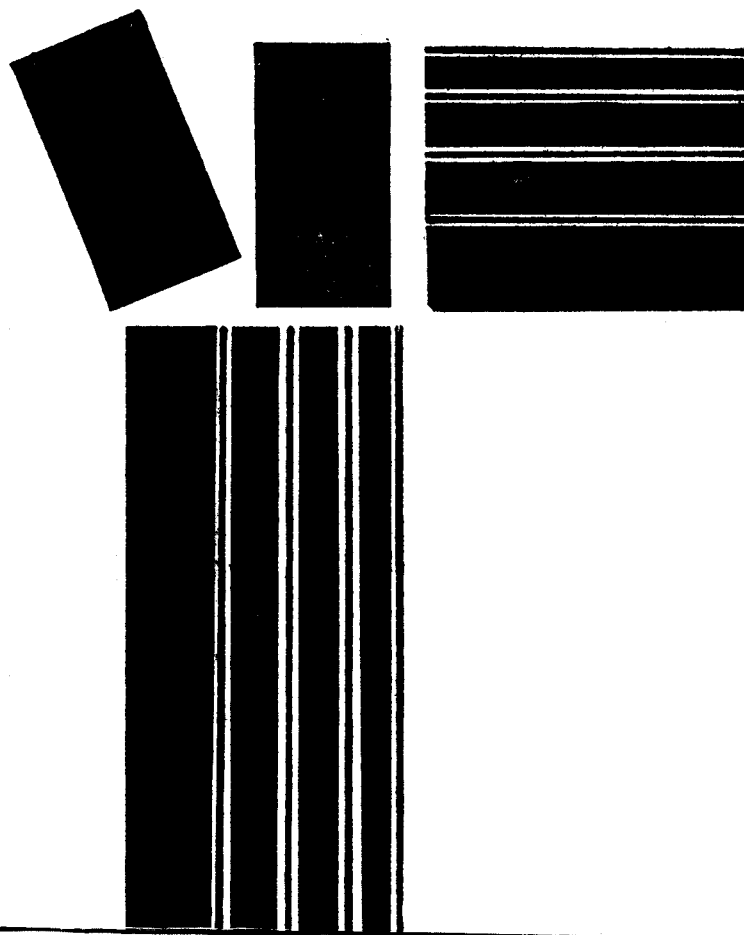


薛春生 主编  
人民卫生出版社

# 新药临床 指南



## 内 容 提 要

本书系在广泛参考国内、外文献的基础上写成的一部评介新药的专著。共收集新药244种。内容翔实、评价中肯、理论联系实际而着重临床实用。适于广大医务工作者、药学工作者、药理学教学和研究人员，以及医药院校学生参考和学习。

### 新药临床指南

薛春生 主编

人民卫生出版社出版

(北京市崇文区天坛西里10号)

北京市房山区印刷厂印刷

新华书店北京发行所发行

850×1168毫米 32开本 21<sup>1</sup>/<sub>2</sub>印张 4插页 588千字

1989年1月第1版 1989年1月第1版第1次印刷

印数：00,001—13,300

ISBN 7-117-00712-5 R·713 定价：9.15元

〔科技新书目171—154〕

**编写人名单**  
(依姓氏笔划为序)

**重庆医科大学**

李克敏 何高琴 涂植光 周歧新 薛春生

**遵义医学院**

刘国雄 孙安盛 何其真 黄燮南

**华西医科大学**

叶松柏 张尊仪 陈嘉钰 曾昭贤

**桂林医学院**

张家铨

---

## 前 言

在党中央实现“四化”的总方针指引下，近年来我国医药工业有了迅速的发展，新药不断问世。这些新药有些是我国首创的，更多的则是由国外引进的。全面地、正确地~~了解~~这些新药的药理作用和临床应用状况，对于医务工作者正确地选择和使用新药防治疾病，显然具有十分重要的意义。但是，评介新药的专书，在我国尚称缺如。这无疑会给广大临床医师造成工作上的困难。有鉴于此，我们在教学之余参考国内、外文献，编写了这本《新药临床指南》，贡献给各级医务工作者。如果它能在与疾病作斗争的过程中对医务工作者有所帮助的话，我们就将感到十分高兴了。

