

Clinical
Ocular
Pharmacology

〈 第二版 〉

眼科

临床药理学

陈祖基 主编



化学工业出版社
生物·医药出版分社

眼科 临床药理学

第2版



人民卫生出版社
人民卫生出版社

Clinical
Ocular
Pharmacology

〈 第二版 〉

眼科

临床药理学

陈祖基 主编



化学工业出版社

生物·医药出版分社

· 北京 ·

本书分总论、眼科常用药物、常见眼病的药物治疗及药源性眼病等四篇，共 53 章，系统介绍了药物眼内药代动力学、眼用药物的作用及其机理、眼科用药的基本原则及常见眼病的药物治疗。在第一版基础上，本书在总论中增加了眼科药理学研究方法，近年来研究发展的眼用药物新剂型，以及新药研究的相应新法规；眼科常用药物篇中，对目前眼科临床较少应用或基本不用的品种进行了压缩和删减，并尽可能增补目前临床应用的新品种，并对各章节内容进行了较多的补充和更新；常见眼病的药物治疗篇新增了葡萄膜炎的药物治疗、近视的药物治疗、新生血管性眼病的药物治疗、眼科疾病的基因治疗以及肉毒毒素在眼科的应用等五章，原有各章节作了较多的更新、补充，有的章节则进行了全面的更新与编写。

本书适用于眼科临床医师、药师及从事眼科药物研究的技术人员。

图书在版编目 (CIP) 数据

眼科临床药理学/陈祖基主编. —2 版. —北京: 化学工业出版社, 2011. 6

ISBN 978-7-122-10489-2

I. 眼… II. 陈… III. 眼科学: 药理学 IV. R988.1

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2011) 第 015884 号

责任编辑: 杨燕玲 余晓捷
责任校对: 陈 静

文字编辑: 杨欣欣
装帧设计: 史利平

出版发行: 化学工业出版社 生物·医药出版分社
(北京市东城区青年湖南街 13 号 邮政编码 100011)

印 刷: 北京云浩印刷有限责任公司

装 订: 三河市万龙印装有限公司

787mm×1092mm 1/16 印张 44¼ 字数 1247 千字 2011 年 6 月北京第 2 版第 1 次印刷

购书咨询: 010-64518888 (传真: 010-64519686) 售后服务: 010-64518899

网 址: <http://www.cip.com.cn>

凡购买本书, 如有缺损质量问题, 本社销售中心负责调换。

定 价: 98.00 元

版权所有 违者必究



眼科医师应战眼病的两大手段就是手术和用药。即使是经手术治疗的眼病，也要适时用药。大学期间，一位外科教授授课时对外科的定义是，外科=内科+手术，其意义亦在此，故眼科医师在医疗实践中必须熟悉并恰当应用药物，以解除患者病痛。

在科学技术飞速发展的今天，眼科所用的药物及其药理作用，如总体医学用药一样，可谓林林总总，浩如烟海。眼科医师欲摆脱在用药中知其然而不知其所以然的模糊状态，案头颇需一册眼科用药的专著。陈祖基教授编著的《眼科临床药理学》正如久旱逢甘霖，给临床医疗用药提供了极有参考价值的参考专著。

《眼科临床药理学》全面地阐述了眼科用药及其药理作用，以及其在眼局部及全身的吸收、分布和代谢过程，不同药物的药效及其应用途径和适应证，以及眼科新药的研究发展等。本书同时也汇入了陈教授潜心从事眼科药学研究数十年所积累的丰富经验。

陈祖基教授是我国眼科学界唯一从事专业眼科药学研究及其临床应用的专家，其权威地位为我国眼科学界所公认。参与本书“常见眼病的药物治疗”各章节的编著者，也都是我国眼科学界专业领域叱咤风云的专家。不言自明，《眼科临床药理学》是一本极具权威性而且实用的高级参考书。

