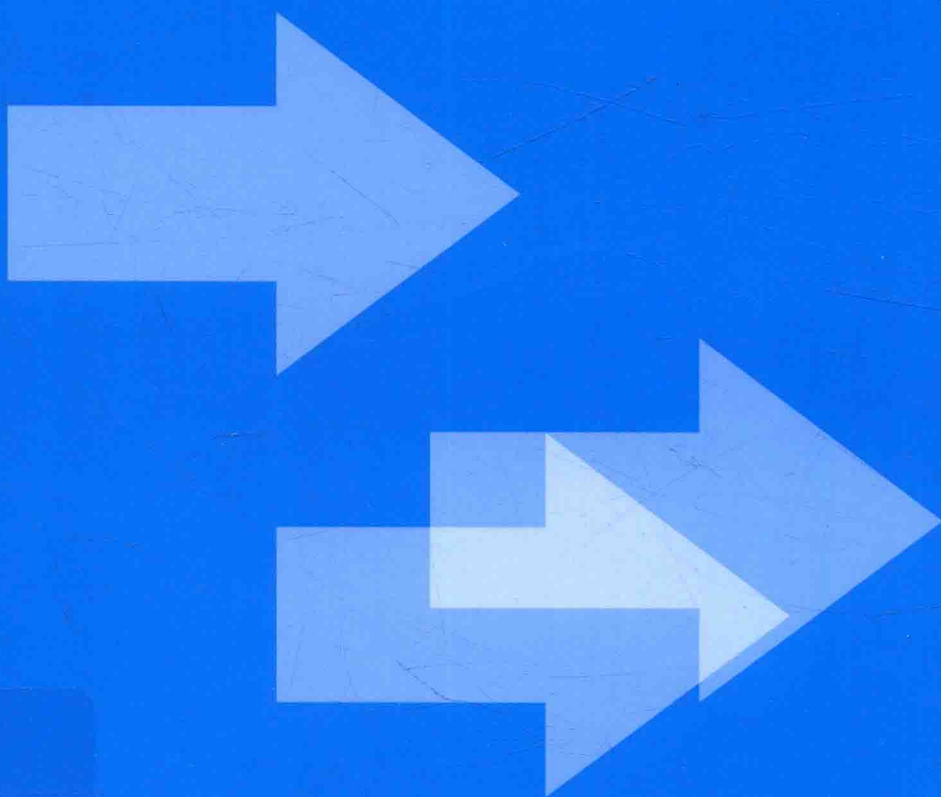


临床药理学 与药物治疗学

(下)

梁绪中等◎主编



 吉林科学技术出版社

临床药学与药物治疗学

(下)

梁绪中等◎主编



第十七章 祛痰药

痰是呼吸道炎症的产物，可刺激呼吸道黏膜引起咳嗽，并可加重感染。祛痰药可稀释痰液或液化黏痰，使之易于咳出。按其作用方式可将祛痰药分为三类：①恶心性祛痰药和刺激性祛痰药：前者如氯化铵、碘化钾、愈创木酚甘油醚、桔梗流浸膏、远志流浸膏等口服后可刺激胃黏膜，引起轻微的恶心，反射性地促进呼吸道腺体分泌增加，使痰液稀释，易于咳出。后者是一些挥发性物质，如桉叶油、安息香酊等加入沸水中，其蒸气亦可刺激呼吸道黏膜，增加腺体分泌，使痰液变稀，易于咳出。②黏痰溶解剂：如氨溴索、乙酰半胱氨酸、沙雷肽酶等可分解痰液的黏性成分如黏多糖和黏蛋白，使黏痰液化，黏滞性降低而易于咳出。③黏液稀释剂：如羧甲司坦、稀化黏素等主要作用于气管、支气管的黏液产生细胞，促其分泌黏滞性低的分泌物，使呼吸道分泌的流变性恢复正常，痰液由黏变稀，易于咳出。

一、氯化铵 (Ammonium Chloride)

其他名称：氯化铵，卤砂，Ammonium Muriate，SALMAIC。

ATC 编码：G04BA01

性状：为无色结晶或白色结晶性粉末，无臭，味咸、凉。有引湿性。在水中易溶，在乙醇中微溶。

药理学：口服后刺激胃黏膜的迷走神经末梢，引起轻度的恶心，反射性地引起气管、支气管腺体分泌增加。部分氯化铵吸收入血后，经呼吸道排出，由于盐类的渗透压作用而带出水分，使痰液稀释，易于咳出。能增加肾小管氯离子浓度，因而增加钠和水的排出，具利尿作用。口服吸收完全，其氯离子吸收入血后可酸化体液和尿液，并可纠正代谢性碱中毒。

适应证：用于急性呼吸道炎症时痰黏稠不易咳出的病例。常与其他止咳祛痰药配成复方制剂应用。纠正代谢性碱中毒（碱血症）。其酸化尿液作用可使一些需在酸性尿液中显效的药物如乌洛托品产生作用；也可增强汞剂的利尿作用以及四环素和青霉素的抗菌作用；还可促进碱性药物如哌替啶、苯丙胺、普鲁卡因的排泄。

用法和用量：①祛痰：口服，成人一次 0.3 ~ 0.6g，一日 3 次。②治疗代谢性碱中毒或酸化尿液：静脉点滴，每日 2 ~ 20g，每小时不超过 5g。

不良反应：①吞服片剂或剂量过大可引起恶心、呕吐、胃痛等胃刺激症状，宜溶于水中、餐后服用。②本品可增加血氨浓度，于肝功能不全者可能诱发肝昏迷。

禁忌证：①肝、肾功能不全者禁用。②应用过量或长期服用易致高氯性酸中毒，代谢性酸血症患者禁用。

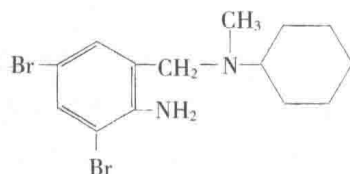
注意：静脉点滴速度过快，可致惊厥或呼吸停止。溃疡病患者慎用。

药物相互作用：

- (1) 与阿司匹林合用，本品可减慢阿司匹林排泄，增强其疗效。
- (2) 与氯磺丙脲合用，可增强氯磺丙脲的降血糖作用。

- (3) 与氟卡尼合用，可减弱氟卡尼的抗心律失常作用。
 - (4) 本品可促进美沙酮的体内清除，降低其疗效。
 - (5) 本品可增加哌氟酰胺的排泄，降低其疗效。
 - (6) 本品不宜与排钾利尿药、磺胺嘧啶、呋喃妥因等合用。
- 制剂（片剂）：每片 0.3g。注射液：每支 5g（500ml）。

