炮制辅料应用精准性及对药效影响探析

王金璐

郑州商业技师学院

摘要：中药炮制是中医药体系的关键环节，辅料应用在其中起着举足轻重的作用。本文聚焦于中药炮制技术中辅料应用的精准性，详细阐述常见辅料的种类、特性以及在炮制过程中的精准选用原则，深入探究辅料从改变药物化学成分、影响药理活性到调控体内药物代谢过程等多方面对药效的影响机制，并结合现代科学技术手段进行剖析，旨在揭示中药炮制辅料与药效之间的内在联系，为推动中药炮制技术的现代化发展、提升临床疗效提供坚实的理论依据。该研究具有先进性、普适性、全面性与有效性，以期助力中医药产业的优化升级。

关键词：中药炮制；辅料应用；游离型蒽醌；糖基化反应

1 引言

中医药作为中华民族的瑰宝，承载着千年的智慧与实践经验。中药炮制技术是中医药学的特色工艺，它依据中医理论，通过对中药材进行净制、切制、炮炙等加工处理，以满足临床用药的不同需求[1]。在这一复杂而精妙的过程中，辅料的使用犹如画龙点睛之笔，精准的辅料应用能够显著改变药物的性能，或增强疗效、或降低毒性、或改变药性趋向，是实现中药精准治疗的核心要素之一，对它进行深入探究具有重大的现实与理论意义。

2 中药炮制常见辅料概述

2.1 液体辅料

以下为用于中药炮制的液体辅料：

● 酒：性大热、味甘辛，具有活血通络、祛风散寒、行药势的功效。乙醇可增加药物有效成分的溶解度，使难溶成分更易溶出。例如，大黄经酒炙后，结合型蒽醌部分转化为游离型，泻下作用缓和而活血化瘀作用增强，这是因为酒促进了成分的化学转化，借助行血之力转移了药效重点；

● 醋：性味酸苦温，有散瘀止血等功效。醋酸能与药物中的游离生物碱成盐，大幅提高在水中的溶解度，确保药效得以释放。像延胡索经醋制后，延胡索乙素等止痛成分提取率大幅提升，镇痛效果显著增强，依靠醋碱化学反应助力成分溶出、从而达到止痛效果；

● 盐水：咸寒，可清热凉血、引药下行。钠离子能够调节渗透压，为入肾经的药物“导航”，引导药物精准作用于肾脏。杜仲经盐炙后，补肝肾的作用大幅增强，盐引导有效成分聚集于肾脏，提升滋补效果；

● 生姜汁：味辛温，能解表散寒、温中止呕，还能抑制药物的异味。生姜汁含有挥发油、姜辣素，既能协同药物解表祛寒，如厚朴经姜汁制后，具有宽中下气兼散表寒的功效；又能借助辛辣味去除腥膻味，优化口感并提高用药顺应性；

● 蜂蜜：味甘平，有补中润燥等作用。蜂蜜富含多种营养成分，能与药物协同增效，还可使饮片外观美观、质地坚实。蜜炙甘草补脾和胃、益气复脉的效果远超生甘草，这是因为蜂蜜中的营养成分与甘草相互作用提高了药效，其黏合作用还优化了饮片的品质[2]。

2.2 固体辅料

以下为用于中药炮制的固体辅料：

● 稻米：味甘性平，具有补中益气的功效。作为辅料使用时，能使药物受热均匀、缓和药性。党参经米炒后带有焦香气味，其健脾止泻的功效更为突出，同时还能吸附药物中的刺激性成分，优化口感，便于患者服用；

● 麦麸：味甘淡，有和中益脾的作用。其质地疏松、传热较慢，枳壳经麸炒后，挥发油含量适中，可缓和燥性与

作者简介：王金璐为郑州商业技师学院讲师，研究方向为中医药专业教学科研。

图 1　中药材刨片机

刺激性，增强健胃消胀的效果。这是依靠缓慢传热使挥发油适度挥发，从而优化药性；

● 白矾：味酸性寒，可起到解毒杀虫等作用。主要用于降低药物毒性、防腐以及矫正异味。用白矾炮制半夏、天南星，可崩解毒性针晶束，使毒性大减、药效平稳。这是靠化学反应改变毒性结构来达到解毒的目的；

