

7801660

SELECTED PAPERS
ON
PLANNED
PARENTHOOD

计 划 生 育 专 题 论 文 选 集



VOLUME

5

Chemistry, Pharmacology and
Clinical Application of Prostaglandins

前列腺素的化学、药理和临床应用

7801660

Selected Papers on Planned Parenthood

Vol. 5

**Chemistry, Pharmacology
&
Clinical Application of
Prostaglandins**



November 1975

中文摘要

前列腺素的化学

Prostaglandins: Members of A New Hormonal System

前列腺素———列新的激素

2

本文作者是最早从事前列腺素分离提纯工作者之一。文内简要介绍了前列腺素的发现、分离、结构测定以及生物合成、代谢和生理作用。

Prostaglandins

13

前列腺素

本文主要介绍有关前列腺素的一些分析方法以及它们的光谱数据。虽不十分详尽,但基本情况已都包括了。另外也概括登载了命名法以及前列腺素的结构测定、生物合成和代谢的简单情况。

Studies on the Total Synthesis of PGs

前列腺素全合成的研究

46

本文小结了自1964年以来哈佛大学 Corey 小组合成六个主要前列腺素的工作。特别强调在合成 PGE 型前列腺素时,应尽可能在后期、并应用尽可能温和的条件构成 β -羟基-酮系统。

Synthesis and Biological Activity of PGs and PG Antagonists

60

前列腺素的合成和生物作用及其对抗体

本文小结 Corey 小组对 7-氧杂 PGE₁ 和 F₁ α 等类似物的合成,并发现环戊烯环氧化物用一般格氏试剂是难以开环的,而用块铝化物易达到目的,此法成为该组合成前列腺素类似物及以后合成前列腺素的关键方法。并首次应用一般切实可行的方法分析八碳的羟基链。

对生物活性的测定,发现 7-氧杂、13-脱氢的一类前列腺素具有抗前列腺素的活性。

New Synthetic Approach in the PG Field

86

前列腺素领域中新的合成途径

本文发展了一条从王二酸合成 (I) 的方法,并从该化合物合成具光学活性的 PGB₁ 以及 11-含氧的 B₁ 衍生物。

Novel PG Syntheses

98

新的前列腺素合成

本文发展了一条从 PGF 合成高生物活性的 15-甲基 PGs, 以及从 15 (R)PGA₂ 转化成 PGE₂ 及 PGF₂ α , 合成半合成前列腺素的方法。

Recent Developments in the Biosynthesis & the Analysis of PGs

113

前列腺素生物合成和分析的最近发展

本文在前列腺素生物合成方面的内容涉及 (1) 前体的专一性, (2) 某些新的前列腺素, (3) 前列腺生物合成的抑制作用, (4) 在脂肪组织中前列腺素的生物合成。

前列腺素的分析部分为 (1) 通论, (2) 前列腺素在皮肤中的分析, (3) 在骨髓质中前列腺素的分析。

The Total Synthesis of Prostaglandins

133

前列腺素的全合成

本文专门综述了1970年以前的前列腺素的化学合成,包括天然前列腺素、结构简化的前列腺素以及氧杂前列腺素的合成。关于从柳珊瑚来的原料半合成前列腺素也有提及。

プロスタグランディンの合成、その進歩と発展(日文)

195

前列腺素的合成及其进展

本文专门介绍1972年底前的前列腺素化学合成的进展,以及合成路线的关键步骤的分类。

Total Synthesis of PGs IV: A Completely Stereospecific Synthesis of PGE₁

217

应用微生物立体专一性合成前列腺素E₁

本文报导了前列腺素E₁的完全立体专一性合成法。关键步骤为铜试剂对 α , β -不饱和酮的共轭加成。本文特点是该不饱和酮可由微生物专一还原而得。据文中宣称,由一个三酮中间体开始,四步得前列腺素,总产率可达百分之三十。

Prostaglandins and Congeners V: (I) Synthesis of dl-PGE₁, dl-11-deoxyPGE₁ and dl-15-hydroxy-9-oxo-13-clis-prostenoic Acid via Conjugate Addition of 3-trityloxy-1-octenyl Magnesium Bromides

221

前列腺素和类似物V: 由3-三苯甲氧基-1-辛烯基溴化镁的共轭加成合成dl-前列腺素E₁, dl-11-去氧前列腺素E₁和dl-15-羟基-9-氧-13-烯-前列腺酸

本文用烯型的格氏试剂在碘化亚铜催化下进行1,4-加成,构成前列腺素的基本骨架。

Total Synthesis of Prostaglandins V: A Synthesis of (-)-Prostaglandin E₂ via A Totally Asymmetric Process

225

前列腺素全合成V: 用完全不对称过程来合成(-)-前列腺素E₂

本文是将前报导的合成前列腺素E₁的方法[J. Amer. Chem. Soc. 95, 1676 (1973)]推广应用于合成PGE₂,由此介绍了所需中间体的合成路线。文内也提了一下采用生物还原法以获得光学活性的1-碘-辛烯-[1]-醇-[8]。

Total Synthesis of Prostaglandins. Control of Regiospecificity in the Alane-Epoxyde Reaction and Selective Catalytic Oxidation of Alkynylation Products

229

前列腺素合成,有机铝-环氧反应中区域专一性的控制和烷基化产物的选择性催化氧化

本文介绍了用有机铝试剂与1,2-环氧化合物区域专一性的反应,是芝加哥大学Fried等合成前列腺素的关键步骤。本文讲述了新获悉的要达到这一专一性的反应条件。另外也介绍了铂催化选择性氧化以及由此而至18-脱氧前列腺素F₂ α 的合成路线。

Prostaglandin Synthesis I: An Improved Synthesis through Bicyclo(3,1,0)Hexane Intermediates

232

前列腺素合成I: 一个通过双环[3,1,0]己烷中间体的改进合成法

六十年代开始,美国Upjohn公司即从事于前列腺素的全合成。1967年开始,报导了以破三碳环为关键步骤的合成路线,但是产率一直不佳。本文报导了他们在这一合成路线方面的新进展。

Direct Stereocontrolled Synthesis of a Prostaglandins Using the Bicyclo(2,2,1)-Heptene Approach