二、溴己新（Bromhexine）



其他名称：溴己铵，必消痰，必嗽平，溴苣环己铵，BISOLVON，BRONCOKIN。

ATC 编码：R05CB02

性状：本品为鸭嘴花碱（vasicine）经结构改造得到的半成品，常用其盐酸盐。系白色或类白色结晶性粉末；无臭，无味。在乙醇或三氯甲烷中微溶，在水中极微溶解。熔点 239 ~ 243℃。

药理学：本品具有较强的黏痰溶解作用。主要作用于气管、支气管黏膜的黏液产生细胞，抑制痰液中酸性黏多糖蛋白的合成，并可使痰中的黏蛋白纤维断裂，因此使气管、支气管分泌的流变学特性恢复正常，黏痰减少，痰液稀释易于咳出。本品的祛痰作用尚与其促进呼吸道黏膜的纤毛运动及具有恶心性祛痰作用有关。服药后约 1 小时起效，4 ~ 5 小时作用达高峰，疗效维持 6 ~ 8 小时。

适应证：用于慢性支气管炎、哮喘、支气管扩张、矽肺等有白色黏痰又不易咳出的患者。脓性痰患者需加用抗生素控制感染。

用法和用量：口服，成人一次 8 ~ 16mg。肌肉注射：一次 4 ~ 8mg，一日 2 次。静脉滴注：一日 4 ~ 8mg，加入 5% 葡萄糖氯化钠溶液 500ml。气雾吸入：一次 2ml，一日 2 ~ 3 次。

不良反应：偶有恶心、胃部不适，减量或停药后可消失。严重的不良反应为皮疹、遗尿。

禁忌证：对本药过敏者禁用。

注意：本品宜餐后服用，胃溃疡患者慎用。

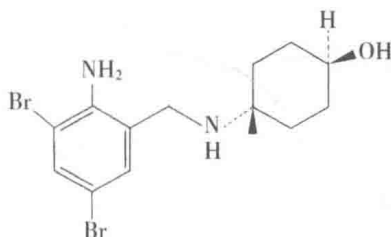
药物相互作用：本品能增加阿莫西林、四环素类抗生素在肺内或支气管的分布浓度，合用时能增强抗菌疗效。

制剂（片剂）：每片 4mg；8mg。注射液：每支 0.2%，2mg（1ml）；4mg（2ml）。气雾剂：0.2% 溶液。

复方氯丙那林溴己新片（Compound Clorprenaline and Bromhexine Tablets）：含盐酸氯丙那林 5mg、盐酸溴己新 10mg、盐酸去氯羟嗪 25mg。

复方氯丙那林溴己新胶囊（Compound Clorprenaline and Bromhexine Capsules）：含盐酸氯丙那林 5mg、盐酸溴己新 10mg、盐酸去氯羟嗪 25mg。

三、氨溴索 (Ambroxol)



其他名称：溴环己胺醇，沐舒坦，美舒咳，安布索，百沐舒，平坦，瑞艾乐，兰苏，兰勃素，BRONCHOPRONT，MUCOSOLVAN，LASOLVAN，MUCOVENT，MUSCO，BROMUSYL，INGTAN，RUIAILE。

ATC 编码：R05CB06

性状：常用其盐酸盐。白色或类白色结晶性粉末，无臭。溶于甲醇，在水或乙醇中微溶。

药理学：本品为溴己新在体内的活性代谢产物。能促进肺表面活性物质的分泌及气道液体分泌，使痰中的黏多糖蛋白纤维断裂，促进黏痰溶解，显著降低痰黏度，增强支气管黏膜纤毛运动，促进痰液排出。改善通气功能和呼吸困难状况。其祛痰作用显著超过溴己新，且毒性小，耐受性好。

雾化吸入或口服后 1 小时内生效，作用维持 3~6 小时。

适应证：用于急、慢性支气管炎及支气管哮喘、支气管扩张、肺气肿、肺结核、肺尘埃沉着病、手术后的咳痰困难等。注射给药可用于术后肺部并发症的预防及早产儿、新生儿呼吸窘迫综合征的治疗。

本品高剂量（每次 250~500mg，一日 2 次）有降低血浆尿酸浓度和促进尿酸排泄的作用，可用于治疗痛风。

用法和用量：口服，成人及 12 岁以上儿童每次 30mg，每日 3 次。长期使用（14 天后）剂量可减半。静脉注射、肌肉注射及皮下注射：成人每次 15mg，每日 2 次。亦可加入生理盐水或葡萄糖溶液中静脉点滴。

不良反应：不良反应较少，仅少数患者出现轻微的胃肠道反应如胃部不适、胃痛、腹泻等。偶见皮疹等过敏反应，出现过敏症状应立即停药。

禁忌证：对本品过敏者禁用。

注意：①妊娠头 3 个月慎用；②注射液不应与 pH 大于 6.3 的其他溶液混合。

药物相互作用：

(1) 本品与阿莫西林、阿莫西林/克拉维酸、氨苄西林、头孢呋辛、红霉素、多西环素等抗生素合用，可增加这些抗生素在肺内的分布浓度，增强其抗菌疗效。

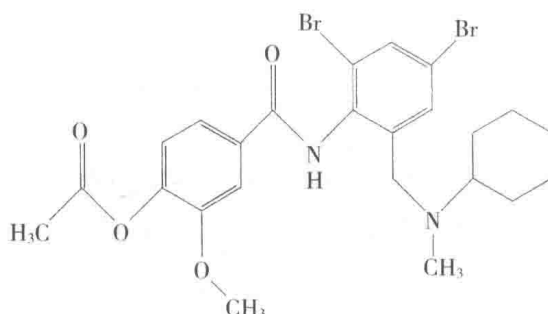
(2) 本品与 β_2 受体激动剂及茶碱等支气管扩张剂合用有协同作用。

制剂（片剂）：每片 15mg；30mg。胶囊剂：每粒 30mg。缓释胶囊：每粒 75mg。口服溶液剂：每支 15mg（5ml）；80mg（60ml）；300mg（100ml）；600mg（100ml）。气雾剂：每瓶 15mg（2ml）。注射液：每支 15mg（2ml）。

