

药品集

分 册 之 四

抗变态反应药物与免疫增强剂

《药品集》编写组 编

上 海 医 药 工 业 研 究 院
中 国 人 民 解 放 军 总 后 勤 部 卫 生 部 印

37
6

《药品集》分册之四

抗变态反应药物与免疫增强剂

《药品集》编写组 编

上海医药工业研究院
中国人民解放军总后勤部卫生部^印

前 言

为了适应我国医药工业发展的需要，经石油化学工业部委托上海医药工业研究院组织有关单位共同编写一本较全面地反映国内外各类药物品种概貌的汇编是十分必要的。本书可作为我国药物品种更新之参考，并供医药卫生工作人员检索药物品种时使用。参加编写工作的有：北京制药工业研究所、天津医药工业研究所、四川抗菌素工业研究所、湖南医药工业研究所、湖北医药工业研究所、广东医药工业研究所、上海市医药工业公司、上海化工学院、上海医药工业研究院等九个单位。

本书定名为《药品集》。全书收载药品约四千五百种左右，分为二十余大类。由于篇幅较大，因此，先分类编写“征求意见稿”，送请有关单位广泛征求意见，经过修改补充之后，再采取分册形式陆续出版。本分册为《抗变态反应药物与免疫增强剂》，收载品种165种。

由于我们水平有限，编写这样一部参考书又缺乏经验，不当与错误之处一定不少，请广大读者提出具体意见和批评，以便在合订全集时予以改正。

本书在编写过程中，得到有关领导部门、各有关教学、临床、科研、生产单位和广大群众的支持，承有关同志对初稿提出了许多宝贵意见，谨致谢意！中国人民解放军总后勤部卫生部对本书的出版给予了热情帮助，在此一并致谢！

《药品集》编写组

一九七八年三月

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，仅有动物试验而无临床效果者，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。

二、本书取材主要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词头组成药名，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

概 论	1
-----------	---

I、抗组胺药

北京制药工业研究所编写 上海医药工业研究院校订

概 述	5
一、H ₁ 受体拮抗剂	5
(一)乙醇胺类	7
1. 苯海拉明(Diphenhydramine)	7
2. 茶苯醇胺(Dimenhydrinate)	8
3. 苯羟醇胺(Pandryl)	9
4. 甲苯醇胺(Moxastine)	9
5. 氯甲苯醇胺(Chlorphenoxamine)	10
6. 溴苯醇胺(Bromodiphenhydramine)	10
7. 溴甲苯醇胺(Embramine)	10
8. 氯苯吡醇胺(Carbinoxamine)	11
9. 左氯苯吡醇胺(Rotoxamine)	11
10. 苯吡甲醇胺(Doxylamine)	12
11. 苄苯醇胺(Phenyltoloxamine)	12
12. 吡咯醇胺(Clemastine)	13
13. 噁啉醇胺(Diphenylpyraline)	13
14. 茶噁醇胺(Piprinhydrinate)	14
(二)乙二胺类	14
15. 甲氧苄二胺(Mepyramine)	14
16. 苄吡二胺(Tripelennamine)	15
17. 氯苄吡二胺(Chloropyramine)	15
18. 噻啉二胺(Thonzylamine)	16
19. 噻苯二胺(Methaphenilene)	16
20. 噻吡二胺(Methapyrilene)	17
21. 异噻吡二胺(Thenylidamine)	17
22. 氯噻吡二胺(Chloropyrilene)	18
23. 呋吡二胺(Methafurylene)	18
24. 吡咯二胺(Histapyrrodine)	18
25. 安他唑啉(Antazoline)	19
26. 苄噁苯胺(Bamipine)	20
27. 噻哌苯胺(Thenalidine)	20
(三)丙胺类	20
28. 甲苯丙胺(Tolpropamine)	20
29. 苯吡丙胺(Pheniramine)	21
30. 氯苯吡丙胺(Chlorpheniramine)	21
31. 右氯苯吡丙胺(Dexchlor-pheniramine)	22
32. 溴苯吡丙胺(Brompheniramine)	22
33. 右溴苯吡丙胺(Dexbrom-pheniramine)	23
34. 吡咯吡胺(Tripolidine)	23
35. 吡咯丁胺(Pyrrobutamine)	24
(四)哌嗪类	24
36. 苯甲哌嗪(Cyclizine)	24
37. 氯苯甲哌嗪(Chlorcyclizine)	25
38. 氯苯苄哌嗪(Meclozine)	25
39. 氯苯丁哌嗪(Buclicine)	26
40. 克敏羟哌嗪(Decloxizine)	26
41. 肉桂苯哌嗪(Cinnarizine)	27
42. 苯咪唑哌嗪(Oxatomide)	27
43. 苯甲庚哌嗪(Homochlorcyclizine)	27
(五)吩噻嗪类	28
44. 异丙哌嗪(Promethazine)	28
45. 甲磺异丙哌嗪(Thiazinamium methylsulphate)	29
46. 异丁哌嗪(Trimeprazine)	29
47. 磺酰异丙哌嗪(Dimetotiazine)	30
48. 双氧异丙哌嗪(Dioxoprothazine)	30
49. 双氧异丁哌嗪(Oxomemazine)	31
50. 胺乙吩嗪(Fenethazine)	31
51. 甲吡吩嗪(Methdilazine)	32
52. 甲奎吩嗪(Mequitazine)	32