235

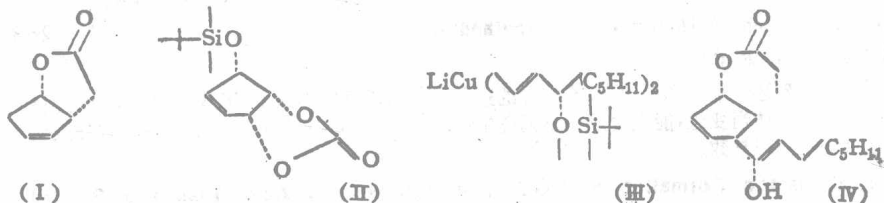
用双环[2,2,1]庚烯来直接、立体控制的合成A型前列腺素

本文在原来合成PGE₂, PGF₂ α 路线的基础上稍作改变,从而直接合成PGA₂。

A New Stereoccontrolled Synthesis of Prostaglandins via Prostaglandin A₂ 236

通过前列腺素A₂的新的立体控制的前列腺素合成

本文用右旋的苯乙胺析分不饱和内酯(I)游离酸后,再转化为(II),用锂铜试剂(III)进行亲核(内酯)取代反应,引进含八碳的羟基链而合成(IV)。



Efficient Generation of the 15-s-Configuration in PG Synthesis, Attractive Interactions in Stereochemical Control of Carbonyl Reduction 238

在前列腺素合成中有效地产生 15-s 构型。羰基还原立体控制中奇妙的相互作用

本文检查分子模型,从理论分析着手,在 11 α 位采用大体积的保护基团,再用大分子的还原剂,则可立体控制还原 15 酮基为 15 (s) 羟基。

Highly Stereoselective Conversion of PGA₂ to the 10, 11 α -oxido Derivative Using A Remotely Placed Exogenous Directing Group. 241

应用远离的完位基团将前列腺素A₂高度立体选择性地转变成 10, 11 α 环氧衍生物

本文从 PGA₂ 的构象分析着手,在 15 (s) 羟基用庞大的基团保护后,可立体控制环氧化 $\Delta^{10,11}$ 双键,最后使得从 PGA₂ 转化为 PGE₂ 的产率很高。

A New Synthetic Route to PGs 245

一个新的前列腺素的合成路线

本文采用类吡喃醇重排的反应使六元环收缩为五元环,同时又具有需引进八碳羟基链的 13-醛基,成为一种新的合成方法。

A Novel Synthesis of Prostaglandin F_{2 α} 249

前列腺素 F_{2 α} 的一个新的合成

本文从全顺 1, 3, 5-环己三醇出发合成所谓 Corey 路线的中间体,再由已知方法得 PGE_{2 α} 。特点是通过多环结构从而保证产物所需的立体构型,中间产物大多为结晶,便于操作。本法缺少实用价值,但某些反应可供参考。

Asymmetric Synthesis of Prostaglandin Intermediates 253

前列腺素中间体的不对称合成

本文报导了用不对称的硼试剂进行硼氢化反应,从而由环戊二烯开始不经析分工作而制备了一些前列腺素合成路线中所需的光学活性中间体。

New Extensions of the Bicyclo[2, 2, 1]Heptane Route to PGs 255

双环[2, 2, 1]庚烷合成前列腺素路线的新进展

本文描述了从(I)用一条新的方法合成各种前列腺素。特别是从石油产品(II)用简易可行的方法合成重要中间体(III),使得早期的合成路线更适合大规模的生产。



Synthesis of PGs by Conjugate Addition and Alkylation of A Directed Enolate Ion, 11-deoxy PGs	258
用共轭加成和定向的烯醇离子的烷化合成前列腺素 11-脱氧前列腺素	
本文用环戊烯酮 1, 4 加成引入含碳的羟基链后, 所生成定向的烯醇离子能直接烷化引入七碳的酸链, 即一步完成前列腺素的基本骨架结构, 是合成前列腺素较短的路线。	
Total Synthesis of 15-Methyl Prostaglandins	263
15-甲基前列腺素的全合成	
本文叙述了在温和条件下, 选择性的进行(类)格氏反应引入 15 甲基, 使得 Corey 路线的中间体经适当变化, 能全合成一系列高生物活性的 15-甲基前列腺素, 并有详细操作及各化合物的物理常数。	
The Enzymatic Formation of PGE ₂ from Arachidonic Acid, PGs and Related Factors	275
用酶使花生四烯酸生成前列腺素 E ₂ 。其他前列腺素及其有关因子	
[³ H]花生四烯酸经绵羊胎精囊孵育后得到 PGE ₂ 。这个结果说明必需脂肪酸是动物体中生物合成前列腺素的前驱物。8, 11, 14-二十碳三烯酸将是前列腺素 E ₁ 的前驱物, 5, 8, 11, 14, 17-二十碳五烯酸将是前列腺素 E ₃ 的前驱物。	
Separation, Identification, and Estimation of Prostaglandins	279
前列腺素的分离、鉴定和评价	
本文是一篇涉及前列腺素的分离, 检定及评价的综述性文章。	
Properties of A Novel Preparation of PG Synthetase from Sheep Seminal Vesicles	327
从绵羊精囊中制备前列腺素合成酶的新方法之特性	
本文报导将绵羊胎精囊做成丙酮戊烷沉淀的酶干粉仍保持前列腺素合成酶的全部活力, 并可反复使用多次。前列腺素的产率较已报导的方法提高三倍。本文同时也讨论了关于这种酶干粉的某些重要性质。	
Isolation and Structure of Two Prostaglandin Endoperoxides That Cause Platelet Aggregation	341
引起血小板凝固的二个内过氧化前列腺素的结构和分离	
本文报导在 P-mercuribenzoate 的存在下, 花生四烯酸和绵羊胎精囊匀浆的微粒体酶短时间孵育, 可以得到 PGG ₂ 和 PGH ₂ 对于主动脉的作用分别为 PGE ₂ 的 50~200 倍和 100~450 倍。	
Identification of PGs in the Gorgonian Plexaura Homomalla	346
柳珊瑚中前列腺素的鉴定	
本文报导 1969 年 Weinheimer 和 Spraggins 从阴干的柳珊瑚 Plexaura Homomalla 皮层中提取得到 0.2% 15(R) PGA ₂ 及 1.3% 15(R) PGA ₂ 的醋酸酯甲酯化合物。	
本文改用氯仿-甲醇作提取溶剂, 从同一品种柳珊瑚中除分离出上述二种相同成份外, 还得到 15(R) PGE ₂ 与 15(R) PGE ₂ 的甲酯化合物。	
15(R) PGE ₂ 的结构是从它的衍生物 O-甲基胍 (O-methylxime) 甲酯与三甲基硅醚化合物的质谱气液层析谱以及氧化断片与合成的 15(s) PGE ₂ 衍生物对比得以证明。	
Prostaglandins from Marine Sources	355
海产中的前列腺素	
1969 年 Weinheimer 和 Spraggins 报导, 他们经佛罗里达海内采集到的柳珊瑚 Plexaura Homomalla 中能提取到 1.3% 含量的 15 R (或称 15 epi (异)-PGA ₂ 甲酯, 醋酸酯) 以及 0.2% 相应的游离酸。	
在人体内的前列腺素如 PGA ₂ (3), PGE ₂ (4) 与 PGF _{2α} (5) 都是 15 s 构型即与上述 15 R 构型相反的, 这些前列腺素具有生理活性, 能促使平滑肌收缩, 可用来控制生育和引产。	

