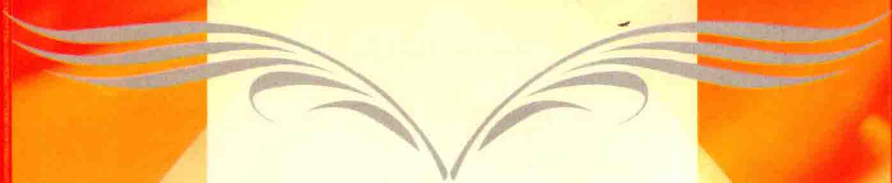
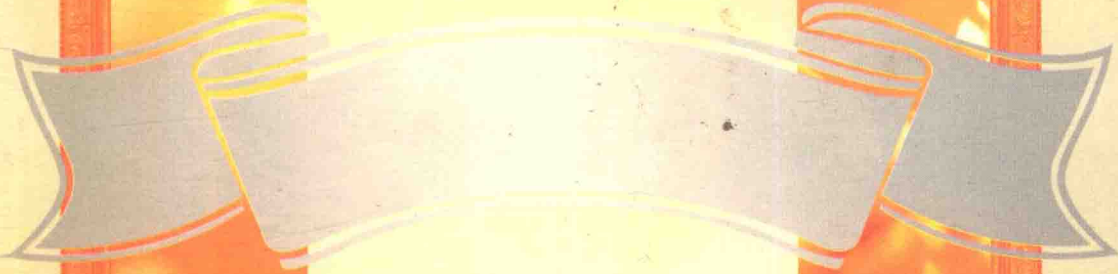


LIN CHUANG YONG
YAO XU ZHI

临床用药须知

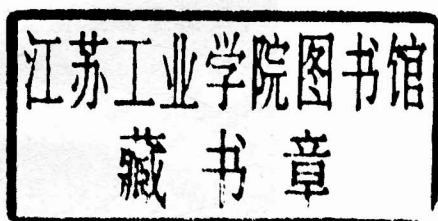


天津电子出版社

临床用药须知

(第一卷)

主编 徐 浩



天津电子出版社

临床用药须知

临床用药须知

主 编：徐 浩

出版发行：天津电子出版社

出版时间：2005年5月

制 作：北京新地光盘有限公司

版 号：ISBN 7-88890-261-8

定 价：998.00元(1CD-ROM + 四卷手册)

前 言

近年来，国内外医药事业飞速发展，新产品、新剂型不断出现，大量新药在临床应用，为了充分发挥药物作用和合理使用药品，防止药源性疾病的发生，提高医务人员的药物知识，正确使用药品，特编写此书。

本书汇集了2005年版药典收藏的药品，以及目前临床上应用比较成熟的常用新品种。对每一药品详细介绍了其临床适应症、药理（药效学和药动学）、不良反应、注意事项、药物相互作用、给药说明、用法与用量、制剂与规格等。同时还收录了在各种生理状态下和不同病理情况下的用药原则和重要疾病的用药指南或治疗方案。

虽然我们在编写此书时倾注了大量热情和心血，做了许多努力，但还存在着不足，期望读者给予指正，以便今后改进。

编 者

2005年5月

编委会

主 编 徐 浩

编 委 夏舜余 朱晓明 余寿林 王萃忠

李胜宏 余厚友 舒卫东 姜志强

李教记 张钦举 韩亚非 刘清义

孙万慈 周柱成 张红旗 吉改军

目 录

1 合理用药	(1)
1.1 药物对人体的作用	(1)
1.2 药物的体内过程	(3)
1.3 药物动力学	(8)
1.4 药物相互作用	(14)
1.5 药品不良反应和药源性疾病	(20)
1.6 药物过量与中毒	(26)
1.7 妊娠期及哺乳期合理用药	(29)
1.8 婴幼儿合理用药	(35)
1.9 儿童合理用药	(36)
1.10 基本药物与药品淘汰	(37)
2 麻醉药与麻醉辅助药	(39)
2.1 全身麻醉药	(39)
2.2 局部麻醉药	(64)
2.3 肌肉松弛药	(76)
2.4 胆碱酯酶抑制药	(88)
3 催眠药和镇静药	(95)
4 抗癫痫药	(126)
5 治疗精神障碍药	(150)
5.1 抗精神病药	(150)
5.2 抗焦虑药	(177)
5.3 抗躁狂抑郁症药	(190)
5.4 精神兴奋药	(205)
6 抗震颤麻痹药	(210)
7 镇痛药	(222)

