第一篇 医　药

第一章 概　论

古代的药物是从自然界的天然产物中得到的。有机化学的发展，使天然产物中许多有效成分的分离、精制、结构测定和人工合成变成了现实。相关化合物与衍生物的合成及药理试验，使药物用品迅速发展。人们陆续从合成产物中发现并合成了各种麻醉剂、消毒剂、血管扩张剂、解热镇痛剂、镇静与催眠剂、维生素、激素和各种其他的化学治疗药物。

目前所使用的药物，大多按药效分类，例如可分为以下几种：

麻醉性药物，包括 全身或局部麻醉用药物 骨骼肌松弛药 抗胆碱酯酶药等

中枢神经系统药物，包括 催眠，镇静，抗惊厥和抗癫痫药物 抗精神病药物 解热、镇痛药物等。

心脑血管及相关疾病的药物，包括 血管收缩或舒张剂 抗心律失常或抗心绞痛药剂 血脂调节药物等。

抗肿瘤及免疫调节剂，包括 各类抗肿瘤制剂(例如烷化剂、抗代谢剂等) 免疫增强剂和免疫抑制剂等。

抗菌及抗病毒类药物，包括 抗生素类药物，如青霉素族、头孢菌素族、四环素族、氨基甙类、大环内酯类、多肽类、林可霉素类、氯霉素类以及其他各类抗生素 磺胺类药物 喹诺酮类药物 抗结核病药 抗麻风病药及其他各种抗菌及抗病毒药物。

呼吸系统及消化系统药物，包括 止咳祛痰剂，平喘剂 抗酸剂 平滑肌松弛剂 助消化药，泻药及止泻药 呕吐剂和止吐剂 舒肝利胆药物等。

激素类药物，包括 性激素制剂，甲状腺激素调节剂，肾上腺类激素，血糖调节药物等。

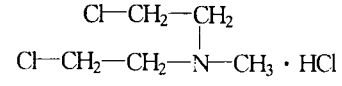
此外，还有抗寄生虫药物，血液及造血系统药物，体液盐水平衡调节药物，维生素类药物，生化及生物制剂(例如疫苗等)，诊断性药剂，消毒剂等各种功效繁多的制剂。

本篇所论及的，仅限于精细化工领域的典型制品。

第二章　抗肿瘤药物

1.2.1 盐酸氮芥(氮芥)　(Chlormethinum)

结构式

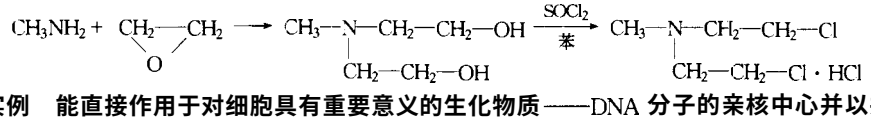


化学式　$C_5H_{12}NCl_3$

相对分子质量　192.52

物化性质　白色片状结晶。熔点 108～111℃。极易溶于水，易溶于乙醇，水溶液极易分解。

制备方法　以伯胺为原料，与过量的环氧乙烷在低温下作用，生成双-(β-羟乙基)-胺类化合物，再以氯化亚砜或其他氯化剂在有机溶剂中（如苯、氯仿等）进行氯化即得。



用途及实例　能直接作用于对细胞具有重要意义的生化物质——DNA 分子的亲核中心并以共价键形成交联，使其失去活性 或破坏 DNA双螺旋间的氢键，使 DNA分子断裂。是一种强烈的细胞毒素，主要用于恶性淋巴瘤和蕈样肉芽肿瘤以及肺癌，对其他肿瘤如卵巢癌、乳腺癌、绒癌、前列腺癌、精原细胞瘤

需要全本请访问 www.ertongbook.com

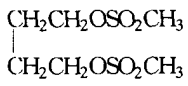
和鼻咽癌等也有一定疗效。抗瘤谱较广，但选择性差，对增殖细胞和非增殖细胞的作用近似。静、动脉或腔内注射，每次 0.1mg/kg，每日或隔日一次，4～6 次为一疗程，必要时休息 4 周再进行第二疗程。

安全性和防护 具有高毒性。危规号：2,2199D。

包装与贮运 塑料薄膜外加金属桶包装，避光、密封保存。

1.2.2 白消安（马利兰）（Busulfan）

结构式

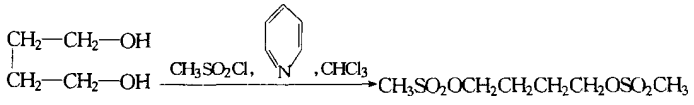


化学式 $C_6H_{14}O_6S_2$

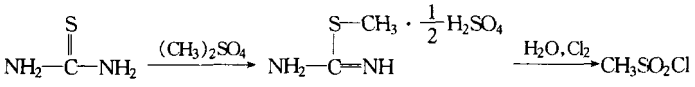
相对分子质量 246.31

物化性质 白色结晶性粉末，几乎无臭。熔点 115～118℃。不溶于水，溶于丙酮，微溶于乙醇。

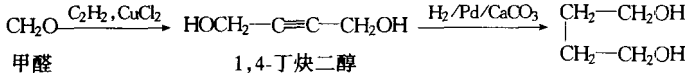
制备方法 由 1,4-丁二醇与甲磺酰氯缩合而得。甲磺酰氯可由硫脲经甲基化和氯氧化而得。



(1) CH_3SO_2Cl 的制备



(2) 1,4-丁二醇的制备



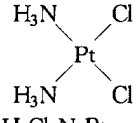
甲醛　　1,4-丁炔二醇

用途及实例 本品为细胞周期非特异性药物，主要作用于 G_1 期和 M 期。其作用原理与氮芥相仿。本品低剂量抑制骨髓粒细胞的生成，对红细胞和淋巴细胞几乎无影响。大剂量时对红细胞和淋巴细胞的生成起抑制作用。由于选择性作用，对慢性粒细胞白血病疗效显著，对其他肿瘤疗效不明显。口服：成人每日 4～8mg，待白细胞降至 10 000 左右时，停药或改用维持量 1～3mg，每日服 1 次或每周服 2次。

包装与贮运 密封，在干燥处保存。

1.2.3 顺氯氨铂(顺-双氯双氨络铂)（Cisplatin）

结构式

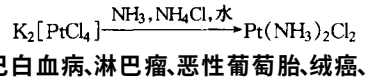


化学式 $H_6Cl_2N_2Pt$

相对分子质量 300.06

物化性质 橙黄色或黄色结晶性粉末、无臭。熔点 268～272℃（分解）。微溶于水，易溶于二甲基甲酰胺。在水溶液中可逐渐转化成反式和水解。

制备方法 由四氯铂酸钾（$K_2[PtCl_4]$）与氯化铵、氨水络合制得。

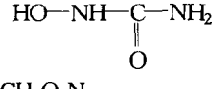


用途及实例 本品用于急性淋巴白血病、淋巴瘤、恶性葡萄胎、绒癌、宫颈癌和成骨肉瘤等。白血病，每日口服 0.1mg/kg，一般需 3～4 周见效。肌注每周 2 次，每次 20～25mg。绒毛膜上皮癌，每日静注 10～20mg，5d为一疗程。鞘内注射，每次 10～15mg。

包装与贮运 遮光，密封保存。

1.2.4 羟基脲(氨甲酰基胺)（Hydroxyurea）

结构式

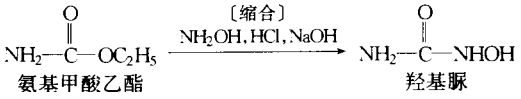


化学式 $CH_4O_2N_2$

相对分子质量 76.06

物化性质 白色或类白色针状结晶.无臭,无味。熔点 133～136℃(分解)。易溶于水或热乙醇,微溶于冷乙醇,不溶于乙醚。

制备方法

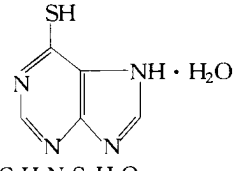


用途及实例 本品主要用于治疗慢性粒细胞白血病。口服每日 60～80mg/kg,每周 2 次,以 6 周为一疗程,或间歇疗法,每次 60mg/kg,每 8h 一次,给药 24h,间歇 4～7d,再进行第二疗程。

包装与贮运 在干燥阴凉处,密闭保存。

1.2.5 巯嘌呤(乐疾宁) (Mercaptopurine)

