

· 老药新用 ·

异烟肼、甘露醇、谷维素、灭滴灵临床新用

解放军81244部队医院 杨瑞萍 任国喜 袁茵

许多药物经过临床长期使用的实践，又不断发现一些新的作用和用途。本文仅就四种老药新的临床应用加以总结，供临床使用参考。

一、异烟肼

异烟肼至今仍为良好的抗结核一线药物之一，在临床使用中发现：（1）治疗麦粒肿有效。口服对外麦粒肿疗效高于内麦粒肿。机理可能是由于其分子小具有强的穿透性，能透入细胞内且易进入细菌细胞膜，当生长期细菌分裂时，抑制第二代细菌的磷脂合成，细胞膜缺乏磷脂而受到损害，使通透性增加而产生抑菌作用。（2）治疗急性菌痢及肠炎。异烟肼治疗菌痢的机理虽然尚不清楚，但阎氏用药敏试验证实，异烟肼对宋内氏痢疾杆菌、志贺氏痢疾杆菌、福氏痢疾杆菌、鲍氏痢疾杆菌等均有不同抑制作用。目前痢疾杆菌对某些广谱抗生素已产生耐药性，而异烟肼又具有疗效高、价格低廉、副作用少等优点，治疗急性菌痢实为一种经济、安全而有效的方法。成人口服异烟肼0.2g，维生素B₆10mg，每日三次；小儿剂量酌减，疗程为症状消失、大便正常后延续用药三天，全部不使用抗生素。

二、甘露醇

甘露醇是一种高渗性脱水剂，临床上主要用于降低颅内压和眼内压，治疗脑水肿和青光眼。目前有用：（1）病毒性肝炎的治疗：口服20%甘露醇20ml，每日三次，治疗病毒性肝炎，10天降酶有效率为85.7%，退黄有效率为71.3%，增进食欲，消除腹胀

的有效率达95%。多半在服药治疗1~2天后起效。据报道治疗顽固性肝硬化腹水，口服20%甘露醇液250mg/天，2次分服，疗程最短1天，最长5天，平均3.5天，有效率为60%。（2）口服清洁肠道：10%口服溶液灭菌后，供临床X光检查和一般腹部、肛门、直肠手术前代替肥皂水灌肠，常规清洁肠道使用。用量一般为500ml，服药时间宜在拍片或术前一日下午六时，不需禁食。还有报道用5~7%甘露醇溶液或以体重45kg口服40g为标准，体重每增减10kg甘露醇增减5g。

三、谷维素

谷维素在临床上主要用于间脑、下丘脑和边缘系统功能失调所引起的植物神经功能失调、更年期综合症、脑外伤后遗症和精神病等。谷维素的新用途可降血脂、抗溃疡和治疗慢性胃炎等。（1）具有广谱性抗溃疡作用，即对应激性溃疡，幽门结扎性溃疡、精神创伤性胃溃疡等均有抑制作用。抗溃疡作用可能与脑内生物胺有关，可能是谷维素通过减少脑内去甲肾上腺素的释放引起脑内生物胺含量增高，从而产生中枢性抗溃疡作用。有抑制基础胃酸分泌作用，对于胃泌素也有抑制作用，这种抗胃泌素作用是与通过植物性神经中枢而抑制迷走神经有关。（2）对慢性胃炎也同样有效，对浅表性胃炎有改善作用；对萎缩性胃炎无效。（3）有较缓和的降血脂作用。

