新一代全天然抗血栓药——博洛克

江西中医学院(南昌 330006)
江中制药厂

陈 奇 陈兰英 毕 明
兰青山 童劲松

博洛克是中国科学院生物物理研究所和江中制药厂共同研制的有效、方便、安全的新一代全天然抗血栓药,由江中制药厂生产,采用生化分离技术从特殊蚯蚓中分离一种蛋白水解酶,是一种多分酶制剂,能直接溶解纤维蛋白和激活纤维蛋白溶酶原,有显著的溶栓效应,适用于血栓和栓塞性疾病。

1 药理作用

1.1 缩短优球蛋白溶解时间:给家兔静脉注射 2500 U/kg 和 5000 U/kg 博洛克,5 和 15 min 后,优球蛋白溶解时间显著缩短,此后逐渐恢复;给家兔口服 4000 U/kg 博洛克后 4 h,优球蛋白溶解时间明显缩短,8 h 降至最低,12 h 恢复到给药前水平。

1.2 溶解体外血栓:用体外血栓形成仪制成血栓,对不同浓度的博洛克(1250、125 和 62.5 U/mL)和尿激酶(1250、300 和 60 U/mL)进行体外溶栓试验,结果显示博洛克作用显著,其溶栓速率和强度均比尿激酶高。

1.3 溶解体内复制血栓:对体内复制血栓的大鼠分别静脉(1000 U/kg)和直肠(6000 U/kg)给药,结果与对照组相比,给药 2~4 h 后,溶栓作用显著,用¹²⁵I 标记的纤维蛋白原摄入全血制成栓子,由家兔颈静脉注入,形成肺栓塞动物模型,以 2000 和 600 U/kg 的剂量从十二指肠给药,给药 3 h 后测得血中放射活性的变化率显著提高,与对照组比较有明显的溶栓效应。

2 毒性研究

急性毒性试验测得小鼠半数致死量 LD₅₀ 为 14.46 万 U/kg,说明本品毒性低;另外,大量的长期

毒性试验说明,博洛克对肝、肾、神经系统、心血管系统、呼吸系统均无明显影响,无致突变和致畸胎作用。

3 临床观察

3.1 I 期临床试验:北京宣武医院、江西医学院第二附属医院和江西省人民医院等,采用博洛克治疗脑梗塞患者 303 例,试验采取随机抽样双盲法,观察临床和血液流变学变化,结果表明该药临床总有效率为 93.7%,显效率为 73.6%,与对照组总有效率和显效率比较,均有显著性差异,并且治疗后纤维蛋白原含量、优球蛋白溶解时间、全血粘度、血浆粘度、血球压积、血小板聚集功能与治疗前比较显著降低。

3.2 II 期临床试验:北京宣武医院等 16 家医院,用博洛克治疗缺血性脑血管病 1560 例,部分医院还观察血液流变学的变化,结果临床总有效率为 88.21%,显效率为 68.9%,并且治疗后血液流变学各项指标均有变化,纤维蛋白原及优球蛋白溶解时间明显减少。

总之,博洛克与纤维蛋白有特殊的亲合力,在临床应用中具有极大的优越性,没有引起高纤溶酶血症进而引起出血的危险,临床使用仅有少数人偶有皮肤瘙痒、皮疹、恶心、腹泻,但未发现明显的毒副作用,可见博洛克不仅疗效确切,而且用药安全,又由于其为肠溶胶囊,进入胃内后不被破坏,既保证了疗效,又服用方便,有利于临床推广应用,是颇有前途的抗血栓新药。

(1997-01-27 收稿)

粉。参数分析包括:1)总周期,卵泡期及黄体期长短;2)卵泡早期、中期及黄体期雌二醇、雌酮、睾酮的血清浓度;3)黄体期血清黄体酮浓度及与雌二醇的比率。第二及第三服用亚麻籽周期的参数与对照期相应作了比较。研究结果表明,服用亚麻籽能延长黄体期,减少无排卵周期,因而减少了卵巢功能障碍的发

生。表明木脂素在饮食、性激素作用关系和在饮食与乳腺癌及其它与激素有关的癌症中的重要特定作用。

(陆顺芳摘译 史玉俊校)

[Herbalgram 1996,(37):16]