给“新药”下一个严格的定义是困难的。何况许多药物在国外已不成其为新药，但在我国却是新投产，许多人还不熟悉它。因此，我们只能以近十余年间在我国已投产者为限。

本书重点评介新药的药理作用和临床应用以及体内过程、不良反应和剂量、用法。正确评价新药也是一件困难的事。因为既是新药，就难免有不十分成熟之处，而且常常有不同意见和争论。对于这种情况，我们也客观地作了介绍，以便读者用药时心中有数，并供进一步研究时参考。

为了便于临床医师阅读，文中对药理作用所涉及的新的基础理论，此类药物发展的概貌等也作了扼要的阐述。

本书共收载新药 244 种，当然尚不能反映我国新药发展的全貌。如蒙读者支持，我们愿继续努力，以赶上国内新药发展的形势。

本书在编写过程中，得到人民卫生出版社的鼓励和支持，华

西医科大学王浴生教授慨允担任主审，在此一并致谢！

虽然编者等力求做到评介中肯、客观和翔实，但限于业务水平不高，经验缺乏，不当和错误之处在所难免，尚祈广大读者批评、指正！

编者 1987

## 编写说明

1. 本书所用药品正名(中文名和外文名),药典已收载者一律依药典(1985年版)。药典未收载者,中文名按《新编药理学》(第12版)、《医用药理学》(第2版)和习惯用名的顺序选择;外文正名以世界卫生组织发表的《药品国际非专利名称》(International Nonproprietary Names for Pharmaceutical Substances)为准。其余列为“别名”。本书一般不用制剂名。

2. 本书于每一药名下均有一小段提要,概括介绍该药的特点。有的章节为了介绍必要的基本理论或该类药物目前的概况,亦在该章第一个药品的提要中叙述。其下分“药理作用”、“体内过程”、“临床应用”、“不良反应”和“剂量和用法”等项叙述,而以“药理作用”和“临床应用”两项为重点。

3. 本书采用国际单位制。但为便于阅读,在正文中时间仍用中文表示,血压采用mmHg与Pa单位并列。在“剂量和用法”项下,则时间单位采用min(分)、h(小时)、d(天)、wk(周)和mon(月)。并采用处方常用拉丁缩写词:qd(每日1次)、qod(隔日1次)、bid(每日2次)、tid(每日3次)和q6h(每6小时1次)等。其余常用缩写词尚有LD<sub>50</sub>(半数致死量)、ED<sub>50</sub>(半数有效量)、MIC(最小抑菌浓度)和MBC(最小杀菌浓度)等。有时为便于读者阅读,亦用中文叙述。

# 目 录

前言	〔2〕
编写说明	〔4〕

## 第一篇 抗微生物药

第一章 头孢菌素类	1
头孢噻吩(3) 头孢噻啶(4) 头孢氨苄(6)	
头孢硫咪(9) 头孢羟氨苄(11) 头孢羟唑(14)	
头孢氨噻肟(16) 头孢氧哌唑(19)	
第二章 青霉素类	21
匹氨青霉素(22) 氧哌嗪青霉素(23) 呋苄青霉素(26)	
羧噻吩青霉素(27)	
第三章 氨基甙类抗生素	29
丁胺卡那霉素(29) 妥布霉素(31)	
第四章 氯霉素类	33
甲砒霉素(33)	
第五章 大环内酯类抗生素	35
乙酰螺旋霉素(35) 麦地霉素(37)	
第六章 其他抗生素	39
磷霉素(39) 林可霉素(41) 克林霉素(43)	
万古霉素(45)	
第七章 合成抗菌药	47
磺胺邻二甲氧嘧啶(47) 甲磺灭脓(48)	
第八章 抗结核药	50
利福平(50) 利福定(57)	
第九章 抗真菌药	59
克霉唑(59) 益康唑(61) 霉康唑(63) 酮康唑(67)	
第十章 抗病毒药	74
无环鸟苷(74) 聚肌胞(81) 干扰素(85)	

