

Pharmacological Effects of A New Anti-inflammatory

Constituents in Spanishneedles (*Bidens bipinnata*)

Wang Jianping, Zhang Huiyun, Qin Xongyan, et al

Bipinnatpolyacetylenic loside—a new natural constituent isolated from *Bidens bipinnata*, produced significant inhibitory effects on swelling of mice ear induced by croton oil and hind paw edema induced by egg white, decreased the weight of cotton pellet granuloma implanted in rats, and also greatly inhibited blood capillary permeability of mice and leukocyte movement induced by acetic acid in rats. Compared with that of dexamethasone, no significant difference and even slightly more potent effects were observed. The flavones in *B. bipinnata* also exhibited better anti-inflammatory effects.

十滴水软胶丸药效学和毒性研究

广东药学院药理教研室(广州 510224) 谭毓治*

江西省中医药研究所(南昌 330006) 赵诗云

江西德兴制药厂 彭宏俊

摘要 十滴水软胶丸具有显著的镇痛和抑制胃肠运动的作用;对经受高温的动物有显著的保护作用和促进恢复作用。十滴水软胶丸小鼠口服 LD_{50} 为 4833.2 ± 26.7 mg/kg。

关键词 十滴水软胶丸 镇痛 胃肠运动 抗高温 LD_{50}

十滴水软胶丸系根据《中华人民共和国卫生部药品标准——中药成方制剂》所载的中成药“十滴水”经改进剂型,研制而成的中药新药,具有健胃驱风之功能,用于因中暑而引起的头晕,恶心,腹痛,胃肠不适等症。根据其主治作用,我们对其药效学和毒性进行了研究,并与十滴水进行了比较。

1 实验材料

1.1 药物:十滴水软胶丸(以下简称“软胶丸”),由江西德兴制药厂提供,批号 921211。其内容物每毫升含 1.075 g 生药。系食用茶油配制的中药提取物混悬液。十滴水,江西南昌建新制药厂产品,批号为 920305,每毫升含 0.1075 g 生药。

1.2 动物:昆明种小鼠,18~20 g, Wistar 大鼠,150~200 g,均雌雄兼用。以上动物均由江西省医学实验动物中心提供。

2 方法和结果

2.1 镇痛作用

2.1.1 扭体法^[1]:小鼠 40 只,随机分成 4 组。各鼠分别灌服供试液,30 min 后,腹腔注射 0.6% 醋酸液 0.2 mL/只,观察 30 min 内出现的扭体反应次数,以及出现扭体反应的时间,并计算镇痛百分率。结果见表 1。十滴水及软胶丸对醋酸腹腔注射引起的疼痛有显著的镇痛作用。

表 1 软胶丸对小鼠的镇痛作用(扭体法)

组别	鼠数	剂量 (mg/kg)	扭体出现时间 (min)	扭体次数	镇痛率 (%)
生理盐水	10	—	4.0±1.7	31.8±9.3	
软胶丸	10	108	7.5±2.0**	14.9±11.0*	53.1
软胶丸	10	54	6.5±2.8*	15.7±4.2**	50.6
十滴水	10	108	6.8±2.7*	18.0±10.0*	43.4

与生理盐水比较 * $P < 0.05$ ** $P < 0.01$ (下同)

2.1.2 热板法^[2]:取 18~20 g 雌性小鼠,调节超级恒温水浴水温在 55 ± 0.5 °C,每次取小鼠 1 只,放在金属板上,测其痛阈,取预选

* Address: Tan Yuzhi, Dept. of Pharmacology, Guangdong Pharmacy College, Guangzhou

合格的小鼠 40 只,随机分成 4 组,先测给药前痛阈值(两次平均),然后,分别口服供试液,于给药后 15、30、60、90 min,测定各鼠痛阈值。并计算用药后痛阈提高百分率。

表 2 软胶丸的镇痛作用(热板法)

