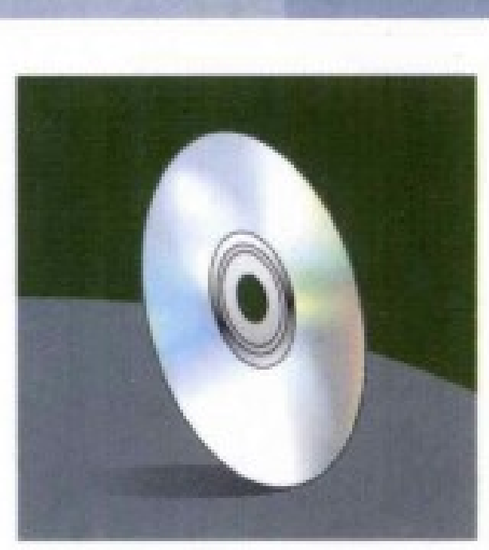
药品编号：HY001401-HY002633

药物集成 [VII]

YAOWUJICHENG

化学原料药及药用辅料（二）



主　审　王国威

总主编　梁安鹏　李玉龙

主　编　刘文娟

中国医药科技出版社

药物集成[VII]

YAOWUJICHENG

ISBN 978-7-5067-3868-2

9 787506 738682 >

责任编辑/何红梅　封面设计/ING设计机构

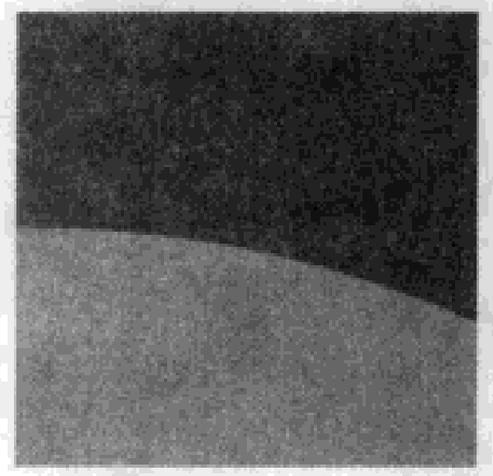
定价：2998.00元(套)
(含光盘)

药品编号：HY001401-HY002633

药物集成 [VII]

YAOWUJICHENG

化学原料药及药用辅料（二）



主　审　王国威
总主编　梁安鹏　李玉龙
主　编　刘文娟

中国医药科技出版社

图书在版编目（CIP）数据

药物集成．7，化学原料药及药用辅料．2/梁安鹏，李玉龙主编．—北京：中国医药科技出版社，2008.5

ISBN 978－7－5067－3868－2

Ⅰ.药… Ⅱ.①梁…②李… Ⅲ.①药物—汇编②化学合成—药物—汇编③制剂辅料（医药）—汇编 Ⅳ.R97

中国版本图书馆 CIP 数据核字（2008）第 036748 号

美术编辑 陈君杞
责任校对 张学军
版式设计 郭小平

出版 中国医药科技出版社
地址 北京市海淀区文慧园北路甲 22 号
邮编 100082
电话 责编：010－62216635 发行：010－62244206
网址 www.cspyp.cn www.mpsky.com.cn
规格 787×1092mm 1/16
印张 44 1/2
字数 1400 千字
印数 1—3250
版次 2008 年 6 月第 1 版
印次 2008 年 6 月第 1 次印刷
印刷 河北省南宫市印刷有限责任公司
经销 全国各地新华书店
书号 ISBN 978－7－5067－3868－2
定价 2998.00 元（套）（含光盘）

本社图书如存在印装质量问题请与本社联系调换

编 写 人 员

主　　审　王国威

总 主 编　梁安鹏　李玉龙

主　　编　刘文娟

副 主 编　王明军

编写人员（以姓氏笔画为序）

王永生　胡东峰　周瑞雪

甄会贤

程序总设计　李玉龙

凡　例

一、本册收载化学原料药及药用辅料1233种（以下称各药品）。截稿时间为2007年9月。

二、各药品按通用名汉语拼音排序。

三、各药品记载药品编号、名称（通用名、其他名称、外文名称）、药物管理信息、药物理化信息、药物药理信息、药物制剂信息6部分内容。其中药品编号、名称为必载内容。个别品种只有品名信息，暂时未查到其他相关资料，但考虑到《药物集成》计算机查询系统的可扩充性以及与本书内容相关联的特征，未查到资料的项目阙如，仅列出品名信息及药品编号，以保证今后补充内容时品名序列的统一。

四、各药品编号前两位字母“HY”代表化学原料药及药用辅料，其后六位数字为各药品在本类中的序号。

五、各药品【其他名称】项是指通用名外的、编者认为有必要收录的其他药品名称。包括曾用名、习惯用名、通用名简写以及研发代号名称等。这些名称并非都是符合相关规定的药品包装用名称，只是为本书的读者提供查阅方便，并体现药品名称规范化管理的发展历程。

六、各药品【外文名称】与该药品或其单方制剂在中国的法定质量标准中所列外文名称一致。

七、各药品“药物管理信息”包括【依据标准】、【特殊管理分类】等项，资料来源于本书截稿时国家相关管理文件及药品标准。未查到相关资料的项目阙如。

八、各药品“药物理化信息”，包括【化学名】、【分子式】、【分子量】、【性状及组成】等项目，资料来源依据本书截稿时编者收集到的该药品的质量标准或其单方制剂质量标准及制剂应用说明书内容。未能查到相关资料的项目阙如。

九、各药品“药物药理信息”包括【药理毒理】、【药代动力学】、【药物相互作用】、【药物过量】、【不良反应】等项目，资料来源主要是该药品的相应制剂的正式药品说明书，也参考《中华人民共和国药典临床用药须知》，《新编药物学·第16版》等国内权威药学著作。如果该药品制剂包含不同的剂型或治疗取向，则尽量将这些不同剂型或治疗取向的信息进行汇总。

十、各药品“药物制剂信息”包括制剂名称，制剂类别以及序号3部分。其中“制剂名称”指以本药品为原料药的制剂的通用名，“制剂类别”包括化学药制剂、生物制品、中成药、民族药制剂。“序号”是指该制剂在《药物集成》中的药品编号，便于读者直接查找该制剂的详细信息。

HY001401　蒙脱石

【其他名称】双八面体蒙脱石

【外文名称】Dioctahedral Smectite

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第55册

药物理化信息

【化学名】蒙脱石

【分子式】$Al_4Si_8O_{20}(OH)_4$

【分子量】720.00

【性状及组成】本品为灰白色细粉，加水湿润后有类似黏土的气味且颜色加深。本品在水、稀盐酸或氢氧化碱试液中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为天然蒙脱石微粒，具有层纹状结构和非均匀性电荷分布，对消化道内的病毒、病菌及其产生的毒素、气体等有极强的固定、抑制作用，使其失去致病作用；此外对消化道黏膜还具有很强的覆盖保护能力，修复、提高黏膜屏障对攻击因子的防御功能，具有平衡正常菌群和局部止痛作用。主要用于急、慢性腹泻，尤以对儿童急性腹泻疗效为佳，也用于食管炎及与胃、十二指肠、结肠疾病有关疼痛的对症治疗及肠道菌群失调。

【药物相互作用】其他药物须与本品间隔一段时间使用。

【不良反应】极少数病人引起便秘，治疗急性腹泻时，应注意纠正脱水。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
蒙脱石分散片	化学药	HZ002677
蒙脱石混悬液	化学药	HZ002678
蒙脱石颗粒	化学药	HZ002679
蒙脱石散	化学药	HZ002680

HY001402　锰元素

【外文名称】Manganese

药物药理信息

【药理毒理】成人体内含锰量约10～20mg，主储存于肝和肾中。在细胞内则主要集中于线粒体中。每日需要量为3～5mg。

锰参与一些酶的构成，如线粒体中丙酮酸羧化酶、精氨酸酶等。不仅参加糖和脂类代谢，而且在蛋白质、DNA和RNA合成中起作用。

【药代动力学】锰在肠道中吸收与铁吸收机制类似，吸收率较低，仅3%。吸收后与血浆β_1球蛋白、运锰蛋白结合而送输。主要由胆汁和尿中排出。

【药物过量】锰中毒的初期表现大多为身体疲乏无力、肌肉痛、头痛头晕，人的情绪和性格也逐渐发生改变，有的变得冷漠，有的变得多语，性欲减退，动作笨拙、不协调等等，中度中毒时会表现得发音困难，行路障碍，语言单调，说话迟缓，口吃，表现呆痴，有的人甚至好哭好笑，动作迟缓，后退困难。到了中毒晚期，病人表现为肌肉僵直，写字困难，出现震颤，身体向前倾，完全不能后退，这就是锰毒性脑病。

长期经静脉进行微量元素制剂投药［Mineralin（R）一安瓶2ml中含有Zn60μmol，Mn20μmol，Cu5μmol］可出现高锰血症，在脑MRI的T1加权像中可见在苍球、被壳、丘脑等处出现高信号区。进而高锰血症一旦长期存在，也可出现帕金森征、记忆障碍、痉挛、神经错乱等神经、精神症状，而这些症状终止微量元素制剂投药后需要几个月才能恢复。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
多维元素片	化学药	HZ000804
多维元素片（16）	化学药	HZ000806
多维元素片（16－Ⅱ）	化学药	HZ000807
多维元素片（21）	化学药	HZ000808
多维元素片（25）	化学药	HZ000809
多维元素片（29）	化学药	HZ000810
多种维生素片	化学药	HZ000817
复方多维元素片（21）	化学药	HZ001151
复方多维元素片（23）	化学药	HZ001152
复方营养混悬剂	化学药	HZ001478
复合维生素片	化学药	HZ001497
善存银片	化学药	HZ003189

HY001403　孟鲁司特钠

【其他名称】Singulair

【外文名称】Montelukast Sodium

药物理化信息

【化学名】[*R*-（*E*）]-1-[[[1-[3-[2-[7-氯-2-喹啉]乙烯基]苯基-3-[2-（1-羟基-1-甲基乙基）苯基]丙基]硫]甲基]环丙烷乙酸单钠

【分子式】$C_{35}H_{35}ClNNaO_3S$

【分子量】608.18

【性状及组成】本品为白色粉末，易溶于甲醇、乙醇和水，不溶于乙腈，对光敏感。

药物药理信息

【药理毒理】本品是一种强效的选择性的白三烯D4（LTD4，cysLT1）受体拮抗剂，是新一代非甾体抗炎药物。能选择性抑制气道平滑肌中白三烯多肽的活性，并有效预防和抑制白三烯所导致的血管通透性增加、气道嗜酸粒细胞（EOS）浸润及支气管痉挛，能减少气道因变应原刺激引起的细胞和非细胞性炎症物质，能抑制变应原激发的气道高反应。对二氧化硫、运动和冷空气等刺激及各种变应原如花粉、毛屑等引起的速发相和迟发相炎症反应均有抑制作用。本品与人类气道中的cysLT受体能高度选择性结合，从而阻断白三烯的病理作用。已经证明，吸入LTD4可引起较组胺强1000倍的剂量依赖性支气管收缩。

【药代动力学】健康成人中观察到孟鲁司特的AUC随静脉应用剂量（3.9～18mg）的增大而按比例增加。血浆清除率平均45.5ml/min（2.73L/h），稳态分布容积10.5L，血浆终点半衰期5.1小时，平均残留时间3.9小时。各项指标在上述研究剂量范围内基本维持恒定。口服孟鲁司特10mg后 C_{max} 男性为385μg/L，女性为350μg/L，用药后 t_{max} 男女分别为3.7及3.3小时。AUC值分别为2441与2270mg·h/L，半衰期为4.9与4.4小时，平均吸收时间为3.4与2.6小时。口服平均生物利用度为64%，健康成人的血浆清除率平均为45ml/min。口服同位素标记孟鲁司特后86%可从5天的粪便中收集到，仅0.2%出现于尿中，提示其代谢物大部分经胆汁排泄。老年志愿者（平均年龄69.4岁）口服一次孟鲁司特10mg后生物利用度为61%，与青年志愿者相似，故老年患者使用孟鲁司特无需调整剂量。肝、肾功能不全时不影响孟鲁司特的排泄。

【药物相互作用】可与其他常规用于预防及长期治疗哮喘的药物合用。在药物相互作用的研究中，孟鲁司特钠的临床推荐用量对下列药物的药代动力学无重要影响：茶碱、泼尼松、泼尼松龙，口服避孕药（炔雌醇/炔诺酮35/1），特非那定，地高辛和华法林。合用苯巴比妥的受试者，孟鲁司特钠的血浆浓度曲线下面积减少约40%。建议不必调整剂量。

【药物过量】在医疗实践中，尚无关于本品过量的专项资料。在治疗慢性哮喘的研究中，成年患者使用的剂量高达每日200mg，连续用药22周及短期研究中使用的剂量高达每日900mg，连续用药约1周，均未出现有临床意义的不良事件。

已有上市后儿童急性药物过量的报道和使用本品日剂量至少150mg的临床研究。临床和实验室发现均一致显示其在成人和年龄较大儿童患者的安全性。在大部分药物过量的报告中，未报道出现不良事件。观察到的最多不良事件是口渴、嗜睡、瞳孔散大、运动机能亢进和腹痛。尚不清楚本品是否能经腹膜或血液透析清除。

【不良反应】本药的一般耐受性良好，不良反应较轻微，通常不需终止治疗。应用本药总的不良反应发生率与安慰剂相似。临床研究已评价了本药在2600名15岁及15岁以上患者的应用情况。在两项设计类似，以安慰剂作对照的12周临床试验中，本药治疗组有≥1%的患者出现与用药有关的腹痛和头痛。其发生率高于接受安慰剂治疗的患者。但两组患者上述不良反应的发生率无显著差异。544名患者在临床试验中累积使用本药至少6个月，253名患者用药1年，21名用药达2年，长期用药的不良反应情况与上述无异。已经评价了本药在约320名6～14岁儿童患者的使用情况，在一项以安慰剂作对照，为期8周的临床试验中，只有头痛是与药物有关的，在大于1%患者中出现此不良反应，其发生率高于接受安慰剂治疗的患者，但两组患者上述不良反应的发生率无显著差异。143名儿科患者累积使用本药至少3个月，44名用药达6个月或更久，长期用药的不良反应情况与上述无异。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
孟鲁司特钠咀嚼片	化学药	HZ002681
孟鲁司特钠片	化学药	HZ002682

HY001404 咪达唑仑

【外文名称】Midazolam

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第39册

药物理化信息

【化学名】8-氯-6-（2-氟苯基）-1-甲基-4*H*-咪唑并[1,5-*a*][1,4]苯并二氮杂䓬

【分子式】$C_{18}H_{13}ClFN_3$

【分子量】325.77

【性状及组成】本品为白色至微黄色的结晶或结晶性粉末；无臭，遇光渐变黄。

本品在三氯甲烷中极易溶解，在冰醋酸或乙醇中易溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 160～164℃。

吸收系数：取本品，精密称定，加 0.1mol/L 盐酸溶液制成每 1ml 约含 12μg 的溶液，放置 35 分钟后，照紫外－可见分光光度法，在 258nm 的波长处测定吸光度，吸收系数为（$E_{1cm}^{1\%}$）358～380。

药物药理信息

【药理毒理】动物试验结果表明，本品具有明显的镇静、肌松、抗惊厥、抗焦虑药理作用。小鼠急性毒性结果，静脉 LD_{50}，雄 91.32mg/kg、雌 93.26mg/kg；腹腔 LD_{50}、雄 240.05mg/kg、雌 212.82mg/kg。

【药代动力学】据文献报道，本品肌肉给药吸收迅速完全，生物利用度高达 90%以上。本品在体内完全被代谢，主要代谢物为羟基咪达唑仑，然后迅速与葡萄糖醛酸结合，呈无活性的代谢物。60%～70%剂量由肾脏排出体外。静脉给药的稳态分布容积可达 50～60L，血浆蛋白结合率约 95%，血中廓清率 300～400ml/min，半衰期为 1.5～2.5 小时。

【药物相互作用】

1. 咪达唑仑可增强催眠药、镇静药、抗焦虑药、抗抑郁药、抗癫痫药、麻醉药和镇静性抗组胺药的中枢抑制作用。

2. 一些肝酶抑制药，特别是细胞色素 P450 3A 抑制药物，可影响咪达唑仑的药代动力学，使其镇静作用延长。

3. 酒精可增强咪达唑仑的镇静作用。

【药物过量】

1. 过量一般主要表现是药理作用的增强：中枢抑制－从过度镇静到昏迷、精神失常、昏睡、肌肉松弛或异常兴奋。在大多数情况下，只需注意监测生命体征即可。

2. 严重过量可导致昏迷、反射消失、呼吸循环抑制和窒息，需采取相应的措施（人工呼吸、循环支持），以及采用苯二氮䓬类受体拮抗剂如氟马西尼逆转。

【不良反应】

1. 较常见的不良反应为嗜睡、镇静过度、头痛、幻觉、共济失调、呃逆和喉痉挛。

2. 静脉注射还可发生呼吸抑制及血压下降，极少数可发生呼吸暂停、停止或心跳骤停。有时可发生血栓性静脉炎。

3. 直肠给药，一些病人可有欣快感。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸咪达唑仑注射液	化学药	HZ004191

HY001405　咪芬

【外文名称】Trimetaphan

药物药理信息

【药理毒理】为神经节阻断药，用于外科手术时控制适当血压、高血压危象需迅速降压者（注射剂静滴）。

【不良反应】同六甲溴铵。

HY001406　咪喹莫特

【外文名称】Imiquimod

药物理化信息

【化学名】1－（2－甲基丙基）－4－氨基－1H－咪唑并［4,5－c］喹啉

【分子式】$C_{14}H_{16}N_4$

【分子量】240.30

药物药理信息

【药理毒理】咪喹莫特为一种人工合成的非核苷类异环胺类药物。

咪喹莫特本身对病毒没有直接作用，而是刺激机体产生细胞素激发免疫应答来消除疣组织和减少病毒的侵蚀。体内外研究表明，咪喹莫特可诱导小鼠、大鼠、兔、豚鼠、猴及人类产生细胞素。种族交叉细胞培养试验表明，主要的响应细胞是单核/巨噬细胞；培养人类外周单核细胞（PBMC），产生了几种 IFN－α 亚型、TNF－α、IL－1，6，8，10，12、MIP－1 和 MCP－1；预先给予 IFN－γ处理，人单细胞 THP－1 才会产生响应，产生 TNF－α、IL－1，6，8，但不产生 IFN－α；对小鼠新鲜 PBMC 进行相同的处理，产生与人类 PBMC 相同的细胞素；衰老巨噬细胞和牙槽巨噬细胞产生了相同的细胞素，小鼠 RAW264.7 和 J774 巨噬细胞族产生 TNF－α 和 IL－6，不产生 IFN－α。通过细胞试验可以确证咪喹莫特能诱导产生 IFN－α 和 TNF－α。

将人类纤维细胞和角化细胞与咪喹莫特或聚胞苷混合物培养 24 小时发现，角化细胞的 IL－6 和 IL－8（没有 TNF－α）的 mRNA 有所增加，但仅检测到了适量的 IL－8 的蛋白质，在高浓度下纤维细胞 IL－8 的分泌与角化细胞类似；咪喹莫特诱导细胞素分泌导致的细胞免疫应答类似 DTH 应答；咪喹莫特能

激活 HPV E7 肿瘤基因转染的荷瘤小鼠的抗肿瘤活性和 DTH 应答；人体及动物试验表明，咪喹莫特能升高 2′，5′－低聚腺苷酸合成酶，该酶可诱导产生干扰素抗病毒；干扰素和其他细胞素能活化 NK 细胞来杀死肿瘤细胞和病毒感染细胞，体内、体外试验表明，咪喹莫特能上调 NK 细胞活性，咪喹莫特刺激小鼠脾脏 B 细胞增生和活化，这种作用是直接作用，而不是细胞素介导的；咪喹莫特不直接增强 T－淋巴细胞的活性，但在体外促有丝分裂反应中能增加 T－细胞 IL－2 的产生及增生，体内试验表明能增强 T 细胞活性；咪喹莫特能增加 HSV 感染的豚鼠 IL－2 的产生、T 细胞增生及 T 细胞活性来加强细胞介导的免疫应答。

咪喹莫特在产生诱导细胞素的浓度下，没有直接的抗病毒和细胞毒作用，单细胞培养及动物感染证实了其间接的抗病毒作用。在体外，咪喹莫特处理的人类 PBMC 抑制了多种病毒的复制；HSV 感染的豚鼠模型证实了咪喹莫特在体内的抗病毒作用；咪喹莫特能激发巨细胞感染的豚鼠和小鼠的抗病毒活性，咪喹莫特的抗病毒活性与感染 Rift Valley 热病毒（本雅病毒属）或 Banzi 病毒（黄病毒属）的小鼠血清中 IFN 相关。

咪喹莫特是通过刺激单核巨噬细胞按特定次序产生一系列的细胞素激发人体先天和后天免疫应答来产生抗病毒作用的。

【药代动力学】 兔口服咪喹莫特后，咪喹莫特的主要代谢物 S－26704 的 C_{max}是母药的 25 倍；猴静脉注射咪喹莫特，$t_{1/2}$为 1.4 小时，分布容积约 5.0L/kg，代谢物为结合性的、非活性的；单剂量外用给药后，^{14}C 标记的药物在尿中不到 1%，皮肤内的药物浓度在有效范围内，皮肤内的代谢物没有研究；结合人及动物口服给药的数据，外用最佳给药间隔为 48～72 小时。

【药物过量】 人用 5% 咪喹莫特乳剂一般不可能过量，因为皮肤吸收非常少。动物实验证实，家兔皮肤给药致死剂量大于 1600mg/m^2。持续过量局部使用 5% 咪喹莫特乳剂，可引起严重的局部皮肤反应。临床多次口服给药剂量 > 200mg 不良反应为低血压，低血压只发生在口服或静脉给药。

【不良反应】 局部皮肤反应，例如：红斑、糜烂、剥脱/剥落和水肿是很常见的。严重的皮肤反应一旦发生，用药部位应用弱碱肥皂和水将乳膏剂洗掉，皮肤反应恢复后可重新再用 5% 咪喹莫特乳膏剂。少数患者也有肌痛、流感样症状、头痛、腹泻等全身反应均为轻度和中度。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
咪喹莫特乳膏	化学药	HZ002684

HY001407 咪唑立宾

【其他名称】 Bredinin

【外文名称】 Mizoribine

药物药理信息

【药理毒理】 本品是从 *Eupenicillium brefediaum* M2166 培养液中分离出的新型咪唑核苷，为抑制核酸的嘌呤合成途径的抗代谢物，具有免疫抑制活性，且几乎没有硫唑嘌呤的骨髓抑制作用和肝脏毒性。对小鼠 IgM 抗体形成能力的抑制率为 47.7%。在对各种哺乳动物培养细胞的体外实验中，能特异地抑制淋巴细胞增殖。在绵羊红细胞免疫家兔的实验中，能抑制由于初次应答及二次应答而生成抗体的过程。在用狗及人外周血淋巴细胞进行的体外实验中能抑制各种致有丝分裂因子引起的胚细胞样转变反应。在豚鼠巨噬细胞的游走抑制试验中，能减弱腹腔内渗出细胞的游走。对小鼠甲状腺移植、大鼠心脏移植及狗肾脏移植，均能延长移植片的着生。

本品通过拮抗嘌呤合成过程中由肌苷酸到鸟苷酸的途径而抑制核酸合成，但并不参入高分子核酸（体外）。

【不良反应】

1. 血液：白细胞减少，偶见血小板减少、红细胞减少、血细胞比容降低。

2. 消化系：偶见食欲减退、恶心呕吐、腹泻、软便、腹部膨满感、消化道出血等。

3. 肝脏：偶见肝功能异常。

4. 偶见发热。

5. 偶见脱毛。

6. 其他：偶见有肺炎等感染，口炎、舌炎、舌苔、γ－球蛋白减少、尿酸值上升。226 例中 48 例（21.2%）发生不良反应 61 起，包括感染、消化系障碍、白细胞减少、肝功能障碍等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
咪唑立宾片	化学药	HZ002685

HY001408 咪唑斯汀

【外文名称】 Mizolastine

药物理化信息

【化学名】 2［［［1（4－氟苯基）甲基］－1］氢

－苯并咪唑－2－基］－4－哌啶基］甲基－氨基］4－（3H）－嘧啶酮

【分子式】$C_{24}H_{25}FN_6O$

【分子量】432.50

药物药理信息

【药理毒理】咪唑斯汀具有独特的抗组胺和抗其他炎症介质的双重作用，是一种强效和高度选择性的 H_1 受体拮抗剂。咪唑斯汀可抑制活化的肥大细胞释放组胺及抑制炎性细胞的趋化作用，同时，还抑制变态反应时细胞间黏附性分子－1 的释放。此外，咪唑斯汀具有抗炎活性，这可能是与其具有抑制 5－脂肪氧合酶的作用有关。咪唑斯汀在抗组胺剂量下没有抗胆碱作用和镇静作用。

长期和短期动物实验都表明咪唑斯汀有令人满意的药理学特性：①抑制组胺诱导的毛细血管通透性增加、水肿及支气管痉挛；②抑制抗原诱导的组胺释放、花生四烯酸诱导的皮肤炎症、5－脂氧合酶活性、中性粒细胞迁徙、被动皮肤过敏、支气管痉挛及休克；③在脑电图上无潜在的镇静作用；④无心血管作用；⑤无致畸、致突变或致癌作用。咪唑斯汀在试管内和体内对组胺 H_1 受体都有高度亲和力，对 H_2 受体没有亲和力。在试管内，咪唑斯汀对 H_1 受体的亲和力比对其他受体（肾上腺能 α_1 和 α_2 受体、多巴胺能 D_1 和 D_2 受体、5－羟色胺能 1、2、3 受体）的亲和力大 20～2100 倍。动物试验表明，咪唑斯汀抑制组胺诱导的支气管收缩的作用与西替利嗪相当，而比氯雷他定强 7 倍。静脉给药时，咪唑斯汀抑制组胺诱导的血管通透性增加的作用比阿司咪唑强 3 倍。用皮内注射组胺诱发风团和潮红反应来观察咪唑斯汀抑制组胺作用的剂量依赖性关系。与安慰剂相比，2mg 咪唑斯汀即可显著抑制组胺的作用（$P<0.001$），10mg 或 20mg 咪唑斯汀分别可达对风团或潮红反应的最大抑制。在花粉过敏的患者，咪唑斯汀可以抑制受累皮肤部位的细胞间黏附分子的释放。咪唑斯汀还有抗其他炎症介质的作用，以口服咪唑斯汀预处理大鼠（0.1～10mg/kg）可以抑制花生四烯酸诱发的水肿，而用其他第二代抗组胺药则无类似效果。因此，咪唑斯汀的抗炎作用不是由阻断 H_1 受体所介导的。实验表明咪唑斯汀可抑制 5－脂氧合酶的活性、白三烯的产生、嗜碱粒细胞表面 CD63 的表达和花生四烯酸诱发的水肿。所以，咪唑斯汀既有抗组胺、抗过敏作用，又有抗炎症作用。

咪唑斯汀单次给药的急性毒性很弱，大多数动物的最大非致死量达 5000mg·kg^{-1}，对大鼠和非人类灵长类动物用 50mg·kg^{-1}，用药 1 年，耐受性良好。在生殖毒性研究中，咪唑斯汀对大鼠（日剂量分别为 525 和 125mg·kg^{-1}）和兔（日剂量分别为 535 和 245mg·kg^{-1}）未产生任何胚胎毒性和致畸作用。咪唑斯汀无致突变和致癌性。

【药代动力学】健康志愿者单剂量口服 10mg 咪唑斯汀片后，吸收迅速，达峰时间为 1.5 小时，血药浓度峰值为 276ng·ml^{-1}，平均消除半衰期为 13.0 小时。咪唑斯汀的生物利用度约为 65.5%，不受食物和酒精的影响。其与血浆蛋白的结合率较高，约为 98.4%。

咪唑斯汀主要在肝脏经葡萄糖醛酸化代谢，其他代谢途径包括由 CYP3A4 酶参与的芳香羟基化，以及脱 4－氟苯基后的 *N*－去烷基化的嘧啶酮的甲基化，已确定的代谢产物均无药理活性。只有极少量（0.5%）的药物以原形从尿中排出。

【药物相互作用】本药不能与咪唑抗真菌类（如酮康唑）或大环内酯类抗生素（如红霉素、醋竹桃霉素、克拉霉素或交沙霉素）同时使用。在同时使用西咪替丁、环孢素和硝苯地平时应特别引起注意。

研究发现酮康唑对咪唑斯汀的代谢有微弱抑制作用：12 例健康志愿者同时给予 10mg 咪唑斯汀与 100、200、400mg 酮康唑，可使咪唑斯汀的 AUC 值增加（给予 400mg 酮康唑时增加 2 倍），但终末清除半衰期无变化。一项研究中，同时口服咪唑斯汀（一日 10mg）与红霉素（1000mg，一日 2 次）。从第 11 天到第 16 天咪唑斯汀的 AUC 值增加了 50%（与同时口服咪唑斯汀及安慰剂相比），而终末清除半衰期无变化。同时口服咪唑斯汀与红霉素期间咪唑斯汀的血浆浓度与每日单独口服 15～20mg 咪唑斯汀的血浆浓度相似。

【药物过量】发生药物过量时，建议在用常规方法清除未吸收药物的同时，进行至少 24 小时的包括 Q－T 间期和心律的心脏监测在内的全面症状监护。对肾功能不全的患者研究的结果表明，血液透析不会增加药物的清除。

【不良反应】本药可能会使个别患者产生的不良反应有：头痛、乏力、口干、胃肠功能紊乱（腹泻或消化不良）、困意、低血压、焦虑、抑郁及白细胞计数、血糖和电解质的轻度异常（罕见）。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
咪唑斯汀缓释片	化学药	HZ002686
咪唑斯汀片	化学药	HZ002687

HY001409　糜蛋白酶

【其他名称】Alpha－CHYMAR、α－糜蛋白酶、Catarasa、Chymar、Chymolase、Chymozym、Impral、甲－糜蛋白酶、胰凝乳蛋白酶

【外文名称】Chymotrypsin

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

【性状及组成】本品系自牛或猪胰中提取的一种蛋白分解酶。按干燥品计算，每 1mg 的效价不得少于 800 单位。

本品为白色或类白色结晶性粉末。

药物药理信息

【药理毒理】本品为牛胰中分离提纯的一种蛋白水解酶，作用与胰蛋白酶相似，不同之处在于本品分解蛋白质的作用点在酪氨酸和苯丙氨酸的羧端肽链处。本品较胰蛋白酶分解能力强，毒性低。临床用于创伤或术后创面愈合、炎症、局部水肿、积血、扭伤血肿、乳房术后水肿、中耳炎、鼻炎、鼻窦炎等。另外，本品对眼球睫状韧带有选择性松懈作用，故可用于白内障摘除术中，可减少囊膜破裂和视网膜损伤。本品为肽链内切酶，具有水解肽键的作用，能使痰中纤维蛋白和黏蛋白等水解为多肽或氨基酸，使黏稠痰液液化，便于咳出，对脓性或非脓性痰都有效。本品还有促进抗生素、化疗药物向病灶渗透的作用。

【不良反应】本品可引起组胺释放，产生过敏反应，可用抗组胺药治疗。肌注偶可引起过敏性休克，用前应做皮肤过敏试验。严重肝肾疾病、凝血功能异常患者不可肌注本品。眼科手术时，可引起暂时性青光眼、眼压升高和角膜水肿。本品对视网膜毒性大，故不能使之进入玻璃体。不满 20 岁或先天性白内障、高玻璃体压及玻璃体不固定的创伤性白内障患者忌用。另需注意：本品不可静注。水溶液极不稳定，需新鲜配制。个别病人出现皮疹等过敏反应，可用抗组胺类药物治疗。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
口服胰糜酶	化学药	HZ002144
注射用糜蛋白酶	化学药	HZ004901
注射用糜胰蛋白酶	化学药	HZ004902

HY001410 米氮平

【其他名称】米塔扎平

【外文名称】Mirtazapine

药物药理信息

【药理毒理】米氮平的体内活性成分氮平是作用于中枢的突触前 α_2 受体拮抗剂，可以增强肾上腺素能的神经传导。它能通过与中枢的 5 - 羟色胺受体（5 - HT_2、5 - HT_3）相互作用起调节 5 - 羟色胺的功能。米氮平的两种旋光对映体都具有抗抑郁活性，左旋体阻断 α_2 和 5 - HT_2 受体，右旋体阻断 5 - HT_3 受体。米氮平的抗组胺受体（H_1）的特性起着镇静作用。该药有较好的耐受性，几乎无抗胆碱能作用，其治疗剂量对心血管系统无影响。

【药代动力学】口服米氮平片后很快被吸收（生物利用度约为 50%），约 2 小时后血浆浓度达到高峰。约 85%与血浆蛋白结合。平均半衰期为 20 ~ 40 小时；因此该药适于一日服用 1 次。血药浓度在服药 3 ~ 4 天后达到稳态，此后将无体内聚积现象发生。在所推荐的剂量范围内，米氮平的药代动力学形式为线性。米氮平大多被代谢并在服药后几天内通过尿液和粪便排出体外。其主要生化方式为脱甲基及氧化反应，随后是结合反应。脱甲基后的代谢产物与原化合物一样仍具有药理活性。肝肾功能不良可引起米氮平清除率降低。

【药物相互作用】米氮平可加重酒精对中枢抑制作用，因此在治疗期间应禁止饮酒。2 周之内或正在使用单胺氧化酶抑制剂的病人不宜使用米氮平。

【药物过量】临床上过量使用米氮平的安全性尚未被完全证实。毒性试验表明过度的不良反应外，未观察到其他不良反应。对过量服药的病人应及时进行洗胃并给予相应的对症和支持治疗。

【不良反应】下列是使用米氮平期间最常见的不良反应：食欲增加，体重增加；镇静，通常发生在服药后的前几周；在极少的情况下，以下不良反应有可能发生：（体位性）低血压；躁狂症；惊厥发作；震颤，肌痉挛；水肿及体重增加；急性骨髓抑制（嗜红细胞增多，粒细胞缺乏，再生障碍性贫血以及血小板减少症）；血清转氨酶水平增加；药疹。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
米氮平片	化学药	HZ002688

HY001411 米非司酮

【外文名称】Mifepristone

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】11 - β［4 - （*N*，*N* - 二甲氨基）- 1 - 苯基］- 17β - 羟基 - 17α - （1 - 丙炔基）- 雌甾 - 4，9 - 二烯 - 3 - 酮

【分子式】$C_{29}H_{35}NO_2$

【分子量】429.61

【性状及组成】本品为淡黄色结晶性粉末；无

臭，无味。

本品在甲醇或二氯甲烷中易溶，在乙醇或醋酸乙酯中溶解，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 192 ~ 196℃。

比旋度：取本品，精密称定，加二氯甲烷制成每 1ml 中含 5mg 的溶液，依法测定比旋度为 + 124°至 + 129°。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：抗早孕药。

米非司酮为受体水平抗孕激素药，具有终止早孕、抗着床、诱导月经及促进宫颈成熟等作用，与孕酮竞争受体而达到拮抗孕酮的作用，与糖皮质激素受体亦有一定结合力。米非司酮能明显增高妊娠子宫对前列腺素的敏感性。小剂量米非司酮序贯合并前列腺素类药物，可得到满意的终止早孕效果。

米非司酮作为一种孕激素受体拮抗剂，具有明显抗着床作用，在所用剂量范围内，抑制子宫内膜着床前的正常生理变化，于着床前用药发挥其紧急避孕作用。

【药代动力学】 本品口服吸收迅速，半合成及合成米非司酮血药浓度达峰时间分别为 1.5、0.81 小时，血药峰值分别为 0.8mg/L 和 2.34mg/L，但有明显个体差异。体内消除缓慢，消除半衰期约 20 ~ 34 小时。服药后 72 小时血药水平仍可维持在 0.2mg/L 左右。本品有明显首过效应，口服 1 ~ 2 小时后血中代谢产物水平已可超过母体化合物。

【药物相互作用】 服用本品 1 周内，避免服用阿司匹林和其他非甾体抗炎药。

【药物过量】 在耐受性研究中，给予健康非妊娠妇女和男性对象单次口服 1800mg 米非司酮，未见有严重不良反应报告。如果病人摄入大大超过剂量，应当密切注意肾上素衰竭征兆。

【不良反应】

1. 部分早孕妇女服药后，有轻度恶心、呕吐、眩晕、乏力和下腹痛，肛门坠胀感和子宫出血。

2. 个别妇女可出现皮疹。

3. 使用前列腺素后可有腹痛，部分对象可发生呕吐、腹泻。少数有潮红和发麻现象。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方米非司酮片	化学药	HZ001319
米非司酮胶囊	化学药	HZ002689
米非司酮胶囊（Ⅱ）	化学药	HZ002690
米非司酮胶丸	化学药	HZ002691
米非司酮片	化学药	HZ002692
米非司酮片（Ⅱ）	化学药	HZ002693

HY001412　米格列醇

【外文名称】 Miglitol

药物理化信息

【化学名】 [2*S*，3*R*，4*R*，5*S*] －1－（2－羟乙基）－2－（羟甲基）－3,4,5－三羟基哌啶三醇

【分子式】 $C_8H_{17}NO_5$

【分子量】 207.20

药物药理信息

【药理毒理】 米格列醇属去氧化野尻霉素衍生物，它可延迟摄入的糖份的消化吸收，从而导致餐后血糖浓度只有轻微升高，因此能降低血糖。米格列醇可降低Ⅱ型糖尿病患者的糖基化血红蛋白水平。糖基化血红蛋白代表既往一段时间的平均血糖浓度，它反映了全身的非酶蛋白糖基化作用。

作用机制：与磺脲类药不同，米格列醇不刺激胰岛素分泌。米格列醇的抗高血糖作用机制为可逆性抑制肠黏膜上的 α－葡萄糖苷酶。小肠刷状缘的 α－葡萄糖苷酶将低聚糖和二糖水解为葡萄糖和其他单糖类。在糖尿病患者，通过抑制此酶的作用延迟了糖的吸收，降低了餐后高血糖。

因为米格列醇作用机制不同于磺脲类，故二者合用时，可增强降低血糖的作用。此外，它可减轻磺脲类促胰岛素分泌和增加体重的作用。米格列醇对乳糖分解醇素有较小的抑制作用，因此，在所推荐的剂量下，不会导致乳糖不耐受。

毒理研究：米格列醇 500mg/kg 饲养小鼠 21 个月（以 AUC 计相当于成人暴露量的 5 倍多），对大鼠则给以相当于人体最大暴露量的米格列醇饲养 2 年。以上二项试验中都未发现口服米格列醇具有致癌作用。

体外实验证明，米格列醇在 Ames 和真核正向回复突变试验（CHO/HGPRT）中均无致突变作用，且在小鼠微核试验中无任何断裂作用，显性致死试验中也无遗传性变化。

给予 Wistar 大鼠米格列醇 300mg/kg（按体表面积计约为成人最大暴露剂量的 8 倍），结果表明雌性和雄性大鼠均无生殖能力异常表现。此外，其后代的存活、生长、发育及受精能力均未受影响。

致畸作用：米格列醇对孕妇的安全性评价尚未进行。已完成了小鼠 50，150 和 450mg/kg（按体表面积计，分别相当于成人最大推荐剂量的 1.5，4 和 12 倍）三个剂量的长毒试验；对兔进行了 10，45 和 200mg/kg（分别相当于成人剂量的 0.5，3 和 10 倍）三个剂量的试验。以上试验均显示出米格列醇无致畸作用。当对兔和大鼠使用米格列醇的剂量为成人

剂量的4和3倍时，动物受精能力及胚胎未见受损。但在以上试验中，当使用最大剂量即450mg/kg之于大鼠和200mg/kg之于兔时则对母体和（或）幼仔有毒性作用。胚胎毒性在大鼠试验中通过轻微而非明显的幼仔体重减轻表现出来。而在兔试验中则表现为幼仔体重减轻，骨化延迟以及存活率降低。在对大鼠的围产期试验中，NOAEL（未出现毒理反应剂量）为100mg/kg（相当于成人量的4倍）。但在妊娠大量长毒试验中，300mg/kg用量时则出现死胎率升高现象，而在450mg/kg用量时却未见该现象。大鼠长毒及围产期试验中，幼仔在存活、出生、发育、行为及生殖方面未表现出不利反应。然而还没有进行充分的人体妊娠试验。由于动物生殖试验结果并不能完全预测人体反应，因此只有在确实需要时方可使用该药。

【药代动力学】

1．正常人

（1）吸收：米格列醇的吸收在高剂量下会达到饱和，剂量为25mg时可完全吸收，而剂量为100mg时只能吸收50%～70%。无论何种剂量，它都是在服药后2～3小时达到血药浓度最高值。没有证据表明米格列醇的全身吸收有助于提高它的治疗作用。

（2）分布：米格列醇的蛋白结合率很低（4.0%），分布体积为0.18L/kg，主要在细胞外液。

（3）代谢：米格列醇在人体内和所研究的任何一种动物体内不进行代谢。在血浆、尿液和粪便中检测不出代谢物，这表明缺乏该物质的系统代谢和进入系统前代谢。

（4）排泄：米格列醇以原形自肾脏排泄。因此，给予25mg剂量，大于95%的药量在24小时内可以在尿中回收。而由于不完全的生物利用度，若给予大于25mg的剂量，从尿中累积回收率稍微低一些，消除半衰期约为2小时。

2．特殊人群

（1）肾脏损害的患者：由于米格列醇主要由肾脏排泄，故其在有肾脏损害的患者体内会出现蓄积，肌酐清除率＜25ml/min的患者服用25mg，每天3次，比肌酐清除率＞60ml/min的患者血药浓度高2倍多。因为米格列醇是局部起作用，所以通过调整剂量来纠正增高的血药浓度是不可行的。对肌肝清除率＜25ml/min的患者的用药安全性尚未确立。

（2）肝脏损害的患者：与健康受试者相比，肝硬化患者的药代动力学没有变化。因为米格列醇不经肝脏代谢，肝脏的生物转化功能没有影响。

（3）性别：在相同体重条件下，男性和女性的米格列醇药代动力学相差不大。

（4）种族：一些对日本和高加索人受试者的药代动力学研究表明，两者的结果相近。一项对黑人和高加索人健康受试者的研究提示，当眼用相同剂量50mg时，比较其药效学，结果他们的葡萄糖和胰岛素效应相似。

【药物相互作用】几项研究发现米格列醇与格列本脲之间可能存在相互作用。6名健康受试者在经过6天米格列醇用药后（先经过100mg，3次/日，连续2天，然后50mg，3次/日，连续4天）给予单一剂量的格列本脲5mg，格列本脲的血药峰值浓度C_{max}和24小时曲线下面积（AUC）分别降低17%和25%。研究还发现对于服用格列本脲3.5mg/d的糖尿病患者，如果给予米格列醇/安慰剂（100mg，3次/日，连续7天），米格列醇联用组中格列本脲的AUC均值降低18%，但与安慰剂组相比无统计学意义。一项美国临床试验提供了米格列醇与格列本脲联用具有潜在相互作用的进一步信息。此项试验中，给予患者米格列醇/安慰剂，这些病人在此前后都在进行格列本脲（10mg，2次/日）的治疗。在6个月及1年的随访中发现，联用米格列醇（100mg，3次/日）的患者其格列本脲的C_{max}均值比单用格列本脲患者分别降低16%和8%，然而，以上差异并无统计学意义。因此，虽然米格列醇与格列本脲联用具有降低AUC和C_{max}趋势，但以上三项研究都无法证实二者具有肯定的相互作用。

在健康受试者中进行了米格列醇（100mg，3次/日，连续7天）对二甲双胍（1000mg单剂量）药代动力学影响的研究，结果表明米格列醇联用组二甲双胍的AUC和C_{max}比安慰剂组降低了12%～13%，但结果无统计学意义。

在一项健康受试者的研究中还发现，当米格列醇（50mg或100mg，3次/日）与地高辛联用时，分别使地高辛血浆浓度下降19%和28%。然而在服用地高辛的糖尿病患者中，其血浆浓度不会因联用米格列醇（100mg，3次/日，连续14天）而改变。

其他在健康受试者中进行的实验证实了米格列醇可使雷尼替丁和普萘洛尔的生物利用度分别下降60%和40%。而对华法林和硝苯地平的药动学或药效学参数无明显影响。

肠吸附剂（如炭粒）和消化酶制剂包括碳水化合物分解酶（如淀粉酶，胰液素）都可降低米格列醇的作用。因此不宜联用。

在12名健康男性受试者中发现，制酸剂并不影响米格列醇的药代动力学参数。

【药物过量】与磺酰胺及胰岛素不同，过量使用米格列醇不会导致低血糖症。但可能会引起暂时性的胃胀气，腹泻和腹部的不适。由于米格列醇尚未发现其他肠道外症状，预计过量的米格列醇可能不

会引起严重的全身系统反应。

【不良反应】

1．胃肠道反应：是最常见的不良反应。在美国一项使用安慰剂的对照试验中表明，服用米格列醇（25mg/kg，3 次/日）的 962 名患者中腹痛、腹泻、胃胀气的发生率分别为 11.7%，28.7%和 41.5%，而相应安慰剂组中 603 名患者上述症状发生率分别为 4.7%，10%和 12%。其中腹痛和腹泻的发生率会随着持续给药而有所减轻。

2．皮肤反应：皮疹发病率为 4.3%，而相应的安慰剂组为 2.4%。皮疹通常是暂时性的。

3．实验室指标异常：使用米格列醇的患者血清铁含量降低，其发生率（9.2%）高于安慰剂组（4.2%）。但是大多数病人都是暂时性的且不伴有血色素降低和其他血液学指标的异常。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
米格列醇片	化学药	HZ002695

HY001413　米库氯铵

【其他名称】氯化米哇库、米伐库铵、米伐氯铵、Mivacurin、美维松

【外文名称】Mivacurium Chloride

【性状及组成】本品为白色无定形粉末。

药物药理信息

【药理毒理】本品为双－苄基异喹啉化合物，作用与氯化筒箭毒碱类似。为短效非去极化型肌松药，在现有非去极化型肌松药中本品的作用时间最短，只有苯磺酸阿曲库铵及维库溴铵的 1/3～1/2，但仍较氯化琥珀胆碱为长。临床剂量下无明显蓄积，易于控制肌松浓度及范围，术后恢复快。当氯化琥珀胆碱禁忌，无法预计手术时间长短，本品被视为较好的替代品。

【药代动力学】静脉注射后 5～15 秒显效，2 分钟可出现最大作用，维持时间约 16 分钟。本品主要由血浆胆碱酯酶水解代谢，代谢物无活性，经肾脏排出，胆汁中亦有分泌，$t_{1/2\beta}$为 2～8 分钟。对于儿童，本品起效快，效程短，术后恢复亦快，老年患者则相反。肝肾功能严重不全者，本品的作用时间约为正常者的 1.5 倍，而非典型血浆胆碱酯酶基因纯合因子患者对本品异常敏感，恢复过程可长达 1 小时。

【不良反应】

1．常见不良反应为面、颈、胸部出现暂时性红疹。偶见一过性低血压、心动过速或心动过缓，心律不齐，支气管哮喘、肌肉痉挛。

2．与氯化筒箭毒碱类似，可致呼吸功能不全。

3．本品可引起组胺释放，影响心血管系统，产生血压一过性降低及心动过速，如降低给药速度可减轻之。

HY001414　米力农

【外文名称】Milrinone

药物理化信息

【化学名】2－甲基－6－氧－1,6－二氢－［3,4′双吡啶］－5 甲腈

【分子式】$C_{10}H_9N_3O$

【分子量】211.22

药物药理信息

【药理毒理】本品是磷酸二酯酶抑制剂，为氨力农的同类药物，作用机制与氨力农相同。口服和静注均有效，兼有正性肌力作用和血管扩张作用。但其作用较氨力农强 10～30 倍。耐受性较好。本品正性肌力作用主要是通过抑制磷酸二酯酶，使心肌细胞内环磷酸腺苷浓度增高，细胞内钙增加，心肌收缩力加强，心排血量增加。而与肾上腺素 α_1 受体或心肌细胞 Na^+、K^+－ATP 酶无关。其血管扩张作用可能是直接作用于小动脉所致，从而可降低心脏前、后负荷，降低左心室充盈压，改善左室功能，增加心脏指数，但对平均动脉压和心率无明显影响。米力农的心血管效应与剂量有关，小剂量时主要表现为正性肌力作用，当剂量加大，逐渐达到稳态的最大正性肌力效应时，其扩张血管作用也可随剂量的增加而逐渐加强。本品对伴有传导阻滞的患者较安全。本品口服时不良反应较重，不宜长期应用。

【药代动力学】静脉给药 5～15 分钟起生效，清除半衰期为 2～3 小时，蛋白结合率 70%。

【药物相互作用】

1．与丙吡胺同用可导致血压过低。

2．与常用强心、利尿、扩血管药合用，尚未见不良相互作用。

3．与硝酸酯类合用有相加效应。

4．本品有加强洋地黄的正性肌力作用，故应用期间不必停用洋地黄。

5．与呋塞米混合立即产生沉淀。

【不良反应】较氨力农少见。少数有头痛、室性心律失常、无力、血小板计数减少等。过量时可有低血压、心动过速。长期口服因副作用大，可导致远期死亡率升高，已不再应用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
米力农注射液	化学药	HZ002696

HY001415 米那索龙

【其他名称】胺乙氧孕烷酮、明醇酮、羟胺孕烷

【外文名称】Minaxolone

药物药理信息

【药理毒理】本品麻醉效能强，无镇痛作用。其麻醉发生迅速，用药后 10～15 秒钟神志消失。作用持续 6～84 分钟。它对呼吸、循环系统影响很小。可用于全身麻醉诱导或小手术。

【不良反应】麻醉过程中可出现兴奋现象。可能发生过敏反应。

HY001416 米诺地尔

【其他名称】长压定、降压定、Loniten、敏乐安、敏乐血定、Rogaine

【外文名称】Minoxidil

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】6－（1－哌啶基）－2，4－嘧啶二胺－3－氧化物

【分子式】$C_9H_{15}N_5O$

【分子量】209.25

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末。本品在冰醋酸中溶解，在乙醇中略溶，有三氯甲烷或水中微溶，在丙酮中极微溶解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗高血压药。

米诺地尔直接扩张小动脉，因而降压，但具体机制未明。本品不扩张小静脉。周围血管阻力减低后引起反射性心率加快、心排血量增加。降压后肾素活性增高，引起水钠潴留。本品不干扰血管运动反射，故不发生直立性低血压。

局部长期使用时，可刺激男性型脱发和斑秃患者的毛发生长。本品治疗脱发的确切机制尚不清楚。

【药代动力学】口服易吸收（可达 90%）。本品不与血浆蛋白结合。给药后 1 小时血中药物浓度达峰值，此后迅速下降。血浆 $t_{1/2}$ 为 2.8～4.2 小时，肾功能障碍时不变。但降压作用与血中米诺地尔浓度并无相应关系。口服一剂后 1.5 小时内降压作用开始，最大降压作用在给药后 2～3 小时出现，降压作用可持续 24 小时或更长（达 75 小时），这可能与其较久地储存于动脉血管平滑肌有关。它在肝内代谢，其代谢物葡萄糖醛酸结合物可随尿排出。3%从粪便排出。透析时本品可被除去。

【药物相互作用】本品与其他降压药、硝酸盐类同用可使降压作用加重。非甾体抗炎镇痛药、拟交感胺类与本品同用使降压作用减弱。

【药物过量】

1．如出现反射性交感兴奋引起的心率加快可加用一种 β－受体阻断药。

2．如出现因水钠潴留而致的体重增加、下肢水肿，可给予利尿剂以解除，常选用呋塞米等泮利尿剂。

3．出现心包积液者应停药。

4．应用本品逾量时可适当扩容治疗，危重时可给去氧肾上腺素或多巴胺，但不宜用肾上腺素或去甲肾上腺素，以避免过度兴奋心脏。

【不良反应】

1．常见的有：

①反射性交感兴奋可引起心率加快、心律失常、皮肤潮红；

②水钠潴留引起体重增加、下肢水肿。

③毛发增生，以脸、臂及背部较著，常在用药后 3～6 周内出现，停药 1～6 月后消退。为减少这些不良反应宜与利尿药或 β－受体阻断药合用。

2．较少见的有：心绞痛、胸痛（心包炎）、头痛（血管扩张所致）。

3．少见的有：过敏反应、皮疹、瘙痒。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
米诺地尔酊	化学药	HZ002697
米诺地尔凝胶	化学药	HZ002698
米诺地尔片	化学药	HZ002699
米诺地尔溶液	化学药	HZ002700

HY001417 米索比妥钠

【其他名称】BRIETAL、美索比妥钠、戊烷巴比妥

【外文名称】Methohexital

【性状及组成】为白色粉末，可溶于水，其 1%～2%溶液的 pH 为 11，与酸性药物混合可产生沉淀。

药物药理信息

【药理毒理】麻醉作用强，为硫喷妥钠的 2～3 倍。安全范围比硫喷妥钠稍宽。局部刺激性小。不增强迷走神经及喉神经敏感性，因而它们痉挛的发

生率低。但易引起不自主活动，肌张力增高，有癫痫史者禁用。术前应用阿片类药物可以使不良反应少。

【药代动力学】在肝内代谢较快，其 $t_{1/2}$半衰期为硫喷妥钠的 1/2，故持效短、苏醒快。

HY001418　米索前列醇

【外文名称】Misoprostol

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 56 册

药物理化信息

【化学名】（±）（11α，13*E*），11,16－二羟基－16－甲基前列烷－9－酮－13－烯－1－酸甲酯

【分子式】$C_{22}H_{38}O_5$

【分子量】382.54

【性状及组成】本品为淡黄色黏稠油状物；微有特臭。

本品在二氯甲烷中极易溶解，在甲醇、乙醇和乙酸乙酯中易溶，在水中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：终止早孕药。

本品具有宫颈软化、增强子宫张力及宫内压作用。与米非司酮序贯合用可显著增高或诱发早孕子宫自发收缩的频率和幅度。本品具有 *E* 型前列腺素的药理活性，对胃肠道平滑肌有轻度刺激作用，大剂量时抑制胃酸分泌。

【药代动力学】本品口服吸收迅速，可于 1.5 小时吸收完全。其血浆活性代谢产物米索前列醇酸达峰值时间为 15 分钟，口服 200μg，平均峰浓度为 0.309μg/L，消除半衰期为 36－40 分钟。主要经尿排出。

【药物相互作用】服用本品 1 周内，避免服用阿司匹林和其他非甾体类抗炎药。

【不良反应】部分早孕妇女服药后有轻度恶心、呕吐、眩晕、乏力和下腹痛。及个别妇女可出现潮红、发热及手掌瘙痒，甚至过敏性休克。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
米索前列醇片	化学药	HZ002702

HY001419　米特福辛

【其他名称】CAS5806685－6、Hexadecyl Phosphorylcholine Chloride、HPC、氯化十六烷基磷酸胆碱、Miltex、米替福新

【外文名称】Miltefosine

药物药理信息

【药理毒理】本品为蛋白激酶 PKC 抑制剂，分子由与亲脂性末端连接的磷酸胆碱组成，结构类似于细胞膜的磷脂组分，可进入细胞膜并阻断细胞信号过程来诱发一种特殊的功能性障碍，阻止肿瘤进一步生长；并具有免疫调节活性，可促进 IL－2 介导的 T 细胞活化，对激素依赖性乳腺癌生长可产生强力的抑制作用，对非激素依赖性细胞系肿瘤无活性。

本品溶于甘油酯乳腺癌患者皮肤用药后，能使溃疡面迅速愈合，皮肤转移灶“皱缩”。

F344 系大鼠，带有移植的由甲基亚硝脲诱导的原发性 PHY 乳腺癌，给予本品，第 5 疗程时瘤体显著缩小，但在第 10 个疗程时失去活性。原来管状的乳头状腺癌可能由于原发性上皮瘤细胞过度生长或者由于反复的移植过程中肿瘤的形态学特征转化而转变成恶性腺角化癌。

【药物相互作用】联合并用无活性剂量的米特福辛和次最佳剂量的顺铂或激素铂复合物，可导致米特福辛对激素敏感肿瘤活性的显著的增大。

【不良反应】

1．恶心，呕吐等胃肠道反应。

2．肾毒性，白细胞与血小板增多。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
米特福辛注射液	化学药	HZ002703

HY001420　明胶

【外文名称】Gelatin

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

【性状及组成】本品为动物的皮、骨、腱与韧带中含有的胶原，经部分水解后得到的一种制品。

本品为淡黄色至黄色、半透明、微带光泽的粉粒或薄片；无臭；潮湿后，易为细菌分解；在水中久浸即吸水膨胀并软化，重量可增加 5 ~ 10 倍。

本品在热水、醋酸或甘油与水的热混合液中溶解，在乙醇、三氯甲烷或乙醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：赋形剂。吸收性止血剂。

明胶被广泛应用于各种药物制剂中，包括植入传递系统中把它用作生物可降解的骨架材料，它最常用来制备硬胶囊或软胶囊。

明胶胶囊装有活性药物，一般是口服给药的单剂量剂型。尽管明胶在冷水中溶解性差，但是明胶胶囊在胃液中会因膨胀而加速其内容物的释放。

硬胶囊分两节制备，把不锈钢栓模浸入明胶溶液，明胶液会均匀分布于栓膜的周围。然后明胶经冷风处理，干燥除去水分。先把二节分别脱模、切平和填充，再将胶囊壳的两节套上，然后贴上有防被偷换的密封条。USPNF20 允许制备硬胶囊的明胶含有不同的着色剂、抗菌防腐剂和十二烷基硫酸钠。生产者可以往硬胶囊中加入硬化剂（如蔗糖）。装量在 0.13～1.37ml 内的胶囊市上有售。

软胶囊用含有增塑剂（如甘油或山梨醇）的明胶水溶液制得。两个已成形的带状胶片夹在合适的阴模之间运转，随着滚动阴模的接近，注入填充物，然后把胶囊的两部分密封在一起而成。

明胶也用于药物的微囊化，即活性药物被封装在一个微型胶囊或小囊中，之后按散剂办法处理。最早被微囊化的药物（小胶丸）是被包裹于一个通过乳化过程制备的明胶小胶丸中的鱼油和油性维生素。

低分子量的明胶能提高口服降解药物的溶出度。明胶的其他应用包括糊剂、锭剂、阴道栓和栓剂的制备。此外，还被用作片剂的黏合剂和包衣材料，以及溶液剂和半固体制剂的增黏剂。

在治疗中，明胶用来制备创伤敷料和血浆替代品，尽管在血浆替代品的研究中曾有过敏反应的报道。吸收性明胶可以用于制备灭菌薄膜，眼用膜剂，灭菌压缩棉，灭菌棉球和灭菌海绵粉末。明胶海绵有止血作用。

明胶还被广泛应用于食品和相片胶卷用乳剂中。

【药物相互作用】明胶是两性物质，与酸和碱都发生反应。它也是蛋白质，因此也具有此类物质的化学性质；如明胶可被大多数蛋白水解系统水解而生成氨基酸。

明胶还可和以下物质发生反应：醛和醛糖、阴离子和阳离子聚合物、电解质、金属离子、增塑剂、防腐剂、表面活性剂。明胶可被以下物质沉淀：乙醇、三氯甲烷、乙醚、汞盐、鞣酸。如果不加抗菌防腐剂妥善保存，凝胶会被细菌作用变成液体。

以上提到的某些相互作用会改变明胶的物理性质；例如，明胶和增塑剂（如甘油）混合可制备软胶囊和栓剂。

【不良反应】在口服制剂中，明胶是无毒无刺激性原料。但是，偶见明胶胶囊黏附食管的报道，这可能导致局部的刺激性。有文献报道，明胶注射给药后会产生过敏反应，包括严重的过敏性样的反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
醋酸氯己定栓	化学药	HZ000589
吸收性明胶海绵	化学药	HZ003643
百仙妇炎清栓	民族药	MZ000045
大蒜油软胶囊	中成药	ZC000709
复方藤果痔疮栓	中成药	ZC001534
复方铁芫止血粉	中成药	ZC001543
骨友灵巴布膏	中成药	ZC001877
关节镇痛巴布膏	中成药	ZC001916
祛风骨痛巴布膏	中成药	ZC004243
少林风湿跌打巴布膏	中成药	ZC004654
生脉颗粒	中成药	ZC005022

HY001421 没食子酸丙酯

【外文名称】Propyl Gallate

药物理化信息

【化学名】3，4，5－三羟基苯甲酸丙酯

【分子式】$C_{10}H_{12}O_5$

【分子量】212.20

【性状及组成】本品为白色、无臭或几乎无臭的结晶性粉末，略有苦涩味。在用作抗氧剂的浓度使用时，苦涩不明显。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗氧化剂。

本品自 1943 年首次用于防止油自动氧化以来，作为抗氧化剂广泛应用于化妆品、香料、食品和药剂领域。它主要应用于防止油和脂肪的酸败，浓度可高达 0.1%（W/V）。它还可用于防止醚中过氧化物的形成，浓度为 0.002%（W/V）；防止三聚乙醛的氧化，浓度为 0.01%（W/V）。有报道，没食子酸丙酯与其他抗氧化剂，如丁羟茴醚和丁羟甲苯有协同作用。没食子酸丙酯还具有抗菌剂的性质。

研究表明，没食子酸丙酯加到酮咯酸中可提高制剂中药物稳定性。

【药物相互作用】没食子酸烷酯与一些金属，如钠、钾和铁等不相容，形成深色复合物。加入一些螯合剂，如枸橼酸，可防止复合物形成。没食子酸丙酯还能与氧化性物质反应。

【不良反应】根据动物实验的报道，没食子酸丙酯有很强的接触过敏性。没食子酸丙酯在 CHO－KI 细胞中还有助于形成细胞作用。尽管如此，有关没食子酸丙酯不良反应的报道很少。已有的报道包括接触性皮炎、过敏性接触性皮炎和婴儿的高铁血红

蛋白症。WHO将没食子酸丙酯一日可接受的摄入量定为每千克体重1.4mg。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
熊胆栓	中成药	ZC006527

HY001422　莫达非尼

【外文名称】Modafinil

药物管理信息

【特殊管理分类】一类精神药

药物药理信息

【药理毒理】莫达非尼能提高正常人群的中枢兴奋性，口服莫达非尼后第1小时到第22小时的脑电图监测表明，反映警觉能力高低的 α/θ 值升高，偶发的微眠波几乎被完全抑制。对睡眠剥夺人群，会造成警觉能力和作业能力的下降，服用莫达非尼能有效改善这种状况。研究表明，经过一整夜的睡眠剥夺后，服用200mg莫达非尼，志愿者的心理运动能力明显高于服用安慰剂组；在长达60小时的睡眠剥夺期间，每隔8小时服用莫达非尼200mg，仍能较好地维持睡眠剥夺者的中枢处于一定的兴奋状态，使他们保持相当的警觉能力和作业能力。莫达非尼还具有一定的神经保护作用。用脑损伤动物模型研究发现，莫达非尼能有效地拮抗1－甲基－4－苯基－1,2,3,6－四氢吡啶产生的神经毒作用，使症状得到明显缓解。莫达非尼的神经保护作用还分别在纹状体机械损伤模型和缺血损伤模型中得到证实。莫达非尼中枢兴奋作用与脑中抑制性递质γ－氨基丁酸（GABA）的减少有关，并受5－羟色胺和去甲肾上腺素的调控。研究中发现，莫达非尼的中枢兴奋作用可能是通过增加谷氨酰胺合成酶，从而减少GABA的生成，并促进神经细胞的解毒功能和能量代谢活动而起作用的。

【药代动力学】莫达非尼口服后迅速完全吸收，大约2小时血浆浓度达到峰值，食物可延缓药物的吸收。莫达非尼在肝脏由细胞色素P450系统的CYP3A4代谢，因此联合应用CYP3A4的诱导剂或抑制剂，会影响莫达非尼的血药浓度及作用周期。莫达非尼经肝脏代谢，生成无治疗作用的两个主要代谢产物莫达非尼酸和莫达非尼砜。药物的清除半衰期为10～15小时，年轻女性的药物清除率高于年轻男性，老年人的清除率明显低于年轻人。

【药物相互作用】卡马西平、伊曲康唑、酮康唑等CYP3A4的抑制剂或苯巴比妥、利福平等CYP3A4的诱导剂与莫达非尼同时应用，可能改变莫达非尼的血药浓度。莫达非尼是CYP3A4的诱导剂，它使环孢素的血药浓度降低50%，也可以降低茶碱的血药浓度，并可能降低口服避孕药的疗效。莫达非尼也可增加三环类抗抑郁药、氯丙嗪、地西泮、奥美拉唑、苯妥英钠、普萘洛尔和华法林等药物的血药浓度。因此，在与上述药物同时应用时，需相应调整剂量，并监测血药浓度。但莫达非尼不会干扰5－HT再摄取抑制剂（SSRI）的代谢。

【不良反应】本品具有较大的安全性，对血压和心率无影响，无活动增多、耐受性或反弹性思睡等不良反应，也无潜在的成瘾性。主要不良反应有恶心、神经过敏和焦虑，加量过快服药可出现轻至中度头痛。因而，用药宜从小剂量（一日50～100mg）开始，每4～5天增加50mg，直至最适剂量（每日200～400mg）。严重肝损害的患者剂量减半，肾功能不全和老年患者服用剂量要酌减，左室肥大、有缺血性心电图改变、胸痛、心律失常或有临床表现的二尖瓣脱垂的患者及近期发生心肌梗死、不稳定型心绞痛或有精神病史者禁用或慎用。

莫达非尼在一般情况下具有较好的耐受性，最常见的不良反应主要包括失眠和食欲减退。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
莫达非尼胶囊	化学药	HZ002706

HY001423　莫海林

【外文名称】Moherin

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（二部）·第6册

【性状及组成】本品系自猪肠黏膜中提取经改构制得的酸性黏多糖物质。按干燥品计算，含酸性黏多糖以氨基葡萄糖（$C_6H_{13}O_5N$）计算，应不低于18.0%。