贮法：遮光、密闭保存。

氨溴特罗口服液：每 100ml（含盐酸氨溴索 150mg，盐酸克伦特罗 0.1mg）。一次 20ml，一日 2 次。

四、溴凡克新（Brovanexine）



其他名称：溴环己酰胺，BROVAN，BRONQUIMUCIL，BROVAXINE。

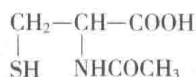
药理学：本品亦为溴己新的活性代谢物，可使痰中酸性黏多糖纤维断裂，降低痰液黏度，使其液化而易于咳出，同时改善肺通气功能。本品口服或直肠给药吸收良好，服后 3 ~ 4 小时，血浓度达到最高峰。毒性低。

适应证：用于急、慢性支气管炎。

用法和用量：口服，成人每次 15 ~ 30mg，一日 3 次。

制剂（片剂）：每片 15mg；30mg。

五、乙酰半胱氨酸（Acetylcysteine）



其他名称：痰易净，易咳净，富露施，MUCOMYST，AIRBRON，FLUIMUCIL，MUCOFILIN，MUCISOL。

ATC 编码：R05CB01

性状：为白色结晶性粉末，有类似蒜的臭气，味酸，有引湿性。在水或乙醇中易溶。熔点 101 ~ 107℃。

药理学：本品具有较强的黏痰溶解作用。其分子中所含巯基（-SH）能使白色黏痰中的黏多糖蛋白多肽链中的二硫键（-S-S-）断裂，还可通过分解核糖核酸酶，使脓性痰中的 DNA 纤维断裂，故不仅能溶解白色黏痰而且也能溶解脓性痰，从而降低痰的黏滞性，并使之液化，易于咳出。此外，本品进入细胞内后，可脱去乙酰基形成 L-半胱氨酸，参与谷胱甘肽（GSH）的合成，故有助于保护细胞免受氧自由基等毒性物质的损害。

适应证：①用于手术后、急性和慢性支气管炎、支气管扩张、肺结核、肺炎、肺气肿等引起的黏稠分泌物过多所致的咳痰困难。②可用于对乙酰氨基酚中毒的解毒以及环磷酰胺引起的出血性膀胱炎的治疗。

用法和用量：

（1）喷雾吸入：仅用于非紧急情况。临用前用氯化钠溶液使其溶解成 10% 溶液，每次 1 ~ 3ml，一日 2 ~ 3 次。

(2) 气管滴入：急救时以 5% 溶液经气管插管或气管套管直接滴入气管内，每次 0.5 ~ 2ml，一日 2 ~ 4 次。

(3) 气管注入：急救时以 5% 溶液用 1ml 注射器自气管的甲状软骨环骨膜处注入气管腔内，每次 0.5 ~ 2ml（婴儿每次 0.5ml，儿童每次 1ml，成人每次 2ml）。

(4) 口服：成人一次 200mg，一日 2 ~ 3 次。

不良反应：可引起咳呛、支气管痉挛、恶心、呕吐、胃炎等不良反应，减量即可缓解，如遇恶心、呕吐，可暂停给药。支气管痉挛可用异丙肾上腺素缓解。

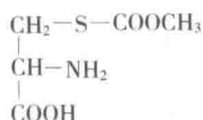
禁忌证：支气管哮喘者禁用。

注意：①本品直接滴入呼吸道可产生大量痰液，需用吸痰器吸引排痰。②不宜与金属、橡皮、氧化剂、氧气接触，故喷雾器须用玻璃或塑料制作。③本品应临用前配制，用剩的溶液应严封贮于冰箱中，48 小时内用完。

药物相互作用：①本品可减弱青霉素、四环素、头孢菌素类的抗菌活性，故不宜同时应用；必要时间隔 4 小时交替使用。②与硝酸甘油合用可增加低血压和头痛的发生。③与金制剂合用，可增加金制剂的排泄。④与异丙肾上腺素合用或交替使用可提高药效，减少不良反应。⑤与碘化油、糜蛋白酶、胰蛋白酶有配伍禁忌。

制剂（片剂）：每片 200mg；500mg。喷雾剂：每瓶 0.5g；1g。颗粒剂：每袋 100mg。泡腾片：每片 600mg。

六、羧甲司坦（Carbocisteine）



其他名称：羧甲基半胱氨酸，贝莱，费立，卡立宁，康普利，强利灵，强利痰灵，美咳片，Carboxymethyl Cysteine，MUCODYNE，MUCOTAB，MUCOCIS，LOVISCOL，TRANS-BRONCHIN。

ATC 编码：R05CB03

性状：为白色结晶性粉末；无臭。在热水中略溶，在水中极微溶解，在乙醇或丙酮中不溶，在酸或碱溶液中易溶。

药理学：为黏液稀释剂，主要在细胞水平影响支气管腺体的分泌，使低黏度的唾液黏蛋白（sialomucin）分泌增加，而高黏度的岩藻黏蛋白（fucomucin）产生减少，因而使痰液的黏滞性降低，易于咳出。本品口服有效，起效快，服后 4 小时即可见明显疗效。

