

• 综述 •

影响大黄药效的有关因素

江西省上饶市人民医院 王智松 金巧英

大黄为临床常用中药。性味苦寒峻猛，其药效作用可因品种、产地、炮制方法、煎制方法、剂量、剂型、给药途径及配伍的不同而大有差异。本文就影响大黄药效的因素探讨如下，以供临床应用时注意。

一、大黄的品种、产地与药效的关系

大黄属植物，全世界共有 60 余种，我国占 2/3，并以质量最优闻名于世，公元前 114 年我国大黄即销往欧洲⁽¹⁾。

大黄又名黄良、将军、火参、肤如，藏名“峻”；由于青海西宁所产大黄表面呈棕红色，可见到类白色薄壁组织与棕红色射线交错而成的内部花纹，排列整齐，极似缎面的织锦，故又称西大黄、锦纹大黄；古时也有将四川所产大黄称为锦纹、川军^(2,3)。

我国医用大黄有两大类。一类为北大黄，包括掌叶大黄（又名天水大黄、葵叶大黄）和唐古特大黄（又名鸡爪大黄）。北大黄的商品有西宁大黄和铨水大黄。西宁大黄主产于青海西宁、同仁、同德等地；此外还有凉州大黄、河州大黄和岷县大黄，其中凉州大黄又名凉黄、狗头大黄（形如狗头）；西宁大黄品质最优，疗效特佳，且服后无腹痛之弊，被誉为地道药材。铨水大黄商品有文县大黄、清水大黄和庄浪大黄数种，产于甘肃文县、成县及清水等县。目前，北大黄在四川也有较大量出产。另一类为南大黄，又称药用大黄、四川大黄和马蹄大黄，商品有雅黄、南川大黄等，主产于四川、湖北、云南和贵州等省^(3~5)。

中国药典 1977 年版收载的大黄为上述蓼科多年生草本植物掌叶大黄 *Rheum Palmatum* L.、唐古特大黄 *R. heum tanguticum* Maxim ex Balf 及药用大黄 *R. heum officinale* Baill. 据卫生部药品生物检定所等单位调查和实验报告，以上三种大黄质量优良，习称正品大黄；其他大黄属植物如山大黄（又称苦大黄，包括华北大黄、河套大黄、天山大黄及藏边大黄）、高山大黄、心叶大黄、拉萨大黄等习称非正品大黄，质量低劣，总大黄酸及番泻甙类含量甚低，抑菌作用及致泻等作用均很差。唐《新修本草》即已指出山大黄与正品大黄不同；由于山大黄味苦而涩，服后可引起较剧烈的腹痛，故其中华北大黄国内一般仅作外用药或兽药用，主要供出口作染料用⁽⁶⁾。市面常有土大黄出售，与本文所提大黄的药效有所不

同，应注意鉴别⁽⁷⁾。

《本草拾遗》载：“若取泻峻快，推陈去热，当取河西锦纹者”。我们使用甘肃及四川所产掌叶大黄治疗上消化道出血观察结果，其疗效较好，无严重的腹痛及恶心呕吐副作用；焦东海等以单味大黄粉（八种大黄制剂）治疗 880 例急性上消化道出血观察结果，也认为甘肃及青海所产掌叶大黄较好，尤以甘肃礼县的品种疗效较为稳定^(8,9)。

二、大黄不同炮制品与药效的关系

《本草纲目》载：“大黄苦寒无毒……酒浸入太阳经，酒洗入阳明经，余经不用酒”。李东垣曰：“大黄苦峻下走，用之于下必生用。若邪气在上，非酒不至，必用酒浸引上至高之分，驱热而下”。孙思邈在《银海精微》中指出：“大黄实者生用，虚者酒蒸”。均简要地指出了大黄的不同炮制方法具有不同的药效，临床上应根据不同的病症选用不同的大黄制品。

