

研究簡報与經驗交流

# 抗血吸虫病合成药物研究簡報

血吸虫病药物研究专题組

我院在1958年合成的SbO酯的基础上，进一步探索合成抗血吸虫病有效药物，1961年在分离和纯化SbO酯的过程中，合成了一系列的锑化合物，其中找到S.J.59与S.J.66两者在小白鼠与家犬的实验治疗中，对日本血吸虫口服均有较显著的疗效，S.J.59正在进行初步临床试验。

S.J.59小白鼠口服十天亚急性LD<sub>50</sub>=36.1毫克/20克鼠重，比在同样条件下测得酒石酸锑钾LD<sub>50</sub>(20.4毫克/20克鼠重)大一倍左右，这就是说S.J.59的毒性较酒石酸锑钾约低一倍。对小白鼠日本血吸虫病的治疗作用，在等毒剂量下，无论用 $\frac{2}{3}$ LD<sub>50</sub>或 $\frac{1}{2}$ LD<sub>50</sub>剂量进行实验治疗比较，均显著优于酒石酸锑钾。以2.5毫克/20克鼠重×14天，对75只病鼠分组治疗，虫数减少率均在96.5%—99.3%，各组之间无显著差别( $P>0.05$ )，其作用比较稳定(详见表一)。

表一  
59隻驗治的小白鼠日本血吸虫病結果表

組別	藥物	劑量 毫克×鼠重克數×川痢 大數	死亡		痊癒		雌蟲完全消灭		每鼠平均虫數 生率或率 度數 少數 (%)		備註			
			驗 鼠 數	死 亡 數	痊 癒 % 實驗	痊 癒 % 介剖	% 消滅 /介剖	%	肝	腸	♀	♂	合計 (%)	
等 毒 量 比 較 組	S·J·592.4 /23×10 (No1) (20克体重2/3LD <sub>50</sub> )	10	1/10	10	1/9	11	7/9	78	1.1	1.10.2	2.0	2.2	10.5	81.7 (非常顯著)
	吐酒石 1.3 /23×10 (20克体重2/3LD <sub>50</sub> )	10	0	0	0	0	0/10	20	1.2	4.11.0	4.3	5.3	26.5	55.8 (不顯著)
	S·J·591.8 /23×10 (No1) (20克体重1/2LD <sub>50</sub> )	10	1/10	10	0	0	0/9	56	1.3	1.40.3	2.4	2.7	13.5	77.5 (非常顯著)
	吐酒石 1.04 /23×10 (20克体重1/2LD <sub>50</sub> )	10	0	0	0	0	0/10	10	1.9	5.91.3	6.5	1.8	38.0	30.0 (非常顯著)
	對照	10							3.2	8.83.7	8.3	12	60.0	
及 双 疗	S·J·592.5 /23×7×7 (No1)	20	4/20	20	13/16	81	15/16	94	0.3	0.0.1	0.2	0.3	0.2	97.7
程組	對照	18							2.6	10.73.5	9.8	13.3	86.5	
十 四 天 通 過	S·J·59 (No2) 2.5 /20×14	15	2/15	13	7/13	54	13/13	100	0.5	0	0.0.5	0.5	2.5	96.5 根據統計學計算各項均P>0.05故虫數減少差別不顯著
	S·J·59 (No3) 2.5 /20×14	15	2/15	13	8/13	62	13/13	100	0.5	0	0.0.5	0.5	2.5	96.5
	S·J·59 (No4) 2.5 /20×14	15	3/15	20	10/12	83	12/12	100	0.2	0	0.0.2	0.2	1.0	98.6
	S·J·59 (No5) 2.5 /20×14	15	3/15	20	8/12	67	12/12	100	0.3	0	0.0.3	0.3	1.5	98.0
	S·J·59 (No6) 2.5 /20×14	15	5/15	33	9/10	90	10/10	100	0.1	0	0.0.1	0.1	0.5	99.3
合 計	對照	75	15/75	70	42/60	66	60	100	0.3	0	0.0.3	0.3	1.5	98.0
		13							1.9	12.5	5.40.2	14.4	72.0	

