

麻黄与麻黄碱的共性与区别

★ 黄云珍 (上海石化地段医院药剂科 上海 200540)

关键词:麻黄;麻黄碱;中药;西药;共性与区别

中图分类号:R 284.1 文献标识码:B

麻黄(*Herba Ephedrae*)是我国应用历史悠久的中药材之一,始载于汉代《神农本草经》,历代本草均收载,直至今日仍为临床常用中药之一。其主要成分为麻黄碱(ephedrine)和伪麻黄碱(pseudoephedrine),二者作为拟肾上腺素药物,被广泛用于多种制剂中。以麻黄碱为主的制剂在国外还有营养补充剂、减肥剂等。但医学研究者最近指出,数百万美国人正在用于健美和减肥的中草药刺激剂麻黄会导致严重的疾病,包括心脏病、中风等各种并发

症,甚至死亡。2003年12月30日美国卫生部长汤普森宣布,含有麻黄的药品全面禁售。但笔者认为麻黄与麻黄碱之间既有相同相似的一面,更有不同之一面。本文就麻黄及麻黄碱来源、有效成分、药理作用3方面加以总结和分析。

1 麻黄与麻黄碱的来源之异同

1.1 麻黄的来源

麻黄是一种药用植物,为麻黄科植物草麻黄或木贼麻黄或中麻黄的干燥草质茎。

2.4.1 供试品溶液的制备 取金丹前列片20片,研细,取粉末10g,加乙酸乙酯10ml,振摇,分取乙酸乙酯层,蒸干,加甲醇至1ml,作为供试品溶液。

2.4.2 对照品溶液的制备 取淫羊藿苷对照品适量,加甲醇制成每1ml含1mg的溶液,作为对照品溶液。

2.4.3 阴性对照溶液的制备 取缺淫羊藿全处方5倍量药材,制备方法同黄柏阴性对照溶液。

2.4.4 层析 照薄层色谱法^[1]试验,吸取上述3种溶液各5 μ l,硅胶H-CMC(0.5%)薄层板上,以醋酸丁酯-甲酸-水(5:3:2)展开,展距15cm,取出,烘干,喷雾1%三氯化铝乙醇溶液,在紫外灯(365nm)下检视。

2.4.5 结果 供试品色谱中,在与对照品色谱相应的位置上显相同的暗紫色斑点,阴性对照品色谱中无此斑点。

2.5 甘草的鉴别

2.5.1 供试品溶液的制备 取金丹前列片20片,研细,取粉末4g,研细,加稀盐酸10ml、氯仿10ml,加热回流1h,放冷,分取氯仿液,水液再加氯仿10ml提取,合并氯仿液,蒸干,残渣加甲醇2ml使溶解,作为供试品溶液。

2.5.2 对照品溶液的制备 取甘草次酸对照品适量,加甲醇制成每1ml含1mg的溶液,作为对照品溶液。

2.5.3 阴性对照溶液的制备 取缺甘草全处方5倍量药材,制备方法同黄柏阴性对照溶液。

2.5.4 薄层色谱 照薄层色谱法^[1]试验,吸取供试品溶液2~5 μ l、对照品溶液2 μ l,分别点于同一以羧甲基纤维素钠

为粘合剂的硅胶GF254薄层板上,以石油醚(30~60℃)-氯仿-醋酸乙酯-冰醋酸(12:20:8:1)为展开剂,展开,取出、晾干,置紫外光灯(254nm)下检视。

2.5.5 结果 供试品色谱中,在与对照品色谱相应的位置上,显相同颜色的斑点,而阴性对照溶液无此斑点。

3 讨论

(1)本制剂对黄柏的鉴别,先用2005版《中国药典》黄柏项下的展开剂苯-醋酸乙酯-异丙醇-甲醇-浓氨试液进行试验,但发现拖尾现象严重。曾改变浓氨试液的比例、用氨蒸气饱和和方法,均没有解决拖尾现象,后采用本实验正丁醇-冰醋酸-水(10:1:1)为展开剂,基本解决了拖尾问题。

(2)由于本制剂主要是以醇为溶剂提取的制备工艺,丹参含有多种活性成分,在80%乙醇中的溶解度较大,加酸调pH值为2,则可使部分干扰成分沉淀除去,以乙酸乙酯萃取,使原儿茶醛转入乙酸乙酯中,以氯仿-丙酮-甲酸(10:2:1的)下层为展开剂,色谱分离度好,阴性对照无干扰。

(3)在制定标准中,我们曾对制剂中的生地、知母、白花蛇舌草进行了薄层色谱鉴别,结果重现性不好,故不能作为该制剂的质量控制指标。

本文提交的这5种薄层鉴别方法简便,结果稳定,重现性好,可用于金丹前列片的质量控制。

参考文献

[1]国家药典委员会,中华人民共和国药典(一部)[S].北京:化学工业出版社,2005:附录VI B.

