



临 ■ 床 ■ 用 ■ 药 ■ 丛 ■ 书

◎ 严宝霞 主编 翟所迪 孙曼琴 副主编

抗感染药物的 临床应用



化学工业出版社

现代生物技术与医药科技出版中心

临床用药丛书

抗感染药物的临床应用

严宝霞 主编

翟所迪 孙曼琴 副主编

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

抗感染药物的临床应用/严宝霞主编. 翟所迪 孙曼琴
副主编. —北京: 化学工业出版社, 2002. 1
(临床用药丛书)
ISBN 7-5025-3420-2

I. 抗… II. ①严…②翟…③孙… III. 抗感染
药-临床应用 IV. R978.2

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2001) 第 069514 号

临床用药丛书
抗感染药物的临床应用
严宝霞 主编
翟所迪 孙曼琴 副主编
责任编辑: 王苏平
责任校对: 洪雅姝
封面设计: 田彦文

*

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) 64918013
[http:// www.cip.com.cn](http://www.cip.com.cn)

*

新华书店北京发行所经销
北京市彩桥印刷厂印刷
北京市彩桥印刷厂装订

开本 850×1168 毫米 1/32 印张 12½ 字数 326 千字
2002 年 1 月第 1 版 2002 年 1 月北京第 1 次印刷
印 数: 1—4000

ISBN 7-5025-3420-2/R · 97
定 价: 25.00 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

《抗感染药物的临床应用》编写人员

主 编 严宝霞

副主编 翟所迪 孙曼琴

编 者 (按姓氏汉语拼音排序)

陈 芳	方娟娟	李燕红	孙曼琴
屠巴丽	王建民	王 琪	王 音
许 宏	严宝霞	阎 黎	翟所迪
张慧英	赵荣生		

编 者 的 话

本书是化学工业出版社组织编写出版的《临床用药丛书》之一。本书既具有独立的参考使用价值，又与其他分册共同构成一部大型系列临床用药参考丛书，使读者足以了解当前临床用药的全貌。

为了满足广大医务工作人员临床用药参考的需要，我们组织了由中国医学科学院中国协和医科大学北京协和医院、北京大学第三医院、北京大学临床药理研究所、中国医学科学院肿瘤医院、北京友谊医院、中国医学科学院阜外心血管病医院、北京安定医院、北京军区总医院、北京核工业医院、中国药品生物制品检定所和有关单位的资深医药专家和权威，共同合作编写了《临床用药丛书》，其内容包括：“抗癌药物的临床应用”；“抗感染药物的临床应用”；“神经系统药物的临床应用”；“循环及血液系统药物的临床应用”；“呼吸、消化、泌尿系统药物及生化药物的临床应用”；“内分泌系统药物及治疗用生物制品的临床应用”等。丛书的内容特点是，除对各类药物的概况及每个药物的基本情况详细介绍外，并结合临床用药的实际经验，突出了用药指导这项内容，希望对读者在选药用药时有所裨益。这套丛书在编写时，由于各分册是分别编写，内容有相对独立性，编者都有各自的经验与创意，可谓百花齐放，各具特色。但从丛书的整体来看，又带来一些编写体例上的不统一，确系美中不足，因为这一点并不影响大家参考本书，所以我们在定

稿时没有强求一致,敬请广大读者见谅。对本书内容编写上的不足与不当之处,尚请予以指正,我们将在今后再版时加以改进。

《临床用药丛书》编委会名单如下:

主 编 孙祖基 殷慕昭
副主编 周际昌 孙定人 姜佐宁 丁锡申 安 良
孙兴昌 严宝霞 崔丽英
编 委 (编委按姓氏汉语拼音排列)
樊朝美 冯奉仪 李一石 齐 平
任艳平 孙曼琴 徐兵河 翟所迪
赵汉臣