本文介绍了几种将柳珊瑚中提取到的 15 R PGA_2 甲酯改造合成为天然前列腺素 (15 s 构型) 的方法。

另外还发现在上述柳珊瑚中也可分离得到少量 5-反式- $\text{PGF}_{2\alpha}$ (22), 5-反式- PGE_2 (24) 或 5-反式- PGA_2 (23)。

PGA_2 Type Prostaglandin Intermediates in the Production of PGA_2 from 15-EPI- PGA_2

360

从 15-EPI- PGA_2 生产 PGA_2 中的 PGA_2 型的前列腺素中间体

本文是利用柳珊瑚 (Plexaura Homomalla) 中主要成份 15 (R)-前列腺素 PGA_2 (I) 转变成天然前列腺素 PGA_2 (即 15 (s)-前列腺素 PGA_2 (III))。转化法是用甲酸处理 PGA_2 甲酯-15 (R) 醋酸酯 (II) 得到甲酸酯混合物。将甲酸酯混合物用 95:5 的甲醇:盐酸放置 16 小时, 生成甲酯醇 (VI), 另外还得到 32% 13-羟基基本异构物 (V)。此异构物 (V) 可用现代光谱仪器如质谱、紫外、核磁共振等得以检出。

此外还介绍各种过渡态金属盐类制成的硅胶板或层析柱能分离不同数目的碳-碳双键或立体异构物, 如 PGA_2 , PGB_2 , 化合物 (II) 与化合物 (VIII), 并列它们在板层析时不同的 Rf 值。

前列腺素的药理

The Physiology of Prostaglandins

369

前列腺素的生理

本文综述了前列腺素的生物合成、释放和代谢; 它在生殖过程中的作用, 以及其它生理作用。说明前列腺素对生殖过度的多个环节, 如受精、排卵、黄体退化、月经、分娩等均有关。

Prostaglandins and The Reproductive Cycle

387

前列腺素与生殖周期

前列腺素对生殖系统具有重要作用。本文综述了近年来它的抗生育作用、溶黄体作用, 它对卵子运行、输卵管活动、排卵和精子运行等的影响。雌激素和宫内避孕器等和前列腺素之间的作用。本文并对前列腺素的临床应用及其衍生物也作了简单介绍。

Physiological Role of PGs in the Control of Parturition and Menstruation

405

前列腺素在分娩及月经控制中的生理作用

本文综述了 PG_s 对人工流产、分娩、月经的作用。介绍有关 PG_s 在抗早孕、流产、引产等方面的应用, 并指出乙醇对 PG 引起的子宫收缩有拮抗作用。

The Demonstration That $\text{PGF}_{2\alpha}$ is the Uterine Luteolysin in the Ewe

421

前列腺素 $\text{F}_{2\alpha}$ 是母羊子宫的溶黄体素

本文就 1) 母羊是否存在于子宫黄体溶解素 (Luteolysin); 2) 前列腺素 $\text{F}_{2\alpha}$ ($\text{PGF}_{2\alpha}$) 是否是一种子宫黄体溶解素; 以及 3) $\text{PGF}_{2\alpha}$ 是否即子宫黄体溶解素等问题作了较全面的综述和讨论。

Histochemical Study of The Effects of Prostaglandins $\text{F}_{2\alpha}$ and E_2 on The Corpus Luteum of Pregnant Rats

432

前列腺素 $\text{F}_{2\alpha}$ 及 E_2 对妊娠大鼠黄体影响的组织化学研究

作者用组织化学方法研究前列腺素 $\text{F}_{2\alpha}$ 和 E_2 ($\text{PGF}_{2\alpha}$, PGE_2) 的溶黄体作用, 结果表明 $\text{PGF}_{2\alpha}$ 和 PGE_2 对妊娠各期的大鼠黄体内 3β 脱氢酶均无影响。而对 20α 脱氢酶 (20α -Hydroxysteroid Dehydrogenase) 则有明显的抑制作用。认为前列腺素溶黄体作用是由于加速孕酮的代谢所致。