用 S.J.59 肠溶片治疗犬，其中两犬治疗剂量分别为 15 毫克/公斤体重，疗程为 10 天，停药后两个月介剖，虫数减少率分别为 83.7% 与 100%（此实验由江苏省血吸虫病研究所协作进行）。另外两犬治疗剂量为 20 毫克/公斤体重，疗程为 14 天，停药后一个月介剖，虫数减少分别为 100% 与 54.7%（此实验在本院进行详见表二），治疗过程中，消化道反应不严重。

S.J.59 实验治疗家犬日本血吸虫病结果表

表二

组别	犬号	剂量 毫克/体重/用药天数	虫数统计					虫子余生率或 发育率(%)	虫数减少率(%)	备注
			肝	肠	♀	♂	合计			
治疗组	3	280/公斤/14	0	0	0	0	0	0	100	
治疗组	4	280/公斤/14	15	94	52	57	109	36.3	54.7	
对照组	1		37	96	121	143	264	79.1 (平均)		平均虫数 237.5 条
对照组	2		57	155	116	95	21			

S.J.66 小白鼠口服十天急性 LD<sub>50</sub>=17.4 毫克/20 克鼠重，于同样条件下测得酒石酸锑钾 LD<sub>50</sub>=20.0 毫克/20 克鼠重，两者毒性相近，用等毒剂量实验治疗日本血吸虫病鼠，S.J.66 1—1.5 毫克/20—24 克鼠虫×(10—14) 天对 70 只病鼠分组治疗，虫数减少率为 78.9%—95.1%，动物实验疗效优于酒石酸锑钾（详见表三）。

S.J.66 实验治疗小白鼠日本血吸虫病结果表

表三

药物	剂 量 毫克/鼠重克数 ×用药天数	实 验 鼠 数	死 亡 数 / 实 验	症 症		雌虫完 全消 灭		每鼠 平均虫数				虫子余 生率或 发育率 (%)	虫数减 少率 (%)	备注		
				死 亡 数	%	症 症 数 / 介 剖	%	消 灭 数 / 介 剖	%	肝	肠	♀	♂	合 计		
S.J.66 对照	1.5 /23×10	10	3/10 30	2/7	38	7/7	100	0.6	0.6	0	1.2	1.2	6.0	93.0		
		8						1.2	16.4	8.5	9.1	17.6	88.6			
S.J.66 1.5 /23×10		20	7/20 35	7/13	54	13/13	100	0.4	1.0	0	1.4	1.4	7.0	89.6	♂△○○	
S.J.66 1.0 /23×10 对照		20	3/20 15	1/17	0	16/17	93	1.6	1.2	0.1	2.7	2.8	14.0	78.9	非常显著	
		18						2.5	10.8			13.3	66.5			
S.J.66 1.16/20×14 (2/3LD <sub>50</sub> ) 吐酒石 1.33/20×14 (2/3LD <sub>50</sub> ) 对照		20	5/20 25	9/15	60	15/15	100	0.7	0	0	0.7	0.7	3.5	95.1	♂△○○	
		20	6/20 30	0/16	0	14/14	100	1.5	0.9	0	2.3	2.3	11.5	84.0	非常显著	
		13						1.9	12.6	5.4	9.2	14.4	72.0			

用 S.J.66 肠溶片治疗二犬，剂量为 15 毫克/公斤体重，疗程分别为 14 天和 7 天，一大停药后一月介剖，一大停药后第二天介剖，结果虫数减少率分别为 58.3% 和 78.1%（详见表四），在治疗过程中，消化道反应轻微。

S.J. 66実験治療家犬日本血吸虫病結果表

表四

組別	犬号	剂量 毫克/体重/用 藥天數	虫數統計					虫子余生率 或發生率 (%)	虫數減 少率 (%)	備註
			肝	腸	♀	♂	合計			
治疗組	5	210/公斤/14	21	78	53	46	99	15.3	58.3	
	6	105/公斤/7	51	1	8	44	52	17.3	78.1	
对照組	1		37	96	121	143	264	79.1		
	2		57	135	116	95	211	(平均)		平均虫數237.5 条

(本文由 执笔)