目前，常用的大黄炮制品有生大黄（常用别名及处方名：大黄、西大黄、锦纹、生锦纹、生军、川军、生川军），熟大黄（制大黄、制军、制川军、制锦纹），酒大黄（酒军、酒川军），大黄炭（军炭、川军炭），醋大黄（醋炒大黄）和清宁片。传统认为：生大黄以攻积导滞、泻火解毒效好，多用于热积便秘，火毒伤络（吐、衄），眼目赤肿、口舌生疮及热毒痈疽等，也可外用（磨汁或研粉油调）于疮疡肿毒；熟大黄泻下力逊，清热化湿力胜，多用于湿热内阻之候如黄疸、淋证及湿热引起的痞满之证；酒大黄和（活）血行血力强，适用于跌打损伤、瘀血腹痛、肠痛等证；大黄炭有收敛止血、止泻之效；醋大黄可泻血分实热，常与活血调经药配伍用于治疗实热壅于血分而致经闭、痛经及产后腹痛等证；清宁片为市售成药，亦常配方使用，泻下力缓，主治胸腹满闷、饮食停滞、便秘涩滞而无须峻攻者^(2,10)。

现代药理研究证实，大黄不同炮制方法对大黄的泻下、收敛、抑菌及抗炎、解热、镇痛等有效成分的影响不同，因而其不同炮制品的药效也有所不同。

1. 不同炮制品的泻下作用：许志明等报告，生大黄经水浸、酒炒、醋炒、酒蒸及炒炭后，其泻下成分依次降低⁽¹¹⁾。赵云生等报告，酒熟大黄和蒸熟大黄中都不再含番泻甙类，酒熟大黄中的泻下成分蒽醌含

量明显减少⁽¹²⁾。吴连英等报告熟大黄、醋炒大黄泻下作用成分降低30%左右，酒大黄、清宁片泻下作用成分降低95%左右，用药后开始出现腹泻的时间明显延长，腹泻次数减少，大黄炭几乎无泻下作用⁽¹³⁾。

2. 大黄的收敛成分鞣质经大黄炒炭存性后，含量无明显变化，且由于加热高沸的作用，生成了一些炭素，故有收敛止血、止泻之效⁽¹⁴⁾。

3. 各种炮制品均有一定的抑菌能力，熟大黄及酒大黄与生大黄作用相似，且对绿脓杆菌、伤寒杆菌的抑菌活性优于生大黄；醋大黄、大黄炭对某些菌种抑菌活性减弱，但对绿脓杆菌仍保持了较好的抑菌活性；制大黄中的抗菌消炎成份芦荟大黄素和大黄素含量较高，分别为生大黄的2.7倍和3.4倍；大黄炭的芦荟大黄素和大黄素含量分别为生大黄的1.9倍和2.8倍左右。各种不同的大黄炮制品的抗炎、解热镇痛效果无明显差异。因此，拟使用大黄作抗菌、消炎、解热、镇痛时，宜选用熟大黄、酒大黄，可避免使用生大黄引起的峻泻副作用^(15~17)。

4. 江文君等体外实验报告：经去鞣质处理后的大黄煎剂对血清中的天然抗体IgMA、IgMB与免疫抗体IgGD的特异性抗原抗体凝反应有明显的阻断作用，而酒焮大黄作用最强，大黄炭剂阻断作用明显减弱，故防治新生儿溶血症时可酌情选择使用^(18,19)。

5. 生大黄致泻作用强，不仅可引起大肠蠕动亢进，且可引起身体远隔部位的血液趋向腹部，可缓解脑、肺、眼结合膜充血或炎症，此乃祖国医学所说的“病在上而取下”的治疗原则，但在此作用的同时，尚可反射性地引起盆腔充血，故孕妇、经期妇女一般慎用或忌用⁽²⁰⁾。

三、大黄不同煎制方法与药效的关系

张仲景对大黄的煎制方法很有研究，他在《伤寒论》和《金匮要略》中论述了大黄有先煎、后下、同煎之分：如大陷胸汤中的大黄先煎，以治疗水热互结的大结胸证；大承气汤中的大黄后下，用作攻下实热、荡涤肠胃燥结；大黄附子汤中的大黄与它药同煎，以治疗寒实内结、阳气不足的邪实正虚之证；其用意可能系取大黄先煎清湿热效好，后下苦寒速降峻攻，同煎缓和泻下之意……对后人合理煎制大黄，以提高临床疗效、扩大治疗范围有指导性启迪。

