指甲、面部、口腔黏膜、下肢紫褐色斑。可出現肝功異常、食慾下降等症狀。

### 五加皮 (一棧五葉加，故名五加，因根皮供藥用故名五加皮)

- 五加科植物細柱五加 *Acanthopanax gracilistylus* W. W. Smith的乾燥根皮，
- 主要化學成分：
  - 刺五加糖苷B1 (eleuthexoside B1)，
  - 紫丁香苷 (syringin)，
  - 五加苷A、B、C、D (acanthoside)，
  - 維生素A、維生素B和多糖。
- 味辛、苦，性溫。歸肝、腎經。

### 與功能主治相關的藥理作用

- 功效：祛風濕，補肝腎，強筋骨。
- 主治：**風濕痺痛，筋骨痿軟，小兒行遲，體虛乏力。**
- 本草綱目：治風濕痿痺、壯筋骨。
- 日華子本草：明目、下氣，治中風骨節攣急，補五勞七傷。

### (1) 抗發炎

- 細柱五加皮水煎醇沉液、正丁醇提取物能明顯抑制角又菜膠所致大鼠足腫脹，連續給藥一周也能明顯抑制小鼠棉球肉芽組織增生。
- 短梗五加醇提物
  - 對角又菜膠、雞蛋清和甲醛所致大鼠足腫脹，巴豆油所致小鼠氣囊腫滲出和棉球肉芽增生均有明顯抑制作用，
  - 能明顯抑制大鼠佐劑性關節腫脹和免疫複合物介導的變態反應性炎症反應。
- 五加皮的抗發炎作用：
  - 減少炎症介質的釋放
  - 抑制其致炎作用。

### (2) 對免疫功能的影响

- 細柱五加皮水煎醇沉液對免疫功能有抑制作用，可明顯降低小鼠腹腔巨噬細胞的吞噬百分率和吞噬指數，明顯抑制小鼠脾臟抗體形成細胞。
- 乳鼠半心移植試驗證明細柱五加皮有一定抗排斥作用，可使移植心肌平均存活時間顯著延長。
- 五加皮總皂苷和多糖：
  - 提升機體免疫功能的作用，
  - 灌胃給藥能促進小鼠網狀內皮系統吞噬功能，使血清碳末廓清率明顯提升，
  - 增加小鼠血清抗體的濃度，提升體液免疫功能。

### (3)鎮靜、鎮痛

—細柱五加皮醇浸膏：

—對闕下戊巴比妥鈉產生協同作用，  
使小鼠睡眠時間明顯延長。

—正丁醇提取物及短梗五加醇提物均能  
提升痛閾，具有明顯鎮痛作用。

### (4)抗鎘致突變作用及抗應激(stress)作用

- 鎘是重金屬誘導劑，對生殖細胞有強的致突變作用，可以誘發小鼠精子畸形和骨髓細胞微核增加。
- 五加皮水提取物小鼠連續灌胃給藥5周，可降低鎘誘發的精子畸形和骨髓細胞微核增加。
- 細柱五加總皂苷可明顯延長小鼠游泳時間、熱應激存活時間和常壓耐缺氧時間。

### 5) 促進核酸合成：

- 1) 細柱五加水提醇沉物可增加幼年小鼠肝脾細胞DNA合成，
- 2) 五加皮多糖對CCl<sub>4</sub>中毒性肝損傷小鼠肝細胞的DNA合成有促進作用。

### 6) 性激素樣作用：

- 1) 細柱五加多糖有性激素樣作用，連續給藥7天能促進未成年大鼠副性器官的發育，使睪丸、前列腺、精囊腺的重量增加。
- 2) 紅毛五加水提物也可以促進幼鼠睪丸發育。

### 2.其他藥理作用

- 1) 降血糖：細柱五加浸膏對四氧嘧啶所致高血糖大鼠有降血糖作用。
- 2) 抗潰瘍：五加皮萜酸對大鼠消炎痛型、幽門結扎型、乙醇性潰瘍模型具有良好的防治作用。
- 3) 減肥：五加皮水提液對高脂飼料形成的大鼠肥胖模型有減肥作用，使體重和BMI降低。
- 4) 五加皮還具有抗腫瘤、增強學習記憶功能、抑制血小板聚集等作用。

### 綜述

- 五加皮的抗發炎作用、鎮痛作用、抑制免疫功能作用與其祛風除濕功效相關；
- 促進DNA合成、性激素樣作用、抗應激作用與其益肝腎、強筋骨功效相關。

### 現代應用

1. 風濕性關節炎和類風濕性關節炎：可單用五加皮泡酒服用，亦可用五加皮散(配木瓜、松節等)。
2. 關節痛：配馬錢子、威靈仙、透骨草等外敷患處使用，如宣痺止痛膏。
3. 小兒行遲：配木瓜、牛膝同用，共奏補肝腎、強筋骨之功。
4. 浮腫：用五加皮飲可達消腫之作用。

### 不良反應

- 細柱五加總皂苷灌胃20 g/kg未見明顯毒性反應;
- 刺五加總苷小鼠皮下注射LD50為4.75 g/kg;
- 無梗五加乙醇提取物腹腔注射LD50為13 g/kg。
- 細柱五加大劑量可出現中樞抑制，下肢軟弱無力。
- 北五加有一定毒性，中毒可致嚴重心律不整，並引起中毒性視神經炎及多發性神經炎。

### 雷公藤

- 衛矛科植物雷公藤 *Tripterygium wilfordii* Hook. f. 的根。
- 主要成分：
  - 生物鹼：雷公藤春鹼(wilfortrine)、雷公藤晉鹼(wilforgine)和雷公藤辛鹼(neowilforine);
  - 二萜類：雷公藤甲素(triptolide)、雷公藤乙素(Triptodiote)、雷公藤丙素(tripterolide)、雷公藤內酯(triptophenolide);
  - 三萜類：雷公藤內酯甲(wilformide)、雷公藤紅素(triptophenolide)等;
  - 倍半萜類：雷藤鹼(wilformide)等。
- 味苦辛，性寒，有大毒。歸心、肝經。

### 與功效主治相關的藥理作用

- 雷公藤：
  - 具有祛風濕、止痺痛之功效。
  - 臨床用於治療風濕性關節炎和類風濕性關節炎。

### (1)對免疫功能的影響

- 雷公藤水煎劑可使大鼠脾臟、胸腺萎縮，淋巴組織內淋巴細胞減少並廣泛壞死，病變以B淋巴細胞分佈的部位最為明顯。(急性毒性實驗)
- 雷公藤中多種成分均有免疫抑制作用。
  - 1) 雷公藤甲素：對單向混合淋巴細胞反應(MLR)、遲發型超敏反應(DTH)、體外誘導的抑制性T細胞(Ts細胞)活性、T淋巴細胞亞群均表現抑制作用;

### (1)對免疫功能的影響

- 2) 雷公藤紅素
  - 能抑制ConA、PHA、PWM及LPS誘導的小鼠脾細胞和淋巴細胞的增生，
  - 腹腔注射可明顯減輕小鼠胸腺重量，降低脾臟溶血空斑形成細胞數，同時能提升血清補體含量。
  - 抑制免疫功能的可能機理：
    - 抑制白細胞介素-1(IL-1)、白細胞介素-2(IL-2)活性和抑制細胞釋放PGE2有關。

1. 雷公藤春鹼和雷公藤新鹼：
  1. 能顯著降低小鼠破粒廓清速度，對網狀內皮系統的吞噬功能有抑制作用。
  2. 80mg/kg對免疫功能的影響與環磷醯胺10mg/kg相似。
2. 雷公藤對免疫功能有抑制效應，用於預防移植排斥反應。
3. 雷公藤總生物鹼及總二萜內酯對小鼠心肌移植的存活時間有顯著延長作用，能顯著延長小鼠尾皮移植的存活時間。

