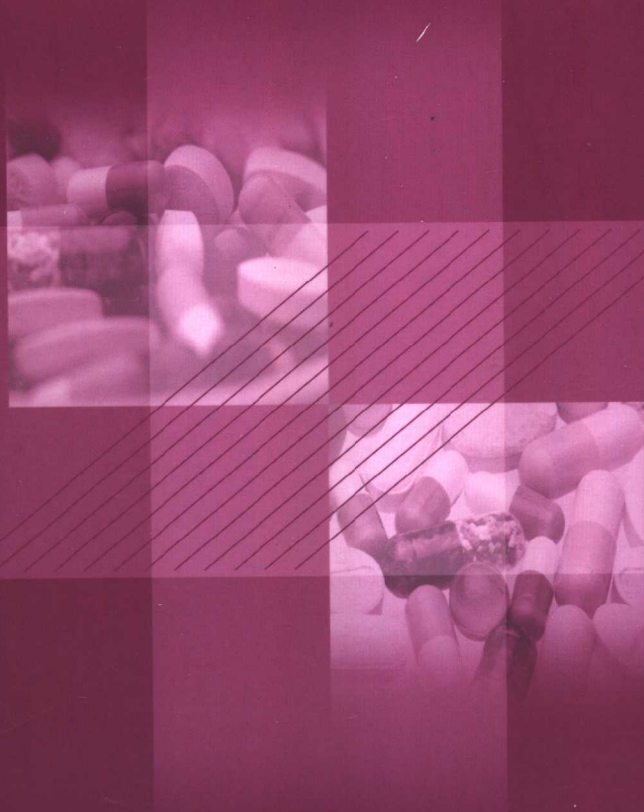


现代 临床药理学

汤光 李大魁 主编



化学工业出版社

现代生物技术与医药科技出版中心

现代临床药理学

汤 光 李大魁 主编

化 学 工 业 出 版 社

现代生物技术与医药科技出版中心

·北 京·

(京)新登字 039 号

图书在版编目 (CIP) 数据

现代临床药理学/汤光, 李大魁主编. —北京: 化学工业出版社, 2003.1

ISBN 7-5025-4130-6

I. 现… II. ①汤… ②李… III. 临床医学-药理学
IV. R97

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2002) 第 099692 号

现代临床药理学

汤 光 李大魁 主编
责任编辑: 孙小芳 余晓捷
文字编辑: 丁建华 徐延荣
责任校对: 凌亚男
封面设计: 蒋艳君

*

化学工业出版社 出版发行
现代生物技术与医药科技出版中心

(北京市朝阳区惠新里 3 号 邮政编码 100029)

发行电话: (010)64982530

<http://www.cip.com.cn>

*

新华书店北京发行所经销

北京管庄永胜印刷厂印刷

三河市东柳装订厂装订

开本 787 毫米×1092 毫米 1/16 印张 73¼ 字数 1858 千字

2003 年 5 月第 1 版 2003 年 5 月北京第 1 次印刷

ISBN 7-5025-4130-6/R·132

定 价: 140.00 元

版权所有 违者必究

该书如有缺页、倒页、脱页者, 本社发行部负责退换

京工商广临字 2003—017 号

编著者

- 汤 光 主编，北京友谊医院药剂科，主任药师，中国药学会医院药学专业委员会名誉主任委员
- 李大魁 主编，北京协和医院药剂科主任，主任药师，教授，中国药学会副理事长，医院药学专业委员会主任委员
- 李美英 原北京邮电总医院、现北京协和医院药剂科副主任，副主任药师
- 鲁云兰 北京大学第一医院药剂科，主任药师
- 李玉珍 北京大学人民医院药剂科主任，主任药师，中国药学会常务理事，药事管理专业委员会副主任委员
- 李长龄 北京大学药学院药理教研室主任，教授
- 宋友华 北京医药股份有限公司，主任药师
- 谢惠民 北京隆福医院药剂科，主任药师
- 孙忠实 海军总医院药剂科，主任药师
- 周志镔 北京安贞医院药剂科，主任药师
- 吴永佩 卫生部医院管理研究所，主任药师
- 傅得兴 北京医院药剂科，主任药师
- 袁锁中 北京铁路总医院药剂科主任，中国药学会医院药学专业委员会副主任委员，主任药师
- 汤致强 中国医学科学院肿瘤医院药剂科主任，主任药师
- 梅 丹 北京协和医院药剂科副主任，主任药师
- 张继春 北京协和医院药剂科副主任，主任药师
- 张 扬 北京中日友好医院，总工程师
- 朱 珠 北京协和医院药剂科，中国药学会医院药学专业委员会委员，教授
- 王 强 北京协和医院药剂科，主管药师
- 杜小莉 北京协和医院药剂科，药师
- 薄少英 北京中医药大学药厂，主任药师
- (杨玉彬、杨海鼎两位药师参与部分编写工作)

