

论文

(E)-2-(4-二乙基胺甲基-苯亚甲基)-5,6-二甲氧基-2,3-二氢-1-茛菪酮与P-糖蛋白的相互作用

夏宗玲;应景艳;孙芳;曾苏;姚彤炜

1. 浙江大学 药学院, 浙江 杭州 310058; 2. 常州市第一人民医院, 江苏 常州 213000

摘要:

考察(E)-2-(4-二乙基胺甲基-苯亚甲基)-5,6-二甲氧基-2,3-二氢-1-茛菪酮(BYZX)在Bcap37和P-糖蛋白(P-gp)高表达的Bcap37/MDR1细胞中的积聚差异,以确证BYZX是否为P-gp的底物。同时,以罗丹明123为底物,比较在上述两种细胞中BYZX对罗丹明123积聚的影响,从而确证BYZX是否是P-gp的抑制剂。采用HPLC法测定BYZX在两种细胞中的累积量,酶标仪法测定细胞内罗丹明123的荧光强度。实验结果显示,BYZX在Bcap37及Bcap37/MDR1细胞内不同时间下的积聚量无明显差异(P>0.05),且不同浓度的BYZX对罗丹明123的外排亦无明显的抑制作用(P>0.05)。这一结果表明BYZX与P-gp没有明显的相互作用,不会被P-gp外排到细胞外而影响其吸收,同时BYZX对P-gp也不存在抑制作用。

关键词: P-糖蛋白 (E)-2-(4-二乙基胺甲基)-5,6-二甲氧基-2,3-二氢-1-茛菪酮 罗丹明123 维拉帕米

Interaction between (E)-2-(4-(diethylamino methyl) benzylidene)-5,6-dimethoxy-2,3-dihydroinden-one and P-glycoprotein

XIA Zong-ling; YING Jing-yan; SUN Fang; ZENG Su; YAO Tong-wei

Abstract:

Cell lines of Bcap37 and Bcap37/MDR1 (the high P-glycoprotein (P-gp) expressing cell line) were used as model to investigate the different accumulations of (E)-2-(4-(diethylamino methyl) benzylidene)-5,6-dimethoxy-2,3-dihydroinden-one (BYZX) in the two kinds of cells. It was authenticated that whether BYZX was the substrate of P-gp. Meanwhile, the inhibitive effects of BYZX on the P-gp were investigated by determining the fluorescence intensity of rhodamine 123 in the model cells, with and without BYZX. A reversed-phase high-performance liquid chromatography (RP-HPLC) method was used to determine the accumulations of BYZX in the two cells. The results showed that the amount of BYZX accumulation in Bcap37/MDR1 cells were as many as those in Bcap37 cells (P>0.05), and the concentrations of BYZX accumulated in the Bcap37/MDR1 cells did not increase when co-incubated with P-gp inhibitor verapamil. Furthermore, different concentrations of BYZX also had no effects on the efflux of rhodamine 123 (P>0.05). These results indicated that there were no interactions between BYZX and P-gp. BYZX will not be pumped out of the cells, and it also not inhibited the P-gp. It was the useful advantage for its absorption.

Keywords: E-2-[4-(diethylamino methyl) benzylidene]-5,6-dimethoxy-2,3-dihydroinden-one Rhodamine123 verapamil P-glycoprotein

收稿日期 2007-07-02 修回日期 网络版发布日期

DOI:

基金项目:

通讯作者: 姚彤炜

作者简介:

参考文献:

本刊中的类似文章

1. 刘晓磊;唐靖;宋娟;何娟;徐萍;彭文兴.川芎嗪对大鼠灌服环孢素A药代动力学的影响[J]. 药学报, 2006,41(9): 882-887
2. 师以康;吴淑英;黄云虹;甄永苏.基因mdr1高表达多药耐药肿瘤细胞对力达霉素的药物敏感性[J]. 药学报, 2006,41(12): 1146-1151

扩展功能

本文信息

- ▶ Supporting info
- ▶ PDF(169KB)
- ▶ [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

