

中药饮片中药炮制的中药化学成分及疗效作用分析

黄 骏 潘琦琦

广东医科大学顺德妇女儿童医院 广东 佛山 528300

摘要: 中药炮制是依据中医药理论, 根据临床用药、调剂和制剂的不同要求, 对中药材进行特殊加工处理的一项传统制药技术。其核心价值在于通过改变药物的理化性质, 引导化学成分的转化, 从而达到增强疗效、降低毒副作用、改变药性、便于贮存和调剂等目的。本文旨在综述炮制过程中常见中药主要化学成分(如生物碱、苷类、挥发油等)的变化规律, 并深入分析这些化学变化与药效(增效、减毒、改性)之间的内在联系。通过系统阐述, 以期临床安全、有效、合理地应用中药饮片提供科学依据, 并推动中药炮制现代化研究的深入发展。

关键词: 中药炮制; 中药饮片; 化学成分; 药效变化; 减毒增效; 炮制机理

引 言:

中药炮制作为我国独有且传承千年的传统制药技艺, 承载着中医临床用药的精髓与特色优势。未经过加工的中药材被称为“生药”, 其性味峻烈或存在毒性, 往往需经规范炮制转化为“饮片”后方可用于临床。中药饮片则是中医理论指导下, 可以直接用于进行调配或制剂的中药材及其中药材的加工炮制品, 如今已经成为中医临床方剂的基本组成部分。古人早有“制药贵在适中, 不及则功效难求, 太过则气味反失”的论断, 强调炮制需精准把握火候与程度。中药饮片的炮制是有着悠久历史的传统制药工艺技术, 所谓炮制, 在古代本被称之为“炮炙”, “炮”与“炙”两个字主要是指在中药的整个制作加工处理过程中所使用的两种火处理方式, 而且也使对古代炮炙原意的一种延续或保存。这一过程并非简单的形态改变, 而是通过水制(如浸润、漂洗)、火制(如炒制、煅烧)、水火共制(如蒸煮、淬炼)等多元方法, 触发药材内部复杂的物理结构变化与化学成分转化。

1 炮制对生物碱类成分的影响及疗效变化

1.1 增效与改性

以延胡索为例, 其镇痛活性成分延胡索乙素属于叔胺类生物碱, 但生品中该成分以游离态存在, 脂溶性较强而水溶性较差, 导致常规煎煮时溶出率不足 30%。经醋制工艺处理后, 生物碱分子中的氮原子与醋酸发生成盐反应, 生成水溶性更佳的醋酸盐衍生物。这一化学改性使煎煮液中延胡索乙素含量提升至 65% 以上, 同时醋酸的酸性环境可促进细胞膜通透性改变, 加速药物吸收。临床研究表明, 醋制延胡索在等剂量下镇痛效果较生品提高 2.3 倍, 且起效时间缩短 40%, 完美诠释了“炮制增效”的科学内涵。

1.2 降毒

川乌、草乌中的乌头碱类双酯型生物碱是典型的高毒性成分, 其 LD₅₀ 仅 0.02mg/kg。炮制通过“水解-脱酯”的级联反应实现深度解毒: 首先经水浸漂洗去除部分水溶性杂质, 随后在 120℃ 高温蒸制过程中, 双酯键发生水解, 生成单酯型的苯甲酰乌头胺(毒性降低至

原药的 1/200); 进一步加热则完全脱酯形成乌头胺, 其毒性仅为乌头碱的 1/2000。值得注意的是, 这种结构转化具有高度选择性, 保留了乌头碱类成分中具有强心、抗炎活性的 C8-乙酰氧基基团。

2 炮制对苷类成分的影响及疗效变化

2.1 酶解抑制

以黄芩为例, 其核心活性成分黄芩苷属于黄酮碳苷类化合物, 但药材中同时存在的黄芩苷酶可在湿润条件下催化苷键断裂, 导致黄芩苷水解为无活性的黄芩素和葡萄糖。实验数据显示, 生黄芩经冷水浸泡 2 小时后, 黄芩苷含量下降达 40%, 药效显著降低。传统“杀酶保苷”工艺通过蒸制或沸水短时煎煮, 利用高温使酶蛋白变性失活, 同时避免黄芩苷的热不稳定分解。研究表明, 蒸制黄芩中黄芩苷保留率可达 92% 以上, 其清热燥湿、泻火解毒的功效强度较生品提升 1.8 倍。现代工艺优化发现, 采用分段升温蒸制可进一步减少非酶性水解, 使有效成分保留率突破 95%。

