

其是高专一而敏感的血清前蛋白和异柠檬酸脱氢酶的正常结果, 为本研究长期常量服用

扑热息痛及其制剂的安全性, 提供了准确可靠的依据。

附表 病人长期服用co-proxamol的血清前蛋白浓度和血浆天门冬酸转氨酶活性

| 病人 | 年龄 | 性别 | 服药史 (月) | Co-Proxamol 剂量 (片/月) | 每年服用扑 热息痛总量 (g) | 血清前 蛋白浓度 (mg/100ml) | 天门冬酸 转氨酶 (iu) |
|----|----|----|------------|----------------------------|-----------------------|---------------------------|---------------------|
| 1 | 72 | 女 | 17 | 112 | 440 | 17 | 40 |
| 2 | 68 | 女 | 24 | 56 | 220 | 25 | 20 |
| 3 | 32 | 男 | 12 | 180 | 700 | 30 | 23 |
| 4 | 58 | 女 | 24 | 100 | 390 | 29 | 26 |
| 5 | 78 | 女 | 15 | 100 | 390 | 23 | 27 |
| 6 | 82 | 男 | 29 | 40 | 160 | 14 | 24 |
| 7 | 86 | 女 | 20 | 65 | 250 | 22 | 24 |
| 8 | — | 女 | 27 | 100 | 390 | 27 | 21 |
| 9 | 63 | 女 | 30 | 150 | 585 | 18 | 24 |
| 10 | 78 | 女 | 11 | 56 | 220 | 20 | 19 |
| 11 | 72 | 女 | 5 | 100 | 390 | 21 | 23 |

* 类风湿性关节炎; + 佩吉特氏病。

[J. pharm. pharmacol 《药学和药理学杂志》, 38 (3): 242~243, 1986 (英文)]

阿司匹林预防白内障的效果

刘海友译 柳静思校 张紫洞审

诱发白内障的危险因素已知有腹泻、糖尿病、青光眼、肾脏疾病及血中葡萄糖和尿素浓度过高。长期应用阿司匹林对白内障的形成具有显著的抑制作用。为将这种现象进一步深入研究, 牛津大学的 Heyningen 和 Harding 把因白内障住院的300名患者 (50~79岁) 与609名对照者作了比较。对所有患者的一般用药 (至少4个月)、吸烟和饮酒嗜好进行询问。通过数据分析, 判断了一般的危险因素模型。根据患者与对照者比较, 明确了肾脏疾病合并糖尿病、青光眼和应用类固醇类药物是形成白内障的危险因素。

有关阿司匹林的资料同效果显著的扑热息痛和其它非甾体药物的资料汇集对比, 认为阿司匹林的预防效果较弱。此类药物预防白内障效果的机理有各种论点。其一, 玻璃体

中的蛋白质乙酰化虽认为可防止白内障的混浊, 但多数非甾体抗炎药不具有乙酰基官能团。并且有关考虑前列腺素 (PG) 的说法照可理解, 但这样强效的PG合成抑制剂的消炎痛, 完全没有预防白内障的效果。反之成为PG的弱抑制剂的扑热息痛却具有较强的抑制作用。

因此, 对患者们非类固醇性白内障的预防作用, 要考虑同时产生的葡萄糖代谢。阿司匹林镇痛样作用, 在糖尿病的状态下没有显示出来, 而在空腹时血糖降低才有。由于阿司匹林、布洛芬、水杨酸盐产生的作用, 对消炎痛说来却没有。从44%的白内障具有异常的葡萄糖耐量曲线事实说明, 可考虑高血糖者为形成白内障的重要因素。这样意味着, 非甾体抗炎药直接引起血糖值下降而达

到预防效果, 进而防止玻璃体蛋白质转化为糖元。

[《药局》38(8): 148~149, 1987(日文)]

单克隆抗体的抗移植排斥作用

叶凤山译 张紫洞校

单克隆抗体首先被美国药物食品管理局(FDA)批准上市用于治疗目的, 它可抑制急性肾脏移植组织的排斥作用, 并减少以后手术的必要性。

每年约有7000名美国人接受新的肾脏, 而其中约有60%的病人机体产生排斥反应, 因此有必要进行免疫系统的抑制治疗。在一项临床试验中, 对病人静脉注射单克隆抗体后有94%的排斥反应消失。这种抗体是FDA批准用于治疗的第四个生物工程产品, 其他为1982年的人胰岛素、1985年的人生长激素

以及同年6月份的 α -干扰素。这三种产品都是在细菌中用基因复制的方法导致基因的拼接而生成。但是单克隆抗体则用基因融合、分离的方法所产生的。这种抗体能够对抗引起肾移植排斥的白血球(T细胞)。

据FDA局长说, 运用单克隆抗体产生的方法有可能生产高度专一的抗体, 以治疗某些严重疾病或癌症, 并希望单抗隆抗体试用于其他器官的排斥有更多的临床研究完成。

[《药局》, 38(8): 149, 1987(日文)]

H₂受体拮抗剂对伊曲康唑药动学影响

马天才译 张紫洞校

伊曲康唑(Itraconazole)是一种新的三唑类抗真菌药物, 口服给药时, 对表皮和深部真菌感染有效。已知: H₂受体拮抗剂可减少其他咪唑类全身活性抗真菌药物酮康唑的吸收。作者在12名健康男性志愿受试者中, 发现伊曲康唑与H₂受体拮抗剂甲氰咪胍和甲硝咪胍之间有类似的相互作用。

每一受试者口服200mg后, 测定本品在

96小时内的药动学, 共测三次, 每次服药间隔2周。第1次仅服用本品, 另二次给予一剂量本品的前三天和四天后服用甲氰咪胍400mg, 每天两次, 或加服甲硝咪胍150mg, 每天两次。这三次治疗都是随机的。伊曲康唑的血清浓度用HPLC测定。其血清t_{1/2}、AUC、C_{max}和t_{max}都进行了计算, 结果见表1。

| 时期 | AUC ($\mu\text{g}\cdot\text{h}^{-1}$) | t _{1/2} (h) | C _{max} ($\mu\text{g}\cdot\text{l}^{-1}$) | t _{max} (h) |
|----|---|----------------------|--|----------------------|
| A | 4402±612 | 18.8±1.4 | 252±22 | 3.5±0.3 |
| B | 4292±444 | 26.8±7.2 | 217±39 | 3.6±0.3 |
| C | 3554±364 | 21.3±2.1 | 201±48 | 3.2±0.3 |