

中药制剂酶类制剂 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/18/2021_2022__E4_B8_AD_E8_8D_AF_E5_88_B6_E5_c23_18174.htm 在人类和动植物活的机体中，普遍存在一类特殊蛋白质。它们参与生化反应，而且使反应进行得极快，这类物质是天然催化剂——酶类。酶具有高度专一性和极高的活性，使有机化合物在体内以一定的反应顺序转换。酶是生物细胞合成的，存在于细胞内的称为胞内酶；由细胞内合成而分泌到细胞外起作用的酶称作胞外酶。各种动物器官、组织和体液中含有酶的种类和数量差别甚大。通常所含酶的总量并不很少，但每一种酶的含量却很少，常在百万分之几至百分之几。因此酶的提取、分离、纯化与确认要靠较高水平的生物化学技术。酶的发现是十九世纪（1833年）有人从麦芽浸液中提得第一个具有活力的蛋白质——淀粉酶。到目前科学家们已从生物体内提纯确认出八百多种酶。但是应用到医药方面作为医药用的酶类制剂不过才有几十种。然而，祖国医药学对含酶类药物的记述确很早，如《药品化义》中记载：“大麦芽，炒香开胃，以除烦闷；生用力猛，主消麦面食积，症瘕气结，胸膈胀满，郁结痰涎，小儿伤乳，又能行上焦滞血。若女人气血壮盛，或产后无儿饮乳，乳房胀痛，丹溪用此二两，炒香捣去皮为末，分作四服立消，其性气之锐，散血行气，迅速如此，勿轻视之”。又如《本草蒙荃》中记载：牛肚“健脾胃，免饮积食伤”等等。由于受技术限制，而未能进一步提纯入药。但由此说明，酶类制剂与中药已早有渊源关系，现在我们讨论酶类制剂，也可认为是中药制剂的发展。酶类制剂的分类 酶制

剂按其临床应用来分类，主要有以下几种：消化类：这类酶研究最早，是品种最多的一类酶。它们的作用是消化和分解食物中各种成分，如淀粉、脂肪、蛋白质等使变成比较简单的物质，便利肠胃道的吸收。当体内消化系统失调，消化液分泌不足时，服用这一类酶就能够补充和纠正体内消化酶的不足，恢复正常消化机能。在这一类酶中主要有胃蛋白酶、胰酶、淀粉酶、纤维素酶、木瓜酶、凝乳酶、无花果酶、菠萝酶等。抗炎净创类：这一类酶是目前在治疗上发展最快，用途最广的一种。这种酶大多数都是蛋白质水解酶，能够分解发炎部位纤维蛋白的凝结物，消除伤口周围的坏疽、腐肉和碎屑。其中有些酶能够分解脓液中的核蛋白使成简单的嘌呤和嘧啶，降低脓液的粘性、达到净洁创口、消除痂皮、排除脓液抗炎消肿的目的。在这一类酶中，主要有胰蛋白酶、糜蛋白酶、双链酶， α -淀粉酶、胰脱氧核糖核酸酶等。给药的方法有外敷、喷雾、灌注、注射、口服等。它们可以单独使用，也可以与抗菌素等合用，治疗各种溃疡、炎症、血肿、脓胸、肺炎、支气管扩张、气喘等症。血凝和解凝类：这一类酶都是从血液中提取出来的，有的能促使血液凝固，有的却能溶解血块。凝血酶的作用是促使血中纤维蛋白元变成不溶性纤维蛋白，从而促使血液凝固，防止微血管出血。纤维蛋白溶解酶的作用是溶解血块，为目前临床上最新的一种酶制品……治疗血栓静脉炎、冠状动脉栓塞等。解毒类：这一类酶的主要作用是解除体内或因注射某种药物产生的一种有害物质。主要品种有青霉素酶、过氧化氢酶和组织胺酶等。青霉素酶能够分解青霉素分子中的 β -内酰胺环，使变成青霉噻唑酸，消除因注射青霉素引起的过敏反应。诊断类：

这一类酶是用作临床上各种生化检查的试剂，帮助临床诊断。最常用的有葡萄糖氧化酶，一葡萄糖苷酸酶和尿素酶。如尿素酶是测定血液中尿素的浓度和尿中尿素的含量的，从而可检查肾功能。酶制剂的一般提取方法：酶的制备一般包括三个基本步骤，即提取、纯化和结晶（或制剂）。首先将所需要的酶从原料中引入溶液，此时不可避免地要夹带着一些杂质，而后再将酶从溶液中选择地分离出来，或者从酶溶液中选择地除去杂质，最后制成纯净的酶制剂。

1) 酶的提取

胞外酶可以直接进行提取分离；胞内游离存在的“离酶”以及与颗粒体（如细胞核、线粒体、微粒体、质膜）结合的“结酶”都有一个破碎细胞过程，“结酶”还有一个转变成水溶液的问题。因此对酶类的提取要采用多种方法，常用的细胞破碎法如下：

机械法：如绞碎、刨碎、匀浆、研磨、挤压或超声波等。研磨时还可加入细砂、石英粉、氧化铝等以利细胞破碎。

化学法：用盐、碱、表面活性剂、EDTA、丙酮和正丁醇等可使细胞破碎、颗粒体结构解体，从而把酶释放出来。例如常将胰脏用数倍量丙酮处理2~3次，制成丙酮粉供多种酶的提取用；用胆酸盐处理膜结构上的脂蛋白和“结酶”，使两者形成复合物，并带上静电荷，由于电荷之间的排斥作用，使膜破裂，达到溶解。

酶解法：用组织自溶或用溶菌酶、脱氧核糖核酸酶、磷脂酶等降解细胞膜结构，然后再进行提取。但应知道组织自溶法对某些酶的提取是不利的，如胰蛋白是以酶原形式纯化后再激活成胰蛋白酶的，若用自溶法提取，酶原已转成酶，纯化就很困难。而用纯的工具酶降解法是无此缺点，但成本较高。

冻融法：采用反复冷冻与融化时由于细胞中形成了冰晶及剩余液体中盐浓度的增

高可以使细胞破裂。酶的提取溶剂可以用水、一定浓度的乙醇、乙二醇、丁醇和稀盐溶液、缓冲溶液等；也可以用稀碱或稀酸溶液，如用稀硫酸提取胰蛋白酶，用稀盐酸提取胃蛋白酶。溶剂用量一般为原料重量的1~5倍。搅拌可加速提取，但转速不宜太快，否则会产生泡沫而难以过滤或使酶变性。多数酶的提取要在50C以下操作，但有的酶在较高温度下提取更好，如胃蛋白酶在450C提得收率较高，一般可在-5~+400C间适当选择。提取液的pH应在酶的稳定pH范围内，并应远离其等电点的pH为宜，如蛋白酶选用pH2.5~3.0，胰蛋白酶和糜蛋白酶则用0.25 N硫酸提取。若在中性或碱性提取时，最常用的是0.15 mol/L氯化钠、0.02~0.05 mol/L磷酸缓冲液、0.02-0.05 mol/L焦磷酸缓冲液。正丁醇的亲脂性强，能透入酶的脂质结合物中，又兼有亲水性，有类似表面活性剂的作用，适用于提取“结酶”。

100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 www.100test.com