

论文

根据青蒿素药效半衰期制订给药方案的探讨

李成韶;杜以兰

山东省中医药研究所,济南

摘要:

为了降低用青蒿素治疗后疟疾的复燃率,用鼠疟模型测定了青蒿素的药效半衰期,并用两种不同给药方案进行了治疗实验。A方案参照药效半衰期每12 h肌注总量的1/6,首次剂量;B方案仿临床用法每隔24 h肌注总量的1/3。A方案各组与相应的B方案各组3天总量相等。共观察3个月。结果表明青蒿素药效半衰期为10.5±2.3 h,A方案治愈率较B方案提高10~40%,即在总剂量相等时,适当缩短给药间隔时间,可提高疗效。

关键词: 青蒿素 抗疟药 伯氏疟原虫ANKA株

RESEARCH ON THE DOSE REGIME OF QINGHAOSU ADMINISTRATION ACCORDING TO ITS BIOLOGICAL HALF-LIFE

LI Cheng-shao and DU Yi-lan

Abstract:

Qinghaosu (Artemisinin) is a new antimalarial drug extracted from the Chinese medicinal herb, Qing Hao (*Artemisia annua Linn.*). Animal experiments and clinical observations indicate that Qinghaosu is highly effective against erythrocytic parasite with low toxicity and marked effect on *falciparum* malaria resistant to Chloroquine. But, in the usual clinical dosage (0.3 g im qd for 3 days), its average recrudescence rate is more than 10%. In order to reduce the recrudescence rate, the biological half-life of the drug and therapeutic effect in mice infected with *Plasmodium berghei* ANKA strain were studied. Two different methods were used for the determination of biological half-life of the drug: one was to examine the pharmacodynamic attenuation rate at different times after intramuscular injection, the other was to complement the SD₅₀ (half suppressive dose). The results of the two methods were similar, i.e. 10.5±2.3 h and 11 h, respectively. Two dose regimes of drug administration were compared: 1. Regime A: based on t_{1/2}, 1/6 of the total test dose of Qinghaosu was administered intramuscularly per 12 hours with the initial dose doubled. The course of the test was 3 days. 2. Regime B: referring to the dosage regime used clinically, i.e. 1/3 of the total dose was injected intramuscularly per 24 hours for 3 days. The total dose of the drug in regime B was the same as that in regime A. After treatment the animals were observed for 3 months, the results demonstrate that dosage regime A was better than dosage regime B. The curative rate in regime A was 10~40% higher than that in regime B with the same dosage. The CD₅₀ and CD₉₅ of regime A were 29.4% and 32.8% lower respectively than those of regime B.

Keywords: Antimalarial drugs *Plasmodium berghei* ANKA strain Qinghaosu

收稿日期 1983-06-08 修回日期 网络版发布日期

DOI:

基金项目:

通讯作者:

作者简介:

参考文献:

本刊中的类似文章

1. 张东;杨岚;杨立新;王满元;屠呦呦.HPLC-UV-ELSD法同时测定青蒿中青蒿素、青蒿乙素和青蒿酸的含量[J]. 药学报, 2007,42(9): 978-981