前 言

药物是防治疾病的主要武器，在现代医疗中占有重要的地位。由于科学的迅速发展，新药和新制剂不断出现，尤其是近年来以惊人的速度发展，许多新药被批准临床应用。治疗感染性疾病的新抗生素和抗菌药物、新的抗高血压药、抗糖尿病药、治疗阿尔茨海默痴呆的抗胆碱酯酶药以及其他各类药物都有不少新品种投入使用。

药物是在临床应用中不断发展的，一些老药也开拓了新用途。与此同时，也有相当多的药物经临床应用因性能不佳而被淘汰。药物库处在迅速不断地更新之中。

药物学不仅要记载药物的性能和应用，还必须反映发展动态，并给予客观评价，才能更好地指导合理应用药物。

为了适应药物发展和临床的要求，本书除收载了近年来的新药和新制剂外，对一些内容，采用了新的观点来加以叙述，如增设了“钙调节药”一章，对一些品种除介绍性能和应用外还做了评价。在运动员禁用药物部分引用了国际奥委会所公布的最新资料。

本书收集了西医应用的药物 1500 余种，对一些相对少用的药物则简写或列表介绍。每种药物按名称、性状、作用、体内过程、应用、注意、不良反应、相互作用和药物过量等项进行叙述。

本书对于药物性质和合理应用提供了一个总的介绍。由于目前药物制剂的品种繁多，同一药物往往有不同厂牌产品，他们的质量和特点不尽一致，本书未涉及该方面的情况。因此，在具体应用任何药品之前，应阅读产品说明书，以说明书内容为准，敬请注意。

本书编写过程中，得到了上海信谊药业有限公司、贵州益佰制药股份有限公司的支持，在此谨致谢意。

本书未尽善之处，敬请广大读者批评指正。

编者
2003 年 1 月

内 容 提 要

本书为我国著名的药学专家汤光、李大魁主编的最新著作。本书从药物作用的原理出发，对当前我国大中型医院临床使用频度最高及最新上市的 1500 余种药物，进行了全面的临床药理学内容介绍，反映了药物发展动态，并给予了安全合理用药的指导性评价。

本书融入了许多新的药理学研究成果与临床应用信息，尤其是注重药物作用新原理的讲述和药物评价的介绍，使得本书分类更加准确，内容更加贴近临床医师和药师的需要。

本书可作为临床医师、药师和医药教学、科研人员的案头参考工具。

目 录

第一章 抗生素	1
第一节 青霉素类	1
第二节 头孢菌素和头霉素类	15
第三节 β -内酰胺酶抑制剂	38
第四节 碳青霉烯类	42
第五节 氧头孢类和碳头孢类	46
第六节 单环 β -内酰胺类	49
第七节 氨基糖苷类抗生素	50
第八节 大环内酯抗生素	64
第九节 四环素类	74
第十节 氯霉素类	77
第十一节 林可胺类	79
第十二节 糖肽类抗生素	81
第二章 合成抗菌药物	85
第一节 磺胺类及甲氧苄啶	85
第二节 硝基呋喃类	88
第三节 喹诺酮类	89
第四节 噁唑酮类药物	103
第五节 其他合成的抗菌药	104
第三章 抗感染用植物药	106
第四章 厌氧菌感染用药	109
第五章 抗分枝杆菌病药	114
第一节 主要用于抗结核病的药物	114
第二节 抗麻风病和防治麻风反应药	121
第六章 抗真菌药	126
第七章 抗病毒药	137
第八章 抗寄生虫病药	151
第九章 中枢兴奋药	168
第十章 镇痛药	175
第十一章 解热、镇痛、抗炎及抗痛风药	190
第一节 解热镇痛药	193
第二节 抗炎镇痛药	207
第三节 其他抗风湿药	252
第四节 中枢性骨骼肌松弛剂	263
第五节 抗痛风药	267

第十二章	镇静、催眠、抗焦虑药	276
第十三章	抗精神病药	295
第十四章	抗抑郁症药	315
第十五章	抗帕金森病药	326
第十六章	抗癫痫药	334
第十七章	胆碱能神经系统药物	344
第十八章	益智药和大脑功能改善药	354
第十九章	麻醉药和骨骼肌松弛药	360
第一节	全身麻醉药	360
第二节	局部麻醉药	369
第三节	骨骼肌松弛药	379
第二十章	治疗充血性心力衰竭药	385
第二十一章	抗心律失常药	396
第二十二章	抗高血压药	418
第一节	利尿剂	418
第二节	血管紧张素转换酶抑制剂	421
第三节	钙通道阻滞剂	430
第四节	血管紧张素Ⅱ受体拮抗剂	438
第五节	β 受体阻滞剂	443
第六节	中枢 α 受体激动剂	446
第七节	α 受体阻滞剂	449
第八节	血管扩张药	453
第九节	酶类药物	459
第十节	其他抗高血压药	461
第二十三章	防治心绞痛药	463
第二十四章	血管舒张-循环促进药及能量激活药	482
第二十五章	抗休克药	496
第二十六章	影响血液及造血系统的药物	506
第一节	促凝血药	506
第二节	抗凝血药	516
第三节	抗贫血药	531
第四节	促进白细胞增生药	537
第五节	血容量扩充剂	544
第二十七章	血脂调节药及减肥药	549
第一节	血脂调节药	549
第二节	减肥药	569
第二十八章	呼吸系统药	572
第一节	镇咳药	572
第二节	祛痰药	578
第三节	平喘药	582