● 豆腐：味甘性凉，能吸附有毒药物的毒性，提供温和的环境。藤黄与豆腐共煮时，毒性成分会渗出并被豆腐吸附，保障用药安全。这是借助豆腐的多孔结构与凉性来解毒、中和毒性；

● 土：味辛性温，有温中燥湿的功效。药物经土炒可借助其温性与吸附性，白术土炒后补脾止泻的作用增强，能吸去挥发油，缓和药性，为药性转变创造条件、优化药物性能[3]。

3　中药炮制中辅料应用的精准性原则

3.1　基于药物功效主治的精准适配

3.1.1　增强疗效

针对活血化瘀类药物，酒为常用辅料。例如川芎，经酒炙后，其活性成分借助酒的辛散行血之力，能更好地舒张心脑血管，增强对血管的调节功效，酒与川芎协同增效。在止咳平喘时，蜜炙是良策，以紫菀为例，蜜炙可优化祛痰镇咳活性成分的溶出，其润肺特性还能辅助药物发挥止咳平喘作用，提升疗效。

3.1.2　降低毒性

有毒药物的炮制关乎用药安全，天南星、半夏常用白矾、生姜来解毒。白矾可使毒性蛋白凝固变性，削减毒性；生姜既能解半夏之毒，又能协同发挥止呕作用。如天南星经此炮制，毒性显著降低，而燥湿化痰、祛风止痉的药效犹存，辅料精准作用于毒性成分，实现解毒留效。

3.1.3　改变药性

部分药物经炮制后可改变药性，以适应临床需求。生地黄性寒，有清热凉血的作用，经蒸制并与酒、砂仁等辅料共制，药性转温，化作熟地黄，滋补肾阴、填精益髓。辅料推动了药性的根本转变，满足了补肾阴的需求。

3.2　依据中医理论的精准指导

3.2.1　五行归经理论

中医五行学说为辅料的应用提供了指导，依“酸入肝、苦入心、甘入脾、辛入肺、咸入肾”的原则。柴胡、香附等归肝经的药物用醋炮制，醋之酸味引药入肝，强化疏肝理气之效；益智仁、补骨脂等补肾药采用盐炙，遵循“咸入肾”的原则，使药物靶向肾脏，提升补肾精准度与疗效。

3.2.2　阴阳学说应用

中医阴阳学说指导用药配伍，对于阳虚寒证的用药，常佐以温热辅料。如附子毒性大、性大热，炮制时加入干姜、甘草等温热辅料，既能降低毒性，又能增强温阳散寒的特性，平衡药物的阴阳属性，贴合辨证论治的原则，有助于药物顺应患者的病理状态。

3.3　结合药物自身特性的精准抉择

3.3.1　药物质地考量

药物质地决定了辅料的选用策略。质地致密的矿物、贝壳类药物，其有效成分难溶，常用煅淬法并加醋促溶，如自然铜经煅淬后放入醋液中，醋的酸性可溶解金属离子，煅淬破坏晶体结构，使铁离子溶出大增，利吸收；质地疏松的花、叶类药物，采用轻炒的方法缓和药性，少用厚重辅料，防有效成分挥发散失。

3.3.2　化学成分特点

依据药物的化学成分选辅料是关键。对于含生物碱的药物，醋制可使生物碱与醋酸形成盐，结构稳、易溶提效，延胡索醋制便是例证；对于含苷类药物，重点是防酶解，黄芩蒸制可灭活酶，稳定黄芩苷。依药物成分“量身定制”辅料，保障药效精准[4]。

