

石菖蒲挥发油有效成分的解痉作用

刘国卿 孙建宁* 何正正* 蒋莹 (南京药学院药理研究室, 南京 210009)

提要 石菖蒲(*Acorus gramineus*)的挥发油成分 α -细辛醚(I), β -细辛醚(II)及 1-烯丙基-2, 4, 5-三甲氧基苯(III)对豚鼠离体气管和回肠有很强的解痉作用。在离体气管标本, I 对抗 ACh、组胺和 5-HT 的最低有效浓度为 10 $\mu\text{g/ml}$; 在离体回肠标本, 其最低有效浓度: 对抗 ACh 和 5-HT 为 10 $\mu\text{g/ml}$, 对抗组胺为 20 $\mu\text{g/ml}$ 。

关键词 石菖蒲; α -细辛醚; β -细辛醚; 1-烯丙基-2, 4, 5-三甲氧基苯; 解痉

石菖蒲为天南星科植物(*Acorus gramineus* Soland)的根茎, 中医用于“除烦闷, 止心腹痛”等。从国产石菖蒲中已提得 6 种单体⁽¹⁾, 其中较重要的有 β -细辛醚(β -asarone)、 α -细辛醚(α -asarone)和 1-烯丙基-2, 4, 5-三甲氧基苯(1-allyl-2, 4, 5-trimethoxybenzene, 简称

1979年9月4日收稿 1982年12月13日修回

*北京中医学院进修教师

Table 1. Minimal effective concentrations of spasmolytic action on isolated trachea and ileum of guinea pigs

	ACh		Histamine		5-HT		BaCl ₂ ileum
	trachea	ileum	trachea	ileum	trachea	ileum	
α -Asarone(μ g/ml)	10	10	10	20	10	10	80
β -Asarone(μ g/ml)	21	42	21	21	21	21	42
1-Allyl-2,4,5,- trimethoxybenzene	21	21	42	10	42	21	42
Volatile oil (μ g/ml)	50	25	25	13	50	13	25
Decoction(μ g/ml)	—	100000	—	100000	—	100000	--
Aminophylline (μ g/ml)	2.5	25000	10	25000	10	25000	--

烯丙基, allyl). 本文报道此三种成分的药理研究.

方法和结果

待试药物配制成含有 0.06% 药物的 5% 乙醇、3% 吐温-80 的溶液⁽²⁾. 对照组均给予等容量的溶剂.

平滑肌解痉作用

1. 对离体豚鼠气管的解痉作用 α -细辛醚对抗致痉剂乙酰胆碱(ACh), 组胺(Hist)和 5-羟色胺(5-HT)的最低有效浓度为 10 μ g/ml. α -细辛醚对抗 Hist 和 5-HT 的作用与氨茶碱相似, 但对 ACh 的对抗作用则远低于氨茶碱(表 1).

α -细辛醚完全阻断致痉剂作用的浓度: 对抗 ACh 为 40 μ g/ml, 对抗 Hist 为 80 μ g/ml, 对抗 5-HT 为 53 μ g/ml, 其效力均高于氨茶碱.

Table 2. Potentiation of pentobarbital-induced hypnosis. n = 10

	Dose(mg/kg)	Mice slept
Control	—	0
α -Asarone	24	5
	28	6
β -Asarone	24	7
	48	6
1-Allyl-2,4,5- trimethoxybenzene	24	4
	48	1
Volatile oil	24	3
	48	10

β -细辛醚和烯丙基有相似的作用, 但都比 α -细辛醚弱. 石菖蒲挥发油因含有多种有效成分, 故亦有较好的解痉作用.

2. 对离体豚鼠回肠的解痉作用 阻断肠管平滑肌痉挛的效果以 α -细辛醚为最优, 其对抗 ACh 和 5-HT 的最低有效浓度为 10 μ g/ml, 对抗 Hist 为 20 μ g/ml, 对抗 BaCl₂ 为 80 μ g/ml; 其次为石菖蒲挥发油, 而石菖蒲煎剂的解痉作用则甚差(表 1).

