

木香的化学成分、药理作用、临床应用研究进展及质量标志物预测

郑加梅¹, 尚明越¹, 王嘉乐¹, 代国娜¹, 宋经元², 段宝忠^{1*}

1. 大理大学药学院, 云南 大理 671000

2. 中国医学科学院药用植物研究所, 北京 100093

摘要: 木香为我国传统大宗药材, 是多种中成药的原料, 《中国药典》2020 版一部以木香烃内酯和去氢木香内酯作为指标成分, 难以系统阐释木香“功效-成分-质量”的关系。近年来, 国内外学者对木香各方面研究逐渐深入, 许多新的化学成分与药理作用不断被发现。在对其化学成分和药理作用进行系统总结的基础上, 根据质量标志物的核心理念, 从植物亲缘、药效、药性、配伍、化学成分可测性等方面, 对木香质量标志物进行预测分析, 以期为本香质量评价体系的建立健全提供参考。

关键词: 木香; 化学成分; 抗肿瘤; 抗炎; 抗菌; 临床应用; 质量标志物; 香烃内酯; 去氢木香内酯

中图分类号: R286.2 **文献标志码:** A **文章编号:** 0253-2670(2022)13-4198-16

DOI: 10.7501/j.issn.0253-2670.2022.13.033

Research progress on chemical constituents, pharmacological effects and clinical applications of *Aucklandiae Radix* and prediction analysis on Q-Marker

ZHENG Jia-mei¹, SHANG Ming-yue¹, WANG Jia-le¹, DAI Guo-na¹, SONG Jing-yuan², DUAN Bao-zhong¹

1. College of Pharmaceutical Science, Dali University, Dali 671000, China

2. Institute of Medicinal Plants Development, Chinese Academy of Medical Sciences, Beijing 100093, China

Abstract: As the traditional bulk medicinal material, Muxiang (*Aucklandiae Radix*) is the raw material of many kinds of Chinese patent medicines. It was difficult to systematically explain the relationship between "efficacy, composition and quality" of *Aucklandiae Radix* using costunolide and dehydrocostus lactone as index components in Chinese Pharmacopoeia 2020 edition. In recent years, with the in-depth investigation of *Aucklandiae Radix*, many new chemical components and pharmacodynamics have been found. According to the chemical component and pharmacological effect research, the quality markers of *Aucklandiae Radix* were predicted from the aspects of plant affinity, efficacy, drug property, compatibility and chemical composition measurability, etc. This review provides systematic and constructive information for the quality evaluation of *Aucklandiae Radix*.

Keywords: *Aucklandiae Radix*; chemical constituents; antitumor; anti-inflammation; antibacterial; clinical applications; quality marker; costunolide; dehydrocostus lactone

木香是传统大宗药材, 为菊科植物木香 *Aucklandia lappa* Decne. 的干燥根, 是历版《中国药典》收载品种, 具健脾消食、行气止痛、安胎之功效^[1], 在药品及化妆品领域的开发应用十分广泛, 是木香顺气丸、六味木香胶囊、木香丸等多种中成药和中药方剂的主要原料, 由于其根含挥发油, 具浓郁香气, 广泛作为香料使用^[2]。木香原产印度, 现主要栽培于我国云南、陕西、四川等省

区, 尤以云南西北部种植较多, 产量大, 是云南重要的道地药材。《中国药典》2020 版一部仅以木香烃内酯 (costunolide, CNL) 和去氢木香内酯 (dehydrocostus lactone, DHC) 作为指标成分, 难以系统阐释木香“功效-成分-质量”之间的关系, 构建传统功效和临床疗效关联的质量评价体系, 是木香产业发展和用药安全的重要问题。近年来, 随着对木香研究的逐渐深入, 其化学成分和

收稿日期: 2022-02-27

基金项目: 云南省重大科技专项 (202002AA100007); 云南省院士专家工作站 (202205AF150026, 202105AF150053); 云南省兴滇英才支持计划 (YNWR-QNBJ-2020251)

作者简介: 郑加梅 (1997—), 硕士研究生, 研究方向为中药资源与鉴定。E-mail: zjmeijm@126.com

*通信作者: 段宝忠, 教授, 研究方向为中药资源与种质创新。Tel: (0872)2257411 E-mail: bzduan@126.com

药理作用研究取得了较大进展,已从木香中分离到具有调节胃肠功能、抗肿瘤、抗菌、抗炎作用的挥发油、萜类、糖苷类等多种成分^[3]。当前,虽已有部分学者对木香的化学成分、生物活性等进行了综述^[3-8],但尚未见从质量标志物角度系统阐释木香质量评价问题的相关研究,限制了对木香科学品质评价体系的建立。本文在对木香化学成分、药理作用和临床应用系统综述的基础上,结合质量标志物概念,从木香植物亲缘学及化学成分相关性、传统功效、传统药性、复方配伍环境、化学成分可测性等方面对其质量标志物成分进行预测,以期对木香质量科学评价体系的建立健全提供参考。

1 本草考证

《中国药典》收载木香为菊科草本植物木香 *Aucklandia lappa* Decne.,但从木香的基原考证来看,古代存在木香、土木香、川木香和青木香混用现象。“木香”一名始见于《神农本草经》,谓:“味辛,温。主邪气,避毒疫瘟鬼,强志,主淋露……生永昌山谷”^[9],此处永昌即今云南保山,张南平等考证认为唐代以前文献所记载的木香,原植物为瑞香科沉香属木本植物^[10],其据唐《云南志》:“青木香,永昌所出,其山名青木香山,在永昌南三日程”^[11],青木香山在今云南省临沧市境内,这一地区分布的云南沉香 *Aquilaria yunnanensis* S. C. Huang 与之相符,因此《神农本草经》所载永昌“木香”并非现今《中国药典》所使用菊科草本木香。

自唐《新修本草》始,木香归为草本,其载“此即青木香也,今皆从外国舶上来,以疗毒肿,消恶气,有验,……,此有二种,当以昆仑来者为佳,出西胡来者不善”^[12],《证类本草》亦曰“昆仑舶上来,形如枯骨者良,出西胡来者不善”,上述“西胡”是古代对西域各族的泛称^[13],《证类本草》木香条下引《西域传》云:“漕国富有青木香,漕国在葱岭之北”,西胡之一的漕国位于现在阿富汗首都喀布尔至坎大哈之间^[14],唐代诗人岑参《临洮龙兴寺玄上人院,同咏青木香丛》:“移根自远方,种得在僧房。六月花新吐,三春叶已长”,印证了《新修本草》记载的一种木香在唐代已有引种栽培,而据考证,药典木香直至 20 世纪 30 年代我国才引种成功^[16];另据宋代《重修政和经史证类备急本草》云:“木香,叶似羊蹄而长大。花如菊花,其实黄黑,所

在亦有之”^[17],我国学者把这种唐代“所在亦有之”的木香考证为土木香 *Inula helenium* L.^[18],印度学者 Prasad 印证了木香的一种混淆品总状土木香 *Inula recemosa* Hook. f.,至今仍在印度广泛使用^[19],因此《新修本草》记载的产自西胡质量不善的木香,应为菊科 *Inula* L.属植物,而非现今中国药典收载之木香。至于“昆仑来者为佳”,据《辞海》“唐代前后,泛称中印半岛南部以及南洋诸岛为昆仑,而作为古国名‘昆仑国’,在唐代主要指南洋一些岛国,如今天的印度尼西亚马鲁古群岛,爪哇岛一带^[20],因此,此“昆仑”应指东南亚地区;木香的质量与其来源、形、味等因素相关,“形如枯骨”“味苦粘牙”等是优质木香的主要特点^[16]。据《本草崇原集说》曰:“五香者,木香也,以味苦粘牙者为真”^[21];《本草品汇精要》记载:“类枯骨,根轻浮,苦而粘舌者为好,土青木香为伪”^[22];明《本草蒙荃》载木香:“无毒出自外番,来从闽广,形如枯骨,苦口粘牙”。此外,《新修本草》所载“消恶气”与现今《中国药典》记载木香“行气”一致。因此,《新修本草》所记载的质量较佳的“消恶气,昆仑来者”,为现今《中国药典》使用的木香 *A. lappa* Decne.,产地主要为东南亚,以“形如枯骨者”质量为上,其所产的木香又主要经海上运至我国集散。我国木香自 20 世纪 30 年代,从印度引种到云南丽江,后引种至四川、甘肃等地;目前主要集中在云南、四川、陕西等地^[16]。1959 年云南木香首次出口,因品质好,被誉为“云木香”,并大量出口,成为道地药材。综上,从本草文献记载来看,古代木香主产于国外,我国生产历史不到百年,对其品质的认识评价还较为模糊。

2 化学成分

目前从木香中分离鉴定出的化学成分共 250 种,按结构类型的可分为萜类(倍半萜类 142 种、单萜类 43 种、三萜类 8 种)、蒽醌类 2 种、黄酮苷 4 种、木脂素苷 4 种及其他 47 种。此外,杨辉等^[2]还报道了含 20 余种氨基酸成分以及胆胺。

2.1 倍半萜类

倍半萜类成分是木香的主要和特征成分,种类繁多且丰富,其基本母核为 3 个异戊二烯单元,含 15 个碳原子。目前,已从木香中分离到 CNL、二氢木香内酯及 DHC 等多个倍半萜类成分(1~142),相关化合物信息见表 1。

