

世界畅销非专利药产品开发 精选 120 种

国家医药管理局信息中心

前 言

目前,世界销售额领先的商标名药(Branded drug)的专利相继到期,这些非专利药(Generic drug)仍具有相当的生命力,它们正在从专利药中脱颖而出,在与商标药的市场争夺中焕发出第二青春。非专利药市场的崛起,标志着世界制药工业进入一个新的发展时期。世界制药公司在研究开发新药(NCE)的同时,普遍重视非专利药的开发。非专利药的开发为我国制药工业提供了发展的跳板和参与国际竞争的机遇。为了促进我国制药工业新药开发和产品结构调整,根据国内外最新资料,编译了《世界畅销非专利药产品开发精选 120 种》,供医药界同行进行产品开发、市场营销和临床用药参考。

该资料收录的 120 个品种,专利已经到期或即将到期,销售额世界领先,包括抗感染药、消炎镇痛药、心脑血管药、精神系统药、呼吸系统药、抗肿瘤药、抗溃疡药、抗糖尿病药、免疫系统药等 20 余种类型。每个品种提供的信息包括中文名、通用名、商标名(生产厂商)、化学名、作用类型、作用特点、适应症、用法与用量、不良反应、禁忌症、注意事项、1993 年世界销售额、1996 年世界销售额预测、专利期满年份、国内商品剂型(生产厂家)和保护期、进口商品剂型(生产厂家)、CA 登记号、专利与文献(1500 余篇)等。为方便读者使用,编有目录和索引。全部资料共有 23 万余字。

本资料由王世玉等编译,王普善审订。由于时间紧迫和水平所限,不妥之处在所难免,恳请同行不吝指教,以利总结经验,改进工作。

编 者

1996 年 3 月

目 录

抗微生物药物

一、抗生素

1. 青霉素类抗生素

羟氨苄青霉素	(007)
舒巴克坦钠	(048)
奥格门丁	(055)

2. 头孢菌素类抗生素

头孢克洛	(010)
头孢噻肟钠	(030)
头孢他啶	(046)
头孢曲松钠	(056)
头孢呋肟酯	(058)
头孢克肟	(099)
氟莫头孢	(119)

3. 氨基甙类抗生素

替考拉宁	(116)
------	-------

4. 大环内酯类抗生素

克拉红霉素	(076)
阿齐红霉素	(109)
罗红霉素	(112)

5. 四环素类抗生素

盐酸米诺环素	(002)
--------	-------

6. 林可霉素类抗生素

克林霉素磷酸酯	(004)
---------	-------

7. 多肽类抗生素

盐酸万古霉素	(001)
--------	-------

8. 其他类抗生素

亚胺培南/西司他丁钠	(070)
------------	-------

二、喹诺酮类抗菌药

盐酸环丙沙星	(077)
--------	-------

三、抗真菌药

酮康唑	(047)
氟康唑	(074)
伊曲康唑	(113)

四、抗病毒药

阿昔洛韦	(034)
齐多夫定	(083)

中枢神经系统药物

一、镇痛药

琥珀酸舒马坦..... (107)

二、解热镇痛抗炎药

吡罗昔康..... (011)

二氯芬酸..... (013)

萘普生钠..... (014)

酮洛酸氨丁三醇..... (038)

依托度酸..... (039)

萘丁美酮..... (061)

酮洛芬..... (104)

替诺喜康..... (118)

三、抗忧郁药

盐酸帕罗酇..... (040)

盐酸氟西汀..... (064)

盐酸舍曲林..... (071)

四、镇静、催眠药

劳拉西泮..... (026)

咪达唑仑..... (049)

五、抗焦虑药

阿普唑仑..... (016)

盐酸丁螺环酮..... (053)

六、抗癫痫药

卡马西平..... (003)

氯硝西泮..... (052)

双丙戊酸氢钠..... (088)

七、抗震颤麻痹药

溴隐亭甲磺酸盐..... (009)

八、其他类药

他克林..... (097)

循环系统药物

一、抗心律失常药

盐酸维拉帕米..... (008)

美西律盐酸盐..... (090)

二、抗心绞痛药

硝苯地平..... (005)

盐酸地尔硫革..... (024)

硝酸甘油贴膜..... (084)

尼索地平..... (114)

三、抗高血压药

阿替洛尔盐酸盐.....	(015)
美托洛尔酒石酸盐.....	(018)
卡托普利.....	(028)
甲磺酸多沙唑嗪.....	(051)
马来酸依那普利.....	(054)
盐酸特拉唑嗪.....	(063)
赖诺普利.....	(066)
氨基地平苯磺酸盐.....	(075)
盐酸尼卡地平.....	(098)
福辛普利.....	(101)
伊拉地平.....	(103)
非洛地平.....	(108)
西拉普利.....	(120)

四、降血脂药及防治动脉粥样硬化药

吉非罗齐.....	(017)
洛伐他丁.....	(043)
普伐他汀.....	(045)
西伐他丁.....	(065)

五、抗心衰药

盐酸多巴酚丁胺.....	(021)
--------------	-------

六、周围血管用药

己酮可可碱.....	(036)
艾地苯醌.....	(094)
尼莫地平.....	(105)

呼吸系统药物

一、平喘药

硫酸沙丁胺醇.....	(006)
丙酸倍氯米松.....	(044)
阿司咪唑.....	(050)
异丙托溴铵.....	(095)
特布他林硫酸盐.....	(102)

二、抗变态反应药

特非拉定.....	(023)
氯雷他定.....	(042)
富马酸酮替芬.....	(096)

消化系统药物

一、抗溃疡药

西咪替丁.....	(022)
法莫替丁.....	(057)
盐酸雷尼替丁.....	(067)

尼札替丁.....	(072)
奥美拉唑.....	(082)
兰索拉唑.....	(091)
替普瑞酮.....	(115)

二、止吐药

盐酸奥坦西隆.....	(081)
盐酸格雷西隆.....	(106)

三、助消化药

西沙必利.....	(087)
-----------	-------

抗肿瘤药

一、抗肿瘤植物药

依托泊甙.....	(019)
紫杉醇.....	(110)

二、激素类抗肿瘤药

醋酸亮丙瑞林.....	(031)
枸橼酸他莫昔芬.....	(069)
醋酸甲羟孕酮.....	(089)
氟他胺.....	(111)

三、其他类抗肿瘤药

醋酸戈舍瑞林.....	(041)
重组干扰素.....	(068)
卡铂.....	(080)
去氧氟尿苷.....	(117)