## (2)抗發炎

- 雷公藤水煎劑：
  - 腹腔注射對大鼠甲型足腫脹、棉球肉芽組織增生有抑制作用，
  - 可抑制組織胺引起的大鼠毛細血管通透性增加。
- 雷公藤
  - 對大鼠角叉菜膠足腫脹、棉球肉芽腫及大鼠佐劑性關節炎均有明顯抑制作用，
  - 大鼠腹腔巨噬細胞產生的IL-1的生成減少。
- 雷公藤乙酸乙酯提取物雷公藤總苷：
  - 灌胃給藥對各種急性慢性實驗性關節炎有較好的抗發炎作用，
  - 尿中17-煙皮質類固醇可顯著升高，
  - 說明有增強腎上腺皮質功能的作用。

- 雷公藤多苷可減少致敏豚鼠支氣管一肺泡灌流液中炎性細胞、嗜酸性細胞總數及其分類計數，說明有明顯抗發炎作用。
- 雷公藤甲素、雷公藤內酯：
  - 對巴豆油誘發的小鼠耳腫脹有明顯抑制作用，
  - 對醋酸所致小鼠腹腔毛細血管通透性增高有抑制作用。
- 雷公藤紅素對大鼠實驗性棉球肉芽腫有明顯抑制作用，呈一定量效關係。
- 雷公藤抗發炎作用機理：
  - 抑制細胞釋放PGE<sub>2</sub>、
  - 降低細胞對PGE<sub>2</sub>及酵母多糖的反應性。

## (3)對血管和血液系統的作用

- 雷公藤乙酸乙酯提取物連續給藥7天：
  - 可使致炎2周和4周佐劑性關節炎大鼠全血和血漿黏度降低、紅血球壓積減少及纖維蛋白原含量明顯降低，
  - 可使血小板最大聚集率明顯下降。
- 雷公藤多苷：
  - 可使主動脈內皮損傷大鼠內膜增生減輕。
  - 可使血管內皮損傷後血漿內源性類洋地黃因子含量明顯減少，血管內皮損傷局部炎症細胞減少。(球囊導管所致胸、腹主動脈內皮損傷模型)
- 雷公藤可促進細胞外基質成分合成，抑制整合素活性，並能輕度提升鈣倚賴性粘連分子活性，(血管內皮細胞體外實驗)
- 提示雷公藤能透過多種機制調控血管的新生過程。

## (4)殺虫抗菌

- 雷公藤水煎劑、醇浸劑及醚提取物能殺蟲、蛆、蠅、蠶等。
- 雷公藤：
  - 對金黃色葡萄球菌、607分支桿菌、枯草桿菌、無核桿菌均有明顯的抑制作用，對革蘭陰性細菌也有抑制作用。
  - 對真菌(如白色念珠菌)抑制作用最強。

## 2. 其他藥理作用

### (1)對生殖系統的影響--抗生育作用

- 雷公藤總苷：
  - 雄性大鼠灌服10 mg/kg，8周後全部動物失去生育能力，
  - 作用的靶細胞主要是精母細胞和精子細胞，能降低初級精母細胞核內DNA含量，
  - 可在精子細胞成熟過程中干擾其圓形向鐮刀形轉變。
- 雷公藤內酯醇：主要作用於附睪精子，
  - 使變態期精子細胞組蛋白-精核細胞取代反應受阻，進而導致附睪精子核蛋白異常。
- 使用雷公藤的女性病患出現閉經，發生率及持續時間與用藥劑量成正比。
- 男性病患的精子濃度和活性指數達不育濃度。
- 雷公藤的抗生育作用與棉酚有相似之處。
- 作用是可逆的，停止給藥後6-8個月生育功能可以恢復。

## (2)抗腫瘤

- 雷公藤甲素、雷公藤乙素和雷公藤內酯有抗癌作用。
- 雷公藤甲素和雷公藤乙素腹腔注射對小鼠淋巴細胞白血病(L1210)、P388及L615白血癩株均有抑制作用，
- 雷公藤內酯腹腔注射可明顯延長網織細胞白血病小鼠存活期。
- 雷公藤的抗腫瘤作用可能與其具有烷化作用有關。

## 綜述

- 雷公藤免疫抑制作用、抗發炎作用、改善血液流變學作用與其祛風濕、止痺痛之功效有關；
- 殺虫解毒功效則是其直接對病原體的抑制作用的結果。

## 現代應用

1. 類風濕性關節炎。
2. 腎小球腎炎和腎病綜合徵。
3. 結締組織病：
  - 雷公藤單用或配小劑量激素可用於紅斑狼瘡、硬皮病、多發性肌炎及血管炎的治療。
  - 雷公藤治療系統性紅斑狼瘡和多發性硬化病，臨床症狀和免疫功能都有明顯改善。

4. 銀屑病、神經性皮炎、濕疹和過敏性紫癩：
  - 雷公藤總鹼：
    - 治銀屑病，早期皮疹不濃、病程短者見效快。
    - 治療神經性皮炎。
  - 雷公藤多甘治療濕疹。
  - 雷公藤總甘治療過敏性紫癩。
5. 慢性支氣管炎和小兒喘息型支氣管炎：雷公藤多甘。

## 不良反應

- 雷公藤毒性較大，對機體多個器官和系統均呈現毒副作用，
- 雷公藤多甘小鼠：
  - 灌胃的LD50為159.7mg/kg、
  - 腹腔注射的LD50為93.99mg/kg、
  - 靜脈注射的LD50為0.8mg/kg。
- 雷公藤微囊大鼠35mg/kg、犬15mg/kg連續灌胃給藥3個月，大鼠血糖、血尿素氮及犬的鹼性磷酸 活性顯著提升，犬血總蛋白及白蛋白含量顯著下降，病理組織學檢查也表明大鼠及犬的心、肝、腎等多種臟器有明顯損害。上述毒性停藥後基本可恢復。

- 臨床的毒副作用，
  - 消化系統：噁心嘔吐、食慾減退、腹脹腹瀉及便秘便血；
  - 神經系統：頭暈、乏力、嗜睡等；
  - 血液系統：白血球及血小板減少，個別發生粒細胞缺乏和再生障礙性貧血；
  - 生殖系統：可使男性病患表現為少精、弱精或無精，進而造成不育，育齡女性可以出現月經紊亂或閉經；
  - 心血管系統：心悸、胸悶，甚至引起心律不整，嚴重中毒時可使血壓急劇下降，甚至出現心源性休克而死亡；
  - 少數病患出現腎功能損害、肌甘清除率下降，嚴重可致急性腎功能衰竭而死亡。
  - 部分病患可出現過敏反應。

## 利水滲濕

## 利水滲濕藥概述

- 通利水道，滲泄水濕的藥物。
- 具有利水消腫，利尿通淋，利濕退黃等功效，
- 主要用於小便不利、水腫、淋證、黃疸、濕瘡、泄瀉、帶下、濕溫、濕痺等水濕內停所致的各種病證。
- 味多甘淡。
- 大體分為利水消腫藥、利尿通淋藥、利濕退黃藥三類。

- 水液自胃的受納，脾的轉輸，肺的通調而下歸於腎，透過腎陽氣化而釐清濁，清者上升複歸於肺而為津，濁者下出膀胱而為尿。
- 若外邪侵襲，飲食起居失常或勞倦內傷，均可導致肺不通調，脾失轉輸，腎失開合，終至膀胱氣化無權，三焦水道失暢，水濕停聚。
- 水濕致病，或泛濫於全身而水腫;或侵犯脾胃而為濕阻;或同其他外邪(如濕熱)相夾雜，濕熱熏蒸而發黃。

- 從現代醫學角度看，水濕所致的各種症狀，應包括泌尿系統感染或結石、消化系統功能低下、變態反應性疾患、腎臟病變、代謝異常、慢性支氣管炎時的痰液積留，及胸水、腹水等體腔內的異常液體和各種原因所致的水腫等疾病。

