

## 五、小 结

旋光法与双相中和法测定结果基本接近 ( $p > 0.05$ )，旋光法有操作简便、快速、结果准确等优点，适合于药厂、医院快速检验。

## 参 考 文 献

1. 中国药典：二部，1985，226
2. 沈克温等：实用药物分离鉴定手册，第一版 北京人民军医出版社 1986：781
3. 中国药典：二部 1985 附录16

## · 文摘 ·

### FDA批准纳法雷林(nafarelin)治疗子宫内膜异位

何芬芬译 魏水易校

治疗子宫内膜异位症纳法雷林醋酸盐滴鼻剂已被允许在美国市场销售。

纳法雷林是一种促性腺激素释放激素的合成类似物。单次或不经常给药能促使黄体激素和卵泡刺激素的释放，导致卵巢类固醇暂时增高。然而，随着重复使用，纳法雷林会使黄体激素和卵泡刺激素的垂体分泌减少，继而抑制性腺类固醇的生成。服用纳法雷林最初1~2周内，黄体激素和卵泡刺激素的活性以及性腺类固醇的浓度随着它们含量的下降而增加。通常停止治疗后4~8周内，垂体内性腺系统的功能恢复正常。纳法雷林对促性腺激素释放激素受体的亲和力约为对促性腺激素释放激素的10倍。

纳法雷林滴鼻后迅速吸收。给药后10~40分钟血药浓度达峰值。400 $\mu$ g药物其生物利用度在1.2%~5.6%之间，约80%的纳法雷林与血浆蛋白结合，血清半衰期为3小时(范围为0.8~10小时)。将标记有C14的纳法雷林醋酸盐通过皮下注射给药，不到3%的药物以原形从尿中排出。已经鉴定出纳法雷林的6种代谢产物，来做活性测定。这些代谢物由许多组织中存在的各种肽酶调节。纳法雷林在鼻粘膜中是否代谢尚不明了。

通过两项多中心双盲试验，证实了纳法雷林治疗子宫内膜异位症的功效。在这两项试验中，进行了鼻腔用纳法雷林和口服丹那唑的比较，治疗6个月。通过腹腔镜观察，这两种治疗方法在症状缓解

和疾病程度减轻方面是相类似的，80%以上的患者的症状都能得到部分减轻或完全减轻。欧洲研究是：每天二次，每次200 $\mu$ g纳法雷林与每天三次，每次200mg丹那唑比较。美国的研究比较了三种给药方法：每天两次，每次200 $\mu$ g纳法雷林；每天两次，每次400 $\mu$ g纳法雷林；每天两次，每次400mg丹那唑。

经常报道的副作用与药物的雌激素降低作用有关。在美国研究中，约90%的女性患者服用纳法雷林后，有发热反应；约10%的患者有鼻腔刺激。治疗6个月后，脊椎小梁骨密度和脊椎骨质地分别平均降低了8.7%和4.3%。治疗结束后部分恢复。治疗期间，一些患者的总胆固醇和甘油三酯浓度可能增高。

纳法雷林治疗子宫内膜异位推荐剂量为每天两次，每次200 $\mu$ g。如果服用该剂量两个月后，由于不产生闭经现象则剂量可以加倍。推荐疗程为6个月未获得长期使用纳法雷林的安全性资料，一般不提倡重复治疗。如果症状重新出现考虑追加治疗，则在重复治疗前必须测定骨密度以确保其为正常值。

将纳法雷林醋酸盐液装在带有计量喷雾泵的容器中，每瓶容量为10ml，每次喷雾量为200 $\mu$ g，每瓶可以使用60次。

[Clinical Pharmacy《临床药理学》  
9(5): 329~330, 1990, (英文)]