(收稿日期:2007-03-26)

1.2 麻黄碱的来源

麻黄碱可以从麻黄植物中提取麻黄碱,也可以有机合成法合成麻黄碱、微生物发酵生成麻黄碱、细胞培养法生成麻黄碱。

2 麻黄的化学成分

麻黄主含生物碱,主要是 1-麻黄碱、d-伪麻黄碱、麻黄次碱及甲基麻黄碱和去甲基麻黄碱等,另含少量的挥发油、有机酸等成分。其中主要药用成分为麻黄碱和伪麻黄碱。麻黄碱是植物麻黄的主要药用成分之一。

3 麻黄与麻黄碱的药理作用之异同

3.1 麻黄的药理作用

3.1.1 发汗作用 麻黄发汗作用已为几千年临床所证实,古人也正是利用其发汗作用,治疗风寒束表、发热无汗的表实证。实验证明,麻黄的挥发油有发汗作用,也曾有人观察到在一般情况下,麻黄虽不能诱发人体出汗,但当人处在温热环境中,用麻黄 50~60 mg、经 0.5~2.0 h 后,汗腺分泌确比未用麻黄者更多、更快。其发汗作用,有人认为可能是由于麻黄阻碍了汗腺导管对钠的重吸收而导致汗液分泌增加。现已发现,麻黄根的生物碱部分能抑制低热和烟碱所致的发汗,此与临床经验相吻合。

3.1.2 平喘作用 麻黄平喘作用,沿用千年,但其作用及作用机理的探讨,直至 21 世纪 30 年代始进行。大量的试验研究证明,麻黄碱是平喘的有效成分。其平喘机理主要是通过以下环节实现的。

(1)促进肾上腺素能神经和肾上腺髓质嗜铬细胞释放去甲肾上腺素和肾上腺素而间接发挥拟肾上腺素的作用。

(2)因其化学结构与肾上腺素相似,亦可直接与支气管平滑肌上的 β -肾上腺素受体结合,使支气管平滑肌松弛。

(3)阻止过敏介质的释放。

(4)直接兴奋 α -肾上腺素受体,使末梢血管收缩,从而可缓解支气管粘膜的肿胀,对哮喘的发作和预防有效。

麻黄碱的平喘作用与肾上腺素相比,其特点是显效较慢,而作用温和、持久,且口服有效。

3.1.3 利尿作用 麻黄有一定的利尿作用,以 d-伪麻黄碱作用最显著。利尿作用的机理,有人认为是由于其扩张肾血管使肾血流增加的结果,也有人认为是阻碍肾小管对钠离子重吸收的缘故。

3.1.4 升高血压 麻黄碱能兴奋肾上腺素能神经

而使心跳加快,心肌收缩力增强,心输出增加,血管收缩,血压升高。因其同时兴奋 α 、 β -肾上腺素受体。故收缩压的升高较舒张压明显,其升压特点是缓慢、温和、持久,反复应用易产生快速耐受体。

3.1.5 兴奋中枢神经系统 麻黄对中枢神经系统有兴奋作用,以麻黄碱最为突出,治疗剂量即能兴奋大脑皮质和皮质下中枢,引起精神兴奋、失眠等症状,并可缩短巴比妥类催眠作用时间,亦能兴奋中脑,延脑呼吸中枢和血管运动中枢。

3.1.6 解热、抗病毒。

3.2 麻黄碱的药理作用

3.2.1 对心血管系统的作用 (1)对心脏的影响 麻黄碱通过激动 β 受体,加快心率,增加收缩力。(2)对血管及血压的影响 麻黄碱激动 α 受体而收缩动脉。麻黄碱和伪麻黄碱均有升高血压、增加心输出量的作用。

3.2.2 对胃肠道、气管、输精管等平滑活动的影响

麻黄碱激动 α 受体增强小鼠输精管的自发收缩活动,同时麻黄碱作用于突触前膜受体,而增强电刺激致小鼠输精管的收缩^[1,2]。激动 β 受体,舒张气管平滑肌,且麻黄碱与异丙肾上腺素有交叉脱敏现象^[3]。

3.2.3 对神经肌肉传递的作用 低浓度麻黄碱可通过选择性激动 β_2 受体,而拮抗高 K^+ 去极化引起的大鼠膈肌麻痹。

3.2.4 对中枢神经系统的作用 麻黄碱兴奋中枢神经系统。

4 讨论

麻黄是一种与麻黄碱同效的草药,而麻黄碱是其主要有有效成分之一,《中国药典》规定麻黄草中麻黄碱($C_{10}H_{15}NO$)的含量 0.8% 以上才符合药用标准。我国临床使用麻黄治疗疾病已有前年历史,临床证明确实有效,我院使用麻黄治疗慢性支气管炎、哮喘用量均在 15 g/剂,疗效明显,无明显不良反应,亦无含麻黄碱制剂所致的癫痫、脑溢血、高血压等不良反应出现。所以,笔者认为中药麻黄与麻黄碱有既有共性又有区别。

参考文献

- [1]束怀德.麻黄碱对小鼠输精管平滑肌的作用[J].生理学报,1983,35(2):142-148.
- [2]束怀德,金蓓,杨藻.麻黄碱抑制小鼠输精管电场刺激收缩的机制[J].生理学报,1986,38(6):583-588.
- [3]徐端正,贡沁燕,杨藻晟.离体豚鼠气管对麻黄碱的脱敏及肾上腺 β 受体的关系[J].中国药理学报,1987,8(4):309-317.

(收稿日期:2007-04-14)