论 著

鞘蕊苏提取物抑制离体豚鼠气管条收缩的活性测定

杨为民¹⁾, 刘一丹²⁾, 陈植和¹⁾, 金歧端³⁾, 许云龙³⁾

(1) 昆明医学院云南省天然药物药理重点实验室, 昆明 650031; 2) 昆明集团制药股份有限公司研究所, 昆明 650100; 3) 中科院昆明植物所植化室, 昆明 650204)

摘要: 目的: 实验测定不同提取工艺分别得到的鞘蕊苏提取物 1~5 号, 拮抗组胺诱导离体豚鼠气管条收缩的活性, 以期通过生物活性测定, 评估鞘蕊苏提取物活性高低. 方法: 按文献方法制备离体豚鼠气管条, 置于装有克氏营养液的麦氏管中, 以累积浓度法加入样品, 观察其对组胺诱导气管条收缩的影响. 结果: 鞘蕊苏提取物 1~5 号均显示抑制组胺诱导离体豚鼠气管条的收缩, 活性高低顺序为: 4 号 > 2 号 > 5 号 > 3 号 > 1 号. 结论: 上述提取物抑制组胺诱导离体豚鼠气管条收缩的作用均高于鞘蕊苏口服液, 现有提取法中 4 号样品的提取法得率较高.

关键词: 鞘蕊苏; 气管条; 豚鼠**中图分类号:** R74 **文献标识码:** A **文章编号:** 1003-4706 (2003) 03-0003-02

滇产鞘蕊苏植物提取物富含佛司可林衍生物. 而佛司可林是迄今发现的活性最强的腺苷酸环化酶 (AC) 直接激动剂, 产生大量环腺苷酸 (cAMP), 从而产生舒张气管平滑肌等药理作用^[1,2]. 由于提取方法不同, 鞘蕊苏提取物中的佛司可林衍生物含量不同, 舒张气管平滑肌的作用强度也不同^[3,4]. 本实验对用不同提取方法得到的鞘蕊苏提取物进行气管条实验, 以期通过活性高低的评价, 初步确定得率较高的提取方法.

1 材料及方法

药物: 鞘蕊苏提取物由昆明植物研究所提供, 临用前溶于 10% PEG-400 水溶液中, 配制成本系列浓度供用. 鞘蕊苏口服液由昆明兴中药厂生产, 批号 021005, 规格为 10 mL/支 (含生药 10 g).

动物: 豚鼠, 雌雄不拘, 体重 250~300 g, 由昆明医学院动物科提供.

离体豚鼠气管条制备及检测: 将豚鼠击头致昏, 迅速剥取气管, 剪成 2 mm × 30 mm 的螺旋条. 将螺旋条悬挂于盛有 20 mL Krebs 液 (37.0 ± 0.5) °C, pH 7.4 ± 0.5 的离体器官测定仪浴槽中, 两端分别连在张力换能器和浴槽底部的通气钩上, 通氧气, 静息负荷 4.5 g, 螺旋条张力变化

由连接于换能器的记录仪 (U-135C, Shimadzu) 记录. 每 20 min 换液一次, 平衡 1 h 后开始实验. 加入组胺 (终浓度 1 μg/mL) 激动, 待最大收缩峰时累积加入不同浓度的鞘蕊苏提取物药液, 测定累积量效关系, 用非线性回归法计算药物抑制组胺诱导离体气管条收缩的半数抑制率 (IC₅₀).

2 结果

结果表明鞘蕊苏提取物 1~5 号均显示抑制组胺诱导离体豚鼠气管条的收缩, IC₅₀ 大小顺序为: 1 号 > 3 号 > 5 号 > 2 号 > 4 号 (见表 1, 2), 因此抑制组胺诱导离体豚鼠气管条收缩的活性高低顺序为: 4 号 > 2 号 > 5 号 > 3 号 > 1 号. 上述样品抑制组胺诱导离体豚鼠气管条收缩作用均高于鞘蕊苏口服液.

