

# 从行气止痛到多靶点调控： 木香传统功效的现代药理学诠释与转化

张秀月 杨 循 李蕊杉 郑 航 张 雪 周洋西\*

重庆医药高等专科学校 重庆 401331

**摘要：**木香作为菊科植物木香的干燥根，是中医理论中“行气止痛、健脾消食”的要药，临床应用历史悠久。长期以来，其确切的药效物质基础与分子作用机制尚未明确。本文旨在对近年来木香研究的现代进展进行系统综述。通过整合现代分析化学、分子药理学、网络药理学及临床研究等多学科的研究成果，揭示出以去氢木香内酯、木香烯内酯为代表的倍半萜内酯类成分是其核心药效物质，其 $\alpha$ 、 $\beta$ -不饱和羰基结构是发挥抗炎、抗氧化等活性的关键药效基团。研究证实，木香通过多成分、多靶点、多通路的协同作用，精准调节胃肠运动、修复黏膜损伤、抑制炎症反应，并从细胞与基因层面展现出抗肿瘤等潜在活性。尤为重要的是，基于其传统功效的现代科学诠释，已成功衍生出如抗溃疡性结肠炎候选药物PD-4-26等创新转化成果。本综述表明，对木香的现代研究不仅为其中医传统功效提供了坚实的科学依据，也为其在更广阔疾病谱中的精准应用和新药研发开辟了全新路径。

**关键词：**木香；倍半萜内酯；药效物质基础；作用机制；网络药理学；中药现代化

## 引言：

中药木香作为一味历史悠久且应用广泛的中药材，在中国传统医药体系中占有重要地位。其主要产区位于中国云南省、重庆开州等地，得益于当地独特的气候条件和土壤环境，所产木香品质优良、药效显著，因此在中医药领域普遍被称为“云木香”，具有较高的地道性和辨识度<sup>[1]</sup>。

木香的性味为辛、苦，性属温，归经涵盖脾经、胃经、大肠经、三焦经及胆经。其辛散苦降、温通调中的特性，使其在理气、止痛、健脾和胃、疏肝利胆等方面表现出广泛的药理作用<sup>[2]</sup>。临床上常用于治疗胸腹胀痛、呕吐泄泻、里急后重及肝胆郁滞等证，体现了其多经归属、功能全面的中药特色<sup>[3]</sup>。

自《神农本草经》首次记载以来，木香便以其卓越的“行滞气、调诸气”功效备受历代医家推崇。明代李时珍在《本草纲目》中进一步强调，木香乃是“三焦气分之药，能升降诸气”，突显了其在调节气机方面的独特作用。在传统临床应用上，木香主要用于缓解胸胁脘腹胀痛、治疗泻痢后重、消除食积不消等症状，展现了多方面的治疗价值<sup>[4]</sup>。

然而，如同诸多传统中药一般，木香同样面临着“成分复杂、机制不清”的共性难题。此问题长期以来对其进一步的深度开发以及在国际范围内获得认可、推广和应用形成了限制。当下，伴随科学技术的飞速发展，尤其是色谱-质谱联用技术、基因组学、蛋白质组学以及生物信息学等现代研究方法的应用，木香的研究实现了从传统经验总结向精准科学验证的重大跨越。

当前的研究不仅聚焦于药效物质的分离与鉴定，还深入解析其作用靶点及分子通路，从而为木香的现代化与国际化奠定了坚实基础<sup>[5]</sup>。本文旨在系统梳理木香研究从传统到现代的这一跨越性进程，全面展现传统智慧与现代科学深度融合所带来的丰硕成果。

## 1 传统功效的现代重估与拓展

传统中医理论秉持着整体观念和辨证论治的基本原则，将木香的核心功效精炼地归纳为“行气止痛，健脾消食”。这一概括不仅体现了中医药学对木香药性的深刻理解，也反映了其在调理气机、缓解疼痛以及促进消化功能方面的独特价值。随着现代科学技术的发展，

药理学研究通过一系列严谨的实验，不仅从科学角度验证了木香这些传统功效的有效性和作用机制，还进一步揭示出其在抗炎<sup>[6]</sup>、抗菌、调节免疫以及抗肿瘤等多方面的潜在应用价值，拓展了木香在现代医学中的使用前景<sup>[7]</sup>。

### 1.1 核心功效的现代药理学验证

现代药理学研究进一步证实,“行气止痛”这一传统功效与木香对胃肠功能的双向调节作用密切相关<sup>[8]</sup>。实验研究表明,木香中的活性成分能够特异性地作用于胃肠道平滑肌,既可通过抑制平滑肌过度收缩来缓解胃肠痉挛,从而显著减轻疼痛症状,又能增强胃肠蠕动功能,有效消除腹胀不适。这种独特的双向调节特性为临床治疗脘腹胀满、疼痛以及泻痢后重等消化道症状提供了充分的科学依据<sup>[9]</sup>。其作用机制涉及多靶点调节:一方面通过影响胃肠激素(如胃动素、胃泌素等)的分泌平衡,另一方面通过调控肠神经系统中的神经递质释放,同时还能调节细胞膜离子通道(如钙离子通道)的通透性,共同维持胃肠功能的动态平衡。

