



● 何凤梅 编

常用药与新药600种

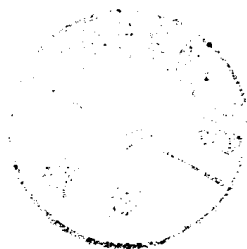
化学工业出版社

1
325-1
H51

V12462

常用药与新药 600 种

何凤梅 编



A0099052

化学工业出版社



(京)新登字 039 号

内 容 简 介

本书收载国内外常用药及新药 600 余种。具有一定的科技信息和情报的价值。

本书内容包括:药物名称、化学结构、理化性质、结构与药理作用的关系、临床应用与用药须知(如不良反应、注意事项、较特殊的用法与用量)。对于重要的有代表性的药物的制备方法或合成路线以及各类药物的演变过程和发展史也作了相应的介绍,以利于开发新药的科技人员开拓思路。

本书可作中等卫生学校、制药厂岗位工人培训的教科书,医护人员、药厂工作者、制药科技工作者的参考书和工作手册,也适用于家庭作用药常识的必备书。

常用药与新药 600 种

何凤梅 编

责任编辑 施承薇

封面设计 李志贤

*

化学工业出版社出版发行

(北京市朝阳区惠新里 3 号)

北京市百善印刷厂印刷

新华书店北京发行所经销

*

开本 787×1092 1/16 印张 34 字数 845.5 千字

1993 年 12 月第 1 版 1993 年 12 月北京第 1 次印刷

印 数 1~2200

ISBN 7-5025-1209-8

R·12

定 价 27.00 元

前 言

本书是编者在北京制药公司所属药厂联办高级药工培训班的药物化学课的讲稿，经过增删、整理而成。是药物化学兼有部份药物学内容的、综合性、中等专业药学教学用书和参考书。

编者力求结合各药厂的生产实际、结合药物化学发展的现状和未来、结合临床常见病、多发病，将全书按药理作用分成十八章，特别是考虑到脑患者日益增多的趋势和高龄社会化的问题，编进一章脑血管障碍治疗药。

本书内容力求完整，包括药物的一般名、化学名、理化性质、结构式、重要类型药物的合成方法、临床应用和注意事项、不良反应、化学结构与活性的关系，还增添了近期发展的新类型药物和新品种，这些药除英文名外，个别还注有日文名。并重点介绍了一些新药开发的历史，先开发与后开发的化合物之间的关系，演变的过程，期望能开拓思路，有益于我国新药的研制和开发。

本书完成之际，承蒙北京医科大学药学院李仁利教授的推荐，在此谨致深深地谢意！

因编者学识和能力所限，错误遗漏之处在所难免，望不吝赐教！

编者 何凤梅

1992年7月

目 录

前言

第一章 麻醉药	(1)
第一节 吸入全麻药	(1)
麻醉乙醚(2) 氟烷(2) 恩氟烷(安氟醚, 氟氯醚)(3) 异氟烷(异氟醚)(4)	
第二节 静脉全身麻醉药	(4)
硫喷妥钠(4) 丙烯炔巴比妥钠(5) 丙烯硫喷妥钠(7) 羟丁酸钠(7) 盐酸氯胺酮(8)	
第三节 局部麻醉药	(9)
盐酸可卡因(盐酸古柯碱)(9) 盐酸普鲁卡因(12) 盐酸丁卡因(盐酸邦妥卡因, 狄卡因)(14) 盐酸利多卡因(15) 盐酸布比卡因(盐酸丁哌卡因)(16) 盐酸辛可卡因(盐酸地布卡因)(17)	
第二章 催眠药和镇静药	(19)
第一节 巴比妥类药	(19)
苯巴比妥(鲁米那)(21) 苯巴比妥钠(22) 异戊巴比妥(22) 司可巴比妥钠(速可眠)(23)	
第二节 苯二氮草类药	(23)
氯氮草(利眠宁)(25) 安定(27) 硝基安定(硝西洋)(28) 盐酸氟安定(盐酸氟西洋)(29) 夸西洋(31) 三唑仑(33) 溴替唑仑(34)	
第三节 氨基甲酸酯类、吡啶酮类催眠药和镇静药	(35)
甲丙氨酯(安宁、眠尔通)(35) 佐匹克隆(35)	
第三章 抗癫痫(惊厥)药	(36)
苯妥英钠(大伦丁钠)(36) 乙琥胺(38) 扑米酮(扑痫酮)(38) 丙戊酸钠(抗癫灵)(40) 氯硝安定(氯硝西洋)(41) 卡马西平(酰胺咪嗪, 痛惊宁)(41)	
第四章 抗精神失常药	(43)
第一节 抗精神病药	(43)
一、吩噻嗪类	(43)
盐酸氯丙嗪(44) 奋及静(羟哌氯丙嗪)(46) 盐酸氟奋乃静(46) 盐酸三氟拉嗪(甲哌氯丙嗪)(47) 癸氟奋乃静(47)	
二、丁酰苯类	(47)
氟哌啶醇(氟哌丁苯)(48) 溴哌利多(49) 癸酸氟哌啶醇酯(癸氟哌啶醇)(50) 五氟利多(50)	
三、硫杂蒽类	(51)
泰尔登(51)	
第二节 三环及四环类抗抑郁药	(52)
盐酸丙米嗪(53) 盐酸阿米替林(依拉维)(53) 盐酸多虑平(凯舒)(55) 盐酸氟西汀(盐酸氟苯氧苯胺)(56) 盐酸卡比米嗪(57) 盐酸哌异丙肼(58) 乙替唑仑(58) 氯噻西洋(59) 盐酸度硫平(二苯噻庚英)(59) 盐酸米安舍林(GB-94)(59)	
第三节 抗焦虑药	(60)
卤哌唑仑(61) 哌唑仑(61) 奥沙西洋(去甲羟安定, 舒宁)(62) 劳拉西洋(氯羟安定)(63) 哈拉西洋(三氟甲安定)(65) 艾司唑仑(舒乐安定)(66) 阿普唑仑(67) 舒必利(止呕灵、硫苯酰胺)(68)	
第四节 抗躁狂药	(69)
碳酸锂(69)	