- Induction of 20 α -Hydroxysteroid Dehydrogenase in Rat Corpora Lutea of Pregnancy by Prostaglandin F_{2 α}** 447
前列腺素 F_{2 α} 对大鼠妊娠黄体中的 20 α -羟基甾体脱氢酶的诱导作用
 本文表明,前列腺素 F_{2 α} 能诱导早孕大鼠黄体的 20 α 羟基类固醇脱氢酶活性,显著降低血浆黄体酮浓度,并终止妊娠。黄体酮、人绒毛膜促性腺激素(HCG)、黄体生成素(LH)和催乳素则能防止 PGF_{2 α} 的上述反应。
- Comparison between the Effect of Luteinizing Hormone and Prostaglandin E₁ on Ovarian Cyclic AMP** 461
促黄体素与前列腺素 E₁ 对卵巢环磷酸腺苷作用的比较
 用大鼠卵巢离体培养的实验来比较 PGE₁ 和黄体生成素(LH)对卵巢 CAMP 的影响。结果两者均能引起卵巢组织和培养基中 CAMP 的积聚,但加入 PGE₁ 后 5~15 分钟,组织中 CAMP 含量就达高峰,而 LH 达到最大反应约需 60 分钟。
- Prostaglandins and Oxytocin: Their Effects on Uterine Smooth Muscle** 471
前列腺素与催产素对子宫平滑肌的影响
 从妊娠和非妊娠牛的子宫分离所得的亚细胞部分(可能即肌浆网),可发生 ATP 依赖的钙结合,加入 PGE₂ 或 PGF_{2 α} 后可抑制此种钙结合,从而释放钙离子,使肌肉收缩。催产素也有同样作用,但妊娠子宫的反应较非妊娠子宫要大得多。
- Effects of Diazoxide and Beta Adrenergic Drugs on Spontaneous and Induced Uterine Activity in the Pregnant Baboon** 479
Diazoxide 和 β -拟肾上腺素药物对妊娠狒狒的自发与诱发子宫活动的影响
 作者观察了 Diazoxide 和作用于 β 受体的拟肾上腺素药物对临产猩猩的自发和用催产素、前列腺素 F_{2 α} (PGF_{2 α}) 诱发的子宫收缩的影响。结果表明: Diazoxide 抑制子宫的作用最强,它和拟肾上腺素药物不同,前者能恒定而明显地抑制 PGF_{2 α} 引起的子宫收缩,而后者(异丙肾上腺素、间羟异丙肾上腺素等)抑制 PGF_{2 α} 所引起的子宫收缩作用不明显。
- The Effect of Intravenously Administered Prostaglandin E₂ on Rat Uterine 3',5'-Adenosine Monophosphate** 491
静脉注射前列腺素 E₂ 对大鼠子宫中 3',5'-腺-磷的影响
 前列腺素 E₂ 静脉注射可使除去卵巢 12 天的大鼠子宫组织的 CAMP 水平增高。此作用与剂量有关,最大作用见于 PGE₂ 注射后 10 分钟时。卵巢切除 25 天的大鼠对 PGE₂ 无此种反应。
- Prostaglandin Receptors in the Human, Monkey, and Hamster Uterus** 505
在人、猴及田鼠子宫内的前列腺素受体
 本文报导用离体组织薄片培养系统研究人、猴和田鼠子宫组织对氘标记前列腺素的摄取和结合。结果支持子宫组织存在前列腺素受体;而前列腺素和受体的结合与卵巢类固醇的水平有关。
- Effect of Prostaglandin F_{2 α} on Ovulation and Fertilization in Rabbit** 515
前列腺素 F_{2 α} 对兔排卵及受精的影响
 本文用兔实验表明,外源性前列腺素 F_{2 α} 于剂量 1 mg/kg 时,不影响排卵或受精过程,但能加速卵子运行,使卵子过早地从雌兔生殖道排出,这一作用可能是兴奋子宫平滑肌的结果。
- Prostaglandin F_{2 α} in the Uterine Horns of Mice with Intrauterine Devices** 523
小鼠子宫角中的前列腺素 F_{2 α} 与宫内节育器的关系
 本文以实验结果表明,将宫内避孕器(IUD)置入小鼠子宫角后,可刺激子宫合成大量前列腺素 F_{2 α} ,并释放入宫腔,从而干扰着床过程。

前列腺素的临床应用

Intravenous Prostaglandin $F_{2\alpha}$ for Induction of Menses,

529

静脉注射前列腺素 $F_{2\alpha}$ 的催经作用

本文报导 13 位妇女在月经过期 14 天内用前列腺素 $F_{2\alpha}$ 25 毫克静脉滴注 8 小时。结果: 妊娠的 9 人中 8 人静滴后有阴道流血, 非妊娠的 4 人都有正常月经样流血。但妊娠的 9 人中仅 5 人妊娠终止了, 另 4 人继续妊娠, 经刮宫后发现组织都有变性。

Termination of Early Pregnancy with Prostaglandin E_2 Vaginal Suppositories 539

用前列腺素 E_2 的阴道投药来终止早孕

本文报导了 10 例在妊娠 6 周内用前列腺素 E_2 阴道坐药作为人工流产。药物剂量: 每 2 小时一次, 每次 20 毫克, 总量 80~120 毫克。结果: 仅 5 例完全流产, 2 例不完全流产, 3 例失败。完全流产者血清 HCG 及孕酮量在用药后短期内有明显的下降, 其余者则不然。付反应有恶心、呕吐、腹泻、嗜睡, 痉挛性腹痛、背痛、及阴道流血。受治者至少具有其中一项付反应。由于前列腺素 E_2 阴道坐药付反应大, 对终止早孕的有效率较低, 所以不及吸宫法, 有效率也比用前列腺素 $F_{2\alpha}$ 为低。

Delayed Menstruation Induced by Prostaglandin in Pregnant Patients 548

用前列腺素对早孕者作催经止孕

作者前已发表过用 5mg 的 $F_{2\alpha}$ 对 22 例月经过期 2 周内的早孕孕妇作外手术性流产的论文, 在本文中又说明用同法对 65 例作治疗性流产的效果, 并介绍用 1mg E_2 一次冲击的 15 例也取得了同样效果。

这种方法对终止早孕的效果好, 又因在冲击前用了镇静剂, 所以药物付反应小, 且宫颈扩张缓慢、损伤小, 对再次受孕可能引起流产及早产的机会也少。作者认为此法可考虑推广使用, 并可能发展为一月一次的催经方法。

The Efficacy of Extraovular "Prostaglandin Impact" in Provoking First Trimester Abortion 549

用前列腺素羊膜腔外的一次冲击对妊娠第一期的流产效果

本文报导妊娠第一期 (9~14 周) 50 例用 $PGF_{2\alpha}$ 10mg 经羊膜腔外一次冲击引产的效果。其中 44 例成功 (占 88%), 其中 54% 完全流产, 34% 不完全流产, 从引产到流产需经 15.8 ± 0.9 小时。失败的 6 例宫颈也已充分扩张, 以至刮宫时无须再行扩宫。流产的成败和用药后孕激素下降有一定关系。此法付作用轻, 即使有也是暂时性的, 患者能予接受。另外, 一次冲击给药方法较多次给药方便, 减少了护理上的麻烦。

