

抑制疗法的病人), 不管耳毒性的风险是大或小, 乙基紫苏霉素确实是适用的。

六、双去氧卡那霉素至今尚未表明有任何优点超过其他抗生素

双去氧卡那霉素尽管用途广泛, 但尚未得到如庆大霉素、妥布霉素、丁胺卡那霉素、乙基紫苏霉素或即始是紫苏霉素同样细致的临床对照研究。因此很难说它比其他同类氨基甙抗生素具有什么明显优点。通常双去氧卡那霉素在临床上的剂量仍然相当低,

也许应用较大剂量可获较佳的效果, 可能同庆大霉素类似, 无较大的肾毒性。耳毒性也较小。不过很多耐庆大霉素、耐紫苏霉素及耐妥布霉素的微生物对双去氧卡那霉素同样有抗药性, 这无疑会限制它在临床效用方面作进一步的深入研究。

[Inpharma 《国际药物文献摘要》, No. 442: 16~17, 1984 (英文)]

费逸明译 张紫洞校

吡丙芬—非甾体镇痛消炎药

吡丙芬 (pirprofen) 是一种丙酸衍生物, 体外试验表明在抑制前列腺素合成酶方面优于消炎痛。多数动物的研究证实了它的镇痛、消炎及退热效果。该药物由胃肠道迅速、完全地吸收, 而且吸收速率不受同时服用的抗酸药或食物的影响。血浆浓度在1~2小时内即达峰值, 消除半衰期约为6小时。口服剂量的80%由尿排出。本品与阿司匹林同时使用可降低吡丙芬的血浆浓度。

一、对通常范围的消炎、镇痛适应症有效

吡丙芬可用于变质性的、炎性的及单关节性风湿病、骨关节病、类风湿性关节炎、关节强直性脊椎炎、腰痛和坐骨神经痛、中度或重度的非风湿性疼痛, 还可用于急性痛风。常用剂量是每次400mg每天两次, 以后常减到每日600mg作为维持治疗。对严重病例可每日三次, 每次服用400mg。单次剂量200~400mg建议用作镇痛, 并根据疼痛的严重程度分剂量可增至1200mg。严重肾功能损伤的病例需降低剂量。

在各种典型牙齿疼痛以及原发性痛经和恶性疾病剧烈疼痛的应用试验中, 吡丙芬较安慰剂的镇痛效能显然要好。与口腔术后80%的病人服用900mg的阿司匹林比较, 有95%

的病人采用300mg吡丙芬治疗得到了满意的镇痛效果。取200mg或400mg吡丙芬用于口腔术后或恶性疾病出现的疼痛, 证明其效果优于采用100mg镇痛新。肌注100mg镇痛新用于癌症疼, 其镇痛效果较400mg的吡丙芬生效快, 但它的持续时间则短些。

类风湿性关节炎, 应用600mg以上的剂量则效果优于安慰剂, 同时一项确定剂量的研究表明, 开始剂量用1200mg/日, 随后维持剂量用600mg/日是适宜的。吡丙芬400mg/日与消炎痛100mg/日比较以及吡丙芬600mg/日与消炎痛150mg/日相比较, 对于类风湿性关节炎的治疗结果是相同的。消炎痛的剂量与吡丙芬相比是相当高的, 并有引起中枢神经系统副作用的趋向。在为期3个月的吡丙芬1200mg/日和消炎痛150mg/日的比较试验中(两周后药物剂量减半), 开始阶段中吡丙芬对疾病活动的疗效评价是较高的, 在维持阶段病情仍能保持不断改善。消炎痛对胃肠道和中枢神经系统的副作用是很常见的。吡丙芬治疗类风湿性关节炎的作用曾与阿司匹林、布洛芬、酮基布洛芬作了比较。比较结果表明吡丙芬对疾病活动的某些参数明显优越, 而耐受性也较佳。在治疗青少年类风湿性关节炎方面, 吡丙芬13~