现代药理研究认为，大黄的不同煎制方法对大黄的某些药效作用成分有不同的影响，因而药效作用不同。

1. 大黄的泻下作用成分为不耐热物质，长时间煎煮可受到破坏，其泻下作用强度随着受热时间的增加

而减弱。顾维章等实验结果表明，大承气汤经典煎法（先煎厚朴、枳实，取药液下大黄，煮沸15分钟后，最后将芒硝纳入药液），比大黄后下法及混煎法（群煎法）溶出的活性成分蒽醌类多11~14%，对小鼠肠道的排空及推进作用和对大鼠离体大肠的蠕动作用比后下法、混煎法作用较强⁽²¹⁾。经典煎法煎制的大承气汤还有明显的利尿作用；大黄煎煮时间适当（10~15分钟），溶出的总蒽醌最多；煎煮时间过短，溶出不完全；煎煮时间过长，有效成分水解、破坏较多；大黄与其他药物同煎（混煎），有效成份（特别是泻下成分蒽醌类）可因其他药渣而影响溶出⁽²²⁾。由此可见，张锡纯《医学衷中参西录》谓：“凡气味俱厚之药，皆忌久煎，而大黄尤甚，且其质轻，经水泡则软，煎一两沸，药力皆出，与他药同煎宜后入，若单用之，开水浸服即可”的论述也值得我们借鉴。

2. 大黄的水溶性抑菌成分对热较耐受，较长时间的煎煮对抑菌活性无明显影响；抑菌有效成分大黄酸和大黄素结晶较稳定，其溶液也能耐热，但对光很敏感，溶液放置过程中也易遭破坏^(15,23)。

3. 大黄的抗炎、解热和镇痛成分对热也较耐受，煎煮时间较长，对抗炎、解热及镇痛药效无明显影响⁽¹⁷⁾。

4. 大黄对抗原抗体反应阻断作用的有机成分对高热不稳定，但在100℃左右较长时间受热不受影响⁽¹⁸⁾。

5. 大黄中的收敛成分鞣质对热较能耐受，且易溶于水，煎时液体越多越易游离，煎煮时间长，鞣质溶出量多，收敛作用增强，故要取大黄的泻下作用，除煎沸时间不超过10分钟外，水量也应尽可能加少些^(14,24)。

6. 生大黄所含抑制胰蛋白酶、胰脂肪酶、胰淀粉酶有效成份（活性成分）极易溶于沸水，一般10~20分钟即可溶出绝大部分，因此，用于治疗胰腺炎时，大黄先浸再煎无意义，久煎不能增加抑制胰蛋白酶、胰脂肪酶和胰淀粉酶活性的作用，反有减轻这种作用的趋势^(25,26)。

7. 对里、实热证急腹症，欲求有效地、迅速地清除里热，大黄用量应较大，煎煮宜后下。

四、大黄的剂型与药效的关系

张锡纯《医学衷中参西录》谓：“大黄……若轧作散服之，一钱之力可抵煎汤者四钱”。焦东海等人在用大黄粉剂与大黄煎剂治疗急性胰腺炎、急性胆囊炎及上消化道出血等疾病时观察结果，认为1g大黄粉剂相当于3~4g大黄汤剂效果^(8,27~29)，与张氏的论述基本相符。

生大黄粉剂、片剂口服有较好的止血、抗菌消炎效果,但有7%的患者服药后有恶心呕吐等反应,且在排便前有小腹或脐周疼痛的副作用,而大黄糖浆、大黄止血药水、大黄醇提片、大黄酚片、复方大黄酚片、大黄止血有效单体晶A(α -儿茶素)和晶B(没食子酸)等止血效果也很好,且无明显的副作用^(29,30)。大黄片剂还可用于阴道给药以治疗滴虫病、宫颈炎⁽³¹⁾。