## 利水滲濕藥的主要藥理作用

## 利尿作用

- 茯苓、豬苓、澤瀉、玉米鬚、半邊蓮、車前子、通草、木通、篇蓄、瞿麥、金錢草、茵陳等均具有不同程度的利尿作用。
- 豬苓、澤瀉的利尿作用較強。
- 利尿作用機理：
  - 豬苓、澤瀉抑制腎小管對鈉離子的重吸收;
  - 茯苓素抗醛固酮;
  - 澤瀉增加心鈉素 (Atrial Natriuretic Factor, ANF) 的含量等。
- 影響利尿作用的因素較多，如藥物的采收季節、實驗動物的種類、給藥途徑、炮製方法等。

## 2. 抗病原微生物作用

- 抗菌作用：茯苓、豬苓、茵陳、金錢草、木通、篇蓄、半邊蓮。
- 抗真菌作用：車前子、茵陳、地膚子、篇蓄、木通。
- 抗病毒作用：茵陳。

## 3. 利膽保肝作用

- 利膽作用：茵陳、半邊蓮、玉米須、金錢草。
- 保肝作用：澤瀉、茵陳、豬苓、垂盆草。

## 4. 抗腫瘤、增強免疫功能

- 茯苓多糖和豬苓多糖
  - 具有顯著的抗腫瘤作用，
  - 能抑制多種實驗性移植性腫瘤的生長。
  - 能提升機體的非特异性及特异性免疫功能。

## 綜述

- 與利水滲濕藥的利水消腫、利尿通淋、利濕退黃等功效相關的藥理作用為利尿、抗病原微生物、利膽保肝、抗腫瘤及增強免疫功能。

**茯苓** · 由松之神靈之氣，伏結而成，因名茯苓。  
· 淮南子·說山訓謂：千年之松，下有茯苓，上有菟絲。

- 為多孔菌科真菌茯苓 *Poria cocos* (Schw.) Wolf 的乾燥菌核。
- 主要成分：
  - 含有β-茯苓聚糖(β-pachyman)，約占乾重的93%。
  - 三萜類：茯苓酸(tumulosic acid)、茯苓素(poriatin)、茯苓醇。
- 味甘、淡，性平。歸心、肺、脾、腎經。

## 茯苓

- 功效：利水滲濕、健脾寧心。
- 用於：水腫尿少、痰飲眩悸、脾虛食少、便溏泄瀉、心神不寧、驚悸失眠等病證。
- 本經：主胸脅逆氣、憂恙、驚邪恐悸、心下結痛、寒熱、煩滿、咳逆、口焦舌乾、利小便。

### 利尿作用

- 茯苓利尿作用受動物種屬、給藥途徑等因素影響。
- 對健康人利尿作用不明顯，但對腎性和心性水腫病患利尿作用顯著。
- 茯苓素：
  - 是茯苓利尿作用的有效成分，
  - 具有和醛固酮及其拮抗劑相似的結構，可與大鼠腎小管細胞漿膜的醛固酮受體結合，拮抗醛固酮活性，提升尿中 $\text{Na}^+/\text{K}^+$ 比值，產生利尿作用。
  - 可能是一種醛固酮受體拮抗劑。

### 免疫調節作用

- 茯苓多糖：
  - 具有顯著增強機體免疫功能的作用。
  - 對機體非特异性免疫功能：
    - 能增加免疫器官胸腺、脾臟、淋巴結的重量；
    - 增強正常小鼠腹腔巨噬細胞的吞噬功能，並能對抗免疫抑制劑醋酸可的松對巨噬細胞吞噬功能的抑制作用，對抗 $^{60}\text{Co}$ 照射引起小鼠外周血白血球的減少；
  - 對機體特异性免疫功能：
    - 可使玫瑰花結形成率及PHA誘發的淋巴細胞轉化率升高；
    - 使小鼠脾臟抗體分泌細胞數明顯增多。
- 增強機體免疫功能的作用機理：可能與誘導產生IL-2有關。

### - 茯苓素：

- 對免疫功能具有調節作用。
- 能增強小鼠腹腔巨噬細胞的吞噬作用，從而提高機體的非特异性免疫功能。
- 但對PHA、LPS和ConA誘導的淋巴細胞轉化及對小鼠血清抗體及脾細胞抗體產生能力均有顯著抑制作用。
- 對IL-2的產生呈劑量倚賴性的抑制作用，可能是其免疫抑制作用的機理之一。

### (3)抗肝硬化

- 茯苓醇：
  - 採用複合因素(皮下注射 $\text{CCl}_4$ 、高脂低蛋白膳食、飲酒)刺激建立大鼠肝硬化模型，在肝硬化形成后，皮下注射 $5\text{ml/kg}$ (含茯苓醇 $75\text{mg}$ )，連續3周，給藥組實驗動物肝硬化明顯減輕、肝內膠原含量降低、尿羧脯氨酸排出量增多，
  - 具有促進實驗性肝硬化動物肝臟膠原蛋白降解，促進肝內纖維組織重吸收作用。

### (4)對胃腸功能的影響

- 茯苓對家兔離體腸管有直接鬆弛作用，
- 對大鼠幽門結紮所形成的潰瘍有預防作用，並能降低胃酸含量。

## 2. 其他藥理作用

### (1)抗腫瘤

- 茯苓多糖
  - 對體外培養的小鼠腹水型肉瘤S180細胞和人慢性骨髓性白血病K562細胞增殖有顯著抑制作用，
- 抗腫瘤作用機制：
  1. 提升宿主的免疫系統功能
  2. 直接的細胞毒作用(如改變腫瘤細胞膜磷脂生化特性)。

### (1)抗腫瘤

- 茯苓素：
  - 延長艾氏腹水癌小鼠存活時間。
  - 對體外培養的小鼠白血病L1210細胞的增殖有顯著抑制作用。
- 抗腫瘤作用機制：
  1. 抑制腫瘤細胞的核甘轉運而抑制腫瘤細胞DNA合成，
  2. 提升巨噬細胞產生腫瘤壞死因子(TNF)的能力，增強殺傷腫瘤細胞作用。

- 2) 抗中毒性耳損害：豚鼠灌服茯苓煎劑，連續10天，可明顯減輕肌肉注射卡那霉素所致的耳損害。
- 3) 還具有抗菌，促進造血功能、鎮靜等藥理作用。

### 綜述

- 與茯苓利尿滲濕、健脾寧心功效相關的藥理作用為利尿、免疫調節、抗肝硬化、對胃腸功能的影響，及鎮靜等作用。
- 主要有效成分是茯苓素、茯苓多糖等。
- 茯苓抗腫瘤、抗中毒性耳損害等作用，則是茯苓藥理作用的現代研究進展。

### 現代應用

1. 水腫：茯苓餅乾(每片含茯苓3.5g，每次8片，每日3次，一周為一療程)治療心性水腫、腎性水腫及非特异性水腫。
2. 嬰幼兒腹瀉：單味茯苓粉(每次用茯苓粉0.5g，每日3次)治療由輪狀病毒感染所致嬰幼兒秋冬季腹瀉。
3. 精神分裂症：茯苓水煎劑(每日60g茯苓水煎服，3個月)治療慢性精神分裂症。

### 豬苓 陶弘景曰：舊云是楓樹苓，其皮至黑，作塊似豬屎，故以名之。

- 為多孔菌科真菌豬苓*Polyporus umbellatus* (Pers.) Fries的乾燥菌核。
- 主要成分：
  - 豬苓多糖 (glucan)、
  - 豬苓酸A (polyprorenic acid A)、
  - 豬苓酸C (polyprorenic acid C)、
  - 角甾醇 (ergosterol)。
- 味甘、淡，性平。歸腎、膀胱經。