本品为白色无定形粉末；无臭，无味，有引湿性。

本品在水中易溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水制成每1ml中含40mg的溶液，依法测定，比旋度应不小于+35°。

药物药理信息

【药理毒理】本品具有降低血脂作用，可刺激脂蛋白酯酶的释放，降低血浆中甘油三酯及胆固醇的含量，减轻动脉壁中胆固醇的沉积，促进其吸收和

消散，以及其抗凝血作用，从而缓解动脉粥样硬化，预防血管中血栓形成，纠正脂质代谢紊乱。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
莫海林片	化学药	HZ002707

HY001424 莫匹罗星

【外文名称】Mupirocin

药物理化信息

【化学名】9－［4－［5－（2，3－环氧－5－羟基－4－甲基己基）－3，4－二羟基四氢吡喃－2－基］－3－甲基丁－2－烯酰氧］壬酸

【分子式】$C_{26}H_{44}O_9$

【分子量】500.60

药物药理信息

【药理毒理】本品作用于菌体内的异亮氨酸 tRNA 合成酶与异亮氨酸结合点，阻碍氨基酸的合成，同时耗竭了细胞内 tRNA，使敏感菌的 RNA 和蛋白质合成中止。本品对哺乳类动物异亮氨酸 tRNA 合成酶的亲和力很低，故对人的毒性甚小。莫匹罗星对需氧革兰阳性球菌有很强的抗菌活性，尤其对皮肤感染有关的金黄色葡萄球菌、表皮葡萄球菌、化脓性链球菌。对耐药金黄色葡萄球菌也有效。对本品敏感的革兰阴性细菌有流感嗜血杆菌、淋球菌等。本品对先天性抗感染屏障作用的皮肤正常菌群从如细球菌、棒状杆菌和丙酸杆菌等抑制较弱。对绿脓假单胞菌、厌氧菌和真菌无抑制作用。本品对其他抗生素无交叉耐药性。与皮肤科病人其他常用的抗生素相比，本品保持对敏感菌株的敏感性。但在长期应用本品的病例中，亦已分离到对本品轻度耐药的菌株。

早期实验表明，外用本品 0.02% ~ 0.1% 浓度制剂对金黄色葡萄球菌即有抑制作用，而用 2% 浓度制剂则起杀菌作用。在偏酸环境下体外活性增强，因而皮肤的低 pH 有利于本品的抗菌活性。

【药代动力学】本品软膏皮肤外用经皮穿透和吸收极少。在一项健康人试验中，用本品 2% 制剂一次性封包占体表面积 70% ~ 80% 的皮肤（约合药 3g）8 小时或在鼻腔内涂布本品，均未测出系统吸收量。在银屑病或湿疹皮损中外用本品，尿中主要代谢产物相当用药量的 0.4% ~ 0.6%，而健康皮肤估计在 0.2% ~ 0.3% 以下。莫匹罗星透皮吸收极微，即使进入循环，通过侧链与核之间的酯键的去酯化作用转变为单胞菌酸的形式而失活并迅速从肾脏排泄。因而莫匹罗星只适于局部外用。

【不良反应】局部应用一般无不良反应，偶见局部痒感或灼感，一般不需停药。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
莫匹罗星软膏	化学药	HZ002708

HY001425 莫沙帕明

【其他名称】Clospipramine，Cremine

【外文名称】Mosapramine

药物药理信息

【药理毒理】本品是一个新的二苯并氮杂䓬类衍生物，具有抗精神分裂症作用。实验证明，本品可对抗阿扑吗啡及脱氧麻黄碱引起的动物的刻板行为或运动过度。此作用比氯卡帕明强 2 倍。其作用机制是由于选择性地阻断脑内多巴胺 D_2 受体与 5－HT_2 受体。

【药代动力学】本品口服易吸收，服药 6－7 小时达血药峰浓度，血浆 $t_{1/2}$ 约为 15 小时，经肝脏代谢，由肾脏排出体外。

【不良反应】

1. 可有心绞痛、心悸、面部潮红。若病人出现缄默、严重肌强直、吞咽不能、心动过速、血压变化、出汗等症状时，应停用本品并采取适当治疗措施。罕见肝功障碍，应减量或停药。

2. 可引起帕金森综合征，发生率 18%。

3. 出现麻痹性肠梗阻、皮肤过敏，应停药。

4. 有时有嗜睡、眩晕、头痛、知觉异常、共济失调、性欲异常、感觉迟缓、疲劳、排尿困难等。亦可能引起低血钠、尿钠增加、尿量增加、抽搐、抗利尿激素分泌异常、伴有神志丧失。

HY001426 莫维普利

【其他名称】Altiopril，Lowpress，Moveltipril

【外文名称】Moveltipril

药物药理信息

【药理毒理】是卡托普利的同类物，降压作用产生较慢，但持久，为卡托普利的 2 倍。

HY001427 牡蛎碳酸钙

【其他名称】活性钙、牡蛎钙

【外文名称】Oyster Shell Calcium

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 47 册

【性状及组成】本品为（长）牡蛎贝壳，经处理，微粉化制成，按干燥品计算，含钙量应为36.0%～40.0%（g/g）。

本品为类白色或灰白色极细粉末，无臭、味微涩。

本品在水中几乎不溶，在乙醇中不溶；在含铵盐或二氧化碳的水中微溶，遇稀醋酸、稀盐酸或稀硝酸即发生泡沸、溶解，并有少量棕色不溶物漂浮。

药物药理信息

【药理毒理】补钙药，钙参与骨骼的形成与骨折后骨组织的再建、维持神经传导和肌肉收缩，降低毛细血管的渗透性，维持其正常渗透压，还参与凝血机制，保持血液酸碱平衡等。

【药物相互作用】

1．本品不宜与洋地黄类药物合用。

2．大量饮用含酒精和咖啡因的饮料以及大量吸烟，均会抑制钙剂的吸收。

3．大量进食富含纤维素的食物能抑制钙的吸收，因钙与纤维素结合成不易吸收的化合物。

4．本品与苯妥英钠及四环素类同用，二者吸收减少。

5．维生素 D、避孕药、雌激素能增加钙的吸收。

6．含铝的抗酸药与本品同服时，铝的吸收增多。

7．本品与噻嗪类利尿药合用时，易发生高钙血症（因增加肾小管对钙的重吸收）。

8．本品与含钾药物合用时，应注意心律失常的发生。

【不良反应】

1．可见嗳气、便秘、腹部不适。

2．偶见高血钙、肾功能不全。

3．过量长期服用可引起反跳性胃酸分泌增多。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
牡蛎碳酸钙胶囊	化学药	HZ002709
牡蛎碳酸钙咀嚼片	化学药	HZ002710
牡蛎碳酸钙颗粒	化学药	HZ002711
牡蛎碳酸钙泡腾片	化学药	HZ002712
牡蛎碳酸钙片	化学药	HZ002713

HY001428　木瓜蛋白酶

【其他名称】木瓜酵素、木瓜酶

【外文名称】Papain

【性状及组成】木瓜蛋白酶是利用未成熟的番木瓜果实中的乳汁，采用现代生物工程技术提炼而成的纯天然生物酶制品。

药物药理信息

【药理毒理】木瓜蛋白酶是一种含疏基（—SH）肽链内切酶，具有蛋白酶和酯酶的活性，有较广泛的特异性，对动植物蛋白、多肽、酯、酰胺等有较强的水解能力，同时，还具有合成功能，能把蛋白水解物合成为类蛋白质、氨基酸等。

【药物过量】表现：①呼吸短促或呼吸困难。②心动过速。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方消化酶胶囊	化学药	HZ001438
木瓜酶肠溶片	化学药	HZ002714
乌鸡白凤胶囊	中成药	ZC005787

HY001429　木糖醇

【外文名称】Xylitol

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】1,2,3,4,5－戊五醇

【分子式】$C_5H_{12}O_5$

【分子量】152.15

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末，无臭，味甜；有引湿性。

本品在水中极易溶解，在甲醇中略溶，在苯中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为营养药。具有补充热量、改善糖代谢、消除酮血症的作用。

木糖醇能够补充机体热量，改善糖代谢。木糖醇是人体糖类代谢的正常中间体，在体内的代谢不依赖胰岛素的参与，能够直接透过细胞膜参与糖代谢，不会增加糖浓度，其甜味及产热量与葡萄糖相仿。木糖醇还具有抑制酮体生成的作用，能使血浆脂肪酸生成减少。用于糖尿病患者的代用糖。

【药代动力学】木糖醇注射液通过静脉注射后，85%及 10%分别由肝脏和肾脏代谢，小部分被血液细胞、肾上腺皮质和其他组织所利用。由于利用完全，在尿中几乎无木糖醇排泄，当体内胰岛素缺乏时代谢不受影响。

【不良反应】口服给药初服时可有肠鸣、腹胀、

腹泻等，适当减少起始剂量，可减少不良反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅴ）	化学药	HZ001068
门冬氨酸钾镁木糖醇注射液	化学药	HZ002668
木糖醇颗粒	化学药	HZ002715
木糖醇口服液	化学药	HZ002716
木糖醇氯化钠注射液	化学药	HZ002717
木糖醇片	化学药	HZ002718
木糖醇注射液	化学药	HZ002719
注射用木糖醇	化学药	HZ004903
金刺参九正合剂	民族药	MZ000253

HY001430 钼酸钠

【外文名称】Sodium Molybdate

【分子式】$Na_2MoO_4 \cdot 2H_2O$

【分子量】241.95

【性状及组成】本品为白色菱形结晶。易溶于水，不溶于丙酮，在100℃或长时间加热会失去结晶水变成白色无水物。

药物药理信息

【药理毒理】生命所必需的微量元素中金属元素绝大部分是第一过渡系元素，钼是惟一的第二过渡系元素。成人的钼含量约9mg，主要分布在骨骼、体液、肝、肾中，以肝肾含量最高。

钼在机体的主要功能是参与硫、铁、铜之间的相互反应。钼是黄嘌呤氧化酶、醛氧化酶和亚硫酸氧化酶发挥生物活力的必需因子，对机体氧化还原过程中的电子传递、嘌呤物质与含硫氨基酸的代谢具有一定的影响。在这三种酶中，钼以辅助因子的形式存在。钼还能抑制小肠对铁、铜的吸收，其机制可能是钼可竞争性抑制小肠黏膜刷状缘上的受体，或形成不易被吸收的铜－钼复合物、硫－钼复合物或硫钼酸铜并使之不能与血浆铜蓝蛋白等含铜蛋白结合。

钼缺乏主要见于遗传性钼代谢缺陷，尚有报道全肠道外营养时发生钼不足者。钼不足可表现为生长发育迟缓甚至死亡，尿中尿酸、黄嘌呤、次黄嘌呤排泄增加。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
肠内营养粉剂（TP）	化学药	HZ000518

续表

制剂名称	类别	序号
多种微量元素注射液（Ⅰ）	化学药	HZ000815
善存液	化学药	HZ003188

HY001431 钼元素

【外文名称】Molybdenum

药物药理信息

【药理毒理】生命所必需的微量元素中金属元素绝大部分是第一过渡系元素，钼是惟一的第二过渡系元素。成人的钼含量约9mg，主要分布在骨骼、体液、肝、肾中，以肝肾含量最高。

钼在机体的主要功能是参与硫、铁、铜之间的相互反应。钼是黄嘌呤氧化酶、醛氧化酶和亚硫酸氧化酶发挥生物活力的必需因子，对机体氧化还原过程中的电子传递、嘌呤物质与含硫氨基酸的代谢具有一定的影响。在这三种酶中，钼以辅助因子的形式存在。钼还能抑制小肠对铁、铜的吸收，其机制可能是钼可竞争性抑制小肠黏膜刷状缘上的受体，或形成不易被吸收的铜－钼复合物、硫－钼复合物或硫钼酸铜（CuMoS）并使之不能与血浆铜蓝蛋白等含铜蛋白结合。

钼缺乏主要见于遗传性钼代谢缺陷，尚有报道全肠道外营养时发生钼不足者。钼不足可表现为生长发育迟缓甚至死亡，尿中尿酸、黄嘌呤、次黄嘌呤排泄增加。

【药代动力学】钼在胃肠系统的吸收是很高的。人体摄取的钼大约有50%进入血液中，但存留量较少，大部分钼通过肾脏从尿中排出。

【药物过量】钼太多会影响铜、钙及磷的代谢。由于钼与铜可生成难溶的钼化铜而不能被机体利用，由于钼干扰了钙和磷的代谢，出现骨骼代谢紊乱，儿童患佝偻病和软骨病。钼过多时，肝内硫化物氧化酶活性降低，使组织含硫化物增多造成贫血和白血病。钼与锌、锰、钴等元素也存在相互拮抗抑制的作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
多维元素片	化学药	HZ000804
多维元素片（25）	化学药	HZ000809
多维元素片（29）	化学药	HZ000810
多种维生素片	化学药	HZ000817
复方多维元素片（21）	化学药	HZ001151

续表

制剂名称	类别	序号
复方多维元素片（23）	化学药	HZ0001152
复方营养混悬剂	化学药	HZ0001478
善存银片	化学药	HZ0003189

HY001432　那氟沙星

【外文名称】Nadifloxacin

药物理化信息

【化学名】（±）-9-氟-6，7-二氢-8-（4-羟基-1-哌啶基）-5-甲基-1-氧代-1*H*，5*H*-苯并［*i*，*j*］喹嗪-2-羧酸

【分子式】$C_{19}H_{21}FN_2O_4$

【分子量】360.39

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：那氟沙星为DNA拓扑异构酶抑制剂，通过阻碍细菌DNA的复制而起杀菌作用。本品对痤疮丙酸杆菌、表皮葡萄球菌、革兰阳性菌、革兰阴性菌及厌氧菌有较强抗菌活性，且抗菌谱广；本品对MRSA耐药和不耐药的金黄色葡萄球菌有同样抗菌活性；对产β-内酰胺酶的细菌有良好抗菌活性；本品与已有的新抗菌药间未发现有交叉耐药性。体内试验显示，本品对皮下感染表皮葡萄球菌等细菌的小鼠模型有较好的治疗效果。

2．毒理研究

（1）遗传毒性：本品组氨酸缺陷型伤寒沙门菌和大肠杆菌回复突变试验、CHL细胞染色体畸变试验结果均为阴性，小鼠微核试验结果为阳性。

（2）生殖毒性：雄鼠于交配前63天至整个交配期，雌鼠于交配前14天至妊娠第7天皮下注射本品日剂量达75mg/kg，除局部刺激、雄鼠体重增长缓慢和盲肠重量增加外，未见对亲代生育力及胎仔存活、内脏和骨骼发育等产生明显影响。雌性大鼠妊娠第7～17天皮下注射本品日剂量75mg/kg，可使胎仔体重减少、胎盘重量减轻，无毒性反应日剂量为15mg/kg。雌性大鼠在围产期皮下注射本品日剂量达75mg/kg，未见对母鼠及子代产生不良影响。

【药代动力学】在健康人背部用本品10g单次涂抹后的最高血浆浓度为1.7ng/ml，半衰期为19.4小时。涂抹本品后48小时，尿中的排泄率为0.09%。本品5g，一日2次，连续7日反复涂抹后的血浆浓度在第5日以后基本保持不变，最后1次涂抹后的血浆浓度在涂抹后8小时达到最高血浆浓度为4.1ng/ml，半衰期为23.2小时，第7日尿中的排泄率为0.16%。

【药物相互作用】与已有的新抗菌药之间未见交叉耐药性。

【不良反应】本品不良反应较少，少数病人有皮肤瘙痒、刺激感、潮红、丘疹、面部发热、接触性皮炎、皮肤干燥，上述不良反应的发生率小于1%。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
那氟沙星软膏	化学药	HZ0002720

HY001433　那格列奈

【外文名称】Nateglinide

药物理化信息

【化学名】*N*-［（反式-4-异丙基环己基）羰基］-D-苯丙氨酸

【分子式】$C_{19}H_{27}NO_3$

【分子量】317.43

药物药理信息

【药理毒理】那格列奈的作用依赖于胰岛β细胞的功能，通过与β细胞膜上的ATP敏感性K^+通道受体结合并将其关闭，使细胞去极化，钙通道开放，钙内流，刺激胰岛素的分泌，降低血糖。那格列奈促胰岛素分泌作用依赖于葡萄糖水平，在葡萄糖水平较低时，促胰岛素分泌减弱。那格列奈有高度的组织选择性，与心肌和骨骼肌的亲和力低。

【药代动力学】餐前服用那格列奈片后迅速吸收，药物浓度平均峰值通常出现在服药1小时内。依据静脉给药数据估计的那格列奈稳态分布容积大约是10L。体外研究表明那格列奈大部分（97%～99%）与血浆蛋白结合。

那格列奈血浆浓度迅速降低且那格列奈清除半衰期平均为1.5小时。与较短的清除半衰期相一致，那格列奈剂量加倍至240mg，一日3次也无明显蓄积。

餐后服用那格列奈，其吸收（AUC）程度不受影响。但吸收速度降低，表现为峰浓度降低和血浆达峰时间延迟。因此推荐餐前服用那格列奈。通常餐前1分钟服用，也可餐前30分钟内服用。

【药物相互作用】体外研究表明那格列奈主要通过细胞色素P450酶CYP2C9（70%）代谢，部分通过CYP3A4（30%）代谢。体外实验发现其可抑制甲磺丁脲的代谢，据此判断那格列奈在体内是CYP2C9的潜在抑制剂。体外实验表明该药对CYP3A4的代谢反应无抑制作用。总之，这些发现说明，该药与其他药物间出现具有临床意义的药代动力学方面相互作用的潜在可能性较低。

那格列奈对下列药物的药代动力学特征无影响：华法林（CYP3A4 和 CYP2C9 的底物）、双氯芬酸（CYP2C9 的底物）、曲格列酮（CYP3A4 诱导剂）和地高辛。因此合用时无论那格列奈、地高辛、华法林或双氯芬酸均无需调整剂量。同样，那格列奈与其他口服抗糖尿病药物，如与二甲双胍或格列苯脲间不存在具有临床意义的药代动力学方面的相互作用。

那格列奈与血清蛋白的结合率较高（98%），主要是与白蛋白结合。体外用蛋白结合率高的药物进行的替换实验发现它们对那格列奈的蛋白结合无影响。这些药物是呋塞米、普萘洛尔、卡托普利、尼卡地平、普伐他汀、格列苯脲、华法林、苯妥英钠、乙酰水杨酸、甲磺丁脲和二甲双胍。同样，那格列奈对普萘洛尔、格列苯脲、尼卡地平、华法林、苯妥英钠、乙酰水杨酸和甲磺丁脲的血清蛋白结合无影响。

口服抗糖尿病药的降血糖作用可被某些药物所加强，这些药物包括非甾体类抗炎药、水杨酸盐、单胺氧化酶抑制剂和非选择性 β－肾上腺素能阻滞剂。

口服抗糖尿病药的降血糖作用可被某些药物所削弱，这些药物包括噻嗪类、可的松、甲状腺制剂和类交感神经药。接受那格列奈治疗的患者加用或停用上述药物时应严密观察血糖的变化。

【药物过量】临床研究显示，逐渐增加那格列奈的剂量至每日 720mg 共服用 7 天时患者仍可耐受。无那格列奈过量的临床试验经验。然而，药物过量可增加降血糖作用，出现低血糖症状。对不伴有意识丧失或神经症状的低血糖症状，均可通过口服葡萄糖、调整药物剂量或（和）进食来治疗。出现昏迷、癫痫发作或其他神经症状的低血糖反应需静脉注射葡萄糖来治疗。由于那格列奈的蛋白结合率较高，因此透析不是一个将其从血液中清除的有效方法。

【不良反应】

1．低血糖：与其他抗糖尿病药物一样，服用那格列奈后，可观察到低血糖的症状。

2．其他反应：临床试验发现的其他不良事件，包括胃肠道反应（腹痛、消化不良、腹泻）、头痛以及糖尿病人群可能同时伴发的一些临床症状（如呼吸道感染）等在那格列奈治疗组与安慰剂治疗组中发生的比例相似。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
那格列奈胶囊	化学药	HZ002721
那格列奈片	化学药	HZ002722

HY001434 那可丁

【其他名称】Capval、Codipect、Coscopine、Coscotabs、Detursso、Gnoscopine、乐咳平、Longatin、诺司咳平

【外文名称】Noscapine

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】［*S*－（*R**，*S**）］－6,7－二甲氧基－3－（5,6,7,8－四氢－6－甲基－4－甲氧基－1,3－二氧杂环戊烯［4,5－*g*］－5－异喹啉基）－1（3*H*）－异苯并呋喃酮

【分子式】$C_{22}H_{23}NO_7$

【分子量】413.43

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末或有光泽的棱柱状结晶；无臭。本品在三氯甲烷中易溶，在苯中略溶，在乙醇或乙醚中微溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 174～177℃。

比旋度：取本品，精密称定，加 0.1mol/L 盐酸溶液溶解并制成每 1ml 中约含 20mg 的溶液，依法测定，比旋度为 +42°至 +48°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：镇咳药。

本品系外周性镇咳药，抑制肺牵张反射引起的咳嗽，镇咳作用一般维持 4 小时。无耐受性和依赖性。主要用于刺激性干咳病人。

【药物相互作用】不宜与其他中枢兴奋药同用。

【不良反应】不良反应轻微，可有嗜睡、眩晕、头痛、恶心、过敏性鼻炎、结膜炎，皮疹等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
那可丁片	化学药	HZ002723
那可丁糖浆	化学药	HZ002724
复方甲氧那明胶囊	化学药	HZ001226

HY001435 那拉曲坦

【外文名称】Naratriptan

药物药理信息

【药理毒理】那拉曲坦是一种新型的高选择性 5－羟色胺（5－TH）受体激动剂。其优点是服用后 24 小时内头痛复发率低。主要用于治疗急性偏头痛发作。缺点是起效慢，口服后虽 1 小时即有应答，然达峰时间却长达 4.0 小时，给药 2 小时后疗效不如舒马曲坦。

在血管收缩功能性研究中，那拉曲坦表现出与舒马普坦相似的体外药理作用，但是效力更强。本品对 5 – HT_{1D}受体、5 – HT_{1A}受体、5 – HT_3 受体分别表现出高度的、较低的和弱的亲和力。可以引起狗的基底动脉、中部大脑动脉和隐静脉的收缩，EC_{50} 值分别为 110、68 和 51nmol/L，活性与 5 – HT 相近。它也能抑制狗的经神经传导的隐静脉的收缩，EC_{50} 值为 10nmol/L。那拉曲坦对小鼠主动脉上的 5 – HT_2 受体既没表现出激动作用也没表现出拮抗作用，不能松弛已由 α – 甲基 5 – HT 引起收缩的乳猪的腔静脉（5 – HT_1 受体），也不能引起豚鼠升结肠（5 – HT_4 受体）的收缩。所有这些都提示了它对颅内血管上的 5 – HT_1 受体的选择性。对麻醉的狗进行体内试验，那拉曲坦产生剂量依赖（1 ~ 300μg/kg，iv）的效力持久的颈动脉血流量的降低，同时增加了颈动脉的血管阻力，CD50 值（能产生最大的血管收缩作用的一半需要的剂量）为（19 ± 3）μg/kg。据报道，舒马普坦为（39 ± 8）μg/kg。本品并不增加动脉血压，但与轻微的剂量依赖的心动过缓有关。

【药代动力学】

$t_{1/2}$为 5.0 ~ 6.3 小时，t_{max}为 4.0 小时，口服生物利用度 63% ~ 74%，代谢与排泄主要途径：肾，70%。随机双盲安慰剂对照试验显示，单次口服不同剂量治疗单次偏头痛发作，以 1.0mg 和 2.5mg 的疗效最好。

【不良反应】

本品的耐受性很好，其副作用总发生率在临床试验中与安慰剂相近，低于舒马曲坦。使用那拉曲坦后患者可有口腔、颈部和胸部压迫感、头晕、疲劳、恶心、手脚麻木、发抖、严重者可见心绞痛、心律失常、心肌梗死。

HY001436　那他霉素

【其他名称】 Natacyn、Pimaricin、匹马菌素、匹马霉素、匹霉素、游霉素

【外文名称】 Natamycin

【性状及组成】 本品为白色或类白色结晶性粉末。无臭，无味。熔点 200℃（分解）。见光变色但不失其活性，对热稳定。溶于甲基吡啶，微溶于乙二醇、丙二醇、甲酰胺，难溶于水及甲醇，不溶于高级醇、酯和醚等。

药物药理信息

【药理毒理】 本品是由链霉菌 *Streptomyces natalensis* 产生的四烯类抗菌素。作用同制霉菌素，其作用机制是通过药物分子与真菌细胞膜的固醇部分结合，形成多烯固醇复合物，改变细胞膜的渗透性，使真菌细胞内的基本细胞成分流出，而致细菌死亡。主要具有抗真菌作用。局部用于治疗白念珠菌所致阴道炎、曲霉菌病、滴虫病。还用于培养基灭菌、新抗生素筛选。

【药代动力学】 本品口服吸收很少，皮肤黏膜不吸收。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
那他霉素滴眼剂	化学药	HZ002727

HY001437　纳布啡

【外文名称】 Nalbuphine

药物管理信息

【特殊管理分类】 二类精神药

药物药理信息

【药理毒理】 国食药监安［2007］633 号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为精神药品。

HY001438　纳多洛尔

【其他名称】 Corgard、康格尔、康加尔多、奈丁乐、萘羟心安、羟氢奈心定、Solgol、维多洛尔、心得乐

【外文名称】 Nadolol

【性状及组成】 本品为白色或灰白色无臭晶状粉末。易溶于乙醇、甲醇及丙二醇，稍溶于三氯甲烷，不溶于丙酮、乙醚。

药物药理信息

【药理毒理】 非选择性 β – 受体阻断药。无内在活性和膜稳定性。主要表现为负性心力和负性频率作用，减少心输出量，降低血压和血浆肾素活性，总外周阻力上升。特点在于该药减慢心率显著，对心肌抑制作用较弱，并增加肾血流量。

【药代动力学】 本品口服仅部分吸收，比例约为 30%。口服血浆药物浓度高峰时间为 2 ~ 4 小时，30%与血浆蛋白结合。$t_{1/2}$为 14 ~ 24 小时。分布容积为 2L/kg，不易透过血脑屏障，但可从乳汁排出，乳汁含量约为血浆的 5 倍。在体内不经代谢变化，73%以原形经肾排泄，其余经粪便排出。可经透析排出。

【不良反应】 本品不良反应有恶心、腹泻、便秘、心动过缓、支气管痉挛、皮疹等。

HY001439 纳米炭

【外文名称】Carbon Nanoparticles

【性状及组成】本品经炭黑处理精制而得。

药物药理信息

【药理毒理】本品为淋巴示踪剂，具有淋巴系统趋向性，注射到恶性肿瘤周缘组织中，被巨噬细胞吞噬，迅速进入淋巴管，聚集滞留到淋巴结，使淋巴结染成黑色，实现肿瘤区域引流淋巴结的活体染色。

炭黑致突变试验结果为阴性，对接触炭黑的人群长期观察也无致癌性。

【药代动力学】本品注射到恶性肿瘤周缘组织内后，很快到达肿瘤的区域引流淋巴结，并随肿瘤切除和淋巴结清扫而消除。本品使用后不进入血循环，也无可行的检测手段，故无法了解其全部药代动力学特征。根据文献报告，进入体内的少量微小炭颗粒被巨噬细胞捕获后，在数月内最终通过肺和肠道排泄而消除。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
纳米炭混悬注射液	化学药	HZ0002728

HY001440 钠石灰

【其他名称】碱石灰

【外文名称】Soda Lime

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第6册

【性状及组成】本品为氧化钙与氢氧化钠（或氢氧化钾）的混合物。

本品为加有变色指示剂的粉红色颗粒，吸收二氧化碳后变为淡黄色。

本品在水中能部分溶解，在稀醋酸中几乎完全溶解。

药物药理信息

【药理毒理】用于封闭麻醉时吸收二氧化碳。

HY001441 奈达铂

【外文名称】Nedaplatin

药物理化信息

【化学名】顺－二氨基甘醇酸铂

【分子式】$pTc_2H_8N_2O_3$

【分子量】303.10

【性状及组成】本品为类白色或微黄色疏松块状物或粉末。

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理作用：奈达铂为顺铂类似物。本品进入细胞后，甘醇酸脂基上的醇性氧与铂之间的键断裂，水与铂结合，导致离子型物质（活性物质或水合物）的形成。然后，断裂的甘醇酸脂基配基变得不稳定并被释放，产生多种离子型物质，与DNA结合。

本品以与顺铂相同的方式与DNA结合，并抑制DNA复制，从而产生抗肿瘤活性。另外，已经证实本品在与DNA反应时，所结合的碱基位点与顺铂相同。

2. 毒理研究

（1）重复给药毒性：本品大鼠每周2次共1个月，每天一次连续1个月、每周一次给药共6个月及狗每周一次共6周静脉注射给药的毒理研究结果显示，本品的毒性与顺铂类似，主要毒性靶器官为血液（红细胞、血小板下降）、肾脏、胰腺。

（2）遗传毒性：本品Ames试验阳性，体外（人体淋巴细胞）及体内（小鼠骨髓细胞）染色体畸变试验结果显示本品可引起染色体畸变率明显增高。

（3）生殖毒性：家兔器官形成期静脉注射本品剂量为500μg/kg时有致畸性，对胎仔的无影响剂量为250μg/kg。大鼠给药剂量达540μg/kg时，可引起胎鼠骨化延迟，但对其外形、骨骼系统、发育等功能无明显影响。

【药代动力学】肿瘤患者静脉滴注奈达铂80mg/m^2或100mg/m^2后，用原子吸收光谱分析法直接测定总铂的方法研究本品的体内动态，结果显示：奈达铂单次静脉滴注后，血浆中铂浓度呈双相性减少，$t_{1/2\alpha}$约为0.1～1小时，$t_{1/2\beta}$约为2～13小时，AUC随给药量增大而增大。本品在血浆内主要以游离形式存在，动物试验可见本品在肾脏及膀胱分布较多，组织浓度高于血浆浓度。本品的排泄以尿排泄为主，24小时尿中铂的回收率在40%～69%之间。

【药物相互作用】

1. 本品与其他抗肿瘤药（如烷化剂、抗代谢药、抗肿瘤抗生素等）及放疗并用时，骨髓抑制作用可能增强。

2. 与氨基糖苷类抗生素及盐酸万古霉素合用时，对肾功能和听觉器官的损害可能增加。

【不良反应】本品主要不良反应为骨髓抑制，表现为白细胞、血小板、血色素减少；其他较常见的不良反应包括恶心、呕吐、食欲减退等消化道症状以及肝肾功能异常、耳神经毒性、脱发等。其他不良反应虽发生率较低，但应引起关注。

1. 严重不良反应

(1) 过敏性休克症状（0.1% ~ 5%）：出现过敏性休克症状（潮红、呼吸困难、畏寒、血压下降等），应细心观察，发现异常应立即停药并做适当的处理。

(2) 骨髓抑制（频度不明）：表现为红细胞减少、贫血、白细胞减少、中性粒细胞减少、血小板减少、出血倾向（0.1% ~ 5%），应细心观察血常规，发现异常，应延长给药间隔、减量或停药并进行适当的处理。

(3) 肾功能异常（0.1% ~ 5%）：出现血尿素氮、血肌酐升高，肌酐清除率下降，β_2 球蛋白升高，以及血尿、蛋白尿、少尿、代偿性酸中毒及尿酸升高等，发现异常，对于是否继续给药，应慎重检查。

(4) 阿－斯综合征发作：有报道因使用本品引起阿－斯综合征而死亡的病。

(5) 听觉障碍、听力低下、耳鸣（频度不明）：本品可引起耳神经系统毒性反应，表现为听觉障碍、听力低下、耳鸣。用药期间应进行适当的听力检查并观察患者的状态，发现异常应停药并做适当的处理；治疗前用过其他铂类制剂的、给药前就有听力低下、肾功能低下的患者应特别注意。

(6) 间质性肺炎（频度不明）：对于伴有发热、咳嗽、呼吸困难，胸部X线异常的间质性肺炎患者，应细心观察，发现异常应终止给药，并给予肾上腺皮质激素等药物进行适当处理。

(7) 抗利尿激素分泌异常综合征（频度不明）：表现为低钠血症，低渗透压血症，尿中钠离子排泄增加，伴有高张尿、意识障碍等，发现这些症状应终止给药，并采取限制水分摄取等适当的方法处理。

2. 其他的不良反应频度种类

神经系统（0.1% ~ 5%）：痉挛、头痛、手足发冷等末梢神经功能障碍。肾脏：BUN升高（11.4%）、血清肌酐清除率低下（25.3%）、β_2 小球蛋白升高血尿、蛋白尿、少尿、代偿性酸中毒、尿酸升高、NAC上升。消化系统：恶心、呕吐（74.9%）、食欲减退（59.5%）。腹泻肠梗阻、腹痛、便秘、口腔炎症等。循环系统：心电图异常（心动过速、ST波低下），心肌受损。呼吸系统：呼吸困难。泌尿系统：尿痛、排尿困难。过敏症状：变态反应（湿疹、发红）、发疹等。肝脏：AST升高（11.9%）、ALT升高（12.3%）胆红素升高、ALP上升、LDH升高、血清总蛋白减少、血清白蛋白降低，电解质钠、钾、氯等电解质异常其他如脱发、全身性疲倦、发热、静脉炎、水肿、潮红、疱疹、白细胞增多（一过性）。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用奈达铂	化学药	HZ004904

HY001442　奈非那韦

【外文名称】Nelfinavir

药物药理信息

【药理毒理】本品为HIV蛋白酶抑制剂。

【药代动力学】口服生物利用度20% ~ 80%，血浆半衰期3.5 ~ 5小时，代谢途径被细胞色素酶P450代谢，CYP3A4抑制较利托那韦（ritonavir）轻。

【药物相互作用】能抑制细胞色素P450，主要经由此途径代谢的药物与奈非那韦同时使用会增加不良反应的出现；不能同时应用的药物包括阿司咪唑，特非那定，利福平，咪达唑仑，三唑仑和西沙比利。

【不良反应】主要是腹泻。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
奈非那韦片	化学药	HZ002730

HY001443　奈莫必利

【外文名称】Nemonapride

药物药理信息

【药理毒理】本品具有较强的抗精神病作用，能改善幻觉和妄想等症状，对脱氧麻黄碱和阿扑吗啡引起的刻板行为及运动过度行为有明显抑制，其作用相似于氟哌啶醇，强于氯丙嗪。其作用机制为选择性地抑制脑内 D_2 －多巴胺受体，且此作用极强，而对 α －肾上腺素受体与M－胆碱受体作用极弱，故而其抗胆碱作用与镇静作用弱，不良反应小。

【药代动力学】本品口服易吸收，2 ~ 3小时后即达血药峰浓度血浆 $t_{1/2}$ 为2.5 ~ 4.5小时。肝脏代谢，肾脏排出。

【药物相互作用】本品与乙醇或中枢抑制药有相互增强作用，并用时应注意调整剂量。

【不良反应】

1. 本品常见的不良反应有失眠、焦虑、嗜睡、兴奋、无力、精神抑郁、痉挛发作、头晕、头痛、口干、出汗、尿潴留、便秘、腹泻、皮疹、体重增加或减少，罕见视力模糊。

2. 本品还用引起血压升高或降低、心律不齐、心电图异常，出现以上症状应减少剂量或停药，用相应药物治疗。初期常见白细胞增多、血清肌酸磷酸激酶升高、偶见肾功、肝功异常。

3. 亦可出现锥体外系反应，此时应减少用量。长期用药可引起不可逆的延迟性运动障碍或内分泌紊乱以致月经失调。

HY001444 奈韦拉平

【其他名称】Viramune、维乐命

【外文名称】Nevirapine

药物理化信息

【化学名】11 - 环丙基 - 5,11 - 二氢 - 4 - 甲基 - 6 氢 - 双吡啶 - ［3,2 - *b*: 2,3 - *e*］［1,4］二氮杂䓬 - 6 - 酮

【分子式】$C_{15}H_{14}N_4O$

【分子量】266.30

药物药理信息

【药理毒理】奈韦拉平是 HIV - 1 的非核苷类逆转录酶抑制剂（NNRTI）。奈韦拉平与 HIV - 1 的逆转录酶直接连接并且通过使此酶的催化端破裂来阻断 RNA 依赖和 DNA 依赖的 DNA 聚合酶活性。

在致癌性研究中，奈韦拉平增加小鼠（日剂量达 750mg/kg）和大鼠（日剂量达 35mg/kg）的肝肿瘤的发生率。但是，这些发现很可能与奈韦拉平是一个较强的肝酶诱导剂有关，但不会产生基因毒性。

在以下一系列体内和体外试验基因的毒理分析中，奈韦拉平未显示出基因突变或诱变的活性。这些试验包括：微生物基因突变测定（沙门菌株和大肠埃希杆菌）、哺乳动物细胞基因突变鉴定（CHO/HGPRT）、口服用药后利用中国仓鼠卵巢细胞系细胞进行遗传学测定和小鼠骨髓微核鉴定等方法。在生殖毒性研究中，有数据提示，在雌鼠接受奈韦拉平以曲线下面积为衡量指标剂量达到全身分布时，其生育力受到损害。这一剂量与本药用于人体的推荐剂量相当。

【药代动力学】吸收及生物利用度：成人口服奈韦拉平后快速吸收（>90%）。奈韦拉平的吸收范围（AUC）与禁食情况下相似。奈韦拉平的吸收不受饮食、抗酸药或其他碱性药物的影响（如去羟肌苷）。

分布：奈韦拉平在人体内分布广泛。奈韦拉平易通过胎盘且可进入乳汁。在血浆浓度为 1 ~ 10μg/ml 时，奈韦拉平约 60% 与血浆蛋白结合。奈韦拉平在人体脑脊液（n = 6）浓度为其血浆浓度的 45%（±5%）。

新陈代谢/消除：奈韦拉平通过细胞色素 P450 代谢、产生葡糖苷酸结合物，之后葡萄糖醛酸化的代谢物由尿中排出。肾排泄对奈韦拉平原形产物的消除所起作用很小。

【药物相互作用】

1. 奈韦拉平是肝细胞色素 P450 代谢酶（CYP3A，CYP2B）的诱导剂，其他主要由 CYP3A，CYP2B 代谢的药物在与本药合用时，奈韦拉平可以降低这些药物血浆浓度。因此，如果一个患者正在接受由 CYP3A 或 CYP2B 代谢的药物的一个稳定剂量的治疗，若开始合用本药，前者药物剂量需要调整。

2. 核苷类逆转录酶抑制剂：当奈韦拉平与叠氮胸苷，去羟肌苷或扎西他宾合用时，不需调整这些药物的剂量。从两组以叠氮胸苷治疗为背景治疗的研究中（n = 33），可得到叠氮胸苷的综合数据，其中 HIV - 1 感染的患者单独接受奈韦拉平（一日 400mg）治疗，或奈韦拉平合用去羟肌苷（一日 200 ~ 300mg），或奈韦拉平合用扎西他宾（一日 0.375 ~ 0.75mg）的治疗，试验结果奈韦拉平对叠氮胸苷药 - 时曲线下面积的下降无显著作用，为 13%；对叠氮胸苷 C_{max}上升无显著作用，为 5.8%。叠氮胸苷对奈韦拉平的药动学无影响。另一交叉研究表明奈韦拉平对去羟肌苷（n = 18）或扎西他宾（n = 8）的稳态药代动力学均无影响。

对 25 例 HIV 感染的患者，应用奈韦拉平、奈非那韦（70mg，tid）和斯泰夫丁（30 ~ 40mg，bid）治疗 36 天的临床试验结果显示，斯泰夫丁的 AUC 或 C_{max}无统计学显著变化。另外，对 90 名接受拉米夫定加奈韦拉平和另一组是奈韦拉平加安慰剂治疗的患者进行人群药代动力学研究，结果显示拉米夫定表观清除率和分布容积无改变。这表明奈韦拉平对拉米夫定的清除无影响。

3. 蛋白酶抑制剂：以下试验中，本药用药方法按照 200mg，每日 1 次，共 2 周。之后，200mg，每日 2 次，共 28 天。

（1）沙奎那韦：一项临床试验（31 例）中，HIV 感染的患者服用奈韦拉平和沙奎那韦（硬胶囊 600mg，每日 3 次）。结果表明二者合用导致沙奎那韦 AUC 平均下降 24%（$P = 0.041$），但奈韦拉平血浆浓度无明显变化。由于相互作用，导致沙奎那韦 AUC 下降，可能进一步引起沙奎那韦血浆浓度下降，两者相互作用的临床意义尚不清楚。联合用药不影响奈韦拉平的药代动力学。

（2）利托那韦：当本药与利托那韦合用时，不需调整剂量。临床试验（n = 25）表明，HIV 感染患者同时接受奈韦拉平和利托那韦（600mg，每日 2 次，采用剂量渐增的用药方案）治疗，两者血浆浓度均无明显变化。

（3）茚地那韦：临床试验（n = 25）表明 HIV 感染患者接受奈韦拉平和茚地那韦（800mg，8 小时 1 次）治疗，茚地那韦 AUC 平均下降 28%（$P < 0.01$），而奈韦拉平血浆浓度无明显变化。对于奈韦拉平和茚地那韦合用的潜在相互影响，还没有肯定的临床

结论。奈韦拉平与茚地那韦合用时，当奈韦拉平剂量为200mg，每日2次时，茚地那韦剂量可考虑增加到1000mg，每8小时1次。但是，目前尚无资料显示，两方案的短期或长期抗病毒作用有何不同。

（4）奈非那韦：一项36天的临床试验（n=25）表明，应用本药，奈非那韦（75mg，每日3次）和d4T（30~40mg，每日2次）的HIV感染患者，在合用本药后，奈非那韦的药代动力学参数没有统计学上显著变化（AUC+4%，C_{max}+14%和C_{min}-2%）。与以前的资料相比，奈韦拉平的药物水平无变化。

当本药与任何蛋白酶抑制剂合用时，尚无安全性降低的报道。

4．酮康唑：奈韦拉平200mg，每日2次，和酮康唑400mg，每日1次合用时，有关酮康唑药代动力学参数明显降低（AUC平均下降63%，C_{max}平均下降40%）。同一试验中，与以前的资料相比，酮康唑可使奈韦拉平的血浆水平上升15%~28%。因此，酮康唑和奈韦拉平不应合并用药。奈韦拉平对伊曲康唑的影响尚不清楚。虽然尚无药物相互作用的试验，但从肾脏排泄的抗真菌药物（如氟康唑）可代替酮康唑。

5．CYP同工酶诱导剂：在一个开放性研究中（n=14），本药对利福平的稳态药代动力学参数C_{max}和AUC无显著影响。相反，同以前的资料相比，利福平可显著降低奈韦拉平的AUC（58%）、C_{max}（50%）和C_{min}（68%）。当奈韦拉平和利福平合用时，目前尚无足够的资料对所需剂量调整进行评估。

（1）利福布丁：奈韦拉平200mg，bid，合用利福布丁300mg，qd（如果患者同时接受ZDV或蛋白酶抑制剂治疗，利福布丁150mg，qd），结果显示利福布丁的浓度没有显著变化（AUC平均升高12%，C_{minss}平均下降3%），C_{maxss}显著增高（20%）。活性代谢产物25-*O*-desacetyl-利福布丁的浓度没有显著变化。在同样的研究中，同以前资料相比，利福布丁可使奈韦拉平的系统清除率有明显的增高（9%）。这些变化无重要临床意义。同时服用奈韦拉平和利福布丁是安全的，不需要调整剂量。

（2）不推荐患者同时服用本药和St. John wort或含St. John wort的产品，因为有报告显示St. John wort和其他抗病毒药物之间有相互作用。服用St. John wort的同时服用非核苷逆转录酶抑制剂，包括奈韦拉平，可降低非核苷逆转录酶抑制剂的浓度，可能影响本药的药效而失去抗病毒作用，并可使病毒产生对奈韦拉平或其他非核苷类逆转录酶抑制剂的耐药性。

6．CYP同工酶抑制剂：奈韦拉平和克拉霉素的药物相互作用研究结果表明，药物合用时，克拉霉素的AUC（30%）、C_{max}（21%）和C_{min}（46%）显著降低，而克拉霉素的活性代谢物14-OH克拉霉素的AUC（58%）和C_{max}（62%）显著升高。奈韦拉平的C_{min}（28%）显著升高，AUC（26%）和C_{max}（24%）非显著性升高。这些结果提示当两药合用时，两药的剂量不需调整。

对参加本药临床试验患者的亚人群分析中，接受甲氰米胍（n=13）治疗的患者，奈韦拉平的稳态谷值血浆浓度上升（7%）。

7．口服避孕药：奈韦拉平200mg，bid，与单剂量含有0.035mg乙炔基雌二醇（EE）和1.0mg炔诺酮（Ortho-Novum 1/35）的口服避孕药同时服用时，与以前单独服用奈韦拉平血浆浓度比较，服用28天奈韦拉平后，17a-EE的AUC显著下降（29%）。EE的平均残留期和半衰期显著缩短。炔诺酮的平均AUC显著降低（18%），平均残留期和半衰期没有改变。如果合并应用奈韦拉平，口服避孕药的剂量能够调整到对除避孕以外的适应症治疗（如子宫内膜异位症）。但如果合用含有雌激素/孕酮的口服避孕药，很可能避孕失败。对正在服用奈韦拉平的有可能妊娠的妇女，建议使用其他方式避孕（如药具避孕）。患者口服避孕药用以调节激素水平时，若合服奈韦拉平，应对前者进行监测。

8．其他资料：利用人的肝细胞微粒体的体外研究表明，奈韦拉平羟化代谢产物的形成不受氨苯砜、利福布丁、利福平和三甲氧苄二氨嘧啶/磺胺甲基异噁唑的影响。酮康唑和红霉素可明显抑制奈韦拉平羟化代谢产物的形成，尚无相关的临床试验。

9．当与本药合用时，作为CYP3A和CYP2B6的底物的药物的血浆浓度可下降。基于对美沙酮代谢机制的了解，奈韦拉平可通过增加肝代谢而可能降低美沙酮的血浆浓度。据报道，同时应用本药和美沙酮治疗的患者曾出现戒断综合征。因此，美沙酮维持给药的病人合用本药时，建议仔细观察戒断综合征征象并对美沙酮的剂量进行相应的调整。

【药物过量】尚无已知的解毒药。有报道过量使用奈韦拉平剂量每日800~1800mg长达15天，患者出现水肿、结节性红斑、乏力、发热、头痛、失眠、恶心、浸润性肺炎、皮疹、眩晕、呕吐和体重下降。在停用奈韦拉平后均好转。

【不良反应】

1．成人：除皮疹和肝功异常外，在所有临床试验中与奈韦拉平治疗相关的最常见的不良反应有恶心、疲劳、发热、头痛、嗜睡、呕吐、腹泻、腹痛和肌痛。

上市后情况表明，最严重的药物不良反应是Stevens-Johnson综合征，毒性表皮坏死溶解，重症

肝炎/肝衰竭和过敏反应，其特征为皮疹，伴全身症状，如发热、关节痛、肌痛和淋巴结病变，以及内脏损害，如肝炎、嗜酸细胞增多、粒细胞缺乏症和肾功能损害。初始 8 周的治疗是很关键的阶段，需要进行严密监测。

（1）皮肤和皮下组织：奈韦拉平主要临床毒性是皮疹，在Ⅱ/Ⅲ期对照研究使用联合用药方案的患者中出现与奈韦拉平有关的皮疹的患者占 16%。在这些临床试验中，服用奈韦拉平的患者 35% 出现皮疹，而对照组中服用叠氮胸苷 + 去羟肌苷，或单用叠氮胸苷的患者有 19% 出现皮疹。奈韦拉平治疗组出现严重或危及生命的皮肤反应的发生率为 6.6%，对照组为 1.3%。总计有 7% 的患者因皮疹而停用奈韦拉平。

皮疹通常是轻度或中度的斑丘疹、红斑样皮疹，有或没有瘙痒，分布在躯干、面部或四肢。曾报道有变态反应出现（过敏反应、喉头水肿和荨麻疹）。应用奈韦拉平，出现过严重和危及生命的皮肤反应，包括 Stevens – Johnson 综合征（SJS）和罕见的毒性表皮坏死溶解（TEN）。曾报道有病例因 SJS、TEN 和变态反应而致死。2861 例用奈韦拉平治疗患者出现 SJS 的比率为 0.3%（9/2861）。

皮疹可单独出现或以皮疹伴随全身症状为特征的变态反应，例如发热、关节痛、肌痛和淋巴节病，以及内脏病变，如肝炎、嗜酸细胞增多、粒细胞减少和肾功能损害。

严重皮疹多数在服药初始 6 周内出现。勃林格殷格翰公司与一个国际专家组一起制定了一个皮疹分类图表和相应处理方案如下：轻/中度皮疹（可包括瘙痒）– 可继续用药，不需停药。红斑 – 导入期出现皮疹或前驱症状，剂量不再增加，直至皮疹消失。弥散性红斑或斑丘症样皮疹 – 若奈韦拉平停药超过 7 天，重新用药时以每日 200mg 导入。

荨麻疹 – 处理原则同上，但若停用奈韦拉平，则不再重新用药。

（2）以下情况者应立即并且永久停药：

严重皮疹（广泛红斑样或斑丘症样皮疹、皮疹或湿性脱屑、血管性水肿、类血清病反应、Stevens – Johnson 综合征、毒性表皮坏死溶解）；任何皮疹伴有相关全身症状，如发热 > 39℃、水疱、口腔损害、结膜炎、肝酶升高、面部水肿、肌痛/关节痛、全身不适；任何皮疹伴有相关全身症状和器官功能损害（肝炎、粒细胞缺乏症、嗜酸细胞增多、肾功能障碍）。

上述指导原则自 1994 年起即被用于奈韦拉平临床研究，对患者皮疹处理很有帮助。

（3）肝胆：最常见的实验室化验异常是肝酶升高，包括 ALAT、ASAT、GGT、总胆红素和碱性磷酸酶。无症状的 GGT 升高是最常见的。黄疸病例曾有报道。用奈韦拉平治疗的患者曾报道出现过肝炎、严重或威胁生命的肝毒性和暴发性肝炎。在一大型临床试验中，有 1121 名患者接受平均超过 1 年的奈韦拉平治疗，其发生严重肝脏事件的危险性是 1.2%（安慰剂组为 0.6%）。肝功化验基础值升高是提示发生严重肝脏事件的最佳指征。奈韦拉平治疗初始 8 周是关键阶段，需严密的监测，但这些事件也有可能以后发生。

2. 儿童患者：对 361 例年龄在 3 天至 19 岁的 HIV – 1 感染的患儿进行奈韦拉平的安全性评价。在两组研究中，多数患儿在接受奈韦拉平治疗的同时服用 ZDV 或 ddI，另一组为 ZDV + ddI + 本药。在一个开放试验中，追踪 37 名患儿平均 33.9 月（范围 6.8 月到 5.3 岁，包括长期追踪试验 BI882）。在一个双盲安慰剂对照试验 ACTG245 中，305 例患儿平均年龄 7 岁（范围 10 个月到 19 岁），接受奈韦拉平等药联合治疗至少 48 周，剂量为 120mg/m^2，一日 1 次，共 2 周，之后为 120mg/m^2，每日 2 次。除粒细胞减少在儿童中更为常见外，儿童患者与奈韦拉平有关最常见的不良反应报道与成人中观察到的一致。有 2 例用奈韦拉平治疗的患儿发生 Stevens – Johnson 综合征或 Stevens – Johnson /毒性表皮坏死溶解综合征，在停用奈韦拉平后，两患儿均康复。

预防垂直传播：基于 HIVNET 012 临床试验，奈韦拉平组和齐多夫定组任何原因引起的母亲的严重不良反应发生率是相似的（4.7% 及 4.4%）。母亲的临床或实验室异常发生率在两组是相似的（齐多夫定组 82.2%，奈韦拉平组 80.7% 至少有一次临床或实验室异常）。皮疹的发生率齐多夫定组和奈韦拉平组均为 2.9%。任何原因引起的婴儿的严重不良反应发生率在两组是接近的（齐多夫定组为 19.8%，奈韦拉平组为 20.5%）。38 例婴儿（占总数 6.8%）死亡（齐多夫定组 22 例占 7.9%，奈韦拉平组 16 例，占 5.7%）。死亡最常见的原因是肺炎，胃肠炎，腹泻，脱水和败血症。斑丘疹发生率齐多夫定组为 1.3%，奈韦拉平组为 1.6%。无母亲和婴儿发生严重的皮疹病例。

接受奈韦拉平治疗的患者可能出现的不良反应总结如下：皮疹（包括 SJS/TEN）；以皮疹伴随全身症状为特征的过敏反应，例如发热、关节痛、肌痛和淋巴结病变，另有以下一项或多项症状被报道过：肝炎、嗜酸细胞增多、粒细胞减少、肾功能损害和其他内脏疾病；肝功异常（ASAT，ALAT，GGT，总胆红素，碱性磷酸酶）；黄疸；肝炎；恶心；乏力；

发热；头痛；嗜睡；呕吐；腹泻；腹痛；肌痛；粒细胞减少症（儿童）；变态反应（过敏反应、喉头水肿，荨麻疹）。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
奈韦拉平胶囊	化学药	HZ002731
奈韦拉平片	化学药	HZ002732

HY001445　萘丁美酮

【外文名称】Nabumetone

药物理化信息

【化学名】4－（6－甲氧基－2－萘基）－2－丁酮

【分子式】$C_{15}H_{16}O_2$

【分子量】228.29

药物药理信息

【药理毒理】本品为一种非酸性非甾体抗炎药，属前体药物，在肝脏内被迅速代谢为6－甲氧基－2－萘乙酸（6－MNA）而起解热、镇痛、抗炎作用。

1．抗炎镇痛解热的作用与萘丁美酮的活性代谢产物抑制了炎症组织中的前列腺素合成有关。

2．对胃黏膜影响小：本品是一种非酸性、非离子性前体药物，在吸收过程中对胃黏膜无明显的局部直接影响；同时本品对胃黏膜生理性环氧合酶的抑制作用较小。因此本品引起的胃肠黏膜糜烂和出血的发生率较低。

3．对出血和凝血无影响：本品对健康志愿者的血标本，在体外进行诱导的血小板聚集作用无影响。对出血时间、凝血试验均无显著改变。

【药代动力学】本品口服后在十二指肠被吸收，经肝脏转化为主要活性代谢物6－MNA，口服萘丁美酮1g后，约3.5%转化6－MNA，50%转化为其他代谢物随后从尿中排泄。6－MNA的血浆蛋白结合率约为99%，表观分布容积约为7.5L，6－MNA体内分布广泛，主要分布在肝、肺、心和肠道，易于扩散在滑膜组织、滑液、纤维囊组织和各种炎性渗出物中，它可进入乳汁和胎盘。6－MNA的消除半衰期在青年人约为24小时，在老年人约为30小时。6－MNA经肝脏转化为非活性产物，80%从尿中排泄，10%从粪便中排泄。

【药物相互作用】

1．和氢氧化铝凝胶、阿司匹林或对乙酰氨基酚并用不影响本品的吸收率。但通常不主张同时用两种或多种非甾体抗炎药。

2．在健康志愿者中本品与抗凝剂华法林之间无相互作用。但尚无在病人中合并应用这两种药物资料。

3．本品与乙酰类抗惊厥药及磺脲类降血糖药并用时应适当减少剂量。

【药物过量】当过量出现中毒症状时，及时洗胃或催吐，给予60g以上活性炭口服，以吸附消化道内残存药物，并给予适当的对症和支持疗法。

【不良反应】

1．胃肠道：恶心、呕吐、消化不良、腹泻、腹痛和便秘约1%～3%。上消化道出血约0.7%。用本品的病例中，溃疡发生率在短疗程（6周～6个月）组和在长疗程（8年）组分别为0.1%和0.95%。每日口服萘丁美酮2g的腹泻发生率增加。

2．神经系统：表现有头痛、头晕、耳鸣、多汗、失眠、嗜睡、紧张和多梦，发生率小于1.5%。

3．皮肤：皮疹和瘙痒约2.1%，水肿约1.1%。

4．少见或偶见的不良反应有黄疸、肝功能异常、焦虑、抑郁、感觉异常、震颤、眩晕、大疱性皮疹、荨麻疹、呼吸困难、哮喘、过敏性肺炎、蛋白尿、血尿及血管神经性水肿等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
萘丁美酮分散片	化学药	HZ002733
萘丁美酮干混悬剂	化学药	HZ002734
萘丁美酮胶囊	化学药	HZ002735
萘丁美酮颗粒	化学药	HZ002736
萘丁美酮片	化学药	HZ002737

HY001446　萘啶酸

【其他名称】Mictral、Nalidixinic acid、Negram

【外文名称】Nalidixic Acid

药物理化信息

【化学名】7－甲基－1－乙基－4－氧代－1,4－二氢－1,8－萘啶－3－羧酸

【分子式】$C_{12}H_{12}N_2O_3$

【分子量】232.24

【性状及组成】本品为淡黄色结晶性粉末；几乎无臭，味微苦。

本品在三氯甲烷中溶解，在乙醇中微溶，在乙醚中极微溶解，在水中几乎不溶；在氢氧化钠或碳酸钠溶液中溶解。熔点：本品的熔点为226～231℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为第一代喹诺酮类抗菌药，对大肠埃希菌、克雷伯菌属、变形杆菌属、志贺菌属、

沙门菌属、肠杆菌属及流感嗜血杆菌的部分菌株具抗菌活性，对淋病奈瑟菌亦具抗菌活性，但对假单胞菌属、不动杆菌属和葡萄球菌属等革兰阳性球菌均无抗菌活性。本品为杀菌剂，尿液 pH 变化对其作用无影响。

【药代动力学】口服后自胃肠道迅速吸收，部分在肝脏代谢成为具抗菌活性的与萘啶酸相仿的羟化萘啶酸并经肾脏快速排泄。本品以原型及代谢物经尿排泄。其他代谢物包括与萘啶酸、羟化萘啶酸结合的葡萄糖醛酸及二羧酸衍生物。羟化萘啶酸占血液中生物学活性药物的 30%，尿液中的 85%。口服 1g 后 2 小时在血浆中的峰浓度为 20～50mg/L，血消除半衰期约 1～2.5 小时。萘啶酸的血浆蛋白结合率为 93%，羟化萘啶酸的血浆蛋白结合率为 63%。给药后 3～4 小时尿液中的峰浓度为 150～200mg/L，$t_{1/2}$约 6 小时。本品约 4%经粪便排泄，也可从乳汁中分泌。本品可透过胎盘屏障。

【药物相互作用】

1. 本品与茶碱类合用时可导致后者血药浓度升高，出现茶碱的不良反应。故合用时应监测茶碱类血药浓度并调整给药剂量。

2. 本品干扰咖啡因的代谢，可导致咖啡因清除减少，血浆 $t_{1/2\beta}$延长。

3. 本品与抗凝药华法林合用时可增强后者的抗凝作用，合用时应严密监测患者的凝血酶原时间。

4. 本品不宜与呋喃妥因合用，两者相互拮抗。

5. 多种维生素，或其他含铁、锌离子制剂及含铝或镁的制酸药可减少本品的口服吸收，导致尿液浓度减低，不得同时服用，不能避免时与服本品间隔至少 2 小时。

6. 与环孢素合用，可使其血药浓度升高，必须监测环孢素血浓度，并调整剂量。

7. 与美法仑合用时会增加胃肠道毒性。

【药物过量】过量服用本品可能会发生精神异常、惊厥、颅内压增高、代谢性酸中毒、恶心、呕吐及昏睡。由于药物快速排泄，反应持续时间较短（2～3 小时），如早期发现药物过量，应进行催吐或洗胃促使胃排空，如药物已经吸收可增加补液量加速排泄，仔细观察病情变化，予以对症处理及支持疗法。

【不良反应】

1. 胃肠道反应：恶心、呕吐、腹泻、腹痛。

2. 中枢神经系统反应：嗜睡、无力、头痛、头昏及眩晕。

3. 过敏反应：皮疹、瘙痒、荨麻疹、血管性水肿、嗜酸粒细胞增多、关节痛伴关节强直及肿胀等过敏样反应。直接暴露于阳光可发生光敏反应。

4. 其他：罕见胆汁淤积、感觉异常、代谢性酸中毒、血小板减少、粒细胞减少或溶血性贫血。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
萘啶酸片	化学药	HZ002738

HY001447 β－萘酚

【外文名称】β－Naphthol

【分子式】$C_{10}H_8O$

【分子量】144.17

【性状及组成】本品白色有光泽的碎薄片或白色粉末。

本品不溶于水，易溶于乙醇、乙醚、三氯甲烷、甘油及碱溶液。

熔点：本品的熔点为 123～124℃。

药物药理信息

【药理毒理】有防腐、止痒的作用。

【药物过量】对眼睛、皮肤、黏膜有强烈刺激作用。可引起出血性肾炎。误服后，能引起呕吐、腹泻、腹痛、痉挛、贫血、虚脱。还可引起溶血性贫血。

【不良反应】萘酚与局部皮肤接触可引起脱皮，甚至产生永久性色素沉着。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方五倍子水杨酸搽剂	化学药	HZ001432

HY001448 萘酚平

【其他名称】降脂萘、萘苯丁酸、纳芬诺平

【外文名称】Nafenopin

药物药理信息

【药理毒理】为氯贝丁酯的类似药物，降血脂作用的机制并未完全明了，可能涉及抑制肝脏胆固醇合成，改变肝脏甘油三酯合成，增加固醇类分泌并从粪便中排出，以及增加血循环中甘油三酯（极低密度脂蛋白）的清除；抗尿崩症的作用来自本品刺激垂体后叶释放出抗利尿素。由于本品的不良反应相对较多，其应用已被其他更新的氯贝丁酸衍生物所取代。

【不良反应】恶心，呕吐，食欲减退，转氨酶升高，性功能障碍（或性欲下降），皮疹，轻度或暂时性粒细胞减少，个别病例出现心律失常。

HY001449　萘夫西林钠

【其他名称】乙氧萘青霉素

【外文名称】Nafcillin Sodium

药物理化信息

【化学名】（2*S*，5*R*）－3,3－二甲基－6－（2－乙氧基－1－萘基）－7－氧化－4－硫杂－1－氮杂双环［3.2.0］庚烷－2－甲酸钠盐一水合物

【分子式】$C_{21}H_{21}O_5N_2SNa \cdot H_2O$

【分子量】454.49

药物药理信息

【药理毒理】本品适用于青霉素耐药的葡萄球菌感染及其他青霉素敏感的细菌感染。

【药物相互作用】

1．本品与氨基糖苷类、去甲肾上腺素、间羟胺、苯巴比妥、维生素B族、维生素C等药物存在配伍禁忌，不宜同瓶滴注。

2．丙磺舒可减少乙氧萘青霉素肾小管分泌，延长本品的血清半衰期。

3．阿司匹林、磺胺药减少本品在胃肠道中吸收，并可抑制本品对血清蛋白的结合，提高本品的游离血药浓度。

【药物过量】药物过量主要表现是中枢神经系统不良反应，应及时停药并予以对症、支持治疗。血液透析不能清除乙氧萘西林。

【不良反应】本品毒性很低，少数可见皮疹、药物热等过敏反应；偶有呕吐、腹泻等胃肠道反应，但不影响继续治疗；极个别出现转氨酶升高，停药后可消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
萘夫西林钠胶囊	化学药	HZ002739
注射用萘夫西林钠	化学药	HZ004905

HY001450　萘磺酸右丙氧芬

【其他名称】Dextropropoxyphene

【外文名称】Propoxyphene Napsylate

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第39册

药物理化信息

【化学名】（1*S*，2*R*）－1－苄基－3－二甲氨基－2－甲基－1－苯丙基酯萘－2－磺酸盐一水合物

【分子式】$C_{22}H_{29}NO_2 \cdot C_{10}H_8O_3S \cdot H_2O$

【分子量】565.75

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶或结晶性粉末；无臭，味苦。

本品在甲醇或三氯甲烷中易溶，在乙醇或丙酮中溶解，在水中极微溶解。

熔点：本品经105℃干燥3小时后，熔点为158～165℃，熔距不得过4℃。

比旋度：取本品，精密称定，加乙醇溶解并定量稀释制成每1ml中约含50mg的溶液，依法测定，比旋度为＋26°～＋31°。

药物药理信息

【药理毒理】镇痛药。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方丙氧氨酚片	化学药	HZ001097

HY001451　萘磺酸左丙氧芬

【其他名称】Conltatuss、挪尔非、左旋丙氧芬、左旋扑嗽芬

【外文名称】Levopropoxyphene

药物药理信息

【药理毒理】本品为非成瘾性中枢镇咳药，其作用约为可待因的1/5，无镇痛和抑制呼吸作用。

【不良反应】偶有恶心、头痛头昏、倦睡、腹胀、咳痰困难、胸闷等，一般不需要停药，1～2天可自行缓解。

HY001452　萘哌地尔

【外文名称】Naftopidil

药物理化信息

【化学名】（±）1－［4－（2－甲氧苯基）哌嗪基］－3－（1－萘甲氧基）－2－丙醇

【分子式】$C_{24}H_{28}N_2O_3$

【分子量】392.50

【性状及组成】本品为白色晶体性粉末，不溶于水，其辛醇、水分的分配系数为75，具有中度亲脂性。

熔点：125～129℃。

药物药理信息

【药理毒理】

1．萘哌地尔为选择性的α_1－受体拮抗剂，能够抑制α_1受体引起的血压上升，并兼有钙离子拮抗作用，药效学试验表明，本品对多种高血压动物模型

有降压作用，降压持续时间长，降压时不引起反射性心动过速，多次口服给药未见明显的首剂效应和耐药现象。心脏血流动力学试验结果显示，本品可降低麻醉开胸犬总外周阻力，扩张外周血管，对心输出量无明显影响。本品还能够缓解分布于前列腺及尿道中的交感神经的紧张程度，降低尿道内压，改善前列腺肥大症引起的排尿困难。