适应证：用于慢性支气管炎、支气管哮喘等疾病引起的痰液黏稠、咳痰困难和痰阻气管等。亦可用于防治手术后咳痰困难和肺炎合并症。用于小儿非化脓性中耳炎，有预防耳聋效果。

用法和用量：口服，成人每次 0.25 ~ 0.5g，一日 3 次。儿童一日 30mg/kg。

不良反应：偶有轻头晕、恶心、胃部不适、腹泻、胃肠道出血、皮疹等不良反应。

注意：①本品与强效镇咳药合用，会导致稀化的痰液堵塞气道。②有消化道溃疡病史者慎用。③有慢性肝脏疾病的老年患者应减量。

制剂：口服液，每支 0.2g（10ml）；0.5g（10ml）。糖浆剂：2%（20mg/ml）。片剂：

每片 0.25g。泡腾剂：每包 0.25g。

贮藏：密闭，于阴凉干燥处保存。

七、沙雷肽酶 (Serrapeptase)

其他名称：舍雷肽酶，达先，敦净，释炎达，DASEN。

性状：从沙雷杆菌提取的蛋白水解酶，系稍有特殊臭味的灰白色到淡褐色粉末。

药理学：本品具有很强的抗炎症、消肿胀作用和分解变性蛋白质、缓激肽、纤维蛋白凝块作用，故可加速痰、脓和血肿液化与排出，促进血管、淋巴管对分解物的吸收，改善炎症病灶的循环，从而起到消炎消肿作用，还能增加抗生素在感染灶和血中的浓度，从而增强抗生素的作用。

适应证：用于手术后和外伤后消炎及鼻窦炎、乳腺淤积、膀胱炎、附睾炎、牙周炎、牙槽肿胀等疾病的消炎，还可用于支气管炎、肺结核、支气管哮喘、麻醉后的排痰困难等。国外报道本品可用于治疗儿童耳炎。

用法和用量：口服，成人每次 5~10mg，每日 3 次，餐后服。

不良反应：①偶见黄疸、转氨酶 (ALT、AST、 γ -GTP) 升高、厌食、恶心、呕吐、腹泻等。②偶见鼻出血、血痰等出血倾向。③偶见皮肤发红，瘙痒、药疹等过敏反应。

注意：①有严重肝肾功能障碍和血液凝固异常者慎用。②使用本品时应让患者及时咳出痰液，呼吸道插管患者应及时吸出痰液，以防止痰液阻塞呼吸道。

药物相互作用：①本品增加青霉素、氨苄西林、磺苄西林等抗生素在感染灶和血中的浓度，增强抗生素的作用；②与抗凝血药合用时，可增强抗凝血药的作用。③与促凝血药合用时可产生部分药理性拮抗作用。

制剂：肠溶片，每片 5mg (10 000 单位)；10mg (20 000 单位)。

八、脱氧核糖核酸酶 (Deoxyrihonuclease)

其他名称：胰去氧核糖核酸酶，胰道酶，DNA 酶，Pancreatic, Dornase, DORNAVAC, DNAase。

ATC 编码：B06AA10

性状：为白色粉末，可溶于水。溶液 pH 为 6~7 时活性最大。在室温中或过度稀释可迅速灭活。

药理学：本品是从哺乳动物胰脏中提取的一种核酸内切酶，可使脓痰中的大分子脱氧核糖核酸 (DNA) 迅速水解成平均链长为 4 个单位的核苷酸，并使原来与 DNA 结合的蛋白质失去保护，进而产生继发性蛋白溶解作用，使痰液黏度降低，易于咳出。与抗生素合用，可使抗生素易于达到感染灶，充分发挥其抗菌作用。

适应证：用于有大量脓痰的呼吸系统感染患者。

用法和用量：气雾吸入，每次 5 万~10 万 U，溶于 2~3ml 的 10% 丙二醇或生理盐水中，一日 3~4 次，可连续用药 4~6 天。腔内注射：5 万 U/次。

不良反应：咽部疼痛，每次喷雾后应立即漱口。长期应用可见皮疹、发热等过敏反应。

禁忌证：急性化脓性蜂窝组织炎及有支气管胸腔瘘管的活动性结核患者禁用。

注意：本品应临用前新鲜配制。

制剂：注射用脱氧核糖核酸酶：每支 10 万 U。

九、稀化黏素 (Gelomyrtol)

为桃金娘科植物蓝桉 (*Eucalyptus globules labill.*)、樟科植物樟 (*Cinnamomum camphora* L.) 树叶提取物的复方制剂。每粒胶囊含桃金娘油 300mg，其中至少含 α -松油萜 (α -pinene) 30mg、柠檬烯 (limonene) 75mg、桉油精 (cineol) 75mg。

其他名称：吉诺通，强力稀化黏素，标准桃金娘油，复方桃金娘油，Oleum Eucalypti, Myrtol, MYRIENOL, GELOMYRTOL FORTE。

性状：本品为无色或微黄色的澄清液体，有特异的芳香气，微似樟脑，味辛，凉。贮存日久，色稍变深。在 70% 乙醇中易溶。

药理学：本品为脂溶性挥发油，口服给药经小肠吸收后，再经呼吸道排出。可在呼吸道黏膜发挥溶解黏液、促进腺体分泌的作用。亦可产生 β -拟交感神经效应，刺激黏膜纤毛运动，增加黏液移动速度，有助于痰液排出。本品尚具有轻度抗炎作用，通过减轻支气管黏膜肿胀而舒张支气管，减轻气道阻塞所致呼吸困难。

适应证：用于急性和慢性支气管炎、鼻窦炎、支气管扩张、肺结核、矽肺及各种原因所致慢性阻塞性肺疾患。亦可用于支气管造影术后，以促进造影剂的排出。

用法和用量：口服。成人：每次 300mg，一日 2~3 次；4~10 岁儿童：每次 120mg，一日 2 次。

不良反应：偶见恶心、胃肠道不适。

禁忌证：妊娠期妇女禁用。

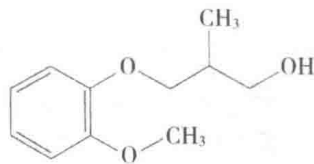
注意：胶囊不可打开或嚼破后服用。宜在餐前 30 分钟整粒吞服。

制剂：胶囊剂，每粒 120mg；300mg。

十、碘化钾 (Potassium Iodide)