表 1 木香中倍半萜类化合物
Table 1 Sesquiterpenoids from *Aucklandiae Radix*

编号	化合物名称	分子式	文献
1	β -木香酸 (β -costic acid)	C ₁₅ H ₂₂ O ₂	23
2	异木香酸 (isocostic acid)	C ₁₅ H ₂₂ O ₂	23
3	4 β -hydroxy-11(13)-eudesmene-12-al	C ₁₅ H ₂₄ O ₂	23
4	13-磺酸基-二氢喘诺木烯内酯 (13-sulfo-dihydro-reynosin)	C ₁₅ H ₂₂ SO ₆	24
5	13-磺酸基-二氢裂叶苣荬菜内酯 (13-sulfo-dihydrosantamarine)	C ₁₅ H ₂₂ SO ₆	24
6	矮艾素 A (arbusculin A)	C ₁₅ H ₂₂ O ₃	25
7	2-(4 α ,8-dimethyl-1,2,3,4,4 α ,5,6,7-octa-hydronaphthalen-2-yl)-prop-2-en-1-ol	C ₁₅ H ₂₄ O	26
8	α -芹子烯 (α -selinene)	C ₁₅ H ₂₄	27
9	β -芹子烯 (β -selinene)	C ₁₅ H ₂₄	28
10	γ -芹子烯 (γ -selinene)	C ₁₅ H ₂₄	28
11	δ -芹子烯 (δ -selinene)	C ₁₅ H ₂₄	2
12	土木香内酯 (alantolactone)	C ₁₅ H ₂₀ O ₂	29
13	异土木香内酯 (isoalantolactone)	C ₁₅ H ₂₀ O ₂	29
14	二氢广木香内酯 (dihydrocostunolide)	C ₁₅ H ₂₀ O ₂	30
15	二氢- α -环木香烯内酯 (dihydro- α -cyclocostunolide)	C ₁₅ H ₂₂ O ₂	31
16	α -环木香烯内酯 (α -cyclocostunolide)	C ₁₅ H ₂₀ O ₂	29
17	1 β -hydroxycolartin	C ₁₅ H ₂₂ O ₄	29
18	11 β ,13-二氢喘诺木烯内酯 (11 β ,13-dihydro-reynosin)	C ₁₅ H ₂₂ O ₃	29
19	11 β ,13-二氢裂叶苣荬菜内酯 (11 β ,13-dihydro-santamarin)	C ₁₅ H ₂₀ O ₃	29
20	11 β ,13-二氢- β -环木香烯内酯 (11 β ,13-dihydro- β -cyclocostunolide)	C ₁₅ H ₂₂ O ₂	29
21	11 β ,13-二氢- α -环木香烯内酯 (11 β ,13-dihydro- α -cyclocostunolide)	C ₁₅ H ₂₂ O ₂	29
22	llicol	C ₁₅ H ₂₆ O ₂	29
23	冬青醇 (ilicic alcohol)	C ₁₅ H ₂₆ O ₂	32
24	α -木香醇 (α -costol)	C ₁₅ H ₂₄ O	33
25	β -木香醇 (β -costol)	C ₁₅ H ₂₄ O	23
26	γ -木香醇 (γ -costol)	C ₁₅ H ₂₄ O	23
27	1 β -羟基-矮艾素 A (1 β -hydroxyarbusculinA)	C ₁₅ H ₂₂ O ₄	33
28	裂叶苣荬菜内酯 (santamarine)	C ₁₅ H ₂₀ O ₃	33
29	β -环木香烯内酯 (β -cyclocostunolide)	C ₁₅ H ₂₂ O ₂	34
30	α -桉叶醇 (α -eudesmol)	C ₁₅ H ₂₆ O	30
31	β -桉叶醇 (β -eudesmol)	C ₁₅ H ₂₆ O	26
32	γ -桉叶醇 (γ -eudesmol)	C ₁₅ H ₂₆ O	28
33	7-epi-amiteol	C ₁₅ H ₂₆ O	30
34	去氢青木香内酯 (isocritonilide)	C ₁₅ H ₂₀ O ₂	28
35	β -木香醛	C ₁₅ H ₂₀ O	28
36	5-表-新臭根子草醇 (5-epi-neochondrinol)	C ₁₅ H ₂₆ O	28
37	柳杉二醇	C ₁₅ H ₂₈ O ₂	35
38	5 α -羟基- β -木香酸 (5 α -hydroxy- β -costic acid)	C ₁₅ H ₂₂ O ₃	36
39	喘诺木烯内酯 (reynosin)	C ₁₅ H ₂₀ O ₃	32
40	木香酸 (costic acid)	C ₁₅ H ₂₂ O ₂	23
41	木兰脂素 (magnolialide)	C ₁₅ H ₂₀ O ₃	2
42	1 β ,4 α -dihydroxy-12,6-eudesmanolide	—	2
43	还含木香醚醛 (saussureal)	C ₁₅ H ₂₂ O ₂	2
44	glaucyl alcohol	C ₁₅ H ₂₄ O	26
45	12-甲氧基二氢木香烯内酯 (12-methoxydihydrocostunolide)	C ₁₆ H ₂₄ O ₃	2
46	云木香素 A (costusin A)	C ₂₅ H ₃₆ O ₄	37
47	saussureamines A	C ₂₀ H ₂₉ NO ₄	38
48	saussureamines B	C ₂₀ H ₂₇ NO ₄	38
49	saussureamines C	C ₁₉ H ₂₆ N ₂ O ₅	38
50	磺酸基木香烯内酯 A (sulfocostunolide A)	C ₁₅ H ₂₀ O ₅ S	39
51	磺酸基木香烯内酯 B (sulfocostunolide B)	C ₁₅ H ₂₀ O ₅ S	39
52	木香内酯 (costuslactone)	C ₁₅ H ₂₀ O ₃	27
53	去氢木香内酯 (dehydrocostus lactone)	C ₁₅ H ₁₈ O ₂	29

续表 1

编号	化合物名称	分子式	文献
54	α -羟基去氢木香内酯 (α -hydroxy dehydrocostus lactone)	C ₁₅ H ₁₈ O ₃	40
55	β -羟基去氢木香内酯 (β -hydroxy dehydrocostus lactone)	C ₁₅ H ₁₈ O ₃	40
56	11 β ,13-二氢去氢木香内酯 (11 β ,13-dihydrodehydrocostus lactone)	—	29
57	11 β ,13-去氢木香内酯 (11 β ,13-dihydrocostunolide)	—	29
58	川木香内酯 (mokko lactone)	C ₁₅ H ₂₀ O ₂	33
59	epoxyisozaluzanin C 4 α 15-epoxide	—	34
60	epoxyisozaluzanin C 11 α 13-epoxide	—	34
61	8 α -羟基-11 β -11,13-二氢去氢木香内酯 (8 α -hydroxy-11 β -11,13-dihydrodehydrocostus lactone)	—	36
62	11,13-dihydro-7,11-dehydro-13-hydroxy-3-desoxyzaluzanin C	—	36
63	11 α ,13-二氢去氢木香内酯 (11 α ,13-dihydroxy-dehydrocostus lactone)	—	36
64	11 β ,13-dihydro-3-epizaluzanin C	—	32
65	木香烯内酯-15- β -D-吡喃葡萄糖苷 (costunolide-15- β -D-glucopyranoside)	—	23
66	4 β -甲氧基去氢木香内酯 (4 β -methoxydehydrocostus lactone)	—	2
67	二氢去氢木香内酯 (dihydrodehydrocostus lactone)	C ₁₅ H ₂₀ O ₂	23
68	12-methoxy dihydrodehydrocostus lactone	C ₁₆ H ₂₄ O ₃	2
69	12-methoxy dihydrocostunolide	—	2
70	异去氢木香内酯 (isodehydrocostus lactone)	C ₁₅ H ₁₈ O ₂	2
71	isozaluzanin C	C ₁₅ H ₁₈ O ₃	2
72	二氢木香烯内酯 (dihydro costunolide)	C ₁₅ H ₂₂ O ₂	41
73	异二氢木香烯内酯 (isodihydrocostunolide)	C ₁₅ H ₂₂ O ₂	41
74	木香烯内酯 (costunolide)	C ₁₅ H ₂₀ O ₂	29
75	小白菊内酯 (parthenolide)	C ₁₅ H ₂₀ O ₃	42
76	11 α ,13-dihydrosantamarine	—	2
77	11 α ,13-dihydroreynosin	C ₁₅ H ₂₂ O ₃	2
78	11 α ,13-去氢木香内酯 (11 α ,13-dihydromagnolialide)	—	2
79	($\pm$)-四甲基环癸二烯甲醇 [($\pm$)-hedycaryol]	C ₁₅ H ₂₆ O	41
80	1(10)-顺-木香内酯[1(10)-cis-costunolide]	C ₁₅ H ₂₀ O ₂	41
81	soulangianolide A	C ₁₅ H ₂₀ O ₃	36
82	($\pm$)-E-香榧醇 [($\pm$)-E-nuciferol]	C ₁₅ H ₂₂ O	26
83	α -白菖考烯 (α -calacorene)	C ₁₅ H ₂₀	30
84	α -广木香醇	C ₁₅ H ₂₄ O	30
85	β -广木香醇	C ₁₅ H ₂₄ O	30
86	γ -广木香醇	C ₁₅ H ₂₄ O	30
87	α -姜黄烯 (α -curcumene)	C ₁₅ H ₂₄	27
88	γ -姜黄烯 (γ -curcumene)	C ₁₅ H ₂₄	28
89	α -姜烯 (α -zingiberene)	C ₁₅ H ₂₄	30
90	γ -古芸烯 (γ -gurjunene)	C ₁₅ H ₂₄	41
91	β -倍半水芹烯 (β -sesquiphellandrene)	C ₁₅ H ₂₄	41
92	易朱栾倍半萜 (valencene)	C ₁₅ H ₂₄	43
93	顺- α -红没药烯 (cis- α -bisabolene)	C ₁₅ H ₂₄	41
94	蓝桉醇 (globulol)	C ₁₅ H ₂₆ O	26
95	桉油烯醇 (spathulenol)	C ₁₅ H ₂₄ O	26
96	环氧柏木烷 (epoxy cedrane)	C ₁₅ H ₂₄ O	43
97	香橙烯氧化物-(2) [aromadendrene oxide-(2)]	C ₁₅ H ₂₄ O	26
98	异-香橙烯 (allo-aromadendrene)	C ₁₅ H ₂₄	27
99	葎草烯-1,6-二烯醇 (humulane-1,6-dien-3-ol)	C ₁₅ H ₂₆ O	26
100	α -蛇麻烯 (α -humulene)	C ₁₅ H ₂₄	41
101	β -蛇麻烯 (β -humulene)	C ₁₅ H ₂₄	41
102	β -榄香烯 (β -elemene)	C ₁₅ H ₂₄	41
103	榄香脑 (elemol)	C ₁₅ H ₂₆ O	27
104	榄香烯醛 (elemene aldehyde)	C ₁₅ H ₂₂ O	28

续表 1

编号	化合物名称	分子式	文献
105	δ -杜松烯 (δ -cadinene)	C ₁₅ H ₂₄	27
106	elema-1,3,11(13)-trien-12-ol	C ₁₅ H ₂₄ O	2
107	elemenal	C ₁₅ H ₂₂ O	2
108	saussurea lactone	C ₁₅ H ₂₂ O ₂	2
109	10 α -羟基-青蒿酸 (10 α -hydroxyl-artemisinic acid)	C ₁₅ H ₂₂ O ₃	44
110	10 α -甲氧基-青蒿酸 (10 α -methoxy-artemisinic acid)	—	45
111	顺式法呢醇 (<i>cis</i> -farnesol)	C ₁₅ H ₂₆ O	30
112	反式-橙花叔醇 (<i>trans</i> -nerolidol)	C ₁₅ H ₂₆ O	46
113	3,7,11-三甲基-1,3,5,8,10-十二烯 (3,7,11-trimethyl-1,3,5,8,10-dodecapentaene)	C ₁₅ H ₂₂	41
114	α -香柑油烯 (α -bergamotene)	C ₁₅ H ₂₄	26
115	(Z)- α -反式香柠檬醇 [(Z)- α - <i>trans</i> -bergamotol]	C ₁₅ H ₂₄ O	26
116	反式-香柠檬-2,12-二烯-14-醛 (<i>trans</i> -bergamotol-2,12-diene-14-aldehyde)	—	28
117	榄香醇 (elemol)	C ₁₅ H ₂₆ O	30
118	檀香醇 (santalol)	C ₁₅ H ₂₄ O	41
119	β -雪松烯 (β -cedrene)	C ₁₅ H ₂₄	28
120	α -雪松烯 (α -cedrene)	C ₁₅ H ₂₄	41
121	缬草萜烯醇 (valerenol)	C ₁₅ H ₂₄ O	27
122	缬草烯醛 (valerenal)	C ₁₅ H ₂₂ O	28
123	氧化石竹烯 (caryophyllene oxide)	C ₁₅ H ₂₄ O	26
124	石竹烯 (isocaryophyllene)	C ₁₅ H ₂₄	43
125	石竹素 (epoxycaryophyllene)	C ₁₅ H ₂₄ O	43
126	α -长叶蒎烯 (α -longipinene)	C ₁₅ H ₂₄	26
127	长叶烯 (longifolene)	C ₁₅ H ₂₄	41
128	β -橄榄烯 (β -maaliene)	C ₁₅ H ₂₄	41
129	香附烯 (cyperene)	C ₁₅ H ₂₄	41
130	ascleposide E	C ₁₉ H ₃₂ O ₈	32
131	长叶龙脑 (longiborneol)	C ₁₅ H ₂₆ O	30
132	4-亚甲基-2,8,8-三甲基-2-乙烯基双环[5.2.0]壬烷 (4-methylene-2,8,8-trimethyl-2-vinylbicyclo[5.2.0]nonane)	C ₁₅ H ₂₄	26
133	绒白乳菇二醇 (vellerdiol)	C ₁₅ H ₂₄ O ₂	26
134	α -可巴烯 (α -copaene)	C ₁₅ H ₂₄	41
135	α -布藜烯 (α -bulnesene)	C ₁₅ H ₂₄	43
136	α -柏木烯 (α -cedrene)	C ₁₅ H ₂₄	43
137	β -柏木烯 (β -cedrene)	C ₁₅ H ₂₄	43
138	β -金合欢烯 (β -farnesene)	C ₁₅ H ₂₄	43
139	7-甲基-4-(1-甲基亚乙基)-双环[5.3.1]十一碳-1-烯-8-醇 (7-methyl-4-(1-methylethylidene)-bicyclo[5.3.1]undec-1-en-8-ol)	C ₁₅ H ₂₄ O	26
140	缬草烯酮 (valerenone)	C ₁₅ H ₂₄ O	30
141	川木香内脂 (mokko lactone)	C ₁₅ H ₂₀ O ₂	33
142	6-(1,3-二甲基-丁基-1,3-二烯基)-1,5,5-三甲基-7-氧基-双环[4.1.0]七-2-烯[6-(1,3-dimethyl-butyl-1,3-dienyl)-1,5,5-trimethyl-7-oxa-bicyclo[4.1.0]hept-2-ene]	C ₁₅ H ₂₂ O	26