2．毒理研究

（1）重复给药毒性：大鼠和 Beagle 犬连续 12 个月口服给予本品，日剂量达 100mg/kg（按体表面积折算，分别约相当于监床最大推荐剂量的 13 和 43 倍）以上时，犬出现震颤、腹卧或眼睑下垂，大鼠可见体重增长减慢、饮水量、摄食量减少及血液学改变，无毒性影响剂量为 25mg/kg。

（2）遗传毒性：本品 Ames 试验、CHL 细胞染色体畸变试验和啮齿动物微核试验结果均为阴性。

（3）生殖毒性：本品在大鼠器官形成期经口给药，可见母鼠及仔鼠体重增长受抑制，提示本品有抑制胎仔发育的作用，但未见致畸性和其他生殖毒性。无毒性影响日剂量为 40mg/kg（按体表面积折算，约相当于临床推荐最大剂量的 5 倍）。

【药代动力学】 健康成人空腹分别单次口服本品 25mg、50mg 和 100mg 后，t_{max} 分别为 0.45 ± 0.21、0.75 ± 0.71、0.65 ± 0.22 小时，C_{max} 分别为 39.3 ± 10.3、70.1 ± 32.9、134.8 ± 55.8mg/ml，半衰期分别为 15.2 ± 4.7、10.3 ± 4.1、20.1 ± 13.7 小时。饭后服用本品一次 50mg，一日 2 次，服药 4 次后血药浓度达稳态。健康成人单次服用 25、50、100mg 本品后，24 小时内尿中累计原形药的排泄率小于 0.01%。主要代谢产物为葡萄糖醛酸结合物及甲氧苯基羟化物。健康成人空腹及餐后单次服用本品 50mg，t_{max} 分别为 0.75 小时和 2.20 小时，餐后血清中药物浓度－时间曲线下面积稍增加，峰浓度及消除相半衰期均未见变化，提示食物对本品的吸收影响较小。健康成人空腹时单次口服本品 100mg，血清蛋白结合率为 98.5%。

【药物相互作用】 本品与利尿剂和降压药合用后具有协同降压作用，应注意血压的变化。血压过低时，须采取减量或停药等措施。

【药物过量】 目前尚无过量服用本品的报道。假如服药过量，应采取对症治疗。

【不良反应】 不良反应较少见，包括头晕，头痛，心悸、上腹不适等，程度轻，持续时间短。继续治疗多可自行消失。偶有病人出现血 ALT 轻度升高，停药后可恢复正常。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
萘哌地尔分散片	化学药	HZ002742
萘哌地尔胶囊	化学药	HZ002743
萘哌地尔片	化学药	HZ002744

HY001453 萘普生

【其他名称】 Anapro、Naprosyn

【外文名称】 Naproxen

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（+）－α－甲基－6－甲氧基－2－萘乙酸

【分子式】 $C_{14}H_{14}O_3$

【分子量】 230.26

【性状及组成】 本品为白色或类白色结晶性粉末；无臭或几乎无臭。本品在甲醇、乙醇或三氯甲烷中溶解，在乙醚中略溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 153～158℃。

比旋度：取本品，精密称定，加氯仿溶解并定量稀释制成每 1ml 中含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为＋63.0°至＋68.5°。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：解热镇痛抗炎药。

本品为非甾体抗炎药，其镇痛、抗炎、解热作用，通过抑制前列腺素合成而起作用。

急性毒性试验结果：大鼠经口 LD_{50}为 534mg/kg，腹腔注射 LD_{50}为 575mg/kg；小鼠经口 LD_{50}为 1234mg/kg，腹腔注射 LD_{50}为 435mg/kg。

【药代动力学】 口服后吸收迅速而完全，口服后 2～4 小时血药浓度达峰值。与食物、含镁和铝物质同服吸收率降低，与碳酸氢钠同服吸收加快。血浆蛋白结合率高于 99%。$t_{1/2}$一般为 13 小时。在肝内代谢，经肾脏排泄，约有 95%以原形及其结合物随尿排出。

直肠给药吸收迅速，血浆蛋白结合率高于 99%。$t_{1/2}$一般为 13 小时。在肝内代谢，经肾脏排泄，约有 95%以原形及其结合物随尿排出。

缓释胶囊口服后缓慢吸收，血药浓度变化较平稳，99%以上与血浆蛋白结合，表观分布容积为 0.16L/kg。

【药物相互作用】

1．饮酒或与其他非甾体抗炎药同用时，胃肠道的不良反应增多，并有溃疡发生的危险。

2. 与肝素及双香豆素等抗凝药同用，出血时间延长．可出现出血倾向，并有导致胃肠道溃疡的可能。

3. 本品可降低呋塞米的排钠和降压作用。

4. 本品可抑制锂随尿排泄，使锂的血药浓度升高。

5. 与丙磺舒同用时，本品的血药浓度升高，$t_{1/2}$延长．可增加疗效，但毒性反应也相应加大。

【药物过量】超量中毒时应予以紧急处理，包括催吐或洗胃，口服活性炭及抗酸药，给予对症及支持疗法，并合理使用利尿药。

【不良反应】

1. 皮肤瘙痒、呼吸短促、呼吸困难、哮喘、耳鸣、下肢水肿、胃烧灼感、消化不良、胃痛或不适、便秘、头晕、嗜睡、头痛、恶心及呕吐等。

2. 视力模糊或视觉障碍、听力减退、腹泻、口腔刺激或痛感、心慌及多汗等。

3. 胃肠出血、肾脏损害（过敏性肾炎、肾病、肾乳头坏死及肾功能衰竭等）、荨麻疹、过敏性皮疹、精神抑郁、肌肉无力、出血或粒细胞减少及肝功损害等较少见。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方萘普生栓	化学药	HZ001325
萘普待因片	化学药	HZ002746
萘普生肠溶微丸胶囊	化学药	HZ002747
萘普生分散片	化学药	HZ002748
萘普生缓释胶囊	化学药	HZ002749
萘普生缓释片	化学药	HZ002750
萘普生胶囊	化学药	HZ002751
萘普生颗粒	化学药	HZ002752
萘普生口服混悬液	化学药	HZ002753
萘普生片	化学药	HZ002759
萘普生散	化学药	HZ002760
萘普生栓	化学药	HZ002761
萘普生注射液	化学药	HZ002762

HY001454　萘普生钠

【外文名称】Naproxen Sodium

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（+）α－甲基－6－甲氧基－2－萘乙酸钠盐

【分子式】$C_{14}H_{14}NaO_3$

【分子量】252.25

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末；无臭；微有引湿性。

本品在水中易溶，在甲醇中溶解，在乙醇中略溶，在丙酮中极微溶解，在三氯甲烷或甲苯中几乎不溶。

比旋度：取本品 0.5g，加水 6ml，滴加 1mol/L 盐酸溶液 2.4ml，边滴加边振摇，析出沉淀后，沉淀用水洗涤至中性，105℃干燥至恒重，精密称定，加三氯甲烷制成每 1ml 中含 10mg 的溶液。依法测定，比旋度为 +63°至 +69°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：解热镇痛抗炎药。

本品为非甾体抗炎药，其镇痛、抗炎、解热作用，通过抑制前列腺素合成而起作用。

萘普生具有剂量依赖性的抗炎镇痛和解热作用。抗炎作用强度约为等剂量保泰松的 11 倍，镇痛、解热作用是阿司匹林的 7 倍和 22 倍。抗炎、镇痛、解热作用相当于吲哚美辛。

作用机制为萘普生通过抑制 COX 活性，从而抑制 PG 合成而产生作用，但对 COX_2 的选择性抑制作用更强，故其抗炎作用强，而胃肠道不良反应较小。

【药代动力学】本品口服后迅速在胃肠道吸收，食物可降低其吸收。给药后 1～2 小时血药浓度达峰值。本品 99%以上都与血浆蛋白结合，表观分布容积为 0.16L/kg。代谢主要在肝脏，95%以原形药和代谢产物由尿中排出。

萘普生游离酸和钠盐的应用等效剂量为 1∶1.1。口服后均易自胃肠道吸收，且完全，但其钠盐吸收速度更快，服药 1 小时后达血药峰浓度，游离酸则需 2 小时。胃内容物可延长其吸收时间，但不影响其吸收率。血浆蛋白的结合率高（＞99.5%）。可分布于全身组织，滑膜液中达有效浓度，并可透过胎盘，进入胎儿体内。经肝脏代谢，肾脏排泄，排泄物中大部分为代谢产物，少量原形。约有 3%自粪便排出，1%乳汁分泌。血浆 $t_{1/2}$为 13 小时。本品亦可直肠给药，但吸收速度比口服慢。

静脉注射后 15 分钟血浆浓度达到峰值，半衰期为 12～14 小时。在体内达到治疗浓度时，有 99%萘普生与血浆蛋白结合，95%的本品以萘普生或代谢物 6－氧－去甲基萘普生以及它们的结合物从尿中排出。可穿过胎盘，并从乳汁排出。不影响各种酶的代谢，在体内无积蓄作用。

【药物相互作用】

1. 与其他非甾体抗炎药同用时，胃肠道的不良

反应增多，并有溃疡发生的危险。

2. 与肝素及双香豆素等抗凝药同用，出血时间延长，可出现出血倾向，并有导致胃肠道溃疡的可能。

3. 本品可降低呋塞米的排钠和降压作用。

4. 本品可抑制锂随尿排泄，使锂的血药浓度升高。

5. 与丙磺舒同用时，本品的血药浓度升高，$t_{1/2}$延长，可增加疗效，但毒性反应也相应加大。

6. 与阿司匹林或其他水杨酸制剂同用时，对症状缓解并无增效，反而增加胃肠道不良反应。

【药物过量】超量中毒时应予以紧急处理，包括催吐或洗胃，口服活性炭及抗酸药，给予对症及支持疗法，并合理使用利尿药。

【不良反应】

1. 皮肤瘙痒、呼吸短促、呼吸困难、哮喘、耳鸣、下肢水肿、胃烧灼感、消化不良、胃痛或不适、便秘、头晕、嗜睡、头痛、恶心及呕吐等。

2. 视力模糊或视觉障碍、听力减退、腹泻、口腔刺激或痛感、心慌及多汗等。

3. 胃肠出血、肾脏损害（过敏性肾炎、肾病、肾乳头坏死及肾功能衰竭等、荨麻疹、过敏性皮疹、精神抑郁、肌肉无力、出血或粒细胞减少及肝功损害等较少见。

4. 注射部位可能有烧灼感。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
萘普生钠胶囊	化学药	HZ002754
萘普生钠颗粒	化学药	HZ002755
萘普生钠片	化学药	HZ002756
萘普生钠伪麻黄碱缓释片	化学药	HZ002757
萘普生钠注射液	化学药	HZ002758
注射用萘普生钠	化学药	HZ004906

HY001455 α－萘乙酸

【外文名称】α－Naphthylacetic Acid

药物药理信息

【药理毒理】α－萘乙酸为一有机弱酸，有极强的抗炎作用，能有效消除胆道的炎性水肿，保持胆道通畅。

【药代动力学】据资料报道，狗口服α－萘乙酸200mg/kg，用药180分钟达血药浓度峰值，持续220～240分钟。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
托尼萘酸片	化学药	HZ003494

HY001456 脑蛋白水解物

【外文名称】Cerebroprotein Hydrolysate

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第16册

【性状及组成】本品为猪脑组织提取、分离、精制而得的制剂。内含约16种游离氨基酸，并含少量肽。

药物药理信息

【药理毒理】本品为一种大脑所特有的肽能神经营养药物。能以多种方式作用于中枢神经，调节和改善神经元的代谢，促进突触的形成，诱导神经元的分化，并进一步保护神经细胞免受各种缺血和神经毒素的损害。本品可通过血脑屏障，促进脑内蛋白质的合成，影响呼吸链，具有抗缺氧的保护能力，改善脑内能量代谢。激活腺苷酸环化酶和催化其他激素系统。提供神经递质、肽类激素及辅酶前体。

【药代动力学】本品可透过血脑屏障进入神经细胞，氨基酸在脑内迅速代谢，$t_{1/2}$由数秒至数小时。

【药物相互作用】

1. 蛋白水解物注射液不能与氨基酸注射液在同一瓶中输注，当同时应用氨基酸输液时，应注意可能出现氨基酸不平衡。

2. 同用抗抑郁药治疗可发生不良的相互作用，导致不适当的精神紧张。此时建议减少抗抑郁药剂量。

【不良反应】本品一般耐受性良好。体内及体外实验、毒理实验均显示无任何潜在的致畸、致敏或致癌作用。注射过快会有轻度热感，极少数病例会出现寒战、轻度发热，且多与病人体质有关。迄今尚未发现用药后持久的不良反应或危及生命的病例。大剂量使用时，注射过快少数病例会引起发热。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方吡拉西坦脑蛋白水解物片	化学药	HZ001092
复方脑蛋白水解物片	化学药	HZ001326
脑蛋白水解物氯化钠注射液	化学药	HZ002764
脑蛋白水解物片	化学药	HZ002765
脑蛋白水解物注射液	化学药	HZ002766
曲克芦丁脑蛋白水解物注射液	化学药	HZ003030
注射用脑蛋白水解物	化学药	HZ004907
注射用曲克芦丁脑蛋白水解物	化学药	HZ004939

HY001457　尼尔雌醇

【其他名称】CEE3、E3 醚、Ethinylestriol－3－cyclopentyl ether、炔雌三醇环戊醚、羟炔雌醚、Weinian、维尼安戊炔雌三醇、戊炔雌醇

【外文名称】Nilestriol

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】3－（环戊基氧基）－19－去甲－17－孕甾－1，3，5（10）－三烯－20－炔－16α，17α－二醇

【分子式】$C_{25}H_{32}O_3$

【分子量】380.53

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末。本品在三氯甲烷中易溶，在丙酮中溶解，在乙醇中略溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 160～165℃。

比旋度：取本品，精密称定，加无水乙醇制成每 1ml 中含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为 +2° 至 +10°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：雌激素类药。

本品为雌三醇的衍生物。雌三醇为雌二醇的代谢产物，其药理作用与雌二醇相似，但生物活性低，故对子宫内膜的增生作用也较弱，适用于围绝经期妇女的雌激素替代疗法。因其 3 位上引入环戊醚后增加了亲脂性，有利于肠道吸收并储存在脂肪组织中，以后缓慢释放而起长效作用。其 17 位引入乙炔基而增强雌激素活性。

【药代动力学】口服易吸收，在体内多功能氧化酶作用下，去 3 位上的环戊醚基团形成炔雌三醇，以后在酶作用下去掉 17 位乙炔基而形成雌三醇，活性即减低。雌三醇的半衰期为 20 小时左右，主要经肾脏排泄，以原形，炔雌三醇和雌三醇 3 种形式由尿中排泄。

【不良反应】

1. 轻度胃肠道反应，表现为恶心，呕吐，腹胀，头痛，头晕。

2. 突破性出血。

3. 乳房胀痛，白带增多。

4. 高血压。

5. 偶有肝功能损害。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
尼尔雌醇片	化学药	HZ002768

HY001458　尼二氢可待因

【外文名称】Nicodicodine

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633 号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY001459　尼伐地平

【其他名称】Escor、NIVADIL

【外文名称】Nilvaldipine

【性状及组成】黄色结晶性粉末；无臭。易溶于丙酮、三氯甲烷、甲醇，不溶于水。

药物药理信息

【药理毒理】为二氢吡啶类钙拮抗药，其与 Ca^{2+} 通道特异部位的结合力比硝苯地平强 10 倍，作用持续时间亦较之长 2～3 倍。血管扩张作用选择性强，对心脏的作用较小，故降低血压作用明显。此外，尚有抗心绞痛及抗动脉粥样硬化作用。可用于防治心绞痛、高血压、脑血管痉挛及缺血性心脏病。

【药代动力学】口服可吸收，血药浓度峰时间为 2 小时，$t_{1/2}$约 10 小时。

【不良反应】常见的不良反应有面部潮红及发热感，心悸。偶见氨基转移酶升高、头痛、眩晕、腹部不适及过敏反应。

HY001460　尼可待因

【外文名称】Nicocodine

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633 号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY001461　尼可地尔

【其他名称】硝酸乙氧烟酸胺、硝烟酯、烟浪丁、烟酰胺硝酸酯

【外文名称】Nicorandil

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 2 册

药物理化信息

【化学名】异－烟酰胺基硝酸乙酯

【分子式】$C_8H_9N_3O_4$

【分子量】211.20

药物药理信息

【药理毒理】本品为抗心绞痛药。本品属硝酸酯类化合物，具有阻止细胞内钙离子游离，增加细胞膜对钾离子的通透性，扩张冠状血管，持续性增加冠状动脉血流量，抑制冠状动脉痉挛的作用，在扩张冠状血管时，并不影响血压、心率、心肌收缩力以及心肌耗氧量。本品还具有抑制血小板聚集防止血栓形成的作用。

【药代动力学】本品口服吸收快而完全，生物利用度为75%，服药后0.5～1小时血药浓度达峰值，半衰期约为1小时。主要分布在肝、心、肾、肾上腺及血液中。在体内经水解脱去硝基，代谢产物药理活性很小，主要从尿中排泄。

【药物过量】一般一日用量不宜超过60mg，大剂量用药易引起血压的过度降低。

【不良反应】

1．常见有头痛、头晕、耳鸣、失眠等反应，服用阿司匹林可减轻症状，否则应停药；出现皮疹等过敏反应时应停药。

2．胃肠症状：腹痛、腹泻、食欲减退、消化不良、恶心、呕吐、便秘等，偶见口角炎，可有氨基转移酶升高。

3．心血管系统：心悸、乏力、颜面潮红、下肢水肿，还可引起反射性心率加快，严重低血压等反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
尼可地尔片	化学药	HZ0002769

HY001462 尼可吗啡

【外文名称】Nicomorphine

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY001463 尼可刹米

【其他名称】Carbamidal、Cardiamine、Coramine、Cordiamid、Corediol、Cormed、Corvofon、Eucoran、二乙烟酰胺、可拉明、Nikardin、尼可拉明、Pinacoryl、Stimulin、Tonocarble、Ventramine、烟酰乙胺

【外文名称】Nikethamide

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】*N*,*N*－二乙基烟酰胺

【分子式】$C_{10}H_{14}N_2O$

【分子量】178.23

【性状及组成】本品为无色或淡黄色的澄清油状液体，放置冷处，即成结晶；有轻微的特臭，味苦，有引湿性。本品能与水、乙醇、三氯甲烷或乙醚任意混合。

相对密度：本品的相对密度在25℃时为1.058～1.066。

凝点：本品的凝点为22～24℃。

折光率：本品的折光率在25℃时为1.522～1.524。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：中枢兴奋药。

本品选择性兴奋延髓呼吸中枢，也可作用于颈动脉体和主动脉体化学感受器反射性地兴奋呼吸中枢，并提高呼吸中枢对二氧化碳的敏感性，使呼吸加深加快，对血管运动中枢有微弱兴奋作用，剂量过大可引起惊厥。

【药代动力学】口服吸收好，起效快，作用时间短暂，一次静脉注射只能维持作用5～10分钟，进入体内后迅速分布至全身，体内代谢为烟酰胺，然后再被甲基化成为N－甲基烟酰胺经尿排出。

【药物相互作用】与其他中枢兴奋药合用，有协同作用，可引起惊厥。

【药物过量】

1．中毒症状：兴奋不安、精神错乱、恶心、呕吐、头痛、出汗、抽搐、呼吸急促，同时可出现血压升高、心悸、心律失常，呼吸麻痹而死亡。

2．处理：

①出现惊厥时，可注射苯二氮䓬类或小剂量硫喷妥钠或苯巴比妥钠等控制。

②静脉滴注10%葡萄糖注射液，促进排泄。

③给予对症治疗和支持疗法。

【不良反应】常见面部刺激症、烦躁不安、抽搐、恶心呕吐等。大剂量时可出现血压升高、心悸、出汗、面部潮红、呕吐、震颤、心律失常、惊厥、甚至昏迷。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
尼可刹米注射液	化学药	HZ002770

HY001464　尼鲁地平

【外文名称】Niludipine

药物药理信息

【药理毒理】作用与硝苯地平相似，扩张冠状动脉的作用比之强3～10倍，持续时间较之长1倍。心率及血压下降时冠脉流量仍有增加，可能是由于静脉回流增加所致。对心肌耗氧量无影响。具有较强的降压作用，且持久。具有负性肌力作用和负性频率作用。可用于心绞痛。

【不良反应】不良反应较少，可见轻度腹胀，便秘，皮疹等。

HY001465　尼麦角林

【其他名称】FI6714、富路通、麦角溴烟酯、尼什枸宁、脑通、Sermion、瑟米恩、Varson、抑血凝

【外文名称】Nicergoline

药物理化信息

【化学名】10α－甲氧基－1，6－二甲基麦角林－8β－甲醇基－5－溴烟酸酯

【分子式】$C_{24}H_{26}O_3N_3Br$

【分子量】484.39

药物药理信息

【药理毒理】本品为半合成麦角碱衍生物。具有α－受体阻滞作用和扩血管作用。可加强脑细胞能量的新陈代谢，增加氧和葡萄糖的利用。促进神经递质多巴胺的转换而增加神经的传导，加强脑部蛋白质的合成，改善脑功能障碍。

【药代动力学】尼麦角林在口服给药后迅速并且几乎完全吸收。绝对生物利用度小于5%。尼麦角林的主要代谢产物为MMDL（1，6－二甲基－8β－羟甲基－10α－甲氧基－尼麦角林）和MDL（6－甲基－8β－羟甲基－10α－甲氧基－尼麦角林）。尼麦角林大部分（>90%）与血浆蛋白结合，对血α－酸糖蛋白的亲和力高于血清蛋白。在大鼠中，给［^3H］标记的尼麦角林（5mg/kg），肝脏的放射活性最高。其次为肾脏、肺、胰腺、唾液、淋巴、脾、肾上腺和心肌。脑中的放射活性低于血中。给［^3H］和［^{14}C］标记的尼麦角林后，肾排泄是放射活性的主要衰减途径（约占总量的80%）。粪便中的放射活性只占总量的10%～20%。

在四组年轻（平均24～32岁）和老年人（平均69～70岁）的志愿者中进行研究，对得到的药代动力学参数分别比较，结果显示尼麦角林的药代动力学不受年龄影响。有严重肾功能不全的患者，尿中的MDL和MMDL的排泄显著减少。在单剂量口服给30mg尼麦角林后，轻度、中度或严重的肾功能不全的患者，与肾功能正常的相比，MDL尿中的排泄量分别平均减少32%、32%和59%。

在国内进行了生物利用度试验，12名健康受试者口服国产的10mg/片尼麦角林薄膜衣片后，估算的MDL的消除半衰期为8.1±1.6小时，峰时间和峰浓度分别为2.7±1.2小时和101.8±23.0μg/ml。12名健康受试者口服国产的30mg/片尼麦角林薄膜衣片后，估算的MDL的消除半衰期为8.5±2小时，峰时间和峰浓度分别为2.6±1.1小时和102.8±30.5μg/ml。

【药物相互作用】尼麦角林片可能会增强降血压药的作用。由于尼麦角林是通过P450 CYTP2D6代谢，不排除与通过相同代谢途径的药物有相互作用。

【药物过量】摄入高剂量的尼麦角林可能引起血压的暂时下降。一般不需治疗，平卧休息几分钟即可。罕见的病例有大脑与心脏供血不足，建议在持续的血压监测下，给予拟交感神经药。

【不良反应】未见严重不良反应的报道。可有低血压、头晕、胃痛、潮热、面部潮红、嗜睡、失眠等。临床试验中，可观察到血液中尿酸浓度升高，但是这种现象与给药量和给药时间无相关性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
尼麦角林胶囊	化学药	HZ002771
尼麦角林片	化学药	HZ002772
尼麦角林注射液	化学药	HZ002773
注射用尼麦角林	化学药	HZ004908

HY001466　尼美舒利

【外文名称】Nimesulide

药物理化信息

【化学名】4－硝基－2－苯氧基甲烷磺酰苯胺

【分子式】$C_{13}H_{12}N_2O_5S$

【分子量】308.32

【性状及组成】为类白色至淡黄色粉末。

药物药理信息

【药理毒理】本品属非甾体类抗炎药，具有抗炎、镇痛、解热作用。其作用机制尚未完全清楚，可能主要与抑制前列腺素的合成、白细胞的介质释

放和多形核白细胞的氧化反应有关。

【药代动力学】尼美舒利口服吸收良好，单次口服本品 0.1g，2.5～3.5 小时内达到血浆峰值，半衰期为 3～4 小时。尼美舒利在肝脏中被代谢，它的主要代谢产物是对羟基衍化物，该代谢产物仍具有药理活性，尼美舒利主要通过尿液排泄（大约 50%的服用剂量），仅有 1%～3%以未原形排出，主要代谢产物羟化尼美舒利只有一种糖醛衍生物，大约 29%的剂量是代谢后经粪便排出。

【药物相互作用】本品可能与阿司匹林、其他非甾体类抗炎药有交叉反应，因此，对这些药物过敏的病人禁用；本品为高度蛋白质结合药物，所以可能置换其他蛋白质结合药物；并用其他非甾体类抗炎药后，如出现视力下降，应停止治疗，进行眼科检查。

【药物过量】超量中毒应予紧急处理包括洗胃、催吐、服用活性炭，同时予以对症支持疗法。

【不良反应】主要有：胃灼热、恶心、胃痛，但症状都很轻微、暂短，很少需要中断治疗。极少情况下，患者服药后出现过敏性皮疹。即使使用尼美舒利未产生这些不良反应，也须注意到本品如同其他非甾体消炎药一样，可能产生头晕、思睡、胃溃疡或肠胃出血以及 Stevens－Johnson 综合征。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
尼美舒利分散片	化学药	HZ002774
尼美舒利干混悬剂	化学药	HZ002775
尼美舒利胶囊	化学药	HZ002776
尼美舒利颗粒	化学药	HZ002777
尼美舒利凝胶	化学药	HZ002778
尼美舒利片	化学药	HZ002779

HY001467 尼美西泮

【外文名称】Nimetazepam

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633 号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为精神药品，但我国未生产或使用。

HY001468 尼莫地平

【其他名称】硝苯砒酯

【外文名称】Nimodipine

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】2，6－二甲基－4－（3－硝基苯基）－1，4－二氢－3，5－吡啶二甲酸－2－甲氧乙基－（1－甲乙基）酯

【分子式】$C_{21}H_{26}N_2O_7$

【分子量】418.45

【性状及组成】本品为淡黄色结晶性粉末，无臭，无味。

本品在丙酮、三氯甲烷中易溶，在乙醇中溶解，在乙醚中微溶，在水中不溶。

熔点：本品的熔点为 124～128℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：钙通道阻滞药。

正常情况下，平滑肌的收缩依赖于 Ca^{2+} 进入细胞内，引起跨膜电流的去极化。尼莫地平通过有效地阻止 Ca^{2+} 进入细胞内、抑制平滑肌收缩，达到解除血管痉挛之目的。动物实验证明，尼莫地平对脑动脉的作用远较全身其他部位动脉的作用强许多，并且由于它具有很高的嗜脂性特点，易透过血脑屏障。当用于蛛网膜下隙出血的治疗时，脑脊液中的浓度可达 12.5ng/ml。由此推论，临床上可用于预防蛛网膜下隙出血后的血管痉挛，然而在人体应用该药的作用机制仍不清楚。此外尚具有保护和促进记忆、促进智力恢复的作用。所以可选择性地作用于脑血管平滑肌，扩张脑血管，增加脑血流量，显著减少血管痉挛引起的缺血性脑损伤。

【药代动力学】缓释胶囊口服吸收后，约 3～4 小时血药浓度达高峰，消除半衰期为 3～5 小时，本品在肝脏和脂肪组织中浓度最高，在肝脏内 93%～95%的药物被代谢，代谢产物主要由胆汁排出，一部分由肾排出。

控释制剂口服后主要从肠胃道吸收，约 5 小时血药浓度达高峰，生物半衰期约 5 小时，本品在肝脏和脂肪组织中浓度最高，在肝脏内 93%～95%的药物被代谢，代谢产物主要由胆汁排出，一部分由肾排出。

静脉滴注尼莫地平 0.03mg/kg，AUC 为 38.8±13.3μg/h，分布容积 0.9±0.4L/kg，总清除率 0.8±0.3L/（kg·h），$t_{1/2\alpha}$ 7.3±3.5 分钟，$t_{1/2\beta}$ 1.1±0.2 小时。15 名蛛网膜下腔出血（1～3 级）病人静滴本品一日 48mg，共 14 天，平均血浆药物浓度 36～72μg/L，均未发现药物蓄积情况，蛋白结合率为 96%～99%，药物分布容积 1.6～3.1L/kg，血浆中药物浓度下降快，代谢产物几无活性，通过胆囊排泄，80%

于粪便，20%于尿液中排出体外。

【药物相互作用】

1．与其他作用于心血管的钙离子拮抗剂联合应用时可增加其他钙离子拮抗剂的效用。

2．当尼莫地平（一日 90mg）与西咪替丁（一日 1000mg）联合应用 1 周以上者，尼莫地平血药浓度可增加 50%，这可能与肝内细胞色素 P450 被西咪替丁抑制了尼莫地平代谢有关。

【不良反应】大量临床实践证明，蛛网膜下隙出血者应用尼莫地平治疗时约有 11.2%的病者出现不良反应。最常见的不良反应有：①血压下降，血压下降的程度与药物剂量有关。②肝炎。③皮肤刺痛。④胃肠道出血。⑤血小板减少。⑥偶见一过性头晕、头痛、面潮红、呕吐、胃肠不适等。

此外，口服尼莫地平以后，个别病人可发生碱性磷酸酶、乳酸脱氢酶、AKP 的升高，血糖升高以及个别人的血小板数的升高。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
尼莫地平分散片	化学药	HZ002780
尼莫地平缓释胶囊	化学药	HZ002781
尼莫地平缓释片	化学药	HZ002782
尼莫地平胶囊	化学药	HZ002783
尼莫地平胶丸	化学药	HZ002784
尼莫地平控释片	化学药	HZ002785
尼莫地平片	化学药	HZ002786
尼莫地平软胶囊	化学药	HZ002787
尼莫地平注射液	化学药	HZ002788
注射用尼莫地平	化学药	HZ004909

HY001469　尼群地平

【其他名称】Bayotensin、Baypress、硝苯乙吡啶

【外文名称】Nitrendipine

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】2,6－二甲基－4－（3－硝基苯基）－1,4－二氢－3,5－吡啶二甲酸甲乙酯

【分子式】$C_{18}H_{20}N_2O_6$

【分子量】360.37

【性状及组成】本品为黄色结晶或结晶性粉末；无臭，无味；遇光易变质。本品在丙酮或三氯甲烷中易溶，在甲醇或乙醇中略溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 157～161℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：钙通道阻滞药。

1．本品为二氢吡啶类钙通道阻滞剂。本品抑制血管平滑肌和心肌的跨膜钙离子内流，但以血管作用为主，故其血管选择性较强。本品引起冠状动脉、肾小动脉等全身血管的扩张，产生降压作用。

2．致癌、致突变和生殖毒性：大鼠口服同类药物硝苯地平两年未见有致癌作用。体内致突变研究结果阴性。

给大鼠 30 倍于人类最大药量可以致畸；交配后的大鼠给予 30 倍于人类最大药量，可引起生殖率下降；给大鼠 3～10 倍于人类最大药量，可引起大鼠、小鼠和兔子流产（胎儿的药物吸收率增加、胎儿死亡率增加、新生儿存活率下降）；孕猴服用 2 倍于人类最大药量，可导致小胎盘和绒毛发育不全。

【药代动力学】本品口服吸收良好，但存在明显的首过效应。蛋白结合率 98%。早期研究报道 $t_{1/2}$为 2 小时，近期研究由于使用了更敏感的测定设备，报道 $t_{1/2}$在 10 至 22 小时。本品口服后约 1.5 小时血药浓度达峰值。口服后 30 分钟收缩压开始下降，60 分钟后舒张压开始下降，降压作用在 1～2 小时最大，持续 6～8 小时。本品在肝内广泛代谢，其代谢产物 70%经肾排泄，8%随粪便排出。肝病患者血药浓度和消除半衰期增加。

【药物相互作用】

1．β－受体阻滞剂：绝大多数患者合用此药可加强降压作用，并可减轻本品降压后发生的心动过速；然而，个别患者有可能诱发和加重体循环低血压、心力衰竭和心绞痛。

2．血管紧张素转换酶抑制剂：合用耐受性较好，降压作用加强。

3．长效硝酸盐类：合用有较好的耐受性，但尚缺乏评价这种合用控制心绞痛的有效性文献。

4．洋地黄：部分研究提示服用此药，能够增加合用的地高辛血浆浓度，平均增加 45%。部分研究认为不增加地高辛血浆浓度和毒性。提示我们在初次使用、调整剂量或停用尼群地平时应监测地高辛的血药浓度，以防地高辛过量或不足。

5．双香豆类抗凝药：尚无报告表明合用尼群地平能够增加香豆类抗凝药物的凝血酶原时间。目前，还不能肯定他们之间的相互作用。

6．西咪替丁：由于西咪替丁可介导抑制肝脏细胞色素 P450 酶，使尼群地平的首过效应发生改变，建议对正在服用西咪替丁治疗的患者合用尼群地平时，注意药物剂量的调整。

【药物过量】现有的文献表明，增加剂量能够导致过度的外周血管扩张，继发或延长体循低血压状态。由药物过量导致临床上出现显著的低血压反应的患者，应及时在心肺监测的同时，给予积极的心血管支持治疗。肝功能不全的患者药物清除率下降。

【不良反应】较少见的有头痛、面部潮红。少见的有头晕、恶心、低血压、足踝部水肿、心绞痛发作，一过性低血压。本品过敏者可出现过敏性肝炎、皮疹，甚至剥脱性皮炎等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
尼群地平片	化学药	HZ002789
尼群地平软胶囊	化学药	HZ002790
尼群地平贴片	化学药	HZ002791

HY001470 尼索地平

【其他名称】硝苯异丙啶

【外文名称】Nisoldipine

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第34册

药物理化信息

【化学名】2,6－二甲基－4－（2－硝基苯基）－1,4－二氢－3,5－吡啶二羧酸异丁甲酯

【分子式】$C_{20}H_{24}N_2O_6$

【分子量】388.42

【性状及组成】本品为黄色结晶性粉末；无臭，无味；遇光不稳定。

本品在丙酮或三氯甲烷中易溶，在乙醇中略溶，在水中不溶。

熔点：本品的熔点为148～152℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为长效钙离子拮抗剂，降压作用强，是硝苯地平的5～10倍。

血管选择性最高的钙离子拮抗剂，是非洛地平、拉西地平、依拉地平的10倍，是氨氯地平的100倍，无心肌抑制作用。

尼索地平抑制平滑肌的电压依赖跨膜钙离子流，对血管平滑肌有高度选择性作用，扩张周围血管与冠状血管，由于冠状动脉扩张而改善氧供，减少后负荷而减少氧耗。治疗剂量无心肌负性作用并不影响心脏产生激动和传导，并有一定排尿钠作用。长期治疗并不产生耐受性。

【药代动力学】口服几乎完全吸收，有明显肝脏首过效应，生物利用度为4%～8%，口服后99%与蛋白结合，口服吸收后1小时达血药峰值。在肝内代谢，70%由尿排出，10%～15%原形和代谢产物由粪便排出。半衰期在病人间变异较大，单剂量口服半衰期为11.4小时，而反复给药为14小时。老年人及肝病患者 C_{max} 和AUC可以增加。

【药物相互作用】

1．与β－阻滞剂或其他降压药同用有协同作用，应注意体位性低血压。

2．与西咪替丁同用可使本品血药浓度增高，作用加强。

3．奎尼丁可能使本品药时曲线下面积轻度减少，可能需要调整本品剂量。

4．利福平由于诱导本品代谢酶的活力而加速本品代谢而减弱降压作用，需调整本品剂量。

【不良反应】

1．循环系统：有时出现心悸、血压降低、胸部痛、面红、热感、肢体下垂部位水肿。

2．精神神经系统：有时出现无力、肌痛、头痛、头晕、耳鸣、乏力，较少数可有胸痛。

3．消化系统：有时出现恶心、腹胀满、腹痛、腹泻、便秘。

4．肝脏：有时出现AST、ALT、ALP的异常。

5．肾脏：有时出现BUN异常。

6．过敏症：有时出现皮疹。

7．偶见尿频、牙龈增生、男性乳房女性化。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
尼索地平缓释胶囊	化学药	HZ002792
尼索地平缓释片	化学药	HZ002793
尼索地平胶囊	化学药	HZ002794
尼索地平片	化学药	HZ002795

HY001471 尼扎替丁

【外文名称】Nizatidine

【性状及组成】本品为结晶状，熔点130～132℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为组胺H_2受体拮抗剂。本品竞争性与组胺H_2受体结合，可逆性抑制受体功能的发挥，特别是作用于分泌胃酸的胃壁细胞上的H_2受体，阻断胃酸形成并使基础胃酸降低，亦可抑制食物和化学刺激所致的胃酸分泌。口服本品300mg，能显著抑制夜间（约12小时）胃酸分泌，抑制率为

90%；显著抑制由食物、咖啡因、氨乙吡唑和五肽胃泌素刺激引起的胃酸分泌，抑制率分别为97%、96%、99%和67%。口服本品75～300mg不影响胃分泌液中胃蛋白酶的活性，但总的胃蛋白酶分泌量随着胃分泌量的减少而相应地减少；口服本品75～300mg增强由氨乙吡唑刺激的内因子分泌；本品不影响基础胃泌素分泌，在口服本品12小时后，进食未见胃沁素分泌量增加。本品不影响血清中促性腺激素、泌乳素、生长激素、抗利尿激素、皮质醇、三碘甲状腺氨酸、甲状腺素、睾酮、5α－二氢睾酮、雄甾烯二酮或雌二醇的浓度。本品未显示有抗男性激素的作用。

急性毒性 LD_{50}（mg/kg）：小鼠，口服，1698（雄）、1630（雌）；小鼠，静脉注射，232。大鼠，口服，2210（雄）、1653（雌）；大鼠，静脉注射，301。

慢性毒性：小鼠，口服，170、800mg/（kg·d）与食物混合，连续90天，出现肝、肾重量轻度增加；犬和大鼠，口服，2000mg/（kg·d），连续30天，可见肝重量增加，但未见病理学改变。

特殊毒理学研究：动物研究表明，尼扎替丁无致癌性、致突变性和致畸性。

【药代动力学】本品口服的绝对生物利用度超过70%。口服150mg或300mg后0.5～3小时血药浓度达峰值，分别为700～1800μg/L和1400～3600μg/L。服药12小时后血浆浓度低于10μg/l。清除半衰期为1～2小时，血浆清除率为40～60L/h，分布容积为0.8～1.5L/kg。由于半衰期较短和清除速度较快，肾功能正常者睡前一次口服300mg本品或150mg一日2次，均不会使药物在体内积聚。本品的血浆蛋白结合率约为35%，主要是与 α_1－酸性糖蛋白结合。同时摄入普鲁本辛不影响本品口服的生物利用度。与食物同服，AUC和峰浓度增加10%。一般多次口服本品无蓄积。本品口服的主要代谢产物为 N^2－单脱甲基尼扎替丁（少于7%口服剂量），它也是一种 H_2 受体拮抗剂，是尿中排出的主要代谢产物。其次为 N^2－氧化物（少于5%口服剂量）和S－氧化物（少于6%口服剂量）。口服本品主要经尿液和粪便排除体外。本品口服在12小时内，90%以上的药物从尿中排出，其中60%为原形排出，肾脏清除率为500ml/min，提示通过肾小管主动排泄。经粪便排泄的药物少于6%。中至重度肾功能障碍明显延长本品半衰期并降低清除率。极重度肾功能衰竭患者，服用本品的半衰期为3.5～11小时，血浆清除率为7～14L/h。为避免药物蓄积，对有显著肾功能障碍的患者，应根据肾功能障碍程度适当减少用药剂量和用药次数。

【药物相互作用】本品与茶碱、氯氮䓬、氯羟去甲安定、利多卡因、苯妥英钠和华法林无药物间相互作用。由于本品不抑制细胞色素P450药物代谢酶系统，故不会发生肝药代谢抑制所产生的药物相互作用。患者每天服用大剂量阿司匹林（3900mg），同时口服本品150mg，每日2次，则出现患者血清水杨酸盐浓度升高。

【不良反应】6000多例患者参与的临床研究表明，本品耐受性良好。患者服用尼扎替丁的最常见的不良反应为贫血和荨麻疹，其发生率分别为0.2%和0.5%；安慰剂作对照，患者贫血和荨麻疹的发生率分别为0%和0.1%，差异有显著性。服用尼扎替丁后出现大于1%的不良反应与服用安慰剂的大致相当。不良反应主要包括全身性：头痛（16.6%）、腹痛（7.5%）、疼痛（4.2%）、无力（3.1%）、背痛（2.4%）、胸痛（2.3%）、感染（1.7%）、发热（1.6%）。消化系统：腹泻（7.2%）、恶心（5.4%）、腹胀（4.9%）、呕吐（3.6%）、消化不良（3.6%）、便秘（2.5%）、口干（1.4%）、畏食（1.2%）、胃肠功能紊乱（1.1%）和牙科疾病（1.0%）。神经系统：头晕（4.6%）、失眠（2.7%）、多梦（1.9%）、嗜睡（1.9%）、焦虑（1.6%）和神经质（1.1%）。呼吸系统：鼻炎（9.8%）、咽炎（3.3%）、鼻窦炎（2.4%）、和咳嗽（2%）。其他：皮疹（1.9%）、瘙痒（1.7%）、弱视（0.1%）和肌痛（1.7%）。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
尼扎替丁胶囊	化学药	HZ002797
尼扎替丁片	化学药	HZ002798

HY001472　L－鸟氨酸－天门冬氨酸复盐

【其他名称】Hepa－Merz、雅博斯

【外文名称】Ornithine and Aspartate Salt

药物药理信息

【药理毒理】本品为*L*－鸟氨酸和*L*－天门冬氨酸的复盐，在体内降解后能发挥鸟氨酸和天门冬氨酸二者的协同作用，促进尿素生成，降低血氨，加速三羧酸循环，启动细胞内呼吸，改善肝功能。它是降低血氨的有效药物，其降血氨作用比天门冬氨酸钾镁更强。

1．解毒作用：通过加速鸟氨酸循环来加强肝细胞的解毒功能。

2．增加肝细胞的能量合成，主要通过促进三羧酸循环来实现。其特点：①迅速恢复肝功能；②使异常升高的血氨迅速下降；③作为肿瘤放疗和抗结核化疗中的辅助用药时，可减少机体细胞所受的伤

害；④对重度肝性脑病者可用高剂量进行抢救促其清醒。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
鸟氨酸天门冬氨酸注射液	化学药	HZ002800

HY001473 尿促卵泡素

【外文名称】Urofollitropin

药物理化信息

【化学名】（+）-（*S*）-α-甲基-3-苯甲酰基-苯乙酸。

药物药理信息

【药理毒理】尿促卵泡素是从绝经期妇女尿中提取纯化而来，其活性成分是FSH，FSH具有促进卵泡募集与发育的作用。对于非原发性卵巢功能衰竭的妇女，尿促卵泡素能刺激卵巢卵泡发育。在缺少内源性LH的情况下，当监测结果显示卵泡已充分发育时，注射本品后应注射人绒毛膜促性腺激素（HCG），以促进卵泡充分发育成熟和排卵。

【药代动力学】国外同品种研究报道：对内源性FSH受到抑制的自愿受试健康妇女，单剂量（225单位）和多剂量（150单位×7天）注射本品，从FSH C_{max}和AUC的稳态比率可以看出，皮下注射和肌内注射本品并不生物等效。多剂量肌内注射本品，C_{max}和AUC的稳态比率为77.7%，而皮下注射为81.8%。

吸收：单剂量皮下和肌内注射本品，FSH血浆浓度达到最大的时间分别为20.5小时和17.4小时，但多剂量注射本品，均约为10小时。

清除：单剂量皮下和肌内注射本品的平均半衰期分别为31.8小时和37小时，但其多剂量（7天）注射本品分别为20.6小时和15.2小时。

【药物相互作用】

1. 本品与枸橼酸克罗米芬合用可增加卵泡反应。

2. 与GnRH激动剂合用时，需要增加本品的剂量以达到适当的卵泡反应。

【药物过量】本品使用过量可导致卵巢过度刺激综合征。

【不良反应】

1. 有报道在应用FSH和HMG后可出现注射部位的局部反应，发热，关节疼痛，出现包括胃腔胀满的胃肠症状以及骨盆疼痛或乳房疼痛，轻度到中度的卵巢增大，有时可见卵巢囊肿，严重的卵巢过度刺激综合征较少见，在某些罕见的病例中发生动脉血栓栓塞，其发生与应用HMG及HCG治疗有关，在应用本品治疗中也可发生这种情况。

2. 在少数病例应用本品治疗后可出现多胎儿，其中大部分为双胞胎，在体外受精中，这种现象与胚胎复制的数目有关。

3. 由堕胎或流产所致的妊娠失败和由其他生育问题所致的妊娠失败的发生率类似，如果有输卵管病变的病史，则有可能发生异位妊娠。

4. 有严重肺病（如肺不张，急性呼吸窘迫综合征）的报道。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用尿促卵泡素	化学药	HZ004910

HY001474 尿促性素

【外文名称】Menotrophin

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

【性状及组成】本品为绝经妇女尿中提取的促性腺激素，主要含卵泡刺激素（FSH）与黄体生成素（LH）。每1mg中卵泡刺激素效价不得少于40单位，黄体生成素的效价与卵泡刺激素效价的比值约为1。

本品为类白色或淡黄色粉末。本品在水中溶解。

药物药理信息

【药理毒理】本品是促性腺激素类药。主要具有促卵泡生成素（FSH）的作用，促进卵巢中卵泡发育成熟和睾丸生成并分泌甾体性激素。使女性子宫内膜增生，男性促进曲细精管发育、造精细胞分裂和精子成熟。

【药代动力学】本品肌注能吸收，血药浓度达峰时间为4~6小时，给药后血清雌二醇在18小时达峰，升高88%，静注150单位后，药物的 C_{max}为24单位/L，在15分钟达峰，消除为双相，主要经肾脏排泄，未见报道母乳中有分泌。

【不良反应】主要为卵巢过度刺激综合征，表现为下腹不适或胀感、腹痛、恶心、呕吐、卵巢增大。严重可致胸闷、气急、尿量减少、胸水、腹水，甚至卵泡囊肿破裂出血等。此外尚有多胎妊娠和早产等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用尿促性素	化学药	HZ004911

HY001475　尿多酸肽

【外文名称】Uroacitides

【性状及组成】本品系从人尿液中提取的多种有机酸和多种分子量在6000D以下的多肽组成的无菌水溶液。主要成分有马尿酸、苯乙酰谷氨酰胺、4－羟基苯乙酸、5－羟基吲哚乙酸和多肽等。

药物药理信息

【药理毒理】本品是从健康人尿中分离、提取和纯化的含有多种有机酸和多肽的静脉注射剂，其作用机制至今尚不清楚。目前临床研究结果（用药两周期）显示，本品与化疗联合使用对非小细胞肺癌和乳腺癌有一定疗效，对患者的生活质量也有一定的改善作用。对患者治疗后一年、二年的随访结果显示，本品对患者中位生存期和生存率有提高的趋势，但无显著意义，需进一步的研究证实。

【药物过量】根据毒理研究表明本品用药安全。

【不良反应】主要为胃肠道反应，表现为恶心、呕吐、腹泻、纳差、腹胀等。其他不良反应表现为疼痛、口干、胸部不适、颜面潮红、心悸等，多数为Ⅰ～Ⅱ°，可自行恢复。可给予对症处理。

外周静脉给药时可能有静脉刺激症状，产生静脉炎，采用锁骨下静脉滴注时静脉刺激明显减轻。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
尿多酸肽注射液	化学药	HZ002801

HY001476　尿激酶

【其他名称】Abbokinase UKidan、Uronase、Win－Kinase

【外文名称】Urokinase

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

【性状及组成】本品为从健康人尿中分离的，或从人肾组织培养中获得的一种酶蛋白。由分子量分别为33000（LMW－tcu－PA）和54000（HMW－tcu－PA）两部分组成。

本品为白色非结晶状粉末。

药物药理信息

【药理毒理】本品直接作用于内源性纤维蛋白溶解系统，能催化裂解纤溶酶原成纤溶酶，后者不仅能降解纤维蛋白凝块，亦能降解血循环中的纤维蛋白原、凝血因子Ⅴ和凝血因子Ⅷ等，从而发挥溶栓作用。本品对新形成的血栓起效快、效果好。本品还能提高血管ADP酶活性，抑制ADP诱导的血小板聚集，预防血栓形成。本品在静脉滴注后，患者体内纤溶酶活性明显提高；停药几小时后，纤溶酶活性恢复原水平。但血浆纤维蛋白或纤维蛋白原水平的降低，以及它们的降解产物的增加可持续12～24小时。本品显示溶栓效应与药物剂量、给药的时间成明显的相关性。

本品毒性很低，小鼠静脉注射半数致死量大于100万单位/kg体重。亦无明显抗原性，致畸性、致癌性和致突变性。临床应用罕有过敏反应报道。但是，鉴于本品增加纤溶酶活性，降低血循环中的未结合型纤溶酶原和与纤维蛋白结合的纤溶酶原，可能出现严重的出血危险。

【药代动力学】本品在人体内药代动力学特点尚未完全阐明。本品静脉给予后经肝脏快速清除，血浆半衰期≤20分钟。少量药物经胆汁和尿液排出。肝硬化等肝功能受损患者其半衰期延长。

【药物相互作用】本品与其他药物的相互作用尚无报道。鉴于本品为溶栓药，因此，影响血小板功能的药物，如阿司匹林、吲哚美辛、保泰松等不宜合用。肝素和口服抗凝血药不宜与大剂量本品同时使用，以免出血危险增加。

【药物过量】本品静脉给予一般达2500单位/分钟方有明显疗效。成人总用药量不宜超过300万单位。溶栓药效必然伴有一定出血风险。一旦出现出血症应立即停药，按出血情况和血液丧失情况补充新鲜全血，纤维蛋白原血浆水平＜100mg/dl伴出血倾向者应补充新鲜冷冻血浆或冷沉淀物，不宜用右旋糖苷羟乙基淀粉。氨基己酸的解救作用尚无报道，但可在紧急情况下使用。

【不良反应】本品临床最常见的不良反应是出血倾向。以注射或穿刺局部血肿最为常见。其次为组织内出血，发生率5%～11%，多轻微，严重者可致脑出血。本品用于冠状动脉再通溶栓时，常伴随血管再通后出现房性或室性心律失常，发生率高达70%以上。需严密进行心电监护。本品抗原性小，体外和皮内注射均未检测到诱导抗体生成。因此，过敏反应发生率极低。但有报告，曾用链激酶治疗的病人使用本品后少数人引发支气管痉挛、皮疹和发热。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用尿激酶	化学药	HZ004912

HY001477 尿嘧啶

【外文名称】Uracil

药物药理信息

【药理毒理】实验研究证明，尿嘧啶可阻断替加氟的降解作用，可特异性地提高肿瘤组织中氟尿嘧啶及其活性代谢物质的浓度。通过对替加氟与尿嘧啶不同的配比，并测定动物血（B）、肿瘤（T）中氟尿嘧啶的浓度，说明二者以1:4配比时，肿瘤和血中氟尿嘧啶浓度的比值（T/B）最大。

本品的作用机制，有人解释为加入尿嘧啶后，抑制了氟尿嘧啶在肿瘤组织中的分解，因而相对地提高了氟尿嘧啶的浓度；此外，氟尿嘧啶主要在肝脏中及部分在肿瘤组织中分解，加尿嘧啶后，在肿瘤组织中只有微量分解，也可能与肿瘤中氟尿嘧啶的磷酸化产物较多有关。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
尿嘧啶替加氟胶囊	化学药	HZ002802
尿嘧啶替加氟片	化学药	HZ002803

HY001478 尿囊素

【外文名称】Allantoin

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（二部）·第3册

药物理化信息

【化学名】2，5－二氧代－4－咪唑烷基脲

【分子式】$C_4H_6N_4O_3$

【分子量】158.12

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末；无臭、无味。

本品在热水中溶解，在乙醇、三氯甲烷或乙醚中不溶；在氯化钠试液中溶解。

熔点：本品的熔点为228～232℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】消化道黏膜保护药。具有促进组织细胞增生、溃疡及伤口愈合的作用。

1．本品直接作用于胃黏膜，从动物实验结果证明：本品能加速损伤部位正常肉芽组织的生长及促进黏膜上皮细胞的再生。

2．按W·Kill及B·Scott法（乳酪凝固法）用复方尿囊素4%混悬液，几乎能全部抑制胃酶的活性。按K·Schaut法，10分钟后能抑制活力至10%以下，其作用能持续100分钟以上。

3．实验动物注射组胺使其胃液分泌亢进后，再给服用复方尿囊素，能使游离酸度、总酸度显著下降，pH为5.8，持续3小时以上。

4．大白鼠造成实验性溃疡后给以复方尿囊素口服治疗，并与服用氢氧化铝组作对照实验，治愈率有明显差别，以前者稍佳。

【不良反应】个别病例出现轻微口干，胃部不适感。也有个别病例在服药期出现乳房胀痛感。但停药后都逐渐消失。长期应用有便秘等不良反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方丙谷胺西咪替丁片	化学药	HZ001094
复方薄荷酊	化学药	HZ001098
复方硫酸软骨素滴眼液（1）	化学药	HZ001274
复方尿囊素片	化学药	HZ001327
复方尿维氨滴眼液	化学药	HZ001328
硫酸锌尿囊素滴眼液	化学药	HZ002411
薄荷止痒酊	中成药	ZC000385
愈裂贴膏	中成药	ZC007114

HY001479 尿囊素铝

【其他名称】二羟基尿囊素铝、尿羟铝、胃肠宁

【外文名称】Aldioxa

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第49册

药物理化信息

【化学名】二羟（5－氧－脲基－2－咪唑啉基）氧铝

【分子式】$C_4H_7AlN_4O_5$

【分子量】218.11

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；无臭，无味。

本品在水、乙醇或乙醚中几乎不溶；在稀盐酸或稀硝酸中略溶，常因部分水解而发生浑浊。

药物药理信息

【药理毒理】

1．抗溃疡作用：在紧张性溃疡（大白鼠），shay溃疡（大白鼠）、苯丁氮酮性溃疡（大白鼠）及利血平性溃疡（大白鼠）等，在肉眼及组织学上观察都有促进治愈及抑制溃疡发生的作用。

2．抗胃蛋白酶作用：尿囊素铝抗胃蛋白酶的作

用与碳酸铋效果相近，4%的本品溶液可使用胃蛋白酶的活性降低至10%（in vitor）。

3．黏膜血流量的增加作用：采用氢气体消除率法（大白鼠），表明本品可增加胃中40%，十二指肠中30%的黏膜血流量。

4．黏膜合成分泌的促进作用：对大白鼠的醋酸溃疡模型，可以增加再生上皮及肉芽组织的酸性黏多糖体的生成。

5．黏膜上皮的再生激活作用：用大白鼠的醋酸溃疡模型，表明在溃疡部，可以激活黏膜上皮细胞的再生。

6．制酸作用：对0.05N盐酸的中和能力与氢氧化铝的水平在同一程度上，另外在铋刺激的胃液中可以发现其游离总酸度降低，pH亦提高（狗）。

毒理作用：给大白鼠分别服用含尿囊素铝2.5%、5.0%、10.0%的饲料，连续服用311天，观察其生长，对食量、生殖系统、血液变化及其他重要器官，均未发现异常损害。

【药代动力学】给狗口服本药0.8g（含主要成分0.4g），在消化器官内水解为尿囊素及氢氧化铝，尿囊素大部分被吸收。尿囊素血药浓度在给药后1.5小时达峰值，5小时后降低至服用前的水平。

【药物相互作用】合并使用四环素的抗生物质或奎烯醌系的抗菌剂，作用有可能会减弱，所以最好不要同时服用。

【不良反应】根据文献报道，在3120例受试病例中，不良反应的发生率为0.16%（5例），均为便秘。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
尿囊素铝颗粒	化学药	HZ002804
尿囊素铝片	化学药	HZ002805

HY001480　尿素

【其他名称】Calmurid、Carbamide、Carmol、脲、Ureaphil、Urederm、Urevert

【外文名称】Urea

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】碳酰二胺

【分子式】CH_4N_2O

【分子量】60.06

【性状及组成】本品为无色棱柱状结晶或白色结晶性粉末；几乎无臭，味咸凉；放置较久后，渐渐发生微弱的氨臭；水溶液显中性反应。本品在水、乙醇或沸乙醇中易溶，在乙醚或三氯甲烷中不溶。

熔点：本品的熔点为132～135℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：角质软化药。

本品为角质溶解药、利尿脱水药。

本品可溶解角蛋白，增加蛋白质的水合作用，从而使角质软化和溶解。

【不良反应】

1．溶血。

2．静注后面色潮红，精神兴奋，烦躁不安，给药局部静脉炎和静脉血栓形成，外漏可引起组织坏死。

3．血尿素氮和非蛋白氮升高。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
桉油尿素乳膏	化学药	HZ000141
桉油尿素软膏	化学药	HZ000142
薄荷尿素贴膏	化学药	HZ000455
醋酸曲安奈德尿素乳膏	化学药	HZ000606
复方克霉唑软膏	化学药	HZ001254
复方乳酸软膏	化学药	HZ001363
氯化亚锡冻干品	化学药	HZ002495
尿素乳膏	化学药	HZ002808
尿素软膏	化学药	HZ002809
尿素贴膏	化学药	HZ002810
尿素维E乳膏	化学药	HZ002811
注射用比西酯	化学药	HZ004702
注射用比西酯Ⅰ	化学药	HZ004703
注射用比西酯Ⅱ	化学药	HZ004704
注射用亚锡葡庚糖酸钠Ⅰ	化学药	HZ005034
麝香活血化瘀膏	中成药	ZC004700

HY001481　尿素［^{14}C］

【外文名称】［^{14}C］－urea

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第59册

药物理化信息

【化学名】尿素［^{14}C］

【分子式】CH_4N_2O

药物药理信息

【药理毒理】哺乳动物细胞中不存在尿素酶，故人胃中存在尿素酶是幽门杆菌存在的证据。因为在胃中尚未发现有其他种类的细菌。为了检测胃幽门螺杆菌，患者口服尿素［^{14}C］后，如果胃中有幽门螺杆菌，其产生的尿素酶能迅速将尿素分解为二氧化碳和氨气，二氧化碳经血液进入肺而排出体外，将排出的$^{14}CO_2$收集后在仪器上测量，即可判断胃内有无感染幽门螺杆菌。

【药代动力学】口服尿素［^{14}C］吸收迅速，0.11小时即可达峰，清除较快，消除相半衰期为5.15小时，肾脏清除率为0.617L（kg·h）。排泄很快，以尿为主，24小时粪尿排出达65%。动物试验所测的心、肝、肺、肾、肌肉、胃、肠、骨、脑、脂肪、生殖腺等器官未见特异性积累。尿素从体内其余部分向膀胱排泄的生物半衰期为6小时。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
尿素［^{14}C］呼气试验药盒	化学药	HZ002806
尿素［^{14}C］胶囊	化学药	HZ002807

HY001482 镍元素

【外文名称】Nickel

【分子量】58.69

【性状及组成】镍的原子序数为28，属于Ⅷ族元素。

药物药理信息

【药理毒理】镍具有刺激血液生长的作用，能促进红细胞再生。在人体内缺铜时，镍的生理活性会充分发挥，又不影响人体内铜的生理活性。补充适量的镍可使红细胞、白细胞及血红蛋白的生成增多。患有各种贫血及肝硬化的病人血中镍均降低，镍有刺激生血功能的作用。治疗贫血有的曾用过硫酸镍和溴化镍。

镍可以激活肽酶，镍还可能是胰岛素分子中的一种成分，相当于胰岛素的辅酶，动物实验证明，添加小量镍的胰岛素，有增强胰岛素降低血糖的作用。

动物实验证明，缺镍可使肝细胞中的固缩核和线粒体发生肿胀，超微结构发生异常。还有研究证明，镍在维持大分子结构稳定性、膜稳定性和细胞的超微结构方面有重要作用。

由于植物性食物含镍较高，因此一般混合膳食能供应足够的镍。人们通常一日可从膳食中得到100～200μg的镍。现在还没有人体因缺乏镍而引起的营养缺乏的综合征的证据，只是在一些疾病中，如肝硬化、慢性肾功能不全的病人血清中含镍量降低。

成人每日镍摄取0.4mg，即可满足生理需要。

【药代动力学】镍主要由呼吸道吸收，小肠吸收率很低，吸收后经代谢主要从粪便排出，尿中排出量较少，每天约为2～20μg，皮肤也不吸收。

正常人血清镍含量为0.026mg/L，头发含镍量为0.64±0.44mg/L，尿中镍平均为4μg/L。正常成年人体内含镍量约6～10mg，主要分布于肾、肺、脑、脊髓、软骨、结缔组织，皮肤等部位。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
多维元素片（29）	化学药	HZ000810
善存银片	化学药	HZ003189

HY001483 柠檬黄

【外文名称】Tartrazine

【性状及组成】本品为一种偶氮型酸性染料。橙黄色粉末。溶于水呈黄色，其水溶液遇硫酸、硝酸、盐酸及氢氧化钠仍呈黄色。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：着色剂。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
二维葡磷钙咀嚼片	化学药	HZ000857
复方阿司匹林双层片	化学药	HZ001022
六合氨基酸颗粒	化学药	HZ002444
葡萄糖酸钙含片	化学药	HZ002884
愈酚待因口服溶液	化学药	HZ004615

HY001484 柠檬醛

【外文名称】Citral

【性状及组成】一般是无色或淡黄色液体。有强烈的柠檬香气。易挥发。不溶于水，溶于乙醇、乙醚、甘油、矿物油、动植物油。

沸点228～229℃，折射率1.4860～1.4900（20℃）。

药物药理信息

【药理毒理】矫味剂

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
红花油	中成药	ZC002126

HY001485　柠檬烯

【其他名称】溶石素

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第6册

药物理化信息

【化学名】1－甲基－4－（1－甲基乙烯基）环己烯

【分子式】$C_{10}H_{16}$

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理：本品为利胆药，具有利胆、溶石、理气开胃、消炎、止痛等作用。

2．毒理：小鼠急性毒性实验结果表明，本品对肝、肾功能无明显影响，对动物各脏器均未见明显病变和病理性改变。

【药代动力学】本品口服后经胃肠迅速吸收，可分布到体内各个部位，48小时内75%～95%的给药量经尿排泄。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
桉柠蒎肠溶软胶囊	化学药	HZ000140
柠檬烯胶囊	化学药	HZ002812

HY001486　牛磺酸

【其他名称】2－氨基乙磺酸、牛胆酸、牛胆素

【外文名称】Taurine

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】2－氨基乙磺酸

【分子式】$C_2H_7NO_3S$

【分子量】125.14

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末；无臭，味微酸。本品在水中溶解，在乙醇、乙醚或丙酮中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品有多种药理活性。

1．强肝利胆作用：豚鼠实验表明，牛磺酸可解除胆汁阻塞，呈利胆作用。

2．解热与抗炎作用：本品可能通过对中枢5－HT系统或儿茶酚胺系统的作用降低体温，用于治疗急性肝炎、感冒、发热、疼痛、神经痛、扁桃体炎、支气管炎、风湿性关节炎、脑炎等。

3．降压作用。

4．强心和抗心律失常作用。

5．降血糖作用。

6．松弛骨骼肌和拮抗肌强直的作用。

【药物相互作用】本品可增强脂溶性维生素、激素的吸收。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
复方硫酸软骨素滴眼液（1）	化学药	HZ001274
复方硫酸软骨素滴眼液（2）	化学药	HZ001275
复方尿维氨滴眼液	化学药	HZ001328
复方牛磺酸滴眼液	化学药	HZ001329
复方牛磺酸胶囊	化学药	HZ001330
复方四维女贞子胶囊	化学药	HZ001399
牛磺酸滴眼液	化学药	HZ002813
牛磺酸胶囊	化学药	HZ002814
牛磺酸颗粒	化学药	HZ002815
牛磺酸片	化学药	HZ002816
牛磺酸散	化学药	HZ002817
七维牛磺酸口服溶液	化学药	HZ002926
五维牛磺酸口服液	化学药	HZ003609
小儿复方氨基酸注射液（18AA－Ⅱ）	化学药	HZ003750
小儿复方氨基酸注射液（19AA－Ⅰ）	化学药	HZ003751
乙诺奇片	中成药	ZC006803

HY001487　浓氨溶液

【外文名称】Strong Ammonia Solution

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

【分子式】NH_3

【分子量】17.03

【性状及组成】本品为无色的澄清液体；有强烈刺激性的特臭；易挥发；显碱性反应。

本品能与水或乙醇任意混合。

相对密度：本品的相对密度为0.900～0.908。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：制剂用药。

氨溶液在药物制剂中一般以稀溶液的形式使用。通常，氨溶液用做缓冲剂或用来调节溶液的pH。浓

缩型浓氨液经常用来稀释制备浓度更小的氨溶液。

在治疗上，稀氨溶液被用作“嗅盐”中的反射刺激剂，用作发赤剂，以及作为昆虫咬伤或螫伤的抗刺激剂。

【药物相互作用】本品与酸、氧化物均发生配伍反应。

【不良反应】本品一般公认是安全的（FDA，1975），一日允许摄入量不作限制性规定（FAO/WHO，1985）。本品对人的皮肤、眼、鼻有刺激性和腐蚀性。

食入浓氨溶液非常危险，会造成口腔，喉咙和胃肠道的强烈疼痛和强烈水肿及咳嗽、呕吐、休克。食管和胃的灼伤可导致穿孔。蒸气的吸入会引起喷嚏、咳嗽，高浓度会引起肺水肿。也有报道会引起窒息。蒸气对眼睛有刺激性。浓溶液伤害结膜和黏膜。即使是稀氨溶液用于昆虫咬伤治疗时，特别是包扎后，也会灼伤皮肤。