为刺激性祛痰剂，可使痰液变稀，易于咳出，并可增加支气管分泌。又配成含碘食盐 (含本品 0.001%~0.02%) 供食用，可预防地方性甲状腺肿。合剂：每 100ml 中含碘化钾 5.0g，碳酸氢钠 2.5g，三氯甲烷适量。遇酸性药物能游离出碘。口服：每次 6~10ml，一日 3 次。

十一、愈创甘油醚 (Guaifenesin)



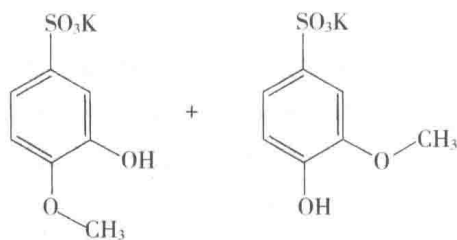
其他名称：愈创木酚甘油醚，Guaiphenesin, Guaiacol Glycerol Ether。

ATC 编码：R05CA03

为恶心祛痰剂，并有轻度的镇咳、防腐作用，大剂量尚有平滑肌松弛作用。用于慢性气管炎的多痰咳嗽，多与其他镇咳平喘药合用或配成复方应用。可见头晕、嗜睡、恶心、胃肠不适及过敏等不良反应。片剂：每片 0.2g，每次 0.2g，一日 3~4 次。糖浆剂：2%

(120ml)，每次 10 ~ 20ml，一日 3 次。

十二、愈创木酚磺酸钾 (Sulfoguaiacol)

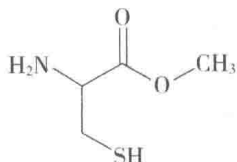


其他名称：Potassium Guaiacolsulfonate。

为刺激性祛痰药，促进支气管分泌，使痰液变稀易于咳出。尚有微弱抗炎作用。用于慢性支气管炎、支气管扩张等。多与其他镇咳、平喘药配成复方应用。口服：每次 0.5 ~ 1g，一日 3 次。

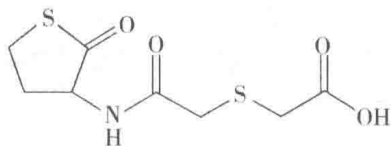
十三、半胱甲酯 (Mecysteine)

其他名称：半胱氨酸甲酯，美司坦，Methyl Cysteine，ACDRILE。



为黏痰溶解剂，用于大量黏痰引起的呼吸困难。不良反应参见乙酰半胱氨酸。雾化吸入：每次 10% 溶液 1 ~ 3ml，一日 2 ~ 3 次；气管滴入或注入：每次 5% 溶液 0.5 ~ 2ml，一日 2 次；口服：每次 0.1g，一日 2 ~ 3 次。片剂：0.1g。粉剂：0.5g；1g。

十四、厄多司坦 (Erdosteine)



其他名称：Dithiosteine，DOSTEIN。

ATC 编码：R05CB15

为黏痰溶解剂，通过使支气管分泌液中糖蛋白二硫键断裂而降低黏液黏性，并保护 α_1 -抗胰蛋白酶使之不被氧化失活。用于急性和慢性支气管炎、鼻窦炎、耳炎、咽炎和感冒等引起的呼吸道阻塞及痰液黏稠。偶见轻微的头痛和口干、腹隐痛、恶心、呕吐、腹泻等胃肠道反应。胶囊剂：100mg；300mg。口服：成人，每次 300mg，每日 2 次。儿童，每日 10mg/kg，分 2 次餐后服。

十五、美司钠 (Mesna)



其他名称：巯乙磺酸，MISTABRON，MUCOFLUID。

ATC 编码：R05CB05，V03AF01

供局部吸入或滴入的速效、强效黏痰溶解剂。作用机制与乙酰半胱氨酸相似。疗效较乙酰半胱氨酸强 2 倍。用于慢性支气管炎、肺炎、肺癌患者痰液黏稠、术后肺不张等所致咳痰困难者。雾化吸入或气管内滴入，每次 20% 溶液 1 ~ 2ml。有局部刺激作用，可引起咳嗽及支气管痉挛。不宜与红霉素、四环素、氨茶碱合用。气雾剂：0.2g/1ml。溶液剂：10% 水溶液。

(李 冠)

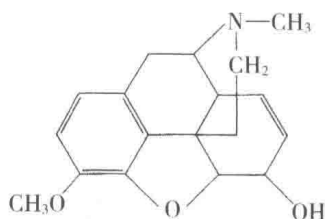
第十八章 镇咳药

咳嗽是呼吸道受到刺激时所产生的的一种保护性反射活动，即呼吸道感受器（化学感受器、机械感受器和牵张感受器）受到刺激时，神经冲动沿迷走神经传到咳嗽中枢，咳嗽中枢被兴奋后，其神经冲动又沿迷走神经和运动神经传到效应器（呼吸道平滑肌、呼吸肌和喉头肌），并引发咳嗽。

轻度咳嗽有利于排痰，一般不需用镇咳药。但严重的咳嗽，特别是剧烈无痰的干咳可影响休息与睡眠，甚至使病情加重或引起其他并发症。此时须在对因治疗的同时，加用镇咳药。由于可能引起痰液增稠和潴留，止咳药应避免用于慢性肺部感染，由于可能增加呼吸抑制的风险也应避免用于哮喘。