组别	鼠剂量 (mg/ kg)	给药 前痛 阈值(s)	给药后痛阈值(s)				痛阈提高百分率(%)				
			15 min	30 min	60 min	90 min	15 min	30 min	60 min	90 min	
生理盐水	10	—	14.0±4.0	11.9±2.6	0.2±3.5	12.0±2.7	11.8±2.3	-15.0	-12.9	-14.3	-15.7
软胶丸	10	108	13.7±2.6	20.6±4.9**	17.7±3.3**	16.8±3.0**	14.2±2.4*	50.4	29.2	22.6	3.6
软胶丸	10	54	13.1±2.4	15.5±2.3*	14.9±1.4	13.7±2.1	11.9±1.8	18.3	13.7	4.6	-9.2
十滴水	10	108	14.0±2.8	17.2±3.1**	16.0±1.8*	14.5±2.3*	13.2±2.2	22.9	14.3	3.6	-5.7

体重 18~20 g,雌雄兼用。随机均分 4 组,灌服供试液 30 min 后,每鼠灌胃 0.2 mL 0.1% 甲基橙水溶液,20 min 后处死,取出胃置试管中,加蒸馏水至 10 mL,剪开胃,将胃中残留的甲基橙溶出。调 pH 至 6.0~6.5,离心,取上清液,在 λ=420 nm 处测定吸收度。并以 0.1% 甲基橙 0.2 mL,加 9.8 mL 蒸馏水的吸收度作基数,计算各组小鼠胃中甲基橙残留率(甲基橙残留率(%)=样品吸收度/基数吸收度×100%)。结果见表 3。十滴水及软胶丸大剂量组对小鼠胃排空呈显著抑制作用。

表 3 十滴水软胶丸对小鼠胃排空的影响

组别	鼠数	剂量(mg/kg)	甲基橙残留率(%)
生理盐水	10	—	39.7±6.5
软胶丸	10	108	47.7±8.2*
软胶丸	10	54	43.3±8.5
十滴水	10	108	48.1±7.0*

2.2.2 对正常小鼠小肠运动的影响:小鼠 40 只,随机均分 4 组,按常法观察供试药物对小鼠小肠运动的影响(炭末法)^[4],结果见表 4。十滴水及软胶丸对小鼠小肠运动呈非常显著的抑制作用。

表 4 软胶丸对小鼠小肠运动的影响

组别	鼠数	剂量(mg/kg)	炭末推进率(%)
生理盐水	10	—	80.5±6.8
软胶丸	10	108	66.3±8.2**
软胶丸	10	54	70.0±9.6*
十滴水	10	108	67.4±7.2**

2.2.3 对小鼠小肠运动亢进和抑制模型的影响:为了观察软胶丸对不同机能状态下小肠运动的影响,分别观察了软胶丸对新斯的

明所致的小肠运动亢进模型及阿托品所致小肠运动抑制模型的影响^[5],结果表明,不管小鼠小肠运动的状态如何,软胶丸及十滴水均表现为抑制小肠运动的作用。

2.2 对胃肠运动的影响

2.2.1 对小鼠胃排空的影响^[3]:小鼠 40 只,

十滴水及软胶丸大剂量组均能显著提高小鼠对刺激的痛阈。

2.3 对经受高温的动物的影响

2.3.1 对经过高温的小鼠的保护作用^[6]:小鼠 80 只,雌雄各半,将恒温箱温度调节于 46±1℃,置小鼠于恒温箱内 35 min,取出后随机分 4 组,每组 20 只,分别灌服供试液,观察各组小鼠 24 h 存活数。结果见表 5。十滴水及软胶丸对经受高温的小鼠有显著的保护作用。

表 5 软胶丸对经受高温小鼠的保护作用

组别	鼠数	剂量(mg/kg)	24 h 存活数
生理盐水	20	—	8
软胶丸	20	108	20**
软胶丸	20	54	18*
十滴水	20	108	18*

2.3.2 对经受高温大鼠肾小腺 Vc 含量的影响^[6]:取 Wistar 大鼠 40 只,雌雄各半,置 45℃ 烘箱中保温 30 min,取出,随机均分 4 组,分别灌服供试液,30 min 后处死大鼠,测各鼠肾上腺 Vc 含量,结果见表 6。

表 6 软胶丸对经受高温大鼠肾上腺 Vc 含量的作用

组别	鼠数	剂量(mg/kg)	肾上腺 Vc 含量(μg/100mg)
生理盐水	10	—	169±17
软胶丸	10	108	21.2±2.5**
软胶丸	10	54	196±18**
十滴水	10	108	202±19**