结构式

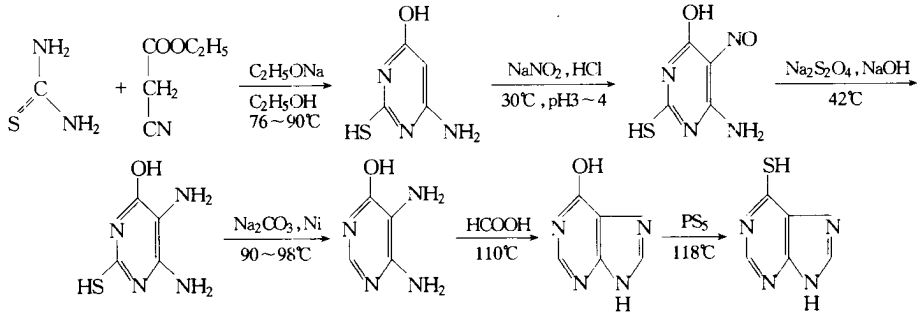


化学式 $C_5H_4N_4S\cdot H_2O$

相对分子质量 170.20

物化性质 微黄色结晶性粉末,味微甜。熔点 313～314℃ (分解)。极微溶于水,稍溶于沸水,几乎不溶于乙醚或乙醇,易溶于碱性水溶液。

制备方法 硫脲在乙酸钠存在下,与氯乙酸乙酯缩合得 2-巯基-4-氨基-6-羟基嘧啶,亚硝化得 2-巯基-4-氨基-5-亚硝基-6-羟基嘧啶,再在碱性中用连二亚硫酸钠(保险粉)还原得 2-巯基-4,5-二氨基-6-羟基嘧啶,在碳酸钠溶液中以活性镍催化脱硫得 4,5-二氨基-6-羟基嘧啶,与甲酸缩合得次黄嘌呤,在吡啶中以五硫化磷转变为巯嘌呤。

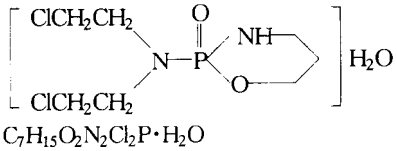


用途及实例 本品能抑制核糖核酸转变成脱氧核糖核酸,从而抑制 DNA合成。其毒性较低,起效迅速,能长期服用。本品主要作用于 S 期,对 G_1/S边界有延缓作用,从而待细胞同步化,集中 G_1 期,此期对放射线敏感,与放疗结合应用可提高疗效。主要用于治疗慢性粒细胞白血病。口服每日 60～80mg/kg,每周 2 次,以 6 周为一疗程,或应用间歇疗法,每次 60mg/kg,每 8h 一次,给药 24h,间歇 4～7 d,再进行第二疗程。

包装与贮运 在干燥阴凉处,密闭保存。

1.2.6 环磷酰胺(安道生) (Cyclophosphamide)

结构式

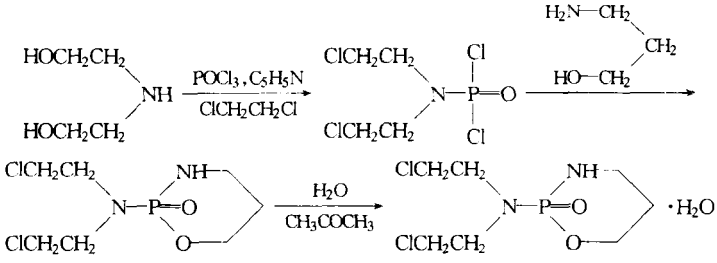


化学式 $C_7H_{15}O_2N_2Cl_2P\cdot H_2O$

相对分子质量 279.10

物化性质　白色结晶或结晶性粉末,无臭,味微苦。熔点 48.5～52℃。易溶于乙醇.溶于水或丙酮,水溶液不稳定。

制备方法　以二乙醇胺为原料，在无水吡啶中，用过量的三氯氧磷同时进行氯化和磷酰化，直接转化为氮芥磷酰二氯再在二氯乙烷中与 3-氨基丙醇缩合即得。

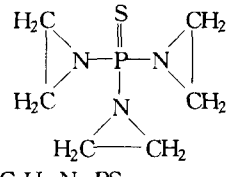


用途及实例　本品未被代谢时，无烃基化活性，对组织无直接损害作用。其代谢物之一为醛磷酰胺，在癌组织中很快分解成磷酰胺氮芥，此产物对癌组织毒化作用强，发挥其选择性抗癌作用。本品用于恶性淋巴瘤效果好,对急性淋巴白血病也具一定疗效,其他对慢性淋巴细胞白血病、乳癌、卵巢癌、睾丸癌、多发性骨髓瘤、神经性细胞瘤、头颈部癌和结肠癌等也有效。本品有免疫抑制作用，用于肾病综合症和类风湿性关节炎等。每日服 3mg/kg，分二次服。静注成人每次 200mg,每日或隔日 1 次.儿童每日 3～4mg/kg,或隔日 1 次。总量：成人一个疗程为 8～10g。

包装与贮运　避光密封,在 30℃以下保存。

1.2.7 噻替派(三胺硫磷,塞替派)　(Thiotepum)

结构式

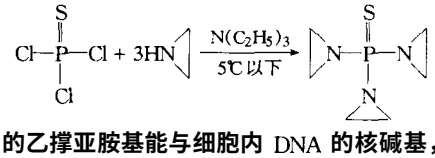


化学式　$C_6H_{12}N_{13}PS$

相对分子质量　189.22

物化性质　白色鳞片状结晶或结晶性粉末，无臭或几乎无臭。熔点 52～57℃。易溶于水、乙醇、乙醚或氯仿。

制备方法　本品可用硫氯化磷在三乙胺存在下，于无水苯中低温与乙烯亚胺缩合得粗品，用石油醚重结晶。

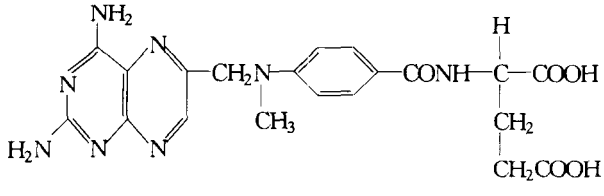


用途及实例　本品化学结构中的乙撑亚胺基能与细胞内 DNA 的核碱基,如与嘌呤结合,从而使 DNA 变性，影响癌细胞的分裂。本品为细胞周期非特异性药物。本品对乳腺癌和卵巢癌有较好的疗效。对消化道的腺癌、宫颈癌、甲状腺癌、肺癌和恶性黑色素瘤等也有一定疗效。肌注、静注每日每次 10mg,连用 5 d后,改为每周 3 次,总量 200～300mg为一疗程。动脉或局部灌注每日 1 次 10～20mg,总量同上。

包装与贮运　遮光，密闭保存。

1.2.8 甲胺喋呤（甲胺基叶酸）　(Methotrexatum)

结构式

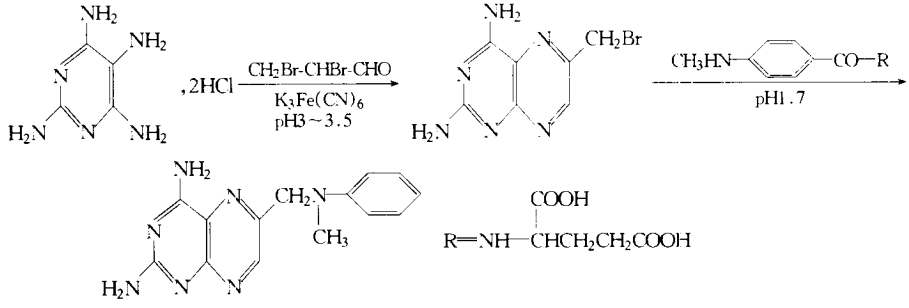


化学式 $C_{20}H_{22}O_5N_8$

相对分子质量 454.45

物化性质 橙黄色结晶性粉末。熔点 185～194℃。几乎不溶于水、乙醇、氯仿或乙醚，易溶于稀碱、酸或碱金属的碳酸盐溶液，微溶于稀盐酸。

制备方法 用四氨基嘧啶双盐酸盐与 2,3-二溴丙醛环合得 6-溴甲基喋啶，最后在酸中与对甲胺基苯甲酰麸氨酸缩合即得。

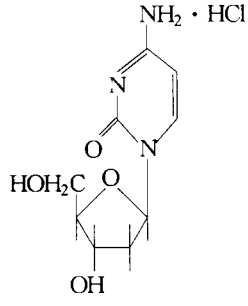


用途及实例 本品主要为二氢叶酸还原酶抑制剂，阻断脱氧胸苷酸和嘌呤核苷酸的生成，使 DNA 和 RNA 合成受阻碍，癌细胞生长受抑制。本品特异性地抑制 S期细胞。生长比率高的细胞对甲氨喋呤的杀伤作用最敏感，较大剂量可使 S期停止 48h 以上，并延缓 G_1 期进入 S期。其作用可被四氢叶酸对抗，用于急性淋巴白血病、淋巴瘤、恶性葡萄胎、绒癌、鳞状上皮癌、肺癌、宫颈癌、乳腺癌和成骨肉瘤(大剂量)等。白血病，每日口服 0.1mg/kg，一般需 3～4 周见效。肌注每周 2 次，每次 20～25mg 。绒毛膜上皮癌，每日静注 10～20mg，5 d 为一疗程，鞘内注射，每次 10～15mg。