一般说来，药物抑制咳嗽反射的任一环节均可产生镇咳作用。目前常用的镇咳药按其作用部位可分为两大类。①中枢性镇咳药：此类药直接抑制延脑咳嗽中枢而产生镇咳作用，其中吗啡类生物碱及其衍生物如可待因、福尔可定、羟蒂巴酚等因具有成瘾性而又称为依赖性或成瘾性止咳药，此类药物往往还具有较强的呼吸抑制作用；而右美沙芬、喷托维林、氯哌司汀、普罗吗酯等，则属于非成瘾性或非依赖性中枢镇咳药，且在治疗剂量条件下对呼吸中枢的抑制作用不明显。中枢性镇咳药多用于无痰的干咳。②外周性（末梢性）镇咳药：凡抑制咳嗽反射弧中感受器、传入神经、传出神经以及效应器中任何一环节而止咳者，均属此类。如甘草流浸膏、糖浆可保护呼吸道黏膜；祛痰药可减少痰液对呼吸道的刺激而止咳；平喘药可缓解支气管痉挛而止咳；那可丁、苯佐那酯的局麻作用可麻醉呼吸道黏膜上的牵张感受器而发挥止咳作用等。有些药如苯丙哌林兼具中枢性及外周性镇咳作用。

一、可待因（Codeine）



其他名称：甲基吗啡，Methylmorphine，PAVERAL。

ATC 编码：R05DA04

性状：常用其磷酸盐，为白色细微的针状结晶性粉末。无臭，有风化性，水溶液显酸性反应。在水中易溶，在乙醇中微溶，在三氯甲烷或乙醚中极微溶解。

药理学：能直接抑制延脑的咳嗽中枢，止咳作用迅速而强大，其作用强度约为吗啡的 1/4。也有镇痛作用，约为吗啡的 1/12 ~ 1/7，但强于一般解热镇痛药。其镇静、呼吸抑制、便秘、耐受性及成瘾性等作用均较吗啡弱。

口服吸收快而完全，其生物利用度为40%~70%。一次口服后，约1小时血药浓度达高峰， $t_{1/2}$ 约为3~4小时。易于透过血脑屏障及胎盘，主要在肝脏与葡萄糖醛酸结合，约15%经脱甲基变为吗啡。其代谢产物主要经尿排泄。

适应证：①各种原因引起的剧烈干咳和刺激性咳嗽，尤适用于伴有胸痛的剧烈干咳。由于本品能抑制呼吸道腺体分泌和纤毛运动，故对有少量痰液的剧烈咳嗽，应与祛痰药并用。②可用于中等度疼痛的镇痛。③局部麻醉或全身麻醉时的辅助用药，具有镇静作用。

用法和用量：

(1) 成人：①常用量：口服或皮下注射，一次15~30mg，一日30~90mg。缓释片剂一次1片(45mg)，一日2次；②极量：一次100mg，一日250mg。

(2) 儿童：镇痛，口服，每次0.5~1.0mg/kg，一日3次，或一日3mg/kg；镇咳，为镇痛剂量的1/3~1/2。

不良反应：一次口服剂量超过60mg时，一些患者可出现兴奋、烦躁不安、瞳孔缩小、呼吸抑制、低血压、心率过缓。小儿过量可致惊厥，可用纳洛酮对抗。亦可见恶心、呕吐、便秘及眩晕。

禁忌证：多痰患者禁用，以防因抑制咳嗽反射，使大量痰液阻塞呼吸道，继发感染而加重病情。

注意：①长期应用亦可产生耐受性、成瘾性。②妊娠期应用本品可透过胎盘使胎儿成瘾，引起新生儿戒断症状，如腹泻、呕吐、打哈欠、过度啼哭等。分娩期应用可致新生儿呼吸抑制。③缓释片必须整片吞服，不可嚼碎或掰开。

药物相互作用：

- (1) 本品与抗胆碱药合用时，可加重便秘或尿潴留的不良反应。
- (2) 与美沙酮或其他吗啡类中枢抑制药合用时，可加重中枢性呼吸抑制作用。
- (3) 与肌肉松弛药合用时，呼吸抑制更为显著。
- (4) 本品抑制齐多夫定代谢，避免二者合用。
- (5) 与甲喹酮合用，可增强本品的镇咳和镇痛作用。
- (6) 本品可增强解热镇痛药的镇痛作用。
- (7) 与巴比妥类药物合用，可加重中枢抑制作用。
- (8) 与西咪替丁合用，可诱发精神错乱，定向力障碍及呼吸急促。

制剂：普通片剂，每片15mg；30mg。缓释片剂，每片45mg。注射液，每支15mg(1ml)；30mg(1ml)。糖浆剂，0.5%，10ml，100ml。

含有可待因的复方制剂：

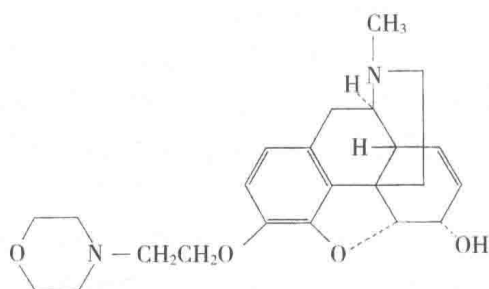
可愈糖浆^[医保(乙)] (Codeine and Guaifenesin Syrup)：每10ml中含磷酸可待因20mg，愈创木酚甘油醚200mg。

菲迪克止咳糖浆 (Pheticol Cold and Cough Syrup)：每5ml含磷酸可待因5mg，盐酸麻黄碱(或右旋麻黄碱)7mg，愈创木酚磺酸钾70mg，盐酸曲普利定0.7mg。

联邦止咳露糖浆 (Amticol Syrup)：每5ml溶液中含磷酸可待因5mg，盐酸麻黄碱4mg，氯苯那敏1mg，氯化铵110mg。

联邦小儿止咳露 (Isedyl Cough Syrup)：每5ml溶液中含磷酸可待因5mg，盐酸异丙嗪5mg，盐酸麻黄碱4mg，愈创木酚磺酸钾50mg。

二、福尔可定 (Pholcodine)



其他名称：吗啡啡，福可定，吗啡乙基啡，Morpholinylethylmorphine, Homocodeine, PHOLCOD, ETHNINE, PHOLDINE, ADAPHOL, PHOLEVAN。