2.2 单萜类

单萜类化合物存在于多种植物中,包括无环(链状)单萜、单环单萜、双环单萜等,其母核结构主要由 2 个异戊二烯单元构成,含 10 个碳原子。目前已从木香中分离得到萜品醇、水芹烯、香芹酚等多种单

萜类成分(143~185),相关化合物信息见表 2。

2.3 三萜类

从木香中主要分离到的三萜类成分有白桦脂醇、鲨烯、木香二内酯等(186~193),相关化合物信息见表 3。

表 2 木香中单萜类化合物

Table 2 Monoterpenoids from *Aucklandiae Radix*

编号	化合物名称	分子式	文献
143	<i>L</i> -4-萜品醇 (<i>L</i> -4-terpineol)	C ₁₀ H ₁₈ O	26-27
144	α -水芹烯 (α -phellandrene)	C ₁₀ H ₁₆	30
145	β -水芹烯 (β -phellandrene)	C ₁₀ H ₁₆	26
146	α -萜品醇 (α -terpineol)	C ₁₀ H ₁₈ O	30
147	<i>D</i> -柠檬烯 (<i>D</i> -limonene)	C ₁₀ H ₁₆	26
148	α -萜品烯 (α -terpinene)	C ₁₀ H ₁₆	27
149	γ -萜品烯 (γ -terpinene)	C ₁₀ H ₁₆	27
150	萜品油烯 (terpinolen)	C ₁₀ H ₁₆	43
151	桉烯 (sabinene)	C ₁₀ H ₁₆	43
152	对-聚伞花素 (<i>p</i> -cymene)	C ₁₀ H ₁₄	27
153	对伞花烃 (<i>p</i> -isopropyl toluene)	C ₁₀ H ₁₄	43
154	邻伞花烃 (<i>o</i> -cymene)	C ₁₀ H ₁₄	43
155	1-异丙烯基-3-甲基苯	C ₁₀ H ₁₂	43
156	薄荷脑 (menthol)	C ₁₀ H ₂₀ O	43
157	香芹酚 (carvacrol)	C ₁₀ H ₁₄ O	43
158	香芹鞣酮 (carvotanacetone)	C ₁₀ H ₁₆ O	27
159	α -异松油烯 (α -terpinolene)	C ₁₀ H ₁₆	27
160	薄荷酮 (menthone)	C ₁₀ H ₁₈ O	27
161	长叶薄荷酮 (pulegone)	C ₁₀ H ₁₆ O	27
162	4-isopropyl-1-methyl-2-cyclohexen-1-ol	C ₁₀ H ₁₈ O	26
163	1,8-桉油精 (1,8-cineol)	C ₁₀ H ₁₈ O	27
164	松油醇 (terpinen-4-ol)	C ₁₀ H ₁₈ O	27
165	香茅醛 (citronellal)	C ₁₀ H ₁₈ O	27
166	水芹醛 (phellandral)	C ₁₀ H ₁₆ O	27
167	反式-2,4-癸二烯醛 (<i>trans</i> -2,4-decadienal)	C ₁₀ H ₁₆ O	43
168	茴香脑 (anethol)	C ₁₀ H ₁₂ O	27
169	麝香草酚 (thymol)	C ₁₀ H ₁₄ O	27
170	香叶基丙酮 (geranyl acetone)	C ₁₃ H ₂₂ O	26
171	β -芳樟醇 (β -linalool)	C ₁₀ H ₁₈ O	26
172	(<i>E</i>)- β -罗勒烯 [(<i>E</i>)- β -ocimene]	C ₁₀ H ₁₆	27
173	月桂烯 (myrcene)	C ₁₀ H ₁₆	27
174	(<i>R</i>)-3,7-二甲基-6-辛烯醇 [(<i>R</i>)-3,7-dimethyl-6-octenol]	C ₁₀ H ₂₀ O	46
175	α -紫罗兰醇 (α -ionol)	C ₁₃ H ₂₂ O	43
176	α -紫罗兰酮 (α -ionone)	C ₁₃ H ₂₀ O	26
177	β -紫罗兰酮 (β -ionone)	C ₁₃ H ₂₀ O	26
178	二氢- α -紫罗兰酮 (dihydro- α -ionone)	C ₁₃ H ₂₂ O	26
179	β -蒎烯 (β -pinene)	C ₁₀ H ₁₆	30
180	α -蒎烯 (α -pinene)	C ₁₀ H ₁₆	27
181	菊油环酮 (chrysanthenone)	C ₁₀ H ₁₄ O	27
182	α -侧柏烯 (α -thujene)	C ₁₀ H ₁₆	27
183	蒎烯 (camphene)	C ₁₀ H ₁₆	27
184	樟脑 (camphor)	C ₁₀ H ₁₆ O	27
185	1-甲基-3-(1-甲基乙基)-环己烯 [1-meth-yl-3-(1-methylethenyl)-cyclohexene]	C ₁₀ H ₁₆	41

表 3 木香中三萜类化合物

Table 3 Triterpenoids from *Aucklandiae Radix*

编号	化合物名称	分子式	文献
186	白桦脂醇 (betulin)	C ₃₀ H ₅₀ O ₂	33
187	白桦脂酸 (betulinic acid)	C ₃₀ H ₄₈ O ₃	33
188	白桦脂酸甲酯 (betulinic acid methyl ester)	C ₃₁ H ₅₀ O ₃	33
189	α -香树脂醇硬脂酸酯 (α -amyrin stearate)	C ₃₀ H ₅₀ O	33
190	α -香树脂醇 (α -amyrin eicosanoate)	C ₃₀ H ₅₀ O	33
191	鲨烯 (squalene)	C ₃₀ H ₅₀	43
192	木香二内酯 (lappa dilactone)	C ₃₀ H ₃₈ O ₆	40
193	3 β -乙酰氧基-9(11)-巴卡林烯 [3 β -acetoxy-9(11)-baecharene]	—	2

2.4 糖苷类

糖苷亦称甙，指单糖的半缩醛羟基与醇或酚的羟基反应后，失水而形成的缩醛式衍生物，其按苷元不同可分为蒽醌苷、木脂素苷、黄酮苷等。目前

已从木香中分离到 2 种蒽醌苷（194、195）、4 种由苯丙素双分子聚合而成的木脂素苷（196~199），4 种含有酮式羰基的黄酮苷（200~203）以及其他糖苷类化合物（204~207），相关信息见表 4。

表 4 木香中糖苷类化合物
Table 4 Glycosides from *Aucklandiae Radix*

编号	化合物名称	分子式	文献
194	aloe-emodin-8-O-β-D-glucopyranoside	C ₂₁ H ₂₀ O ₁₀	47
195	rhein-8-O-β-D-glucopyranoside	C ₂₁ H ₁₆ GaO ₁₁	47
196	1,5-dihydroxypinoresinol-4'-O-β-D-glucopyranoside	—	47
197	(+)-1-hydroxypinoresinol 4''-O-methyl ester-4'-β-D-glucopyranoside	—	32
198	(+)-1-hydroxypinoresinol-4''-O-β-D-glucopyranoside	—	32
199	(+)-1-hydroxypinoresinol-1-O-β-D-glucopyranoside	—	32
200	3'-(3R-乙酰氧基-5,5-二甲基环戊-1-烯)-4'-O-甲基黄芩素 7-O-(6'''-O-乙酰基-β-D-葡萄糖-吡喃糖基-(1→3)-[α-L-吡喃鼠李糖基-(1→2)]-β-D-吡喃葡萄糖苷	C ₄₅ H ₅₆ O ₂₃	48
201	7-O-(6'''-O-acetyl-β-D-吡喃葡萄糖基-(1→3)-[α-L-吡喃鼠李糖基-(1→2)]-β-D-吡喃葡萄糖苷}	C ₅₃ H ₇₂ O ₃₅	48
202	7-O-(6'''-O-acetyl-β-D-吡喃葡萄糖基-(1→3)-[α-L-吡喃鼠李糖基-(1→2)]-β-D-吡喃葡萄糖苷	C ₅₆ H ₆₈ O ₃₄	48
203	7-O-(6'''-O-acetyl-β-D-glucopyrano-syl- (1→3)-[α-L-吡喃鼠李糖基-(1→2)]-β-D-吡喃葡萄糖苷	C ₅₉ H ₆₄ O ₂₉	48
204	苯基-β-D-葡萄糖苷 (phenyl-β-D-glucopyranoside)	C ₁₂ H ₁₆ O ₆	32
205	苄基-β-D-葡萄糖苷 (benzyl-β-D-glucopyranoside)	C ₁₃ H ₁₈ O ₆	32
206	正丁基-β-D-葡萄糖苷 (n-butyl-β-D-glucopyranoside)	C ₁₀ H ₂₀ O ₆	32
207	正丁基-β-D-吡喃果糖苷 (n-butyl-β-D-fructopyranoside)	C ₁₀ H ₂₀ O ₆	25

2.5 其他类

除上述成分以外，木香中还分离到蒽醌、黄酮、高级脂肪酸，以及小脂肪族醇、醛、酸等成分（208~250），相关化合物信息见表 5。

3 药理作用

3.1 对消化系统的作用

木香对消化系统的药效主要体现为促进胃肠运动、止泻、保护胃粘膜、抗溃疡和利胆等作用。木香煎剂^[55]和挥发油^[56]对胃排空及肠推进均有促进作用，并呈剂量相关关系^[55]；进一步的研究显示，CNL 对脾虚小鼠肠推进有明显促进作用，其与 DHC 均可促进脾虚小鼠胃排空^[57]；木香提取液对胃溃疡具有明显抑制作用^[58-60]，且不抑制胃酸分泌^[58]，对急性胃粘膜损伤有缓解作用^[61]；此外，CNL 抗炎利胆效果显著^[62]，木香提取物可有效抑制胃肠道平滑肌痉挛^[56, 63]，并缓

