

西药卷

现代个体化 药物新剂型

XianDai GeTiHua YaoWu
XinJiXing

第2版

主编 侯连兵 王春霞



人民军医出版社

PEOPLE'S MILITARY MEDICAL PRESS

第2版

现代个体化药物新剂型

XIANDAI GETIHUA YAOWU XINJIXING

(西药卷)

主 编 侯连兵 王春霞
副主编 刘世霆 郭 丹 文晓芸 曾煦欣
严鹏科 霍启录 肖 炜 肖小燕
主 审 肖翔林 周本杰
编 者 (以姓氏笔画为序)
马 云 马平勃 王春霞 王晓露
文晓芸 邓 凡 叶海英 田雪梅
西 娜 庄志铨 刘世霆 刘思佳
严鹏科 李颖嘉 杨 凌 杨西晓
肖 炜 肖小燕 岑远明 宋晓兵
罗景慧 周本杰 单友亮 侯连兵
侯剑萍 郭 丹 黄乐松 腊 蕾
曾 芬 曾方银 曾煦欣 解庆东
霍启录



人民军医出版社

PEOPLE'S MILITARY MEDICAL PRESS

北 京

图书在版编目(CIP)数据

现代个体化药物新剂型. 西药卷/侯连兵,王春霞主编. —2版. —北京:人民军医出版社,2009.9
ISBN 978-7-5091-2911-1

I. 现… II. ①侯…②王… III. 剂型 IV. R944

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2009)第 150019 号

策划编辑:黄建松 文字编辑:秦 珑 黄维佳 责任审读:周晓洲

出 版 人:齐学进

出版发行:人民军医出版社

经销:新华书店

通信地址:北京市 100036 信箱 188 分箱 邮编:100036

质量反馈电话:(010)51927290;(010)51927283

邮购电话:(010)51927252

策划编辑电话:(010)51927300—8057

网址:[www. pmmp. com. cn](http://www.pmmp.com.cn)

印、装:三河市春园印刷有限公司

开本:850mm×1168mm 1/16

印张:29 字数:830 千字

版、印次:2009 年 9 月第 2 版第 1 次印刷

印数:0001~2800

定价:150.00 元

版权所有 侵权必究

购买本社图书,凡有缺、倒、脱页者,本社负责调换

内 容 提 要

编者在参考、总结了近年国内外个体化药物新制剂、新剂型研究的成果和文献资料,以及 1997 年出版的《常用药物新剂型及临床应用》的基础上,系统地介绍了 352 种化学药物(西药)新制剂和新剂型的处方组成、制备工艺、临床应用和注意事项,并扼要介绍了药物的性状、来源、药理作用与用途。本书是一本集科学性、实用性、信息性于一体的大型药物著作,内容新颖独特,信息量丰富,既可作为临床医务工作者选择、配制新制剂及观察新药临床疗效的指导用书,又可供药物研究者开发药物新制剂、新剂型时参考阅读。

主编简介

侯连兵,男,1957年生,湖南株洲人,主任药师、教授、博士生导师。毕业于上海第二军医大学药学院,后师从我国著名药理学家吴曙光教授,并获药理学硕士学位,一直潜心于药物药剂与药理学评价研究。现任南方医院药学部主任、南方医科大学国家药物临床试验机构办公室副主任、临床药理研究所所长、临床药学教研室主任,另受聘为国家科技奖评审专家、国家自然科学基金评审专家、国家新药评审专家、《中国药房》杂志主编、《中药材》杂志编委会副主任委员等学术团体职务。近年主持国家、省、市基金科研课题15项,其中国家重点科技攻关和国家自然科学基金各1项,省、市级项目13项;参与国家863和国家自然科学基金等7项。发表论文133篇,获国际、全国优秀论文奖6项,其中一等奖3项、二等奖2项、三等奖1项。主编专著6部,副主编5部。获国家、省科技进步奖15项,其中广东省科技进步一等奖2项,中国专利优秀奖1项,国家新药研制三等奖1项,中国药学会科学技术三等奖1项,省部级二等奖3项,三等奖7项。国家发明专利5项。获国家一类、二类和三类新药证书4项。荣立个人三等功1次。

王春霞,女,1970年生,四川广安人,副主任药师。毕业于第一军医大学(现为南方医科大学),获博士学位。参加工作后一直在南方医院从事医院药学研究。2001年攻读研究生期间,主攻术后粘连疗效指标评价体系、细胞因子对肠粘连影响以及肠粘连防治新药的研究。受聘为中华中医药研究促进会药品管理与中药知识产权保护专业委员会委员、广东省医疗机构药事管理专家委员会秘书、广东省中医药学会医院药学专业委员会委员。近年主持广东省科技攻关项目1项,广东省医院药学基金1项,参与国家、省、市基金科研课题8项。获广东省科技进步一等奖和二等奖各1项、军队科技进步三等奖1项,发表学术论文32篇,副主编专著1部、参编3部。

