

[本期目录] [下期目录] [过刊浏览] [高级检索]

[打印本页] [关闭]

论文

口服双氢青蒿素在兔和狗体内的药代动力学研究

赵凯存;宋振玉

中国医学科学院药物研究所,北京100050

摘要:

关键词: 青蒿素 双氢青蒿素 药代动力学 放射免疫测定法

THE PHARMACOKINETICS OF DIHYDROQINGHASU GIVEN ORALLY TO RABBITS AND DOGS

KC Zhao and ZY Song

Abstract:

Qinghaosu (QHS), also known as artemisinine and arteannuin, is isolated from the Chinese herb *Artemisia annua* L. It is highly active against both chloroquine-sensitive and chloroquine-resistant strains of *P. berghei* and has been approved by the Ministry of Health for the treatment of malaria. When QHS is treated with sodium borohydride, dihydroqinghaosu (DHQHS) is resulted with the antimalarial activity enhanced several fold. This paper reports the pharmacokinetics of DHQHS studied with the radioimmunoassay method. When the drug was given orally in tablet form to rabbits at doses of 10, 20 and 30 mg/kg, peak serum levels of 0.03, 0.05 and 0.13 μg/ml, respectively, were obtained in 1 to 2 h. The corresponding $T_{1/2}$ of the drug were found to be 1.19, 1.00 and 1.10 h and the MRTs were 1.73, 1.36 and 1.53 h. No significant difference between dosages used was observed. When dogs were given DHQHS tablets at the dose of 20 mg/kg, a peak serum concentration of 0.13 μg/ml was reached in about 2 h with a $T_{1/2}$ of 2.10 h and an MRT of 3.04 h. However, when dogs were given QHS tablets at the dose of 70 mg/kg, no drug was detected in the serum. It would appear that the bioavailability of DHQHS tablets is much higher than that of QHS when given orally to the dog.

Keywords: Artemisinine Arteannuin Dihydroqinghaosu Pharma cokinetics Qinghaosu

收稿日期 1989-02-01 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. 张东;杨岚;王满元;屠呦呦.HPLC-UV-ELSD法同时测定青蒿中青蒿素、青蒿乙素和青蒿酸的含量[J]. 药学学报, 2007, 42(9): 978-981
2. 王增;周慧君.二氢青蒿素下调粒系白血病细胞转铁蛋白受体表达[J]. 药学学报, 2008, 43(6): 576-583
3. 杨树德;马建民;孙娟华;陈端霞.静脉注射青蒿酯后人体尿药排泄数据的初步分析[J]. 药学学报, 1987, 22(6): 401-404
4. 李成韶;杜以兰.效量半衰期 $t_{1/2(ED)}$ 及其计算公式[J]. 药学学报, 1986, 21(3): 165-169
5. 赵凯存;陈其明;宋振玉.青蒿素及其两个活性衍生物在狗体内药代动力学的研究[J]. 药学学报, 1986, 21(10): 736-739
6. 李成韶;杜以兰;姜齐.伯氏疟原虫对青蒿素抗药性的研究[J]. 药学学报, 1986, 21(11): 811-815
7. 李英;陈一心;虞佩琳;嵇汝运.青蒿素类似物的研究——VI.从青蒿素降解产物双酮合成二氢青蒿酸的研究[J]. 药

扩展功能

本文信息

► Supporting info

► PDF(176KB)