第四节	减充血剂·····	604
第二十九章	消化系统药 ·····	607
第一节	肝胆疾病用药·····	607
第二节	胃肠疾病用药·····	624
第三十章	泌尿系统药 ·····	674
第一节	利尿药·····	674
第二节	抗利尿药·····	683
第三节	脱水药·····	685
第四节	作用于泌尿系统的其他药物·····	687
第三十一章	作用于子宫的药物 ·····	690
第一节	子宫兴奋药·····	690
第二节	促进子宫颈成熟剂·····	702
第三节	抗早产药·····	703
第四节	退乳药·····	705
第三十二章	垂体激素 ·····	706
第三十三章	肾上腺皮质激素 ·····	714
第三十四章	雄激素及蛋白同化激素类药物 ·····	738
第一节	雄激素·····	738
第二节	蛋白同化激素·····	743
第三十五章	雌激素、孕激素、促性腺激素和避孕药 ·····	749
第一节	雌激素·····	749
第二节	孕激素·····	757
第三节	促性腺激素·····	763
第四节	避孕药·····	769
第三十六章	抗糖尿病药 ·····	783
第一节	胰岛素·····	783
第二节	口服降血糖药·····	794
第三节	高血糖素·····	814
第三十七章	甲状腺激素和抗甲状腺药 ·····	815
第一节	甲状腺激素·····	815
第二节	抗甲状腺药·····	818
第三十八章	抗变态反应药 ·····	822
第一节	抗组胺药·····	822
第二节	过敏活性物质阻释药·····	835
第三节	组胺脱敏剂·····	838
第三十九章	抗肿瘤药 ·····	839
第一节	抗代谢药·····	841
第二节	烷化剂·····	851
第三节	抗肿瘤抗生素·····	865
第四节	来自天然药物的抗癌药·····	877

第五节	激素类	890
第六节	杂类	895
第七节	放疗和化疗增敏剂	908
第四十章	免疫系统药物	911
第一节	免疫调节剂	911
第二节	免疫抑制药	920
第三节	抗毒血清和免疫球蛋白	927
第四十一章	钙调节药	932
第四十二章	水、电解质及酸碱平衡调节用药	944
第四十三章	维生素、微量元素及营养支持疗法用药	966
第一节	维生素类药物	966
第二节	氨基酸	979
第三节	微量元素	983
第四节	营养支持疗法用药	993
第四十四章	专科用药	1001
第一节	消毒防腐药	1001
第二节	皮肤科用药	1008
第三节	外科用药	1020
第四节	五官科用药	1025
第五节	男科用药	1032
第四十五章	解毒药	1042
第一节	金属中毒解毒药	1043
第二节	氰化物中毒解毒药	1048
第三节	有机磷类中毒解毒药	1050
第四节	其他解毒药	1053
第四十六章	预防及诊断用生物制品	1059
第四十七章	诊断用药	1067
第一节	造影剂	1067
第二节	器官功能检查及其他诊断剂	1073
第四十八章	药用附加剂	1076
附录		1080
附录 1	INN 采用的词干及其中文译名表	1080
附录 2	中国药品通用名称命名中盐(或酯)与加合物的名称	1085
附录 3	国际奥委会禁用药物类别和禁用方法	1087
附录 4	药物妊娠安全性分类索引	1091
附录 5	哺乳期妇女慎用的药物	1096
附录 6	维生素每日需要量	1100
附录 7	能使尿色改变的药物	1101
附录 8	能使粪便染色的药物	1101
中文索引		1102
英文索引		1133
声明		1161

第一章 抗 生 素

第一节 青 霉 素 类

概 说

来源 青霉素类 (penicillins) 是由青霉菌发酵提取或由 6-氨基青霉烷酸半合成制取的一类以青霉烷 (penam) 为母核的 β -内酰胺抗生素 (β -lactam antibiotics)。青霉烷由 β -内酰胺环和噻唑环组成 (参见青霉素钠的结构式)。 β -内酰胺环 6 位 C 原子上所接基团的改变可改变本类药物的抗菌性质。噻唑环上羧基具酸性, 不同药物可为游离酸 (供口服), 也可为钠、钾盐 (增加溶解度而作注射用) 以及制成不溶性盐 (延缓吸收, 延长作用时间) 和制成酯化物 (利于口服吸收) 等。