解过度兴奋^[56, 63]；还具有止泻^[64]和镇痛^[65]等作用，这为木香的临床研究提供了合理的依据。

3.2 抗肿瘤作用

木香在临床上广泛用于肿瘤治疗，据王绪颖等^[66]对普济方数据库中的肿瘤用药规律分析，发现在与肿瘤相类似的病名与症状中，木香应用频次位列第 2。大量药理学研究证实，木香中有效成分对肺癌^[67]、肝癌^[68]、前列腺癌^[69-70]、膀胱癌^[71]；卵巢癌、乳腺癌、宫颈癌、喉癌^[72-73]；胃癌、急性早幼粒白血病^[74]和慢性髓性白血病^[75]等肿瘤细胞的增殖具有抑制作用，相关药理及作用机制见表 6。

3.3 抗炎作用

研究发现，木香提取物可减少炎性细胞浸润及滑膜增生，降低血清中 C 反应蛋白、白细胞介素 1β (interleukin-1beta, IL-1β) 和白细胞介素-6、肿瘤坏

表 5 木香中其他化学成分
Table 5 Other components from *Aucklandiae Radix*

编号	化合物名称	分子式	文献
208	绿原酸 (chlorogenic acid)	C ₁₆ H ₁₈ O ₉	49
209	大黄酚 (chrysophanic acid)	C ₁₅ H ₁₀ O ₄	41
210	亚油酸 (linoleic acid)	C ₁₈ H ₃₂ O ₂	30
211	亚麻酸 (linolenic acid)	C ₁₈ H ₃₀ O ₂	43
212	十六烷酸 (palmitic acid)	C ₁₆ H ₃₂ O ₂	30
213	反式-13-十八碳烯酸[(E)-13-octadecenoic acid]	C ₁₈ H ₃₄ O ₂	43
214	十五烯 (pentadecene)	C ₁₅ H ₃₀	43
215	单紫杉烯 (aplotaxene)	C ₁₇ H ₂₈	35
216	1,4-环辛二烯 (1,4-cyclooctadiene)	C ₈ H ₁₂	43
217	细辛脑 (asarone)	C ₁₂ H ₁₆ O ₃	50
218	乙酸芳樟酯 (linalyl acetate)	C ₁₂ H ₂₀ O ₂	43
219	莱菔苦素 (cynaropicrin)	C ₁₈ H ₃₂ O ₂	51
220	油酸酰胺 (oleic acid amide)	C ₁₈ H ₃₅ NO	43
221	芥酸酰胺 (erucylamide)	C ₂₂ H ₄₃ NO	43
222	丁香树酯醇 (syringaresinol)	C ₂₂ H ₂₆ O ₈	52
223	豆甾醇 (stigmasterol)	C ₂₉ H ₄₈ O	52
224	菜油甾醇 (campesterol)	C ₂₈ H ₄₈ O	43
225	γ-谷甾醇 (γ-sitosterol)	C ₂₉ H ₅₀ O	43
226	邻苯二甲酸二丁酯 (dibutyl phthalate)	C ₁₆ H ₂₂ O ₄	43
227	2-庚基乙酰乙酸乙酯 (ethyl 2-acetylnonan-1-oate)	C ₁₃ H ₂₄ O ₃	35
228	2-单棕榈酸甘油 (2-palmitoylglycerol)	C ₁₉ H ₃₈ O ₄	35
229	棕榈酸甲酯 (analytical standard)	C ₁₇ H ₃₄ O ₂	43
230	东莨菪内酯 (scopoletin)	C ₁₀ H ₈ O ₄	52
231	丙酸香草酯 (citronellyl propionate)	C ₁₃ H ₂₄ O ₂	27
232	亚油酸甲酯 (methyl linoleate)	C ₁₉ H ₃₄ O ₂	27
233	亚油酸乙酯 (ethyl linoleate)	C ₂₀ H ₃₆ O ₂	27
234	柠檬酸三乙酯 (triethyl citrate)	C ₁₂ H ₂₀ O ₇	43
235	香柑内酯 (bergapten)	C ₁₂ H ₈ O ₄	53
236	油酸-1-甘油单酯 (glyceryl monooleate)	C ₂₁ H ₄₀ O ₄	25
237	甘油 (glycerol)	C ₃ H ₈ O ₃	35
238	香草醛 (vanillin)	C ₈ H ₈ O ₃	53
239	5-羟甲基糠醛 (5-hydroxymethylfurfural)	C ₆ H ₆ O ₃	25
240	3,5-二甲氧基-4-羟基苯甲醛 (3,5-dimethoxy-4-hydroxybenzaldehyde)	C ₉ H ₁₀ O ₄	25
241	3-甲氧基-5-(4-甲氧基苯基)-2-环己烯酮 [3-methoxy-5-(4-methoxyphenyl)-2-cyclohexenone]	C ₁₄ H ₁₆ O ₃	30
242	2-仲丁基-1-苯基-1,3-丁二酮 [2-(sec-butyl)-1-phenyl-1,3-butanedione]	C ₁₄ H ₁₈ O ₂	30
243	6,8-二甲氧基-3,7-二甲基异香豆素 (6,8-dimethoxy-3,7-dimethyl isocoumarin)	C ₁₃ H ₁₄ O ₄	30
244	异丙基环己烯酮 (cryptone)	C ₉ H ₁₄ O	27
245	4-茨烯基-2-丁酮 (4-camphenyl-2-butanone)	C ₁₄ H ₂₂ O	35
246	对烯丙基茴香醚 (estragole)	C ₁₀ H ₁₂ O	27
247	木香碱 (saussurine)	—	48
248	7-乙氧基-5-甲氧基-2,2-二甲基-2H-苯并吡喃 (7-ethoxy-5-methoxy-2,2-dimethyl-2H-chromene)	C ₁₄ H ₁₈ O ₃	28
249	3,5-O-二咖啡酰基奎宁酸 (3,5-O-dicaffeoyl quinic acid)	C ₂₅ H ₂₄ O ₁₂	54
250	丹皮酚 (paeonal)	C ₉ H ₁₀ O ₃	41

表 6 木香抗肿瘤作用机制

Table 6 Anticancer effects and mechanisms of *Aucklandiae Radix*

肿瘤类别	肿瘤细胞类型	活性成分	药效及作用机制	文献
肺癌	NCI-H1299、NCI-H460 细胞	小白菊内酯	上调 p53 和 mdm2 蛋白; 下调磷酸化蛋白激酶 B (phospho-Akt, p-42 Akt) 和 pSI66-mdm2 蛋白表达, 促进细胞凋亡	67
	A549 细胞	挥发油、DHC、CNL	抑制血管内皮细胞生长因子表达	67
肝癌	HepG2 细胞	土木香内酯	上调 p53 基因表达, 促进下游靶基因表达	42
	HepG2 细胞	木香挥发油	阻断 HepG2 细胞的 S 期和 G ₂ /M 期, 激活 Caspase3 途径诱导细胞凋亡, 抑制细胞增殖, 迁移和侵袭	68, 76
	HA22T/VGH 细胞	CNL	上调蛋白激酶 (Chk2、Cdc25c、Cdk1) 和细胞周期蛋白 (cyclin77 B1) 的表达, 阻止细胞周期, 诱导细胞凋亡	76
	Hep3B 细胞	木香挥发油	阻断 S 期和 G ₂ /M 期, 抑制 Hep3B 细胞增殖; 通过激活 Caspase3 通路, 诱导细胞凋亡	76
乳腺癌	SMMC-7721 细胞	DHC、CNL	阻滞 S 期, 抑制细胞增殖, 诱导凋亡	78
	T-47D 细胞	木香提取物	抑制细胞增殖, 诱导细胞凋亡	73
	MDA-MB-435s	CNL	抑制细胞增殖, 诱导凋亡	75
	MDA-MB-231、SK-BR-3 细胞	DHC	抑制细胞增殖, 导致细胞周期停滞和凋亡	72
	MCF-7 细胞	木香挥发油	抑制核转录因子 (nuclear factor kappa-B, NF-κB) 通路, 下调基	79
	SK-BR-3 细胞	DHC、CNL	质金属蛋白酶-9 表达, 抑制细胞侵袭和转移	79
宫颈癌	C33a 细胞	DHC	上调促凋亡蛋白 (Bcl2-associated X, Bax)、半胱氨酸蛋白酶-380 (Caspase-3) 和半胱氨酸蛋白酶-3 抗体 (cleaved Caspase-3) 表达, 下调 B 细胞淋巴瘤/白血病-2 基因 (B-cell lymphoma/leukemia-2 gene, Bcl-2) 表达, 抑制 SK-BR-3 细胞增殖和迁移, 诱导其凋亡	73
	Hela 细胞	木香醇提物	下调磷脂酰肌醇-3-激酶 (phosphatidylinositol-3-kinase, PI3K) 和蛋白激酶 B (protein kinase B, Akt) 表达, 抑制细胞的增殖	81
卵巢癌	SK-OV-3 细胞	DHC	上调 Caspase-3/Caspase-9/Bax, 下调 Bcl-2 的表达, 诱导 Hela 细胞凋亡	73
	OVCAR-3	CNL	阻滞细胞周期, 抑制细胞增殖, 诱导 SK-OV-3 细胞凋亡	72
前列腺癌	PC3 细胞	CNL	阻滞细胞周期, 抑制细胞增殖, 诱导细胞凋亡	72
	DU145 细胞	土木香内酯	通过 p53 信号的上调增加了周期蛋白依赖性激酶 (cyclin-dependent kinases, cdk) 表达, 抑制 p21 蛋白表达	42
	PC3 细胞	DHC	上调促细胞凋亡因子 (Bax、Bak、Bok、Bik、truncated Bid) 和 Bmf69 蛋白表达	69
	PC-3M 细胞	CNL	增加 cdk 表达, 抑制 PC3 细胞增殖	75
	LNCaP 细胞	CNL	阻滞细胞 G ₁ 周期, 上调 p21, 抑制调控因子 (cdk2/CyclinE) 表达	78
	PC3 细胞	DHC	上调 Bax 基因, 下调抗体 (pro-caspase-8/9/3)、聚腺苷二磷酸核糖 70 聚合酶、促细胞凋亡因子 Bid 和 Bcl-2 表达, 诱导细胞凋亡	70
胃癌	SGC7901 细胞	CNL	通过 p53 信号通路阻滞 G ₂ /M 周期, 抑制细胞生长, 诱导细胞凋亡	75
	HL604 细胞	小白菊内酯	上调 p53 和 mdm2; 下调 p-Akt 和 pSI66-mdm2 表达, 促进细胞凋亡	42
	K562/ADR 细胞	土木香内酯	上调 p53 和 p21 的表达, 抑制 K562/ADR 细胞增殖	42
	HL-60 细胞	CNL	促进活性氧 (ROS) 产生, 诱导线粒体通透转移及细胞色素 C 的释放, 诱导细胞凋亡	74
喉癌	K562 细胞	土木香内酯、CNL	抑制 NF-κB 通路, 诱导细胞凋亡	75
	TU212 细胞	DHC	上调 p53/P21, 下调 PI3K/Akt/Bad 信号通路, 抑制细胞的存活、迁移和增殖, 诱导凋亡	82
膀胱癌	HEp-2 细胞	乙醇提取物	诱导 DNA 断裂和细胞质收缩, 抑制细胞生长和增殖	73
	T24 细胞	CNL	促进 ROS 产生, 介导线粒体功能障碍, 诱导细胞凋亡	71
口腔表皮癌	KB 细胞	甲醇提取物	激活 Caspase-3 和 Caspase-9 途径, 抑制细胞增殖, 诱导细胞凋亡	83
结肠癌	HCT116、RKO 细胞	小白菊内酯	上调 p53 和 mdm2; 下调 p-Akt 和 pSI66-mdm2 表达, 促进细胞凋亡	42
	SW620 细胞	木香内酯	降低 SW620 细胞溴脱氧核苷尿嘧啶阳性百分比, 上调 Bax、cleaved Caspase-3 和蛋白酪氨酸磷酸酶基因表达, 下调细胞增殖核抗原蛋白及 Bcl-2 的表达, 增加细胞凋亡率	84
黑色素瘤	HCT15 细胞	提取液 C17-多烯醇	—	85
	Colo-205 细胞	异二氢木香烯内酯	—	86
	SK-MEL-2 细胞	CNL	抑制磷酸二酯酶抑制剂诱导的黑色素生成	85
皮肤癌	B16 细胞	喘诺木烯内酯	下调 Bcl-2 蛋白表达, 通过线粒体氧化应激通路, 诱导细胞凋亡	86
	A-431 细胞	异二氢木香烯内酯	抑制 A-431 细胞增殖, 诱导其凋亡	86
中枢神经瘤	XF498 细胞	木香提取物	—	85

