

国内外药物简讯(1987年2季度)

· **药物新源——腐植酸**: 腐植酸是一个有机高分子混合物, 分子中既有芳香核, 又有脂肪链, 核上带有一个或几个官能团, 如羧基、羟基、醌基等。这些官能团能使腐植酸具有离子交换能力、氧化还原能力、螯合能力以及生理活性等。所以腐植酸具有影响机体分泌、抑制透明酸酶和提高机体免疫的作用。临床试用表明, 腐植酸具有止血和活血作用。无论对外伤性出血、消化道出血和拔牙出血等均有止血功效。腐植酸还具有明显的收敛、消肿、去腐生肌的作用, 可用于消炎或促进溃疡的愈合。据报道北京一家医院用腐植酸治疗慢性胃溃疡, 总有效率达87.7%; 特别是治疗结肠炎效果更为明显。浙江、北京、云南等地试验用腐植酸治疗痔疮、眼外伤、眼角膜溃疡、风湿病和妇产科疾病等, 也取得了很好的效果。(医药)

· **佳乐定片**是近年来发展的一种新型中枢神经系统用药, 对失眠症、癫痫病、焦虑症、忧郁症有效, 其剂量小、作用快、毒性低。

藻酸双酯钠是以海藻提取物为基础原料, 属肝素类防治缺血性心、脑血管疾病的新药。具有抗血凝、降血脂、降血压、降血糖、改善微循环等多种功效。(药经)

· 1987年春季广交会上, 原料药的出口有一个明显的特点, 即适销货源紧俏, 价格升幅可观, 尤为突出的是以下几类药物: 抗生素、磺胺类、维生素(特别是VC、V-B₆)、解热镇痛抗炎药、寄生虫药、心血管系统用药等。(药经)

· **免疫药物的发展趋向**: 由于对疾病和药物作用的分子机理研究日益深入, 免疫药物将从粗糙的大分子制剂过渡到活性强的小分子纯化药物; 提高选择性, 减少副作用,

环孢菌素A为其代表, 该药作用于T、B细胞, 在抗排斥和抑制自身免疫反应的几个环节上针对性极强, 对骨髓造血细胞的毒性远较其他免疫抑制剂低; 开发和利用内源性免疫调节剂, 白细胞间介素、干扰素、神经肽等, 可提供高效无毒的新药和治疗途径; 单克隆抗体提高了药物的导向性, 在免疫诊断和治疗中其前景不可估量; 发掘具有免疫活性的天然物质, 如中药人参、黄芪、某些多糖类药物的研究已有重大突破。(药信)

· **只降低体重不降低体力的减肥良药**“减肥降脂灵”经过近四百例临床验证, 有效率达91.5%。这种减肥药经临床验证, 平均每个疗程可降低体重2~3公斤, 不但有良好的降脂效果, 并且达到了国际上减肥保健药物必须达到的三项标准: 不厌食、不腹泻、减轻体重而不降低体力。(药信)

· 在对中草药进行广泛筛选中发现, 仙鹤草具有抗癌作用和止痛功能。它的优点是杀伤癌细胞而不损坏正常细胞, 且能促进新细胞的生长发育。经试验证明仙鹤草对子宫癌细胞抑制有效。每天用仙鹤草40克, 加水60倍, 煎后去渣熬成浓汁, 分三次用温水送服, 连服三个月见效。(药信)

· 对偏头痛等疾病有显著镇痛、安定作用的药物泰必利已于目前投产推向市场。它对血管性头痛、神经性头痛和典型偏头痛的有效率达85%以上; 对老年性精神运动障碍有效率达84.3%; 对抽动——秽语综合症有效率达75.8%; 对迟发性运动障碍有效率达69.2%。泰必利的疗效主要由于对脑内多巴胺受体具有选择性阻滞作用, 并抑制了机体对疼痛刺激的高度紧张反应。