十滴水及软胶丸能使经受高温的大鼠肾

上腺 Vc 含量显著提高。

2.4 软胶丸急性毒性试验:小鼠口服急性毒性试验表明:小鼠给药后,活动增加,兴奋、狂燥,惊厥。经观察和病理切片光镜检查证实,死亡小鼠的死因为呼吸功能衰竭。按 Bliss 法计算,软胶丸小鼠口服 LD₅₀为 4833.1±26.7 mg/kg,相当于成人一次用量的 450 倍。表明该药毒性小。

3 讨论与小结

高温可使机体处于亢进状态,引起肾上腺皮质储备耗竭。肾上腺皮质类固醇合成时,消耗 Vc,致使腺体 Vc 含量降低。软胶丸能显著提高经受高温大鼠肾上腺 Vc 的含量,表明其有助于经受高温的动物机体之恢复。

实验结果表明:软胶丸具有显著的镇痛作用;对胃肠运动有显著的抑制作用;对经受

高温的动物有显著的保护作用和促进恢复作用。这些作用为其功用提供了药效学实验依据。急性毒性试验表明毒性小。

软胶丸与原剂型十滴水比较,药效作用无统计学差异。

参考文献

- 1 陈 奇主编.中药药理实验.贵阳:贵州人民出版社,1988,120
- 2 陈 奇主编.中药药理研究方法学.北京:人民卫生出版社,1993.377
- 3 张明发,等.中医杂志,1984(12):63
- 4 谭毓治,等.中药药理与临床,1990,6(2):8
- 5 谭毓治,等.中药药理与临床,1992,8(3):9
- 6 李仪奎主编.中药药理实验方法学.上海:上海科技出版社,1991.153

(1996-05-20 收稿)

A Study on Pharmacodynamics and Toxicity of Shidishui Softcapsule

Tan Yuzhi, Peng Hongjun, et al

Shidishui Softcapsule(SDSSC)is a new Chinese medicinal preparation contrived by renovating the traditional Shidishui tincture (SDST). Pharmacodynamic study indicated that both SDSSC and SDST had significant analgesic effects and could significantly inhibit gastrointestinal motility in mice, per os; could decrease the death rate of mice experienced high temperature(45°C) for 35 minutes; and could increase Vc content of adrenal gland in rat experienced high temperature(45°C)for 30 minutes. LD₅₀ of SDSSC was 4833.1±26.7 mg/kg in mice, per os.

《国外医药——植物药分册》1998 年征订启事

《国外医药——植物药分册》杂志是由国家科委和新闻出版署批准、国家医药管理局主管、国家医药管理局中草药信息中心站主办、国家医药管理局天津药物研究院出版、公开发行的医药科技专业期刊。办刊宗旨是准确、迅速、全面、系统地报道世界植物药领域中的新成果、新技术、新理论和新动向,以促进我国医药工业的发展,促进中草药在中医药理论指导下与现代国际要求接轨、与现代医药科学发展水平相适应并走向世界。

本刊以综述、编译、文摘、信息、题录等形式向读者提供植物药有效成分的分离提取、结构鉴定;生产工艺和质量控制;生化药理活性与临床研究;组织培养与生物技术工程;各民间药物的开发与植物药专利;市场贸易与各国的药政管理。此外,与植物相关的保健食品、化妆品、兽药、农药、饲料、调料等亦属本刊的报道范围。信息来源涉及十几个国家出版发行的一百多种期刊,每年向读者提供约 500 万字新、特快信息。为满足广大读者需要,本刊近年来还不断增设新栏目,为我国医药研究、教育和生产部门的科研选题、产品更新换代、工艺改进、高新技术的应用、领导的决策与规划提供了有益的启示。本刊曾获国家医药管理局医药情报成果二等奖和三等奖。本刊为双月刊,全年 6 期,每期定价 9.50 元,全年 60 元(包括包装费与邮资)。自办发行,随时可以订阅。收到征订通知者按通知要求办理订阅,未收到征订通知者可直接与本刊发行部联系。联系地址:天津市鞍山西道 308 号,国家医药管理局天津药物研究院《国外医药——植物药分册》发行部。邮编:300193 电话:(022)27381328 开户银行:天津市工商银行南门外分理处 帐号:701088089632

本部现有部分 1991—1996 年度合订本,可与本刊发行部直接联系订购。