死因子 α (tumor necrosis factor- α , TNF- α), 具有改善大鼠关节炎作用^[87]; DHC 能显著降低血清中 IL-1 β 和 TNF- α 水平, 减少巨噬细胞对 CLP 小鼠肝组织的浸润, 降低 CLP 小鼠肺、肝组织诱导的一氧化氮 (NO) 合成酶表达, 其可能机制为通过 p38MAPK/Nrf2 信号通路, 诱导 RAW264.7 细胞中血红素加氧酶-1 (Heme oxygenase-1, HO-1) 产生^[88]。采用甲醇提取物处理小鼠肥大细胞系 MC/9 细胞 24 h 后, 可明显降低组胺释放^[89]; 屋尘螨诱导的 Nc/Nga 小鼠经提取物处理后, 皮炎分数、血清中免疫球蛋白 E (IgE) 和胸腺活化调节趋化因子 (thymus and activation regulated chemokine, TARC) 水平降低, 提示木香具有抗炎作用^[90]; 木香石油醚流分可抑制 RAW264.7 细胞中 NO 生成发挥抗炎作用^[29]; 此外, CNL、DHC、土木香内酯具有治疗炎症性皮肤病的潜力, 其机制为降低 HaCaT 细胞中 TARC/CCL17、调节活化正常 T 细胞表达和分泌的因子、巨噬细胞衍生趋化因子和白细胞介素-8 等的 mRNA 表达^[91]; DHC 可显著降低脓毒血症小鼠血清中 IL-1 β 和 TNF- α 水平^[88], 并可抑制 NLRP3 炎症小体激活的启动和组装阶段, 机制为抑制凋亡相关斑点样蛋白寡聚化^[92]; CNL、DHC、丙酮提取物可显著降低炎症性肺嗜酸性粒细胞、2 型细胞因子及过敏小鼠中特异性 Ig E 和黏液的产生^[93]。

3.4 抗菌作用

研究表明, 木香醇提取物可抑制变异链球菌生长和产酸, 降低其黏附性, 且能显著抑制非水溶性葡聚糖的合成, 表明可抑制变形链球菌所致龋齿的形成^[94]; 进一步研究发现, DHC 和 CNL 对变异链球菌的生长、产酸、黏附均有一定的抑制作用^[95]; 木香不同提取物对大肠杆菌、绿脓杆菌、枯草芽孢杆菌、金黄色葡萄球菌、真菌 (白色念珠菌) 均有抑制作用, 且有机溶剂提取物比水提取物抑菌效果好, 提示小极性的挥发油或萜类是抗菌的活性物质^[96]; 木香醇提取物和乙醚提取物分别对串珠镰孢菌^[97]和幽门螺杆菌株^[98]均有一定的抑菌作用; 提取物可作为牙根平整术的辅助剂使用, 与广谱抗菌剂葡萄糖酸氯己定组无显著差异^[99]。此外, 研究发现木香挥发油对金黄色葡萄球菌有较强的抗菌活性, 且剂量相关性抑制 α -毒素、中毒性休克综合征毒素 1 以及肠毒素 A、B 的产生^[100]。

3.5 其他作用

除上述药理作用外, 木香还具有抗氧化、强心、抗惊厥、降血糖以及保肝等作用等。DHC 可增加 HepG2 细胞抗过氧化氢导致的氧化损伤作用, 机制与上调 Nrf2/HO-1 表达相关^[49]; 木香提取物对二苯基苦基苯肼自由基清除活性与维生素 E 相当, 对低密度脂蛋白具有抑制作用^[101], 亦可防止组织脂质过氧化损伤, 保护 DNA 免受氧化损伤^[102]。水提取物对异丙肾上腺素诱导的心肌损伤具有显著的剂量依赖性活性, 可显著恢复心肌乳酸脱氢酶、肌酸激酶、谷草转氨酶、硫代巴比妥酸反应物和谷胱甘肽水平, 与阳性药 α -生育酚作用相当^[103]; 甲醇提取物对离体心脏具有显著的负性肌力效应, 在剂量 0.5、2.5、5.0 μg 下表现出显著的正性肌力作用^[104]。石油醚和乙醇提取物对戊四唑和苦瓜毒素诱导的小鼠惊厥具有良好抑制作用, 水提取物可显著增加小鼠阵发性惊厥的潜伏期, 减少惊厥发作和死亡率^[105]; CNL 可抑制多巴胺所致多巴胺能神经元细胞毒性, 从而保护神经中枢, 其机制与调节多巴胺代谢相关基因的表达有关^[106]。CNL 和 DHC 可显著增强糖尿病小鼠血清超氧化物歧化酶活性, 并显著降低血清丙二醛和血糖水平, 其机制为抑制氧化应激而减轻胰岛素抵抗^[107]。此外, 木香挥发油、DHC 及 CNL 成分具有显著的抑制二磷酸腺苷 ADP 诱导的血小板聚集作用^[108]; 木香提取物可降低小鼠 D-氨基半乳糖和脂多糖诱导的谷丙转氨酶和谷草转氨酶水平, 发挥保肝作用^[109], 并可改善大鼠精子异常、减轻睾丸组织和 DNA 损伤、抑制 P53 蛋白表达, 对大鼠生殖毒性具有潜在的预防和治疗作用^[110]; 木香多糖 APS-2 具有良好的抗补体活性, 作用靶点为补体因子 C1q、C2、C3、C5 和 C9^[111], 有望开发成免疫疾病治疗药物。

4 临床应用

木香在临床上应用广泛, 主要以复方形式入药。古代医家常用木香配伍不同中药治疗腹痛、胃脘痛、泄泻、呃逆、呕吐等疾病。如宋代《太平惠民和剂局方》大香连丸为木香与黄连配伍, 治疗湿热泻痢^[112]; 北宋《小儿药证直诀》七味白术散为木香配伍其他中药, 治疗脾胃久虚、呕吐、泄泻频作不止^[113]; 清《杂病源流犀烛》木香破气散为木香配伍其他中药, 治疗胸膈痞闷、脘腹胀痛、呕吐恶心、暖气纳呆。现代临床应用于本草记载基本一致, 主要用于消化系统疾病的治疗, 木香顺气丸可

促进肛门排气排便,减少胃肠反应的并发症,促进术后康复^[114],使用木香顺气散治疗功能性消化不良,临床总有效率达 96.55%^[115];香连片治疗急性菌痢和急性肠炎,显效以上达 96.59%和 96.67%^[116],亦有用加味香连汤治小儿急性细菌性痢,总有效率达 90.0%^[117];在常规西药治疗基础上,联合应用木香和黄连治疗,发现慢性溃疡性结肠炎患者的腹泻、腹痛症状显著改善^[118];六味木香胶囊治疗慢性胃炎,总有效率达 95%^[119];使用自拟木香散敷脐治疗腹胀 80 例,总有效率达 97.5%^[120];木香顺气丸用于恶性腹腔积液患者腹胀治疗,发现治疗组有效率达 75.00%,优于对照组^[121]。此外,采用木香治疗慢性乙型肝炎患者,发现患者胆红素、谷草转氨酶、谷丙转氨酶、碱性磷酸酶等指标均有一定改善^[122];木香槟榔莪朮汤加红外肝病治疗仪治疗肝炎肝硬化,可明显改善患者临床症候群,恢复肝功能,降低肝纤维化指标,减轻门静脉压,临床疗效良好^[123];将木香用于男性不育症的治疗,发现 68%的患者有轻度改善,20%的患者无明显变化,12%的患者有中度改善^[124]。

5 质量标志物预测分析

5.1 基于植物亲缘学及化学成分特有性的木香质量标志物预测分析

木香为菊科风毛菊属 *Saussurea* DC.植物,风毛菊属全世界有 400 余种,分布于亚洲、欧洲等地,我国约 264 种,全国各地均有分布。已有研究表明,倍半萜类是风毛菊属植物中分布最广的一类成分^[125],其生物合成途径有甲羟戊酸途径、脱氧木酮糖-5-磷酸途径和甲基赤藓醇 4-磷酸途径^[126]。木香与其他同属植物相比,倍半萜的种类存在差异,如香叶烷型倍半萜类成分木香内酯、二氢去氢木香内酯等为其所特有^[125];此外,研究显示不同产地的木香所含的 CNL、DHC 和木香醇等成分含量差异较大^[28, 127],鉴于木香中倍半萜类成分的种类及含量生长环境的影响,其挥发油成分如 CNL、DHC、木香醇等可作为木香的质量标志物参考。

5.2 基于成分与传统功效相关性的质量标志物预测分析

中药的传统功效是临床用药的理论依据,确定与功效的关联的化学成分是质量标志物筛选的关键。有关木香的应用,始载于《新修本草》“疗毒肿,消恶气,有验”;《日华子本草》载:“治心腹一切气,止泻,霍乱,痢疾,安胎,健脾消

食”;《药性论》载:“霍乱吐泻,心腹痞刺”;《本草纲目》载:“行气止痛,健脾和胃”;《中国道地药材》载“行气止痛,燥湿止痢”;《中华人民共和国药典》载:“行气止痛,健脾消食;用于胸胁、脘腹胀痛,泻痢后重,食积不消,不思饮食”,可见历代本草记载木香具有行气,健脾之功,主要用于脘腹胀痛、腹泻、痢疾等。现代研究表明,木香的挥发油对金黄色葡萄球菌有较强的抗菌活性,CNL 和 DHC 具有调节胃肠运动、抗菌和抗炎作用^[62, 97, 128];所含的 3,5-O-二咖啡酰基奎宁酸亲水性强,能较好地转移到煎液中,具有较好的抗氧化和抑菌作用^[54];上述均与木香的传统功效一致。因此,木香的挥发油、尤其是 CNL、DHC 和 3,5-O-二咖啡酰基奎宁酸,应是质量标志物的主要选择。

