

预防疟疾新方案

F. W. H. M. Merkus (荷兰, 阿姆斯特丹大学生物药剂学教授)

当去地方病流行地区旅游的时候, 对于预防疟疾采用何种最佳治疗的问题, 各专家之间存在着不同的意见。有关疟疾预防药物应用的争论资料的一个典型例子, 可以在近期的《英国医学杂志》上查阅到。

自从我们发表了关于“疟疾预防”评论以后, 又有了新的更好的资料, 因此可使我们对疟疾的化学预防提出最新建议。

在列出附有药物的国家名单之前, 提出几点总的说明会有好处的。

(一) 采用氯胍和氯喹预防疟疾应该从动身那天开始用药。凡西达(乙胺嘧啶 25mg 和周效磺胺 500mg—译者注)可在动身前1—2周就开始用药, 以检测有何不良副作用。不论采取何种防治方法, 在离开疟疾流行地区之后还应继续用药 4 周。

(二) 制剂和剂量。成人剂量如下:

氯胍(百乐君), 每天100mg;

氯喹(按碱基算), 每周300mg;

乙胺嘧啶 25mg 和周效磺胺 500mg (凡西达), 每周 1 片。

对于磺胺过敏的病人, 马罗匹林[Maloprim; 乙胺嘧啶12.5mg 和氨苯砒100mg]可作为代替品, 每周 1 片。

1岁以下儿童— $\frac{1}{4}$ 剂量; 1—5岁儿童— $\frac{1}{2}$ 剂量; 6—12岁儿童— $\frac{3}{4}$ 剂量。

(三) 妊娠和化学预防法

许多专家认为应用抗疟药比妊娠期间患疟疾安全些。包装说明书通常载有警告一项内容(例如凡西达就有)。Woodruff 等人曾推荐马罗匹林取代凡西达用于妊娠期和对磺胺有过敏的患者, 但根据《医学通讯》(Medical Letter)的建议, 孕妇不应该服用乙胺嘧啶, 因此马罗匹林不可能是一个真正的代替品。

唯一的“代替品”却是在马罗匹林中的长效磺胺已经由氨苯砒所代替。虽然妊娠期中磺胺药的安全使用尚未确定, 但乙胺嘧啶如同其它的叶酸拮抗剂一样, 都是不安全的。就我们所知, 妊娠期间服用氨苯砒是否安全仍然有待解决。

表 1 列了许多疟疾危险地区, 并附有化学预防方法的荐推意见, 这是根据荷兰中央卫生监督署(传染病处)和 Woodruff 等人的建议编制。

表1 建议的化学预防疗法

国家和地区	药物
美洲	
美国南部(一般而言)	氯 胍
巴西(热带区)	凡西达
哥伦比亚、厄瓜多尔、巴拿马	凡西发
圭亚那(林区)	凡西达
苏里南(林区)	凡西达
委内瑞拉(林区)	凡西达
非洲	
北非洲	氯 胍
热带非洲	氯 喹
亚洲	
中东, 包括巴基斯坦	氯 胍
孟加拉国	凡西达
缅甸	凡西达
中国	
北纬25°以北	氯 胍
北纬25°以南	凡西达
菲律宾	凡西达
印度	
阿萨姆邦	凡西达
其它省份	氯 胍
印度尼西亚	
伊里安爪哇岛(沿海地区)	凡西达
加里曼丹	凡西达
其它地区	氯 胍
亚洲	
柬埔寨	凡西达
南朝鲜(4月~11月)	氯 胍
老挝	凡西达
马来西亚(檳榔屿无疟疾)	凡西达
巴布亚-新几内亚	凡西达
斯里兰卡	氯 胍
泰国	凡西达
越南	凡西达
大洋洲	
太平洋岛屿	氯 胍

说明: 澳大利亚、文莱、香港、日本、澳门、南朝鲜、新加坡(主岛)和中国台湾省无疟疾。
 旅游者只访问巴西、哥伦比亚、厄瓜多尔、圭亚那、巴拿马、苏利南、委内瑞拉、中国、

菲律宾、印度尼西亚、马来西亚、斯里兰卡和泰国等的首都，那就无需疟疾预防措施。

参考文献(4篇，略)

[Pharmacy international《国际药学》，2(8): II, 1981(英文)]

张 钧译 张紫洞校

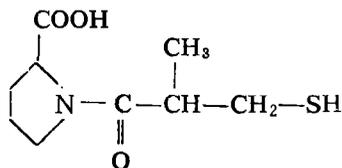
甲硫丙脯酸：血管紧张素转化酶抑制剂

Heinrich Koch (奥地利，维也纳大学药物化学研究所室主任)

肾素—血管紧张素系统在高血压发病机理中的复杂情况，现已为人们充分认识。从肾脏释放的肾素首先与血浆球蛋白成分(血管紧张素原)作用，产生血管紧张素 I (A I)，一种无活性的十肽化合物。后者主要在肺部，又经血管紧张素转化酶(ACE)的作用，转化为八肽血管紧张素 II (A II)，这是迄今所知最强效的内源性升压物质。血管紧张素 II 刺激肾上腺皮质分泌醛固酮，后者是一种引起钠和液体潴留并升高血压的类固醇激素。显然，业已受损的肾脏不能适当地调节这些相互联系的机制，而形成的高血压又进一步损伤肾脏，导致肾血管机能不全的继续加重的恶性循环。

甲硫丙脯酸(Captopril)这种新颖的药物，是以 ACE 的活性部分分子相似为基础而合理设计的结果。它是一种在体内、体外对 ACE 具有强效、特效的抑制剂，并被认为类似于 A I 的内源性物质，与 ACE 的活性部位结合，因而阻断了酶的作用，中断上述的恶性循环。按照这假设的作用机理，本品在治疗临床高血压和心力衰竭中代表了一种全新的治疗原则。

本品化学名为 N[(2S)-3-巯基-2-甲基丙酰基]-L-脯氨酸，从前采用代号为 SQ-14225，直到最近商品名称为‘Capoten’和‘Lopirin’。美国 Squibb 药厂研制的甲硫丙脯酸经口服用完全有效。对数种动物进行体内、体外的多次药理和生化研究，证实本品具有抗高血压作用。



除原发性醛固酮增多症外，本品对大多数类型的人类高血压有效。若伴用利尿剂治疗或限制饮食中钠的摄入，可获得更佳的降压效果。临床试验是在高肾素的、正常的和低肾素的病人以及在患有难治的或者不能耐受常规抗高血压治疗的高血压患者中进行的。治疗持续时间为一年或一年以上。剂量范围每天在 25~1000mg 之间，最佳维持剂量约为每天 100mg。