对阈下剂量戊巴比妥钠的协同 小鼠 90 只, 分成 9 组, ip 给药后 20 min, 再 ip 戊巴比妥钠 15 mg/kg, 观察每组翻正反射消失鼠数. 当 α -细辛醚和 β -细辛醚剂量增至 24—48 mg/kg 时, 对戊巴比妥钠有一定的协同作用(表 2)

其他 ip α -细辛醚 24 或 48 mg/kg 后, 小鼠、大鼠的自发活动无明显减少, 无降温作用, 亦不能对抗麦角酰二乙胺(LSD-25)的升温作用. 给小鼠 ip α -细辛醚 24 mg/kg, 对苯丙胺的毒性无保护作用, 而氯丙嗪 3 mg/kg 则有非常明显的保护. α -细辛醚对戊四唑及电休克惊厥亦无明显对抗. im α -细辛醚 15 mg/kg, 对有攻击行为的猴, 未观察到有明显安定作用, 而氯丙嗪 3 mg/kg 则作用显著.

讨论和小结

α -细辛醚 10 μ g/ml 在体外即具有对抗致痉剂对气管和肠管平滑肌的作用, α -细辛醚完

全阻断致痉剂对气管作用的浓度远低于氨茶碱, 其强度为后者的 2-6 倍。β-细辛醚和烯丙基对气管和肠管平滑肌的解痉作用, 除个别情况外, 一般都比 α-细辛醚弱。值得注意的是, 石菖蒲煎剂的作用甚微。这是可以理解的, 因为挥发油等脂溶性成分在煎剂中是很少的。

文献报道, α-细辛醚对小鼠、大鼠及猴有明显的、多方面的中枢抑制作用, 具有与氯丙嗪和利血平相似的安定作用⁽³⁻⁶⁾。我们用高于原报道 3-8 倍的剂量在小鼠、大鼠和猴对 α-细辛醚的中枢抑制作用进行了研究。除了它对戊巴比妥钠有一定的协同作用外, 其他作用多不能得到证实。我们的实验结果和 Banerjee 是

一致的, 他认为 α-细辛醚不是一个安定剂⁽⁷⁾。

参 考 文 献

- 1 南京药学院中麻研究组. 中草药通讯 1978 年 6 月, (6):1 及 1978 年 7 月, (7):1
- 2 Dandiya PC, Menon MK. *J Pharmacol Exp Ther* 1964 Jul, 145 (1):42
- 3 Menon MK, Dandiya PC. *J Pharm Pharmacol* 1967 Feb, 19 (2):170
- 4 Sharm JD, Dandiya PC, Baxter RM, Kandel SI. *Nature* 1961 Dec 30, 192 (4809):1299
- 5 Dandiya PC, Menon MK. *Br J Pharmacol* 1963 Jun, 20 (3):436
- 6 Dandiya PC, Bapna JS. *Annu Rev Pharmacol* 1974, 14:115
- 7 Banerjee SP. *Indian J Physiol Pharmacol* 1969 Apr, 11(4):191

Acta Pharmacologica Sinica 1983 Jun, 4 (2) : 95-97

SPASMOLYTIC ACTIONS OF ACTIVE PRINCIPLES OF VOLATILE OIL OF *ACORUS GRAMINEUS*

LIU Guo-qing, SUN Jian-ning, HE Zheng-zheng, JIANG Yin

(Department of Pharmacology, Nanjing College of Pharmacy, Nanjing 210009)

ABSTRACT Three active principles, α-asarone (I), β-asarone (II) and 1-allyl-2, 4, 5-trimethoxybenzene (III), obtained from *Acorus gramineus* were found to possess spasmolytic action on isolated guinea pig's trachea and ileum against the spasmogens acetylcholine (ACh), histamine (Hist), serotonin (5-HT), and BaCl₂. Out of these 3 compounds, I was most effective with the minimal effective concentrations of 10 μg/ml against ACh, Hist and 5-HT on trachea; 10 μg/ml against ACh, 20 μg/ml against Hist, 10 μg/ml against 5-HT, and 80 μg/ml against BaCl₂ on ileum. The concentrations of I for complete blocking action

against spasmogens were 40 μg/ml against ACh, 80 μg/ml against Hist, and 53 μg/ml against 5-HT on trachea. II and III were less potent than I. Dandiya et al reported in 1964 that I (3 or 6 mg/kg) possessed many neuropharmacological properties similar to chlorpromazine and reserpine. These properties were not reproduced even with the doses of 24 and 48 mg/kg in our laboratory except I potentiated pentobarbital-induced hypnosis.

KEY WORDS *Acorus gramineus*; α-asarone; β-asarone; 1-allyl-2, 4, 5-trimethoxybenzene; spasmolytics