

· 综述 ·

桔梗的炮制历史沿革、化学成分及药理作用研究进展

邓亚玲, 任洪民, 叶先文, 夏澜婷, 祝婧, 于欢, 张普照, 杨明*, 张金莲*, 徐松兵
(江西中医药大学药学院, 现代中药制剂教育部重点实验室, 南昌 330004)

[摘要] 桔梗始载于《神农本草经》, 功著于华盖之脏, 有“诸药舟楫”之称, 既能载诸药上行, 又能引苦泄峻下。桔梗的炮制早在晋代就已有记载, 具有悠久的炮制历史, 除沿用至今的净制、切制和蜜炙, 古代还出现了清炒、麸炒、醋炙、酒炙、姜炙、米泔水制、百合制等炮制方法。古人认为桔梗经过炮制加工可增强其宣肺、利咽、止咳之效。就桔梗的化学成分而言, 目前已从桔梗的根、茎、叶中分离鉴定得到三萜皂苷类、黄酮类、酚类、甾醇类、多糖类、聚炔类及其他化合物共百余种, 其中主要为三萜皂苷类化合物。此外, 桔梗具有祛痰、镇咳、抗炎等药理作用。桔梗的药效成分主要是三萜皂苷类和多糖类, 其中三萜皂苷类成分生物活性多样, 是当前研究的热点。桔梗具有良好的宣肺祛痰作用, 经过炮制后其药效增强; 其成分复杂多样, 具有丰富的药理活性。在整理文献资料的基础上, 该文从桔梗的炮制历史沿革、化学成分及药理作用等方面进行论述, 以期为桔梗的特色饮片炮制及现代研究提供参考, 并为其炮制机制及质量控制研究提供理论依据。

[关键词] 桔梗; 炮制方法; 历史沿革; 炮制工艺; 化学成分; 药理作用; 特色饮片

[中图分类号] R22; R28; R96; R914; R943.1 [文献标识码] A [文章编号] 1005-9903(2020)02-0190-13

[doi] 10.13422/j.cnki.syfx.20191946

[网络出版地址] <http://kns.cnki.net/kcms/detail/11.3495.R.20190618.0914.001.html>

[网络出版时间] 2019-06-19 08:59

Progress of Historical Evolution of Processing, Chemical Composition and Pharmacological Effect of Platycodonis Radix

DENG Ya-ling, REN Hong-min, YE Xian-wen, XIA Lan-ting, ZHU Jing, YU Huan, ZHANG Pu-zhao,
YANG Ming*, ZHANG Jin-lian*, XU Song-bing

(Key Laboratory of Modern Preparation of Traditional Chinese Medicine (TCM), Ministry of Education,
School of Pharmacy, Jiangxi University of TCM, Nanchang 330004, China)

[Abstract] Platycodonis Radix, which was first recorded in the *Agriculture God's Canon of Materia Medica*. It is a multi-functional drug with a wide range of applications. The processing of Platycodonis Radix has been recorded as early as in the Jin dynasty, and has a long history of processing. Today, in addition to the washing, cutting and stir-frying with honey, there have also been more than 20 kinds of processing methods, such as stir-frying with wine, stir-frying with bran, stir-frying with Lili Bulbus juice and so on. The ancients believed that Platycodonis Radix could enhance the effect of diffusing the lung, promoting pharynx and relieving cough by processing. In terms of the chemical compositions in Platycodonis Radix, more than 100 compositions, like triterpenoid saponins, flavonoids, phenols, sterols, polysaccharides and polyacetylenes, have been isolated and identified from it. Among them, triterpenoid saponins are the essential compositions. In addition, Platycodonis

[收稿日期] 20190418(029)

[基金项目] 国家重点研发计划“中医药现代化研究”重点专项(2018YFC1707200, 2018YFC1707206); 江西省“双一流”学科(中药学)建设项目; 江西省重点研发计划项目(2019BBG70073); 国家自然科学基金项目(81560651)

[第一作者] 邓亚玲, 在读硕士, 从事中药学研究, E-mail: 1484578980@qq.com

[通信作者] * 张金莲, 博士, 教授, 硕士生导师, 从事中药炮制机制、炮制工艺及质量研究, Tel: 0791-87118995, E-mail: jxjzzjl@163.com;

* 杨明, 博士, 教授, 博士生导师, 从事中药新剂型、新技术、新工艺研究, Tel: 0791-87118108, E-mail: yangming16@126.com

Radix has the pharmacological effects of expectorant, antitussive, anti-inflammatory, anti-tumor, etc. The medicinal ingredients of Platycodonis Radix are mainly triterpenoid saponins and polysaccharides. Among them, triterpenoid saponins have diverse biological activities, which lead it to be one of the hotspots of current researches. Platycodonis Radix has a good role in promoting lung and removing phlegm. After being processed, its medicinal effects are enhanced. It is complex and diverse in compositions of Platycodonis Radix so that has rich pharmacological activities. On the basis of sorting out the literature, this paper discusses the processing history, chemical composition and pharmacological effect of Platycodonis Radix, in order to provide reference for the special processing and modern research of Platycodonis Radix. Furtherly, it provides a theoretical basis for the research of its processing mechanism and quality control.

[Key words] Platycodonis Radix; processing method; historical evolution; processing technology; chemical composition; pharmacological effects; characteristics decoction pieces

桔梗为桔梗科植物桔梗 *Platycodon grandiflorum* 的干燥根, 主入肺经, 辛苦苦泄, 具有宣肺祛痰、利咽排脓的功效, 主治咽喉肿痛、肺痈吐脓、胸满胁痛等证^[1]。因此草之根结实而梗直, 故名^[2]。桔梗首次收载于《神农本草经》^[3], 列为下品。《本草乘雅半偈》^[4]载: “桔梗, 如桔槔之梗, 倾则仆, 满则立, 载上载下, 其冯以枢, 合入少阳少阴枢药也。”《本草求真》^[5]曰: “桔梗, 专入肺, 兼入心, 胃, 辛苦而平。”桔梗是药食同源的中药之一, 种植广泛。历代本草与医家典籍中关于桔梗炮制的记载颇多, 现代在其化学成分及药理作用方面也开展了大量工作, 且临床应用广泛。本文拟对桔梗炮制方法的记载及其化学成分、药理作用、炮制工艺的研究概况进行归纳与梳理, 以期对桔梗的深入研究提供参考。

1 炮制历史沿革

1.1 炮制方法的历史沿革

1.1.1 古代炮制方法 葛洪的《肘后备急方》^[6]最早记载桔梗的炮制, 其将桔梗“烧末”使用。南北朝刘宋时期雷敫最先在《雷公炮炙论》^[7]中提出“百合制桔梗”, 并作详细说明。唐代的《仙授理伤续断秘方》^[8]中记载将桔梗去芦去苗使用, 其去芦的方法仍可在古代典籍中搜查到。发展到宋代, 相关本草书籍中不仅增加了桔梗的炮制方法(如切制、炒制等), 还补充了炮制辅料的种类, 如许叔微在《普济本事方》^[9]中首次提到了用姜汁浸、炒桔梗的炮制方法, 至此, 桔梗的炮制方法已趋向清晰化。金元时期, 除沿用前人的炮制方法之外, 新增了蜜炙桔梗。到明清时期又出现了一些新的炮制方法, 明代朱橚等编撰的《普济方》^[10]中首次记载了酒炒桔梗的炮制方法, 对炮制程度也提出了具体要求; 方贤在其所编辑的《奇效良方》^[11]中增加了麸炒、醋炙的炮制方法; 李时珍则在《本草纲目》^[2]中首次明确提出桔

梗炮制前需去浮皮。历代本草典籍收载的桔梗炮制方法详见表 1。

综上所述, 历代经典名著收载了多种炮制桔梗的方法, 如净制、切制、加辅料制等, 具体炮制方法有去苗、去皮、细切等, 南北朝就有百合制, 到明代以百合制、米泔水制、蜜炙为主流炮制方法, 清代保留了明代的炮制方法, 使用的辅料为百合汁、米泔水和蜂蜜。

1.1.2 现代炮制方法 桔梗的现代炮制以蜜炙法为主流, 但各地方亦保留了其独具特色的炮制方法。自 1960 年代以来, 国家与各地方中医药管理部门为了传承与规范中药饮片的炮制工艺, 相继制定颁布了《中国药典》以及各省(市、自治区)中药饮片炮制规范^[42], 收载的桔梗炮制方法概况见表 2。结果发现历版《中国药典》收载的桔梗饮片品种均只有桔梗生品, 而全国地方炮制规范除收载了桔梗生品外, 还收载了蜜桔梗、炒桔梗。

1.2 炮制工艺研究概况 目前, 关于桔梗炮制工艺优选方面研究已有不少, 张振凌等^[73]以桔梗皂苷 D 含量为评价指标, 优选得到蜜炙桔梗的炮制加工工艺为每 100 g 桔梗用炼蜜 15 g, 加炼蜜 1/3 量的水稀释后拌匀, 80 °C 烘 1 h 至干燥; 且蜜炙桔梗中总皂苷的含量明显高于 2005 年版《中国药典》要求。王正益等^[74]以桔梗总皂苷浸出率为考察指标, 采用正交试验比较不同条件下得到的炮制品, 发现烘制桔梗中含量最高, 炒桔梗次之, 生桔梗最低, 同时优选出烘制桔梗的最佳炮制工艺为 90 °C 下烘 45 min。为了比较不同辅料对桔梗炮制品的影响, 刘汉珍等^[75]测定不同炮制品中桔梗总皂苷含量, 结果桔梗总皂苷含量排序为蜜制品 > 酒制品 > 醋制品 > 姜汁制品 > 生品。罗学伦^[76]以桔梗总皂苷的含量为评价指标, 采用重量法比较几种桔梗炮制品的总皂苷