第五章 解热镇痛药	(70)
第一节 水杨酸类	(71)
乙酰水杨酸(阿司匹林)(71) 赖氨酸阿司匹林(72) 二氟苯基水杨酸(73)	
第二节 乙酰氨基类	(73)
对乙酰氨基酚(扑热息痛)(73) 盐酸丙帕他莫(74)	
第三节 吲哚类	(75)
吲哚美辛(消炎痛)(75) 舒林酸(硫茛酸)(79)	
第四节 芳基丙酸类	(79)
布洛芬(异丁苯丙酸)(80) 布洛芬愈创木酚酯(82) 酮洛芬(优布芬)(82) 噻洛芬酸(84) 氟比洛芬(85) 烯丙胺布洛芬(86) 萘普生(87) 罗索普洛芬钠(89)	
第五节 萘环与芳乙酸类	(90)
萘丁美酮(90) 芬替酸(91)	
第六节 苯并噻嗪、苯并噻吩与二芳基噻唑类	(91)
炎痛喜康(吡罗昔康)(92) 替诺喜康(噻吩喜康)(93) 噻丙嗪(94)	
第七节 联苯乙酸类	(95)
芬布芬(95) 联苯乙酸(96)	
第六章 呼吸系统药	(98)
第一节 镇咳药	(98)
枸橼酸维静宁(枸橼酸喷托维林,咳必清)(98) 磷酸苯丙哌林(咳快好)(99) 磷酸二甲吗啉(磷酸二甲啡烷)(100) 枸橼酸异丙苯戊腈(咳得平)(101) 盐酸双苯 哌丙嗪(依普拉酮)(101)	
第二节 祛痰药	(102)
乙酰半胱氨酸(102) 奈索半胱(102) 盐酸溴己新(必消痰)(103) 盐酸氨溴索(104)	
第三节 平喘药和抗变态反应药	(105)
氨茶碱(105) 二羟丙茶碱(喘定)(106) 胆茶碱(107) 硫酸沙丁胺醇(硫酸舒喘灵)(107) 氢溴酸非诺特罗(定量气雾剂)(108) 盐酸吡丁胺醇(盐酸吡布特罗)(109) 硫酸特布他林(博利康尼)(109) 盐酸克仑特罗(110) 盐酸马布特罗(112) 盐酸异丙肾上腺素(喘息定)(112) 富马酸福莫特罗(113) 色甘酸钠(115) 异丙托溴铵(溴化异丙阿托品)(115) 富马酸酮替芬(116)	
第七章 抗组胺药	(117)
盐酸异丙嗪(盐酸非那根)(118) 扑尔敏(马来酸氯苯那敏)(119) 盐酸异吡丙嗪(121) 富马酸吡咯醇胺(122) 美唑他嗪(123) 盐酸苯海拉明(124) 茶苯海明(乘晕宁)(126) 盐酸西替立嗪(126) 盐酸派力苯沙明(盐酸吡苻明)(127) 盐酸赛庚啶(128)	
第八章 消化系统用药	(130)
第一节 制酸药	(130)
硫糖铝(胃溃宁)(130) 铝镁加(131) 丙谷胺(二丙谷酰胺)(131) 组胺 H ₂ 受体阻滞药(132) 西咪替丁(甲氧咪胍)(133) 盐酸雷尼替丁(135) 法莫替丁(137) 盐酸罗沙替丁醋酸酯(140) 盐酸哌仑西平(141) 枸橼酸铋钾(得乐)(142)	
第二节 解痉药	(142)
一、颠茄生物碱	(142)
硫酸阿托品(143) 溴化丁基东莨菪碱(解痉灵)(145) 氢溴酸东莨菪碱(146) 氢溴酸山莨菪碱(147)	
二、合成解痉药	(147)
溴化丙胺太林(普鲁本辛)(147) 奥诺前列素(149) 服止宁(149)	