ATC 编码：R05DA08

性状：为白色或类白色的结晶性粉末；无臭，味苦；水溶液显碱性反应。在乙醇、丙酮或三氯甲烷中易溶，在水中略溶，在乙醚中微溶，在稀盐酸中溶解。

药理学：本品与磷酸可待因相似，具有中枢性镇咳作用，也有镇静和镇痛作用，但成瘾性较磷酸可待因弱。

适应证：用于剧烈干咳和中等度疼痛。

不良反应：偶见恶心、嗜睡等。可致依赖性。

禁忌证：禁用于痰多者。

用法和用量：口服，常用量，一次 5 ~ 10mg，一日 3 ~ 4 次；极量，一日 60mg。

注意：新生儿和儿童易于耐受此药，不致引起便秘和消化不良。

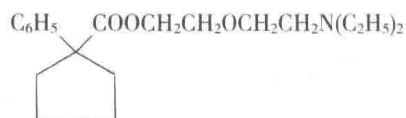
制剂（片剂）：每片 5mg；10mg；15mg；30mg。

贮法：本品有引湿性，遇光易变质。应密封，在干燥处避光保存。

复方福尔可定口服溶液（Compound Pholcodine Oral Solution）：每 1ml 含福尔可定 1mg，盐酸苯丙烯啉 0.12mg，盐酸伪麻黄碱 3mg，愈创木酚甘油醚 10mg，海葱流浸液 0.001ml，远志流浸液 0.001ml。

复方福尔可定口服液（Compound Pholcodine Oral Solution）：每支 10ml 含福尔可定 10mg，盐酸伪麻黄碱 30mg，马来酸氯苯那敏 4mg。

三、喷托维林 (Pentoxyverine)



其他名称：维静宁，咳必清，托可拉斯，Carbetapentane, TOCLASE。

ATC 编码：R05DB05

性状：常用其枸橼酸盐，为白色或类白色的结晶性或颗粒性粉末；无臭，味苦。在水中易溶，在乙醇中溶解，在三氯甲烷中略溶，在乙醚中几乎不溶。熔点 88 ~ 93℃。

药理学：本品对咳嗽中枢有选择性抑制作用，尚有轻度的阿托品样作用和局麻作用，大剂量对支气管平滑肌有解痉作用，故它兼有中枢性和末梢性镇咳作用。其镇咳作用的强度约

为可待因的 1/3。但无成瘾性。一次给药作用可持续 4~6 小时。

适应证：用于上呼吸道感染引起的无痰干咳和百日咳等，对小儿疗效优于成人。

用法和用量：口服，成人，每次 25mg，一日 3~4 次。

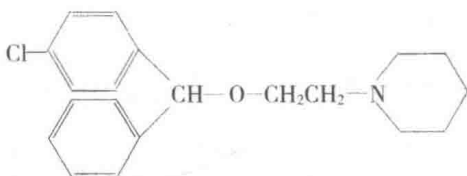
不良反应：偶有轻度头晕、口干、恶心、腹胀、便秘等不良反应，乃其阿托品样作用所致。注意：①青光眼及心功能不全伴有肺瘀血的患者慎用。②痰多者宜与祛痰药合用。

制剂（片剂）：每片 25mg。滴丸：每丸 25mg。冲剂：每袋 10g。糖浆剂：0.145%；0.2%；0.25%。

喷托维林氯化铵糖浆（Pentoxyverine Citrate and Ammonium Chloride Syrup）：每 100ml 内含喷托维林 0.2g，氯化铵 3g（含 25mg 喷托维林）。口服，一次 10ml，一日 3 或 4 次。

喷托维林愈创甘油醚片：含枸橼酸喷托维林 25mg，愈创甘油醚 0.15g。口服，一次 1 片，一日 3 次。

四、氯哌斯汀（Cloperastine）



其他名称：氯哌啉，氯苯息定，咳平，咳安宁，Chloperastine，HUSTAZOL，NITOSSIL，SEKISAN。

ATC 编码：R05DB21

性状：为白色或类白色结晶性粉末，无臭，味苦有麻木感。在水中易溶解。熔点 145~156℃。

药理学：为非成瘾性中枢性镇咳药，主要抑制咳嗽中枢，还具有 H_1 受体拮抗作用，能轻度缓解支气管平滑肌痉挛及支气管黏膜充血、水肿，这亦有助于其镇咳作用。本品镇咳作用较可待因弱，但无耐受性及成瘾性。服药后 20~30 分钟生效，作用可维持 3~4 小时。

适应证：用于急性上呼吸道感染、慢性支气管炎、肺结核及肺癌所致的频繁咳嗽。

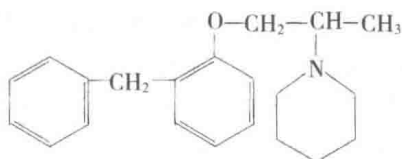
不良反应：偶有轻度口干、嗜睡等不良反应。

用法和用量：口服，成人，每次 10~30mg，一日 3 次；儿童，每次 0.5~1.0mg/kg，一日 3 次。

制剂（片剂）：每片 5mg；10mg。

贮法：遮光密封保存。

五、苯丙哌林（Benproperine）



其他名称：咳快好，咳哌宁，二苯哌丙烷，咳福乐，COFREL，PIREXYL，BLASCORID。

ATC 编码: R05DB02

性状: 常用其磷酸盐, 为白色或类白色粉末; 微带特臭, 味苦。在水中易溶, 在乙醇、三氯甲烷或苯中略溶, 在乙醚或丙酮中不溶。熔点 $148 \sim 153^{\circ}\text{C}$ 。

药理学: 本品为非麻醉性镇咳剂, 具有较强镇咳作用。药理研究结果证明, 狗口服或静注本品 2mg/kg 可完全抑制多种刺激引起的咳嗽, 其作用较可待因强 $2 \sim 4$ 倍。本品除抑制咳嗽中枢外, 尚可阻断肺-胸膜的牵张感受器产生的肺-迷走神经反射, 并具有罂粟碱样平滑肌解痉作用, 故其镇咳作用兼具中枢性和末梢性双重机制。

