

人药口品佳木

# 镇咳祛痰平喘药物

上海科学技术出版社

《药品集》分册之三

镇咳、祛痰、平喘药物

上海医药工业研究院主编

上海科学技术出版社出版

(上海瑞金二路 450 号)

新華書店上海发行所发行 江西印刷公司印刷

开本787×1092 1/16 印张9.5 字数228,000

1979年5月第1版 1979年5月第1次印刷

印数 1—100,000

书号：14119·1368 定价：0.94元

新華書店

## 编 写 说 明

一、《药品集》是一本基本反映国内外药物品种面貌的参考书，所收载品种主要是国内外医疗中应用的药物，某些临床研究中疗效较好、有发展前途的新品种也予收入，仅有动物试验而未临床试用者，一般不予收载。此外，少数药物目前虽已少用或不用，但在文献中经常提及，为便于查阅了解与参考起见，也酌情收入。全书收载药品四千二百余种，采取分册形式陆续出版。本分册为《镇咳、祛痰、平喘药物》，收载药品计二百三十八种。

二、本书取材主要来自国内外新近出版的大型药物手册、药理手册及部分近期期刊和资料。主要参考书统一列于书末，近期期刊及资料种类繁多，不一一列出。

三、全书所收载的中、西药物基本上均按用途分类，一药多用者，除在主要类别中全面叙述外，在其他类别中也予以分述，并注明参见。

四、本书仅收载单一品种，复方不予收载。每类药物之前有一概述。每一药物的编写内容有：1.中外文名称；2.化学名称；3.结构式（无结构的写药物来源）；4.性状；5.作用与用途；6.不良反应与禁忌；7.参考剂量等。在作用与用途一项内简要地介绍药理作用、临床用途、特点及可能作出的评价。所引述的剂量仅供参考。

五、本书收载药物的命名原则是：1.已有通用中文名称的，尽可能沿用，不另取名；2.原有名称实在不妥，需另行命名的，其通用名置括号内列于正名之后；3.无中文名称需命名的，原则上按化学名称的重点字头组成药名，并考虑同类药物名称的系列化，应用相同的词头、词干或词尾，有的采用音译结合治疗作用命名。

六、为了便于检索，各分册后面均附有中文和外文索引。

# 目 录

## I、镇 咳 药

北京制药工业研究所编写

上海医药工业研究院校订

概 述 .....	1
<b>一、中枢性镇咳药 .....</b>	<b>4</b>
(一)成瘾性镇咳药 .....	4
1. 吗啡(Morphine) .....	4
2. 可待因(Codine) .....	4
3. 乙基吗啡(Ethylmorphine) .....	5
4. 二氢可待因(Dihydrocodeine) .....	5
5. 乙酰可待因(Thebacon) .....	6
6. 二氢可待因酮(Hydrocodone) .....	6
7. 氢化吗啡酮(Hydromorphone) .....	7
8. 吗啉吗啡(Pholcodine) .....	7
9. 羟甲吗喃醇(Drotebanol) .....	8
(二)非成瘾性镇咳药 .....	8
10. 右羟吗喃(Dextrorphan) .....	8
11. 右甲吗喃(Dextromethorphan) .....	9
12. 二甲吗喃(Dimemorfan) .....	9
13. 环丁羟吗喃(Butorphanol) .....	10
14. 氨苯已酮(Normethadone) .....	10
15. 苯哌丙醇(Diphepanol) .....	11
16. 氯苯胺丙醇(Clofedanol) .....	11
17. 氯苯胺丁醇(Cllobutinol) .....	12
18. 异丙苯戊腈(Isoaminal) .....	12
19. 左旋朴嗽芬(Levopropoxyphene) .....	13
20. 咳美芬(Caramiphen) .....	13
21. 咳必清(Pentoxyverine) .....	14
22. 咳乃定(Oxeladin) .....	14
23. 咳息定(Butamirate) .....	15
24. 咳吩嗪(Dimethoxanate) .....	15
25. 咳噬坦(Pipazetate) .....	16
26. 咳吗宁(Promolat) .....	16
27. 咳吡喃(Fedritate) .....	17
28. 双丁萘磺钠(Sodium dibunate) .....	17
29. 双丁萘磺乙酯(Ethyl dibunate) .....	18
30. 二苯溴铵(Bibenzonium bromide) .....	18

31. 吡哌乙胺(Picoperine) .....	18
32. 氯苯息定(Cloperastine) .....	19
33. 丙烯氯苯胺(Alloclamide) .....	19
34. 双苯哌丙酮(Eprazinone) .....	20
35. 双苯哌丙醇(Zipeprol) .....	21
36. 羟苯哌嗪(Dropropizine) .....	21
37. 胺酰苯吗啉(Fominoben) .....	22
38. 胺甲氧芬噪(Oxomemazin) .....	22
39. 吗啉双苯酮(Morclofone) .....	23
40. 五甲哌丙胺(Pemerid nitrate) .....	23
41. 乙哌双酮(Dihyprylone) .....	23
42. 四甲阿卜啡(Glaucine) .....	24
43. 双噻哌啶(Tipepidine) .....	24
<b>二、末梢性镇咳药 .....</b>	<b>25</b>
(一)局部麻醉性镇咳药 .....	25
44. 退嗽(Benzonataate) .....	25
45. 二苯哌丙烷(Benproperine) .....	26
46. 哌乙噁唑(Libexin) .....	26
47. 胺乙噁唑(Oxolamine) .....	27
(二)支气管解痉性镇咳药 .....	27
48. 那可汀(Noscapine) .....	27
49. 氢化可可宁(Hydrocotarnine) .....	28
(三)粘膜保护性镇咳药 .....	28
50. 甘草流浸膏 .....	28
<b>三、中草药来源的镇咳药 .....</b>	<b>29</b>
51. 杏 仁 .....	29
52. 枇杷叶 .....	29
53. 百 部 .....	29
54. 半 夏 .....	30
55. 胆 汁 .....	30
56. 止咳酮 .....	30
57. 木犀草素(Luteolin) .....	31
58. 杜鹃酮(Germacrone) .....	31
59. 矮茶素(Bergenin) .....	32