第三节 镇吐药	(150)
甲氧氯普胺(胃复安)(150) 盐酸地芬尼多(二苯哌啶丁醇)(151) 吗叮啉(丙哌双苯唑酮,多潘立酮)(152)	
第四节 胰腺炎治疗药	(152)
甲磺酸茚发莫特(福山)(153)	
第九章 利尿脱水药	(154)
第一节 吩噻嗪类利尿药	(154)
氢氯噻嗪(双氢氯噻嗪)(155) 苄氟噻嗪(157)	
第二节 抗醛固酮性利尿药	(158)
螺内酯(安体舒通)(158) 坎利酸钾(159)	
第三节 髓祥利尿药与脱盐利尿药	(160)
呋喃苯胺酸(呋塞米)(160) 阿佐塞米(161) 利尿酸(依他尼酸)(162) 布美他尼(丁尿胺)(163) 美托拉宗(甲苯噻嗪酮;甲苯噻唑磺胺)(164)	
第十章 心血管系统药	(165)
第一节 强心药	(165)
地高辛(165)	
第二节 抗心律失常药	(166)
盐酸普鲁卡因胺(奴佛卡因胺)(167) 盐酸美西律(慢心律)(167) 盐酸普罗帕酮(心律平)(169) 盐酸普萘洛尔(心得安)(169) β -受体阻断药(170) 吲哚洛尔(心得静;心复宁)(172) 阿替洛尔(173) 酒石酸美托洛尔(173) 氧烯洛尔(心得平)(173) 盐酸布克莫洛尔(174) 盐酸布尼洛尔(175) 吡二丙胺(达舒平)(176) 盐酸妥卡胺(176) 盐酸劳卡胺(氯克律)(177) 盐酸恩卡胺(178) 氟卡胺(178) 盐酸胺碘酮(安律酮)(179) 盐酸维拉帕米(异博定)(180) 钙通道阻滞剂(182)	
第三节 抗心绞痛药	(182)
亚硝酸异戊酯(182) 硝酸甘油(183) 硝酸异山梨酯(消心痛)(183) 双嘧达莫(潘生丁)(184) 硝苯地平(心痛定硝苯啶)(186) 尼群地平(188) 盐酸苄普地尔(189) 盐酸依他苯酮(乙胺苯丙酮)(192) 三甲氧苄啶(曲美他啶)(193) 盐酸奥克西非汀(193)	
第四节 抗高血压药	(194)
卡巴唑啉磺酸钠三水合物(195) 利血平(196) 降压灵(197) 盐酸可乐定(198) 硫酸胍乙啶(199) 二氢噻(降压噻)(200) 盐酸地尔硫草(哈氮草)(200) α_1 -肾上腺素受体阻断药(203) 盐酸哌唑嗪(204) 盐酸特拉唑嗪(盐酸四唑唑)(205) 盐酸布纳唑嗪(205) 甲磺酸多沙唑嗪(206) 酮舍林(207) 胍苯酞噻类降压药(207) 布特拉唑(208) 血管紧张素转化酶(ACE)抑制剂(208) 卡托普利(巯甲丙脯酸)(209) 马来酸恩那普利(苯丁脯酸)(210) 硝普钠(211) 米诺地尔(长压定)(212)	
第五节 抗动脉硬化药	(212)
氯贝丁酯(安妥明冠心平,氯苯丁酯)(213) 对氯苯氧异丁铝(降脂铝)(214) 双贝特(降脂丙二醇,安妥明丙二酯;冠心平-Ⅱ)(214) 非诺贝特(215) 克林诺贝特(216) 烟酸肌醇酯(216) 烟酸酯类血脂代谢改善药(217) 亚油酸(217) 吡醇氨酯(安吉宁,血脉宁)(218)	
第十一章 脑血管障碍治疗药	(219)
第一节 脑血管障碍的分类及其治疗	(219)
一次性脑缺血发作(219) 脑梗塞(220) 脑出血(220) 蛛网膜下出血(221) 高血压症脑病(221) 痴呆(221) 偏头痛(221)	
第二节 脑代谢赋活药	(222)

γ -氨基丁酸(氨酪酸)(222) 羟基氨酪酸(223) 巴氯芬(氯苯氨酪酸)(223) 羟乙基芦丁(维脑路通)(224) 盐酸苄苯氧胺(盐酸必非美兰)(225) 盐酸茛洛酮(226) 富马酸尼唑苯酮(226) 索科舍利和索利(227) 吡乙酰胺(吡咯烷酮乙酰胺,脑复康)(227) 奥拉西坦(羟基吡咯烷酮乙酰胺)(228) 盐酸金刚烷胺(228) 阿尼西坦(茴拉西坦)(229) 脑复清(229) 马来酸泰洛噻啉(229) 盐酸吡硫醇(脑复新)(230) 胞二磷胆碱(CDP-胆碱)(231) 艾地苯醌(233) 盐酸硫必利(234) 马来酸利苏灵(235) 细胞色素C(236) 三磷酸腺苷二钠(ATP)(237) 何洋酸钙(237)

第三节 脑循环改善药 (238)

甲磺酸双氢麦角托克斯(239) 麦角溴烟酯(240) 己酮可可碱(240) 长春西汀(阿朴长春胺酸乙酯)(241) 丙戊茶碱(242) 富马酸溴长春胺(242) 富马酸苄环庚烷(242) 异丁得乐(243) 盐酸布酚宁(盐酸苄丙酚胺)(243) 硫酸巴美生(硫酸丁酚胺)(244) 盐酸异舒普林(盐酸苯氧丙酚胺)(245) 酒石酸艾芬地尔(酒石酸苄哌酚胺)(247) 环扁桃酯(248) 桂利嗪(脑益嗪)(248) 盐酸氟桂嗪(250) 马来酸辛帕嗪(251) 克冠草(地拉齐普)(251) 烟酸生育酚酯(252) 枸橼酸烟胺乙酯(尼卡美酯)(253) 曲拉地尔(唑啉胺,乐可安)(254) 草酸萘呋胺(255) 二甲磺酸烯丙哌三嗪-阿吗碱(255) 盐酸尼卡地平(256) 尼莫地平(258) 舒洛地尔(硫苯辛胺醇)(259) 盐酸莫西赛利(百星胺)(259) 血管舒缓素(260) 盐酸噻氯匹啶(260) 昔洛斯他唑(261) 双烟酰苯二甲酰胺(262)

第十二章 抗菌药 (263)

第一节 磺胺类药 (263)

磺胺甲基异噁唑(新诺明)(265) 甲氧苄胺嘧啶(267)

第二节 抗结核药 (268)

硫酸链霉素(268) 硫酸卡那霉素(269) 硫酸卷曲霉素(269) 硫酸结核放线菌素(271) 环丝氨酸(271) 利福平(甲哌利福霉素)(271) 利福定(利福霉素)(272) 异烟肼(雷米封)(273) 吡嗪酰胺(274) 丙硫异烟胺(274) 盐酸乙胺丁醇(275) 对氨基水杨酸钠(PAS-Na)(276)

第三节 喹诺酮类合成抗菌药 (277)