本品口服易吸收, 服后 $15 \sim 20$ 分钟即生效, 镇咳作用可持续 $4 \sim 7$ 小时。本品不抑制呼吸, 不引起胆道及十二指肠痉挛或收缩, 不引起便秘, 未发现耐受性及成瘾性。

适应证: 用于治疗急性支气管炎及各种原因如感染、吸烟、刺激物、过敏等引起的咳嗽, 对刺激性干咳效佳。有报道本品的镇咳疗效优于磷酸可待因。

不良反应: 偶见口干、胃部烧灼感、食欲不振、乏力、头晕和药疹等不良反应。

用法和用量: 成人, 口服, 一次 $20 \sim 40\text{mg}$, 一日 3 次; 缓释片一次 1 片, 一日 2 次。儿童用量酌减。

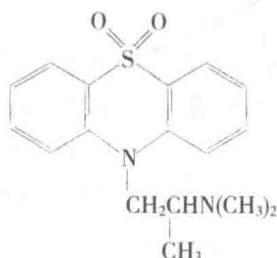
禁忌证: 对本品过敏者禁用。

注意: ①服用时需整片吞服, 切勿嚼碎, 以免引起口腔麻木。②妊娠期妇女应在医师指导下应用。

制剂: 片(胶囊)剂, 每片(粒) 20mg 。泡腾片: 每片 20mg 。缓释片剂: 每片 40mg 。口服液: $10\text{mg}/10\text{ml}$; $20\text{mg}/10\text{ml}$ 。冲剂: 每袋 20mg 。

贮法: 密闭、避光保存。

六、二氧丙嗪 (Dioxopromethazine)



其他名称: 双氧异丙嗪, 克咳敏, Oxymeprazine, PROTHANON。

性状: 其盐酸盐为白色至微黄色粉末或结晶性粉末; 无臭, 味苦。在水中溶解, 在乙醇中极微溶解。

药理学: 本品具有较强的镇咳作用, 并具有抗组胺、解除平滑肌痉挛、抗炎和局部麻醉作用, 还可增加免疫功能, 尤其是细胞免疫。

适应证: 用于慢性支气管炎, 镇咳疗效显著。双盲法对照试验指出, 本品 10mg 的镇咳作用约与可待因 15mg 相当。多于服药后 $30 \sim 60$ 分钟显效, 作用持续 $4 \sim 6$ 小时或更长。尚可用于过敏性哮喘、荨麻疹、皮肤瘙痒症等。未见耐药性与成瘾性。

用法和用量: 口服。常用量: 每次 5mg , 一日 2 次或 3 次; 极量: 一次 10mg , 一日 30mg 。

不良反应: 常见困倦、乏力等不良反应。

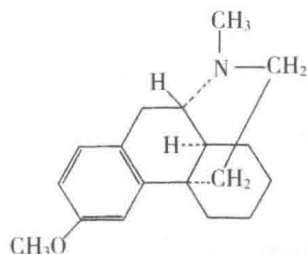
禁忌证：高空作业及驾驶车辆、操纵机器者禁用。

注意：①治疗量与中毒量接近，不得超过极量。②癫痫、肝功能不全者慎用。

制剂（片剂）：每片5mg。颗粒剂：每袋3g（含1.5mg二氧丙嗪）。

复方二氧丙嗪茶碱片（Compound DioxopromethazineHydrochloride Tablets）：每片含盐酸二氧丙嗪5mg，茶碱55mg，盐酸克仑特罗15 μ g。

七、右美沙芬（Dextromethorphan）



其他名称：美沙芬，右甲吗喃，Dexmetorphen，ROMILAR，TUSSADE，SEDATUSS，Mothorphan。

ATC 编码：R05DA09

性状：本品氢溴酸盐为白色或类白色结晶性粉末，无味或微苦，溶于水、乙醇，不溶于乙醚。熔点125℃左右。

药理学：本品为吗啡类左吗喃甲基醚的右旋异构体，通过抑制延髓咳嗽中枢而发挥中枢性镇咳作用。其镇咳强度与可待因相等或略强。无镇痛作用，长期应用未见耐受性和成瘾性。治疗剂量不抑制呼吸。

口服吸收好，15~30分钟起效，作用可维持3~6小时。血浆中原形药物浓度很低。其主要活性代谢产物3-甲氧吗啡烷在血浆中浓度高， $t_{1/2}$ 为5小时。

适应证：用于干咳，适用于感冒、急性或慢性支气管炎、支气管哮喘、咽喉炎、肺结核以及其他上呼吸道感染时的咳嗽。

用法和用量：口服，成人，每次10~30mg，一日3次。一日最大剂量120mg。

不良反应：偶有头晕、轻度嗜睡、口干、便秘等不良反应。

禁忌证：妊娠3个月内妇女及有精神病史者禁用。

注意：妊娠期妇女及痰多患者慎用。

药物相互作用：①与奎尼丁、胺碘酮合用，可增高本品的血药浓度，出现中毒反应。②与氟西汀、帕罗西汀合用，可加重本品的不良反应。③与单胺氧化酶抑制剂并用时，可致高烧、昏迷等症状。④与其他中枢抑制药合用可增强本品的中枢抑制作用。⑤酒精可增强本品的中枢抑制作用。

制剂：普通片剂，每片10mg；15mg。分散片，每片15mg。缓释片，每片15mg；30mg。胶囊剂，每粒15mg。颗粒剂，每袋7.5mg；15mg。糖浆剂，每瓶15mg（20ml）；150mg（100ml）。注射剂，每支5mg。

复方美沙芬片：每片含对乙酰氨基酚0.5g、氢溴酸右美沙芬15mg、盐酸苯丙醇胺12.5mg、氯苯那敏2mg。用于流行性感冒、普通感冒及上呼吸道感染，可减轻发烧、咳嗽、咽痛、头痛、周身痛、流涕、打喷嚏、眼部发痒、流泪、鼻塞等症状。口服，每次1~2片，