当作为溶剂使用时，氨溶液应高度稀释后应用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
桉氨溶液	化学药	HZ000139
复方甘草口服溶液	化学药	HZ001173
稀氨溶液	化学药	HZ003650
清凉油	中成药	ZC004112
清凉油（棕色）	中成药	ZC004114
万宝油	中成药	ZC005639
远志糖浆	中成药	ZC007137

HY001488 浓戊二醛溶液

【外文名称】Strong Glutaral Solution

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

【性状及组成】本品为淡黄色的澄清液体；有刺激性特臭。本品能与水或乙醇任意混合。

药物药理信息

【药理毒理】消毒防腐药。橡胶、塑料制品及手术器械消毒，常用 2% 水溶液。

【药物相互作用】器械消毒时加 0.5% 亚硝酸钠溶液。

【不良反应】宜致皮肤和黏膜损伤。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
稀戊二醛溶液	化学药	HZ003653

HY001489 诺氟沙星

【外文名称】Norfloxacin

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】1－乙基－6－氟－1,4－二氢－4－氧代－7－（1－哌嗪基）－3－喹啉羧酸

【分子式】$C_{16}H_{18}FN_3O_3$

【分子量】319.24

【性状及组成】本品为类白色至淡黄色结晶性粉末；无臭，味微苦；在空气中能吸收水分，遇光色渐变深。本品在二甲基甲酰胺中略溶，在水或乙醇中极微溶解，在醋酸、盐酸或氢氧化钠溶液中易溶。

本品的熔点为 218～224℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：喹诺酮类抗菌药。

本品为氟喹诺酮类抗菌药，具广谱抗菌作用，尤其对需氧革兰阴性杆菌的抗菌活性高，对下列细菌在体外具良好抗菌作用：肠杆菌科的大部分细菌，包括枸橼酸杆菌属、阴沟肠杆菌、产气肠杆菌等肠杆菌属、大肠埃希菌、克雷伯菌属、变形菌属、沙门菌属、志贺菌属、弧菌属、耶尔森菌等。诺氟沙星体外对多重耐药菌亦具抗菌活性。对青霉素耐药的淋病奈瑟菌、流感嗜血杆菌和卡他莫拉菌亦有良好抗菌作用。

最低抑菌浓度一般低于 0.5μg/ml。流感杆菌对本品亦高度敏感。对铜绿假单胞菌及其他假单孢菌亦有作用，但需要较高的浓度，最低抑菌浓度在 4～32μg/ml；由于在尿中浓度超过上述浓度数倍至十多倍，用于治疗铜绿假单胞菌泌尿系统感染仍然有效。在革兰阳性球菌中，对金黄色葡萄球菌及表皮葡萄球菌较敏感，抑制 90% 细菌的最低浓度约为 1～2μg/ml，对肠球菌和肺炎球菌的抑制 90% 细菌的最低浓度约为 4μg/ml 和 16μg/ml。

诺氟沙星为杀菌剂，通过作用于细菌 DNA 螺旋酶的 A 亚单位，抑制 DNA 的合成和复制而导致细菌死亡。

【药代动力学】空腹时口服吸收迅速但不完全，约为给药量的 30%～40%；广泛分布于各组织、体液中，如肝、肾、肺、前列腺、睾丸、子宫及胆汁、痰液、水疱液、血、尿液等，但未见于中枢神经系统。血清蛋白结合率为 10%～15%，血消除半衰期为 3～4 小时，肾功能减退时可延长至 6～9 小时。

单次口服本品 400mg 和 800mg，经 1～2 小时血药浓度达峰值，血药峰浓度分别为 1.4～1.6mg/L 和

2.5mg/L。肾脏（肾小球滤过和肾小管分泌）和肝胆系统为主要排泄途径，26% ~ 32%以原形和小于10%以代谢物形式自尿中排出，自胆汁和（或）粪便排出占28% ~ 30%。

尿液pH影响本品的溶解度。尿液pH7.5时溶解最少，其他pH时溶解增多。

健康成人空腹一次口服本品0.4g，1 ~ 2小时血药峰浓度为1.32μg/ml，8小时后尚有0.33μg/ml，吸收半衰期为0.41小时，分布相半衰期为0.41小时，消除相半衰期为2.54小时。12小时内尿中平均排出量占给药量的27.88%，其中22.56%在6小时内排出。

大鼠口服本品后，迅速分布各组织间，肾、肝、淋巴结、脾、颚下腺、血浆等的药物浓度均较高，上颚扁桃体及兔的皮肤也有分布。

静脉滴注本品0.4g，经0.5小时后达血药峰浓度，约为5μg/ml，随后逐渐降低，1小时后血药浓度约为2μg/ml，4小时后血药浓度约为1.0μg/ml，9小时后血药浓度约为0.05μg/ml。本品迅速分布，分布半衰期约为0.245 ± 0.93小时，广泛分布于各组织、体液中，如肝、肾、肺、前列腺、睾丸、子宫及胆汁、痰液、水疱液、血、尿液等，但未见于中枢神经系统。血清蛋白结合率为10% ~ 15%。从体内消除较慢，血消除半衰期约为4.45 ± 1.42小时，肾功能减退时可延长。肾脏（肾小球滤过和肾小管分泌）和肝胆系统为主要排泄途径，26% ~ 32%以原形和小于10%以代谢物形式自尿中排出、自胆汁和（或）粪便排中的排出量占28% ~ 30%。

【药物相互作用】

1. 尿碱化剂可减少本品在尿中的溶解度，导致结晶尿和肾毒性。

2. 本品与茶碱类合用时可能由于与细胞色素P450结合部位的竞争性抑制，导致茶碱类的肝清除明显减少，血消除半衰期延长，血药浓度升高，出现茶碱中毒症状，如恶心、呕吐、震颤、不安、激动、抽搐、心悸等，故合用时应测定茶碱类血药浓度和调整剂量。

3. 环孢素与本品合用，可使前者的血药浓度升高，必须监测环孢素血浓度，并调整剂量。

4. 本品与抗凝药华法林同用时可增强后者的抗凝作用，合用时应严密监测患者的凝血酶原时间。

5. 丙磺舒可减少本品自肾小管分泌约50%，合用时可因本品血浓度增高而产生毒性。

6. 本品与呋喃妥因有拮抗作用，不推荐联合应用。

7. 多种维生素，或其他含铁、锌离子的制剂及含铝或镁的制酸药可减少本品的吸收，建议避免合用，不能避免时在本品服药前2小时，或服药后6小时服用。

8. 去羟肌苷可减少本品的口服吸收，因其制剂中含铝及镁，可与氟喹诺酮类螯合，故不宜合用。

9. 本品干扰咖啡因的代谢，从而导致咖啡因清除减少、血消除半衰期延长，并可能产生中枢神经系统毒性。

【药物过量】小鼠及大鼠单剂口服本品剂量达4g/kg，未发现致死作用。急性药物过量时需进行催吐或洗胃促使胃排空，仔细观察病情变化，予以对症处理及支持疗法。必须维持适当的补液量。

【不良反应】

1. 胃肠道反应：较为常见，可表现为腹部不适或疼痛、腹泻、恶心或呕吐。

2. 中枢神经系统反应：可有头昏、头痛、嗜睡或失眠。

3. 过敏反应：皮疹、皮肤瘙痒，偶可发生渗出性多性红斑及血管神经性水肿。少数患者有光敏反应。

4. 偶可发生：①癫痫发作、精神异常、烦躁不安、意识障碍、幻觉、震颤。②血尿、发热、皮疹等间质性肾炎表现。③静脉炎。④结晶尿，多见于高剂量应用时。⑤关节疼痛。

5. 少数患者可发生血清氨基转移酶升高、血尿素氮增高及血常规白细胞降低，多属轻度，并呈一过性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
诺氟沙星滴眼液	化学药	HZ002825
诺氟沙星胶囊	化学药	HZ002826
诺氟沙星脚气水	化学药	HZ002827
诺氟沙星片	化学药	HZ002828
诺氟沙星葡萄糖注射液	化学药	HZ002829
诺氟沙星乳膏	化学药	HZ002830
诺氟沙星软膏	化学药	HZ002831
诺氟沙星栓	化学药	HZ002832
诺氟沙星药膜	化学药	HZ002833
诺氟沙星注射液	化学药	HZ002834
小儿诺氟沙星糖粉	化学药	HZ003765

HY001490　诺美沙朵

【外文名称】Noracymethadol

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】本品为麻醉性镇痛药。国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品。

HY001491 诺米芬新

【其他名称】氨苯甲异喹、Alival、Meritpi

【外文名称】Nomifensine

药物药理信息

【药理毒理】本品为四氢异喹琳衍生物，具有抗抑郁作用。适用于治疗内源性抑郁症、躁狂抑郁症、焦虑抑郁症。

【药物相互作用】应用MAOI者，在14日内不可用本品。

【不良反应】不良反应有焦虑不安、恶心、呕吐、口干，罕见有溶血性贫血。可加重精神分裂症，故精神病人禁用。

HY001492 诺匹哌酮

【外文名称】Norpipanone

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY001493 帕非洛尔

【外文名称】Pafenolol

药物药理信息

【药理毒理】选择性阻断β_1-受体，无内在拟交感活性，但作用为普萘洛尔的1～3倍。用于高血压。

【不良反应】可见乏力、嗜睡、头晕、失眠、恶心、腹胀、皮疹、晕厥、低血压、心动过缓等。

HY001494 帕米膦酸二钠

【外文名称】Pamidronate Disodium

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第58册

药物理化信息

【化学名】3-氨基-1-羟基亚丙叉-1，1-二膦酸二钠五水合物

【分子式】$C_3H_9NNa_2O_7P_2 \cdot 5H_2O$

【分子量】369.11

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末，无臭、无味；有引湿性，在干热空气中易失水。

本品在水中溶解，在乙醇中不溶，在氢氧化钠试液中易溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为双膦酸类药物，体外和动物试验表明可强烈抑制羟磷灰石的溶解和破骨细胞的活性，对骨质的吸收具有十分显著的抑制作用。对癌症的溶骨性骨转移所致的疼痛有止痛作用，亦可用于治疗癌症所致的高钙血症。

【药代动力学】文献报道，癌症病人以该品45mg溶于500ml氯化钠注射液后静脉滴注4小时以上，滴注结束时血浓度为0.96μg/ml，平均有51%的药物以原形从尿中排泄；尿的排泄显示双相处置动力学特点，$t_{1/2\alpha}$和$t_{1/2\beta}$分别为1.6小时和27.2小时。动物实验表明：给药后迅速从循环系统消除，主要分布在骨骼、肝脏、脾脏和气管软骨中。本品可长期滞留于骨组织中，半衰期最长可达300天。

【药物过量】过量或速度过快，可能引起低钙血症，出现抽搐、手指麻木症状，可适量补钙。

【不良反应】少数病人可出现轻度恶心、胸痛、胸闷、头晕乏力及轻微肝肾功能改变等，偶见发热反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
帕米膦酸—钠葡萄糖注射液	化学药	HZ002836
帕米膦酸二钠注射液	化学药	HZ002837
注射用帕米膦酸二钠	化学药	HZ004913

HY001495 帕尼培南

【外文名称】Panipenem

【性状及组成】本品为白色-淡黄色，呈粉末状或块状。极易溶于水，易溶于甲醇，不易溶于无水乙醇，几乎不溶于乙醚。具有吸湿性，遇湿潮解。

药物药理信息

【药理毒理】帕尼培南是碳青霉烯类抗生素，具有抗菌谱广，抗菌活性强，对G^-菌和G^+菌，需氧和厌氧菌包括多重耐药或产β-内酰胺酶的细菌皆有强大的抗菌活性。对金葡球菌、表皮葡萄球菌、大肠杆菌、肺炎杆菌、流感杆菌、阴沟杆菌、变形

杆菌、枸橼酸杆菌、类杆菌属等作用强，对铜绿假单胞菌有效。帕尼培南对青霉素结合蛋白显示高亲和性，抑制细胞壁合成而发挥杀菌作用。对各种β-内酰胺酶稳定。

【药代动力学】帕尼培南复方制剂帕尼培南/倍他米隆投药量为250mg，500mg和1.0g时，帕尼培南血浆中浓度分别为14.26和27.51，49.27μg/ml。帕尼培南和倍他米隆血液半衰期分别为70和40分钟，投药后24小时内的帕尼培南和倍他米隆累积尿中排泄率分别为28%～31%和93%～100%，静脉点滴开始0～2小时内的平均尿中浓度分别为361～938和1287～3893μg/ml。本制剂应用后分布于痰液、前列腺、胆汁、子宫、卵巢、输卵管、盆腔死腔液、前房水、皮肤、中耳、上额窦黏膜、扁桃体组织、口腔组织、唾液、脑脊液等，无蓄积作用。帕尼培南通过肾小球的滤过，主要从肾脏排泄，受丙磺舒影响小。

【药物相互作用】可致血中丙戊酸钠浓度降低，导致癫痫发作。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用帕尼培南倍他米隆	化学药	HZ0004914

HY001496　哌苯甲醇

【其他名称】MERATRAN、米拉脱灵、匹普鲁多

【外文名称】Pipradrol

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

药物药理信息

【药理毒理】本品为精神兴奋药。能提高精神活动，可对抗抑郁症。作用比苯丙胺弱，毒性及不良反应亦较少。主要用于轻微脑功能失调（MBD）。

【药代动力学】口服易吸收，一次服药作用可维持4小时左右。在体内迅速代谢，经尿排出。$t_{1/2}$为30分钟。

【不良反应】超量可引起失眠、恶心、食欲减退、焦虑等不良反应。一般停药后即可消失。

HY001497　哌泊噻嗪十一烯酸酯

【其他名称】十一烯酸哌泊噻嗪

【外文名称】Pipotiazine Undecylenat

药物药理信息

【药理毒理】本品是长效抗精神病药，治疗精神病肌注100mg，维持时间为2～3周。

HY001498　哌泊噻嗪棕榈酸酯

【其他名称】安乐嗪棕榈酸酯、安棕酯、棕榈酸哌泊噻嗪

【外文名称】Pipotiazine Palmitate

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第9册

药物理化信息

【化学名】10-［3-［4-（2-羟基乙基）哌啶子基］丙基］-*N*,*N*-二甲基吩噻嗪-2-磺酰胺棕榈酸酯

【分子式】$C_{40}H_{63}N_3O_4S_2$

【分子量】714.09

【性状及组成】本品为淡黄色结晶性粉末；无臭、无味。

本品在三氯甲烷中极易溶解，在丙酮或乙醚中易溶，在无水乙醇中微溶，在水中不溶。

熔点：本品的熔点为58.0～61.5℃。

药物药理信息

【药理毒理】动物试验证明，药物从注射点缓慢向组织中扩散，在组织中药物分子被酶水解生成具有中枢性作用的物质——哌泊噻嗪。通过对大鼠对抗苯丙胺和阿扑吗啡引起的刻板动作症等十项试验证明，本药具有强力的中枢活性，其生物活性衰减缓慢、具有长效抗精神病作用，本品能有效地激发中枢多巴胺的代谢，选择性地增加3，4-二羟苯乙酸硫酸酯的血浆水平。本品对心血管及呼吸系统无明显影响，无抗胆碱能作用，仅有微弱的抗肾上腺素能作用。

【药代动力学】大鼠肌内注射氚标记的哌泊噻嗪棕榈酸酯0.75mg/kg时，血浆浓度不超过100μg/L，脑中最大浓度不超过200μg/kg，20～30天内约有50%放射活性物排出体外，80天后有90%排出体外，80天内任何时刻注射药物的那条腿留有的放射活性占整体的95%，45天从尿和粪中排出的放射活性物占注入的65%，从粪中排出的约是从尿中排出的10倍。

【不良反应】主要有锥体外系反应，常出现震颤、强直、静坐不能、动眼危相、反射亢进、流涎等症状，一般在继续治疗或减少剂量时可消除或好转，严重时可使用抗帕金森氏症药物。此外，可有迟发性运动障碍、睡眠障碍、口干、恶心、低血压、便秘、畏食、月经不调、乏力等不良反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
哌泊噻嗪棕榈酸酯注射液	化学药	HZ002839

HY001499 哌啶

药物管理信息

【特殊管理分类】易制毒药

药物药理信息

【药理毒理】本品是一种强有机碱。主要在医药工业中用于制备硝酸哌啶、盐酸哌啶等药物。也用于橡胶工业和塑料工业的有机合成。还用作环氧树脂固化剂。

《易制毒化学品管理条例》（国务院令第445号）规定本品为易制毒化学药品。

HY001500 哌腈米特

【外文名称】Piritramide

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安〔2007〕633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY001501 哌库溴铵

【其他名称】必可松、RGH－1106、溴化比哌考尼、溴化比哌尼

【外文名称】Pipecuronium Bromide

药物理化信息

【化学名】2β，6β－二（4－二甲基哌嗪基））－3α，17β－二乙基酰氧基－5α－雄甾烷二溴化物

【分子式】$C_{35}H_{62}Br_2N_4O_4$

【分子量】762.70

药物药理信息

【药理毒理】非去极化型神经肌肉阻断剂。

通过与神经递质乙酰胆碱竞争性结合横纹肌运动终极板区烟碱样受体，阻断运动神经和横纹肌间的信号传递过程。

与去极化神经肌肉阻断剂如琥珀胆碱不同，哌库溴铵不会引起肌颤。

哌库溴铵无激素活性。

应用胆碱酯酶抑制剂如新斯的明、吡啶斯的明或依酯氯铵，可消除哌库溴铵的神经肌肉阻断作用。

哌库溴铵的神经肌肉阻断作用对横纹肌具有高度选择性。

哌库溴铵既无神经节阻断作用，也无抗迷走神经作用和拟交感神经活性，即使药物剂量倍量于ED_{90}的剂量（产生90%肌颤抑制所需剂量），也无这些作用。目前为止，尚未观察到哌库溴铵的心血管不良反应。

通过剂量－反应曲线的研究表明，哌库溴铵用于平稳麻醉的ED_{50}（产生50%肌颤抑制所需剂量）和ED_{90}分别为0.03和0.05mg/kg体重。剂量为0.05mg/kg体重时足以为大量平均时间40～50分钟的外科手术提供充分的肌松作用。

从给药到出现最大神经肌肉阻断作用的时间（起效时间）取决于给药剂量其范围从1.5分钟到5分钟之间。当剂量达到0.07～0.08mg/kg体重时，起效时间最短。进一步加大剂量不能缩短起效时间，却能明显延长作用时间。

【药代动力学】在氟烷麻醉时，以0.007mg/kg体重静脉给药后，血浆半衰期大约为3.6±2.5分钟。稳态分布容积为3000±78ml/kg，哌库溴铵的消除半衰期平均为121±45分钟，血浆清除率大约为2.4±0.5ml/（min·kg）；在采取神经麻醉时这些数值分别为7.6，353，161和1.8。在体内，主要以原形通过肾脏排泄。维持剂量在0.01～0.02mg/kg体重之间，当按25%的恢复控制肌颤程度重复给予维持剂量，其蓄积作用可以忽略不计或无蓄积作用。

【药物相互作用】下列药物可影响非去极化神经肌肉阻断药物的作用强度或/和作用时间。

1．加强和（或）延长作用

（1）吸入麻醉药（氟烷、甲氧氟烷、乙醚、安氟醚、异氟烷、环丙烷）。

（2）静脉麻醉药（氯铵酮、芬太尼、丙泮尼地、巴比妥酸盐、嗪羟脂）。

（3）大剂量局麻药。

（4）其他非去极化肌肉松弛剂，预先给予琥珀胆碱。

（5）某些抗生素（氨基糖苷类和多肽类抗生素、咪唑类、甲硝唑等）。

（6）利尿药、β－肾上腺素能受体阻滞剂、维生素B1，单胺氧化酶抑制剂，胍类、鱼精蛋白、α－肾上腺素能受体阻滞剂，钙拮抗剂、镁盐。

（7）大多数抗心律失常药物，包括奎尼丁和静脉注射的利多卡因，增强非去极化肌松药的阻断作用。

2．作用变化：长期使用皮质类固醇激素、新斯的明、氯化依酯氯铵、吡啶斯的明、去甲肾上腺素、咪唑巯嘌呤、茶碱，术前给予氯化钾、氯化钠、氯化钙。去极化肌松药减弱非去极化肌松药的作用。

3. 不确定反应：应用本品后再给予去极化肌松药可以引起肌肉阻断作用的增强或减弱（取决于剂量、应用时间和个体敏感性）。

4. 其他：不推荐本品与其他溶液或药物在同一注射器内注射。

【药物过量】在药物过量或神经肌肉阻断作用延长的情况下，应保持机械通气，直至病人恢复自主呼吸。在恢复期，胆碱酯酶抑制剂作为解毒剂，应足量给予，并严密检测，慎重估计自主呼吸能力。

根据外周神经刺激仪或临床肌肉松弛阻断症状评定，本品引起的神经肌肉阻断作用的 80% ~ 85% 可被 1 ~ 3mg 的新斯的明或 10 ~ 30mg 的加兰他敏拮抗，应连用阿托品。肌松作用的逆转程度应在通过外周神经刺激仪检测核对并同时观察临床肌肉阻断症状而改善。

【不良反应】有报道可见对神经肌肉阻断剂的全身过敏反应和组胺释放反应。尽管关于哌库溴铵此种不良反应未见报道，但应始终保持警惕治疗此种不良反应。特别是对已知先前对肌肉阻断剂有过敏反应者，应用哌库溴铵应特别谨慎。

剂量达 0.1mg/kg 体重时，并不引起神经结阻断或抗迷走神经作用，只观察到对心血管系统的、血压或心率有轻微的影响。对于在诱导麻醉时使用氟烷或芬太尼的病人，可以出现心动过缓和血压下降。

本品不引起组胺释放反应，偶见过敏反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用哌库溴铵	化学药	HZ004915

HY001502　哌拉西林

【其他名称】Pipracil、Piprl、Tazocin、氧哌嗪青霉素

【外文名称】Piperacillin

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（2*S*，5*R*，6*R*）－3,3－二甲基－6－[（4－乙基－2,3－二氧代－1－哌嗪甲酰氨基）苯乙酰氨基]－7－氧代－4－硫杂－1－氮杂双环[3.2.0]庚烷－2－甲酸

【分子式】$C_{23}H_{27}N_5O_7S \cdot H_2O$

【分子量】535.58

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；无臭；略有引湿性。

本品在甲醇中易溶，在无水乙醇或丙酮中溶解，在水中极微溶解。

比旋度：取本品，精密称定，加无水乙醇溶解并稀释成每 1ml 中含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为 + 160°至 + 178°。

药物药理信息

【药理毒理】β－内酰胺类抗生素，青霉素类。

HY001503　哌拉西林钠

【外文名称】Piperacillin Sodium

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（2*S*，5*R*，6*R*）－3.3－二甲基－6－[（4－乙基－2，3－二氧代－1－哌嗪甲酰氨基）苯乙酰氨基]－7－氧代－4－硫杂－1－氮杂双环[3.2.0]庚烷－2－甲酸钠盐

【分子式】$C_{23}H_{26}N_5NaO_7S$

【分子量】539.54

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末；无臭；极易引湿。本品在水或甲醇中极易溶解，在无水乙醇中溶解，在丙酮中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并稀释成每 1ml 中含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为 + 175°至 + 190°。

药物药理信息

【药理毒理】β－内酰胺类抗生素，青霉素类。

哌拉西林是半合成青霉素类抗生素，具广谱抗菌作用。哌拉西林对大肠埃希菌、变形杆菌属、沙雷菌属、克雷伯菌属、肠杆菌属、枸橼酸菌属、沙门菌属和志贺菌属等肠杆菌科细菌，以及铜绿假单胞菌、不动杆菌属、流感嗜血杆菌、奈瑟菌属等其他革兰阴性菌均具有良好抗菌作用。本品对肠球菌属、A 组、B 组溶血性链球菌、肺炎链球菌以及不产青霉素酶的葡萄球菌亦具有一定抗菌活性。包括脆弱拟杆菌、梭状芽孢杆菌等许多厌氧菌也对哌拉西林敏感。

哌拉西林的作用机制为通过抑制细菌细胞壁合成发挥杀菌作用。

【药代动力学】本品口服不吸收。正常人肌内注射本品 1g 后 0.71 小时达血药峰浓度为 52.2mg/L，6 小时血药浓度为 1.3mg/L。静脉滴注和静脉推注本品 1g 后即刻血药浓度达 58.0mg/L 和 142.1mg/L，6 小时分别为 0.5mg/L 和 0.6mg/L。给严重肾功能损害病人（内生肌酐清除率≤5ml/L）于 30 分钟内按体重静脉滴注 70mg/kg，1 小时后的血药浓度约为 350mg/L。

本品的血清蛋白结合率为17%～22%，表观分布容积为0.18～0.3L/kg，分布半衰期为11～20分钟，在骨、心脏等组织和体液中分布良好，在脑膜有炎症时在脑脊液中也可达到相当浓度。

正常肾功能者哌拉西林血消除半衰期为0.6～1.2小时，中度以上肾功能不全者可延长至3.3～5.1小时，在肝内不代谢。本品系通过肾（肾小球滤过和肾小管分泌）和非肾（主要经胆汁）途径清除。静脉注射1g后，12小时尿中排出给药量的49%～68%。肝功能正常者10%～20%的药物经胆汁排泄。很少量药物经乳汁排出。血液透析4小时可清除给药量的30%～50%。肌内注射前1小时口服丙磺舒1g，可使血药峰浓度增高30%，血消除半衰期延长30%。

【药物相互作用】

1．在体外本品与氨基糖苷类药物（阿米卡星、庆大霉素或妥布霉素）合用对铜绿假单胞菌、部分肠杆菌科细菌具有协同抗菌作用。

2．本品与头孢西丁合用，因后者可诱导细菌产生β－内酰胺酶而对铜绿假单胞菌、沙雷菌属、变形杆菌属和肠杆菌属出现拮抗作用。

3．与肝素、香豆素、茚满二酮等抗凝血药及非甾体抗炎止痛药合用时可增加出血危险，与栓溶剂合用可发生严重出血。

4．本品与氨基糖苷类抗生素不能同瓶滴注，否则两者的抗菌活性均减弱。

【药物过量】应及时停药并予对症、支持治疗。血液透析可清除哌拉西林。

【不良反应】

1．过敏反应：青霉素类药物过敏反应较常见，包括荨麻疹等各类皮疹、白细胞减少、间质性肾炎、哮喘发作和血清病型反应，严重者如过敏性休克偶见；过敏性休克一旦发生，必须就地抢救，予以保持气道畅通、吸氧及给用肾上腺素、糖皮质激素等治疗措施。

2．局部症状：局部注射部位疼痛、血栓性静脉炎等。

3．消化道症状：腹泻、稀便、恶心、呕吐等；伪膜性肠炎罕见。

4．个别患者可出现胆汁淤积性黄疸。

5．中枢神经系统症状：头痛、头晕和疲倦等。

6．肾功能减退者应用大剂量时，因脑脊液浓度增高，出现青霉素脑病，故此时应按肾功能进行剂量调整。

7．其他：念珠菌二重感染、出血等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用哌拉西林钠	化学药	HZ004916
注射用哌拉西林钠舒巴坦钠	化学药	HZ004917
注射用哌拉西林钠他唑巴坦钠	化学药	HZ004918

HY001504 哌替啶中间体A

【外文名称】Pethidine Intermediate A

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY001505 哌替啶中间体B

【外文名称】Pethidine Intermediate B

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY001506 哌替啶中间体C

【外文名称】Pethidine Intermediate C

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY001507 α－蒎烯

【外文名称】α－pinene

药物药理信息

【药理毒理】本品为烃类合成香料。主要用于配制香水及消臭剂，用作合成萜品醇、冰片、樟脑的原料，并且可以进行异构化反应生成β－蒎烯，其用作各种蒎烯类合成香料的起始原料。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
桉柠蒎肠溶软胶囊	化学药	HZ000140

HY001508　潘必啶

【其他名称】五甲哌啶

【外文名称】Pempidine

药物药理信息

【药理毒理】本品为神经节阻断药，用于重症高血压。

【药代动力学】口服吸收迅速完全，2小时其血药浓度达高峰，大部分药在24小时内排出。

【不良反应】不良反应与美卡拉明相仿，但较少见。

HY001509　泮库溴铵

【外文名称】Pancuronium Bromide

药物理化信息

【化学名】1,1′［－（3α，17β－双乙酰氧基）－5α雄甾烷－2β，16β－撑］－双（1－甲基哌啶）二溴物

【分子式】$C_{35}H_{60}N_2O_4Br_2$

【分子量】732.68

药物药理信息

【药理毒理】本品为类固醇铵类中长时间显效的非去极化型肌肉松弛药，能与递质乙酰胆碱竞争神经肌肉接头的N_2胆碱受体，从而产生骨骼肌的松弛，强度为氯化筒箭毒碱的5～7倍，时效较之为短或与之近似。由于抗迷走神经作用及儿茶酚胺释放作用，用药后有轻度心率加快，外周阻力增加与血压升高。临床剂量无神经节阻断作用，组胺释放作用较弱，不引起低血压。能解除肌肉成束收缩、强直、阵挛或惊厥，便于机械通气管理。可用于剖腹产，其透过胎盘之量少，不影响新生儿的Apgar评分、肌肉张力及心肺适应性。

【药代动力学】静脉注射后4～6分钟起效，维持临床肌松时间约120分钟。血浆蛋白结合率约10%。约20%经肝脏降解，其代谢物为3－OH、17－OH和3，17－OH衍生物，无明显的神经肌肉阻断作用。主要由肾脏排泄，约40%～50%以原形由尿中排出，泮库溴铵及代谢物的40%由胆汁排泄。$t_{1/2\beta}$为107分钟，肝、肾功能不全者，其消除时间延长。

【药物相互作用】影响泮库溴铵非去极化神经肌肉阻断作用的药物如下。

1．增效作用的药物：吸入麻醉剂（如氟烷、乙醚、安氟醚、异氟醚）、硫喷妥钠、氯胺酮、芬太尼、甲苄咪唑等，尤以安氟醚和异氟醚作用更为强大。

其他非去极化神经肌肉松弛剂如，琥珀酰胆碱、氨基苷类抗生素、多肽类抗生素、利尿剂、肾上腺素阻断剂、维生素B_1、单氨氧化酶抑制剂、奎尼丁、鱼精蛋白、苯妥英钠、咪唑安定、甲硝唑、镁盐等都能增强其作用，应予充分注意。

2．减效作用药物：新斯的明、依酚氯铵、吡啶斯的明、去甲肾上腺素、硫唑嘌呤、茶碱、氯化钾、氯化钙。

【药物过量】过量泮库溴铵可延长神经肌肉阻断作用，病人只能在机械作用下呼吸，这时可适当地给予拮抗药，如新斯的明、依酚氯铵等，直到病人自主呼吸恢复为止。

【不良反应】

1．可产生心血管作用，如心率略增快，平均动脉血压和心输出量略增加。

2．极少数患者可出现过敏反应和组胺释放。

3．在麻醉过程中有时出现流涎，特别是术前未使用抗胆碱能药物时。

4．可使正常及升高之眼压明显下降（±20%）达数分钟之久，也会产生缩瞳。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
泮库溴铵注射液	化学药	HZ002841

HY001510　泮托拉唑钠

【外文名称】Pantoprazole Sodium

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】5－二氟甲氧基－2－［［（3，4－二甲氧基－2－吡啶基）－甲基］亚磺酰基］－1H－苯并咪唑钠一水合物

【分子式】$C_{16}H_{14}F_2N_3NaO_4S\cdot H_2O$

【分子量】423.38

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末。

本品在水或甲醇中易溶，在三氯甲烷或乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：消化系统用药。

本品为胃壁细胞质子泵抑制剂，在中性和弱酸性条件下相对稳定，在强酸性条件下迅速活化，其pH依赖的活化特性，使其对H^+、K^+－ATP酶的作

用具有更好的选择性。本品能特异性地抑制壁细胞顶端膜构成的分泌性微管和胞浆内的管状泡上的 H^+、K^+ – ATP 酶，引起该酶不可逆性的抑制，从而有效地抑制胃酸的分泌。由于 H^+、K^+ – ATP 酶是壁细胞泌酸的最后一个过程，故本品抑酸能力强大。它不仅能非竞争性抑制促胃泌素、组胺、胆碱引起的胃酸分泌，而且能抑制不受胆碱或 H_2 受体阻断剂影响的部分基础胃酸分泌。本品与其他药物伍用时，具有药物间相互作用小的优点。本品通过肝细胞内的细胞色素 P450 酶系的第Ⅰ系统进行代谢，同时也可以通过第Ⅱ系统进行代谢。当与其他通过 P450 酶系代谢的药物伍用时，本品的代谢途径可以通过第Ⅱ酶系统进行，从而不易发生药物代谢酶系的竞争性作用，减少体内药物间的相互作用。无致突变、致癌和致畸作用。

【药代动力学】本品具有较高的生物利用度，首次口服时即可以达到 70% ~ 80%，达峰时间 1 小时，有效抑酸达 24 小时。静脉注射与口服给药的生物利用度比值为 1.2。口服 40mg 时的 t_{max} 为 2 ~ 4 小时，C_{max} 约为 2 ~ 3μg/ml，清除半衰期约为 1.1 小时。约 80%的口服或静注本品的代谢物经尿中排泄，肾功能不全不影响药代动力学，肝功能不全时可延缓清除。$t_{1/2}$、清除率和表观分布容积与给药剂量无关。

【不良反应】偶见头晕、失眠、嗜睡、恶心、腹泻、便秘、皮疹和肌肉疼痛等症状。大剂量使用时可出现心律失常、氨基转移酶升高、肾功能改变、粒细胞降低等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
泮托拉唑钠肠溶胶囊	化学药	HZ002843
泮托拉唑钠肠溶片	化学药	HZ002844
注射用泮托拉唑钠	化学药	HZ004919

HY001511 抛射剂

【其他名称】氟里昂

【性状及组成】二氯二氟甲烷是液化气，在室温时，当贮藏于自身的蒸气压下为液态，当暴露于室温和大气压条件下呈气态。液态是无色无味的，高浓度气体微有乙醚臭。它无腐蚀性，无刺激性且不燃。二氯四氟乙烷是无色的，略有醚臭的不燃性的液化气体，三氯一氟甲烷室温常压下是澄清挥发性液体，它有类似四氯化碳的异臭，无刺激性，不燃。

药物药理信息

【药理毒理】药品标准类别：气雾剂抛射剂。

在气雾剂中，二氯二氟甲烷、二氯四氟乙烷和三氯一氟甲烷是氟里昂类抛射剂。

二氯二氟甲烷可单独或与二氯四氟乙烷、三氯一氟甲烷或氟里昂类混合使用，作为口腔或鼻腔给药的定量吸入气雾剂的抛射剂。二氯二氟甲烷也可作为胸膜内用的灭菌滑石粉气雾剂或单独用于含有类固醇的气雾剂的定量吸入剂。

二氯四氟乙烷与二氯二氟甲烷一起，有时也与二氯二氟甲烷、三氯一氟甲烷一起被用作口腔和鼻腔定量给药气雾剂的抛射剂。

三氯一氟甲烷和二氯二氟甲烷一起被用作定量给药用的口腔和鼻腔的气雾剂的抛射剂，它也可与二氯四氟乙烷和二氯二氟甲烷一起使用。

对溶液型气雾剂，这三种抛射剂可以混合使用，以达到定量吸入的药物的适宜溶解度，并且可以产生合适的蒸气压以得到最佳的粒径分布和适当的吸入分数。

混合三氯一氟甲烷和二氯二氟胶丸（抛射剂 11/12）或抛射剂 11/114/12 在 21℃时产生的蒸气压为 103 ~ 484kPa（15 ~ 70psig），这正覆盖了令人满意的气雾剂产品合适的粒径分布所需要的压力范围。三氯一氟甲烷在氟里昂中是惟一的在室温常压下为液体的物质，用它可作制备可溶性药物的糊状材料。

【药物相互作用】三氯一氟甲烷溶液的含水量大于 5%时，可使抛射剂水解并形成痕量的盐酸，可刺激皮肤并腐蚀金属容器。在乙醇存在下，三氯一氟甲烷也可与铝反应，腐蚀容器产生氢气，类似情况在痕量氧、过氧化物或其他自由基催化剂的存在下，乙醇可以与三氯一氟甲烷反应产生痕量的盐酸。

二氯二氟甲烷和二氯四氟乙烷均可与大部分气雾剂的组分配伍。因它们与水的可混合性很差，所以大部分定量吸入的气雾剂都作成混悬剂，而溶液型定量吸入气雾剂可以用乙醇作为共溶剂使完全溶解（含水量不大于 5%）。

【药物过量】安全性早已确定，作为口腔气雾剂抛射剂一般迅速气化，大部分气体逃逸而未被吸入，少量的抛射剂可随活性组分一起吸入并被携带进入呼吸系统，吸入部分可被迅速地从肺组织清除而不存在毒性问题。蓄意吸入过量氟里昂抛射剂可导致死亡。

【不良反应】二氯二氟甲烷，二氯四氟乙烷和三氯一氟甲烷作为局部用、口腔或鼻腔用气雾剂的抛射剂已有约 40 年的历史，一般认为按说明书使用无毒、无刺激性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
聚甲基丙烯酸乙氧乙酯气雾剂	化学药	HZ002028
利巴韦林气雾剂	化学药	HZ002205

HY001512　泡非美钠

【其他名称】Photofrin

【外文名称】Porfimer Sodium

【性状及组成】本品是以猪血中的血叶琳二盐酸盐为原料合成的叶琳醚及酯结合成的聚合物。

药物药理信息

【药理毒理】本品为血叶琳衍生物的纯化产品，通过酯和醚连接的光敏聚叶琳低聚物，结合在一起的聚合体。是对肿瘤有亲合性的光敏物质。与特定波长的激光并用，可作为抗肿瘤的新疗法。

作用机制：可能由于静脉给予本品后，肿瘤细胞比正常细胞摄取本品更多，而且滞留性也好。对本品滞留的肿瘤部位光照，由于本品吸收光能成为激活状态。这种光能在组织中可使氧转变成活性氧。这种活性氧抑制线粒体的酶系统而损害细胞内呼吸，引起肿瘤细胞变性、坏死。

【药物相互作用】下列药物可有致光敏作用，应用本品期间应避免使用：四环素类、磺胺类、吩噻嗪类、磺脲类降糖药、噻嗪类利尿剂、喹诺酮类抗菌药、非类固醇类消炎镇痛剂、氟脲嘧啶类抗癌药、甲氨蝶呤、灰黄霉素、甲基补骨酯。

【不良反应】有时有皮肤光敏反应、色素沉着、红斑、皮疹及颜面潮红、水肿等。有时 AST、ALT、ALP 升高及血清总蛋白减低。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用泡非美钠	化学药	HZ004920

HY001513　培哚普利叔丁胺盐

【外文名称】Perindopril

药物理化信息

【化学名】（2S，3a*S*，7a*S*）－1［（*S*）－*N*－［（*S*）－1－乙酯基丁基］丙氨酰］八氢－1H－吲哚－2－羧酸叔丁胺盐

【分子式】$C_{19}H_{32}N_2O_5$，$C_4H_{11}N$

【分子量】441.60

药物药理信息

【药理毒理】本品为不含巯基的强效、长效血管紧张素转换酶抑制剂，在肝内代谢为有活性的培哚普利拉而起作用。作用产生较慢。本品为含羧基的前体药。良好的抗高血压作用，降压效果持续，稳定，谷峰比值为 75% ~ 100%。

培哚普利是一种血管紧张转换酶抑制剂（ACEI）。血管紧张素转换酶可将血管紧张素Ⅰ转化为血管紧张素Ⅱ。血管紧张素Ⅱ具有明显的缩血管作用，并可刺激肾上腺皮质分泌醛固酮。培哚普利片可导致：醛固酮分泌减少；由于缺少醛固酮的副反馈，肾素活性增高；长期服用，总外周动脉阻力降低，且优先作用于肌肉和肾脏血流，不伴有钠和液体潴留或反射性心动过速。

与所有的转化酶抑制剂相同，培哚普利抑制强烈肽类血管扩张物质－缓激肽降解为无活性的肽类。

对于低肾素水平或正常肾素水平的患者，培哚普利均能降低血压。

培哚普利以其活性成分培哚普利拉发生作用，其他代谢产物无活性。

治疗高血压：培哚普利可用于治疗各种程度的高血压：轻度，中度，或重度。降低卧位和立位的收缩压和舒张压。服用单一剂量后，4 ~ 6 小时出现最大降压作用，而且持续 24 小时以上。24 小时后残留的转换酶抑制作用仍然很高（接近 80%）。

对于有效的患者，治疗 1 个月后血压可恢复正常化，而且不产生耐药性。

停止治疗后，不引起血压反跳。

培哚普利有血管扩张作用，恢复大动脉弹性并降低左室肥厚。

必要时与噻嗪类利尿剂合用可产生协同作用。转换酶抑制剂与噻嗪类利尿合用可以减少单独服用利尿剂引起的低血钾的危险性。

治疗心力衰竭：对慢性心衰的研究显示，和其他同类药物比较，培哚普利降低血压更为缓和，极少发生突然性血压下降。

【药代动力学】培哚普利口服吸收迅速。吸收量为服用剂量的 65% ~ 70%。培哚普利水解为培哚普利拉，培哚普利拉是特异性血管紧张素转换酶抑制剂。培哚普利拉的生成量受饮食的影响。血浆培哚普利拉达峰浓度的时间是 3 ~ 4 小时。血浆蛋白结合率少于 30%，而且为浓度依赖性。继连续每天 1 次服用培哚普利后，平均达到稳态浓度的时间是 4 天。有效的累积半衰期约为 24 小时。在肌酐清除率 < 60ml/min 的病人，血浆培哚普利拉浓度显著升高，这可能是由于肾衰或年老的关系。在心力衰竭患者，

药物的清除延缓。培哚普利的血液透析清除率是70ml/min。

在肝硬化的患者，培哚普利动力学有所改变，母体分子的肝清除率减半。而培哚普利拉的生成量并无减少，因此不需要调整剂量。ACE 抑制剂能通过胎盘。

【药物相互作用】

1．禁忌配伍

（1）保钾利尿剂（螺内酯，氨苯蝶啶，单独或联合），治疗心力衰竭时除外（小剂量 ACE 抑制剂＋保钾利尿剂）钾盐。

高钾血症（可以致命，尤其在肾衰的病例，药物对血钾的升高具有协同作用）。除低血钾的患者，不要将补钾制剂或保钾利尿剂与 ACE 抑制剂合用。

（2）锂：ACE 抑制剂升高血锂浓度甚至达到毒性水平（减少锂的肾排泄）。如果必须使用 ACE 抑制剂，必须严密监测血锂水平并调整剂量。

（3）雌二醇氨芥：血管神经性水肿的危险性增加。

2．谨慎配伍

（1）非甾体类抗炎药和水杨酸≥每日 3g：在高危患者［老年和（或）脱水患者］，ACE 抑制剂与非甾体类抗炎药合用，通过降低肾小球滤过、抑制扩血管前列腺素合成，可引起急性肾功能衰竭，而降血压作用减弱。故治疗开始时应适当补液，并监测肾功能。

（2）抗糖尿病制剂（胰岛素，磺脲类）：有关卡托普利和依那普利的描述，接受胰岛素和磺脲类降糖药治疗的患者，ACE 抑制剂可以增强降低血糖的作用。但极少出现低血糖症状（改善葡萄糖耐量而使胰岛素的需要量下降）加强血糖的自我监测。

（3）巴氯芬：增加抗高血压作用。必要时监测血压和调整抗高血压药物剂量。

（4）保钾利尿剂：在已有水钠丢失的病例，开始 ACE 抑制剂治疗时有引起突发性低血压和（或）急性肾衰竭的危险。在高血压患者，如果以前接受的利尿剂治疗已经引起水钠丢失（近期接受利尿剂治疗、低盐饮食、血液透析的患者）。

建议：开始 ACE 抑制剂治疗以前，停止使用利尿剂，以后必要的话，重新使用非保钾利尿剂。或由小剂量开始 ACE 抑制剂治疗并逐步增加剂量。对服用利尿剂的充血性心力衰竭患者，如果必要，在减少非保钾利尿剂剂量后，从小剂量开始 ACE 抑制剂治疗。所有的病例，开始 ACE 抑制剂治疗的最初几个星期内，监测肾脏功能（血肌酐）。

保钾利尿剂：单独或联合使用（阿米洛利，烯睾丙甲酸，螺内酯，氨苯蝶啶），用于治疗心力衰竭（小剂量 ACE 抑制剂＋保钾利尿剂）

如果对联合用药的地方条件不了解，ACE 抑制剂与保钾利尿剂合用存在引起高钾血症，甚至致命的危险。

使用小剂量 ACE 抑制剂和保钾利尿剂。事先排除高钾血症和肾功能不全的存在，密切监测血钾和血肌酐（在治疗后的第一个月内每周测定 2 次，此后每周测定 1 次）。

3．可以考虑的配伍

（1）氨磷汀：增强降血压作用。

（2）非甾体类抗炎药：如吲哚美辛类，可减弱抗高血压作用（NSAIDs 抑制血管扩张剂前列腺和保泰松的水钠潴留）

（3）三环类抗抑郁药，精神安定药，抗高血压作用和直立低血压的危险增加（协同作用）

（4）可的松，替可克肽（口服）（除外皮质激素作为 Addison 病的替代治疗），减弱抗高压作用（皮质激素导致水钠潴留）

一般考虑：应避免 ACE 抑制剂与免疫抑制剂和（或）可能导致白细胞减少的制剂合用，多种药物合用的病例，有必要严密监测血红蛋白和肾脏指标。

【药物过量】过量时最可能发生的事件是低血压。

一旦发生低血压，可以将病人放平至仰卧位且头部较低，必要时静脉注射等渗生理盐水或采取其他扩容的方法。

培哚普利的活性形式培哚普利拉可以通过透析排出体外。

【不良反应】

1．不良反应

（1）头痛，疲倦，眩晕，情绪或睡眠紊乱，痛性痉挛。

（2）体位性或非体位性血压。

（3）少数病例皮疹。

（4）胃痛，畏食，恶心，腹痛，味觉障碍。

（5）已报道干咳与服用 ACE 抑制剂有关，其特点为持续性，但停药后干咳消失。如有上述情况，应考虑这种症状可能是由药物引起的。

（6）极少见：血管神经性水肿。

2．对实验指标的影响

（1）血尿素和血肌酐中度升高，停止治疗后可恢复。这种升高多见于合并肾动脉狭窄、利尿剂治疗的高血压和肾衰患者。

（2）在肾小球肾病患者，ACE 抑制剂可引起蛋白尿。

（3）高血钾，通常为一过性。

（4）已报道贫血发生服用 ACE 抑制剂治疗的特殊病人（肾移植，血液透析）。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
培哚普利片	化学药	HZ002845
培哚普利吲达帕胺片	化学药	HZ002846

HY001514　培加帕加司

【其他名称】Oncaspar、培门冬酶

【外文名称】Pegaspargase

药物药理信息

【药理毒理】某些肿瘤细胞本身不能合成L-天门冬酰胺（它是合成蛋白质必需的氨基酸）。本品可使进入肿瘤组织的L-天门冬酰胺水解，肿瘤细胞得不到L-天门冬酰胺，而影响其蛋白质的合成，最终使肿瘤细胞的增长繁殖受到抑制。正常组织细胞自身有合成L-天门冬酰胺的能力，不受本品的影响。本品的抗原性比天然L-天门冬酰胺酶低。血浆半衰期比天然型显著延长。

【不良反应】

1. 过敏反应：本品肌内注射时，过敏反应发生率为天然L-天门冬酰胺酶过敏者的30%，而对天然L-天门冬酰胺酶不过敏的病人为11%。

2. 胰腺炎：约1%的患者发生胰腺炎，有时胰腺炎暴发是致命的。

3. 血栓形成：约4%的患者可发生血栓形成。

4. 可发生轻度到重度高血糖，约3%的患者需用胰岛素控制。

5. 肝功能损害：恶心、呕吐、发热不适、接触性刺激、肿瘤溶解综合征。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
培加帕加司注射液	化学药	HZ002847

HY001515　培美曲塞二钠

【外文名称】Pemetrexed Disodium

【分子式】$C_{20}H_{19}N_5Na_2O_6 \cdot 7H_2O$

【分子量】597.49

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理作用：本品是一种结构上含有核心为吡咯嘧啶基团的抗叶酸制剂，通过破坏细胞内叶酸依赖性的正常代谢过程，抑制细胞复制，从而抑制肿瘤的生长。体外研究显示，本品能够抑制胸苷酸合成酶、二氢叶酸还原酶和甘氨酰胺核苷酸甲酰转移酶的活性，这些酶都是合成叶酸所必需的酶，参与胸腺嘧啶核苷酸和嘌呤核苷酸的生物再合成过程，本品通过运载叶酸的载体和细胞膜上的叶酸结合蛋白运输系统进入细胞内。一旦本品进入细胞内，它就在叶酰多谷氨酸合成酶的作用下转化为多谷氨酸的形式。多谷氨酸存留于细胞内成为胸苷酸合成酶和甘氨酰胺核苷酸甲酰转移酶的抑制剂，多谷氨酸化在肿瘤细胞内呈现时间-浓度依赖性过程，而在正常组织内浓度很低。多谷氨酸化代谢物在肿瘤细胞内的半衰期延长，从而也就延长了药物在肿瘤细胞内的作用时间。

临床前研究显示培美曲塞体外可抑制间皮瘤细胞系（MSTO-211H，NCI-H2052）的生长。间皮瘤细胞系（MSTO-211H）的研究显示出培美曲塞与顺铂联合有协同作用。

人群药效学分析采用的指标是绝对中性粒细胞计数；此时人群接受的为单药培美曲塞，未接受叶酸和维生素B_{12}的补充治疗。通过观察粒细胞最低值来判断血液学毒性发生的严重程度，结果发现其与本品给药剂量呈负相关关系。研究中也发现如果患者基线检查时胱硫醚或高半胱氨酸浓度高，那么其绝对粒细胞计数下降的会更为严重。叶酸和维生素B_{12}可以降低胱硫醚或高半胱氨酸这两种底物的浓度。经过培美曲塞多周期治疗，未见对中性粒细胞的累积毒性。

本品全身给药后（AUC38.3～316.8μgh/ml），中性粒细胞下降至最低点的时间约为8～9.6天，经过最低点后，中性粒细胞计数恢复至基线水平的时间为4.2～7.5天。

2. 毒理研究

（1）遗传毒性：小鼠骨髓体内微核测定显示培美曲塞是断裂剂，但体外的多个实验研究（Ames测定，CHO细胞测定）均未显示致突变作用。

（2）生殖毒性：培美曲塞按照0.1mg/（kg·d）或更大剂量给予雄性小鼠，可导致生育能力下降、精液过少和睾丸萎缩。

（3）致癌作用：未进行培美曲塞致癌作用的研究。

【药代动力学】本品药代动力学评价在426例多种肿瘤类型的患者中进行，采用单药治疗，剂量为0.2～838mg/m^2，10分钟静脉内给药。培美曲塞主要以原药形式从尿路排泄，在给药后的24小时内，70%～90%的本品还原成原药的形式从尿中排出。本品总体清除率为91.8ml/min（肌酐消除率是90ml/min），对于肾功能正常的患者，体内半衰期为3.5小时；随着肾功能降低，清除率会降低，但体内剂量

会增加。随着本品剂量的增加，曲线下面积 AUC 和最高血浆浓度 C_{max}会成比例增加。多周期治疗并未改变培美曲塞的药代动力学参数，本品呈现一稳态分布容积为 16.1l。体外研究显示，本品的血浆蛋白结合率约为 81%，且不受肾功能影响。

本品特殊人群中的药代动力学研究为在总计 400 例患者中的单组研究。

老年人：对于年龄为 26～80 岁的人群，培美曲塞药代动力学无明显变化。

儿童：临床研究中未纳入儿童患者。

性别：男性患者与女性患者相比，本品药代动力学无差别。

种族：高加索裔和非洲裔患者，本品的药代动力学相似。曾有试验对日本患者的药代动力学进行研究，虽然没有日本患者和西方患者之间药代动力学参数规范的统计学对照报告，但仍可说明两者的绝对剂量参数值是基本相似的，而且没有显著的临床差异。

肝脏功能不全：AST、ALT 和总胆红素升高，不影响本品的药代动力学。但是，未进行肝损害患者的药代动力学研究。

肾功能不全：总计 127 例肾功能不全患者进行了本品药代动力学研究。如果同时合并有顺铂治疗，随着肾功能降低，培美曲塞的血浆清除率降低，而全身暴露剂量增加。将培美曲塞全身总暴露量（AUC）与 100ml/min 的肌酐清除率比较，当肌酐清除率分别为 45、50 和 80ml/min 时，全身总暴露量（AUC）增加 65%、54%和 13%。

【药物相互作用】

1. 化疗药物：顺铂不改变本品的药代动力学，本品也对所有铂类药物的药代动力学无影响。

2. 维生素：同时给予口服叶酸和肌注维生素 B_{12}不改变本品的药代动力学。

3. 细胞色素 P450 酶对药物代谢－体外肝脏微球蛋白预测研究结果显示，本品未导致通过 CYP3A 酶，CYP2D6 酶，CYP2C9 酶和 CYP1A2 酶代谢的药物清除率降低。没有进行研究观察本品对细胞色素 P450 同工酶的影响。因为，如果按照推荐的给药日程（每 21 天 1 次），本品对任何酶均无明显诱导作用。

4. 阿司匹林：给予低到中等剂量（每 6 小时 325mg）的阿司匹林，未影响本品的药代动力学，高剂量的阿司匹林对培美曲塞药代动力学影响目前还不清楚。

5. 布洛芬：肾功能正常患者，布洛芬每日剂量为 400mg，每日 4 次时，可使本品的清除率降低 20%（AUC 增加 20%）。更高剂量的布洛芬对本品药代动力学影响目前还不清楚。

6. 本品主要通过肾小球的过滤和肾小管的排泄作用，以原药形式从尿路排出体外。同时给予对肾脏有危害的药物会延迟本品的清除，同时给予增加肾小管负担的其他药物（例如丙磺舒）也可能延迟本品的清除。

7. 对于肾脏功能正常（肌酐清除率的患者≥80ml/min）的患者，本品可以和布洛芬同时用药（400mg，4 次/日），但是对于有轻到中度肾功能不全（肌酐清除率在 45 到 79ml/min 之间）的患者，本品与布洛芬同时使用要小心。有轻到中度肾功能不全的患者，在应用本品治疗前 2 天、用药当天和用药后 2 天，不要使用半衰期短的非甾体类抗炎药。

8. 长半衰期的非甾体类抗炎药与本品潜在相互作用目前还不确定。但在应用本品治疗前 5 天、用药当天和用药后 2 天，也要中断非甾体类抗炎药的治疗。如果一定要应用非甾体类抗炎药，一定要密切监测毒性反应，特别是骨髓抑制、肾脏及胃肠道的毒性。

【药物过量】仅有几例本品药物过量的报告。报告的主要不良反应为中性粒细胞减少、贫血、血小板减少、黏膜炎和皮疹。可预料到的药物过量并发症主要有骨髓抑制，表现为中性粒细胞减少、血小板减少和贫血。另外，也可能出现伴随或不伴随发热的的感染、腹泻和黏膜炎。一旦发生药物过量，应立即在医师指导下采取合适医疗措施。

临床研究中，如果出现 3 天以上 4 度白细胞减少或 3 天以上 4 度中性粒细胞减少，可以使用甲酰四氢叶酸，如果出现 4 度血小板减少或 3 度血小板减少相关的出血或 3～4 度黏膜炎，应立即使用甲酰四氢叶酸。甲酰四氢叶酸的推荐使用剂量和方法是：静脉给药，第 1 次剂量 100mg/m^2，以后 50mg/m^2，每 6 小时 1 次，连用 8 天。

通过透析解除本品过量的作用尚未确定。

【不良反应】主要为骨髓抑制，表现为中性粒细胞、血小板减少症和贫血。还有发热、感染、口腔炎/咽炎、皮疹/脱皮等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用培美曲塞二钠	化学药	HZ004921

HY001516 喷他佐辛

【其他名称】Fortal、Fortalgesic、Fortalin、Sosigon、TALWIN、戊唑星、镇痛新

【外文名称】Pentazocine

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

【性状及组成】本品白色或类白色结晶性粉末，无臭，味苦。性稳定。不溶于水，易溶于三氯甲烷，可溶于乙醇等。其氢溴酸盐溶于水，1% 水溶液的 pH 为 5.9。

药物药理信息

【药理毒理】本品为阿片受体的部分激动剂。镇痛效力较强，皮下注射 30mg（1 支）相当于吗啡 10mg 的镇痛效应。呼吸抑制作用约为吗啡的 1/2。增加剂量其镇痛和呼吸抑制作用并不成比例增加。对胃肠道平滑肌作用与吗啡相似，但对胆道括约肌作用较弱，对心血管作用不同于吗啡，大剂量反可引起血压上升，心率加快，此作用可能与升高血浆中儿茶酚胺含量有关。

【药代动力学】口服及注射均易吸收。口服后 1 小时发挥作用，1 次给药，作用可持续 5 小时以上。肌注后 15 分钟血浆浓度达高峰。肌注半衰期约为 2 小时。主要在肝脏代谢，经肾脏排泄。24 小时约排出总量的 60%。

【药物相互作用】

1. 吩噻嗪类中枢性抑制药以及三环类抗抑郁药等与本类药同时并用，呼吸抑制和（或）低血压可更期显，便秘也增加，依赖性更容易产生，用量应彼此配合互减。

2. 高血压治疗用药不论是作用于神经节的如胍乙啶或美加明，利尿药如氢氧嗪等，或其他药物如金刚烷胺、溴隐亭、左旋多巴、利多卡因、亚硝酸盐、普鲁卡因酰胺、奎尼丁等，与本类药同用时，有发生体位性低血压的危险，给药后立即随访监测。

3. 与 M 胆碱药尤其是阿托品并用时，不仅便秘严重，而且可有麻痹性肠梗阻和尿潴留的危险。

4. 静注硫酸镁后的中枢性抑制，尤其是呼吸抑制和低血压，会因同时使用阿片类药而加剧。

5. 阿片类镇痛药，通过引起胃肠道蠕动徐缓，括约肌痉挛，可使甲氧氯普胺应有的效应不明。

6. 应先停用单胺氧化酶抑制药（如呋喃酮、丙卡巴肼等）14～21 天后，才可应用本类药，尤其是哌替啶、芬太尼等；而且应先试用小量（1/4 常用量），以免发生难以预料的、严重的、足以致死的循环虚脱，后者的先驱症状一般为：激动（狂燥）、多汗、僵直、血压很高或很低、呼吸抑制严重、昏迷、惊厥或（和）高热。

【不良反应】

1. 本品的不良反应多种多样。

（1）瞳孔缩到针尖大小时，可出现视觉模糊或复视。

（2）便秘：有局部胃肠道因素，也有中枢性因素。

（3）抗利尿作用以吗啡为明显，兼有输尿管痉挛时，可出现少尿、尿频、尿急、排尿困难。

（4）体位改变血压下降时，常有晕眩感、步态不稳、以及疲乏感。

（5）中枢神经活动处于抑制状态时，临床表现可有嗜睡、梦幻、头痛眩晕等，继而觉口干、食欲减退、饮食乏味以及恶心呕吐等不适，后者更多见于急症和第一次给药时。

（6）组胺的释放可引起面颊潮红、汗多。

（7）胃肠道刺激和胆管痉挛可致腹痛。

（8）可引起情绪紧张不安或难以入眠等反应。

2. 少见但有危险的不良反应

（1）呼吸频繁减慢又很不规则、潮气量小、提示呼吸抑制严重，有些阿片类药又可引起骨骼肌主要是胸壁呼吸肌低直，尤其是量大、快速静注时容易出现。

（2）中枢神经毒性表现，以惊厥、幻觉、耳鸣、震颤、动作不能自制等最为突出。

（3）中枢性抑制过度，以神智模糊、抑郁、消沉、迟钝等为多见，小儿且可出现阵发性兴奋激动，大剂量可引起呼吸抑制、血压上升及心率加速。

（4）组胺释放过多，可诱发弹性荨麻疹，皮肤瘙痒、颜面红润微肿、支气管痉挛、喉痉挛、喉水肿等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
喷他佐辛注射液	化学药	HZ002849

HY001517　喷替酸

【其他名称】Diethylenetriaminepentaacetic Acid、DTPA

【外文名称】Pentetate Acid

药物理化信息

【化学名】二乙三胺五醋酸

【分子式】$C_{14}O_{10}H_{23}N_3$

【分子量】393.00

药物药理信息

【药理毒理】本品不直接使用，无单独的药理毒理作用。

本品的钠盐与钙的络合剂可溶于水，该药物可用于铅、钴、铬、铁、锌等金属中毒的解救，也可治疗放射性元素如钚、铀等对机体造成的损伤。

【药代动力学】口服不吸收，用作静滴和肌注。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用亚锡喷替酸	化学药	HZ005033

HY001518 喷替酸钙钠

【其他名称】促排灵、DTPA－CaNa、二乙撑三胺五醋酸、Pentetic Acid、五醋三胺钠钙、乙撑三胺戊醋酸钠钙

【外文名称】Calcium Trisodium Pentetate

药物药理信息

【药理毒理】解毒作用基本上同依地酸钙钠，由于该药分子中的N和O配位原子增加，络合金属能力增强。可用于铅、铁、锌、钴、铬中毒的解救；治疗钚、铀、锶、钇等放射性元素对机体的损伤亦有效，静脉注射后可增加钚的尿排出量达50～100倍。

【药代动力学】口服吸收差，口服在48小时内仅吸收4%，78%由粪排出，18%仍留在胃肠道内。静脉注射后迅速由尿排出，2h约排出30%～40%，24小时内排出90%。

【不良反应】常见有头皮瘙痒、阴囊瘙痒、皮肤红斑、丘疹、湿疹等，似属过敏反应。个别病人出现乏力、头晕、恶心、食欲减退和腹胀等。常用量对电心图、肝、肾功能、血钙、磷等均无明显影响。有报道本品易致畸胎。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
喷替酸钙钠注射液	化学药	HZ002850

HY001519 喷昔洛韦

【外文名称】Penciclovir

药物理化信息

【化学名】9－［4－羟基－3－（羟甲基）－丁基］－鸟嘌呤

【分子式】$C_{10}H_{15}N_5O_3$

【分子量】253.26

药物药理信息

【药理毒理】本品为核苷类抗病毒药，体外对Ⅰ型和Ⅱ型单纯疱疹病毒有抑制作用，在病毒感染细胞中，病毒胸腺嘧啶脱氧核苷激酶将本品磷酸化为喷昔洛韦单磷酸盐，然后细胞激酶将喷昔洛韦单磷酸盐转化为喷昔洛韦三磷酸盐。体外实验表明，喷昔洛韦三磷酸盐与脱氧鸟嘌呤核苷三磷酸盐竞争性抑制单纯疱疹病毒多聚酶，从而选择性抑制单纯疱疹病毒DNA的合成。耐本品的单纯疱疹病毒突变株的产生是由于病毒胸腺嘧啶脱氧核苷激酶或DNA多聚酶性质发生了改变，最常见耐阿昔洛韦的病毒突变株缺乏胸腺嘧啶核苷激酶，它们对本品也耐药。

【药代动力学】文献报道，健康男性志愿者12人，单次或多次使用1%喷昔洛韦软膏（每次180mg，约为临床常用剂量的67倍），在血浆或尿中未检出喷昔洛韦。

【不良反应】未见全身不良反应，无肝肾损伤，偶见用药局部轻度灼热感、疼痛、瘙痒等，均能很快消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
喷昔洛韦乳膏	化学药	HZ002854

HY001520 硼砂

【其他名称】Natrii Tetraboras、硼酸钠、Sodium Borate、Sodium Tetraborate、四硼酸二钠、重硼酸钠

【外文名称】Borax

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】四硼酸钠

【分子式】$Na_2B_4O_7 \cdot 10H_2O$

【分子量】381.37

【性状及组成】本品为无色半透明的结晶或白色结晶性粉末；无臭；有风化性；水溶液显碱性反应。

本品在沸水或甘油中易溶，在水中溶解，在乙醇中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：消毒防腐药。

1．黏膜消毒。

2．用于制备冷霜或其他润肤剂。

3．作为滴眼剂的pH调节剂。

【不良反应】用于大面积的创伤、烧伤或表皮剥落处易吸收蓄积中毒。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
丁硼乳膏	化学药	HZ000741
复方硫黄乳膏	化学药	HZ001271
复方硼砂含漱液	化学药	HZ001334
复方硼砂漱口片	化学药	HZ001335
硫磺硼砂乳膏	化学药	HZ002320
氯化钠滴眼液	化学药	HZ002490

续表

制剂名称	类别	序号
硼砂甘油钾溶液	化学药	HZ002855
色甘酸钠滴眼液	化学药	HZ003173
右旋糖酐70滴眼液	化学药	HZ004594

HY001521　硼酸

【其他名称】 Boracic Acid、Fumarole Acid、Orthoboric Acid、正硼酸

【外文名称】 Boric Acid

药物管理信息

【依据标准】 中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】 正硼酸

【分子式】 H_3BO_4

【分子量】 61.83

【性状及组成】 本品为无色微带珍珠光泽的结晶或白色疏松的粉末，有油腻感；无臭；水溶液显弱酸性反应。本品在沸水、沸乙醇或甘油中易溶，在水或乙醇中溶解。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：消毒防腐药。