吡哌酸(279) 诺氟沙星(氟哌酸)(280) 环丙沙星(环丙氟哌酸)(282) 氧氟沙星(氟嗪酸,奥氟星)(284) 托磺沙星对甲苯磺酸盐(286)

第四节 抗病毒化学疗法药 (287)

碘苷(疱疹净)(288) 阿昔洛韦(288)

第十三章 抗生素 (287)

第一节 主要作用于革兰氏阳性菌的抗生素 (289)

青霉素(287) 青霉素钾(289) 苄星青霉素(291) 半合成青霉素(291) 苯唑青霉素钠(苯唑西林钠)(291) 邻氯青霉素钠(293) 哌拉西林(氧哌嗪青霉素)(297) 盐酸林可霉素(盐酸洁霉素)(298) 盐酸克林霉素(300) 盐酸万古霉素(300)

第二节 主要作用于革兰氏阴性菌的抗生素 (301)

多粘菌素(301) 硫酸多粘菌素B(302) 硫酸粘菌素(硫酸多粘霉素E)(303) 盐酸匹夫甲亚胺青霉素(303) 盐酸壮观霉素(盐酸奇放线菌素)(304) 头孢磺啶钠(磺吡苄头孢菌素钠)(305) 单环 β -内酰胺类抗生素(305) 卡路莫南钠(306)

第三节 主要作用于革兰氏阳性、阴性菌的抗生素 (307)

半合成青霉素(6-氨基青霉烷酸的制备)(307) 氨苄青霉素钠(氨苄西林钠)(309) 羟氨苄青霉素(阿莫西林)(310) 磺苄青霉素钠(磺苄西林钠)(312) 羧苄青霉素钠(羧苄西林钠)(313) 卡茛西林钠(治平霉素)(314) 磷霉素钙(314) 头孢菌素类抗生素(先锋霉素)(315) 头孢噻吩钠(噻孢霉素钠)(317) 头孢羟氨苄(羟氨苄头孢菌素)(318) 头孢噻吩钠(323) 头孢氨苄(苯甘孢霉素)(324) 头孢唑啉钠(327) 头孢哌酮(先锋必)(钠)(329) 头孢替坦(CTT)(329) 氨基糖甙类抗生素(330) 单硫

酸卡那霉素(331) 硫酸新霉素(332) 硫酸巴龙霉素(333) 硫酸庆大霉素(334) 硫酸丁胺卡那霉素(硫酸阿米卡星)(335) 硫酸地贝卡星(336) 妥布霉素(336) 硫酸小诺霉素(沙加霉素)(337) 硫酸链霉素(338) 硫酸奈替米星(338) 硫酸福提霉素(阿司米星)(339) 硫酸异丝帕米星(ISP)(341) 单内酰胺环类抗生素(342) 氨基南(噻吩单酰胺菌素,氨基羧单酰胺菌素;菌克单)(344)	
第四节 主要作用于革兰氏阳性菌、立克次氏体的抗生素	(345)
红霉素(345) 红霉素及其衍生物(346) 三乙酰竹桃霉素(347) 十六元环大环内酯类抗生素(348) 醋酸麦迪霉素(349) 乙酰螺旋霉素(350) 罗他霉素(350) 交沙霉素(351)	
第五节 主要作用于革兰氏阳性菌、阴性菌、立克次体的抗生素	(351)
氯霉素(351) 甲砒霉素(355) 四环素类抗生素(355) 盐酸四环素(357) 盐酸土霉素(358) 强力霉素(盐酸脱氧土霉素)(358) 甲烯土霉素(360) 盐酸米诺霉素(二甲胺四环素)(360) 硝酸罗利霉素(361)	
第六节 抗生素新进展	(361)
衣米配内(IPM)(361) 头孢唑南钠(362)	
第十四章 抗寄生虫药	(364)
甲硝唑(364) 硝咪唑(365) 吡嗪酮(366) 双羟萘酸噻嘧啶(噻嘧啶)(366) 驱蛲快(368) 盐酸左旋咪唑(368) 噻苯唑(噻苯咪唑)(369) 阿苯达唑(肠虫清)(370) 甲苯达唑(甲苯咪唑)(372) 氯硝柳胺(灭绦灵,血防 67)(373) 枸橼酸哌嗪(374) 磷酸哌嗪(375)	
第十五章 降血糖药	(376)
甲苯磺丁脲(377) 氯磺丙脲(378) 格列本脲(优降糖)(379) 磺酰脲类衍生物降血糖药(379) 甲磺吡脲(格列齐特,达美康)(380) 格列喹啶钠(380) 格列丁唑(381) 甲磺氯草脲(381) 醋磺己脲(乙酰苯磺环己脲)(382) 格列喹酮(糖适平)(384) 盐酸苯乙双胍(降糖灵)(384) 胰岛素(385)	
第十六章 维生素类药	(387)
第一节 油溶性维生素	(387)
维生素 A(387) 维生素甲酸(389) 维生素 D(389) 活性型维生素 D——二氢速甾醇(392) 钙代谢调节药——骨化三醇(392) 维生素 E(生育酚)(393) 微小循环系统赋活药——烟酸生育酚酯(396) 维生素 K ₁ (397) 维生素 K ₃ (397) 微生素 K ₃ (甲萘醌)(398) 维生素 K ₄ (2-甲基-1,4-酚)(401)	
第二节 水溶性维生素	(400)
维生素 B ₁ (盐酸硫胺)(400) 维生素 B ₁ 的衍生物(403) 呋喃硫胺(405) 盐酸呋喃硫胺(405) 维生素 B ₂ (核黄素)(408) 辅酶型维生素 B ₂ ——黄素腺嘌呤二核苷酸(408) 磷酸维生素 B ₂ (408) 核黄素四丁酸酯(408) 维生素 B ₆ (盐酸吡哆醇)(409) 维生素 B ₆ (6-氨基嘌呤盐酸盐)(412) 泛酸钙(412) 泛硫乙胺(双泛酸硫乙胺)(415) 维生素 B ₁₂ (氰钴胺)(417) 维生素 C(抗坏血酸)(419) 叶酸(423) 烟酸(425) 烟酰胺(426)	
第十七章 激素类药	(427)
第一节 含氮激素	(427)
一、甲状腺激素	(427)
甲状腺素(427) 左旋甲状腺素钠(428) 三碘甲状腺氨酸钠(碘塞罗宁钠)(428)	
二、抗甲状腺药	(430)
甲硫咪唑(他巴唑)(430) 卡比马唑(甲亢平)(431) 丙基硫氧嘧啶(PTU)(432)	
三、副甲状腺激素	(433)
依降钙素(433)	
四、肾上腺素及其衍生物	(434)
肾上腺素(434) 重酒石酸去甲肾上腺素(435) 盐酸去氧肾上腺素(436)	

