

白屈菜提取物对大鼠离体灌注 肝脏胆汁分泌的作用

白屈菜 *Chelidonium majus* 是具有止痛、镇痉、利尿和利胆作用的药用植物,临床报道它能增加十二指肠管中的胆汁流量并有效治疗多种肝胆管疾病。但是研究人员用不同的动物进行试验却出现不一致的结果。作者用大鼠离体灌注肝脏模型来测试白屈菜提取物的 3 个组分:总提取物(I),酚性组分(II)和生物碱组分(III)的利胆活性。

向灌注介质中加入白屈菜 I,发现胆汁流量较处理前值明显增加,40min 后翻了一番多,停止加入后胆汁流量立即降低,30min 后回到处理前值。整个过程中胆酸含量却显著降低,因此胆酸产物不受加入提取物的影响。组分 II、III 及二者合并均可使胆汁流量较处理前值稍有增加,分别为 6%,10%和 20%,且胆酸含量均显著降低,胆酸产物不受这些加入组分的影响。实验排除了胆道 Oddi 括约肌对胆汁流量的影响和生物碱的解痉作用,表明白屈菜 I 是通过增加胆酸非依赖性胆汁流量而产生利胆作用的,且利胆作用是由 I 产生而不是由其中 I 个或 2 个主要成分引起。

(奉意端摘译 史玉俊校)

[Planta Med 1995,61(3),267]

锡生藤属 *Cissampelos sympodialis* Eichl 根的醇水提取物对豚鼠气管条和 支气管肺泡白细胞的作用

防己科锡生藤属 *Cissampelos sympodialis* Eichl 是一种匍匐植物,多生长于潮湿地带,如在巴西东北部的河边分布多而广,其根部的水浸液用于治疗气喘、关节炎、支气管炎和尿路感染。本文对其水溶性部位的药理作用作了研究。

取药材根部,40℃烘干,室温下 25~30℃以 70%乙醇水溶液浸取 3d,浸液 60℃减压干燥至恒重,得率 19.0%。将粗提取物溶于水,过滤,提纯率为 69%~70%。

进一步的药理实验表明:水溶性部位能可逆地降低豚鼠气管条的自发张力状态,并能抑制由次高

浓度(最高浓度的 60%~70%)的碳酸胆碱(carbachol)、组胺、前列腺 F_{2a}和 P 物质引发的豚鼠气管收缩,该水溶部位的 IC₅₀值根据所用的激动剂在 13.9~95.5μg/ml 范围内变动,它能松弛由气喘内源介质引起的豚鼠气管收缩,表明水溶部位是气管收缩的拮抗剂。此水溶提取物与标准药物氨茶碱有近乎同等的功效。当提取物的浓度为 1~100μg/ml 时,还能提高豚鼠支气管肺泡白细胞的细胞内环腺苷酸(cAMP)水平。*C. sympodialis* 具有较强的松弛平滑肌和改善支气管肺泡白细胞代谢等作用,这种联合功能为该植物治疗气喘的临床应用提供药理基础。确证该部位在整体动物中的作用和活性成分的分离正在进行中。

(徐汝明摘译 陈泽乃校)

[Phytotherapy Res 1995,9:473]

抗哮喘和抗炎药物夹竹桃麻素 和乙酰丁香配基的基因毒性效应

4-羟基-3-甲氧基苯乙酮,俗称夹竹桃麻素(apocynin),是从生长在喜马拉雅山地区海拔 3000m 以上的药用植物胡黄连 *Picrorrhiza kurrooa* Royle ex Benth. 根部分得的一种活性成分,能抑制炎症介体血栓素 A₂ 的释放和中性白细胞超氧化物的产生,因而具有抗炎作用。3,5-二甲氧基-4-羟基苯乙酮,即乙酰丁香配基(acetosyringenin)是其甲氧基化的半合成衍生物,具有高度的镇喘作用,用豚鼠体积描记法与其它苯乙酮类化合物比较,是抑制支气管收缩活性最强的一个化合物。

本文以鼠伤寒杆菌 *Salmonella typhimurium* 菌株 TA97,TA98,TA100 和 TA102 在含和不含有鼠肝脏匀浆情况下,进行 Ames 试验,分析其突变性。结果表明,无论是否通过代谢活化,夹竹桃麻素和乙酰丁香配基均不显示突变性,但高浓度时在某几个实验株中两者可呈毒性,组氨酸原营养性细菌的菌落细小或所有细菌死亡。以人体的外周淋巴细胞进行体外姐妹染色体丝交换(SCE)试验,显示每次有丝分裂,二者均不明显增加 SCE 数目,试验中二者剂量可增加至使增生指数明显下降,高剂量时将抑制淋巴细胞的生长以至细胞死亡。

被试的苯乙酮类化合物在 Ames 试验中均不增

加回复体数目,在 SCE 试验中,其 SCE 数目也均未超过自发水平,此结果与以前的研究一致。

实验结果表明,至今尚未得到夹竹桃麻素与乙酰丁香配基具有基因毒性的任何证据。

(严忠红摘译 陈泽乃校)

[Phytomedicine 1995,4:319]