Intrauterine Administration of Prostaglandin $F_{2\alpha}$ As An Outpatient Procedure for Termination of Early Pregnancy 555

用前列腺素 $F_{2\alpha}$ 的宫腔内投药作为终止早孕的门诊手术

本文报导 20 例早孕妇女, 在末次月经开始后 38 至 46 天, 经宫腔单次注入前列腺素 $F_{2\alpha}$ 5 毫克作为人工流产。注药后门诊留察 4~6 小时。结果: 13 例 (65%) 流产成功, 7 例失败。7 人有发热、出血及高血压等严重反应, 其中 2 人是流产成功的, 在失败的 5 人中, 有 3 人发生了感染性不完全流产。

本组结果成功率低 (65%), 付作用多 (35%), 与 Csapo 所报导经宫腔注入前列腺素 $F_{2\alpha}$ 有 90% 成功率和付作用少的结果不同, 本文作者认为这种给药方法不该作为终止早孕的方法。

Intrauterine Injection of Prostaglandin $F_{2\alpha}$ for Termination of Early Pregnancy in Out-Patient 561

用前列腺素 $F_{2\alpha}$ 的宫腔注入使门诊病人终止早孕

本文报导用 $PGF_{2\alpha}$ 宫腔单次“冲击”法对 34 例早孕妇女在门诊给药, 并按不同的给药剂量, 分成几组。结果表明剂量为 2mg 的一组效果最好, 该组共 18 例, 其中 14 例在二周随访时已完全流产, 其余 4 例亦在第三周完全流产。

Early Abortion Induced with PGF_{2α} and A PG Analogue I. C. I. 74205

575

用前列腺素 F_{2α} 及其同系物 I. C. I. 74205 导致早期流产

本文用前列腺素 F_{2α} 及前列腺素 F_{2α} 衍生物 I. C. I. 74205 宫腔给药, 观察二者对终止期妊娠的效果。对停经 38~64 天的妊娠者 7 例用 PGF_{2α}, 8 例用 I. C. I. 74205。结果: 用 PGF_{2α} 组 7 例都引起了流产, 其中 1 例因疑为失败作了刮宫, 但未得到残留组织物; 用 I. C. I. 74205 组的 8 例中 5 例引起流产, 刮宫 3 例 (包括 2 例在 14 天内失败者及 1 例持续阴道流血者)。试用病例虽有限, 而且近期效果不及常用吸宫法, 但表明二者对终止早孕都有作用, 可作进一步研究。

16-Aryloxyprostaglandins: A New Class of Potent Luteolytic Agent

577

16-Aryloxy PGs: 一种新的强溶黄体剂

本文作者用实验证实了 16-Aryloxy PGs 是一种强溶黄体剂, 它将可能用于控制生育。这说明前列腺素衍生物 (或类似物) 比其母体在控制生育方面较有前途。

Prostaglandin for Induction of Abortion and Labour

581

前列腺素用于流产与引产

由于前列腺素 E₂ 和 F_{2α} (PGE₂ 和 PGF_{2α}) 对各期妊娠子宫都有刺激收缩的作用, 临床已用来终止各期妊娠, 目前已发展研究其合成的衍生物, 为 15(s)-15-methyl-PGF_{2α} (15-me-PGF_{2α}) 无论在体内或体外都具有刺激平滑肌收缩的作用, 较 PGF_{2α} 作用强, 持续时间长, 且可作肌肉注射。

本文主要介绍 PGF_{2α}, PGF_{2α} 及 15-Me-PGF_{2α} 终止各期妊娠的情况, 包括妊娠 11-13 周子宫吸刮前作为术前扩张子宫颈应用的情况。本文并比较了静脉滴注 PGE₂、PGF_{2α} 与催产素足月引产的优缺点。

Comparison of the Actions of the 15-methyl Analogs of PGE₂ and F_{2α} on Hormone Levels after Their Administration for Therapeutic Abortion

599

用前列腺素 E₂ 及 F_{2α} 的 15 甲基衍生物进行治疗性流产时激素水平的比较

作者用 50 微克 15 甲基 PGF_{2α} 和 500 微克 15 甲基 PGF_{2α} 的肌肉注射, 终止 6~11 周妊娠各 5 例。比较了二组药物的效果, 并探讨了用药前及用药后 8 小时内血浆孕酮、雌激素和 HCG 值的变化与引产成败的关系, 和三种激素变化可能发生的原因。

Therapeutic Abortion & Induction of Labour by the Intravaginal Administration of Prostaglandins

610

用前列腺素 E₂ 及 F_{2α} 的阴道内给药作为流产和引产剂

作者对 45 例妊娠第一期及第二期的孕妇, 用 PG 乳糖片的阴道给药进行人工流产, PG 乳糖片每片含 PGE₂ 20mg 或 PGF_{2α} 50 mg, 每 2 个半小时给药一次, 直至流产。结果, 40 例完全流产, 5 例不完全流产, 从第一次给药到流产的时间为 18 小时 15 分钟。付作用: 6 例呕吐, 1 例腹泻。

作者又对 10 例妊娠 36~42 周的妇女, 用上法引产, 但用药剂量要小得多, 每片 PG 乳糖片仅含 2mg 的 PGE₂ 或 5mg 的 PGF_{2α}, 每 2 小时给药一次, 直至临产建立。其时, 宫颈已扩张到 5~6 公分, 宫缩达 2~3 分钟一次, 如羊膜腔尚未破即予刺破。结果, 10 例全部成功。从第一次给药到引产成功的时间为: PGE₂ 组平均是 8 小时 20 分, 而 PGF_{2α} 组平均为 14 小时, 无付作用。

