

· 新产品、新设备 ·

威诺匹林(VENOPIORIN)—静脉注射阿司匹林

章云樵

从19世纪末以来,阿司匹林(Yixians Huizangsuan)作为一种非甾体抗炎镇痛剂广泛应用于解热、镇痛、消炎。

通常,阿斯匹林一直是以口服给药,因此消化道溃疡、出血等胃肠道副反应就成为一个难以解决的问题。日本绿十字株式会社进行广泛的研究,利用阿司匹林的DL-赖氨酸盐(乙酰水杨酸-DL-赖氨酸),发展了较稳定的静脉注射用阿司匹林针剂—威诺匹林。以静注方式使用阿司匹林,不仅能避免口服引起的胃肠道反应,还可迅速地提高阿司匹林在血中的浓度。

动物实验证明,静注阿司匹林见效快,其消炎、镇痛及退热作用与口服阿司匹林相比,具有少量给药而疗效相同之优点。此外,威诺匹林与水杨酸及其他二、三种镇痛药相比,也显示出更优异的退热、止痛效果。

将威诺匹林介绍如下:

一、组成与性状

每瓶含有下列成份:

阿司匹林DL-赖氨酸 900mg

甘氨酸(稳定剂) 100mg

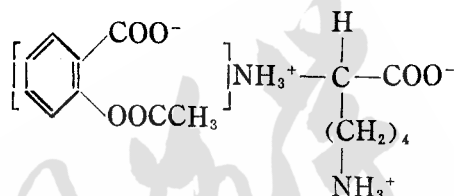
无水氯化钙 50mg

阿司匹林DL-赖氨酸由阿司匹林497mg和DL-赖氨酸403mg组成的盐类药物。本品为白色结晶状粉末。无臭、味稍苦,极易溶于水而极难溶于甲醇;在乙醇、乙醚、氯仿、苯中几乎不溶。

分子式: $C_{15}H_{22}O_6N_2$

分子量: 326.35

结构式:



二、作用

实验证明:静脉注射威诺匹林5分钟后,即观察到60%以上的环氧合酶活性受到抑制,至1小时后达最高度。而口服阿司匹林对环氧合酶的抑制作用,在给药30分钟后才逐渐显现,经2小时达最高值。并且,给药2小时后的抑制效果,威诺匹林约为口服阿司匹林的两倍。由此可见,使用同一剂量的阿司匹林时,静脉注射威诺匹林较口服阿司匹林表现作用的速度明显快。对于前列腺素生物合成系统的给药2小时后的积蓄效果(抑制率—时间曲线面积),前者达到后者的4倍多。

1. 镇痛作用:

对各种类型疼痛都有抑制作用,如肌肉痛、关节痛、术后疼痛等具有镇痛作用。小白鼠试验结果证明:口服200mg/kg阿司匹林与静注威诺匹林115mg/kg(即阿司匹林54mg/kg)效果相同。

2. 抗炎作用:

对减轻慢性风湿性关节炎、急性风湿热等症状有抗炎作用。

3. 解热作用:

威诺匹林能降低病理性发热。这种降温

(下转第17页)

(上接第36页)

解热作用是因为调整了视丘下部的体温调节中枢,引起血管扩张而增进了人体的散热功能。

三、毒性与副作用:

威诺匹林的静脉注射测得小白鼠的 LD_{50} 为1070mg/kg,大白鼠 LD_{50} 为1525mg/kg。

2. 亚急性毒性试验的最大耐受量为125mg/kg/day(约为临床用量的6倍)。

3. 慢性毒性试验的最大耐受量为63mg/kg/day(约为临床用量的三倍)。

四、用法、用量

本品每瓶含阿司匹林DL-赖氨酸900mg,溶介于5~20ml注射用水,静脉注射。

通常成人每次注射1瓶,每日1~2次,并按年龄、症状增减用量。

五、包装

粉针剂;每瓶1050毫克,每合10瓶

六、生产厂

日本国大阪市绿十字株式会社