本品为弱防腐剂，与细菌蛋白质中的氨基结合，对细菌及真菌抑制作用较弱，但无刺激性。

【药代动力学】 完整皮肤不易穿透，可从破损皮损及黏膜吸收，吸收量在12小时内从尿中排出约50%，其余于3~7天内排出。在体内排泄较慢，可致蓄积中毒。

【药物相互作用】 禁忌与聚乙烯醇和鞣酸配伍。

【不良反应】 外用一般毒性不大。用于大面积损害，吸收后可发生急性中毒，早期症状为呕吐、腹泻、皮疹、中枢神经系统先兴奋后抑制，可有脑膜刺激症状和肾损伤，严重者发生循环衰竭或（和）休克，于3~5天死亡。致死量成人约为15~20g，小儿为3~6g。由于本品排泄缓慢，反复应用可产生蓄积，导致慢性中毒，表现为畏食、乏力、精神错乱、皮炎、秃发和月经紊乱。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
冻疮膏	化学药	HZ000747
复方薄荷柳酯搽剂	化学药	HZ001099
复方磺胺氧化锌软膏	化学药	HZ001218
复方硫酸锌滴眼液	化学药	HZ001278

续表

制剂名称	类别	序号
复方马勃水杨酸散	化学药	HZ001315
复方麝香草酚撒粉	化学药	HZ001374
复方氧化锌水杨酸散	化学药	HZ001468
萘敏维滴眼液	化学药	HZ002741
硼酸冰片滴耳液	化学药	HZ002856
硼酸软膏	化学药	HZ002857
硼酸洗液	化学药	HZ002858
硼酸氧化锌冰片软膏	化学药	HZ002859
硼酸氧化锌软膏	化学药	HZ002860
鞣柳硼三酸散	化学药	HZ003087
水杨酸复合洗剂	化学药	HZ003293
水杨酸氧化锌软膏	化学药	HZ003302
百仙妇炎清栓	民族药	MZ000045
大枫子油	中成药	ZC000688
妇炎灵胶囊	中成药	ZC001248
妇炎灵泡腾片	中成药	ZC001249
妇炎平胶囊	中成药	ZC001251
妇炎平泡腾片	中成药	ZC001252
妇炎平散	中成药	ZC001253
复方苦参水杨酸散	中成药	ZC001425
复方蛇脂软膏	中成药	ZC001502
烂耳散	中成药	ZC003151
清凉止痒搽剂	中成药	ZC004115
麝香活血化瘀膏	中成药	ZC004700
四味珍层冰硼滴眼液	中成药	ZC005338
熊胆眼药水	中成药	ZC006529
足光散	中成药	ZC007622

HY001522　硼替佐米

【外文名称】 Bortezomib

药物理化信息

【化学名】 [（1*R*）-3-甲基-1-[[（2*S*）-1-氧-3-苯基-2-[（吡嗪羧基）氨基]丙基]氨基]丁基]硼酸

【分子式】 $C_{19}H_{25}BN_4O_4$

【分子量】 384.24

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药效学：硼替佐米是哺乳动物细胞中 26S 蛋白酶体糜蛋白酶样活性的可逆抑制剂。26S 蛋白酶体是一种大的蛋白质复合体，可降解泛蛋白。泛蛋白酶体通道在调节特异蛋白在细胞内浓度中起到重要作用，以维持细胞内环境的稳定。蛋白水解会影响细胞内多级信号串联，这种对正常的细胞内环境的破坏会导致细胞的死亡。而对 26S 蛋白酶体的抑制可防止特异蛋白的水解。体外试验证明硼替佐米对多种类型的癌细胞具有细胞毒性。临床前肿瘤模型体内试验证明硼替佐米能够延迟包括多发性骨髓瘤在内的肿瘤生长。

2. 毒理学：尚未进行硼替佐米的致癌性研究。

用中国仓鼠卵巢细胞进行体外染色体畸变分析显示硼替佐米有诱裂活性（染色体结构畸变）。体外诱变性分析（埃姆斯试验）和小鼠体内小核分析结果显示硼替佐米没有基因毒性。

尚未对生育影响进行研究，但是在一般毒理学研究中对生殖组织进行了评价。6 个月的大鼠毒理研究显示，剂量≥0.3mg/m^2（临床推荐剂量的 1/4）时发现对卵巢有变性的作用，剂量为 1.2mg/m^2 时发现有变性的改变。本品可能对男性或女性的生育能力有潜在影响。

【药代动力学】对 8 名多发性骨髓瘤患者静脉给予本品 1.3mg/m^2，最大血药浓度中值为 509ng/ml（范围 109 ~ 1300ng/ml），肌酐清除率为 31 ~ 169ml/min。对晚期恶性肿瘤患者给予本品 1.45 ~ 2.00mg/m^2，首剂量后的平均消除半衰期为 9 ~ 15 小时。作为单药，推荐剂量的硼替佐米在多发性骨髓瘤患者体内的药代动力学尚不完全明确。

1. 分布：尚未对推荐剂量的硼替佐米在多发性骨髓瘤患者体内的分布容积进行研究。浓度为 100 ~ 1000ng/ml 时，硼替佐米与人体血浆蛋白的平均结合率为 83%。

2. 代谢：利用人体肝微粒体和互补脱氧核糖核酸表达的细胞色素 P450 同工酶进行的体外研究显示，硼替佐米主要通过细胞色素 P450 酶系的 3A4、2D6、2C19、2C9 和 1A2 酶氧化代谢。主要代谢途径是去硼酸化，形成 2 个去硼酸化代谢物，再通过羟基化形成几个代谢产物。去硼酸化的硼替佐米代谢产物无抑制 26S 蛋白酶体的活性。8 名患者给药后 10 ~ 30 分钟的血浆数据显示，血浆中代谢产物的浓度比原形药物低。

3. 消除：尚未对硼替佐米在人体内的消除途径进行研究。

【药物相互作用】尚未进行正规的药物相互作用研究。

人体肝微粒体的体外研究表明硼替佐米是细胞色素 P450 酶系 3A41、2D6、2C19、2C9 和 1A2 的底物。与细胞色素 P450 3A4 的抑制剂或者诱导剂合用时，应密切监测毒性的发生或有效性的降低。

在临床试验中，有糖尿病患者口服降糖药后出现低血糖症和高血糖症的报道。在使用本品治疗时，应密切监测口服抗糖尿病药患者的血糖水平，并注意调节抗糖尿病药的剂量。

告知患者应谨慎合用可能会引起周围神经病的药物（如胺碘酮、抗病毒药、异烟肼、呋喃妥因或他汀类）及引起血压降低的药物。

【药物过量】猴子的心血管安全性药理学研究显示，静脉注射的致死量与血压下降、心率增加、收缩力增加，以及末梢致死性低血压有关。给猴子注射本品 3.0mg/m^2 或更高剂量（约为临床推荐剂量的 2 倍），在给药后 1 小时出现进行性低血压，12 ~ 14 小时内死亡。

在临床试验中，尚无药物过量的报告。给成人注射的最高剂量达到每周 2.0mg/m^2。如药物过量，应监测患者的生命体征，并采取适当的支持治疗以维持血压和体温。

本品尚无特殊的解救药。

【不良反应】在两项临床研究中，228 名多发性骨髓瘤患者接受本品治疗，剂量为 1.3mg/m^2，每周注射 2 次，连续注射 2 周后停药 10 天（即 21 天为 1 个疗程），最多持续 8 个疗程。

最常见的不良事件有虚弱（包括疲劳、不适和乏力）（65%）、恶心（64%）、腹泻（51%）、食欲下降（包括畏食）（43%）、便秘（43%）、血小板减少（43%）、周围神经病（包括周围感觉神经病和周围神经病加重）（37%）、发热（36%）、呕吐（36%）和贫血（32%）。

14%的患者至少有过一次 4 级不良反应，最常见的不良反应为血小板减少（3%）和中性粒细胞减少症（3%）。

严重不良事件：严重不良事件的定义为，无论是否有因果关系任何导致死亡、危及生命、导致住院或延长住院时间、造成明显残疾或为重大的医疗事件。在研究过程中，228 位患者中共有 113 位（50%）发生了严重不良事件。最常见的严重不良事件包括发热（7%）、肺炎（7%）、腹泻（6%）、呕吐（5%）、脱水（5%）和恶心（4%）。

18%的患者因研究者认为与药物相关的不良事件而导致停药，停药原因包括周围神经病（5%）、血小板减少（4%）、腹泻（2%）和疲劳（2%）。

在试验中有 2 例死亡的报告，研究者认为可能与研究的药物有关，1 例为心跳呼吸停止，另 1 例为

呼吸衰竭。

虚弱（疲劳、不适、乏力）：有65%的患者报告出现虚弱，主要为1、2级不良事件。疲劳首次发生的报告多出现在第1、2疗程中。18%患者的虚弱为3级不良事件。2%患者由于疲劳而停止治疗。

胃肠道不良事件：在研究中多数患有胃肠道不良事件，包括恶心、腹泻、便秘和呕吐。21%的患者发生3、4级胃肠道不良事件，13%的患者发生严重不良事件。7%的患者呕吐和腹泻为3级不良事件，少于1%的患者呕吐和腹泻为4级不良事件。5%的患者因胃肠道不良事件而停止治疗。43%的患者出现食欲下降（畏食），食欲下降为3级的不良事件的发生率为3%。

血小板减少：在使用本品治疗期间，43%的患者出现血小板减少，其特征为在使用本品治疗期间（第1到11天）血小板数量下降，在停药期（第12到21天）血小板数量恢复到基线。血小板减少达到3、4级的患者分别为27%和3%。4%的患者因血小板减少而停止治疗。

周围感觉神经病：37%的患者出现周围神经病、周围感觉神经病和周围神经病加重。14%的患者周围神经病为3级，没有发生4级。在整个疗程中均观察到新发病或现有神经病加重。6%的患者因神经病而停止治疗。超过80%的受试者在入组评估时发现有周围神经病的体征或症状。入组评估时没有神经病的患者有5%（2/41）发生了3级周围神经病。停止治疗后，有些患者的症状会得到改善或恢复到入组水平。

发热：有36%的患者出现发热（>38℃）的不良事件，被确定为3级的占4%。

中性粒细胞减少症：24%的患者发生中性粒细胞减少症，达到3级的为13%，4级的为3%。发热中性粒细胞减少症的发病率低于1%。

低血压：12%的患者发生低血压（包括体位性低血压），大多数为1级和2级，3级占4%，没有4级。发生体位性低血压的患者在入组时没有体位性低血压，1/2的患者有高血压病史，1/3的患者有周围神经病。在使用本品治疗期间，可能需要调整抗高血压药物的剂量。4%的患者发生低血压（包括体位性低血压）的同时还伴有晕厥。

临床研究中的严重不良事件：

下面列举了约580名患者中发生的严重不良事件（以上未提及），这些不良事件被认为至少可能与研究药物有关，患者至少使用本品进行单药治疗或与其他化学疗法联合使用。这些研究是在血液恶性肿瘤和实性瘤患者中进行的。

血液和淋巴系统疾病：弥散性血管内凝血。

心脏疾病：房性纤颤恶化、房性扑动、心脏淀粉样变性、心脏停搏、充血性心衰、心肌缺血、心肌梗死、心包积液、肺水肿，以及室性心动过速。

胃肠道疾病：腹水、吞咽困难、粪便嵌塞、出血性胃炎、胃肠道出血、呕血、麻痹性肠梗阻、大肠梗阻、小肠梗阻、大肠穿孔、口腔炎、黑粪，以及急性胰腺炎。

肝胆系统：高胆红素血症、门静脉血栓形成。

免疫系统疾病：过敏反应、药物过敏，以及免疫复合物介导的过敏。

感染：菌血症。

损伤、中毒和并发症：骨折和硬膜下血肿。

代谢和营养失调：低钙血症、高尿酸血症、低血钾症、低钠血症和肿瘤溶解综合征。

神经系统：共济失调、昏迷、眩晕、发音困难、家族性自主神经功能异常、颅内麻痹、癫痫大发作性惊厥、出血性中风、运动功能障碍、脊髓受压、一过性缺血。

精神病：激越、精神错乱、精神障碍、自杀性意念。

肾和泌尿系统：肾结石、双侧肾积水、膀胱痉挛、血尿、尿失禁、尿潴留、肾衰、急慢性增生性肾小球肾炎。

呼吸，胸和纵隔系统：急性呼吸窘迫综合征、肺萎陷、慢性阻塞性呼吸道疾病加重、吞咽困难、呼吸困难、劳累性的呼吸困难、鼻出血、咳血、组织缺氧、肺浸润、胸腔积液、肺炎、呼吸窘迫、呼吸衰竭。

血管：脑血管意外、深部静脉血栓形成、末梢栓塞、肺部栓塞。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用硼替佐米	化学药	HZ004923

HY001523　匹氨西林

【其他名称】吡呋氨卡西林、匹氨青霉素、匹呋氨苄青霉素、匹呋青霉素、匹呋西林

【外文名称】Pivampicillin

药物药理信息

【药理毒理】为氨苄西林的三甲基甲酯衍生物，口服后在肠道分解出氨苄西林。故抗菌谱同氨苄西林。以基质氨苄西林计算给予同等剂量口服，血中浓度约为氨苄西林1.5~2倍，用途同氨苄西林。

【不良反应】常见的不良反应有腹部不适、腹痛、食欲减退、恶心、呕吐、腹泻与药疹，个别病

人有转氨酶升高，停药可恢复。本品味苦，有特异嗅，宜将整个胶囊吞服，不宜咬碎。

HY001524 匹多莫德

【其他名称】Polimod

【外文名称】Pidotimod

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第35册

药物理化信息

【化学名】（*R*）-3-（*S*）-（5-氧代-2-吡咯烷基）羰基］-四氢噻唑-4-羧酸

【分子式】$C_9H_{12}N_2O_4S$

【分子量】244.26

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；无臭，无味。

本品在水中溶解，在甲醇或乙醇中微溶，在三氯甲烷或正己烷中几乎不溶，在二甲基甲酰胺中易溶。

熔点：本品的熔点为192～196℃，熔融时同时分解。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释成每1ml含1mg的溶液，依法测定，比旋度应为-149°至-151°。

药物药理信息

【药理毒理】匹多莫德为免疫促进剂，既能促进非特异性免疫反应又促进特异性免疫反应。匹多莫德可促进巨噬细胞及中性粒细胞的吞噬活性，提高其趋化性；激活自然杀伤细胞；促进有丝分裂原引起的淋巴细胞增殖，使免疫功能低下时降低的辅助性T细胞（$CD4^+$）与抑制性T细胞（$CD8^+$）的比值升高恢复正常；通过刺激白介素-2和γ-干扰素促进细胞免疫反应。

动物试验及临床试验均表明匹多莫德尽管无直接的抗菌及抗病毒活性，但通过对肌体的免疫功能的促进可发挥显著的治疗细菌（肺炎双球菌、大肠杆菌、绿脓杆菌、变形杆菌等）及病毒（流感病毒、单纯疱疹病毒、鼠脑心肌炎病毒及门果病毒等）感染的疗效。

【药代动力学】8名健康男性志愿者单剂量口服本品800mg后，血中药物达峰时间为1.9±0.6小时，达峰浓度为5.8±1.968μg/ml，消除半衰期为1.65±0.33小时，曲线下面积为24.68±6.88μg/ml·h，各药代参数与从意大利进口的匹多莫德口服液相比均无显著性差异。

【药物相互作用】尚未有本药与其他药物相互作用、相互影响的资料及报道。

【药物过量】尚未有使用本品药物过量的报道，如遇药物过量，则需用常规方法如催吐、导泻、输液等促进过量药物排出。

【不良反应】尚未有用本品出现严重不良反应的报道。少见的不良反应有头痛、眩晕、恶心、呕吐、腹痛、腹泻、皮疹等，一般无须停药治疗。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
匹多莫德分散片	化学药	HZ002862
匹多莫德颗粒	化学药	HZ002863
匹多莫德口服液	化学药	HZ002864
匹多莫德片	化学药	HZ002865
匹多莫德散	化学药	HZ002866

HY001525 匹考哌林

【其他名称】吡哌乙胺、COBEN、哌比苯胺

【外文名称】Picoperine

药物药理信息

【药理毒理】本品为非成瘾性中枢性镇咳药，并能缓解支气管痉挛，其镇咳效果与可待因相近，对呼吸中枢无影响。抑制肠蠕动作用较可待因弱，无成瘾性。用于感冒、咽喉炎、支气管炎、肺炎、肺结核所致咳嗽。

【不良反应】可见头痛、食欲减退、恶心、便秘等不良反应。

HY001526 匹美西林

【外文名称】Pivmecillinam

药物药理信息

【药理毒理】本品为美西林酯。口服后吸收在体内水解生成美西林。抗菌谱同美西林，其特点为可供口服，口服后吸收良好。

【药代动力学】本品在体内为酯酶迅速水解为美西林而发挥抗菌活性。食物可促进本品的吸收，宜在饭后服用。

【药物相互作用】丙磺舒可使本品血浓度增高而持久。

【不良反应】

1. 偶有胃肠道反应，如恶心、呕吐、腹泻。
2. 过敏反应有皮疹、荨麻疹等。
3. 用药前应作青霉素皮试，对青霉素过敏者禁用。

HY001527　匹米诺定

【其他名称】皮米诺定、去痛定

【外文名称】Piminodine

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

【依据标准】卫生部颁药品标准（二部）·第4册

药物药理信息

【药理毒理】本品为强效麻醉性镇痛药，镇痛作用较吗替啶强。用于胆囊炎合并胆结石、胰腺炎、癌症等引起的剧痛。

【不良反应】有成瘾性。

HY001528　匹莫林

【外文名称】Pemoline

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

【依据标准】卫生部颁药品标准（二部）·第4册

药物理化信息

【化学名】2－亚胺基－5－苯基－4（5*H*）－噁唑烷酮

【分子式】$C_9H_8N_2O_2$

【分子量】176.11

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；无臭，无味。

本品在氢氧化钠溶液中易溶，在丙二醇中微溶，在乙醇、丙酮中极微溶解，在水、三氯甲烷、乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为251～256℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】本品为中枢兴奋药，中枢兴奋作用温和，并有弱拟交感作用，临床多用于治疗多动综合征，其机制可能与其提高中枢去甲肾上腺素含量有关。

【药代动力学】本品的蛋白结合率为50%。口服后2～4小时血药浓度达峰值，血药浓度达稳态需2～3日。半衰期为12小时。本品在肝内代谢，代谢产物为匹莫林结合物、匹莫林双酮、扁桃酸等，由尿中排泄，24小时可排出口服药的75%，其中50%为原形药。

【药物相互作用】

1．本品可降低惊厥发作的阈值，故合用抗癫痫药时需调整后者的用量。

2．本品与其他中枢神经兴奋药合用时，可相互增强。

【药物过量】

1．中毒症状：恶心、呕吐、出汗、潮红、高热、瞳孔散大、头痛、震颤、抽搐、痉挛、反射亢进、激动、欣快、幻觉、谵妄、神志错乱、心血管系统可见心动过速、高血压。

2．处理：误服大剂量应立即催吐、洗胃。静脉注射或静脉滴注高渗葡萄糖注射液以促进排泄。依病情给予对症治疗和支持疗法。

【不良反应】

1．常见的为畏食、失眠或体重减轻。

2．少见的为头昏、萎靡、易激惹、抑郁、恶心、皮疹、胃疼。

3．罕见的为黄疸。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
匹莫林片	化学药	HZ002867

HY001529　匹莫齐特

【其他名称】Opiram、哌迷清

【外文名称】Pimozidete

【性状及组成】本品白色结晶性粉末；几乎不溶于水，可溶于乙醇（1:1000）、乙醚（1:1000）、甲醇（1:1000）、丙酮（1:100）和三氯甲烷（1:10），微溶于0.1mol/L盐酸。

药物药理信息

【药理毒理】本品作用类似氟哌啶醇，具有长效抗精神病作用，能改善幻觉、妄想、淡漠、抑郁、思维障碍、运动迟滞等症状，促使退缩、被动的慢性精神分裂症病人振奋。此外，本品还有某些钙拮抗作用。用于急、慢性精神分裂症，对幻觉、妄想、淡漠效果好。对慢性退缩性病人尤为适用。

【药代动力学】本品口服后经广泛的首过代谢，约4～12小时血药浓度达峰值。个体差异大。$t_{1/2}$约55小时或更长；经肝代谢，主要代谢途径为N－去烷基；代谢产物和原形排泄于尿液和粪便中。

【药物过量】每日口服剂量不应超过20mg。

【不良反应】常见有锥体外系反应，其他有口干、乏力、失眠等。

HY001530　匹那西泮

【外文名称】Pinazepam

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为精神药品，但我国未生产或使用。

HY001531 匹维溴铵

【其他名称】吡喹利乌、Dicetal、Eldicel、LAT－1717、Pinaverium Br

【外文名称】Pinaverium Bromide

药物理化信息

【化学名】4－［（2－溴代－4，5－二甲氧基苯基）甲基］－4－［2－［2（6,6－二甲基双环[3,1,1］庚－2－基）乙氧基］乙基］吗啉溴化物

【分子式】$C_{26}H_{41}Br_2NO_4$

【分子量】591.42

【性状及组成】本品为结晶，熔点为181℃。

药物药理信息

【药理毒理】匹维溴铵是一种对胃肠道具有高度选择性解痉作用的钙拮抗药，对平滑肌的作用机制和其他钙拮抗剂一样，但对结肠平滑肌具有高度选择作用。匹维溴铵通过阻断钙离子流入肠壁平滑肌细胞，防止肌肉过度收缩而达到解痉作用，能消除肠平滑肌的高反应性，并增加肠道蠕动能力。匹维溴铵对心血管平滑肌细胞亲和力极低，每天单剂口服1200mg，也不会引起血压的变化。匹维溴铵不会影响食管下部贲门括约肌的压力，也不引起十二指肠反流，但对奥迪括约肌有松弛作用。体外研究表明，本品对氯化钡、乙酰胆碱、去甲肾上腺素、卡巴胆碱和电刺激引起的平滑肌收缩，有剂量依赖的抑制作用。

匹维溴铵在体内的作用是通过钙通道的激活来实现的。体外研究结果表明匹维溴铵通过阻滞电压依赖性钙电流而产生抗痉挛作用。

【药代动力学】口服不易吸收，t_{max}约0.3～3小时，PB近100%，原药和代谢物主要经粪便排泄，$t_{1/2}$约1.5小时。

匹维溴铵是四价氨的复合物，因而限制了它通过肠黏膜的吸收，口服之后不足10%的剂量进入血液，其中95%～98%与蛋白结合。口服匹维溴铵100mg，0.5～3小时后血药浓度达峰值，终末半衰期为1.5小时。本品吸收后在肝内进行首过代谢，代谢迅速，其特征为甲氧基团之一去甲基，降蒎烷环基化，清除苯甲基团，随后吗啉环开放。原药和代谢产物由肝胆系统排泄，通过粪便排除。

【药物相互作用】无已知的相互作用。

【不良反应】腹痛、腹泻、便秘，偶见瘙痒、皮疹、恶心、口干等。国外资料报道，两例患者在两餐之间口服匹维溴铵后出现了胃灼热和吞咽困难，内窥镜检查显示有急性的食管溃疡形成，停药即可恢复。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
匹维溴铵片	化学药	HZ002868

HY001532 偏重亚硫酸钾

【其他名称】焦亚硫酸钾

【外文名称】Potassium Metabisufite

【性状及组成】本品为白色晶体或粉末。有二氧化硫气味。易溶于水，不溶于乙醇。

熔点：190℃（分解）。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
玉金方胶囊	中成药	ZC007071
玉金方片	中成药	ZC007072

HY001533 泊洛沙姆

【外文名称】Poloxamer

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】α－氢－ω－羟聚（氧乙稀）a－聚（氧丙烯）b－聚（氧乙稀）c］嵌段共聚物

【性状及组成】本品为α－氢－ω－羟聚（氧乙稀）a－聚（氧丙烯）b－聚（氧乙稀）c］嵌段共聚物；在共聚物中，a和c为2～130，b为15～67。含聚氧乙烯为81.8%±1.9%。平均分子量为1000～7000的应为标示量的90.0%～110.0%。平均分子量为7000以上的应为标示量的80.0%～120.0%。

本品为白色或微黄色半透明蜡状固体；微有异臭。本品在乙醇或水中易溶，在无水乙醇或乙酸乙酯中溶解，在乙醚或石油醚中几乎不溶。

本品的红外光吸收图谱应与对照的图谱一致。

酸碱度：取本品1.0g，加水40ml溶解后，依法测定，pH应为5.0～7.5。

药物药理信息

【药理毒理】药用辅料（供口服用）。

HY001534　泼尼松

【其他名称】Decortisyl、Deltacortone、Deltasone、Di－Adreson、Econosone、Meticorten、强的松、去氢可的松

【外文名称】Prednisone

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】17α，21－二羟基孕甾－1,4－二烯－3,11,20－三酮

【分子式】$C_{21}H_{26}O_5$

【分子量】358.43

【性状及组成】本品为白色或几乎白色的结晶性粉末；无臭。本品在乙醇或三氯甲烷中微溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 225～231℃（测定时将毛细管于 220℃放入），熔融时同时分解。

比旋度：取本品，精密称定，加二氧六环溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 5mg 的溶液，依法测定比旋度应为 +167°至 +175°。

药物药理信息

【药理毒理】肾上腺皮质激素类药。

HY001535　泼尼松龙

【其他名称】Di－Adreson－F、Pediapred、Precortisyl、强的松龙、氢化泼尼松（Hydroprednisone）、去氢氢化可的松（Dehydrohydro－cortisone）

【外文名称】Prednisolone

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】11β，17α，21－三羟基孕甾－1，4－二烯－3，20－二酮

【分子式】$C_{21}H_{28}O_5$

【分子量】360.45

【性状及组成】本品为白色或几乎白色的结晶性粉末；无臭，味微苦；有吸湿性。本品在甲醇或乙醇中溶解，在丙酮或二氧六环中略溶，在三氯甲烷中微溶，在水中极微溶解。

熔点：本品的熔点为 225～236℃，熔融时同时分解。

比旋度：取本品，精密称定，加二氧六环溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 10μg 的溶液，依法测定比旋度应为 +96°至 +103°。

吸收系数：取本品，精密称定，加乙醇溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 10μg 的溶液，照紫外－可见分光光度法，在 243nm 的波长处测定吸光度，吸收系数为 400～430。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：肾上腺皮质激素类药物。本品超生理量时具有抗炎、抗过敏和抑制免疫等多种药理作用。

1．抗炎作用：糖皮质激素减轻和防止组织对炎症的反应，从而减轻炎症的表现。

2．免疫抑制作用：防止或抑制细胞中介的免疫反应，延迟性的过敏反应，减少 T 淋巴细胞、单核细胞嗜酸粒细胞的数目，降低免疫球蛋白与细胞表面受体的结合能力，并抑制白介素的合成与释放，从而降低 T 细胞向淋巴母细胞转化，并减轻原发免疫反应的扩展。

3．抗毒、抗休克作用：糖皮质激素能对抗细菌内毒素对机体的刺激反应，减轻细胞损伤，发挥保护机体的作用。

【药代动力学】本品极易由消化道吸收，其本身以活性形式存在，无须经肝脏转化即发挥其生物效应。口服后约 1～2 小时血浆血药浓度达峰值，$t_{1/2}$ 为 2～3 小时。在血中本品大部分与血浆蛋白结合（但结合率低于氢化可的松），游离型和结合型代谢物自尿中排出，部分以原形排出，小部分可经乳汁排出。

本品不溶于水。本品磷酸钠盐极易吸收，而其醋酸酯混悬液则吸收缓慢。制成稀乙醇溶液（50%）后，可用于静脉滴注，半衰期为 2－3 小时。在血中本品大部分与血浆蛋白结合（但结合率低于氢化可的松），游离型和结合型代谢物自尿中排出，部分以原形排出，小部分可经乳汁排出。

【药物相互作用】

1．非甾体消炎镇痛药可加强其致溃疡作用。

2．可增强对乙酰氨基酚的肝毒性。

3．与两性霉素 B 或碳酸酐酶抑制剂合用，可加重低钾血症，长期与碳酸酐酶抑制剂合用，易发生低血钙和骨质疏松。

4．与蛋白质同化激素合用，可增加水肿的发生率，使痤疮加重。

5．与抗胆碱能药（如阿托品）长期合用，可致眼压增高。

6．三环类抗抑郁药可使其引起的精神症状加重。

7．与降糖药如胰岛素合用时，因可使糖尿病患者血糖升高，应适当调整降糖药剂量。

8．甲状腺激素可使其代谢清除率增加，故甲状

腺激素或抗甲状腺药与其合用，应适当调整后者的剂量。

9. 与避孕药或雌激素制剂合用，可加强其治疗作用和不良反应。

10. 与强心苷合用，可增加洋地黄毒性及心律紊乱的发生。

11. 与排钾利尿药合用，可致严重低血钾，并由于水钠潴留而减弱利尿药的排钠利尿效应。

12. 与麻黄碱合用，可增强其代谢清除。

13. 与免疫抑制剂合用，可增加感染的危险性，并可能诱发淋巴瘤或其他淋巴细胞增生性疾病。

14. 可增加异烟肼在肝脏代谢和排泄，降低异烟肼的血药浓度和疗效。

15. 可促进美西律在体内代谢，降低血药浓度。

16. 与水杨酸盐合用，可减少血浆水杨酸盐的浓度。

17. 与生长激素合用，可抑制后者的促生长作用。

【药物过量】可引起类肾上腺皮质功能亢进综合征。

【不良反应】糖皮质激素在应用生理剂量替代治疗时无明显不良反应，不良反应多发生在应用药理剂量时，而且与疗程、剂量、用法及给药途径等有密切关系。常见不良反应有以下几类：

1. 长程使用可引起以下不良反应：医源性库欣综合征面容和体态、体重增加、下肢水肿、紫纹、易出血倾向、创口愈合不良、痤疮、月经紊乱、肱或股骨头缺血性坏死、骨质疏松及骨折（包括脊椎压缩性骨折、长骨病理性骨折）、肌无力、肌萎缩、低血钾综合征、胃肠道刺激（恶心、呕吐）、胰腺炎、消化性溃疡或穿孔，儿童生长受到抑制、青光眼、白内障、良性颅内压升高综合征、糖耐量减退和糖尿病加重。

2. 患者可出现精神症状：欣快感、激动、谵妄、不安、定向力障碍，也可表现为抑制。精神症状由易发生于患慢性消耗性疾病的人及以往有过精神不正常者。

3. 并发感染为肾上腺皮质激素的主要不良反应。以真菌、结核菌、葡萄球菌、变形杆菌、绿脓杆菌和各种疱疹病毒为主。

4. 糖皮质激素停药综合征。有时患者在停药后出现头晕、昏厥倾向、腹痛或背痛、低热、食欲减退、恶心、呕吐、肌肉或关节疼痛、头疼、乏力、软弱，经仔细检查如能排除肾上腺皮质功能减退和原来疾病的复燃，则可考虑为对糖皮质激素的依赖综合征。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
泼尼松龙片	化学药	HZ002870
泼尼松龙注射液	化学药	HZ002871

HY001536 脯氨酸

【外文名称】Proline

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】吡咯烷－2－羧酸

【分子式】$C_5H_9NO_2$

【分子量】115.13

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末；微臭，味微甜。本品在水中易溶，在乙醇中溶解，在乙醚或正丁醇中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并稀释成每 1ml 中约含 40mg 的溶液，依法测定比旋度为－84.5°至－86.0°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：氨基酸类药。

复方氨基酸大输液原料之一。用于营养不良、蛋白质缺乏症、严重胃肠道疾病，烫伤及外科手术后的蛋白质补充。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
复方氨基酸颗粒（14AA）	化学药	HZ001049
复方氨基酸口服溶液（14AA）	化学药	HZ001050
复方氨基酸(15)双肽(2)注射液	化学药	HZ001051
复方氨基酸注射液（14AA）	化学药	HZ001055
复方氨基酸注射液（15AA）	化学药	HZ001056
复方氨基酸注射液（15－HBC）	化学药	HZ001057
复方氨基酸注射液（17AA）	化学药	HZ001058
复方氨基酸注射液（17AA－Ⅰ）	化学药	HZ001059
复方氨基酸注射液（17AA－H）	化学药	HZ001060
复方氨基酸注射液（17种氨基酸）	化学药	HZ001061
复方氨基酸注射液（18）	化学药	HZ001062
复方氨基酸注射液（18AA）	化学药	HZ001063
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅰ）	化学药	HZ001064
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅱ）	化学药	HZ001065
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅲ）	化学药	HZ001066

续表

制剂名称	类别	序号
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅳ）	化学药	HZ001067
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅴ）	化学药	HZ001068
复方氨基酸注射液（18AA－N）	化学药	HZ001069
复方氨基酸注射液（18－B）	化学药	HZ001070
复方氨基酸注射液（20AA）	化学药	HZ001071
小儿复方氨基酸注射液(18AA－Ⅰ)	化学药	HZ003749
小儿复方氨基酸注射液(18AA－Ⅱ)	化学药	HZ003750
小儿复方氨基酸注射液(19AA－Ⅰ)	化学药	HZ003751
脂肪乳氨基酸葡萄糖注射液	化学药	HZ004653

HY001537　扑米酮

【其他名称】 Hexamidine、麦苏林（Mysoline）、扑痫酮、去氧苯巴比妥（Primaclone）

【外文名称】 Primidone

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 5－乙基－5－苯基－二氢－4,6（1*H*,5*H*）嘧啶二酮

【分子式】 $C_{12}H_{14}N_2O_2$

【分子量】 218.26

【性状及组成】 本品为白色结晶性粉末；无臭，味微苦。本品在乙醇中微溶，在水、丙酮或苯中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 280～284℃。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：抗癫痫药。

在体内的主要代谢产物为苯巴比妥也具较强抗癫痫作用。体外电生理实验见其使神经细胞的氯离子通道开放，细胞过极化，拟似 γ－氨基丁酸的作用。在治疗浓度时可降低谷氨酸的兴奋作用、加强 γ－氨基丁酸的抑制作用，抑制中枢神经系统单突触和多突触传递，导致整个神经细胞兴奋性降低，提高运动皮质电刺激阈。使发作阈值提高，还可以抑制致痫灶放电的传播。

【药代动力学】 口服胃肠道吸收较快，但慢于苯巴比妥。小儿的生物利用度约 92%。口服 3～4 小时血药浓度达峰值（0.5～9 小时），血浆蛋白率结合率较低，约为 20%，分布广泛，表观分布容积一般为 0.6L/kg，$t_{1/2}$约 10～15 小时。由肝脏代谢为活性产物苯乙基二酰胺（PEMA）和苯巴比妥，前者 $t_{1/2}$为 24～48 小时，后者成人 $t_{1/2}$为 50～144 小时，小儿为 40～70 小时。成人被吸收的扑米酮 15%～25%转化为苯巴比妥，服药 1 周血药浓度达稳态，血浆有效浓度为 10～20μg/ml。给药后约 20%～40%以扑米酮、30%以 PEMA、25%以苯巴比妥的形式由肾排泄。可通过胎盘、可分泌入乳汁。

【药物相互作用】

1．饮酒、全麻药、具有中枢神经抑制作用的药、注射用硫酸镁与本品合用时可增加中枢神经活动或呼吸的抑制，用量需调整。

2．与抗凝药、皮质激素、洋地黄、地高辛、盐酸多西环素或三环类抗抑郁药合用时，由于苯巴比妥对肝酶的诱导作用，使这些药物代谢增快而疗效降低。

3．与单胺氧化酶抑制药合用时，本品代谢抑制可能出现中毒。

4．本品可减低维生素 B_{12}的肠道吸收，增加维生素 C 由肾排出，由于肝酶的正诱导，可使维生素 D 代谢加快。

5．与垂体后叶素合用，有增加心律失常或冠脉供血不足的危险。

6．与卡马西平合用，由于两者相互的肝酶正诱导作用而疗效降低，应测定血药浓度。

7．与其他抗癫痫药合用，由于代谢的变化引起癫痫发作的形式改变，需及时调整用量。

8．与丙戊酸钠合用，本品血浓增加，同时丙戊酸半衰期缩短，应调整用量，避免引起中毒。

9．不宜与苯巴比妥合用。

10．与苯妥英钠合用时本品代谢加快。与避孕药合用时可致避孕失败。

【不良反应】

1．患者不能耐受或服用过量可产生视力改变，复视，眼球震颤，共济失调，认识迟钝，情感障碍，精神错乱，呼吸短促或障碍。

2．少见的有儿童和老人者为异常的兴奋或不安等反常反应。

3．偶见有过敏反应（呼吸困难，眼睑肿胀，喘鸣或胸部紧迫感），粒细胞减少，再障、红细胞发育不良，巨细胞性贫血。

4．发生手脚不灵活或引起行走不稳、关节挛缩，眩晕、嗜睡。少数患者出现性功能减退、头痛、食欲减退，疲劳感，恶心或呕吐，但继续服用往往会减轻或消失。可出现中毒性表皮坏死。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
扑米酮片	化学药	HZ002873

HY001538 葡甘聚糖

【外文名称】Polygluosan

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第12册

【性状及组成】本品为天南星科植物的地下块茎提取的多糖，主要含葡甘聚糖。按干燥品计算，含葡甘聚糖以无水葡萄糖计不得少于60.0%。

本品为类白色至淡黄色颗粒状粉末，有少许类黑色颗粒，微臭；溶于冷水成胶状溶液。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：容积性泻药。

葡甘聚糖胶囊为天然纤维类植物多糖，在肠内不吸收，有极强的缚水性和持水性，吸水后体积膨大50倍以上，故可增大粪便容和粪便含水量，使粪便蓬松湿润，利于排出。肠腔内容积的增大刺激肠壁，反射性地增强肠蠕动，从而缩短排便间隔时间和平均一次排便时间，使排便自然通畅而不会产生腹泻。葡甘聚糖胶囊吸水膨胀成为黏性溶胶，能增加食物的黏度，并覆盖在肠黏膜的表面形成扩散屏障，同时吸附和结合一部分糖类物质，并将其带出体外，因而限制了糖类在肠内的扩散和吸收，使糖的吸收减少，餐后血糖变得平缓。葡甘聚糖胶囊能吸附和结合肠道内的胆固醇，将其带出体外，从而减少人体对中性脂肪和胆固醇的吸收；通过抑制肠黏膜对胆汁酸的主动运输，部分阻断胆汁酸的肠肝循环，减少其重吸收，起到降低血脂的作用。

【不良反应】部分患者有口渴感，可多饮水；大多数患者都有轻微腹胀，可继续服药，排便后自行消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
葡甘聚糖胶囊	化学药	HZ002875

HY001539 葡庚糖酸钠

【外文名称】Sodium Glucoheptonate

【分子式】$C_7H_{13}NaO_8$

【分子量】248.16

药物药理信息

【药理毒理】本品不直接使用，无单独的药理毒理作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用亚锡葡庚糖酸钠Ⅰ	化学药	HZ005034
注射用亚锡葡庚糖酸钠Ⅱ	化学药	HZ005035

HY001540 葡甲胺

【外文名称】Meglumine

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】1-脱氧-1-（甲氨基）-D-山梨醇

【分子式】$C_7H_{17}NO_5$

【分子量】195.22

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；几乎无臭，味微甜，带咸涩。本品在水中易溶，在乙醇中略溶，在三氯甲烷中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为128~132℃。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每1ml中含0.01g，在25℃时，依法测定，比旋度为-15.5°至-17.5°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：诊断用药。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
泛影葡胺注射液	化学药	HZ000891

HY001541 葡醛内酯

【其他名称】Glucurone、肝泰乐、葡萄糖醛酸内酯、葡萄糖酸内酯

【外文名称】Glucurolactone

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（二部）·第4册

药物理化信息

【化学名】D-葡萄糖醛酸-γ-内酯

【分子式】$C_6H_8O_6$

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末；无臭，味微苦；遇光色渐变深；溶于水后，一部分内酯变成葡萄糖醛酸，达成平衡状态，显酸性反应。

本品在水中易溶，在甲醇中略溶，在乙醇中微溶。

熔点 本品的熔点为170~176℃，熔融时同时分解。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释使成每 1ml 中约含 0.1g 的溶液，依法测定，在 25℃时比旋度为 + 18.0°至 + 20.0°。

药物药理信息

【药理毒理】 肝脏疾病辅助用药及解毒药。

本品为葡萄糖醛酸的前体物质，后者为体内重要的解毒物质，它能与肝内及肠内的毒物结合变成无毒的葡萄糖醛酸结合物而排出，故具有保肝作用。另本品还能使肝糖增加、脂肪贮量减少。

在肝内能与某些毒物结合而起解毒作用，并降低肝淀粉酶活性，使肝糖原增加，脂肪贮量降低，本品亦为构成体内结缔组织的成分。可用于治疗急慢性肝炎、肝硬化及中毒等引起的肝功能障碍，亦可用作关节炎、风湿病的辅助治疗。

【不良反应】 用后偶有面红，轻微的胃肠不适等。减量或停药后即可消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
二维葡醛内酯片	化学药	HZ000858
葡醛内酯胶囊	化学药	HZ002876
葡醛内酯片	化学药	HZ002877
葡醛内酯注射液	化学药	HZ002878
舒肝康胶囊	中成药	ZC005156

HY001542　葡醛酸钠

【外文名称】 Sodium Glucuronic Acide

药物理化信息

【化学名】 D－葡萄醛酸钠

【分子式】 $C_6H_9NaO_7 \cdot H_2O$

【分子量】 234.25

【性状及组成】 本品 0.133g 相当于葡萄糖醛酸内酯 0.1g。

药物药理信息

【药理毒理】 本品进入机体后，在酶的作用下变为葡萄醛酸而起作用，可降低肝淀粉酶的活性，阻止糖原分解，使肝糖原含量增加，脂肪储量减少。本品能与肝内及肠内含有羟基或羧基的毒物结合变为低毒或无毒的葡醛酸结合物而由尿排出。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
葡醛酸钠氯化钠注射液	化学药	HZ002879
注射用葡醛酸钠	化学药	HZ004924

HY001543　葡萄糖

【其他名称】 右旋糖（Dextrose）

【外文名称】 Glucose

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 D－（+）－吡喃葡萄糖一水合物

【分子式】 $C_6H_{12}O_6 \cdot H_2O$

【分子量】 198.17

【性状及组成】 本品为无色结晶或白色结晶性或颗粒性粉末；无臭，味甜。本品在水中易溶，在乙醇中微溶。

比旋度：取本品约 10g，精密称定，置 100ml 量瓶中，加水适量与氨试液 0.2ml，溶解后，用水稀释至刻度，摇匀，放置 10 分钟，在 25℃时，依法测定，比旋度 + 52.5°至 + 53.0°。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：营养药。

葡萄糖是人体主要的热量来源之一，每 1g 葡萄糖可产生 4 大卡（16.7kJ）热能，故被用来补充热量。治疗低糖血症。当葡萄糖和胰岛素一起静脉滴注，糖原的合成需钾离子参与，从而钾离子进入细胞内，血钾浓度下降，故被用来治疗高钾血症。高渗葡萄糖注射液快速静脉推注有组织脱水作用，可用作组织脱水剂。另外，葡萄糖是维持和调节腹膜透析液渗透压的主要物质。

【药代动力学】 静脉注射葡萄糖直接进入血液循环。葡萄糖在体内完全氧化生成 CO_2 和水，经肺和肾排出体外，同时产生能量。也可转化成糖原和脂肪贮存。一般正常人体每分钟利用葡萄糖的能力为 6mg/kg。

【不良反应】

1．静脉炎，发生于高渗葡萄糖注射液滴注时。如用大静脉滴注，静脉炎发生率下降。

2．高浓度葡萄糖注射液外渗可致局部肿痛。

3．反应性低血糖：合并使用胰岛素过量，原有低血糖倾向及全静脉营养疗法突然停止时易发生。

4．高血糖非酮症昏迷：多见于糖尿病、应激状态、使用大量的糖皮质激素、尿毒症腹膜透析患者腹腔内给予高渗葡萄糖溶液及全营养疗法时。

5．电解质紊乱，长期单纯补给葡萄糖时易出现低钾、低钠及低磷血症。

6．原有心功能不全者，易致水潴留。

7．高钾血症，Ⅰ型糖尿病患者应用高浓度葡萄糖时偶有发生。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
阿奇霉素葡萄糖注射液	化学药	HZ000060
阿魏酸钠葡萄糖注射液	化学药	HZ000101
阿昔洛韦葡萄糖注射液	化学药	HZ000116
氨甲苯酸葡萄糖注射液	化学药	HZ000217
奥沙利铂葡萄糖注射液	化学药	HZ000267
奥扎格雷钠葡萄糖注射液	化学药	HZ000285
胞磷胆碱钠葡萄糖注射液	化学药	HZ000308
棓丙酯葡萄糖注射液	化学药	HZ000312
吡拉西坦葡萄糖注射液	化学药	HZ000385
茶碱葡萄糖注射液	化学药	HZ000506
长春西汀葡萄糖注射液	化学药	HZ000514
单硝酸异山梨酯葡萄糖注射液	化学药	HZ000642
多索茶碱葡萄糖注射液	化学药	HZ000793
莪术油葡萄糖注射液	化学药	HZ000818
二甲硅油散	化学药	HZ000839
法莫替丁葡萄糖注射液	化学药	HZ000880
酚磺乙胺葡萄糖注射液	化学药	HZ000918
氟康唑葡萄糖注射液	化学药	HZ000975
氟罗沙星葡萄糖注射液	化学药	HZ000984
氟尿嘧啶葡萄糖注射液	化学药	HZ000993
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅳ）	化学药	HZ001067
复方电解质葡萄糖 MG3 注射液	化学药	HZ001140
复方电解质葡萄糖 R2A 注射液	化学药	HZ001141
复方电解质葡萄糖注射液 M3A	化学药	HZ001142
复方电解质葡萄糖注射液 M3B	化学药	HZ001143
复方电解质葡萄糖注射液 R4A	化学药	HZ001144
复方电解质眼内冲洗液	化学药	HZ001145
复方甘草酸单铵 S 葡萄糖注射液	化学药	HZ001180
复方酵母碳酸铋片	化学药	HZ001232
复方乳酸钠葡萄糖注射液	化学药	HZ001361
腹膜透析液（乳酸盐）	化学药	HZ001528
甘草酸二铵葡萄糖注射液	化学药	HZ001547
葛根素葡萄糖注射液	化学药	HZ001614
果葡糖浆	化学药	HZ001659
含糖胃蛋白酶	化学药	HZ001680
核酪口服溶液	化学药	HZ001690
核酪注射液	化学药	HZ001691

续表

制剂名称	类别	序号
环丙沙星葡萄糖注射液	化学药	HZ001726
环磷腺苷葡胺葡萄糖注射液	化学药	HZ001730
环磷腺苷葡萄糖注射液	化学药	HZ001732
肌苷葡萄糖注射液	化学药	HZ001796
己酮可可碱葡萄糖注射液	化学药	HZ001808
加替沙星葡萄糖注射液	化学药	HZ001818
甲磺酸加替沙星葡萄糖注射液	化学药	HZ001859
甲磺酸培氟沙星葡萄糖注射液	化学药	HZ001867
甲硝唑葡萄糖注射液	化学药	HZ001914
克林霉素磷酸酯葡萄糖注射液	化学药	HZ002107
口服补液盐Ⅰ	化学药	HZ002135
口服补液盐Ⅱ	化学药	HZ002136
口服葡萄糖	化学药	HZ002138
口服四维葡萄糖	化学药	HZ002140
口服维 D_2 葡萄糖	化学药	HZ002141
口服五维赖氨酸葡萄糖	化学药	HZ002142
口服五维葡萄糖	化学药	HZ002143
苦参碱葡萄糖注射液	化学药	HZ002147
苦参素葡萄糖注射液	化学药	HZ002152
利巴韦林葡萄糖注射液	化学药	HZ002204
亮菌甲素葡萄糖注射液	化学药	HZ002255
磷酸川芎嗪葡萄糖注射液	化学药	HZ002285
膦甲酸钠葡萄糖注射液	化学药	HZ002311
硫酸奈替米星葡萄糖注射液	化学药	HZ002365
氯化钾葡萄糖注射液	化学药	HZ002488
门冬氨酸钾镁葡萄糖注射液	化学药	HZ002670
门冬氨酸洛美沙星葡萄糖注射液	化学药	HZ002673
钠钾葡萄糖注射液	化学药	HZ002729
诺氟沙星葡萄糖注射液	化学药	HZ002829
帕米膦酸二钠葡萄糖注射液	化学药	HZ002836
葡萄糖氯化钙注射液	化学药	HZ002881
葡萄糖氯化钠钾注射液	化学药	HZ002882
葡萄糖氯化钠注射液	化学药	HZ002883
葡萄糖酸钙维 D_2 散	化学药	HZ002891
葡萄糖鱼肝油乳	化学药	HZ002913
葡萄糖注射液	化学药	HZ002914
氢溴酸高乌甲素葡萄糖注射液	化学药	HZ002982

续表

制剂名称	类别	序号
曲克芦丁葡萄糖注射液	化学药	HZ003032
糅酸蛋白酵母散	化学药	HZ003088
乳酸加替沙星葡萄糖注射液	化学药	HZ003109
乳酸左氧氟沙星葡萄糖注射液	化学药	HZ003130
参芎葡萄糖注射液	化学药	HZ003194
输血用1号抗凝液	化学药	HZ003215
输血用2号抗凝液	化学药	HZ003216
四维王浆葡萄糖颗粒	化学药	HZ003321
替硝唑葡萄糖注射液	化学药	HZ003392
维 B_1 乳酸钙片	化学药	HZ003516
维生素C葡萄糖注射液	化学药	HZ003563
硝酸甘油葡萄糖注射液	化学药	HZ003694
硝酸异山梨酯葡萄糖注射液	化学药	HZ003719
小儿电解质补给注射液	化学药	HZ003745
小儿四维葡钙颗粒	化学药	HZ003775
小儿四维葡钙片	化学药	HZ003776
新福菌素注射液	化学药	HZ003797
血液保存液Ⅱ	化学药	HZ003817
血液滤过置换液	化学药	HZ003818
烟酸占替诺葡萄糖注射液	化学药	HZ003838
烟酰胺葡萄糖注射液	化学药	HZ003842
盐酸氨溴索葡萄糖注射液	化学药	HZ003879
盐酸昂丹司琼葡萄糖注射液	化学药	HZ003888
盐酸吡硫醇葡萄糖注射液	化学药	HZ003920
盐酸川芎嗪葡萄糖注射液	化学药	HZ003938
盐酸丁丙诺啡注射液	化学药	HZ003958
盐酸丁咯地尔葡萄糖注射液	化学药	HZ003968
盐酸多巴酚丁胺葡萄糖注射液	化学药	HZ003973
盐酸格拉司琼葡萄糖注射液	化学药	HZ004023
盐酸环丙沙星葡萄糖注射液	化学药	HZ004033
盐酸精氨酸葡萄糖注射液	化学药	HZ004061
盐酸克林霉素葡萄糖注射液	化学药	HZ004074
盐酸赖氨酸葡萄糖注射液	化学药	HZ004090
盐酸利多卡因葡萄糖注射液	化学药	HZ004109
盐酸林可霉素葡萄糖注射液	化学药	HZ004119
盐酸洛美沙星葡萄糖注射液	化学药	HZ004158
盐酸米托蒽醌葡萄糖注射液	化学药	HZ004198

续表

制剂名称	类别	序号
盐酸奈福泮葡萄糖注射液	化学药	HZ004211
盐酸尼卡地平葡萄糖注射液	化学药	HZ004221
盐酸曲马多葡萄糖注射液	化学药	HZ004259
盐酸托烷司琼葡萄糖注射液	化学药	HZ004320
盐酸溴己新葡萄糖注射液	化学药	HZ004353
盐酸左氧氟沙星葡萄糖注射液	化学药	HZ004399
氧氟沙星葡萄糖注射液	化学药	HZ004416
乙酰谷酰胺葡萄糖注射液	化学药	HZ004505
右旋糖酐20葡萄糖注射液	化学药	HZ004591
右旋糖酐40葡萄糖注射液	化学药	HZ004593
右旋糖酐70葡萄糖注射液	化学药	HZ004596
注射用转化糖	化学药	HZ005134
转化糖电解质注射液	化学药	HZ005138
转化糖注射液	化学药	HZ005139
左卡尼汀葡萄糖注射液	化学药	HZ005147
涩肠止泻散	民族药	MZ000482
丹参滴注液	中成药	ZC000739
丹香葡萄糖滴注液	中成药	ZC000753
人参蜂王浆胶囊	中成药	ZC004309
参茸加口服液	中成药	ZC004874
西瓜霜清咽含片	中成药	ZC005902

HY001544　葡萄糖酸钙

【其他名称】糖酸钙

【外文名称】Calcium Gluconate

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】D－葡萄糖酸钙盐一水合物

【分子式】$C_{12}H_{22}CaO_{14}\cdot H_2O$

【分子量】448.40

【性状及组成】本品为白色颗粒性粉末，无臭，无味。本品在沸水中易溶，在水中缓缓溶解，在无水乙醇、三氯甲烷或乙醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：补钙药。

本品为钙补充剂。钙可以维持神经肌肉的正常兴奋性，促进神经末梢分泌乙酰胆碱。血清钙降低时可出现神经肌肉兴奋性升高，发生抽搐，血钙过

高则兴奋性降低，出现软弱无力等。钙离子能改善细胞膜的通透性，增加毛细管的致密性，使渗出减少，起抗过敏作用。钙离子能促进骨骼与牙齿的钙化形成，高浓度钙离子与镁离子之间存在竞争性拮抗作用，可用于镁中毒的解救；钙离子可与氟化物生成不溶性氟化钙，用于氟中毒的解救。

【药代动力学】血浆中约45%钙与血浆蛋白结合，正常人血清钙浓度2.25～2.50mmol/L（9～11mg/100ml），甲状旁腺素，降钙素、维生素D的活性代谢物维持血钙含量的稳定性。钙主要自粪便排出（约80%），部分（约20%～30%）自尿排出。维生素D可促进钙的吸收，钙可分泌入汗液、胆汁、唾液、乳汁、尿、粪等。

【药物相互作用】

1．大量饮用含酒精和咖啡因的饮料以及大量吸烟，均会抑制口服钙剂的吸收。

2．大量进食富含纤维素的食物，能抑制钙的吸收，因钙与纤维素结合成不易吸收的化合物。

3．本品与苯妥因钠类以及四环素同用，二者吸收均减低。

4．维生素D、避孕药、雄性激素能增加钙的吸收。

5．含铝的抗酸药与本品同服时，铝的吸收增多。

6．与钙通道阻滞剂（如硝苯地平）同用，血钙可明显升高至正常以上，但盐酸维拉帕米等的作用则降低。

7．本品与噻嗪类利尿药合用时，易发生高钙血症，（因增加肾小管对钙的重吸收）。

8．本品与含钾药物合用时，应注意心律失常。

9．与氧化镁等有轻泻作用制酸药合用或交叉应用，可减少嗳气、便秘等不良反应。

10．注射剂禁与氧化剂、枸橼酸盐、可溶性碳酸盐、磷酸盐及硫酸盐配伍。

11．与噻嗪类利尿药同用，可增加肾脏对钙的重吸收而致高钙血症。

【不良反应】静脉注射可有全身发热，静注过快可产生心律失常甚至心跳停止、呕吐、恶心。可致高钙血症，早期可表现便秘、倦睡、持续头痛、食欲减退、口中有金属味、异常口干等，晚期征象表现为精神错乱、高血压、眼和皮肤对光敏感，恶心、呕吐，心律失常等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
醋酸甲羟孕酮复合胶囊	化学药	HZ000578
二维葡钙片	化学药	HZ000856

续表

制剂名称	类别	序号
二维葡磷钙咀嚼片	化学药	HZ000857
复方二氯醋酸二异丙胺片	化学药	HZ001156
复方赖氨酸颗粒	化学药	HZ001257
复方葡萄糖酸钙口服溶液	化学药	HZ001338
复方炔雌醇甲羟孕酮胶囊	化学药	HZ001354
复方锌铁钙颗粒	化学药	HZ001445
葡钙维 B_1 片	化学药	HZ002874
葡萄糖酸钙含片	化学药	HZ002884
葡萄糖酸钙颗粒剂	化学药	HZ002885
葡萄糖酸钙口服液	化学药	HZ002886
葡萄糖酸钙氯化钠注射液	化学药	HZ002887
葡萄糖酸钙片	化学药	HZ002888
葡萄糖酸钙维 D_2 咀嚼片	化学药	HZ002889
葡萄糖酸钙维 D_2 咀嚼片（Ⅱ）	化学药	HZ002890
葡萄糖酸钙维 D_2 散	化学药	HZ002891
葡萄糖酸钙锌口服液	化学药	HZ002892
葡萄糖酸钙注射液	化学药	HZ002893
三合钙咀嚼片	化学药	HZ003151
三维葡磷钙咀嚼片	化学药	HZ003162
四维钙片	化学药	HZ003318
维 D_2 磷葡钙片	化学药	HZ003522
维磷葡钙片	化学药	HZ003526
五维葡钙口服溶液	化学药	HZ003610
小儿葡磷泛三钙片	化学药	HZ003766
小儿四维葡钙颗粒	化学药	HZ003775
小儿四维葡钙片	化学药	HZ003776
复方太子参颗粒	中成药	ZC001532
龙牡壮骨颗粒	中成药	ZC003356
益肺健脾颗粒	中成药	ZC006813

HY001545 葡萄糖酸氯己定

【外文名称】Chlorhexidine Gluconate

药物理化信息

【化学名】1,6－双（N^1－对氯苯基－N^5－双胍基）己烷二葡萄糖酸盐

【分子式】$C_{22}H_{30}Cl_2N_{10}\cdot 2C_6H_{12}O_7$

药物药理信息

【药理毒理】本品为消毒防腐药。某些葡萄球

菌、变异链球菌、唾液链球菌、白色念珠菌、大肠埃希菌和厌氧丙酸菌对本品高度敏感，嗜血链球菌中度敏感，变形杆菌属、假单胞菌属、克雷伯杆菌属和革兰阴性球菌（如韦永球菌属）低度敏感。本品对革兰阳性和阴性菌的抗菌作用，比苯扎溴铵等强。本品在血清、血液等存在时仍有效。

本品的作用机制为吸附于细菌胞浆膜的渗透屏障，使细胞内容物漏出而发挥抗菌作用。低浓度有抑菌作用，高浓度则有杀菌作用。

【药代动力学】本品带阳性电荷，口腔含漱时吸附于带阴性电荷的齿、斑块和口腔黏膜表面，随后吸附的药物从这些部位弥散，逐渐释出。胃肠道吸收很少。绝大部分随粪便排出。

【不良反应】

1. 偶可引起接触性皮炎。高浓度溶液对眼结膜刺激性强。

2. 本品可使口腔表面着色，早者在使用后1周左右发生。使用6个月后约50%的患者可将牙齿染色，约10%的患者重度着色，较多牙斑块沉积者着色更显著。假牙因表面或边缘粗糙可发生永久性着色。

3. 可发生味觉改变，继续治疗可恢复。

4. 10~18岁小儿和青少年可发生口腔无痛性浅表脱屑。

5. 少见局部刺激和过敏反应。

6. 小儿误饮本品后，可出现酒精中毒症状（如口齿不清、嗜睡、步态摇晃等），应立即送急诊处理。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方氯己定含漱液	化学药	HZ001302
复方樟脑乳膏	化学药	HZ001487
甲硝唑氯己定洗剂	化学药	HZ001911
葡萄糖酸氯己定含漱剂	化学药	HZ002894
葡萄糖酸氯己定溶液	化学药	HZ002895
葡萄糖酸氯己定软膏	化学药	HZ002896
葡萄糖酸氯己定贴	化学药	HZ002897
稀葡萄糖酸氯己定溶液	化学药	HZ003652

HY001546　葡萄糖酸镁

【外文名称】Magnesium Gluconate

药物理化信息

【化学名】葡萄糖酸镁

药物药理信息

【药理毒理】葡萄糖酸镁在体内解离成镁离子和葡萄糖酸，参与体内所有的能量代谢，激活或催化300多个酶系统。DNA和RNA的合成以及细胞膜的结构均少不了镁离子参与。本品具有明显的肌肉松弛的作用，可缓解冠状动脉痉挛，减少乙酰胆碱的释放，维持机体钾、镁离子的平衡，能预防因缺镁导致的血小板聚集及冠脉血栓的形成，具有钙结抗和膜稳定作用。

【药代动力学】本品在体外均由葡萄糖转化生成，其吸收途径与葡萄糖相同。吸收在1小时内开始，以恒定的速率持续至8小时，饥饿时可能吸收较快且较完全。本品最大的特点是螯合的阳离子吸收和消化都远远好于其他类型，所有年龄组均能经胃肠道良好吸收。吸收的镁主要由肾脏排出。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
葡萄糖酸镁口服液	化学药	HZ002898

HY001547　葡萄糖酸钠

【外文名称】Sodium Gluconate

药物理化信息

【化学名】五羟基己酸钠

【分子式】$C_6H_{11}O_7Na$

【分子量】218.14

【性状及组成】白色结晶颗粒或粉末。极易溶于水，略溶于酒精，不溶于乙醚。

药物药理信息

【药理毒理】用于调节人体内酸碱平衡，以恢复神经正常作用，钠对维持细胞外渗透压和容量，调节酸碱平衡，发挥神经肌肉的正常功能具有重要的作用。

本品可有效地防止低钠综合征的发生。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方电解质注射液	化学药	HZ001146
复方二氯醋酸二异丙胺注射液	化学药	HZ001157
注射用复方二氯醋酸二异丙胺	化学药	HZ004759

HY001548　葡萄糖酸锑钠

【其他名称】可乐锑、Pentostan、葡酸锑钠、圣露斯锑波霜、Solustibosan、斯锑黑克、Stihek、斯锑康

【外文名称】Sodium Stibogluconate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】葡萄糖酸锑钠

【性状及组成】本品为组成不定的五价锑化合物。按干燥品计算，含锑（Sb）应为 30.0% ~ 34.0%。

本品为白色或微显淡黄色的无定形粉末；无臭；水溶解显右旋性。本品在热水中易溶，在水中溶解，在乙醇或乙醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗黑热病药。

本品为五价锑化合物。对组织中培养生长的前鞭毛体无作用，但对体内寄生者（无前鞭毛体）则有良效，在体内五价锑必须还原成三价锑才能发挥作用。其作用机制不详，已知锑可通过与巯基结合而起作用。药物通过选择性细胞内胞饮摄入，进入巨噬细胞的吞噬体，其中存在的利什曼原虫即被消灭。

【药代动力学】本品口服吸收差。肌注吸收良好，不与红细胞结合，其血浆浓度则远较三价锑化合物为高，但维持时间较短，较快由肾脏排出，80%的药物于 6 小时内由尿中排出，静脉注射相同量药物后 95%以上由尿中排出，表明该药物在体内无明显代谢，无明显蓄积现象。但如肾功能受损，则可妨碍锑的排泄，可致中毒。小量在肝内还原成三价锑。约 12%蓄积于血管外腔隙，在该处给药 5 日后即呈饱和状态，由此锑剂缓慢释放。

【不良反应】与三价锑相仿，但较少而轻，一般病人多能耐受。有时出现恶心、呕吐、咳嗽、腹痛、腹泻现象，偶见白细胞减少。特殊反应包括肌注局部痛、肌痛和关节僵直。后期出现心电图改变（如 T 波低平或倒置、Q－T 时间延长等），为可逆性，但可能为严重心律失常的前奏。肝、肾功能异常者应加强监测。罕见休克和突然死亡。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
葡萄糖酸锑钠片	化学药	HZ002899
葡萄糖酸锑钠注射液	化学药	HZ002900

HY001549 葡萄糖酸铜

【外文名称】Copper Gluconate

药物药理信息

【药理毒理】营养增补剂。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517

HY001550 葡萄糖酸锌

【外文名称】Zinc Gluconate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】葡萄糖酸锌

【分子式】$C_{12}H_{22}O_{14}Zn$

【分子量】455.68

【性状及组成】本品为白色结晶性或颗粒性粉末；无臭，味微涩。本品中沸水中极易溶解，在水中溶解，在无水乙醇、三氯甲烷或乙醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：补锌药。

锌为体内众多酶（金属酶、蛋白酶、核酸合成酶）的重要组成部分，具有促进生长发育、改善味觉等多重作用，锌对儿童的生长发育尤为重要。

本品可提高 DNA 复制能力，加速 DNA 和 RNA 的生物合成，促使细胞更新，能激活胸腺激素，使 T 细胞增加，维持脑下垂体、性腺、胰腺的正常功能。

【药代动力学】本品口服后由小肠吸收，能广泛分布于肝、肠、脾、心、胰、肾、肺、肌肉及中枢神经系统、骨骼等内。

【药物相互作用】

1．本品与铝盐、钙盐、铋盐、碳酸盐、氢氧化物等不可同用。

2．本品可降低青霉胺及四环素类药品的作用。

3．如正服其他药品，使用本品前请咨询医师或药师。

【不良反应】

1．有轻度恶心、呕吐、便秘等反应。

2．应避免空腹服药，必要时可减少用量或停药以使不良反应减轻。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
多维元素胶囊（16）	化学药	HZ000803
多维元素片（25）	化学药	HZ000809
复方氨酚葡锌片（1）	化学药	HZ001035
复方氨酚葡锌片（2）	化学药	HZ001036
复方锌布颗粒	化学药	HZ001444

续表

制剂名称	类别	序号
复方锌铁钙颗粒	化学药	HZ001445
赖氨葡锌颗粒	化学药	HZ002171
赖氨葡锌片	化学药	HZ002172
洛芬葡锌那敏片	化学药	HZ002568
葡萄糖酸钙锌口服液	化学药	HZ002892
葡萄糖酸锌胶囊	化学药	HZ002901
葡萄糖酸锌咀嚼片	化学药	HZ002902
葡萄糖酸锌颗粒	化学药	HZ002903
葡萄糖酸锌口服液	化学药	HZ002904
葡萄糖酸锌喷鼻剂	化学药	HZ002905
葡萄糖酸锌片	化学药	HZ002906
葡萄糖酸锌软膏	化学药	HZ002907
葡萄糖酸锌糖浆	化学药	HZ002908
善存液	化学药	HZ003188
四维葡锌胶丸	化学药	HZ003319
小儿复方四维亚铁散	化学药	HZ003760
锌布颗粒	化学药	HZ003796
健胃消食口服液	中成药	ZC002531
消朦片	中成药	ZC006082

