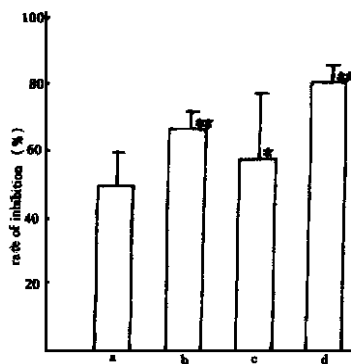




a-ACT 1.29×10^{-4} mol/L; b-ACT 1.72×10^{-4} ; c-VER 7.5×10^{-6} mol/L; d-VER 1.0×10^{-5} mol/L

compared to the control * $P < 0.05$ ** $P < 0.01$

Fig. 7 Effects of Arctigenin on the Intracellular Calcium-Dependent Contraction ($n = 5$, $\bar{x} \pm s$)

of some pathogens, such as bacteria, fungi and virus due to its action to increase immunological functions. In traditional Chinese medical concept, pulmonary functions and intestinal symptoms represent the exterior and interior manifestations of

diseases. The relaxation of colon may facilitated bowel movement to relieve gastrointestinal cold. Result of the present study showed that ACT, the main active principle of *Fructus Arctii*, can relieve the exterior syndrome with simultaneous improvement of intestinal peristalsis. Determination of the ACT content in *Fructus Arctii* is a suitable and feasible quality control criterion to assess the quality of the drug.

References

- 1 Ichikawa K, Kinoshita T, Nishibe S, *et al.* Chem Pharm Bull, 1986, 34: 3514
- 2 Chen S H, Yin Z S, Ma B B, *et al.* Acta Pharm Sini, 1988, 9 (6): 533
- 3 Tenner T J, Eur J Pharmacol, 1981, 73: 289
- 4 Macvicar BA, 1984, 226: 1345
- 5 Liu K, Guan Y Y. Chin Pharmacol Bull, 1992, 8(2): 91

编辑部注: 本文经我刊顾问、英文编审史玉俊研究员修改、审定。

(Received in April 30th, 2000)

钩藤中不同成分降压作用的差异[△]

上海中医药大学中药研究所 (200032) 宋纯清* 樊懿 黄伟晖 吴大正 胡之璧

摘要 目的: 比较钩藤中提取的异钩藤碱、钩藤碱、钩藤总碱及非生物碱部分的降压作用。方法: 大鼠麻醉后经颈总动脉插管记录外周血压和经股静脉微量输注实验用药。结果: 实验表明钩藤中 4 种成分的降压强度为异钩藤碱 (42.0%) > 钩藤碱 (32.1%) > 钩藤总碱 (21.3%) > 钩藤非生物碱 (12.4%)。结论: 提示钩藤中主要降压成分为异钩藤碱和钩藤碱。

关键词 钩藤 钩藤碱 异钩藤碱 钩藤总碱 钩藤非生物碱 外周血压

Different Hypotensive Effects of Various Active Constituents Isolated from *Uncaria rhynchophylla*

Institute of Chinese Materia Medica, Shanghai University of TCM (Shanghai 200032) Song Chunqing, Fan Yi, Huang Weihui, Wu Dazheng and Hu Zhibi

Abstract Hypotensive effects of rhynchophylline, isorhynchophylline, total alkaloid and non-alkaloid fraction isolated from *Uncaria rhynchophylla* (Miq.) Jacks. were compared. Change in peripheral blood pressure was recorded by inserting a catheter into the right common carotid artery of anaesthetized rat, while each of the four hypotensive constituents was injected individually into the femoral vein by a microinfusion pump. Results of the findings showed that the four constituents in *U. rhynchophylla* displayed different hypotensive potency in the order of isorhynchophylline [lowering of mean arterial pressure (MAP) by 42.0%] > rhynchophylline (lowering of MAP by 32.1%) > total alkaloid (lowering of MAP by 21.3%) > non-alkaloid fraction (lowering of MAP by 12.4%). It was concluded that isorhynchophylline and rhynchophylline were the main hypotensive constituents in *U. rhynchophylla*.