第2版序

《现代个体化药物新剂型》(西药卷)是一部专述个体化药物新制剂、新剂型及临床应用研究著作,是1997年由人民军医出版社出版的我国首部《常用药物新剂型及临床应用》专著的再版。该著作将国内外个体化药物新制剂、新剂型最新研究成果、技术与信息进行了系统归纳和总结,可为一线工作者在工作中遇到的问题和困难提供有益的帮助和解决问题的有关信息。为此,由衷地祝贺该著作的如期出版。

《现代个体化药物新剂型》(西药卷)是一部适时完成与推出的个体药物制剂技术专著。该著作的突出特点是:①专述个体化药物新制剂、新剂型及临床应用的最新研究进展与成果;②提供给广大研究者的信息是个体化药物新制剂、新剂型系统的研究概况;③内容新颖全面,重点突出,实用性强。因此,该著作具有很强的信息性、知识性和实用性。有此书在手,可知个体化药物新制剂、新剂型研究的最新研究进展与信息,可减少因信息不灵所造成的重复和盲目研究。给药品生产企业和新药研究者在研究新制剂、新剂型和开发新产品时以启迪,给临床医务工作者在观察新产品的临床疗效、选择和配制新制剂时以指导。该著作将成为从事药学研究、教学 and 管理的医药卫生工作人员的重要参考书。

中国工程院院士

第2版前言

在药物新剂型发展的同时,个体化药物的新制剂、新剂型也得到蓬勃发展,涌现出大量研究开发成果,大大提高了药物的疗效,促进了药物的应用。因此,1996年我们在参考、总结国内外研究成果与应用经验的基础上,结合自己的研究成果与应用体会,撰写了我国首部个体化药物新制剂、新剂型著作《常用药物新剂型及临床应用》一书。此书的出版立即得到广大医药工作者的好评。我国著名药学家、原中国药学会药剂学专业委员会主任委员刘国杰教授审阅本书时给予了极高评价,并为之作序。

随着科学技术的不断进步,各学科相互渗透、相互促进,特别是材料学、信息学等的飞速发展,使得个体化药物新制剂、新剂型领域的发展更是日新月异。因此,几年前我们在刘国杰教授指导下开始再版编写,将《常用药物新剂型及临床应用》分为西药卷和中药卷两部专著,并更名为《现代个体化药物新剂型》,以更加突出本书主旨。然而,本书再版的难度远远超出了我们的预期,我们历时数年,终于完成了西药卷的编写。

新版的西药卷共分为21章,包括抗微生物药物、抗寄生虫药物,作用于中枢神经系统、植物神经系统、循环系统、呼吸系统、消化系统、泌尿系统、生殖系统等的药物,抗肿瘤、抗变态反应、抗衰老药物以及激素类、维生素类、营养类等药物。各章重点介绍了常见西药药物各种新制剂、新剂型研究及其临床应用,并扼要介绍了性状、药理作用与用途及使用的注意事项等,不仅提供了个体化药物新制剂、新剂型的组成与配方、制备工艺及临床应用效果等信息,而且还提供了大量参考文献和系统研究最新结果,以启迪研究者对药物研究与开发的新思路。希望本书的出版能够为个体化药物新制剂、新剂型的研制、开发与应用提供参考,为我国药物制剂研究的发展起积极推动作用。

由于如今药物制剂发展日新月异,书中内容可能存在一定的不足或错漏,诚恳读者不吝赐教。我国著名中药制药学家、中国工程院院士李大鹏教授为本书第2版作序。此外,由于种种原因,参与本书第1版编著的大部分编写人员未能参加第2版的编写,第2版的编写人员也几经更替,故在此付梓之际,特向为本书付出艰辛劳动的所有相关人员表示感谢!同时,为感谢刘国杰教授对本书编写提供的巨大支持和悉心指导,我们将其1997年为本书第1版出版时所作的序及亲笔签名再次刊登,以表我们最沉痛的哀思!

南方医科大学 侯连兵 王春霞

第 1 版序

药物剂型总体发展,已从汤、膏、丸、丹、散、片剂、注射剂发展到当今的缓释、控释与靶向制剂。药物剂型技术的发展日新月异,并已有专著总结、论述,促使其提高与发展。单个药物剂型的发展,也是经过这样一个过程的,但这方面的研究成果,尚未见有学者整理、阐述。《常用药物新剂型及临床应用》一书的出版,将结束这一历史。值得为此而高兴。

