

· 国外新药 ·

新产品和新用途

▲舒喘灵(新剂型)

舒喘灵现由Schering公司制成一种新剂型—雾化吸入预防液投放市场。

舒喘灵是一种选择性 β_2 -肾上腺素能受体的支气管扩张药。其作用机理为激活腺苷酸环化酶(此酶能催化ATP转化成环状AMP)。

本品雾化吸入液适用于急性支气管痉挛或可逆性气道阻塞性气道疾病等支气管痉挛者的缓解。

它的副作用包括:眩晕、神经质和支气管痉挛。偶然出现的有头痛、失眠、咳嗽、支气管炎和哮喘等不良反应。

本品推荐剂量:每次2.5mg雾化吸入、3~4次/每日。剂量亦可取0.5ml的0.5%舒喘灵溶液用3ml生理盐水稀释配成,或用3ml的0.083%舒喘灵喷雾液给药。但病人应该注意,本品药效可维持6小时,而且使用不应超过推荐的次数。

本品由Schering公司用Proventil溶液商品名出售,两种包装:一是0.5%溶液20ml的多剂量瓶,另一是0.083%的3ml螺旋帽单剂量瓶。

▲辣椒辣素(Capsaicin)

辣椒辣素现由Genderm公司制成0.025%霜剂以商品名Zostrix上市。这种新产品适用于治疗疱疹病毒感染后的神经痛。

辣椒辣素的作用是耗竭和阻止外周感觉神经元的P物质的再积蓄,从而使皮肤对疼痛不敏感。这种物质是皮肤损伤后带状疱疹引起疼痛的化学介质。

本品涂于患处3~4次/日。此药可引起局部灼痛,尤其每天用药次数少于3~4次。这点要向病人讲清,同时劝告他们在涂

抹后及时洗手。

本品市售规格为0.025%霜剂45克管装。

▲盐酸艾司洛尔(Esmolol HCl)

艾司洛尔(商品名Brevibloc)现由Du-pont Critical Care生产上市。它是一种供静脉输注的新型 β 受体阻滞剂。

本品为短效 β_1 受体阻滞剂,是一种对心脏有选择性作用的药物,但在较大剂量时,它也能抑制肺的 β_2 受体。在常用量范围内,没有内在拟交感作用或膜稳定活性。

本品的分布半衰期为2分钟,消除半衰期约为9分钟。通过酯键水解迅速被代谢。给予负荷剂量时,通常在5分钟内可达稳态血液。本品与血浆白蛋白结合率为55%。

本品可迅速控制心房纤颤或心房扑动病人的心率,同时也证明用于非代偿性窦性心动过速。

不良反应与其他 β 受体阻滞剂相似。最常见的有低血压、出汗、头晕、嗜睡、恶心以及在输注部位发生炎症。对患有窦性心动过缓、心力衰竭、心源性休克或心传导阻滞超过一度者禁用。由于本品的心脏选择作用,故对有支气管痉挛的病人要慎用。如同其他 β 阻滞剂一样,糖尿病患者也应慎用。

治疗室上性心动过速,能引起足够反应的剂量一般在50~200 μ g/kg分钟。平均剂量通常约为100 μ g/kg/分钟。应根据每个病人的情况,做到剂量个体化。

本品不能直接注射,须经稀释后注射。稀释方法是从一个可配伍的500ml瓶装中取出20ml液体,然后加入2支安瓿本品,最后浓度为10mg/ml,稀释液在室温下24小时内稳定。

重要的是本品与其他药物混合时检查是否有配伍禁忌。药厂指出本品不能与碳酸氢钠混合。

规格:2.5g/10ml安瓿装。

▲乙型肝炎疫苗重组体

乙型肝炎疫苗 μ 重组体)以商品名Re-combivax HB 现在已由美国 Merck, Sharp和Dohme公司生产。

1986年7月美国食品药品监督管理局(FDA)批准用于免疫接种,预防乙型肝炎病毒的感染。

现有两种规格用于临床,单剂量小瓶装5mg/0.5ml(儿科用剂型)和多剂量小瓶装,每瓶3ml含量为10 μ g/ml(成人用剂型)。

▲高活性胰脂酶(High Lipase Pancreatin)

Reicl—Rowell公司现已生产一种高活性胰脂酶上市,商品名Creon。它为一种新的含有强力脂酶活性的胰酶,能使病人每日服用较少的胶囊。

本品胶囊内含浓缩的猪胰酶的高脂肪酶肠溶微粒。每个胶囊中所含成份是:脂肪酶8000美国药典单位、淀粉酶30,000美国药典单位以及蛋白酶13000美国药典单位。

胰酶的作用机理是催化脂肪水解。它们在体内能够催化脂肪转化成甘油和脂肪酸、淀粉转化成糊精、蛋白质变成脂类。胰酶包上肠衣以免被胃酸破坏。

Creon通常适用于治疗胆囊纤维变性、慢性胰腺炎和胰切除等引起的胰腺外分泌不足者。

本品不良反应有恶心、痉挛及腹泻。大剂量时可引起高尿酸尿或高尿酸血症。由于本品脂肪酶的含量高于常规制剂,所以在低剂量时就可以控制脂肪痢。本品对猪肉或酶过敏的患者和早期急性胰腺炎禁用。