在外用大黄粉剂与大黄油剂治疗皮肤病时,对创面炎性渗出物较多者,宜选用收敛吸附作用较好的粉剂;而烧烫伤、创口红肿、热痛较剧时,选用大黄油剂,则有消肿、止痛和减少瘢痕形成之效^(32~35)。

大黄注射液,可因其制备工艺的不同其所含的药用有效成分不同而呈现不同的药效,但其泻下成份在制备过程中所剩无几,故大黄注射液(目前所报道的制剂)口服、肌肉注射或静脉给药,基本无泻下作用⁽³⁶⁾,故有学者认为:大黄含有大量鞣质,制注射液时须除去,又其中蒽醌类很不稳定,容易发生水解、氧化等变化生成游离蒽醌,且泻下作用限于大肠,因此,如以泻下为目的,似无制成注射液必要,如为其他目的,须经过仔细研究证实后方可,否则难以保证安全与有效。

大黄的复方制剂较多,可根据临床不同的需要而选用或制作,以增强大黄的疗效,防止大黄的副作用,扩大治疗范围。如大黄苏打片、复方大黄酊、复方大黄散有健胃、增进食欲及帮助消化之效;复方清胆注射液可用于胆道感染和结石,大承气汤冲剂可用于肠梗阻,疗效均较好^(32~35)。

酒有通行十二经、扩张血管、加速血液循环的作用,故大黄酊剂(大黄浸酒作药用)活血祛瘀作用较强。

五、大黄剂量与药效的关系

大黄具有调和脾胃、安和五脏、以通为补的作用,不仅适用于里、实、热证,且可用于表虚寒证,正确认识大黄的攻补功效的关键在于用量的大小,小剂量以“补”为主,大剂量以攻为主,由实致虚者用量宜大,由虚致实者用量宜小^(37,38)。

大黄小剂量(0.3g以下)有健胃助消化作用;0.2g以下可引起便秘,这是所含鞣质的收敛作用掩盖了含量过少的泻下成分的泻下作用所致;中等剂量(1~2剂大黄粉剂)有缓泻作用;通便为主用6~12g煎服;排除积滞和结石可用大黄15~30g煎服;用大黄的炭作止血、止泻时,一般用5~10g为宜^(20,33~35)。

古代文献有称大黄无毒,亦有称有微毒、剂量大时有毒;近代认为大黄一般剂量无毒性反应,大剂量时对心、肝、肾有毒性反应⁽²⁰⁾;晚近报告了用大剂量

大黄治疗急性胆囊炎、出血性坏死性肠炎、流行性出血热、急性胰腺炎及急性黄疸型肝炎等疾病^(28,39~43),取得了明显的疗效,未发生明显的毒性反应;有人以单味大黄治疗急性胰腺炎时观察到有早泻早缓解,迟泻迟缓解现象,故以出现腹泻为评定大黄用量指标之一,有一例患者24小时内大黄累积用量达500g(煎剂)才取得疗效⁽²⁷⁾,由此也证实了张锡纯在《医学衷中参西录》中论述的“大黄之力虽猛,然有病则病当之,恒有多用不妨者……盖用药以胜病为准,不如此则不能胜病,不得不放胆多用也”的经验可供借鉴。

六、大黄的不同给药途径与药效的关系

口服大黄给药方便,服大黄粉、片剂、胶囊剂一般2~3小时血药浓度达最高峰,此后缓慢下降^(20,34)。

大黄总蒽醌栓剂直肠给药或大黄煎剂灌肠,给药后1~2小时血药浓度达到峰值,血药浓度高于胶囊剂口服浓度⁽⁴⁴⁾,对便秘及直肠、结肠的炎症性疾病疗效较好,也可降低尿素氮,治疗尿毒症^(33,45,46)。

大黄注射液或复方大黄注射液肌肉注射或静脉给药能较快地提高血药浓度。

局部给药:大黄粉剂、大黄油剂及三黄软膏等大黄单味和复方制剂对化脓性皮肤病,湿疹、烧烫伤外用有抗菌消炎和镇痛效果^(32,33);石灰大黄纱条用于治疗淋巴结核疗效较好⁽⁴⁷⁾;阴道局部给予大黄片剂、总蒽醌及浸膏制剂、大黄提取液等对阴道滴虫病、宫颈炎有较好的疗效^(31,33)。