## 第二篇 抗寄生虫药

- 第十一章 驱肠虫药 .....89  
    甲苯咪唑(89) 丙硫咪唑(92) 噻嘧啶(96)  
    噻苯咪唑(99) 氯硝柳胺(103) 鹤草酚(105)  
    酚嘧啶(107)
- 第十二章 抗丝虫药 .....108  
    吡喃嘧啶(108)
- 第十三章 抗疟药 .....111  
    青蒿素(111)(附:蒿甲醚, 113) 硝喹(114) 双喹啶(117)
- 第十四章 抗滴虫病和阿米巴病药 .....119  
    甲硝唑(119)
- 第十五章 抗血吸虫病药 .....124  
    吡喹酮(124)

## 第三篇 全麻药和局麻药

- 第十六章 全麻药 .....130  
    安氟醚(130) 异氟烷(132) 氯胺酮(135)
- 第十七章 局麻药 .....138  
    甲哌卡因(138) 布吡卡因(139)

## 第四篇 主要作用于中枢神经系统的药物

- 第十八章 促进脑功能恢复的药物 .....142  
    脑复康(142) 胞二磷胆碱(144) 吡硫醇(147)  
    氯酯醒(148) 氢麦角碱(149)
- 第十九章 治疗精神病的药物 .....151  
    三氟拉嗪(151) 氟哌啶醇(154) 氟哌啶(159) 氯噻吨  
    癸酸酯(161) 舒必利(163) 泰必利(166) 氯氮平(168)
- 第二十章 抗焦虑药 .....171  
    去甲羟安定(171) 三唑安定(173) 氯羟安定(175)  
    氟安定(178)
- 第二十一章 抗抑郁药 .....180



丙咪嗪(180) 阿米替林(184) 多虑平(187)	
麦普替林(189) 米塞林(191)	
第二十二章 抗躁狂药 .....	194
碳酸锂(194)	
第二十三章 治疗锥体外系功能障碍的药物 .....	202
左旋多巴(202) $\alpha$ -甲基多巴肼(208) 溴麦亭(209)	
金刚烷胺(213) 二甲氨乙醇(215)	
第二十四章 抗癫痫药 .....	217
丙戊酸钠(217) 氯硝基安定(223) 扑米酮(226)	
抗痫灵(228)	
第二十五章 治疗儿童多动综合征的药物 .....	230
哌醋甲酯(230) 匹莫林(232)	

## 第五篇 主要作用于减轻痛症的药物

第二十六章 中枢性镇痛药 .....	234
镇痛新(234) 强痛定(236) 平痛新(248)	
双氢埃托啡(241)	
第二十七章 治疗中枢性疼痛综合征的药物 .....	243
酰胺咪嗪(243)	
第二十八章 解热镇痛消炎药 .....	247
赖氨匹林(247) (附: 精氨酸阿司匹林, 249) 痛灭定(249)	
芬布芬(252) 非诺洛芬(253) 甲灭酸(255) 炎痛喜康(257)	
萘普生(259)	
第二十九章 抗痛风药 .....	262
别嘌醇(262) 丙磺舒(266) 苯溴马隆(268)	

## 第六篇 主要作用于传出神经系统的药物

第三十章 肾上腺素 $\beta$ 受体阻断剂 .....	271
普萘洛尔(271) 萘羟心安(279) 心得静(281) 心得舒(283)	
心得平(284) 噻吗心安(286) 氨酰心安(288)	
甲氧乙心安(294)	
第三十一章 胆碱M受体阻断剂 .....	297

