

进行着。大量天然的和合成的化合物现在正以常规方式筛选其抗病毒活性。根据对病毒分子生物学知识的了解,我们已取得了巨大的进展,这对合理研制阻止和干涉病毒一个或几个主要复制步骤提供了重要的线索。

一个很好的例子是被称作可溶性的CD₄药物,CD₄已被证实能同艾滋病病毒结合,阻断病毒受体,达到防止感染的目的。对已受艾滋病病毒感染的病人,CD₄的可能有益效果近来正在临床研究中进行评估。其它通过干扰病毒同靶细胞结合的药物也在评估中。然尔到目前为止,已证实对艾滋病病人有效的药物是叠氮胸苷(AZT)。这是唯一注册许可可在市场上出售的抗逆转录病毒药物,另

外,大量其它化合物正在研究中,但它们潜在的有益效果仍在控制较严的临床研究中进一步去确定。

一些有前途的实验性抗逆转录病毒药物是核甙酸同类物,它们通过与叠氮胸苷相同的机理起作用。核甙酸类药物中之一是双脱氧胞苷(Dideoxycytidine, DDC),它同叠氮胸苷合用进行临床试验,其目的是减少毒性作用的出现。双脱氧肌苷(Dideoxyinosine, DDI)是最近引入临床试验的,它似乎比叠氮胸苷和双脱氧胞苷的治疗指数更佳。

[世界卫生组织《世界卫生》杂志,10月号,1989(英文)]

艾滋病产品的开发:一年的综述

朱全刚译

张紫洞校

从1987年中至1988年中的12个月期间,开发艾滋病药物、疫苗、诊断剂的公司数字增长31%,被开发的产品数字增长76%。

制药工业协会新近一次的开发艾滋病产品的调查,同1987年夏季的第一次调查相比,表明对开发产品目录有了如下的增加:12种免疫调节剂、6种抗感染药物、5种疫苗及22种诊断剂。增添了三种抗病毒药物,但是删除和重新分类导致在此范畴内净减少两种开发的产品。

三种药物的申请批准已由食品药物管理局备案。同一年前的两种相比,六种产品正处于第Ⅲ期临床试验——进一步的人类试验。

这些定量数字说明制药工业对艾滋病危机有一个显著的反应。制药公司前所未有地如此迅速和强烈地动员起来同疾病斗争。

然而,这些数字不容过分乐观。没有一

个产品可看作是治疗艾滋药的良药,它们正被试验,尚有许多问题不能得到足够的承认而通过临床试验。

已经获准的两种产品叠氮胸苷(Retrovir)和戊烷脒(Pentam300W)及trime-trexate的应用,使得一些艾滋病人可生活得更长,这就也使一个实验药物通过新药批准前的治疗计划是可行的。但是要寻找治愈或控制艾滋病的措施仍占有最高的研究优先权。

制药工业协会的调查反映出在过去12个月中有下列变化:

1. 产品: 86种药物、疫苗和诊断剂正在开发中,而一年前仅49种。
2. 公司: 由45家公司发展到现在56家公司开发或协作开发产品。
3. 免疫调节剂: 从产品目录中删除3种而增加了12种。同1987年17家公司研究13

种产品相比, 现有22种产品正被19家公司研究。

4. 抗感染药物: 从去年夏天开始, 增添了一个新的产品种类, 它现在至少包括五家公司开发的六种抗感染药物。

5. 疫苗: 现正研究的疫苗数为1987年的2倍。同去年8家公司开发5种产品相比, 12家公司现正在开发10种疫苗。全部处于开发的早期阶段, 2种进入临床试验阶段, 其余处于临床前阶段。

6. 抗病毒药物: 13家公司从事15种抗病毒药物的研究, 同去年18家公司开发17种产品相比, 有一个净减少。尽管本年度有3种新产品增加到产品目录中, 但是2种被删除, 3种因重新分类而归入免疫调节剂或抗感染药物。

7. 诊断剂: 1987年仅9家公司开发, 14种用于检测人类免疫缺陷病毒的检验剂, 而现在18家公司已发展或正在开发33种产品。

8. 新药申请: 三种产品的申请由FDA备案。抗病毒药Cytovene已通过Ⅲ期临床试验。在此年度中, 两种免疫调节剂Intron-A和Roferon-A(两者均为 α -干扰素的 商品名——校者注) 被增加到产品目录中。虽然这两种产品已被批准用于其他疾病, 但是正在请求批准用于艾滋病有关的治疗。

9. Ⅲ期临床试验: 六种药品现处于Ⅲ期: β -干扰素(Betaseron, 抗病毒药); Ampligen, 1MREG-1, 异丙肌苷(免疫调节剂); Diflucan和戊烷脒气雾剂(抗感染药)。1987年夏, 仅有两种药物(抗病毒药) 被列于Ⅲ期; 其中一个Cytovene 现已作为新药申请而备案; 另一个trimetrexate已于1988年2月被批准作为艾滋病有关病情的新药批准前的第一个治疗药。

上述调查未记载的是去年对人类免疫缺陷病毒的理解和它如何破坏人体免疫系统方面所取得的进展。借助生物技术等现代工具的帮助, 使得病毒学知识以一个令人难忘的速度扩展。

具备有关这种知识, 公司即可开始设计特别瞄准某种病毒的药物, 例如rCD4, 它是一种免疫调节剂, 已在8月份进入临床试验。

对开发有效的艾滋病药物来说, 工业面对挑战是难以对付的。数十年期间, 科学家一直试图努力发展治疗病毒性疾病的药物, 然而仅有7种应用有限的产品被生产出来。结果使得病毒性疾病象感冒一样蔓延并象病毒性脑膜炎无法治疗一样严重, 尽管深入研究多年。

[Pharmacy Times《药学时代》, (6): 148~149, 1989(英文)]

普罗帕酮的临床评价

第二军医大学长海医院药局 孙华君 潘珍如

普罗帕酮(Propafenone)为一新的作用于心室肌及浦肯野纤维的膜稳定剂, 八十年代我国广泛应用于临床, 治疗室性及室上性心律失常。

临床药理

普罗帕酮主要降低心肌动作电位的最大

上升速率, 延长复极化时间, 阻滞房室结传导, 减慢His-Parkinson传导, 使窦律QRS复合波变宽; 此外, 它还具有 β -肾上腺素拮抗剂等多种活性, 其 β -拮抗作用机理尚不清楚, 但不是竞争性抑制。研究表明, 普罗帕酮也具有负性心肌力作用, 并能降低免