孙祖基
2001 年 6 月

前 言

抗感染药物是近百年来发展最快、应用最广的一大类药物。通常对病原微生物感染和寄生虫感染的疾病都归之为感染性疾病，因此，我们将这些药物合并在一起向大家介绍。本书第一篇抗微生物药物（含抗生素类药、氟喹诺酮类药、磺胺类药、其他类药、植物类药、抗真菌药、抗病毒药、抗结核药、抗麻风药等），由北京大学第三医院严宝霞教授等和北京大学临床药理研究所孙曼琴教授等编写；第二篇抗寄生虫病药物（含抗疟药、抗阿米巴药、抗滴虫病药、抗黑热病药、抗血吸虫病药、抗丝虫病药和驱肠虫药等），由北京军区总医院王建民等编写。全书共收载临床常用的药物及新药 264 种。各类药物均有概述，介绍药物的发展和应用情况，每个药物则按名称、药理、用途、用法用量、不良反应、药物相互作用、注意事项、用药指导、制剂规格等项加以叙述。

由于我们的编写经验不够，加上收集资料与选择整理的仓促，书中难免存在不足之处，敬请广大读者与同行们指正。

2001 年 7 月

目 录

第一篇 抗微生物药物

第一章 抗微生物药物总论	1
第一节 抗微生物感染的药物来源	1
第二节 抗微生物药物的发展	1
第三节 抗微生物药物的分类	2
第四节 抗微生物感染药物临床应用的基本原则及药效评价	4
第五节 抗微生物药物的体内药代动力学	6
第六节 抗菌后效应	10
第七节 抗微生物药物的耐药性	11
第八节 抗微生物药物的不良反应	12
第二章 β -内酰胺类抗生素概论	14
第一节 β -内酰胺类抗生素的化学结构	14
第二节 β -内酰胺类抗生素的作用机理	15
第三节 β -内酰胺类抗生素的耐药性	16
第四节 β -内酰胺酶抑制剂	18
第三章 青霉素类抗生素概论	20
第一节 青霉素类抗生素的发展	20
第二节 青霉素类抗生素的抗菌作用	21
第三节 青霉素类抗生素的作用机理及给药方案	23
第四节 青霉素类的过敏反应	24
第四章 青霉素类抗生素各论	26
青霉素 G(26) 普鲁卡因青霉素(29) 苄星青霉素(29) 青霉素 V(30) 氨苄西林(30) 巴氨西林(33) 仑氨西林(33) 酞氨西林(34) 甲氧西林(35) 萘夫西林(36) 卡茆西林(37) 舒他西林(38) 阿莫西林(39) 阿莫西林-克拉维酸(40) 苯唑西林(41) 氯唑西林(42) 双氯西林(43) 氟氯西林(44) 羧苄西林(45) 替卡西林(46) 替卡西林-克拉维酸(47) 呋布西林(48) 哌拉西林(49) 哌拉西林+他佐巴坦钠(50)阿洛西林(51) 美洛西林(52) 磺苄西林(54) 美西林(55)	

替莫西林(55)

