·天然药物进展·

地锦草中的抗微生物成分

地锦草(Euphorbia humufusa)在中草药中用来治疗慢性支气管炎、肠炎和其它一些细菌性疾病。已报道其中含有栎精(quercetin)、五倍子酸(gallic acid)、甲基鞣酸盐(methyl gallate)和內消旋环已六醇(mesoinositol)。作者从其醋酸乙酯提取物中发现具有对抗金黄色葡萄球菌的活性,并从中分离出四个成分:莨菪亭(Scopoletin)、散形酮(umbelliferone)、三脉泽兰素(ayapin)和棕榈酸(palmitic acid)。莨菪亭和散形酮有活性,而三脉泽兰素和棕榈酸没有活性。

成分提取和分离: 从香港购进的干燥压碎的地锦草250g,用醋酸乙酯回流提取三次,每次2小时,得到醋酸乙酯提取物8.7g,经硅胶层析,正丁醇一醋酸乙酯洗脱得下剂化合物。

莨菪亭(1) 3 mg, 无色针晶, mp230 ~231℃。散形酮(2) 5 mg, 无色针晶。 三脉泽兰素(3)2 mg, 无色针晶, mp274~ 276℃。棕榈酸 18mg,无色粉末,mp72~75℃。鉴定莨菪亭和散形酮用标准品直接对照,棕榈酸经甲酯化后,和甲基棕榈酸标准品一齐经气相层析确定。由于没有三脉泽兰素标准品,三脉泽兰素是通过光谱数据推断的。

(3)
$$R_1 = R_2 = {-0 \atop -0} CH_2$$

抗微生物作用的分析: 抗微生物试验是使用金黄色葡萄球菌的琼脂培养皿法,实验用的提取物和上述成分溶解于50%DMSO中,浓度1%。活性用37℃孵化18小时后的抑制直径表示。提取物平均抑制直径为18mm, 莨菪亭19.2mm, 散形酮15mm,三脉译兰素和棕榈酸为8mm。

[《生药学杂志》, 40(4): 427,1986(日文)] 崔 熙节译 张紫洞校

・文摘・

庆大霉素在不同肾功能的青老年病人中的处置

具有不同肾功能的99名发烧病人,测定年龄对 庆大霉素的半衰期、分布容积和总体清除率的影响。 其中50名病人年龄为18到64岁,庆大霉素的清除率 为79.0±27.0ml/分(均数±标准差);肌酐清除 率98.6±33.3ml/分;分布容积0.242±0.077升/公斤,半衰期2.63±0.90小时。其他49名老年病人 年龄在65~90岁之间,庆大霉素的 清除 率36.9±16.3ml/分;肌酐清除 率为51.2±21.2ml/分;分布容积0.244±0.102升/公斤,半衰期5.8±4.13小时。两组间除分布容积外,所有参数均有显著的差异。庆大霉素的处置特点(清除率和排泄率常数)与年龄以及肌酐清除率之间的线性回归呈良好的相

关性。然而庆大霉素清除率与肌酐清除率的比率和 年**龄之间无明显关系(r** = 0.0731)。这些发现证明庆**大霉素的处置**与年龄无关,但与肾功能有关。

随着年龄增长许多生理功能发生改变,包括心脏指数、肾小球滤过率和肝脏药物代谢。此外体内成分、体内的脂肪含量、细胞内、外体液等,也随着成年人的变老而发生了改变。不过据报道具有"正常"肾功能的老年病人与有正常肾功能的年轻病人比较,未观察到庆大霉素处置的不同。

[J Clin Pharmacol《临床药理学杂志》,27 (3),216,1987(英文)]

贾丹兵摘译 张紫洞校