山莨菪碱(297) 樟柳碱(299)	
第三十二章 抗胆碱酯酶药 .....	302
腾喜龙(302) 吡斯的明(305) 催醒宁(308)	

## 第七篇 主要作用于心血管系统的药物

第三十三章 强心药 .....	310
甲基地高辛(310) 氨利酮(312) 多巴酚丁胺(315)	
第三十四章 降压药 .....	318
甲基多巴(318) 可乐定(322) 哌唑嗪(327)	
柳胺苄心定(331) 长压定(335) 降压嗪(338)	
硝普钠(341) 环轮宁(346) 甲硫丙脯酸(349)	
第三十五章 抗心律失常药 .....	356
氟卡胺(356) 室安卡因(359) 乙吗噻嗪(361)	
丙胺苯丙酮(363) 双异丙吡胺(365) 美西律(369)	
常咯啉(372) 茚满丙二胺(374) 阿吗灵(378)	
胺碘酮(379)	
第三十六章 抗心绞痛药 .....	383
双环己哌啶(383) 三甲氧苄嗪(386) 心可定(388)	
克冠草(390) 潘生丁(392) 川芎嗪(395)	
第三十七章 钙拮抗剂 .....	397
维拉帕米(397) 硝苯啶(402) 地尔硫草(406)	
粉防己碱(411)	
第三十八章 降血脂药 .....	413
氯贝丁酯(413) 益多酯(417) 非诺贝特(419)	
消胆胺(421) (附: 降胆宁, 424) 丙丁酚(424)	
糖酐酯(426) 谷固醇(428)	
第三十九章 周围血管扩张药 .....	429
环扁桃酯(429) 抗眩啶(430)	

## 第八篇 主要作用于呼吸系统的药物

第四十章 镇咳药 .....	433
双氧异丙嗪(433)	
第四十一章 平喘药 .....	434

沙丁胺醇(434) 克仑特罗(437) 六甲双喘定(440)

叔丁氯喘通(441) 异丙阿托品(443)

(附: 异丙东莨菪碱, 446) 二丙酸培氯米松(447)

第四十二章 预防哮喘发作的药物 .....449

色甘酸钠(449) 酮替芬(453)

## 第九篇 主要作用于消化系统的药物

第四十三章 治溃疡病药 .....456

西米替丁(456) 雷尼替丁(462) 哌仑西平(466)

丙谷胺(468) 溃消净(470) 甘珀酸钠(471)

第四十四章 胃肠解痉药 .....474

胃复康(474) 獐牙菜苦甙(475)

第四十五章 镇吐药 .....477

甲氧氯普胺(477) 吐来抗(482) 地芬尼多(484)

第四十六章 利胆药 .....485

去氢胆酸(485) 利胆素(486) 鹅去氧胆酸(487)

第四十七章 肝病辅助用药 .....491

门冬氨酸钾镁(491) 乳果糖(493) 齐墩果酸(495)

联苯双酯(497) 水飞蓟素(498)

## 第十篇 主要作用于泌尿系统的药物

第四十八章 利尿药 .....500

呋喃苯胺酸(500) 利尿酸(503) 丁尿胺(505)

## 第十一篇 主要作用于血液和造血系统的药物

第四十九章 溶栓药 .....509

链激酶(509) 尿激酶(514) 去纤酶(518)

第五十章 用于防治血友病出血的药物 .....520

抗血友病球蛋白(520)

第五十一章 血容量扩张剂 .....522

淀粉代血浆(522)

第五十二章 促进白细胞增生药 .....524

小檗胺(524)