8 解热镇痛消炎及抗痛风药	(262)
8.1 解热镇痛药	(262)
8.2 抗炎镇痛药	(280)
8.3 治疗痛风药物	(291)
9 中枢神经兴奋药	(299)
10 循环系统药	(310)
1 概述	(310)
2 强心甙	(335)
3 非强心甙类强心药物	(361)
4 抗心律失常药物	(395)
5 β 受体阻断剂	(450)
6 钙离子拮抗剂	(503)
7 硝酸酯类药物	(537)
8 血管扩张药	(568)
9 抗休克药	(609)
10 调血脂及抗动脉粥样硬化药物	(631)
11 血管紧张素转化酶抑制剂	(673)
12 溶栓药物	(710)
13 抗凝血及抗血栓形成药物	(727)
14 心肌营养和改善心肌代谢药物	(765)
11 呼吸系统药	(786)
1 镇咳药	(786)
2 平喘药	(800)
3 祛痰药	(835)
12 消化系统药	(841)
12.1 抗消化性溃疡及胃炎药	(841)
12.2 助消化药及胃肠运动功能促进药	(882)
12.3 泻药与止泻药	(889)
12.4 止吐药及催吐药	(901)

12.5	利胆药	(908)
12.6	肝病辅助用药	(914)
13	利尿药与脱水药	(929)
13.1	利尿药	(929)
13.2	脱水药	(961)
14	子宫收缩药及引产药	(964)
15	血液系统药	(979)
15.1	促凝血(止血)及抗纤溶药	(979)
15.2	抗贫血药	(987)
15.3	血浆代用品	(992)
16	抗组胺药	(995)
16.1	化学结构	(995)
16.2	药理作用	(996)
16.3	临床评价	(996)
16.4	用途	(997)
16.5	不良反应	(997)
16.6	中毒	(998)
17	糖类、盐类及酸碱平衡调节药	(1037)
18	肾上腺皮质激素	(1066)
18.1	皮质激素的分类	(1066)
18.2	构效关系	(1066)
18.3	糖皮质激素	(1068)
18.4	盐皮质激素	(1095)
19	雄激素及蛋白同化类固醇	(1097)
20	雌激素、孕激素和避孕药	(1105)
20.1	雌激素类药	(1105)
20.2	孕激素类药	(1115)
20.3	避孕药	(1123)
21	垂体激素及相关药物	(1130)

21.1	甲状腺用药	(1144)
21.2	降血糖药	(1155)
22	甲状腺激素及抗甲状腺药	(1168)
22.1	甲状腺激素	(1168)
22.2	抗甲状腺药	(1172)
23	降血糖药	(1179)
23.1	磺酰脲类	(1179)
23.2	双胍类	(1187)
23.3	α -葡萄糖苷酶抑制剂	(1189)
23.4	格列酮类	(1191)
23.5	非磺酰脲类促胰岛素分泌剂	(1193)
24	维生素类药	(1195)
24.1	脂溶性维生素	(1195)
24.2	水溶性维生素	(1206)
25	酶制剂类药	(1221)
25.1	酶制剂分类	(1221)
25.2	酶制剂使用的注意事项	(1221)
25.3	酶制剂药物	(1222)
26	抗感染药物	(1234)
26.1	抗菌药物	(1234)
26.2	抗病毒药	(1368)
26.3	抗真菌药	(1391)
26.4	抗结核药物	(1408)
26.5	抗麻风药	(1418)
27	抗寄生虫药	(1424)
27.1	抗疟原虫药	(1425)
27.2	抗阿米巴和滴虫药	(1431)
27.3	抗吸虫药	(1435)
27.4	抗丝虫药	(1438)