植物中的苯乙酮化合物对体外中性白细胞呼吸爆发活力的抑制效应

从喜马拉雅地区的一种带有块茎的植物胡黄连 *Picrorrhiza kurroa* 中曾分离得到苯乙酮葡萄糖甙 androsin,该化合物及其相应的糖甙配体磁麻脂 (apocynin)对过敏源和由 PAF 诱导的支气管收缩显示了强烈的抑制作用;对 androsin 和磁麻脂进行

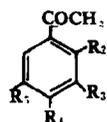


图 苯乙酮衍生物的结构

化学修饰所得的一系列苯乙酮衍生物对防止豚鼠的支气管阻塞更有效。本文作者研究了 19 种不同取代的苯乙酮的衍生物在体外对由 N-乙酰甲硫氨酸亮氨酸苯基丙氨酸 (FMLP) 刺激人体多型核中性白细胞释放超氧阴离子 (O_2^-) 的抑制作用。

研究表明:1)磁麻脂 ($R_2 = R_5 = H, R_3 = OCH_3, R_4 = OH$) 和 4-羟基乙氧基-3-甲氧基苯乙酮具有几乎完全的抑制活性 ($100\mu\text{mol/L}$)。2)云杉苷 (picein, $R_2 = R_3 = R_5 = H, R_4 = O-\beta\text{-D-Glc}$) 因 C_3 上无甲氧基几乎无活性。乙酰丁香配基 (acetosyringenin, $R_2 = H, R_3 = R_5 = OCH_3, R_4 = OH$) 因比磁麻脂在 C_5 多了一个甲氧基而使活性降低 50%。3)2,4-二羟基-3-甲基-苯乙酮与芍药酮 (paeonol, $R_2 = OH, R_3 = R_5 = H, R_4 = OCH_3$) 相比,虽然 C_3 的取代不同,但两者的活性相同;而前者比磁麻脂的活性降低 28%~31%,磁麻脂的 5-氯(或溴)的衍生物活性显著降低。如苯乙酮衍生物的乙酰基被醛基代替活性约降低 50%。总之,上述苯乙酮衍生物中 R_4 为羟基或乙氧基, R_3 为甲氧基或甲基是其具有抑制中性白细胞释放超氧阴离子活性的结构特征。而 $R_3 = H$ 时,苯乙酮衍生物不显活性或仅显弱活性。此外苯乙酮衍生物 C_4 的 OH 如与葡萄糖成甙则相应的活性

降低 50%。作者还测试了一些不同浓度苯乙酮衍生物的抑制活性,表明抑制活性与浓度有关。

(刘慧中摘译 陈泽乃校)

[Phytomedicine 1995,4:283]

棉叶麻疯树及王不留行对淡水螺——血吸虫宿主的毒性

血吸虫病是一种人畜共患的疾病。许多种淡水螺在这一疾病传播途径中充当中间宿主的角色。消灭淡水螺是控制血吸虫病行之有效的途径。含皂甙的植物曾被报道有抗螺活性,因此作者对含皂甙的棉叶麻疯树 *Jatropha gossypifolia* 及王不留行 *Vaccaria pyramidata* 进行了抗螺活性及其对非螺生物毒性的研究。

棉叶麻疯树及王不留行的阴干种子以 MeOH 提取。提取物用水溶解后分别以 n-BuOH 及 MeOH 提取。得提取物,备用。所用淡水螺为 *Indoplanorbis exustus* 及 *Lymnaea luteola*,非螺生物为淡水鱼 *Rasbora daniconius*,蜻蜓蛹 *Pentala flavescens*,蜉蝣 *Ephemera vulgata*。将 n-BuOH、MeOH 提取物配成 10~50mg 不同浓度的溶液,将上述实验动物及螺卵在各浓度的溶液中放养 24h,再移到清水中,其中非螺动物只在 n-BuOH 提取物中放养且淡水鱼放养时间为 96h。观察、记录动物死亡率,抗螺实验的 LC_{50} 及 LC_{90} ;安全性评价以非螺生物的 LC_{10} 同抗螺 LC_{90} 的比值作为指标。同时在 pH5.5、6.5、7.5、8.5 及 9.5 及配以 100mg/L 酵母进行了上述实验。

结果表明:棉叶麻疯树的抗螺活性比王不留行高;n-BuOH 提取物活性高于 MeOH 提取物。两种植物的 n-BuOH 提取物对非螺生物的安全性高出对螺的倍数。棉叶麻疯树对鱼、蜉蝣蛹和蜻蜓分别为 7.33、2.31 和 4.90 倍;而王不留行则为 2.68、0.49 和 1.35 倍。由此计算出棉叶麻疯树对鱼的 LC_{90} 为 705mg/L,王不留行为 1854mg/L。此外,pH5.5~7.5 时对作用无影响,碱性更高时,活性有所减弱;酵母存在与否对活性无影响。棉叶麻疯树因其对淡水螺的高毒性及对其它非螺生物的高安全性而可作杀螺剂使用。其所含皂甙可能是活性成分。

(高永莉摘译 史玉俊校)

[Fitoterapia 1995,66(5):393]