青霉素类抗生素的英文国际非专有名均有“~cillin”字尾。中文通用名, 半合成品均称“~西林”; 但系直接自培养液中提取者则称“青霉素”。

作用原理 青霉素类药物干扰细菌细胞壁的合成, 使新生的细胞壁产生缺陷而发生溶菌。这一作用是通过青霉素类作用于细菌细胞膜上的青霉素结合蛋白 (penicillin-binding protein; PBP) 而实现的。PBP 有多型, 不同细菌的细胞膜上 PBP 组成不同。不同的青霉素具有不同的 PBP 结合性质, 造成各种药物的抗菌作用差别。

细菌的耐药性 细菌主要通过产生 β -内酰胺酶 (β -lactamase) 而对本类药物耐药。此酶能使 β -内酰胺环破裂 (N_1-N_7 间键断裂) 而使抗生素失效。

β -内酰胺酶产生菌有各种葡萄球菌、流感嗜血杆菌、布拉汉菌 (卡他球菌)、大肠杆菌、肺炎克雷伯杆菌、淋球菌、各种变形杆菌、军团菌、铜绿假单胞菌、肠杆菌属 (其中包括痢疾杆菌和伤寒杆菌)、普鲁威登菌、不动杆菌、沙雷杆菌、枸橼酸杆菌以及脆弱拟杆菌等, 都可产生产酶菌株而使青霉素分解失效。

一般认为不产生 β -内酰胺酶的病原菌有各种链球菌 (包括肺炎链球菌、肠球菌等)、脑膜炎球菌、梭状芽孢杆菌属、消化链球菌、消化球菌及部分拟杆菌等。但近年也发现了若干耐青霉素菌株。

抗葡萄球菌青霉素有耐葡萄球菌所产生 β -内酰胺酶的性能, 但不耐革兰阴性菌的酶。本类药物可作为葡萄球菌产酶株感染的首选药物。

金葡菌除主要通过产酶来分解青霉素外, 还可以通过靶物质 (PBP) 改变而产生耐药性。近年来发现耐甲氧西林金葡菌 (methicillin-resistant staphylococcus aureus; MRSA)。对于抗葡萄球菌青霉素显示耐药性。MRSA 属多耐药菌株 (multiple resistant strain), 对许多常见的抗生素都耐药。国外推荐用万古霉素或利福平加 SMZ /TMP 治疗。

分类 青霉素类药物根据结构和性能, 进一步分类如下:

(1) 青霉素 G 及其不同的盐。

(2) 青霉素 V 及其盐。

(3) 抗葡萄球菌青霉素 (antistaphylococcal penicillins): 曾称为新青霉素、耐酶青霉素。主要品种有苯唑西林、氯唑西林, 国外尚用甲氧西林 (meticillin)。

(4) 氨苄西林及其酯。

(5) 抗假单胞菌青霉素 (antipseudomonal penicillins): 本类药物具有氨苄西林的广谱抗菌性能, 尚对一些假单胞菌 (包括铜绿假单胞菌) 有抗菌作用, 但不耐酶。主要品种有哌拉西林, 羧苄西林等。

(6) 美西林 (mecillinam) 及其酯: 本类药物具有一个氮杂萘环, 抗菌性能近似氨苄西林。

(7) 甲氧基青霉素类 (methoxypenicillins): 在 C₆ 位上有一个甲氧取代基, 如坦莫西林。

过敏反应 青霉素类的主要的不良反应是变态反应, 较多见的是皮疹、哮喘、药物热、血清病型反应, 也可致过敏性休克。皮疹等反应可在用药后不久或数日后出现。过敏性休克也可在连续用药过程中发生, 但常发生于用药后的短时间 (几分钟内), 且来势凶猛, 为了防止过敏性休克发生, 在使用本类药物时应做到

(1) 用药前询问病人的药物过敏史, 如病人过去有青霉素过敏史或属过敏体质者应慎重。

(2) 用药前应做皮试。凡开始用药或过去用过而间隔已有 7 日 (儿童则为 3 日) 以上者均应试验。连续用药过程中可不试验。

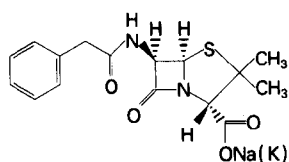
(3) 试验确认阴性者可用药, 肌肉注射后应观察病人, 过 20 min 无反应始可离去。静滴全过程中都要加强观察。遇有过敏反应发生, 应立即停药并及时救治。

(4) 少数过敏者在皮试过程中也可发生休克反应, 应予注意。

(5) 青霉素类药物均可以用青霉素钠液 (浓度 500 单位/ml) 或以所用品种的青霉素液 (浓度 300 μg/ml) 来做皮试。

(6) 口服青霉素类 (氨苄西林、阿莫西林等), 与其他青霉素有交叉过敏反应。对青霉素过敏者禁用。皮试可按青霉素钠进行。

青霉素 Benzylpenicillin



注射用青霉素钠 注射剂 0.24 g(40 万单位)/瓶;
0.48 g(80 万单位)/瓶;
0.6 g(100 万单位)/瓶
注射用青霉素钾 注射剂 0.25 g(40 万单位)/瓶