## 第十二篇 激素及其有关药物和前列腺素类

- 第五十三章 甲状腺制剂 .....527  
    碘甲腺氨酸钠(527)
- 第五十四章 口服降血糖药 .....529  
    甲磺双环脲(529)
- 第五十五章 局部用皮质激素制剂 .....531  
    丙酸氯培他索(531)
- 第五十六章 女用避孕药 .....534  
    乙炔雌二醇(534) 炔诺酮(538) 醋酸甲地孕酮(541)  
    双炔失碳酯(544)
- 第五十七章 男用避孕药 .....546  
    棉酚(546)
- 第五十八章 治疗不育症的药物 .....548  
    氯米酚(548) 达那唑(551)
- 第五十九章 前列腺素类 .....555  
    前列腺素类(555)

## 第十三篇 影响免疫功能的药物

- 第六十章 免疫增强剂 .....560  
    人血丙种球蛋白(560) 胸腺素(562) 抑氨肽酶B(565)
- 第六十一章 免疫抑制剂 .....566  
    环孢素A(566)

## 第十四篇 眼科和皮肤科用药

- 第六十二章 眼科用药 .....570  
    碘磷灵(570) 托品酰胺(571) 碘苷(573) 酞丁安(575)
- 第六十三章 皮肤科用药 .....576  
    赛庚啉(576) 维甲酸类(578) 尿囊素(583)

## 第十五篇 抗肿瘤药

- 第六十四章 烷化剂 .....585

甘磷酰芥(585) 环己亚硝脒(587)	
第六十五章 抗代谢药 .....	589
磺巯嘌呤(589) 呋氟尿嘧啶(591) 阿糖胞苷(592)	
环胞苷(595) 羟基脲(597)	
第六十六章 抗生素 .....	599
正定霉素(599) 博来霉素(601) 平阳霉素(603)	
丝裂霉素C(605) 光辉霉素(607) 阿霉素(608)	
第六十七章 抗雌激素制剂 .....	612
三苯氧胺(612)	
第六十八章 杂类 .....	614
顺氯氨铂(614) 氮烯咪胺(617) 丙亚胺(619)	
门冬酰胺酶(620) 三尖杉酯碱和高三尖杉酯碱(622)	
喜树碱(624)	

## 第十六篇 其他药物

第六十九章 解毒药 .....	627
青霉胺(627) 纳络酮(632)	
第七十章 减肥药 .....	635
氟苯丙胺(635)	
第七十一章 辅酶制剂 .....	637
辅酶Q <sub>10</sub> (637) 辅酶维B <sub>12</sub> (640)	
第七十二章 防治矽肺的药物 .....	641
克矽平(641)	
第七十三章 调节电解质平衡的药物 .....	643
降钾树脂(643)	
第七十四章 用于人工流产的药物 .....	645
芫花酯甲(645) (附: 芫花酯乙, 647)	
第七十五章 诊断用药 .....	647
苯酪肽(647)	
中文药名索引 .....	651
英文药名索引 .....	660

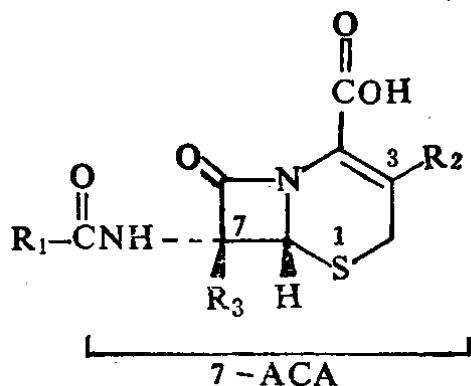
# 第一篇 抗微生物药

## 第一章 头孢菌素类

### Cephalosporins

别名 先锋霉素类

头孢菌素类和青霉素类同属  $\beta$ -内酰胺抗生素，所不同的是头孢菌素类的母核是 7-氨基头孢烷酸 (7-aminocephalosporanic acid, 7-ACA)，而青霉素的母核则是 6-氨基青霉烷酸。由于这一结构上的差异使头孢菌素能耐受青霉素酶。