53. 氮异丙嗪(Isothipendyl)	33
(六)其他.....	33
54. 吡啶苄胺(Dimethindene)	33
55. 苯苄胺(Phemindamine)	34
56. 甲苄咪啉(Mebhydrolin)	34
57. 吡咯咪唑(Clemizcle)	35
58. 二硫庚啉(Dithiaden)	36
59. 硫庚啉(Methiaden).....	36
60. 塞庚啉(Cyproheptadine)	36
61. 哌吡庚啉(Azatadine)	37

62. 托品庚啉(Deptropine)	38
63. 甲哌硫苄(Pimethixene)	38
64. 双苯噻醇(Phencarol)	39
二、组胺酸脱羧酶抑制剂.....	39
65. 酞茂异喹(Tritoqualine)	39
66. 溴羟苄氧胺(Brocresine).....	40
三、其他抗组胺药.....	40
67. 组胺球蛋白(Histaglobin)	40
68. 双苯咪唑(Diphenylimidazol)	41

II、过敏反应介质阻滞剂

上海医药工业研究院编订

概 述.....	42
1. 色甘酸钠(Cromolyn sodium).....	43
2. 四唑色酮(AA-344).....	44
3. 异丁色酮酸(Terbucromil)	45
4. 四唑硫苄酮(Doxantrazole)	45
5. 丁氮菲酸(Bufrolin)	46
6. 异丙氧苄酮酸钠(Xanoxate sodium)	46
7. 羟乙氧苄酮酸(AH7725).....	47
8. 酞苯吡喃啉(Y9000)	47

9. 苯氮嘌呤酮(M & B 22948).....	48
10. 肉桂氮苄酮(N-5')	48
11. 羟哌苯噻酮(Tiaramide).....	49
12. 香氧丙哌嗪(BM15100)	49
13. 胺甲苯羧酯(WY-16922)	50
14. 双甲硝苄酮(Nivimedone)	50
15. 双苯酰胺苯(AB50).....	51
16. 甲哌噻庚酮(Ketotifen)	51
17. 黄芩	52
18. 防己	53

III、钙盐与脱敏制剂

上海医药工业研究院编订

概 述.....	54
1. 氯化钙(Calcium chloride).....	54
2. 葡萄糖酸钙(Calcium gluconate)	

.....	54
3. 磷注射液	55

IV、抗过敏中草药

上海医药工业研究院编订

概 述.....	56
1. 苍耳	56
2. 苦参	56
3. 荆芥	57
4. 漆大姑	57

5. 艾叶	57
6. 徐长卿	58
7. 地肤子	58
8. 白鲜皮	58

V、糖皮质激素

上海医药工业研究院编订

概 述.....59	 63
1. 泼尼松(Prednisone)61	5. 倍氯美松双丙酸酯(Beclomethasone dipropionate)64
2. 氢化泼尼松(Prednisolone).....61	6. 甘草64
3. 氟美松(Dexamethasone)62	
4. 氟去炎舒松(Fluocinolone acetonide)	

VI、免疫抑制剂

上海医药工业研究院编订

概 述.....66	12. 更生霉素(Actinomycin D).....77
1. 环磷酰胺(Cyclophosphamide)69	13. 甲砒霉素(Thiampenicol).....77
2. 异环磷酰胺(Iphosphamide)70	14. 优青糖苷(Bredinin)78
3. 苯丁酸氮芥(Chlorambucil)71	15. 抗淋巴细胞球蛋白(Antilymphocyte globuline)78
4. 甲基苄肼(Procarbazine)71	16. 抗Rho(D)球蛋白(Rho(D) immune globulin)79
5. 巯嘌呤(Mercaptopurine)72	17. 环孢多肽 A(Cyclosporin A)80
6. 硫唑嘌呤(Azathioprine)73	18. 门冬酰胺酶(L-Asparaginase)80
7. 氟尿嘧啶(5-Fluorouracil)74	19. 亚磺酰吡啶(Oxisuran)81
8. 阿糖胞苷(Cytarabine)74	20. 青霉素(Penicillamine)81
9. 氮甲蝶呤(Methotrexate)75	21. 氯喹(Chloroquin)82
10. 羟基脲(Hydroxyurea).....76	22. 羟氯喹(Hydroxychloroquine)83
11. 乙亚胺(Ethylenediamide tetra-acetylimide).....76	

VII、免疫增强剂

上海医药工业研究院编订

一、主要提高巨噬细胞吞噬功能的药物

.....84
1. 结核活菌苗(Bacillus Calmette-Guerin vaccine)88
2. 死卡介苗88
3. 短小棒状杆菌苗(Corynebacter parvum)89
4. 溶链菌(Picibanile).....89
5. 伤寒杆菌脂多糖90
6. 胎盘脂多糖91
7. 马兜铃酸(Aristolochic acid).....91