包装与贮运 遮光，密封保存。

1.2.9 盐酸阿糖胞苷（阿糖胞苷）（Cytarabine Hydrochloride）

结构式

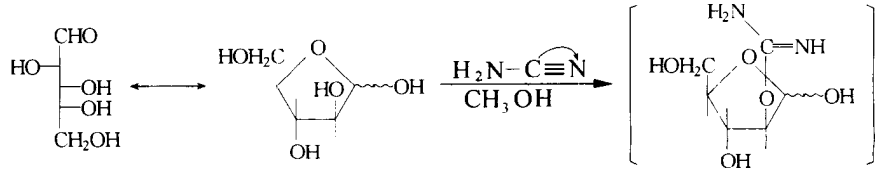


化学式 $C_9H_{13}O_5N_3 \cdot HCl$

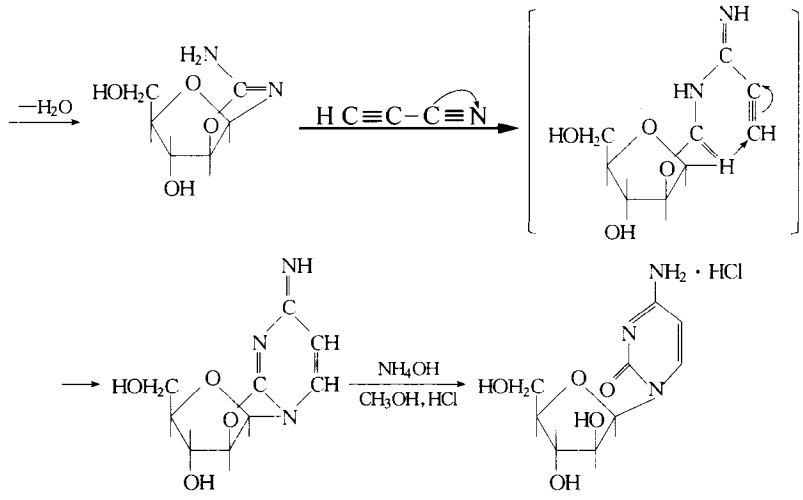
相对分子质量 279.68

物化性质 白色细小针状结晶或结晶粉末，无臭。熔点 190～195℃（分解）。极易溶于水，略溶于乙酸，几乎不溶于乙醚。

制备方法 以 D-阿拉伯糖为原料，在甲醇中与氰胺作用，生成乙-胺基-D-阿糖噁唑啉，再与丙炔腈反应，分子内环合生成环胞苷，以氨水处理再成盐即得。



需要全本请访问 www.ertongbook.com

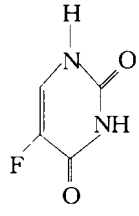


用途及实例　本品主要用于各类急性白血病（为急性粒细胞白血病首选治疗药物，与硫唑嘌呤合用较好）。静注，每日 1 次 2mg/kg，连续 10d。静滴，每日 0.5～1mg/kg，连续 10d 给药。

包装与贮运　避光，严封，在冷处保存。

1.2.10　氟尿嘧啶(5-氟尿嘧啶)　(Fluorouracil)

结构式

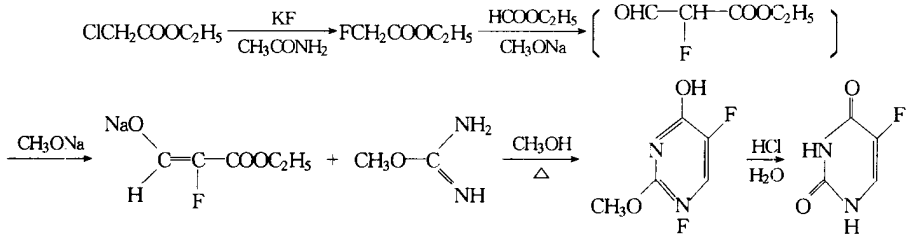


化学式　$C_4H_3O_2N_2F$

相对分子质量　130.08

物化性质　白色或类白色结晶或结晶性粉末。熔点 281～284℃(分解)。略溶于水，微溶于乙醇，几乎不溶于氯仿，可溶于稀盐酸或氢氧化钠溶液。

制备方法　以氯乙酸乙酯为原料，在乙酰胺中与无水氟化钾作用进行氟化，经分馏得氟乙酸乙酯。在甲苯中，以甲醇钠为缩合剂，与甲酸乙酯缩合得氟代甲酰乙酸乙酯烯醇型钠盐，再与甲基异脲缩合得 2-甲氧基 4-羟基-5-氟嘧啶，最后用稀盐酸水解即得。

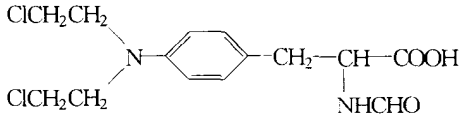


用途及实例　本品用于消化系统癌、头颈部癌、妇科癌症、肺癌、肝癌、膀胱癌、胰腺癌和皮肤癌等。口服，每日 150～300mg，分 3 次 静注，每次 10mg/kg，一般每次 500mg，每周 2 次，直至出现毒性反应。静脉滴注，每日 15～30mg/kg，每次滴注时间不得少于 6～8h，10d 为一疗程，静注和静脉滴注前均应称体重，准确计算剂量。

包装与贮运　避光，密封保存。

1.2.11 N-甲酰溶肉瘤素（氮甲） (Formyl Merphalan)

结构式

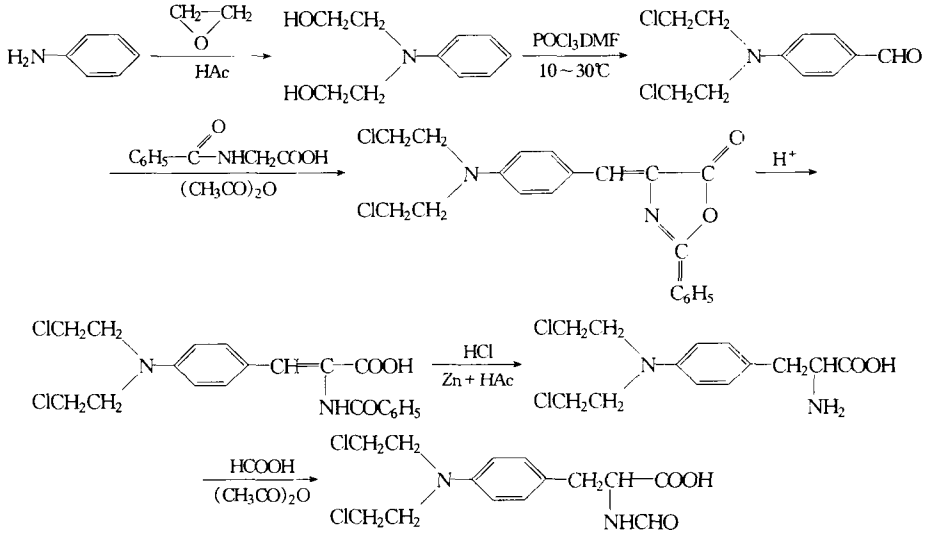


化学式 $C_{14}H_{18}O_3N_2Cl_2$

相对分子质量 333.21

物化性质 白色或淡黄色结晶性粉末，遇光变色。熔点 150～155℃。不溶于水、略溶于乙醇，微溶于丙酮。

制备方法 以苯胺为原料，与环氧乙烷在醋酸中作用，得双-苯胺，用三氯氧磷和 DMF 于低温下进行 Vilsmeier 反应。同时氯化得苯甲醛氮芥，与马尿酸缩合得苯甲醛氮芥噁唑酮，用锌粉在冰醋酸和盐酸中，同时进行还原和水解得溶肉瘤素，最后在醋酐中，以甲酸甲酰化即得。