第二节 前列腺素	(437)
前列地尔(前列腺素 E ₁ -α-环糊精包合物)(448) 前列地尔脂肪乳剂(449) 依前列醇钠(前列环素 I ₂)(449) 地诺前列酮(前列腺素 E ₂)(450) α-环糊精(451) 地前列腺素氨丁三醇(452) 吉美前列素(453) 前列素腺 E ₂ ·甲基橙皮甙(453) 利码前列腺素(454)	
第三节 甾体激素	(454)
一、雄激素及蛋白同化激素	(456)
甲基睾丸素(457) 丙酸睾丸素(459) 氟羟甲基睾丸素(460) 丙酸甲雄烷酮(460) 蛋白同化激素(460) 苯丙酸诺龙(463) 康力龙(464) 氧雄龙(内酯龙)(465)	
二、肾上腺皮质激素	(466)
醋酸可的松(468) 氢化可的松(皮质醇)(469) 醋酸氢化可的松(472) 醋酸卤泼尼松(473) 醋酸泼尼松(醋酸强的松)(474) 倍他米松(474) 醋酸地塞米松(475) 醋酸氟氢可的松(475) 氯泼尼醇(476) 三卤米他松(476) 醋酸氟氢松(477)	
三、雌激素与黄体激素	(477)
戊酸雌二醇(478) 己烯雌酚(479) 氯烯雌醚(泰舒)(480) 枸橼酸氯米酚(枸橼酸氯蔗酚胺)(480) 环芬尼(双醋环烷)(481) 黄体酮(孕酮)(481) 6-去氢逆孕酮(482)	
四、甾体避孕药	(482)
甲基炔诺酮(483) 炔诺酮(485) 炔雌醇(486) 米那司酮(抗孕酮息百虑)(486)	
第十八章 抗肿瘤药	(488)
第一节 烷化剂	(488)
一、氮芥类	(488)
甲酰溶肉瘤素(氮甲)(488) 苯丁酸氮芥(瘤可宁)(490)	
二、磺酸酯类及溴化物类	(491)
白消安(马利兰)(492) 甲磺丙胺(493) 二溴甘露醇(493)	
三、乙烯亚胺类	(494)
塞替派(494) 环磷酰胺(495) 异环磷酰胺(497)	
四、亚硝基脲类	(497)
洛莫司汀(环己亚硝脲)(498) 雷诺氮芥(499) 盐酸尼莫司汀(盐酸嘧啶亚硝脲)(500) 卡波酞(501)	
五、三氮烯咪唑类	(502)
达卡巴嗪(氮烯唑胺)(502) 盐酸丙卡巴肼(盐酸甲基苄肼)(503)	
第二节 抗代谢物类抗肿瘤药	(504)
一、嘌呤类	(505)
巯嘌呤(6-MP)(505) 硫鸟嘌呤(506)	
二、叶酸代谢拮抗药	(506)
甲氨蝶呤(507) 甲酰四氢叶酸钙(亚叶酸钙,叶醛酸钙)(508)	
三、嘧啶类拮抗性抗肿瘤药	(509)
氟尿嘧啶·尿嘧啶(优福定)(509) 氟尿嘧啶(5-FU)(510) 溴尿苷(512) 卡莫氟(513) 去氧氟尿苷(514) 盐酸阿糖胞苷(515) 依诺他宾(516)	
第三节 抗肿瘤植物药	(519)
硫酸长春碱(518) 硫酸长春新碱(519) 硫酸酰胺基长春碱(519) 高三尖杉酯碱(520)	
第四节 抗生素类抗癌药	(521)
盐酸柔红霉素(522) 盐酸阿克拉柔比星(523) 阿霉素(524) 氢化吡喃阿霉素(匹拉柔比星)(525)	

盐酸米托蒽醌(525) 盐酸佐柔比星(博来霉素)(526) 盐酸平阳霉素(526) 更生霉素(放线霉素 D)
(527) 丝裂霉素 C(自力霉素)(527)

第五节 激素类及其他类抗癌药..... (528)

雌甾氮芥(雌二醇氮芥磷酸二钠)(528) 安宫黄体酮(醋酸甲羟孕酮)(529) 己酸孕诺酮(529) 枸橼
酸他莫昔芬(三苯氧胺)(530) 乌苯美司(530) 醋酸亮苯瑞林(531) 醋酸性瑞林(531) 顺铂(顺氯
氨铂)(532)卡波铂(533)

主要参考文献 (536)