为祝贺《眼科临床药理学》的出版，特为序。

张士元

中华眼科学会名誉主任委员
北京眼科研究所 教授



《眼科临床药理学》第一版自 2002 年出版，迄今已近 10 年，其间广大读者反映该书内容丰富，是一本广大眼科工作者的重要药理学参考书。出书后购读踊跃，虽经重印，现书已告罄。近 10 年来，眼科药物研究发展迅速，眼科新药不断增多，知识更新显著加快，为适应新形势的需要，我们对其进行了再版修订。

在第二版的总论中增加了眼科药理学研究方法，近年来研究发展的眼用药物新剂型，以及新药研究的相应新法规；眼科常用药物篇中，对目前眼科临床较少应用或基本不用的品种进行了压缩和删减，并尽可能增补目前临床应用的新品种，并对各章节内容进行了较多的补充和更新；常见眼病的药物治疗篇新增了葡萄膜炎的药物治疗、近视的药物治疗、新生血管性眼病的药物治疗、眼科疾病的基因治疗以及肉毒毒素在眼科的应用等五章，原有各章节也作了较多的更新、补充，有的章节则完全重写。把内容丰富、新颖实用的临床用药经验呈现给读者，使之对眼科临床治疗更具参考价值和实用性。

限于我们的能力和水平，书中恐仍有错误和疏漏不足之处，敬请读者不吝指正，以便增补、改正、修订。

编者
2011 年 1 月



治疗疾病与合理用药密不可分，眼科临床用药更是如此，眼科疾病的诊断、预防和治疗都离不开药物。随着现代科学技术的迅猛发展，越来越多的现代新技术、新方法、新材料应用于眼科药物研究领域，促使眼科新药的开发、眼科药物的实验研究和临床治疗在不断革新，并取得了令人瞩目的成果，为眼科药理学的兴起和发展奠定了良好的基础。

目前，我国有关眼科药理学以及阐述眼科药物治疗的书籍尚不多见。为此，邀请国内十余位眼科药理学和眼科临床专家，在参阅国内外有关文献及拙著《实用眼科药理学》的基础上，集眼科药理学和治疗学的最新进展，结合作者们的研究心得和临床实践经验，编著成《眼科临床药理学》一书，以期对我国眼科药理学和治疗学研究有所推动与促进。

本书分总论、眼科常用药物、常见眼病的药物治疗及药源性眼病等四篇，共53章。系统介绍了药物眼内药代动力学、眼用药物的作用及其机理、眼科用药的基本原则及常见眼病的药物治疗。眼科用药与临床其他学科用药虽有相同的一面，但也有独特之处。论述药物在眼内的吸收、分布、代谢及排除，对眼组织的作用及其机理，眼科临床疗效及其适应证，全身特别是眼局部的给药途径，以及可能引起的眼和全身不良反应等，就成为研究眼科临床药理学这门新兴学科的特定内容。

本书的编写旨在系统地介绍眼科药物的基础理论与临床应用，以期读者通过阅读此书，了解眼用药物的作用特点、临床适应证及可能出现的眼和全身不良反应，达到临床合理用药的目的；了解眼科药物治疗学的最新进展及新药发展方向，拓宽临床诊断、治疗思路，强化及丰富治疗手段，更好地造福于眼病患者。因此，本书可供眼科临床医师、药理学工作者及执业药师参考。

本书各篇章的编著者均为该领域有造诣的专家与学者，书中许多内容是他们多年从事临床科研工作的经验总结，因而增加了本书的先进性和实用性。尤其在常见眼病的药物治疗篇章里，写作风格迥异，立论各具匠心，把内容丰富、新颖实用的临床用药经验呈现给了读者。