作者认为这种给药途径效果好, 付反应小, 比较静脉滴注或肌注更易为患者所接受。如果能将阴道坐药改进为缓慢释放剂型, 可避免反复给药的缺点, 则更为方便。

The Use of Prostaglandins for the Therapeutic Termination of Pregnancy

617

前列腺素在终止妊娠中的应用

本文回顾了自 1970 年应用 PGE₂ 及 PGF_{2α} 终止妊娠获得成功以来, 对各种给药途径作了分析。对终止中期妊娠用 PGF_{2α} 羊膜腔内及羊膜腔外给药方法是比较安全有效的。用 PGE₂ 阴道给药对第一期妊娠及第二期妊娠虽都有效, 但尚须继续临床研究。PG 衍生物 (15-s)-15 甲基 PGE₂ 甲脂虽其活性持续时间较长, 可以肌肉注射, 但其付作用未见减少, 尚须研究其适当的剂量。

Extra-Amniotic Prostaglandin-Oxytocin Abortion: Comparison with the Intra-Amniotic Method

621

羊膜腔外前列腺素-催产素流产与羊膜腔内方法的比较

本文介绍用前列腺素-催产素作中期流产。临床医生将 126 例中期妊娠妇女分成四组:

第一组: 23 例。用 $\text{PGF}_{2\alpha}$ 羊膜腔外给药;

第二组: 35 例。用 $\text{PGF}_{2\alpha}$ 加催产素在羊膜腔外给药;

第三组: 10 例。用 $\text{PGF}_{2\alpha}$ 羊膜腔外给药, 三小时后加催产素静滴;

第四组: 58 例。用 $\text{PGF}_{2\alpha}$ 羊膜腔内给药, 后加催产素静滴。

结果, 以第四组羊膜腔内给 $\text{PGF}_{2\alpha}$ 加催产素静滴的效果最好, 成功率最高, 达 95%, 平均引产-流产时间最短 (19.8 小时)。虽剂量较大, 但副作用并不大, 且其感染较羊膜腔外插导管组为少, 住院时间亦短。其平均用药量为: $\text{PGF}_{2\alpha}$ 27.5 mg, 催产素 105 单位。

Therapeutic Abortion Employing the Synergistic Action of Extra-Amniotic Prostaglandin E_2 & An Intravenous Infusion of Oxytocin

633

用羊膜腔外注射 PGE_2 及静脉滴注催产素的协同作用来终止妊娠

本文报导了 38 例妊娠妇女用羊膜腔外注射 PGE_2 及静脉滴注催产素来终止妊娠, 取得了成功。平均从引产到流产的时间为 13.7 小时, 平均用药总量为 1480 mg。给药方法: 经 Foley's 导管插入子宫羊膜外时, 注射 PGE_2 200 mg/2 cc N. S., 每 2 小时一次, 直至流产。自 PGE_2 第一次注射后 2~3 小时开始静脉滴注催产素。

Intrauterine Extra-Amniotic Administration of Prostaglandin $\text{F}_{2\alpha}$ for Therapeutic Abortion

637

用前列腺素 $\text{F}_{2\alpha}$ 宫腔内给药作治疗性流产

为了寻找导管插入羊膜腔的最适位置, 本实验对 7 例妊娠 8~20 周的妇女分别插入导管, $\text{PGF}_{2\alpha}$ 经导管注入羊膜腔。实验证明: 插入子宫底部的效果最好, 而插入子宫体中部及宫颈内口上 2 cm 处的效果不理想, 因为子宫底部肌肉比其它部位对药物的敏感性大。又在羊膜腔内测压时发现, 孕周早者较孕周晚者的子宫肌肉对药物的敏感性大, 张力反应也大。由此可见, 应用羊膜腔外给药时必须注意将导管插至子宫底部, 才能取得好的效果。

The Effect of Ethyl Alcohol on Prostaglandins E_2 & $\text{F}_{2\alpha}$ Induced Uterine Activity in Pregnant Women

43

乙醇对于由前列腺素 E_2 和 $\text{F}_{2\alpha}$ 所引起的孕妇子宫活动的影响

本文用实验证明 10% 乙醇静滴能降低或完全消除由 PGE_2 或 $\text{PGF}_{2\alpha}$ 引起的子宫收缩, 但乙醇不能减轻用催产素静滴所引起的宫缩。这一发现有一定的临床意义, 根据这一现象, 医生在使用 PG 引产时要注意避免使用乙醇浸泡塑料管或局部消毒, 以防降低宫缩, 影响疗效。反之, 在羊膜腔注入 PG 引产时, 遇有强直性宫缩, 而宫颈却未扩张或扩张不良, 因此可能导致宫颈撕裂或子宫破裂时, 则可考虑试用 10% 乙醇静滴, 以减轻宫缩, 但须密切观察, 一俟强直性宫缩停止, 即需立即停止乙醇静滴, 否则又将过份影响宫缩, 以致影响用药效果。

Induction of Term Labor with Intravenous $\text{PGF}_{2\alpha}$: A Review

647

静脉注射前列腺素 $\text{F}_{2\alpha}$ 作为足月产的引产剂

自从 1968 年 Karim 首先报告了 10 位妇女用前列腺素 $\text{F}_{2\alpha}$ 对足月引产取得效果以后, 国外有许多类似的研究, 约发表了 100 篇论文。本文就对 $\text{PGF}_{2\alpha}$ 某些基本问题, 总结了其中 45 篇主要论文, 着重地比较了 $\text{PGF}_{2\alpha}$ 与催产素引产的效果和对母婴的安全性。

CONTENTS

目次

Chemistry of Prostaglandins

前列腺素的化学

Prostaglandins: Members of A New Hormonal System.....2

前列腺素：一系列新的激素

(*Science*, V. 157, N. 3787, p. 382-391, 1967)

Prostaglandins13

前列腺素

(*Progress in the Chemistry of Fats and Other Lipids*, V. 9,
p. 233-257; 267-273, 1971)

Studies on the Total Synthesis of Prostaglandins46

前列腺素全合成研究

(*Annals of The New York Academy of Sciences*, V. 180,
p. 24-37, 1971)

Synthesis and Biological Activity of Prostaglandins and Prostaglandin

Antagonists60

前列腺素的合成和生物活性及其抗体

(*Annals of The New York Academy of Sciences*, V. 180,
p. 38-63, 1971)

New Synthetic Approach in the Prostaglandin Field86

前列腺素领域中新的合成方法

(*Annals of The New York Academy of Sciences*, V. 180,
p. 64-75, 1971)