扩展功能

本文信息

- Supporting info
- PDF (263KB)
- [HTML全文]
- 参考文献

服务与反馈

- 把本文推荐给朋友
- 加入我的书架
- 加入引用管理器
- 引用本文
- Email Alert
- 文章反馈
- 浏览反馈信息

本文关键词相关文章

- 青蒿素
- 抗疟药
- 伯氏疟原虫ANKA株

本文作者相关文章

- 李成韶
- 杜以兰

PubMed

- Article by
- Article by

2. 王增;周慧君.二氢青蒿素下调粒系白血细胞转铁蛋白受体表达[J]. 药理学, 2008,43(6): 576-583
3. 杨树德;马建民;孙娟华;陈端霞.静脉注射青蒿酯后人体尿药排泄数据的初步分析[J]. 药理学, 1987,22(6): 401-404
4. 李成韶;杜以兰.效量半衰期 $t_{1/2}(ED)$ 及其计算公式[J]. 药理学, 1986,21(3): 165-169
5. 赵凯存;陈其明;宋振玉.青蒿素及其两个活性衍生物在狗体内药代动力学的研究[J]. 药理学, 1986,21(10): 736-739
6. 李成韶;杜以兰;姜齐.伯氏疟原虫对青蒿素抗药性的研究[J]. 药理学, 1986,21(11): 811-815
7. 李英;陈一心;虞佩琳;嵇汝运.青蒿素类似物的研究——VI.从青蒿素降解产物双酮合成二氢青蒿酸的研究[J]. 药理学, 1986,21(12): 899-905
8. 陈一心;虞佩琳;李英;嵇汝运.青蒿素类似物的研究 III.二氢青蒿素二元酸双酯和单酯类衍生物的合成[J]. 药理学, 1985,20(2): 105-111
9. 虞佩琳;陈一心;李英;嵇汝运.青蒿素类似物的研究 IV.含卤素、氮、硫等杂原子的青蒿素衍生物的合成[J]. 药理学, 1985,20(5): 357-365
10. 张秀琴;徐礼燊.中药青蒿中青蒿素的脉冲极谱测定法[J]. 药理学, 1985,20(5): 383-386
11. 李高德.伯氏疟原虫K173株对喹啉抗药性的实验研究[J]. 药理学, 1985,20(6): 412-417
12. 杨树德;马建民;孙娟华;宋振玉.还原型电化学极谱检测高效液相色谱法测定人血浆中青蒿酯和双氢青蒿素[J]. 药理学, 1985,20(6): 457-462
13. 陈一心;虞佩琳;李英;嵇汝运.青蒿素类似物的研究 VII.双(二氢青蒿素)醚和双(二氢脱氧青蒿素)醚类化合物的合成[J]. 药理学, 1985,20(6): 470-473
14. 李锐;周莉玲;李迅;钟镜金;李灿辉;廖灶引.应用气——质联用等法对青蒿酯钠体内命运的研究[J]. 药理学, 1985,20(7): 485-490
15. 宋振玉;赵凯存;梁晓天;刘春雪;仪明光.青蒿酯和青蒿素的放射免疫测定法[J]. 药理学, 1985,20(8): 610-614
16. 周晋;杜智敏;邱晓红;孙建平;何树庄;杨宝峰.抗疟药青蒿素抗心律失常的作用机制[J]. 药理学, 1999,34(8): 569-572
17. 张景丽;李金翠;吴毓林.臭氧化合成青蒿素类似物[J]. 药理学, 1988,23(6): 452-455
18. 王仲山;曹秀玲.二氢青蒿素的变旋作用与差向异构体转化研究[J]. 药理学, 1988,23(8): 610-615
19. 李成韶;杜以兰;张翠莲;赵新静.双氢青蒿素对小鼠抗疟作用的药效动力学[J]. 药理学, 1989,24(7): 487-489
20. 赵凯存;宋振玉.双氢青蒿素在人的药代动力学及与青蒿素的比较[J]. 药理学, 1993,28(5): 342-346
21. 李英;杨正修;陈一心;章辛. $^{15}\text{-}^{14}\text{C}$ 标记青蒿素的合成[J]. 药理学, 1994,29(9): 713-716
22. 糜竞芳.若干青蒿素和青蒿乙素反应中间体的圆二色谱研究[J]. 药理学, 1991,26(7): 557-560
23. 叶斌;吴毓林;李国福;焦岫卿.脱羧青蒿素的抗疟活性[J]. 药理学, 1991,26(3): 228-230
24. 赵凯存;宋振玉.口服双氢青蒿素在兔和狗体内的药代动力学研究[J]. 药理学, 1990,25(2): 147-149
25. 赵凯存;宣文漪;赵一;宋振玉.青蒿琥酯皮肤擦剂在小鼠和兔体内的药代动力学研究[J]. 药理学, 1989,24(11): 813-816
26. 李茵;周慧君;.二氢青蒿素抑制K562细胞血管内皮生长因子的表达[J]. 药理学, 2005,40(11): 1041-1045
27. 杨忠顺;李英.与青蒿素相关的1,2,4-三恶烷及臭氧化物的研究进展[J]. 药理学, 2005,40(12): 1057-1063
28. 张建新;王峻霞;张瑜;左建平;吴锦明;隋毅;李英.具有免疫抑制作用的含有聚乙二醇基的青蒿素衍生物的合成[J]. 药理学, 2006,41(1): 65-70
29. 梁瑞玲;刘天伟;屈凌波;唐明生;相秉仁.基于过氧键裂解的青蒿素抗疟机制量子化学研基于过氧键裂解的青蒿素抗疟机制量子化学研究[J]. 药理学, 2006,41(6): 544-547
30. 糜竞芳;沈春镒.用旋光谱和圆二色谱研究青蒿素降解产物失碳倍半萜内酯的立体化学[J]. 药理学, 1984,19(3): 184-189
31. 曾衍霖;李端;严汉英.用平均吸收率计算吸收速率常数[J]. 药理学, 1982,17(3): 171-175
32. 张银娣;王长根;许帼英;庄怡华;曾衍霖.血浆中甲基还原青蒿素(蒿甲醚)的薄层扫描定量法[J]. 药理学, 1982,17(3): 212-217
33. 糜竞芳;沈春镒.若干青蒿素合成中间体的旋光谱[J]. 药理学, 1982,17(6): 421-424
34. 邵葆若;叶秀玉;郑浩.伯氏鼠疟原虫(*Plasmodium berghei*)对咯萘啶抗药性的研究[J]. 药理学, 1982,17(8): 566-571
35. 李万亥;束汉麟;许国英;曾衍霖.青蒿素及其衍生物与血浆蛋白的结合[J]. 药理学, 1982,17(10): 783-786
36. 柳乃方 屈凌波 相秉仁 杨 冉.青蒿素类化合物抗肿瘤机制研究— 青蒿素类化合物/转铁蛋白对接研究[J]. 药理学, 2009,44(2): 140-144

反馈人	<input type="text"/>	邮箱地址	<input type="text"/>
反馈标题	<input type="text"/>	验证码	<input type="text"/> 6624