二、主要提高细胞免疫的药物.....92

8. 左旋咪唑(Levamisole)92
9. 云芝多糖K(Polysaccharoid K)93
10. 白山芸芝多糖94
11. 香菇多糖(Lentinan)94
12. 猪苓多糖95
13. 茯苓多糖(Pachymaran)95
14. 植物血球凝集素(Phytohaemagglutinin)95
15. 甜瓜蒂96
16. 核酪96

17. 转移因子(Transfer factor)	97
18. 免疫核糖核酸(Immunogenic RNA)	98
19. 胸腺素(Thymosin)	98
三、影响体液免疫的药物	99
20. 乙氨苄酮(Tilorone)	99
21. 金刚烷胺(Amantadine)	100
22. 丙种球蛋白(γ -Globulin)	100
23. 丙球蛋白A(Gamma A concentrate)	101
24. 丙球蛋白M(Gamma M concentrate)	101
25. 麻疹免疫球蛋白(Measles immune globulin).....	102
26. 百日咳免疫球蛋白(Pertussis immune globulin).....	102
27. 破伤风免疫球蛋白(Tetanus immune globulin).....	102

四、具有免疫增强作用的中草药	103
28. 人参.....	103
29. 刺五加.....	104
30. 黄芪.....	104
31. 党参.....	105
32. 白术.....	105
33. 仙灵脾.....	105
34. 白花舌蛇草.....	106
35. 地黄.....	106
五、其他	107
36. 干扰素(Interferon)	107
37. 聚肌胞苷酸(Polyinosinic-polycyti- dylic acid).....	108
38. 聚腺尿苷酸(Polyadenylic-polyuri- dylic acid).....	108
39. 异丙酯肌苷 (Isoprinosine)	109
40. 辅酶 Q_{10} (Coenzyme Q_{10}).....	109

概 论

一、有关变态反应的基本概念

变态反应也称为过敏反应，它是机体受抗原性物质刺激后引起的组织损伤或生理功能紊乱，是异常的免疫反应，即病理性的免疫反应。

在正常情况下，抗原物质(如细菌、病毒、寄生虫、花粉等等)进入机体后，体内会产生特异性的免疫物质——抗体或致敏淋巴细胞，当同一抗原再次进入机体时，机体就可借助这种特异性的免疫物质将抗原消灭或排除，这就是机体具有的特异性免疫防卫系统。

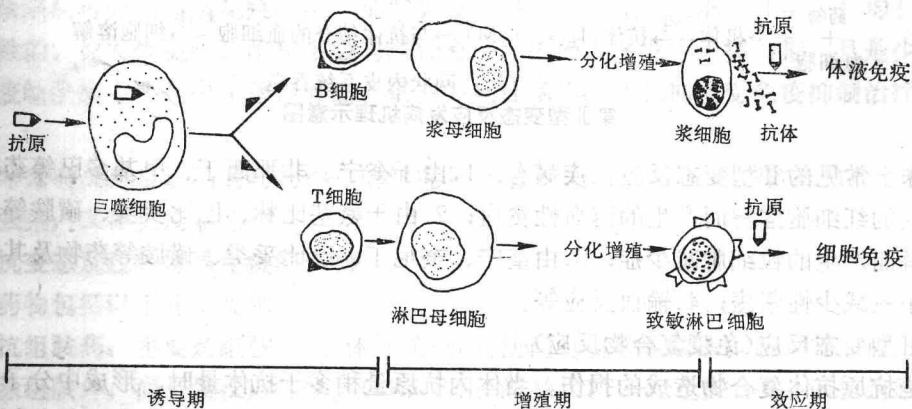
机体的特异性免疫可分体液免疫和细胞免疫两种，其过程是抗原物质进入机体后，由巨噬细胞吞噬和处理，将抗原信息传递给免疫活性细胞B细胞或T细胞。

B细胞接受抗原信息后，转化为浆母细胞，再分化增殖为浆细胞，浆细胞合成并分泌抗体，抗体释放至体液中，并随血液循环分布于全身，执行免疫任务。当再次与相同抗原相遇时，即形成免疫复合物，使抗原失去毒力，并激活补体，使抗原分解，或是吸引巨噬细胞过来，将抗原吞噬清除，是为体液免疫。

T细胞接受抗原信息后，转化为淋巴母细胞，并分化增殖成大量的致敏淋巴细胞，然后进入血液循环，执行免疫任务。当相同抗原再次进入机体与致敏淋巴细胞相遇后，致敏淋巴细胞则释放出多种淋巴因子，以清除、破坏或杀灭抗原性异物，发挥特异的免疫作用，是为细胞免疫。

上述免疫反应过程又可分为三期：1.诱导期 是指机体接触抗原后直至抗原刺激抗原敏感细胞B细胞和T细胞的阶段。2.增殖期 是指B细胞、T细胞接受抗原信息后分别转化增殖为浆细胞和致敏淋巴细胞的阶段。3.效应期 机体再次接触相应抗原，引起体液免疫和细胞免疫的过程。