本品由产黄青霉 *Penicillium chrysogenum* 经培养产生的一种天然青霉素, 制品有钠盐和钾盐。其普鲁卡因盐和苄星盐另行叙述。

【其他名称】苄青霉素, 青霉素 G

【性状】本品为白色粉末, 极易溶于水, 几不溶于脂肪油或液体石蜡中。本品干燥时稳定, 吸湿结成团块, 粘瓶、变色并分解。水溶液在 pH5.5~6.5 较稳定, 浓溶液遇酸析出游离酸并分解, 遇碱迅速分解。

本品 1 个单位 (U, 也作国际单位 IU) 相当于 0.6 μg (0.5988 μg) 的青霉素钠。1 mg

青霉素钠 ($C_{16}H_{17}N_2NaO_4S$) 相当于 1670 单位。1 mg 青霉素钾 ($C_{16}H_{17}KN_2O_4S$) 相当于 1598 单位。每 40 万单位青霉素钠含 $Na^+0.672$ mmol 或 15.5 mg。每 40 万单位青霉素钾含 $K^+0.672$ mmol 或 26.2 mg。

【作用】青霉素的抗菌谱主要包括一些革兰阳性菌、某些革兰阴性球菌、螺旋体和放线菌。目前对青霉素较敏感（指耐药菌株相对较少）的细菌有链球菌（不包括绿色链球菌和肠球菌）、炭疽杆菌、梭状芽孢杆菌属（除难辨梭状芽孢杆菌外）、白喉杆菌、丹毒丝菌、李司德菌、脑膜炎球菌、出血败血性巴斯德菌、链杆菌、螺菌等，厌氧菌中对青霉素敏感的有多数的拟杆菌（除外脆弱拟杆菌）、梭形杆菌、放线菌、疏螺旋体、钩端螺旋体、密螺旋体等。淋球菌、嗜血杆菌、卡他球菌、葡萄球菌等的多数菌株常对本品耐药。

【体内过程】口服受胃酸破坏而吸收甚少。按治疗量注射可达有效的血浓度。肌肉注射 600 mg 钠盐（相当于 100 万单位），于 15~30 min 达峰，血浆药物浓度为 $12 \mu\text{g}$ (20 单位)/ml。消除半衰期为 0.5 小时。体内分布以肺、肾、横纹肌和脾内浓度高；也可进入浆膜腔、关节腔、胆汁和胎儿循环；在骨胎、母乳、唾液、脓液中的浓度低；较难透过正常人血脑屏障，但在脑膜发炎时则可透入，但需加大用量，以提高中枢组织中浓度。

【应用】适用于上述敏感菌所致的呼吸道、腹腔（包括胆道）、妇科、泌尿生殖系、中耳、咽喉等部位的感染，以及猩红热、白喉、败血症等。

成人 肌注：适用于轻症感染，每次 80 万单位，每日 2~4 次。静脉给药适用于中或重症感染。根据感染程度，每日剂量 400 万~1000 万单位，最多可达每日 2000 万单位，分次给予。将一次剂量溶于 50~100 ml 0.9% 氯化钠液或注射用水中滴注，也可加入茂菲滴管中随输液进入。

儿童 肌注（较轻感染）：每日 2.5 万~5 万单位/kg，分 3~4 次。静脉给药（较重感染），每日 5 万~20 万单位/kg，分 2~4 次用。

新生儿（足月产） 肌注或静脉给药：每次 5 万单位/kg，2 日龄前每 12 小时给上量 1 次。3 日龄至 12 周龄者每 8 小时给上量 1 次。超过 12 周龄者每 6 小时给上量 1 次。

早产婴儿 肌注或静脉给药：每次 3 万单位/kg，1 周龄前，每 12 小时给药 1 次。2~4 周龄者每 8 小时给药 1 次。4 周龄以上者每 6 小时给药 1 次。

肾功能不足者 肾小球滤过率 (GFR) 为 10~15 ml/min 者，剂量减少 25% 或延长给药间隔时间 0.5 倍（若原为 8 小时 1 次则延长为 12 小时 1 次）；GFR 少于 10 ml/min 者，剂量减为正常量的 $\frac{1}{4}$ ~ $\frac{1}{2}$ 或给药间隔改为 12~18 小时 1 次。一般地说，肾功能轻度或中度不足者可不调整，按正常剂量和时间间隔应用。

