

临床药物介绍

药01 青蒿素 (qinghaosu): 一种新的抗疟疾药
[Bruce-Chwatt L J: Br Med J 284(6318):767, 1982 (英文)]

目前热带病学最主要的问题之一是氯喹抗药性的日益广泛,至今氯喹还是最可靠的防治疟疾的药物。过去3年镰状疟原虫对氯喹与磺胺类药物并用,或者与磺胺加有乙胺嘧啶并用已出现抗药性,这意味着对现存的合成抗疟药中没有一个可以信赖。甲氟喹是一种有价值的新合成化合物,美军研究组曾试验过,但是由于在等待战场试验结果,故尚未批准广泛应用。

公元前168年在中国首先提到一种草药——青蒿 (qinghao)。后经 Linnaeus 描述并定名为黄花蒿 (artemisia annua),属于菊科,常见于北方的国家。1972年中国科学家分离出黄花蒿的有效成分,并证明它是倍半萜内酯结构,命名为青蒿素或 artemisinin。初步研究证实其有效成分的杀疟原虫效果。鉴于这发现的重要意义,世界卫生组织1981年10月在北京召开了一次热带病会议专门计划研究培养青蒿素的发展及研究其抗疟疾药物的衍生物。在会议上中国的化学家、药理学家、毒理学家和内科医生提出了许多优秀论文,表明中国在这种新化合物方面进行了大量的工作。中国不仅已分离出和说明了该有效成分,而且还对其在动物和人体的疗效作了评价。目前已经合成两种衍生物 artemether 和 artesunate,评价了它们对鼠疟原虫和猴疟原虫的作用,进行了广泛的生化和药代动力学的研究,随访了南方几省疟疾病例的治疗结果。初步报告指出 artesunate 对抗氯喹的脑型疟疾来说,其疗效可能优于奎宁。但是青蒿素和其衍生物的临床应用,毒性和致畸亦有些疑问,需要进一步研究。看来这种新化合物是有很远大前途的。

(杨莉莉摘 胡本荣校)

药02 头孢噻唑丁酸——一种新型头孢菌素族抗生素
[Gozzard D et al: Lancet I(8282): 1152, 1982 (英文)]

头孢噻唑丁酸 (ceftazidime) 是一种新型头孢菌素,它对多种革兰氏阴性杆菌,包括绿脓杆菌、吲哚阳性变形杆菌有高度抗菌作用,但对金黄色葡萄球菌作用较其他头孢菌素弱。肾功能正常者,头孢噻唑丁酸的半衰期为 1.9h。静脉给药 1g,药在脓、痰、胆汁达到治疗浓度。药在体内不代谢,约90%以原型从尿排出,可静注或肌注给药。

严重感染患者65例,以头孢噻唑丁酸治疗,年龄16~84岁,男32、女33例。58例静注给药,7例肌注。剂量为每12h 0.5g至每8h 2g,疗程3~34(平均8.7)天,总剂量7~110(平均30)g。

结果 52例(80%)疗效满意,包括12例癌症、白血病或其他免疫功能低下者11例也获得满意疗效。败血症26例中19例感染被控制,但其中5例(4例胆管脓毒症、1例脊髓炎)仍需手术才完全痊愈;4例治疗失败;另2例分别死于肝衰竭、心力衰竭。急性尿道感染19例中17例治愈,肾结石1例和尿道插管1例患者4周后复发。呼吸道感染12例:细菌性肺炎9例中7例治愈,另2例死于肺出血和心肌梗塞;2例肺脓肿中,1例红斑性狼疮患者的感染治愈,但治疗后期有药热,1例因发热、皮疹停药,1周后死亡;1例 legionnaire's 病者痊愈。蜂窝织炎9例中7例治愈,其中2例需切开排脓;另2例中1例死于肺栓塞,1例有糖尿病的患者治疗失败。

本组患者应用头孢噻唑丁酸未发现有严重不良反应。尿常规检查无异常,4例合用速尿肾功能亦未见异常。4例发生皮疹,其中3例合并药热。5例转氨酶短暂升高。1例总剂量达110g时抗人球蛋白试验直接阳性,但无溶血。2例嗜酸性白细胞升高。

讨论 业已证明头孢噻唑丁酸对治疗严重感染有效,包括机体防御机制异常的患者。它对需氧的革兰氏阴性杆菌感染特别有价值,可作为氨基甙类如庆大霉素有效而安全的代替品,特别对老年和肾功能衰竭患者。如怀疑有葡萄球菌感染的可能,须与氟氯青霉素等抗生素联用。合并肠内感染或骨盆疾患,须与灭滴灵合用。

(黄焕莉摘 黄守坚 区淑仪校)

药03 新的长效组织胺 H₂ 受体拮抗剂 胍 噻 胍 胍与甲氧咪胍的比较
[Richardson CT et al: Gastroenterology 80(2):301, 1981 (英文)]

本文观察十二指肠溃疡患者口服胍 噻 胍 胍 (tiotidine) 和甲氧咪胍对食物刺激胃酸分泌发生抑制作用的快慢、强度和持续时间,研究药物对血清胃泌素和不吸收物质聚乙二醇 (PGE) 对胃排空的作用,同时测定胍 噻 胍 胍和甲氧咪胍的血浆浓度与药物抑制胃酸的关系。

12例无症状的慢性十二指肠溃疡患者,平均年龄52(34~64)岁,平均基础胃酸分泌量为 9.5 ± 3.7 mmol/h,注射五肽胃泌素 6μg/kg 后的最高胃酸分泌量为 49.5 ± 8.9 mmol/h。服药顺序随机应用胍 噻 胍 胍胶囊、甲氧咪胍片和安慰剂胶囊,彼此相隔48h。所用试餐中加入 12g PGE 以测胃的排空。在用药和