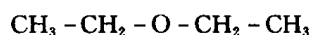
第一章 麻醉药

麻醉药分为全身麻醉药(全麻药)和局部麻醉药(局麻药)。全身麻醉药作用于中枢神经系统,伴随意识和感觉的消失而得到无痛的效果。抑制中枢神经系统而必须达到不麻痹延髓、呼吸和血管运动中枢的目的。麻醉时,中枢神经系统的活动处于有选择性的、可逆性的抑制状态,使意识、感觉和反射消失、肌肉松弛,处于嗜睡或睡眠状态,以适应外科手术的进行。全麻药又分为两类:吸入全麻药和静脉麻醉药。

第一节 吸入全麻药

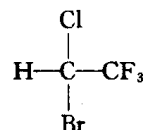
吸入全麻药又称挥发性全麻药(Volatile Anesthetics)。麻醉时,吸入全麻药与一定比例的空气或氧气混合后,随呼吸进入肺泡,从肺泡膜弥散入血液,经脑血流分布到大脑组织而发挥作用。吸入的全麻药大多以原形从肺部呼气排出,体内无变化,不同程度地转变为二氧化碳或其他代谢物,随尿排出。

最早外科使用的全麻药是氧化亚氮(笑气) N_2O (Nitrous Oxide),但麻醉作用弱,可与其他麻醉药合用或与氧的混合气体用于无痛分娩、牙科麻醉及术后止痛。经临床应用,现已知司沃氟烷作用最强,异氟烷最安全,恩氟烷价格较高,氟烷起效最快,甲氧氟烷对肾脏毒性大,麻醉乙醚缺点多、优点少,逐渐少用。司沃氟烷(Sevoflurane)是1971年由瓦林(Wallin)开发的氟化物麻醉药。其血/气分配系数低、苏醒快,与其他氟烷比较,麻醉后对呼吸抑制轻微而且排泄快。



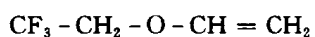
麻醉乙醚

Anesthetic Ether



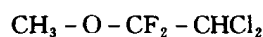
氟烷

Halothane, Fluothane



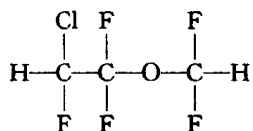
氟乙烯醚

Fluroxene



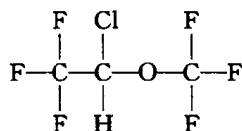
甲氧氟烷

Methoxyflurane



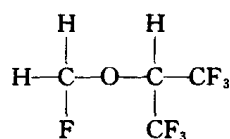
恩氟烷(安氟醚)

Enflurane



异氟烷(异氟醚)

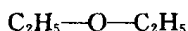
Isoflurane



司沃氟烷
(Sevoflurane)

麻醉乙醚

Ether pro Narcosi



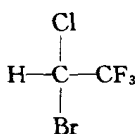
本品为无色澄明、易流动的液体；有特臭，有极强的挥发性与燃烧性，蒸气与空气混合后遇火能爆炸，在空气与日光影响下，渐渐氧化变质。与乙醇、氯仿、苯、石油醚、脂肪油或挥发油均能任意混合。在水中溶解，本品沸程为 33.5~35.5℃。相对密度为 0.713~0.718(20℃)。

本品氧化变质产生过氧化物及醛等物质，对呼吸道有刺激性，能引起肺水肿及肺炎等症，严重时能致死。因此，变质的乙醚不能供药用。启封 24 小时后，也不能再作麻醉用。麻醉乙醚纯度要求高，对呼吸中枢有抑制作用；气味不佳，刺激性强，能使呼吸器官粘膜、粘液腺分泌增多，气道难以保证通畅。

优点是使用时易于操作控制，能产生良好的镇痛及肌肉松弛作用，直接的麻醉死亡率低。

氟 烷

Halothane (Fluethane, Halothane)



本品为 1,1,1-三氟-2-氯-2-溴乙烷。

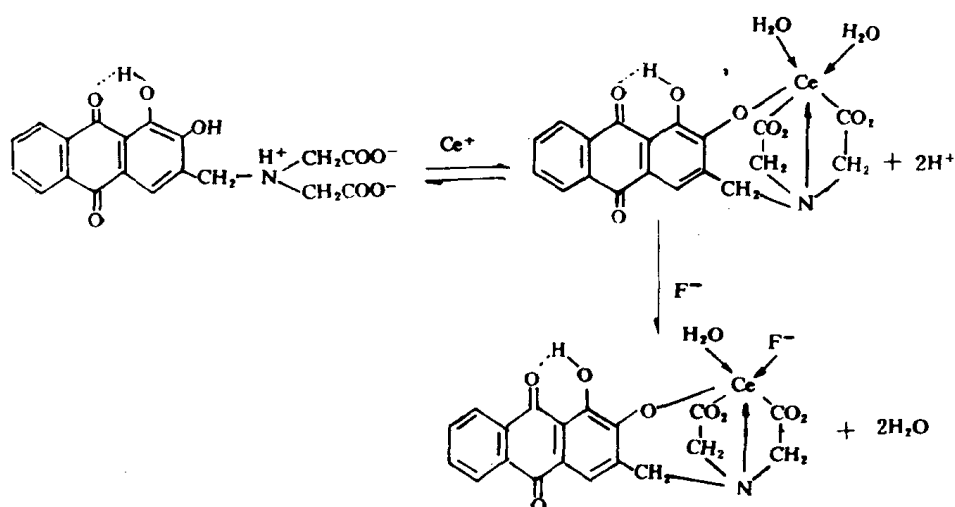
本品为无色、易流动的重质液体。相对密度为 1.871~1.875(20℃)。沸程 49~51℃。有类似氯仿的香气、味甜。性质较稳定，与氧任意混合而不易爆炸，也不易燃烧。但遇日光、热和湿空气却能缓缓分解，生成氢卤酸等。所以本品加有 0.01%(g/g)麝香草酚为稳定剂。本品与乙醇、乙醚或非挥发性油类任意混合。本品在水中微溶。质重，不溶于硫酸，当加入硫酸后，应聚集在酸层下面(与甲氧氟烷的区别)。本品呈有机氟化物的特殊反应。将氟烷用氧瓶燃烧法有机破坏后，以稀氢氧化钠吸收，用醋酸-醋酸钾缓冲液调 pH 4.3 时与硝酸亚铈和茜素氟蓝络合，产生蓝紫色(见下页反应式)。