表 1 历代本草记载的桔梗炮制方法

Table 1 Processing methods of *Platycodonis Radix* in ancient literature

| 朝代 | 来源 | 炮制方法 | 相关记载 |
|-----|--------------------------------|-------------|---|
| 晋 | 《肘后备急方》 ^[6] | 烧末 | (烧)二枚,末之 |
| 南北朝 | 《雷公炮炙论》 ^[7] | 百合制 | 凡使,去头上尖硬二三分已来,并两畔附枝子,于槐砧上细锉,用百合水浸一伏时,漉出,缓火熬令干用。每修事四两,用生百合五分捣作膏,投入水中浸 |
| 唐 | 《仙授理伤续断秘方》 ^[8] | 净制 | 去芦,去苗 |
| 唐 | 《全生指迷方》 ^[12] | 净制 | 去芦 |
| 宋 | 《普济本事方》 ^[9] | 姜汁制 | 切作小块,姜汁浸,炒 |
| 宋 | 《重修政和经史证类备用本草》 ^[13] | 切制、百合制 | 剉碎、捣罗为散。每修事四两,用生百合五分捣作膏,投于水中浸 |
| 宋 | 《小儿卫生总微论方》 ^[14] | 米泔水制 | 去芦,米泔水浸一宿,焙干用 |
| 宋 | 《类证活人书》 ^[15] | 切制 | 细切 |
| 宋 | 《伤寒总病论》 ^[16] | 炒制 | 去芦,炒,微炒 |
| 宋 | 《洪氏集验方》 ^[17] | 切制 | 洗净,去头尾,薄切,焙燥 |
| 宋 | 《圣济总录》 ^[18] | 炒制、蜜蒸制 | 去芦头炒。剉碎,炒焦为度。切,用蜜拌,于饭上蒸三日 |
| 宋 | 《类编朱氏集验医方》 ^[19] | 炒制 | 剉大块,慢火炒令变紫黑色 |
| 元 | 《活幼心书》 ^[20] | 蜜炙 | 剉用蜜水浸透。蜜水炒剉用 |
| 元 | 《汤液本草》 ^[21] | 米泔水制 | 去芦,米泔浸一宿。去芦,米泔水浸一宿焙干用 |
| 元 | 《卫生宝鉴》 ^[22] | 炒制、蜜炙、米泔水制 | 去芦,炒,微炒。蜜拌,甑蒸。去芦,米泔水浸一宿,焙干用,铡碎剉,桶剉,竹筛齐用 |
| 元 | 《丹溪心法》 ^[23] | 炒黄 | 去芦苗,炒黄色 |
| 明 | 《本草约言》 ^[24] | 米泔水制 | 凡使,去芦,米泔浸一宿,焙干用 |
| 明 | 《普济方》 ^[10] | 切制、清炒、酒炙、蜜炙 | 切碎。锉细,微炒。锉碎,炒微焦为度。去芦头,切碎,酒炒至金黄色。切,用蜜拌,于饭上蒸三日 |
| 明 | 《本草蒙筌》 ^[25] | 米泔水制 | 入药芦苗去净,泔渍洗,米泔渍一宿,焙干 |
| 明 | 《本草纲目》 ^[2] | 米泔水制 | 今但刮去浮皮,米泔水浸一夜,切片,微炒用 |
| 明 | 《证治准绳》 ^[26] | 炒制、蜜炙、米泔水制 | 炒黄。剉片,蜜水炒过。米泔浸一宿,焙干,竹筛齐用 |
| 明 | 《本草通玄》 ^[27] | 百合制 | 凡用桔梗,去芦及浮皮并尖,以百合捣烂,同浸一日,挫碎,微焙 |
| 明 | 《先醒斋广笔记》 ^[28] | 米泔蒸制 | 去芦,米泔浸,蒸 |
| 明 | 《本草征要》 ^[29] | 米泔水制 | 泔浸,去芦,微焙 |
| 明 | 《本草乘雅半偈》 ^[4] | 百合制 | 修事,去头上硬尖二三分,并两畔附枝。槐砧上细锉,用生百合捣膏,投水中浸一伏时,取出,缓火熬干。每桔梗四两,用百合二两五钱 |
| 明 | 《雷公炮制药性解》 ^[30] | 百合制 | 凡使勿用本梗,真似桔梗,咬之只是腥涩,不堪用凡,使去头尖硬二三分以来,并两畔,附枝子于槐砧上细锉,用百合水浸一伏时,漉出,缓火熬令干用,每修事四两,用生百合五分,捣作膏,投水中浸 |
| 明 | 《炮炙大法》 ^[31] | 百合制 | 凡使,去头上尖硬二三分以来,并两畔附枝子,于槐砧上细锉,用百合水浸一伏时,漉出,缓火熬令干用。每修事四两,用生百合五分,捣作膏,投于水中浸一法,用米泔浸一宿,微焙用 |
| 清 | 《本草备要》 ^[32] | 米泔水制 | 去浮皮,泔浸,微炒用 |
| 清 | 《本草从新》 ^[33] | 米泔水制 | 去浮皮,泔浸,微炒 |
| 清 | 《本草撮要》 ^[34] | 米泔水制 | 去浮皮,泔浸,微炒用 |
| 清 | 《本草害利》 ^[35] | 米泔水制、百合制 | 米泔水浸一夜,切片微炒用。古法每桔梗四两,用生百合二两五钱,捣膏投水中,浸一伏时,滤出,缓火熬令干用 |
| 清 | 《本草易读》 ^[36] | 米泔水制 | 泔浸炒用 |
| 清 | 《本草述钩元》 ^[37] | 米泔水制 | 去头及两畔附枝,米泔浸一宿,焙干 |
| 清 | 《本草择要纲目》 ^[38] | 米泔水制 | 去芦净米泔水浸一宿,焙干用 |
| 清 | 《本草详节》 ^[39] | 米泔水制 | 凡使,米泔水浸,切片,微炒用 |
| 清 | 《得配本草》 ^[40] | 米泔水制 | 刮去浮皮,米泔浸,微炒 |
| 清 | 《外科大成》 ^[41] | 蜜炙 | 蜜水拌炒 |

表 2 《中国药典》及各地方标准收录的桔梗炮制方法

Table 2 Processing methods of *Platycodonis Radix* in *Chinese Pharmacopoeia* and various local standards

| 参考文献 | 饮片 | 炮制方法 |
|-----------|-----|---|
| [43] | 桔梗 | 除去杂质,去芦,洗净,捞出,润透后切片,晒干即得 |
| [44] | 桔梗 | 除去杂质,稍泡,洗净,润透,切片,晾干 |
| [1,45-50] | 桔梗 | 除去杂质,洗净,润透,切厚片,干燥 |
| [42] | 桔梗 | ①除去杂质,洗净,润透,切厚片,干燥;②取原药材,除去杂质,洗净,润透,切薄片,干燥;③取原药材,除去杂质,洗净,稍浸,取出,闷润 8~12 h,至内外湿度一致,切薄片,干燥,筛去碎屑;④取原药材,除去杂质,洗净,润透,切 1~2 mm 薄片,干燥;⑤除去杂质,去净芦头,用清水洗净,捞出,闷润至透,切片,晒干;⑥除去杂质,洗净,润透,稍晾,切片,干燥;⑦除去杂质,洗净泥土,捞出,沥水,切 1.5 mm 片,干燥;⑧将原药除去残茎等杂质,洗净,润透,切厚片,干燥,筛去灰屑;⑨取原药材,除去杂质,洗净,润软,切厚片或薄片,干燥;⑩取原药材,除去杂质,洗净,润透,切薄片,干燥,筛去碎屑;除去杂质及芦头,洗净,⑪润透,切薄片,干燥;⑫取原药材,除去杂质,洗净,润透,切短段片,干燥,筛去碎屑;⑬除去杂质,洗净,稍润,切中片或厚片,干燥,筛去灰屑;⑭取药材桔梗,除去杂质,洗净,润透,切厚片,干燥;⑮取原药材,除去杂质,洗净,润透,切厚片,干燥 |
| | 蜜桔梗 | ①取炼蜜用适量开水稀释后,加入桔梗片拌匀,闷透,置锅中,用文火加热,炒至黄色不粘手为度,取出,放凉,每桔梗片 100 kg,用炼蜜 25 kg;②取桔梗,照蜜炙法(附录 I),炒至不粘手;③取桔梗,与炼蜜拌匀,稍闷,炒至不粘手时,取出,摊凉。每桔梗 100 kg,用炼蜜 15~25 kg;④取净桔梗片,照蜜炙法①(附录 I),炒至不粘手,表面呈黄色。每 100 kg 桔梗,用炼蜜 20 kg;⑤取桔梗片,照蜜炙法(炮制通则)炒至片面呈黄色、不粘手;⑥取饮片桔梗,照蜜炙法(附录 I)炒至不粘手;⑦取炼蜜,加适量开水稀释,加入净桔梗拌匀,稍闷透,置锅内,用文火加热,炒至不粘手为度,出锅,放凉,每净桔梗 100 kg,用炼蜜 25 kg |
| | 炒桔梗 | 取桔梗,炒至表面微黄色,微具焦斑时,取出,摊凉 |
| [51] | 桔梗 | 捡净杂质,洗净,润透,去芦,切成 0.3 cm 左右片,晒干 |
| [52] | 蜜桔梗 | 取片 1 斤,用炼蜜 3 两拌炒,至蜜汁吸净为度 |
| [53] | 桔梗 | 去芦,洗净,润透,切 |
| [54] | 桔梗 | 捡去杂质,清水洗净,捞出,润透后切顶刀片 0.8~1 mm 厚,晒干 |
| [55] | 桔梗 | 取原药材,捡净杂质,用清水洗去泥土,稍浸捞出,闷 8~12 h(夏、冬季时间适当增减)至内外湿度一致,切片,过筛,将不合格的片反复操作,掺匀,晒干或烘干,过净土末,入库即得 |
| [56] | 桔梗 | 捡净杂质,洗净,润透,稍晾,切片,晒或烘干 |
| [57] | 桔梗 | 捡净杂质,浸洗,捞出,润透,切 1.5 mm 片,干燥 |
| [58] | 桔梗 | 去净芦头和杂质,洗净,润透,切薄片,干燥 |
| [59] | 桔梗 | 取桔梗,倒入沸水中,迅速搅动次数,立即取出,闷一夜,切成薄片,晒干 |
| [60] | 桔梗 | 取桔梗除去杂质,洗净,润透,切薄片,干燥 |
| [61] | 桔梗 | 拣去杂质,抢水洗净,捞入框内,上盖湿布,稍闷润后切薄片,晒干或烘干 |
| [62] | 桔梗 | 将原药除去杂质及残茎,洗净,润软,切极薄片,干燥,筛去灰屑 |
| [63] | 桔梗 | 将原药除去杂质,洗净,润透,切薄片,干燥 |
| [64] | 桔梗 | 除去杂质,用清水洗净泥土,捞出,润透,切片,晒干 |
| [65] | 桔梗 | 捡去杂质,洗净泥沙,捞出,沥干余水,润透,去芦,切 3~6 mm 段片,晒干或烘干,筛去灰屑即得 |
| [66] | 桔梗 | 取原药捡净杂质,用水淘洗后捞出,冬春吸润约 8~12 h,夏秋吸润约 4~6 h,取出,铡成厚约 2 mm 的原片,晒干即可 |
| [67] | 生桔梗 | 取原药材,除去杂质,洗净,润软,切薄片,干燥,筛去灰屑 |
| | 炒桔梗 | 取生桔梗,炒制微黄,微具焦斑 |
| | 蜜桔梗 | 取生桔梗,照蜜炙法(13 页)炒至不粘手为度。每生桔梗 100 kg,用炼蜜 15 kg |
| [68] | 桔梗 | 取原药材,除去杂质,用水洗净,沥去水分,闷透,用铡刀铡成薄片,干燥 |
| [69] | 桔梗 | 除去杂质,用清水洗净,略浸,闷润至透,切薄片,干燥 |
| [70] | 桔梗 | 捡去杂质,洗净泥沙,捞出,沥干余水,润透,去芦,切 3~6 mm 段片,晒干或烘干,筛去灰屑即得 |
| [71] | 桔梗 | 取原药材,除去杂质,洗净,润软,切薄片,干燥;产地已切片者,筛去灰屑 |
| [72] | 蜜桔梗 | 除去杂质,洗净,润软,切薄片,干燥,筛去灰屑。取净桔梗片,照蜜炙法[2015 年版《中国药典》(四部)通则 0213]炒至不粘手。每 100 kg 桔梗,用炼蜜 20 kg |