30. 浙贝母	32	62. 咳宁醇(Pinitol)	33
61. 川贝母	32		

## II、祛痰药

北京制药工业研究所编写

上海医药工业研究院校订

### 概 述 ..... 34

### 一、恶心性祛痰药 ..... 36

1. 氯化铵(Ammonium chloride) ..... 36
2. 醋酸铵(Ammonium acetate) ..... 36
3. 碘化钾(Potassium iodide) ..... 37
4. 吐根(Ipecacuanha radix) ..... 37
5. 酒石酸锑钾(Antimony potassium tartrate) ..... 37
6. 石蒜碱(Lycorine) ..... 38
7. 海葱(Squill) ..... 38
8. 愈创木酚甘油醚(Guaiphenesin) ..... 39
9. 双噻哌啶(Tipepidine) ..... 39

### 二、中草药来源的祛痰药 ..... 39

10. 桔 梗 ..... 39
11. 远 志 ..... 40
12. 紫 菀 ..... 40
13. 天南星 ..... 41
14. 白芥子 ..... 41
15. 前 胡 ..... 41
16. 款冬花 ..... 42
17. 野决明 ..... 42
18. 白 前 ..... 42
19. 竹 沥 ..... 43
20. 淡竹液 ..... 43
21. 杜鹃素(Farrerol) ..... 43
22. 薄菜素(Rorifone) ..... 44

### 23. 榆皮素(Quercetin) ..... 44

### 24. 杧果甙(Mangiferin) ..... 45

### 25. 伞花烃(p-Cymene) ..... 45

### 三、粘痰溶解药 ..... 46

26. 乙酰半胱氨酸(Acetylcysteine) ..... 46
27. 半胱氨酸甲酯(Methylcysteine) ..... 47
28. 半胱氨酸乙酯(Ethylcysteine) ..... 47
29. 羧甲半胱氨酸(Carbocysteine) ..... 48
30. 硫乙磺酸钠(Mesna) ..... 48
31. 鸭咀花(Adhatoda) ..... 49
32. 溴环己胺(Bromhexine) ..... 49
33. 溴环己胺醇(Ambroxol) ..... 49
34. 溴环己胺胶(Broyanexine) ..... 50
35. 胰脱氧核糖核酸酶(Pancreatic dornase) ..... 50
36. 麝蛋白酶(Chymotrypsin) ..... 51
37. 菠萝蛋白酶(Bromelains) ..... 51
38. 酸性蛋白酶 ..... 52
39. 四丁酚酮(Tyloxapol) ..... 52
40. 己醇磺酸钠(Sodium etasulfate) ..... 53

### 四、其他祛痰药 ..... 53

41. 水合碘二醇(Terpin hydrate) ..... 53
42. 愈创木酚磺酸钾(Sulfoguaiacon) ..... 53
43. 碘氯丙醇(Iodinated glycerol) ..... 54
44. 苯甲酸钠(Sodium benzoate) ..... 54

## III、平喘药

北京制药工业研究所编写

天津医药工业研究所校订

### 概 述 ..... 55

### 一、肾上腺素能 $\beta$ 受体兴奋剂 ..... 58

1. 肾上腺素(Adrenaline) ..... 58
2. 异丙肾上腺素(Isoprenaline) ..... 59
3. 乙基去甲肾上腺素(Ethylnoradrenaline) ..... 60