### 與功效主治相關的藥理作用

- 功效：利水滲濕。
- 用於：小便不利、水腫、泄瀉、淋濁、帶下。
- 本草綱目：豬苓開腠理，治淋腫腳氣，白濁帶下，妊娠子淋胎腫，小便不利。

### (1)利尿

- 健康人服豬苓煎劑8g(4次)，6小時尿量與尿中氯化物增加，具有顯著的利尿作用。
- 豬苓水煎劑或流浸膏給雄性家兔灌胃，6小時內總尿量無明顯增加，但尿中氯化物增加。
- 利尿作用機制：主要是與抑制腎小管對水及電解質，特別是鈉、鉀、氯的重吸收有關。

### (2)增強免疫功能

- 豬苓水提取物或醇提水溶部分，均能明顯增強小鼠網狀內皮系統吞噬功能。
- 豬苓多糖：
  - 是豬苓增強免疫功能作用的主要有效成分，
  - 能提升荷瘤小鼠及化療小鼠腹腔巨噬細胞吞噬能力。
  - 能直接促進小鼠免疫細胞(B細胞)的有絲分裂，明顯促進小鼠T細胞對ConA和B細胞對細菌脂多糖(LPS)的增殖反應，
  - 增強小鼠異型脾細胞誘導的遲發型超敏反應，並明顯增強小鼠異型脾細胞激活的細胞毒T細胞對靶細胞的殺傷活性。

## 2. 其他藥理作用

### (1)抗腫瘤

- 豬苓醇提水溶部分腹腔注射對小鼠肉瘤S<sub>180</sub>抑制率為62%，對小鼠肝癌抑制率為37%-54%。
- 豬苓多糖：
  - 為豬苓抗腫瘤作用有效成分。
  - 對小鼠移植性肉瘤S<sub>180</sub>具有明顯的抑制作用。
  - 能降低N-丁基-N(4-羥丁基)亞硝胺(BBN)誘發的大鼠膀胱癌發生率，並使每鼠腫瘤數、腫瘤直徑和惡性程度均顯著降低。
  - 抑制腫瘤的作用機制：
    - 與抑制腫瘤細胞的DNA合成
    - 增強機體免疫功能等作用有關。

### 2) 保肝：

#### 1) 豬苓多糖：

- 能減輕CCl<sub>4</sub>對小鼠肝臟損傷，表現為肝組織病理損傷減輕、血清谷丙轉氨酶活力下降，防止肝6-磷酸葡萄糖磷酸酶和結合磷酸酯活力降低。
- 對D-半乳糖胺誘發小鼠肝損傷也具有預防和治療作用。

#### 3) 豬苓還具有抗菌、抗輻射、抗誘變等藥理作用。

### 綜述

- 與豬苓利水滲濕、開腠理等功效相關的藥理作用為利尿、增強免疫功能、抗菌等作用。
- 豬苓的抗腫瘤、保肝等作用，則是對豬苓的現代研究進展。

### 現代應用

1. 各種類型肝炎：
  1. 目前臨床常以豬苓多糖合併乙肝疫苗治療慢性B型肝炎。
  2. 豬苓多糖與干擾素，或卡介苗合用，治療非A非B型。
2. 銀屑病。
3. 惡性腫瘤。

### 不良反應

- 豬苓多糖注射液可引起藥物性皮炎、血管神經性水腫、過敏性休克等過敏反應。
- 豬苓多糖可致系統性紅斑性狼瘡。

### 澤瀉

澤指沼澤，瀉謂鹽鹼的土地，因其生於沼澤鹽鹼之地中，故名澤瀉。

- 澤瀉科植物澤瀉 *Alisma orientalis* (Sam.) Juzep. 的乾燥塊莖。
- 主要化學成分：
  - 澤瀉萜醇A (alisol A)、
  - 澤瀉萜醇B (alisol B)、
  - 澤瀉萜醇A、B、C的醋酸酯，
  - 表澤瀉萜醇A (epi-alisol A)、
  - 澤瀉醇 (alismol)、
  - 澤瀉素 (alimin)等。
- 味甘，性寒。歸腎、膀胱經。

### 與功效主治相關的藥理作用

- 澤瀉：
  - 功效：利小便，清濕熱。
  - 用於：小便不利，水腫脹滿，泄瀉尿少，痰飲眩暈，熱淋澀痛。
  - 別錄：澤瀉補虛損五勞，除五臟痞滿、起陰氣、止泄精、消渴、淋瀝、逐膀胱三焦停水。

### (1)利尿作用

- 澤瀉水煎劑
  - 給家兔灌胃或澤瀉流浸膏兔腹腔注射，均可使尿量增加。
  - 50%澤瀉水煎液給大鼠灌胃後1小時，利尿作用達到尖峰。
- 澤瀉利尿作用的強弱因採集季節，藥用部位及炮製方法的不同而異。
  - 冬季採集者作用強，春季採集者作用稍差；
  - 澤瀉鬚(冬季產的)稍有利尿作用，澤瀉草根則無利尿作用；
  - 生澤瀉及酒製、麩製澤瀉均有一定的利尿作用，而鹽澤瀉則無利尿作用。

#### -澤瀉的利尿作用機理：

- 直接作用於腎小管的集合管(collecting tube)，抑制K<sup>+</sup>的分泌，同時抑制Na<sup>+</sup>的重吸收；
- 增加血漿心鈉素(ANF，從心房組織釋放的一種低分子多肽，具有排鈉利尿作用)的含量；
- 抑制腎臟Na<sup>+</sup>, K<sup>+</sup>-ATP酶的活性，減少Na<sup>+</sup>重吸收。

#### (2)抗實驗性腎結石

##### -澤瀉水提液：

- 能明顯抑制乙二醇與活性維生素D<sub>3</sub>誘導的大鼠實驗性腎結石的形成。
- 其作用是透過明顯降低腎鈣含量和減少腎小管內草酸鈣結晶形成。

#### (3)抗發炎

##### -澤瀉水煎劑：

- 能明顯減輕二甲苯引起的小鼠耳廓腫脹，抑制大鼠棉球肉芽組織增生而呈現對急慢性炎症均有抑制作用。
- 其抗發炎作用機制可能是直接作用，不是透過興奮垂體-腎上腺皮質系統間接發揮作用。

## 2. 其他藥理作用

#### (1)降血脂

- 澤瀉的多種粗製劑(粗提液、醇浸膏，醇浸膏的乙酸乙酯提取物，乙酸乙酯浸膏)有降低實驗性高脂血症動物(家兔、大鼠)的血清膽固醇、甘油三酯和低密度脂蛋白(LDL)的作用。
- 澤瀉的不同萜醇類化合物對實驗性高脂血症大鼠血清膽固醇含量有顯著降低作用，其中以澤瀉萜醇A醋酸酯的降低膽固醇的作用最為顯著，澤瀉萜醇C、澤瀉萜醇B的醋酸酯、澤瀉萜醇A也有顯著作用。

#### (1)降血脂

- 澤瀉提取物降低膽固醇的作用機制：
- 降低小腸膽固醇的吸收率
- 抑制小腸膽固醇的酯化。

## (2)抗動脈粥狀硬化

- 澤瀉提取物：
  - 能使實驗性動脈粥狀硬化家兔的動脈內膜斑塊明顯變薄，
  - 內膜下泡沫細胞層數和數量明顯減少，
  - 血管平滑肌細胞增生及炎細胞浸潤減輕，
  - 表明澤瀉具有抗實驗性動脈粥狀硬化作用。
- 澤瀉抗動脈粥狀硬化的機理：
  - 與降血脂、升高高密度脂蛋白(HDL)，調節PGI<sub>2</sub>/TXA<sub>2</sub>的動態平衡，抗氧化，抑制動脈壁內鈣異常升高，及改善血液流變性等多種作用有關。

