

象；而对人体是否有此作用尚未搞清。故在未搞清或确立本品对孕妇的安全性之前，建议避免使用或慎用。此外，本品能透过胎盘，并刺激胰腺产生胰岛素，从而使胎儿发生低血糖症。

4. 本品有少量从乳汁中排泄，其对新生儿是否影响也未搞清，哺乳期的患者应慎用。

5. 幼年型糖尿病患者对本品无效，新生儿糖尿病者应选用胰岛素。此外，本品对并发性酸中毒、酮症、高血糖昏迷者的疗效不可靠，通常也不推荐使用。

6. 老年人、肝肾机能严重障碍、营养不良、饮食摄取不规则、原发性或继发性肾机能不全者使用本品时应谨慎。

7. 本品在使用过程中有时可出现疗效自然下降现象（称自发性失效，发生率为3~30%），若加大剂量后疗效仍不满意时可并用其他磺酰脲类口服降血糖药，如二甲双胍等。

8. 对本品有过敏者禁用。

9. 本品使用过程中应避免饮酒，以免发生复杂的相互作用。患者应于饭后服药，以减少胃肠道反应。

主要参考文献

[1] 上海第一医学院主编：医用药理学，人民卫生

出版社，p. 650~651，1976

[2] 成都、北京军医学校主编：药物化学，解放军战士出版社，p. 183，1981

[3] 济南军医学校主编：药理学，解放军战士出版社，p. 189，1981

[4] Aust J pharm, 65 (771) : 459~471, 1984

[5] 於毓文等译：临床药理学，人民卫生出版社，p. 607，1985

[6] Judis J. et al; Journal of pharmaceutical Sciences, (61) : 89~93, 1972

[7] Jain A. et al; New England Journal of Medicine, (293) : 1282~1287, 1975

[8] Larsson Y. et al; Lancet, (2) : 1424~1426, 1960

[9] Iber F. et al; Clinical Pharmacology and Therapeutics, (22) : 736~742, 1977

[10] 苏开仲译：药学情报通讯，(2) : 35, 1986

[11] 唐镜波编：药物相互作用，河南科技出版社，p. 485~494, 1981

[12] Bird G. et al; British Medical Journal, (1) : 687~692, 1972

[13] Aust. J. Pharm, 65 (768) : 201, 1984

[14] 苏开仲译：药学情报通讯，(1) : 53, 1986

[15] Andreasen P. et al; Clinical pharmacology and Therapeutics, (16) : 1059~1064, 1974

新的非甾体抗炎药——芳基丙酸类

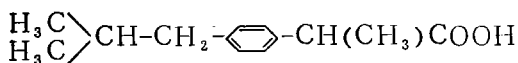
解放军第一七二医院 姜宝珍

非甾体抗炎药物中阿司匹林易引起消化道出血，消炎痛及保太松毒副作用较大，因而限制了它们的临床应用。非那西汀因对肾脏毒性较强而被淘汰。六十年代初问世的新非甾体抗炎药——芳基丙酸类的共同特点是疗效强、毒性低、患者易于耐受。经国内外

研究和临床证明，它是一类高效、安全的抗炎、解热、镇痛药。近几年来这类药物发展很快，已有20几个品种应用于临床，常用的有布洛芬、苯酮苯丙酸、苯氧苯丙酸、萘普生、氟联苯丙酸等。现以布洛芬为典型，重点介绍如下：

布洛芬 Ibuprofenum(异丁苯丙酸、异丁洛芬、拔怒风)

结构式:



化学名: 2-[4-异丁苯基]丙酸

本品于1964年由Nicholson和Adams合成。英国药典(1980版)、美国药典(第二十一版)、日本药局方第十改正版,我国药典(1985年版)均已收载。英国和美国分别于1983年底和1984年5月批准为非处方止痛药。

本品经动物试验证明:解热作用比阿司匹林强25倍,镇痛作用强16~32倍。毒副作用较阿司匹林、扑热息痛小。临床应用证明布洛芬的镇痛作用较强、消炎作用较弱,退

热作用与阿司匹林、扑热息痛相当,但作用持久,对胃肠道的刺激作用小,安全度大,可长期服用。

性状及药代动力学:本品为白色结晶或结晶性粉末,无味。熔点为85~87℃,几乎不溶于水,在碱性溶液中易溶,易溶于大多数有机溶剂。

本品口服吸收快,生物利用度为70%;1~2小时达最高血药浓度;半衰期为2小时;血浆蛋白结合率为99%;表观分布容积为0.14L/kg。布洛芬在体内大部分被代谢,代谢产物主要经尿排泄,尿中未出现原形药物。

健康成人空腹口服200及400mg,血药浓度呈线性关系,数据如下:

| 时 间 (h) | 0.75 | | 1.5 | | 3 | | 6 | |
|-------------|------|------|------|------|-----|------|-----|-----|
| 剂 量 (mg) | 200 | 400 | 200 | 400 | 200 | 400 | 200 | 400 |
| 浓 度 (μg/ml) | 15.0 | 33.0 | 14.0 | 31.0 | 7.4 | 16.0 | 2.3 | 9.0 |

临床应用

1. 用于镇痛:布洛芬能抑制损伤部位前列腺素的合成,术前使用可使外周疼痛感受器的敏感性和活性减到最低度,从而减少有害刺激向神经中枢传入,故可用于手术止痛。剂量:口服每次900mg,一日三次。