· 美国科罗拉多州立大学一位生物化学家研制出一种全新止痛药, 止痛原理与以往

所有镇痛药不同，其止痛功能几乎可达百分之一百。令人体产生痛感的化学物质是一种存在于血液中的“徐缓蛋白”，它平时附在血液中一种被称为“先驱”的分子之上并不断在血液中流动。每当身体任何部位出现损伤时，“徐缓蛋白”就会从“先驱”中析出，聚集到损伤部位的神经讯音接收器上，引发痛感，经由神经传导到神经中枢。该药由人工化学合成，具有和“徐缓蛋白”一样的依附特性，进入血管后同样紧附在伤口附近的神经讯息接收器上，因而“徐缓蛋白”无法进入接收器，就消除了痛感。美国诺华制药厂已开始试产此药，不久将正式问世。（药经）

• 以色列与美国康奈尔大学正共同试验二甲基硫脲的新作用——对黑色素瘤的抗增殖作用。二甲基硫脲（DMTU）本来是用于抑制甲状腺功能的药物，在加入老鼠黑瘤细胞培养中，可以抑制其生长及形态学变化，并发现它增加了细胞的黑色素含量，减少了恶性黑瘤的发生。动物活体试验发现接种黑瘤细胞的老鼠，给予DMTU后延迟了肿瘤的显现，延长了生存期。

• 东京医科大学讲师羽田发表的一篇试验报告认为，人参汤和小柴胡汤可增加艾滋病感染者的淋巴细胞数量，特别是人参汤可使吞噬艾滋病毒的NK细胞增加，从而提高人体的免疫力。羽田曾对9名感染艾滋病毒的患者作过试验，其中4人服用人参汤，5人服用小柴胡汤，发现服用人参汤的患者中有3人NK细胞增多，本来受艾滋病毒影响而减少的核酸T细胞增加了0.5至0.6倍。羽田认为这项研究成果对预防艾滋病带来了希望。（医药）

• 从六十年代末首先发现含铂化合物——“顺氯氨铂”可作为抗癌药物以来，西方国家又陆续筛选出一系列可抗肿瘤的有机金属化合物。其中包括顺氯金，二氯环戊二烯钛以及5-磺酸基水杨酸铂等等。（药经）

• 抗凝药肝素可以提供一种安全、有效

而价廉的方法，使早期心肌梗塞病人阻断的冠状动脉得以再获灌注。在急性心肌梗塞后一小时使用肝素，78%病人的冠状动脉重新得到血液，疼痛缓解，ST段降低，使用剂量为静注7500~10000单位，以后每小时静滴800~1000单位以保持凝血激酶时间2~3倍于正常，并未见出血并发症。肝素使用安全，不像链激酶或尿激酶那样发生较多出血并发症。它不同于其它血溶物，而可以由鱼精蛋白快速逆转其作用。（药信）

• 英国卫生和社会部于1986年6月10日宣布，由于阿司匹林随着雷耶氏综合症的发生可能增加，决定取消所有小儿用阿司匹林的生产。英国一些有权威的专家认为，在某些小儿中阿司匹林对发生雷耶氏综合症起着传播者的作用。在英国每年约有500名婴儿被检查出患有雷耶氏综合症，死亡率为50%。英国这一措施也影响了美国制药商，他们也愿意在阿司匹林说明中作上述告诫。据悉西德在1984年已对阿司匹林作了上述说明。希腊、意大利最近也规定在阿司匹林中作上述说明。（医药）

• 世界卫生组织（WHO）4年前制订的癌症病人止痛的阶梯型方法，作为全球首要任务之一，控制80~90%的癌症疼痛而又简便、价廉。WHO的阶梯止痛途径是：开始先用非阿片类止痛剂如阿司匹林、扑热息痛；如果疼痛未减或加重，则用弱的阿片类如可待因、丙氧吩；最后，如有必要增加止痛效果，则用强的阿片类如吗啡、美散痛、度冷丁、符合标准的阿片、盐酸二氧吗啡酮和左吗喃在使用上述止痛药同时，均辅以其它药物。按此计划实施，可收到达87%最终止痛效果而副作用最小。（医药）

• 钙离子参与心肌缺血再灌注时对心肌细胞功能和代谢的损伤，阻止过多钙离子进入心肌，对防治心肌梗塞和缺血有重要的意义，目前钙拮抗剂的研究相当活跃，但多数是西药，近年来中药的研究日益深入，发现