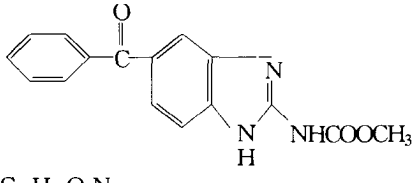
用途及实例 本品对多发性骨髓瘤和精原细胞瘤有较突出的疗效，对恶性淋巴瘤也有明显疗效。口服，成人每日 150～200mg(3～4mg/kg)，分 3～4 次或睡前 1 次服用，6～8g 为一疗程。

包装与贮运 避光，密封保存。

第三章 抗寄生虫病药物

1.3.1 甲苯咪唑 (Mebendazole)

结构式



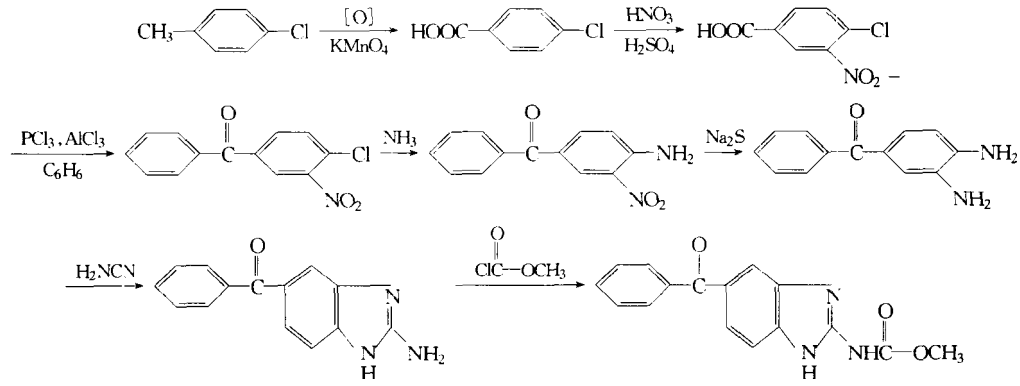
化学式 $C_{16}H_{13}O_3N_2$

相对分子质量 281.29

物化性质 白色或微黄色极细粉末，无臭，无味，不吸湿，在空气中稳定。熔点 285～287℃。几乎不溶于水、醇、醚及氯仿，易溶于甲酸及苯甲醛、冰醋酸，微溶于二甲亚砜。

制备方法 以对氯甲苯为原料，经氧化及硝化反应得 3-硝基-4-氯苯甲酸，再经氯化、Friedel-Crafts 反应，制得 3-硝基-4-氯二苯酮，经胺化及还原反应得 3,4-二氨基二苯酮，再与腈胺反应生成 5(6)-苯甲酰基苯

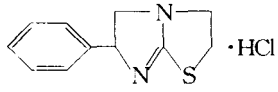
并咪唑-2-氨基，最后与氯代碳酸甲酯缩合即得。



用途及实例　本品对于蛔、蛲、鞭、钩等多种肠道蠕虫均有效。抑制虫体对葡萄糖的摄取，导致糖元耗竭，影响蠕虫的生长繁殖。使其活动逐渐减弱，最后死亡。对人的血糖无影响。对于鞭、蛲、蛔、钩虫感染均有较高的治愈率，为首选抗鞭虫药物。治疗鞭、蛔、钩虫感染，每日早晚各服 100mg，连服 3d。如未治愈，3周后进行第二疗程。治疗绦虫感染，每次服 300mg，每日 2次，连服 3d。

包装与贮运　避光，密封保存。

1.3.2　盐酸左旋咪唑　(Levamisole Hydrochloride)

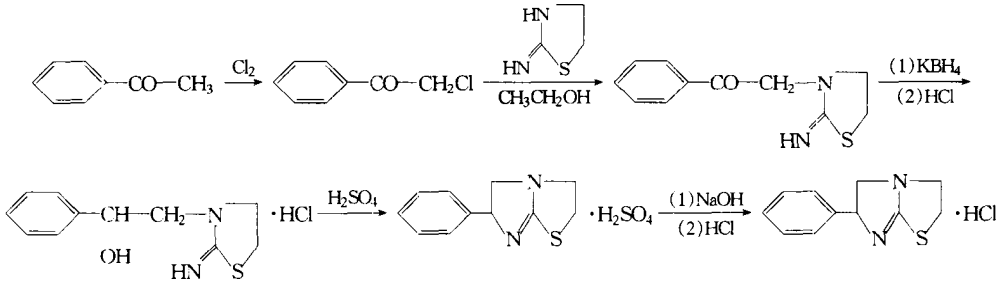
结构式　

化学式　$C_{11}H_{12}N_2S\cdot HCl$

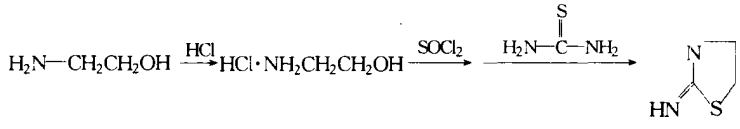
相对分子质量　240.75

物化性质　白色或微黄色结晶性粉末，无臭，味苦。极易溶于水，易溶于乙醇，微溶于氯仿，极微溶于丙酮。熔点 225～230℃，比旋光度 −120°～−127°。

制备方法　以苯乙酮为原料经氯化反应生成 α-氯化苯乙酮，再与 α-氨基噻唑啉缩合得 2-亚氨基-3-苯甲酰甲基噻唑啉盐酸盐，经硼氢化钾还原及成盐得 α-亚氨基-3-(α-羟基苯乙基)-噻唑啉盐酸盐。经浓硫酸脱水环合、碱化得四咪唑，最后用盐酸酸化即得。



2-氨基噻唑啉是以氨乙醇为原料经成盐酸盐、氯化与硫脲环合而得。



用途及实例　本品为广谱驱虫药，其活性为消旋体的两倍，毒性及副作用也较低。左旋咪唑抗蛔虫作用较好，口服单剂量的抗蛔虫疗效可达 90%～100%，对钩虫、蛲虫也有明显抗虫作用，适于集体治疗。左旋咪唑能使蛔虫肌肉麻痹后，随粪便排出体外。实验证明，它能选择性地抑制虫体肌肉中的琥珀酸脱氢酶，使延胡索酸不能还原为琥珀酸，从而影响虫体肌肉的无氧代谢，减少能量的产生。但对哺乳动物的

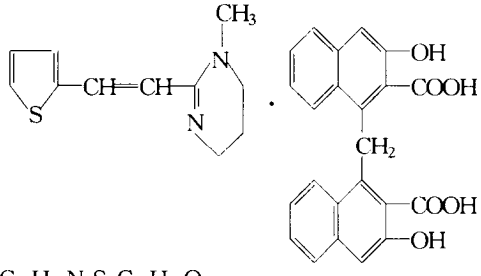
琥珀酸脱氢酶并无影响。本品又是免疫调节剂，可使细胞免疫力原来较低者得到恢复，但不会将正常免疫力过度提升。提高细胞免疫力功能可能与其提高淋巴细胞内的环乌苷酸相对水平有关。

本品可用于原发性免疫缺陷病，小儿继发性免疫缺陷而致呼吸道反复感染第Ⅰ期肺癌手术后加用本品可延迟及减少复发。本品用于一些自身免疫性疾病，如类风湿性关节炎等，可能是恢复抑制性胸腺淋巴细胞(TS)功能，从而抑制产生自身抗体的骨髓淋巴细胞(BL)而奏效。抗蛔虫口服，成人每日1.5～2.5mg/kg，半空腹顿服；儿童每日2～3mg/kg。抗钩虫口服，每次服1.5～2.5mg，每晚1次，连服3d。抗丝虫口服，每日4～8mg/kg，分2～3次服，连服2～3d。用于增强免疫：每2周用药3d，每次50mg，每日2～3次或每周用药2次，每次50mg，每日2次。治疗自身免疫性疾病和增强免疫的用法及用量相同，或连续每日用药，每次50mg，每日2～3次。

包装与贮运　密闭保存。

1.3.3　双羟萘酸噻嘧啶　(Pyrantele Pamoate)