### 4. 乙基异丙肾上腺素(Isoetaline) ..... 60

### 5. 双甲苯喘定(Bitolterol) ..... 61

### 6. 哌喘定(Rimiterol) ..... 61

### 7. 胡芦巴碱(Protokylol) ..... 62

### 8. 六甲双喘定(Hexoprenaline) ..... 63

### 9. 异丙喘宁(Orciprenaline) ..... 63

10. 酚丙喘宁(Fenoterol) .....	64
11. 叔丁喘宁(Terbutaline) .....	65
12. 叔丁喘宁双丁酸酯(Ibuterol) .....	65
13. 茶丙喘宁(Reprotoerol) .....	66
14. 舒喘宁(Albuterol) .....	66
15. 甲氧苯舒喘宁(Salmefamol) .....	67
16. 吡丁舒喘宁(Pyrbuterol) .....	68
17. 甲磺喘宁(Soterenol).....	68
18. 苦甲磺喘宁(Zinterol) .....	69
19. 脲喘宁(Carbuterol) .....	69
20. 异丙喹喘宁(Procaterol) .....	70
21. 氯喘通(Clorprenaline) .....	70
22. 甘氯喘通(Clorprenaline glycyrhizinate) .....	71
23. 叔丁氯喘通(C-78) .....	72
24. 氨双氯喘通(Clenbuterol).....	72
25. 甲哌双喘通(Eprazinol) .....	73
26. 螺癸酮喘通(Fenspirid) .....	73
27. 喘速宁(Tretoquinol).....	74
28. 喘咳宁(Methoxyphenamine) .....	74
29. 麻黄碱(Ephedrine) .....	75
30. 伪麻黄碱(Pseudoephedrine) .....	76
31. 甲基麻黄碱(Methylephedrine) .....	77
32. 乙基麻黄碱(Etafedrine) .....	77
33. 去甲麻黄碱(Norephedrine).....	78
<b>二、肾上腺素能α受体阻滞剂</b> .....	78
34. 百里胺(Moxislyte) .....	78
35. 苦唑啉(Tolazoline) .....	79
36. 呀派胺(Indoramine) .....	79
<b>三、胆碱能M受体阻滞剂</b> .....	80
37. 异丙阿托品(Ipratropium bromide) .....	80
38. 山莨菪碱(Anisodamine) .....	80
39. 洋金花.....	81
40. 莩菪子.....	82
41. 热参.....	82
<b>四、磷酸二酯酶抑制剂</b> .....	83
42. 茶碱(Theophylline) .....	83
43. 氨茶碱(Aminophylline) .....	84
44. 茶碱乙醇胺(Theophylline ethanolamine) .....	85
45. 胆茶碱(Cholinophylline) .....	85
46. 甲葡萄茶碱(Glucophylline) .....	86
47. 茶碱醋酸钠(Theophylline sodium acetate) .....	86
48. 茶碱甘氨酸钠(Theophylline sodium glycinate).....	87
49. 茶碱乙酸哌嗪盐(Acetyllyline piperazine) .....	87
50. 羟丙茶碱(Proxyphylline) .....	88
51. 双羟丙茶碱(Diprophylline) .....	89
52. 苛乙胺茶碱(Bamiphylline) .....	89
<b>五、过敏介质阻释剂</b> .....	90
53. 色甘酸钠(Cromolyn sodium) .....	90
54. 丁氟菲酸(Bufrolidine) .....	91
55. 羟乙氧蒽酸(AH-7725) .....	91
56. 异丙氧蒽酸钠(Xanoxate sodium) .....	92
57. 四唑色酮(AA-344) .....	92
58. 四唑硫蒽酮(Doxantrazole) .....	93
59. 丙苯氮噪酮(M & B 22948) .....	93
60. 肉桂氨基酸(N-5') .....	94
61. 双醋柳胺酸(AB 50) .....	94
62. 双甲硝茚酮(Nivimedone) .....	95
<b>六、肾上腺皮质激素</b> .....	95
63. 氢化可的松(Hydrocortisone) .....	95
64. 泼尼松(Prednisone) .....	96
65. 氢化泼尼松(Prednisolone) .....	96
66. 去炎舒松(Triamcinolone acetonide) .....	97
67. 倍氟美松(Betamethasone) .....	98
68. 倍氟美松戊酸酯(Betamethasone valerate) .....	98
69. 倍氟美松双丙酸酯(Beclothesone dipropionate) .....	99
<b>七、平喘中草药</b> .....	100
70. 麻黄 .....	100
71. 檀叶油 .....	100
72. 山苍子油 .....	101
73. 苦甘草 .....	101
74. 苦参 .....	101
75. 菊目 .....	102
76. 胡颓叶 .....	102
77. 七叶莲 .....	103
78. 少年红 .....	103
79. 艾叶油 .....	104
80. 芸香草 .....	104
81. 地龙 .....	105
<b>八、其他平喘药</b> .....	106
82. 去氯羟嗪(Decloxitazine) .....	106

83. 克喘肟酰嗪(Taloximine) .....	106
84. 莨菪亭(Scopoletin) .....	107
85. 甲基莨菪亭(Scoparone) .....	107
86. 乙酰胡葵乙胺 .....	108
87. 前列腺素E(Prostaglandin-E) .....	108
88. 哮喘菌苗 .....	109
89. 核酪注射液 .....	110

## IV、防治气管炎中草药

北京制药工业研究所编写

天津医药工业研究所校订

概述 .....	111
1. 石韦 .....	111
2. 白皮松塔 .....	112
3. 侧柏叶 .....	112
4. 买麻藤 .....	113
5. 马兜铃 .....	113
6. 拳参 .....	113
7. 阴阳莲 .....	114
8. 千日红 .....	114
9. 商陆 .....	115
10. 八角莲 .....	115
11. 淫羊藿 .....	116
12. 鸡素苔 .....	116
13. 北豆根 .....	116
14. 白屈菜 .....	117
15. 薄菜 .....	117
16. 夜关门 .....	118
17. 泽漆 .....	118
18. 猫眼草 .....	119
19. 铁包金 .....	119
20. 棉花根 .....	120
21. 芫花 .....	120
22. 烈香杜鹃 .....	120
23. 满山红 .....	121
24. 紫花杜鹃 .....	122
25. 照山白 .....	122
26. 满山白 .....	123
27. 映山红 .....	123
28. 百里香杜鹃 .....	123
29. 青海杜鹃 .....	124
30. 杜香 .....	124
31. 矮地茶 .....	125
32. 花曲柳 .....	125
33. 暴马子 .....	126
34. 萝藦 .....	126
35. 通光散 .....	126
36. 牡荆 .....	127
37. 荆条 .....	127
38. 白毛夏枯草 .....	128
39. 全叶青兰 .....	128
40. 蛤蟆草 .....	129
41. 龙葵 .....	129
42. 泡桐 .....	129
43. 白毛鹿茸草 .....	130
44. 石吊兰 .....	130
45. 丝瓜藤 .....	131
46. 翅茎香青 .....	131
47. 三脉叶马兰 .....	131
48. 金龙胆草 .....	132
49. 野马追 .....	132
50. 佛耳草 .....	133
51. 穿山龙 .....	133
主要参考文献 .....	134
中文索引 .....	135
外文索引 .....	141