第五章 头孢菌素类抗生素	57
第一节 头孢菌素类抗生素概述	57
第二节 常用第一代头孢菌素	62
头孢噻吩钠(62) 头孢唑啉钠(63) 头孢拉定(64) 头孢硫脒(65) 头孢氨苄(66) 头孢羟氨苄(67)	
第三节 常用第二代头孢菌素	68
头孢呋辛(68) 头孢孟多(69) 头孢替安(70) 头孢西丁(71) 头孢美唑(72) 头孢呋辛酯(73) 头孢克洛(74) 头孢丙烯(75)	
第四节 常用第三代头孢菌素	76
头孢噻肟(76) 头孢唑肟(77) 头孢甲肟(78) 头孢曲松(79) 头孢哌酮(80) 舒巴坦/头孢哌酮(81) 头孢他啶(81) 头孢地嗪(82) 头孢匹胺(83) 拉氧头孢(84) 头孢米诺(85) 头孢克肟(86) 头孢泊肟酯(88) 头孢布烯(88)	
第五节 第四代头孢菌素类	89
头孢匹罗(89) 头孢吡肟(90)	
第六节 其他 β -内酰胺类抗生素	91
羧碳头孢(92) 氨曲南(92) 亚胺培南-西司他丁钠(93) 帕尼培南+倍他米隆(95) 美洛培南(96)	
第六章 氨基糖苷类抗生素	98
第一节 氨基糖苷类抗生素概述	98
第二节 氨基糖苷类抗生素各论	100
链霉素(100) 卡那霉素(102) 庆大霉素(103) 阿米卡星(104) 妥布霉素(105) 核糖霉素(106) 西索米星(107) 奈替米星(108) 小诺米星(109) 阿司米星(110) 异帕米星(111) 地贝卡星(112) 大观霉素(113)	
第七章 四环素类抗生素	114
第一节 四环素类抗生素概述	114
第二节 四环素类抗生素各论	116
四环素(116) 土霉素(117) 金霉素(117) 多西环素(118) 米诺环素(119)	
第八章 大环内酯类抗生素	121
第一节 大环内酯类抗生素概述	121
第二节 大环内酯类抗生素各论	122
红霉素(122) 依托红霉素(124) 琥乙红霉素(124) 罗红霉素(125) 克拉霉素(126) 阿奇霉素(127) 吉他霉素(128) 麦迪霉素(129) 交沙霉素(130) 乙酰螺旋霉素(131)	

第九章 其他抗生素类	133
第一节 酰胺苯醇类	133
氯霉素(133) 甲砒霉素(135)	
第二节 万古霉素类	136
万古霉素(136) 去甲万古霉素(138)	
第三节 林可霉素类	138
林可霉素(138) 克林霉素(141)	
第四节 磷霉素类	142
磷霉素(142)	
第五节 多粘菌素类	143
多粘菌素 B(143) 多粘菌素 E(145)	
第十章 喹诺酮类抗菌药物	146
第一节 喹诺酮类药物的发现与发展	146
第二节 喹诺酮类药物的药理作用	147
第三节 喹诺酮类药物的耐药性	150
第四节 喹诺酮类药物的不良反应	153
第五节 喹诺酮类药物的药物相互作用	156
第六节 喹诺酮类药物的临床应用	156
第七节 喹诺酮类药物的使用注意事项	158
第八节 喹诺酮类药物各论	159
吡哌酸(159) 诺氟沙星(160) 依诺沙星(162) 甲氟哌酸(163) 环丙沙星(164)	
氧氟沙星(166) 左氧氟沙星(167) 氟罗沙星(170) 司帕沙星(171) 洛美沙星	
(173) 莫西沙星(175) 芦氟沙星(177) 妥舒沙星(178)	
第十一章 磺胺类药物及抗菌增效剂	180
第一节 磺胺类药物的概述	180
第二节 常用磺胺类药物	182
磺胺嘧啶(182) 磺胺嘧啶银(184) 磺胺二甲嘧啶(184) 磺胺甲噁唑(185)	
复方新诺明(186) 增效联磺片(187) 甲氧苄啶(188) 柳氮磺吡啶(189)	
第十二章 其他化学抗菌药物	191
第一节 硝基呋喃类抗菌药	191
呋喃妥因(191) 呋喃唑酮(192)	
第二节 硝咪唑类	193
甲硝唑(193) 替硝唑(195) 奥硝唑(197)	

