

成反比。

Jorgensen证明随年龄的增大,人的凝血时间缩短,PGI₂合成减少。大剂量阿司匹林在年龄为18~32和28~33岁的两组人可明显缩短凝血时间,而在66~70岁的一组则不能产生如此作用。

不同的生理部位和组织合成PGI₂的能力不同。由于肺可不断产生大量PGI₂,因此使动脉血中较静脉血中PGI₂水平高,因而前者具有更强的抗凝性质。Rozsa等通过生物测定表明,胃部PGI₂水平的高低顺序是:十二指肠>胃窦>胃体;在十二指肠溃疡时,十二指肠内PGI₂水平略下降,但不十分明显。

由此可见,PGI₂合成和释放受多方面因素和多种药物的影响,因此我们可寻找一些影响PGI₂的药物达到影响某种生理作用的目的。

五、有关PGI₂的作用机理

PGI₂可激活血小板的腺苷酸环化酶,升高cAMP水平,产生抗血小板凝聚作用。PGI₂也是通过cAMP影响血管平滑肌张力的。虽然前列腺素类物质可使许多组织cAMP水平提高,但使脂肪细胞cAMP水平降低。

体外试验表明,PGI₂升高鼠脑垂体前叶的cAMP水平与剂量有关,因此可以对垂体功能产生影响,但不影响cGMP水平。

在局部缺血的肝脏,PGI₂对肝细胞的

保护作用是因肝中cAMP含量升高,注射PGI₂可以阻止缺血肝中ATP和cGMP的降低,加速再氧合期间肝中ATP的储存。Sikujara的试验结果也支持这一观点。可见,PGI₂对肝细胞的保护作用与升高肝中ATP和环核苷酸有密切关系。

PGI₂升高许多细胞的cAMP水平,包括培养的人成纤维细胞,人脂肪细胞空泡和豚鼠肺匀浆,但对血小板例外。因此,在这些细胞中,PGI₂与TXA₂系统的相互作用有可能导致类似于在血小板观察到的细胞活动调节,提示PGI₂/TXA₂系统在细胞调节和前列腺素受体的确定方面具有更广泛的生理意义。

六、结束语

综上所述,由于PGI₂广泛的血管扩张作用,将对于研究原发性高血压发生及发展机理、寻找新的降血压药物及其作用机理有所帮助。动脉粥样硬化症与病灶区脂肪过氧化物的蓄积和PGI₂合成能力的下降之间的关系指示我们,是否可通过抑制过氧化反应及提高PGI₂在病灶区的含量以治疗和预防动脉粥样硬化。而PGI₂的扩冠和抗血小板凝聚作用,则可能有助于治疗心肌梗死、心绞痛和心脏局部缺血。总之,PGI₂在心血管作用方面的研究将会促进心血管生理、病理研究的迅速发展。

(参考文献41篇,略)

郭忠武综述 钱定华校 芮耀诚审

· 文摘 ·

由南天竹中分离出5-羟色胺受体拮抗剂

日本多年使用南天竹 *Nandina domestica* Thunberg的果实治疗气喘、哮喘性咳嗽、咽肿胀、子宫出血。该植物中含有多种生物碱,并发现果实的甲醇提取物对离体兔主动脉有选择性的抑制5-羟色胺诱导收缩作用。作者对果实中的5-羟色胺拮抗剂进行了分离和结构测定。

干燥南天竹果实粉末(4 kg)用甲醇(3 × 6 L)提取,室温得729克粗提物再用正丁醇抽提,将此具有药理活性的部分继续用硅胶层析分离,最后由乙酸乙酯重结晶,得到一种无色针状物质,mp. 140~

141°C, [α]_D + 102.0°, 经NMR, MS, UV测定,确定其分子式C₂₀H₂₁NO₃,也测定了结构式,证明为南天竹宁(Nantenine)。

经生物检验证明,南天竹宁可选择性地抑制离体兔主动脉对5-羟色胺诱导的收缩作用,为此可以认为南天竹具有一种5-羟色胺受体的阻断作用。

(J. Pharm. Sci. 《药科学杂志》, 73

(4): 568~570, 1984 (英文))

朱春青 苟奎斌摘 苏中武校