含量,结果表明各炮制品均优于生品,且以蜜炙桔梗最优。王正益等^[77]以桔梗总皂苷为考察指标,以烘制时间、烘制温度、用蜜量为考察因素,优选得到烘制制备蜜炙桔梗的最佳炮制工艺为烘制温度 80 ℃,烘制时间 1.5 h,每 100 kg 桔梗用炼蜜 25 kg,且温度易控,不会造成环境污染,可用于大批量样品的炮

制加工。

2 化学成分

2.1 三萜皂苷类化合物 三萜皂苷类在桔梗中广为存在,是主要的活性成分。目前,已从桔梗中分离并鉴定的三萜皂苷类成分有 75 种,其结构母核见图 1,化合物详见表 3。

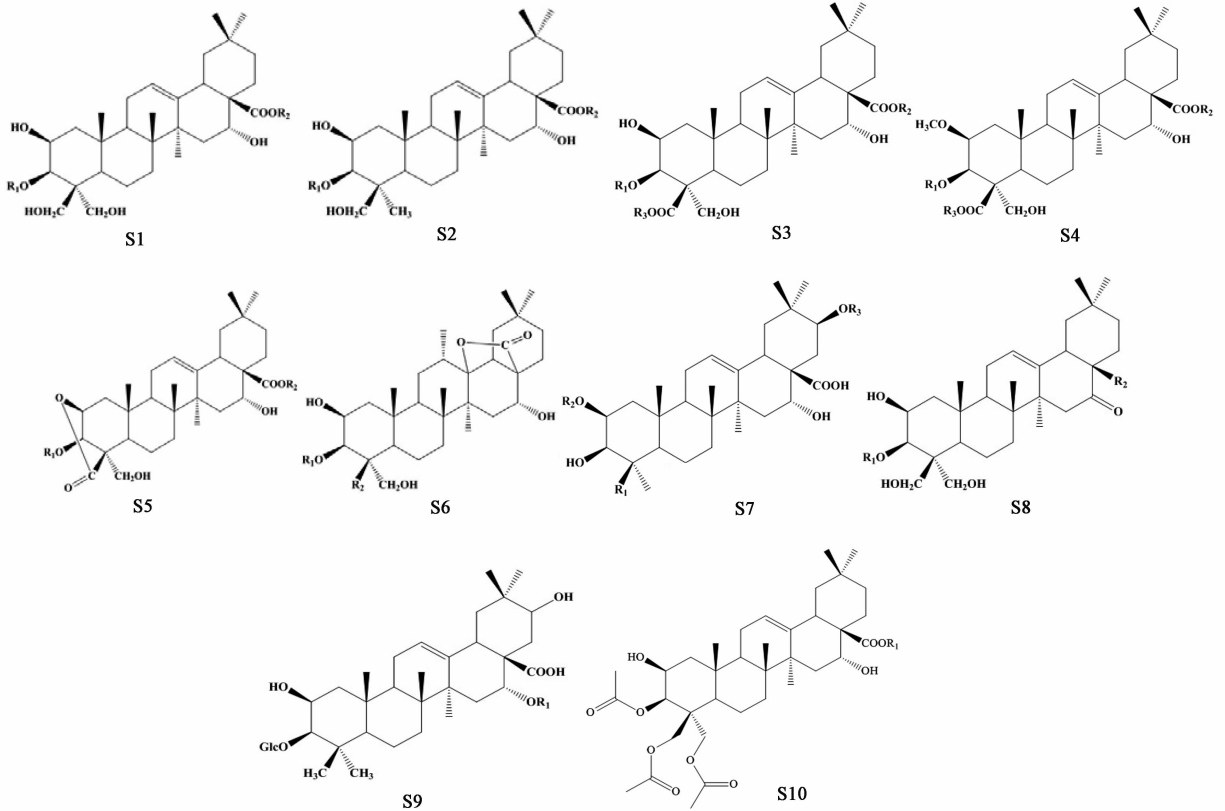


图 1 桔梗中三萜皂苷类成分的母核结构

Fig. 1 Maternal nucleus structures of triterpenoid saponins in *Platycodonis Radix*

表 3 桔梗中的三萜皂苷类成分

Table 3 Triterpenoid saponins in *Platycodonis Radix*

| 化合物 | 分子式 | 相对分子质量 | R ₁ | R ₂ | R ₃ | 母核 | 参考文献 |
|--------------------------------------|--|-----------|----------------|-----------------|----------------|----|--------|
| 桔梗皂苷元 (platicodigenin) | C ₃₀ H ₄₈ O ₇ | 520. 71 | H | H | | S1 | [78] |
| 桔梗皂苷甲酯 (platicodigenin methyl ester) | C ₃₁ H ₅₀ O ₇ | 534. 73 | H | CH ₃ | | S1 | [78] |
| 桔梗皂苷 A (platicodin A) | C ₅₉ H ₉₄ O ₂₉ | 1 267. 37 | Glc | A7 | | S1 | [79] |
| platicodin C | C ₅₉ H ₉₄ O ₂₉ | 1 267. 37 | Glc | A8 | | S1 | [79] |
| platicodin D | C ₅₇ H ₉₂ O ₂₈ | 1 225. 34 | Glc | A4 | | S1 | [79] |
| platicodin D ₂ | C ₆₃ H ₁₀₂ O ₃₃ | 1 387. 48 | Lam | A4 | | S1 | [79] |
| platicodin D ₃ | C ₆₃ H ₁₀₂ O ₃₃ | 1 387. 48 | Gen | A4 | | S1 | [79] |
| platicodin J | C ₅₇ H ₉₀ O ₂₉ | 1 239. 32 | GlcA | A4 | | S1 | [80] |
| platicodin K | C ₅₉ H ₉₂ O ₃₀ | 1 281. 36 | GlcA | A7 | | S1 | [80] |
| platicodin L | C ₅₉ H ₉₂ O ₃₀ | 1 281. 36 | GlcA | A8 | | S1 | [80] |
| 桔梗皂苷 B (platicoside B) | C ₅₄ H ₈₆ O ₂₅ | 1 135. 26 | Glc | A5 | | S1 | [81] |
| platicoside C | C ₅₄ H ₈₆ O ₂₅ | 1 135. 25 | Glc | A6 | | S1 | [79] |
| platicoside E | C ₆₉ H ₁₁₂ O ₃₈ | 1 549. 62 | A1 | A4 | | S1 | [79] |