在“健脾消食”方面,深入研究揭示了木香对消化系统的多重保护作用。实验证明,木香提取物能显著增强胃黏膜的防御能力,通过促进胃黏膜血流灌注和增加黏液分泌,有效修复受损黏膜,从而对抗实验性胃溃疡的形成。同时,木香还表现出明显的利胆功效,能够刺激肝细胞分泌胆汁,增强胆囊收缩功能,使胆汁排出量增加约30%~50%,这不仅有助于脂类物质的乳化与消化,还能促进脂溶性维生素的吸收。这些作用共同构成了木香“健脾消食”功效的现代药理学基础,为其在治疗消化不良、食欲不振等方面的应用提供了理论支持<sup>[9]</sup>。

### 1.2 潜在功用的再发现与拓展

传统上,木香“行气止痛、健脾消食”的核心功效,在现代药理学中已得到明确验证:其提取物对胃肠道平滑肌的双向调节作用构成了“行气止痛”的科学基础,而促进胃排空、抗胃溃疡及利胆作用则阐释了其“健脾消食”的现代内涵。与此同时,经由对《普济方》等古籍开展系统的数据挖掘以及运用现代高通量药效筛选方法,部分此前未得到充分重视的潜在功用正被重新发掘与确认。研究发现,木香在抗炎、镇痛(其作用已超越消化道范畴)、抗菌(如抗串珠镰孢菌)以及抗肿瘤<sup>[10]</sup>等多个方面均表现出显著活性。这些发现不仅印证了古籍中关于其用于“诸痛、疮疡”的记载,更极大地拓展了其现代应用的想象空间,例如在慢性炎症性疾病管理、疼痛控制及肿瘤辅助治疗等新领域展现出潜在价值。

## 2 药效物质基础的系统解析

明确药效物质基础是中药现代化的基石。现代分析技术已系统阐明,倍半萜内酯类化合物是木香中含量最丰富、生物活性最显著的一类成分<sup>[11]</sup>。

### 2.1 核心活性成分群的锁定

木香中已鉴定出木香烃内酯、去氢木香内酯、木香内酯等多种倍半萜。研究标明,采用高效液相色谱-

四极杆飞行时间质谱结合化学计量学方法,对14批木香样本进行分析,明确指出以木香烃内酯和去氢木香内酯为代表的、具有 $\alpha, \beta$ -不饱和羰基结构的倍半萜内酯,是其发挥抗炎(抑制一氧化氮生成)和抗氧化(清除活性氧)作用的核心药效成分群。该研究通过“谱-效”关系分析,确证了这些成分的生物活性贡献(相关系数 $>0.85$ ),并利用半胱氨酸迈克尔加成反应验证了 $\alpha, \beta$ -不饱和羰基这一关键药效团的必要性<sup>[12]</sup>。

### 2.2 成分合成与调控的生物学研究

研究不再局限于静态的成分分析,更深入到成分生成的动态生物学过程。例如,通过比较不同生长年限木香根部的转录组差异,可以挖掘与倍半萜生物合成关键酶相关的基因。这类研究为通过分子育种或合成生物学策略提升木香药材质量、稳定药效提供了理论依据<sup>[13]</sup>。

## 3 作用机制的深度阐释:从整体观察到分子靶点

现代研究正从器官组织水平深入到细胞、分子乃至基因通路水平,多维度阐释木香的作用机制。

### 3.1 抗炎与抗氧化机制的新见解

以往已知木香具有抗炎作用,但机制模糊。最新研究表明,其核心倍半萜内酯的 $\alpha, \beta$ -不饱和羰基结构,能够通过与蛋白质中的半胱氨酸残基发生共价修饰,从而调控关键靶蛋白功能。例如,去氢木香内酯被证实是一种强活性、高选择性的NLRP3炎症小体活化抑制剂,能直接干预细胞内重要的炎症信号通路,这为其治疗溃疡性结肠炎等炎症性疾病提供了清晰的分子图解。

### 3.2 多靶点协同作用的系统视角:以抗肿瘤为例

网络药理学和分子对接技术为理解木香多成分协同治疗复杂疾病提供了强大工具。一项针对木香治疗胃癌的机制研究发现<sup>[14]</sup>,其活性成分(如白桦脂酸、 $\beta$ -谷甾醇等)可通过作用于前列腺素内过氧化物合成酶(PGCS2/COX-2)、单胺氧化酶(MAO)等关键靶点,干预癌症相关的多条信号通路,实现多靶点协同干预。这完美诠释了中药“多成分-多靶点-多通路”的整体作用模式。

## 4 从药材到新药的转化探索

木香现代研究的价值,在于推动临床应用的精准化和催生创新药物。以木香烃内酯、去氢木香内酯等已明确药效关联的成分作为质量标志物,建立更科学、关联疗效的药材和产品质量标准,是保证木香制剂疗效稳定、安全可控的关键。木香研究已走出“纸上谈兵”,进入成果转化阶段。有研究表明,基于对木香“理气止痛”功效物质基础的深入研究,以去氢木香内酯为先导化合物,成功研发了用于治疗溃疡性结肠炎(UC)的创