第三节 其他类	197
西地碘片(197)	
第十三章 抗感染植物药制剂	199
盐酸小檗碱(199) 双黄连口服液(片,胶囊,颗粒)(200) 注射用双黄连(冻干)	
(200) 双黄连气雾剂(201) 双黄连栓(201) 清开灵口服液(201) 穿琥宁注射液	
(203) 穿心莲片(204) 鱼腥草注射液(204) 大蒜新素(205) 蒲公英颗粒(206)	
银黄口服液(206) 银黄含片(207) 板蓝根颗粒剂(冲剂)(207)	
第十四章 抗真菌药物	209
第一节 抗真菌药物概述	209
第二节 抗真菌抗生素	211
一、多烯类抗真菌药物	211
两性霉素 B(211) 制霉菌素(214) 甲帕霉素(215) 曲古霉素(216)	
二、非多烯类抗真菌药物	217
灰黄霉素(217)	
第三节 唑类抗真菌药物	219
一、咪唑类抗真菌药物	219
克霉唑(219) 酮康唑(221) 咪康唑(224) 益康唑(226) 噻康唑(227) 联苯苄	
唑(228) 布康唑(230) 硫康唑(230)	
二、三氮唑类抗真菌药物	231
氟康唑(231) 伊曲康唑(234)	
第四节 烯丙胺类抗真菌药物	236
特比萘芬(236)	
第五节 其他抗真菌药物	237
氟胞嘧啶(237) 环吡酮胺(239) 阿莫罗芬(240) 托西拉酯(241) 硫化硒(242)	
十一烯酸(243)	
第十五章 抗病毒药物	244
第一节 抗病毒药物概述	244
第二节 抑制病毒复制的药物	246
金刚烷胺(246) 曲金刚胺(247)	
第三节 干扰病毒复制的药物	248
一、嘧啶核苷类抗病毒药物	248
吗啉双胍(248) 碘苷(249) 曲氟尿苷(250) 环胞苷(251)	
二、嘌呤核苷类抗病毒药物	252

阿糖腺苷(252) 阿昔洛韦(255) 万乃洛韦(257) 更昔洛韦(259) 喷昔洛韦(261) 泛昔洛韦(262)	
三、非核苷类抗病毒药物	263
利巴韦林(263) 膦甲酸钠(265)	
第四节 影响核糖体翻译的药物	267
酞丁安(267)	
第五节 逆转录酶抑制剂	267
齐多夫定(267) 扎西他宾(269) 拉米夫定(270) 二脱氧肌苷(272)	
第六节 蛋白酶抑制剂	274
茚地那韦(274)	
第七节 生物抗病毒药物	275
干扰素(275) 白细胞介素-2(278)	
第八节 其他抗病毒药物	279
斑蝥素(279)	
第十六章 抗结核病药	281
第一节 抗结核病药概述	281
第二节 常用抗结核病药物	286
链霉素(286) 卡那霉素(287) 利福霉素钠(287) 利福平(288) 利福定(289)	
利福喷丁(290) 利福布坦(291) 利福布丁(291) 卷曲霉素(292) 紫霉素(292)	
环丝氨酸(293) 异烟肼(293) 卫非特(295) 卫非宁(295) 帕司烟肼(296)	
异烟醇(297) 乙硫异烟胺(297) 丙硫异烟胺(298) 对氨基水杨酸钠(298)	
氨硫脲(299) 吡嗪酰胺(299) 乙胺丁醇(300)	
第十七章 抗麻风病药物及抗麻风反应药物	302
第一节 抗麻风病药物概述	302
第二节 抗麻风病药物	304
一、砒类抗麻风病药物	304
氨苯砒(304) 苯丙砒(307) 醋氨苯砒(308)	
二、其他抗麻风病药物	309
氯法齐明(309) 硫苯咪唑(310) 硫安布新(311)	
第三节 抗麻风反应药物	312
沙立度胺(312)	