续表 3

| 化合物 | 分子式 | 相对分子质量 | R ₁ | R ₂ | R ₃ | 母核 | 参考文献 |
|---|--|----------|----------------|-----------------|-----------------|----|------|
| platycoside F | C ₄₇ H ₇₆ O ₂₀ | 961.11 | Glc | A2 | | S1 | [81] |
| platycoside G ₂ | C ₅₉ H ₉₆ O ₃₀ | 1 285.39 | A1 | A2 | | S1 | [82] |
| platycoside K | C ₄₂ H ₆₈ O ₁₇ | 844.99 | Lam | H | | S1 | [83] |
| platycoside L | C ₄₂ H ₆₈ O ₁₇ | 844.99 | Gen | H | | S1 | [83] |
| 去芹菜糖桔梗皂苷 D (deapio-platycodin D) | C ₅₂ H ₈₄ O ₂₄ | 1 093.22 | Glc | A3 | | S1 | [79] |
| deapio-platycodin D ₂ | C ₅₈ H ₉₄ O ₂₉ | 1 255.36 | Lam | A3 | | S1 | [79] |
| deapio-platycodin D ₃ | C ₅₈ H ₉₄ O ₂₉ | 1 255.36 | Gen | A3 | | S1 | [84] |
| deapio-platycoside E | C ₆₄ H ₁₀₄ O ₃₄ | 1 417.50 | A1 | A3 | | S1 | [79] |
| 2''-O-乙酰基远志皂苷 D (2''-O-acetyl polygalacin D) | C ₅₉ H ₉₄ O ₂₉ | 1 267.37 | Glc | A7 | | S1 | [79] |
| 2''-O-乙酰基桔梗皂 D ₂ (2''-O-acetyl platycodin D ₂) | C ₆₅ H ₁₀₄ O ₃₄ | 1 429.51 | Lam | A7 | | S1 | [79] |
| 3''-O-acetyl platycodin D ₂ | C ₆₅ H ₁₀₄ O ₃₄ | 1 429.51 | Lam | A8 | | S1 | [79] |
| 3''-O-β-D-吡喃葡萄糖基桔梗皂苷元 (3''-O-β-D-glucopyranosyl platycodigenin) | C ₃₆ H ₅₈ O ₁₂ | 682.85 | Glc | H | | S1 | [85] |
| 3-O-β-D-glucopyranosyl platycodigenin methyl ester | C ₃₇ H ₆₀ O ₁₂ | 696.88 | Glc | CH ₃ | | S1 | [86] |
| 3-O-β-D-昆布二糖基桔梗皂苷元甲酯 (3-O-β-D-laminaribiosyl platycodigenin methyl ester) | C ₄₃ H ₇₀ O ₁₇ | 859.02 | Lam | CH ₃ | | S1 | [87] |
| 3-O-β-D-龙胆二糖基桔梗皂苷元甲酯 (3-O-β-D-gentiobiosyl platycodigenin methyl ester) | C ₄₃ H ₇₀ O ₁₇ | 859.02 | Gen | CH ₃ | | S1 | [87] |
| polygalacin D | C ₅₇ H ₉₂ O ₂₇ | 1 209.34 | Glc | A4 | | S2 | [79] |
| polygalacin D ₂ | C ₆₃ H ₁₀₂ O ₃₂ | 1 371.48 | Lam | A4 | | S2 | [79] |
| platycoside D | C ₆₉ H ₁₁₂ O ₃₇ | 1 533.62 | A1 | A4 | | S2 | [87] |
| platycoside G ₃ | C ₆₃ H ₁₀₂ O ₃₂ | 1 371.48 | Gen | A4 | | S2 | [80] |
| platycoside H | C ₅₈ H ₉₄ O ₂₈ | 1 239.36 | Gen | A3 | | S2 | [83] |
| platycoside I | C ₆₄ H ₁₀₄ O ₃₃ | 1 401.50 | A1 | A3 | | S2 | [83] |
| platycoside J | C ₅₂ H ₈₄ O ₂₃ | 1 077.22 | Glc | A3 | | S2 | [81] |
| platycoside N | C ₅₃ H ₈₆ O ₂₄ | 1 107.25 | Gen | A2 | | S2 | [88] |
| 远志酸 (polygalacic acid) | C ₃₀ H ₄₈ O ₆ | 504.71 | H | H | | S2 | [78] |
| 2''-O-acetyl polygalacin D ₂ | C ₆₅ H ₁₀₄ O ₃₄ | 1 429.51 | Lam | A7 | | S2 | [79] |
| 3''-O-acetyl polygalacin D ₂ | C ₆₅ H ₁₀₄ O ₃₄ | 1 429.51 | Lam | A8 | | S2 | [79] |
| 3''-O-acetyl polygalacin D | C ₅₉ H ₉₄ O ₂₈ | 1 251.37 | Glc | A8 | | S2 | [79] |
| 3-O-β-D-glucopyranosyl polygalacic acid | C ₃₆ H ₅₈ O ₁₁ | 666.85 | Glc | H | | S2 | [85] |
| 3-O-β-D-laminaribiosyl polygalacic acid | C ₄₂ H ₆₈ O ₁₆ | 829.10 | Lam | H | | S2 | [89] |
| 甲基-3-O-β-D-吡喃葡萄糖基远志皂苷 (methyl-3-O-β-D-glucopyranosyl polygalaeate) | C ₃₇ H ₆₀ O ₁₁ | 680.97 | Glc | CH ₃ | | S2 | [87] |
| methyl-3-O-β-D-laminaribiosyl polygalaeate | C ₄₃ H ₇₀ O ₁₆ | 859.18 | Lam | CH ₃ | | S2 | [87] |
| 桔梗酸 A (platyconic acid A) | C ₅₇ H ₉₀ O ₂₉ | 1 239.32 | Glc | A4 | H | S3 | [90] |
| platyconic acid B | C ₅₉ H ₉₂ O ₃₀ | 1 281.36 | Glc | A8 | H | S3 | [80] |
| platyconic acid C | C ₅₂ H ₈₂ O ₂₅ | 1 107.20 | Glc | A3 | H | S3 | [80] |
| platyconic acid D | C ₅₄ H ₈₄ O ₂₆ | 1 149.24 | Glc | A5 | H | S3 | [80] |
| platyconic acid E | C ₅₈ H ₉₂ O ₃₀ | 1 269.34 | Gen | A3 | H | S3 | [80] |
| platycoside O | C ₅₃ H ₈₄ O ₂₅ | 1 121.23 | Glc | A3 | CH ₃ | S3 | [81] |
| platycogenic acid A | C ₃₀ H ₄₆ O ₈ | 534.69 | H | H | H | S3 | [87] |
| 3''-O-acetyl platyconic acid A | C ₅₉ H ₉₂ O ₃₀ | 1 281.34 | Glc | A8 | H | S3 | [91] |
| methyl-platycogenate A | C ₅₈ H ₉₂ O ₃₀ | 1 269.34 | Glc | A4 | CH ₃ | S3 | [87] |
| platyconic acid A methyl ester | C ₅₈ H ₉₂ O ₂₉ | 1 253.33 | Glc | A4 | CH ₃ | S3 | [92] |

续表 3

| 化合物 | 分子式 | 相对分子质量 | R ₁ | R ₂ | R ₃ | 母核 | 参考文献 |
|---|---|----------|-----------------|--------------------|-----------------|-----|------|
| dimethyl-3- <i>O</i> -β- <i>D</i> -glucopyranosyl platycogenate A | C ₃₈ H ₆₀ O ₁₃ | 725.01 | Glc | CH ₃ | CH ₃ | S3 | [87] |
| methyl-2- <i>O</i> -methyl platycogenate A | C ₅₉ H ₉₄ O ₃₀ | 1 283.38 | Glc | A4 | CH ₃ | S4 | [87] |
| dimethyl-2- <i>O</i> -methyl-3- <i>O</i> -β- <i>D</i> -glucopyranosyl platycogenate A | C ₃₉ H ₆₂ O ₁₃ | 738.91 | Glc | CH ₃ | CH ₃ | S4 | [87] |
| platycoside M-1 | C ₃₆ H ₅₄ O ₁₂ | 678.82 | Glc | H | | S5 | [93] |
| platycoside M-2 | C ₄₇ H ₇₂ O ₂₀ | 957.07 | Glc | A2 | | S5 | [93] |
| platycoside M-3 | C ₅₂ H ₈₀ O ₂₄ | 1 089.19 | Glc | A3 | | S5 | [81] |
| 桔梗酸 A 内酯 (platyconic acid A lactone) | C ₅₇ H ₈₈ O ₂₈ | 1 221.29 | Glc | A4 | | S5 | [87] |
| platycogenic acid A lactone | C ₃₀ H ₄₄ O ₇ | 516.67 | H | H | | S5 | [92] |
| platyconic acid B lactone | C ₆₃ H ₉₈ O ₃₃ | 1 383.43 | Gen | A4 | | S5 | [91] |
| deapio-platyconic acid B lactone | C ₅₈ H ₉₀ O ₂₉ | 1 251.32 | Gen | A3 | | S5 | [94] |
| 3- <i>O</i> -β- <i>D</i> -glucopyranosyl-2β, 12α, 16α, 23, 24-pentahydroxy-oleanane-28(13)-lactone | C ₃₆ H ₅₈ O ₁₃ | 698.83 | Glc | CH ₂ OH | | S6 | [95] |
| 3- <i>O</i> -β- <i>D</i> -glucopyranosyl-3-β- <i>D</i> -glucopyranosyl-2β, 12α, 16α, 23α-tetrahydroxy-oleanane-28(13)-lactone | C ₄₂ H ₆₈ O ₁₇ | 844.98 | Lam | CH ₃ | | S6 | [95] |
| platycogenic acid B | C ₃₀ H ₄₆ O ₈ | 534.69 | COOH | H | H | S7 | [79] |
| platycogenic acid C | C ₃₀ H ₄₈ O ₆ | 504.70 | CH ₃ | H | H | S7 | [87] |
| platycosaponin A | C ₄₂ H ₆₈ O ₁₆ | 828.99 | CH ₃ | Glc | Glc | S7 | [79] |
| platycodonoids A | C ₂₉ H ₄₆ O ₅ | 474.68 | H | H | | S8 | [85] |
| platycodonoids B | C ₃₅ H ₅₆ O ₁₀ | 636.82 | Glc | H | | S8 | [85] |
| 16- <i>O</i> XO-桔梗皂苷 D(16- <i>O</i> XO-platycodin D) | C ₅₇ H ₉₀ O ₂₈ | 1 223.32 | Glc | A4 | | S8 | [79] |
| platycodon A | C ₄₂ H ₆₈ O ₁₆ | 828.99 | Glc | | | S9 | [96] |
| platycodon B | C ₄₁ H ₆₆ O ₁₅ | 798.96 | Xyl | | | S9 | [96] |
| <i>tri</i> - <i>O</i> -acetyl platycodigenin methyl ester | C ₃₇ H ₅₆ O ₁₀ | 660.85 | CH ₃ | | | S10 | [78] |