《常用药物新剂型及临床应用》一书分西药和中药两部分,共 21 章,其中西药 18 章,中药(单味中药、经验方剂及中成药)3 章。由第一军医大学、南方医院、解放军总医院、广州军区广州总医院、海军药学中心等单位的经验丰富的中青年技术骨干集体编写。其特点是:①较全面、系统地介绍了单个药物性状(或来源),原药物的药理作用及用途,新剂型的药理作用及用途,新剂型研究(包括处方组成及制备工艺),新剂型的临床应用,新剂型的注意事项;②突出介绍单个药物的新剂型及临床应用进展;③信息量较大,收入了国内近几十年、国外近几年研究的内容。因此,本书对医院药学及药物研究工作者来说,可提供单个药物新剂型的处方组成及制法的信息,以减少因信息不灵所造成的重复、盲目工作;对生产企业来说,可以通过其临床应用的效果,来决定其研制与开发前景;对临床医护人员来说,也可为疾病诊治提供新的药物、新的选择。因此本书实为一集信息性、知识性和实用性于一体的专著,对单个药物新剂型的研制、开发与应用均有较高的参考价值。此书必将丰富和加速单个药物新剂型研究和临床应用。

中国药科大学教授



1996 年 2 月 1 日

说明

1. 本书共收载药物(西药部分)352种。
2. 药物名称、中文名,参照《中华人民共和国药典》第二部(2005版)和《英汉、汉英药名词汇》(卫生部药典委员会汇编);外文名,以联合国世界卫生组织发表的《药品国际非专利名称》中的英文名为准。
3. 西药药物类别依照《新编药理学》(陈新谦,等,第15版,北京:人民卫生出版社,2006)编排。
4. 本书所收载的内容全部来自国内外医药期刊正式发表的原著,均有文献出处,以供查找。
5. 本书所收载的处方必须满足两个条件,一是组成和处方用量明确或组成明确,否则不予收载;二是处方中药物、辅料的剂量单位,以原著为准,未加换算。
6. 本书各药物处方中凡省略单位的一律为克(g),“ml”代表毫升,“mol/L”代表某物质的浓度,“d”代表天等。
7. 新制剂、新剂型研究是一个创新性工作,需要临床验证和长期随访观察。因此本书在1997年出版的《常用药物新剂型及临床应用》的基础上,仅精选了截至2005年的有关药物新制剂与新剂型的文献报道。
8. 部分临床疗效确切、使用安全,并已上市的药物新剂型因未见文献报道,以药厂或医药公司产品推荐的材料作为参考文献。

目 录

第 1 章 抗微生物药物

氨苄西林 Ampicillin	(1)	柳氮磺吡啶 Sulfasalazine	(43)
阿莫西林 Amoxicillin	(2)	磺胺米隆 Mafenide	(43)
头孢氨苄 Cefalexin	(4)	磺胺嘧啶锌 Sulfadiazine Zinc	(44)
头孢羟氨苄 Cefadroxil	(6)	磺胺嘧啶银 Sulfadiazine Silver	(45)
头孢唑肟 Ceftizoxime	(7)	磺胺甲噁唑 Sulfamethoxazole	(47)
头孢克洛 Cefaclor	(7)	呋喃妥因 Nitrofurantoin	(48)
头孢拉定 Cefradine	(8)	呋喃唑酮 Furazolidone	(49)
庆大霉素 Gentamicin	(9)	呋喃西林 Nitrofuril	(50)
链霉素 Streptomycin	(12)	吡哌酸 Pipemidic Acid	(51)
卡那霉素 Kanamycin	(13)	诺氟沙星 Norfloxacin	(52)
妥布霉素 Tobramycin	(15)	氧氟沙星 Ofloxacin	(59)
新霉素 Neomycin	(16)	依诺沙星 Enoxacin	(64)
小诺米星 Micronomicin	(18)	环丙沙星 Ciprofloxacin	(66)
四环素 Tetracycline	(19)	甲硝唑 Metronidazole	(70)
土霉素 Oxytetracycline	(20)	乌洛托品 Urotropine	(78)
金霉素 Chlortetracycline	(21)	苦参碱 Matrine	(79)
氯霉素 Chloramphenicol	(22)	异烟肼 Isoniazid	(80)
甲砒霉素 Thiamphenicol	(26)	利福定 Rifandin	(82)
红霉素 Erythromycin	(27)	利福平 Rifampicin	(83)
琥乙红霉素 Erythromycin Ethylsuccinate	(28)	利福霉素钠 Rifamycin Sodium	(86)
罗红霉素 Roxithromycin	(29)	两性霉素 B Amphotericin B	(86)
阿奇霉素 Azithromycin	(31)	咪康唑 Miconazole	(87)
麦迪霉素 Midecamycin	(33)	氟康唑 Fluconazole	(89)
醋酸麦迪霉素 Midecamycin Acetate ..	(34)	酮康唑 Ketoconazole	(92)
乙酰螺旋霉素 Acetylspiramycin	(35)	克霉唑 Clotrimazole	(95)
林可霉素 Lincomycin	(36)	制霉菌素 Nystatin	(96)
克林霉素 Clindamycin	(38)	阿昔洛韦 Aciclovir	(97)
多黏菌素 E Colistin	(40)	利巴韦林 Ribavirin	(100)
磺胺嘧啶 Sulfadiazine	(41)	膦甲酸钠 Foscarnet Sodium	(103)
磺胺甲噁唑 Sulfamerazine	(42)	酞丁安 Ftibamzone	(104)
		阿糖腺苷 Vidarabine	(104)