穴位敷贴疗法:用大黄粉醋调外敷涌泉穴,对减轻多种原因引起的腹胀有明显的疗效^(34,48)。

七、大黄不同配伍与药效的关系

大黄配附子,变寒下为温下。大黄可使胃排空加快,但对阳虚动物反可使胃运动发生障碍⁽⁴⁹⁾;若加入附子,可协同大黄促进胃蠕动排空,故祖国医药学将大黄附子汤列为温下法的代表方;大黄配麻仁,变攻下为润下;大黄配甘草,变峻下为缓下。大黄伍用厚朴或莱菔子对解除便秘及肠腹胀气疗效较好,大黄配枳实和芒硝,泻下作用增强、加速⁽⁵⁰⁾。

大黄配黄连有加强清热泻火之功,对抑制痢疾杆菌有协同作用;大黄配茵陈清利湿热、利胆退黄可增强疗效。大黄配白芨或石花或干姜或生地或儿茶治疗上消化道出血均有较好的疗效报道⁽⁵¹⁾。

对于体质较弱者使用大黄宜攻补兼施,《本草正》载:“大黄……气虚同以人参,名黄龙汤;血虚同以当归,名玉烛散。佐以甘草、桔梗可缓其行,佐以芒硝、厚朴,益助其锐。”