27.5	抗利什曼原虫药	(1439)
27.6	抗卡氏肺孢子虫药	(1439)
27.7	驱肠道蠕虫药	(1442)
27.8	抗性传播疾病药	(1447)
28	抗肿瘤药	(1448)
28.1	烷化剂	(1448)
28.2	抗代谢药	(1453)
28.3	植物来源的抗肿瘤药	(1460)
28.4	抗肿瘤抗生素	(1466)
28.5	铂类化合物	(1471)
28.6	激素类抗肿瘤药	(1473)
28.7	基因工程来源的抗肿瘤药	(1477)
28.8	杂类抗肿瘤药	(1477)
28.9	肿瘤治疗辅助药	(1479)
29	皮肤科外用药	(1502)
29.1	外用抗菌、抗病毒和抗寄生虫剂	(1504)
29.2	皮肤清洁剂、皮肤保护剂、皮肤润滑剂、止痒剂和止痛剂	(1525)
29.3	角质促成剂和角质剥离剂	(1531)
29.4	收敛剂、腐蚀剂、遮光剂和止汗剂	(1535)
29.5	脱色剂和增色剂	(1537)
29.6	促毛剂和脱毛剂	(1539)
29.7	外用皮质类固醇药物	(1540)
29.8	外用维 A 酸类药物	(1545)
29.9	外用细胞毒性药物	(1549)
29.10	抗过敏性药物	(1551)
29.11	其他	(1554)
29.12	复方制剂	(1556)
30	眼科用药	(1566)
30.1	眼用抗感染药	(1566)

30.2	糖皮质激素滴眼液	(1576)
30.3	非甾体类抗炎药滴眼液	(1579)
30.4	防治白内障药物	(1582)
30.5	散瞳与睫状肌麻痹剂	(1584)
30.6	抗过敏滴眼液	(1585)
30.7	眼部润滑与角膜保护剂	(1588)
30.8	其他滴眼剂	(1594)
31	解 毒 药	(1596)
31.1	概 述	(1596)
31.2	一般性解毒药	(1597)
31.3	特异性解毒药	(1599)
32	消毒防腐药	(1607)
33	X线造影剂与诊断用药	(1626)
34	放射性药物	(1637)
35	生物制品	(1673)
35.1	血液制品	(1673)
35.2	抗毒素类药	(1676)

1 合理用药

1.1 药物对人体的作用

1.1.1 药物的局部作用和系统作用

药物对人体的作用可分为局部作用和系统作用两种。

局部作用是指不吸收的药物在人体表皮或黏膜表面所起的作用，如油类的润滑作用、收敛剂的止泻作用等；或是药物应用于人体表皮或黏膜有一定的吸收（包括一些局部注射用药），但只在浅层组织中所起的作用，如樟脑擦剂外用引起的表皮充血、局部麻醉药的止痛止痒作用等。

系统作用是药物通过吸收进入机体而实现的。根据药物作用性质的不同，可有以下几种系统作用。

(1) 对机体生长发育的影响 如性激素类药物可促进或抑制性器官的发育（并对功能起调节作用），生长激素可促进机体生长、发育等。

(2) 对机体功能起调节作用 许多药物可调节机体的功能，起促进或抑制某些生理功能的作用。

(3) 抗病原体的药物对机体的影响 许多抗病原体药物（抗生素、抗寄生虫病药等），除对病原体起作用外，还常影响人体的生理功能，如左旋咪唑不仅用于驱虫，还可增强机体的免疫功能。大多数的抗感染药物对人体生理功能的影响，都是以副作用或毒性来表现的。

1.1.2 药物对机体功能的调节作用

许多药物对机体生理功能起调节作用。使原有生理功能加强的作用称为“兴奋”（或激动），如咖啡因可增强大脑皮质的兴奋过程，以兴奋延脑呼吸中枢和血管运动中枢；而使原有生理功能减弱的作用则称为“抑制”（或拮抗），如普萘洛尔的抑制 β 受体功能作用。