大观霉素 Spectinomycin	(106)	拉米夫定 Lamivudine	(108)
头孢克肟 Cefixime	(106)	阿米卡星 Amikacin	(109)
头孢吡肟 Cefepime	(107)	依替米星 Etimicin	(110)

第2章 抗寄生虫病药物

左旋咪唑 Levamisole	(128)	双氢青蒿素 Dihydroartemisinin	(133)
甲苯达唑 Mebendazole	(129)	蒿甲醚 Artemether	(133)
哌嗪 Piperazine	(130)	青蒿琥酯 Artesunate	(134)
吡喹酮 Praziquantel	(131)	阿苯达唑 Albendazole	(134)
青蒿素 Artemisinin	(132)	氯硝柳胺 Niclosamide	(136)

第3章 主要作用于消化系统的药物

西咪替丁 Cimetidine	(140)	硫糖铝 Sucralfate	(152)
鞣酸蛋白 Tannalbin	(141)	美沙拉嗪 Mesalazine	(152)
米索前列醇 Misoprostol	(142)	碳酸钙 Calcium Carbonate	(153)
胰酶 Pancreatin	(143)	奥美拉唑 Omeprazole	(153)
硫酸镁 Magnesium sulfate	(143)	西沙必利 Cisapride	(154)
法莫替丁 Famotidine	(144)	格拉司琼 Granisetron	(155)
雷尼替丁 Ranitidine	(145)	比沙可啶 Bisacodyl	(155)
胃蛋白酶 Pepsin	(146)	洛哌丁胺 Loperamide	(155)
碳酸氢钠 Sodium Bicarbonate	(146)	十六角蒙脱石 Dioctahedral Smectite	(156)
甘油 Glycerin	(148)	精氨酸 Arginine	(157)
碱式碳酸铋 Bismuth Subcarbonate	(149)	联苯双酯 Bifendate	(157)
兰索拉唑 Lansoprazole	(149)	马洛替酯 Malotilate	(157)
氢氧化铝 Aluminium Hydroxide	(150)	核糖核酸 Ribonucleic Acid	(158)
门冬氨酸钾镁 Potassium, Magnesium Aspartate	(150)	促肝细胞生长素 Hepatocyte Growth-promoting Factors	(158)
铝碳酸镁 Hydrotalcite	(151)	非布丙醇 Febuprol	(159)
胶体果胶铋 Colloidal Bismuth Pectin	(151)	泮托拉唑 Pantoprazole	(159)

第4章 主要作用于呼吸系统的药物

色甘酸钠 Cromoglycate Sodium	(162)	异丙肾上腺素 Isoprenaline	(174)
氯化铵 Ammonium Chloride	(163)	溴己新 Bromhexine	(175)
氯丙那林 Clorprenaline	(164)	氨溴索 Ambroxol Hydrochloride	(175)
异丙托溴铵 Ipratropium Bromide	(165)	乙酰半胱氨酸 Acetylcysteine	(176)
麻黄碱 Ephedrine	(165)	福尔可定 Pholcodine	(177)
伪麻黄碱 Pseudoephedrine	(167)	可待因 Codeine	(177)
沙丁胺醇 Salbutamol	(168)	苯丙哌林 Benproperine	(178)
氨茶碱 Aminophylline	(170)	右美沙芬 Dextromethorphan	(179)
茶碱 Theophylline	(171)	布地奈德 Budesonide	(180)
特布他林 Terbutaline	(173)	丙卡特罗 Procaterol	(182)

第5章 主要作用于循环系统的药物

地高辛 Digoxin	(187)	双氢奎尼丁 Dihydroquinidine	(199)
普鲁卡因胺 Procainamide	(187)	丙吡胺 Disopyramide	(200)
卡托普利 Captopril	(188)	普罗帕酮 Propafenone	(200)
依纳普利 Enalapril	(188)	单硝酸异山梨酯 Isosorbide Mononitrate	(201)
维拉帕米 Verapamil	(189)	烟酸肌醇 Inositol Nicotinate	(201)
普萘洛尔 Propranolol	(190)	烟酸 Nicotinic Acid	(201)
硝酸甘油 Nitroglycerin	(190)	罂粟碱 Papaverine	(202)
美西律 Mexiletine	(192)	环扁桃酯 Cyclandelate	(202)
肼屈嗪 Hydralazine	(192)	可乐定 Clonidine	(202)
硝苯地平 Nifedipine	(193)	莫索尼定 Moxonidine	(203)
硝酸异山梨酯 Isosorbide Dinitrate	(194)	多沙唑嗪 Doxazosin	(203)
尼卡地平 Nicardipine	(195)	乌拉地尔 Urapidil	(203)
尼群地平 Nitrendipine	(196)	特拉唑嗪 Terazosin	(204)
地尔硫革 Diltiazem	(197)	米诺地尔 Minoxidil	(204)
尼莫地平 Nimodipine	(198)	硝普钠 Sodium Nitroprusside	(205)
尼索地平 Nisoldipine	(198)		
非洛地平 Felodipine	(199)		