HY001551　葡萄糖酸亚铁

【其他名称】Fegon、Simron

【外文名称】Ferrous Gluconate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】D－葡萄糖酸亚铁盐二水合物

【分子式】$C_{12}H_{22}FeO_{14}\cdot 2H_2O$

【分子量】482.17

【性状及组成】本品为灰绿色或微黄色粉末或颗粒；有焦糖臭，味涩。本品在热水中易溶，在水中溶解，在乙醇中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗贫血药。

铁是人体重要元素之一，参与血红蛋白的合成，在传递氧和参与人体代谢活动中起重要作用。铁为血红蛋白及肌红蛋白的主要组成成分。血红蛋白为红细胞中氧的主要携带者。肌红蛋白系肌肉细胞贮存氧的部位，为肌肉运动时提供氧的需要。与三羧酸循环有关的大多数酶和因子均含铁，或仅在铁存在时才能发挥作用。所以对缺铁患者积极补充铁剂后，除血红蛋白合成加速外，与组织缺铁和含铁酶活性降低的有关症状如生长迟缓、行为异常、体力不足、黏膜组织变化以及皮肤、指甲病变也均能逐渐得以纠正。

【药代动力学】

1．吸收：铁剂以亚铁离子（Fe^{2+}）形式主要在十二指肠及空肠近端吸收。非缺铁者口服铁的吸收率约为 5%～10%可自肠黏膜吸收，随着体内贮存量的缺乏，铁吸收量可成比例增加。饭后铁的吸收量约较空腹时减少 1/3～1/2。

2．分布：吸收进入肠黏膜细胞的铁一部分与去铁蛋白结合成铁蛋白，贮存于肠黏膜细胞内；吸收的另一部分铁通过与铁蛋白（是一种 β 球蛋白）结合，转送入血。进入血液的 Fe^{2+}，在血浆铜兰蛋白（又称亚铁氧化酶）催化下氧化成 Fe^{3+}，并与转铁蛋白结合，成为血浆铁。然后转运到骨髓、肝、脾，铁从小肠黏膜细胞或从肝、脾、贮存部位转运到骨髓造血组织，是以转铁蛋白－离子复合物的形式，通过与成熟红细胞膜上的转铁蛋白受体结合，使铁进入红细胞参与合成血红蛋白。多余的铁与这些组织中的去铁蛋白结合成铁蛋白。和变性成含铁血黄素两种形式贮存。

3．代谢和排泄：铁的每日排泄量，男性约 0.5～1.0mg，女性因月经或哺乳，平均约 1.0～1.5mg。经代谢的铁主要通过肾排泄，未被吸收的铁及经肠黏膜细胞脱落从粪便排出，少量铁由胆汁、尿、汗液排出。

【药物相互作用】

1．本品与制酸药如碳酸氢钠、磷酸盐类及含鞣酸的药物或饮料同用，易产生沉淀而影响吸收。

2．本品与西咪替丁、去铁胺、二巯丙醇、胰酶、胰脂肪酶等同用，可影响铁的吸收；铁可影响四环素类药物、氟喹诺酮类、青霉胺及锌制剂的吸收。

3．与维生素 C 同服，可增加本品吸收。

【药物过量】过量误服本品，可能产生坏死性胃炎、肠炎，患者可有严重呕吐、腹泻及腹痛，以致血压降低，代谢性酸中毒，甚至昏迷等急性中毒症状。24～48 小时后，严重中毒可进一步发展至休克及血容量不足，肝损害及心血管功能衰竭，患者可有全身抽搐。中毒后期症状有皮肤湿冷、发绀、嗜睡、极度疲乏及虚弱、心动过速。有急性中毒征象应立即用去铁胺救治。中毒获救后，有可能遗有幽门或贲门狭窄、肝损害或中枢神经系统病变，要及早妥善处理。

过量发生的急性中毒多见于小儿，小儿单次口

服 1000mg 以上铁剂，可引起急性中毒；2000mg 以上可致死亡。

【不良反应】

1．常见不良反应为轻度恶心、食欲减退、胃部或腹部疼痛等，多与剂量有关。

2．轻度腹泻或便秘。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方锌铁钙颗粒	化学药	HZ001445
葡萄糖酸亚铁胶囊	化学药	HZ002909
葡萄糖酸亚铁片	化学药	HZ002910
葡萄糖酸亚铁糖浆	化学药	HZ002911
善存液	化学药	HZ003188

HY001552 葡萄糖酸依诺沙星

【外文名称】 Enoxacin Gluconate

药物理化信息

【化学名】 1－乙基－6－氟－1,4－二氢－4－氧代－7－（1－哌嗪基）－1,8－萘啶－3－羧酸－D－葡萄糖酸盐一水合物

【分子式】 $C_{15}H_{17}FN_4O_3 \cdot C_6H_{12}O_7 \cdot H_2O$

【分子量】 534.50

药物药理信息

【药理毒理】 本品具广谱抗菌作用，尤其对需氧革兰阴性杆菌抗菌活性高，对下列细菌在体外具良好抗菌作用：肠杆菌科的大部分细菌，包括枸橼酸杆菌属、阴沟、产气肠杆菌等肠杆菌属、大肠埃希菌、克雷伯菌属、变形杆菌属、沙门菌属、志贺菌属、弧菌属、耶尔森菌等。常对多重耐药菌也具有抗菌活性。对青霉素耐药的淋病奈瑟菌、产酶流感嗜血杆菌和莫拉菌属均具有高度抗菌活性。对铜绿假单胞菌等假单胞菌属的大多数菌株具抗菌作用 。本品对甲氧西林敏感葡萄球菌具抗菌活性，对肺炎链球菌、溶血性链球菌和粪肠球菌仅具中等抗菌活性。对沙眼衣原体、支原体、军团菌具良好抗微生物作用，对结核杆菌和非典型分枝杆菌也有抗菌活性。对厌氧菌的抗菌活性差。依诺沙星为杀菌剂，通过作用于细菌 DNA 螺旋酶的 A 亚单位，抑制 DNA 的合成和复制而导致细菌死亡。

【药代动力学】 静脉给药 0.2g 和 0.4g，血药达峰时间约为 1 小时，血药峰浓度约为 2mg/L 和 3～5 mg/L。血消除半衰期约为 3～6 小时，蛋白结合率为 18%～57%。

本品吸收后广泛分布至各组织、体液，组织中的浓度常超过血药浓度而达有效水平。

本品主要自肾排泄，48 小时内给药量的 52%～60%以原形自尿中排出，一部分（20%）在体内代谢。胆汁排泄为 18%。

【药物相互作用】

1．尿碱化剂可减低本品在尿中的溶解度，导致结晶尿和肾毒性。

2．本品与茶碱类合用时可能由于与细胞色素 P450 结合部位的竞争性抑制，导致茶碱类的肝消除明显减少，血消除半衰期延长，血药浓度升高，出现茶碱中毒症状，如恶心、呕吐、震颤、不安、激动、抽搐、心悸等，应避免合用，不能避免时应测定茶碱类血药浓度并调整剂量。

3．环孢素与本品合用时，其血药浓度升高，必须监测环孢素血浓度，并调整剂量。

4．本品与抗凝药华法林合用时可增强后者的抗凝作用，故应避免二者合用。不能避免时应严密监测患者的凝血酶原时间，并调整剂量。

5．丙磺舒可减少本品自肾小管分泌约 50%，合用时可因本品血浓度增高而产生毒性。

6．本品干扰咖啡因的代谢，从而导致咖啡因消除减少，血消除半衰期延长，并可能产生中枢神经系统毒性，故应避免二者合用。不能避免时应严密监测患者咖啡因的血药浓度并调整剂量。

7．本品与非甾体类抗炎药芬布芬合用时，偶有抽搐发生，因此不宜与芬布芬合用。

【不良反应】

1．胃肠道反应较为常见，可表现为腹部不适或疼痛、腹泻、恶心或呕吐。

2．中枢神经系统反应可有头昏、头痛、嗜睡或失眠。

3．过敏反应：皮疹、皮肤瘙痒，偶可发生渗出性多形性红斑及血管神经性水肿。少数患者有光敏反应。

4．偶可发生：①癫痫发作、精神异常、烦躁不安、意识混乱、幻觉、震颤。②血尿、发热、皮疹等间质性肾炎表现。③静脉炎。④结晶尿，多见于高剂量应用时。⑤关节疼痛。⑥面部潮红、心悸、胸闷。

5．少数患者可发生血清氨基转移酶升高、血尿素氮增高及周围血常规白细胞降低，多属轻度，并呈一过性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
葡萄糖酸依诺沙星注射液	化学药	HZ002912
注射用葡萄糖酸依诺沙星	化学药	HZ004925

HY001553　普伐他汀钠

【外文名称】Pravastatin Sodium

药物理化信息

【化学名】{1*S* -［1a（bs*，ds*），2a，6a，8b（R*）8aa］} -1,2,6,7,8,8a-六氢-b，d，6-三羟-2-甲基-8-（2-甲基-1-氧丁氧基）-1-萘庚酸单钠盐

Sodium（+）-（3*R*，5*R*）-3,5-dihydroxy-7-[（1*S*，2*S*，6*S*，8*S*，8aR）-6-hydroxy-2-methyl-8-［（*S*）-2-methylbutyryloxy］-1,2,6,7,8,8a-hexahydro

【分子式】$C_{23}H_{35}NaO_7$

【分子量】446.52

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理作用：本品为3-羟基-3-甲基戊二酰辅酶A（HMG-CoA）还原酶抑制剂。选择性地作用于合成胆固醇的主要脏器肝脏和小肠，迅速且强力降低血清胆固醇值，改善血清脂质。

本品通过二方面发挥其降脂作用。第一为可逆性抑制HMG-CoA还原酶活性使细胞内胆固醇的量有一定程度的降低，导致细胞表面的低密度脂蛋白（LDL）受体数的增加，从而加强了由受体介导的低密度脂蛋白胆固醇（LDL-C）的分解代谢和血液中LDL-C的清除。第二，通过抑制LDL-C的前体——极低密度脂蛋白胆固醇（VLDL-C）在肝脏中的合成从而抑制LDL-C的生成。

研究表明总胆固醇（TC）、LDL-C及载脂蛋白B（Apo B）的升高可促使人体动脉粥样硬化的形成；同时，降低高密度脂蛋白胆固醇（HDL-C）与其转运复合物载脂蛋白A（Apo A）的水平，也与动脉粥样硬化形成相关。心血管患病率与死亡率随总胆固醇水平的升高而升高，随HDL水平的升高而降低。虽然甘油三酯水平的升高时常与低HDL水平伴随出现，但不能作为冠心病的独立风险因素。单纯升高HDL或降低甘油三酯对冠状动脉疾病与心血管疾病的发病或死亡率有何影响目前尚无定论，在健康志愿者与高胆固醇血症患者中，用本品治疗后可降低TC、LDL与Apo B，并降低VLDL和甘油三酯，升高HDL及Apo A，对其他诸如Lp（a）、纤维蛋白原等冠心病独立患病因素的影响效果尚不明确。临床研究表明，对伴有不同程度胆固醇升高的患者，本品能减少心血管疾病的发病率和死亡率。

2. 毒理作用：SD系大鼠给予普伐他汀钠（混食给予10、30、100mg/（kg·d），24个月）实验中，100mg/（kg·d）给药组（最大临床用量的250倍）中仅雄鼠发生的肝肿瘤较对照组明显，但雌鼠未发生（美国施贵宝研究所）。

狗给予普伐他汀钠（12.5、50、200mg/（kg·d）、5周、口服及12.5、25、50、100mg/（kg·d）、13周、口服）实验中，100mg/（kg·d）给药组见到脑微小血管渗出性出血等（三共研究所）。

【药代动力学】

1. 吸收、分布及代谢：本品为水溶性HMG-CoA还原酶抑制剂，主要从十二指肠吸收，口服后吸收迅速，高浓度分布于胆固醇生物合成旺盛的肝脏及小肠等，而在脑、肾上腺、生殖器等脏器的分布极低。本品给药后1～2小时即达最大血药浓度，血药浓度随给药量的增加而依存性增加。半衰期约为1.5小时，分布容积为830.0L，血清蛋白结合率为53.1%，AUC为14.0±3.9ng·h/ml。本品主要经肝脏代谢，但不经细胞色素P450 3A4代谢，稳态AUC、C_{max}和C_{min}分析均提示本品（普伐他汀）无论是一日1次或每日2次服用，体内都没有蓄积。

2. 排泄：本品通过肝、肾双通道进行清除：以粪中排泄为主（80%以上），尿中排泄为2%～13%。所以肾或肝功能不全的患者可通过代偿性改变排泄途径而清除。

【药物相互作用】经体内和体外实验证实，本品不经细胞色素P450 3A4代谢，因此不会与其他由细胞色素P450系统代谢的药物（如苯妥英钠、奎尼丁等）产生明显的相互作用，也不会与细胞色素P450 3A4抑制剂（如地尔硫䓬、伊曲康唑、酮康唑、红霉素等）产生明显的相互作用。

华法林：华法林与普伐他汀钠40mg同时服用对凝血酶原时间不会产生影响。

西咪替丁：普伐他汀钠单用或与西咪替丁合用时的普伐他汀0～12小时的AUC之间没有区别。单用普伐他汀钠或普伐他汀钠与西米替汀合用的AUC与普伐他汀钠与抗酸药合用时的AUC具显著差异。

地高辛：0.2mg地高辛与20mg普伐他汀钠合用9天，地高辛的生物利用度未发生改变；普伐他汀的AUC有增高趋势，但普伐他汀与其代谢产物合并生物利用度没有发生改变。

环孢霉素：至今为止，已有一些环孢霉素与普伐他汀钠（剂量高至20mg）合用的临床资料，这些资料没有显示环孢霉素的浓度会受到普伐他汀的影响。

吉非贝齐：临床试验发现，普伐他汀钠与吉非贝齐合用，CPK水平升高和因骨骼肌肉症状而停药的发生率，与安慰剂对照组、单用吉非贝齐组、单用普伐他汀钠组相比，有升高的趋势，普伐他汀的

尿排泄量及其蛋白结合均减少。建议普伐他汀钠不要和吉非贝齐联合使用。

其他：与阿司匹林、抗酸剂（服用本品 1 小时后）、西咪替丁、烟酸合用药代动力学无明显差异。与利尿剂、抗高血压药、洋地黄、血管紧张素转换酶抑制剂、钙通道阻断剂、β－受体阻断剂及硝酸甘油合用无明显药物相互作用。

【不良反应】可见轻度氨基转氨酶升高，皮疹，肌痛，头痛，胸痛，恶心，呕吐，腹泻，疲乏等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
普伐他汀钠片	化学药	HZ002915

HY001554 普拉洛芬

【其他名称】普南扑灵、Pranopulin

【外文名称】Pranoprofen

药物理化信息

【化学名】2－（5*H*－［1］苯并吡喃［2，3－*b*］吡啶－7－基）丙酸

【分子式】$C_{15}H_{13}NO_3$

【分子量】255.27

【性状及组成】本品为白色－微黄白色的结晶粉末。易溶于二甲基甲酰胺，溶解于冰醋酸，略溶于甲醇，微溶于乙晴、乙醇和醋酐，极微溶于乙醚，几乎不溶于水。普拉洛芬在二甲基甲酰胺（1∶30）中无旋光性。

药物药理信息

【药理毒理】对实验性眼部炎症有抑制前列腺素生成的作用（家兔）。对过敏性结膜炎、急性结膜炎及持续性结膜炎等各种实验性结膜炎具有抗炎作用（大鼠）。

【不良反应】在使用效果调查的 5843 例患者中，其中 79 例出现了眼部不良反应。发生率为 0.1%～5%的有：刺激感、结膜充血、瘙痒感、眼睑发红、肿胀、眼睑炎、分泌物；发生率小于 0.1%的有：流泪、弥漫性表层角膜炎、异物感、结膜水肿。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
普拉洛芬滴眼液	化学药	HZ002916

HY001555 普拉马林

【其他名称】丙阿义马林、丙缓脉灵、NEOGIL-URYTMAL

【外文名称】Prajmaline

药物药理信息

【药理毒理】本品是阿义马林的活性代谢物，作用比阿义马林强 5～10 倍，应用亦同阿义马林。

【不良反应】可有乏力、恶心、呕吐、食欲减退、腹泻等。静注可有发热感。尚可能有肝功能损害等。

HY001556 普拉西泮

【外文名称】Prazepam

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633 号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为精神药品，但我国未生产或使用。

HY001557 普卢利沙星

【外文名称】Prulifloxacin

药物理化信息

【化学名】（±）－6－氟－1－甲基－7－［4－（5－甲基－2－氧代－1,3－二氧杂环戊烯－4－基）甲基－1－哌嗪基］－4－氧代－4*H*－［1,3］硫氮杂环丁烷并［3,2－*a*］喹啉－3－羧酸

【分子式】$C_{21}H_{20}FN_3O_6S$

【分子量】461.46

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：本品为喹诺酮类抗菌药，本品为前体药物，在体内经血清酶催化水解得到的活性成分（ulifloxacin），其敏感菌为葡萄球菌、淋球菌、肺炎球菌、肠球菌、莫拉克斯菌、大肠菌、志贺杆菌、沙门菌（伤寒菌、副伤寒菌除外）、柠檬酸菌、克雷伯菌、肠细菌、沙雷菌属、变形杆菌、霍乱菌、流感菌、绿脓杆菌、消化链球菌属。本品的作用机制是以高浓度进入细菌体内，抑制 DNA 螺旋酶的活性发挥杀菌作用。

2．毒理研究：

（1）遗传毒性：本品细菌回复突变试验、人淋巴细胞染色体畸变试验及小鼠微核试验结果均为阴性。

（2）生殖毒性：兔胎儿器官形成期试验中，本品剂量 100mg/kg 未发现致畸作用。大鼠妊娠前和妊娠初期给药剂量 1000mg/kg、围产期、哺乳期给药剂

量 300mg/kg 对动物的生殖未见明显影响。

【药代动力学】

1. 血药浓度：本品口服后从小肠上部吸收，是在肠道组织、门静脉血中以及通过肝脏时遇水分解，以活性主体 ulifloxacin 分布于全身。单剂量 264.2mg 口服，$t_{max} = 0.7 \pm 0.3$ 小时，$C_{max} = 1.09 \pm 0.41 \mu g/ml$，$t_{1/2} = 8.19 \pm 1.6$ 小时，$AUC_{0\to\infty} = 6.41 \pm 1.75 \mu g \cdot h/ml$。

2. 蛋白结合：采用限外过滤法测定与人血清蛋白的结合率，ulifloxacin 浓度在 0.1 ~ 10μg/ml 范围内的结合率为 50.9% ~ 52.1%（体外）。

3. 分布：患者口服本品 264.2mg 后前列腺、胆囊、女性性器官、皮肤组织、耳鼻咽喉组织、眼组织、痰液中 ulifloxacin 最高浓度为 1.21 ~ 8.25μg/g (ml)，与血清浓度的比值为 1.79 ~ 58.2，显示良好的分布率。

4. 代谢、排泄：本品在肠道组织中、门静脉血中以及肝脏组织内主要被代谢成 ulifloxacin，在血浆及尿液中发现 ulifloxacin 的哌嗪结构部分被修饰化物以及与葡萄糖醛酸结合物等代谢产物。健康成人给予 132.1 和 264.2mg 本品后，24 小时内尿液中 ulifloxacin 累积排泄率分别为 43.1% 和 36.2%，重复给药未发现有蓄积。

5. 肾功能不全及老年患者的药代动力学：肾功能不全患者及老年患者与健康成人比较，血清中 ulifloxacin 半衰期延长，AUC 增大，尿液中 ulifloxacin 的累积排泄率降低。

【药物相互作用】

1. 本品与芬布芬、氟联苯丙氨酸 + 头孢氨呋肟、氟联苯丙氨酸合用，因可增强本品与 GABA 受体结合的阻碍作用，可引起痉挛，应禁用。

2. 本品与茶碱及氨基茶碱等合用，可使血中茶碱的浓度升高，增强其作用，如合用时应采取包括降低茶碱剂量等适当措施。

3. 本品与含有铝及镁的抗酸剂，铁剂，含钙制剂等合用，可能会减弱本品的作用，如果需要同时使用这类制剂，应在给予本品两小时后服用。

4. 本品与 H_2 - 受体拮抗剂（如西咪替丁）、质子泵抑制剂（如奥美拉唑）等合用，可能会减弱本品的效果。

【不良反应】据资料介绍，在进行安全性评价的 2936 例患者中，共有 131 例（4.46%），172 件不良反应发生，主要为腹痛、腹泻、嗳气等。在临床检查值变化方面，2584 例患者中共有 148 例（5.73%），240 件异常变化发生，主要包括 AST 及 ALT 升高等。

1. 本品可能引起的严重不良反应如下。

（1）休克、过敏样症状（发生频率不明）。如果出现呼吸困难、血压低下、全身发红、荨麻疹、面部浮肿等症状，应停止给药并采取适当的处理措施。

（2）伴有以肌肉疼痛、脱力感、CK（CPK）升高、血及尿液中肌红蛋白升高为特征、伴有肾功能迅速恶化的横纹肌溶解症（0.1% 以下）。如出现异常应停止给药，并采取适当的处理措施。

（3）低血糖（频率不明）（老年患者、肾功能不全患者及糖尿病患者较易出现），如出现意识水平低下、痉挛、全身倦怠感等症状，应停止给药，并采取适当的处理措施。

2. 本品同其他新喹诺酮类抗菌药一样引起的严重不良反应如下：

据报道，其他新喹诺酮类抗菌药可引起以下严重不良反应（发生率低于 0.1%），故使用时应密切观察，如出现异常应停止给药，并采取适当的处理措施。

（1）皮肤黏膜综合症（Stevens - Johnson 症）、中毒性表皮坏死症（Lyell 症）。

（2）血细胞总数减少、粒细胞缺乏，溶血性贫血、血小板减少。

（3）急性肾功能不全等重症肾功能不全。

（4）肝功能不全、黄疸。

（5）心室频率加快（包括 Torsades de pointes）、Q - T 间期延长。

（6）跟腱炎，腱断裂等腱障碍（症状为腱周围疼痛、浮肿）。

（7）伴有假膜性大肠炎性便血的重症大肠炎（症状：腹痛、反复腹泻等）。

（8）间质性肺炎（症状：发热、咳嗽、呼吸困难、胸部 X 线异常、嗜酸粒细胞增加等）；（处理方法：给予肾上腺皮质激素）。

（9）痉挛。

（10）精神错乱、抑郁等精神症状。

（11）血管炎。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
普卢利沙星片	化学药	HZ002917

HY001558　普鲁卡因青霉素

【其他名称】Crysticillin、Duracillin、普鲁卡因苄青霉素、普鲁卡因青霉素 G、普青、Procaine Penicillin G、Procime Penicillin、青霉素混悬剂

【外文名称】Procaine Benzylpenicillin

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】对氨基苯甲酰基2-（二乙氨基）乙酯（6*R*）-6-（2-苯基乙酰氨基）-青霉烷酸盐一水合物

【分子式】$C_{13}H_{20}N_2O_2 \cdot C_{16}H_{18}N_2O_4S \cdot H_2O$

【分子量】588.72

【性状及组成】本品为白色微晶性粉末；遇酸、碱或氧化剂等即迅速失效。本品在甲醇中易溶，在乙醇或三氯甲烷中略溶，在水中微溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗生素类药。

本品为青霉素的普鲁卡因盐，其抗菌活性成分为青霉素。青霉素对溶血性链球菌等链球菌属、肺炎链球菌和不产青霉素酶的葡萄球菌具有良好抗菌活性。淋病奈瑟菌、脑膜炎奈瑟菌、白喉棒状杆菌、炭疽芽孢杆菌、牛型放线菌、念珠状链杆菌、李斯特菌、钩端螺旋体和梅毒螺旋体对本品敏感。本品对流感嗜血杆菌和百日咳鲍特菌亦具抗菌活性。本品对梭状芽孢杆菌属、消化链球菌和产黑色素拟杆菌等厌氧菌具良好抗菌作用，对脆弱拟杆菌抗菌作用差。

青霉素通过抑制细菌细胞壁合成发挥杀菌作用。

【药代动力学】普鲁卡因青霉素肌内注射后，青霉素徐缓释放并被吸收。成人肌内注射30万单位，血药峰浓度2小时到达，约为1.6mg/L，24小时后仍可测得微量。出生1周内新生儿按每千克体重肌内注射5万单位后，2～12小时平均血药浓度为7.4～8.8mg/L，24小时为1.5mg/L。给予出生1周以上新生儿相同剂量时，血药浓度则较低，4小时为5～6mg/L，24小时为0.4mg/L。约60%～90%的给药量经肾排出。

【药物相互作用】丙磺舒、阿司匹林、吲哚美辛、保泰松和磺胺药减少青霉素的肾小管分泌而延长本品的血清半衰期。青霉素可增强华法林的抗凝作用。

【药物过量】药物过量主要表现是中枢神经系统不良反应，应及时停药并予对症、支持治疗。血液透析可清除青霉素。

【不良反应】

1. 过敏反应：荨麻疹等各类皮疹较常见、白细胞减少、间质性肾炎、哮喘发作和血清病型反应较少见；过敏性休克偶见，一旦发生，必须就地抢救，予以保持气道畅通、吸氧及给用肾上腺素、糖皮质激素等治疗措施。

2. 赫氏反应和治疗矛盾：用普鲁卡因青霉素治疗梅毒、钩端螺旋体病等疾病时可由于病原体死亡致症状加剧，称为赫氏反应；治疗矛盾也见于梅毒患者，系治疗后梅毒病灶消失过快，而组织修补相对较慢或病灶部位纤维组织收缩，妨碍器官功能所致。

3. 二重感染：可出现耐青霉素金葡菌、革兰阴性杆菌或念珠菌二重感染。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用普鲁卡因青霉素	化学药	HZ004926

HY001559 普罗布考

【外文名称】Probucol

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】4,4′-［（1-甲基亚乙基）二硫］双［2,6-二（1,1-二甲乙基）苯酚］

【分子式】$C_{31}H_{48}O_2S_2$

【分子量】517.86

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末；有特臭。

本品在三氯甲烷中极易溶解，在乙醇中溶解，在水中不溶。

熔点：本品的熔点为124～127℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：降血脂药。

本品为血脂调节药并具有抗动脉粥样硬化作用。其降脂作用是通过降低胆固醇合成与促进胆固醇分解使血胆固醇和低密度脂蛋白降低，还改变高密度脂蛋白亚型的性质和功能，使血高密度脂蛋白胆固醇减低。其降血高密度脂蛋白胆固醇的临床意义未明。本品对血甘油三酯的影响小。本品有显著的抗氧化作用，能抑制泡沫细胞的形成，延缓动脉粥样硬化斑块的形成，消退已形成的动脉粥样硬化斑块。已有的研究未发现本品有致癌、致突变作用。

【药代动力学】本品经胃肠道吸收有限且不规则，如与食物同服可使其吸收达最大。一次口服本品后18小时达血药浓度峰值，$t_{1/2}$为52～60小时。每天服本品，血药浓度逐渐增高，3～4个月达稳态水平。本品在体内产生代谢产物。口服剂量的84%从粪便排出、1%～2%从尿中排出，粪便中以原形为主，尿中以代谢产物为主。

【药物相互作用】

1. 本品与可导致心律失常的药物，如三环类抗抑郁药、Ⅰ类及Ⅲ类抗心律失常药和吩噻嗪类药物合用时，应注意不良反应发生的危险性增加。

2. 本品能加强香豆素类药物的抗凝血作用。

3. 本品能加强降糖药的作用

4. 本品与环孢素合用时，与单独服用环孢素相比，可明显降低后者的血药浓度

【不良反应】

1. 本品最常见的不良反应为胃肠道不适，腹泻的发生率大约为10%，还有胀气、腹痛、恶心和呕吐

2. 其他少见的反应有：头痛、头晕、感觉异常、失眠、耳鸣、皮疹、皮肤瘙痒等

3. 有报道发生过血管神经性水肿的过敏反应

4. 罕见的严重的不良反应有：心电图Q-T间期延长、室性心动过速、血小板减少等

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
普罗布考片	化学药	HZ002920

HY001560　普罗雌烯

【其他名称】 Colpotrofin、Colpotrophine、Deliporderm、更宝芬、甲氧基丙氧基三烯甲雌醇核、普罗雌醚

【外文名称】 Promestriene

【分子式】 $C_{22}H_{32}O_2$

【分子量】 328.49

【性状及组成】 熔点：64～67℃

比旋度：+64°至+71°

药物药理信息

【药理毒理】 本品为雌二醇羟基的氢被丙基和甲基取代的衍生物，具有雌激素的特性，而对子宫、乳房、垂体均无作用；阴道使用也未见全身性雌激素作用

本品是一种合成的不对称雌二醇二醚，研究提示，与传统的局部用雌激素制剂比较，普罗雌烯穿透阴道或表皮上皮细胞的能力较差，全身吸收以及全身性激素反应很小。局部用药时，普罗雌烯具有抗阴道黏膜或宫颈黏膜萎缩的作用

【药代动力学】 局部用药的普罗雌烯不在组织内聚集，其生物半衰期小于24小时。在皮肤上施药后，只有少于1%被吸收，阴道用药后，从未观察到全身的激素效应，尤其是距离阴道较远的雌激素敏感器官（如乳房和子宫）

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氯唑那多普罗雌烯阴道片	化学药	HZ002501
普罗雌烯乳膏	化学药	HZ002921
普罗雌烯阴道栓	化学药	HZ002922
普罗雌烯阴道用软胶囊	化学药	HZ002923

HY001561　普罗碘铵

【其他名称】 安妥碘、Entodon

【外文名称】 Prolonium Iodide

药物管理信息

【依据标准】 中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】 二碘化（2-羟基-1、3-亚丙基）双（三甲铵）

【分子式】 $C_9H_{24}I_2N_2O$

【分子量】 430.11

【性状及组成】 本品为白色或类白色粉末；无臭；暴露空气中渐变黄色。本品在水中极易溶解，在乙醇或二氯甲烷中几乎不溶

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：眼科用药。

本品为有机碘化物，促进病理性混浊物吸收的辅助治疗药。注射后吸收缓慢，大部分存在于脂肪组织与神经组织中，在体内逐渐分解成为游离碘，分布于全身。能促进组织内炎症渗出物及其他病理沉着物的吸收和慢性炎症的消散

【不良反应】 本品久用可偶见轻度碘中毒症状，如恶心、发痒、皮肤红疹等。出现症状时可暂停使用或少用

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
普罗碘铵注射液	化学药	HZ002924

HY001562　普罗吩胺

【其他名称】 爱普把嗪、巴息多、Ethoquazine、乙异丙嗪、PASIDOL

【外文名称】 Profenamine

药物药理信息

【药理毒理】 本品具有中枢性抗胆碱作用，并有轻度抗组胺及局麻作用。口服作用可持续4小时。用于治疗帕金森病、药物引起的锥体外系反应。也用于肝豆状核变性及先天性手足徐动症的对症治疗。另有认为用于震颤麻痹及脑炎后、动脉硬化及自发性震颤麻痹综合征。对僵直效果好，对震颤、流涎

亦有效。

【不良反应】常见不良反应有困倦、无力、口干、恶心、呕吐、复视等

HY001563 普罗庚嗪

【外文名称】Proheptazine

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用

HY001564 普罗瑞林

【外文名称】Protirelin

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第47册

药物理化信息

【化学名】5－氧代脯氨酰－组氨酰－脯氨酰胺合成三肽

【分子式】$C_{16}H_{22}N_6O_4$

【分子量】362.39

【性状及组成】本品为白色粉末，有吸湿性。

本品在水、甲醇、乙醇或冰醋酸中易溶，在乙醚或三氯甲烷中不溶

比旋度：取本品精密称定，加水溶解并稀释成每1ml中含5mg的溶液，依法测定比旋度为－62°至－70

药物药理信息

【药理毒理】本品刺激垂体前叶分泌促甲状腺素（TSH）及泌乳素（PRL）。用药后血中TSH浓度升高。根据血中TSH浓度升高的幅度（△TSH）可进行诊断。

参考值：

正常人△TSH：1.6～9.2uIU/ml，达峰时间Tp＝30分。

活跃反应△TSH：＞9.2uIU/ml，Tp＝30分。

弱反应△TSH：0.5～1.6uIU/ml，Tp＝30分

无反应△TSH：＜0.5uIU/ml，Tp＝30分

【药代动力学】正常人静脉注入本品15～30分钟后，使TSH达峰值，为基础值的2～3倍以上

【药物相互作用】其对TSH的调节受多巴胺及去甲基肾上腺素影响，α－受体阻断剂和左旋多巴胺均可对其发生抑制，溴隐亭也影响其作用

【不良反应】

1．可出现头痛，头晕，面部潮红，恶心及口腔奇异味道，心悸，胸闷，心率增快。

2．偶可致血压升高或低血压。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用普罗瑞林	化学药	HZ004927

HY001565 普罗替林

【其他名称】丙氨环庚烯、CONCORDIN、Vivactil

【外文名称】Protriptyline

药物药理信息

【药理毒理】作用相似于阿米替林，但精神兴奋作用强而镇静作用弱。适用于以退缩、少动为主的内源性抑郁症患者和抑郁状态。

【药代动力学】口服吸收较慢，生物利用度75%～90%，治疗血药浓度130～250ng/ml。半衰期为54～92小时。在体内分布广泛，主要以游离和结合形式的代谢物由尿排出

【不良反应】可出现焦虑、激动、心动过速、低血压等。

HY001566 普诺地嗪

【其他名称】LIBEXIN、哌乙嘧唑、TIBEXIN、VAROXIL

【外文名称】Prenoxdiazin

药物药理信息

【药理毒理】本品为末梢性镇咳药，镇咳作用可能与其局麻作用和解除支气管平滑肌痉挛作用有关。用于上呼吸道感染、慢性支气管炎、支气管肺炎、哮喘及肺气肿所致咳嗽。也可与阿托品并用于气管镜检查。

【不良反应】服用时不可嚼碎，以免引起口腔黏膜麻木感。

HY001567 七氟烷

【外文名称】Sevoflurane

药物理化信息

【化学名】1,1,1,3,3,3－六氟－2－（氟甲氧基）丙烷

【分子式】$C_4H_3F_7O$

【分子量】200.06

【性状及组成】本品不燃烧，沸点58.5℃，蒸气

压（25℃）26.7kPa，易挥发，遇碱石灰不稳定。

药物药理信息

【药理毒理】七氟烷是用于全身麻醉诱导和维持的吸入麻醉药，其血/气分配系数为0.6～0.7，MAC（最小肺泡内浓度）1.71%，诱导和苏醒较现有的强效麻醉药快。对心血管影响比异氟烷小，心律失常少见，与肾上腺素合用无妨。有良好的肌松作用。随麻醉加深，呼吸抑制加重，但较氟烷轻。对脑血流量、颅内压影响与异氟烷相似，未见明显的肝损害。

遗传毒性：本品在Ames试验、小鼠微核试验、小鼠淋巴瘤诱变试验、人淋巴细胞培养试验、哺乳动物细胞转化试验和^{32}P DNA加合试验中未见致突变作用，在哺乳动物细胞试验中也未引起染色体异常。

生殖毒性：大鼠和家兔试验结果显示，七氟烷在最小无毒剂量0.3MAC（最小肺泡内浓度）时对动物生育力和胚胎均无明显损害。孕鼠只在中毒浓度下会引起其胎儿体重的减少和骨骼改变的增加，兔实验中未发现对胎儿的不利影响。本品在体内被迅速排出，麻醉后24小时在乳汁中的药物已无临床意义。

【药代动力学】本品吸入给药后10～15分钟血中浓度达稳态。吸入结束后血中消除半衰期呈三相，分别为2.7分钟、9.04分钟和30.7分钟。其代谢产物为无机氟、脱氟的葡糖醛酸与氢氧化物的共轭物，自尿中排泄。以原药从呼气中排出。

七氟烷在血液中的较低溶解度导致其在麻醉诱导时肺泡药物浓度快速上升而停止吸入后又快速下降。人体中只有不到5%的七氟烷吸收后会被代谢。七氟烷经肺快速并广泛的清除，减少了其可代谢量。七氟烷经细胞色素P450（CYP）2E1脱氟产生六氟异丙醇（HFIP），同时释放出无机氟化物和二氧化碳（或单碳碎片）。HFIP又快速转变为葡萄糖醛酸并随尿液排泄。

【药物相互作用】

1．七氟烷可明显地加强非去极化肌松剂的肌松作用，因此，使用七氟烷时，应适当调整此类药物的剂量。

2．七氟烷与异氟烷相类似，均须在因导致心肌敏感而发生外因性心律失常时加用肾上腺素。

3．七氟烷的MAC随着氧化亚氮的增加而减少。

4．和其他药物相似，七氟烷与静脉麻醉药如丙泊酚合用时可降低其使用浓度。

5．CYP2E1诱导剂（异烟肼、酒精）会增加七氟烷的代谢，但巴比妥类不会增加其代谢。

【药物过量】在七氟烷过量后应马上停止使用、保持气管通畅、吸入纯氧以帮助或控制呼吸、并维持心血管功能。

【不良反应】据报道本品可能产生恶性高热，它继发于体温调节中枢受损，必须立即停药，并采用静注肌松药、全身冷却、吸氧等措施处理。本品可引起子宫肌松弛，故产科麻醉应注意观察。孕妇用药安全性尚未建立。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
吸入用七氟烷	化学药	HZ003641

HY001568　七叶皂苷钠

【外文名称】Aescine Sodium

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第16册

【性状及组成】本品的主要成分为七叶皂苷钠A和七叶皂苷钠B，是从七叶树科植物天师栗的干燥成熟种子中提取的一种含酯键的三萜皂苷。

本品为白色疏松块状物，有引湿性。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理：本品能促使机体提高ACTH和可的松血浆浓度，能促进血管壁增加PGF2α的分泌，能清除机体内自由基，从而起到抗炎、抗渗出，提高静脉张力，加快静脉血流，促进淋巴回流，改善血液循环和微循环，并有保护血管壁的作用。

2．毒理：在日剂量每千克体重0.5mg以下未发现溶血现象。急性毒性研究：静脉注射LD_{50}剂量，动物发生急性中毒，主要表现为实质性器官（心、肝、肾）的溶血性缺氧坏死；对黏膜和肌肉组织有较强的刺激作用。慢性毒性研究：每天静脉给予家兔相当于LD_{50}的1/5剂量，连续30天，未发生动物死亡，其实质器官也未发生任何病理性变化。致畸试验：无致畸作用，观测到孕妇头3个月羊水中药物含量较高，故建议孕妇禁用。

【药代动力学】

1．体内分布：① 用氚标记的七叶皂苷钠（1mg/kg）静脉给予大鼠，6小时后测定其放射活性。七叶皂苷钠在体内各器官的分布（注射量的百分数）为：血5.92%，肝3.79，肾0.87%，肌肉2.85%，胃肠73.5%和唾液腺0.08。② 小鼠器官和体液中七叶皂苷钠的分布：将^{3}H七叶皂苷静脉注射和腹腔注射于小鼠体内，通过计算血液中药物浓度曲线下面积计算药物的吸收率，得到七叶皂苷和七叶皂苷代谢物的吸收率为12.5%。如将^{3}H－七叶皂苷灌入小鼠胃内，发现灌入后1小时，七叶皂苷的血液药物浓度

最大；同时，约40%的未经代谢的七叶皂苷从肾脏排出。

2. 吸收、排泄与代谢：七叶皂苷钠的半衰期仅为1.5小时，但因能促进机体增加ACTH、前列腺素F2a的分泌，使生物效应维持时间较长，静脉注射16小时后，仍有抗渗出、消肿作用。静脉给药，几乎没有生物转化，注射1小时后，有1/3剂量排泄，其中2/3通过胆汁排入肠道，1/3进入尿中。七叶皂苷与血浆蛋白结合率在90%以上。

【药物相互作用】与下列各类药物联合使用时要谨慎。

1. 与血清蛋白结合率高的药物。

2. 能严重损害肾功能的药物。

3. 皮质激素类药物。

4. 含碱性基团的药物（配伍时可能发生沉淀）。

【药物过量】据马丁代尔大药典报告，当七叶皂苷钠静脉注射超过每千克体重0.4mg（日剂量）时，肾脏会受不同程度损伤。若已发生，应立即停止用药，并作肾功能检查，根据检查结果，按损伤程度进行治疗。

【不良反应】

1. 可见注射部位局部疼痛、肿胀，经热敷可使症状消失。

2. 偶有过敏反应，可按药物过敏处理原则治疗。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方七叶皂苷钠凝胶	化学药	HZ001341
七叶皂苷二乙胺水杨酸凝胶	化学药	HZ002928
七叶皂苷钠搽剂	化学药	HZ002929
七叶皂苷钠片	化学药	HZ002930
注射用七叶皂苷钠	化学药	HZ004928
迈之灵片	中成药	ZC003480

HY001569 齐墩果酸

【其他名称】CaryopHyllin、扶正女贞素、Oleanol

【外文名称】Oleanolic Acid

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（二部）·第3册

药物理化信息

【化学名】3－羟基上土当归－12－烯－28－酸

【分子式】$C_{30}H_{48}O_3$

【分子量】456.71

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末；无臭无味。

本品在三氯甲烷中略溶，在甲醇、乙醇、丙酮中微溶，在水中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加三氯甲烷制成每1ml含6mg的溶液，依法测定，比旋度为+73.0°至+83.0°。

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理：本品对肝损伤有一定的保护作用，可使升高的血清丙氨酸氨基转移酶下降，加速坏死组织的修复，促进肝细胞再生。

2. 毒理：大鼠口服LD_{50}为lg/kg；皮下给药500mg/kg未见中毒及死亡发生。

【不良反应】有口干、腹泻、上腹部不适感等反应。个别患者可出现血小板轻度减少，停药后可恢复。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
齐墩果酸胶囊	化学药	HZ002931
齐墩果酸片	化学药	HZ002932
肝速康胶囊	中成药	ZC001711
肝喜乐胶囊	中成药	ZC001715
肝喜乐片	中成药	ZC001716

HY001570 齐多夫定

【其他名称】Azidothymidine、AZT、叠氮脱氧胸苷、叠氮胸苷、叠氮胸腺嘧啶脱氧核甙

【外文名称】Zidovudine

药物理化信息

【化学名】为3′－叠氮基－3′－脱氧胸苷

【分子式】$C_{10}H_{13}N_5O_4$

【分子量】267.24

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理作用：齐多夫定为天然胸腺嘧啶核苷的合成类似物，其3′－羟基被叠氮基取代。在细胞内，齐多夫定在酶的作用下转化为其活性代谢物齐多夫定5′－三磷酸酯（AztTP）。AztTP通过竞争性利用天然底物脱氧胸苷5′－三磷酸酯（dTTP）和嵌入病毒DNA来抑制HIV逆转录酶。嵌入的核苷类似物中3′－羟基的缺失，可阻断使DNA链延长所必须的5′－3′磷酸二酯键的形成，从而使病毒DNA合成终

止。活性代谢物 AztTP 还是细胞 DNA 聚合酶 - α 和线粒体聚合酶 - γ 的弱抑制剂，据报道可嵌入到体外培养细胞的 DNA 中。

体外 HIV 对齐多夫定的敏感性与临床治疗反应之间的关系尚在进一步研究之中。由于体外敏感试验尚未标准化，故实验结果受方法学因素的影响差异较大。

据报道，从长期接受齐多夫定治疗患者体内分离出来的 HIV 在体外实验中对齐多夫定的敏感度有所降低。目前的研究结果表明，相对于晚期 HIV 感染，早期 HIV 感染患者体外实验中 HIV 对齐多夫定敏感度下降的机率高，幅度大。

病毒对齐多夫定敏感性的降低和对齐多夫定耐药株的出现限制了临床单药治疗的应用。体外试验表明，齐多夫定与拉米夫定联合应用时，本已对齐多夫定耐药的病毒株可因对拉米夫定耐药性的出现而恢复对齐多夫定的敏感性。并且在体内试验中，临床有证据显示齐多夫定与拉米夫定的联合应用可延迟对齐多夫定耐药性在抗逆转录病毒的病人中的出现。

有研究结果显示，齐多夫定与许多其他抗 HIV 制剂，特别是拉米夫定、ddI 及 α 干扰素有疗效叠加效应或协同作用，可更有效地抑制 HIV 在细胞培养中的复制。

尽管如此，体外试验表明，三种核苷类似物或两种核苷类似物加一种蛋白酶抑制剂较比一种或两种药物联合使用，可更有效地抑制 HIV - 1 诱导的细胞病变。

国际上认可的指导原则（疾病控制和预防中心，1998 年 6 月），推荐在意外暴露于 HIV 感染的血液事件中如：针刺伤，应立即给予齐多夫定和拉米夫定联合治疗（在 1 ~ 2 小时内）。在高危情况下，还应包括蛋白酶抑制剂。建议抗逆转录病毒预防持续 4 周。没有关于暴露后预防的对照临床研究且支持数据有限。尽管立即给予抗逆转录病毒制剂治疗，HIV 感染仍有可能会发生。

2. 毒理研究

（1）重复给药毒性：大鼠连续灌服本品 6 个月，剂量为 500mg/（kg·d）（血药浓度相当于临床剂量下的 100 倍）时，动物出现贫血。猴连续给予本品 3 个月或 6 个月，34 ~ 300mg/（kg·d）组动物出现贫血，给药 6 个月时可见骨髓变化及末梢红细胞形态轻微变异。

（2）遗传毒性：齐多夫定对小鼠 5178Y/K^+/- 淋巴细胞有致突变性，体外细胞转化试验结果呈阳性，对体外培养的人淋巴细胞有致断裂作用，多次给药的小鼠和大鼠微核试验结果呈阳性。单次给药的大鼠细胞遗传学试验结果呈阴性。

（3）生殖毒性：雌雄大鼠给予本品剂量为成人常用剂量的 7 倍（以体表面积计）时，对生育力（受孕率）未见影响。

大鼠和家兔给予本品 500mg/（kg·d）未见致畸作用。大鼠给予本品 150mg/（kg·d）或 450mg/（kg·d）导致胚胎毒性，表现为吸收胎增加。该试验中大鼠的血药峰浓度为临床推荐剂量（每 4 小时 100mg）下人血浆稳态峰浓度的 66 ~ 226 倍，家兔为 12 ~ 87 倍。在体外小鼠受精卵细胞试验中，本品给药产生剂量依赖性的胚泡形成减少。在另一项致畸试验中，大鼠给予本品 3000mg/（kg·d）（接近大鼠灌服半数致死量 3683mg/kg），导致明显的母体毒性和胎仔畸形增加。这一剂量的血药峰浓度是人血药峰浓度的 350 倍（其 AUC 约为人每日给予 600mg 时的 300 倍），本试验在 600mg/（kg·d）以下剂量未见致畸作用。

在一项 HIV 感染孕妇上进行的随机、双盲、安慰剂对照的试验中，本品和安慰剂组的母亲所产婴儿的先天畸形发生率相似。

（4）致癌性：小鼠和大鼠分别给予本品三个剂量（每组雌、雄各 60 只），开始时小鼠给药剂量为 30、60、120mg/（kg·d），大鼠剂量为 80、220、600mg/（kg·d），给药 90 天后，因小鼠出现贫血，剂量降低至 20、30、40mg/（kg·d），大鼠的高剂量组在给药 91 天后降至 450mg/（kg·d），279 天后降至 300mg/（kg·d）。在小鼠试验中，19 个月后，高剂量组 7 只动物出现阴道肿瘤（5 例非转移鳞状细胞癌、1 例鳞状细胞乳头状瘤、1 例鳞状息肉），中剂量组 1 只动物的阴道出现迟发性鳞状细胞乳头状瘤。低剂量组动物未见阴道肿瘤。在大鼠试验中，给药 20 个月后高剂量组出现两例非转移性阴道扁平细胞癌，中、低剂量组动物未见阴道肿瘤。两种动物的不同性别中均未见其他肿瘤。在发生肿瘤的剂量下，小鼠和大鼠的药物暴露量（以 AUC 计），分别为临床推荐剂量（每 4 小时 100mg）下人体暴露量的 3 倍和 24 倍。

在小鼠还进行了两个特殊的致癌试验。一个试验从母鼠妊娠第 10 日起给予本品 20 或 40mg/（kg·d），至分娩、哺乳期，仔鼠持续给药至产后 24 个月。该试验齐多夫定的暴露量约为临床推荐剂量下人体暴露量的 3 倍。给药 24 个月后，可见（仔鼠）阴道肿瘤发生率增加，肝、肺等其他器官未见肿瘤发生率增加。这些发现与小鼠经口给药的标准致癌性试验结果一致。在第二项试验中，孕鼠在妊娠第 12 ~ 18 天给予齐多夫定的最大耐受量 12.5mg/d 或 25mg/d（以未妊娠时体重计，约为 1000mg/kg，以足孕时体重计，约为 450mg/kg），结果高剂量组仔鼠

肺、肝及雌性生殖道肿瘤发生率增加。尚不清楚啮齿类动物致癌性试验的结果对人类肿瘤的发生有多大的预见性。

【药代动力学】

1. 成人药代动力学

齐多夫定经胃肠吸收良好，在临床试验的所有剂量水平下，其生物利用度均可达到 60% ~ 70%。在一项Ⅰ期临床研究中，每 4 小时口服齐多夫定（溶液剂）5mg/kg，其血浆稳态峰值浓度（C_{ssmax}）及血浆稳态谷值浓度（C_{ssmin}）的均值分别为 7.1 及 0.4μm/l（或 1.9 及 0.1μg/ml）。一项生物等效性的研究结果显示，每 4 小时口服齐多夫定胶囊 200mg，其 C_{ssmax}及 C_{ssmin}的均值分别为 1.2μg/ml 及 0.1μg/ml。

有关研究表明，静脉注射齐多夫定其平均终末血浆半衰期为 1.1 小时，平均整体清除率为 27.1ml/(min·kg)，平均表观分布容积为 1.6L/kg 体重。齐多夫定的肾脏清除率远远超过肌酐清除率，表明其肾小管分泌活跃。

齐多夫定在血浆及尿液中的主要代谢产物均为 5′ – 葡萄糖苷酸齐多夫定，约 50% ~ 80%的该药以此代谢产物的形式经肾脏清除。静脉给药后，齐多夫定亦可代谢为 3′ – 氨基 3′ – 脱氧胸腺嘧啶核苷。

对于肝、肾功能受损的患者，齐多夫定药物代谢动力学资料尚很有限。目前尚无有关老年人齐多夫定药物代谢动力学的研究资料。

2. 儿童药代动力学

对于 5 个月以上儿童，齐多夫定的药物代谢动力学特点与成人相似。对于所有研究剂量，齐多夫定的胃肠道吸收良好，其生物利用度为 60% ~ 74%，平均 65%。口服齐多夫定（溶液剂）120ml 及 180ml/m^2，C_{ssmax}分别为 1.19μg/ml 及 2.06μg/ml。

静脉给药时，终末血浆半衰期及全身清除率的均值分别为 1.5 小时及 30.9ml/（min·kg）。主要代谢产物为 5′ – 葡萄糖苷酸（衍生物）。静脉给药后，29%以原形、45%以葡萄糖苷酸代谢物的形式排泄至尿中。齐多夫定的肾脏清除率远远超过肌酐清除率，这表明肾小管的分泌功能活跃。

对于新生儿和较小婴儿的药代动力学的研究表明，14 天以下的婴儿，其齐多夫定的葡萄糖醛酸化降低，同时生物利用度增加，清除率降低，半衰期延长，但尽管如此，药代动力学与成年人相似。

3. 妊娠药代动力学

本品的药代动力学在一项由 8 名妊娠后期妇女参加的试验中进行了研究。随着妊娠的进展，无证据显示药物蓄积。妊娠妇女的药代动力学与非妊娠妇女相似。持续被动的药物通过胎盘，使出生时婴儿血浆中齐多夫定的浓度与产时母体血浆浓度基本相同。

4. 分布

用药 2 ~ 4 小时后，成人齐多夫定脑脊液/血浆药物浓度的均值约为 0.5。有资料表明，齐多夫定可以通过胎盘，并可在羊水及胎儿血中检出。齐多夫定曾在精液和乳汁中检出。

对于儿童，口服给药 0.5 ~ 4 小时以后，齐多夫定脑脊液浓度/血浆浓度的均值分别为 0.52 ~ 0.85。在静脉注射治疗输注 1 小时后的 1 ~ 5 小时内，脑脊液/血浆药物浓度的均值为 0.87。连续静脉滴注，脑脊液/血浆药物浓度的稳态均值为 0.24。

齐多夫定的血浆蛋白结合率相对较低（34% ~ 38%），目前尚无因竞争蛋白结合位点而出现药物相互作用的报道。

【药物相互作用】

1. 对醋氨酚、乙酰水杨酸、苯二氮䓬类、西咪替丁、保泰松、吗啡、磺胺药等都抑制本品的葡萄糖醛酸化，而降低清除率，应避免联用。

2. 与阿昔洛韦（无环鸟苷）联用可引起神经系统毒性，如昏睡、疲劳等。

3. 丙磺舒抑制本品的葡萄糖醛酸化，并减少肾排泄，可引起中毒危险。

【药物过量】

1. 症状和体征：无论对于成人还是儿童，关于短期过量服用齐多夫定临床表现的报道尚不多见，除了出现如疲劳、头痛、恶心以及偶尔报告的血液学紊乱等不良反应外，有报告曾有一位病人过大剂量服用齐多夫定，血液中齐多夫定水平超过普通治疗剂量的 16 倍，但未出现短期的临床、生化或血液学上的后遗症。

2. 治疗：对于患者应密切观察有无中毒征象并给予必要的对症支持治疗。血液透析及腹膜透析无助于加快齐多夫定的清除，但可加快其葡萄糖苷酸代谢物的清除。

【不良反应】

1. 有骨髓抑制作用，可引起意外感染、疾病痊愈延缓和牙龈出血等。在用药期间要进行定期查血。嗝咐病人在使用牙刷、牙签时要防止出血。

2. 可改变味觉，引起唇、舌肿胀和口腔溃疡。

3. 叶酸和维生素 B_{12}缺乏者更易引起血常规变化。

4. 在肝脏中代谢，肝功能不足者易引起毒性反应。

5. 遇有发生喉痛、发热、寒战、皮肤灰白色、不正常出血、异常疲倦和衰弱等情况，应注意到骨髓抑制的发生。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
齐多夫定胶囊	化学药	HZ002933
齐多夫定片	化学药	HZ002934
齐多夫定注射液	化学药	HZ002935
齐多拉米双夫定片	化学药	HZ002936
注射用齐多夫定	化学药	HZ004929

HY001571　齐培丙醇

【外文名称】Zipeprol

药物管理信息

【特殊管理分类】一类精神药

药物药理信息

【药理毒理】本品为非麻醉性中枢性镇咳药。药理研究证明，其镇咳作用不及可待因，但优于喷托维林。本品尚具有局麻作用和松弛支气管平滑肌作用，并有较强的抗胆碱、抗组胺作用。体外试验证明，本品具有黏痰溶解作用，使痰液的黏滞性降低。与可待因不同，本品不抑制呼吸，亦无成瘾性。用于各种原因引起的咳嗽。

HY001572　蕲蛇酶

【外文名称】Acutase

药物理化信息

【化学名】本品系从蕲蛇毒中提取的凝血酶样酶

【分子量】27000.00

【性状及组成】本品系从蕲蛇毒中提取的凝血酶样酶。分子量：27000 ± 3000。

药物药理信息

【药理毒理】本品作用于血浆纤维蛋白原，使其转变为不稳定的纤维蛋白产物，后者易被纤溶酶降解为小分子肽，经尿排出。用药后可使血浆纤维蛋白原含量下降，凝血酶时间延长，优球蛋白溶解时间缩短，血小板聚集功能受抑制及血小板数量下降；因而阻止血栓形成。其作用不受肝素影响。

【药代动力学】本品经静脉注入大鼠后，迅速分布于肾、肝、肺、脾等血流丰富的组织，肾脏是其主要排泄途径。一次静脉给药后，2 小时肾脏含量最高，4 小时肾、脾、肺、和肝含量仍高，心脏含量较少，其他组织未见分布。尿中含量高，胆汁中量少，说明本品主要自肾脏经尿排出。本品不同剂量一次静脉注入于人，具有二室开放模型的一级动力学消除的特征，其半衰期 15.95 ± 2.41 ~ 19.73 ± 4.28 小时；给药后 4 小时排出达高峰，给药后 24 小时尿中已检测不出。

【不良反应】本品在常规治疗剂量下可致血小板聚集功能明显抑制，部分患者出现血小板计数减少，皮下及黏膜少量出血，停药后可自行恢复。本品可引起过敏反应如皮疹。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
蕲蛇酶注射液	化学药	HZ002938

HY001573　前列地尔

【其他名称】前列腺素 E1

【外文名称】Alprostadil

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】11α，15 - （S） - 双羟基 - 9 - 羰基 - 13 - 反前列烯酸

【分子式】$C_{20}H_{34}O_5$

【分子量】354.49

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：前列腺素药。

本品具有易于分布到受损血管部位的靶向特性，从而发挥本品的扩张血管、抑制血小板凝集的作用。

【药代动力学】本品静注后，与血浆蛋白微弱地结合，$t_{1/2}$为 5 ~ 10 分钟。在体内代谢完全，剂量的 68% 经肝脏首关效应代谢，以代谢物形式经肾排泄。

【药物相互作用】本品可增强降压药和血小板聚集抑制剂的作用。

【不良反应】

1. 休克：偶见休克，要注意观察，发现异常现象时，立刻停药，采取适当的措施。

2. 注射部位：有时出现血管疼、发红，偶见发硬，瘙痒等。

3. 循环系统：有时出现加重心衰，肺水肿，胸部发紧感，血压下降等症状，一旦出现立即停药。另外，有时出现发红、血管炎，偶见脸面潮红，心悸。

4. 消化系统：有时出现腹泻、腹胀，不愉快感，偶见腹痛，食欲减退，呕吐，便秘。

5. 肝脏：偶见 AST、ALT 上升等肝功能异常。

6. 精神和神经系统：有时头晕、头痛、发热，疲劳感，偶见发麻。

7. 皮肤：有时出疹或瘙痒感，偶见荨麻疹。

8. 血液系统：偶见嗜酸细胞增多，白细胞减少。

9. 其他：偶见视力下降，口腔肿胀感，脱发，四肢疼痛，水肿，发热感，不适感。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
前列地尔尿道栓	化学药	HZ002939
前列地尔注射液	化学药	HZ002940
前列腺素 E1 乳膏	化学药	HZ002941
注射用前列地尔	化学药	HZ004930

HY001574 茜草双酯

【外文名称】Rubidati

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 3 册

药物药理信息

【药理毒理】茜草双酯是人工合成的蒽醌类化合物，系茜草提取物升白主要苷元成分，本品具有升高外周血白细胞作用，促进造血细胞增殖分化的能力，是目前为数不多的优良升白药物之一。

【不良反应】少数患者用药后有口干、头痛、乏力、恶心等症状。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
茜草双酯片	化学药	HZ002942

HY001575 羟苯磺酸钙

【外文名称】Calcium Dobesilate

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 34 册

药物理化信息

【化学名】2，5－二羟基苯磺酸钙的一水合物

【分子式】$C_{12}H_{10}CaO_{10}S_2 \cdot H_2O$

【分子量】436.42

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末；无臭，味苦；遇光易变质，有吸湿性。

本品极易溶于水，易溶于乙醇或丙酮，极微溶于三氯甲烷或乙醚。

药物药理信息

【药理毒理】本品通过调节微血管壁的生理功能，减少阻力，降低血浆黏稠度和血小板的高聚集性，从而防止血栓形成。能提高红细胞柔韧性；能间接增加淋巴的引流而减轻水肿。另外，本品还可抑制血管活性物质（组胺、5－羟色胺、缓激肽、透明质酸酶、前列腺素）对微血管引起的高通透作用，改善基底膜胶原的生物合成。

【药代动力学】健康男性，口服本品 500mg，约 4 小时血药浓度达峰值，峰浓度约为 13μg/ml。在组织中分布广泛，与血浆蛋白结合率为 20% ~ 25%，但不能透过血脑屏障。本品主要以原形从尿中排泄，口服后 24 小时内约有 50% 从尿中排出，其中仅有 10% 是代谢产物。静脉给本品 500mg 后 5 分钟，血浓达峰，峰浓为 65μg/ml。静注后 24 小时内约有 75% 从尿中排出。其药动学特征符合二房室模型，β 相消除半衰期为 4.1 小时。

【不良反应】本品即使长期服用也耐受良好，变态反应不能除外，偶尔有胃部不适、恶心、胃灼热、食欲下降等症状时，应酌情减量，必要时中止给药。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
羟苯磺酸钙胶囊	化学药	HZ002944
羟苯磺酸钙片	化学药	HZ002945

HY001576 羟苯乙酯

【其他名称】Aethylis Paraoxybenzoas、对羟基苯甲酸乙脂、尼泊金 A、尼泊金乙脂、Nipagin A

【外文名称】Ethylparaben

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】4－羟基苯甲酸乙酯

【分子式】$C_9H_{10}O_3$

【分子量】166.18

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；无臭或有轻微的特殊香气，味微苦、灼麻。

本品在乙醇或乙醚中易溶，在三氯甲烷中略溶，在甘油中微溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 114 ~ 118℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料，防腐剂。

1. 用于药剂（液体制剂、霜剂）和食物的防腐。

2. 用于真菌性角膜溃疡。

【药物相互作用】本品与非离子表面活性剂合用则抗微生物活性减弱。本品遇铁变色，遇弱碱或强酸易水解。

【不良反应】有时应用本品会引起过敏，出现皮

炎。但急性毒性和慢性毒性很低，LD_{50}为 8g/kg（小鼠，经口）。一般公认是安全的，每日允许摄入量为 0～10mg/kg（FAO/WHO，1985）。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方枇杷氯化铵口服溶液	化学药	HZ001336
肝素钠乳膏	化学药	HZ001578
开塞露	化学药	HZ002077
六合氨基酸颗粒	化学药	HZ002444
氯化钠滴眼液	化学药	HZ002490
博性康药膜	民族药	MZ000059
貂胰防裂软膏	民族药	MZ000093
肺力咳合剂	民族药	MZ000140
感清糖浆	民族药	MZ000184
咳速停糖浆	民族药	MZ000288
咳痰合剂	民族药	MZ000289
七味解毒活血膏	民族药	MZ000390
日晒防治膏	民族药	MZ000451
日舒安湿巾	民族药	MZ000452
日舒安洗液	民族药	MZ000453
石榴补血糖浆	民族药	MZ000569
消白软膏	民族药	MZ000661
消痔洁肤软膏	民族药	MZ000669
养阴口香合剂	民族药	MZ000710
云实感冒合剂	民族药	MZ000733
痔痛安搽剂	民族药	MZ000757
百日咳片	中成药	ZC000201
鼻塞通滴鼻液	中成药	ZC000310
蚕蛾公补合剂	中成药	ZC000465
大蒜油软胶囊	中成药	ZC000709
肥儿口服液	中成药	ZC001055
复方鱼腥草合剂	中成药	ZC001613
肝肾安糖浆	中成药	ZC001698
肝肾康糖浆	中成药	ZC001701
黄英咳喘糖浆	中成药	ZC002301
抗骨增生口服液	中成药	ZC002997
咳感康口服液	中成药	ZC003036
咳立停糖浆	中成药	ZC003037
裸花紫珠合剂	中成药	ZC003447
女贞子糖浆	中成药	ZC003741

续表

制剂名称	类别	序号
赛霉安乳膏	中成药	ZC004430
伤风净喷雾剂	中成药	ZC004607
伤复欣喷雾剂	中成药	ZC004611
伤可贴	中成药	ZC004622
参辣软膏	中成药	ZC004767
参坤养血口服液	中成药	ZC004773
参芪鹿茸口服液	中成药	ZC004831
参芝安神口服液	中成药	ZC004925
小儿清毒糖浆	中成药	ZC006287
新肤螨软膏	中成药	ZC006474
熊胆川贝口服液	中成药	ZC006518
熊胆眼药水	中成药	ZC006529
益精口服液	中成药	ZC006832
苑叶止咳糖浆	中成药	ZC007138
枣参合剂	中成药	ZC007190
止咳梨煎膏	中成药	ZC007334
止咳祛痰糖浆	中成药	ZC007344
治伤软膏	中成药	ZC007431
紫桔止咳糖浆	中成药	ZC007602

HY001577　羟丙甲纤维素

【其他名称】 HPMC、羟丙基甲基纤维素、纤维素羟丙基甲基醚

【外文名称】 Hypromellose

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 2－羟丙基醚甲基纤维素

【分子式】 $C_8H_{15}O_8-(C_{10}H_{18}O_6)N-C_8H_{15}O_8$

【分子量】 86000.00

【性状及组成】 本品为白色至乳白色、无臭无味、纤维状或颗粒状易流动的粉末，在水中溶解形成澄明至乳白色具有黏性的胶体溶液，一定浓度的溶液可因温度的变化出现溶胶－凝胶互变现象。不溶于乙醇、三氯甲烷和乙醚，可溶于甲醇和氯甲烷的混合溶剂中，有部分型号的产品可溶于 70%乙醇、丙酮、氯甲烷和异丙醇的混合溶剂以及其他有机溶剂。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：药用辅料。

可用作制剂中的薄膜包衣材料、黏合剂、延滞剂、控释剂、致孔道剂、助悬剂和成膜剂等。

本品具有乳化、增稠、助悬、增黏、黏合、胶凝和成膜等特性和作用，在药剂中具有以下广泛的用途。

1. 作薄膜包衣材料和成膜材料：本品低黏度者用作片剂、丸剂的水溶性薄膜包衣料，高黏度者用于非水性薄膜包衣，使用浓度 2% ~ 10%。

2. 作黏合剂和崩解剂：本品低黏度者作片剂、丸剂、颗粒剂的黏合剂和崩解剂，高黏度者仅作黏合剂，用量因型号和要求不同而异，一般为 2% ~ 5%。

3. 作增稠剂和胶体的保护胶：作增稠剂常用浓度为 0.45% ~ 1.0%。用于增加疏水胶的稳定性，防止粒子聚结、沉淀，常用浓度为 0.5% ~ 1.5%。

4. 作阻滞剂、控释剂和致孔道剂：高黏度型号用于制备混合材料骨架缓释片、亲水凝胶骨架缓释片的阻滞剂和控释剂；低黏度型号用于缓释或控释片剂的致孔道剂，使这类片剂迅速获得治疗作用的首剂量，然后再缓释或控释，以维持血中有效浓度。