一种药物对不同器官可显示不同性质的作用，如阿托品对胃肠平滑肌起松弛作用，

从而抑制其蠕动，而对心脏则可解除迷走神经的抑制使心搏加快。

多数药物对机体功能的调节作用是通过药物与体内的有关受体或效应器（指细胞、组织、腺体、器官等或是体内的某些生理物质，如酶等）相结合而发生效应的。

1.1.3 药物的受体

对于受体，目前了解较多的有胆碱能受体、肾上腺能受体、组胺受体，了解不多的有多巴胺受体、阿片受体、5-羟色胺受体、 γ -氨基酪酸（GABA）受体，后者还和苯二氮草受体有关。一些化学物质，包括体内内源性的激动剂和合成的激动剂及拮抗剂，能与受体结合产生一定的效应，它们都被称之为递质。上述受体和有关的递质见表 1-1。

表 1-1 受体与其相应的递质

受 体	体内分布	激 动 剂	拮抗剂(阻滞剂)
胆碱能受体			
毒蕈碱亚型(M)	副交感神经支配的组织	乙酰胆碱及其类似药	阿托品类、苯海索、奎尼丁、丙吡胺、三环抗抑郁药、哌仑西平(Pirenzepine)等
烟碱亚型(N)	神经肌肉接点,神经节后细胞	乙酰胆碱及其类似物	神经肌肉阻滞药、神经节阻滞药、奎尼丁、氨基糖苷类
肾上腺能受体			
α/β		肾上腺素、去甲肾上腺素	拉贝洛尔(Labetalol)
α_1	血管平滑肌,瞳孔散大肌	去氧肾上腺素(新福林)	哌唑嗪
α_2	突触前神经终端,CNS	可乐定	育亨宾(Yohimbine)
α_1/α_2			酚妥拉明
β_1	心脏,CNS	多巴胺、多巴酚丁胺	阿替洛尔、美托洛尔
β_2	平滑肌(支气管、血管、子宫),胰岛	沙丁胺醇、特布他林等	
β_1/β_2		异丙肾上腺素	普萘洛尔、氧烯洛尔
多巴胺受体	CNS,肾脉管系统	多巴胺、溴隐亭、阿扑吗啡	酚噻嗪类、噻吨类、丁酰苯类、甲氧氯普胺
组胺受体			
H ₁	平滑肌(气管、血管、胃肠道)	组胺	抗组胺药
H ₂	胃	组胺	西咪替丁、雷尼替丁
阿片受体	CNS,血管平滑肌,消化道,胆管,泌尿道,瞳孔肌	吗啡及类似物内啡肽、非阿片类麻醉镇痛药(喷他佐辛)	纳络酮类

续表

受体	体内分布	激动剂	拮抗剂(阻滞剂)
5-羟色胺受体 (5-HT)	CNS, 血管平滑肌	5-羟色胺	美西麦角(Methysergide)、酮色林(Ketanserin)
5-HT ₃			昂丹司琼(Ondansetron)
GABA 受体			
GABA _A /BDZ 复合 亚型	CNS	GABA、苯二氮草类	
GABA _B 亚型	CNS(突触前)	GABA、巴氯芬(Baclofen)	

注: ①细黑体字表示内源性激动剂。

②GABA 为 γ -氨基酪酸 (γ -氨基丁酸); BDZ 为 Benzodiazepines (苯二氮草类); CNS 为中枢神经系统。

1.2 药物的体内过程

药物进入机体, 作用于机体而产生效应。药物要经历吸收 (absorption)、分布 (distribution)、代谢 (metabolism) 和消除 (elimination) 而最后排出体外, 这是药物的体内过程, 简称 ADME 过程。

1.2.1 吸收

口服或外用的药品, 要起系统作用必先通过吸收。影响药物吸收的因素有以下一些。

(1) 药物的溶解性能 多数药物是通过被动转运形式透膜吸收的。所谓被动转运, 就是依靠药物的溶解性能而透膜。

1) 药物处于溶解状态下较易被吸收: 药物的溶液比固体易于吸收。易溶于水的药物制成水溶液, 不仅吸收较迅速, 而且可降低对胃的刺激性; 水中溶解甚微但在油中有一定溶解度的药物, 如灰黄霉素、螺内酯等, 于油脂餐后服用可增加吸收, 这也是利用它们可溶于油的性质。