本品的推荐起始剂量是1~2个胶囊,随饮食或外餐一起服用。以后剂量可以根据病人脂肪痢的控制情况来调节。服药时为了保护肠衣,病人不要压碎或嚼碎胶囊。此外微球不能含在口腔内,因为它们能产生局部刺激。对于吞咽困难的病人,可以将胶囊

打开,将微球加到一匙液体或软食物中服用。然后吞服并用一杯水送下。

▲胰岛素(新剂型)

胰岛素现已由Squibb Novo公司制成的新剂型上市,即把本品装于一种独特的给药系统,这套装置包括可处理的胰岛素针筒及针头。

Novopen(商品名)外壳是由镍和铬镀层的黄铜制成,圆柱形大约长6英寸。本品的针管和可处理的针头很方便地插入本装置中。这样本品可使糖尿病患者自己方便地、准确地注射胰岛素,从而取代了传统的瓶装和注射器。本品有一种可更换的半合成正规人胰岛素的针管。每一针管内含胰岛素150个单位,大约可应用一周。室温下一个月内是稳定的。针头是一种可掉弃的27号口径的斜面针头。

病人在使用胰岛素时,必须先将筒帽旋下,把笔枪倒置其中打开针头。每按一次按钮就能相应给予2个单位的胰岛素。这种“扣板机”装置使病人准确地应用胰岛素。

▲硝酸甘油透皮吸收剂

目前市售的透皮剂硝酸甘油,商品名NTS是由Bolar药物公司投放市场的新型硝酸甘油贴膏。

NTS的薄层基质中含有硝酸甘油,是一种独特的给药系统。将它贴在皮肤上时即可不断吸收硝酸甘油。释放进入全身循环中的量是5ng/24小时/10cm²或15mg/24小时/30cm²,可根据浓度有选择地用于病人。

本品产生的不良反应与其他透皮剂硝酸甘油相似,包括一过性头痛、低血压、晕厥和头昏。偶可出现呕吐和皮炎。

本制剂起始剂量为5mg/24小时/10cm²。根据病人的临床反应,有些病人需增加剂量。一般将贴膏牢固地贴手臂或胸部,避免贴在身体的末梢部位。

▲叠氮胸武(Zidovudine)

叠氮胸甙是由Bunoughs wellcome 公司生产, 商品名Retrovir。它将用于艾滋病的治疗。

本品的作用机理是对逆转录病毒的抑制。它干扰人类免疫缺陷HIV病毒的RNA依赖性DNA聚合酶并抑制病毒的复制。

本品用于患有症状性人类免疫缺陷病毒感染的治疗。这种病人往往有卡氏肺囊虫性肺炎的病史或CD₄型淋巴细胞计数的绝对值小于200/mm³。

本品的不良反应包括: 粒细胞缺乏症和贫血, 其他还有剧烈头痛、恶心、失眠和肌痛。偶见无力、发热、全身不适、厌食、腹泻、胃肠道疼痛和皮疹。

本品推荐初始剂量是每4小时服用200mg。服药过程中病人需检测贫血和粒

胞减少。出现明显的贫血, 和粒细胞减少时, 要减少剂量或中断给药。应告诉病人治疗期间可能需要调整剂量或输血。并劝告病人每4小时服药一次。

应该告知病人有关本品的药物相互作用。那些抑制葡萄糖醛酸化的药物(如醋氨酚、阿司匹林、消炎痛)与本品合用均可产生毒性。此外具有肾毒性或免疫抑制性的药物(包括氨苯砜、戊烷脒, 两性霉素B和干扰素)与本品合用时也可增加对病人的毒性。

规格为100mg胶囊装。

[Hospital Pharmacy《医院药学》, 22(5): 540~542, 1987(英文)]

田红译 贺金山校 张紫洞审

· 文摘 ·

乙醇注射可缩小肝脏肿瘤

乙醇是对人类肝脏损害最大的物质之一, 而意大利科学家报道, 直接注射乙醇至器官中治疗癌症也许是一种肝脏复活剂。

文中对15例病人的20个不宜进行手术的小肿瘤进行初步研究表明, 纯乙醇的注射可根治或缩小所有肝脏肿瘤而没有任何并发症。如果这一初步结果能有更多的研究证实, 则本法可以代替外科手术。

当摄入啤酒、葡萄酒或液体饮料, 其中乙醇是由肝脏负责代谢的, 但是乙醇也是器官处置的一种最毒的物质。反复、过量的饮酒可导致组织发生斑痕、肝硬化及黄疸。醇中毒亦可考虑是肝癌的一种因素, 在美国每年有13,600人患此症而有10,600人致死。

但作者也发现, 如果用直径小于1毫米的不锈钢针把纯乙醇直接注入小肿瘤中治疗肝癌是非常有效的。

研究者选择乙醇, 因为它容易得到、便宜、易于注射。用超声装置精确地确定肿瘤的位置后, 选择注射部位, 可不损害周围组织。对15名门诊的癌症病人进行治疗, 每星期1或2次, 共治疗3到24次。

注射乙醇根治了8个肿瘤, 使另外12个肿瘤缩小。乙醇破坏肿瘤与损害正常肝组织有很相似的机制, 可使细胞脱水, 阻塞供应肿瘤血液的小血管。随访两年没有一名病人肝癌复发。

〔《华盛顿健康邮报》, 12月1日, 1987(英文)〕

贾丹兵译 张紫洞校