4　辅料对中药药效的影响机制

4.1　对药物化学成分的影响

4.1.1　增溶与促溶效应

辅料可改变药物的化学环境，实现增溶与促溶。例如，乙醇和醋酸具有不同的极性，能够瓦解药物的晶体结构，让药物成分更易于溶解。以酒炙丹参为例，在酒的作用下，丹参酮类脂溶性成分的溶出率大增。酒作为溶剂，不仅增大了活性成分与溶剂的接触面积，还打破了溶解平衡，促使更多的有效成分溶出，为后续药理作用提供了更丰厚的物质基础。

4.1.2　化学反应诱导

辅料与药物成分常常会发生酯化、酸碱中和、络合等反应。蜂蜜中的糠醛可与药物羟基、氨基发生缩合反应，生

成具有独特活性的新物质；矿物药与白矾发生反应，会改变元素的价态和配位情况，从而转化药效。这些化学反应改变了药物的化学结构，催生了新的药理活性或优化了原有的活性，是辅料影响药效的关键化学路径。

4.1.3 酶解抑制与成分转化

在炮制过程中，辅料能调控酶活性，保护药效并降低毒性。苦杏仁燀制时依靠加热灭活苦杏仁苷酶，防止苦杏仁苷被酶解产生剧毒的氢氰酸，从而保障用药安全；何首乌在炮制过程中，在微生物和辅料的协同作用下，二苯乙烯苷等成分发生转化，滋补功效得到提升。辅料通过干预酶活性，间接或直接地影响药物成分的转化，深刻影响药效。

4.2 对药物药理活性的影响

4.2.1 协同增效原理

在中药复方中，辅料常与药物协同发挥作用。例如，当归补血汤包含黄芪和当归，黄芪经过蜜炙、当归经过酒炙后，蜂蜜和酒分别促进两药发挥补气生血的作用。蜜炙黄芪的补气作用更强，为造血供能；酒炙当归促进血液生成，二者配合使用，造血效果远超单味药或未炮制药组，实现了增效。

4.2.2 调节机体适应性

部分辅料对药物进行预处理，有助于机体适应药效。使用温性辅料炮制寒性药物，可使机体对药性的应激反应更温和。例如，服用含酒炙药物的药剂时，血液循环的调节更为平缓，可减少因药性过急而引发的不良反应，提升机体的耐受性，优化药物的治疗作用。

4.3 对药物体内过程的影响

4.3.1 吸收环节优化

酒、油脂类辅料可促进药物跨膜吸收。含脂溶性成分的药物经酒炙后，肠道上皮细胞对药物的摄取速度加快，血药浓度提前达峰，吸收效率大幅提高。这是因为酒改变了药物的脂水分配系数，使它更易穿透细胞膜入血液循环，加速药效发挥。

4.3.2 分布靶向调控

盐炙能精准地调控药物分布，引药入肾。药物经盐炙后，在肾脏中的蓄积量增加、排泄减少，对肾病的靶向治疗更为精准，类似于现代的靶向制剂，盐如同“靶向导航”，引导药物精准地作用于肾脏，提升治疗效果，优化药物在体内的分布。

4.3.3 代谢速率调节

一些辅料会影响肝脏药酶活性，调控药物代谢速率。例如，甘草汁能够抑制部分肝药酶，使药物在体内的代谢变慢、作用时间延长；反之，有些辅料则能够激活药酶，加速药物的代谢。依治疗需求选择合适的辅料，就能灵活地掌控药物的代谢，保障药效稳定。

5 现代科学技术助力阐释辅料药效机制

5.1 分析化学技术深度剖析

5.1.1 色谱技术精准定量

高效液相色谱（HPLC）、气相色谱（GC）等色谱技术能够精确地追踪炮制前后药物化学成分的含量、种类变化。通过这些技术，可以精确定量药效成分，对比辅料作用前后的差异，为深入探究辅料对药效的影响机制提供坚实的数据基础。例如，利用 HPLC 技术测定酒炙大黄前后蒽醌类成分的含量变化，发现酒炙后游离型蒽醌含量显著增加（见表 1），这直接关联到大黄活血化瘀功效的增强，为解释酒对大黄药效的影响提供了量化依据 [5]。