第6章 主要作用于泌尿系统的药物

螺内酯 Spironolactone	(209)	垂体后叶粉 Insufflation Posterior Pituitary	(215)
氯苯蝶啶 Triamterene	(210)	尿素 Urea	(215)
呋塞米 Furosemide	(211)	非那雄胺 Finasteride	(217)
氢氯噻嗪 Hydrochlorothiazide	(213)	阿米洛利 Amiloride	(218)
氯噻嗪 Chlorthiazide	(213)		
甘露醇 Mannitol	(214)		

第7章 主要作用于生殖系统及泌乳系统的药物

溴隐亭 Bromocriptine	(221)	普拉睾酮 Prasterone	(223)
卡麦角林 Cabergoline	(222)	芫花碱 Yuanhuacin	(223)
利托君 Ritodrine	(223)	壬苯醇醚 Nonoxinol	(224)

第8章 主要作用于植物神经系统的药物

毛茛菪碱 Pilocarpine	(226)	颠茄 Belladonna	(231)
阿托品 Atropine	(226)	萘甲唑林 Naphazoline	(232)
东莨菪碱 Scopolamine	(228)	阿替洛尔 Atenolol	(232)
后马托品 Homatropine	(229)	比索洛尔 Bisoprolol	(233)
山莨菪碱 Anisodamine	(229)	索他洛尔 Sotalol	(233)

第9章 主要作用于中枢神经系统的药物

多塞平 Doxepin	(236)	水合氯醛 Chloral Hydrate	(237)
-------------------	-------	----------------------------	-------

吡罗昔康 Piroxicam	(238)	阿司匹林 Aspirin	(256)
布洛芬 Ibuprofen	(240)	氯丙嗪 Chlorpromazine	(258)
酮洛芬 Ketoprofen	(243)	艾司唑仑 Estazolam	(259)
地西泮 Diazepam	(245)	苯巴比妥 Phenobarbital	(260)
对乙酰氨基酚 Paracetamol	(246)	碳酸锂 Lithium Carbonate	(260)
阿尼利定 Anileridine	(248)	硝西泮 Nitrazepam	(261)
双氯芬酸 Diclofenac	(248)	氯硝西泮 Clonazepam	(261)
吲哚美辛 Indometacin	(250)	苯妥英钠 Phenytoin Sodium	(261)
吲哚美辛锌 Zinc Indometacin	(254)	依托芬那酯 Etofenamate	(262)
桂美辛 Cinmetacin	(255)		

第 10 章 影响血液及造血系统的药物

蝮蛇抗栓酶 Ahylysantinfarctase	(269)	肌苷 Inosine	(278)
肝素 Heparin	(270)	卡巴克络 Carbazochrome	(278)
葡萄糖酸亚铁 Ferrous Gluconate	(272)	鱼精蛋白 Protamine	(279)
硫酸亚铁 Ferrous Sulfate	(273)	凝血酶 Thrombin	(279)
酚磺乙胺 Etamsylate	(273)	曲克芦丁 Troxerutin	(282)
双嘧达莫 Dipyridamole	(274)	维生素 B ₁₂ Vitamin B ₁₂	(283)
氨甲环酸 Acid Transamic	(276)	噻氯匹定 Ticlopidine	(284)
氨甲苯酸 Aminomethylbenzoic Acid	(276)	叶酸 Folic acid	(285)
醋硝香豆素 Nicoumalone Acenocoumarol	(277)	川芎嗪 Ligustrazine	(286)
Acenocoumarin	(277)	蚓激酶 Lumbrukinase	(287)

第 11 章 抗肿瘤药物

氟尿嘧啶 Fluorouracil	(291)	阿克拉霉素 Aclacinomycin	(302)
甲氨蝶呤 Methotrexate	(293)	高三尖杉酯碱 Homoharringtonine	(303)
环磷酰胺 Cyclophosphamide	(294)	平阳霉素 Bleomycin A5	(303)
顺铂 Cisplatin	(295)	卡铂 Carboplatin	(304)
多柔比星 Doxorubicin	(297)	依托泊苷 Etoposide	(305)
丝裂霉素 Mitomycin	(300)	紫杉醇 Paclitaxel	(305)
阿糖胞苷 Cytarabine	(302)	他莫昔芬 Tamoxifen	(307)

第 12 章 激素及其有关药物

胰岛素 Insulin	(310)	炔诺孕酮 Norgestrel	(320)
碘化油 Iodized Oil	(313)	雌二醇 Estradiol	(320)
碘化钾 Potassium Iodide	(313)	丙酸睾酮 Testosterone Propionate	(321)
地塞米松 Dexamethasone	(314)	左炔诺孕酮 Levonorgestrel	(322)
己烯雌酚 Diethylstilbestrol	(317)	达那唑 Danazol	(323)
雌三醇 Estriol	(317)	睾丸素 Testosterone	(324)
氯米芬 Clomiphene	(318)	醋酸甲地孕酮 Megestrol Acetate	(324)
黄体酮 Progesterone	(319)	甲羟孕酮 Medroxyprogesterone	(325)