结构式

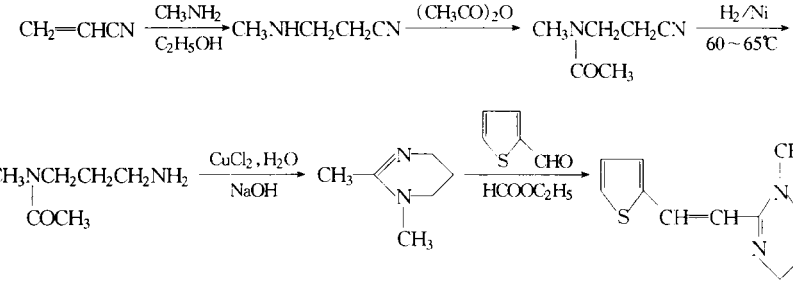


化学式　$C_{11}H_{14}N_2S\cdot C_{23}H_{16}O_6$

相对分子质量　594.69

物化性质　淡黄色粉末，无味无臭。不溶于水、甲醇、醚及氯仿，微溶于乙醇，易溶于吡啶。熔点262～266℃(分解)。

制备方法　以丙烯腈为原料，先与甲胺加成，经乙酰化、催化氢化、环合反应得2-甲基-1,4,5,6-四氢嘧啶。再与2-醛基噻吩在甲酸乙酯溶液中缩合得噻嘧啶，最后与甲撑双羟萘酸成盐。

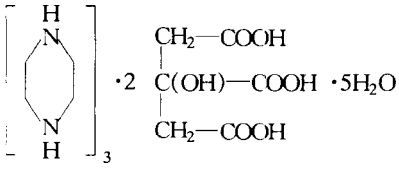


用途及实例　本品为对蛔虫、钩虫和蛲虫都有效的广谱抗肠虫药。它通过抑制胆碱酯酶，使虫体肌肉强烈收缩并导致痉挛性麻痹，使虫体不能附着于肠壁，但不引起蛔虫骚动。其治疗量对人体该酶无影响。常用于治疗蛲虫、蛔虫、钩虫。抗蛔虫成人剂量，每日口服1.2～1.5g，顿服；抗钩虫对十二指肠钩虫，每日口服1.5g，顿服，对美洲钩虫，每日1.5g，顿服，连服3d。抗钩虫联合用药，双羟萘酸噻嘧啶，每日0.3g，盐酸左旋咪唑，每日50mg，顿服。抗蛲虫每日1.5g，顿服，连服3d，第一疗程两周后，进行第二疗程。儿童剂量，30mg/kg，睡前一次顿服。

包装与贮运　遮光，密闭保存。

1.3.4　枸橼酸哌嗪　(Piperazine Citrate)

结构式

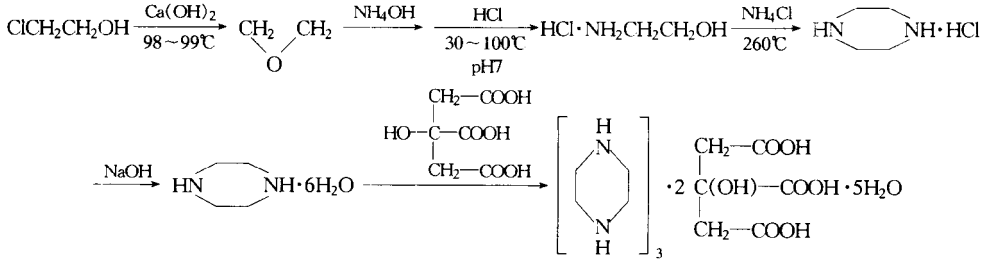


化学式 $(C_4H_{10}N_2)_3\cdot 2C_6H_8O_7\cdot 5H_2O$

相对分子质量 732.75

物化性质 白色结晶性粉末，无臭，味酸，微有吸湿性。易溶于水，极微溶于甲醇，不溶于乙醇、氯仿、乙醚及苯。熔点 182～187℃.

制备方法 以氯乙醇为原料，环化生成环氧乙烷，再经氨化、盐酸化生成盐酸氨基乙醇，然后环合、中和生成六水哌嗪，最后与枸橼酸成盐即得

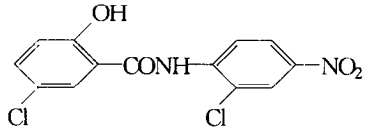


用途及实例 哌嗪是一种安全而有效的抗蛔虫和抗蛲虫药。它能麻痹蛔虫，使虫体不能附着于宿主肠壁，随肠蠕动而排出。原因在于它能减弱乙酰胆碱对蛔虫肌肉的兴奋作用。临床上用于抗蛔虫，对蛔虫感染有良效；对蛔虫所致的不全性肠梗阻或早期胆道蛔虫病，于疼痛缓解后应用也有效。抗蛔虫：成人口服，每次 3～3.5g，每日 1 次 儿童每次口服 0.1～0.16g/kg，每日 1 次，每日剂量不超过 3g，连服 2 d。抗蛲虫 成人每次口服 1～1.2g，日服 2 次，连服 7～10d 儿童每次口服 30mg/kg，每日 2 次，剂量每日不超过 2g，连服 7～10d。

包装及贮运 遮光，密闭保存。

1.3.5 氯硝柳胺 Niclosamide)

结构式

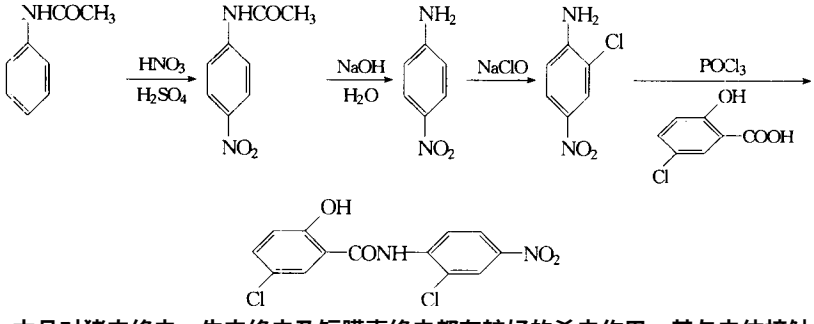


化学式 $C_{13}H_8O_4Cl_2N_2$

相对分子质量 327.13

物化性质 灰黄色结晶性粉末，无臭无味，不溶于水，微溶于乙醇、氯仿。溶于热乙醇、环己酮及氢氧化钠溶液。熔点 225～230℃，233℃分解。

制备方法 以乙酰苯胺为原料，经硝化、水解及氯化制得 2-氯-4-硝基苯胺，然后在三氯氧磷存在下与 5-氯水杨酸缩合即得。



用途及实例 本品对猪肉绦虫、牛肉绦虫及短膜壳绦虫都有较好的杀虫作用。其与虫体接触后，绦虫头节和近端节片即被杀死，绦虫因头节脱离肠壁而被排出体外，或被肠蛋白酶分解。本品的杀虫机理可能为抑制绦虫线粒体氧化磷酸化过程，抑制绦虫对氧和葡萄糖的摄入，使糖原分解增加和乳酸脱氢酶的活性受抑制。

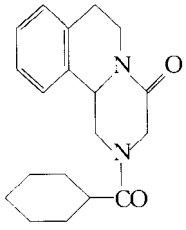
本品对日本血吸虫尾蚴和钉螺也有杀灭作用。本品口服后难吸收，主要从粪中排泄，仅有 20%～

30%从尿中排出。临床上用于治疗绦虫感染，对猪肉绦虫及短膜壳绦虫均有效，其治愈率为 84.6%～97%。可预防日本血吸虫感染，可制得防蚴膏涂擦皮肤，以阻止日本血吸虫尾蚴侵入人体。还用于杀螺，制成杀螺药，以杀钉螺。抗牛肉绦虫和猪肉绦虫：早晨空腹 1g,0.5～1h 后再服 1g,经 1～2h 后服硫酸镁导泻。抗短膜壳绦虫 口服,第一日 2g,以后每日服 1g,连服 7～8d。服药时，应将药片充分咬碎后吞下，并应尽量少喝水，使药物能在十二指肠上部达到较高浓度

包装与贮运　遮光，密封保存。

1.3.6 吡喹酮　(Praziquantel, Pyqueton)