青霉素在注射用水和 0.9% 氯化钠液中较为稳定，但也必须在临用前溶解，避免溶解后放置，以减少分解。5%~10% 葡萄糖液中含有少量酸 (pH3.3~5.5)，青霉素在低 pH 的药液中迅速分解（约可损失 15%~20%），应该避免配伍。至于在碱性液（如碳酸氢钠注射液）中，青霉素分解更迅速，可损失大部分效价。一般在青霉素液中不应添加其他药物。肌注青霉素可用 0.5% 盐酸利多卡因注射液作溶剂。

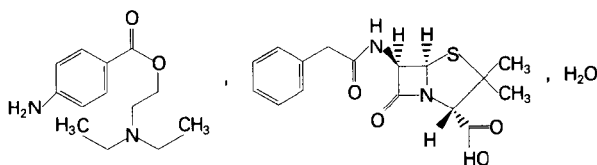
【注意】①用前做青霉素皮试，阳性反应者禁用。②大剂量青霉素可致青霉素脑病（症状为肌肉痉挛、抽搐、昏迷等）及精神病、癫痫发作，此反应多见于幼儿、老年人、肾功能衰退者或有癫痫病史者。③青霉素类药物可干扰碱性酒石酸铜试液（菲林试液）检测葡萄糖的反应，出现假阳性结果。


【相互作用】①丙磺舒可阻滞本品的肾小球滤过排泄。口服丙磺舒每次 0.5 g，每日 4 次

可使本品的血浓度升高1~2倍。②一般认为氯霉素、红霉素、四环素类、林可霉素类、磺胺类等抑菌药物可减弱青霉素的杀菌作用而不宜合用。但是在脑膜炎球菌性脑膜炎时常需用磺胺嘧啶钠配合青霉素治疗；流感嗜血杆菌性脑膜炎时联合应用青霉素和氯霉素。③氨基糖苷类与青霉素类置同一注射器皿中可发生分解反应，宜分开给药。④大剂量青霉素有抑制血小板聚集的作用，故可加强抗凝药的作用。

【评价】青霉素（尤其是钾盐）肌注后可引起局部疼痛，因此常在注射时添加局麻药。曾经使用过的2%苯甲醇注射液，因可引起局部肌肉挛缩硬结，现已不再提倡使用。可应用0.9%氯化钠注射液来溶解青霉素钠盐。如必要添加局麻药，可考虑使用0.5%盐酸利多卡因注射液来作溶剂。静注和静滴的药液中禁止添加任何局麻药。

普鲁卡因青霉素 Procaine Benzylpenicillin



 注射用普鲁卡因青霉素
注射剂 40万单位(含普鲁卡因青霉素30万单位，青霉素钠10万单位)/瓶；80万单位(比例如上)/瓶

本品为青霉素与普鲁卡因结合而成的盐，制品为一水合物。

【其他名称】青霉素普鲁卡因

【性状】本品为白色微晶性粉末；微溶于水，制品中加有助悬剂，加水振摇成外观乳白色的混悬液。本品遇水后不稳定，应立即使用，不可保存。


【体内过程】肌注后药物在局部缓慢吸收水解释放青霉素，药物达峰时间为1~4小时，有效浓度可维持12~24小时，但血药浓度较低。

【应用】适用于慢性扁桃体炎、轻型链球菌性肺炎、奋森咽峡炎、钩端螺旋体病、虱传回归热、早期梅毒等。

肌注：每次40万~80万单位，加适量注射用水，振摇成混悬液，用粗针头注入深部臀肌内。每日1~2次。

【注意】①用前应按照规定做青霉素皮试。②对普鲁卡因过敏者对本品也过敏。③个别病人应用本品后可出现自觉心里难受、眩晕、耳鸣、心悸、血压升高、幻觉，有濒危恐惧感，甚至发热、抽搐、昏迷等。此种症状发生在注射当时或注后1~2min内。病人自觉症状明显突出而阳性体征相对较少，一般无呼吸障碍和循环障碍。而多数患者有血压升高（与过敏性休克相鉴别）。遇有此反应可肌注抗组胺药（苯海拉明或氯苯那敏）或用镇静药，预后良好。

苄星青霉素 Benzathine Benzylpenicillin

 注射用苄星青霉素 注射剂 60万单位/瓶；120万单位/瓶

本品为青霉素（酸）与二苄基乙二胺（碱）结合的盐，制品为一水合物。

【其他名称】长效青霉素，青霉素苄星盐

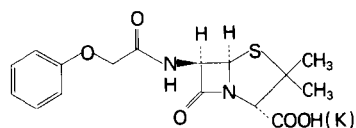
【性状】本品白色结晶性粉末，极微溶于水。

【体内过程】肌注给药，本品在局部缓慢水解释放青霉素而起作用，达峰时间约为24小时，可维持有效血浓度4周。至12周，尚可在尿中检出。本品在胃液中稳定，故可口服给药，1次口服可维持有效血浓度达6小时。