影响血液及造血系统的药物

一、抗贫血药

重组人红细胞生成素.....	(078)
----------------	-------

二、促白细胞增生药

非拉替姆.....	(086)
-----------	-------

三、抗血小板药

噻氯匹定盐酸盐.....	(092)
--------------	-------

麻醉药及骨骼肌松弛药

一、麻醉药

普罗弗尔.....	(033)
-----------	-------

二、肌松药

阿曲库铵苯磺酸盐.....	(093)
---------------	-------

降血糖药物

格列本脲.....	(025)
格列吡嗪.....	(027)
单组分人胰岛素.....	(059)

激素类药物

左旋炔诺孕酮.....	(020)
雌二醇.....	(060)

眼科用药

马来酸噻吗心安.....	(037)
色甘酸钠.....	(062)

皮肤科用药

异维 A 酸	(073)
--------------	-------

诊断造影剂

碘帕醇.....	(032)
碘海醇.....	(035)

免疫抑制剂

环孢菌素.....	(029)
硫唑嘌呤.....	(100)

生物药品

基因重组生长激素.....	(012)
β -依泊丁	(079)
阿特普酶.....	(085)

001 【中文名】 盐酸万古霉素

【通用名】 Vancomycin Hydrochloride

【商标名(生产厂商)】 Vancocin (Eli Lilly); Vancomycin HCl (Lilly); vancocina (Lilly); Vancomycin (Shionogi)

【作用类型】 抗生素类药。

【CA 登记号】 CAS-1404-90-6; CAS-1404-93-9

【作用特点】 本品抗菌谱窄,主要对革兰氏阳性菌有效。如溶血性链球菌、葡萄球菌、肠球菌、肺炎球菌、棒状杆菌和梭状芽胞杆菌等。高浓度对本品杀菌作用迅速。但对革兰氏阴性菌、真菌无效。本品的作用机理是阻断粘肽复合物的结合而抑制细菌细胞壁合成。细菌对本品不容易产生耐药性,本品与其它抗生素也无交叉耐药性。本品口服不吸收,肌内注射极痛,一次静注 0.5g,1-2 小时血浓度达峰值, $t_{1/2}$ 为 6 小时,12 小时后仍可测到有效血浓度。其杀菌浓度可渗入胸膜、心包液、腹水及滑液内,脑膜发炎时可进入脑脊液,其浓度为血清浓度的 10-20%。本品大部分经肾脏排泄,反复给药时有蓄积作用,肾功能减退者 $t_{1/2}$ 可延长到 150-240 小时。

【适应症】 临床只限用于对其它抗生素产生耐药性的严重葡萄球菌感染,如败血症、心内膜炎、肺炎、脑膜炎等。

【用法与用量】 静注 成人 2g/d,每 12 小时 1g 或每 6 小时 0.5g,儿童 45mg/kg.d。先用 10ml 注射用水将 0.5g 溶解,再加入 100-200ml 的生理盐水或 5%葡萄糖液中进一步稀释后,20-30 分钟缓慢注入。

【不良反应】 主要不良反应是对听觉及肾脏有损害,肾毒性表现为蛋白尿、血尿、尿素氮升高;另外可引起血栓性静脉炎、皮疹、药物热、注射区疼痛也多见;有时可引起二重感染。

【禁忌症】 严重肝肾功能不全,对本品过敏者禁用。

【注意事项】 1. 肾功能不全者及新生儿慎用。2. 治疗期间应经常检查肝、肾功能,听力和尿、血常规。3. 本品不宜推荐作为常规用药或用于轻度感染症。

【1993 年世界销售额(亿美元)】 2.650 (Lilly)

【1996 年世界销售额预测(亿美元),年增

长率(%) (生产公司)】 3.150;3.6(Lilly)

【专利期满年份】 1979

【进口商品剂型(生产厂商)】 粉针剂:0.5g,美国“Lilly”;针剂,美国“Abbott”。

【专利与文献】

1. Antibiot. Ann. 1955-56,606

2. U. S. pat. 3,067,099 (Lilly,1962)

3. Antibiot. Ann. 1957-58,906

4. J. Med. Chem. 8;18(1965)

5. J. Chem. Soc. Perkin Trans 1: 443 (1972)

6. ibid. 2369(1974)

7. Nature 271:223(1978)

8. J. Am. Chem. Soc. 103:6580(1961)

9. ibid. 105:6915(1983)

10. Biochem. J. 123:789(1971)

11. J. Am. Chem. Soc. 99:2768(1977)

12. Antibiot. Ann. 1956-57,75

13. J. Antimicrob. Chemother. 14, Suppl. D,1-109(1984)

14. Eur. pat. 145484 (Eli Lilly,1984)

15. Drugs of Today 22:491(1986)

【合成路线】 略

002 【中文名】 盐酸米诺环素

【通用名】 Minocycline Hydrochloride

【商标名(生产厂商)】 Minocin (Lederle); Klinomycin (Lederle); Mynocine (Lederle-Novalis); Minocin (Cyanamid); Minocin Vena (Cyanamid); Minomycin (Lederle-Takeda); Vectrin (Parke-Davis)

【化学名】 4,7-Bis(dimethylamino)-1,4,4a,5,5a,6,11,12a-octahydro-3,10,12,12a-tetrahydroxy-1,11-dioxo-2-naphthacene-carboxamide hydrochloride

【作用类型】 抗生素类药。

【CA 登记号】 CAS-10118-90-8; CAS-13614-98-7

【性状】 本品为黄色片。

【作用特点】 本品为半合成四环素抗生素,其抗菌作用在四环素抗生素中较强。本品对革兰氏阳性菌,包括四环素耐药株的金黄色葡萄球菌、链球菌、脑膜炎双球菌等均高度敏感,对革兰氏阴性的淋球菌作用亦很强,对革兰氏

阴性杆菌的作用一般较弱,另外本品对沙眼衣原体和溶脲支原体亦有较好的抑菌作用。

本品脂溶性高,口服吸收完全,一次口服0.3g,2-3小时内可达血药峰浓度,其值为5-6 μ g/ml、超过常见敏感菌的MIC(0.3-3 μ g/ml)。本品在体内分布广泛,可进入甲状腺、肠、肝、肾、肺、脑、前列腺等组织,在胆汁及尿中浓度比血浓度高10-30倍。本品排泄缓慢,主要从肾和胆汁排出,平均半衰期为10小时左右。血清蛋白结合率为76-83%。

【适应症】 适用于因葡萄球菌、链球菌、肺炎球菌、淋球菌、痢疾杆菌、大肠杆菌、克雷伯氏菌、变形杆菌、绿脓杆菌、梅毒螺旋体及衣原体等对盐酸米诺环素敏感的病原体引起的下列感染症:

