

定 NO 合酶的活性,实验表明脂多糖浓度范围在 0.1~1ng/ml 就足以明显引发 NO 合酶的活性,因此,此试验系统在原理上能检出处于该浓度水平的任何内毒素污染,除非被测物中存在具有相似活性的或干扰作用的某一成分。以上结果为测定植物药的此类污染提供了- 种简便、可靠和灵敏的方法。

(刘惠中摘译 陈泽乃校)

[Phytomedicine 1995,2(2):133]

通过黄芪、人参和黄芩水提取物的处理增加血管平滑肌细胞中 NO 合酶和环磷鸟苷

作者研究了黄芪、人参和黄芩的水提物诱导培养的血管平滑肌细胞(VSMC)中 NO 合成的机理。Northern blot 分析表明,以水提取物处理导致 VSMC 中的诱导 NO 合酶(iNOS)基因转录的增加。免疫组织化学和免疫斑点证明,在以水提物处理后 VSMC 中 iNOS 蛋白质显著增加。

内皮衍生的 NO 松弛 VSMC 并抑制血小板的粘附和聚集的作用来自于它具有活化可溶性鸟苷酸环化酶(sGC)的能力,从而增加细胞内的环磷鸟苷(cGMP)。实验证明:用该水提物处理后,VSMC 中发生依赖于 NO 的 cGMP 的累积。因此,黄芪、人参和黄芩水提物调节 VSMC 细胞功能是经由 NO-sGC-cGMP 介导的信号转换通道的。

将生药切成小片,悬浮于 20 倍体积的蒸馏水中,徐徐煮沸,直至溶液体积减至一半,提取物趁热过滤,冻干。冻干的提取物重新悬浮于蒸馏水中,浓度为 20mg/ml,得贮备液。本法水提物的收率(%生药干重):黄芪 22,人参 22,黄芩 20。

将细胞植入 48 孔板用于 cGMP 定量或植入 6 孔板用于 RNA 制备,细胞密度为 6×10^5 /ml。处理前预培养 24h。处理时,细胞通过在培养液中加入浓贮备液,每一种生药提取物处理 24h,其剂量为黄芪

和人参各 500 μ g/ml,黄芩 100 μ g/ml。在所有生药提取物的培养液中培养 24h 后,分析细胞的 iNOS 蛋白质,iNOS mRNA 和 cGMP 细胞内水平。

(新朝东摘译 刘德延校)

[和汉医药学杂志 1995,12(1):38]

一些新植物成分抑制 HIV-1 逆转录酶的机理评价

从獐牙菜中分离出一种新的二氢黄酮-咕吨酮 swertifranchoside(I),从 *Maprounea africana* 根中分离出一种三萜 1 β -hydroxyaleuritic acid 3-*p*-hydroxybenzoate(II)及从冰岛衣 *Cetraria islandica* 中分离出一种脂肪族原苔甾酸(protolichesterinic acid,III),均被证实是 HIV-1 逆转录酶(HIV-1 RT) DNA 聚合酶活性的强抑制剂,IC₅₀分别为 43,3.7 和 24 μ mol/L。它们对哺乳动物培养细胞无细胞毒作用。化合物 I~III 的活性研究表明,其作用途径可能是通过抑制核酸聚合酶而抑制 HIV-1 RT。

实验结果表明,I~III 具有潜在的抑制核酸聚合酶的活性,对 RNA 聚合酶的影响最小。I 对其它聚合酶如 HIV-1 RT、HIV-2 RT、AMV RT、DNA 聚合酶抑制效果相近;II 对 HIV-1 RT 和 DNA 聚合酶 β 有强抑制作用;III 对 DNA 聚合酶 β 的抑制作用最强,对其它聚合酶的 IC₅₀在 20~30 μ mol/L 范围内。

与从植物中分离出的其它次级天然产物相比,I~III 对 HIV-1 RT 抑制则较明显,同时,对一些培养的哺乳动物细胞无细胞毒性。I 连接 DNA,对模板-引物为竞争抑制剂,而对底物(TTP)为混合型竞争抑制剂。II 和 III 是混合型模板-引物竞争抑制剂,对 TTP 为非竞争抑制剂。它们在底物链(核苷酸链)位置或模板-引物链位置无特异性作用。

(张忠诚摘译 刘 湘校)

[J Nat Prod 1995,58(7):1024]

欢迎订阅《国外医药·植物药分册》杂志

《国外医药·植物药分册》是国家医药管理局主管、国家医药管理局中药药信息中心站主办、国家医药管理局天津药物研究院出版、经国家科委和新闻出版署批准的国内外公开发行的国家级医药科技期刊。主要报道国外植物药研究、生产的先进技术和经验,以利于我国大医药(医药、兽药、保健食品、调料、饲料、化妆品等)的开发。本刊无征订截止日期,随时可以订阅。订阅者请向本刊发行部索取订单。地址:300193 天津市鞍山西道 308 号《国外医药·植物药分册》发行部。