据日本岗山大学应用于各种神经痛、变形关节炎等,有效率达84.6%。山东省人民医院用于治疗风湿性关节炎、头痛等各种疼痛,有效率达90.63%。剂量:口服每日三次,每次200~400mg。

布洛芬是有效的止痛药,对风湿性关节炎、神经痛、白血病引起的骨痛、结核性胸膜炎、蛛网膜下出血等引起的头痛、牙齿痛等均有较好的止痛效果。

2. 用于解热:据日本报道,布洛芬栓剂对小儿发热的退热作用有效率达89.7%,具有快速而持久的退热作用,疗效确切,无副作用。疗效优于羟基保太松,与阿司匹林

相似,但作用比阿司匹林持久;与扑热息痛比较,两药解热效果均在12小时以上,但给药6~8小时后布洛芬平均下降值明显大于扑热息痛。布洛芬与青霉素合用,解热效果明显增强。

3. 用于消炎:据北京医学院三附院报道,用于21例风湿性关节炎患者,3例关节肿胀患者中2例肿胀消失,21例中有9例血沉下降占43%,病程在一年以内者3例血沉均下降,一年以上者16例,下降者7例,说明病程短的比病程长的疗效好。布洛芬还可用于呼吸道感染及其它感染,有一定的消炎作用,并具有控制上呼吸道分泌物的优点。

副作用及不良反应

布洛芬经长期或短期服用,副作用较小,具有良好的耐受性和安全性,有的患者连续服用2~5年未见不良反应。但个别病人在用药过程中暂时出现一些副作用和不良反应,主要表现为消化道,偶见轻度的消化

不良、胃胀胃痛、呕吐。头晕、皮疹、白细胞微降等。极少数出现胃溃疡及微量出血，转氨酶升高。停药后症状会逐渐消失。

药物相互作用

布洛芬不宜与降血糖药合用，因能增加后者的降血糖作用，引起急性低血糖；本品也能增强抗凝血药的抗凝血作用，也不宜合用；使用皮质激素者不宜突然停药；丙磺舒能增加本品的血浆水平，延长其半衰期。

本类药物常用的尚有：

芬布芬 Fenbufenum(联苯丁酮酸)：本品为一较新型长效非甾体消炎镇痛药，对胃肠道刺激小，抗炎作用较布洛芬强，具有迅速长效的优点。在体内代谢成联苯乙酯，而抑制前列腺素的合成，阻断炎症介质的作用，产生消炎效果。适用于风湿性、类风湿性关节炎、强直性脊椎炎、牙痛、手术痛、外伤痛等，总有效率达87%。已被第九届世界抗风湿会议评为优良抗风湿药。口服每日60~90mg，一次或2~3次分服。服后2小时血药浓度达高峰，半衰期为12~17小时，蛋白结合率为99%，可进入乳汁。

副作用与不良反应同布洛芬。有消化道溃疡、肝、肾、心功能不全、支气管哮喘者慎用。

萘普生 Naproxenum (甲氧萘丙酸、

消炎灵)：经动物试验证实，抗炎作用为保太松的11倍，镇痛作用为阿司匹林的22倍，为一高效低毒的消炎、镇痛、解热药。本品作用与用途与布洛芬相似，但半衰期较长(12~15小时)99%以上与血浆蛋白结合，表观分布容积0.1L/kg。口服剂量每日500~750mg，维持剂量375~750mg，早晚两次分服。

酮基布洛芬 ketoprofenum(苯酮苯丙酸、优洛芬)：本品具有较强的镇痛、消炎及解热作用。消炎作用较布洛芬强。在同等剂量下，消炎作用为阿司匹林的150倍，退热作用为阿司匹林的100倍、消炎痛的4倍而毒性仅为消炎痛的1/4。口服易吸收，一次给药后0.5~2小时达血浆峰浓度，半衰期为1.6~2小时，血浆蛋白结合率达99%以上。其钠盐肌注后15分钟奏效，可维持5小时，用于癌肿止痛效果较好。口服每次50mg，一日3~4次；或开始每次100mg，一日三次，以后改为一日二次，饭后服。本品疗效高、毒性低、剂量小，是一个有希望的新型非甾体消炎、镇痛、退热药。

综上所述芳基丙酸类非甾体抗炎药，由于它的高效、低毒安全的特点，为临床医生所喜用，这是一类颇有前途的抗炎镇痛解热药。

番木瓜的医疗用途

贵州省中药研究所 陈龙珠

第二军医大学药理学系 郑汉臣

番木瓜 (*Carica papaya* L.) 为番木瓜科 (*Caricaceae*) 植物，英文名称为 *Papaya*。原产美洲热带地区，我国福建、广东、广西、云南南部广泛栽培，为著名热带果树。

番木瓜植株各部分及绿色果实均含有丰富的乳汁。乳汁味苦，有收敛作用，比重1.023。乳汁中含有两种烈性的结晶性酶——

木瓜蛋白酶 (*Papain*) 和木瓜凝乳蛋白酶 (*Chymopapain*)；果实尚含番木瓜碱 (*Car-paine*)、蛋白质、脂肪、葡萄糖、果糖、蔗糖、钙、磷、铁、酒石酸、柠檬酸、维生素B₁、B₂和C，在淡黄色果实中含隐黄素 (*Cryptoxanthin*)、蝴蝶梅黄素 (*violaxanthin*)、β-胡萝卜素 (*β-Carotene*)、δ-胡萝卜素和隐黄素环氧化物 (*Cryptoxa-*