1. 败血症、菌血症。
2. 浅表性化脓性感染:毛囊炎、脓皮症、疖、疖肿症、痈、蜂窝组织炎、汗腺炎、痤疮、皮脂囊肿粉瘤、乳头状皮肤炎、甲沟炎、脓肿、鸡眼继发性感染;扁挑体炎、肩周围炎、咽炎;泪囊炎、眼睑缘炎、麦粒肿;牙龈炎、牙冠周围炎、牙科上颌窦炎、感染性上腭囊肿、牙周炎、外耳炎;外阴炎、阴道炎;创伤感染、手术后感染。
3. 深部化脓性疾病:乳腺炎、淋巴管炎、颌下腺炎、骨髓炎、骨炎。
4. 急慢性支气管炎、喘息性支气管炎、支气管扩张、支气管肺炎、细菌性肺炎、异型肺炎、肺部化脓症。
5. 痢疾、肠炎、感染性食物中毒、胆管炎、胆囊炎。
6. 腹膜炎。
7. 肾盂肾炎、肾盂炎、肾盂膀胱炎、尿道炎、膀胱炎、前列腺炎、副睾丸炎、宫内感染、淋病。
8. 中耳炎、副鼻窦炎、颌下腺炎。
9. 梅毒。

【用法与用量】 口服。成人首次给药量0.2g,以后每隔12小时再口服0.1g,或遵医嘱。

【不良反应】

1. 休克:偶有休克现象发生,须注意观察,如发现有不快感、口内异常感、哮喘、便意、耳鸣等症状时,应中止给药,并作适当处理。
2. 过敏症:偶有发热、皮疹、荨麻疹、光过敏症、浮肿(四肢、颜面)等过敏症状发生,应中止给药,稀有全身性红斑狼疮出现,应中止给药,

并作适当处理。

3. 皮肤:长期服用后,偶有皮肤、粘膜处色素沉着现象发生。

4. 中枢神经系统:偶有头晕、对汽车驾驶员、从事危险性较大的机器操作以及高空作业者,应中断上述工作。

5. 肝脏:偶有SGOT、SGPT上升等肝功能异常现象,此外,大剂量给药会造成肝损害(黄疸、脂肪肝等)。

6. 消化器官:时有食欲不振、恶心、呕吐、腹痛、腹泻、口腔炎、舌炎、肛门周围炎等症状。

7. 血液:偶有血小板减少、中性粒细胞减少、嗜酸性粒细胞增多等症状。

8. 菌群交替症:如有因菌群交替症引起其他致病菌感染时,应中止给药,并作适当处置。

9. 维生素缺乏症:偶有维生素K缺乏症状(低凝血酶原血症,出血倾向等)、维生素B类缺乏症(舌炎、口腔炎、食欲不振、神经炎等)等症状。

10. 颅内压升高:偶有呕吐、头痛、复视、郁血乳头、前卤膨隆等伴有颅内压升高的症状的出现,此时应中止给药。

11. 其它:时有头晕、倦怠感等。

【禁忌症】 对四环素类药过敏者禁用。

【注意事项】

1. 由于服用米诺环素会使牙齿着色、珐琅质形成不全、一时性骨骼发育不全等现象发生,对新生儿、婴幼儿及小儿最好在其它药物无效或不能服用时再处方盐酸米诺环素。

2. 妊娠后期服用本品使胎儿发生一时性骨骼发育不全,牙齿色素沉着及珐琅质形成不全等症状;动物实验证实米诺环素对胎儿有毒性,故对妊娠妇女或可能受孕的妇女给药时应权衡利弊慎重处方。

3. 如该药滞留于食道并崩解时,会引起食道溃疡,故要多饮水,尤其是临睡前服用更应注意。

4. 对下列病人给药时须慎重。

(1)有肝脏损害者;

(2)有肾脏损害者;

(3)有食道通过障碍者;

(4)口服吸收不良或不能进食的病人、老年人、全身状况恶化的病人(因会引发维生素K缺乏症,应注意观察)。

【1993 年世界销售额(亿美元)】 2. 500 (Lederle)

【1996 年世界销售额预测(亿美元); 年增长率(%) (生产公司)】 1. 600; -13. 5 (Am-Cyanamid)

【专利期满年份】 1982

【国内商品剂型(生产厂家)】 胶囊剂(重庆第七制药厂; 成都制药厂; 丹东制药厂; 深圳中联制药厂; 云南省昆明制药厂; 哈尔滨制药四厂; 苏州立达制药厂有限公司)片剂(广州白云山制药厂; 丹东制药厂)。

【国内商品保护期】 胶囊剂, 三年自 1992 年 9 月 25 日至 1995 年 9 月 24 日; 片剂, 三年自 1994 年 5 月 19 日至 1997 年 5 月 18 日。

【进口商品剂型(生产厂家)】 胶囊剂(美国 Lederle); 胶囊剂, 颗粒剂(美国 American Cyanamid Co.); 原料药(日本 Kyowa Hakk Kogyo); 原料药(意大利 Biochimica Opos S. P. A.); 原料药(意大利 Pierrel S. P. A.)。

【专利与文献】

1. Drugs of Today 5: 73 (1969); 7: 188 (1971); 8: 93 (1972)

2. U. S. pat. 3, 148, 212 (American Cyanamid, 1964)

3. U. S. pat. 3, 226, 436 (American Cyanamid, 1965)

4. U. S. pat. 3, 345, 410 (American Cyanamid, 1967)

5. J. Org. Chem. 36: 723 (1971)

6. J. Med. Chem. 10: 44 (1967)

7. Farmaco Ed. Sei. 30: 736 (1975)

8. Antimicrob. Ag. Chemother. 1966, 359

9. Toxicol. Appl. Pharmacol. 11: 171 (1967)

10. ibid. 128

11. Antimicrob. Ag. Chemother. 1968, 335

12. Curr. Ther. Res. 13: 227 (1971)

【合成路线】 略

003 【中文名】 卡马西平

【通用名】 Carbamazepine

【商标名(生产厂商)】 Tegretol (Ciba); Tegretal (Geigy); Timonil (Desitin); Lexin (Fujinaga); Telesmin (Yoshitom)

【化学名】 5H-Dibenz[b, f]azepine-5-carboxamide

【作用类型】 抗癫痫, 镇痛药。

【CA 登记号】 CAS-298-46-4

【作用特点】 本品有抗癫痫作用, 对精神运动性发作最有效, 对大发作与局限性发作的疗效与苯妥英钠相似, 可作为苯妥英钠的替代品; 有抗外周神经痛的作用, 对三叉神经和舌后神经痛, 疗效比苯妥英钠好, 显效也快; 此外, 还具有利尿作用, 可迅速减少尿崩症的尿量及缓解口渴症状。