2) 具有适当油/水分配系数的药物易于以被动转运形式吸收: 适度的脂溶性有助于药物穿透生物膜类脂质层而实现吸收。除了被动转运形式透膜外, 还有些物质可以通过主动转运或易化扩散方式透膜, 这与被动转运透膜的原理不同。

(2) 固体药物的晶型与粒度 固体药物的晶型和粒度也影响药物的吸收。如无味氯霉素 B 型结晶较 A 型结晶易于被吸收; 螺内酯、灰黄霉素等因在体液中溶解较慢, 其大粒结晶不能完全被吸收, 因此要求其以微粒结晶应用。

(3) 弱电解质类药物的电离程度与其吸收的关系 弱电解质的电离程度随 pH 的变化而改变。弱电解质处在分子状态下,具有一定的脂溶性可以透膜,而在离子状态时,则不能透过生物膜的一类脂质层而几乎不被吸收。弱酸类药物在胃部(胃液 pH 值为 1~2)吸收较多,进入肠道后,随 pH 值的上升而吸收逐渐减少;弱碱类药物则相反,其主要的吸收部位是在肠道,随着肠道 pH 值上升而吸收也逐渐增多。

1.2.2 分布

药物吸收进入血流,在体内有一个分布的过程。药物进入作用部位方能显示效应。影响药物分布的因素有以下一些。

(1) 药物本身的性质 药物的溶解性能决定药物在体内的分布。脂溶性极强的物质,进入体内后较多地分布在脂肪组织中,如六氯对二甲苯(抗血吸虫病药),口服一剂,可在脂肪中长期贮存,在半年中不断释放药物而起作用。

油/水分配系数较高的药物,透膜进入作用部位较快且较多,如硫喷妥比一般巴比妥的油/水分配系数大,注射后迅速透过血—脑脊液屏障,所以被用作静脉麻醉药。

(2) 药物与血浆蛋白结合 许多药物进入血流后与血浆蛋白以大致一定的比率结合,生成结合物。以下式表示(D代表药物、P代表血浆蛋白、D-P为结合物):



上述反应是可逆的,结合物逐渐分解重新释出游离药物。

各种药物具有各自的蛋白结合性能,即具有不同的结合率。结合性能强的可高达 95%~98%,而结合性能弱的只有百分之十几。有的药物几乎与蛋白不结合(结合率接近 0)。

游离型药物可以透膜进入作用部位,具有活性。而结合物则因系大分子物质,不能透膜进入作用部位,分布较窄,且暂时失去活性。

同类药物中,蛋白结合率较高者,游离体的血浓度较低,消除较慢,如磺胺多辛的蛋白结合率 > 95%,因而是长效磺胺,而磺胺二甲嘧啶则是短效磺胺,后者较适用于急性感染的治疗。

1.2.3 代谢

许多药物进入体内后要经历代谢(也有一些药物不经代谢)。多数药物的原形体是活性物(具有药理作用的物质),而其代谢物常是非活性物,某些时候也可为活性物。药物代谢是一个生物体内的化学变化过程,依靠各种不同的酶催化而进行。不同的药物在体内的代谢转化各不相同,如氧化(别嘌呤醇、保泰松等)、水解(如普鲁卡因、阿

托品等)、乙酰化(异烟肼、磺胺药等)、与葡萄糖醛酸结合(吗啡、对乙酰氨基酚等)。各种不同的酶参与了有关的反应。也有一些药物在体内不经代谢,如氨基糖苷类抗生素、某些头孢菌素等。

与药物代谢有关的问题论述如下。

(1) 首关作用 由十二指肠、小肠吸收的药物,随血流通过门静脉进入肝脏;在肝脏中,部分药物经代谢转化为代谢物,其余药物则随血流进入体循环。药物通过肝脏部分转化为代谢物的作用称为首关作用或首关代谢,也称为第一关卡效应。