四、灭滴灵

灭滴灵有杀灭毛滴虫及阿米巴的作用，

主要用于治疗肠阿米巴痢疾及肝脓肿和阴道滴虫病。根据报道此药在体内外对G⁻和G⁺厌氧菌都有效,其中包括脆性类杆菌、产黑色素类杆菌、侵肺类杆菌、腐蚀类杆菌、细梭菌属、产气荚膜梭状芽胞杆菌、双酶梭状芽胞杆菌、消化球菌、消化链球菌等。机理是灭滴灵对于细菌及有厌氧代谢的细胞有活性。该药之所以能选择性地作用于厌氧菌株,是由于这类细菌具有电子转移成分在很低的氧化还原电位就可参与氧化还原反应。甲硝唑的硝基还原后最初生成不稳定的中间产物,对于DNA有生物活性。被还原的甲硝唑与DNA结合使DNA螺旋断裂、溶解并使之降解,与此同时直接或间接地抑制DNA修复内切酶I的活性,从而阻止了DNA的复制与转录。目前临床上:(1)广泛用于敏感厌氧菌引起的脑膜炎、脑脓肿、腹膜感染、盆腔感染、骨髓炎、脓毒性关节炎及心内膜炎:由于其易透过血脑屏障,对β-内酰胺酶稳定,特别适用于脆性类杆菌引起的脑膜炎和脑脓肿。还可作为耐青霉素的类杆菌引起的心内膜炎的首选药。对耐氯林可霉素和氯霉素的脆性类杆菌引起的感染也有效。对厌氧菌包括脆性类杆菌和消化球菌引起的非特异性阴道炎有效率达94~100%。(2)在预防感染方面能显著减少腹腔和盆腔手术后厌氧菌感染;用于剖腹产术后立即静脉输

注灭滴灵500mg,每日二次,2~4天后改为每日三次口服,每次250mg,持续3~7天。还用于结肠一直肠手术后感染的预防及预防阑尾炎切口的感染。(3)灭滴灵还可与其它抗菌药产生增效作用:初步认为与红霉素、螺旋霉素、利福平及萘啶酸对脆弱杆菌有抗菌增效作用。(4)治疗疥疮等:用复方灭滴灵软膏或霜剂局部涂擦治疗疥疮、酒渣鼻。复方甲硝唑擦剂对毛囊虫皮炎、酒渣鼻、寻常型痤疮、特别是炎性丘疹及脓疮性损害、脂溢性皮炎、传染性皮肤病一疥疮和各种癣症均有良好效果。(5)治疗口腔疾病:复方灭滴灵漱口液,治疗牙周脓肿、冠周炎、牙周炎、牙槽脓肿、疱疹性口炎、复发性口疮、拔牙后伤口感染、牙周手术后、齿槽修整手术后、舌及唇和龈外伤等疾病都有显著的疗效。(6)还有灭滴灵等药物的复方阴道栓、膜剂治疗滴虫性霉菌性老年性阴道炎、宫颈糜烂等妇科常见病多发病,收到较好效果。(7)降血脂:据报道对11例高脂血症用灭滴灵1800mg,每日分三次口服一周后,总脂、胆固醇、甘油三酯分别下降29、27、30%。(8)复方灭滴灵滴鼻液,用于治疗慢性化脓性鼻炎有一定效果。

(参考文献21篇略)

·文摘·

丽来灵(Lilaline)——从白色百合中分得的黄酮类生物碱

贺蕊 陈雨安摘译 韩公羽校

作者采自捷克的南斯洛伐克省的白色百合植物(*Lilium candidum* L.)的干燥花1500g,用96%和70%的乙醇在室温浸渍数次,滤液蒸发浓缩冷冻干燥,此干燥物在乙醇中浸渍,依次用汽油、乙醚、氯仿及氯仿-乙醇(2:1)提取。将乙醚提取物用硅胶柱层析,苯-丙酮洗脱,得到富含lilaline的部分,再用葡聚糖凝胶LH-20柱层析,甲醇洗脱。从丙酮中得到26mg lilaline的黄色棱柱状结晶。熔点:247°C。比旋光度+65°(C_{0.2}, 甲醇)。此结晶与碘化铋钾试剂不反应,

但与FeCl₃及AlCl₃试剂呈阳性反应。紫外光下显黄色荧光,氨熏后黄色荧光加强。经紫外、红外光谱、质谱、核磁共振氢谱及碳谱测定,该物质的结构为3, 5, 7, 4'-四羟基-8-(3-甲基-2-氧(1-5-吡咯烷)黄酮。

迄今为止,已报道过榕碱(ficine)、异榕碱(isoficine)等四种黄酮类生物碱,而Lilaline是黄酮类生物碱中首次发现的吡咯烷黄酮醇。

[Phytochemistry 《植物化学》, 29 (6): 1844~1845, 1987 (英文)]