第二篇 抗寄生虫病药物

第一章 抗疟药	314
---------------	-----

第一节 概述	314
第二节 控制症状的抗疟药	315
氯喹(315) 磷酸萘啶(317) 青蒿素(318) 蒿甲醚(320) 双氢青蒿素(320)	
奎宁(321) 哌喹(322) 卤泛曲林(323) 本芴醇(324) 青蒿琥酯(325)	
第三节 用于根治的抗疟药	326
伯氨喹(326)	
第四节 主要用于预防的抗疟药	327
乙胺嘧啶(327)	
第五节 抗疟药的评价	328
第二章 抗阿米巴药	330
第一节 概述	330
第二节 肠道内抗阿米巴药	330
喹碘方(330) 卡巴肿(331) 双碘喹啉(332) 巴龙霉素(333) 鸦胆子(333)	
大蒜(333) 白头翁(334)	
第三节 肠道外抗阿米巴药	334
氯喹(334)	
第四节 兼有肠道内外抗阿米巴药	334
甲硝唑(334) 替硝唑(336) 依米丁(337) 奥硝唑(338) 苯酰甲硝唑混悬	
液(339) 二氯尼特(340)	
第五节 抗阿米巴药的评价	341
第三章 抗滴虫病药	342
第一节 概述	342
第二节 抗滴虫病药	342
甲硝唑(342) 奥硝唑(342) 替硝唑(343) 苯酰甲硝唑(343)	
第三节 抗滴虫病药的评价	343
第四章 抗黑热病药	344
第一节 概述	344
第二节 抗黑热病药	344
葡萄糖酸锑钠(344) 锑酸葡胺(345) 喷他脒(346)	
第三节 抗黑热病药的评价	347
第五章 抗血吸虫病药	348
第一节 概述	348
第二节 抗血吸虫病药	348

吡啶酮(348) 六氯对二甲苯(350) 硝硫氰胺(351)	
第三节 抗血吸虫病药的评价	352
第六章 抗丝虫病药	353
第一节 概述	353
第二节 抗丝虫病药	353
乙胺嗪(353) 呋喃嘧酮(354) 伊维菌素(355)	
第三节 抗丝虫病药的评价	356
第七章 驱肠虫药	357
第一节 概述	357
第二节 驱肠线虫药	358
甲苯达唑(358) 阿苯达唑(359) 噻苯达唑(360) 噻嘧啶(361) 左旋咪唑(362)	
哌嗪(363)	
第三节 驱绦虫药	364
氯硝柳胺(364) 吡啶酮(365) 鹤草酚(366) 槟榔(366) 南瓜子(367)	
第四节 驱肠虫药的评价	367
附录一 药名中文索引	369
附录二 药名英文索引	376

第一篇 抗微生物药物

第一章 抗微生物药物总论

抗微生物药物 (Anti-microbial agents) 包括用以治疗各种病原体 (病毒、衣原体、支原体、立克次体、细菌、螺旋体、真菌) 所致感染的各种药物。包括抗生素、磺胺类、喹诺酮类、咪唑类、硝咪唑类、呋喃类等, 由于这些药物的化学结构明确, 利用这些药物来治疗感染性疾病也称之为药物化学治疗 (Chemotherapy)。

第一节 抗微生物感染的药物来源

1. 天然抗生素 由微生物生物合成, 微生物在生长过程中为了生存竞争而产生的能抑制或杀灭其他微生物的化学物质, 如青霉素 G、青霉素 V、红霉素、庆大霉素等。

2. 半合成抗生素 以微生物生物合成的抗生素为基础, 以构效关系理论为指导, 对其结构进行改造, 以获得所需要的理化、药理特性的新化合物, 如分离出青霉素母核 6-APA 和头孢菌素母核 7-ACA, 通过半合成的方法, 研究开发出一系列的青霉素类抗生素及头孢菌素类抗生素。

3. 完全由人工合成方法研发的抗菌药物如磺胺类药物、喹诺酮类药物。

第二节 抗微生物药物的发展

现代化的抗微生物化学治疗起始于磺胺药物的临床使用。1941 年青霉素产品的生产及少量的临床试验, 开始了抗生素的“金色时代 golden age”。1944 年研究开发成功链霉素, 1947 年氯霉素, 多粘