由于眼科临床药理学研究正在发展之中，尚需不断完善，加之作者各自的实践与经验有其局限性，书中难免有缺点及错误，殷切期望同道们不吝指教。

编者

目录

第一篇

001 总 论

第一章 眼科药物治疗学发展史和研究范畴	003
一、眼科药物治疗学的发展史	003
二、眼科药理学的研究范畴	004
三、眼科药理学的研究方法	004
第二章 药物对机体及眼的作用	005
一、药物的基本作用	005
二、药物作用的基本规律	005
三、药物作用的机制	008
第三章 药物的眼内过程	010
一、体内（或眼内）过程的基本规律	010
二、眼用药物的吸收	011
三、药物在眼内的分布	020
四、药物在眼内的排出	021
五、药物在眼组织内的代谢	022
六、动力学过程和药动学参数	023
第四章 滴眼剂的眼内药代动力学	025
一、结膜囊内药代动力学	025
二、眼内药代动力学	026
三、药效反应与眼内药代动力学	029
第五章 影响药物作用的因素	033
一、给药途径	033
二、联合用药与药物相互作用	034
三、患者生理因素	035
四、病理状态	037
五、合理用药	037
第六章 眼用药物剂型	038
一、滴眼液和眼膏	038
二、滴眼剂污染的控制	040
三、眼用注射液	042
四、新型眼部给药系统	042
第七章 眼科新药临床研究	050
一、新药的概念及分类	050
二、眼科新药临床研究的目的是分期	051
三、参与新药临床试验的各方的职责	052

四、临床试验前的准备·····	054
五、I 期临床试验·····	054
六、II 期临床试验·····	056
七、III 期临床试验·····	058
八、IV 期临床试验·····	058
九、新药临床试验的设计·····	059

第二篇

063

眼科常用药物

第一章 抗微生物药物概论 ·····	65
一、正常菌群和眼科临床常见病原菌·····	65
二、机体、药物与病原体间的相互关系·····	66
三、药物敏感试验·····	66
四、化学治疗药物的常用术语·····	67
五、耐药性·····	68
六、抗微生物药物的作用机制·····	69
第二章 抗生素 ·····	71
一、青霉素类·····	71
二、头孢菌素类·····	80
三、其他 β -内酰胺类·····	86
四、大环内酯类·····	89
五、氨基糖苷类·····	92
六、肽类·····	97
七、四环素类·····	100
八、氯霉素类·····	102
九、利福平·····	104
十、林可霉素和克林霉素·····	105
十一、夫西地酸·····	105
第三章 化学合成抗菌药物 ·····	108
一、喹诺酮类 (Quinolones)·····	108
二、噁唑烷酮类 (Oxazolidinones)·····	118
三、磺胺类及磺胺增效剂·····	119
四、甲硝唑和替硝唑·····	122
第四章 抗结核药物 ·····	125
第五章 抗菌药物在眼科临床的合理应用 ·····	130
一、抗菌药物的选择·····	130
二、抗菌药物间的联合应用·····	134
三、抗菌药物与糖皮质激素等抗炎药物的联合应用·····	135
四、抗菌药物合理用药新理念·····	136
第六章 抗真菌药物 ·····	139
一、多烯类抗真菌抗生素·····	139
二、氟胞嘧啶·····	142

三、唑类 (azoles)	143
四、棘白菌素类 (Echinocandins)	151
五、烯丙胺类	153
第七章 抗病毒药物	155
一、非选择性抗疱疹病毒药物	156
二、选择性抗疱疹病毒药物	160
三、广谱抗病毒药物	172
四、其他抗病毒药物	172
五、干扰素及其诱生剂	173
第八章 抗肿瘤药物和抗增殖药物	176
一、烷化药	176
二、抗代谢药物	178
三、抗肿瘤抗生素	179
四、植物药	182
五、铂类化合物	183
六、拓扑异构酶 I 抑制药	184
七、抑制新生血管生成的药物	185
第九章 糖皮质激素	188
一、主要药理作用	189
二、眼内通透性	191
三、临床应用	193
四、不良反应	198
五、眼科常用的糖皮质激素类药物	203
第十章 非甾体抗炎药物	209
一、参与炎症反应的化学介质	209
二、眼科常用的非甾体抗炎药	211
第十一章 影响免疫功能的药物	224
一、免疫抑制药	224
二、免疫增强药 (immunopotentiating agents)	238
三、抗变态反应药	241
第十二章 拟肾上腺素药物	253
一、主要作用于 α 受体的拟肾上腺素药	253
二、作用于 α 及 β 受体的拟肾上腺素药	259
第十三章 肾上腺素受体阻断药	266
一、 β 肾上腺素受体阻断药	266
二、 α 肾上腺素受体阻断药	281
第十四章 拟胆碱药物	284
一、拟乙酰胆碱药	285
二、节后拟胆碱药	286
三、作用于胆碱酯酶的药物	292
第十五章 碳酸酐酶抑制药	298
一、全身应用的碳酸酐酶抑制药	299
二、眼局部应用的碳酸酐酶抑制药	306