本药口服吸收相对缓慢, 口服后 4-24 小时血药浓度达峰值, 与血浆蛋白结合率为 70-80%。口服 1 次后, 血浆中 $t_{1/2}$ 平均约为 36 小时, 而多次给药, 由于肝脏酶的自身诱导, 其 $t_{1/2}$ 平均为 16-24 小时, 如同时接受有酶诱导作用的其它抗癫痫药患者, 痛可灵的平均 $t_{1/2}$ 为 9-10 小时。仅有 2-3% 的药物以原形从小便排出。

【适应症】 主要用于精神运动性发作癫痫性精神病, 癫痫后性格障碍, 对大发作和局限性发作和混合型癫痫有效, 对小发作无效。另外, 还用于三叉神经痛。治疗中枢神经性尿崩症及多尿症。

【用法与用量】 口服 癫痫: 成人开始 100mg/次, 每日 2 次, 然后慢慢增加剂量, 直至达到理想的疗效, 通常为 400mg/d, 分 2-3 次, 饭时服; 儿童按 10-20mg/kg. d 计算, 分次服药。

三叉神经痛: 开始 200-400mg/d, 慢慢加量至疼痛消失, 用量可达 1000-1200mg/d, 然后, 渐渐减到维持量, 疗程最短的 1 周见效, 最长 2-3 个月。尿崩症: 200mg/次, 每日 2-3 次。对儿童可按年龄和体重, 酌情给药。

【不良反应】 偶尔可发生以下副作用, 如食欲不振、口干、恶心、腹泻、便秘、头痛、嗜睡、运动失调, 老年人可发生精神混乱和焦虑, 以上副作用通常在 7-14 天后可自行消失。偶还见少数病人发生皮肤过敏反应、剥脱性皮炎、白细胞减少、血小板减少、粒细胞缺乏、再障性贫血、血栓、心传导障碍、黄疸、肝功能不全、蛋白尿、充血性心力衰竭等。

【禁忌症】 对本品过敏者、房室传导阻滞者禁用。

【注意事项】

1. 对严重心血管病,肝、肾功能不全者,怀孕早期的妇女、授乳妇女及老年病人,应在医生严格监护下,选择合适剂量,一般尽量不用本品。

2. 用药期间定期查血象,肝功能、尿常规。

3. 出现过敏反应,白细胞和(或)血小板减少,肝功能恶化,应停药。

【1993年世界销售额(亿美元)】 3.363 (Ciba)

【1996年世界销售额预测(亿美元);年增长率(%) (生产公司)】 3.590;2.9 (Ciba-Geigy)

【专利期满年份】 1986

【进口商品剂型(生产厂家)】 片剂,原料药,缓释片剂(瑞士 Ciba-Geigy);片剂(芬兰 Huhtamaki);缓释片(芬兰 Orion);片剂(塞浦路斯 Messre Remedica);片剂(民主德国 VEB)。

【专利与文献】

1. Drugs of Today 1:82 (1965)
2. U. S. pat. 2,948,718 (Geigy, 1960)
3. Drug Metab. Rev. 4:97 (1975)
4. Clin. Pharmacokinet. 3:128-143 (1978)
5. Ther. Drug Monit. 1:409-431 (1979)
6. Med. Exp. 11:191 (1964)

【合成路线】 略

004 【中文名】 克林霉素磷酸酯(氯洁霉素)

【通用名】 Clindamycin Phosphate

【商标名(生产厂商)】 Cleocin (Upjohn); Sobelin (Upjohn); Dalacine (Upjohn); Dalacin C (Upjohn)

【化学名】 Mithyl-7-chloro-6,,7,8-trideoxy-6-trans-(1-methyl-4-propyl-L-2-pyrrolidinecarboxamido)-1-thio-threo- α -D-galacto-octopyranosidephosphate

【作用类型】 抗生素类药。

【CA登记号】 CAS-18323-44-9; CAS-21462-39-5

【性状】 本品为无色或微带黄色的澄明液体。

【作用特点】 本品为化学半合成的克林霉素衍生物,它在体外无抗菌活性,进入机体迅速

水解为克林霉素而显示其药理活性,故抗菌谱、抗菌活性及治疗效果与克林霉素相同,但它的脂溶性及渗透性比克林霉素好,可口服也可肌肉注射和静脉滴注给药。与林可霉素相比其抗菌作用强4-5倍,吸收好、血浓度高、且对厌氧菌感染具有良好的疗效。本品主要对革兰氏阳性球菌及厌氧菌有很强的抗菌活性,包括:革兰氏阳性球菌:金黄色葡萄球菌、表皮葡萄球菌、链球菌(磷链球菌除外)、肺炎链球菌、微球菌属等;厌氧菌:梭状芽孢杆菌属、拟杆菌属、梭状杆菌属、丙酸杆菌属、真杆菌、厌氧球菌等。

克林霉素磷酸酯进入机体后在血液中碱性磷酸酯酶作用下很快水解为克林霉素。正常人的药代动力学表明:单次静脉滴注0.6g克林霉素磷酸酯,血液中克林霉素立即达高峰,浓度为 $11.09 \pm 2.02 \text{mg/L}$,8小时血浓度为 $1.69 \pm 0.35 \text{mg/L}$ 。单次肌注0.6g,血液中克林霉素1-2小时达高峰,浓度为 $5.92 \pm 1.45 \text{mg/L}$,8小时血浓度为 $2.51 \pm 0.91 \text{mg/L}$,有效血浓度可维持8小时以上。克林霉素磷酸酯给药后,主要在肝内代谢,并经胆汁和粪便排泄,每6小时静脉滴注0.6g,胆汁中浓度可达48-55mg/L,部分经尿排泄。静脉滴注和肌肉注射0.6g,8小时排泄率分别为 $11.72 \pm 1.33\%$ 和 $10.51 \pm 2.68\%$ 。

【适应症】 革兰氏阳性菌引起的下列各种感染性疾病:

1. 扁桃体炎、化脓性中耳炎、鼻窦炎等。
2. 急性支气管炎、慢性支气管炎急性发作、肺炎、肺脓肿和支气管扩张合并感染等。
3. 皮肤和软组织感染:疖、痈、脓肿、蜂窝组织炎、创伤、烧伤和手术后感染等。
4. 泌尿系统感染:急性尿道炎、急性肾盂肾炎、前列腺炎等。
5. 其他:骨髓炎、败血症、腹膜炎和口腔感染等。

厌氧菌引起的各种感染性疾病:

1. 脓胸、肺脓肿、厌氧菌性肺炎。
2. 皮肤和软组织感染、败血症。
3. 腹内感染:腹膜炎、腹腔内脓肿。
4. 女性盆腔及生殖器感染:子宫内膜炎、非淋球菌性输卵管及卵巢脓肿、盆腔蜂窝组织炎及妇科手术后感染等。