结构式

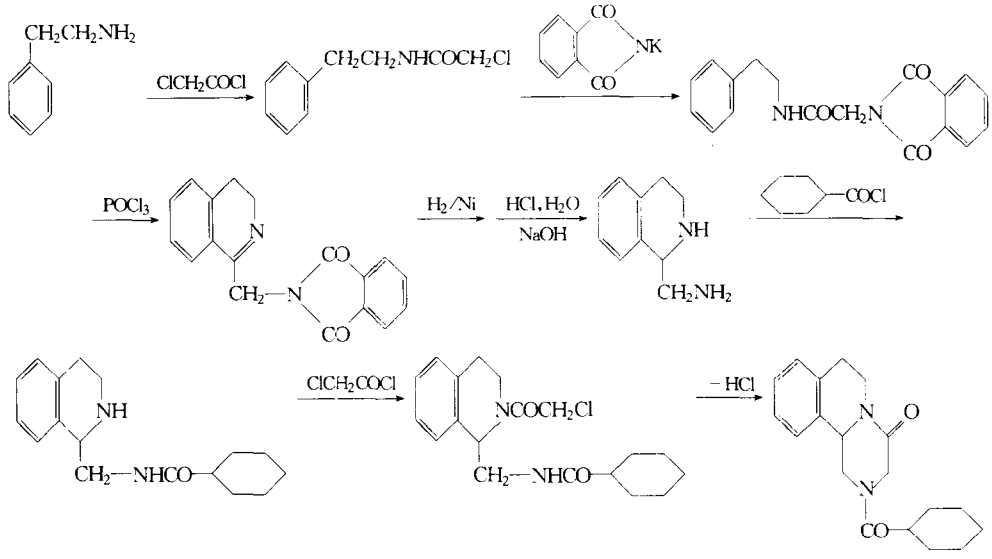


化学式　$C_{19}H_{24}O_2N_2$

相对分子质量　312.42

物化性质　白色或类白色结晶性粉末，具有苦味。不溶于水，易溶于氯仿、二甲亚砜。熔点 136～139℃

制备方法　以苯乙胺为原料，经氯乙酰化后，与苯二甲酰亚胺钾缩合生成 N-苯二甲酰胺乙酰基苯乙胺，然后在三氯氧磷作用下脱水环合成 3,4-二氢异喹啉衍生物，再经氢化、酸性水解得 1-氨甲基四氢异喹啉，再经环己甲酰化及氯乙酰化，最后脱氯化氢环合即得。



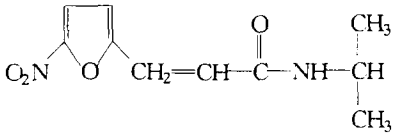
用途及实例　本品是对日本血吸虫、曼氏血吸虫和埃及血吸虫、华支睾吸虫、肺吸虫、姜片虫、绦虫和囊虫都有效的抗蠕虫药。杀幼虫的作用弱，而杀成虫的作用强而迅速，临床应用疗效好。本品对虫体的糖代谢有明显的抑制作用，影响虫对葡萄糖的摄入，促进虫体内糖原分解，使糖原明显减少或消失。治疗血吸虫感染、慢性血吸虫病 成人口服,每次 10mg/kg,每日 3 次,连服 2d;或每次 15mg/kg,每日 2 次,连服 2d。急性血吸虫病：成人口服，每次 10mg/kg,每日 3 次,连服 4～6d。治疗肺吸虫感染：成人每次 15mg/kg 每日 3 次,连服 2d。治疗华支睾吸虫感染、轻感染 成人口服,每次 25mg/kg,每日 3 次,服 1d。重感染者,成人口服,每次 20mg/kg,每日 3 次,连服 2d。治疗绦虫感染 成人口服,每次 10～20mg/kg,顿服。

包装与贮运　遮光，密闭保存。

需要全本请访问 www.ertongbook.com

1.3.7 呋喃丙胺 (Fura Promide)

结构式

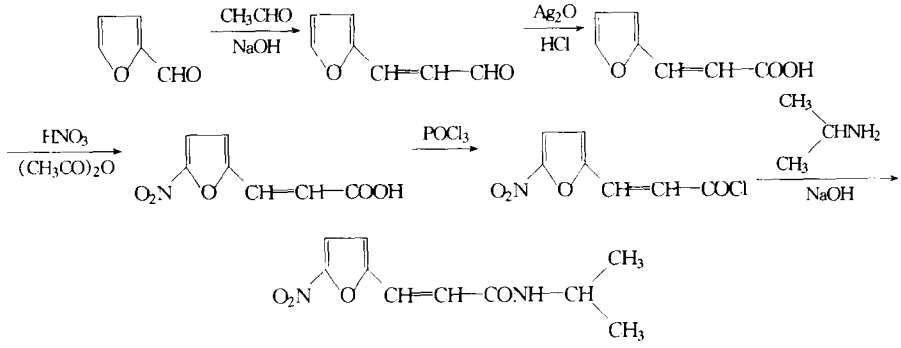


化学式 $C_{10}H_{12}O_4N_2$

相对分子质量 224.22

物化性质 淡黄色鳞片状结晶,无臭无味,露置日光下色渐变深。不溶于水,略溶于丙酮或氯仿,微溶于乙醇。熔点 189～193℃.

制备方法 以呋喃甲醛为原料,与乙醛缩合生成呋喃丙烯醛,经氧化成呋喃丙烯酸,再经硝化、酰氯化及胺解即得。

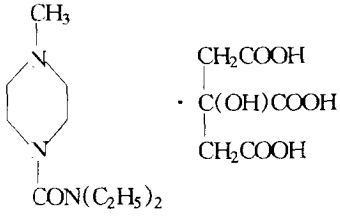


用途及实例 本品对血吸虫成虫、童虫及虫卵均有杀死作用。因呋喃丙胺能杀死组织内各发育阶段的虫卵，所以对急性血吸虫病发热有明显退热及控制症状的作用。虫受药作用后糖元含量明显减少和消失,虫体麻痹,随血流入肝脏,最后变性虫体被宿主细胞包围消灭。临床用于治疗急性血吸虫病、慢性早期血吸虫病，亦可用于晚期血吸虫病伴有发热，但无黄疸、腹水且肝功能尚好的患者。对姜片虫感染亦有较好的疗效。抗血吸虫 成人口服,每次 20mg/kg,日服 3次,连服 14～20d 儿童口服,每次 20mg/kg,日服 4 次,疗程相同。抗姜片虫 成人口服,日服 1～2g,连服 2d。

包装与贮运 遮光，密闭保存。

1.3.8 枸橼酸乙胺嗪 (Diethyl Carbazine Citrate)

结构式

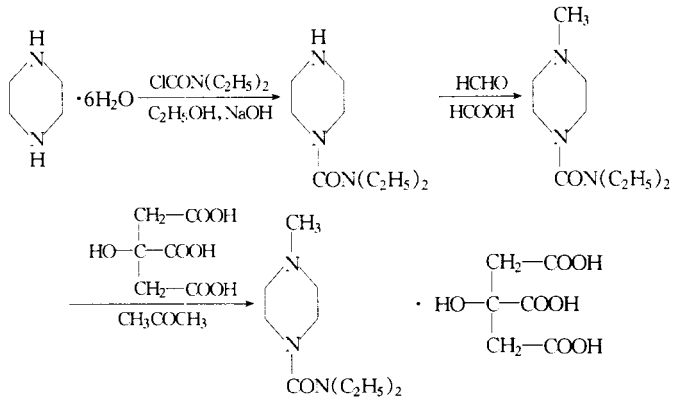


化学式 $C_{10}H_{21}ON_3 \cdot C_6H_8O_7$

相对分子质量 391.43

物化性质 白色结晶性粉末，无臭，味酸苦，微有引湿性。易溶于水，略溶于乙醇，不溶于丙酮、氯仿或乙醚。熔点 135～138℃.

制备方法 以六水哌嗪为原料经二乙胺基甲酰化、甲基化制得 1-二乙胺基甲酰-4-甲基哌嗪,最后在丙酮中与枸橼酸成盐即得。

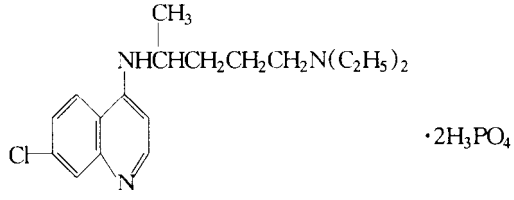


用途及实例　本品对微丝蚴及成虫均有作用，以对微丝蚴作用最强。其作用并不能直接杀死微丝蚴，而是改变其性质，使易受网状内皮系统清除。本品体外无杀死微丝蚴的作用，用药后，血中微丝蚴迅速集中到肝脏的微血管中，经一段时间即被吞噬细胞所消灭。微丝蚴死亡所释放的大量异体蛋白，常可引起高热等过敏反应。本品对斑氏丝虫和马来丝虫病人用足量及长疗程治疗可杀死成虫，但成虫死亡时导致局部组织反应。临床用于丝虫病的治疗与预防。成人口服，每次 0.1～0.2g,每日 3 次,7～14d 一个疗程,采用 2 个疗程,间隔 1～2 月。马来丝虫病，成人口服 1～1.5g,顿服,或每次 0.75g,日服 2次,一日为一疗程，可服 2～3 疗程,间隔 1 个月以上。斑氏丝虫病，成人口服，总剂量 3g 的 3d或 5d 疗法,或 4.5g 的 7d 疗法。可服 2～3 疗程,间隔 1个月以上。将本品拌入食盐内食用可预防丝虫病。