## (3)抗脂肪肝作用

- 澤瀉的水提物可使低蛋白飼料所致動物實驗性脂肪肝的肝內脂肪含量明顯降低。
- 澤瀉粉可抑制大鼠肝脂肪的蓄積。
- 澤瀉提取物對CCl<sub>4</sub>引起的大鼠損傷性脂肪肝有保護作用。
- 澤瀉所含膽鹼、卵磷脂、不飽和脂肪酸是其抗脂肪肝的有效成分。

## (4)抗血小板聚集和抗血栓

- 澤瀉的水提液在體外對ADP誘導的血小板聚集均有抑制作用。
- 澤瀉可使正常大鼠和實驗性動脈粥狀硬化家兔的血栓長度明顯縮短，血栓乾重明顯減輕。

- 5) 降血壓：澤瀉醇口服或腹腔給藥對腎型高血壓和原發性高血壓大鼠均有持久的降血壓作用。
- 澤瀉還具有降血糖、鬆弛離體家兔主動脈平滑肌、提升纖維溶解酶活性等作用。

## 綜述

- 與澤瀉利小便，清濕熱功效相關的藥理作用為利尿、抗實驗性腎結石和抗發炎等作用。
- 澤瀉的降血脂、抗動脈粥狀硬化、抗脂肪肝、抑制血小板聚集、抗血栓形成和降血壓等作用，則是澤瀉藥理作用的現代研究進展。

## 現代應用

1. 高脂血症：對IIa、IIb、IV和V型高脂蛋白血症均有一定療效。
2. 美尼爾氏病。
  1. 通常發生在中年或老年人。
  2. 由於不同因素破壞耳內水液系統的正常平衡，導致內耳功能失調。
  3. 中醫學認為，主要是由臟腑內傷造成，以**肝**、**腎**、**脾**功能失調為主。
  4. 內傷引致**清**衰失養，**髓**海不足，因而產生眩暈。

### 不良反應

1. 澤瀉煎劑小鼠腹腔注射的LD<sub>50</sub>為36.36 g/kg、靜脈注射醇提取物的LD<sub>50</sub>為1.27 g/kg。以4 g/kg灌胃未見死亡。
2. 澤瀉含有刺激性物質，內服可引起胃腸炎，貼於皮膚引起發泡。

### 茵陳

- 菊科植物的乾燥地上部分：
- 濱蒿 *Artemisia scoparia* Waldst. et kit
- 茵陳蒿 *Artemisia capillaris* Thunb.
- 春季采收的習稱“綿茵陳”，秋季采割的稱“茵陳蒿”。
- 味苦、辛，性微寒。歸脾、胃、肝、膽經。

### 茵陳

民謠：三月茵陳四月蒿，五月藥(厂纟)當柴燒。

- 主要化學成分：
- 香豆素類如6,7-二甲氧基香豆素 (6,7-dimethoxycoumarin);
- 色原酮類如茵陳色原酮 (capillarisin);
- 黃酮類如茵陳黃酮 (areapillin)、薊黃素 (cirsimanitin);
- 香豆酸及其他有機酸類如茵陳香豆酸A、茵陳香豆酸B (capillartemisin A、B)、綠原酸 (chlorogenic acid) 和揮發油類如茵陳二炔、茵陳二炔酮、β-蒎烯等化學成分。
- 從濱蒿中提得對羥基苯乙酮。

### 與功效主治相關的藥理作用

- 功效：清濕熱、退黃疸。
- 主治：黃疸尿少，濕瘡癢癢等。
- 本經：茵陳“主風濕寒熱邪氣、熱結黃疸”，
- 醫學入門：茵陳“消遍身瘡疥”。

### (1)利膽

- 茵陳水煎劑、熱水提取物、水浸劑、去揮發油水浸劑、揮發油、醇提取物，無論對正常實驗動物(如慢性膽囊造瘻犬、急性膽道插管大鼠)，還是對CCl<sub>4</sub>所致肝損傷大鼠，均有促進膽汁分泌和排泄作用。
- 茵陳水煎液口服，連續5日，可使膽石症患者膽汁流量明顯增加，膽汁中膽固醇含量降低，可預防膽固醇結石的形成。

### (1)利膽

- 茵陳利膽作用的有效成分：
- 茵陳香豆酸(A、B)、6,7-二甲氧基香豆素、茵陳色原酮、茵陳黃酮、茵陳二炔、茵陳二炔酮、茵陳炔內酯、綠原酸、咖啡酸及對羥基苯乙酮等。
- 均能使膽汁流量增加，膽汁排泄加速，同時能擴張膽管、收縮膽囊，只是作用強度上有所不同。
- 對羥基苯乙酮等還能增加大鼠膽汁中的膽酸、膽固醇等成分的分泌量。

**(2)保肝**

- 茵陳煎劑對CCl<sub>4</sub>所致動物實驗性肝損傷有保護作用，能減輕肝細胞腫脹、氣球樣變、脂肪變和壞死程度，降低血清轉氨酶活性。
- 茵陳色原酮、6,7-二甲氧基香豆素、茵陳黃酮，均有保肝作用。

**(2)保肝**

- 茵陳煎劑：
  - 能使小鼠肝臟微粒體中的P450含量增加，
  - 能使異戊巴比妥鈉誘導的睡眠時間縮短，使安替比林消除半衰期明顯縮短，
  - 說明茵陳具有誘導肝藥酶的作用。
- 茵陳還能抑制白葡萄糖醛酸酶活性，減少葡萄糖醛酸的分解，增強肝臟的解毒功能。

**(2)保肝**

- 茵陳中的鋅、錳等微量元素含量相當高，
  - 鋅參與200多種酶的合成，
  - 鋅、錳等元素能直接參與機體的核酸、糖、脂肪、蛋白質代謝。
- 茵陳的保肝作用機理：
  - 誘導肝藥酶、
  - 增強肝臟的解毒功能、
  - 保護肝細胞膜的完整
  - 促進肝細胞的再生。
- 茵陳蒿湯對CCl<sub>4</sub>等所致實驗性肝損傷均有保護作用。

**(3)抗病原微生物**

- 茵陳蒿有較強的抗病原微生物作用，在體外對金黃色葡萄球菌有明顯的抑制作用，對痢疾桿菌、溶血性鏈球菌、肺炎雙球菌、白喉桿菌、牛型及人型結核桿菌、大腸桿菌、傷寒桿菌、綠膿桿菌、枯草桿菌、病原性絲狀體，以及黃麴霉菌。
- 雜色麴霉菌等皮膚真菌有一定的抑制作用。
- 茵陳抗菌活性成分：茵陳炔酮、對羥基苯乙酮和其他揮發油成分。
- 茵陳蒿乙醇提取物對流感病毒有抑制作用。

**(4)降血脂與抗動脈粥狀硬化**

- 茵陳煎劑：
  - 對家兔實驗性高膽固醇血症具有降低膽固醇和β-脂蛋白的作用，
  - 能使高膽固醇血症家兔的主動脈壁中膽固醇含量明顯降低，動脈壁粥樣硬化斑塊病變減輕，內臟脂肪減少，
  - 表明茵陳具有降血脂和抗動脈粥狀硬化作用。

**(5)解熱、鎮痛、抗發炎**

- 茵陳水煎劑和茵陳醇提取物
  - 對傷寒混合菌苗所致家兔體溫升高均有明顯解熱作用，
  - 茵陳醇提取物的解熱作用起效快、作用強。
- 6,7-二甲氧基香豆素對鮮啤酒酵母、2,4-二硝基苯酚致熱大鼠和傷寒混合菌苗致熱家兔均有明顯的解熱作用。
- 6,7-二甲基七葉苷元：
  - 在熱板法和醋酸扭體法鎮痛實驗中，對小鼠有一定程度的鎮痛作用，
  - 對角叉菜膠所致大鼠足趾關節腫脹程度有抑制作用。