第十六章 前列腺素衍生物	313
第十七章 高渗脱水药	326
一、全身高渗脱水药	327
二、眼局部高渗脱水药	330
第十八章 青光眼视神经保护药物	332
一、钙离子通道阻滞药	332
二、兴奋性毒素和 NMDA 受体拮抗药	342
三、神经生长因子	344
四、一氧化氮途径的抑制药	345
五、抗氧化药	345
六、中草药视神经保护作用的研究	345
第十九章 抗青光眼滤过术的辅助药物	348
一、抗代谢药物	348
二、其他类药物	354
第二十章 扩瞳药和睫状肌麻痹药	358
第二十一章 影响凝血系统和血管的药物	368
一、抗凝血药和溶血栓药	368
二、促凝血药和止血药	378
三、血管扩张药	383
第二十二章 眼科手术用药	389
一、局部麻醉药	389
二、手术前用药	395
三、术中用药	408
四、术后用药	412
第二十三章 影响眼组织代谢的药物	414
一、维生素类	414
二、微量元素	423
三、酶及生物制品	426
第二十四章 防治白内障的药物	432
一、概述	432
二、防治老年性白内障药物	432
三、防治糖尿病性白内障药物	436
四、后发性白内障的药物防治	438
五、防治白内障的中成药	440
第二十五章 生长因子	442
第二十六章 其他类药物	453
一、消毒防腐药	453
二、促进吸收药	459
三、螯合剂	461
四、染色剂	464
五、组织黏合剂	467

第一章 感染性眼表疾病的药物治疗	471
一、细菌性角膜炎的药物治疗.....	471
二、真菌性角膜炎的药物治疗.....	476
三、病毒性角膜炎的药物治疗.....	480
四、棘阿米巴性角膜炎的药物治疗.....	481
第二章 非感染性眼表疾病的药物治疗	483
一、结角膜变性疾病的药物治疗.....	483
二、过敏性结膜炎的药物治疗.....	485
三、蚕蚀性角膜溃疡的药物治疗.....	487
四、角膜移植术后免疫排斥反应的药物治疗.....	488
第三章 干眼的药物治疗	490
一、概述.....	490
二、治疗干眼的常用药物.....	491
三、各种类型干眼症的治疗原则.....	498
第四章 眼化学烧伤的药物治疗	504
一、眼化学烧伤的治疗.....	504
二、眼化学烧伤药物的新进展.....	514
第五章 抗青光眼药物的联合应用	517
一、概述.....	517
二、青光眼药物治疗要点与趋势.....	517
三、主要降眼压药物.....	518
四、青光眼的药物联合治疗.....	519
五、采用联合药物治疗的注意事项.....	522
第六章 改善视网膜微循环障碍的药物	524
一、微循环概述.....	524
二、视网膜微循环障碍的原因.....	524
三、眼微循环障碍的表现.....	526
四、改善视网膜微循环的药物.....	526
第七章 增生性玻璃体视网膜病变的药物治疗	535
一、病理和药物治疗原则.....	535
二、药物治疗.....	538
三、结语.....	543
第八章 黄斑部疾病的药物治疗	545
一、黄斑病理生理学特点.....	545
二、光学相干断层扫描在黄斑病变检查中的作用.....	546
三、治疗黄斑病变的常用药物.....	546
四、常见黄斑病变的药物治疗.....	550
第九章 病毒性视网膜炎的药物治疗	556
一、急性视网膜坏死综合征的药物治疗.....	556

