

本研究选用能引起细胞明显中毒的大剂量(40 $\mu\text{g}/\text{ml}$)对AM处理后,见到此剂量下的汉甲能明显阻抑AM的吞噬功能,使细胞吸附酵母的能力大大降低,严重扰乱了细胞内环境渗透压的平衡,使胞内 Ca^{2+} 激增,而 K^{+} 骤降,高度损伤细胞对骨架修饰调控的能力,使细胞骨架网络丧失率明显下降。本文中汉甲对细胞功能和形态的毒性作用与文献报道是一致的。

近年来,随着制剂技术的革新,出现了新的释药系统,脂质体就是其中之一。它能将药物包裹起来,通过细胞的内吞、融合、吸附和脂质交换的作用特点,使药物具有能使用最小剂量,降低到最小副作用,而发挥最大疗效的优点[6],本研究结果表明,脂质体能将汉甲包裹而成为汉甲的药物载体。并发现,制备而成的汉甲多相脂质体可以明显减轻原有游离汉甲的细胞毒性。脂质体包裹后,改善了汉甲对细胞吞噬功能的影响,使细胞对酵母的吸附率明显增加,削弱了汉甲对细胞内环境渗透压的扰乱,使细胞 K^{+} 明显回升,而 Ca^{2+} 明显返落,并减轻了汉甲对细胞骨架修饰调控能力的损伤,使细胞骨架网络丧失率明显下降。

总之,用脂质体作为汉甲的药物载体,能明显减轻汉甲原有的细胞毒性。这对解决目前汉甲治疗矽肺中出现较严重的组织细胞毒性作用具有重要意义,是一项具有实用价值的新尝试。汉甲脂质体到达机体后是否能保持汉甲对矽肺的疗效,而又明显降低对肝、肾等组织细胞的毒性,我们的动物实验也取得了阶段结果(另文),值得进一步探讨。

参 考 文 献

- 1 杨赛丽,等. 浙江医科大学学报, 1990, 19 (4): 164
- 2 Penal S D J. Cell Biology Interational Reports, 1980, 4(2): 149
- 3 陈宁蒙,等. 卫生研究, 1984, 13(5): 5
- 4 陈宁蒙,等. 卫生研究, 1986, 15(6): 7
- 5 泮竞生,等. 北京医科大学学报, 1987, 19 (3): 177
- 6 林东海,等. 沈阳药学院学报, 1988, 5(3): 217
- 7 洪巨伦,等. 中国药理学报, 1989, 10(6): 533
(1994-09-19收稿)

越桔叶中熊果甙的分离与鉴定

黑龙江中医学院(哈尔滨 150040)

马英丽 田振坤 郭桂彬* 王 刚

越桔叶为杜鹃花科植物越桔 *Vaccinium vitidacea* L. 的叶, 异名“熊果叶”。近年来临床上将其做成制剂治疗气管炎和肺心病。发现具有较好的镇咳和平喘作用(王刚. 全国第一届中西医结合呼吸病学术交流会论文汇编. 1987. 42) 化学成分预试, 越桔叶含有甙, 黄酮, 鞣质等成分。我们对其甙类成分进行分离得一白色针晶, 经鉴定为熊果甙(arbutin)。文献[张银娣. 药学学报, 1982, 17(12): 16]报道, 它具有镇咳作用。

1 提取和分离

取干燥越桔叶(采自黑龙江省大兴安岭, 经本院中药系王迪副教授鉴定)粗粉, 用乙醇回流提取2次, 每次2h, 提取液减压回收乙醇, 浓缩至膏状, 加水溶解, 滤除水不溶物, 用乙酸乙酯萃取4~5次, 将萃取液合并, 浓缩, 得萃取物用甲醇溶解, 拌入

聚酰胺粉20g, 经低压聚酰胺柱依次用不同浓度的乙醇洗脱, 得4个部分。将75%乙醇洗脱部分再经硅胶柱分离, 用氯仿-甲醇-水(80:18:2)洗脱, 得白色结晶, 用无水乙醇重结晶。

2 鉴定

白色针晶, mp 198~200°C, Molisch反应阳性, 与 α -萘酚浓 H_2SO_4 反应在溶液界面出现紫色环。与 FeCl_3 试剂呈淡蓝绿色。将结晶溶于无水乙醇中, 加醇性KOH出现白色沉淀。以上化学反应提示此化合物为酚甙类。UV入 $\frac{\text{MeOH}}{\text{MeX}}$ nm: 225, 828; IR $\nu_{\text{max}}^{\text{KBr}}$ cm^{-1} : 1220 (C-O-C), 1480, 1520 (苯环), 2875, 2950 (CH), 3354 (-OH)。MSm/z: 272 (M^+), 主要碎片峰162 (糖基)。由UV, IR及MS等光谱可知该化合物基本母核为苯环, 加上主要碎片峰质量162, 239。用分子离子