5.3 基于传统药性的质量标志物预测分析

中药的药性是对中药作用的基本性质与特征的高度概括,其包含的性味归经是指导中医临床用药的重要依据^[129]。木香性温,味辛、苦,归脾、胃、大肠、三焦、胆经。据“辛味”“辛味能散能行,有发散、行气、化湿功能,适用于表症、湿阻等证”^[130];寒湿内阻多表现为脘腹胀痛,辛可行气,一般与胃肠道运动产生联系^[131];“苦味能泄、能燥、能坚”,即具有清泄火热、泄降气逆、通泄大便、燥湿、坚阴等作用^[132]。“苦辛”合用,能降能通,使郁结于肝胆之邪气有外透之机,阴寒冷积亦能顺其外出^[133]。因此,现代研究 CNL 和 DHC “调节胃肠功能、抗炎利胆”与其性味“辛、苦,归脾、胃、大肠、胆经”是一致的。已有大量研究表明,辛味药中萜类及挥发油类明显较其他成分多^[134]。因此,结合木香药性和成分的相关性,其所含挥发油类成分是木香的重要质量标志物。

5.4 基于复方配伍环境的质量标志物预测分析

木香在临床上常以方剂配伍的形式出现。以木香作为君药的名方“木香槟榔丸”,临床常用于治疗胃炎、细菌性痢疾、溃疡性结肠炎和肠功能紊乱等各种消化系统的疾病^[135],LC-MS 研究显示检测到木香中发挥药效的主要成分 DHC^[136]。此外,木香顺气丸是由木香、砂仁、醋香附、槟榔、甘草、陈皮、厚朴、枳壳(炒)、苍术(炒)、青皮(炒)和生姜 1 味中药组方的中药复方制剂,方中木香为君药,具有行气化湿、健脾和胃之功效;临

床上用于胃肠功能紊乱障碍、腹胀等症^[114, 137-138], 其指纹图谱研究显示检测到 CNL、DHC^[139], 大量的研究表明 CNL 和 DHC 具有抗炎作用, 并可促进脾虚小鼠胃排空^[57]。因此, 以 CNL 和 DHC 为主的萜类成分, 在配伍环境中发挥作用与现代药理学调节胃肠功能, 抗炎、抗菌等研究结果一致, 可将上述成分作为木香配伍中质量标志物筛选的参考。

5.5 基于成分可测性的木香质标志物量预测分析

化学成分的可测性是质量标志物确定的重要依据之一。已有研究表明, 木香中所含的化学成分 CNL、DHC 可通过 HPLC 法测定^[127-128], 黎晓丽等^[54]认为 3,5-O-二咖啡酰基奎宁酸是木香的水溶性有效成分, 并建立了其 UPLC 测定含量测定方法; 陈飞龙^[30]、包玉敏等^[46]建立了木香挥发油的气相质谱检测方法, 分别鉴定了 46 和 53 种挥发性成分, 为木香质量评价提供了新方法。综上, 木香中萜类成分、3,5-O-二咖啡酰基奎宁酸及挥发油等成分可用多种分析手段定量分析, 可作为木香的质量标志物进行选择。

6 结语

木香作为我国传统中药, 药用历史悠久, 具有广泛的药理活性。随着现代研究的深入, 木香的很多药理作用也被发现, 如抗肿瘤、抗菌等。木香的传统应用一般入汤药水煎服, 现行标准中以 CNL、DHC 作为质控指标, 两者均为脂溶性成分, 较难转移至煎液中^[54]; 此外, CNL、DHC 也存在于其他常用中药, 如川木香 *Vladimiriae Radix* 中^[1], 故仅将其作为木香的质控指标, 其特有性和专属性差, 难以反映木香的质量特质。中药的功效与所含化学成分密不可分, 木香作为行气药, 其中的倍半萜类成分 CNL、DHC 为其促进胃肠运动、抗炎的主要物质基础^[62, 97, 128]; 同时木香还具有抗溃疡、止泻、抗菌等作用^[58, 64, 97], 其所含成分 3,5-O-二咖啡酰基奎宁酸, 以及其他水溶性成分亦可能是其治疗胃肠疾病的物质基础^[54]。因此, 仅以 CNL、DHC 作为木香质控指标, 与其功效相关物质的关联性不强, 无法满足质量控制及评价要求, 建立科学、合理的质量评价方法, 对于保证木香质量和促进健康产业发展具有重要意义。本文对木香化学成分、药理作用和临床应用进行总结, 并在此基础上依据中药质量标志物的概念, 从植物亲缘, 传统功效、传统药性, 以成分可测性, 复方配伍等

方面对其质量标志物进行了预测分析, 推测木香中萜类及挥发油等成分可作为其质量标志物, 如 CNL、DHC、3,5-O-二咖啡酰基奎宁酸等。为木香质量标志物的选择提供了思路与方法, 以便于建立木香更加科学、完善的质量评价标准。

利益冲突 所有作者均声明不存在利益冲突

参考文献

- [1] 中国药典 [S]. 一部. 2020: 63.
- [2] 杨辉, 谢金伦, 孙汉董. 云木香化学成分及药理作用研究概况 [J]. 天然产物研究与开发, 1998, 10(2): 90-98.
- [3] 魏华, 彭勇, 马国需, 等. 木香有效成分及药理作用研究进展 [J]. 中草药, 2012, 43(3): 613-620.
- [4] 王阳, 范潇晓, 杨军, 等. 木香的萜类成分与药理作用研究进展 [J]. 中国中药杂志, 2020, 45(24): 5917-5928.
- [5] 张建春, 蔡雅明, 周德斌, 等. 木香的研究进展 [J]. 甘肃科技, 2010, 26(20): 170-173.
- [6] 潘阳, 王小静, 潘娟, 等. 木香烃内酯的药理作用及构效关系研究进展 [J]. 中南药学, 2013, 11(2): 108-112.
- [7] 杨美礼, 王晓玲. 去氢木香烃内酯的药理活性研究进展 [J]. 宝鸡文理学院学报: 自然科学版, 2021, 41(2): 64-70.
- [8] 杨娟, 全健, 余中莲, 等. 云木香研究进展 [J]. 亚太传统医药, 2019, 15(6): 181-184.
- [9] 清·顾观光. 神农本草经 [M]. 第 2 版. 兰州: 兰州大学出版社, 2009: 23.
- [10] 张南平, 余坤子, 康帅, 等. 《神农本草经》等古代本草中木香基原考证 [J]. 中国药事, 2019, 33(2): 172-176.
- [11] 樊绰. 云南志校释 [M]. 北京: 中国社会科学出版社, 1985: 270, 318.
- [12] 唐·苏敬等撰. 尚志钧辑校. 唐·新修本草: 辑复本 [M]. 合肥: 安徽科学技术出版社, 1981: 172-173.
- [13] 金素安, 郭忻. 《海药本草》蜜香、木香、沉香之考辨 [J]. 上海中医药杂志, 2011, 45(2): 23-24.
- [14] 张云. 上古西藏与波斯文明 [M]. 北京: 中国藏学出版社, 2005: 16-17.
- [15] 唐·岑参著. 陈铁民 侯忠义校注. 岑参集校注 [M]. 上海: 上海古籍出版社, 1981: 127.
- [16] 李林玉, 刘大会, 杨斌, 等. 木香的本草考证 [J]. 中药材, 2020, 43(2): 492-495.
- [17] 宋·唐慎微撰. 重修政和经史证类备用本草 (三十卷) [M]. 影印本. 北京: 人民卫生出版社, 1957: 159-160.
- [18] 陈重明, 黄胜白. 本草学 (第 2 版) [M]. 南京: 东南大学出版社, 2005: 82-86.
- [19] Pushkarmool Planet Ayurveda. 印度传统医学网站, 藏木香 [EB/OL]. [http://www. planetayurveda. Com /](http://www.planetayurveda.Com/)