【应用】用于控制链球菌感染流行和预防风湿热。临用前加灭菌注射用水制成混悬液，成人1次量60万~120万单位，每2~4周1次，用粗针头注入臀肌深部。

【注意】首次应用应做青霉素皮试。间隔20日后再用应重做皮试。

青霉素 V Phenoxymethylpenicillin



青霉素 V 钾片 片剂 125 mg(20 万单位)/片

本品（钾盐）为半合成青霉素，具有耐酸性质，但不耐酶。

【其他名称】Penicillin V Potassium，苯氧甲基青霉素钾

【作用】与青霉素钠（钾）相同。

【体内过程】口服在胃中不分解，与餐同用其吸收略高于空腹，约吸收60%。在体内，80%与血浆蛋白结合。肾和尿液中浓度最高；其次则为肝、皮肤、小肠；在脑脊液中的浓度很低；可进入羊水中。药物由肾排泄，肾功能受损者、新生儿或幼儿则排泄速率减慢。

【应用】参见青霉素。主要用于链球菌、肺炎链球菌引起的呼吸道感染、猩红热及不产酶金葡菌引起的轻症感染，也可用于心内膜炎或风湿热的预防。

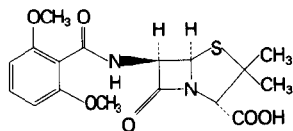
成人（包括>12岁的儿童）口服：轻度感染每次125 mg，每日3~4次；中度感染每次250 mg，每日3次；咽炎及呼吸道感染每次250~500 mg，每日3~4次。

儿童 口服：每日15~50 mg/kg，分3~6次用。

预防用 口服：每次125 mg，每日2次。

【注意】青霉素过敏及过敏体质者禁用。其余参见青霉素。

甲氧西林 Methicillin



注射用甲氧西林钠 注射剂 0.5 g/瓶；1g/瓶

【其他名称】甲氧苯青霉素，Methicillin，新青 I

【作用】本品（钠盐）为第一个半合成的抗葡萄球菌青霉素，有耐抗金葡菌（及其他葡萄球菌）产生的青霉素酶的性质，因此曾用作葡萄球菌感染的治疗药，但现已少用。

本品的重要性在于国外以本品作为抗葡萄球菌青霉素的代表药物。因为细菌对本类药物具有交叉的敏感性和交叉的耐药性。金葡菌主要通过产酶机制来分解一般青霉素（本类药物有耐酶性能）。但近来也发现了金葡菌可通过非酶机制（靶物质改变）而对本类药物耐药。这样的菌株称为耐甲氧西林金葡菌（methicillin-resistant staphylococcus aureus; MRSA），同

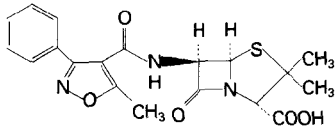
样还有耐本品的表皮葡萄球菌 (MRSE)。可以有产酶的 MRSA 或 MRSE, 也可有不产酶的 MRSA 和 MRSE。

【应用】参见苯唑西林。

本品只供注射, 每次 1 g, 每 4~6 小时 1 次, 肌注、静注或静滴。至多每日用 12 g。

【注意】参见青霉素, 本品偶可引起间质性肾炎, 现已少用。

苯唑西林 Oxacillin



苯唑西林胶囊 胶囊剂 250 mg/粒

注射用苯唑西林钠 注射剂 500

mg/瓶;

1000 mg/瓶

【其他名称】苯唑青霉素钠, 新青 II

本品 (钠盐) 为半合成的抗葡萄球菌青霉素, 制品为一水合物。本品游离酸也可供口服。

【性状】本品为白色结晶性粉末, 有特异臭, 味苦; 易溶于水, 水溶液 pH 为 5~7。

本品以苯唑西林计量, 制品 (或处方) 苯唑西林钠 1 g 内含苯唑西林 (C₁₉H₁₉N₃O₅S) 纯品 1 g; 含钠量为 53 mg (2.3 mmol)/g。

【作用】本品的抗菌谱类似青霉素。特点是有耐抗金葡菌及其他葡萄球菌所产生的青霉素酶的能力, 适用于葡萄球菌产酶株所引起的感染。本品对于不产 β-内酰胺酶的链球菌属 (包括各型链球菌、肺炎链球菌、肠球菌等)、梭状芽孢杆菌属、消化球菌、消化链球菌、脑膜炎球菌以及口腔拟杆菌等也有抗菌作用。

【体内过程】本品有耐酸性质, 口服可吸收, 但不完全。胃内食物可阻碍本品的吸收, 空腹口服 500 mg, 1 小时血中浓度为 3~6 μg/ml。肌注 500 mg, 半小时血中浓度为 15 μg/ml, 剂量加倍, 血药浓度也加倍。蛋白结合率 93%; 体内主要分布于周围各脏器和体液中, 也进入胸水、滑液和骨组织中, 并可透过胎盘, 也可进入乳汁, 但不透过健康脑膜。有 20%~40% 药物以原形或代谢物形式自尿排泄, 也有部分由胆汁排泄。健康者的半衰期为 0.5 小时, 新生儿则延长。