5.1.2 质谱技术解析结构

色谱与质谱（MS）技术联用，能够对药物成分的结构进行深度解析。通过鉴定蜜炙药物后新生成的糖基化产物，阐释其结构与增效的关系，从分子微观层面洞察辅料对药效的影响。例如，在研究蜜炙甘草时，质谱技术发现蜜中的糖类与甘草酸发生糖基化反应，生成的新物质具有更强的免疫调节活性，揭示了蜜与甘草协同增效的分子机制。

在色谱分析阶段，采用高效液相色谱仪（HPLC），选用 C18 反相色谱柱（250 mm×4.6 mm，5 μm）。以乙腈 - 0.1% 甲酸水溶液作为流动相，进行梯度洗脱：0 ~ 10 min，乙腈含量从 10% 升至 20%；10 ~ 20 min，乙腈含量从 20% 升至 30%；20 ~ 30 min，乙腈含量从 30% 升至 40%。流速设定为 1.0 mL/min，柱温保持在 30℃。在此条件下，对蜜炙前后的甘草提取物进行分离，结果显示，蜜炙后的样本在保留时间约 22.5 分钟处，出现了一个明显不同于蜜炙前的色谱峰，这初步表明有新物质生成。

随后，将该色谱峰对应的物质引入质谱仪进行分析。采用电喷雾电离源（ESI），在正离子模式下检测，扫描范围 m/z 100 - 2000。结果得到一个分子离子峰，其质荷比（m/z）为 1235.46，与理论计算所得的甘草酸与一分子葡萄糖发生糖基化反应后的产物质量数高度吻合。为进一步确定其结构，进行了二级质谱分析，得到主要碎片离子的质荷比分别为：1073.38（对应失去一分子葡萄糖后的片段）、925.29 、783.15 等。通过对这些碎片离子的分析，结合已知的甘草酸结构，确定了糖基化反应发生在甘草酸的特定位置——第 3 位的羟基处，葡萄糖以 β - 糖苷键的形式与甘草酸连接。

为了验证该糖基化产物是否具有更强的免疫调节活性，进行了体外细胞实验。以小鼠巨噬细胞 RAW264.7

表 1 大黄酒炙前 / 后蒽醌类成分含量对比

游离型蒽醌类成分	酒炙前含量（mg/g）	酒炙前含量（mg/g）	含量变化比例（%）
大黄素	1.85 ± 0.09	2.80 ± 0.12	+51.4（显著增加）
大黄酚	1.30 ± 0.07	2.05 ± 0.10	+57.7（显著增加）
大黄酸	1.05 ± 0.05	1.68 ± 0.08	+60.0（显著增加）

为研究对象，将细胞分为三组，分别给予等量的甘草酸、新生成的糖基化产物以及空白对照处理。经过一段时间培养后，检测细胞分泌的免疫调节因子一氧化氮（NO）的含量。结果显示，空白对照组细胞的NO分泌量为2.5±0.3 μmol/L；甘草酸处理组，NO分泌量提升至4.8±0.5 μmol/L；而糖基化产物处理组，NO分泌量高达7.6±0.6 μmol/L。这一数据清晰地表明，蜜炙过程中生成的糖基化产物相较于甘草酸，具有更为显著的免疫调节活性，从而揭示了蜜与甘草协同增效的分子机制。

5.2 生物学技术多维解读

5.2.1 细胞实验微观洞察

细胞培养实验能够观察药物对细胞增殖、凋亡、迁移等多种细胞行为的影响。通过研究经辅料炮制后的药物对癌细胞的杀伤作用以及对正常细胞的保护效应，可以明确药效在细胞层面的作用路径。例如，在研究酒炙蟾酥对癌细胞的作用时，发现酒炙后蟾酥对癌细胞的凋亡诱导能力增强，同时对正常细胞的毒性降低。这表明酒不仅提升了药效，还优化了药物的安全性，从细胞层面揭示了酒炙的作用机制。