包装与贮运　密封，干燥处保存。

1.3.9　磷酸氯喹　(Chloroquine Phosphate)

结构式

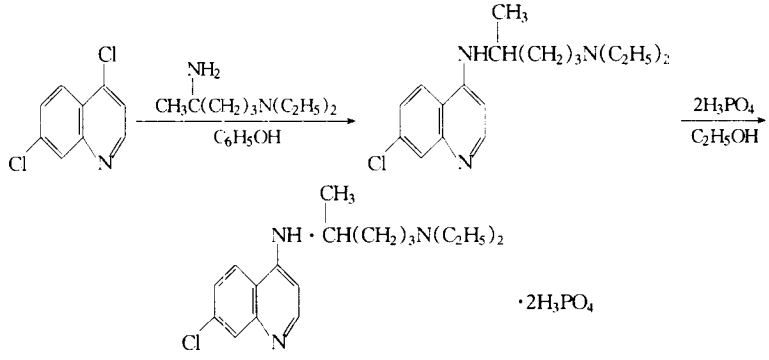


化学式　$C_{18}H_{26}N_3Cl\cdot 2H_3PO_4$

相对分子质量　515.88

物化性质　白色结晶性粉末,无臭,味苦,遇光渐变色。易溶于水,不溶于乙醇、氯仿、乙醚或苯。熔点 192～195℃(分解)。

制备方法以 4,7-二氯喹啉为原料，与 4-二乙胺基-1-氨基戊烷在苯酚存在下脱氯化氢缩合得氯喹，最后以乙醇为溶剂与磷酸成盐即得。



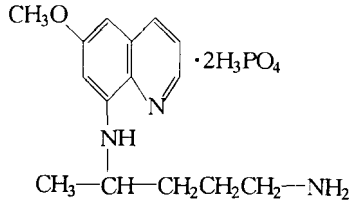
用途及实例　本品主要作用于红血球内期的疟原虫，能有效地控制恶性疟原及间日疟的临床症状，是治疗症状发作最有效的药物。其特点是作用快、效力强、作用持久。氯喹凭其喹啉环上带负电性的氯原子

与 DNA链上碱基鸟嘌呤的 2-位氨基接近，可嵌入到 DNA双螺旋的两股之间,与 DNA形成复合物,从而阻止 DNA 的复制和 RNA 的转录，干扰疟原虫的核酸代谢，抑制疟原虫的生长繁殖。氯喹还能抑制疟原虫对氨基酸的摄取，抑制己糖激酶及谷氨酸脱氢酶等，这些作用都可能对疟原虫产生伤害性影响。本品还用于治疗肠外阿米巴病、肺吸虫病及华支睾吸虫病。还具有一定免疫抑制作用，可用于治疗红斑狼疮、类风湿性关节炎、肾病综合症等。治疗疟疾：成人口服，总剂量 2g 三日疗程，剂量每天分别为 1g、0.5g,儿童口服,随年龄不同总剂量也不同,疗程同上。按 11～15 岁、6～10 岁,3～5 岁,2 岁以下分四组,总剂量依次为 1.5g,1g,0.5g,0.25g。

包装与贮运 遮光，密封保存。

1.3.10 磷酸伯喹 (Primaquine Phosphate)

结构式

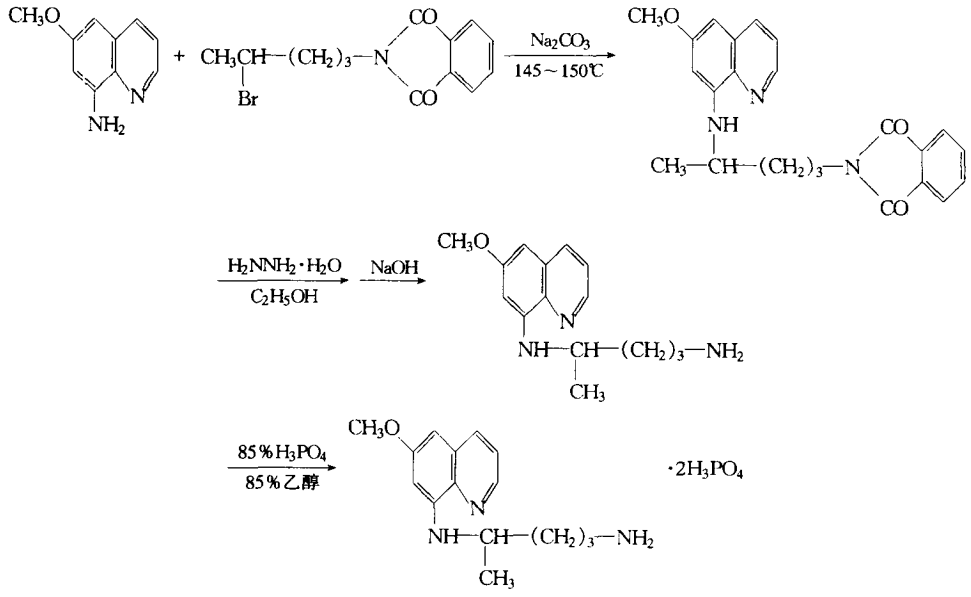


化学式 $C_{15}H_{21}ON_3 \cdot 2H_3PO_4$

相对分子质量 455.35

物化性质 橙红色结晶性粉末，无臭，味苦，水溶液显酸性反应。易溶于水，不溶于氯仿或乙醚。熔点 200～205℃.

制备方法 以 6-甲氧基-8-氨基喹啉为原料,与 4-溴-1-邻苯二甲酰亚胺基戊烷在碳酸钠存在下进行缩合反应,再肼解、碱性水解得伯喹,最后在乙醇中与磷酸成盐即得。

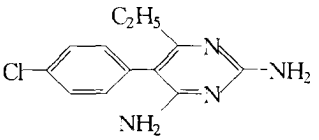


用途及实例 本品对红血球外期的疟原虫及配子体有较强的杀灭作用，是有效的阻断复发、中断传播的药物。本品对红血球内期裂殖体的作用弱，故临床上有时与氯喹联合使用。本品代谢产物具有氧化性质，可能干扰疟原虫红血球外期的辅酶 Ⅱ 的还原过程，影响疟原虫的能量代谢或呼吸。口服，每次 26.4mg,每日 1 次,连服 14d,或每次 39.6mg 连服 8d,或每次 52.8mg,连服 4d。

包装与贮运 遮光，密封保存。

1.3.11 乙胺嘧啶 (Pyrimethamine)

结构式

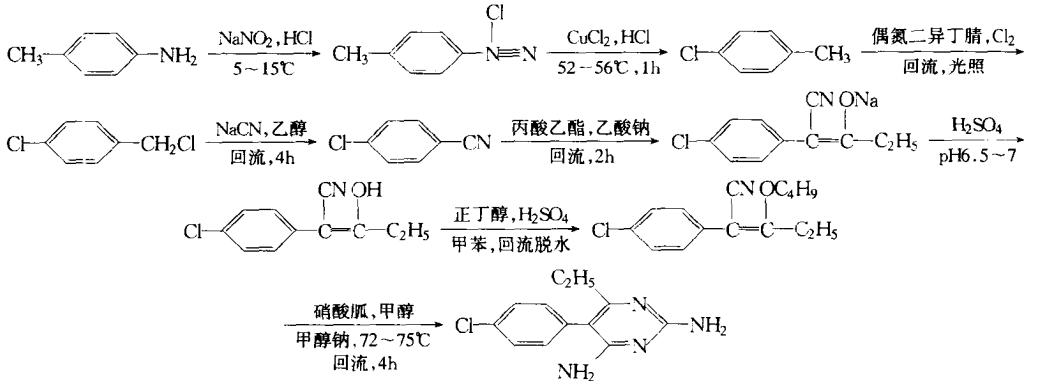


化学式 $C_{12}H_{13}N_4Cl$

相对分子质量 248.72

物化性质 白色结晶性粉末，无臭，无味。不溶于冷水，微溶于热水、乙醇、氯仿，溶于稀硫酸。熔点239～242℃.