头孢菌素核

在  $\beta$ -内酰胺环 7 位上的  $R_1$  用不同基团取代可影响其抗菌活性，在二氢噻嗪环 3 位上的  $R_2$  进行取代，则影响其药动学特性。

通常将头孢菌素类分为第一、二和三代。第一代是较早开发者，其特点是抗菌活性较强而抗菌谱较窄，主要用于革兰氏阳性菌感染。我国已研制成功者有头孢噻吩、头孢噻啶、头孢氨苄、头孢硫咪、和头孢羟氨苄等。第二代头孢菌素比第一代头孢菌素对革兰氏阴性肠道细菌有较强的抗菌活性，但对革兰氏阳性细菌的活性则稍弱。国内已研制成功者有头孢羟唑和头孢呋肟。第三代头孢菌素抗革兰氏阴性细菌的范围更广，对  $\beta$ -内酰胺酶有较强的抗性，对第一、二代头孢菌素抗药的细菌常对此代敏感，但抗

革兰氏阳性细菌的活性更弱。国内已研制成功者有头孢氨噻肟和头孢氧哌唑等。

头孢菌素的抗菌作用机制与青霉素相同。早期认为唯一的作用是抑制转肽酶而干扰细菌细胞壁质的合成。但近已证明， $\beta$ -内酰胺化合物还可与某些蛋白质（ $\beta$ -内酰胺结合蛋白）结合，这些蛋白质的本质可能是细胞膜上的一些酶。由此改变细菌细胞膜的通透性，抑制蛋白质合成，并释放自溶素（autolysin）。因此，有溶菌作用，或使之不分裂而成长纤维状。

抗药性的发生与细菌对抗生素的通透性降低和产生 $\beta$ -内酰胺酶有关。金葡菌产生的 $\beta$ -内酰胺酶被认为是真性青霉素酶，只灭活青霉素，不破坏头孢菌素。因此，头孢菌素对产生青霉素酶的金葡菌有效。革兰氏阴性细菌产生5类 $\beta$ -内酰胺酶，有的主要破坏青霉素，有的主要破坏头孢菌素，有的则对二者都有破坏作用。一般说来，第一代头孢菌素对多种革兰氏阴性细菌常无效。第二代和第三代的大多数头孢菌素则常有抗 $\beta$ -内酰胺酶特性，因此，对抗青霉素的菌株有效。

过敏反应是头孢菌素类最常见的不良反应，可见皮疹、荨麻疹、药热和嗜酸性白细胞增多等，偶而发生过敏性休克。因为其母核与青霉素不同，因此其抗原性亦有差异。它与青霉素的交叉过敏反应主要不是源于 $\beta$ -内酰胺环或其母核，而是决定于 $R_1$ 的取代基是否与青霉素相似。交叉过敏反应的发生率一般认为只有4~5%，也有人认为可达16%。应用头孢菌素后发生的交叉过敏反应的严重性，与该个体对青霉素过敏反应的严重性是相关的。对青霉素仅轻度过敏或仅发生迟发反应者，头孢菌素不会引起严重过敏反应。但对青霉素发生立即反应（特别是过敏性休克）者，应用头孢菌素可致严重反应。给对青霉素过敏的人应用头孢菌素总有一定的危险性，所以要做好急救的准备。

头孢菌素通常不作为首选药用。因为对敏感细菌其抗菌活性常不及青霉素等，对于耐青霉素的细菌，由于本类抗生素价格昂贵，常可采用红霉素或氯霉素等代替。

## 头孢噻吩

### Cephalothin

**别名** 先锋霉素 I，头孢娄新，噻孢霉素，Keflin

本品为最早上市而至今仍广泛应用的一种头孢菌素，是一种广谱杀菌剂。对革兰氏阳性菌有较强活性，绝大多数金葡菌（包括产酶株）、酿脓链球菌、草绿色链球菌和肺炎球菌均敏感。革兰氏阴性杆菌则较不敏感。肠球菌、产气杆菌、变形杆菌和绿脓杆菌均耐药。主要用于产酶金葡菌感染或对青霉素过敏者。供静脉注射用。