菌素, 1948 年金霉素, 1950 年土霉素, 1952 年红霉素, 1957 年卡那霉素, 利福霉素。60 年代开发了由小单孢菌产生的庆大霉素、链霉菌产生的妥布霉素、核糖霉素、竹桃霉素、麦迪霉素、交沙霉素等一系列氨基糖苷类及大环内酯类抗生素, 在此期间还开发了林可霉素。1959 年从青霉素发酵液中分离出青霉素母核 (6 氨基青霉烷酸, 6APA), 自 60 年代初开始在青霉素母核, 6 位氨基连接不同的侧链获得了一系列半合成青霉素。1953 年发现了对青霉素酶稳定的头孢霉素 C, 对头孢菌素 C 进行结构改造, 研制成功一系列的具有不同特点的头孢菌素类药物。其他类药物如四环素类、利福霉素、林可霉素类也都有了发展, 自 60 年代以来半合成抗生素已成为寻找新抗生素的主要途径, 其中以 β -内酰胺类新抗生素的进展最为突出。已成为临床控制重症感染最主要的一类抗生素。

20 世纪 80 年代以来, 对喹诺酮的基本结构进行改造、合成开发成功一系列新的氟喹诺酮类药物, 具有抗菌谱广, 抗菌作用强的特点, 有的对绿脓杆菌, 厌氧菌, 耐药金葡菌均有较强作用, 有的半衰期长, 耐酸, 可以一天口服药一次, 大大提高了病人用药的依从性, 手性药物 (如左旋氧氟沙星) 的研发更提高了药效, 降低了毒性。

90 年代对 β -内酰胺酶抑制剂的研究开发, 碳青霉烯类、头霉素类抗生素的发展更加扩大了抗菌谱, 提高了耐药菌感染的疗效, 救治了大量难治的重度感染的病人。

第三节 抗微生物药物的分类

一、按化学结构分类

按化学结构分类是目前国际上常用的方法。

1. 青霉素类 Penicillins
2. 头孢菌素类 Cephalosporins
3. 其他 β -内酰胺类 Other β -lactams
4. 氨基糖苷类 Aminoglycosides
5. 大环内酯类/林可霉素类/万古霉素类 Macrolides/Lincosamides/Vancomycins

6. 四环素类 Tetracyclines
7. 喹诺酮类 Quinolones
8. 磺胺类 Sulphonamides
9. 硝基呋喃类 Nitrofurans
10. 抗结核分支杆菌类 Antimycobacterial agents

二、按药物作用机理分类

1. 抑制微生物细胞壁合成的药物。如 β -内酰胺类抗生素，青霉素类、头孢菌素类药物，及化学结构不相似的万古霉素，环丝氨酸、杆菌肽及咪唑类抗真菌药（咪康唑、酮康唑）。

2. (1) 直接作用微生物细胞膜、影响穿透力而导致细胞内容物的外透。包括多粘菌素，多粘菌素 E 甲磺酸。(2) 药物与细胞壁固醇结合导致膜的渗透性改变，胞浆内容漏出导致真菌死亡。如多烯类 (Polyene) 抗真菌药，制霉菌素及两性霉素 B。

3. 作用于 30S 或 50S 核蛋白体亚单位而逆转、抑制微生物蛋白质的合成，而起到抑菌作用，包括，氯霉素，四环素、红霉素、克林霉素等。

4. 与 30S 核蛋白体亚单位结合和替代性蛋白质合成而导致细胞死亡，由于本类作用于蛋白质合成的多个重要环节，因而与其他作用于蛋白质合成的抗生素不同，不是抑菌作用而是杀菌作用，如氨基糖苷类。

5. 影响微生物的核酸代谢。如利福平能与微生物的 DNA 依赖性 RNA 多聚酶 (DNA-dependent RNA polymerase) 形成稳定性的结合，阻抑该酶活性，从而抑制细菌 RNA 的合成。如喹诺酮类抑制了螺旋酶，破坏了 DNA 的螺旋结构，DNA 松弛不卷曲，根本无法容纳在胞壁内，也无法进行正常的 DNA 复制、转录、转运、重组而杀灭微生物。

6. 阻断微生物必需的特异性的代谢。如甲氧苄啶 (TMP) 抑制二氢叶酸还原酶、磺胺抑制二氢叶酸合成酶，使细菌的叶酸代谢受到阻断。

7. 核酸类似物。如齐多夫定、更昔洛韦、阿昔洛韦与病毒 DNA 聚