药物通过首关代谢的代谢率有大致一定的比率(也称肝提取率),如若代谢率改变,则会使药效起相应的变化。一些经历首关代谢的重要药物见表1-2。

表1-2 与首关代谢有关的重要药物

心血管系统药	阿司匹林
地尔硫草	可待因
硝酸甘油	右丙氧芬
胍屈嗪	吗啡
硝酸异山梨酯	喷他佐辛
拉贝洛尔	哌替啶
利多卡因	抗精神病药
美托洛尔	阿米替林
哌唑嗪	多塞平
普萘洛尔	丙咪嗪
维拉帕米	去甲替林
呼吸系统药物	细胞毒类
沙丁胺醇	氟尿嘧啶
特布他林	硫嘌呤
神经系统药物	其他
双氢麦角胺	多潘立酮
左旋多巴	甲苯咪唑
新斯的明	口服避孕药
镇痛药	吡嗪酮

(2) 影响药物肝代谢的因素 影响药物肝代谢的因素有肝病、遗传所致酶异常以及药物相互作用等。

1) 肝病:肝脏是体内药物代谢的主要部位。肝脏有病则药物的代谢功能常不足,

致使药物的血浓度高于正常，导致不良反应。对于肝病者，慎用肝代谢药物，适当掌握剂量，至为重要。

2) 遗传所致酶异常：在人群中，部分人存在着酶异常的情况，即部分人的酶不足（包括酶量不足或活力低下），也有部分人的酶高于正常，但以前者为多见。人体内的酶数以百计，而具体到一个人，遗传所致酶不足并非涉及到所有的酶，而常表现为一种酶不足，如某些人缺乏 N-乙酰化酶（中国汉族中约占 22%），又有些人则缺乏羟化酶（汉族中约占 1%），缺乏 2 种以上者极为罕见。酶不足者不同于肝病者。酶不足者肝脏并无疾病，而是遗传所致。酶不足者应用正常剂量的药物，可因首关代谢不足，血药浓度过高，而致效应过强，甚至可发生意外，应予注意（参见“药物不良反应和药源性疾病”一节）。

3) 药物相互作用：某些药物可提高肝酶的功能，致使其他药物的代谢加速（或首关作用加强），从而使之迅速降效；其他一些药物又可抑制肝酶的功能，致使其他药物的代谢减慢（或首关作用减弱），从而增强药效。这些问题在“药物相互作用”一节中作进一步探讨。

1.2.4 消除

消除是指药物自体内减少和消失。排泄是消除的一种主要方式。代谢也和消除有关。

药物（及其代谢产物）的主要排泄途径是肾排泄。此外，尚可经肝、胆汁排入肠道，自汗腺排出等，但这些途径的排泄都是少量，而肾排泄是最主要的。影响药物肾排泄的有以下一些因素。

(1) 肾病的影响 肾功能不全者尿量减少，排泄药物的能力也降低，常可致药物滞留，血药浓度升高，因此对于肾功能不良者应该减少用量或延长给药的间隔时间。

(2) 尿碱化对弱电解质尿排泄的影响 正常人的尿液 pH 值范围为 5~8，可因食物、药物的影响而改变。如服用碳酸氢钠，可使尿液的 pH 值接近或略超过 8，而弱酸性药物在碱性介质中电离率增大，离子型药物的透膜性能差。当弱酸性药物在 pH 为 7.4 的血液中时，其电离率较在 pH 8 的介质中为小，故离子部分减少而分子部分增多。所以，在尿液 pH 高于血液时，弱酸性药物易自血液透膜进入尿液，并且不易由尿液重吸收到血液，因而尿液碱化时，弱酸性药物排泄增多。

弱碱性药物则相反。当尿液 pH 高于血液时，其分子部分相对较多，而有利于重吸收到血液中，此时，弱碱性药物的排泄减少。

(3) 尿酸化对弱电解质尿排泄的影响 应用盐酸、氯化铵等药物时，可以使尿酸