

丽珠感乐

杨 薇 戴德银

(解放军第 452 医院 成都 610061)

丽珠感乐又名特酚伪麻片,其疗效与美国无嗜睡感冒药寒丹(Seldene)相似,具有处方新颖,不含扑尔敏,能消除感冒的各种症状。

一、处方组成

丽珠感乐片每片含特非那丁(terfenadine)15mg,盐酸伪麻黄碱 15mg,对乙酰氨基酚(扑热息痛)162.5mg。

二、药理作用及作用特点

特非那丁是一种新型抗组织胺药,具有特异的外周 H_1 -受体拮抗作用,不易透过血脑屏障,不产生中枢神经抑制作用,也不增强其它中枢神经抑制剂如酒精、安定类药物的抑制作用,能迅速减轻或消除流泪,打喷嚏和流涕等感冒症状,不产生嗜睡作用。

对乙酰氨基酚为解热镇痛药,通过抑制前列腺素合成酶使前列腺素合成减少而发挥治疗头痛、发热、四肢疼痛、肌肉痛、全身不适等感冒症状。

盐酸伪麻黄碱为拟肾上腺素类药物,具有明显的收缩上呼吸道粘膜血管作用,可减轻上呼吸道粘膜充血,能消除感冒所致的鼻塞、眼鼻瘙痒、流泪、流涕、打喷嚏等感冒症状。

上述三种药物配伍使用,疗效加强,而毒副作用则相互拮抗。如处方中盐酸伪麻黄碱与特非那丁有明显协同作用,消除上呼吸道粘膜充血及一系列过敏症状效果很显著。本品用于控制感冒症状,属短期用药,安全性高,对人体无害。

三、药代动力学

特非那丁口服后吸收迅速,1~2h 达血

浆浓度峰值,吸收后 97%与血浆蛋白结合,广泛分布于全身各组织,其中肝、肺、胆囊中浓度较高,而脑浓度极低,除少量以药物原型从尿中排出外,99.5%以代谢物形式从尿和粪便中排出。

盐酸伪麻黄碱口服吸收迅速,3h 达血浆浓度峰值,人体内广泛分布。极小部分在体内经脱氧化而被代谢。90%以上药物以原型从尿中排出。

对乙酰氨基酚口服吸收迅速,0.5~2h 达血药浓度峰值,吸收后可分布全身,血浆蛋白结合率 25~50%,主要以代谢物形式从尿中排出。

四、临床应用与评价

经北京医科大学第一附属医院用丽珠感乐治疗感冒 100 例临床观察,服药后 2h 控制打喷嚏、鼻塞鼻痒、流泪流涕、头痛和肌肉痛、发热的显效率分别为 81%,75%,85%,82%,90%;服药后 48h 上述症状消除率分别为 90%,70%,84%,83%,94%。临床验证表明本品具有组方合理、疗效高、无嗜睡等优点,可确保技工、学生、脑力劳动者高效和安全地工作。

五、用法用量

口服,成人每日三次,每次 1~2 片;6~12 岁儿童用成人剂量一半;6 岁以下儿童遵医嘱。

六、不良反应

不良反应少而轻。偶见恶心呕吐(1.7%),口干(1.7%),头晕(1.3%),头痛(0.7%),耳鸣(0.3%),皮疹(0.7%),均可自

(下转 179 页)

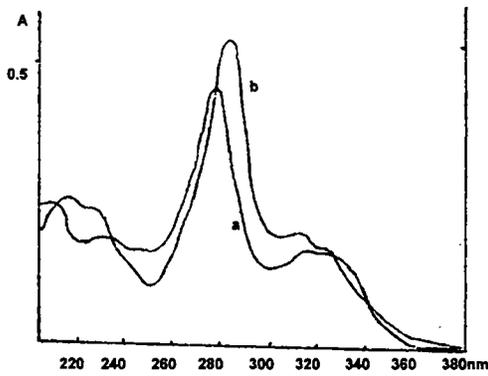


图 3 盐酸洛美沙星在两种溶剂中的紫外吸收光谱

a pH7.2 磷酸缓冲液中
b 0.1mol/mlHCl 液中

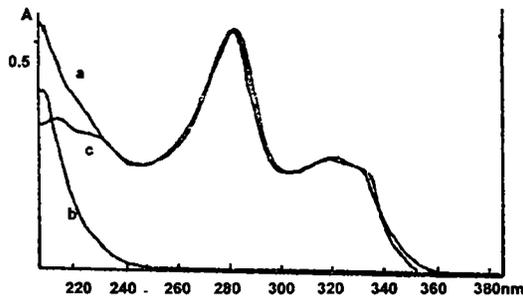


图 4 样品在 0.1mol/L HCl 液中的紫外吸收光谱

a 药膜 b 空白膜 c 标准品

三、小结与讨论

本文以 pH7.2 磷酸缓冲溶液作溶剂,建立了药膜体外释药速率实验模型,实验结果

表明,体外释药曲线与体内释药曲线基本一致,证明该实验模型的建立较为成功。

因为实验使用与体液酸度相近的 pH7.2 磷酸缓冲溶液作溶出液进行盐酸洛美沙星膜体外释药速率考察,所以,以该缓冲液为溶剂进行溶出液药物含量测定直接方便,而且,考察结果表明,该方法回收率及重现性良好(回收率为 101.6%,RSD 为 0.65%),在 1~10 μ g/ml 浓度范围内线性优良($r=0.9999$),在 12h 内测定稳定,可以认为,用上述方法考察药膜体外释药速率结果可信。但是作为药膜定量方法仍不够理想,因此本文以 0.1mol/LHCL 溶液作溶剂重新考察了盐酸洛美沙星抗菌药膜的定量方法[盐酸洛美沙星在两种溶剂中的紫外吸收光谱有明显差异(图 3)]。

经实验证明,以 0.1mol/LHCL 液作溶剂,用紫外分光光度法,可以简便、快速、准确地对盐酸洛美沙星药膜进行定量检测,回收率及重现性良好(回收率为 100.27%,RSD 为 0.42%),在 2~10 μ g/ml 浓度范围内线性优良($r=0.9999$),在 24h 内测定稳定,而且药膜溶解速度快,在 100 $^{\circ}$ C 水浴中,10 分钟内完全溶解,比在缓冲溶液中快 5 倍,所以,不失为理想的药膜定量方法。

参考文献

[1]林赴田. 洛美沙星药理临床. 新药与市场,1990;4:8

(上接 145 页)
行恢复。

七、禁忌症

对本品成分过敏者,严重冠状动脉疾病患者或高血压患者及哺乳期妇女禁用。

八、注意事项

孕妇、老年病人及对盐酸伪麻黄碱药理

作用较敏感者慎用。高血压、糖尿病、心脏病、甲状腺功能亢进、前列腺肥大、肝功能损害,眼压升高患者不宜服用。不宜与单胺氧化酶抑制剂或降压药联合使用。若同时接受酮康唑或三乙酰竹桃霉素治疗时,应减少本品用药剂量。