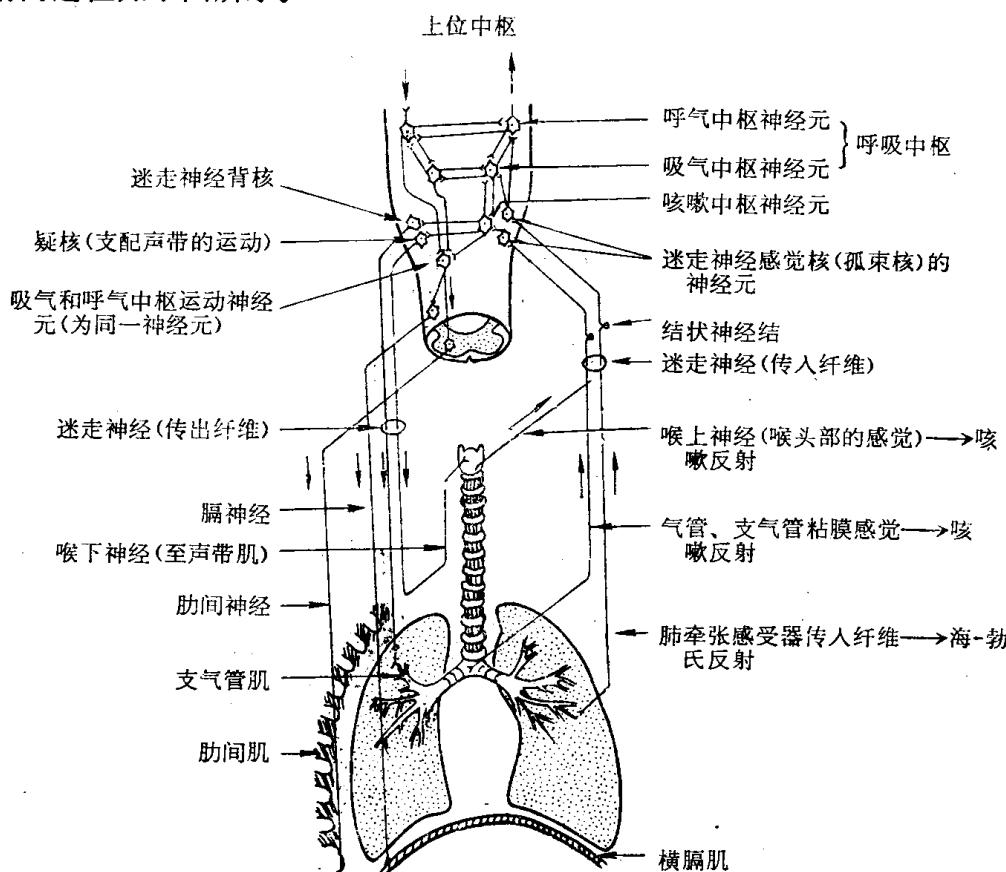
# I. 镇咳药

## 概 述

咳嗽是人体的一种保护性反射运动，轻微而不频繁的咳嗽有助于清除气管内的痰液与异物，且会自然缓解。但是，强烈而频繁的咳嗽则是某些疾病的症状，不仅使病人感到不适与痛苦，甚至由于久咳而形成肺气肿以及产生其他并发症，因此，须采用镇咳药进行治疗。

咳嗽是由于延髓咳嗽中枢受传入冲动的刺激而引起的。当咽喉、气管、支气管、肺及胸膜等器官受刺激后，冲动经不同的传入神经（主要是迷走神经）传入咳嗽中枢，然后经传出神经到声门和呼吸肌等处，产生咳嗽动作。咳嗽反射涉及四个环节：1.感受器 主要是气管分支附近粘膜上皮下的机械感受器、支气管和小支气管粘膜上皮下的化学感受器、胸膜及呼吸道平滑肌束中的肺牵张感受器。2.传入神经 主要为迷走神经，能将上述各感受器的兴奋沿迷走神经传入纤维经延髓内的孤束核传至咳嗽中枢。3.咳嗽中枢 位于延髓的背侧部，邻近呼吸中枢。4.传出神经 包括支配气管支气管平滑肌的迷走神经传出纤维（出自迷走神经背核）、支配声带肌的喉下神经（出自疑核）和支配横膈的膈神经等。

咳嗽反射的途径如下图所示。



镇咳药分中枢性和末梢性两大类。抑制延髓咳嗽中枢而产生镇咳作用的称中枢性镇咳药；

抑制咳嗽反射途径中其他环节的药物称末梢性镇咳药。某些镇咳药兼具中枢性和末梢性的镇咳作用。

### 一、中枢性镇咳药

能直接抑制延髓咳嗽中枢而产生镇咳效应的镇咳药，称为中枢性镇咳药，绝大多数的镇咳药均为中枢性镇咳药。此类中又可按其是否有成瘾性分为成瘾性和非成瘾性两类。

(一) 成瘾性镇咳药 阿片、吗啡是一类具有强效镇咳、镇痛作用的药物，祖国医学对其早有认识，唯其成瘾性太大，不宜应用。阿片生物碱中所含的可待因(Codeine)，为吗啡的甲基衍生物，镇咳作用强，也有镇痛作用，相对说来成瘾性较小，适用于各种原因引起的剧烈干咳，应用广泛，在镇咳新药筛选寻找工作中均以可待因的效果为标准进行对比评价，成为强效镇咳剂中的一个标准药物。

吗啡衍生物尚有二氢可待因(Dihydrocodeine)、乙酰可待因(Thebacon)、二氢可待因酮(Hydrocodone)、氢化吗啡酮(Hydromorphone)、吗啉吗啡(Pholcodine)、羟甲吗喃醇(Drotenanol)等。内中乙酰可待因的镇咳作用为可待因的4倍，二氢可待因酮的镇咳作用也比可待因强约1倍，二者均有强效镇痛作用，临床仅用于剧咳而伴有疼痛的病例。羟甲吗喃醇及吗啉吗啡较之可待因有一定的优点。

可待因及其类似物镇咳作用虽强，但均能抑制气管纤毛的摆动，阻碍其正常的排痰功能，故有粘痰及脓痰者不可应用。此类药物均具有成瘾性，故不可多用。

(二) 非成瘾性镇咳药 可待因一类的镇咳药，虽具有疗效可靠、起效迅速等优点，但由于有成瘾性等不良反应，限制了其应用。因而，长期以来研究寻找非成瘾性镇咳药一直很受重视。