本品为吸入全麻药。全麻效能强，为乙醚的 4 倍；有水果香味，对粘膜刺激小；合理使用能保持支气管扩张，平滑肌松弛，苏醒时不呕吐。

缺点是①麻醉氟烷纯度要求高，万一掺有微量的氟丁烷和氟丁烯聚合体，剧毒，可致极度的肝功能不全而致死；②化学性质不很稳定，与加热的碱石灰接触而变质产生剧毒物，液态氟烷均加稳定剂；③氟烷蒸气于水蒸汽饱和下能腐蚀锡、铝、黄铜和铅等金属(除纯铜外)，又能溶

解橡胶塑料,而后徐徐释出,增加麻醉用具制造上的麻烦;④镇痛效能不佳,骨骼肌松弛效能也差,再加上能扰乱心肌正常的应激性,在中等度全麻时,抑制呼吸和循环功能使之减弱,因此,体内的内环境难以保持正常。使用时均须格外注意。

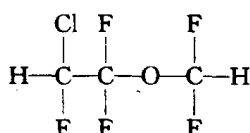
氟烷不会燃烧爆炸,适用于需用电力或电灼的手术;适用于某些疑难病例,如支气管哮喘、



糖尿病等;便于控制降压。不得反复吸入,相隔应在3个月以上,以免损害肝功能。以下病例禁用:①肝炎患者;②剖腹产;③体克、心功能不全、心肌损害等病情。

恩 氟 烷(安氟醚,氟氯醚)

Enflurane



化学名 二氟甲基-1,1,2-三氟-2-氯乙基醚。

为无色、透明挥发性液体。沸点 56.5℃。蒸气密度 6.4。化学性质稳定,不燃烧、不爆炸,对呼吸道无刺激性,血/气分配系数为 1.19,肺泡气最低有效浓度(Minimal Alveolar Concentration, MAC)为 1.68%。蒸气香味悦人,诱导迅速、苏醒快。不与钠石灰发生作用,不因光照分解变质,一般对金属无腐蚀性。如与 30%氧化氮混合,MAC 可降至 1.17%,当氧化氮为 70%时,MAC 只有 0.5%。

本品为吸入全麻药。优点是①全麻诱导快,苏醒也快,吸入 5 分钟后一般可达施行手术的麻醉要求,停止吸入后肺泡浓度迅速降低很快苏醒。吸入量可达 85.1%,其中 82.7%以原形从呼气中排出,只有 2.4%形成代谢物排出;②对呼吸道粘膜无刺激性,不引起分泌物增多;③骨骼肌松弛比氟烷好,对肝功能影响小于氟烷;④不会诱发胃肠道紊乱,恶心呕吐较少见;⑤ 0.5%浓度加 40%氧化亚氮吸入,可用于分娩,产妇清醒合作,不影响宫缩,不抑制胎儿;⑥代

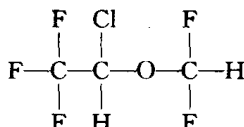
谢物氟化物产量和排泄远低于甲氧氟烷对肾的损害,对血糖无影响。

缺点是麻醉过深时脑电图可见棘波状,偶见面部或四肢肌肉强直阵挛性抽搐;本品必须通过专用蒸发器;镇痛持续时间短,停药得及早应用镇痛药。

注意事项 严重心肺功能不全,肝肾功能损害、癫痫患者、对卤素过敏者禁用。

异氟烷(异氟醚)

Isoflurane



1-氯-2,2,2-三氟乙基·二氟甲基醚。

本品为无色透明、易挥发性液体。沸点为 48.5℃。血/气分配系数在现有的吸入全麻药中最低,为 1.4。肺泡气最低有效浓度(MAC) 1.15%,介于氟烷与恩氟烷之间,是强效全麻药。不燃不爆。吸入 5~10 分钟后,浓度可增至 5%而达到手术要求的麻醉水平,30 分钟后呼气与吸气浓度比几乎为 1:1,诱导较氟烷慢,溶解度低,绝大部分随呼气迅速排出,迅速苏醒,在体内分化降解代谢的量极小,所以最安全。对心脏收缩力及心输出量无明显影响,由于外周阻力降低,血压稍有下降,可使收缩的支气管扩张,这有利于慢性阻塞性肺疾患者的麻醉。且不易发生心律失常,本品适用于各科手术时的诱导和维持。缺点是气味虽无明显的刺激,但一般不大受欢迎;本品对子宫肌松弛并对胎儿有害,故产科手术应慎用;使用专用蒸发器。

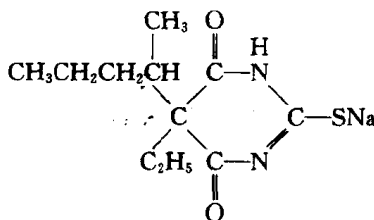
第二节 静脉全麻药

静脉全麻药一般仅适用于时间短、镇痛要求不高的小手术。临床上常与吸入全麻药或麻醉辅助用药合用，用于复合全麻的诱导和维持，使病人安静、倦睡、对外界环境应激反应迟钝，使感觉、意识、记忆消失，一直到外科手术完成并延续一段时间。

