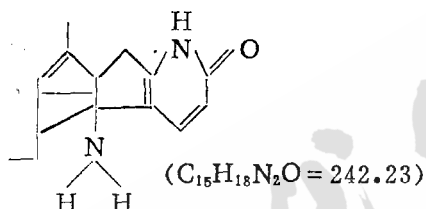


· 新药评介 ·

石 杉 硷—甲

Shi shan jian-jia
HUPHRZINUM-A



为类白色或微黄色结晶性粉末，无臭；味微苦。易溶于甲醇、氯仿，溶于乙醇，不溶于水。

本品由浙江医学研究院和中国科学院上海药物所共同研究，从浙江民间草药千层塔 [*Huperzia Serrata* (Thunb) Trev] 中提取的生物碱，经衍生物制备、红外光谱、紫外光谱、质谱， 1H 和 ^{13}C 核磁共振等测定，证明为国内外尚未见报道的新化合物，具有强效的胆硷酯酶抑制作用，优于同类药物毒扁豆硷。

药理作用：石杉硷甲是一种可逆性胆硷酯酶抑制剂，对真性胆硷酯酶有选择性的抑制作用，其加强间接电刺激神经引起的肌肉收缩振幅作用以及增强大鼠的记忆功能均强于毒扁豆硷，但毒性低于毒扁豆硷， $[^3H]$ 石杉硷甲的大鼠血药时间曲线，经分析为开放型二房室， $T_{1/2\alpha} = 5.9$ 分， $T_{1/2\beta} = 119.5$

分。在小鼠的肾，肝内含量最高，主要由尿内排出，七天排出为注射量的86.1%，部分以代谢产物形式排出体外。

急性、亚急性毒性试验：小鼠皮下注射的 LD_{50} 为3mg/kg；腹腔注射的 LD_{50} 为1.8mg/kg；大鼠腹腔注射的 LD_{50} 为5mg/kg；犬用药6个月的亚急性毒性试验结果表明，约相当于临床剂量的45倍，对犬无明显毒付反应。无致畸及致突变作用。

临床研究：石杉硷甲0.2~0.4mg/次治疗重症肌无力128例，总有效率99%，显效率55.5%。其中69例用新斯的明及石杉硷甲作双盲自身对照试验，其作用见效最佳作用时间与新斯的明类似，而有效维持时间明显长于新斯的明($P < 0.001$)。对反应的总频度比较。经统计学处理，无显著差异($P > 0.05$)。

【作用与用途】本品是一种可逆性胆硷酯酶抑制剂，用于重症肌无力症。

【用法与用量】肌肉注射一次0.2~0.4mg，一日1次或遵医嘱。

【注意】慎与硷性药物配伍。

【规格】1ml: 0.2mg

【贮藏】遮光、密闭保存。

【生产单位】温岭制药厂。

(王虎根)