【用法与用量】

成人:深部肌肉注射或静脉滴注给药:

中度感染:0.6-1.2g/日,分2、3、4等分剂量,每12、8、6小时一次。

严重感染:1.2-2.7g/日,分2、3、4等分剂量,每12、8、6小时一次。或遵医嘱。

儿童:肌肉注射或静脉滴注给药:

中度感染:15-25mg/kg日,分3或4等分剂量,8或6小时一次。

重度感染:25-40mg/kg日,分3或4等分剂量,8或6小时一次。或遵医嘱。

静脉滴注需将本品0.6g用100-200ml生理盐水或5%葡萄糖液稀释 $\leq 6\text{mg/ml}$ 浓度的药液,静脉滴注30分钟。

【不良反应】

1. 局部反应:肌肉注射后,在注射部位偶可出现轻微疼痛,长期静脉滴注应注意静脉炎的出现。

2. 胃肠道反应:偶见恶心、呕吐、腹痛及腹泻。

3. 过敏反应:少数病人可出现药物性皮炎。

4. 对造血系统基本无毒性反应,偶可引起中性粒细胞减少,嗜酸性粒细胞增多,血小板减少等,一般轻微为一过性。

5. 少数病人可发生一过性碱性磷酸酶、血清转氨酶轻度升高及黄疸。

6. 极少数病人可产生伪膜性结肠炎。

【禁忌症】 本品与林可霉素、克林霉素有交叉耐药性,对克林霉素或林可霉素有过敏史者禁用。

【注意事项】

1. 和青霉素、头孢菌素类抗生素无交叉反应,可用于对青霉素类过敏者。

2. 与氨苄青霉素、苯妥英钠、巴比妥盐酸盐、氨茶碱、葡萄糖钙及硫酸镁可产生配伍禁忌;与红霉素呈拮抗作用,不宜合用。

3. 肝、肾功能损害者及小于4岁儿童慎用。孕妇及哺乳期妇女使用本品应注意其利弊。

4. 如出现伪膜性肠炎,选用万古霉素口服0.125-0.5g,每日4次进行治疗。

【1993年世界销售额(亿美元)】2.330(Upjohn)

【1996年世界销售额预测(亿美元);年增长率(%)(生产公司)】2.050;-2.4(Upjohn)

【专利期满年份】1986

【国内商品剂型(生产厂家)】 原料药(华

北制药厂);注射剂(华北制药厂)。

【国内商品保护期】三年自1994年1月19日至1997年1月18日。

【进口商品剂型(生产厂家)】 粉针剂;胶囊剂(比利时 Upjohn);原料药(意大利 Biochimica Opos S. P. A.);外用液(波多黎谷 Upjohn);霜剂(美国 Upjohn)。

【专利与文献】

1. Drugs of Today 6:171 (1971);7:188 (1972)

2. U. S. pat. 3,418,414 (Upjohn;1968)

3. U. S. pat. 3,475,407 (Upjohn;1969)

4. U. S. pat. 3,509,127 (Upjohn;1970)

5. U. S. pat. 3,627,887 (Upjohn;1971)

6. J. Chem. Soc. 2224 (1953)

7. J. Chem. Soc. 2281 (1954)

8. J. Chem. Soc. 3043 (1956)

9. Antimicrob. Ag. Chemother. 727 (1966)

10. U. S. pat. 3,544,551 (Upjohn;1970)

11. U. S. pat. 3,513,155 (Upjohn;1970)

12. J. Med. Chem. 13:616 (1970)

13. J. Pharm. Sci. 59:63 (1970)

14. J. Med. Sci. 256:279 (1968)

15. J. Antimicrob. Chemother. 7, Suppl. A,3 (1981)

16. Toxicol. Appl. Pharmacol. 21: 516 (1972)

【合成路线】 略

005 【中文名】 硝苯地平(心痛定)

【通用名】 Nifedipine

【商标名(生产厂商)】 Adalat (Bayer); Adalate (Bayer-Pharma); Nifedin (Gentili); Procardia (Pfizer); Citilat (C. T.); Nifehexal (Hexal); Procardia (Bayer)

【化学名】 1,4-Dihydro-2,6-dimethyl-4-(O-nitrophenyl)-3,5-pyridinedicarboxylic acid, dimethyl ester

【作用类型】 钙拮抗剂,抗高血压,抗心绞痛药。

【CA登记号】 CAS-21829-25-4

【性状】 本品为薄膜衣片,除去薄膜衣后显黄色。

【作用特点】 硝苯地平通过阻碍心肌及血管平滑肌钙离子的膜转运抑制钙离子向细胞内的流入,引起心肌的收缩性降低和血管扩张。动物实验表明,通过降低心肌的收缩性及末梢血管的抵抗性,而使心肌的耗氧量减少;通过冠状血管的扩张和侧副行路的发达,增加心肌缺血部位的氧供给;通过抑制高能量磷酸化物的消耗,增强抗缺氧能力。

本品口服后经胃肠道吸收迅速而完全,由于肝首过效应造成本品的生物利用度低,本品的控释片血浓度峰时在 1.6-4 小时之间,血药浓度-时间曲线平缓长久,每服用一次能维持最低有效血药浓度(10ng/ml)以上时间达 12 小时。

本品组织分布广泛,药物在肝、血清、肾及肺中浓度较高,而在脑、骨骼肌中浓度较低。本品在人体内血浆蛋白结合率达 92-98%,但其主要代谢物的蛋白结合率较低,为 54%。

本品在体内经肝微粒酶系统包括细胞色素 P-450 单氧化酶的作用被氧化成三种无药理活性的代谢物,70-80% 的药物以水溶性代谢物从尿中排出,24 小时后 90% 的药物消除,主要以非原型的代谢产物从尿中排出,原型药物仅 0.1% 经尿排泄,体内无蓄积作用。

【适应症】 各种类型的高血压及心绞痛。

【用法与用量】 口服。一次 10-20mg,一日 2 次。极量,一次 40mg,一日 0.12g。

【不良反应】

1. 肝脏:偶尔出现黄疸及 GOT、GPT 上升。

2. 循环系统:偶尔出现胸部疼痛、头痛、脸红、眼花、心悸、血压下降、下肢浮肿等。

3. 过敏症:偶尔出现麻疹、瘙痒等过敏症状。

4. 消化系统:偶尔出现腹痛、恶心、食欲不振、便秘等症。

5. 口腔:可能出现齿肉肥厚。

6. 代谢异常:偶尔出现高血糖症状。

【注意事项】

1. 中止服用 Ca 拮抗剂时应逐渐减量,没有医生指示,不要中止服药。

2. 孕妇、儿童禁用。

3. 低血压患者慎用。

4. 严重主动脉瓣狭窄、肝肾功能不全患者慎用。

【1993 年世界销售额(亿美元)】 12.090 (Pfizer);12.000 (Miles)

