

· 短讯 ·

中药大黄的生化研究

XIX 蒽醌衍生物对线粒体呼吸链的抑制部位

陈春麟* 陈琼华

(生物化学研究室)

本实验观察了大黄中活性较强的三种蒽醌衍生物如大黄素、大黄酸和芦荟大黄素对大鼠肝线粒体呼吸链四个电子传递复合体的影响。实验结果表明：上述三种蒽醌衍生物是线粒体呼吸链电子传递的抑制。1. 大黄酸、大黄素和芦荟大黄素对NADH脱氢酶（复合体Ⅰ）有不同程度的抑制作用。浓度为 $60\mu\text{g/ml}$ 时，抑制率分别为83.5%、66.0%和45.1%。50%抑制的药物浓度分别为 $22\mu\text{g/ml}$ 、 $38\mu\text{g/ml}$ 和 $72\mu\text{g/ml}$ 。2. 大黄素对琥珀酸脱氢酶（复合体Ⅱ）有较强的抑制作用。50%抑制的药物浓度为 $55\mu\text{g/ml}$ 。而大黄酸和芦荟大黄素对此酶只有轻微的抑制作用。3. 大黄素、大黄酸和芦荟大黄素对辅酶Q—细胞色素C还原酶（复合体Ⅲ）及细胞色素C氧化酶（复合体Ⅳ）也仅有轻微的抑制作用，浓度为 $60\mu\text{g/ml}$ ，抑制率均在20%以下。4. 动力学观察表明：大黄酸、大黄素和芦荟大黄素对NADH脱氢酶的抑制作用均为竞争性的，抑制常数 K_i 值分别为 $35\mu\text{M}$ 、 $60\mu\text{M}$ 和 $110\mu\text{M}$ 。由此可见，大黄蒽醌衍生物明显抑制线粒体呼吸链电子传递，使主要能源断绝，这可能是大黄蒽醌衍生物抗菌、抗癌作用机制之一。