体液免疫和细胞免疫的过程如下图所示：

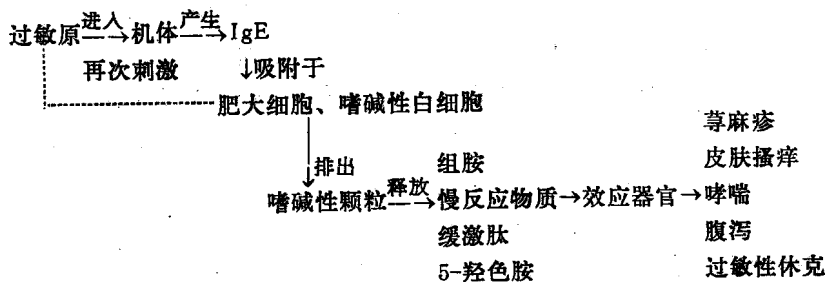


然而，在某些情况下，某些抗原(此时可称为过敏原或变应原)进入某些个体后，所引起的免疫反应却导致机体组织的损伤或破坏，这种异常的或病理性的免疫反应，称之为变态反

应。变态反应可分为四型：

第 I 型变态反应(过敏反应)：

某些过敏体质的人在初次接触虾、蟹等食物、青霉素、磺胺等药物、植物花粉、动物皮毛和尘螨等抗原性物质后产生相应的抗体 IgE，IgE 有亲细胞性，往往吸附在毛细血管周围的肥大细胞和血液中嗜碱性白细胞的表面，使机体处于致敏状态，当已致敏的机体再次接触相同的抗原(致敏原)时，致敏原即与肥大细胞或嗜碱性白细胞表面的 IgE 结合，不需补体参加，即可导致细胞内嗜碱性颗粒释放组胺、慢反应过敏物质(SRS-A)、缓激肽及 5-羟色胺等等生物活性物质。这类活性物质具有使毛细血管扩张和通透性增加，平滑肌痉挛，腺体分泌增多等生物效应，临床上表现为皮肤红肿、搔痒、荨麻疹、流涕、喷嚏、哮喘、呼吸困难、恶心、呕吐、腹痛、腹泻等等。严重病例可发生过敏性休克，如抢救不及时，可因严重低血压及循环衰竭而死亡。

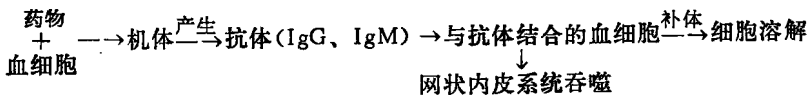


第 I 型变态反应发病机理示意图

I 型变态反应性疾病是临床上最常见的变态反应性疾病，通常称为过敏性疾病。

第 II 型变态反应(细胞溶解型或细胞毒型变态反应)：

这是由于药物等半抗原物质进入过敏体质的机体后，与体内的血细胞或其他组织的细胞结合构成完全抗原，再刺激机体使之产生相应的抗体 IgG 或 IgM(主要是 IgG，少数是 IgM)，IgG 或 IgM 与结合在细胞上的过敏原起反应，在补体参与下导致细胞的溶解。此外，IgG 或 IgM 与血细胞等表面的过敏原结合后，血细胞易被网状内皮系统吞噬，这也使血细胞的数量减少。



第 II 型变态反应发病机理示意图

临床上常见的 II 型变态反应性疾病有：1. 由于奎宁、非那西丁、甲基多巴等药物及其他原因引起的红细胞溶解而产生的溶血性贫血；2. 由于氨基比林、巴比妥类、磺胺等引起的粒细胞溶解而产生的粒细胞减少症；3. 由奎宁、奎尼丁、巴比妥类、磺胺等药物及其他因素引起的血小板减少性紫癜；4. 输血反应等。

第 III 型变态反应(免疫复合物反应)：

、这是抗原抗体复合物造成的损伤。当体内抗原量稍多于抗体量时，形成中分子可溶性的抗原抗体复合物，由于不易被吞噬细胞吞噬，而在血液中循环，最后沉积在某些部位的毛细血管基底膜或其他间隙，激活补体系统及吸引中性白细胞，后者释放出其溶酶体的各种水解酶(胶原酶、组织蛋白酶、弹性蛋白酶、酸性肽酶等等)，引起炎症反应，使血管壁及邻近组

织发生坏死。

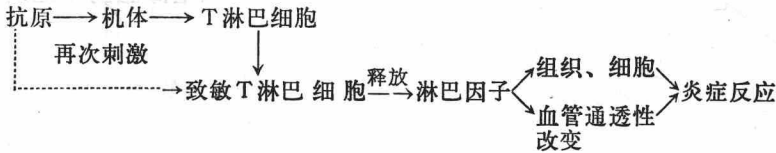
抗原抗体复合物(中等分子) $\xrightarrow{\text{沉积于}}$ 毛细血管基底膜或其他间隙 $\xrightarrow{\text{激活补体, 吸引中性白细胞}}$
释放溶酶体酶 $\rightarrow$ 炎症反应组织坏死

第Ⅲ型变态反应发病机理示意图

临床上常见的Ⅲ型变态反应性疾病有肾小球肾炎和类风湿性关节炎,以及变应性脉管炎、血清病、全身性红斑狼疮等。

第Ⅳ型变态反应(迟发型变态反应):