通过吗啡结构改造，合成了一些高效的非成瘾性药物，其中首推右甲吗喃(美沙芬，Dextromethorphan)，作用强度与可待因相同，疗效确切可靠，临床应用广泛。新药二甲吗喃(Dimemorfan)，似略优于右甲吗喃。近年报道的环丁羟吗喃(Butorphanol)，镇咳作用较可待因强10~20倍，镇痛作用也强，是值得重视的一个新药。

对具有镇咳作用的强效镇痛药美散痛(Methadone)的结构与效应关系进行了深入的研究，合成了一些有效的镇咳剂，如氯苯己酮(Normethadone)、氯苯胺丙醇(敌退咳，Clofedanol)、氯苯胺丁醇(Clobutinol)、异丙苯戌睛(Isoaminil)、左旋朴嗽芬(Levopropoxyphene)等，这些药物的镇咳作用与可待因相近，临床疗效评价不一。

非成瘾性镇咳药中另一大类是一些胺基酯类药物，熟知的有咳美芬(Caramiphen)、咳必清(Pentoxyverine)、咳吩嗪(Dimethoxanate)等；较新的有咳乃定(Oxeladin)、咳息定(Butamirate)等；类似物有咳塞坦(Pipazetate)、咳吗宁(Promolat)和咳吡喃(Fedrilate)等。品种也较多，内中有些国内早已生产应用。实验表明，这些药物的镇咳作用均与可待因相近或较强，临床疗效的评价也有出入，且缺少对照观察与研究。

此外，尚有许多不属于上述类别的非成瘾性镇咳药，如双丁萘磺钠(Sodium dibunate)、吡哌乙胺(Picoperine)、氯苯息定(Cloperastine)、丙烯氯苯胺(Alloclamide)、双苯哌丙酮(Eprazinone)、双苯哌丙醇(Zipeprol)、胺酰苯吗啉(Fominoben)、五甲哌丙胺(Pémerid nitrate)、双噻哌啶(安嗽灵，Tipepidine)等等。双苯哌丙酮国内临床评价尚佳，双苯哌丙醇、胺酰苯吗啉除镇咳作用外尚具有降低痰液粘度的作用，但其疗效有待国内临床评定。五甲哌丙胺镇咳作用强，无苦味，宜儿童服用。双噻哌啶既有镇咳作用，又有显著的祛痰作用，唯国内

临床应用，表明其疗效不理想。

## 二、末梢性镇咳药

凡不直接抑制咳嗽中枢，而是抑制咳嗽反射中其他环节（感受器、传入神经和传出神经）产生镇咳作用的药物，均称为末梢性镇咳药。

末梢性镇咳药中主要是一些具有局部麻醉作用的药物。许多支气管解痉药也兼具末梢性镇咳作用，这是由于支气管痉挛也是引起咳嗽的原因之一，缓解支气管痉挛，同时可产生镇咳作用。此外，祛痰药可减少积痰对呼吸道粘膜下感受器的刺激作用，从而减轻咳嗽，起到末梢性镇咳的效果。

（一）局部麻醉性镇咳药 具有局部麻醉作用的镇咳药物，其作用原理是对呼吸道粘膜感受器产生局部麻醉作用，抑制咳嗽反射的向心冲动，从而缓解咳嗽。此类药物中熟知的有退嗽（Benzonatate），它是作用于肺牵张感受器，抑制咳嗽冲动的传导，产生镇咳作用。具有相同作用机理的新药为二苯哌丙烷（Benproperine），据云，其镇咳作用较可待因强约2~4倍，而没有可待因所具有的成瘾性、呼吸抑制及便秘等等不良反应。此外，哌乙噁唑（Libexin）及胺乙噁唑（Oxolamine）也具有相似的药理作用，前者镇咳效果似可待因，后者则远不及可待因有效。

（二）支气管解痉性镇咳药 支气管痉挛也是产生咳嗽的主要原因之一，这可能是由于呼气阻力增大使肺过度充气从而刺激肺牵张感受器之故。由阿片生物碱中提取的那可汀（Noscapine）是一个良好的镇咳药，镇咳作用与可待因相当，却无可待因所具有的成瘾性，过去多认为是中枢性非成瘾性镇咳药。据近年文献报道，现在也有人认为，那可汀的镇咳作用主要是由于其支气管平滑肌解痉作用。其他许多支气管解痉药也兼具镇咳作用。

（三）粘膜保护性镇咳药 某些药物口服后能复盖在发炎的咽部粘膜上，减弱对粘膜的刺激作用，也可达到镇咳的目的，如甘草流浸膏、蜂蜜、糖浆之类，唯其镇咳作用微弱，常用作复方镇咳祛痰剂的组分之一供临床应用。

## 三、中草药来源的镇咳药

长期以来，在感冒、慢性气管炎等疾病的治疗中，中草药一直是应用广泛而卓有疗效的武器，杏仁、枇杷叶、百部、川贝、象贝以及胆汁等等疗效显著，应用广泛，且不良反应少见。

近几年来，在毛主席革命卫生路线的指引下，防治感冒、慢性气管炎的群众性运动蓬勃开展，在中草药研究方面，收集、整理了大量的单方、验方，对重点药物进行了药理筛选、临床验证、化学提取、结构测定等一系列工作，已经临床试用的有止咳酮、木犀草素（Luteolin）、杜鹃酮（Germacrone）、矮茶素（Bergenin）、咳宁醇（Pinitol）等等。临床应用中，止咳酮对上呼吸道感染和急性气管炎的止咳作用良好，且起效迅速。