Novel Prostaglandin Synthesis98

新的前列腺素合成

(*Annals of The New York Academy of Sciences*, V. 180,
p. 76-90, 1971)

Recent Developments in the Biosynthesis & the Analysis of Prostaglandins...113

前列腺素生物合成和分析的最近发展

(*Annals of The New York Academy of Sciences*, V. 180,
p. 181-199, 1971)

The Total Synthesis of Prostaglandins	133
前列腺素的全合成	
(<i>The Total Synthesis of Natural Products</i> , V. 1, p. 81-142, 1973)	
プロスタグランデインの合成, その進歩と発展	195
前列腺素的合成及其进展	
(有机合成化学协会志, V. 31, N. 5, p.353-374, 1973)	
Total Synthesis of PGs IV: A Completely Stereospecific Synthesis of PGE ₁ ...	217
前列腺素全合成 4: 前列腺素 E ₁ 完全立体专一性的合成	
(<i>Journal of the American Chemical Society</i> , V. 95, N. 5, p. 1676-1677, 1973)	
Prostaglandins & Congeners V: (1) Synthesis of dl-PGE ₁ , dl-11-deoxy-PGE ₁ & dl-15-Hydroxy-9-oxo-13-cis-Prostenoic Acid via Conjugate Addition of-3-Trityloxy-1-Octenyl Magnesium Bromide	221
前列腺素和类似物 V: 由-3 立苯甲氧基-1-辛稀基溴化镁的共轭加成合成 dl-前列腺素 E ₁ , dl-11-去氧前列腺素 E ₁ 和 dl-15-羟基-9-氧-13-US-前列腺酸	
(<i>Prostaglandins</i> , V. 3, N. 4, p. 505-508, 1973)	
Total Synthesis of Prostaglandins V: A Synthesis of (-)-Prostaglandin E ₂ via A Totally Asymmetric Process	225
前列腺素全合成 V: 用不完全对称过程来合成(-)-前列腺素 E ₂	
(<i>Tetrahedron Letters</i> , N. 25, p. 2313-2316, 1973)	
Total Synthesis of Prostaglandins, Control of Regiospecificity in the Alane-Epoxyde Reaction & Selective Catalytic Oxidation of Alkynylation Products.....	229
前列腺素全合成, 有机铝-环氧反应中区域专一性的控制和烷基化产物的选择性催化氧化	
(<i>Tetrahedron Letters</i> , N. 40, p. 3899-3902, 1973)	
Prostaglandin Synthesis I: An Improved Synthesis through Bicyclo-(3,1,0)hexane Intermediates	232
前列腺素合成 I: 一个通过双环[3,1,0]己烷中间体的改进合成法	
(<i>Journal of American Chemical Society</i> , V. 95, N. 8, p. 2746-2747, 1973)	
Direct Stereocontrolled Synthesis of A Prostaglandins Using the Bicyclo-(2,2,1)heptene Approach	235
用双环[2,2,1]庚稀来直接地立体控制 A 型前列腺素的合成	
(<i>Journal of the American Chemical Society</i> , V. 95, N. 20, p. 6831-6832, 1973)	

A New Stereocontrolled Synthesis of Prostaglandins via Prostaglandin A ₂	236
通过前列腺素 A ₂ 的新的立体控制来合成前列腺素	
(Journal of the American Chemical Society, V. 95, N. 20, p. 6832-6833, 1973)	
Efficient Generation of the 15S-Configuration in PG Synthesis. Attractive Interactions in Stereochemical Control of Carbonyl Reduction ...	238
在前列腺素合成中有效地产生 15-S 构型, 羰基还原立体化学控制中奇妙的相互作用	
(Journal of the American Chemical Society, V. 94, N. 24, p. 8616-8618, 1972)	
Highly Stereoselective Conversion of Prostaglandin A ₂ to the 10, 11 α -Oxido Derivative Using A Remotely Placed Exogenous Directing Group	241
应用远离的完位基团将前列腺素 A ₂ 高度立体选择性地转变成 10, 11 α 环氧衍生物	
(The Journal of Organic Chemistry, V. 38, N. 18, p. 3187-3189, 1973)	
A New Synthetic Route to Prostaglandins	245
一条新的前列腺素合成路线	
(Tetrahedron Letters, N. 33, p. 3091-3094, 1973)	
A Novel Synthesis of Prostaglandin F ₂ α	249
前列腺素 F ₂ α 的新合成	
(Journal of the American Chemical Society, V. 95, N. 20, p. 6853-6855, 1973)	
Asymmetric Synthesis of Prostaglandin Intermediates	253
前列腺素中间的不对称合成	
(Journal of the American Chemical Society, V. 95, N. 21, p. 7171-7172, 1973)	
New Extensions of the Bicyclo(2,2,1)heptane Route to PGs	255
双环[2,2,1]庚烷合成前列腺素路线的新发展	
(Journal of the American Chemical Society, V. 95, N. 22, p. 7522-7523, 1973)	
Synthesis of PGs by Conjugate Addition & Alkylation of A Directed Enolate Ion, 11-DeoxyPGs	258
用共轭加成和定向的稀醇离子烷化合成前列腺素, 11-脱氧前列腺素	
(The Journal of Organic Chemistry, V. 39, N. 17, p. 2506-2509, 1974)	