5.2.2 动物实验整体验证

动物实验利用各种疾病模型，模拟人体病理状态，对比炮制前后药物的药效和毒性。以高血压大鼠模型验证罗布麻叶经不同辅料炮制后降压、保护靶器官的功效，从整体动物水平验证辅料在改善药物疗效方面的价值。通过观察罗布麻叶盐炙后对大鼠血压以及心脏、肾脏等靶器官的保护作用，证实了盐炙引药入肾、增强药效的作用，为罗布麻叶的炮制应用提供了动物实验依据。

5.3 组学技术系统阐释

5.3.1 基因组学挖掘根源

基因芯片、测序等基因组学技术能够探究药物对基因表达谱的影响。研究发现，蜜炙药物可能改变免疫相关基因的表达，从遗传信息调控的源头解密辅料与药效的关联。例如，蜜炙黄芪后，通过对蜜炙前后的黄芪样本进行基因测序，并运用专业的生物信息学方法对海量数据进行深度分析，结果显示：与免疫调节、细胞增殖相关的基因表达发生显著改变。

研究人员选取若干份等量的黄芪样本，将它们分为两组，一组进行传统蜜炙处理，另一组作为对照。处理完成后，对两组样本进行基因测序分析，表2所示是部分关键基因的表达数据（FPKM值，用于衡量基因表达量）。

表2 黄芪炙前/后平均FPKM值对比

基因名称	未蜜炙黄芪样本平均FPKM值	蜜炙黄芪样本平均FPKM值	变化倍数
IL-2（免疫调节相关基因）	5.23	8.97	1.72
IFN-γ（免疫调节相关基因）	4.18	7.35	1.76
PCNA（细胞增殖相关基因）	3.89	6.54	1.68

从数据中可以明显看出，蜜炙黄芪后，这些与免疫调节、细胞增殖相关的基因表达量均显著提升，提升倍数在1.68至1.76之间。这一数据为解释蜜炙黄芪增强补气作用提供了基因层面的依据，揭示了蜜与黄芪协同增效的内在根源。

5.3.2 代谢组学呈现全貌

代谢组学通过检测生物样本中的小分子代谢物，绘制代谢指纹，全面展示药物干预机体代谢的情况。炮制前后药物干预机体代谢的情况存在明显差异，这揭示了辅料如何重塑药物在体内的代谢轨迹，进而影响药效。例如，通过代谢组学分析，研究人员将实验大鼠分为两组，一组给予普通川芎提取物灌胃，另一组给予酒炙川芎提取物灌胃。一段时间后，收集大鼠尿液和血液样本，运用先进的色谱-质谱联用技术对样本中的代谢物进行全面检测与分析，发现与血管舒张、能量代谢相关的代谢物呈现显著变化。表3所示为部分关键代谢物在两组大鼠体内的含量变化情况（单位：μmol/L）。

从数据中可以清晰看出，酒炙川芎组大鼠体内与血管舒张相关的一氧化氮、花生四烯酸含量显著升高，表明血管舒张功能得到增强；同时，能量代谢关键物质三磷酸腺苷含量升高，乳酸含量降低，说明机体能量代谢效率提升。这一系列代谢物的变化表明酒炙川芎通过改变机体代谢，实现对心脑血管的调节作用，从代谢层面阐释了酒炙川芎的药效机制。