羟孕酮 Hydroxyprogesterone Caproate	(326)	曲安奈德 Triamcinolone Acetonide ...	(330)
甲泼尼龙 Methylprednisolone	(326)	倍氯米松 Beclomethasone	(331)
泼尼松龙 Prednisolone	(327)	己烷雌酚 Hexestrol	(331)
氟轻松 Fluocinolone Acetonide	(327)	米非司酮 Mifepristone	(332)
甲巯咪唑 Thiamazole	(328)	卡前列素 Carboprost	(333)
甲睾酮 Methyltestosterone	(328)	卡前列甲酯 Carboprost Methylate	(333)
那法瑞林 Nafarelin	(328)	天花粉 Trichosanthin	(333)
炔诺酮 Norethisterone	(329)	格列吡嗪 Glipizide	(333)
氢化可的松 Hydrocortisone	(329)	格列齐特 Gliclazide	(334)
		格列喹酮 Gliquidone	(335)

第 13 章 影响机体免疫功能的药物

环孢素 Cyclosporin	(340)	MSHA Vaccine for Treat	(345)
硫唑嘌呤 Azathioprine	(342)	卡介苗 Bacillus Vaccine Calmette-Guerin	(346)
干扰素 Interferon	(343)		
铜绿假单胞菌苗 Pseudomonas aeruginosa			

第 14 章 麻醉药及其辅助药物

普鲁卡因 Procaine	(348)	苯佐卡因 Benzocaine	(355)
利多卡因 Lidocaine	(349)	氯胺酮 Ketamine	(356)
辛可卡因 Cinchocaine	(352)	依托咪酯 Etomidate	(357)
布比卡因 Bupivacaine	(352)	达克罗宁 Dyclonine	(357)
丁卡因 Tetracaine	(353)		

第 15 章 抗变态反应药物

苯海拉明 Diphenhydramine	(362)	异丙嗪 Promethazine	(366)
酮替芬 Ketotifen	(363)	氯马斯汀 Clemastine	(368)
赛庚啶 Cyproheptadine	(364)	特非那定 Terfenadine	(368)
氯苯那敏 Chlorpheniramine	(365)	曲尼司特 Tranilast	(369)

第 16 章 延缓衰老药及某些老年病用药

硫酸锌 Zinc Sulfate	(372)	胸腺素 Thymosin	(375)
葡萄糖酸锌 Zinc Gluconate	(373)	吡拉西坦 Piracetam	(376)
超氧化物歧化酶 Superoxide Dismutase ...	(374)		

第 17 章 维生素类药物

维生素 C Vitamin C	(379)	鱼肝油 Cod-Liver Oil	(384)
维生素 E Vitamin E	(381)	维生素 B ₁ Vitamin B ₁	(385)
维生素 A Vitamin A	(382)	维生素 B ₂ Vitamin B ₂	(386)
维生素 D ₃ Vitamin D ₃	(383)	维生素 B ₆ Vitamin B ₆	(386)

第 18 章 营养药

氨基酸 Amino Acids	(390)	木糖醇 Xylitol	(395)
-----------------------	-------	-------------------	-------

第 19 章 调节水、电解质及酸碱平衡用药

氯化钠 Sodium Chloride	(398)	氯化钙 Calcium Chloride	(400)
氯化钾 Potassium Chloride	(399)	葡萄糖酸钙 Calcium Gluconate	(401)

第 20 章 各临床科室备用药物

氯己定 Chlorhexidine	(403)	薄荷脑 Menthol	(422)
碘 Iodine	(406)	过氧化氢 Hydrogen Peroxide	(424)
碘仿 Iodoform	(406)	硼砂 Borax	(424)
聚维酮碘 Iodophor	(407)	硼酸 Boric Acid	(425)
水杨酸 Salicylic Acid	(409)	苯扎氯铵 Benzalkonium Chloride	(427)
苯甲酸 Benzoic Acid	(412)	苯扎溴铵 Benzalkonium Bromide	(427)
苯酚 Phenol	(414)	氢醌 Hydroquinone	(428)
依沙吖啶 Ethacridine	(414)	苯酚磺酸锌 Zinc Phenolsulfonate	(429)
维 A 酸 Tretinoin	(417)	氧化锌 Zinc Oxide	(429)
升华硫 Sulfur Sublimate	(419)	甲氧沙林 Psoralen	(430)
鞣酸 Tannic Acid	(420)	汞溴红 Merbromin	(431)
甲紫 Methylrosaniline Chloride	(420)	戊二醛 Glutaral	(432)
乳酸 Lactic Acid	(421)	腐植酸钠 Sodium Humate	(433)