5. 作助悬剂：本品高黏度者是混悬剂型液体制剂的良好的助悬剂，其常用量为 0.5% ~ 1.5%。

【药物相互作用】 本品应避免小于 3 和大于 11 的极端 pH 条件及抗氧剂。

【不良反应】 本品无毒、安全，可作食品添加剂，但不增加热量。一日允许摄入量为 0 ~ 25mg/kg（FAL/WHO，1985）。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方氯化钠滴眼液	化学药	HZ001298
富马酸酮替芬分散片	化学药	HZ001514
洛度沙胺滴眼液	化学药	HZ002561
马来酸噻吗洛尔毛果芸香碱滴眼液	化学药	HZ002595
羟丙甲纤维素滴眼液	化学药	HZ002946
丹参益心胶囊	民族药	MZ000085
紫丹活血片	民族药	MZ000771
肝悦片	中成药	ZC001722
感特灵片	中成药	ZC001763
绞股蓝总苷分散片	中成药	ZC002586
脉平片	中成药	ZC003500
七生静片	中成药	ZC003821
前列安通片	中成药	ZC003928
乳安片	中成药	ZC004370
参茸蜂王浆胶囊	中成药	ZC004868

HY001578 羟丙甲纤维素 2910

【外文名称】 Hypromellose 2910

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：增稠剂。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
右旋糖酐 70 滴眼液	化学药	HZ004594

HY001579 羟丙纤维素

【外文名称】 Hyprolose

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 低取代 2 - 羟丙基醚纤维素

【分子式】 $(C_{15}H_{28}O_8)_n$

【性状及组成】 本品为白色或类白色无臭、无味的粉末，其性能与羟丙基的含量及聚合度有关，目前国内已开发并批准应用的是低取代度的羟丙基纤维素（LS - HPC），该产品在水中溶胀成为胶体溶液，在乙醇、丙酮或乙醚中不溶（取代度高于 37% 的 HPC 溶解于水）。本品有强烈的亲水性，在冷水中膨胀度大，微溶于冷水。这种特性可使片剂在压制过程中具有黏结性能，当药片进入体内后能迅速吸收体液膨胀，迅速崩解，而且其崩解性能在各种 pH 介质中无明显差异。因此既可用于胃中崩解的药物，也适用于肠道中崩解的药物。本品的 10% 碱溶液在 20 ± 0.2℃温度下，其黏度为 0.02 ~ 0.08Pa·s。本品也具有良好的成膜性质，将本品 7%，$NaOH_8$% 的黏胶液在 20%（NH_4）$2SO_4$ 液中再生，可制得透明度好，厚薄均匀的有一定强度的低取代羟丙基纤维素薄膜，可作为药物的载体应用。同时本品较其他水溶性纤维素衍生物具有良好的抗酶解性能，对片剂贮存稳定性有一定的意义。

本品按干燥品计算，含羟丙氧基应为 7.0% ~ 16.0%。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：药用辅料。

本品是一种不同取代基的非离子型纤维素醚，低取代基者主要作片剂崩解剂和黏合剂，高取代者主要用作包衣材料、成膜材料、缓释材料、增稠剂、助悬剂、凝胶剂等。本品作黏合剂、崩解剂的特点是：容易压制成型，适用性较强，特别是不易成型的片剂，如塑性、脆性、疏散性等较强的片剂，加

入本品后，则有改善作用；压制的片剂具有较好的硬度，特别是松片，撬盖的片剂，加入本品后，不仅易于成型，而且外观也较好；加入本品还能使片剂崩解迅速，即使片子得硬度达到13kg不碎，崩解也只需十几分钟，使片子提高内在质量，提高疗效；用本品制得的片剂长期保存崩解度不受影响。而用淀粉、糖粉等一般辅料制得的片剂贮存期后崩解时限普遍增长；用本品后片剂不易发霉变质；用本品后减少了片重，节约了包装，同时也节约了粮食。在我国制药工业上具有强大的生命力，不仅解决了片剂生产中的许多老大难问题，而且也可以改进制剂工艺，提高片剂质量，增强我国片剂制剂的国际市场的竞争能力。

本品作片剂黏合剂，湿法制粒时一般加5%～20%，用在原料本身有一定黏性的品种；粉末直接压片时用量5%～20%，用于小剂量西药或中草药片剂。作片剂崩解剂，用量2%～10%，一般为5%，内加和外加均可，视具体处方和选用的品种型号而定。

本品也是食品添加剂，在食品工业中用作乳化剂、稳定剂、助悬剂、增稠剂、被膜剂，用于饮料、糕点、果酱等制造。本品还用于日化工业，用作霜剂、香波、乳液等化妆品的制造。

【药物相互作用】本品不能与其他高浓度电解质配伍，否则会引起“盐析”。溶解后的本品与苯酚衍生物，如甲基和丙基对羟基苯甲酸盐有某些配伍禁忌。

【不良反应】营养性相当于纯纤维素，无任何代谢。无毒，安全。急性毒性：$LD_{50} > 15.0g/kg$。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
参维冻干蜂王浆片	中成药	ZC004917

HY001580　羟布宗

【其他名称】Hydroxyphenylbutazone、Oxalid、羟保泰松、羟基保泰松、Tanderil、坦特利尔

【外文名称】Oxyphenbutazone

【分子式】$C_{19}H_{20}N_2O_3 \cdot H_2O$

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶性粉末。无臭，略带苦味。

本品易溶于丙酮或三氯甲烷，溶于乙醇或乙醚，几乎不溶于水，在氢氧化碱溶液中溶解。

熔点118～124℃。

药物药理信息

【药理毒理】作用与保泰松基本相似，有解热、镇痛、抗风湿及消炎作用，但无保泰松的排尿酸作用。

【不良反应】本品与保泰松比较对胃肠道刺激较小，但代谢较缓慢，可在人体内造成积聚，每天服用不超过400mg，亦可出现多种毒性及不良反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
羟布宗片	化学药	HZ002947

HY001581　羟蒂巴酚

【其他名称】Metebanyl、Oxymethebanol、羟甲吗啡、羟甲吗喃醇

【外文名称】Drotebanol

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

【性状及组成】白色或近白色结晶或结晶性粉末，味稍苦。几不溶于水，易溶于乙醇和三氯甲烷，能溶于丙酮，微溶于乙醚。

药物药理信息

【药理毒理】本品抑制咳嗽中枢，为强效中枢性镇咳药，药理作用与可待因相似。口服用药的镇咳效果较磷酸可待因强5～14倍，皮下注射的作用较磷酸可待因强10～25倍，临床所用剂量仅为磷酸可待因的1/10，而且起效快，作用持久。适用于急、慢性支气管炎，肺结核，肺癌等各种原因引起的剧烈干咳。

【药代动力学】口服后20～30分钟生效，持续6～8小时，皮下注射后10～30分钟生效，持续4～8小时。

【不良反应】可有口干、食欲减退、恶心、呕吐、便秘或腹泄、倦睡、眩晕、头痛等。

HY001582　羟丁酸钠

【其他名称】GHB、γ－羟丁酸钠

【外文名称】Sodium Hydroxybutyrate

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】4－羟基丁酸钠盐

【分子式】$C_4H_7NaO_2$

【分子量】126.09

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；微臭，味咸；有引湿性。本品在水中极易溶解，在乙醇中

溶解，在乙醚或三氯甲烷中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：静脉全麻药。

本品静脉注射后 3～5 分钟出现嗜睡，10～15 分钟进入深睡，作用持续 90～120 分钟，有时可持续数小时不等。

1. 中枢神经系统：本品对中枢神经活动的抑制，主要是由于兴奋 GABA 受体所致。一般剂量作用于大脑皮质，大剂量也影响脑干及中脑，产生催眠作用，但不抑制网状激活系统，易出现肌肉抽搐、不随意运动及锥体外系症状。本品无镇痛作用。

2. 循环系统：对循环系统有兴奋作用，使血压稍高、脉搏慢而有力，对心排血量无影响，不引起颅内压增高。促使 K^+ 进入细胞内，心电图可显示 T 波低平、倒置，或出现 U 波。

3. 呼吸系统：一般剂量可使呼吸频率稍减慢，潮气量略增。但大剂量快速注射后能产生呼吸抑制。

4. 能使咽喉反射迟钝、抑制、下颌松弛。表面麻醉后能施行气管内插管。

【药代动力学】本品组织分布很广，通过血－脑屏障需一定时间，且脑组织中浓度仅及血浆中浓度的 50%，静脉注射后 10～15 分钟才显效，因而起效慢。此后，血中浓度逐渐升高达峰值，45 分钟中枢性作用才最明显，静脉注射后 30 分钟一般在血浆中即可测到代谢物，60 分钟后血中浓度开始下降，作用时间约 2 小时。约 80%～90%在体内分解代谢，进行氨基转换，参与三羧酸循环，最后氧化成水和二氧化碳，后者随呼气排出体外。约 10%～20%在 4～6 小时内随尿排出。

【药物相互作用】

1. 与阿托品并用可减少本品对副交感神经兴奋作用，防止心率减慢发生。

2. 与肌松药并用时，可增强肌松作用。

3. 与巴比妥类及安定类药物并用时可减少锥体外系症状。

【不良反应】

1. 麻醉诱导与苏醒过程中可引起锥体外系症状。

2. 用药后呼吸分泌物增加。

3. 本品能抑制呼吸，出现呼吸频率减慢。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
羟丁酸钠注射液	化学药	HZ0002948

HY001583 羟芬胺

【外文名称】N－hydroxy

药物管理信息

【特殊管理分类】一类精神药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633 号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为精神药品，但我国未生产或使用。

HY001584 羟基脲

【其他名称】HU、HUR、HYDREA

【外文名称】Hydroxycarbamide

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】羟基脲

【分子式】$CH_4N_2O_2$

【分子量】76.06

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；无臭，味微涩。本品在水中易溶，在乙醇中微溶，在乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为 138～145℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗肿瘤药。

本品是一种核苷二磷酸还原酶抑制剂，可阻止核苷酸还原为脱氧核苷酸，干扰嘌呤及嘧啶碱基生物合成，选择性地阻碍 DNA 合成，对 RNA 及蛋白质合成无阻断作用。周期特异性药，S 期细胞敏感。

【药代动力学】本品口服吸收佳，血浆 t_{max} 为 1～2 小时，6 小时从血中消失，可透过血脑脊液屏障，CFS 中 t_{max} 为 3 小时，20%在肝内代谢，80%由尿排出。

【药物相互作用】可能减少 5－Fu 转变为活性代谢物 Fd－UMP，二者并用应慎重；本品对中枢神经系统有抑制作用，故用本品时慎用巴比妥类、安定类、麻醉药等；本品有可能提高患者血中尿酸的浓度，故与别嘌呤醇、秋水仙碱、丙磺舒等合用治疗痛风时，须调整上述药物剂量。本品与别嘌呤醇合用能预防并逆转其所致的高尿酸血症，与烷化剂无交叉耐药。

【不良反应】

1. 骨髓抑制为剂量限制性毒性，可致白细胞和血小板减少，停药后 1～2 周可恢复。

2．有时出现胃肠道反应，尚有致睾丸萎缩和致畸胎的报道。

3．偶有中枢神经系统症状和脱发，亦有本药引起药物性发热的报道，重复给药时可再出现。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
羟基脲片	化学药	HZ002949

HY001585　羟甲香豆素

【其他名称】BMU、Cantabiline、胆通、Himecol

【外文名称】Hymecromone

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】4－甲基－7－羟基 2*H*－1－苯并吡喃－2－酮

【分子式】$C_{10}H_8O_3$

【分子量】176.17

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶性粉末；无臭，无味。本品在甲醇、乙醇或丙醇中略溶，在水中不溶；在氢氧化钠溶液中易溶。

熔点：本品的熔点为 188～192℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：利胆药。

羟甲香豆素为香豆素衍生物，能松弛奥狄括约肌，具有较强的解痉、镇痛作用，同时也能温和、持续地促进胆汁分泌，加强胆囊收缩和抗菌作用，具有明显的利胆作用，有利于结石排出，对胆总管结石有一定排石效果。部分原有丙氨酸氨基转移酶升高的患者，服药后随炎症的消除而恢复正常。本品毒性低，小鼠急性毒性 LD_{50}为 5375mg/kg。

【不良反应】个别患者可有头晕、腹胀、胸闷、皮疹、腹泻等不良反应，停药后可自行消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
羟甲香豆素胶囊	化学药	HZ002950
羟甲香豆素片	化学药	HZ002951
复方胆通胶囊	中成药	ZC001327
复方胆通片	中成药	ZC001328

HY001586　羟甲烟胺

【其他名称】利胆素、羟甲基烟酰胺、羟甲烟酰胺

【外文名称】Hydroxymethylnicotinamide

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 3 册

药物理化信息

【化学名】吡啶－3－羟甲基酰胺

【分子式】$C_7H_8N_2O_2$

【分子量】152.15

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；无臭。

本品在水中溶解，在乙醇中略溶，在乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 147～151℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为利胆消炎药，进入体内后分解为烟酰胺和甲醛，前者有保肝作用，后者有抗菌作用，对胆道及肠道中的双球菌、脓球菌、肠球菌及大肠杆菌等的感染均有抑制作用。

【不良反应】一般耐受良好。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
羟甲烟胺片	化学药	HZ002952

HY001587　羟吗啡酮

【外文名称】Oxymorphone

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】本品又名羟氢吗啡酮。为麻醉性镇痛药。具有显著的镇痛作用和成瘾性。本品盐酸盐为强效阿片受体激动剂，作用与用途与吗啡相同，但无止咳作用。肌注等效镇痛作用比吗啡强 9 倍，一般用于解除中至重度疼痛，包括产妇止痛。也用于辅助麻醉。

HY001588　羟哌替啶

【外文名称】Hydroxypethidine

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633 号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY001589 羟喜树碱

【其他名称】 10－羟基喜树碱、HPT、OPT、羟基喜树碱

【外文名称】 Hydroxycamptothecin

药物管理信息

【依据标准】 化学药品地标升国标·第16册

药物理化信息

【化学名】 4－乙基－4,10－二羟基－1*H*－吡喃并［3,4；6,7］－吲嗪并［1，2*b*］喹啉－3,14－（4*H*，12*H*）－二酮

【性状及组成】 本品为黄色柱状结晶，不溶于水，微溶于有机溶剂。溶液具有荧光。

药物药理信息

【药理毒理】 本品是从珙桐科落叶植物喜树的种子或根皮中提出一种生物碱。喜树广泛分布于我国南方十余省，资源丰富。原来的喜树碱因泌尿系统毒性较大，临床应用受到限制。近年来由于发现此药物可抑制拓扑异构酶，又重新受到广泛重视。证明对肝癌、大肠癌和肺癌均有效。为喜树碱的羟基衍生物，作用机制与喜树碱相似，但毒性较小。为DNA合成抑制剂，实验研究表明它主要作用于DNA合成期（即S期），对G0期细胞没有作用，对G1、G2与M期细胞有轻微杀伤力。对多种动物肿瘤有抑制作用。作用机制为抑制DNA拓扑异构酶。与常用抗肿瘤药物无交叉耐药性。动物实验显示其抗瘤谱较广。对核酸特别是DNA的合成有明显抑制作用。本品与喜树碱一样，亦是从喜树中提取的一种生物碱。在化学结构上比喜树碱在10位上多一个羟基，作用和作用机制与喜树碱相似，但抗瘤谱较广，毒性也较小，与喜树碱相比，是一种高效低毒的化合物。

【药代动力学】 ^{3}H标记的羟喜树碱静脉注射后$t_{1/2\alpha}$为4.5分，$t_{1/2\beta}$为29分。主要从粪便中排出，12小时排出29.6%，48小时为47.8%，24小时排出8.8%，48小时排出12.8%。静脉注射羟喜树碱后，药物浓度以胆囊以及小肠内容物最高，其次为癌细胞、小肠、肝、骨髓、胃及肺组织。

【药物过量】 可引起严重骨髓抑制，脏器功能损害。

【不良反应】

1．胃肠道反应，恶心、呕吐。

2．骨髓抑制主要为白细胞下降。

3．其他少数病人有脱发、心电图改变及泌尿道刺激症状，但远较喜树碱为轻。本品的不良反应与喜树碱似，但发生率低，程度轻，偶见有心电图改变。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
羟喜树碱氯化钠注射液	化学药	HZ002953
羟喜树碱注射液	化学药	HZ002954
注射用羟喜树碱	化学药	HZ004931

HY001590 羟乙桂胺

【其他名称】 苯烯酰胺醇、施力柔

【外文名称】 Idrocilamide

【性状及组成】 本品存在于格林属植物桂皮中。

本品可从乙酸乙酯中得到白色结晶，溶于乙醇，难溶于水。

熔点100～102℃。

药物药理信息

【药理毒理】 本品具有中枢性肌肉松弛作用、抗炎作用。可减少肌肉痉挛。制剂为软膏。适用于风湿性疼痛、运动性疼痛和功能康复时局部按摩，如：脊柱疼痛（腰痛，颈痛），肌肉韧带疾患如扭伤及功能康复过程中的疼痛；痉挛、扭伤及关节非严重性创伤；指关节疾患疼痛发作。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方羟乙桂胺乳膏	化学药	HZ001344

HY001591 羟乙基淀粉20

【外文名称】 Hydroxyethyl Starch 20

药物理化信息

【化学名】 羟乙基淀粉20

药物药理信息

【药理毒理】 本品静脉滴注后，较长时间停留于血液中，提高血浆渗透压，使组织液回流增多，迅速增加血容量，稀释血液，并增加细胞膜负电荷，使已聚集的细胞解聚、降低全身血黏度，改善微循环。

【药代动力学】 本品静脉滴注后，由于分子量大，主要停留于血循环内，主要分布于肝脏，大部分从肾脏排出，小部分随大便排出，仅微量被肌体分解代谢。1次静脉滴注后，24小时内尿中排出63%，大便中排出16.5%。

【不良反应】 偶可发生输液反应。少数患者出现荨麻疹、瘙痒。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
羟乙基淀粉20氯化钠注射液	化学药	HZ002955

HY001592　羟乙基淀粉40

【外文名称】Hydroxyethyl Starch 40

药物理化信息

【化学名】羟乙基淀粉40

药物药理信息

【药理毒理】本品静脉滴注后，较长时间停留于血液中，提高血浆渗透压，使组织液回流增多，迅速增加血容量，稀释血液，并增加细胞膜负电荷，使已聚集的细胞解聚，降低全身血黏度，改善微循环。

【药代动力学】本品静脉滴注后，由于分子量大，主要停留于血循环内，主要分布于肝脏，大部分从肾脏排出，小部分随大便排出，仅微量被机体分解代谢。一次静脉滴注后，24小时内尿中排出63%，大便中排出16.5%。

【不良反应】偶可发生输液反应。少数患者出现荨麻疹、瘙痒。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
高渗氯化钠羟乙基淀粉40注射液	化学药	HZ001587
羟乙基淀粉40氯化钠注射液	化学药	HZ002956

HY001593　羟乙基淀粉130/0.4

【外文名称】Hydroxyethyl Starch 130/0.4

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第15册

药物理化信息

【化学名】聚（*O*-2-羟乙基）淀粉

【性状及组成】本品的摩尔取代度0.30~0.60，平均分子量130000。

药物药理信息

【药理毒理】本品静脉滴注后，较长时间停留于血液中，提高血浆渗透压，使组织液回流增多，迅速增加血容量，稀释血液，并增加细胞膜负电荷，使已聚集的细胞解聚，降低全身血黏度，改善微循环。

与临床应用比较成熟的羟乙基淀粉450/0.7，羟乙基淀粉200/0.62，羟乙基淀粉200/0.5相比，羟乙基淀粉130/0.4有以下优点：降低了分子量和取代级，更有利的取代模式和分子量分布，具有更好的容量效应（扩容效果和持续时间），又增加了消除，避免了蓄积，安全性得到了改善，对心、脑、肾及凝血功能的影响较小，可以大剂量使用至33ml/kg/天。可用于儿童。

【药物相互作用】给予羟乙基淀粉时，病人血淀粉酶浓度将升高，可能干扰胰腺炎的诊断。

【药物过量】同其他容量替代品一样，如使用过量，可能引起循环系统负荷过量（如肺水肿），应立即停药，必要时给予利尿剂。

【不良反应】极个别患者在使用含羟乙基淀粉的药品时，可能发生过敏性样反应（过敏反应、类似中度流感的症状、心动过速、支气管痉挛、非心源性肺水肿）。在输液过程中，如患者发生不可耐受的反应，应立即终止给药，并给予适当的治疗处理。给予羟乙基淀粉时，患者血淀粉酶浓度将升高，可能干扰胰腺炎的诊断。

长期大剂量使用羟乙基淀粉，患者会出现皮肤瘙痒。

大剂量使用时，由于稀释效应，可能引起血液成分如凝血因子、血浆蛋白的稀释，以及红细胞压积的下降。

使用羟乙基淀粉时，可能发生与剂量相关的血液凝结异常。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
羟乙基淀粉130/0.4氯化钠注射液	化学药	HZ002957

HY001594　羟乙膦酸钠

【外文名称】Etidronatedi Sodium

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第60册

药物理化信息

【化学名】（1-羟基亚乙基）双膦酸氢二钠

【分子式】$C_2H_6Na_2O_7P_2$

【分子量】249.99

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；无臭，味微咸；具引湿性。

本品在水中易溶，在乙醇或丙酮中几乎不溶，在冰醋酸中溶解。

药物药理信息

【药理毒理】本品是骨代谢调节剂，能进入骨基质羟磷灰石晶体中，当破骨细胞溶解晶体，药物被释放，能抑制破骨细胞活性，并通过成骨细胞间接

起抑制骨吸收效应，防止骨质的丢失。

【药代动力学】正常成人一次口服 20mg/kg，1 小时后血清中浓度达到最高，体内不进行代谢，半衰期为 1～6 小时，24 小时后为 0.03μg/ml，连续服药 7 天未见积蓄倾向。本品吸收率约 6%，进入体内后在骨及肾脏中浓度最高，24 小时内 50%的量通过肾脏排泄，50%被骨吸收。

【药物相互作用】

1．抗酸药和导泻剂因常含钙或其他金属离子如镁、铁等而会影响本药吸收。

2．与氨基糖苷类合用会诱发低钙血症。

【不良反应】腹部不适，腹泻，呕吐，口炎，头痛，咽喉灼热感，瘙痒，皮疹等症状。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
羟乙膦酸钠片	化学药	HZ002959

HY001595 青光安

【其他名称】碘三甲糠胺、呋喃蒙、Furamonum、Furanol

【外文名称】Furamon

药物药理信息

【药理毒理】本品直接兴奋 M 受体，使瞳孔缩小，眼内压降低。用于治疗青光眼。由于作用快，尤适用于急性发作的患者。

【不良反应】本品偶有结膜充血水肿、流泪、泪道阻塞、暂时性远视力下降。

HY001596 青蒿琥酯

【外文名称】Artesunate

药物理化信息

【化学名】（3*R*，5a*S*，6*R*，8a*S*，9*R*，10*S*，12*R*，12a*R*）－十氢－3,6,9－三甲基－3,12－桥氧－12H－吡喃［4,3－*j*］－1,2－苯并二塞平－10－醇，琥珀酸单酯

【分子式】$C_{19}H_{28}O_8$

【分子量】322.00

药物药理信息

【药理毒理】本品为青蒿素的衍生物。对疟原虫红内期有强大且快速的杀灭作用，能迅速控制临床发作及症状。青蒿素的作用机制尚不十分清楚，主要是干扰疟原虫的表膜一线粒体功能。青蒿素通过影响疟原虫红内期的超微结构，使其膜系结构发生变化。由于对食物泡膜的作用，阻断了疟原虫的营养摄取，当疟原虫损失大量胞浆和营养物质，而又得不到补充，因而很快死亡。其作用方式是通过其内过氧化物（双氧）桥，经血红蛋白分解后产生的游离铁所介导，产生不稳定的有机自由基及（或）其他亲电子的中介物，然后与疟原虫的蛋白质形成共价加合物，而使疟原虫死亡。

本品对鼠疟原虫红内期超微结构的影响，主要是疟原虫膜系结构的改变，该药首先作用于食物泡膜、表膜、线粒体、其次是核膜、内质网，此外对核内染色质也有一定的影响。提示本品的作用方式主要是干扰表膜－线粒体的功能。体外培养的恶性疟原虫对氚标记的异亮氨酸的摄入情况也显示其起始作用方式可能是抑制原虫蛋白合成。动物毒理实验表明本品有一定的胚胎毒性，表现为胚胎吸收。

【药代动力学】口服后体内分布甚广，以肠、肝、肾较高。主要在体内代谢转化。仅有少量由尿、粪便排泄。静脉注射后血药浓度很快下降，$t_{1/2}$为 30 分钟左右。体内分布甚广，以肠、肝、肾较高。主要在体内代谢转化，仅有少量由尿、粪便排泄。

【药物过量】用量大于 2.75mg/kg，可能出现外周网织细胞一过性降低。

【不良反应】推荐剂量未见不良反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
青蒿琥酯片	化学药	HZ002960
注射用青蒿琥酯	化学药	HZ004932

HY001597 青蒿素

【其他名称】Artemisine、黄蒿素、QHS、Quinghaosu

【外文名称】Artemisinin

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（3*R*，5a*S*，6*R*，8a*S*，9*R*，12*S*，12a*R*）－八氢－3,6,9－三甲基－3,12－桥氧－12*H*－吡喃［4,3－*j*］－1,2－苯并二塞平－10（3*H*）－酮

【分子式】$C_{15}H_{22}O_5$

【分子量】282.34

【性状及组成】本品为无色针状结晶，味苦。本品在丙酮、乙酸乙酯、三氯甲烷、苯或冰醋酸中易溶，在甲醇、乙醇、稀乙醇、乙醚及石油醚中溶解，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 150～153℃。

比旋度：取本品，精密称定，加无水乙醇制成每 1ml 中含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为＋75°至＋78°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗疟药。

药理学：青蒿素是从中药青蒿中提取的有过氧基团的倍半萜内酯药物，是高效、速效、低毒抗疟药。对疟原虫红内期有强大且快速的杀灭作用，能迅速控制临床发作及症状。青蒿素的作用机制尚不十分清楚，主要是干扰疟原虫的表膜－线粒体功能。青蒿素通过影响疟原虫红内期的超微结构，使其膜系结构发生变化。由于阻断了疟原虫的营养摄取，当疟原虫损失大量胞浆和营养物质，而又得不到补充，因而很快死亡。其作用方式是通过其内过氧化物（双氧）桥，经血红蛋白分解后产生的游离铁所介导，产生不稳定的有机自由基及（或）其他亲电子的中介物，然后与疟原虫的蛋白质形成共价加合物，而使疟原虫死亡。蒿甲醚的抗疟活性较青蒿素大6倍。

毒理学：本药有一定的胚胎毒性，表现为胚胎吸收。

【药代动力学】本品吸收后分布于组织内，以肠、肝、肾的含量较多。本品为脂溶性物质，易透过血脑屏障进入脑组织。在体内代谢快，主要从肾及肠道排出，24小时可排出84%，72小时仅少量残留。由于代谢与排泄均快，有效血药浓度维持时间短，不利于彻底杀灭疟原虫，故复燃率较高。

【药物相互作用】

1．本品与伯氨喹合用可根治间日疟；

2．与甲氧苄啶合用有增效作用，并可减少近期复燃。

【不良反应】

1．少数病人出现轻度恶心、呕吐、腹泻。

2．偶见一过性转氨酶升高，皮疹。

3．肌内注射部位较浅时可致局部疼痛与硬结。

4．过量可出现红细胞减少、外周网织红细胞消失、心肌损伤与肾上皮细胞肿胀。

5．动物试验中本品有胚胎毒性，孕妇慎用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
青蒿素栓	化学药	HZ002961

HY001598　青霉胺

【其他名称】cupremin、Cuprenil、Distamin、二甲苯胱氨酸

【外文名称】Penicillamine

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】D－3－巯基缬氨酸

【分子式】$C_5H_{11}NO_2S$

【分子量】149.21

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末。本品在水中易溶，在乙醇中微溶，在三氯甲烷或乙醚中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加0.1mol/L氢氧化钠溶液溶解制成每1ml中约含50mg的溶液，依法测定，比旋度为－61.0°至－65.0°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：重金属解毒药。

1．络合作用

（1）重金属中毒，本品能络合铜、铁、汞、铅、砷等重金属，形成稳定和可溶性复合物由尿排出。其驱铅作用不及依地酸钙钠，驱汞作用不及二巯丙醇；但本品可口服，不良反应稍小，可供轻度重金属中毒或其他络合剂有禁忌时选用。

（2）Wilson病，是一种常见染色体隐性遗传疾病，主要有大量铜沉积于肝和脑组织，引起豆状核变性和肝硬化，本品能与沉积在组织的铜结合形成可溶性复合物由尿排出。

（3）胱氨酸尿及其结石，本品能与胱氨酸反应形成半胱氨酸－青霉胺二硫化物的混合物，从而降低尿中胱氨酸浓度；该混合物的溶解度要比胱氨酸大50倍，因此能预防胱氨酸结石的形成；长期服用6～12个月，可能使已形成的胱氨酸结石逐渐溶解。

2．抗类风湿关节炎：治疗类风湿关节炎的作用机制尚未明了。用药后发现有改善淋巴细胞功能，明显降低血清和关节囊液中的IgM类风湿因子和免疫复合物的水平，但对血清免疫球蛋白绝对值无明显降低。体外有抑制T细胞的活力，而对B细胞无影响。本品还能抑制新合成原胶原交叉连接，故也用于治疗皮肤和软组织胶原病。

【药物相互作用】本品可加重抗疟药、金制剂、免疫抑制剂、保泰松对造血系统和肾脏的不良反应。口服铁剂患者，本品宜在服铁剂前2小时口服，以免减弱本品疗效。

【不良反应】药物不良反应大多在停药后自动缓解和消失。过敏反应用肾上腺皮质激素和抗组胺药物治疗有效。味觉异常，除Wilson病患者外，可用4%硫酸铜溶液5～10滴，加入果汁中口服，一日2次，有助于味觉恢复。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
青霉胺片	化学药	HZ002962

HY001599 青霉素钾

【外文名称】Benzylpenicillin Potassium

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（2*S*，5*R*，6*R*）－3,3－二甲基－6－（2－苯乙酰氨基）－7－氧代－4－硫杂－1－氮杂双环［3.2.0］庚烷－2－甲酸钾盐

【分子式】$C_{16}H_{17}KN_2O_4S$

【分子量】372.49

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；无臭或微有特异性臭；有引湿性；遇酸、碱或氧化剂等即迅速失效，水溶液在室温放置失效。本品在水中极易溶解，在乙醇中略溶，在脂肪油或液状石蜡中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：β－内酰胺类抗生素，青霉素类。

青霉素对溶血性链球菌等链球菌属、肺炎链球菌和不产青霉素酶的葡萄球菌具有良好抗菌作用。对肠球菌有中等度抗菌作用。淋病奈瑟菌、脑膜炎奈瑟一定抗菌活性，其他革兰阴性需氧或兼性厌氧菌对本品敏感性差。本品对梭状芽孢杆菌属、消化链球菌厌氧菌以及产黑色素拟杆菌等具良好抗菌作用，对脆弱拟杆菌的抗菌作用差。

青霉素通过抑制细菌细胞壁合成而发挥杀菌作用。

【药代动力学】肌内注射后，0.5 小时达到血药峰浓度，肌内注射 100 万单位（600mg）的峰浓度为 20000 单位/L（12mg/L）。成人每 2 小时静脉注射青霉素 200 万单位或每 3 小时注射 300 万单位，平均血药浓度约为 19.2mg/L。于 5 分钟内静脉注射 500 万单位（3g）青霉素，给药后 5 分钟和 10 分钟的平均血药浓度为 400mg/L 和 273mg/L，1 小时即降至 45mg/L，4 小时仅有 3.0mg/L。新生儿按体重肌内注射青霉素 2.5 万单位/kg 后（15mg/kg），0.5～1 小时的平均血药浓度约为 21mg/L，12 小时后即降至 9.6～19.2mg/L。本品广泛分布于组织、体液中。胸、腹腔和关节腔液中浓度约为血清浓度的 50%。本品不易透入眼、骨组织、无血供区域和脓腔中，易透入有炎症的组织。青霉素可通过胎盘，除在妊娠头 3 个月羊水中青霉素浓度较低外，一般在胎儿和羊水中皆可获得有效治疗浓度。本品难以透过血－脑脊液屏障。

本品血浆蛋白结合率为 45%～65%。血消除半衰期（$t_{1/2}$）约为 30 分钟，肾功能减退者可延长至 2.5～10 小时，老年人和新生儿也可延长。新生儿的 $t_{1/2}$与体重、日龄有关，体重低于 2kg 者，7 日和 8～14 日龄新生儿的 $t_{1/2}$分别为 4.9 和 2.6 小时；体重高于 2kg 者，7 日和 8～14 日龄的 t1/2 则分别为 2.6 小时和 2.1 小时。

本品约 19%在肝内代谢。肾功能正常情况下，约 75%的给药量于 6 小时内自肾脏排出。青霉素主要通过肾小管分泌排泄，在健康成年人经肾小球滤过排泄者仅占 10%左右；但在新生儿，青霉素则主要经肾小球滤过排泄。亦有少量青霉素经胆道排泄，肌内注射 600mg 青霉素后 2～4 小时胆汁中浓度达到峰值，为 10～20mg/L。由于青霉素可被肠道细菌所产青霉素酶破坏，粪便中不含或仅含少量青霉素。血液透析可清除本品，而腹膜透析则不能。

【药物相互作用】

1．氯霉素、红霉素、四环素类、磺胺类可干扰本品活性，故不宜同瓶滴注。

2．丙磺舒、阿司匹林、吲哚美辛、保泰松和磺胺药减少青霉素的肾小管分泌而延长本品的血清半衰期。青霉素可增强华法林的抗凝作用。

3．本品与重金属，特别是铜、锌、汞呈配伍禁忌。

4．青霉素静脉输液中加入头孢噻吩、林可霉素、四环素、万古霉素、琥乙红霉素、两性霉素 B、去甲肾上腺素、间羟胺、苯妥英钠、盐酸羟嗪、丙氯拉嗪、异丙嗪、维生素 B 族、维生素 C 族等后将出现浑浊。

5．本品与氨基糖苷类抗生素同瓶滴注可导致两者抗菌活性降低，因此不能置同一容器内给药。

【药物过量】药物过量的主要表现是中枢神经系统不良反应，应及时停药并予对症、支持治疗。血液透析可清除青霉素。

【不良反应】

1．过敏反应：青霉素过敏反应较常见，包括荨麻疹等各类皮疹、白细胞减少、间质性肾炎、哮喘发作等和血清病型反应；过敏性休克偶见，一旦发生，必须就地抢救，予以保持气道畅通、吸氧及使用肾上腺素、糖皮质激素等治疗措施。

2．毒性反应：少见，但静脉滴注大剂量本品或鞘内给药时，可因脑脊液药物浓度过高导致抽搐、肌肉阵挛、昏迷及严重精神症状等（青霉素脑病）。此种反应多见于婴儿、老年人和肾功能不全患者。

3．赫氏反应和治疗矛盾：用青霉素治疗梅毒、钩端螺旋体病等疾病时可由于病原体死亡致症状加剧，称为赫氏反应；治疗矛盾也见于梅毒患者，系治疗后梅毒病灶消失过快，而组织修补相对较慢或

病灶部位纤维组织收缩，妨碍器官功能所致。

4. 二重感染：可出现耐青霉素金葡菌、革兰阴性杆菌或念珠菌等二重感染；肾功能不全患者应用大剂量青霉素钾可导致高钾血症。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用青霉素钾	化学药	HZ004933

HY001600　青霉素钠

【外文名称】Benzylpenicillin Sodium

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（2*S*，5*R*，6*R*）－3,3－二甲基－6－（2－苯乙酰氨基）－7－氧代－4－硫杂－1－氮杂双环［3.2.0］庚烷－2－甲酸钠盐

【分子式】$C_{16}H_{17}N_2NaO_4S$

【分子量】356.38

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；无臭或微有特异性臭；有引湿性；遇酸、碱或氧化剂等即迅速失效，水溶液在室温放置失效。本品在水中极易溶解，在乙醇中溶解，在脂肪油或液状石蜡中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：β－内酰胺类抗生素，青霉素类。

青霉素对溶血性链球菌等链球菌属，肺炎链球菌和不产青霉素酶的葡萄球菌具有良好抗菌作用。对肠球菌有中等度抗菌作用，淋病奈瑟菌、脑膜炎奈瑟菌、白喉棒状杆菌、炭疽芽孢杆菌、牛型放线菌、念珠状链杆菌、李斯特菌、钩端螺旋体和梅毒螺旋体对本品敏感。本品对流感嗜血杆菌和百日咳鲍特氏菌亦具一定抗菌活性，其他革兰阴性需氧或兼性厌氧菌对本品敏感性差。本品对梭状芽孢杆菌属、消化链球菌厌氧菌以及产黑色素拟杆菌等具良好抗菌作用，对脆弱拟杆菌的抗菌作用差。

青霉素通过抑制细菌细胞壁合成而发挥杀菌作用。

【药代动力学】肌内注射后，0.5 小时达到血药峰浓度，肌内注射 100 万单位（600mg）的峰浓度为 20000 单位/L（12mg/L）。新生儿按体重肌注青霉素 2.5 万单位/kg（15mg/kg），经 0.5～1 小时后，平均血药浓度约为 22mg/L，12 小时后即降至 9.6～19.2 mg/L。成人每 2 小时静脉注射本品 200 万单位或每 3 小时注射 300 万单位，平均血药浓度约为 19.2mg/L。于 5 分钟内静脉注射 500 万单位（3g）青霉素，给药后 5 分钟和 10 分钟的平均血药浓度为 400mg/L 和 273mg/L，1 小时即降至 45mg/L，4 小时仅有 3.0mg/L。

本品广泛分布于组织、体液中。胸、腹腔和关节腔液中浓度约为血清浓度的 50%。本品不易透入眼、骨组织、无血供区域和脓腔中，易透入有炎症的组织。青霉素可通过胎盘，除在妊娠头 3 个月羊水中青霉素浓度较低外，一般在胎儿和羊水中皆可获得有效治疗浓度。本品难以透过血－脑脊液屏障，在无炎症脑脊液中的浓度仅为血药浓度的 1%～3%。在有炎症的脑脊液中浓度可达同期血药浓度的 5%～30%。乳汁中可含有少量青霉素，其浓度为血药浓度的 5%～20%。

本品血浆蛋白结合率为 45%～65%。血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）约为 30 分钟，肾功能减退者可延长至 2.5～10 小时，老年人和新生儿也可延长。新生儿的 $t_{1/2\beta}$与体重、日龄有关，体重低于 2kg 者，7 日和 8～14 日龄新生儿的 $t_{1/2\beta}$分别为 4.9 和 2.6 小时；体重高于 2kg 者，7 日和 8～14 日龄的 $t_{1/2\beta}$则分别为 2.6 小时和 2.1 小时。

本品约 19% 在肝内代谢。肾功能正常情况下，约 75% 的给药量于 6 小时内自肾脏排出。青霉素主要通过肾小管分泌排泄，在健康成年人经肾小球滤过排泄者仅占 10% 左右；但在新生儿，青霉素则主要经肾小球滤过排泄。亦有少量青霉素经胆道排泄，肌内注射 600mg 青霉素后 2～4 小时胆汁中浓度达到峰值，为 10～20mg/L。由于青霉素在被肠道细菌所产青霉素酶破坏，粪便中不含或仅含少量青霉素。血液透析可清除本品，而腹膜透析则不能。

【药物相互作用】

1. 氯霉素、红霉素、四环素类、磺胺类可干扰本品的活性，故本品不宜与这些药物合用。

2. 丙磺舒、阿司匹林、吲哚美辛、保泰松和磺胺药减少青霉素的肾小管分泌而延长本品的血清半衰期。青霉素可增强华法林的抗凝作用。

3. 本品与重金属，特别是铜、锌、汞呈配伍禁忌。

4. 青霉素静脉输液中加入头孢噻吩、林可霉素、四环素、万古霉素、琥乙红霉素、两性霉素 B、去甲肾上腺素、间羟胺、苯妥英钠、盐酸羟嗪、丙氯拉嗪、异丙嗪、维生素 B 族、维生素 C 族等后将出现浑浊。

5. 本品与氨基糖苷类抗生素同瓶滴注可导致两者抗菌活性降低，因此不能置同一容器内给药。

【药物过量】药物过量的主要表现是中枢神经系

统不良反应，应及时停药并予对症、支持治疗。血液透析可清除青霉素。

【不良反应】

1. 过敏反应：青霉素过敏反应较常见，包括荨麻疹等各类皮疹、白细胞减少、间质性肾炎、哮喘发作等和血清病型反应；过敏性休克偶见，一旦发生，必须就地抢救，予以保持气道畅通、吸氧及使用肾上腺素、糖皮质激素等治疗措施。

2. 毒性反应：少见，但静脉滴注大剂量本品或鞘内给药时，可因脑脊液药物浓度过高导致抽搐、肌肉阵挛、昏迷及严重精神症状等（青霉素脑病）。此种反应多见于婴儿、老年人和肾功能不全患者。

3. 赫氏反应和治疗矛盾：用青霉素治疗梅毒、钩端螺旋体病等疾病时可由于病原体死亡致症状加剧，称为赫氏反应；治疗矛盾也见于梅毒患者，系治疗后梅毒病灶消失过快，而组织修补相对较慢或病灶部位纤维组织收缩，妨碍器官功能所致。

4. 二重感染：可出现耐青霉素金葡菌、革兰阴性杆菌或念珠菌等二重感染。

5. 应用大剂量青霉素钠可因摄入大量钠盐而导致心力衰竭。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
青霉素皮试剂	化学药	HZ002963
注射用普鲁卡因青霉素	化学药	HZ004926
注射用青霉素钠	化学药	HZ004934

HY001601 青霉素 V 钾

【外文名称】 Phenoxymethylpenicillin Potassium

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 （2*S*，5*R*，6*R*）－3，3－二甲基－7－氧代－6－（2－苯氧基乙酰氨基）－4－硫杂－1－氮杂双环［3.2.0］－庚烷－2－甲酸钾盐

【分子式】 $C_{16}H_{17}KN_2O_5S$

【分子量】 388.49

【性状及组成】 本品为白色结晶或结晶性粉末；无臭或微臭，微苦。

本品在水中易溶，在三氯甲烷、乙醚或液体石蜡中几乎不溶。

比旋度：取本品适量，精密称定，加新沸并冷至室温的水制成每 1ml 中约含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为 +215°至 +230°。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：β－内酰胺类抗生素，青霉素类。

本品为青霉素类抗生素。抗菌谱与青霉素相同。对多数革兰阳性菌、革兰阴性球菌、个别革兰阴性杆菌（如嗜血杆菌属）、螺旋体和放线菌均有抗菌活性，但多数葡萄球菌菌株（>90%）包括金黄色葡萄球菌和凝固酶阴性葡萄球菌可产生 β－内酰胺酶使本品水解而失活。本品对大多数敏感菌株的活性较青霉素弱 2～5 倍。对产青霉素酶的菌株无抗菌作用。

本品的作用机制是抑制细菌细胞壁的合成，使细菌迅速破裂溶解。

【药代动力学】 本品耐酸，口服后不被破坏，约 60%在十二指肠被吸收。口服 0.5g 后约 1 小时达血药峰浓度，为 3～5mg/L。食物可减少本品的吸收。蛋白结合率约 80%。给药量的 20%～35%以原形经尿排出。本品的血消除半衰期约为 1 小时。

【药物相互作用】

1. 丙磺舒、阿司匹林、吲哚美辛、保泰松、磺胺药可减少本品在肾小管的排泄，因而使本品的血药浓度升高，血消除半衰期延长，毒性也可能增加。

2. 本品与别嘌醇合用时，皮疹发生率显著增高，故应避免合用。

3. 本品不宜与双硫仑等乙醛脱氢酶抑制药合用。

4. 本品与氯霉素合用于细菌性脑膜炎时，远期后遗症的发生率较两者单用时高。

5. 本品可刺激雌激素代谢或减少其肠肝循环，因此可降低口服避孕药的效果。

6. 氯霉素、红霉素、四环素类等抗生素和磺胺药等抑菌药可干扰本品的杀菌活性，因此不宜与本品合用，尤其在治疗脑膜炎或急需杀菌药的严重感染时。

7. 本品可加强华法林的作用。

8. 克拉维酸可增强本品对产 β－内酰胺酶细菌的抗菌活性；氨基糖苷类抗生素在亚抑菌浓度时一般可增强本品对粪肠球菌的体外杀菌作用。

【药物过量】 本品过量的处理以对症治疗和支持疗法为主，血液透析可加速本品的排泄。

【不良反应】

1. 常见恶心、呕吐、上腹部不适、腹泻等胃肠道反应及黑毛舌。

2. 过敏反应：皮疹（尤其易发生于传染性单核细胞增多症者）、荨麻疹及其他血清病样反应、喉水肿、药物热和嗜酸粒细胞增多等。

3. 二重感染：长期或大量服用本品可致耐青霉

素金黄色葡萄球菌、革兰阴性杆菌或白念珠菌感染（舌苔呈棕色甚至黑色）。

4. 少见溶血性贫血、血清氨基转移酶一过性升高、白细胞减少、血小板减少、神经毒性和肾毒性等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
青霉素V钾分散片	化学药	HZ002964
青霉素V钾胶囊	化学药	HZ002965
青霉素V钾颗粒	化学药	HZ002966
青霉素V钾片	化学药	HZ002967

HY001602　青阳参总苷

【性状及组成】本品为由萝藦科鹅绒藤属植物青羊参根粉经三氯甲烷提取所得的总苷。已从总苷中分离出有效成分有：告达亭、青阳参苷元、罗素他命、青阳参苷甲，青阳参苷乙及11-α-乙酰基青阳参苷元等。

本品为棕黄色或棕色粉末，味苦。

本品在甲醇，乙酸乙酯，三氯甲烷中易溶，在水，酸，石油醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】动物实验证实，本品对听源性惊厥发作有对抗作用，有效作用时间可维持24小时。单用对小鼠超强电休克惊厥（MES）无对抗作用，但能加强苯巴比妥或苯妥英钠的抗小鼠MES效应，即合用时有协同作用。对戊四氮引起的惊厥无效。

临床试用结果表明，本品对各型癫痫均有效，对大发作疗效较好，总有效率为80%；与其他抗癫痫药合用治疗顽固性癫痫或难治性癫痫的总有效率达79%。

临床主要与苯妥英钠或苯巴比妥等抗癫痫药合用治疗顽固性癫痫或难治性癫痫，亦可单独用于治疗一般性癫痫。

作为抗癫痫药，本品具有以下特点：①有效时间长，不需频繁给药，采用间断给药（一般1~2日1次），即可获得满意的疗效。②对各种类型的癫痫均有一定疗效。③无镇静及嗜睡作用。④近期（6~20个月）观察，尚未发现明显不良反应。⑤癫痫患者兼有肝功能不良时，加服本品后能恢复正常。⑥由于癫痫发作频繁和病程迁延而兼有头痛、头昏的癫痫患者，加服本品后症状可迅速减轻或完全消失。

【药物过量】对人有明显蓄积作用，故临床应用时宜采用间断给药法，日剂量每千克体重不超过20mg。

【不良反应】口服用药毒性低。临床常用剂量在治疗期间未发现毒性作用，但加大剂量至103mg/kg体重（试用于精神分裂症）时，可出现恶心、呕吐、眩晕，继而出现抽搐、昏迷。

HY001603　氢化可的松

【其他名称】Hycor、Hydrocort、Hydrocortex、Hydrocortistab、Hydrocortone、Hydrofoam、可的索（Cortisol）、皮质醇、氢化皮质素、氢可的松

【外文名称】Hydrocortisone

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】11β、17α、21-三羟孕甾-4-烯-3,20-二酮

【分子式】$C_{21}H_{30}O_5$

【分子量】362.47

【性状及组成】本品为白色或几乎白色的结晶性粉末；无臭，初无味，随后有持续的苦味；遇光渐变质。本品在乙醇或丙酮中略溶，在三氯甲烷中微溶，在乙醚中几乎不溶，在水中不溶。

熔点：本品的熔点为212~222℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：肾上腺皮质激素类药物。

本品超生理量时具有抗炎、抗过敏和抑制免疫等多种药理作用。

1. 抗炎作用：糖皮质激素减轻和防止组织对炎症的反应，从而减轻炎症的表现。

2. 免疫抑制作用：防止或抑制细胞中介的免疫反应，延迟性的过敏反应，并减轻原发免疫反应的扩展。

3. 抗毒、抗休克作用：糖皮质激素能对抗细菌内毒素对机体的刺激反应，减轻细胞损伤，发挥保护机体的作用。

【药代动力学】本品可自消化道迅速吸收，约1小时血药浓度达峰值。本品不溶于水，用稀乙醇制成注射液稀释后，可用于静脉注射。其生物半衰期约为100分钟，血中90%以上的氢化可的松与血浆蛋白相结合。大多数代谢产物结合成葡萄糖醛酸酯，极少量以原形经尿排泄。

【药物相互作用】

1. 非甾体消炎镇痛药可加强其致溃疡作用。

2. 可增强对乙酰氨基酚的肝毒性。

3. 与两性霉素 B 或碳酸酐酶抑制剂合用，可加重低钾血症，长期与碳酸酐酶抑制剂合用，易发生低血钙和骨质疏松。

4. 与蛋白质同化激素合用，可增加水肿的发生率，使痤疮加重。

5. 与抗胆碱能药（如阿托品）长期合用，可致眼压增高。

6. 三环类抗抑郁药可使其引起的精神症状加重。

7. 与降糖药如胰岛素合用时，因可使糖尿病患者血糖升高，应适当调整降糖药剂量。

8. 甲状腺激素可使其代谢清除率增加，故甲状腺激素或抗甲状腺药与其合用，应适当调整后者的剂量。

9. 与避孕药或雌激素制剂合用，可加强其治疗作用和不良反应。

10. 与强心苷合用，可增加洋地黄毒性及心律紊乱的发生。

11. 与排钾利尿药合用，可致严重低血钾，并由于水钠潴留而减弱利尿药的排钠利尿效应。

12. 与麻黄碱合用，可增强其代谢清除。

13. 与免疫抑制剂合用，可增加感染的危险性，并可能诱发淋巴瘤或其他淋巴细胞增生性疾病。

14. 可增加异烟肼在肝脏代谢和排泄，降低异烟肼的血药浓度和疗效。

15. 可促进美西律在体内代谢，降低血药浓度。

16. 与水杨酸盐合用，可减少血浆水杨酸盐的浓度。

17. 与生长激素合用，可抑制后者的促生长作用。

【药物过量】可引起类肾上腺皮质功能亢进综合征。

【不良反应】糖皮质激素在应用生理剂量替代治疗时无明显不良反应，不良反应多发生在应用药理剂量时，而且与疗程、剂量、用法及给药途径等有密切关系。常见不良反应有以下几类。

1. 长程使用可引起：医源性库欣综合征面容和体态、体重增加、下肢水肿、紫纹、易出血倾向、创口愈合不良、痤疮、月经紊乱、肱或股骨头缺血性坏死、骨质疏松及骨折（包括脊椎压缩性骨折、长骨病理性骨折）、肌无力、肌萎缩、低血钾综合征、胃肠道刺激（恶心、呕吐）、胰腺炎、消化性溃疡或穿孔，儿童生长受到抑制、青光眼、白内障、良性颅内压升高综合征、糖耐量减退和糖尿病加重。

2. 患者可出现精神症状：欣快感、激动、谵妄、不安、定向力障碍，也可表现为抑制。精神症状由易发生于患慢性消耗性疾病的人及以往有过精神不正常者。

3. 并发感染为肾上腺皮质激素的主要不良反应。以真菌、结核菌、葡萄球菌、变形杆菌、绿脓杆菌和各种疱疹病毒为主。

4. 糖皮质激素停药综合征。有时患者在停药后出现头晕、昏厥倾向、腹痛或背痛、低热、食欲减退、恶心、呕吐、肌肉或关节疼痛、头疼、乏力、软弱，经仔细检查如能排除肾上腺皮质功能减退和原来疾病的复燃，则可考虑为对糖皮质激素的依赖综合征。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方氢化可的松新霉素乳膏	化学药	HZ001346
氯霉素氢化可的松滴耳液	化学药	HZ002521
氢化可的松片	化学药	HZ002968
氢化可的松乳膏	化学药	HZ002969
氢化可的松新霉素滴耳液	化学药	HZ002970
氢化可的松注射液	化学药	HZ002971

HY001604 氢化可的松琥珀酸钠

【外文名称】Hydrocortisone Sodium Succinate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】11β，17－二羟基－21－（3－羧基－1－羟丙氧基）孕甾－4－烯－3，20－二酮一钠盐

【分子式】$C_{25}H_{33}NaO_8$

【分子量】484.52

【性状及组成】本品为白色或几乎白色的结晶性粉末；无臭，有引湿性。

本品在水中易溶，在乙醇中略溶，在三氯甲烷及乙醚中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加 90% 乙醇制成每 1ml 中含 10mg 的溶液，依法测定，按干燥品计算，比旋度为 + 135°至 145°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：肾上腺皮质激素类药。

氢化可的松琥珀酸钠是氢化可的松的盐类化合物。具有抗炎、抗过敏和抑制免疫等多种药理作用。

1. 抗炎作用：糖皮质激素减轻和防止组织对炎症的反应，从而减轻炎症的表现。

2. 免疫抑制作用：防止或抑制细胞中介的免疫反应，延迟性的过敏反应，并减轻原发免疫反应的

扩展。

3. 抗毒、抗休克作用：糖皮质激素能对抗细菌内毒素对机体的刺激反应，减轻细胞损伤，发挥保护机体的作用。

【药代动力学】氢化可的松琥珀酸钠盐为水溶性制剂，可用于静脉注射或作为迅速吸收的肌内注射剂而迅速发挥作用，其生物半衰期约为 100 分钟，血中 90%以上的氢化可的松与血浆蛋白相结合。本品主要经肝脏代谢，转化为四氢可的松和四氢氢化可的松，大多数代谢产物结合成葡萄糖醛酸酯，极少量以原形经尿排泄。

【药物相互作用】

1. 非甾体消炎镇痛药可加强其致溃疡作用。

2. 可增强对乙酰氨基酚的肝毒性。

3. 与两性霉素 B 或碳酸酐酶抑制剂合用，可加重低钾血症，长期与碳酸酐酶抑制剂合用，易发生低血钙和骨质疏松。

4. 与蛋白质同化激素合用，可增加水肿的发生率，使痤疮加重。

5. 与抗胆碱能药（如阿托品）长期合用，可致眼压增高。

6. 三环类抗抑郁药可使其引起的精神症状加重。

7. 与降糖药如胰岛素合用时，因可使糖尿病患者血糖升高，应适当调整降糖药剂量。

8. 甲状腺激素可使其代谢清除率增加，故甲状腺激素或抗甲状腺药与其合用，应适当调整后者的剂量。

9. 与避孕药或雌激素制剂合用，可加强其治疗作用和不良反应。

10. 与强心苷合用，可增加洋地黄毒性及心律紊乱的发生。

11. 与排钾利尿药合用，可致严重低血钾，并由于水钠潴留而减弱利尿药的排钠利尿效应。

12. 与麻黄碱合用，可增强其代谢清除。

13. 与免疫抑制剂合用，可增加感染的危险性，并可能诱发淋巴瘤或其他淋巴细胞增生性疾病。

14. 可增加异烟肼在肝脏代谢和排泄，降低异烟肼的血药浓度和疗效。

15. 可促进美西律在体内代谢，降低血药浓度。

16. 与水杨酸盐合用，可减少血浆水杨酸盐的浓度。

17. 与生长激素合用，可抑制后者的促生长作用。

【药物过量】可引起类肾上腺皮质功能亢进综合征。

【不良反应】糖皮质激素在应用生理剂量替代治疗时无明显不良反应，不良反应多发生在应用药理剂量时，而且与疗程、剂量、用药种类、用法及给药途径等有密切关系。常见不良反应有以下几类。

1. 长程使用可引起：医源性库欣综合征面容和体态、体重增加、下肢水肿、紫纹、易出血倾向、创口癒合不良、痤疮、月经紊乱、肱或股骨头缺血性坏死、骨质疏松或骨折（包括脊椎压缩性骨折、长骨病理性骨折）、肌无力、肌萎缩、低血钾综合征、胃肠道刺激（恶心、呕吐）、胰腺炎、消化性溃疡或穿孔，儿童生长受到抑制、青光眼、白内障、良性颅内压升高综合征、糖耐量减退和糖尿病加重。

2. 患者可出现精神症状：欣快感、激动、谵妄、不安、定向力障碍，也可表现为抑制。精神症状由易发生于患慢性消耗性疾病的人及以往有过精神不正常者。

3. 并发感染为肾上腺皮质激素的主要不良反应。以真菌、结核菌、葡萄球菌、变形杆菌、绿脓杆菌和各种疱疹病毒为主。

4. 糖皮质激素停药综合征。有时患者在停药后出现头晕、昏厥倾向、腹痛或背痛、低热、食欲减退、恶心、呕吐、肌肉或关节疼痛、头疼、乏力、软弱，经仔细检查如能排除肾上腺皮质功能减退和原来疾病的复燃，则可考虑为对糖皮质激素的依赖综合征。

5. 静脉迅速给予大剂量可能发生全身性的过敏反应，包括面部、鼻黏膜、眼睑肿胀，荨麻疹，气短，胸闷，喘鸣。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用氢化可的松琥珀酸钠	化学药	HZD04935

HY001605　氢化棕榈油

【性状及组成】本品为白色微细的粉末。可溶于热轻质矿物油、乙烷、三氯甲烷、石油醚和热异丙醇，不溶于水。

药物药理信息

【药理毒理】在药剂中起润滑、缓释等作用，是一种优良的片剂润滑剂，能大大地减小模壁摩擦和黏冲，也是一种缓释材料和软膏基质，用于制造缓释制剂，以及油膏剂、乳膏剂等。在日化工业中也广泛用于制备霜剂、香皂等产品。

【药物相互作用】本品与强酸和氧化剂有配伍变化。

【不良反应】本品安全无毒，无刺激作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
葛兰心宁软胶囊	中成药	ZC001783

HY001606 氢可酮

【外文名称】Hydrocodone

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】本品又名二氢可待因酮。为强效中枢性镇咳药，作用较可待因强。用于缓解刺激性咳嗽而伴有疼痛者的治疗。

HY001607 氢氯噻嗪

【其他名称】DCT、Dichlotride、Esidrix、Hydrodiuril、噢列特（Oretic）、Richlyn、双克、双氢克尿塞、双氢氯噻嗪、双氢氯消疾

【外文名称】Hydrochlorothiazide

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】6－氯－3,4－二氢－1,2,4－苯并噻二嗪－7－磺酰胺－1,1－二氧化物

【分子式】$C_7H_8ClN_3O_4S_2$

【分子量】297.74

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；无臭，味微苦。本品在丙酮中溶解，在乙醇中微溶，在水、三氯甲烷或乙醚中不溶；在氢氧化钠溶液中溶解。

熔点：本品的熔点为 265 ~ 273℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：利尿药，抗高血压药。

1．对水、电解质排泄的影响。①利尿作用，尿钠、钾、氯、磷和镁等离子排泄增加，而对尿钙排泄减少。本类药物作用机制主要抑制远端小管前段和近端小管（作用较轻）对氯化钠的重吸收，从而增加远端小管和集合管的 Na^+-K^+ 交换，K^+ 分泌增多。其作用机制尚未完全明了。本类药物都能不同程度地抑制碳酸酐酶活性，故能解释其对近端小管的作用。本类药还能抑制磷酸二酯酶活性，减少肾小管对脂肪酸的摄取和线粒体氧耗，从而抑制肾小管对 Na^+、Cl^- 的主动重吸收。②降压作用。除利尿排钠作用外，可能还有肾外作用机制参与降压，可能是增加胃肠道对 Na^+ 的排泄。

2．对肾血流动力学和肾小球滤过功能的影响。由于肾小管对水、Na^+ 重吸收减少，肾小管内压力升高，以及流经远曲小管的水和 Na^+ 增多，刺激致密斑通过管－球反射，使肾内肾素、血管紧张素分泌增加，引起肾血管收缩，肾血流量下降，肾小球入球和出球小动脉收缩，肾小球滤过率也下降。肾血流量和肾小球滤过率下降，以及对亨氏袢无作用，是本类药物利尿作用远不如袢利尿药的主要原因。

【药代动力学】口服吸收迅速但不完全，进食能增加吸收量，可能与药物在小肠的滞留时间延长有关。本药部分与血浆蛋白结合，另部分进入红细胞内。口服 2 小时起作用，达峰时间为 4 小时，作用持续时间为 6 ~ 12 小时。$t_{1/2}$为 15 小时，肾功能受损者延长。本药吸收后消除相开始阶段血药浓度下降较快，以后血药浓度下降明显减慢，可能是由于后阶段药物进入红细胞内有关。主要以原形由尿排泄。

【药物相互作用】

1．肾上腺皮质激素、促肾上腺皮质激素、雌激素、两性霉素 B（静脉用药），能降低本药的利尿作用，增加发生电解质紊乱的机会，尤其是低钾血症。

2．非甾体类消炎镇痛药尤其是吲哚美辛，能降低本药的利尿作用，与前者抑制前列腺素合成有关。

3．与拟交感胺类药物合用，利尿作用减弱。

4．考来烯胺能减少胃肠道对本药的吸收，故应在口服考来烯胺 1 小时前或 4 小时后服用本药。

5．与多巴胺合用，利尿作用加强。

6．与降压药合用时，利尿降压作用均加强。

7．与抗痛风药合用时，后者应调整剂量。

8．使抗凝药作用减弱，主要是由于利尿后机体血浆容量下降，血中凝血因子水平升高，加上利尿使肝脏血液供应改善，合成凝血因子增多。

9．降低降糖药的作用。

10．洋地黄类药物、胺碘酮等与本药合用时，应慎防因低钾血症引起的不良反应。

11．与锂制剂合用，因本药可减少肾脏对锂的清除，增加锂的肾毒性。

12．乌洛托品与本药合用，其转化为甲醛受抑制，疗效下降。

13．增强非去极化肌松药的作用，与血钾下降有关。

14．与碳酸氢钠合用，发生低氯性碱中毒机会增加。

【药物过量】应尽早洗胃，给予支持、对症处理，并密切随访血压、电解质和肾功能。

【不良反应】大多不良反应与剂量和疗程有关。

1．水、电解质紊乱所致的不良反应较为常见。低钾血症较易发生与噻嗪类利尿药排钾作用有关，

长期缺钾可损伤肾小管，严重失钾可引起肾小管上皮的空泡变化，以及引起严重快速性心律失常等异位心律。低氯性碱中毒或低氯、低钾性碱中毒，噻嗪类特别是氢氯噻嗪常明显增加氯化物的排泄。此外低钠血症亦不罕见，导致中枢神经系统症状及加重肾损害。脱水造成血容量和肾血流量减少亦可引起肾小球滤过率降低。上述水、电解质紊乱的临床常见反应有口干、烦渴、肌肉痉挛、恶心、呕吐和极度疲乏无力等。

2. 高糖血症。本药可使糖耐量降低，血糖升高，此可能与抑制胰岛素释放有关。

3. 高尿酸血症。干扰肾小管排泄尿酸，少数可诱发痛风发作。由于通常无关节疼痛，故高尿酸血症易被忽视。

4. 过敏反应，如皮疹、荨麻疹等，但较为少见。

5. 血白细胞减少或缺乏症、血小板减少性紫癜等亦少见。

6. 其他，如胆囊炎、胰腺炎、性功能减退、光敏感、色觉障碍等，但较罕见。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氨苯蝶啶氢氯噻嗪片	化学药	HZ000144
厄贝沙坦氢氯噻嗪胶囊	化学药	HZ000824
厄贝沙坦氢氯噻嗪片	化学药	HZ000825
复方氨苯蝶啶胶囊	化学药	HZ001027
复方地巴唑氢氯噻嗪胶囊	化学药	HZ001128
复方卡托普利缓释片	化学药	HZ001249
复方卡托普利片	化学药	HZ001250
复方卡托普利注射液	化学药	HZ001251
复方利血平氨苯蝶啶片	化学药	HZ001261
复方利血平片	化学药	HZ001262
复方利血平氢氯噻嗪片	化学药	HZ001263
复方硫酸双肼屈嗪片	化学药	HZ001277
复方罗布麻片Ⅰ	化学药	HZ001311
复方罗布麻片Ⅱ	化学药	HZ001312
复方三嗪芦丁片	化学药	HZ001365
复方双嗪利血平片	化学药	HZ001381
复方四嗪利血平片	化学药	HZ001398
复方替米沙坦片	化学药	HZ001404
复方盐酸阿米洛利片	化学药	HZ001454
复方依那普利片	化学药	HZ001470

续表

制剂名称	类别	序号
氯沙坦钾氢氯噻嗪片	化学药	HZ002533
氢氯噻嗪片	化学药	HZ002974
双嗪利血平片	化学药	HZ003269
缬沙坦氢氯噻嗪胶囊	化学药	HZ003790
缬沙坦氢氯噻嗪片	化学药	HZ003791
依那普利氢氯噻嗪片	化学药	HZ004456
降压避风片	中成药	ZC002564
溃疡宁片	中成药	ZC003120
罗已降压片	中成药	ZC003443
脉君安片	中成药	ZC003492
珍菊降压片	中成药	ZC007227