了许多中草药成份具有抗钙或钙拮抗剂类似作用,如粉防己碱、丹参酮ⅢA、小檗胺、三七总甙、四氢巴马汀等,它们对寻找新的抗心肌缺血药和解释某些中药的抗心肌缺血作用有一定启示。(药信)

•日本昭和大学最近试验证实,从五针松的松塔中提取的粉末物质具有抑制艾滋病病毒繁殖的作用。研究人员把这种粉末用在感染上艾滋病病毒的培养淋巴细胞上,结果发现控制艾滋病病毒繁殖的能力达70%至90%。

•据有关资料介绍,英国发现一种可治疗妇女不孕症的新药——“默罗丁”。这种药是从已过更年期的妇女尿液中提取的一种激素。专家们认为:有些妇女不孕是由于体内激素不平衡而诱发卵巢多囊症所致。而默罗丁则能促进卵泡成熟,使患卵巢多囊症妇女体内的黄体激素及卵泡生成素平衡。最近伦敦已有5家医院对52名原来不孕的妇女试用“默罗丁”治疗,其中11名已经怀孕。

(药信)

(景凡伟)

· 文摘 ·

乙醇、甘油和丙二醇对苯巴比妥钠稳定性的影响

乙醇、甘油、丙二醇、磷酸盐缓冲液和离子浓度对苯巴比妥钠溶液的稳定性的影响,在与水比较时,乙醇的稳定作用最强,依次为丙二醇和甘油。在四种溶剂中于50°C估算的半衰期分别为:

水 78天、20%甘油水溶液 95天、20%丙二醇水溶液 109天、20%乙醇水溶液 127天。磷酸盐缓冲液和离子浓度的影响可以忽略。苯巴比妥液剂型的稳定性取决于pH和赋形剂。减少降解的常用方法是采用水和乙醇、甘油或丙二醇等有机溶剂的混合溶媒。乙醇的稳定作用是由于降低介电常数,从而使相同电荷的离子亦即电离形式的苯巴比妥和羟离子之间的反应速度减慢。

最近的分析方法是采用高效液相色谱法。色谱仪配有多波长测定器和记录器,用中极性柱。流动相含有35%甲醇的0.02M醋酸铵水溶液,流速3.0 ml/分,温度与环境相同。灵敏度确定在0.1 (245 nm),记录纸速30.5Cm/小时。

样品溶液与苯巴比妥钠标准液(水作溶媒,每天新制)均制成0.5mg/ml,溶液贮于60ml棕色瓶置于50±1°C的电烘箱内,在适当间隔时间用HPLC测定各溶液,并记录数据。

[J of Pharma Scien《药学科学杂志》, 73 (11) : 1663, 1984 (英文)]

王敏摘译 张紫洞校

生物试样中5-氟尿嘧啶及其代谢产物的高效液相色谱定量法

本文报道了用高效液相色谱法同时测定各种生物试样中的5-氟尿嘧啶(5-FU)及其代谢产物5-氟尿嘧啶核苷(FUR)和氟脱氧尿核甙(FUdR)。方法系将样品中5-FU及其两种代谢产物用溶剂提取或在制备柱上进行纯化,然后将制得样品溶解在流动相—正己烷(3:2)的混合溶剂中,吸取此溶液注入Develosil 60-3高效色谱柱(4.6×50mm, 3μm),用乙酸酯—正己烷—甲酸(88%)-水(60:40:0.5:0.2)的混合溶剂进行洗脱,洗脱液在UV-264nm波长处检

测。结果测得血清、肝脏、胃等12种生物试样中5-FU、FUdR和FUR三种成份的回收率分别为64.0—93.2%、64.9—87.5%、15.1—66.5%;测得其定量检测限分别为0.02、0.05和0.2μg/ml;还将其定量测定结果同生物测定法进行比较,结果两法基本一致。

[《药学杂志》, 105 (12) : 1058, 1985 (日文)]

胡晓波摘 李修祿校