

结果与讨论

(I)——(V) 诸分子的碳氧电荷值及解痉活性强度见表 3, 油水分配系数的对数值 ($\lg P_{o/c}$) 也一并列入, 以资参考。

表 3

化合物	碳氧电荷值	解痉活性强度 [1]	$\lg P_{o/c}$ [3]
I	1.323	+++	2.20
II	1.313	+++	1.20
III	1.306	++	1.58
IV	1.294	++	1.48
V	1.303	+	

根据上述, 提出以下几点供讨论

- 具共轭烯、醛酮结构的(I)——(V) 诸分子对支气管平滑肌的解痉活性与其碳氧电荷值呈正变关系 (苯甲醛除外)。
- 因这些物质没有带正电荷的阳离子头, 也没有形成金属螯合物的基团, 这些物质不是通过与肾上腺素能受体的作用而产生生理效应的, 其作用机制——是否与磷酸二酯酶酶蛋白表面上的亲电性基团结合, 使磷酸二酯酶失活, 从而阻断二酯酶分解 cAMP 的生化过程, 使 cAMP 在组织内的浓度增高, 发挥其解痉活性——有待进一步探讨。

参 考 文 献

- [1] 黄天俊等: 中华医学杂志, 57: 5, 301 (1977)
- [2] Ariëns E J: Drug Design Vol. I (Academic Press, 1971), P. 408
- [3] Albert Leo, et al: Chemical Reviews, 71: 6, 525 (1971)

※ ※ ※ ※ ※

水飞蓟宾水溶性衍生物的比较

水飞蓟宾为抗肝病的良好药物, 但极难溶于水, 也不易增溶或助溶, 影响药理及临床应用。对此, 江苏水飞蓟科研组试制了七种水飞蓟宾的水溶性衍生物: N-甲葡胺盐、二乙胺盐酸盐、半胱氨酸盐、镁络盐、六次甲基亚氨复合物、偏琥珀酸醋、酰酸酯, 并对这些水溶性衍生物进行纸层、薄层、显色反应、元素分析、紫外、红外光谱等分析鉴定。在七个水溶性衍生物中, 以酸性酰酸水飞蓟宾钠盐最为稳定。可制成注射剂, 水溶液的 pH 近中性, 能以流通蒸气灭菌, 冷藏或在贮存时间的澄明度、色泽不发生变化。稳定剂以大分子聚合物乙烯吡咯烷酮为理想。有关水飞蓟宾临床药理在继续研究中。

(吴知行)