【1996 年世界销售额预测(亿美元);年增长率(%)(生产公司)】 9.300;-2.1 (Pfizer); 9.260;-3.0 (Bayer)

【专利期满年份】 1989

【国内商品剂型(生产厂家)】 控释片剂(青岛黄海制药厂);片剂(山东省德州制药厂)

【国内商品保护期】控释片剂,三年自 1991 年 12 月 27 日至 1994 年 12 月 26 日;片剂,三年自 1992 年 8 月 25 日至 1995 年 8 月 24 日。

【进口商品剂型(生产厂家)】 软胶囊剂(西德 Bayer);片剂(芬兰 Farnos);胶囊剂(西德 Hexal)。

【专利与文献】

1. S. Afr. pat. 6801,482 (Bayer;1968)
2. U. S. pat. 3,485,847 (Bayer;1969)
3. Arzneimittel-Forsch. 22: 1-56, 330-388 (1972)
4. Am. J. Cardiol. 47:179 (1981)
5. Arzneimittel-Forsch. 32:267 (1982)
6. N. Engl. J. Med. 308:880 (1983)
7. Gen. Pharmacol. 17:255-260 (1986)
8. U. S. pat. 3,644,627 (Bayer;1972)
9. U. S. pat. 3,784,684 (Bayer;1974)
10. Drugs of Today 11:152 (1975);8:438 (1972)

【合成路线】 略

006 【中文名】 硫酸沙丁胺醇

【通用名】 Salbutamol Sulfate

【商标名(生产厂商)】 Albuterol (USAN);Cybutol (Pharbita B. V.);Proventil (Schering);Salmol (Atlantic);Ventilan (Glaxo);Ventolin (Glaxo)

【化学名】 1-(3-Hydroxymethyl-4-hydroxyphenyl)-2-tertbutylaminoethanolsulfate

【作用类型】 β -2 受体激动剂,支气管扩张药。

【CA 登记号】 CAS-18559-94-9;CAS-51022-70-9

【作用特点】 本品为选择性 β_2 受体兴奋剂。支气管扩张作用较异丙肾上腺素强约 10 倍,兴奋心脏的作用为后者的 1/7-1/10。其作

用持续时间为同剂量异丙肾上腺素的3倍。

口服从胃肠道吸收,15分钟起效,2小时血药浓度达峰值,由于本品在体内不被儿茶酚氧位甲基转移酶代谢失活,因此可维持4-6小时。

【适应症】用于支气管哮喘,喘息性支气管炎,支气管痉挛,支气管扩张,肺气肿等。

【用法与用量】口服 成人:2-6mg/次,每日3次;儿童:2-6岁,1-2mg/次;6-12岁,2mg/次;12岁以上,2-4mg/次;每日3次。儿童对本品耐受性好,必要时可审慎地增加剂量。

【不良反应】副作用主要有肌肉和手指震颤、心悸、头痛、恶心、失眠等。

【禁忌症】甲亢、高血压、心功能不全者禁用。

【注意事项】

1. 孕妇初期、糖尿病患者慎用。
2. 老年及对受体兴奋剂敏感者慎用,使用时应从小剂量开始逐渐加大剂量。
3. 不能与 β 阻滞剂合用。
4. 久用易产生耐药性。

【1993年世界销售额(亿美元)】7.792 (Glaxo);3.530 (Schering-Plough)

【1996年世界销售额预测(亿美元);年增长率(%) (生产公司)】10.090;0.9 (Glaxo);5.250;4.0 (Schering-Plough)

【专利期满年份】1989

【进口商品剂型(生产厂家)】片剂,长效片剂,粉剂,气雾剂,粉吸入剂(英国 Glaxo);片剂,气雾剂(芬兰 Huhtamaki oy Leiras)。

【国内商品剂型(生产厂家)】气雾剂(重庆葛兰素制药有限公司)。

【国内商品保护期】三年自1991年6月20日至1994年6月19日。

【专利与文献】

1. Drugs of the Future 4:629 (1979)
2. Drugs of Today 5:136 (1969)
3. Brit. pat. 1,200,886 (Allen & Hanburys,1966)
4. U. S. pat. 3,642,896 (Allen & Hanburys,1972)
5. U. S. pat. 3,705,233 (Allen & Hanburys,1972)
6. S. Afr. pat. 6705,591 (Allen & Hanburys,1968)

7. U. S. pat. 3,644,353 (Allen & Hanburys,1972)

8. J. Med. Chem. 13:674 (1970)

9. ibid. 14:895 (1971)

10. Nature 219:862 (1968)

11. Brit. J. Pharmacol. 35:141 (1969)

12. Eur. J. Pharmacol. 14:183 (1971)

13. Arch. Intern. Med. 138:1394 (1978)

14. ibid. 139:639 (1979)

15. Lancet 1:42 (1981)

16. Drugs 1:274-302 (1971)

【合成路线】略

007 【中文名】羟氨苄青霉素(阿莫西林)

【通用名】Amoxicillin

【商标名(生产厂商)】Amoxil (Smith Kline Beecham);Amoxycillin trihydrate (B. P. 1980, U. S. P.);Amolin (Takeda Japan), Bristamox (Bristol);Clamoxyl (Beecham);Larocin (Roche)

【化学名】D-(-)- α -Amino-p-hydroxybenzyl-penicillin trihydrate

【作用类型】青霉素类抗生素。

【CA登记号】CAS-26787-78-0

【性状】本品为白色或类白色片。

【作用特点】本品为广谱半合成青霉素,对于溶血性链球菌、草绿色链球菌、肺炎球菌、青霉素G敏感金黄色葡萄菌、淋球菌、流感嗜血杆菌、肠球菌、沙门氏菌、伤寒杆菌及变形杆菌等均有抗菌作用。

本品对产生青霉素酶的金黄色葡萄菌无作用。细菌对本品和氨苄青霉素有完全交叉耐药性。

本品耐酸,口服后吸收良好,且不受食物影响,一小时血浓度达高峰,其峰值为氨苄青霉素的2-3倍。口服本品后正常人的血中半衰期为1小时,血清蛋白结合率17%;8小时内尿中排泄量可达药量的77%,部份药物经胆汁排泄。本品在尿溶液胆汁中的浓度较高,并能渗入痰液,达到抗菌浓度,但难以通过血脑屏障。