是机体对某些抗原性物质的细胞性免疫反应。由T淋巴细胞中介,无抗体参加。由于反应出现较迟,故又称迟发型变态反应,而Ⅰ、Ⅱ、Ⅲ型变态反应曾统称为速发型变态反应。Ⅳ型变态反应发病机理是机体在某种抗原物质刺激下使T淋巴细胞致敏,转化为致敏淋巴细胞,当致敏淋巴细胞再次与相同的抗原接触后,释放出各种淋巴因子(巨噬细胞移动抑制因子、巨噬细胞激活因子、趋化因子、发炎因子等等),引起炎症反应,甚至坏死。



第Ⅳ型变态反应发病机理示意图

临床上常见的Ⅳ型变态反应性疾病有接触性皮炎、结核性乾酪病变、乙型肝炎以及溃疡性结肠炎、重症肌无力等。

肿瘤免疫也属于第Ⅳ型变态反应(详见《药品集》抗肿瘤药物分册)

二、有关免疫缺陷的基本概念

免疫缺陷主要是指机体的体液免疫、细胞免疫以及吞噬功能的降低或缺乏。机体由于免疫功能障碍所致的疾病称为免疫缺陷病。免疫缺陷病中最常见的临床表现为机体抗感染能力的降低,往往导致严重感染的产生。

免疫缺陷病可分为体液免疫缺陷、细胞免疫缺陷、联合免疫缺陷等几类,且均有原发性的和继发性的。原发性免疫缺陷病多数与遗传有关,因而大多发生于婴幼儿期,且是少见病。继发性免疫缺陷病主要是由于恶性肿瘤、蛋白损耗性肠病以及长期接受免疫抑制治疗等原因而引起。

近十年来有关免疫缺陷病药物治疗的研究日益增多,已形成了一类新的药效类别的药物,即免疫增强剂,又称免疫刺激剂。

三、抗变态反应和增强免疫的药物

此类药物包括以下几个类别:

Ⅰ、抗组胺药:主要是组胺 H_1 受体拮抗剂,其他尚有组胺脱羧酶抑制剂等。由于过敏反应性物质除组胺外,尚有慢反应性物质(SRS-A)、缓激肽和5-羟色胺等等,而抗组胺药仅能拮抗组胺的作用,因而其疗效有限。

Ⅱ、过敏反应介质阻释剂:主要有色甘酸钠及其类似物,是通过稳定肥大细胞膜,阻止组胺、慢反应性物质、缓激肽等生物活性物质的释放,以达到抗过敏作用。

Ⅲ、钙盐类与脱敏制剂：钙盐有减轻和缓解症状的效果。脱敏制剂是一类强抗原性物质，有使机体逐渐脱敏的效果。临床用于过敏性疾病。

Ⅳ、中草药：为某些功能清热、解毒、祛湿的药物，其抗过敏性疾病的作用机理有待进一步研究。

Ⅴ、糖皮质激素：对变态反应的疗效肯定，临床广泛应用于一般变态反应性疾病、自身免疫性疾病及脏器移植时以抑制排斥反应。

Ⅵ、免疫抑制剂：是通过抑制机体的免疫反应以治疗变态反应性疾病的药物，临床应用的主要是一些抗肿瘤药物。

Ⅶ、免疫增强剂：免疫增强剂是近年来发展形成的一个新的药效类别，是通过增强机体免疫功能以防治疾病，临床上用于防治与免疫功能低下有关的疾病和免疫缺陷病。

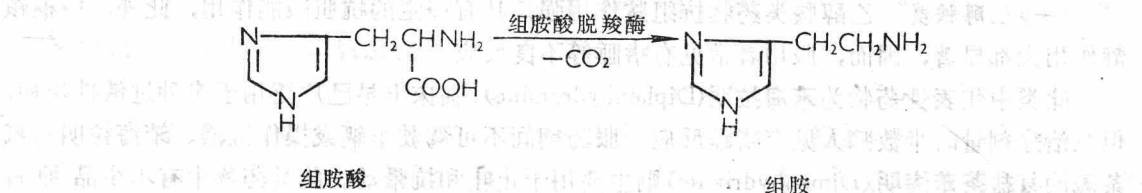
(上海医药工业研究院编写)

I、抗组胺药

概 述

抗组胺药是一类竞争性抑制组胺的药物，临床上用于某些过敏性疾病，有缓解症状的效果。

组胺(又称组织胺)是由细胞内的组氨酸经组氨酸脱羧酶脱去羧基后生成的:



组胺在体内主要是以结合的形式贮存在肥大细胞和嗜碱性白细胞内。在某些类型的(主要是I型,也可在III型)过敏反应过程中,释放出组胺、慢反应过敏物质(SRS-A)、缓激肽及5-羟色胺等生物活性物质,引起一系列过敏症状。

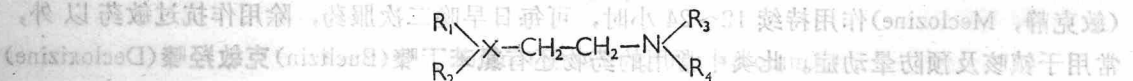
组胺具有多种生理、病理作用，它能使毛细血管扩张，增加其通透性，降低血压；使支气管、胃肠道平滑肌痉挛；促进胃酸的分泌等。

