

## 大黄素在兔体内的药动学

大黄素存在于虎杖、大黄、首乌、决明子等多种中草药中,有抗癌、抗菌、利尿、免疫抑制和舒张血管作用,也有致突变的报道。本实验用 HPLC 法测定大黄素在兔体内的绝对生物利用度和蛋白结合率。

将 2~3kg 重雄性新西兰大白兔分为 2 组,每组 6 只,给药前 24h 禁食,照常饮水,肌注开他敏(ketamine)20~40mg/kg 镇静,胃内容物用 37℃ 生理盐水冲洗,在下午 6 时给动物戴上口罩以防出现“食秽”行为。药液临时配制:准确称取大黄素,溶于 5~10 滴 1mol/L NaOH 中,用 0.1mol/L HCl 调 pH 为 10,0.2 $\mu$ m 膜滤过得注射液,口服液不必滤过。固定动物,一组左耳静脉注射(10.0mg/kg);另一组用硅管向胃内灌注(10.0mg/kg),同法饲以 30g 流食。用静脉导管从右耳采血 1.5ml,为静脉注射后 5、10、20min 等共 14 次;口服后 15、30、45min 等共 14 次,离心 30min,分离血清,于 -20℃ 保存。

蛋白结合实验在 37℃ 水浴中以平衡透析法进行,24h 达到平衡。测得大黄素与血清蛋白的结合率为 99.6%。

20 $\mu$ l 血清用含有 15.6 $\mu$ g/ml 内标(2-甲基-蒽醌)的乙腈 600 $\mu$ l 进行去蛋白、离心,收集上清液,必要时可吹氮气加以浓缩。取 20 $\mu$ l 注入 HPLC 柱,流动相:乙腈-2%乙酸(73:27 v/v),流速 0.9ml/min,280nm,用 Pcnonlin 法分析得出药动学参数。

结果表明,大黄素药动学特性在兔体内存在较大个体差异。口服给药时吸收速度和吸收度均很低,表明绝对生物利用度很低。原因之一可能是由于大黄素为酸性化合物,微溶于水,在胃内溶解度很低;肠道中高 pH 环境有助于大黄素离子化,但形成的离子却难以吸收。另一原因可能是首过效应。

(王宗伟摘译 史玉俊校)

[Planta Med 1995,61(5):406]

## 无花果树叶水提物对链脲霉素诱发糖尿病大鼠血糖平衡的作用

在西班牙的 Extremadura,民间用无花果 *Ficus carica* 叶煎剂治疗糖尿病。本文报道无花果叶抗糖尿病作用的研究结果。

使用 Wistar 成年雌性大鼠(200~250g),通过腹腔注射链脲霉素(streptozotocin,80mg/kg 体重)枸橼酸盐缓冲液(pH4.5),诱发建立糖尿病模型。取干燥无花果叶 100g,加 900ml 水煮沸 30min,过滤得煎剂,将之分成 9 份,每天 1 份代替水喂饲糖尿病或非糖尿病大鼠,食物和流质随意供给。每周测定体重和血液葡萄糖水平,每月测定血浆胰岛素水平。为了检测无花果的快速降血糖作用,还测定了腹腔注射 3 IU 胰岛素,或腹腔同时注射胰岛素和无花果水提物后的血糖变化。该实验是以长期给药组或对照组进行的。给药后 0、30、60、120min 及 24h 经尾部静脉切口各取 1 次血样。数据分析用 Manova 和 Kruskal-Wallis 方法, $P < 0.05$  认为有效。

结果:糖尿病大鼠口服或腹腔注射无花果水提物都有明显降血糖作用,以腹腔注射反应较快,但在 90min 时两者下降水平相同。胰岛素加无花果水提取物的实验表明,胰岛素的作用不仅没有因加用无花果水提取物而加强,似乎反被抑制,而且当胰岛素作用消失后,无花果水提取物的活性尚能继续 24h。

结论:无花果水提取物对糖尿病大鼠具有明显的降血糖作用。由于无花果水提取物不能增强胰岛素的作用,也不可能增加胰岛素的释放,因此无花果水提取物中可能存在一种胰外活性物质,作用机理尚未阐明。

(张 敏摘译 陈泽乃校)

[Phytother Res 1996,10:82]

## 安徽省高校科技函授部中医函授大专班招生

为继承和发展祖国医学,给有志于中医事业者开辟自学成才之路,经省教委批准继续面向全国招生。使用全国统编教材,确保大专水平。根据高教自考规定,开设十二门中西医课程。各科均由著名专家教授全面辅导教学。高中或初中以上文化程度均可报名。来函至 236000 安徽阜阳高函办《总部招生办》即寄简章。