

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和力,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,有利于临床广泛推广应用,是颇有前途的抗血栓新药。

(1997-01-27 收稿)

芍药甙外,其余有效成分在去皮根中含量均大于有皮根,尤其是芍药甙高出 35%,表明芍药甙主要存在于白芍根的中心部位,而在赤芍中则主要存在于皮层部分。因此白芍药材最好采用去皮的根,而赤芍

药材则应保留其皮层,一般选用硬脆粗大的药材质量更好。

〔姚莉韵摘译 陈泽秀校〕

〔Planta Med 1996,62(4):347〕