二、巨细胞病毒性视网膜炎的药物治疗	560
第十章 视神经疾病的药物治疗	566
一、视神经乳头炎、球后视神经炎的药物治疗	566
二、视乳头血管炎的药物治疗	568
三、缺血性视神经病变的药物治疗	568
四、外伤性视神经病变的药物治疗	570
五、视乳头水肿的药物治疗	571
六、视神经萎缩的药物治疗	571
七、Leber 病的药物治疗	572
八、中毒性视神经病变的药物治疗	573
九、视神经病变的常用药物	574
第十一章 眼眶疾病的药物治疗	582
一、眼眶病概述	582
二、眼眶病药物治疗	584
第十二章 葡萄膜炎的药物治疗	594
一、糖皮质激素	595
二、免疫抑制药	596
三、生物制剂	599
四、非甾体抗炎剂	600
五、睫状肌麻痹剂	601
六、葡萄膜炎常见并发症治疗	602
七、常见葡萄膜炎类型的建议治疗方案	603
第十三章 近视的药物治疗	605
一、近视概述	605
二、近视的药物治疗原则	605
三、近视的药物治疗	606
四、可能用于治疗近视的新药	615
五、治疗近视药物开发中应注意的问题	616
第十四章 眼部肿瘤的药物治	619
一、视网膜母细胞瘤 (Retinoblastoma, RB)	619
二、葡萄膜恶性黑色素瘤	621
第十五章 新生血管性眼病的药物治疗	623
一、新生血管性眼病的概述	623
二、常见新生血管性眼病	624
三、新生血管性眼病的药物治疗	624
第十六章 眼内感染的药物治疗	630
一、致病微生物	630
二、临床表现与诊断	630
三、药物治疗	631
四、治疗效果	633
第十七章 眼科疾病的基因治疗	634
一、引言	634
二、基因治疗的策略与方法	634

三、基因治疗角膜病变·····	638
四、基因治疗色素膜病变·····	640
五、基因治疗视网膜病变·····	641
六、基因治疗青光眼·····	643
七、基因治疗眼肿瘤·····	645
八、基因治疗的前景与挑战·····	648
第十八章 肉毒毒素在眼科的应用·····	653
一、肉毒毒素应用的历史·····	653
二、肉毒毒素的药理学·····	653
三、A 型肉毒毒素治疗斜视的临床应用·····	656
四、肉毒毒素在其他眼科疾病中的应用·····	664
五、肉毒毒素的免疫反应·····	667
六、结语·····	667

第四篇

671

药源性眼病

第一章 概述·····	673
一、眼组织在机体器官中所居的特殊地位·····	673
二、药源性眼病的历史回顾·····	673
三、对药源性眼病研究的重视·····	674
第二章 引起药源性眼病的主要药物·····	675
一、中枢神经系统药物·····	675
二、心血管系统药物·····	676
三、糖皮质激素（详见有关篇章）·····	678
四、非甾体激素抗炎药·····	678
五、口服避孕药·····	679
六、化疗药物·····	680
七、其他药物·····	685
八、孕期用药可能引起先天性眼畸形的药物·····	685
九、结语·····	687
附录·····	689
一、药物浓度与计量的计算·····	689
二、药物的比例浓度与百分比的关系·····	690
三、法定计量单位·····	690