【适应症】对本品敏感细菌引起的上呼吸道感染、咽炎、扁桃体炎、急性慢性支气管炎、肺炎、支气管扩张症、尿路感染、皮肤及软组织感染等。

【用法与用量】 口服 一次 0.5-1g,一日 3-4 次服用。小儿每公斤体重一日 50-100mg,分 3-4 次服用。

【不良反应】 少数患者可出现恶心、呕吐、食欲减退、腹泻等消化道副反应,一般不影响治疗。偶可出现皮疹,应立即停药。

【禁忌症】 对青霉素类药物过敏者禁用。

【注意事项】 使用前需做青霉素钠的皮内敏感试验,阳性反应者禁用。

【1993 年世界销售额(亿美元)】 4. 185 (SKB)

【1996 年世界销售额预测(亿美元);年增长率(%)(生产公司)】 2. 950;-7. 1(SK B)

【专利期满年份】 1989

【国内商品剂型(生产厂家)】 片剂(上海友谊药厂);原料药;粉针剂(羟氨苄青霉素钠哈尔滨制药二厂)。

【国内商品保护期】 片剂,三年自 1988 年 5 月 27 日至 1991 年 5 月 26 日;原料药,三年自 1992 年 10 月 22 日至 1995 年 10 月 21 日;粉针剂,三年自 1992 年 10 月 31 日至 1995 年 10 月 30 日。

【进口商品剂型(生产厂家)】 胶囊剂(新加坡 Beecham);原料药(意大利 Ribbon S. R. L.);胶囊剂(香港 The United Laboratories);原料药(意大利 Bristol-Myers Squibb);粉剂(美国 Biocraft);原料药(西班牙 Gema S. A.);原料药(西班牙 Antibioticos S. A.);颗粒剂(香港联邦制药厂);干糖浆(泰国 Atlantic)。

【专利与文献】

1. Drugs of Today 7:183 (1971); 8: 194 (1972)

2. Brit. pat. 978178 (Beecham;1964)

3. U. S. pat. 3,192,198 (Beecham;1965)

4. J. Chem. Soc. (c) 1920 (1971)

5. U. S. pat. 3,674,776 (Beecham;1972)

6. Brit. pat. 1,241,844 (Beecham;1971)

7. U. S. pat. 4,128,547 (Gist-Brocades; 1978)

8. Brit. pat. 1,339,605 (Beecham;1971)

9. U. S. pat. 4,053,360 (Bristol-Myers; 1977)

10. Brit. pat. 1,535,291 (Bristol-Myers;

1976)

11. U. S. pat. 4,098,796 (Novo;1978)

12. Belg. pat. 867414 (Antibioticos S. A.; 1978)

13. U. S. pat. 4,073,687 (Shionogi;1978)

14. Brit. pat. 1,543,317 (Beecham;1976)

15. Brit. pat. 1,504,767 (Beecham;1976)

16. Brit. pat. 1,539,510 (Beecham;1976)

17. Brit. pat. 1,532,993 (Beecham;1975)

18. U. S. pat. 4,053,360 (Bristol-Myers; 1977)

19. Ger. pat. 1,942,693 (Beecham;1970)

20. Antimicrob. Ag. Chemother. 407-430 (1970)

21. Drugs 18:169-184 (1979)

【合成路线】 略

008 【中文名】 盐酸维拉帕米

【通用名】 Verapamil Hydrochloride

【商标名(生产厂商)】 Calan (Searle); Elthon (Knoll); Isoptin (Knoll); Isoptine (Knoll-France); Cordilox (Abbott); Vasolan (Eisai); Calan (Monsanto)

【化 学 名】 5-[(3, 4-Dimethoxyphenethyl) methylamino]-2-(3, 4-dimethoxyphenyl)-2-isopropyl valeronitrile hydrochloride

【作用类型】 钙通道阻滞药。抗高血压、心绞痛、抗心律失常。

【CA 登记号】 CAS-52-53-9; CAS-152-11-4

【性状】 本品为类白色片。

【作用特点】 钙通道阻滞药。可降低窦房结自律性,延缓房室传导,延长房室结有效不应期,从而消除经房室结的折返,也能减慢心房扑动和颤动的心室率,此外,尚能抑制心肌,扩张血管,降低血压。口服后吸收缓慢而完全,半小时出现作用,可持续 12-24 小时。吸收后在肝内代谢,主要代谢途径为 N-脱烷基和 O-脱甲基,很大部分以无活性代谢物从尿中排出。去甲基维拉帕米是一种活性代谢物,其扩张冠状血管活性为原药的 20%。口服本品后,药时曲线较普通片为稳定,一次 0.24g 口服血浓度与普通片 80mg tid 相当。

【适应症】 同盐酸维拉帕米普通片,用于高血压病,快速性室上性心律失常及心绞痛等。

【用法与用量】 本品为缓释放制剂,口服,一次 0.24g,一日 1 次,或遵医嘱。

【不良反应】 部分病人可出现便秘、眩晕、头痛、胸闷、恶心、口干,一般不需处理,能自行消失,个别较严重者,可对症处理。

【禁忌症】

1. 严重低血压或心源性休克。
2. 二、三度房室传导阻滞。
3. 病窦综合症。
4. 严重充血性心力衰竭。
5. 静脉给 β 受体阻滞剂数小时内。
6. 伴有房室传导减慢、低血压、心率严重过缓者慎用或禁用。

【注意事项】

1. 与 β 受体阻滞剂合用时注意对心脏起搏、传导抑制作用加强。
2. 对心功能不正常者可致心衰和低血压。
3. 本品为缓释制剂,严禁击碎服药。

【1993 年世界销售额(亿美元)】 3.500 (Searle)

【1996 年世界销售额预测(亿美元);年增长率(%)(生产公司)】 2.470;-10.2 (Montanto)

【专利期满年份】 1989

【国内商品剂型(生产厂家)】 缓释片(连云港制药厂)。

【国内商品保护期】 三年自 1992 年 8 月 8 日至 1995 年 8 月 7 日。

【进口商品剂型(生产厂家)】 片剂,缓释片,水针剂(西德 Knoll);原料药(芬兰 Orion)。

【专利与文献】

1. U. S. pat. 3,261,859 (Knoll;1966)
2. U. S. pat. 4,115,432 (Knoll;1978)
3. Belg. pat. 615,861 (Knoll;1962)
4. U. S. pat. 3,261,859 (Knoll;1966)
5. Appel. Arzneimittel-Forsch. 12: 562 (1962)
6. Helv. Chim. Acta. 58:2050 (1975)
7. ibid. 549
8. ibid. 559
9. J. Med. Chem. 14:1178 (1971)