第 21 章 其他药物

谷胱甘肽 Glutathione	(440)	玻璃酸酶 Hyaluronidase	(443)
硫代硫酸钠 Sodium Thiosulfate	(440)	荧光素钠 Fluorescein Sodium	(444)
亚甲蓝 Methylthioninium Chloride	(441)	硝酸铈 Cerous Nitrate	(445)
泛影葡胺 Meglumine Diatrizoate	(442)	前列腺素 Prostaglandin	(445)
硫酸钡 Barium Sulfate	(443)		

第 1 章 抗微生物药物

氨苄西林 Ampicillin

又名氨苄青霉素、欧倍林、思必欣、安必欣,为半合成的广谱青霉素,其游离酸含 3 分子结晶水,供口服用;其钠盐供注射用。

【性状】

本品及其钠盐均为白色结晶性粉末,无臭或几无臭,味微苦。其游离酸微溶于水,几不溶于醇、醚等有机溶剂, pK_a 为 2.5 和 7.3。钠盐易溶于水,略溶于丙酮,有较强的引湿性,10% 水溶液的 pH 为 8~10。本品在干燥状态下稳定,受潮或在水溶液中不稳定,除降解反应外还发生聚合反应,生成可致敏的聚合物。

【药理作用与用途】

1. 基本作用与用途 对革兰阳性菌的作用与青霉素近似,对绿色链球菌和肠球菌的作用较优,对其他菌的作用则较差。对耐青霉素的金黄色葡萄球菌无效。革兰阴性菌中淋球菌、脑膜炎球菌、流感嗜血杆菌、百日咳杆菌、大肠杆菌、伤寒副伤寒杆菌、痢疾杆菌、奇异变形杆菌、布氏杆菌等对本品敏感,但易产生耐药性。肺炎杆菌、吡啶阳性变形杆菌、铜绿假单胞菌对本品不敏感。主要用于敏感菌所致的泌尿系统、呼吸系统、胆道、肠道感染以及脑膜炎、心内膜炎等。

2. 新剂型的作用与用途 氨苄西林栓的药动学研究表明含主药 125 mg 和 250 mg,直肠给药 5 min 达血浆峰值,分别为 4.8 和 7.1 $\mu\text{g}/\text{ml}$,6 h 尿回收率为 30.4%~45.6%,9 min 内达有效水平,其生物有效性近似于肌肉注射或口服,可代替上述剂型给药。此剂型通过直肠静脉吸收,避免了肝脏首关效应。主用于儿童疾病给药。锭剂口服给药的峰浓度和相对生物利用度分别是胶囊口

服的 1.8 和 1.7 倍。缓释直肠胶囊,给药 20 min 血药浓度达 2.62 $\mu\text{g}/\text{ml}$,6 h 尿液药浓度达 11.86 $\mu\text{g}/\text{ml}$ 。微型胶囊,体外释放 50% 约需 54.9 min,比粉末释药 50% 所需时间延长数千倍,如将其口服,既能延长疗效,减少服用次数和服用剂量,又可降低毒性反应。

【新剂型】

1. 氨苄西林栓^[1] 取基质适量,置容器中水浴加热至溶,加主药搅拌至完全混匀,稍冷,注入已涂润滑剂的栓模中,放冷待凝后,整理,脱模即得。每枚含主药 125 mg 或 250 mg。

2. 氨苄西林微囊^[2] 将乙基纤维素(EC)(4.8、4.2、3.0、2.4)分别溶于丙酮(60.0 ml)中,相应加入氨苄西林钠粉末(1.2、1.8、3.0、3.6),在 10℃,300 r/min 搅拌 20 min,得混悬液,加到含有表面活性剂的液状石蜡(200 ml)中,将体系温度逐渐升至 35℃,保温搅拌 6 h,升温至 57℃,搅拌 1 h,减压过滤,微囊用 30 ml 正己烷洗涤 3 次,减压干燥,得含主药 56.2% 的微囊。

3. 氨苄西林微囊^[3] 取氨苄西林(45.0)、二甲基氨基异丙基丙烯酸酯(105.0)、四氯乙烯(500.0 ml)配成均匀混悬液,喷雾干燥成平均直径为 5 μm 的微囊。

4. 氨苄西林缓释直肠胶囊^[4] 取适量氨苄西林及直肠吸收促进剂(水杨酸钠),混合后装入 I 号空心胶囊,用缓释膜浆包衣后做缓释部分;胶浆组为乙烯-醋酸乙烯共聚物(EVA)、聚乙烯吡咯烷酮(PVP)及氟仿,装入含药适量的 0 号空心胶囊(作速释部分)。本剂型根据硬胶囊可在直肠中迅速崩解,膜包衣胶囊可延缓崩解的性能而制备。