- pushkarmool. Htm [2018-10-15]
- [20] 辞海编辑委员会. 辞海 缩印本(1979 年版) [M]. 上海: 上海辞书出版社, 1980: 8.
- [21] 清·仲昂庭纂集. 孙多善点校. 本草崇原集说 [M]. 北京: 人民卫生出版社, 1997: 41-43.
- [22] 明·刘文泰. 本草品汇精要 (四十二卷) 续集十卷 附二卷 考证一卷 [M]. 新 1 版. 北京: 人民卫生出版社, 1964: 143.
- [23] 杨辉, 谢金伦, 孙汉董. 云木香化学成分研究 I [J]. 云南植物研究, 1997, 19(1): 85-91.
- [24] Yin H Q, Fu H W, Hua H M, et al. Two new sesquiterpene lactones with the sulfonic acid group from *Saussurea lappa* [J]. *Chem Pharm Bull (Tokyo)*, 2005, 53(7): 841-842.
- [25] 尹宏权, 齐秀兰, 华会明, 等. 云木香化学成分研究 [J]. 中国药物化学杂志, 2005, 15(4): 217-220.
- [26] 梁晟, 梁逸曾, 李雅文, 等. 木香挥发性化学成分的气相色谱-质谱分析 [J]. 广州化学, 2007, 32(4): 12-17, 24.
- [27] Chang K M, Kim G H. Comparison of volatile aroma components from *Saussurea lappa* C.B. Clarke root oils [J]. *Prev Nutr Food Sci*, 2008, 13(2): 128-133.
- [28] 陈飞龙, 谭晓梅, 汤庆发, 等. 不同产地木香挥发油成分的 GC-MS 分析比较 [J]. 中国药房, 2011, 22(23): 2187-2189.
- [29] Zhao F, Xu H, He E Q, et al. Inhibitory effects of sesquiterpenes from *Saussurea lappa* on the overproduction of nitric oxide and TNF- α release in LPS-activated macrophages [J]. *J Asian Nat Prod Res*, 2008, 10(11/12): 1045-1053.
- [30] 陈飞龙, 谭晓梅, 汤庆发, 等. 几种“木香”挥发油成分的 GC-MS 比较研究 [J]. 中药材, 2011, 34(3): 395-399.
- [31] 尹宏权, 付红伟, 华会明, 等. 云木香的化学成分 [J]. 沈阳药科大学学报, 2006, 23(10): 641-643.
- [32] 张婷, 马林, 吴丰, 等. 云木香乙醇提取物化学成分研究 [J]. 中国中药杂志, 2012, 37(9): 1232-1236.
- [33] Choi J Y, Na M, Hyun Hwang I, et al. Isolation of betulinic acid, its methyl ester and guaiane sesquiterpenoids with protein tyrosine phosphatase 1B inhibitory activity from the roots of *Saussurea lappa* C.B. Clarke [J]. *Molecules*, 2009, 14(1): 266-272.
- [34] Robinson A. Isolation of α -amyrin eicosanoate, a triterpenoid from the roots of *Saussurea lappa* Clarke-differential solubility as an aid [J]. *J Pharma Sci Technol*, 2010, 54(4): 207-212.
- [35] 杨琴芳, 赵筱斐, 袁吕江. 木香挥发油成分的 GC-MS 分析 [J]. 现代盐化工, 2019, 46(1): 60-62.
- [36] 张婷, 王洪庆, 杜冠华, 等. 云木香化学成分研究 [J]. 中国中药杂志, 2009, 34(10): 1223-1224.
- [37] 胡祖艳, 刀建华, 赵旻. 云木香中 1 个新愈创木烷型倍半萜内酯 [J]. 中草药, 2021, 52(14): 4136-4140.
- [38] Yoshikawa M, Hatakeyama S, Inoue Y, et al. Saussureamines A, B, C, D, and E, new anti-ulcer principles from Chinese *Saussurea Radix* [J]. *Chem Pharm Bull (Tokyo)*, 1993, 41(1): 214-216.
- [39] Wang F, Xie Z H, Gao Y, et al. Sulfonated guaianolides from *Saussurea lappa* [J]. *Chem Pharm Bull*, 2008, 56(6): 864-865.
- [40] Sun C M, Syu W J, Don M J, et al. Cytotoxic sesquiterpene lactones from the root of *Saussurea lappa* [J]. *J Nat Prod*, 2003, 66(9): 1175-1180.
- [41] 娄方明, 李群芳, 张倩茹. 固相微萃取-气相色谱-质谱联用分析云木香挥发油成分 [J]. 药物分析杂志, 2011, 31(3): 513-518.
- [42] 乔巍, 汪小莞, 李晓春, 等. 四种倍半萜类化合物广谱抗肿瘤效应的研究进展 [J]. 中国生化药物杂志, 2016, 36(3): 5-8.
- [43] 马士玉, 王文翠, 韩光明, 等. 丽江云木香精油成分提取分析 [J]. 上海交通大学学报: 农业科学版, 2017, 35(2): 54-60.
- [44] Duan J A, Hou P F, Tang Y P, et al. A new sesquiterpene and other constituents from *Saussurea lappa* root [J]. *Nat Prod Commun*, 2010, 5(10): 1531-1534.
- [45] Cao K, Qian W, Xu Y, et al. A new sesquiterpenoid from *Saussurea lappa* roots [J]. *Nat Prod Res*, 2016, 30(19): 2160-2163.
- [46] 包玉敏, 张力, 马莹莹, 等. 木香挥发油化学成分分析 [J]. 光谱实验室, 2011, 28(1): 121-123.
- [47] Li S, An T Y, Li J, et al. PTP1B inhibitors from *saussurea lappa* [J]. *J Asian Nat Prod Res*, 2006, 8(3): 281-286.
- [48] Rao K S, Babu G V, Ramnareddy Y V. Acylated flavone glycosides from the roots of *Saussurea lappa* and their antifungal activity [J]. *Molecules*, 2007, 12(3): 328-344.
- [49] Jeong G S, Pae H O, Jeong S O, et al. The α -methylene- γ -butyrolactone moiety in dehydrocostus lactone is responsible for cytoprotective heme oxygenase-1 expression through activation of the nuclear factor E2-related factor 2 in HepG2 cells [J]. *Eur J Pharmacol*, 2007, 565(1/2/3): 37-44.
- [50] 张兰胜, 杨志勇, 董光平, 等. 云木香挥发油化学成分的研究 [J]. 大理学院学报, 2007, 6(12): 9-12.
- [51] Cho J Y, Park J, Yoo E S, et al. Inhibitory effect of sesquiterpene lactones from *Saussurea lappa* on tumor necrosis factor- α production in murine macrophage-

- like cells [J]. *Planta Med*, 1998, 64(7): 594-597.
- [52] 张婷, 杨燕, 杜冠华, 等. 云木香化学成分研究 II [J]. 中国中药杂志, 2011, 36(12): 1620-1622.
- [53] 王于方. 云木香根的化学成分研究 [D]. 石家庄: 河北医科大学, 2009.
- [54] 黎晓丽, 孙冬梅, 罗宇琴, 等. 基于主成分分析及聚类判别模式的木香 UPLC 指纹图谱研究 [J]. 中草药, 2019, 50(20): 5040-5046.
- [55] 朱金照, 冷恩仁, 陈东风. 木香对大鼠胃肠运动的影响及其机制探讨 [J]. 中国中西医结合脾胃杂志, 2000, 8(4): 236-238.
- [56] 张猛, 郭建生, 王小娟, 等. 云木香不同提取物对小鼠胃排空和小肠推进功能的影响 [J]. 中国实验方剂学杂志, 2012, 18(2): 136-139.
- [57] 侯影, 张旭, 尹丽波, 等. 木香生品、麸煨品及活性单体对小鼠胃肠运动的影响 [J]. 中国实验方剂学杂志, 2011, 17(24): 132-135.
- [58] 韩坚, 林煌权, 钟志勇, 等. 木香超临界提取物抗实验性胃溃疡的研究 [J]. 中药材, 2005, 28(11): 1017-1019.
- [59] 李秀芳, 林青, 代蓉, 等. 云木香丙酮提取物对大鼠实验性胃溃疡模型的影响 [J]. 云南中医中药杂志, 2007, 28(6): 34-35, 1.
- [60] Yang X, Zhang X, Yang S P, *et al.* Evaluation of *Aucklandia lappa* Decne extracts as antiulcer activity in animals [J]. *Pak J Pharm Sci*, 2016, 29(5): 1695-1701.
- [61] 应军, 罗小萍. 木香对大鼠急性胃粘膜损伤的拮抗作用 [J]. 中药材, 1999, 22(10): 526-527.
- [62] 王永兵, 王强, 毛福林, 等. 木香的药效学研究 [J]. 中国药科大学学报, 2001, 32(2): 146-148.
- [63] Gilani A H, Shah A J, Yaeesh S. Presence of cholinergic and calcium antagonist constituents in *Saussurea lappa* explains its use in constipation and spasm [J]. *Phytother Res*, 2007, 21(6): 541-544.
- [64] 张旭, 侯影, 贾天柱. 木香及其炮制品的抗腹泻作用研究 [A] // 中华中医药学会中药炮制分会 2011 年学术年会论文集 [C]. 贵州: 中华中医药学会, 2011.
- [65] 吴承艳, 李振彬, 石建喜. 木香、丁香和威灵仙镇痛及胃肠动力作用的实验研究 [J]. 江苏中医药, 2005, 37(12): 61-63.
- [66] 王绪颖, 贾晓斌, 陈彦. 木香类药材的研究进展 [J]. 中药材, 2010, 33(1): 153-157.
- [67] 郝立杰, 赵烽, 高治廷, 等. 木香倍半萜对血管内皮细胞生长因子的抑制作用 [J]. 天然产物研究与开发, 2010, 22(4): 687-691.
- [68] Nair S V G, Hettihewa M, Rupasinghe H P V. Apoptotic and inhibitory effects on cell proliferation of hepatocellular carcinoma HepG2 cells by methanol leaf extract of *Costus speciosus* [J]. *Biomed Res Int*, 2014, 2014: 637098.
- [69] Kim E J, Lim S S, Park S Y, *et al.* Apoptosis of DU145 human prostate cancer cells induced by dehydrocostus lactone isolated from the root of *Saussurea lappa* [J]. *Food Chem Toxicol*, 2008, 46(12): 3651-3658.
- [70] Tian X, Song H S, Cho Y M, *et al.* Anticancer effect of *Saussurea lappa* extract via dual control of apoptosis and autophagy in prostate cancer cells [J]. *Medicine (Baltimore)*, 2017, 96(30): e7606.
- [71] Rasul A, Bao R, Malhi M, *et al.* Induction of apoptosis by costunolide in bladder cancer cells is mediated through ROS generation and mitochondrial dysfunction [J]. *Molecules*, 2013, 18(2): 1418-1433.
- [72] Choi E J, Kim G H. Evaluation of anticancer activity of dehydrocostuslactone *in vitro* [J]. *Mol Med Rep*, 2010, 3(1): 185-188.
- [73] Hasson S S, H Al-Shubi A S, Al-Busaidi J Z, *et al.* Potential of *Aucklandia lappa* decne ethanolic extract to trigger apoptosis of human T47D and hela cells [J]. *Asian Pac J Cancer Prev*, 2018, 19(7): 1917-1925.
- [74] Lee M G, Lee K T, Chi S G, *et al.* Costunolide induces apoptosis by ROS-mediated mitochondrial permeability transition and cytochrome C release [J]. *Biol Pharm Bull*, 2001, 24(3): 303-306.
- [75] 王璐, 赵烽, 何恩其, 等. 18 种木香倍半萜对 6 种人源肿瘤细胞增殖的影响 [J]. 天然产物研究与开发, 2008, 20(5): 808-812.
- [76] Lin X J, Peng Z X, Fu X H, *et al.* Volatile oil from *Saussurea lappa* exerts antitumor efficacy by inhibiting epithelial growth factor receptor tyrosine kinase-mediated signaling pathway in hepatocellular carcinoma [J]. *Oncotarget*, 2016, 7(48): 79761-79773.
- [77] Liu C Y, Chang H S, Chen I S, *et al.* Costunolide causes mitotic arrest and enhances radiosensitivity in human hepatocellular carcinoma cells [J]. *Radiat Oncol*, 2011, 6: 56.
- [78] 许卉, 刘生生, 王振华, 等. 木香的倍半萜类化学成分及其肿瘤细胞毒活性研究 [A] // 创新药物及新品种研究、开发学术研讨会论文集 [C]. 济南: 创新药物及新品种研究、开发学术研讨会, 2006.
- [79] Peng Z X, Wang Y, Gu X, *et al.* Metabolic transformation of breast cancer in a MCF-7 xenograft mouse model and inhibitory effect of volatile oil from *Saussurea lappa* Decne treatment [J]. *Metabolomics*, 2015, 11(3): 636-656.
- [80] 马强, 熊书, 苗加伟, 等. 木香烯内酯对人乳腺癌 SK-BR-3 细胞增殖、迁移和凋亡的影响及机制研究 [J]. 中国药房, 2020, 31(11): 1342-1347.
- [81] Wu J H, Chen C, Zhao K N. Phosphatidylinositol 3-