- ▶ P-糖蛋白
- ▶ (E)-2-(4-二乙基胺甲基)-5,6-二甲氧基-2,3-二氢-1-茛菪酮
- ▶ 罗丹明123
- ▶ 维拉帕米

本文作者相关文章

- ▶ 夏宗玲
- ▶ 应景艳
- ▶ 孙芳
- ▶ 曾苏
- ▶ 姚彤炜

PubMed

- ▶ Article by
- ▶ Article by
- ▶ Article by
- ▶ Article by
- ▶ Article by

3. 史成军;符立梧.P-糖蛋白的表O达和功能活性调控研究进展[J]. 药学学报, 2007,42(9): 911-916
4. 黄建耿;斯陆勤;左克源;吴祥根;裘军;李高.普朗尼克抑制P-糖蛋白泵的作用[J]. 药学学报, 2007,42(9): 989-994
5. 李国锋;王春霞;晏媛;岸本展明;山本昌.体外扩散池法评价瑞巴派特经大鼠肠黏膜的透过特性[J]. 药学学报, 2008,43(3): 314-317
6. 李恩;李燕.P-糖蛋白对布格味喃大鼠肠道吸收的影响[J]. 药学学报, 2008,43(4): 361-365
7. 王天晓;杨晓虹.功劳木中异汉防己碱对P-糖蛋白介导的人乳腺癌细胞多药耐药性的逆转作用[J]. 药学学报, 2008,43(5): 461-466
8. 刘瑶;曾苏.MDCK-MDR1细胞模型及其在药物透过研究中的应用进展[J]. 药学学报, 2008,43(6): 559-564
9. 张伟;方晓玲.泊洛沙姆在药物穿越血脑屏障中的重要作用[J]. 药学学报, 2008,43(9): 890-897
10. 闫方;斯陆勤;黄建耿;李高.肠道P-糖蛋白辅料抑制剂的研究进展[J]. 药学学报, 2008,43(11): 1071-1076
11. 符立梧;谭炳炎;梁永钜;潘启超;黄红兵;冯公侃.Bullatacin克服肿瘤多药抗性作用及其机理[J]. 药学学报, 1999,34(4): 268-271
12. 符立梧;何丽容;梁永钜;陈黎明;熊慧瑜;杨小平;潘启超.番荔枝内酯单体89-2实验治疗KBv200及KB细胞移植瘤的作用[J]. 药学学报, 2003,38(8): 565-570
13. 齐静;彭晖;高瀛岱;徐晨;梁中琴;顾振纶;杨纯正.抗P-糖蛋白多肽模拟物的设计、合成与活性评价抗P-糖蛋白多肽模拟物的设计、合成与活性评价[J]. 药学学报, 2003,38(11): 826-830
14. 祝浩杰;吴玉林;刘国卿.洛美利嗪逆转K562/ADM细胞多药耐药性[J]. 药学学报, 2004,39(5): 333-337
15. 李佩茵;林晨.人卵巢癌细胞阿霉素耐药株的建立及其耐药机制的探讨[J]. 药学学报, 1995,30(4): -
16. 沙先谊;方晓玲;;吴云娟.9-硝基喜树碱在Caco-2细胞模型中的体外摄取、转运及外排动力学[J]. 药学学报, 2004,39(10): 839-843
17. 焦正;梁惠琪;丁俊杰;李中东;施孝金;钟明康.MDR1基因多态性对口服环孢素A药代动力学的影响[J]. 药学学报, 2004,39(12): 971-974
18. 苏成业.P-糖蛋白在药物代谢动力学中的作用及其临床意义[J]. 药学学报, 2005,40(8): 673-679
19. 王磊 李宁 韩得恩 孙伟 高子栋 陈西敬.环孢素A对银杏内酯B大鼠体内药动学的影响[J]. 药学学报, 2009,44(6): 632-639
20. 吴 娟 沙先谊 方晓玲.阿立哌唑在Caco-2细胞单层模型中的跨膜转运[J]. 药学学报, 2009,44(2): 188-191

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 style="width: 95%;" type="text"/>	邮 箱 地 址	<input style="width: 95%;" type="text"/>
反 馈 标 题	<input style="width: 95%;" type="text"/>	验 证 码	<input style="width: 40%;" type="text"/> 1789