(下转第485页)

* 本院中药系87届毕业生

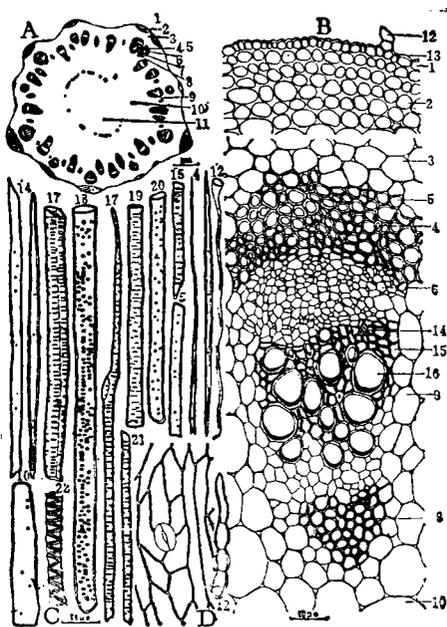


图1 日本藜苳

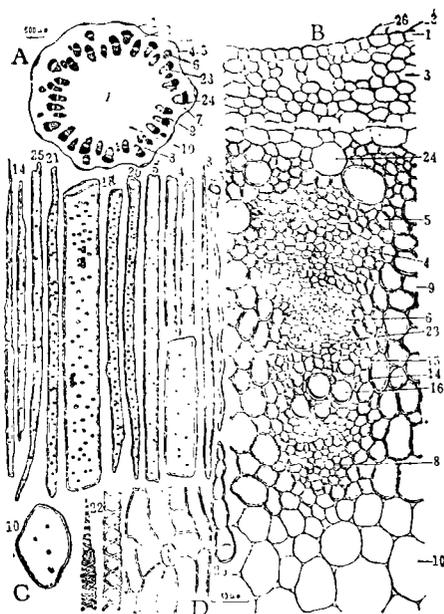


图2 中国藜苳

A-横切面简图 B-横切面详图 C-解离组织 D-表皮表面观

- 1-表皮 2-厚角组织 3-皮层 4-韧皮纤维 5-木化韧皮薄壁细胞 6-韧皮部 7-木质部 8-纤维 9-射线
 10-髓或髓细胞 11-空隙 12-非腺毛 13-角质层 14-木纤维 15-木薄壁细胞 16-导管 17-梯纹导管
 18-具缘纹孔导管 19-网纹导管 20-孔纹导管 21-管胞 22-螺旋导管 23-形成层 24-分泌道
 25-纤维管胞 26-非腺毛

圆钝或平钝，壁厚 $1.4\sim 3.4\sim 6\mu\text{m}$ ，具缘纹孔导管分子末端有短尾突或呈长尾状；孔纹导管分子有的末端呈长尾状。有韧型纤维和纤维管胞。

髓占横切面的 $3/5$ 。

(1994-03-25收稿 1995-05-14修回)

(上接第472页)

峰272减去239为34的碎片。从化学反应可知此化合物含酚羟基，推测苯环上应含有2个酚羟基(34)。

$\text{HNMR}(\text{DMSO}-d_6)$: $\delta 3.26\sim 3.64$ (m, 糖上H), 5.80 (1H, d, 糖 $\text{C}_1\text{-H}$), 6.42 (2H d, $J=8\text{Hz}$), 6.80 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 示苯环上存在 A_2B_2 系统的4个质子，苯环为对位取代， 8.82 (1H, s, 酚OH质子)，推测此化合物为对苯二酚与1分子葡萄糖生成的甙。

将结晶 0.5g 加 $1\text{mol/L H}_2\text{SO}_4$ 20ml ，回流 6h 冷后，乙醚萃取4次，合并醚液水洗至中性，无水 Na_2SO_4 脱水，挥去乙醚后，加少量氯仿，放置得白色晶形，与分析纯对苯二酚做对照TLC两者比移

值一致，与对苯二酚混合熔点不下降，上述水解液所得酸液用 BaCO_3 中和过滤，浓缩后做糖的样品溶液，在纸层析分离后〔正丁醇-冰醋酸-水(4:1:5) (上层)〕，用 0.1mol/L AgNO_3 + 10% NH_4OH (1:1) 显色，加热 $50\sim 60^\circ\text{C}$ ，呈现棕色斑点，比移值与葡萄糖一致。

综上所述，此化合物为对苯二酚单葡萄糖甙，与文献〔续俊文，贵州医药，1978，12(8):26〕报道熊果甙(arbutin)完全一致。

致谢：质谱，核磁共振谱由军事医学科学院代测。

(1994-01-31收稿)