注: A1. -Glc⁶-Glc⁶-Glc; A2. -Ara³-Rha; A3. -Ara³-Rha⁴-Xyl; A4. -Ara³-Rha⁴-Xyl³-Api; A5. -Ara³-Rha(3-OAc)⁴-Xyl; A6. -Ara³-Rha(4-OAc)⁴-Xyl; A7. -Ara³-Rha(3-OAc)⁴-Xyl³-Api; A8. -Arap³-Rha(4-OAc)⁴-Xyl³-Api; Glc. 葡萄糖; GlcA. 葡萄糖醛酸; Rha. 鼠李糖; Ara. 阿拉伯糖; Xyl. 木糖; Api. 芹糖; Lam. 昆布二糖; Gen. 龙胆二糖(表 4, 6 同)。

2.2 黄酮类化合物 黄酮类化合物主要存在于桔梗的地上部分, 已被分离并鉴定出的黄酮

类成分有 11 种, 其结构母核见图 2, 化合物详见表 4。

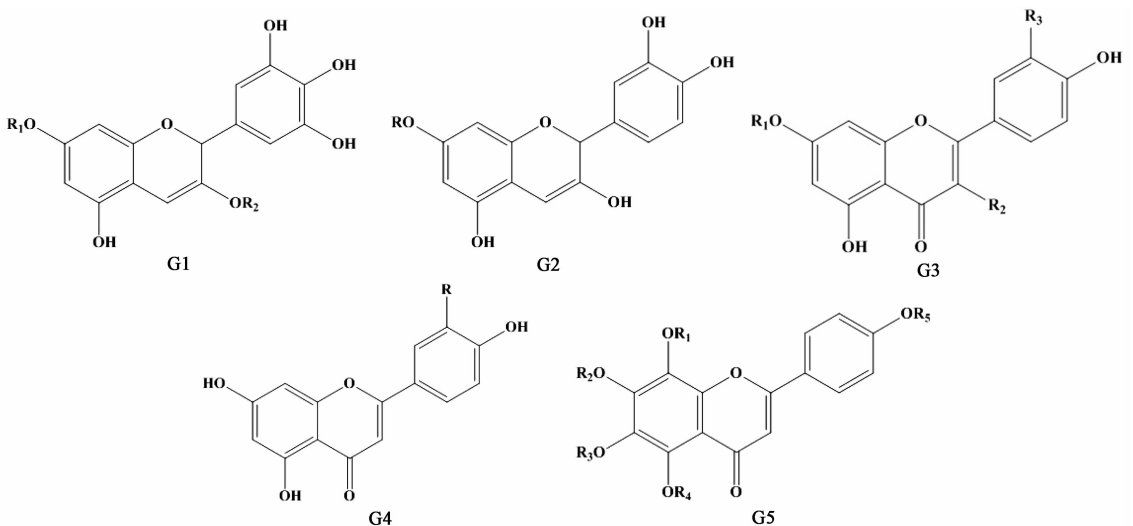


图 2 桔梗中黄酮类化合物的母核结构

Fig. 2 Maternal nucleus structures of flavonoids in *Platycodonis Radix*

表 4 桔梗的黄酮类化学成分

Table 4 Flavonoids in *Platycodonis Radix*

| 化合物 | 分子式 | 相对分子质量 | 取代基 | 母核 | 参考文献 |
|--|---|-----------|---|----|------|
| platyconin | C ₆₃ H ₇₄ O ₃₇ | 1 423. 14 | R ₁ = Glc ⁶ -Caf ⁴ -Glc ⁶ -Caf ⁴ -Glc ⁶ -Caf, R ₂ = Glc ⁶ -Rha | G1 | [87] |
| delphinidin-3-rutinoside-7-glucoside | C ₃₃ H ₄₂ O ₁₆ | 694. 68 | R ₁ = Glc, R ₂ = Glc ⁶ -Rha | G1 | [97] |
| (2 <i>R</i> ,3 <i>R</i>)-tanxifolin | C ₁₅ H ₁₂ O ₇ | 304. 25 | R = H | G2 | [87] |
| flavoplatycoside | C ₂₇ H ₃₂ O ₁₆ | 612. 53 | R = Glc ⁶ -Rha | G2 | [87] |
| 槲皮素-7- <i>O</i> -葡萄糖苷 (quercetin-7- <i>O</i> -glucoside) | C ₂₁ H ₂₀ O ₁₂ | 464. 38 | R ₁ = Glc, R ₂ = R ₃ = OH | G3 | [87] |
| luteolin-7- <i>O</i> -glucoside | C ₂₁ H ₂₀ O ₁₁ | 448. 38 | R ₁ = Glc, R ₂ = H, R ₃ = OH | G3 | [87] |
| quercetin-7- <i>O</i> -rutinoside | C ₂₇ H ₃₀ O ₁₆ | 610. 52 | R ₁ = Glc ⁶ -Rha, R ₂ = R ₃ = OH | G3 | [87] |
| apigenin-7- <i>O</i> -glucoside | C ₂₁ H ₂₀ O ₁₀ | 432. 28 | R ₁ = Glc, R ₂ = R ₃ = H | G3 | [87] |
| 芹菜素 apigenin | C ₁₅ H ₁₀ O ₅ | 270. 24 | R = H | G4 | [87] |
| 木犀草素 luteolin | C ₁₅ H ₁₀ O ₇ | 286. 24 | R = OH | G4 | [87] |
| 蜜桔素 tangeritin | C ₂₀ H ₂₀ O ₇ | 372. 37 | R ₁ = R ₂ = R ₃ = R ₄ = R ₅ = CH ₃ | G5 | [98] |

注: Caf. 咖啡酰基。

2.3 酚类化合物 酚类化合物广泛存在于桔梗的根部及地上部分。Mazol 等^[99]利用 TLC 和 HPLC 对桔梗地上部分的提取液进行分析,得到香草酸、咖啡酸等 12 种游离型或结合型酚酸类及其衍生物。Lee 等^[100]从桔梗根的石油醚[石油醚-乙醚(8:2)]提取物中分离得到 2 种抗氧化酚类化合物。见表 5。

表 5 桔梗的酚酸类化学成分

Table 5 Phenolic acids in *Platycodonis Radix*

| 化合物 | 分子式 | 相对分子质量 | 文献来源 |
|---|--|---------|-------|
| 3,4-二甲氧基肉桂酸(3,4-dimethoxycinnamic acid) | C ₁₁ H ₁₂ O ₄ | 208. 21 | [99] |
| 咖啡酸(caffeic acid) | C ₉ H ₈ O ₄ | 180. 16 | [99] |
| 绿原酸(chlorogenic acid) | C ₁₆ H ₁₈ O ₉ | 354. 31 | [99] |
| 阿魏酸(ferulic acid) | C ₁₀ H ₁₀ O ₄ | 194. 18 | [99] |
| 异阿魏酸(isoferulic acid) | C ₁₀ H ₁₀ O ₄ | 194. 18 | [99] |
| α-二羟基苯甲酸(α-resorcylic acid) | C ₇ H ₆ O ₄ | 154. 12 | [99] |
| 高香草酸(homovanillic acid) | C ₉ H ₁₀ O ₄ | 182. 17 | [99] |
| 3-羟基肉桂酸(<i>m</i> -coumaric acid) | C ₉ H ₈ O ₃ | 164. 16 | [99] |
| 4-羟基肉桂酸(<i>p</i> -coumaric acid) | C ₉ H ₈ O ₃ | 164. 16 | [99] |
| 对羟基苯甲酸(4-hydroxybenzoic acid) | C ₇ H ₆ O ₃ | 138. 12 | [99] |
| 2-hydroxy-4-methoxysalicylic acid | C ₈ H ₈ O ₄ | 168. 15 | [99] |
| 2,3-二羟基苯甲酸(2,3-dihydroxybenzoic acid) | C ₇ H ₆ O ₄ | 154. 12 | [99] |
| coniferyl palmitic acid | C ₂₆ H ₄₂ O ₄ | 418. 61 | [100] |
| coniferyl oleic acid | C ₂₈ H ₄₄ O ₄ | 444. 65 | [100] |

2.4 甾醇类化合物 研究发现桔梗中还含有多种甾醇类化合物,如菠菜甾醇,β-谷甾醇和白桦脂醇等^[97]。

2.5 多糖 桔梗根中含有大量桔梗聚糖(均由果糖组成)和菊糖,已明确结构的有桔梗聚糖 GF2 ~ GF9^[101]。

2.6 聚炔类化合物 研究表明桔梗中含有党参炔醇,党参炔苷,lobetyolinin,桔梗炔苷 A 和桔梗炔苷 B^[102-103],其中党参炔醇、党参炔苷和 lobetyolinin 是植物桔梗分类的重要标准之一。结构母核见图 3,化合物详见表 6。

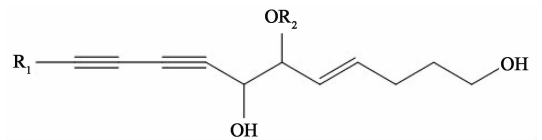


图 3 桔梗中聚炔类化合物的结构母核

Fig. 3 Maternal nucleus structure of polyacetylenes in *Platycodonis Radix*

2.7 其他 除皂苷类、黄酮类、酚类、甾醇类、多糖类和聚炔类化合物外,桔梗还含有丰富的氨基酸、挥发油、无机元素等。赵淑春等^[104]发现桔梗根中至少含有 18 种氨基酸,其中包括 1 种在人脑能量代谢过程中不可或缺神经传导化学物质——γ-氨基丁酸。丁长江等^[105]采用 GC-MS 技术从桔梗的挥发油中分离检测出 75 种化合物,已鉴定的有 21 种。李元敬等^[106]利用火焰原子吸收分光光度法对桔梗中无机元素进行了分析,发现桔梗中至少含有铜、锌、