静脉全麻药有巴比妥类药如硫喷妥钠、丙烯炔巴比妥钠(Methohexital Sodium)、丙烯硫喷妥钠(Thiamylal Sodium)等;盐酸氯胺酮、羟丁酸钠临床上也常使用。

硫 喷 妥 钠

Thiopental Sodium

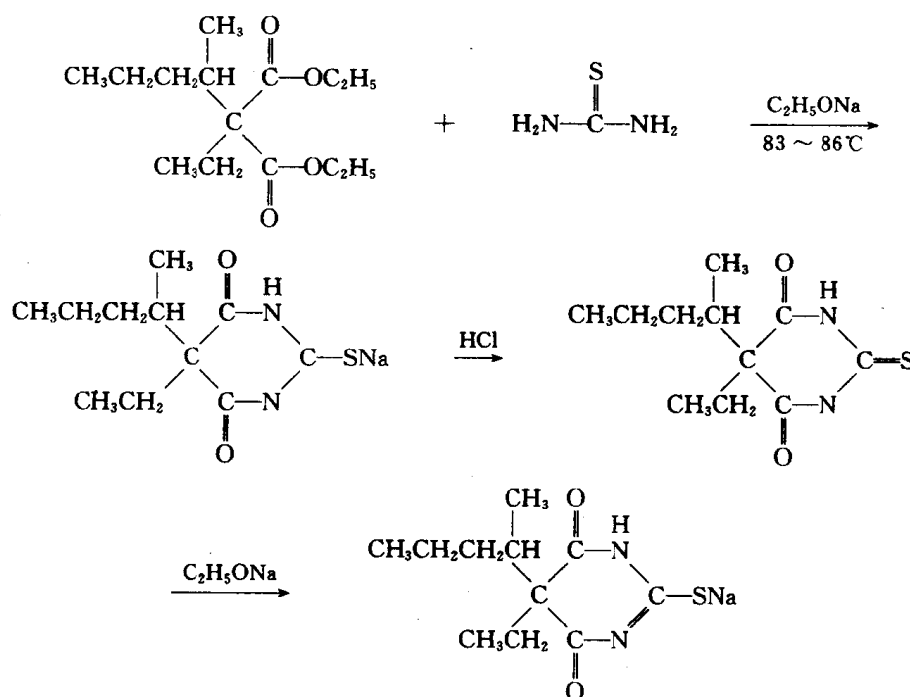


本品为 5-乙基-5-(1-甲基丁基)硫代巴比妥酸钠。

本品水溶液放置后(尤其遇二氧化碳)易解析析出沉淀,若加热分解更快,故注射用硫喷妥钠采用 100 份硫喷妥钠与 6 份碳酸钠混合的灭菌粉末,临用前以注射用水新鲜配制,并不得超过 24 小时使用,同时忌与酸性药物配伍。

本品为淡黄色粉末,有似蒜臭、味苦,露置空气中极易吸湿,能溶于水,在醇中部分溶解,不溶于醚、苯中。水溶液对石蕊试纸呈碱性反应。加酸酸化,析出白色的硫喷妥沉淀。本品与氢氧化钠溶液煮沸,不发生氨臭。本品与吡啶硫酸铜试液作用显绿色,这不同于其他巴比妥类药。

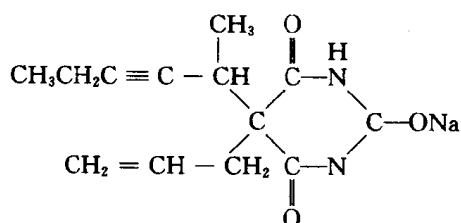
制备以乙基(1-甲基正丁基)丙二酸二乙酯在乙醇钠存在下,与硫脲缩合,温度 83~86℃,缩合后酸化,得硫喷妥沉淀,最后与乙醇钠作用得本品。



本品为超短作用的巴比妥类药。静脉注射用于全麻诱导或反复静注小量,用于复合全麻。也可灌肠偶用于小儿的基础麻醉。本品静注能纠正全麻药导致颅内压升高,一般均有效。本品也用于抗癫痫(抗惊厥),起效快,但不持久,只能救急。

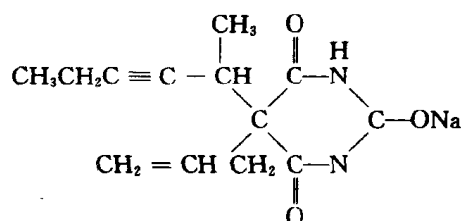
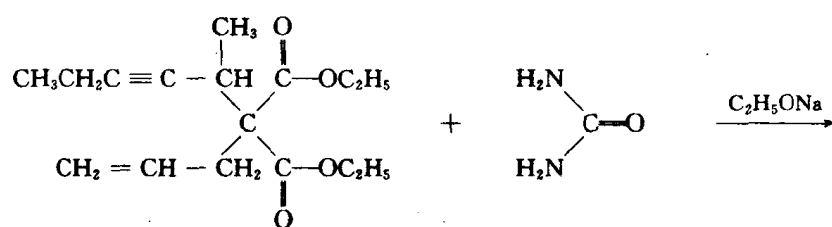
丙烯炔巴比妥钠

Methohexital Sodium



本品为长效巴比妥类药。作用时间大于 6 小时。与吸入全麻药配合用于外科手术。合成

路线为:



由 1-丁炔和乙基溴化镁反应得到的有机金属试剂与乙醛进行缩合,生成醇化物(I),再与三溴化磷作用,生成相应的炔丙基溴化物(I),与丙二酸二乙酯进行炔化反应,然后用烯丙基溴炔化,便得到制备丙烯炔巴比妥的原料(II):