【应用】应用于葡萄球菌产酶株所引起的呼吸道、胆囊、腹腔、妇科、尿路、皮肤及软组织、骨和关节等部位感染以及菌血症等。

成人 口服: 适用于轻症感染, 每次 0.5~1 g (游离酸), 空腹服下, 每日 3~4 次。注射给药 (用钠盐) 适用于轻、中或重症感染, 每次剂量为 0.5~2 g, 每日 3~4 次, 肌注、静注或静滴 (静滴时将一次剂量溶于输液 100 ml 中, 滴注 1 小时)。

儿童 肌注、静注或静滴: 每次 12.5~25 mg/kg, 每 6 小时 1 次。

新生儿 (体重 < 2 kg) 肌注或静滴: 每次 25 mg/kg, 每日 2 次。

早产儿 肌注或静滴: 每日 25 mg/kg, 分 2 次给予。

肾功能轻度或中度不足者 可按正常量给予; 重度不足者酌减用量。

本品对弱酸稳定, 可用氯化钠溶液或葡萄糖液作溶剂溶解注射。

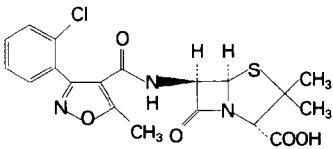
【注意】① 注射前应做青霉素皮试, 阳性反应者禁用。② 大剂量应用对肝、肾可能引起损害, 引起血清谷丙转氨酶值升高、血尿及蛋白尿等, 并可能引起神经毒性, 停药可恢复。

③ 与氨基糖苷类配伍可致效价下降, 与四环素类配伍产生沉淀。

【相互作用】丙磺舒可抑制本品排泄，提高血浓度而增效。

【评价】20世纪60年代，葡萄球菌对青霉素耐药的主要方式是产酶使青霉素分解。后来，一些半合成青霉素，如甲氧西林、苯唑西林对金葡菌所产生的 β -内酰胺酶有抵抗能力，在当时对金葡菌所致的感染有良好作用，因此称为抗葡萄球菌青霉素（anti-staphylococcal penicillins），此名词沿用至今。但到20世纪80年代后，葡萄球菌对青霉素类的耐药性有了新的发展，发现了非酶机制的耐药性。细菌靶物质（PBP）的改变，产生了耐甲氧西林金黄色葡萄球菌（meticillin-resistant staphylococcus aureus, MRSA），致使青霉素、头孢菌素等 β -内酰胺类对此类菌不再有效。目前此种耐药菌所致感染约占葡萄球菌感染总数的半数以上，苯唑西林类虽已少用，但在治疗葡萄球菌产酶株引起感染方面仍占一定地位。

氯唑西林 Cloxacillin



注射用氯唑西林钠 注射剂 250 mg/瓶；
500 mg/瓶

氯唑西林胶囊 胶囊剂 250 mg/粒

本品为半合成的抗葡萄球菌青霉素，制品为氯唑西林钠一水合物。本品的游离酸也可供口服用。

【其他名称】邻氯青霉素钠

【性状】本品（钠盐）为白色结晶性粉末，味极苦；易溶于水（1:2.5），有较强的引湿性；10%水溶液 pH 为 5~7。

本品制品以氯唑西林计量。处方氯唑西林钠 1 g 含氯唑西林纯品 1 g；含钠量为 48.3 mg (2.1 mmol)/g。

【作用】本品的作用性质类似苯唑西林。

【体内过程】本品口服吸收不完全，食物可妨碍其吸收。空腹服用 500 mg，于 1~2 小时内血药浓度达峰值，为 7~14 $\mu\text{g}/\text{ml}$ 。肌注 500 mg 后 30 min，血药浓度值为 15 $\mu\text{g}/\text{ml}$ 。剂量加倍，血药浓度值也相应加倍。蛋白结合率 94%。体内部分代谢。35% 药物以原药和代谢物形式自尿排泄，10% 自胆汁排泄。其他均与苯唑西林同。

【应用】适应证参见苯唑西林。

轻症 口服（空腹）：每次 0.25~0.5 g，每日 4 次

肌注：每次 0.25 g，每日 4~6 次（或 0.5 g，每日 3 次）。

重症 静滴或静注：每次 1 g，每 4~6 小时 1 次。

本品也可注射入胸腔（每次用量 0.5 g，溶于 10 ml 溶剂中）。吸入用：每次 125~250 mg，溶于注射用水 3 ml，每日 4 次。

2 岁以下儿童用量按成人量的 1/4，2~10 岁儿童按成人量 1/2 给予。新生儿与早产儿用量参照苯唑西林用量。

本品可用注射用水、0.9% 氯化钠液、5%~10% 葡萄糖液作溶剂。肌注时也可用 0.25% 盐酸利多卡因注射液溶解，以减轻局部疼痛。

其他均参见苯唑西林。