* Address: Song Chunqing, Institute of Chinese Materia Medica, Shanghai University of TCM, Shanghai

宋纯清 男, 1964年毕业于南京药学院, 上海中医药大学教授、博士生导师。专长中药化学, 现任中药研究所中药化学室主任。1986年和1993年先后在日本东京大学和美国普渡 (Purdue) 大学多年访问合作研究, 近年负责和承担国家和上海市研究课题 8 项, 主要从事中药和中药复方药效物质基础、质量标准及其作用机制研究, 发表论文 40 余篇。参加抗癌新药羟基喜树碱的研究, 获得上海市重大科技成果奖。

[△]国家中医药管理局“九五”攻关基金 (969030203)

Key words *Uncaria rhynchophylla* (Miq.) Jacks. rhynchophylline isorhynchophylline total alkaloid non-alkaloid fraction from *U. rhynchophylla* peripheral blood pressure

钩藤,性甘寒,具有清热平肝、熄风镇痉之功效,是著名平肝熄风代表方“天麻钩藤饮”的主药之一。现代药理学研究证明钩藤具有扩张外周血管、降压、负性肌力及负性频率的作用^[1-5]。临床上主要用于治疗高血压等疾病。中药化学研究证明钩藤中降压、扩张外周血管的主要成分是钩藤碱(rhynchophylline)和异钩藤碱(isorhynchophylline)^[2,3]。两者强度比较,证明异钩藤碱强于钩藤碱^[3]。鉴于以上结果是通过静脉一过性给药而获取,不足以说明其静脉持续性给药的结果。本研究的目的是将钩藤中提取的4种成分:钩藤碱、异钩藤碱、钩藤总碱和非生物碱部分通过静脉内持续给药,观察4种成分的降压效果和降压程度,为临床应用钩藤治疗高血压提供前瞻性研究。

1 材料与方法

1.1 动物:健康雄性 Wistar 种大鼠,体重(220±14)g,由上海中医药大学实验动物中心提供。

1.2 药物:钩藤碱、异钩藤碱、钩藤总碱及非生物碱部分由上海中医药大学中药研究所从大叶钩藤 *Uncaria macrophylla* Wall. 中提得,均为白色粉末。为了精确地比较其降压作用,用量均为等比例的生药

量。用前经 0.1 mol/L HCl 溶解后,分别用蒸馏水稀释为 1 mg/mL, 1 mg/mL, 6 mg/mL 及 1 mg/mL, pH 调至 6.5。

1.3 方法:28只大鼠随机分成4组,每组7只,分别为钩藤碱、异钩藤碱、钩藤总碱及非生物碱组。各组大鼠均以2%戊巴比妥钠 45 mg/kg ip 麻醉,分离气管,插入气管套管;分离右颈总动脉,插管后经压力换能器连接 GY-640 四道生理记录仪记录收缩压(SAP)、舒张压(DAP)及平均动脉压(MAP);同时记录肢体II导联心电图。不同的药物通过 WZ-50G 微量注射泵以每小时 5 mL/kg 注入股静脉,连续观察给药 1 h 和停药 1 h 中的外周血压变化。通过 Macintosh 7600/120 微型计算机和 SE+ Graphic 5.0 软件进行数据分析统计。各参数以 $\bar{x} \pm s$ 表示。百分率(%)用 $X_2 \div X_1 \times 100 - 100$ 公式计算。

2 结果

2.1 对血压的影响:异钩藤碱、钩藤碱、钩藤总碱和非生物碱部分引起的血压变化见表1。以 MAP 为例,在给药 1 h 和停药 1 h 后,异钩藤碱使 MAP 降低 42%,钩藤碱降低 32.1%,钩藤总碱降低 21.3%,非生物碱降低 12.4%。

表1 钩藤中各有效成分对 SAR、DAP、MAP 的影响 (kPa)