制备方法 以对甲苯胺为原料,经重氮化、置换、氯化反应生成对氯氯甲苯,再经氰化、缩合、酸化生成 α-氰基 对氯苯丁酮，最后经醚化，环合反应即得。

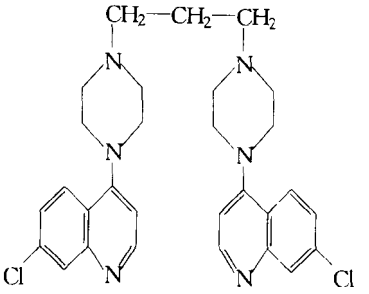


用途及实例 本品可抑制疟原虫的二氢叶酸还原酶，使二氢叶酸不能转变为四氢叶酸，因四氢叶酸辅酶的缺乏，导致核酸的合成减少，使疟原虫的繁殖受到抑制。本品对某些恶性疟及间日疟的疟原虫红血球前期有抑制作用，是较好的病因性预防药，作用持久。它对配子体无明显作用，但能抑制配子体在蚊体内的发育，也能阻断疟疾传播。近年来出现耐氨嘧啶虫株，可与长效磺胺等药物配伍，产生协同增效作用。病因性预防：口服每次 25mg,每周 1 次,或每次 50mg ,每半月 1 次。休止期抗复发治疗，成人口服，每次 50mg 连服 2d。

包装与贮运 遮光，密闭保存。

1.3.12 磷酸喹哌 (Piperaquine Phosphate)

结构式



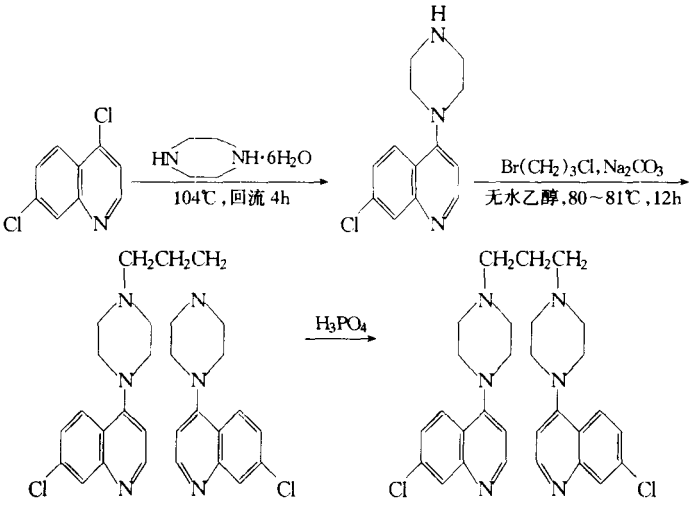
$\cdot 4H_3PO_4 \cdot 4H_2O$

化学式 $C_{29}H_{32}N_6Cl_2 \cdot 4H_3PO_4 \cdot 4H_2O$

相对分子质量 999.58

物化性质 淡黄色结晶性粉末,无臭,味微苦,有引湿性,遇光易变色。易溶于 90℃热水,微溶于水,几乎不溶于无水乙醇或氯仿。极易溶于盐酸。熔点 246～252℃(分解)。

制备方法 以 4,7-二氯喹啉为原料，与六水哌嗪缩合生成 4-哌嗪-7-氯喹啉,再与 1-氯-3-溴丙烷缩合生成喹哌，与磷酸成盐即得。

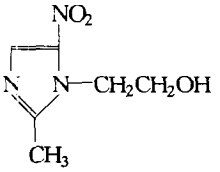


用途及实例　本品抗疟疾作用与氯喹相似，口服后贮存于肝中，并不断释放入血中，故作用持久，用于抑制性治疗，每月服药一次。预防服药：口服成人每月一次，每次服 2 片，睡前服药为宜。连续服药 3～4 个月。治疗服药：成人首次服 2 片，隔 8～12h 再服 1～2 片，总量 3～4 片。

包装与贮运　避光，密封保存。

1.3.13　甲硝羟乙唑　(Metronidazole)

结构式

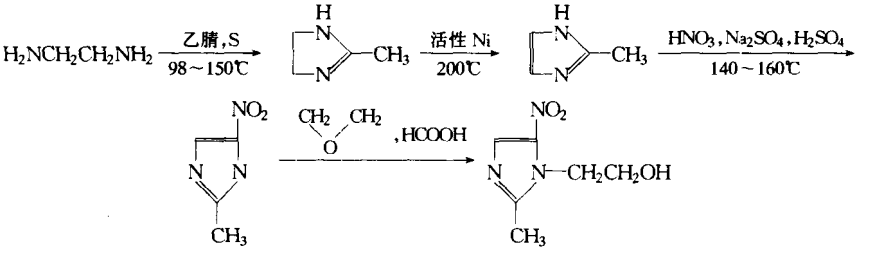


化学式　$C_6H_9O_3N_3$

相对分子质量　171.16

物化性质　白色或微黄色结晶性粉末，微臭，味苦而略咸，溶于热水，略溶于乙醇，微溶于冷水、氯仿。熔点 159～163℃。

制备方法　以乙二胺为原料，与乙腈环合生成 2-甲基咪唑啉，再经脱氢、硝化反应得 2-甲基-5-硝基咪唑，最后羟乙基化即得。

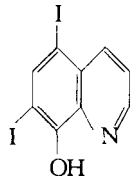


用途及实例　本品对组织内及肠腔内阿米巴滋养体有杀灭作用，24h 杀死全部滋养体。本品还能杀灭阴道滴虫而不影响阴道正常菌丛的生活。同时本品对所有致病的厌氧菌均有明显的抗菌作用，特别对专性厌氧菌作用较强。临床上用于治疗阿米巴病、阴道滴虫感染、厌氧菌感染、贾第鞭毛虫感染。治疗阿米巴病：每次 0.4～0.8g，每日 3 次，5d 一疗程。治疗阴道滴虫病：每次 0.2g，每日 3 次，7d 一疗程。治疗厌氧菌感染，每次 0.2～0.4g，每日 3 次，7d 一疗程；婴儿及儿童，每次 7.5mg/kg。治疗贾第鞭毛虫感染，每次 0.8g，每日 3 次，5～10d 一疗程，连续 2～3 个疗程。

包装与贮运　遮光，密闭保存。

1.3.14 双碘喹啉 (Diiodoquinum)

结构式

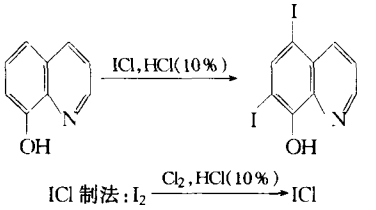


化学式 $C_9H_5ONI_2$

相对分子质量 396.98

物化性质 微黄色至黄棕色细微结晶性粉末，无臭，无味。几乎不溶于水、乙醇。熔点 200～215℃.

制备方法 以 8-羟基喹啉为原料，经碘化即得。

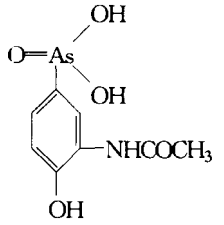


用途及实例 本品在肠道内抑制肠道内共生菌，而阿米巴与细菌共生，利用它的生长繁殖，抑制肠道细菌使其繁殖发生障碍，故本品对滋养体有用，对包囊无杀灭作用。临床用于治疗阿米巴痢疾，对急性阿米巴痢疾常与其他药物联合使用，方可根除。对肠外阿米巴病均无效。口服每次 0.6g,每日 3 次,共给药 14～20d。

包装与贮运 遮光，密闭保存。

1.3.15 乙酰胂胺 (Acetarsol)

结构式

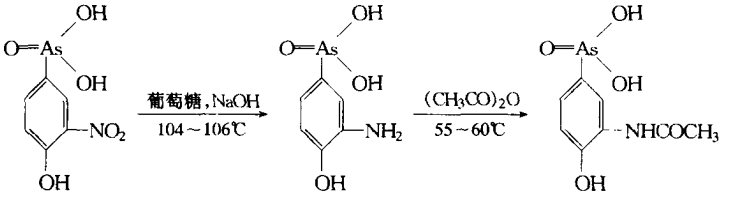


化学式 $C_8H_{10}O_5NAs$

相对分子质量 275.09

物化性质 白色或微黄色粉末，无臭，在常温下稳定。微溶于水，不溶于乙醇和稀酸，溶于氢氧化碱溶液或碳酸碱溶液。熔点 240～250℃(分解)。

制备方法 以 3-硝基-4-羟基苯胂酸为原料，经还原、乙酰化反应即得。



用途与实例 消毒药，有杀灭滴虫作用，用于治疗阴道鞭毛滴虫病。使用前先用低浓度的普通消毒剂进行阴道洗涤，然后将本品放入阴道后穹窿部，一次 1～2片，用后次晨进行一次坐浴。

包装与贮运 遮光，密闭在干燥处保存。

需要全本请访问 www.ertongbook.com