37mg/公斤/日的剂量证明是有效的,而且在此剂量范围内耐受良好。

450~750mg吡丙芬与75~125mg消炎痛治疗强直性关节炎的比较试验中,消炎痛的结果是更令人印象深刻。治疗同一病症的另一项试验则表明应用吡丙芬1000mg/日较之消炎痛125mg/日会得到更好的结果,而後者的中枢神经系统作用就更为常见。

对那些患有颈椎或腰椎骨关节炎的患者,吡丙芬600mg/日和消炎痛75mg/日对症状的改善程度效果相同。采用吡丙芬有略多的病人出现胃肠道反应,而消炎痛则产生3倍之多的中枢神经系统作用。吡丙芬800mg/日用于治疗腰椎骨关节炎,其效果优于苏灵大(Sulindac)400mg/日,两种药物的副作用发生率则相似。在比较吡丙芬600mg/日与布洛芬1200mg/日的两次试验中,吡丙芬治疗髌或膝关节炎的研究评价较好,而布洛芬用于腰骨关节炎较好。吡丙芬800mg/日和萘普生500mg/日治疗髌骨关节炎的效果类似。

在一项公开的研究中,每12小时肌注400mg的吡丙芬对于急性痛风能迅速地产生明显的反应。这些优良的结果曾与保太松的疗效也作了比较,而且并无副作用发生。

二、吡丙芬的副作用范围与其他非甾体镇痛消炎药相似

吡丙芬禁用于胃及十二指肠溃疡、严重肝疾患、对吡丙芬过敏和气喘。有胃肠道症状、消化性溃疡、大便隐血或心脏或肾功能严重受损伤病史的病人在接受治疗时要密切观察。长期肝功能失调是撤药的一个指征。对那些凝血功能不正常的病人、应用抗凝剂或有出血倾向应注意。怀孕期的头三个月和哺乳期不宜使用吡丙芬。当吡丙芬与其它蛋白结合率高药物合用亦须谨慎。正如其它非甾体镇痛消炎药一样可发生胃肠道副作用。曾有报道长期用药可形成消化性溃疡。偶然的轻度可逆性药疹也有报道。

[Inpharma《国际药物文献摘要》, No.442:16~18, 1984(英文)]

费逸明译 张紫洞校

氯化糖类会成为未来的男用避孕药吗?

Heinrich Koch (奥地利,维也纳大学药物化学研究所)

迄今使用避孕药在实践上得到成功的只有女性。在逻辑上调换一种办法,对男性采用抗生育处理,虽然常常讨论过,但却没有付之实现。不过有一些半合成糖类衍生物正在制造出来,它们就是有效的、无毒的与可逆性的精子发生抑制剂。

用干扰激素调节来阻碍卵巢周期的办法虽然有效,但随着体内激素失去平衡,常需承担严重副作用的风险。对妇女来讲,不良的症状是相当重的,甚至会受到生命威胁(如高血压、癌症等),日后当中断用药还可能波及后代。因此通过男方来实现家庭计划生育,似乎更为合理,并且可能成为未来节育的良好措施。

在葡萄糖与蔗糖以及其他来自自然界或合成的单糖、低聚糖和有关的糖醇类分子上替代某些羟基,原来是为了寻找新的、更强力的合成甜味剂而

进行的工作。想通过氯化作用,给碳水化合物得到一个较高的亲脂性,从而增加味觉受体的结合力,借以增强甜味效果。确实经证明。蔗糖每个分子代入1~5个氯原子组成的氯化蔗糖,甜味能比蔗糖增加2~4000倍。

然而,当进行毒理学评价时带来了一个不希望的副作用,其中有些化合物能抑制精子活性而强烈地阻碍男性生育能力,不过这是完全可逆的,一旦停止给药,生育能力可以得到恢复。正由于这点,人们对这些化合物的注意力就从甜味剂上转移到作为有潜在性的抗生育药物方向。现在研究焦点主要集中在两个化合物:6-氯-6-脱氧葡萄糖(6-CDG)与6,6'-二氯-6,6'-二脱氧-β-D-呋喃果糖酐-α-D-吡喃葡萄糖甙(6,6'-dichloro 6,6 dideoxy-β-D-fructo furamoryl