#### **抗菌作用**

本品主要对革兰氏阳性菌有较强的抗菌活性。对绝大多数金葡菌（包括产青霉素酶的金葡菌）、酿脓链球菌、草绿色链球菌和肺炎球菌的 MIC 均在  $0.62\mu\text{g}/\text{ml}$  以下。对本品敏感的革兰氏阳性菌还有厌氧链球菌、产气荚膜梭状芽胞杆菌、单核细胞增多性李司忒氏菌和白喉杆菌等。对伤寒杆菌、大肠杆菌、痢疾杆菌及其他沙门氏菌也有一定活性，MIC 多在  $5\mu\text{g}/\text{ml}$  以下。产气杆菌、变性杆菌等其他肠杆菌科细菌，以及产碱杆菌、绿脓杆菌、肠球菌等均耐药。对结核杆菌亦无效。

**体内过程** 本品口服吸收不良。肌注时吸收迅速，约 30 分钟达血清峰浓度。血浆蛋白结合率约 70%。分布容积为  $0.26 \pm 0.11 \text{ l}/\text{kg}$ 。可进入各种组织和体液，亦可透过胎盘屏障，并出现于胆汁中。但不易透过血脑屏障，即使在脑膜炎时脑脊液中药浓度也只能达到血浓度的 1%。约 60~90% 以原形经肾小管分泌入尿，其余以其去乙基代谢物排出。常用量时，尿中浓度可达数  $\mu\text{g}/\text{ml}$ 。丙磺舒可延迟其排泄。血清半衰期为 45~60 分钟。每 4~6 小时给药一次可维持有效血浓度。

#### **临床应用**

本品主要用于敏感细菌所致严重感染而患者对青霉素过敏时。这些感染包括败血症、呼吸道感染、软组织炎症、骨关节炎



症、尿路感染和心内膜炎等。

国内试用于 51 例，其中败血症 15 例，肺部感染 19 例，尿路感染 6 例，结果治愈和进步各 20 例，有效率 78.4%。未发现与其他抗生素有交叉耐药性，对多种抗生素耐药的细菌感染亦有效。

腹膜炎时本品有效。但以用氨基甙类合并氯林可霉素为佳。

国内、外都有少数用于脑膜炎的报道。因脑脊液中分布很少，不宜用本品治疗。如患者对青霉素过敏，可用氯霉素。

**不良反应** 常见者有皮疹、发热、嗜酸性白细胞增多等。过敏性休克罕见。有时可见直接 Coombs' 反应阳性，尤其常见于氮质血症者，但溶血性贫血很少发生。偶而亦可见粒细胞减少，血尿素氮和 SGOT 一过性升高。虽曾有引起实验动物肾小管坏死的报告，但临床一般肾疾患者可以耐受。因本品抗菌范围较广，不敏感菌可过度生长，以致发生二重感染。应定期作血象、肝功和肾功检查。

肌注可致严重疼痛，甚至发生无菌性脓肿和坏死。静脉注射可致血栓性静脉炎。不宜作椎管内注射。现有资料认为对孕妇和新生儿是安全的。

**剂量和用法** 静脉注射：国外常用量为 4~12g/d。国内常用 1.5~4g/d，偏低。分 4 次溶于 NaCl 或葡萄糖液中缓慢（60 分钟）静脉注射或滴注。儿童剂量为 50~100mg/kg/d，亦分次注射。

深部肌肉注射：成人 0.5~1g，每 4~6 小时一次。病情严重时可将每次量加至 2g。

肾功能障碍时应适当减量。加用丙磺舒（0.5g，qid）可延缓排泄，提高其血浓度。

（薛春生）

## 头孢噻啉

### Cephaloridin

**别名** 先锋霉素 II，头孢萎利定，Cefaloridin, Loridin