药理研究表明，半夏、百部、止咳酮、木犀草素、杜鹃酮和矮茶素等均主要作用于中枢，为中枢性非麻醉性镇咳药。贝母、咳宁醇等可能是末梢性镇咳作用的药物。

## 一、中枢性镇咳药

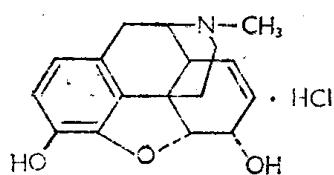
### (一) 成瘾性镇咳药

#### 1. 吗啡(盐酸吗啡)

Morphine

7,8-去氢-4,5-桥氧-3,6-二羟基-N-甲基吗啡烷盐酸盐

7,8-Dehydro-4,5-epoxy-3,6-dihydroxy-N-methylmorphinan hydrochloride



【性状】 无色带有亮光的针状结晶或白色结晶性粉末，无臭，味苦，熔点约200℃(分解)。溶于水，难溶于乙醇，不溶于乙醚、氯仿。

【作用与用途】 是阿片中所含的主要生物碱。主要用作镇痛药，也能抑制延髓咳嗽中枢，因此用于止咳，特别是刺激性咳嗽，但在痰多时不能使用，以防抑制咳嗽，障碍痰液的排出，使之存留肺内，加重感染。吗啡镇咳作用较可待因和二氢可待因酮为强，但由于成瘾性大，抑制呼吸等不良反应多，临幊上已极少用作镇咳药。

【不良反应】 过量时导致中毒，可引起昏迷、呼吸缓慢、发绀、血压降低、瞳孔极度缩小，可因呼吸衰竭而死亡。

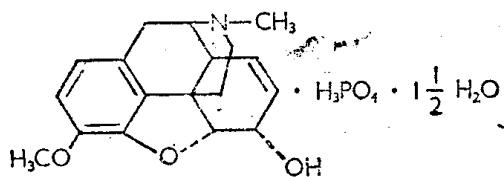
【参考剂量】 口服 每次5~10毫克，一日1~3次。极量为一次30毫克，一日100毫克。

#### 2. 可待因(甲基吗啡)

Codeine

7,8-去氢-4,5-桥氧-3-甲氧基-6-羟基-N-甲基吗啡烷磷酸盐

7,8-Dehydro-4,5-epoxy-3-methoxy-6-hydroxy-N-methylmorphinan phosphate



为阿片中所含生物碱之一，含量约0.5~1%，也可由吗啡经甲基化而制得。

【性状】 一水合物 为无色结晶或白色结晶性粉末，无臭，味苦，熔点154~159℃。微溶于水，易溶于甲醇、乙醇、氯仿，溶于苯、乙醚。

**磷酸盐** 为白色细微针状结晶或白色结晶性粉末，无臭，味苦，易溶于水，微溶于乙醇，难溶于乙醚、氯仿。

**【作用与用途】** 为中枢性麻醉性镇咳药，作用与吗啡相似，是直接抑制咳嗽中枢而产生镇咳作用。镇咳作用强度约为吗啡的1/4，为目前临幊上最有效的镇咳药之一，且起效迅速，口服后20分钟内见效，持续2~3小时。适用于各种原因引起的剧烈干咳，对胸膜炎干咳伴胸痛者尤为适用。在有少量痰时，宜与祛痰药合用，多痰者不宜服用。可待因尚具有良好的镇痛作用，其镇痛作用强度为吗啡的1/10，可用于中等度疼痛。

本品可引起成瘾性，但不如吗啡那样容易产生，其欣快感不明显。治疗量不影响呼吸，中毒量亦不麻痹中枢。

**【不良反应】** 一般剂量耐受良好，但也偶有恶心、呕吐、便秘及眩晕；剂量超过60毫克时往往可使病人烦躁不安，小儿过量时可发生惊厥。

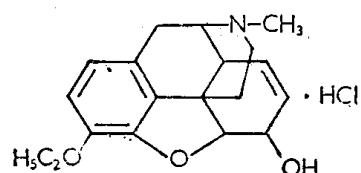
**【参考剂量】** 口服 每次15~30毫克，一日3次。极量为一次100毫克，一日250毫克。

### 3. 乙基吗啡(狄奥宁)

Ethylmorphine (Dionin)

7,8-去氢-4,5-桥氧-3-乙氧基-6-羟基-N-甲基吗啡烷盐酸盐

7,8-Dihydro-4,5-epoxy-3-ethoxy-6-hydroxy-N-methylmorphinan hydrochloride



**【性状】** 白色结晶性粉末，无臭，味苦，熔点约123℃(分解)。溶于水、乙醇，微溶于氯仿、乙醚。

**【作用与用途】** 为中枢性麻醉性镇咳药，其镇咳效果不如可待因，也具有镇痛作用。虽可用作镇咳镇痛药，但临幊上主要以其1~5%溶液滴眼，利用其局部刺激作用治疗角膜疾患或虹膜炎，以加强淋巴及血液循环，促进病损组织产物的吸收。

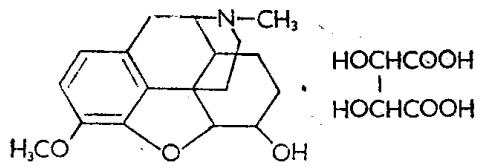
**【参考剂量】** 口服 每次10~30毫克，一日3次。

### 4. 二氢可待因

Dihydrocodeine (Paracodin)

7,8-二氢可待因酒石酸氢盐

7,8-Dihydrocodeine bitartrate



**【性状】** 白色结晶性粉末，味苦，熔点 186~190℃。易溶于水，不溶于乙醇和乙醚。

**【作用与用途】** 为中枢性镇咳药，镇咳作用较可待因强约一倍，作用时间持续 4~5 小时。尚具有镇痛作用，其镇痛作用也比可待因强，故也可用作镇痛剂。本品成瘾性也较可待因大。

**【不良反应】** 与吗啡相同，但较吗啡轻。肝功能不良和哮喘病人慎用。

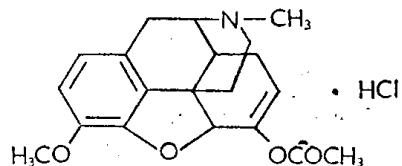
**【参考剂量】** 口服 每次 10 毫克，一日 3 次。

## 5. 乙酰可待因

Thebacon (Acedicon, Acetohydrocodon, Acethyldihydrocodeinone)