5. 氨苄西林毫微球靶向剂^[5] 本靶向剂以多聚物(异己基氰基丙烯酸酯)作为载体。此毫微球

既能和微生物结合,也能和其分离,但都分布于吞噬体和吞解体内,因而起到了较好的靶向作用。

6. 氨苄西林壳聚糖骨架缓释片^[6] 将氨苄西林包裹于壳聚糖骨架内,能获得较好控释效果。

7. 氨苄西林颗粒剂^[7] 按颗粒剂技术要求而制成。

【临床应用】

1. 氨苄西林缓释直肠胶囊 治疗过敏性支气管哮喘。患儿,7岁,每次给药2枚,2/d,同时雾化(不含抗生素)吸入治疗,用药7d,痊愈^[4]。

2. 氨苄西林栓 治疗急性呼吸道感染77例,有效率为88.3%,略高于氨苄西林口服组(86.7%);治疗急性肺炎31例,与静脉注射给药比较,有效率为93.5%,而静脉注射为83.3%。耳鼻喉科临床观察有效率为93.3%,高于口服剂组(89.1%);对其他疾病患儿480例观察表明有效率为93.8%。因此,对儿童急性呼吸道感染和急性肺炎,栓剂的临床疗效和安全性与口服或静脉注射相仿,或略优于它们,故对儿童有关疾病的治疗,本剂型有用药方便、患儿乐于接受、临床易于推广等优点^[8]。

3. 氨苄西林锭 对8名志愿健康者(男7,女1)观察表明,本品具有峰浓度高的特点,是对照组胶囊的1.8倍($P < 0.05$),生物利用度大大提高(相对生物利用度为1.7)^[9]。

【注意事项】

1. 缓释直肠胶囊的刺激性研究表明5名受试者开始有异物感,以后可感到直肠有“肠鸣音”,无其他刺激症状。1名受试者在用药8h后有难耐便意,解少量稀便。

2. 本品可致过敏性休克,皮疹发生率较其他青霉素类药高,可达10%或更多。有时也发生药热。

3. 本品在弱酸性葡萄糖液中分解较快,宜用中性液体做溶剂。

4. 氨苄西林与其他药物的相互作用与配伍

(1)与其他抗菌药物的相互作用:氨苄西林与庆大霉素、阿米卡星等静滴可因其 β -内酰胺环与糖氨基交联断裂生成氨基酰胺化合物而失去活性。但两类药物合用常获得协同作用,合用时应分别给药。氨苄西林与林可霉素、乳糖酸红霉素、多黏菌素B等亦有配伍禁忌,如需合用时宜分别

给药。氨苄西林与青霉素属同类药物,合用最多获相加作用而绝不可能获协同作用,合用可使药物过敏反应的机会增加,不良反应增加,且可同时诱导细菌对两种药产生耐药性,常规合用欠妥当,不宜推荐。氨苄西林与氟喹诺酮类药物无交叉耐药性,不发生拮抗却会增加作用,联用可扩大抗菌谱并减少耐药菌株,缩短病程,降低重复感染率,可联用。

(2)与其他非抗菌药物配伍:氨苄西林和间羟胺并用,可使后者结构中的酚羟基氧化失败,故宜分别给药。氨苄西林与维生素C配伍1h即分解失效,应分别给药。氨苄西林可刺激雌激素代谢或减少其肝肠循环,因此可降低口服避孕药的效果。丙磺舒可减少氨苄西林的肾排泄,使血药浓度升高,合用宜减少氨苄西林的用量。氨苄西林水溶液不稳定,不宜与多巴胺、肾上腺素、阿托品、氢化可的松、维生素B、钙剂、复合氨基酸注射液、多糖(如低分子右旋糖酐-40)等配伍。

阿莫西林 Amoxicillin

又名羟氨苄青霉素。

【性状】

白色或类白色结晶性粉末;味微苦。在水中微溶,在乙醇中几乎不溶。 pK_a 为2.4、7.4和9.6。0.5%水溶液的pH为3.4~5.5。

【药理作用与用途】

1. 基本作用与用途 抗菌谱与氨苄西林相同,微生物对本品和氨苄西林有完全的交叉耐药性。本品口服吸收良好。服用同量药物,本品的血清浓度比氨苄西林高约1倍。常用于敏感菌所致的泌尿系统、呼吸系统、胆道感染以及伤寒等。

2. 新剂型的作用与用途 克拉维酸与 β -内酰胺类抗生素阿莫西林联合,制成酶抑制联合制剂,能有效地抑制TEM-1、SHV-1、PSE-4、K1和KCAZ等5种广谱和超广谱酶对阿莫西林的水解。有实验证明克拉维酸浓度在10g/ml以下时,对阿莫西林的抑酶效率达到83%~98%。克拉维酸使阿莫西林避免了 β -内酰胺酶的破坏作用,可在不同程度上保护阿莫西林不被 β -内酰胺酶灭活,从而提高后者的抗产酶耐药菌的作用,提高临床疗效。研究证明 β -内酰胺类抗生素与其抑制药对产超广谱 β -内酰胺酶(extended-spectrum β -lactamase, ESBL)菌如大肠杆菌、肺炎克雷伯菌