## 2. 其他藥理作用

### (1) 抗腫瘤

- 茵陳水煎劑：
  - 對小鼠艾氏腹水癌細胞和移植Meth A細胞有抑殺作用，能延長荷瘤小鼠的存活時間。
  - 對致癌劑黃麴毒素B<sub>1</sub>(AFB<sub>1</sub>)的致突變作用有顯著抑制，並呈劑量效應關係。
  - 對亞硝酸鈉和N-甲基卡胺誘導的SD大鼠食道上皮的增生性病變和骨髓微核突變有抑制作用。
- 茵陳色原酮和薊黃素具有顯著抑制Hela細胞和Ehrlich腹水癌細胞增殖作用。

### 2) 對心血管系統的影響：

- 1) 茵陳水浸液、煎劑、醇提取物對離體蟾蜍心臟有抑制作用。
- 2) 茵陳水煎劑、乙醇浸液及揮發油、6, 7-二甲氧基香豆素均有降血壓作用。
- 3) 茵陳還具有利尿、興奮平滑肌、殺滅蛔蟲、增強免疫功能等藥理作用。

### 綜述

- 與茵陳清濕熱、退黃疸功效相關的藥理作用為利膽、保肝、抗病原微生物、降血脂，及解熱、鎮痛、抗發炎等作用。
- 茵陳具有的抗腫瘤、對心血管系統的影響，則是茵陳藥理作用的現代研究進展。

### 現代應用

- 高膽固醇血症。
- 膽石症。
- 膽道蛔蟲症。
- 瘡癤。

### 不良反應

- 茵陳二炔酮小鼠灌胃的LD<sub>50</sub>為6.98 mg/kg。
- 小鼠灌胃6, 7-二甲氧基香豆素的LD<sub>50</sub>為497 mg/kg，死亡前有陣發性驚厥。
- 對羥基苯乙酮小鼠腹腔注射的LD<sub>50</sub>為0.5 g/kg，口服LD<sub>50</sub>為2.2 g/kg。

## 芳香化濕藥

### 芳香化濕藥概述

- 定義：氣味芳香，具有化濕運脾作用的藥物。
- 功效：疏暢氣機、宣化濕濁、健脾醒胃，
- 主治：濕阻中焦證、濕溫、暑濕等證。
- 辛香溫燥，多入脾、胃、肺、大腸經。

146

### 化濕藥概述

- 脾喜燥而惡濕，“土愛暖而喜芳香”。
- 脾為濕困，可出現脘(說文解字：「脘，胃腑也。」)腹痞滿、嘔吐泛酸、大便溏薄、食少體倦、口甘多涎、舌苔白膩等證。
- 濕阻中焦證與消化系統疾病如急性胃腸炎、痢疾、胃腸過敏、潰瘍病、胃無力或胃下垂、胃腸神經官能症、消化不良等疾病相似。

147

### 芳香化濕藥概述

- 辛香溫燥，主入脾、胃經，能促進脾胃運化，消除濕濁，前人謂之“醒脾”、“醒脾化濕”。
- 辛能行氣，香能通氣，能行中焦之氣機，以解除因濕濁引起的脾胃氣滯之症狀。
- 部分藥兼有解暑、辟穢、開竅、截癘作用。

148

### 芳香化濕藥

- 化濕，即化除濕邪（化中焦濕濁）
- 內經：“諸濕腫滿，皆屬於脾”
- 辛香悅脾 溫燥化濕

149

### 芳香化濕藥

- 氣味芳香，多含揮發油，一般以作為散劑服用療效較好，如入湯劑宜後下，且不應久煎，以免其揮發性有效成分逸失而降低療效；
- 本類藥物多屬辛溫香燥之品，易於耗氣傷陰，故陰虛血燥及氣虛者宜慎用。

150

## 芳香化濕藥的主要藥理作用

### 調整胃腸運動功能

- 均含有揮發油，具有健胃驅風作用，故有刺激或調整胃腸運動功能的作用。
- 佩蘭、白豆寇能提升腸道緊張度，
- 砂仁有促進腸管推進運動作用。
- 對乙醯膽鹼、氯化鉍等引起的動物離體腸肌痙攣，厚朴、蒼朮、砂仁等則有程度不等的解痙作用。

### 2.促進消化液分泌

- 厚朴、廣藿香、白豆寇、草豆寇、草果
- 均含有揮發油，
- 透過刺激嗅覺、味覺感受器，或溫地和刺激局部黏膜，反射性地增加消化腺分泌。

### 3.抗潰瘍作用

- 蒼朮、厚朴、砂仁作用機制：
  1. 增強胃黏膜保護作用：
    - 從蒼朮中提取的氨基己糖具有促進胃黏膜修復作用。
    - 關蒼朮提取物還能增加氨基己糖在胃液和黏膜中的含量。
    - 砂仁能促進胃黏膜細胞釋放前列腺素，保護胃黏膜免遭許多外源性原素的損傷。
  2. 抑制胃酸分泌過多：
    - 厚朴酚能明顯對抗四膚胃泌素及氣甲酚膽鹼所致胃酸分泌增多，
    - 茅蒼朮所含回一枝葉醇有抗H2受體作用，能抑制胃酸分泌，並對抗皮質激素對胃酸分泌的刺激作用。

### 4.抗病原微生物

- 厚朴酚、蒼朮提取物、廣藿香酮對金黃色葡萄球菌、溶血性鏈球菌、肺炎球菌、百日咳桿菌、大腸桿菌、枯草桿菌、變形桿菌、痢疾桿菌、綠膿桿菌等具有抑制或殺滅作用。其中尤以厚朴抗菌力強，抗菌譜廣。
- 蒼朮對黃麴霉菌及其他致病性真菌，藿香的乙醚及乙醇浸出液對白色念珠菌、許蘭氏黃癩菌、趾間及足趾毛癬菌等多種致病性真菌有抑制作用。
- 厚朴、蒼朮、廣藿香、砂仁、白豆寇對腮腺炎病毒、流感病毒等有抑制作用。

### 綜述

- 疏暢氣機、宣化濕濁、健脾醒胃等功效相關的藥理作用為調整胃腸運動功能、促進消化液分泌、抗潰瘍、抗病原微生物。
- 主要有效成分是揮發油。
- 本類藥的藥理作用多與所含揮發性成分有關，因此入藥不宜久煎。

### 厚朴《神農本草經》

- 木蘭科植物的乾燥幹皮、根皮及枝皮
- 厚朴 *Magnolia officinalis* Rehd. Et Wils.
- 凹葉厚朴 *Magnolia officinalis* Rehd. Et Wils. Var. *biloba* Rehd. Et Wils.
- 主要成分：
  - 木脂素類：厚朴酚 (**Magnonol**)、四氫厚朴酚 (Tetrahydromagnonol)、異厚朴酚 (isomagnonol) 及和厚朴酚 (**honokiol**)，
  - 生物鹼類：木蘭箭毒鹼 (Mmagnocurarine)，
  - 揮發油：β-桉葉醇 (machilol)。
- 味苦、辛，性溫。歸脾、胃、肺、大腸經。

### 與功效主治相關的藥理作用

- 功效：燥濕、消積、行氣、平喘。
- 主治：濕滯傷中，皖痞吐瀉，食積氣滯，腹脹便秘，痰飲喘咳。
- 名醫別錄：消痰下氣，療霍亂及腹痛脹滿。
- 藥性論：主療積年冷氣，腹內雷鳴，虛吼，宿食不消，除痰飲，去結水……消化水谷，止痛。大溫胃氣，嘔吐酸水，主心腹滿。

### 一. 燥濕行氣--濕滯中焦證

### 二. 消積--腸胃積滯

### 三. 平喘--痰飲咳喘

159

### (1) 調整胃腸運動功能

- 厚朴煎劑對兔離體腸肌有興奮作用。
- 在一定劑量範圍內對小鼠離體腸管產生興奮作用，
- 加大劑量則產生抑制作用。
- 對豚鼠離體腸管的作用與小鼠基本一致，但興奮作用不明顯，而抑制作用更顯著。
- 厚朴酚對組織胺所致十二指腸痙攣有一定的抑制作用。