6-乙酰氨基-4,5-环氧-3-甲氧基-N-甲基吗啡-6-烯盐酸盐

6-Acetoxy-4,5-epoxy-3-methoxy-N-methylmorphin-6-ene hydrochloride



**【性状】** 针状结晶，熔点 154℃。不溶于水，可溶于多种有机溶剂。

**【作用与用途】** 为高效、强效镇咳药，其镇咳作用比可待因强约四倍，无明显的肠蠕动抑制作用及所导致的便秘。镇痛作用也很强，但次于吗啡，为吗啡的 2/3。

临床仅用于可待因无效的严重咳嗽。

**【不良反应】** 可见有呕吐。

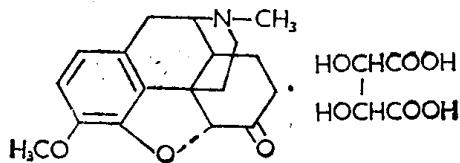
**【参考剂量】** 口服 每次 5 毫克，一日 2 次。

## 6. 二氢可待因酮

Hydrocodone (Dicodid, Dihydrocodeinone)

3-甲氧基-4,5-环氧-N-甲基-6-酮基吗啡烷酒石酸氢盐

3-Methoxy-4,5-epoxy-N-methyl-6-oxomorphinan hydrogen tartrate



**【性状】** 白色结晶或结晶性粉末，无臭，味微酸、苦和咸，熔点 146~148℃。不溶于水、乙醇。

**【作用与用途】** 本品为强效镇咳药，其作用较可待因强，成瘾性介于可待因与吗啡之间，主要用来缓解刺激性咳嗽而伴有疼痛的病例。与可待因相比无明显优点。

**【不良反应】** 与可待因相同，但成瘾性较可待因大。

**【参考剂量】** 口服 每次 5~10 毫克，每日 3~4 次。

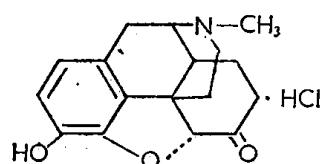
皮下注射 每次 15 毫克，一日最高剂量可用至 45 毫克。

## 7. 氢化吗啡酮

Hydromorphone (Dihydromorphinon, Dilaudiol, Dimorphone)

3-羟基-4,5-环氧-N-甲基-6-氧吗啡烷盐酸盐

3-Hydroxy-4,5-epoxy-N-methyl-6-oxomorphinan hydrochloride



**【性状】** 白色结晶性粉末，无臭，味苦，熔点 305~315℃。易溶于水，微溶于乙醇，几乎不溶于氯仿、乙醚。

**【作用与用途】** 为强效镇咳、镇痛药，镇咳作用较等剂量可待因强，成瘾性也较大。用途与吗啡相似，仅用于伴有疼痛的严重咳嗽，且经用可待因、二氢可待因酮而无效者。

**【不良反应】** 有恶心、呕吐、呼吸抑制、嗜睡及便秘等。

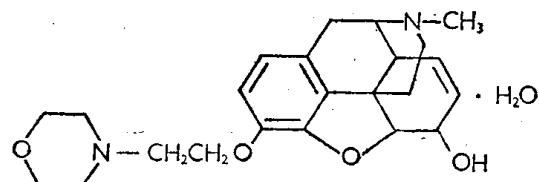
**【参考剂量】** 口服 每次 1 毫克，每 3~4 小时一次。

## 8. 吗啉吗啡(福可定)

Pholcodine (Adaphol, Glycodin, Pholevan)

吗啉乙基吗啡

Morphalinylethylmorphine



**【性状】** 一水合物 为白色或近白色结晶性粉末，无臭，味极苦，熔点约 99℃。可溶于水，易溶于无水乙醇，极易溶于丙酮、氯仿，微溶于乙醚。

**酒石酸盐** 为白色结晶性粉末，无臭，味苦。可溶于水，微溶于氯仿、乙醚，极微溶于乙醇。

**【作用与用途】** 本品与可待因相似，可抑制咳嗽中枢，特别对干咳更为有效。毒性较可待因小，小剂量即可生效，对新生儿和儿童耐受性好，不致引起便秘或消化紊乱，成瘾性比可待因小，对呼吸中枢的抑制较吗啡弱，只有微弱的镇静作用。常用其酒石酸盐以增加其水溶性。

**【不良反应】** 偶见有恶心、嗜睡。

**【参考剂量】** 口服 一水合物，每次 5~15 毫克，一日 3 次。

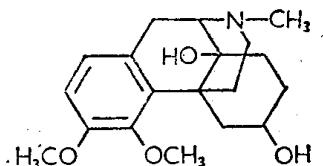
酒石酸盐，每次 10~30 毫克，一日 3 次。

## 9. 羟甲吗喃醇

Drotebanol (Metebanyl, Oxymethanol)

3, 4-二甲氧基-N-甲基吗啡烷二醇-6β, 14

3, 4-Dimethoxy-N-methylmorphinandiol-6β, 14



**【性状】** 白色或近白色结晶或结晶性粉末，味稍苦，熔点 169℃。几乎不溶于水，易溶于乙醇和氯仿，难溶于乙醚。

**【作用与用途】** 本品为强效的中枢性镇咳药，药理作用与可待因相同。动物实验，口服比磷酸可待因强 5~14 倍，皮下注射强 10~25 倍。临床试验，其镇咳效果比磷酸可待因强，剂量仅为磷酸可待因的 1/10。作用迅速而持久，口服后 20~30 分钟出现作用，持续时间 6~8 小时；皮下注射 10~30 分钟出现作用，持续时间 4~8 小时。便秘作用较小，呼吸抑制作用和催吐作用都比磷酸可待因和盐酸吗啡轻微，成瘾性在通常用量也较磷酸可待因低。临幊上对急慢性支气管炎、肺结核、肺癌的咳嗽，有很好的镇咳效果，对干咳尤为显著。