组别		输注前	输注 30 min	输注 60 min	停药 30 min	停药 60 min
钩藤碱	MAP	16.45±0.61	14.63±0.80	12.95±0.87*	12.16±1.03*	11.19±0.82*
	SAP	20.76±0.61	18.31±0.90	16.77±0.98	15.91±2.12	14.57±1.14
	DAP	13.79±1.08	12.77±0.84	11.03±1.52	10.29±0.67*	10.28±0.54*
异钩藤碱	MAP	15.83±0.84	13.81±1.28	11.93±1.06*	10.40±1.03*	9.17±1.10*
	SAP	20.63±1.28	14.69±0.90	17.69±1.25	17.23±1.56	16.31±1.67
	DAP	14.04±1.09	11.76±2.11*	9.89±2.04*	8.31±1.52*	7.20±1.85*
钩藤总碱	MAP	16.41±0.57	14.69±0.99	13.99±1.06	13.47±0.77	12.80±1.11*
	SAP	20.03±0.71	17.91±1.15	16.03±1.16	14.57±1.46	13.13±1.59*
	DAP	14.31±0.97	13.11±1.45	12.15±1.49	11.57±1.24	11.04±0.72
非生物碱	MAP	16.01±1.28	15.55±0.80	14.55±0.71*	14.21±0.60	14.01±1.05
	SAP	20.51±1.09	19.69±1.79	19.57±1.69	19.13±1.22	19.20±1.18
	DAP	13.76±0.78	12.67±1.28	12.03±1.16	11.75±0.79	11.43±0.53

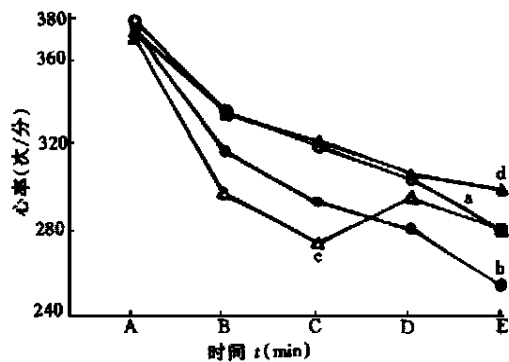
与给药前比较: * $P < 0.05$ ** $P < 0.01$

2.2 对心率(HR)的影响:异钩藤碱、钩藤碱、钩藤总碱和非生物碱部分对心率的影响见图1。

2.3 对心指数的影响:异钩藤碱、钩藤碱、钩藤总碱和非生物碱部分对心指数的影响见图2。心指数由 $(SAP \times HR)^{-0.5}$ 计算而得^[6],各组在给药前的心指数为 210 左右,当 iv 上述 4 药,均出现心指数下降,其中以异钩藤碱的作用最明显,这和血压的变化相一致。

3 讨论

本实验表明钩藤中钩藤碱、异钩藤碱、钩藤总碱及非生物碱均有降压及负性心率作用,其中以异钩藤碱为最强,降压强度的顺序为异钩藤碱>钩藤碱>钩藤总碱>非生物碱部分。心指数是反映心肌耗氧量的一个比较敏感的指标^[6],钩藤中各有效成分均能降低心指数,即降低心肌耗氧量,以异钩藤碱的效应最强。在此心指数的降低主要是通过减慢心

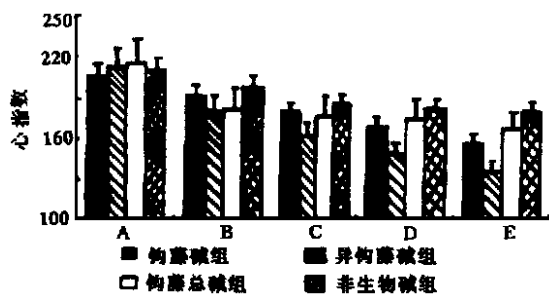


a-钩藤碱; b-异钩藤碱; c-钩藤总碱; d-非生物碱

A输注前; B输注后 30 min; C输注后 60 min

D停药后 30 min; E停药后 60 min

图 1 钩藤中各有效成分对心率的影响



A输注前; B输注后 30 min; C输注后 60 min;

