

· 临床药学 ·

阿司匹林与异烟肼配伍用药的商讨

江西省九江市第二人民医院 黄振东

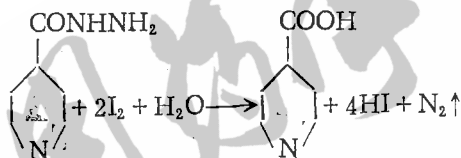
结核病患者在服用异烟肼治疗期间,因感冒、发热并服阿司匹林(或其制剂)在临床上时有发生。两者伍用是否合理,有无配伍变化,值得商讨。

异烟肼(INH)吸收后是在肝内经乙酰转移酶的催化,其氨基与乙酰辅酶A反应生成乙酰异烟肼而灭活^[1]。然而,阿司匹林属于强乙酰化剂^[2]两者伍用,在胃液中能否反应生成无活性的乙酰异烟肼。对此笔者进行了体外实验:取异烟肼0.1g、阿司匹林0.3g,混合研粉置三角烧瓶内,加蒸馏水20ml,用1N盐酸液调pH至3,置水浴箱内37℃放30分钟,定性滤纸过滤,为〔I〕。另取异烟肼0.1g,不加阿司匹林,其余同上,为〔II〕。分别精密吸取2ml,加水10ml,加N/10碘液5ml,盐酸(1—>2)2ml,密塞,在室温下放置15分钟后,加碘化钾试液1ml,立即用N/10硫代硫酸钠液滴定,至近终点,加淀粉指示剂2滴,继续滴定至蓝色消失,反应式如下,滴定结果附表:

附表

编 号	耗N/10 Na ₂ S ₂ O ₃ ml 数	N/10 I ₂ 与异烟肼反应 ml 数
I	4.4	0.6
II	4.05	0.95

注:以上数值为三次滴定结果。



讨论:①异烟肼很易被氧化,当与碘等氧化剂在酸性溶液中,能氧化生成异烟酸,而乙酰异烟肼则不易被氧化。实验时溶液调PH至3(与胃酸相当)有利于上述反应进行。I组内阿司匹林将部分异烟肼乙酰化,使之生成乙酰异烟肼,故与之反应的碘液比II组(对照组)少0.35ml。

②异烟肼在机体内的代谢产物主要是乙酰异烟肼和异烟酸,尚可生成少量异烟酸结合型产物,这些产物基本上都失去抗结核杆菌作用。异烟肼若与阿司匹林同服,在胃液中部分先生成乙酰异烟肼,势必影响异烟肼的生物利用度。至于阿司匹林究竟使多少异烟肼乙酰化,血药浓度低多少,均有待于药代动力学进一步研究证实。

参 考 文 献

[1] 上海第一医学院编:医用生物化学P.668,人民卫生出版社,1977。

[2] 药学通报:19(2), 61, 1984