- kinase signaling as a therapeutic target for cervical cancer [J]. *Curr Cancer Drug Targets*, 2013, 13(2): 143-156.
- [82] Zhang R, Hao J, Wu Q M, *et al.* Dehydrocostus lactone inhibits cell proliferation and induces apoptosis by PI3K/Akt/Bad and ERS signalling pathway in human laryngeal carcinoma [J]. *J Cell Mol Med*, 2020, 24(11): 6028-6042.
- [83] Moon S M, Yun S J, Kook J K, *et al.* Anticancer activity of *Saussurea lappa* extract by apoptotic pathway in KB human oral cancer cells [J]. *Pharm Biol*, 2013, 51(11): 1372-1377.
- [84] 吴仁瑞, 刘华峰, 汪琛, 等. 木香内酯对结肠癌细胞增殖和凋亡的影响 [J]. *中国现代应用药学*, 2021, 38(13): 1559-1565.
- [85] Jung J H, Kim Y, Lee C O, *et al.* Cytotoxic constituents of *Saussurea lappa* [J]. *Arch Pharm Res*, 1998, 21(2): 153-156.
- [86] Robinson A, Kumar T V, Sreedhar E, *et al.* A new sesquiterpene lactone from the roots of *Saussurea lappa*: Structure-anticancer activity study [J]. *Bioorg Med Chem Lett*, 2008, 18(14): 4015-4017.
- [87] Tag H M, Khaled H E, Ismail H A, *et al.* Evaluation of anti-inflammatory potential of the ethanolic extract of the *Saussurea lappa* root (*Costus*) on adjuvant-induced monoarthritis in rats [J]. *J Basic Clin Physiol Pharmacol*, 2016, 27(1): 71-78.
- [88] Park E J, Park S W, Kim H J, *et al.* Dehydrocostuslactone inhibits LPS-induced inflammation by p38MAPK-dependent induction of hemeoxygenase-1 *in vitro* and improves survival of mice in CLP-induced Sepsis *in vivo* [J]. *Int Immunopharmacol*, 2014, 22(2): 332-340.
- [89] Lim H S, Ha H, Lee M Y, *et al.* *Saussurea lappa* alleviates inflammatory chemokine production in HaCaT cells and house dust mite-induced atopic-like dermatitis in Nc/Nga mice [J]. *Food Chem Toxicol*, 2014, 63: 212-220.
- [90] Lim H S, Ha H, Shin H K, *et al.* The genome-wide expression profile of *Saussurea lappa* extract on house dust mite-induced atopic dermatitis in nc/nga mice [J]. *Mol Cells*, 2015, 38(9): 765-772.
- [91] Seo C S, Lim H S, Jeong S J, *et al.* Anti-allergic effects of sesquiterpene lactones from the root of *Aucklandia lappa* Decne [J]. *Mol Med Rep*, 2015, 12(5): 7789-7795.
- [92] 陈媛媛. 去氢木香内酯对炎症小体的调控作用及机制研究 [D]. 济南: 山东中医药大学, 2020.
- [93] Pyun H, Kang U, Seo E K, *et al.* Dehydrocostus lactone, a sesquiterpene from *Saussurea lappa* Clarke, suppresses allergic airway inflammation by binding to dimerized translationally controlled tumor protein [J]. *Phytomedicine*, 2018, 43: 46-54.
- [94] Yu H H, Lee J S, Lee K H, *et al.* *Saussurea lappa* inhibits the growth, acid production, adhesion, and water-insoluble glucan synthesis of *Streptococcus mutans* [J]. *J Ethnopharmacol*, 2007, 111(2): 413-417.
- [95] 邵旭媛, 卢友光, 潘在兴, 等. 木香中有效成分对变异链球菌的体外实验研究 [J]. *海峡预防医学杂志*, 2018, 24(2): 73-75.
- [96] Mohamed A. Evaluation of antimicrobial activity of different solvent extracts of *Saussurea lappa* [J]. *World J Pharm Pharm Sci*, 2017: 12-18.
- [97] 王锦, 刘翠青, 石晓霞. 中药木香乙醚部分提取物抗串珠镰孢菌作用研究 [J]. *河北中医药学报*, 2006, 21(1): 21-22.
- [98] Li Y, Xu C, Zhang Q, *et al.* *In vitro* anti-*Helicobacter pylori* action of 30 Chinese herbal medicines used to treat ulcer diseases [J]. *J Ethnopharmacol*, 2005, 98(3): 329-333.
- [99] Trivedi S, Dixit J. Clinical effects of irrigation with *Saussurea lappa* extract in the treatment of chronic periodontitis: A pilot randomized trial [J]. *J Orofac Sci*, 2015, 7(2): 80-85.
- [100] Qiu J, Wang J, Luo H, *et al.* The effects of subinhibitory concentrations of *Costus* oil on virulence factor production in *Staphylococcus aureus* [J]. *J Appl Microbiol*, 2011, 110(1): 333-340.
- [101] Sadik I, Abd Allah A, Abdulhameed M, *et al.* Antioxidant activity and *in-vitro* Potential inhibition of *Nigella sativa* and *Saussurea lappa* against LDL oxidation among Sundance [J]. *E3 J Med Res*, 2017, 6(3): 22-26.
- [102] Garg R, Sharma A K. Antioxidant Activities of *Saussurea lappa* (Root), *Ficus bengallensis* (Root), *Flacourtria romantchi* (Stem Bark and Root), and *Oroxylum indicum* (Root) in Swiss Albino Mice [J]. *Int J Pharm Pract*, 2016, 6(3): 274-296.
- [103] Saleem T S, Lokanath N, Prasanthi A, *et al.* Aqueous extract of *Saussurea lappa* root ameliorate oxidative myocardial injury induced by isoproterenol in rats [J]. *J Adv Pharm Technol Res*, 2013, 4(2): 94-100.
- [104] Akhtar M S, Bashir S, Malik M N, *et al.* Cardiogenic activity of methanolic extract of *Saussurea lappa* Linn roots [J]. *Pak J Pharm Sci*, 2013, 26(6): 1197-1201.
- [105] Ambavade S D, Mhetre N A, Muthal A P, *et al.* Pharmacological evaluation of anticonvulsant activity of root extract of *Saussurea lappa* in mice [J]. *Eur J Integr Med*, 2009, 1(3): 131-137.
- [106] Ham A, Lee S J, Shin J, *et al.* Regulatory effects of

- costunolide on dopamine metabolism-associated genes inhibit dopamine-induced apoptosis in human dopaminergic SH-SY₅Y cells [J]. *Neurosci Lett*, 2012, 507(2): 101-105.
- [107] 金清. 云木香中降糖活性成分的分离及降糖机制研究 [D]. 重庆: 西南大学, 2012.
- [108] 侯鹏飞, 陈文星, 赵新慧, 等. 木香挥发性成分气质联用分析及其抑制血小板聚集作用的研究 [J]. 中国实验方剂学杂志, 2008, 14(7): 26-30.
- [109] Yaeesh S, Jamal Q, Shah A J, et al. Antihepatotoxic activity of *Saussurea lappa* extract on D-galactosamine and lipopolysaccharide-induced hepatitis in mice [J]. *Phytother Res*, 2010, 24(2): S229-S232.
- [110] Abd Eldaim M A, Tousson E, El Sayed I E T, et al. Ameliorative effects of *Saussurea lappa* root aqueous extract against Etchephon-induced reproductive toxicity in male rats [J]. *Environ Toxicol*, 2019, 34(2): 150-159.
- [111] 曾敏, 徐惠芳. 云木香多糖的抗补体活性研究 [J]. 现代中药研究与实践, 2018, 32(2): 23-26.
- [112] (宋)太平惠民和剂局编. 刘景源点校. 太平惠民和剂局方 [M]. 北京: 人民卫生出版社, 1985: 153.
- [113] (宋)钱乙著. 李志庸校注. 小儿药证直诀 [M]. 北京: 中国中医药出版社, 2008: 74.
- [114] 高敏, 汝明. 木香顺气丸对妇产科手术后腹胀及胃肠功能恢复的临床观察 [J]. 中医临床研究, 2013, 5(1): 91-92.
- [115] 朴基万, 柴俊田. 木香顺气散治疗功能性消化不良的临床观察 [J]. 中医药学报, 2003, 31(2): 36.
- [116] 朱起贵. 香连片(浓缩)治疗急性菌痢急性肠炎临床观察 [J]. 湖北中医杂志, 1990, 12(2): 9-11.
- [117] 温欣. 加味香连汤治疗小儿急性细菌性痢疾临床观察 [J]. 山西中医, 2012, 28(8): 21.
- [118] 毕夏. 黄连木香配伍治疗溃疡性结肠炎临床疗效及机制研究 [J]. 辽宁中医药大学学报, 2019, 21(5): 187-190.
- [119] 斯红英. 六味木香胶囊治疗慢性胃炎 60 例临床观察 [J]. 江西中医药, 2005, 36(5): 21.
- [120] 马素娟. 木香散敷脐治疗腹胀 80 例 [J]. 中国民间疗法, 2004, 12(5): 32.
- [121] 崔虎军. 木香顺气丸治疗恶性腹腔积液腹胀的临床研究 [J]. 中医学报, 2012, 27(8): 999-1000.
- [122] Ansari S, Siddiqui M A, Maaz M. Hepatocurative effect of *Saussurea lappa* C. B Clarke and *Artemisia absinthium*, Linn in chronic hepatitis B [J]. *J Young Pharm*, 2018, 10(3): 354-357.
- [123] 黎成贵, 陈辉, 何柳荫. 木香槟榔莪朮汤加红外肝病治疗仪治疗肝炎肝硬化的疗效观察 [J]. 湖北中医杂志, 2015, 37(4): 14-15.
- [124] Jani D P, Patel B R. A clinical evaluation of kushtha (*Saussurea lappa*. -C. B. Clarke.) on Shukradushti w. s. r. to seminal parameters and sexual health parameters [J]. *Int J Ayu Pharm Chem*, 2015, 2(3): 11-22.
- [125] 王红兵, 秦国伟. 风毛菊属植物的化学成分和生物活性 [J]. 国外医药: 植物药分册, 2005, 20(2): 47-52.
- [126] 陆锦池, 陈荣山, 刘长辉, 等. 浅述植物萜类物质的生物合成途径 [J]. 农业科技通讯, 2009(3): 78-80.
- [127] 饶文霞, 张开元, 尹显梅, 等. 不同产地木香中两种倍半萜内酯的含量测定 [J]. 中药与临床, 2016, 7(5): 13-15.
- [128] 王永兵, 许华, 张玉凤, 等. 木香药材的质量评价研究: HPLC 法测定木香中 2 种倍半萜内酯的含量 [J]. 药物分析杂志, 2000, 20(6): 366-368.
- [129] 冯科冉, 李伟霞, 王晓艳, 等. 丹参化学成分、药理作用及其质量标志物(Q-Marker)的预测分析 [J]. 中草药, 2022, 53(2): 609-618.
- [130] 王花, 汪海英. 中医基础理论与适宜技术 [M]. 西安: 第四军医大学出版社, 2015: 13.
- [131] 傅睿. 中药药性理论辛味功效及物质基础研究思路初探 [J]. 亚太传统医药, 2014, 10(9): 55-56.
- [132] 吴文博. “苦”味药三大功效分析 [N]. 中国中医药报, 2018-3-7(4).
- [133] 吴安芝, 张引拖. 论述苦味药的药性特征及其配伍作用 [J]. 内蒙古中医药, 2011, 30(7): 85-86.
- [134] 周复辉, 易增兴, 罗亨凡. 辛味中药化学成分的分析 [J]. 安徽农业科学, 2006, 34(12): 2760.
- [135] 蒋健. 木香槟榔丸临床运用发挥 [J]. 福建中医药, 2008, 39(6): 40-41.
- [136] 伏光耀, 张小龙, 陈洪岩. LC-MS/MS 法测定木香槟榔丸中 7 个有效成分的含量 [J]. 药学与临床研究, 2021, 29(4): 263-266.
- [137] 蔡威, 陈文莉, 付会玲. 木香顺气丸对尿毒症前期患者消化功能紊乱的影响及机制研究 [J]. 中国中西医结合杂志, 2017, 37(1): 34-38.
- [138] 刘斯颖, 杨岚, 王丽峰. 木香顺气丸联合芒硝外敷治疗宫颈癌术后胃肠功能障碍 43 例临床观察 [J]. 中国民族民间医药, 2021, 30(17): 99-101.
- [139] 曹瑞竹. 木香顺气丸 HPLC 特征指纹图谱研究及多成分含量测定 [J]. 药物分析杂志, 2017, 37(6): 1127-1134.

[责任编辑 时圣明]