

论文

四氢异喹啉类生物碱对大鼠脑内 α 肾上腺素受体的作用

韩邦媛;刘国卿

中国药科大学药理教研室,南京; **1988届研究生

摘要:

应用放射受体结合法研究了近30种四氢异喹啉类(TIQs)生物碱对大鼠脑内 α 肾上腺素受体的作用。其中I-CBN,I-THC和I-STP对 α_1 受体亲和力最高, K_i 值为 $\sim 2.0 \times 10^{-7}$ mol/L。其次是DHS,XLP和I-DCT, K_i 值分别为 4.7×10^{-7} , 6.5×10^{-7} 和 7.6×10^{-7} mol/L。DHS对 α_2 受体亲和力最高($K_i=1.25 \times 10^{-6}$ mol/L),I-REM次之。对 α 受体亚型亲和力选择比 $K_i(\alpha_2)/K_i(\alpha_1)$ 最高的是I-STP(357)和XLP(154),它们对 α_2 受体几无亲和力($K_i > 10^{-4}$ mol/L)。提示I-STP和XLP对 α_1 受体有较高的选择性。I-SPD和I-THP对 α_1 和 α_2 受体亲和力相近,均为中等强度。THJ,DRC及I-TTD等6种TIQs对 α_1 和 α_2 受体均无亲和力($K_i > 10^{-4}$ mol/L)。

关键词: 四氢异喹啉类生物碱 左旋千金藤碱 左旋克班宁 左旋四氢黄连碱 α 肾上腺素受体

EFFECT OF TETRAHYDROISOQUINOLINE ALKALOIDS ON ALPHA ADRENOCEPTORS IN RAT BRAIN

BY Han and GQ Liu

Abstract:

About 30 tetrahydroisoquinolines have been investigated for their in vitro affinities to rat brain alpha adrenoceptors. I-Crebanine(1-CBN) and I-tetrahydrocoptisine (I-THC) were found to be the most potent inhibitors of [³H] WB 4101 binding to alpha-1 adrenoceptors ($K_i=1.9 \times 10^{-7}$ and 2.0×10^{-7} mol/L, respectively), I-Stephanine(I-STP), dehydrostephanine(DHS) and xylopine(XLP) were also shown to be effective on alpha-1 adrenoceptors ($K_i=2.8 \times 10^{-7}$, 4.7×10^{-7} and 6.5×10^{-7} mol/L, respectively). DHS appeared to be the most active in displacing [³H] clonidine binding to alpha-2 adrenoceptors ($K_i=1.25 \times 10^{-6}$ mol/L). I-tetrahydropalmatine(I-THP) and I-stepholidine (I-SPD) exhibited similar affinities to alpha-1 and alpha-2 adrenoceptors. Berbamine(BBA)interacted moderately with alpha-2 adrenoceptors ($K_i=6.16 \times 10^{-6}$ mol/L). I-STP and XLP have relatively high affinities to alpha-1 adrenoceptors (as above), but they did not show any affinity to alpha-2 adrenoceptors. Their alpha-1 and alpha-2 adrenoceptors binding selectivity ratios $K_i(\alpha_2)/K_i(\alpha_1)$ were 357 and 154 respectively. It is suggested that I-STP and XLP are more selective to alpha-1 adrenoceptors.

Keywords: I-Stephanine I-Crebanine I-Tetrahydrocoptisine Alpha adrenoceptors Tetrahydroisoquinoline alkaloids

收稿日期 1987-10-04 修回日期 网络版发布日期

DOI:

基金项目:

通讯作者:

作者简介:

参考文献:

本刊中的类似文章

1. 侯羽飞;刘国卿.粉防己碱,小檗胺等四氢异喹啉类生物碱对大鼠脑内M-胆碱受体的作用[J]. 药学报, 1988,23(11): 801-805
2. 陈曙光;刘国卿;闵知大.某些四氢异喹啉类生物碱对大鼠脑内多巴胺和5-羟色胺受体的作用[J]. 药学报, 1987,22(5): 341-346

扩展功能

本文信息

- Supporting info
- PDF (329KB)
- [HTML全文]
- 参考文献

服务与反馈

- 把本文推荐给朋友
- 加入我的书架
- 加入引用管理器
- 引用本文
- Email Alert
- 文章反馈
- 浏览反馈信息

本文关键词相关文章

- 四氢异喹啉类生物碱
- 左旋千金藤碱
- 左旋克班宁
- 左旋四氢黄连碱
- α 肾上腺素受体

本文作者相关文章

- 韩邦媛
- 刘国卿

PubMed

- Article by
- Article by

反馈人	<input type="text"/>	邮箱地址	<input type="text"/>
反馈标题	<input type="text"/>	验证码	<input type="text" value="0922"/>