

产品名称: 石杉碱甲
学名: Huperzine A
CAS编号: 102518-79-6
别名: 石杉碱甲 ; (-)-Huperzine A;(-)-Selagine
分子式: C₁₅H₁₈N₂O
分子量: 242.31622
纯度: 98%
品牌: pureonebio
规格: 10mg/20mg

详细信息:

[石杉碱甲的来源]

]本品系由石杉科植物千层塔Huperzinaserrata(Thumb.)Trev中提取的一种生物碱，是一强效的胆碱酯酶可逆性抑制剂，其作用特点与新斯的明相似，但作用维持时间比后者为长。

[石杉碱甲的药理作用]

]动物实验表明，本品对AChE的抑制强度进行了不同药物间的效价比较，结果为：石杉碱甲>毒扁豆碱>新斯的明>石杉碱乙>加兰他敏；对BuChE的抑制强度依次为：毒扁豆碱>新斯的明>石杉碱甲>石杉碱乙。本品加强间接电刺激神经引起的肌肉收缩振幅作用，以及增强增强大鼠的记忆功能的作用均强于毒扁豆碱，但毒性低于毒扁豆碱，作用时间长。急性毒性试验：小鼠腹腔注射的LD₅₀为1.8mg/kg，大鼠为5mg/kg。亚急性毒性试验，给予相当于临床剂量的45倍，给药6个月，结果无明显毒副作用。此外，也未见致畸、诱变作用。

[石杉碱甲的用途]石杉碱甲它易透过血脑屏障，对脑内乙酰胆碱酯酶(AchE)具有强效抑制作用，明显提高脑内乙酰胆碱水平，是AchE一种可逆性的抑制剂。经注射或ig该药，有明显促进学习、记忆过程或明显改善记忆障碍的作用，且选择性分布在皮质海马等与学习、记忆有关的脑区。石杉碱甲片用于治疗良性衰老性遗忘症（Beniga Senescent Forgetfulners BSF）和阿尔采末病（Alzeheimers Disease，AD）有良好疗效。

[石杉碱甲的其它资料]

1.石杉碱甲的药理作用及临床应用

石杉碱甲又名福定碱,是从石杉科石杉属蛇足石杉(千层塔)中分离出的一种生物碱,化学名为(5R,9R,11E)-5-氨基-11-亚乙基-5,6,9,10-四氢-7-甲基-5,9-亚甲基环芳辛并(b)吡啶-2(1H)酮,商品名为双益平、哈伯因。1993年美国FDA批准上市,1996年我国批准为二类新药,用于治疗阿尔海默茨病(AD),是第二代乙酰胆碱酯酶抑制剂。

2.石杉碱甲预防有机磷类神经毒剂攻击的研究

有机磷类神经性毒剂是不可逆的胆碱酯酶抑制剂，毒性高，不易觉察，既是恐怖活动和化学战中最可能使用的毒剂，更是国内外防化医学研究的重点，但目前国际上并无理想的预防用药。石杉碱甲(Huperzine A)是从中草药蛇足石杉中分离所得到的天然产物，其化学名为(5R, 9R, 11E)-5-氨基-11-亚乙基-5, 6, 9, 10-四氢-7-甲基-5, 9-亚甲基环辛四烯并(b)吡啶-2(1H)酮，是一种乙酰胆碱酯酶的可逆性抑制剂，有望对神经性毒剂引起的中毒具有较好的预防作用。目前国内尚未见有

关石杉碱甲预防神经毒剂攻击的报道。本课题旨在研究石杉碱甲抑制胆碱酯酶活性的基本特点、预防神经毒剂攻击的效果、筛选最佳预防剂量并与目前国际上使用的溴化吡啶斯的明作比较，以期用其取代溴化吡啶斯的明，用作神经毒剂中毒的预防药物，为实际应用提供依据，具有一定的经济、社会效益。方法：本研究共分为四个部分。第一部分为胆碱酯酶测定方法的建立及改进。对全血胆碱酯酶活性的分光光度测定方法(WS / T67—1996)加以改进并绘制标准曲线；第二部分为石杉碱甲对胆碱酯酶活性抑制作用的研究。

3.从蛇足石杉中分离纯化石杉碱甲的工艺研究

蛇足石杉是我国的传统中药，在民间用于利尿止血，痙挛肿痛已有几千年的历史。近年来，从蛇足石杉中提取的一种生物碱成分——石杉碱甲，具有抑制乙酰胆碱酯酶的活性，用于老年痴呆症的治疗，并被认为是最有前景的一类药物。虽然石杉碱甲及其类似物的化学合成已有报道，但因其合成成本过高，利用植物提取目前仍是石杉碱甲的主要来源。本文在详细总结了目前天然产物及中草药有效成分的提取和分离的基础上，简要介绍了石杉碱甲(Huperzine A, Hup A)结构、性质、应用及其提取理论，并对石杉碱甲的含量分析、提取和纯化工艺进行了研究。在研究中，我们首先建立了适合目标产物的快速、准确、重现性好的HPLC分析检测方法，作为在分离过程中跟踪检测目标产物的手段，并应用于蛇足石杉植物的不同部位石杉碱甲含量测定。色谱条件：色谱柱：Symmetry C₁₈柱；流动相：乙腈：0.028M KH₂PO₄(12：88)；检测波长：311nm；灵敏度：0.01AUFS。石杉碱甲对照品溶液质量在0.8—4.0 μg内与峰面积呈良好线性关系，r为0.99964；回收率为100.098%...

4.石杉碱甲抑制海洛因自身给药大鼠线索或海洛因诱导的觅药行为

药物成瘾是一种以复吸为特征的慢性脑疾病，成瘾性药物激活了与奖赏和学习记忆有关的神经环路，长期使用造成了神经通路的神经元适应性变化从而使机体对环境和毒品产生异常的联系，当再次暴露可以产生强迫性的用药和心理渴求。本实验室已发现乙酰胆碱参与海洛因精神依赖和复吸过程。本课题主要通过观察胆碱酯酶抑制剂石杉碱甲系统给药或核团给药查明胆碱能神经在海洛因奖赏和复吸过程中的作用，查明背外侧被盖核(laterodorsal tegmental nucleus, LDTg)/脚桥被盖核(pedunculopontine tegmental nucleus, PPTg)核团胆碱能神经传导在消退后条件性线索诱导海洛因复吸中的作用，以期发现新的参与海洛因复吸的神经通路，并为海洛因复吸的防治提供实验依据。方法：雄性SD大鼠应用FR5强化程序建立自身给予蔗糖模型，全程训练七天。自身给予蔗糖训练笼设置两侧对称的触鼻反应器，有效鼻触器内绿灯亮，此时一个有效鼻触得到蔗糖颗粒，同时熄灭绿灯，开启实验笼灯，给药结束后进入下一个给药循环，此时仅记录鼻触反应。自身给予蔗糖行为稳定后，观察石杉碱甲对大鼠自身给予蔗糖行为的影响。数据记录...

总机: 021-50278061

邮箱: info@pureonebio.com

网址: <http://www.pureonebio.com>