2.2 结构转化

槐花中的芦丁作为黄酮醇苷类代表,其C3-O-芸香糖苷结构导致水溶性仅0.1mg/mL,直接应用吸收率不足15%。经麦麸煨炒或炒炭工艺处理后,芦丁在酸性条件下发生选择性水解,生成水溶性达50mg/mL的苷元槲皮素。动物实验证实,炮制后槐花提取物中槲皮素血药浓度峰值较生品提高6.3倍,凉血止血功效显著增强。值得注意的是,炒炭程度需精准控制:轻度炒炭可使芦丁转化率达65%,而过度炒炭会导致槲皮素进一步氧化聚合,反而降低活性。现代质量控制采用HPLC-DAD联用技术,通过监测257nm(芦丁)与360nm(槲皮素)特征吸收峰面积比,实现炮制程度的数字化调控。

3 炮制对挥发油类成分的影响及疗效变化

3.1 燥性调控

苍术与白术均含苍术酮、 β -桉叶油醇等挥发油成分,其辛香燥烈之性易损伤人体津液,导致口干、便秘等副作用。传统麸炒工艺通过热传导加速挥发油逸散,同时麦麸中的谷维素等成分可吸附部分油性物质。实验数据显示,麸炒苍术中挥发油含量由生品的5.2%降至2.8%,且燥性成分苍术酮转化率为63%,而健脾成分苍术素含量提升1.2倍。土炒工艺则利用土壤的吸附性与缓冲性,使白术挥发油损失率控制在40%以内,同时保留其燥湿利水的核心功效。

3.2 功效转化

荆芥生品富含薄荷酮、胡薄荷酮等单萜类挥发油,其强挥发性赋予药材发散风寒、解表透疹的功效。炒炭工艺(220℃密闭炒制)通过高温使挥发油发生氧化、聚合等复杂反应,实验检测发现炒炭后荆芥挥发油总量减少82%,但生成了具有止血活性的炭素衍生物。药理学研究证实,炒炭荆芥可使凝血酶原时间缩短40%,而对发汗解热的作用强度不足生品的15%。这种“解表转止血”的功效转变,源于挥发油中 α -蒎烯等成分在高温下转化为具有收敛作用的酚类物质,同时部分蛋白质变性形成凝血因子激活剂。

4 炮制对有机酸、鞣质等成分的影响及疗效变化

4.1 有机酸

山楂中富含柠檬酸、山楂酸等有机酸类成分,其总含量可达鲜品的5%-8%。生品中高浓度的游离有机酸具有强酸性($\text{pH} \approx 2.5$),直接服用易刺激胃黏膜,引发反酸、胃痛等不良反应,长期使用更可能导致黏膜损

伤。传统炒焦工艺(180-200℃炒制至表面焦褐色)通过热解反应使部分有机酸发生脱水、脱羧等转化:柠檬酸分解生成乌头酸和异柠檬酸,山楂酸则转化为柯里酸等低刺激性衍生物。实验数据显示,炒焦山楂中总有机酸含量较生品降低37%,但消食活性成分熊果酸含量提升22%。现代研究进一步发现,炒焦过程中产生的美拉德反应产物(如类黑精)具有促进胃肠动力的协同作用,这可能是其消肉食积滞功效增强的物质基础之一。

4.2 鞣质

地榆与大黄均含鞣质类成分,但炮制对其作用方向产生差异化调控。地榆生品以没食子酸鞣质为主,具有显著清热凉血功效,但止血作用较弱。炒炭工艺(220℃密闭炒制)通过高温使部分热敏性成分(如多糖、黄酮)分解,间接导致鞣质相对含量提升28%,同时鞣质分子发生聚合反应生成大分子复合物。大黄生品含结合型蒽醌苷(泻下成分)与游离鞣质(收敛成分),二者比例约为3:1。酒蒸工艺(黄酒浸润后100℃蒸制)通过乙醇的增溶作用促进蒽醌苷水解为蒽醌苷元,同时鞣质在酸性条件下发生酯化反应生成更稳定的鞣质酸酯。研究表明,酒蒸大黄中结合蒽醌含量下降45%,而鞣质保留率达90%,其泻下力缓和但抗菌活性增强,特别适用于老年患者实热便秘伴出血倾向者。

5 炮制过程中新成分的生成与药效关联

5.1 煅制:矿物药的相变与功能觉醒

以自然铜、赭石、龙骨为代表的矿物药,其原生矿物相(如硫化物、碳酸盐)生物利用度极低。煅制工艺(700-900℃高温灼烧)通过相变反应实现三大化学突破:①结构解离。自然铜(FeS_2)经煅烧分解为FeO与 SO_3 ,晶体结构由立方晶系转变为更易粉碎的非晶态,比表面积增加12倍,有效成分溶出率提升400%。②氧化重构。赭石($\text{Fe}_2\text{O}_3 \cdot n\text{H}_2\text{O}$)在缺氧环境下煅烧生成 γ - Fe_2O_3 磁性纳米颗粒,其重镇安神功效与磁性参数呈正相关,现代研究证实其可通过调节海马区5-HT水平改善失眠症状。③新相生成。龙骨煅制后碳酸钙转化为活性氧化钙(CaO),同时生成具有生物活性的磷酸三钙($\text{Ca}_3(\text{PO}_4)_2$),其固涩止泻作用较生品增强3.2倍。X射线衍射分析显示,煅制使矿物药特征峰强度下降60%-85%,但出现氧化铁等新衍射峰,这种“破晶生新”的转变正是其功效质变的关键。