经典的抗组胺药如苯海拉明、异丙嗪等,能在一定程度上拮抗组胺的毛细血管扩张作用、支气管平滑肌痉挛作用等,但却不能对抗组胺的胃酸分泌促进作用,其原因长久不能解释。近几年来,随着生理生化及药理学研究的进展,了解到组胺的靶细胞有两种受体,分别称为 H_1 受体和 H_2 受体,经典的抗组胺药仅拮抗 H_1 受体,此类药物现在称之为 H_1 受体拮抗剂,过去所称的抗组胺药指的仅是此类药物,组胺的胃酸分泌促进作用与 H_2 受体有关。由于经典的抗组胺药(H_1 受体拮抗剂)无 H_2 受体拮抗作用,故对组胺的促进胃酸分泌无拮抗作用。现在已研制出一类拮抗 H_2 受体的药物,称为 H_2 受体拮抗剂,如甲硫咪胺(Metiamide)、甲氰咪胺(Cimetidine)等,其药理作用是抑制胃酸的分泌,适用于胃及十二指肠溃疡的治疗,将在《药品集》消化系统药物分册中详述。

一、组胺 H₁ 受体拮抗剂

组胺 H_1 受体拮抗剂即通常所称的抗组胺药,它是与组胺竞争效应细胞上的组胺 H_1 受体,使组胺不能与 H_1 受体结合,从而抑制其作用。

已知的大多数 H_1 受体拮抗剂的基本化学结构式如下图所示。式中 R_1, R_2 为苯基、五元或六元杂环, R_3, R_4 大都为甲基。式中 $X=O$ 为乙醇胺类, $X=N$ 为乙二胺类, $X=C$ 为丙胺类。



此类药物对皮肤、粘膜的过敏反应，如荨麻疹、皮肤瘙痒、过敏性鼻炎等疗效较佳。对血清病、接触性皮炎等疗效较差。对支气管哮喘，老的文献都认为无效或疗效不明显，但近年临床研究表明，氯苯吡丙胺(扑尔敏)对某些哮喘患者有满意疗效。现在有人认为H₁受体激活与肺cAMP水平的增高有关，采用异丙嗪、苯海拉明、甲氧苄二胺或其他H₁受体拮抗剂阻滞这一作用，降低cGMP水平，对某些哮喘病人可能有一定效果。也有文献报道，某些组胺H₁受体拮抗剂在低浓度时即能抑制免疫性组胺的释放，因此，对此类药物的药理作用尚应深入研究。

多数H₁受体拮抗剂有镇静作用，因而常致嗜睡；部分药物有镇吐作用；大多数具有轻微的局部麻醉作用和阿托品样作用；少数有中枢兴奋作用。这些作用有的很轻微，没有治疗效果，但某些药物的抗胆碱作用明显，因而青光眼及尿潴留者忌用，这些药物也有口干等副作用。

(一)乙醇胺类 乙醇胺类药物抗组胺作用强，具有一定的抗胆碱能作用，此外，中枢镇静作用大都显著，因而，服用者常见有嗜睡等不良反应。

此类中代表性药物为苯海拉明(Diphenhydramine)，临床上早已广泛用于多种过敏性疾病，但在治疗剂量时半数病人见有嗜睡反应，服药期间不可驾驶车辆或操作机器。苯海拉明与氯茶碱的复盐茶苯海明(Dimenhydrinate)则主要用于止吐和抗晕动。此类药物中有不少品种较之苯海拉明有一定优点，如甲苯醇胺(Moxastine)、溴苯醇胺(Bromodiphenhydramine)、氯苯吡醇胺(Carbinoxamine)、左氯苯吡醇胺(Rotoxamine)、吡咯醇胺(Clemastine)、吡啶醇胺(Diphenylpyraline)等，尤其是吡咯醇胺和吡啶醇胺，不仅是抗组胺作用较强，且止痒效果显著，而嗜睡副作用则轻微少见。

(二)乙二胺类 乙二胺类抗组胺药的作用与乙醇胺类大致相等，但中枢抑制作用较弱，嗜睡少见或轻微。

此类中代表性药物为甲氧苄二胺(新安替根，Mepyramine)，应用较广。氯苄吡二胺(Chloropyramine)止痒效果良好，可用于皮肤各种搔痒症。噻吡二胺(Methapyrilene)在美国应用广泛，但并无多大优点。值得注意的为安他唑啉(Antazoline)治疗剂量少见有不良反应，且对室性早搏有较好疗效，也是一个有效的抗心律失常的药物。

(三)丙胺类 丙胺类药物的抗组胺作用最强，小剂量即产生治疗效果，且嗜睡反应较轻也较少见，不影响劳动。

此类中代表性药物为氯苯吡胺(扑尔敏，Chlorpheniramine)特点是其抗组胺作用较苯海拉明和异丙嗪强，中枢抑制作用轻微，少见有嗜睡，氯苯吡胺应用广泛，较之苯海拉明有较大优点，氯苯吡胺的右旋异构体右旋氯苯吡胺(Dexchlorpheniramine)用量更小，不良反应少见。溴苯吡胺(Brompheniramine)、吡咯吡胺(Tripolidine)等也都各具一定优点。