### (2) 促進消化液分泌

- 厚朴所含揮發油，透過刺激嗅覺、味覺感受器，或溫和地刺激局部黏膜，能反射性地增加消化腺分泌。

### (3) 抗潰瘍

- 生品厚朴煎劑、姜炙厚朴煎劑、厚朴酚及和厚朴酚對大鼠幽門結紮型潰瘍及應激型潰瘍均有明顯抑制作用。
- 厚朴乙醇提取物對大鼠HCl-乙醇所致潰瘍有顯著抑制作用。
- 厚朴酚還能明顯對抗因應激，或靜脈注射胃泌素、氫甲酚膽鹼所致胃酸分泌增多。
- 厚朴抗潰瘍作用與其抑制胃酸分泌過多有關。

#### (4)保肝

- 厚朴對小鼠實驗性病毒性肝炎有一定保護作用，可減輕細胞變性壞死等實質性病理損害。
- 厚朴酚為抗肝炎病毒的有效成分。
- 厚朴酚
  - 對急性實驗性肝損傷，具有降血清ALT作用。
  - 能對抗免疫性肝纖維化損傷，能明顯防止肝纖維化及肝硬變的形成，並能提升免疫性肝纖維化大鼠血漿SOD活性，降低LPO含量。

#### (5)抗菌抗病毒

- 名醫別錄：厚朴“殺三虫”。
- 厚朴酚
  - 對革蘭陽性菌、耐酸性菌、類酵母菌和絲狀真菌均有顯著的抗菌活性。
  - 對各種變形鏈球菌及乳酸桿菌均有抑制作用。
  - 對引起人類急性膿瘡和絨毛狀膜塊疾病的炭疽桿菌有明顯抗菌活性。
- 厚朴的酚性成分、乙醚及甲醇提取物，對牙病中致齲齒的變形鏈球菌有十分顯著的抗菌作用，能抑制該菌在牙平滑面上的附着。
- 厚朴酚、和厚朴酚及其代謝產物四氫厚朴酚、四氫和厚朴酚，由於聯苯環上的煙基及烯丙基可產生抗菌活性，均有極強的抗菌作用。
- 厚朴中所含新木脂素對Epstein-Barr病毒激活有抑制作用。

#### (6)抗發炎鎮痛

- 厚朴乙醇提取物：
  - 對醋酸引起的小鼠腹腔毛細血管通透性升高、二甲苯所致耳殼腫脹、角叉菜膠引起的足腫脹均有明顯的抑制作用。
  - 對小鼠醋酸所致扭體回應及熱痛刺激甩尾回應也呈現抑制作用。
  - 表明具有較好的抗發炎和鎮痛作用。

## 2.其他藥理作用

#### (1)中樞抑制和肌肉鬆弛

- 厚朴酚、和厚朴酚及厚朴乙醚提取物：
  - 有明顯的中樞抑制作用，
  - 小鼠腹腔注射可明顯減少自主活動，
  - 可對抗甲基苯丙胺或阿朴嗎啡所致的中樞興奮。
- 厚朴提取物對腦幹網狀架激活系統及下視丘前部的覺醒中樞有抑制作用。
- 厚朴酚能顯著抑制中樞興奮性氨基酸谷氨酸的作用而產生脊髓抑制。
- 厚朴酚及和厚朴酚具有中樞性肌肉鬆弛作用，能明顯抑制脊髓反射，作用可被大劑量的士的寧(strychnine)所拮抗，屬於非箭毒樣的肌肉鬆弛劑。

#### (1)中樞抑制和肌肉鬆弛

- 厚朴鹼：
  - 靜脈注射能阻斷動物神經運動終板的傳遞功能，使橫紋肌鬆弛，且無快速耐受現象，此作用與靜脈注射箭毒鹼相似，
  - 靜脈注射新斯的明(neostigmine)可對抗其肌肉鬆弛效應，
  - 厚朴鹼可能屬非去極化型骨骼肌鬆弛劑，具有筒箭毒鹼樣肌肉鬆弛作用。

- 2) 抑制血小板聚集：厚朴酚與和厚朴酚
  - 能明顯抑制膠原、花生四烯酸所誘導的家兔血小板血漿的聚集，並抑制ATP釋放。
  - 與抑制血栓烷A<sub>2</sub>(TXA<sub>2</sub>)的合成及細胞內的Ca<sup>2+</sup>流動有關。
- 3) 降血壓、鬆弛血管平滑肌：
  - 低於肌肉鬆弛劑量的厚朴鹼注射給藥
    - 有明顯的降低血壓作用，
    - 不被抗組織胺藥異丙嗪所對抗，
    - 表明並非由於組織胺釋放所致。
  - 厚朴酚及和厚朴酚：
    - 能對抗K<sup>+</sup>、Ca<sup>2+</sup>、去甲腎上腺素等所引起的大鼠主動脈條收縮，
    - 可能與鈣通道阻滯作用有關。
- 4) 厚朴提取物尚有抗過敏、抗腫瘤作用。

### 綜述

- 與厚朴燥濕、消積、行氣功效相關的藥理作用為調整胃腸運動、促進消化液分泌、抗潰瘍、保肝、抗菌、抗病毒、抗發炎、鎮痛等作用。
- 主要有效成分是以厚朴酚為代表的木脂素類成分。
- 厚朴的中樞抑制、肌肉鬆弛、鈣通道阻滯、抑制血小板聚集、降血壓等作用，則是其藥理作用的現代研究進展。

### 現代應用

1. 細菌性痢疾。
2. 防治齲齒：
  - 用厚朴酚凝膠(厚朴酚結晶、分子量為400的聚乙二醇、木糖醇，以煙乙基纖維素為基質，加適量調味劑)。
  - 厚朴牙膏亦有預防齲齒發生的作用。
3. 肌強直：用厚朴9-15g，加水分煎2次，頓服。

### 不良反應

- 厚朴酚凝膠預防齲齒，用藥週期1年左右，未見明顯不良反應發生。
- 厚朴中有毒成分主要是木蘭箭毒鹼，其在腸中吸收緩慢，吸收後即經腎臟排泄，血中濃度較低，故口服毒性較小。
- 厚朴煎劑、木蘭箭毒鹼給小鼠腹腔注射的LD<sub>50</sub>分別為6.12 g/kg和45.55 mg/kg。
- 厚朴在一般肌肉鬆弛劑量下，對實驗動物心電圖無影響，大劑量可致呼吸肌麻痺而死亡。

### 蒼朮

- 為菊科植物
- 茅蒼朮 *Attractylodes lancea* (Thunb.) DC.
- 北蒼朮 *A. chinensis* (DC.) Koidz. 的乾燥根莖。
- 主要成分：揮發油
  - 蒼朮醇 (atractylol)，為β-桉葉醇 (β-eudesmol) 和茅朮醇 (hinesol) 的混合物，
  - 蒼朮酮 (Atractylone)、蒼朮素 (atractylodin)。
  - 茅蒼朮根莖：5%-9%，
  - 北蒼朮根莖：1.5%，
- 味辛、苦，性溫。歸脾、胃經。

### 與功效主治相關的藥理作用

- 功效：燥濕健脾，祛風濕。
- 主治：濕阻中焦，風寒濕痺，腳膝腫痛，痿軟無力，雀目夜盲。
- 珍珠囊：能健胃安脾，諸濕腫非此不能除。
- 本草綱目：治濕痰留飲……及脾濕下流，濁瀝帶下，滑瀉腸風。
- 新修本草：利小便。