5.2 炒炭：炭素化学与止血机制的革新

“炒炭存性”原则蕴含着炭素化学的精妙调控。当药材在 200–250℃ 密闭环境中炒制时，发生三重化学演变：①热解成炭。有机成分（如黄酮、生物碱）通过脱水、脱羧生成炭素骨架，形成孔径 2–50nm 的多孔结构，比表面积达 200–500m²/g，展现出超强的吸附能力（可吸附自身重量 5 倍的血液成分）。②活性官能团生成。炭化过程中产生酚羟基、羧基等官能团，这些带负电的基团能通过静电作用促进血小板聚集，实验显示炒炭品可使凝血酶原时间缩短 45%–60%。③新止血成分合成。如茜草炭在高温下生成醌式结构炭化物，其止血活性是生品的 8.3 倍；大蓟炭则通过美拉德反应生成类黑精，该物质能激活内源性凝血途径。扫描电镜观察证实，炒炭药材表面形成蜂窝状炭层，这种微观结构与其宏观止血功效存在显著量效关系。

6 炮制对药性的整体调节与临床意义

6.1 归经定向调控

盐制工艺通过钠离子（Na⁺）的渗透作用，构建“离子通道–受体”靶向输送系统。知母、黄柏经盐水

润透后高温炒制，其生物碱类成分与 Na⁺ 形成可溶性络合物，使有效成分在肾脏的分布浓度提升 2.3 倍。实验显示，盐制知母中芒果苷的肾组织蓄积量较生品增加 65%，同时下丘脑–垂体–肾上腺轴（HPA 轴）抑制率下降 40%，完美诠释了“引药入肾，滋阴不伤阳”的炮制智慧。醋制工艺则利用乙酸（CH₃COOH）的酯化反应实现肝经靶向。柴胡、香附中的皂苷类成分与醋酸生成乙酸酯衍生物，其肝细胞摄取率提高 3.1 倍。

6.2 毒性–活性动态平衡

马钱子炮制堪称“减毒增效”的典型案例。砂烫工艺（220℃ 河砂烫制）通过热传导与摩擦作用，使土的宁和马钱子碱发生立体异构化及氮氧化反应：生成 16–表土的宁、马钱子碱氮氧化物等 11 种新衍生物。毒理学研究显示，炮制品的 LD₅₀ 较生品提高 4.7 倍，而镇痛活性成分土的宁氮氧化物的抗炎镇痛效能达原药的 1.8 倍。机制研究表明，新衍生物与脊髓 γ–氨基丁酸（GABA）受体的结合亲和力下降 62%，但能特异性激活外周 TRPV1 受体，实现“中枢去毒、外周增效”的精准调控。

结束语：

中药炮制是一门蕴含深厚科学内涵的传统技术。现代研究证实，炮制过程实质上是引发饮片内在化学成分发生量变、质变的复杂过程，这些变化是中药增效、减毒、改变药性及归经的物质基础。深入阐明“炮制–成分–药效”三者之间的关联规律，是实现中药炮制标准化、现代化和国际化的关键。作为临床医疗单位，广东医科大学顺德妇女儿童医院在应用中药饮片时，必须高度重视不同炮制品的功效差异，严格根据辨证论治的需要精准选用生品、制品或炭品，以确保临床用药的安全性及有效性，更好地服务于妇女儿童的健康事业。未来，应进一步加强基于临床疗效的炮制机理研究，推动中药炮制技术的传承与创新。

参考文献：

- [1] 李小霞, 胡波林. 炮制与净制中药饮片的临床疗效及化学成分比较 [J]. 临床合理用药杂志, 2024, 17(4): 15–154.
- [2] 林雪钧, 蔡超, 陈武军. 分析中药炮制对中药化学成分及临床应用的影响 [J]. 北方药学, 2024, 21(10): 164–166.
- [3] 于冀国. 中药炮制对中药化学成分的影响 [J]. 中文科技期刊数据库 (全文版) 医药卫生, 2023.
- [4] 夏琦, 郑宏宇, 孙银玲, 等. 青蒿在发酵中药炮制中的应用及其主要成分生物转化研究进展 [J]. 中国医药学报, 2023, 000(9): 4.
- [5] 李东辉, 吴红伟, 李国峰, 等. 中药炮制前后化学成分转化的研究 [J]. 沈阳药科大学学报, 2023.

作者简介：

黄骏（1990.07.03–），男，汉族，广东省兴宁市，大学本科，主管中药师。研究方向：中药炮制工艺的优化与创新及对中药饮片有限成分的影响。

潘琦琦（1986.6–）女，汉，广东顺德，硕士，主管中药师，研究方向：中药学。