► [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

► 青蒿素

► 双氢青蒿素

► 药代动力学

► 放射免疫测定法

本文作者相关文章

► 赵凯存

► 宋振玉

PubMed

► Article by

► Article by

- 学学报, 1986, 21(12): 899-905
8. 陈一心; 虞佩琳; 李英; 嵇汝运. 青蒿素类似物的研究 III. 二氢青蒿素二元酸双酯和单酯类衍生物的合成[J]. 药学学报, 1985, 20(2): 105-111
9. 虞佩琳; 陈一心; 李英; 嵇汝运. 青蒿素类似物的研究 IV. 含卤素、氮、硫等杂原子的青蒿素衍生物的合成[J]. 药学学报, 1985, 20(5): 357-365
10. 张秀琴; 徐礼燊. 中药青蒿中青蒿素的脉冲极谱测定法[J]. 药学学报, 1985, 20(5): 383-386
11. 李高德. 伯氏疟原虫K173株对喹哌抗药性的实验研究[J]. 药学学报, 1985, 20(6): 412-417
12. 杨树德; 马建民; 孙娟华; 宋振玉. 还原型电化学极谱检测高效液相色谱法测定人血浆中青蒿素和双氢青蒿素[J]. 药学学报, 1985, 20(6): 457-462
13. 陈一心; 虞佩琳; 李英; 嵇汝运. 青蒿素类似物的研究 VII. 双(二氢青蒿素)醚和双(二氢脱氧青蒿素)醚类化合物的合成[J]. 药学学报, 1985, 20(6): 470-473
14. 李锐; 周莉玲; 李迅; 钟镜金; 李灿辉; 廖灶引. 应用气—质联用等法对青蒿素体内命运的研究[J]. 药学学报, 1985, 20(7): 485-490
15. 宋振玉; 赵凯存; 梁晓天; 刘春雪; 仪明光. 青蒿素和青蒿素的放射免疫测定法[J]. 药学学报, 1985, 20(8): 610-614
16. 周晋; 杜智敏; 邱晓红; 孙建平; 何树庄; 杨宝峰. 抗疟药青蒿素抗心律失常的作用机制[J]. 药学学报, 1999, 34(8): 569-572
17. 张景丽; 李金翠; 吴毓林. 臭氧化合成青蒿素类似物[J]. 药学学报, 1988, 23(6): 452-455
18. 王仲山; 曹秀玲. 二氢青蒿素的变旋作用与差向异构体转化研究[J]. 药学学报, 1988, 23(8): 610-615
19. 李成韶; 杜以兰; 张翠莲; 赵新静. 双氢青蒿素对小鼠抗疟作用的药效动力学[J]. 药学学报, 1989, 24(7): 487-489
20. 赵凯存; 宋振玉. 双氢青蒿素在人的药代动力学及与青蒿素的比较[J]. 药学学报, 1993, 28(5): 342-346
21. 李英; 杨正修; 陈一心; 章辛. $15-^{14}\text{C}$ 标记青蒿素的合成[J]. 药学学报, 1994, 29(9): 713-716
22. 麋竞芳. 若干青蒿素和青蒿乙素反应中间体的圆二色谱研究[J]. 药学学报, 1991, 26(7): 557-560
23. 叶斌; 吴毓林; 李国福; 焦岫卿. 脱羧青蒿素的抗疟活性[J]. 药学学报, 1991, 26(3): 228-230
24. 赵凯存; 宣文漪; 赵一; 宋振玉. 青蒿琥酯皮肤擦剂在小鼠和兔体内的药代动力学研究[J]. 药学学报, 1989, 24(11): 813-816
25. 李茵; 周慧君. 二氢青蒿素抑制K562细胞血管内皮生长因子的表达[J]. 药学学报, 2005, 40(11): 1041-1045
26. 杨忠顺; 李英. 与青蒿素相关的1,2,4-三恶烷及臭氧化物的研究进展[J]. 药学学报, 2005, 40(12): 1057-1063
27. 张建新; 王峻霞; 张瑜; 左建平; 吴锦明; 隋毅; 李英. 具有免疫抑制作用的含有聚乙二醇基的青蒿素衍生物的合成[J]. 药学学报, 2006, 41(1): 65-70
28. 梁瑞玲; 刘天伟; 屈凌波; 唐明生; 相秉仁. 基于过氧键裂解的青蒿素抗疟机制量子化学研基于过氧键裂解的青蒿素抗疟机制量子化学研究[J]. 药学学报, 2006, 41(6): 544-547
29. 麋竞芳; 沈春镒. 用旋光谱和圆二色谱研究青蒿素降解产物失碳倍半萜内酯的立体化学[J]. 药学学报, 1984, 19(3): 184-189
30. 李成韶; 杜以兰. 根据青蒿素药效半衰期制订给药方案的探讨[J]. 药学学报, 1984, 19(6): 410-414
31. 曾衍霖; 李端; 严汉英. 用平均吸收率计算吸收速率常数[J]. 药学学报, 1982, 17(3): 171-175
32. 张银娣; 王长根; 许帼英; 庄怡华; 曾衍霖. 血浆中甲基还原青蒿素(蒿甲醚)的薄层扫描定量法[J]. 药学学报, 1982, 17(3): 212-217
33. 麋竞芳; 沈春镒. 若干青蒿素合成中间体的旋光谱[J]. 药学学报, 1982, 17(6): 421-424
34. 邵葆若; 叶秀玉; 郑浩. 伯氏鼠疟原虫(*Plasmodium berghei*)对咯萘啶抗药性的研究[J]. 药学学报, 1982, 17(8): 566-571
35. 李万亥; 束汉麟; 许国英; 曾衍霖. 青蒿素及其衍生物与血浆蛋白的结合[J]. 药学学报, 1982, 17(10): 783-786
36. 柳乃方; 屈凌波; 相秉仁; 杨冉. 青蒿素类化合物抗肿瘤机制研究—青蒿素类化合物/转铁蛋白对接研究[J]. 药学学报, 2009, 44(2): 140-144

文章评论 (请注意: 本站实行文责自负, 请不要发表与学术无关的内容! 评论内容不代表本站观点.)

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"/> 2015