(四)哌嗪类 哌嗪类抗组胺药是常用品种较多的一类抗组胺药物，此类药物大都作用强而持久，嗜睡较少产生，且有止吐作用，可用于晕动症，如此类中的苯甲嗪(Cyclizine)，主要用于妊娠、术后的呕吐及晕动症等。

此类中代表性药物为氯苯甲嗪(Chlorcyclizine)，作用持续时间为8~12小时。氯苯苄嗪(敏克静，Meclozine)作用持续12~24小时，可每日早晚二次服药，除用作抗过敏药以外，常用于镇咳及预防晕动症。此类中常用的药物还有氯苯丁嗪(Buclizin)克敏嗪(Decloxizine)等，后者主要用于支气管哮喘。此外，尚有一类似物苯甲庚嗪(Homochlorcyclizine)，除用于过

敏性皮肤病外，也常用于哮喘的治疗。

(五)吩噻嗪类 此类药物的特点是抗组胺作用很强，且大都具有显著的镇静作用。

此类中代表性药物为异丙嗪(Promethazine)，抗组胺作用较扑尔敏强，适用于各种过敏性疾病，且能增强麻醉药、催眠药、镇痛药的作用，常与度冷丁、氯丙嗪配伍用于人工冬眠。此外，尚有显著的镇吐作用，可用于妊娠呕吐及晕动症等。异丙嗪与氯代茶碱的复盐茶异丙嗪(Promethazine theoclate)则主要用作镇吐药。异丁嗪(Trimeprazin)的抗组胺作用较异丙嗪强而持久。磺酰异丙嗪(Dimethothiazine)尚具有抗5-羟色胺的作用，故亦用于治疗偏头痛。甲吡吩嗪(Methdilazine)是吩噻嗪类抗组胺药中嗜睡反应最少的一种，且抗组胺作用较异丙嗪强，此外，氮异丙嗪(Isothipendyl)较之异丙嗪也有一定的优点。

(六)其他 除上述的各类结构相似的抗组胺药以外，还有不少其他结构类型的抗组胺药，均为杂环类化合物，其中常用的有苯茛胺(Phenindamine)，作用迅速持久，且无嗜睡作用，局部应用止痒效果尚佳，此类中某些药物的抗组胺作用较异丙嗪强，中枢抑制作用则轻微，如硫庚啉(Methiaden)、二硫庚啉(Dithiaden)等。

值得一提的是，某些三环结构的抗组胺药，尚具有显著的抗5-羟色胺作用以及抗缓激肽等作用，有人称之为“广谱抗胺剂”，如吡唑庚啉(Azatadine)、托品庚啉(Deptropine)等等，这些药物的适应症基本与H₁拮抗剂相同，但对支气管哮喘的效果则较显著与确实，其中某些品种具有显著的抗5-羟色胺的作用，治疗偏头痛有良好效果。

二、组胺酸脱羧酶抑制剂

组胺酸脱羧酶抑制剂是一类新型的抗组胺药。与H₁拮抗剂不同，不是竞争性地阻断组胺H₁受体而产生抗组胺效果，而是抑制组胺的合成。细胞内的组胺是由组氨酸在组氨酸脱羧酶的作用下经脱羧而生成的，抑制脱羧酶就能抑制组氨酸脱去羧基，从而抑制组胺的生成，当过敏反应发生时所释放的组胺量相对地少，因而，临床症状减轻。此类药物的作用原理使其有预防过敏反应的效果，且无一般抗组胺药所具的嗜睡反应，是为其特点。目前已临床应用的组胺酸脱羧酶抑制剂有酞茂异喹(Tritoqualine)，适用于过敏性疾病，尚未见有何不良反应。溴羟苄氧胺(Brocresine)也是具有组胺酸脱羧酶抑制作用的抗组胺药，但也有文献指出其组胺酸脱羧酶抑制作用可疑。

三、其他抗组胺药

临床应用的有组胺球蛋白(Histaglobin)，是促使体内产生抗组胺抗体的药物，并无显著优点，应用也不多。此外，尚有局部应用的抗组胺药双苯咪唑(Diphenylimidazol)，外用有止痒、消炎作用。

一、H₁受体拮抗剂

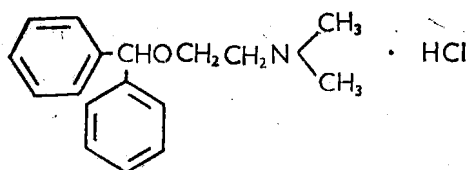
(一)乙醇胺类

1. 苯海拉明

Diphenhydramine(Benadryl, Dimedrolum)

2-二苯甲氧基-N, N-二甲基乙胺盐酸盐

2-Diphenylmethoxy-N, N-dimethylethylamine hydrochloride



【性状】 白色结晶或结晶状粉末，无臭，味苦麻。熔点 $168^{\circ}\sim 172^{\circ}\text{C}$ 。溶于水、乙醇、丙酮和氯仿，微溶于乙醚。