Total Synthesis of 15-Methylprostaglandins	263
15-甲基前列腺素的全合成	
(<i>Journal of the American Chemical Society</i> , V. 96, N. 18, p. 5865-5876, 1974)	
The Enzymatic Formation of Prostaglandin E ₂ from Arachidonic Acid, Prostaglandins & Related Factors 32	275
用花生四烯酸制备前列腺素 E ₂ 的酶的构成, 前列腺素及其有关因子 32	
(<i>Biochimica et Biophysica Acta</i> , V. 90, N. 1, p. 207-210, 1964)	
Separation, Identification, & Estimation of Prostaglandins	279
前列腺素的分离、鉴定和判断	
(<i>Methods of Biochemical Analysis</i> , V. 17, p. 325-371, Ed. by: Darid Glick, 1969)	
Properties of A Novel Preparation of Prostaglandin Synthetase from Sheep Siminal Vesicles	327
从绵羊精囊中制备前列腺素合成酶新方法特性	
(<i>Biochimica et Biophysica Acta</i> , V. 231, N. 3, p. 445-457, 1971)	
Isolation & Structure of Two Prostaglandin Endoperoxides That Cause Platelet Aggregation.....	341
引起血小板凝固的二个内过氧化前列腺素的结构和分离	
(<i>Proceedings of the National Academy of Sciences of the USA</i> , V. 71, N. 2, p. 345-349, 1974)	
Identification of PGs in the Gorgonian, <i>Plexaura homomalla</i>	346
柳珊瑚中前列腺素的鉴定	
(<i>European Journal of Biochemistry</i> , V. 28, N. 2, p. 232-240, 1972)	
Prostaglandins from Marine Sources	355
从海产中提取前列腺素	
(<i>International Food-Drugs from the Sea Conference</i> , p. 151-155, 17-21 Nov., 1974)	
PGA ₂ Type Prostaglandin Intermediates in the Production of PGA ₂ from 15-EPI-PGA ₂	360
用 15-表-前列腺素 A ₂ 生产前列腺素 A ₂ 过程中的前列腺素 A ₂ 型的前列腺素 中间体	
(<i>International Food-Drugs from the Sea Conference</i> , p. 157-163, 17-21 Nov., 1974)	

Pharmacology of Prostaglandins

前列腺素的药理

The Physiology of Prostaglandins	369
前列腺素的生理	
(<i>Clinic Endocrinology & Metabolism</i> , V. 2, N. 3, p. 393-410, 1973)	
Prostaglandins & the Reproductive Cycle	387
前列腺素与生殖周期	
(<i>Federation Proceedings</i> , V. 33, N. 1, p. 61-77, 1974)	
Physiological Role of PGs in the Control of Parturition and Menstruation	405
前列腺素在分娩和月经控制中的生理作用	
(<i>Journal of Reproduction & Fertility</i> , Supplement 16, p. 105-119, 1972)	
The Demonstration That PGF ₂ α is the Uterine Luteolysin in the Ewe.....	421
前列腺素 F ₂ α 是母羊子宫的溶黄体素	
(<i>Journal of Reproduction & Fertility</i> , V. 38, N. 2, p. 261-271, 1974)	
Histochemical Study of the Effects of Prostaglandins F ₂ α & E ₂ on the Corpus Luteum of Pregnant Rats.....	432
前列腺素 F ₂ α 及 F ₂ 对妊娠大鼠黄体影响的组织化学研究	
(<i>Biology of Reproduction</i> , V 10, N. 1, p. 24-38, 1974)	
Induction of 20 α -hydroxysteroid Dehydrogenase in Rat Corpora Lutea of Pregnancy by Prostaglandin F ₂ α	447
前列腺素 F ₂ α 对妊娠大鼠黄体中的 20 α -羟基甾体脱氢酶的诱导作用	
(<i>Prostaglandins</i> , V. 5, N. 1, p. 73-85, 1974)	
Comparison between the Effect of Luteinizing Hormone & Prostaglandin E ₁ on Ovarian Cyclic AMP	461
促黄体素与前列腺素 E ₁ 对卵巢环磷酸腺苷作用的比较	
(<i>Prostaglandins</i> , V. 6, N. 4, p. 303-311, 1974)	
Prostaglandins & Oxytocin: Their Effects on Uterine Smooth Muscle.....	471
前列腺素与催产素对子宫平滑肌的影响	
(<i>Prostaglandins</i> , V. 5, N. 1, p. 33-40, 1974)	

Effects of Diazoxide & β -Adrenergic Drugs on Spontaneous & Induced Uterine Activity in the Pregnant Baboon.....	479
Diazoxide 和 β -拟肾上腺素药物对妊娠狒狒的自发与诱发子宫活动的影响 (<i>American Journal of Obstetrics & Gynecology</i> , V. 118, N. 4, p. 499-509, 1974)	
The Effect of Intravenously Administered Prostaglandin E_2 on Rat Uterine 3',5'-Adenosine Monophosphate.....	491
静脉注射前列腺素 E_2 对大鼠子宫中 3',5'-腺-磷的影响 (<i>Prostaglandins</i> , V. 6, N. 4, p. 289-301, 1974)	
Prostaglandin Receptors in the Human, Monkey & Hamster Uterus.....	505
在人、猴和田鼠子宫内的前列腺素受体 (<i>Endocrinology</i> , V. 95, N. 1, p. 55-64, 1974)	
Effect of Prostaglandin $F_{2\alpha}$ on Ovulation & Fertilization in Rabbit	515
前列腺素 $F_{2\alpha}$ 对兔排卵及受精的影响 (<i>Prostaglandins</i> , V. 5, N. 4, p. 341-347, 1974)	
Prostaglandin F in the Uterine Horns of Mice with Intrauterine Devices ...	523
小鼠子宫角中的前列腺素 F 与宫内节育器的关系 (<i>Journal of Reproduction & Fertility</i> , V. 37, N. 2, p. 429-432, 1974)	

Clinical Application of Prostaglandins

前列腺素的临床应用

Intravenous Prostaglandin $F_{2\alpha}$ for Induction of Menses.....	529
静脉注射前列腺素 $F_{2\alpha}$ 的催经作用 (<i>Fertility & Sterility</i> , V. 24, N. 8, p. 569-577, 1973)	
Termination of Early Pregnancy with Prostaglandin E_2 Vaginal Suppositories	539
用前列腺素 E_2 的阴道投药来终止早孕 (<i>Contraception</i> , V. 8, N. 3, p. 255-263, 1973)	
Delayed Menstruation Induced by Prostaglandin in Pregnant Patients.....	548
用前列腺素对早孕孕妇的催经止孕 (<i>The Lancet</i> , Vol. 2, N. 7830, p. 683, 1973)	
The Efficacy of Extraovular "Prostaglandin-Impact" in Provoking First Trimester Abortion	549
用前列腺素羊膜腔外一次冲击对妊娠第一期流产的效果 (<i>Prostaglandins</i> , V. 5, N. 3, p. 269-374, 1974)	