表 6 桔梗的聚炔类化学成分

Table 6 Polyacetylenes in Platycodonis Radix

| 化合物 | 分子式 | 相对分子质量 | 取代基 | 参考文献 |
|-----------------------|---|--------|--|-------|
| 党参炔醇(lobetyol) | C ₁₄ H ₁₈ O ₃ | 234.31 | R ₁ = CH = CHCH ₃ (反式), R ₂ = H | [102] |
| 党参炔苷(lobetyolin) | C ₂₀ H ₂₈ O ₈ | 396.43 | R ₁ = CH = CHCH ₃ (反式), R ₂ = Glc | [102] |
| lobetyolinin | C ₂₆ H ₃₄ O ₁₂ | 537.81 | R ₁ = CH = CHCH ₃ (反式), R ₂ = Gen | [102] |
| 桔梗炔苷 A(platetyolin A) | C ₂₀ H ₂₆ O ₈ | 394.41 | R ₁ = CCCC ₃ , R ₂ = Glc | [103] |
| platetyolin B | C ₂₀ H ₂₈ O ₈ | 396.43 | R ₁ = CH = CHCH ₃ (顺式), R ₂ = Glc | [103] |

锰、镍、钴等无机元素,且铜、锌、锰的含量均较高。

3 药理作用

3.1 祛痰、镇咳 桔梗是常用的止咳祛痰药,对治疗支气管炎、咽喉炎、鼻窦炎等多种炎症疾病疗效明显。朱继孝等^[107]选取 9 个不同产地的桔梗进行镇咳祛痰作用对比分析,发现桔梗具有显著的祛痰镇咳作用,且产地不同作用差异明显,还得出桔梗祛痰镇咳作用的强弱与桔梗皂苷 D 含量不呈正相关的结论。梁仲远^[108]研究发现桔梗水提液镇咳、祛痰疗效显著。

3.2 抗炎 研究表明桔梗不仅能有效改善支气管哮喘症状,而且能预防支气管炎疾病;桔梗提取物高剂量组能有效延长哮喘豚鼠引喘潜伏期,并明显抑制氧自由基的生成与释放,同时有效促进哮喘豚鼠 γ -干扰素(IFN- γ)和人脂氧素 A4(LXA4)释放,间接平衡辅助性 T 细胞(Th) 1/Th2,并调节机体内 LXA4,使其更好地发挥抗炎、促消散作用^[109]。隋美娇等^[110]认为桔梗总皂苷能有效改善肺炎支原体感染大鼠肺部组织的炎症情况,机制可能是通过上调肺表面活性蛋白 A 的表达来实现对肺部的修复。谢菲^[111]研究发现桔梗提取液给药组的发病率明显低于其他各组,且具有显著的量-效关系,提示桔梗提取液能有效治疗由传染性喉气管炎病毒(ILTV)导致的传染性喉气管炎。

3.3 抗肥胖 桔梗总皂苷不仅可以防止肝脏脂肪变性,还可抑制高血脂小鼠子宫脂肪组织质量的生长,其机制可能是因为桔梗皂苷 D 能够抑制脂肪在小肠中的吸收^[112]。郑毅男等^[113]也得出了类似结论,认为是胰脂肪酶的活性受到桔梗皂苷类成分有效抑制,才抑制了小肠对脂肪的吸收,从而实现抗肥胖的目的。

3.4 降血糖 乔彩虹等^[114]观察给予桔梗多糖后的糖尿病大鼠,发现其进水量、进食量和尿量显著减少,体质量显著增加,且桔梗多糖低、中、高剂量组空腹血糖明显降低,空腹胰岛素水平、胰岛素敏感指数及葡萄糖耐受能力明显增强,除此之外桔梗多糖还

能有效促进肝组织超氧化物歧化酶活性,降低丙二醛含量,说明桔梗降血糖作用很好,其作用机制可能与改善了空腹胰岛素水平、提高了抗氧化能力有关。

3.5 降血脂 徐丽萍^[115]认为高、中剂量的桔梗总皂苷能显著降低高血脂症大鼠的总胆固醇水平,并能降低其低密度脂蛋白水平;高、中、低剂量给药后的高血脂症大鼠的甘油三酯水平均显著降低,而高密度脂蛋白水平增加。相关研究表明桔梗皂苷降低胆固醇的作用是通过低密度脂蛋白受体转运胆固醇来实现的,说明桔梗具有降血脂作用^[116]。

3.6 抗肿瘤 据报道,桔梗皂苷影响肿瘤细胞端粒酶逆转录酶的磷酸化,并控制细胞端粒酶的活性,从而调控肿瘤细胞的生长^[117]。代群等^[118]证明桔梗皂苷 D 具有明显的细胞毒作用,能诱导肺癌细胞凋亡。陆文总等^[119]进一步推测,调控 p19ARF 和 B 细胞淋巴瘤-2(Bcl-2)相关 X 蛋白(Bax)基因的表达是桔梗多糖抑制 U-14 移植瘤生长的作用机制之一,从而诱导癌细胞发生凋亡。ZHANG 等^[120]体内研究证实,通过灭活核转录因子- κ B(NF- κ B)途径,桔梗皂苷 D 可抑制口腔鳞状细胞癌(OSCC)细胞的增殖和侵袭,并诱导 OSCC 细胞显著凋亡。

3.7 保肝 相关研究发现,桔梗皂苷 D 可能是通过抑制肝星状细胞的增殖和活化、降低肝组织转化生长因子- β_1 的表达水平和升高骨形成蛋白-7 的表达水平来达到抗肝纤维化的作用^[121]。栾海艳等^[122]发现桔梗总皂苷具有降低 2 型糖尿病肝病大鼠的血糖、改善血脂代谢紊乱、保护肝功能等作用,进而减轻 2 型糖尿病肝病大鼠肝脏的损伤。

3.8 其他 在一定质量浓度范围内,桔梗皂苷 D 可促进小鼠脾淋巴细胞增殖、诱导细胞因子分泌、提高 CD4⁺/CD8⁺亚群比值、促进细胞进入 DNA 合成期,具有良好的免疫调节活性^[123]。吴敬涛^[124]研究表明桔梗总皂苷清除体内自由基的能力较强,可显著改善高脂乳剂诱导的大鼠血清与肝脏高脂质水平的氧化状态,同时还有强还原力。冯慧慧等^[125]报道称桔梗皂苷 D 可促进脾淋巴细胞增殖,加强巨噬

细胞的吞噬功能,提高小鼠的自身免疫力。于婷等^[126]对小鼠腹腔注射高、中、低剂量(738.4, 369.2, 184.6 mg·kg⁻¹)的桔梗醇提物,连续给药 3 周,结果发现 3 种剂量的桔梗醇提物均显著延长了小鼠爬杆和游泳时间,并显著提高了小鼠运动后肝糖原和肌糖原的储备,从而达到延缓疲劳和提高机体对运动负荷的适应能力。

4 讨论与小结

晋代的《肘后备急方》^[6]最早提出对桔梗进行炮制处理,通过挖掘与整理历代本草典籍,发现桔梗的炮制方法有净制、切制、烧末、清炒、麸炒、醋炙、酒炙、蜜炙、姜炙、米泔水制、百合制、蒸制等,多达 20 余种,使用的辅料有蜜、酒、姜汁、米泔水、醋、麦麸、百合汁等。其中百合制桔梗首载于《雷公炮炙论》^[7],后续《本草乘雅半偈》《重修政和经史证类备用本草》《本草通玄》等著作中对百合制桔梗的炮制操作步骤及百合用量进行了细化与完善。此外,许多宣肺祛痰的方剂中也常将桔梗与百合配伍使用,如桔梗汤、桔梗杏仁煎、宁肺桔梗汤等。通过文献的整理可知,百合与桔梗配伍或炮制存在增效的作用,而现代桔梗的炮制方法主要为净制、切片、炒黄或蜜炙等,并没有收载百合制桔梗的炮制饮片品种,据国家中药炮制技术传承基地建设项目的调查研究发现,还有不少名老中医的临方特色炮制品种中还在使用百合制桔梗,故加强对百合制桔梗炮制品种的研究,阐明其炮制科学内涵,对特色饮片的传承与发展具有重要意义。

在炮制工艺研究方面,多集中于常用辅料制桔梗饮片的炮制工艺优选,关于百合制桔梗的炮制研究极少。此外,目前桔梗炮制工艺优选的评价指标选择较为单一,无法全面衡量桔梗的质量,故有必要通过现代药理及成分分析技术的有效结合,寻找炮制品的功效成分或成分群,并以此为评价指标,对桔梗的炮制工艺进行优化,为临床提供优质、有效的饮片。桔梗中越来越多的化学成分被分离并鉴定,包括皂苷类、黄酮类、酚类、甾醇类、多糖、聚炔类等,其中关于其三萜皂苷类成分的研究最多。目前对桔梗药理作用的研究主要集中在生品及其皂苷类、多糖类成分,对桔梗炮制品的药理作用研究极少,相关内容均有待于进一步研究。

目前,大多学者认为桔梗炮制的主要目的是通过提高桔梗总皂苷的含量来达到增强其宣肺化痰的作用。以百合制桔梗,能增强桔梗的宣肺、祛痰、利咽作用,后续可运用 UPLC-Q-TOF-MS/MS 等技术手

段对百合制桔梗加以研究,找出其炮制前后化学成分的量变与质变,对桔梗炮制前后祛痰止咳等功效进行药效学考察,并进行谱效关联分析,深入阐述百合制桔梗的科学内涵,为优选桔梗炮制工艺提供全面支撑,进一步规范百合制桔梗传统炮制工艺,建立生产标准操作规程,细化工艺技术参数,制定与药效物质密切相关的百合制桔梗质量标准,推进桔梗新型饮片的工业化生产进程。

[参考文献]