【作用与用途】 能对抗组织胺对血管、胃肠道和支气管平滑肌的作用，但不能拮抗组织胺的胃液分泌作用，因此，接近年药理研究的进展来分类，苯海拉明为 H_1 拮抗剂。也具有较强的中枢神经抑制作用，但较异丙嗪弱。尚有轻度的阿托品样解痉作用、局部麻醉作用以及镇吐作用。本品疗效不及异丙嗪，作用时间持续 4~6 小时。有人认为是抗组胺药物中可供注射用的首选药物。

适用于皮肤、粘膜的过敏反应，如荨麻疹、皮肤瘙痒、过敏性鼻炎、血管神经性水肿等症，能有效地控制症状；用于血清病、接触性皮炎、过敏性结膜炎等过敏性疾病，疗效次之；虽可用于支气管哮喘，但单独用疗效很差，与麻黄碱合用可增强疗效，并可对抗后者的中枢兴奋作用。

【不良反应】 主要有嗜睡、眩晕、乏力、口干、恶心、呕吐等。长期应用（6 个月以上）可致贫血。

【参考剂量】 口服 每次 25~50 毫克，1 日 2~3 次。

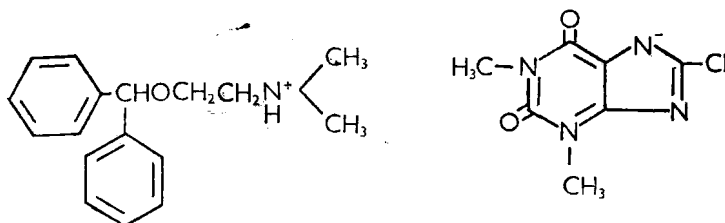
肌注、静注 每次 20 毫克，一日 1~2 次。极量 1 次 100 毫克，1 日 300 毫克。

2. 茶苯醇胺(茶苯海明，乘晕宁，海晕宁)

Dimenhydrinate (Diphenhydramine theoclate, Chloranautine, Anautin, Theohydramine, Dramamine)

2-二苯甲氧基-N, N-二甲基乙胺 8-氯-茶碱盐

2-Diphenylmethoxy-N, N-dimethylethylamine 8-Chlorotheophyllinate



【性状】 白色透明结晶性粉末，无臭，熔点 $102^{\circ}\sim 107^{\circ}\text{C}$ 。微溶于水，易溶于乙醇。

【作用与用途】 为苯海拉明与氯茶碱的复合物。抗组胺与止吐作用较苯海拉明更强，尤适用于防治晕动病、妊娠呕吐、术后呕吐、眩晕等。

【不良反应】 与苯海拉明同。

【参考剂量】 口服 每次 50 毫克，一日 3 次。用于预防晕动可在车、船开动前半小时服 50 毫克。

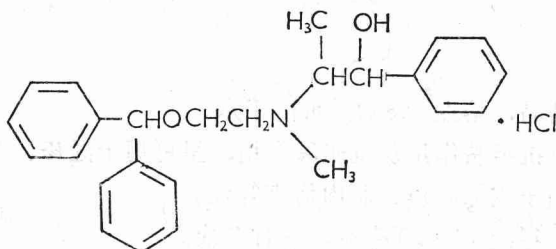
肌注、静注 每次 50 毫克。静注时 50 毫克置于 10 毫升生理盐水内于 2 分钟注入。

3. 苯羟醇胺

Pandryl

N-甲基-N-(β-二苯甲氧乙基)-1-苯基-2-氨基丙醇-1 盐酸盐

N-Methyl-N-(β-diphenylmethoxyethyl)-1-phenyl-2-aminopropanol-1 hydrochloride



【性状】 白色结晶性粉末，无臭，味苦麻，难溶于水，微溶于甲醇，易溶于氯仿。

【作用与用途】 是苯海拉明经过结构改造制取的衍生物，抗组胺作用很强，且持续时间长，尚具有阿托品样解痉作用，而中枢抑制作用轻微，不良反应少见。

适用于感冒、鼻炎、一般咳嗽、支气管哮喘、荨麻疹、湿疹、药疹、过敏性皮肤病等。

【不良反应】 嗜睡、眩晕、头痛、乏力、口渴等。

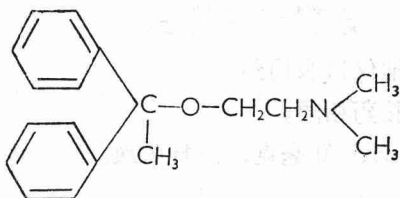
【参考剂量】 口服 每次 30~50 毫克，一日 3 次。

4. 甲苯醇胺

Moxastine (Alfadryl, Mephenhydramine)

2-(1-苯基-1-苯乙氧基)-N,N-二甲基乙胺

2-(1-phenyl-1-phenylethoxy)-N,N-dimethylethylamine



【作用与用途】 为苯海拉明的甲基衍生物。其抗组胺作用较苯海拉明强得多，毒性则相似。尚具有一定的阿托品样作用。用途与苯海拉明相似，可用于过敏性疾病作症状缓解。

【不良反应】 与苯海拉明等抗组胺药相似。

【参考剂量】 口服 每次 毫克，一日 3 次。