3 讨论

本实验观察鞘蕊苏提取物对磷酸组胺诱导离体豚鼠气管条收缩的影响, 同时比较各提取物之间的活性高低, 并与鞘蕊苏口服液比较. 结果证明鞘蕊苏提取物抑制组胺诱导离体豚鼠气管条收缩的活性高低顺序为: 4 号 > 2 号 > 5 号 > 3 号 > 1

基金项目: 云南省自然科学基金资助项目 (95C070M)**作者简介:** 杨为民 (1969~), 女, 云南龙陵人, 硕士, 副研究员, 主要从事天然药物药理的研究.

号。上述样品抑制组胺诱导离体豚鼠气管条收缩作用均高于鞘蕊苏口服液。因此在现有提取方法中4号样品提取方法得率较高。

表1 鞘蕊苏提取物抑制组胺诱导离体豚鼠气管条收缩

终浓度 μg/mL	抑制率 (%)					鞘蕊苏口服液
	1号	2号	3号	4号	5号	
1.56	-	-	-	6.7±0.7	-	-
3.12	-	1.15±0.8	3.4±0.4	22.5±3.3	5.5±0.6	-
6.25	8.9±0.2	35.5±4.2	25.3±2.1	52.3±4.6	11.0±1.1	-
12.5	17.6±2.1	85.9±8.2	78.9±5.9	100±12.4	55.3±4.9	-
25.0	33.3±3.5	100±11.1	98.6±9.9	-	97.1±7.9	-
50.0	77.1±6.4	-	-	-	-	-
370	-	-	-	-	-	13.1±1.5
1 100	-	-	-	-	-	19.4±2.9
3 300	-	-	-	-	-	38.8±6.7
10 000	-	-	-	-	-	85.9±12.9

注：溶媒为10% PEG-400水溶液，预实验证明溶媒对该实验无影响，鞘蕊苏口服液终浓度为生药浓度。

表2 鞘蕊苏提取物抑制组胺诱导离体豚鼠气管条收缩的半数抑制率 (IC₅₀)

样品	IC ₅₀ 及95%可信限 (μg/mL)
1号	29.3 (21.7~39.7)
2号	7.0 (5.3~9.1)
3号	16.3 (15.3~17.5)
4号	3.4 (1.9~6.1)
5号	9.7 (7.3~13.0)
鞘蕊苏口服液	3 000 (1 500~5 700)

注：IC₅₀计算方法采用非线性回归方法。

参考文献：

- [1] 金歧端, 谢显厚, 木全章. 毛喉鞘蕊花的化学成分研究 [J]. 天然产物研究与开发, 1990, 2 (1): 6
- [2] 金歧端, 和碧荷. 毛喉鞘蕊花的微量成分 [J]. 云南植物研究, 1998, 20 (4): 469
- [3] CAPRIOLI J, SEARS M, MEAD A, et al. Adenylate cyclase stimulation and intraocular pressure reduction by forskolin analogs [J]. J Ocul Pharmacol, 1989, 5 (3): 181
- [4] 陈植和, 王新华, 马国义, 等. 滇产毛喉鞘蕊花提取成分的药理作用 [J]. 昆明医学院学报, 1991, 12 (1): 19

(2003-03-17 收稿)

Effect of the Extract from Plant Qiaoruisu on Isolated Trachea of Guinea Pig

YANG Wei-min¹⁾, LIU Yi-dan²⁾, CHEN Zhi-he¹⁾, JIN Qi-duan³⁾, XU Yun-long³⁾

(1) Yunnan Pharmacological Laboratory of Natural Products, Kunming Medical College, Kunming 650031;

2) Kunming Pharmaceutical Co., Kunming 650100; 3) Kunming Institute of Botany, Kunming 650204)

Abstract: To investigate effect of the extract from plant Qiaoruisu on the contractions induced by histamine in isolated trachea of guinea pig. The cumulative concentration-response curves for drugs were determined in isolated trachea strips of guinea pig. In trachea strips, sample 1, 2, 3, 4, 5 inhibited the contractions induced by histamine. We compared their activities; sample 4 > sample 2 > sample 5 > sample 3 > sample 1. The results suggested that the extract from plant Qiaoruisu inhibited the contractions of guinea pig trachea induced by histamine with various activities in vitro.

Key words: Qiaoruisu; Trachea; Guinea pig