- [1] 国家药典委员会. 中华人民共和国药典. 一部[M]. 北京:中国医药科技出版社,2015:277.
- [2] 明·李时珍. 本草纲目[M]. 北京:人民卫生出版社,1957:51.
- [3] 佚名. 神农本草经[M]. 北京:中医古籍出版社,1982:218.
- [4] 明·卢之颐. 本草乘雅半偈[M]. 北京:中国中医药出版社,1986.
- [5] 清·黄宫绣. 本草求真[M]. 上海:上海科学技术出版社,1959.
- [6] 晋·葛洪. 肘后备急方[M]. 明刘自化刻本. 北京:人民卫生出版社,1963:7.
- [7] 南北朝刘宋·雷敦. 雷公炮炙论[M]. 王兴法,辑校. 上海:上海中医学院出版社,1986.
- [8] 唐·蔺道人. 仙授理伤续断秘方[M]. 北京:人民卫生出版社,1957:37.
- [9] 宋·许叔微. 普济本事方[M]. 上海:上海科学技术出版社,1959:53.
- [10] 明·朱橚,滕硕,刘醇,等. 普济方[M]. 北京:人民卫生出版社,1959:1087.
- [11] 明·方贤. 奇效良方[M]. 上海:商务印书馆,1956:78.
- [12] 宋·王规. 全生指迷方[M]. 北京:人民卫生出版社,1986:96.
- [13] 宋·唐慎微. 重修政和经史证类备用本草[M]. 北京:人民卫生出版社,1957:98.
- [14] 宋·佚名. 小儿卫生总微论方[M]. 北京:人民卫生出版社,1990.
- [15] 宋·朱肱. 类证活人书[M]. 天津:天津科学技术出版社,2003:129.
- [16] 宋·庞安时. 伤寒总病论[M]. 北京:人民卫生出版社,2007:698.
- [17] 宋·洪遵. 洪氏集验方[M]. 上海:商务印书馆,1956:56.
- [18] 宋·赵佶. 圣济总录[M]. 北京:人民卫生出版社,1982:283.
- [19] 宋·朱佐. 类编朱氏集验医方[M]. 上海:商务印书馆,1956:41.

- [20] 元·曾世荣. 活幼心书[M]. 清武昌医馆据医风堂藏至元刻本重稿刊, 1910:39.
- [21] 元·王好古. 汤液本草[M]. 北京:人民卫生出版社, 1987:68.
- [22] 元·罗天益. 卫生宝鉴[M]. 北京:中国中医药出版社, 1963:149, 358.
- [23] 元·朱震亨. 丹溪心法[M]. 李经纬, 编. 北京:北京市中国书店, 1986:249.
- [24] 明·薛己. 本草约言[M]. 臧守虎, 杨天真, 杜凤娟, 校注. 北京:中国中医药出版社, 2015:44.
- [25] 明·陈嘉谟. 本草蒙筌[M]. 北京:人民卫生出版社, 1988:83.
- [26] 明·王肯堂. 证治准绳[M]. 上海:上海科学技术出版社, 1959:62.
- [27] 明·李中梓. 本草通玄[M]. 北京:中国中医药出版社, 2015:5.
- [28] 明·缪希雍. 先醒斋广笔记[M]. 南京:江苏科技出版社, 1919:34.
- [29] 明·李中梓. 本草征要[M]. 北京:北京科学技术出版社, 1986.
- [30] 明·李中梓. 雷公炮制药性解[M]. 钱允治, 补订. 北京:中国中医药出版社, 2000:582.
- [31] 明·缪希雍. 炮炙大法[M]. 太原:山西科学技术出版社, 2009.
- [32] 清·汪昂. 本草备要[M]. 北京:人民卫生出版社, 2017.
- [33] 清·吴仪洛. 本草从新[M]. 天津:天津科学技术出版社, 2003.
- [34] 清·陈其瑞. 本草撮要[M]. 上海:上海科学技术出版社, 1985.
- [35] 清·凌奂. 本草害利[M]. 北京:中医古籍出版社, 1982:17.
- [36] 清·汪切庵. 本草易读[M]. 太原:山西科学技术出版社, 2015:48.
- [37] 清·杨时泰. 本草述钩元[M]. 上海:上海科学技术出版社, 1958:103.
- [38] 清·蒋介繁. 本草择要纲目[M]. 上海:上海科学技术出版社, 1985:109.
- [39] 清·闵钺. 本草详节[M]. 卢煌, 校. 北京:中国中医药出版社, 2015:9.
- [40] 清·严西亭, 施澹宁, 洪缉菴. 得配本草[M]. 上海:上海科学技术出版社, 1959:7.
- [41] 清·祁坤. 外科大成[M]. 上海:上海卫生出版社, 1957:47.
- [42] 于江泳, 张村. 全国中药饮片炮制规范辑要[M]. 北京:人民卫生出版社, 2016:389.
- [43] 国家药典委员会. 中华人民共和国药典. 一部[M]. 北京:人民卫生出版社, 1963:230.
- [44] 国家药典委员会. 中华人民共和国药典. 一部[M]. 北京:人民卫生出版社, 1977:469.
- [45] 国家药典委员会. 中华人民共和国药典. 一部[M]. 北京:人民卫生出版社, 1985:238.
- [46] 国家药典委员会. 中华人民共和国药典. 一部[M]. 北京:人民卫生出版社, 1990:245.
- [47] 国家药典委员会. 中华人民共和国药典. 一部[M]. 北京:人民卫生出版社, 1995:243.
- [48] 国家药典委员会. 中华人民共和国药典. 一部[M]. 北京:化学工业出版社, 2000:225.
- [49] 国家药典委员会. 中华人民共和国药典. 一部[M]. 北京:化学工业出版社, 2005:196.
- [50] 国家药典委员会. 中华人民共和国药典. 一部[M]. 北京:中国医药科技出版社, 2010:259.
- [51] 辽宁省卫生局. 辽宁省中药饮片炮制规范[M]. 沈阳:辽宁省卫生局, 1962:61.
- [52] 上海市卫生局. 上海市中药饮片炮制规范[M]. 上海:上海科学技术出版社, 1962:70.
- [53] 武汉市中医药学会. 湖北省中药切制规范[M]. 武汉:湖北人民出版社, 1958:39.
- [54] 河南省革命委员会卫生局. 河南省中药材炮制规范[M]. 郑州:河南人民出版社, 1974:136.
- [55] 北京市卫生局. 北京市中药饮片切制规范[M]. 北京:北京市卫生局, 1974:116.
- [56] 辽宁省卫生局. 辽宁省中药炮制规范[M]. 沈阳:辽宁省卫生局, 1975:44.
- [57] 天津市卫生局. 天津市中药饮片切制规范[M]. 天津:天津科技出版社, 1975:81.
- [58] 山东省革命委员会卫生局. 山东省中草药炮制规范[M]. 济南:山东人民出版社, 1975:89.
- [59] 贵州省革命委员会卫生局. 贵州中药饮片炮制规范[M]. 贵阳:贵州人民出版社, 1975:60.
- [60] 四川省卫生局. 四川省中药饮片炮制规范[M]. 成都:四川人民出版社, 1977:60.
- [61] 湖北省革命委员会卫生局. 湖北中草药炮制规范[M]. 武汉:湖北人民出版社, 1979:74.
- [62] 上海市卫生局. 上海市中药饮片炮制规范[M]. 上海:上海科学技术出版社, 1983:80.
- [63] 江苏省卫生局. 江苏省中药饮片炮制规范[M]. 南京:江苏科学技术出版社, 1980:93.
- [64] 甘肃省卫生局. 甘肃省中药饮片炮制规范[M]. 兰州:甘肃人民出版社, 1980:77.
- [65] 湖南省卫生厅. 湖南省中药材炮制规范[M]. 长沙:湖南科学技术出版社, 1983:79.
- [66] 云南省卫生局. 云南省中药饮片炮制规范[M]. 昆明:云南科技出版社, 1986:102.
- [67] 浙江省卫生厅. 浙江省中药炮制规范[M]. 杭州:浙江科学技术出版社, 1986:126.