10. Arzneimittel-Forsch. 37:956 (1987)

11. ibid. 20:1277-1336 (1970)

12. Am. J. Cardiol. 47:179 (1981)

13. Drugs 25:125 (1983)

14. Am. J. Cardiol. 57:1D-107D (1986)

15. Circ. Res. 52(2),pt. 2,117-128 (1983)

【合成路线】 略

009 【中文名】 溴隐亭甲磺酸盐

【通用名】 Bromocriptine Methanesulphonate

【商标名(生产厂商)】 Parlodel (Sandoz); Pravidel (Sandoz); Parlodel (Sankyo);Bromocriptinum (USAN);Bromergon (Lek);Bromocriptin (Gedeon);Ergolatin (Lek); Medocriptene (Medochemie); Sero-cryptin (Serono)

【化学名】 (5')-2-Bromo-12'-hydroxy-2'-(1-methylethyl)-5'-(2-methylpropyl) ergo-taman-3',6',18-trione methanesulphonate

【CA 登记号】 CAS-25614-03-3; CAS-22260-51-1

【作用类型】 催乳激素抑制药,多巴胺拮抗剂。

【作用特点】 本品为麦角类的多巴胺受体兴奋剂,是一种新颖的神经内分泌药物。它可透过血脑屏障进入中枢神经内,通过激动突触后的多巴胺受体使多巴胺功能加强。本品具有以下几方面作用:

1. 抗震颤麻痹作用,其通过激动纹状体的多巴胺受体而对纹状体内多巴胺缺乏的震颤麻痹患者有效。

2. 通过激动丘脑下多巴胺受体而抑制催乳素分泌,对垂体激素无影响,从而可抑制病理性高催乳素状态下的乳溢及一些生理性泌乳。

3. 也可通过激动丘脑下多巴胺受体而抑制生长激素的释放,临床用于血清高生长激素水平的肢端肥大症患者。

本品口服量的 28% 左右自胃肠道吸收。大部分被代谢,在血浆中原形药的排泄 $t_{1/2}$ 为 3-4 小时,代谢物是 50 小时。活性药物和代谢物几乎完全在肝脏灭活,仅有 6% 经肾排出,血浆蛋白结合率为 96%。

【适应症】 用于治疗帕金森氏症,肢端肥

大症,乳溢症,催乳激素增高所致经前期综合征,如胸部触痛、乳房痛、浮肿、垂体瘤等。

【用法与用量】 口服 帕金森氏症:开始 1.25mg/次,每日 2 次,2-4 周内每日增加 2.5mg,直至找到最佳效果的小剂量。

肢端肥大症:开始 2.5mg/d,根据疗效和耐受情况逐增至 10-20mg/d,分 4 次服用。乳溢症:开始 1.25mg/d,于经前 14 日开始服用,每日增加 1.25mg,直至 2.5mg/次,每日 2 次为止,用至月经来潮。

垂体瘤:7.5-25mg/d,分次服用。

本品与食物同服。

【不良反应】 主要不良反应有恶心、呕吐、食欲下降、眩晕及体位性低血压、运动障碍、腿部肿痛等,这些不良反应与剂量有关,按常规用药,一般对这些副反应可耐受,不影响治疗。

【禁忌症】 对麦角生物碱过敏者,严重冠心病和周围血管病人,孕妇禁用。

【注意事项】

1. 某些患者服用本品治疗第一天出现血压下降现象,机械操作者或驾驶员应注意。

2. 大剂量用药可致精神障碍和痴呆,应慎用。

3. 有心肌梗塞史伴心律失常病人,合用左旋多巴时应慎重。

4. 肝功能障碍患者慎用。

5. 长期服用应检查肝功能及血象。治疗期间定期测量血压。

6. 女性用药超过 6 个月应定期进行妇科检查,定期检查血浆催乳素、排卵及黄体水平。

7. 本品能使妇女恢复正常排卵,所以用药期间应采取非口服的避孕方法。

8. 与食物同服,可减少胃肠道不良反应。

9. 本品与降压药合用应小心,谨防低血压。

10. 乙醇可降低本品的耐受性。

11. 与 H_2 受体阻滞剂、吩噻嗪类药合用时,可明显升高催乳素的血清浓度,从而降低疗效。

【1993 年世界销售额(亿美元)】 2.466 (Sandoz)

【1996 年世界销售额预测(亿美元);年增长率(%)(生产公司)】 2.260;-5.7(Sandoz)

【专利期满年份】 1990

【进口商品剂型(生产厂家)】 片剂,原料

药(瑞士 Sandoz);片剂(南斯拉夫 Lek);片剂(意大利 Serono);片剂(匈牙利 Gedeon Richter);片剂(塞浦路斯 Medochemie);原料药(捷克 Galena)。

【专利与文献】

1. Drugs of Today 12:87 (1976)

2. U. S. pat. 3,752,814 (Sandoz;1973)

3. U. S. pat. 3,752,888 (Sandoz;1973)

4. Ger. pat. 1,926,045 (Sandoz;1969)

5. Experientia 24:1130 (1968)

6. J. Nat. Cancer Inst. 45:1105 (1970)

7. Experientia 27:915 (1971)

8. Adv. Biochem. Psychopharmacol. 23:25 (1980)

9. Mol. Pharmacol. 19:517 (1981)

10. Schweiz. Med. Wochenschr. 103: 847 (1973)

11. Immunopharmacology 6:231 (1983)

12. Fertil. Steril. 33:463 (1980)

13. Adv. Biochem. Psychopharmacol. 23:271 (1980)

14. J. Am. Geriatric Soc. 29:251 (1981)

15. J. Am. Med. Assoc. 247:311 (1982)

16. Advan. Neurol. 45:535 (1986)

17. ibid. 539

18. Advan. Drug. Res. 12:247-344 (1977)

19. Drugs 36:67-82 (1988)

【合成路线】 略

010. 【中文名】 头孢克洛

【通用名】 Cefaclor

【商标名(生产厂商)】 Ceclor (Eli Lilly);Panoral (Lilly);Distaclor (Dista);Kefral (Shionogi);Alfatil (Lilly);Kefolox (Lilly);Panacef (Lilly)

【化学名】 (6R,7R)-7-[(R)-2-amino-2-phenylacetamido]-3-chloro-8-oxo-5-thia-1-azabicyclo[4.2.0.]oct-2-ene-2-carboxylic acid

【作用类型】 头孢类抗生素。

【CA 登记号】 CAS-53994-73-3

【性状】 本品为胶囊,内含类白色或淡黄色粉末。

【作用特点】 对金黄色葡萄球菌产生的 β -内酰胺酶稳定,因而对革兰氏阳性细菌具有较