**【不良反应】** 可有口干、食欲不振、恶心、呕吐、便秘、腹痛、嗜睡、眩晕、头痛等症状。

**【参考剂量】** 口服 每次 2 毫克，一日 3 次。

皮下或肌注 每次 2 毫克，一日 1~3 次。

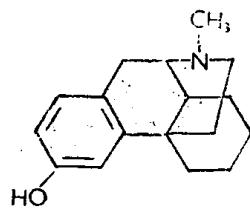
## (二) 非成瘾性镇咳药

### 10. 右羟吗喃

Dextrorphan (Dextrorphanolum)

(+)-3-羟基-N-甲基吗啡烷

(+)-3-Hydroxy-N-methylmorphinan



**【性状】** 结晶，熔点 198~199℃。

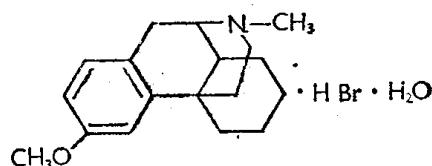
**【作用与用途】** 中枢性镇咳药。其左旋体特马伦为强效镇痛药，而本品镇痛作用不显著，仅可作镇咳药。其镇咳作用强度不及其 3-甲基衍生物右甲吗喃，临床少有应用。

## 11. 右 甲 吗 喹(美沙芬)

Dextromethorphan (Romilar, Tussade)

(+)-3-甲氧基-N-甲基吗啡烷氢溴酸盐

(+)-3-Methoxy-N-methylmorphinan hydrobromide



**【性状】** 白色结晶或结晶性粉末，微有臭味，味苦，熔点 126~127℃。微溶于水，可溶于乙醇，易溶于氯仿，不溶于乙醚。

**【作用与用途】** 本品是中枢性镇咳药，抑制延髓咳嗽中枢而产生作用。其镇咳作用与可待因相等或稍强，但没有镇痛作用及成瘾性，治疗剂量不会抑制呼吸，且毒性很低，不良反应少见。口服 15~30 分钟后起效，作用可持续 3~6 小时。

临床适用于感冒、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。

**【不良反应与禁忌】** 偶有头晕、头痛、嗳气、食欲不振、便秘等。孕妇慎用。

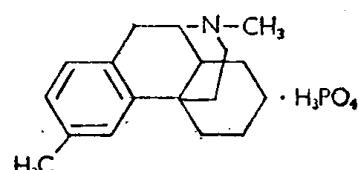
**【参考剂量】** 口服 每次 10~20 毫克，一日 3~4 次。

## 12. 二 甲 吗 喹

Dimemorfan (Astomin)

(+)-3-甲基-N-甲基吗啡烷磷酸盐

(+)-3-Methyl-N-methylmorphinan phosphate



**【性状】** 白色结晶或结晶性粉末，无臭，味苦涩，熔点265℃(分解)。微溶于水和甲醇，易溶于醋酸，不溶于乙醇、丙酮、氯仿、苯和乙醚中。

**【作用与用途】** 本品的结构与美沙芬相似，也是直接作用于延髓咳嗽中枢而产生镇咳作用，其镇咳效果略优于美沙芬，约为可待因的2倍。毒性低，安全性较大，镇咳有效剂量没有呼吸抑制作用，未发现有便秘作用和成瘾性。

**【不良反应】** 仅少数病人有嗜睡、口干、食欲不振、腹泻等。

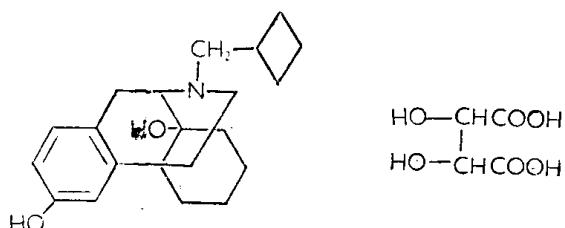
**【参考剂量】** 口服 每次10~20毫克，一日3次。

### 13. 环丁羟吗喃

Butorphanol

1-N-环丁甲基-3,14-二羟基吗啡烷酒石酸盐

1-N-Cyclobutylmethyl-3,14-dioxymorphinan tartrate



**【作用与用途】** 是近年报道的中枢性镇咳药。动物试验中，皮下注射其镇咳作用较可待因强约100倍，注射后30分钟显效，作用持续时间较可待因长；口服1~2小时后达最大效果，其作用仅为可待因的10~20倍。除镇咳作用外，本品尚有很强的镇痛作用，比镇痛新强约20倍，肌注15~30分钟起效，可维持4小时。

**【不良反应】** 主要为嗜睡。

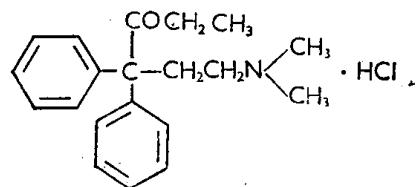
**【参考剂量】** 肌注、皮下 每次2毫克。

### 14. 氨苯己酮(去甲美散痛)

Normethadone

6-二甲氨基-4,4-二苯基己酮-3盐酸盐

6-Dimethylamine-4,4-diphenylhexanone-3 hydrochloride



**【性状】** 结晶，熔点174~150℃，可溶于水、乙醇。

**【作用与用途】** 为镇痛药美散痛的去甲衍生物，对咳嗽中枢有抑制作用，但不影响呼吸中枢及肠蠕动。镇咳作用较可待因强约一倍，镇痛作用与可待因相似。临床适用于刺激性咳