新候选药物 PD-4-26, 并实现了专利技术转让<sup>[15-16]</sup>。这是从中药传统功效出发, 通过现代科学技术阐明机制、

优化结构, 最终开发出拥有自主知识产权现代药物的典范, 标志着木香研究达到了一个全新高度。

### 结论与展望：

综上所述, 木香的现代研究已构建起一条从传统功效到药效物质, 再到分子机制与临床转化的完整证据链。科学验证不仅夯实了木香“行气止痛、健脾消食”传统认知的可靠性, 更揭示了其在抗炎、免疫调节乃至抗肿瘤等领域的巨大潜力。

未来研究应在以下方向深化：

**机制纵深：**进一步阐明核心成分共价修饰的具体细胞靶点及其下游信号网络。

**临床定位：**开展更多高质量的临床研究, 精准定位木香及其活性成分在溃疡性结肠炎、胃肠功能紊乱及肿瘤辅助治疗中的疗效和价值。

**综合利用：**结合合成生物学和智能制造技术, 实现木香珍稀活性成分的高效、绿色生产。

**复方解码：**深入探究木香在经典复方（如香连丸、木香槟榔丸）中的配伍科学内涵和协同机制。木香的现代研究历程, 是中医药宝库通过现代科技“解码”、重焕生机并贡献于世界医学的生动缩影。随着多学科融合的不断深入, 这一古老药材必将为人类健康带来更多创新性的解决方案。

### 参考文献：

[1] 杨雁, 董思含, 苗玥, 等. 不同干燥方法对云木香外观性状与有效成分及品质的影响 [J]. 西南农业学报, 2024, 37(12): 2749-2756.

[2] 薛旭龙, 张鹏程, 曹洋, 等. 木香炔内酯的药理作用研究进展 [J]. 现代药物与临床, 2025, 40(06): 1569-1574.

[3] 赵云, 苏科巧, 苏敏, 等. 云木香化学成分提取分离及结构鉴定的研究进展 [J]. 广州化工, 2024, 52(18): 5-9+23.

[4] 黄茜, 甘梵飞, 赵飞亚, 等. 道地药材云木香药理作用研究进展 [J]. 农垦医学, 2024, 46(03): 243-245+250.

[5] 黄亮, 伍湘峰. 木香关键成分抗乳腺癌代谢组学相关性研究 [J]. 山西中医, 2023, 39(04): 62-65.

[6] 李晓艺, 邹秋萍, 毛泽伟, 等. 去氢木香内酯衍生物的合成及其抗炎活性研究 [J]. 化学通报, 2023, 86(02): 240-243.

[7] 杨恒俐, 毛泽伟, 李艳平. 云木香中倍半萜类成分及其衍生物的结构修饰与药理活性研究进展 [J/OL]. 云南民族大学学报(自然科学版), 1-22.

[8] 金鑫. 木香历代临床用量沿革及量效关系的分析与实验论证 [D]. 黑龙江中医药大学, 2025.

[9] 吴东明. 木香内酯介导的 NLRP3 自噬在放射性肠炎中的作用及机制研究 [D]. 兰州大学, 2023.

[10] 方莹, 潘海华. 基于 COX-2 调控探讨木香炔内酯抑制胃癌细胞 MGC-803 增殖的作用机制 [J]. 中国中医药科技, 2025, 32(06): 969-972+977.

[11] 严小婷, 王鑫焯, 白明, 等. 天然倍半萜内酯类成分抗胶质瘤作用机制的研究进展 [J]. 中国临床药理学与治疗学, 2024, 29(10): 1174-1184.

[12] 卢敏南, 杨学芳, 邓菊庆, 等. HPLC 指纹图谱联合化学计量学在不同产地云木香药材鉴别中的应用 [J]. 昆明医科大学学报, 2017(010): 038.

[13] 郭连安, 潘媛, 谭均, et al. 不同生长年限木香转录组分析及倍半萜合成基因挖掘 [J]. Southwest China Journal of Agricultural Sciences, 2024, 37(9).

[14] 黄茜, 陈颖志, 甘梵飞, 等. 基于网络药理学和分子对接技术探讨木香治疗胃癌的作用机制 [J]. 现代医药卫生, 2024, 40(08): 1261-1266.

[15] 周青. 木香颗粒对 UC 的影响及其作用机制 [D]. 南京中医药大学, 2020.

[16] 高璐. 木香炔内酯和去氢木香炔内酯在正常大鼠和溃疡性结肠炎大鼠肠道菌中代谢产物的研究 [D]. 河北医科大学, 2023.

### 基金项目：

1. 重庆市卫生健康委员会科学技术研究项目“木香关键成分木香炔内酯抗乳腺癌的作用及其分子机理研究”（批准号：2025WSJK134）
2. 重庆医药高等专科学校校级自科项目“重庆特色临方炮制品种——四制黄连饮片质量标准研究”（批准号：ygzzk2025118）