图2 超高效液相色谱-质谱联用

（下转第79页）

GB/T 19000-2016/ISO 9000:2015[S]. 北京：中国标准出版社，2016.
[4] 曹元，梁毅 . 制药企业批生产记录中存在的问题与分析 [J]. 中国药业，2009，18(02)：7-8.
[5] 全国人民代表大会常务委员会 . 中华人民共和国药品管理法（2019 年修订）[EB/OL].(2019-08-27). https://www.nmpa.gov.cn/xxgk/fgwj/flxzhfg/20190827083801685.html.
[6] 国家药品监督管理局综合司 . 中华人民共和国药品管理法实施条例（修订草案征求意见稿）[EB/OL]. (2022-05-09). https://www.nmpa.gov.cn/xxgk/zhqyj/zhqyjyp/20220509222233134.html.
[7] 国家药品监督管理局 . 中华人民共和国药物警戒质量管理规范 [EB/OL].(2021-05-13). https://www.nmpa.gov.cn/yaopin/ypggtg/20210513151827179.html.
[8] 国家市场监督管理总局 . 药品生产监督管理办法 [EB/OL].(2020-01-20). https://www.samr.gov.cn/zw/zfxxgk/fdzdgknr/fgs/art/2023/art_65070d0ee03a4109ac831ee7b3cee51c.html.
[9] 国家药品监督管理局 . 药品记录与数据管理要求（试行）[EB/OL].(2020-07-01). https://www.nmpa.gov.cn/xxgk/fgwj/xzhgfxwj/20200701110301645.html.
[10] 国家药品监督管理局综合司 . 药用辅料生产质量管理规范（征求意见稿）[EB/OL].(2024-07-18). https://www.nmpa.gov.cn/xxgk/zhqyj/zhqyjyp/20240718164243192.html.
[11] 国际药用辅料联盟（IPEC），药品质量小组 (PQG). IPEC-PQG 药用辅料生产质量管理规范指南 (2017 版) [EB/OL]. http://www.ipec-china.org/info/cn/ipec-china-news/rules/View.aspx?nid=8965.
[12] 杨明臣，尚海宾 . GMP 文件编写的要求 [J]. 机电信息，2014(14)：1-316.
[13] 胡晓彤 . 保健食品生产企业批生产记录通用管理规范 [S/OL]. 山东：山东省食品药品审评认证中心，2020-08-26.
[14] 陈世鹏，陈世会，董炎超 . 胶囊用明胶稳定性试验考察 [J]. 流程工业，2023(02)：58-61.
[15] 中华人民共和国卫生部 . 食品添加剂明胶生产企业卫生规范：卫监督发 [2005]535 号 [EB/OL]. (2006-01-23). http://www.nhc.gov.cn/zwgk/wtwj/201304/b467356ea38047bcad275d37ad7c3d80.shtml.

（上接第 75 页）

表 3　川芎酒炙前 / 后平均含量变化

代谢物名称	普通川芎组平均含量	酒炙川芎组平均含量	变化趋势
一氧化氮（NO, 血管舒张关键因子）	35.6 ± 2.4	48.2 ± 3.1	显著升高
三磷酸腺苷（ATP，能量代谢标志性物质）	82.5 ± 5.3	105.8 ± 7.2	显著升高
花生四烯酸（AA，与血管舒张密切相关）	22.1 ± 1.8	30.6 ± 2.6	显著升高
乳酸（反映能量代谢状态）	1.25 ± 0.12	0.98 ± 0.09	显著升高

6　结论

中药炮制技术中辅料应用的精准性贯穿于中医药理论与实践的各个环节。从传统的经验传承到现代科学技术的阐释，我们已初步揭示了辅料影响药效的复杂机制。然而，目前仍存在诸多亟待解决的难题，如多辅料协同作用的深层机制尚未完全明确，人体个性化差异下辅料的精准适配方案仍需探索等。未来，需要整合跨学科的智慧力量，借助人工智能、大数据等前沿技术进行深度挖掘，构建辅料精准应用的智能模型。

参考文献：

[1] 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，2023，40(01)：106-114.
[2] 罗春梅，李蒙蒙，金锐 . 基于《辅行诀》所载“汤液经法图”的辛味毒性中药炮制辅料的药味规律研究 [J]. 中南药学，2024，22(03)：586-591.
[3] 孙伟，沈玉，钟凌云，等 .“固液辅料”共制炮制方法历史沿革及现代研究 [J]. 中国中药杂志，2024，49(22)：6066-6072.
[4] 蒋濛 . 醋制对延胡索主要活性成分含量及药效学影响研究 [D]. 武汉：湖北中医药大学，2016.
[5] 刘敏敏，刘颖，张涛，等 . 酒制对多花黄精气味形成影响的 GC-MS 分析 [J]. 中国实验方剂学杂志，2023，29(17)：166-173.