D停药后 30 min; E停药后 60 min

图 2 钩藤中各有效成分对心指数的影响

率和降低血压而实现的。本研究提示了钩藤碱及异钩藤碱具有较明显的降压及负性频率作用,在钩藤中占主导地位。钩藤碱和异钩藤碱在钩藤中含量较高,在大叶钩藤 *Uncaria macrophylla* Wall. 茎中的平均含量分别为 0.328% 和 1.634%^[7]。说明钩藤作为一种治疗高血压疾病的药物,起作用的成分主要为钩藤碱和异钩藤碱。从本实验中可看到钩藤碱和异钩藤碱降压幅度较以往文献报道大^[8],提示很可能是用药的持续时间不同,因本实验采用的是静脉内持续给药而不是快速的一过性给药,这些药物在体内的反应时间比较长,特别是停药后 1 h 中血压呈持续性下降。由此表明钩藤碱和异钩藤碱在药物代谢动力学方面值得深入地研究。

参考文献

- Phillipson J D, Handa S S. Lloydia, 1978, 41(5): 385
- Sutter M C, Wang Y X. Cardiovasc Res, 1993, 27(11): 1891
- 石京山, 刘国雄, 吴芹, 等. 中国药理学报, 1992, 13(1): 35
- 王小良, 张黎明, 华峰. 中国药理学报, 1994, 15(2): 115
- 朱毅, 黄燮南, 刘国雄. 中国中药杂志, 1995, 20(2): 112
- Albert J S. Physiopathology of the Cardiovascular System. Boston: Little, Brown and Company, 1984: 33
- 楼之岑, 秦波主编. 常用中草药品种整理和质量研究. 北京: 北京医科大学中国协和医科大学联合出版社, 1995: 992
- 石京山, 刘国雄, 吴芹, 等. 中国药理学与毒理学杂志, 1989, 3(3): 205

(2000-04-26收稿)

桔梗总皂苷对大鼠高脂血症的影响

西北大学生物系(西安 710069)

中国咸阳保健品厂

高云芳* 陈超 张海祥

梁固城

摘要 采用饲喂高脂饲料建立大鼠高脂血症模型,研究桔梗总皂苷对高脂血症的作用。结果显示,桔梗总皂苷具降血脂的作用,不同剂量的桔梗总皂苷对大鼠高脂血症的降低作用差异较为显著:大剂量(200 mg/kg·d)可以显著性地降低高脂血症大鼠的 TG、LDL-C、HDL-C,其作用程度超过阳性药物组(绞股蓝);小剂量组和中剂量组仅对血脂的部分指标有影响。提示适当剂量的桔梗总皂苷对大鼠高脂血症具明显疗效。

关键词 桔梗总皂苷 高脂血症 降脂作用

据文献报道,桔梗具镇痛、止咳祛痰等药效。所含的桔梗总皂苷与人参总皂苷、三七总皂苷等都属三萜类皂苷。人们已熟知,人参总皂苷具有很好的降脂作用,桔梗总皂苷是否也具有类似作用尚无报道,故本研究旨在探讨不同剂量的桔梗总皂苷对血脂的影响。

1 材料

1.1 药品与试剂:桔梗总皂苷由咸阳保健品厂提供,并用蒸馏水配成 3 个剂量(0.75, 1.5, 3.0 mg/mL)待用,测试用试剂采用东鸥生物工程有限公司产品。

1.2 饲料:饲料均采用机制颗粒饲料。基础饲料配

* Address: Gao Yunfang, Department of Biology, Northwest University, Xi'an

高云芳,女,副教授,生于 1958 年,1982 年毕业于陕西师范大学生物系,获理学学士学位;1989 年毕业于陕西师范大学生物系,获理学硕士学位,动物学专业,生理学方向。毕业后主要从事生理学教学与科研工作。已发表研究论文 23 篇,目前正在进行新药研究开发方面的工作。