〔本文承蒙江西中医学院药学系熊昌华副教授和北京市中医院内科李乾构主任指导, 特致谢意〕

参 考 文 献

1. 徐国钧, 等. 生药学, 第1版, 北京: 人民卫生出版社, 1958: 78.
2. 徐国龙, 等. 常用中药处方名辨义, 第1版, 合肥: 安徽科学技术出版社, 1982: 9.
3. 成都中医学院主编. 中药学, 第1版, 上海: 上海科学技术出版社, 1978: 146.
4. 谭一新, 等. 十种大黄质量鉴定——蒽醌甙元的定性和定量分析. 药物分析杂志 1984; 2: 74.
5. 肖培根. 大黄属植物的资源利用. 中药通报 1981; 2: 11.
6. 李九丹, 等. 大黄商品基源调查与质量考察. 药物分析杂志 1983; 6: 333.
7. 郭济贤, 等. 十种大黄的质量分析. 中成药研究 1980; 1: 21.
8. 焦东海, 等. 生大黄止血作用研究概况. 中成药研究 1980; 2: 34.
9. 焦东海, 等. 单味大黄治疗上消化道出血病例分析. 中华消化杂志 1983; 4: 254.
10. 陆拯. 中药临床生用与制用, 第1版, 北京: 人民卫生出版社 1983: 82.
11. 许志明, 等. 大黄及其炮制品泻下作用及药性变化的研究. 湖南医药杂志 1979; 6: 34.
12. 赵云生, 等. 炮制熟大黄时加酒与否对化学成分的影响. 药学通报 1984; 7: 33.
13. 吴连英. 中药大黄炮制研究 II——炮制对大黄泻下作用与泻下成分的影响. 中药通报 1983; 2: 20.
14. 李胜华, 等. 中药大黄炮制前后蒽醌类成分及鞣质含量的变化. 药学通报 1980; 8: 41.
15. 江文君, 等. 中药大黄炮制研究 IV——炮制对大黄抑菌作用与成分的影响. 中药通报 1983; 3: 18.
16. 洪筱坤, 等. 大黄及其炮制品的化学成分分析. 上海中医药杂志 1984; 6: 46.
17. 刘炳芳, 等. 不同方法制备的大黄提取液对药理作用的影响. 中草药 1982; 7: 33.
18. 江文君, 等. 中药大黄炮制研究——大黄及其炮制品对血清抗原抗体形成作用的影响. 中成药研究 1983; 12: 16.
19. 陈蕙英. 妊娠期服大黄茵陈冲剂预防新生儿溶血症. 新医学杂志 1978; 11: 19.
20. 吴葆杰主编. 中草药药理学, 第1版, 北京: 人民卫生出版社, 1983: 138.
21. 顾维章, 等. 不同煎法对大承气汤中大黄蒽醌类溶出量及药理作用的影响. 中草药 1985; 1: 8.
22. 南京药学院《中草药编写组》. 中草药学. 中册, 第1版, 南京: 江苏人民出版社, 1976: 168.
23. 荒川和男, 等. Proc Symp WAKAN—YAKU 1980; 13: 85.
24. 郝淑清. 大黄煎煮方法对有效成分的影响. 中草药 1984; 2: 15.
25. 高晓山, 等. 生大黄对4种消化酶活性的影响及其与药性关系的探讨. 中药通报 1981; 3: 25.
26. 李树珍, 等. 大黄不同提出物对胰蛋白酶活性的影响. 中药通报 1985; 4: 41.
27. 焦东海, 等. 三种大黄制剂治疗急性胰腺炎 150 例临床及实验研究. 中成药研究 1984; 2: 18.
28. 焦东海, 等. 单味大黄治疗急性胆囊炎(附10例报告). 陕西中医 1980; 3: 21.
29. 焦东海, 等. 大黄对消化性溃疡合并出血作用的临床研究. 中西医结合杂志 1984; 4(10): 597.
30. 杜上鉴, 等. 大黄有效成分研究. 中成药研究 1983; 7: 29.
31. 广西中医学院大黄研究组. 中医教学 1976; 4: 55.
32. 曹春林主编. 中药制剂汇编, 第1版, 北京: 人民卫生出版社, 1983.
33. 陈琼华. 大黄的实验研究和临床应用. 新医药学杂志 1974; 5: 34.
34. 江苏新医学院编. 中药大辞典, 上册, 第1版, 上海: 上海人民出版社, 1977: 102.
35. 全国中草药汇编编写组. 全国中草药汇编, 上册, 第1版, 北京: 人民卫生出版社, 1975: 62.
36. 郝淑清. 大黄注射液的制备工艺对蒽醌衍生物含量的影响. 中草药 1982; 10: 38.
37. 杨如哲, 等. 大黄的补益功效. 云南中医杂志 1984; 3: 42.
38. 焦东海, 等. 对消化道出血虚证患者能用大黄止血的探讨. 中医杂志 1980; 1: 36.
39. 周建宜. 大剂量生大黄治疗急性出血性坏死型肠炎的初步观察. 福建中医药 1985; 1: 36.
40. 黄孝明. 流行性出血热少尿期急性肾功能衰竭 44 例观察. 北京中医 1984; 1: 24.
41. 吴才贤, 等. 大剂量单味生大黄治疗急性黄疸型肝炎的初步观察. 中西医结合杂志 1984; 4(2): 88.
42. 舒友元. 运用下法治疗流行性出血热. 上海中医药学杂志 1983; 11: 16.
43. 姚锋. 单味中药新用. 中级医刊 1982; 1: 49.
44. 侯国平, 等. 大黄总蒽醌栓剂生物利用度测定. 中成药研究 1981; 10: 6.
45. 钱广平, 等. 大黄保留灌肠治疗肾功能衰竭. 中医杂志 1980; 11: 8.
46. 时振声, 等. 慢性肾功能衰竭的中医治疗进展. 中医杂志 1983; 4: 75.
47. 刘德厚. 石灰大黄治疗淋巴结核 208 例疗效观察. 中医杂志 1980; 10: 52.
48. 张志圣. 大黄的药理作用及其在急腹症中的应用. 福建中医药 1985; 1: 50.
49. 杨天权. 大黄的临床应用和药理作用. 陕西中医 1980; 6: 36.
50. 项育民. 大承气汤的剂型改革及临床应用. 中药通报 1984; 3: 27.
51. 焦东海, 等. 大黄止血的历史沿革与现状. 中成药研究 1984; 7: 30.