第一篇

总 论

1 Posts

第一章 眼科药物治疗学发展史和研究范畴

第二章 药物对机体及眼的作用

第三章 药物的眼内过程

第四章 滴眼剂的眼内药代动力学

第五章 影响药物作用的因素

第六章 眼用药物剂型

第七章 眼科新药临床研究

第一章

眼科药物治疗学发展史和研究范畴

一、眼科药物治疗学的发展史

在古代(约公元前1000年),国外主要用蓝铜矿、绿青、硫酸铜、硝酸盐、蜂蜜等治疗各种眼病。Cajus Plinius Secmidus(公元23~79年)在其名著《自然史》(Naturalis Historia)中,记述了用Anagallidis的汁液滴眼有散瞳作用。公元1世纪,希腊人Pedanius Dioscorides在其药理学著作中记述了可用白色、金黄色和网状三种曼陀罗(*Hyoscyamus albus, aureus, reticulatus*)作为眼炎的镇痛剂。古代也有用罂粟汁等作为镇痛的记载,还有应用许多矿物药,如氧化亚铅、氧化铁等的记述。

我国古代眼科药物发展较早,如先秦古书《山海经》中收载药百余种,其中记载有冉遗之鱼、植楮等7种可以治疗眼病的动植物;《神农本草经》是我国最早也是全世界第一部药理学著作,成书于公元1世纪前后,收载药物365种,其中眼科药物70多种(包括明目药40余种,治疗眼病药30余种),书中所载的黄连、秦皮等,至今仍是中医眼科的常用药物。治疗眼病的主治药物有:①青盲——空青、决明子、菟实等;②目痛、目赤痛——石胆、黄连、决明子等;③目翳——长石、瞿麦、秦皮等;④伤眦——黄连等;⑤泪出、多涕泪——菊花、决明子、苦参、白芷等;⑥眼赤白膜——决明子、秦皮等;⑦风邪目盲——防风等;⑧目瞑——伏翼等;⑨目欲脱——菊花等;⑩面目浮肿——葱实、蓼实、郁李仁、泽泻等。隋末唐初孙思邈所著的《千金翼方》(公元652年)中记载了明目药55种、止泪药15种、治赤痛药15种、通九窍药6种,既有内服药,也有外用药,还介绍了洗眼法、滴眼法等局部用药方法。内服药主要为含维生素丰富的营养药,外用药主要有黄连、秦皮、食盐等。《备急千金要方》(简称《千金要方》)中有99个治眼病方剂,其中内服药方39个,外用药方60个,可见中国古代极为重视利用外用药治疗眼病。唐朝(公元659年)修订的《新修本草》中收载药物844种,较《神农本草经》增加药物479种,所增药物中明目药30余种,治疗眼病药20余种。如龙脑香明目去目赤翳,诃梨勒实核治风赤眼痛等。历代药物学家对本草都有新的增补,1596年(明代)李时珍著《本草纲目》,收载药物1892种,眼科药物400多种,其中明目药120余种、治疗用药300余种,并附有历代名方和作者经验良方,表明明代的眼科药物治疗已有很大发展。

John Ray(1686)首先记述了当颠茄叶用于邻近眼旁的小脓肿时,可引起瞳孔散大。约100年后,分别有3个独立的报道推荐将其用于白内障摘除术。

Mein(1831)提取出阿托品,并于1856年用于治疗虹膜炎;1863年Thomas Fraser发现毒扁豆浸出液可引起瞳孔收缩,次年Jobst和Hesse分离得生物碱,定名毒扁豆碱(又名依色林),被Laqueur(1875)用于治疗青光眼;1871年Hardy从毛茛芸香属植物叶中提取得毛茛芸香碱(又称匹罗卡品),1877年Weber描述了本品对瞳孔、汗腺和唾液腺的作用,将其引用于眼科治疗青光眼;Niemann(1860)获得可卡因纯品,Karl Koeller(1886)首先将其用于眼科,证明了它的局麻作用等。以上均显示了近代眼科药物治疗的发展历程。

20世纪30年代磺胺类药物的合成,40年代青霉素等抗生素的相继问世,使各种感染性眼病得以很