### (1)調整胃腸運動功能

- 蒼朮煎劑、蒼朮醇提取物在一定劑量範圍內：
  - 能明顯緩解乙酰膽鹼所致家兔離體小腸痙攣，
  - 對腎上腺素所致小腸運動抑制，則有一定的對抗作用。
- 蒼朮醇提取物：
  - 對抗乙酰膽鹼、氯化鋇所致大鼠離體胃平滑肌痙攣，
  - 對正常大鼠胃平滑肌則有輕度興奮作用。
- 蒼朮丙酮提取物、β-桉葉醇及茅朮醇：
  - 對氣甲醯膽鹼、Ca<sup>2+</sup>及電刺激所致大鼠在體小腸收縮加強，均有明顯對抗作用。
- 蒼朮丙酮提取物對小鼠碳末推進運動則有明顯促進作用。

### (2)抗潰瘍作用

- 茅蒼朮及北蒼朮：
  - 對幽門結紮型潰瘍、幽門結紮-阿司匹林潰瘍、應激性潰瘍有較強的抑制作用，
  - 均能顯著抑制潰瘍動物的胃液量、總酸度、總消化能力及胃黏膜損害。
- 蒼朮抗潰瘍作用機理：
  1. 抑制胃酸分泌：
    - 北蒼朮中的蒼朮醇能抑制胃體激素的釋放，減輕胃體激素對胃酸分泌的刺激，
    - 茅蒼朮所含β-桉葉醇有抗H<sub>2</sub>受體作用，能抑制胃酸分泌，並對抗皮質激素對胃酸分泌的刺激作用。
  2. 增強胃黏膜保護作用：
    - 北蒼朮可使胃黏膜組織血流量增加，
    - 氨基己糖具有促進胃黏膜修復作用，
    - 關蒼朮 (A. japonica)還能明顯增加氨基己糖在胃液和黏膜中的含量，從而增強胃黏膜保護作用。

### 3) 保肝：

- 蒼朮及β-桉葉醇、茅朮醇、蒼朮酮對CCl<sub>4</sub>及D-氨基半乳糖誘發的培養鼠肝細胞損害均有顯著的預防作用。
- 蒼朮煎劑對小鼠肝臟蛋白質合成有明顯促進作用。

### 4) 抑菌：

- 蒼朮提取物能降低細菌耐藥性的產生。

## 2.其他藥理作用

### (1)對血糖的影響

- 蒼朮煎劑灌胃給藥或醇浸劑皮下給藥：
  - 可使正常家兔血糖水準升高，
  - 對四氧嘧啶性糖尿病家兔則有降血糖作用。
- 蒼朮水提取物灌胃可使鏈黴素(streptozotocin)誘發的大鼠高血糖水準降低。
- 蒼朮有效成分和腺嘌呤核苷酸在同一粒線體上起競爭性抑制作用，從而抑制細胞內氧化磷酸化作用，干擾能量的轉移過程。

### (2)抗缺氧

- 對氰化鉀所致小鼠缺氧模型，蒼朮丙酮提取物750 mg/kg灌胃，
  - 能明顯延長小鼠的存活時間，
  - 降低小鼠相對死亡率。
- 抗缺氧的主要活性成分為β-桉葉醇。

### (3) 中樞抑制

- 茅蒼朮、北蒼朮、 $\beta$ -桉葉醇、茅朮醇對小鼠有鎮靜作用，能抑制小鼠自發活動。
- 茅蒼朮提取物和揮發油，小劑量使脊髓反射亢進，較大劑量則呈抑制作用，終致呼吸麻痺而死。
- 茅蒼朮和北蒼朮的提取物：
  - 能增強巴比妥睡眠作用，
  - 藥理活性成分： $\beta$ -桉油醇和茅朮醇。

- 4) 抗腫瘤：蒼朮揮發油、茅朮醇、 $\beta$ -桉葉醇 100 mg/mL 在體外對食管癌細胞有抑制作用，其中茅朮醇作用較強。
- 5) 促進骨鈣鈣化：
  - 蒼朮中含有與鈣磷吸收有關的**維生素D**，
  - 揮發油具有促進骨鈣鈣化作用。
- 6) 對心血管系統的影響：
  - 蒼朮對蟾蜍心臟有輕度抑制作用，對蟾蜍後肢血管有輕度擴張作用。
  - 蒼朮浸膏小劑量靜脈注射，可使家兔血壓輕度上升，大劑量則使血壓下降。

### 綜述

- 與蒼朮燥濕健脾功效相關的藥理作用為調整胃腸運動功能、抗潰瘍、保肝、抑菌等。
- 蒼朮主要有效成分是以 $\beta$ -桉葉醇及茅朮醇為代表的**揮發油**。
- 蒼朮對血糖的影響、抗缺氧、中樞抑制、抗腫瘤、促進骨鈣鈣化及對心血管系統的影響等作用，則是現代研究進展。

### 現代應用

1. 小兒腹瀉。
2. 佝僂病。
3. 防水痘、腮腺炎、感冒。
4. 皮膚癢痒症。

### 不良反應

- 小鼠灌胃北蒼朮揮發油的LD<sub>50</sub>為4.71 mL/kg。

### 廣藿香

- 為唇形科植物廣藿香 *Pogostemon cablin* (Blanco) Benth. 的乾燥地上部分。
- 主要成分：
  - **揮發油**約1.5%：
    - 廣藿香醇 (patchouli alcohol)，約占52%-57%，
    - 廣藿香酮 (pogostone)。
  - 苯甲醛、丁香油酚、桂皮醛、廣藿香比啉。
  - 多種倍半萜及黃酮類成分。
- 味辛，性微溫。歸脾、胃、肺經。

### 與功效主治相關的藥理作用

- 功效：芳香化濁，開胃止嘔，發表解暑。
- 主治：濕濁中阻，脘痞嘔吐，暑濕倦怠，胸悶不舒，寒濕閉暑，腹痛吐瀉，鼻淵頭痛。
- 本草圖經：治脾胃吐逆，為最要之藥。
- 名醫別錄：去惡氣，止霍亂、心痛。
- 本草正義：能祛除陰霉濕邪，而助脾胃正氣，為濕困脾陽，倦怠無力，飲食不好，舌苔濁垢者最捷之藥。

### (1)促進胃液分泌

- 揮發油：可刺激胃黏膜，促進胃液分泌，增強消化能力。

### (2)抗病原微生物

- 抗菌作用：
  - 廣藿香酮可抑制金黃色葡萄球菌、肺炎雙球菌、溶血性鏈球菌、大腸桿菌、痢疾桿菌、綠膿桿菌；
  - 藿香煎劑、水浸出液、醚浸出液、醇浸出液對許蘭氏黃癬菌、趾間及足距毛癬菌等多種致病性真菌有抑制作用，煎劑抗菌作用弱於後者；
  - 藿香黃酮類物質有抗病毒作用，可抑制消化道、上呼吸道鼻病毒生長繁殖。
  - 藿香煎劑對鉤端螺旋體有低濃度抑制，高濃度殺滅作用。

### 2.其他藥理作用

- 細胞毒活性：
  - 新的二萜類成分，具有細胞毒活性。
  - 衍生化的產物也具有類似活性。
  - 在體外能非特異性地作用於多種人癌細胞鏈。

### 綜述

- 芳香化濁、開胃止嘔、發表解暑功效相關的藥理作用為促進消化液分泌、抗病原微生物等作用。
- 主要有效成分是廣藿香酮、廣藿香醇及黃酮類成分。
- 細胞毒活性則是廣藿香的現代研究進展，主要有效成分是二萜類成分。

### 現代應用

- 藿香正氣散(丸、水、膠囊)治療急慢性胃腸炎、消化不良、胃腸過敏、夏日感冒。
- 藿香配伍用藥治療早孕及霉菌性陰道炎具有一定療效。{早期妊娠，指從末次月經第一日起至第13週末之前。胚胎在此時會急劇改變發展。大約一半的女性會在這時（也只在這時）出現害喜症狀。}
- 單用藿香煎湯，時時漱口，可去口臭。