- [68] 贵州省卫生厅. 贵州省中药饮片炮制规范[M]. 贵阳:贵州人民出版社,1986:70.
- [69] 山东省卫生厅. 山东省中药炮制规范[M]. 济南:山东科学技术出版社,1990:69.
- [70] 湖南省卫生厅. 湖南省中药材炮制规范[M]. 长沙:湖南科学技术出版社,1999:79.
- [71] 浙江省食品药品监督管理局. 浙江省中药炮制规范[M]. 北京:中国医药科技出版社,2015:101.
- [72] 安徽省药品监督管理局. 安徽省中药饮片炮制规范[M]. 合肥:安徽科学技术出版社,2018.
- [73] 张振凌,杨海玲. 桔梗蜜炙工艺的研究[J]. 时珍国医国药,2008,19(2):347-349.
- [74] 王正益,田效志,李平,等. 桔梗烘法炮制初探[J]. 河南中医学报,2004,19(6):34-35.
- [75] 刘汉珍,张晖. 不同炮制法对桔梗总皂苷粗品含量的影响[J]. 时珍国医国药,2006,17(4):586-587.
- [76] 罗学伦. 桔梗炮制的实验研究[J]. 中国中医药科技,2002,9(1):52.
- [77] 王正益,曹继华,李风雷. 正交法优选蜜制桔梗的最佳炮制工艺[J]. 中药材,2000,23(12):750-752.
- [78] Akiyama T, Iitaka I Y, Tanaka O. Structure of platycodigenin, a sapogenin of *Platycodon grandiflorum* A. de Candolle [J]. Tetrahedron Lett, 1969, doi: 10.1016/S0040-4039(1)97634-8.
- [79] MA X Q, LI S M, CHAN C L, et al. Influence of sulfur fumigation on glycoside profile in *Platycodonis Radix* (Jiegeng) [J]. Chin Med, 2016, doi: 10.1186/s13020-016-0101-1.
- [80] Fukumura M, Iwasaki D, Hirai Y. Eight new oleanane-type triterpenoid saponins from platycodon root [J]. Heterocycles, 2010, 81(12):2793-2806.
- [81] FU W W, FU J N, ZHANG W M, et al. Platycoside O, a new triterpenoid saponin from the roots of *Platycodon grandiflorum* [J]. Molecules, 2011, 16(6):4371-4378.
- [82] HE Z D, QIAO C F, HAN Q B, et al. New triterpenoid saponins from the roots of *Platycodon grandiflorum* [J]. Tetrahedron, 2005, 61(8):2211-2215.
- [83] FU W W, Shimizu N, DOU D Q, et al. Five new triterpenoid saponins from the roots of *Platycodon grandiflorum* [J]. Chem Pharm Bull, 2006, 54(4):557-560.
- [84] Hwang Y L, Ahn H J, Ji G E. Fermentation of *Platycodi Radix* and bioconversion of platycosides using co-cultures of *Saccharomyces cerevisiae* KCTC 7928 and *Aspergillus awamori* FMB S900 [J]. Food Sci Biotechnol, 2015, 24(1):183-189.
- [85] ZHAN Q, ZHANG F, SUN L N, et al. Two new oleanane-type triterpenoids from *Platycodi Radix* and anti-proliferative activity in HSC-T6 cells [J]. Molecules, 2012, 17(12):14899-14907.
- [86] Ishii H, Tori K, Tozyo T, et al. Saponins from roots of *Platycodon grandiflorum*. Part 1. Structure of prosapogenins [J]. Cheminform, 1981, 12(43):1928-1933.
- [87] 金在久. 桔梗的化学成分及药理和临床研究进展[J]. 时珍国医国药, 2007, 18(2):506-509.
- [88] LI W, ZHANG W, XIANG L, et al. Platycoside N: a new oleanane-type triterpenoid saponin from the roots of *Platycodon grandiflorum* [J]. Molecules, 2010, 15(12):8702-8708.
- [89] FU W W, HOU W B, DOU D Q, et al. Saponins of polygalacic acid type from *Platycodon grandiflorum* [J]. Acta Pharm Sin, 2006, 41(4):358-360.
- [90] WANG Z X, ZHANG Y X, ZENG Y L, et al. Discovery of TAS2R14 agonists from *Platycodon grandiflorum* using virtual screening and affinity screening based on a novel TAS2R14-functionalized HEMT sensor combined with UPLC-MS analysis [J]. J Agric Food Chem, 2018, 66(44):11663-11671.
- [91] Yoo D S, Choi Y H, CHA M R, et al. HPLC-ELSD analysis of 18 platycosides from balloon flower roots (*Platycodi Radix*) sourced from various regions in Korea and geographical clustering of the cultivation areas [J]. Food Chem, 2011, 129(2):645-651.
- [92] Kim J W, Lee S W, Park J S, et al. Pharmaceutical composition for preventing or treating hepatitis c, comprising the roots extract of *Platycodon grandiflorum* or *Platycodon grandiflorum* saponin components: European, WO2010085091 [P]. 2011-11-30.
- [93] FU W W, Shimizu N, Takeda T, et al. New A-ring lactone triterpenoid saponins from the roots of *Platycodon grandiflorum* [J]. Chem Pharm Bull, 2006, 54(9):1285-1287.
- [94] Choi Y H, Yoo D S, CHA M R, et al. Antiproliferative effects of saponins from the roots of *Platycodon grandiflorum* on cultured human tumor cells [J]. J Nat Prod, 2010, 73(11):1863-1867.
- [95] ZHANG L, LIU Z H, TIAN J K. Cytotoxic triterpenoid saponins from the roots of *Platycodon grandiflorum* [J]. Molecules, 2007, 12(4):832-841.
- [96] Tamura K, Teranishi Y, Ueda S, et al. Cytochrome P450 monooxygenase CYP716A141 is a unique β -amyrin C-16 β oxidase involved in triterpenoid saponin biosynthesis in *Platycodon grandiflorus* [J]. Plant Cell Physiol, 2017, 58(5):874-884.
- [97] 郭丽,张村,李丽,等. 中药桔梗的研究进展[J]. 中国中药杂志, 2007, 32(3):181-186.

- [98] 刘振华. 桔梗的化学成分研究[D]. 杭州:浙江大学, 2006.
- [99] Mazol I, Gleńsk M, Cisowski W. Polyphenolic compounds from *Platycodon grandiflorum* A. DC. [J]. Acta Pol Pharm, 2004, 61(3):203-208.
- [100] Lee J Y, Yoon J W, Kim C T, et al. Antioxidant activity of phenylpropanoid esters isolated and identified from *Platycodon grandiflorum* A. DC. [J]. Phytochemistry, 2004, 65(22):3033-3039.
- [101] 王颖, 石俊英. 近十年中药桔梗研究进展[J]. 食品与药品, 2006, 8(12):22-24.
- [102] WANG C Z, ZHANG N Q, WANG Z Z, et al. Rapid characterization of chemical constituents of *Platycodon grandiflorum* and its adulterant *Adenophora stricta* by UPLC-QTOF-MS/MS[J]. J Mass Spectrom, 2017, 52(10):643-656.
- [103] 陈宝, 李新培, 霍晓慧, 等. HPLC法同时测定不同产地桔梗中3种聚炔类成分[J]. 药物分析杂志, 2018, 38(9):1484-1489.
- [104] 赵淑春, 富丽, 刘敏莉, 等. 桔梗等3种植物营养成分的测定[J]. 食品科学, 1994(4):47-49.
- [105] 丁长江, 卫永第, 安占元, 等. 桔梗中挥发油化学成分分析[J]. 白求恩医科大学学报, 1996, 22(5):471-473.
- [106] 李元敬, 谢立群. 火焰原子吸收光度法测定中药桔梗中锰锌铜镍钴[J]. 北华大学学报, 2005, 6(5):399-400.
- [107] 朱继孝, 曾金祥, 张亚梅, 等. 不同产地桔梗镇咳祛痰作用比较研究[J]. 世界科学技术—中医药现代化, 2015, 17(5):976-980.
- [108] 梁仲远. 桔梗水提液的镇咳、祛痰作用研究[J]. 中国药房, 2011, 22(35):3291-3292.
- [109] 于维颖, 祝红杰. 桔梗治疗支气管哮喘的药理机制研究[J]. 中医药学报, 2012, 40(3):38-40.
- [110] 隋美娇, 姚琳, 隋文霞, 等. 桔梗总皂苷对肺炎支原体感染大鼠肺组织 SP-A 的影响[J]. 中国实验方剂学杂志, 2015, 21(9):156-159.
- [111] 谢菲. 桔梗提取物对鸡传染性喉气管炎经呼吸道感染的预防效果研究[D]. 保定:河北农业大学, 2008.
- [112] HAN L K, ZHENG Y N, XU B J, et al. Saponins from platycodi radix ameliorate high fat diet-induced obesity in mice[J]. J Nutr, 2002, 132(8):2241-2245.
- [113] 郑毅男, 刘可越, 徐宝军, 等. 桔梗抗肥胖机理试验研究[J]. 吉林农业大学学报, 2002(6):42-46, 53.
- [114] 乔彩虹, 孟祥顺. 桔梗多糖降血糖作用及其机制[J]. 中国老年学杂志, 2015, 35(7):1944-1946.
- [115] 徐丽萍. 桔梗总皂苷降血脂作用的研究[J]. 食品工业科技, 2007(8):224, 236.
- [116] 杨桂英, 吴敬涛. 桔梗皂苷对高胆固醇血大鼠低密度脂蛋白受体的调节[J]. 泰山学院学报, 2015, 37(6):104-108.
- [117] Kim M O, Moon D O, Choi Y H, et al. Platycodin D induces apoptosis and decreases telomerase activity in human leukemia cells [J]. Pharmacol Res, 2005, 51(5):437-443.
- [118] 代群, 陈哲, 葛宇清, 等. 桔梗皂苷 D 诱导人肺癌细胞 A549 的凋亡及机制[J]. 中国中药杂志, 2012, 37(17):2626-2629.
- [119] 陆文总, 杨亚丽, 贾光锋, 等. 桔梗多糖对 U-14 宫颈癌抗肿瘤作用的研究[J]. 西北药学杂志, 2013, 28(1):43-45.
- [120] ZHANG Z Y, ZHAO M C, ZHENG W X, et al. Platycodin D, a triterpenoid saponin from *Platycodon grandiflorum*, suppresses the growth and invasion of human oral squamous cell carcinoma cells via the NF- κ B pathway [J]. J Biochem Mol Toxicol, 2017, doi: 10.1002/jbt.21934.
- [121] 魏建波, 刘琴, 赵秋枫. 桔梗皂苷 D 对大鼠肝纤维化的干预作用及部分机制研究[J]. 中华中医药学刊, 2014, 32(3):570-572.
- [122] 栾海艳, 张建华, 赵晓莲, 等. 桔梗总皂苷对 2 型糖尿病肝病大鼠糖脂代谢影响的研究[J]. 中成药, 2013, 35(6):1307-1309.
- [123] 王萌, 韩嘉祺, 张凤, 等. 桔梗皂苷 D 对小鼠脾淋巴细胞免疫调节活性的研究[J]. 中国兽医科学, 2018, 48(1):93-100.
- [124] 吴敬涛. 桔梗皂苷的抗氧化及脂质调节作用研究[D]. 济南:山东师范大学, 2011.
- [125] 冯慧慧, 安妮, 付越, 等. 桔梗皂苷 D 对小鼠巨噬细胞和脾淋巴细胞体外增殖和分泌功能的影响[J]. 饲料研究, 2016(17):41-47.
- [126] 于婷, 李晓东, 金乾坤, 等. 桔梗提取物对小鼠的抗疲劳作用[J]. 食品工业科技, 2012, 33(24):394-396, 402.

[责任编辑 刘德文]