HY001608　氢吗啡醇

【外文名称】Hydromorphinol

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY001609　氢吗啡酮

【外文名称】Hydromorphone

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】本品又名二氢吗啡酮。为强效中枢性镇咳、镇痛药，作用较可待因强。其用途同吗啡，仅用于伴有疼痛的严重咳嗽，且经用可待因、二氢可待因酮无效者的治疗。

HY001610　氢溴酸苯甲托品

【外文名称】Benzatropine Hydrobromide

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第7册

【分子式】$C_{21}H_{25}NO \cdot HBr$

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氢溴酸苯甲托品片	化学药	HZ002975

HY001611 氢溴酸东莨菪碱

【外文名称】Scopolamine Hydrobromide

药物管理信息

【特殊管理分类】医疗用毒性药品

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】6β，7β－环氧－1aH，5aH－托烷－3α－醇（－）托品酸酯氢溴酸盐三水合物

【分子式】$C_{17}H_{21}NO_4 \cdot HBr \cdot 3H_2O$

【分子量】438.32

【性状及组成】本品为无色结晶或白色结晶性粉末；无臭；微有风化性。

本品在水中易溶，在乙醇中略溶，在三氯甲烷中极微溶解，在乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为 195～199℃，熔融时同时分解。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 50mg 的溶液，依法测定，比旋度为－24°至－27°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗胆碱药。

本品为一种外周作用较强的抗胆碱药，阻断 M 胆碱受体。本品的外周作用较阿托品强而维持时间短，对呼吸中枢有兴奋作用，中枢作用以抑制为主。能抑制腺体分泌，解除毛细血管痉挛，改善微循环，扩张支气管，解除平滑肌痉挛；对大脑有镇静、催眠作用，对呼吸中枢有兴奋作用。

本品具有中枢抑制作用，降低前庭神经、内耳功能，并抑制胃肠道蠕动，产生镇静、镇吐和抗眩晕症的作用。

【药代动力学】口服易吸收，$t_{1/2}$为 2.9 小时，分布容积为 1.7L/kg。可透过血脑屏障和胎盘。口服大部分被代谢，只有小部分以原形经肾排出。缓释剂型作用可持续 12 小时。

【药物相互作用】不能与抗抑郁、治疗精神病和抗帕金森病的药物合用。

【药物过量】儿童用药过量可出现抽搐，严重者致死。药物过量可用巴比妥或水合氯醛解救，或用拟胆碱药如新斯的明等对抗。

【不良反应】常有口干，眩晕，严重时瞳孔散大，皮肤潮红，灼热，兴奋，烦躁，谵语，惊厥，心跳加快。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
苯巴比妥东莨菪碱片	化学药	HZ000330
复方阿托品麻黄碱栓	化学药	HZ001023
复方氢溴酸东莨菪碱贴膏	化学药	HZ001347
复方盐酸克仑特罗栓	化学药	HZ001457
氢溴酸东莨菪碱片	化学药	HZ002976
氢溴酸东莨菪碱贴片	化学药	HZ002977
氢溴酸东莨菪碱眼膏	化学药	HZ002978
氢溴酸东莨菪碱注射液	化学药	HZ002979
晕宁软膏	中成药	ZC007175

HY001612 氢溴酸二氢加兰他敏

【其他名称】力可拉敏、Lycoramine

【外文名称】Dihydrogalanthamine Hydrobromide

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第 1 册

药物理化信息

【化学名】3，4－二氢加兰他敏氢溴酸盐

【分子式】$C_{17}H_{23}NO_3 \cdot HBr$

【分子量】370.29

【性状及组成】本品为从石蒜科植物红花石蒜、黄花石蒜、紫花石蒜或其他同科植物的鳞茎中分离得到的一种生物碱的氢溴酸盐。

本品为白色或几乎白色的结晶性粉末；无臭，味苦。

本品在水中易溶，在乙醇中略溶。

熔点：本品的熔点为 229～236℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】本品为乙酰胆碱酯酶抑制药。作用类似于加兰他敏，但较弱。对运动终板上的胆碱 N_2 受体也有直接兴奋作用，可改善神经肌肉间的传导。可透过血－脑屏障，故有一定的中枢拟胆碱作用。

【药物过量】用药过量或过敏患者偶可出现流涎、腹痛、心动过缓或眩晕等不良反应，但较加兰他敏轻。

【不良反应】治疗剂量偶致过敏反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氢溴酸二氢加兰他敏注射液	化学药	HZ002980

HY001613　氢溴酸高乌甲素

【外文名称】Lappaconite Hydrobromide

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（二部）·第5册

药物理化信息

【化学名】（1α，14α，16β）－20－乙基－1,14,16－三甲氧乌头烷－4，8，9－三醇 4－［2－（乙酰氨基）苯甲酸酯氢溴酸盐一水合物

【分子式】$C_{32}H_{44}N_2O_8 \cdot HBr \cdot H_2O$

【分子量】683.64

【性状及组成】本品为从毛茛科植物高乌头根中提取的一种生物碱（拉巴乌头碱）的氢溴酸盐。

本品为白色结晶、无臭、味苦。

本品在甲醇中溶解，在水中微溶，在乙醇中极微溶解，在三氯甲烷中几乎不溶。

熔点：本品熔点为217～221℃，熔融时同时分解。

比旋度：取本品，精密称定，制成每1ml中含20mg的甲醇溶液，依法测定，比旋度为＋29.5°至＋32.5°。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理学：本品为非成瘾性镇痛药，具有较强的镇痛作用。本品还具有局部麻醉、降温、解热和抗炎作用。本品与哌替啶相比镇痛效果相当，起效时间稍慢，而维持时间较长；镇痛作用为解热镇痛药氨基比林的7倍。

2．毒理学：本品动物试验无致畸胎作用。急性毒性试验结果：大鼠经口 LD_{50} 为20mg/kg；小鼠腹腔注射 LD_{50} 为9.1mg/kg，静脉注射 LD_{50} 为6.9mg/kg。

【不良反应】个别患者出现荨麻疹、心慌、胸闷、头晕等，停药后很快消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氢溴酸高乌甲素片	化学药	HZ002981
氢溴酸高乌甲素葡萄糖注射液	化学药	HZ002982
氢溴酸高乌甲素注射液	化学药	HZ002983
注射用氢溴酸高乌甲素	化学药	HZ004936

HY001614　氢溴酸后马托品

【外文名称】Homatropine Hydrobromide

药物管理信息

【特殊管理分类】医疗用毒性药品

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第1册

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末；无臭；遇光易变质。

本品在水中易溶，在乙醇中略溶，在乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为212～217℃，熔融时部分分解。

药物药理信息

【药理毒理】本品为合成的抗胆碱药，具有阻断乙酰胆碱的作用，使瞳孔括约肌和睫状肌麻痹引起散瞳和调节麻痹，比阿托品效力快而弱，适用于眼科检查和验光。

【不良反应】青光眼及青光眼可疑患者禁用。前列腺肥大患者慎用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氢溴酸后马托品眼膏	化学药	HZ002984

HY001615　氢溴酸加兰他敏

【外文名称】Galanthamine Hydrobromide

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】11－甲基－3－甲氧基－4a,5,9,10,11,12－六氢－6*H*－苯并呋喃［3a,2－*ef*］［2］苯并氮杂䓬－6－醇氢溴酸盐

【分子式】$C_{17}H_{21}NO_3 \cdot HBr$

【分子量】368.27

【性状及组成】本品为白色或几乎白色的结晶性粉末；无臭，味苦。本品在水中溶解，在乙醇中微溶，在丙酮、三氯甲烷、乙醚或苯中均不溶。

吸收系数：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每1ml中约含50μg的溶液，照紫外－可见分光光度法，在289nm的波长处测定吸光度，吸收系数（$E^{1\%}_{1cm}$）为79.6～86.2。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗胆碱酯酶药。

本品为乙酰胆碱酯酶抑制药。可透过血脑屏障，对抗非去极化肌松药。对运动终板上的 N_2 胆碱受体也有直接兴奋作用，可改善神经肌肉传导。并有一定的中枢拟胆碱作用。

【药物过量】用药过量或过敏患者偶可出现流

涎、腹痛、心动徐缓或眩晕等不良反应，症状严重时可皮下注射阿托品。

【不良反应】 治疗剂量偶致过敏反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氢溴酸加兰他敏胶囊	化学药	HZ002985
氢溴酸加兰他敏片	化学药	HZ002986
氢溴酸加兰他敏注射液	化学药	HZ002987

HY001616 氢溴酸山莨菪碱

【外文名称】 Anisodamine Hydrobromide

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

【分子式】 $C_{17}H_{23}NO_4 \cdot HBr$

【分子量】 386.29

【性状及组成】 本品为茄科植物山莨菪根中提取得到的一种生物碱的氢溴酸盐。现临床常用制剂为人工合成的山莨菪碱氢溴酸盐。为白色结晶或结晶性粉末；无臭。本品在水中极易溶解，在乙醇中易溶，在丙酮中微溶。

熔点：本品的熔点为 176～181℃。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 0.1g 的溶液，依法测定，比旋度应为 -9.0°至 -11.5°。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：抗胆碱药。

本品是作用于 M 胆碱受体的抗胆碱药，有明显外周抗胆碱作用，作用与阿托品相似或稍弱，能松弛平滑肌，解除微血管痉挛，故有解痉止痛和改善微循环作用。其扩瞳和抑制腺体分泌的作用是阿托品的 1/20～1/10。因不能通过血脑屏障，故中枢作用较弱。与阿托品相比，具有选择性较高、毒性及不良反应较低的优点。

【药代动力学】 本品的人体药代动力学参数尚未见研究。动物实验中，给大鼠静脉注射后，15 分钟以肾脏的含量最高，30 分钟以胰腺的含量最高。消除半衰期为 40 分钟，38.8%药量从尿中排出。

【药物相互作用】

1. 与甲氧氯普胺、多潘立酮等同用，各自的作用降低。

2. 本品可延长胃排空时间，故能增加很多药物的吸收率而产生不良反应。

【药物过量】 用药剂量过大可出现阿托品样中毒症状，中毒解救可应用 1%匹鲁卡品 0.25～0.5ml，每隔 15～20 分钟皮下注射 1 次。

【不良反应】 口干、面红、轻度扩瞳、视近物模糊等，个别患者有心率加快及排尿困难，多在 1～3 小时消失，长期应用无蓄积中毒。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氢溴酸山莨菪碱片	化学药	HZ002988
氢溴酸山莨菪碱注射液	化学药	HZ002989

HY001617 氢溴酸西酞普兰

【其他名称】 西酞普兰

【外文名称】 Citalopram Hydrobromide

药物理化信息

【化学名】 1－（3－二甲氨丙基）－1－（4－氟代苯基）－1.3－二氢异苯并呋喃－5－腈，氢溴酸盐

【分子式】 $C_{10}H_{22}BrFN_2O$

【分子量】 405.35

【性状及组成】 本品的片剂为白色椭圆形薄膜衣片。

药物药理信息

【药理毒理】 西酞普兰是一种很强的、选择性 5－羟色胺摄取抑制剂，具有抗抑郁作用。特别是这种药物对胆碱能毒蕈碱受体、组织胺受体和 α－肾上腺素能受体无抑制作用。若这些受体被抑制，则会产生很多抗抑郁药物引起的不良反应。西酞普兰对内源性和非内源性抑郁的病人同样有效。其抗抑郁作用通常在 2～4 周后建立。本药不影响心脏传导系统和血压。这一点对于老年病人尤为重要。另外，也不影响血液、肝及肾等系统。本药少见的不良反应和最轻度镇静的特性使它特别适用于长期治疗。而且，本药既不会导致体重增加，也不会强化乙醇的作用。

【药代动力学】 西酞普兰的口服生物利用度大约为 80%。服用每日用量后，可在 2～4 小时内达到西酞普兰的最高血浆水平。蛋白结合率低于 80%，药物和代谢产物可穿过胎盘屏障，而在胎儿的分布则与母体相似。哺乳期妇女服用本药会有少量药物及其代谢物通过母乳进入婴儿体内。生物半衰期大约为 36 小时。通过尿液及粪便排泄。

【药物相互作用】 同时服用单胺氧化酶抑制剂可导致高血压危象，服用单胺氧化酶抑制剂的病人不可同时使用本药。停用单胺氧化酶抑制 14 天后方可使用本药。但如使用半衰期的可逆单胺氧化酶抑制剂，如 moclobemide，则可于停药后 1 天使用。

【药物过量】

1. 症状：服药 600mg 时可出现疲乏、无力、嗜睡、头晕、手颤和恶心。最高服药量记录为 2000mg，病人在木僵及呼吸困难状态下进院，但无心脏中毒迹象。病人很快康复。

2. 治疗：对症治疗和支持疗法。口服过量药物后尽快洗胃。插管以保持呼吸道通畅。缺氧时予吸氧，惊厥出现时予安全。建议给予 24 小时医疗监护。

【不良反应】所观察到本药的不良反应通常很少，很轻微，且短暂。最常见的有：恶心、出汗增多、流涎减少、头痛和睡眠时间缩短。通常在治疗开始的第一或第二周时比较明显，随着抑郁状态的改善一般都逐渐消失。在稀有个案中曾观察到癫痫发作。在已存心搏缓慢病人中，心搏过缓可使治疗更复杂。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氢溴酸西酞普兰胶囊	化学药	HZ002990
氢溴酸西酞普兰片	化学药	HZ002992

HY001618　氢溴酸烯丙吗啡

【外文名称】Nalorphine Hydrobromide

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶性粉末；无臭；在空气中色渐变暗。

本品在水中溶解，在乙醇中略溶，在三氯甲烷或乙醚中几乎不溶；在稀碱溶液中溶解。

熔点：本品的熔点为 257 ~ 261℃，熔融时同时分解。

比旋度：取本品，精密称定，加甲醇溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为 - 100°至 - 105°。

药物药理信息

【药理毒理】本品属双向类药，有拮抗阿片类药的作用，以拮抗 μ 受体为主，且对 δ 受体有强烈的激动作用，也有一定的镇痛和抑制呼吸作用。由于小量时即可有困倦欲睡、微弱激动、急躁、缩瞳等不良反应，临床不作镇痛用，而利用它可拮抗阿片受体激动药的作用（包括镇痛、欣快感、呼吸抑制、缩瞳等作用）。

【药代动力学】口服吸收很差，皮下或静脉注射很快进入脑组织，皮下注射后 90 分钟脑内浓度为相同剂量吗啡的 3 ~ 4 倍。一般 1 分钟或 2 ~ 3 分钟内即起效，消除半衰期为 2 ~ 3 小时，随着用量加大而延长。在肝内代谢，经肾排泄，用量的 2% ~ 6% 在尿中呈原形排出。可通过胎盘屏障进入胎儿。

【不良反应】大剂量可产生发音困难、缩瞳、倦怠和发汗等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氢溴酸烯丙吗啡注射液	化学药	HZ002993

HY001619　氢溴酸右美沙芬

【其他名称】美沙芬、氢溴酸右甲吗喃、Romilar、Tussade

【外文名称】Dextromethorphan Hydrobromide

药物理化信息

【化学名】3 - 甲氧基 - 17 - 甲基 - 9α、13α、14α - 吗啡喃氢溴酸盐水合物

【分子式】$C_{18}H_{25}NO \cdot HBr \cdot H_2O$

药物药理信息

【药理毒理】本品具有中枢性镇咳作用，主要抑制延脑的咳嗽中枢而发挥作用。其镇咳作用强度与可待因相似或较强，治疗剂量时不抑制呼吸中枢，无成瘾性，亦无镇痛作用。

【药代动力学】本品从胃肠道吸收完全。口服后 5 小时左右血药浓度达峰值 5.0 ± 1.4ng/ml。消除半衰期为 7.9 ± 1.75 小时。本品在进入体循环前通过肠壁、门脉及肝（有首过效应）。血浆中原形药物（右吗喃）浓度很低。有 3 - 甲氧吗啡烷、3 - 羟 - 17 - 甲吗啡烷、3 - 羟吗啡烷三个主要代谢产物，并有较大的个体差异。3 - 甲氧吗啡烷在血浆中的浓度最高，是主要活性成分。其他两个代谢产物在血浆中的浓度很低，药理作用较微甚至可不计。单剂量给药及连续服药 7 天的代谢过程基本相同。8 名健康受试者，一次本品滴鼻 7.5mg（10 滴），血浓度达峰时间为 20.9 ± 6.4 分，半衰期为 176.1 ± 62.2 分，峰浓度为 7.9 ± 3.2ng/ml，曲线下面积为 1002.3 ± 293.1ng·min/ml。

【药物相互作用】

1. 不得与抗精神抑郁药物并用。

2. 本品不宜与乙醇及其他中枢神经系统抑制药物并用，因可增强对中枢的抑制作用。

3. 如正在服用其他药品，使用本品前请咨询医师或药师。

4. 不宜同时服用单胺氧化酶抑制剂。

【药物过量】儿童过量中毒可用纳洛酮解救。

【不良反应】偶有头晕、轻度嗜睡、口干、便秘

及恶心等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氨酚麻美糖浆	化学药	HZ000174
氨酚美伪麻片/苯酚伪麻片	化学药	HZ000175
氨酚伪麻美芬氨麻美敏Ⅱ片	化学药	HZ000188
氨酚伪麻美芬片	化学药	HZ000189
氨酚伪麻美芬片（Ⅱ）	化学药	HZ000190
氨酚伪麻美芬片（Ⅲ）	化学药	HZ000191
氨酚伪麻美芬片Ⅲ/氨麻美敏片Ⅲ	化学药	HZ000192
氨麻苯美片	化学药	HZ000240
氨麻美敏胶囊Ⅱ	化学药	HZ000241
氨麻美敏口服溶液	化学药	HZ000242
氨麻美敏片	化学药	HZ000243
氨麻美敏片（Ⅱ）	化学药	HZ000244
氨麻美敏片Ⅲ	化学药	HZ000245
氨愈美麻片	化学药	HZ000251
酚麻美敏混悬液	化学药	HZ000922
酚麻美敏胶囊［夜用］	化学药	HZ000923
酚麻美敏咀嚼片	化学药	HZ000924
酚麻美敏颗粒	化学药	HZ000925
酚麻美敏口服溶液（成人用）	化学药	HZ000926
酚麻美敏口服溶液（小儿用）	化学药	HZ000927
酚麻美软胶囊	化学药	HZ000928
酚美愈伪麻分散片	化学药	HZ000929
酚美愈伪麻口服溶液	化学药	HZ000930
复方氨酚甲麻口服液	化学药	HZ001031
复方氨酚美沙芬片（Ⅰ）	化学药	HZ001032
复方氨酚美沙糖浆	化学药	HZ001033
复方氢溴酸右美沙芬胶囊	化学药	HZ001348
复方氢溴酸右美沙芬糖浆	化学药	HZ001349
复方沙芬那敏糖浆	化学药	HZ001370
美芬伪麻咀嚼片	化学药	HZ002629
美酚伪麻胶囊	化学药	HZ002630
美酚伪麻片	化学药	HZ002631
美敏伪麻咀嚼片	化学药	HZ002636
美敏伪麻口服液（1）	化学药	HZ002637
美敏伪麻口服液（2）	化学药	HZ002638
美扑伪麻咀嚼片	化学药	HZ002640

续表

制剂名称	类别	序号
美羧伪麻颗粒	化学药	HZ002647
美息伪麻拉明分散片	化学药	HZ002654
美息伪麻软胶囊	化学药	HZ002655
美愈伪麻胶囊	化学药	HZ002659
美愈伪麻颗粒	化学药	HZ002660
美愈伪麻口服溶液	化学药	HZ002661
氢溴酸右美沙芬滴鼻液	化学药	HZ002994
氢溴酸右美沙芬分散片	化学药	HZ002995
氢溴酸右美沙芬缓释片	化学药	HZ002996
氢溴酸右美沙芬胶囊	化学药	HZ002997
氢溴酸右美沙芬咀嚼片	化学药	HZ002998
氢溴酸右美沙芬颗粒	化学药	HZ002999
氢溴酸右美沙芬口服液	化学药	HZ003000
氢溴酸右美沙芬片	化学药	HZ003001
氢溴酸右美沙芬溶液	化学药	HZ003002
氢溴酸右美沙芬软胶囊	化学药	HZ003003
氢溴酸右美沙芬糖浆	化学药	HZ003004
双分伪麻/酚麻美敏胶囊	化学药	HZ003222
双分伪麻胶囊	化学药	HZ003223
双酚伪麻糖浆	化学药	HZ003224
小儿美敏伪麻口服液	化学药	HZ003764
小儿伪麻美芬滴剂	化学药	HZ003780
小儿愈美那敏溶液	化学药	HZ003782
右美沙芬缓释混悬液	化学药	HZ004586
右美沙芬愈创甘油醚糖浆	化学药	HZ004587
愈美分散片	化学药	HZ004623
愈美缓释片	化学药	HZ004624
愈美甲麻敏糖浆	化学药	HZ004625
愈美胶囊	化学药	HZ004626
愈美颗粒	化学药	HZ004627
愈美片	化学药	HZ004628

HY001620 氢溴酸樟柳碱

【外文名称】Anisodine Hydrobromide

药物药理信息

【药理毒理】本品为抗胆碱药，有对抗震颤、解痉、平喘、抑制唾液分泌、散瞳等以及对抗有机磷中毒农药的作用，作用强度较阿托品为弱。其毒性

较其他托品类抗胆碱药物为小。用于治疗血管性头痛、视网膜血管痉挛、中心性视网膜病变、缺血性视神经病变、急性瘫痪、震颤麻痹、支气管哮喘、晕动病、有机磷农药中毒等。

通过家兔原发性和继发性眼缺血以及眼血管阻塞性缺血的动物模型试验，结果表明：本品可以加速恢复眼缺血区血管活性物质的正常水平，缓解血管痉挛，维持脉络膜血管的正常紧张度及舒缩功能，增加血流量，改善血流供应，促进缺血组织迅速恢复。

【不良反应】可有口干、头昏、视力模糊、面红、疲乏等反应，偶见暂时性黄视、意识模糊、排尿困难等，减量或停药后可自行消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方四环素泼尼松膜	化学药	HZ001397
复方樟柳碱注射液	化学药	HZ001485
氢溴酸樟柳碱注射液	化学药	HZ003007
三维樟柳碱膜	化学药	HZ003166

HY001621　氢氧化钙

【外文名称】Calcium Hydroxide

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（二部）·第5册

药物理化信息

【化学名】氢氧化钙

【分子式】$Ca(OH)_2$

【分子量】74.10

【性状及组成】本品为白色粉末；无臭，味微苦。取本品适量，加3～4倍重量的水，搅拌，使成均匀的乳浆，放置，沉淀后，澄明的上层液显碱性反应。

本品在甘油或糖浆中溶解，在水中微溶，在乙醇中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：收敛药。本品制成溶液用于烫伤或灼伤。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氢氧化钙糊剂	化学药	HZ003008

HY001622　氢氧化钾

【其他名称】苛性钾

【外文名称】Potassium Hydroxide

【性状及组成】本品为白色或近白色的熔体；呈小丸状、薄片状、棒状及其他形状；脆、硬，具有结晶断裂面。氢氧化钾具有吸湿性和潮解性；暴露在空气中时，能迅速吸收二氧化碳和水，生成碳酸钾。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：碱化剂。

在临床治疗上利用本品强烈的灼烧性用于除去疣，以及制成2.5%甘油溶液用作表皮溶剂。在药剂制备中用作碱化剂、pH调节剂和中和剂，广泛用于各种液体制剂和半固体制剂的制备，也是制造螺内酯、黄体酮、丙酸睾丸素等多种药物的原料。本品也是食品添加剂，在食品制造中作碱性剂。此外，在日化、纺织、印染等工业也有广泛用途，是制造冷霜、洗发膏、洗涤剂、人造纤维等产品的主要原料之一。

【药物相互作用】氢氧化钾是强酸，与任何容易发生水解或氧化的化合物均不相容。不应贮藏在玻璃或铝制容器中。能与酸类、酯类、醚类发生反应，特别是在水溶液中。

【不良反应】一般认为是安全的，每日允许摄入量不作限制性规定（FAO/WHO，1985）。但具有极强的腐蚀性和灼烧性，不得与皮肤接触，严防误入眼内。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方氨基酸注射液（17种氨基酸）	化学药	HZ001061
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅰ）	化学药	HZ001064

HY001623　氢氧化铝

【外文名称】Aluminium Hydroxide

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】氢氧化铝

【分子式】$Al(OH)_3$

【分子量】78.00

【性状及组成】本品为白色无晶形粉末；无臭，无味。本品在水或乙醇中不溶；在稀无机酸或氢氧化钠溶液中溶解。

药物药理信息

【药理毒理】对胃酸的分泌无直接影响，和胃内已存在的胃酸起中和或缓冲的化学反应，可导致胃内 pH 升高，从而使胃酸过多的症状得以缓解。其中和酸的能力比含镁制剂和碳酸钙为低，而比碳酸铝、碳酸双羟铝钠为高。另外，铝离子在肠内与磷酸盐结合成不溶解的磷酸铝自粪便排出。

【药代动力学】极少量的本品在胃内转变成可溶性的氯化铝被吸收，并从尿中排泄，大部分铝离子在肠内结合成不溶解的铝盐如：磷酸盐、碳酸盐及脂肪酸盐，自粪便排出。本品起效缓慢，在胃内作用时效的长短与胃排空快慢有关。空腹服药作用可持续 20～30 分钟，餐后 1～2 小时服药时效可能延长到 3 小时。

【药物相互作用】

1．服药 1～2 小时内应避免摄入其他药物，因可能与氢氧化铝结合而降低吸收率，影响疗效。

2．与西咪替丁、雷尼替丁同用，可使后者吸收减少，一般不提倡两药在 1 小时内同用。

3．本品含多价铝离子，可与四环素类形成络合物而影响其吸收，故不宜合用。

4．可通过多种机制干扰地高辛、华法林、双香豆素、奎宁、奎尼丁、氯丙嗪、普萘洛尔、吲哚美辛、异烟肼、维生素类及巴比妥类的吸收或消除，使上述药物的疗效受到影响，应尽量避免同时使用；

5．与肠溶片同用，可使肠溶衣加快溶解，对胃和十二指肠有刺激作用。

【不良反应】

1．可引起恶心、呕吐、便秘等症状，长期大剂量服用，可致严重便秘，甚至粪结块引起肠梗阻。

2．老年人长期服用，可影响肠道吸收磷酸盐，可导致骨质疏松，铝盐吸收后沉积于脑，可引起老年性痴呆。

3．肾衰竭患者长期服用可引起骨软化、脑病、痴呆及小细胞性贫血等，特别是对接受血液透析的患者，可产生透析性痴呆，表现为肌肉疼痛抽搐、神经质或烦躁不安、味觉异常、呼吸变慢以及极度疲乏无力等症状。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
二甲硅油片	化学药	HZ000837
复方氨茶碱片	化学药	HZ001028
复方颠茄氢氧化铝片	化学药	HZ001136
复方颠茄氢氧化铝散	化学药	HZ001137
复方木香铝镁片	化学药	HZ001322

续表

制剂名称	类别	序号
复方尿囊素片	化学药	HZ001327
复方氢氧化铝镁片	化学药	HZ001350
复方氢氧化铝片	化学药	HZ001351
复方维生素 U 胶囊	化学药	HZ001423
复方维生素 U 片	化学药	HZ001424
复方维 U 颠茄铋片	化学药	HZ001426
复方溴丙胺太林铝镁片	化学药	HZ001448
复方延胡索氢氧化铝片	化学药	HZ001452
盖胃平片	化学药	HZ001534
甘镁颠茄片	化学药	HZ001561
海藻酸铝镁颗粒	化学药	HZ001679
铝镁颠茄片	化学药	HZ002459
铝镁混悬液	化学药	HZ002460
铝镁咀嚼片	化学药	HZ002462
氢氧化铝凝胶	化学药	HZ003009
氢氧化铝片	化学药	HZ003010
神黄钠铝胶囊	化学药	HZ003195
维 U 颠茄铝胶囊	化学药	HZ003586
维 U 颠茄铝胶囊Ⅱ	化学药	HZ003587
维 U 颠茄铝胶囊Ⅲ	化学药	HZ003588
维 U 颠茄铝镁胶囊	化学药	HZ003589
维 U 颠茄铝镁片	化学药	HZ003590
维 U 颠茄铝镁片Ⅱ	化学药	HZ003591
愈创维林那敏片	化学药	HZ004613
苍莲感冒片	中成药	ZC000474
穿心莲内酯胶囊	中成药	ZC000629
复方陈香胃片	中成药	ZC001293
龙七胃康片	中成药	ZC003358
神曲胃痛片	中成药	ZC004945
胃乐胶囊	中成药	ZC005709
胃痛宁片	中成药	ZC005737
胃友新片	中成药	ZC005755
正胃片	中成药	ZC007295

HY001624 氢氧化镁

【外文名称】Magnesium Hydroxide

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第6册

【分子式】$Mg(OH)_2$

【分子量】58.32

药物药理信息

【药理毒理】为常用抗酸药，口服后能中和胃酸而降低胃内容物酸度，从而解除胃酸对胃、十二指肠黏膜的侵蚀和对溃疡面的刺激，并降低胃蛋白酶活性，发挥缓解疼痛和促进愈合的作用。

【药代动力学】口服吸收缓慢，约10%的镁自肠道吸收，作用时效一般在2～8小时开始，持续时间长，但中和胃酸能力低。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
法莫替丁钙镁咀嚼片	化学药	HZ0000874
复方法莫替丁咀嚼片	化学药	HZ0001160
复方氢氧化铝镁片	化学药	HZ0001350
复方维生素U片	化学药	HZ0001424
铝镁混悬液	化学药	HZ0002460
铝镁咀嚼片	化学药	HZ0002462

HY001625　氢氧化钠

【其他名称】火碱、苛性钠、烧碱

【外文名称】Sodium Hydroxide

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】氢氧化钠

【分子式】NaOH

【分子量】40.00

【性状及组成】本品为熔制的白色干燥颗粒、块、棒或薄片；质坚脆，折断面显结晶性；引湿性强，在空气中易吸收二氧化碳。

本品在水中极易溶解，在乙醇中易溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料，碱化剂。

本品为基本化工原料应用于多种工业，在药剂中主要用作碱化剂和pH调节剂。

【药物相互作用】遇酸可成盐，加入有机碱的盐溶液会生成沉淀。

【不良反应】本品具腐蚀性，不能直接与皮肤、眼睛接触，也不能直接入口。每日允许摄入量不作限制性规定（FAO/WHO，1958）。一般公认是安全的。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方氨基酸注射液（17种氨基酸）	化学药	HZ0001061
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅰ）	化学药	HZ0001064
琥珀酰明胶注射液	化学药	HZ0001707
加香甲酚皂溶液	化学药	HZ0001820
右旋糖酐70滴眼液	化学药	HZ0004594

HY001626　琼脂

【其他名称】琼胶、洋菜

【外文名称】Agar

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

【性状及组成】本品系自石花菜或其他数种红藻类植物中浸出并经脱水干燥的黏液质。

线形琼脂呈细长条状，类白色或淡黄色；半透明，表面皱缩，微有光泽，质轻软而韧，不易折断；完全干燥后，则脆而易碎；无臭，味淡。

粉状琼脂为鳞片状粉末，无色或淡黄色；用冷水装置，在显微镜下观察，为无色的不规则多角形黏液质碎片；无臭，味淡。

本品在沸水中溶解，在冷水中不溶，但能膨胀成胶块状；水溶液显中性反应。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料，赋形剂。

本品具有胶凝、增稠、助悬、稳定、成膜、乳化等作用。在药剂中用作胶凝剂、增稠剂、助悬剂、乳化剂和乳化稳定剂等，用作制备乳剂、合剂、冻胶剂等，也用于制备细菌培养基。本品也是食品添加剂，用于制备果酱、果冻、饮料、糖果、糕点等。

【药物相互作用】本品类似于其他（树）胶类，用乙醇脱水则可生成沉淀；与鞣酸配伍也可以使本品沉淀；加入电解质可引起部分脱水并使胶液黏度减低。

【不良反应】每日摄取量未作限制性规定（FAD/WHO，1985）一般公认是安全的。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
龟苓膏	中成药	ZC001994

HY001627　秋水仙碱

【其他名称】Aquacolchin、COLC、Colchineos、

Colcin、Colgout、秋水仙素

【外文名称】 Colchicine

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 *N* -（5,6,7,9 - 四氢 - 1,2,3,10 - 四甲氧基 - 9 - 氧 - 苯并［*a*］庚间三烯并庚间三烯 - 7 - 基）乙酰胺

【分子式】 $C_{22}H_{25}NO_6$

【分子量】 399.44

【性状及组成】 本品为百合科植物丽江山慈菇的球茎中提取得到的一种生物碱。

本品为淡黄色结晶性粉末；无臭，遇光色变深。本品在乙醇或三氯甲烷中易溶，在水中溶解（但在一定浓度的水溶液中能形成半水合物的结晶析出），在乙醚中极微溶解。

熔点：本品的熔点为 148 ~ 153℃，熔融时同时分解。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中含 10mg 的溶液，依法测定，按无溶剂的干燥品计算，比旋度为 - 425°至 - 450°。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：抗痛风药，抗肿瘤药。

秋水仙碱通过：① 和中性粒细胞微管蛋白的亚单位结合而改变细胞膜功能，包括抑制中性白细胞的趋化、黏附和吞噬作用；② 抑制磷脂酶 A2，减少单核细胞和中性白细胞释放前列腺素和白三烯；③ 抑制局部细胞产生白介素 - 6 等，从而达到控制关节局部的疼痛、肿胀及炎症反应。秋水仙碱不影响尿酸盐的生成、溶解及排泄，因而无降血尿酸作用。急性痛风性关节炎于口服后 12 ~ 24 小时起效，90% 的患者在服药 24 ~ 48 小时疼痛消失。

急性毒性试验结果：大鼠静脉注射 LD_{50} 为 1.6mg/kg；小鼠静脉注射 LD_{50} 为 4.13mg/kg。

【药代动力学】 口服后在胃肠道迅速吸收，血浆蛋白结合率低，仅为 10% ~ 34%，服药后 0.5 ~ 2 小时血药浓度达峰值。口服 2mg 的血药峰值为 2.2ng/ml。在分离出的中性粒细胞内的药物浓度高于血浆浓度并可维持 10 天之久。本品在肝内代谢，从胆汁及肾脏（10% ~ 20%）排出。肝病患者从肾脏排泄增加。停药后药物排泄持续约 10 天。

【药物相互作用】

1. 本品可导致可逆性的维生素 B_{12} 吸收不良。

2. 本品可使中枢神经系统抑制药增效，拟交感神经药的反应性加强。

【药物过量】 本品是细胞有丝分裂毒素，毒性大，一旦过量缺乏解救措施，须格外注意药物过量。

【不良反应】 与剂量大小有明显相关性，口服较静脉注射安全性高。

1. 胃肠道症状：腹痛、腹泻、呕吐及食欲减退为常见的早期不良反应，发生率可达 80%，严重者可造成脱水及电解质紊乱等表现。长期服用者可出现严重的出血性胃肠炎或吸收不良综合征。

2. 肌肉、周围神经病变：有近端肌无力和（或）血清肌酸磷酸激酶增高。在肌细胞受损同时可出现周围神经轴突性多神经病变，表现为麻木、刺痛和无力。肌神经病变并不多见，往往在预防痛风而长期服用者和有轻度肾功能不全者出现。

3. 骨髓抑制：出现血小板减少，中性细胞下降，甚至再生障碍性贫血，有时可危及生命。

4. 休克：表现为少尿、血尿、抽搐及意识障碍。死亡率高，多见于老年人。

5. 致畸：文献报道 2 例 Down 综合征婴儿的父亲均为因家族性地中海热而有长期服用秋水仙碱史者。

6. 其他：脱发、皮疹、发热及肝损害等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
秋水仙碱片	化学药	HZ003015

HY001628 巯嘌呤

【外文名称】 Mercaptopurine

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 6 - 嘌呤硫醇一水合物

【分子式】 $C_5H_4N_4S \cdot H_2O$

【分子量】 170.19

【性状及组成】 本品为黄色结晶性粉末；无臭，味微甜。本品在水或乙醇中极微溶解，在乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：抗肿瘤药。

属于抑制嘌呤合成途径的细胞周期特异性药物，化学结构与次黄嘌呤相似，因而能竞争性地抑制次黄嘌呤的转变过程。本品进入体内，在细胞内必须由磷酸核糖转移酶转为 6 - 巯基嘌呤核糖核苷酸后，方具有活性。其主要的作用环节有二：①通过负反馈作用抑制酰胺转移酶，因而阻止 1 - 焦磷酸 - 5 - 磷酸核糖转为 1 - 氨基 - 5 - 磷酸核糖的过程，干扰了嘌呤核苷酸合成的起始阶段。②抑制复杂的嘌呤

间的相互转变，即能抑制次黄嘌呤核苷酸转为腺嘌呤核苷酸及次黄嘌呤核苷酸转为黄嘌呤核苷酸、鸟嘌呤核苷酸的过程，同时本品还抑制辅酶Ⅰ的合成，并减少了生物合成DNA所必需的脱氧三磷酸腺苷及脱氧三磷酸鸟苷，因而肿瘤细胞不能增殖，本品对处于S增殖周期的细胞较敏感，除能抑制细胞DNA的合成外，对细胞RNA的合成亦有轻度的抑制作用。用巯嘌呤治疗白血病常产生耐药现象，其原因可能是体内出现了突变的白血病细胞株，因而失去了将巯嘌呤变为巯嘌呤核糖核苷酸的能力。

【药代动力学】口服胃肠道吸收不完全，约50%。广泛分布于体液内。血浆蛋白结合率约为20%。本品吸收后的活化分解代谢过程主要在肝脏内进行，在肝内经黄嘌呤氧化酶等氧化及甲基化作用后分解为硫尿酸等而失去活性。静脉注射后的半衰期约为90分钟，约半量经代谢后在24小时即迅速从肾脏排泄，其中7%～39%以原药排出。

【药物相互作用】

1．与别嘌呤同时服用时，由于后者抑制了巯嘌呤的代谢，明显地增加巯嘌呤的效能与毒性。

2．本品与对肝细胞有毒性的药物同时服用时，有增加对肝细胞毒性的危险。

3．本品与其他对骨髓有抑制的抗肿瘤药物或放射治疗合并应用时，会增强巯嘌呤效应，因而必须考虑调节本品的剂量与疗程。

【不良反应】

1．较常见的为骨髓抑制：可有白细胞及血小板减少。

2．肝脏损害：可致胆汁郁积出现黄疸。

3．消化系统：恶心、呕吐、食欲减退、口腔炎、腹泻，但较少发生，可见于服药量过大的患者。

4．高尿酸血症：多见于白血病治疗初期，严重的可发生尿酸性肾病。

5．间质性肺炎及肺纤维化少见。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
巯嘌呤片	化学药	HZ003016

HY001629　曲安奈德

【其他名称】Acetospan、Adcortyl A、Aristocort Acetonide、Aristoderm、丙酮氟羟泼尼松龙、丙酮去炎松、丙酮缩去炎松、丙酮缩去炎舒松、丙酮特安皮质醇、丙炎松、氟羟氢化泼尼松缩丙酮、康灯乐、Kenacort－A、Kenalog In Orabase（Kenalog in Orabase）、康纳可A、康宁克通A、康纳乐、宁康、曲安舒松、曲安缩松、去炎松A、确炎松－A、去炎舒松、确炎舒松A、去炎松缩酮、Rineton、Rineton A、Tramacin、Triacet、Triamcinolon Acetonidum、Triamcinolonum Acetonidum、Triamonlnde 40、Trymex、Vetalog

【外文名称】Triamcinolone Acetonide

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】9－氟－11β，21－二羟基－16α，17［（1－甲基亚乙基）双（氧）］－孕甾－1,4－二烯－3,20－二酮

【分子式】$C_{24}H_{31}FO_6$

【分子量】434.48

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末；无臭。

本品在丙酮中溶解，在三氯甲烷中略溶，在乙醇中微溶，在水中极微溶解。

比旋度：取本品，精密称定，加二氧六环溶解并定量稀释制成每1ml中含10mg的溶液，依法测定，比旋度为＋101°至＋107°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：肾上腺皮质激素类药。

抗炎抗过敏作用较强且持久。本品潴钠作用微弱，在皮质激素外用制剂中，本品属中效类。本品4mg的抗炎活性约相当于5mg的泼尼松龙或相当于20mg氢化可的松。

【药代动力学】肌内注射在数小时内起效，经1～2日达最大效应，作用可维持2～3周。

单剂量鼻腔给予健康志愿者和患者曲安奈德鼻喷雾剂220mg。研究结果表明曲安奈德被吸收入血液的量很少，12小时内的平均血药浓度低于0.06ng/ml，24小时血药浓度低于仪器能够检测的限度。剂量从110μg到440μg时的$AUC_{0\to\infty}$为1.4到4.7ng/（h·ml）。给予440 mg的C_{max}和AUC比给予110mg和220mg的增加很少。本品治疗过敏性鼻炎的作用应为局部作用。

【药物相互作用】曲安奈德鼻喷雾剂与其他皮质激素如去炎松同用时，可能增加对下丘脑－垂体－肾上腺轴的抑制作用，因此对正接受或最近接受去炎松或其他皮质激素治疗的患者，使用曲安奈德鼻喷雾剂治疗时应注意。

【药物过量】如果过量用药，全身性肾上腺皮质激素效果如高类固醇和肾抑制可能发生。一旦发生，应该逐渐停止本品的使用。

【不良反应】

1．长期外用，可引起皮肤萎缩、毛细血管扩

张、痤疮和毛囊炎等，此类不良反应大于氢化可的松。

2. 偶尔可引起接触性皮炎。

3. 皮损内局部注射可引起皮肤萎缩、出血或溃疡。

4. 关节腔内注射可能引起关节损害。

5. 长期用于眼部可引起眼内压升高。

6. 用于破损皮肤，易吸收引起全身性作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
曲安奈德鼻喷雾剂	化学药	HZ003017
曲安奈德口腔软膏	化学药	HZ003018
曲安奈德益康唑乳膏	化学药	HZ003020
曲安奈德注射液	化学药	HZ003022

HY001630 曲安西龙

【其他名称】ADCORTYL、ARISTOCORT、Fluoxyprednisolone、氟羟强的松龙、氟羟氢化泼尼松、LEDERCORT、去炎松、Triamcortisone

【外文名称】Triamcinolone

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】9α－氟－11β，16α，17α，21－四羟基孕甾－1,4－二烯－3,20－二酮

【分子式】$C_{21}H_{27}FO_6$

【分子量】394.44

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶性粉末；无臭。

本品在二甲基甲酰胺中易溶，在甲醇或乙醇中微溶，在水或三氯甲烷中几乎不溶。

比旋度 取本品，精密称定，加二甲基甲酰胺溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 2mg 的溶液，依法测定，比旋度为 +65°至 +72°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：肾上腺皮质激素类药。

本品为糖皮质激素类药物。对免疫器官的影响：糖皮质激素可使胸腺、淋巴结和脾脏重量减轻，体积缩小，使外周血液和骨髓中淋巴细胞迅速减少。影响淋巴细胞的分布：小鼠应用氢化可的松后，T 细胞向骨髓转移。在临床亦可见到用药后淋巴细胞重分布现象，炎症渗出物中单核－巨噬细胞明显减少，主要由于糖皮质激素抑制了它们的转移，并非由于细胞溶解。对细胞免疫的作用：糖皮质激素抑制 T 淋巴细胞对有丝分裂原 ConA、PHA 及抗原引起的增殖反应，还可抑制同种混合淋巴细胞反应。糖皮质激素抑制 Tc 细胞活化，抑制其细胞毒作用。对体液免疫的作用：皮质激素对敏感动物的抗体生成有明显的抑制作用而对人类的抗体水平影响不一致，对 IgG 及 IgA 的抑制强于 IgM。有报道哮喘患者在结束皮质激素治疗后，血清 IgE 水平有提高。对巨噬细胞的作用：巨噬细胞对糖皮质激素最为敏感，抑制巨噬细胞趋化作用的浓度仅为抑制中性粒细胞的 1/30，并使巨噬细胞的杀菌作用能力减弱。单核细胞产生的细胞因子如白细胞介素 1（IL－1）及纤维蛋白溶酶原激活因子的产生均可被皮质激素所抑制。

抗炎作用：糖皮质激素的强大抗炎作用可能是多种因素的综合结果。抑制花生四烯酸代谢产生前列腺素及抑制白三烯的合成；增加血管张力和降低毛细血管通透性；抑制吞噬细胞在炎症部位的积聚，并抑制其加工处理抗原和产生 IL－1 的功能；干扰补体激活，减少炎症介质的产生；稳定溶酶体膜，防止溶酶体酶的释放；抑制成纤维细胞增殖与分泌，延迟肉芽组织形成及伤口愈合时间。

抗炎作用较氢化可的松、泼尼松均强。水钠潴留作用则较轻微。

【药代动力学】糖皮质激素的口服吸收速度与其脂溶度成正比，而注射给药的吸收速度则与其水溶性程度成正比。糖皮质激素约 90% 以上与血浆蛋白结合后而无生物活性，具有生物活性的不到 10%。它在体内的分布并无选择性，但炎症部位由于血流量及血管通透性增加，该处的药物浓度可高于其他器官。糖皮质激素主要在肝脏灭活，淋巴细胞亦有氧化或还原糖皮质激素的能力。近年证明 B 细胞代谢糖皮质激素比 T 细胞更快，解释了 B 细胞比 T 细胞对糖皮质激素更易耐受的机制。可的松在体内转化为皮质醇产生活性，地塞米松本身即具活性。临床常用的几种糖皮质激素在体内半衰期各不相同，可供用药依据。糖皮质激素由肾排泄，在尿中游离的可的松小于 2%，而 90% 以上是灭活的，说明在肾功能不全时不会引起血浆中活性激素水平的升高。

【不良反应】类同于其他糖皮质激素，胃肠道反应：中上腹不适，腹胀，畏食，恶心，少数患者有可能诱发胃、十二指肠溃疡甚至并发出血、穿孔。内分泌、代谢异常：长期应用可诱发内分泌异常（如类固醇性糖尿病、月经不规则、儿童生长抑制）。电解质紊乱。类库欣综合征：毛发分布异常、满月脸、水牛背、皮肤紫纹、肌肉萎缩、高血压、低血钾性碱中毒。骨质疏松。肌无力。神经精神异常：兴奋、失眠、轻度抑郁、嗜睡，少数可诱发头痛、

颅内压升高、惊厥或精神失常。眼科并发症：角膜下白内障，眼压升高及青光眼。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
曲安西龙片	化学药	HZ003023
曲安西龙双醋酸酯混悬注射液	化学药	HZ003024

HY001631　曲伏前列素

【外文名称】Travoprost

药物药理信息

【药理毒理】

1．作用机制：曲伏前列素游离酸是一种选择性的FP前列腺类受体激动剂，据报道FP前列腺素类受体激动剂可通过增加葡萄膜巩膜通路房水外流的机制来降低眼压。至今尚未清楚其准确的作用机制。

2．致癌、致突变，生育能力的损害：在大鼠和小鼠皮下给予一日10，30或100μg/kg的两年致癌性研究中未发现致突变作用。但在100μg/kg的剂量，雄性大鼠仅治疗了82周，在小鼠的研究中示达到最大耐受剂量（MTD）。按照血浆有效药物量，高剂量（100μg/kg）相当于人眼用推荐最在剂量0.04μg/kg暴露量的400倍以上。典伏前列素在艾姆斯试验、小鼠微核试验及大鼠染色体畸变试验中都未发现致突变作用。在另一项（两项中的一项）小鼠淋巴瘤试验中，高浓度的曲伏前列素只在有大鼠S-9活性酶存在时才有轻微的致突变作用。

曲伏前列素在雌雄大鼠和小鼠中皮下使用，用量达到10μg/kg（人眼用推荐最大剂量的250倍），不影响交配或生育能力指数。在此剂量下，黄体平均数量减少，植入后的失败增加。但是在3μg/kg（人眼用推荐最大剂量的75倍）下黄体数量无改变。

【药代动力学】

1．吸收：曲伏前列素通过角膜吸收，被水解为具有生物学活性的游离酸。4个多剂量药代研究（总共有107名受试者）显示，2/3患者的游离酸的血浆浓度低于0.01ng/ml（分析的定量限）。在可计量血浆浓度的受试者中（N=38），平均血浆C_{max}为0.018±007ng/ml（范围从0.01到0.052ng/ml），并在30分钟内达到最高峰。从这些结果我们可以认为曲伏前列素的血浆半衰期为45分钟。第1天和第7天间的血浆浓度无差异，显示较早的稳态且无显著蓄积现象。

2．代谢：曲伏前列素是异丙酯前体，能很快被角膜酯酶水解为具有生物学活性的游离酸，在全身代谢中，曲伏前列素游离酸能被氧化代谢为非活性代谢产物。生物转化包括a碳酸链的β-氧化产生1,2-二醇，和1,2,3,4-四醇的类似物、15-羟基部分氧化，及13,14双键还原作用。

3．排泄：曲伏前列素游离酸从血浆中的排泄非常迅速、通常在给药后的1小时内就会低于限量。从14多患者中评估曲伏前列素最终排泄的半衰期，在曲伏前列素眼局部用药中，有低于2%的曲伏前列素游离酸在4小时内从尿中排出。

【不良反应】在本品滴眼液的临床对照研究中，观察到的最常见眼部不良反应是眼充血，见于35%~50%的患者。大约3%的患者因结膜充血停止用药。5%~10%的眼部不良反应包括视力下降，眼部不适，异物感，疼痛，瘙痒。1%~4%的眼部不良反应包括视力异常、眼睑炎、视力模糊、白内障、结膜炎、干眼、眼部不适、房闪、虹膜异色、角膜炎、睑缘结痂、畏光、结膜下出血和流泪。

非眼部不良反应占1%~5%，包括外伤、心绞痛、焦虑、关节炎、背痛、心动过缓、气管炎、胸痛、感冒综合征、抑郁、消化不良、胃肠功能紊乱、头痛、高胆固醇血症、高血压、低血压、感染、疼痛、前列腺功能紊乱、窦炎、尿失禁和尿道感染。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
曲伏前列素滴眼液	化学药	HZ003025

HY001632　曲克芦丁

【其他名称】Hydroxyethylrutin、羟乙基芦丁、托克芦丁、Vitamin P_4、维脑路通、维生素P_4

【外文名称】Troxerutin

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第3册

药物理化信息

【化学名】7,3′,4′-三羟乙基芦丁

【分子式】$C_{33}H_{42}O_{19}$

【分子量】742.68

【性状及组成】本品为黄色、黄绿色或浅棕黄色粉末；无臭，味微咸；有引湿性。本品在水中易溶，在甲醇中微溶，在乙醇中极微溶解，在三氯甲烷中不溶。熔点156℃。

药物药理信息

【药理毒理】能抑制血小板的凝集，有防止血栓形成的作用。同时能对抗5-羟色胺、缓激肽引起的血管损伤，增加毛细血管抵抗力，降低毛细血管通透性，可防止血管通透性升高引起的水肿。对急性缺血性脑损伤有显著的保护作用。本品系芦丁经羟

乙基化制成的半合成黄酮化合物，具有抑制红细胞和血小板聚集，防止血栓形成，同时能增加血中氧饱和度，改善微循环，增进侧支循环。它对内皮细胞有保护作用，能对抗5－羟色胺和缓激肽引起的血管损伤，增加毛细血管抵抗力，降低毛细血管通透性，可防止因血管通透性升高而引起的水肿。对急性缺血性脑损伤有显著的保护作用。

【药代动力学】口服曲克芦丁主要从胃肠道吸收，达峰时间1～6小时，血浆蛋白结合为30%左右，消除相半衰期10～25小时，可能存在肠肝循环，代谢产物70%随粪便排出体外。

【不良反应】有胃肠道反应及过敏反应，潮红、头痛，个别患者静注本品可引起心血管系统及肝脏毒性反应、急性脑水肿和心律失常等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
曲克芦丁胶囊	化学药	HZ003026
曲克芦丁颗粒	化学药	HZ003027
曲克芦丁口服液	化学药	HZ003028
曲克芦丁氯化钠注射液	化学药	HZ003029
曲克芦丁脑蛋白水解物注射液	化学药	HZ003030
曲克芦丁片	化学药	HZ003031
曲克芦丁葡萄糖注射液	化学药	HZ003032
曲克芦丁羟丙茶碱胶囊	化学药	HZ003033
曲克芦丁羟丙茶碱片	化学药	HZ003034
曲克芦丁香豆素片	化学药	HZ003035
曲克芦丁注射液	化学药	HZ003036
注射用曲克芦丁	化学药	HZ004938
注射用曲克芦丁脑蛋白水解物	化学药	HZ004939

HY001633 曲马唑嗪

【其他名称】三甲氧唑啉

【外文名称】Trimazosin

药物药理信息

【药理毒理】本品作用与哌唑嗪相似，具有α_1－受体阻断作用，可降低血压，可用于高血压。现已少用。

HY001634 曲美托嗪

【其他名称】Sedoxazin、三甲氧琳、TRIOXAZINE

【外文名称】Trimetozine

药物药理信息

【药理毒理】本品为镇静安定剂，可减轻紧张及焦虑状态。其优点在于对病人的活动无明显抑制作用，对运动神经系统、血压及呼吸均无明显影响。适用于伴有恐惧、紧张和情绪激动的神经精神症状及儿童行为障碍；对于带有神经质综合征的患者，本药可有效地消除兴奋；在精神病的治疗上可做为一种维持治疗用药。

【不良反应】一般耐受良好，大剂量时可见乏力、倦怠、恶心、嗜睡等。少数人可见过敏反应。

HY001635 曲尼司特

【外文名称】Tranilast

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第53册

药物理化信息

【化学名】*N*－（3,4－二甲氧基肉桂酰）邻氨基苯甲酸

【分子式】$C_{18}H_{17}NO_5$

【分子量】327.34

【性状及组成】本品为淡黄色或淡黄绿色结晶或结晶性粉末；无臭，无味。

本品在二甲基甲酰胺中易溶，在吡啶中溶解，在水中不溶。

熔点：本品的熔点为207～210℃。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理学：本品有稳定肥大细胞和嗜碱粒细胞的细胞膜作用，阻止其脱颗粒，从而抑制组胺、5－羟色胺过敏性反应物质的释放，对于IgE抗体引起的大白鼠皮肤过敏反应和实验性哮喘有抑制作用。

2．毒理学：动物实验可致畸胎。

【药代动力学】临床药代动力学表明，给药后2～3小时，血药浓度达到峰值，半衰期为8.6小时左右，24小时明显降低，48小时后在检出限度之下。主要从尿中排出，体内代谢产物主要是曲尼司特的4位脱甲基与硫酸及葡萄糖醛酸的结合物。

【不良反应】

1．肝脏：偶尔出现肝功能异常，需注意观察，可采取减量、停药等适当措施。

2．胃肠：有时发现食欲减退，恶心、呕吐、腹痛、腹胀、便秘、腹泻、胃部不适，偶有胃部不消化感。

3．血液：可有红细胞数和血色素量下降。

4．精神神经系统：头痛、嗜睡、偶尔头重、失眠、头昏、全身疲倦感等症状。

5. 过敏反应：皮疹，偶见全身痒等过敏症状，此时应停药。

6. 泌尿系统：偶见膀胱刺激症状，应停止用药。

7. 其他：偶见心悸、水肿、面部红晕、鼻出血、口腔炎等症状。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方曲尼司特胶囊	化学药	HZ001353
曲尼司特胶囊	化学药	HZ003038
曲尼司特颗粒	化学药	HZ003039
曲尼司特片	化学药	HZ003040

HY001636　曲匹布通

【其他名称】胆灵、舒胆通、三乙丁酮、三乙氧苯酰丙酸

【外文名称】Trepibutone

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第4册

药物理化信息

【化学名】3-（2,4,5-三乙氧基苯甲酰）丙酸。

药物药理信息

【药理毒理】本品具有选择性松弛胆道平滑肌并直接抑制胆道奥狄括约肌的作用，可使胆道括约肌松弛，使它能降低胆总管与十二指肠汇合部位的通过阻力；本品能降低胆囊、胆管内压、促进胆汁和胰液的排出而改善食欲、消除腹胀。本品还具有解痉镇痛及利胆的作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
曲匹布通胶囊	化学药	HZ003041

HY001637　曲匹地尔

【其他名称】乐可安、Rocornal、唑嘧胺、唑噻胺

【外文名称】Trapidril

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第4册

药物理化信息

【化学名】5-甲基-7-二乙胺基-1,2,4-三唑

药物药理信息

【药理毒理】

1. 扩张冠状动脉：抑制磷酸二酯酶的活性，对大冠状动脉的扩张作用比小动脉强，利于侧枝循环建立。

2. 抑制血小板聚集：可防止花生四烯酸及血小板自身诱发的血小板聚集，并有解聚作用，防止血栓形成。

3. 竞争性拮抗血小板衍生生长因子的受体，抑制平滑肌细胞增生。减少经皮穿刺冠状动脉腔内成形术后再狭窄的发生。

4. 抑制组胺释放，松弛支气管平滑肌。

5. 扩张外周血管，减轻心脏的前、后负荷。

【不良反应】不良反应少，偶有胃肠道反应、面红、心悸等症状。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
曲匹地尔片	化学药	HZ003043
曲匹地尔注射液	化学药	HZ003044

HY001638　曲司氯铵

【外文名称】Trospium Chloride

药物药理信息

【药理毒理】本品为人工合成的具有四个铵基结构的托品酸衍生物，属副交感神经的阻滞药，作用类似于阿托品，主要通过与内源性神经递质乙酰胆碱竞争性结合突触后膜M受体而起作用，对有副交感神经支配的器官起着降低副交感神经张力、去除因副交感神经引起的平滑肌痉挛的作用，对胃肠、胆道和泌尿道也有一定作用。

本品脂溶性低而不易通过血脑屏障，不会产生中枢神经系统不良反应。

两种啮齿动物的急性和慢性毒性实验显示：可观察到的不良反应是由于药效活性的提高所致，而不是特异性的靶器官毒性，且没有性别间的差异。在最大耐受剂量下无生殖毒性，体内体外实验显示无致基因突变效应和致癌效应。

【药代动力学】口服本品20~60mg，药代动力学参数C_{max}和$AUC_{0\to inf}$与剂量成比例；当与高脂肪含量的早餐同服时，其生物利用度明显减少。单剂量口服时，本品药代动力学参数个体差异很大，有关吸收和排泄参数的变异系数高达45%~65%；静脉给予时，药代动力学参数个体差异明显变小。老年人药代动力学参数无明显变化。由于本品主要通过肾脏排泄，因此肾损害时会影响本品的药代动力学，肌酐清除率小于40mL/min的慢性肾衰患者应适当减少剂量。体外试验提示本品蛋白结合率很高，大约50%以上。静脉给予同位素标记的本品，90%通过

尿液和粪便排泄，大约分别为70%和20%。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
曲司氯铵片	化学药	HZ003045

HY001639 曲昔匹特

【其他名称】曲昔派特

【外文名称】Troxipide

药物理化信息

【化学名】（±）3,4,5－三甲氧基－*N*－3－哌啶基苯甲酰胺

【分子式】$C_{15}H_{22}N_2O_4$

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末；无臭；味苦。在甲醇、三氯甲烷中溶解，在乙醇中略溶，在水、丙酮中微溶，在乙醚中不溶；在冰醋酸、稀盐酸中易溶。

熔点：本品的熔点为177～181℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为一新型防御因子增强型胃炎、胃溃疡治疗剂，对各种试验性溃疡均有抑制作用，对试验性胃炎有治疗和预防作用，对急性胃黏膜病变有预防作用，能增强胃黏膜的血流量，促进组织的修复，对其作用机制的研究表明：与H_2受体拮抗剂不同，对胃酸分泌无影响，而是增强胃黏膜的防御因子，促进胃溃疡部位的修复。

【药代动力学】口服本品0.1g后吸收和分布迅速，消除半衰期较长，t_{max}2.33±0.52小时；C_{max}1.07±0.36mg/L；$AUC_{0\to\infty}$9.38±1.74h·mg/L；$t_{1/2\beta}$12.52±3.69小时。体内过程符合线性动力学。吸收后主要分布在小肠，依次为肝、肾、肺、脾等。相对其原药水溶液的生物利用度为99.6%±7.3%。据文献报道，健康成人口服曲昔匹特0.1g，24小时尿中排泄量为给药量的61%。48小时尿中排泄量为给药量的87%。尿中排泄量的98%以上为原形药物。

【不良反应】

1．消化系统：有时出现便秘，偶有腹部胀满、胸部灼烧、恶心等症。

2．肝脏：有时出现AST、ALT上升，偶有ALP、γ－GPT上升等肝功能异常。

3．过敏症：偶有瘙痒、皮疹等。

4．其他：偶见头重、全身乏力、心悸等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
曲昔匹特胶囊	化学药	HZ003046
曲昔匹特片	化学药	HZ003047

HY001640 屈氟尿苷

【其他名称】曲氟尿苷、三氟哩啶、三氟尿苷、Viroptic

【外文名称】Trifluridine

药物药理信息

【药理毒理】本品结构与碘苷相似。对单纯疱疹病毒（HSV－1和HSV－2）作用最强，对腺病毒、牛痘病毒、巨细胞病毒、带状疱疹病毒亦具一定作用，对阿昔洛韦耐药的疱疹病毒有效。其三磷酸衍生物可结合进DNA并与三磷酸胸腺嘧啶脱氧核苷竞争性地抑制DNA多聚酶。对病毒DNA和宿主细胞的DNA无选择性。适用于单纯疱疹性角膜炎、结膜炎及其他疱疹性眼病。疗效与阿糖腺苷相似而优于碘苷。对碘苷无效或过敏者可试用本品。

【不良反应】不良反应似碘苷，为局部疼痛、发炎、瘙痒、眼睑水肿等。实验动物中有致畸、致突变作用，只供局部应用。

HY001641 去甲斑蝥素

【外文名称】Demethylcantharidin

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第1册

药物理化信息

【化学名】外－1:2－顺－3:6－氧桥－六氢化邻苯二甲酸酐

【分子式】$C_8H_8O_4$

【分子量】168.15

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理：本品动物体外试验，对肝癌BEL－7402、食管癌CaEs－17、喉癌SMMC－7721、宫颈癌Hela等细胞株的形态或增殖有破坏或抑制作用。体内试验，对小鼠艾氏腹水癌、肉瘤180及肝癌实体型有一定的抑制效力，可提高腹水肝癌H22小鼠瘤细胞微粒体的呼吸控制率及溶酶体酶活性，抑制癌细胞DNA合成，破坏癌细胞骨架及超微结构。干扰癌细胞分裂，阻断于M期，并影响其周期运行速度，使癌细胞骨架破坏（微丝、微管）影响癌细胞超微结构导致线粒体、微绒毛及质膜损伤等，阻断细胞分裂周期的M期干扰癌细胞分裂。

2．毒理：小鼠灌胃细胞的LD_{50}为43.3mg/kg。对小鼠的研究显示去甲斑蝥素对免疫功能无明显抑制。用药后可见的细胞有一定程度升高。并有改善肝功能及抑制乙型肝炎病毒复制作用，与其他化疗

药物合用能提高疗效，降低不良反应。

【药代动力学】以^{3}H－去甲斑蝥素给小鼠灌胃研究显示，本品吸收后较快分布于各组织，在动物的肝、肾、胃、肠、心、肺、唾液腺、甲状腺及瘤体中具有较高的药物浓度。给药后15分钟在肝脏，癌组织达高峰浓度，6小时后浓度显著下降，24小时内大部分经肾排泄，体内较少积蓄。

【不良反应】部分病人可出现恶心、呕吐、头晕等症状，停药减量或对症处理可自行消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
去甲斑蝥素片	化学药	HZ003049

HY001642　去甲斑蝥酸钠

【外文名称】Sodium Demethylcantharidate

药物理化信息

【化学名】1，2－顺－3，6－氧桥－六氢化邻苯二甲酸钠盐。

药物药理信息

【药理毒理】本品体外试验，对肝癌、食管癌、喉癌、肺癌、宫颈癌等细胞株的形态或增殖有破坏和抑制作用。体内试验，对小鼠艾氏腹水瘤、肉瘤－180及肝癌实体型有一定抑制效力，可提高腹水肝癌H_{22}小鼠癌细胞线粒体的呼吸抑制率及溶酶体酶活性，干扰癌细胞分裂，阻断于M期，并影响其周期运行速度。本品可使癌细胞骨架破坏（微丝、微管），影响癌细胞超微结构，导致线粒体、微绒毛及质膜受损等。能抑制癌细胞DNA合成，但对正常骨髓细胞不抑制，并能升高白细胞。

【药代动力学】本品给动物静注后，可较快分布于各组织、在肝、肾、肺、胃、肠、心、唾液腺、甲状腺、癌组织中均有较高的药物浓度，血药浓度约半小时下降一半，24小时完全消除，肝中药物浓度1小时达高峰，6小时下降一半，24小时完全消除；药物主要通过泌尿系统排泄、静注后，尿中药物浓度0.5～1小时达到高峰，24小时大部分自尿中排出。

【药物过量】部分患者可能出现消化道反应和心、肝、肾损伤，可酌情减量或对症处理。

【不良反应】一次注射量若超过30mg，部分患者出现恶心、呕吐等消化道症状。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
去甲斑蝥酸钠氯化钠注射液	化学药	HZ003050
去甲斑蝥酸钠注射液	化学药	HZ003051
注射用去甲斑蝥酸钠	化学药	HZ004941

HY001643　去甲可待因

【外文名称】Norcodeine

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY001644　去甲麻黄碱

【外文名称】Norephedrine

药物管理信息

【特殊管理分类】易制毒药

药物药理信息

【药理毒理】《易制毒化学品管理条例》（国务院令第445号）规定本品为易制毒化学药品。

HY001645　去甲吗啡

【外文名称】Normorphine

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY001646　去甲美沙酮

【外文名称】Normethadone

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY001647 去甲伪麻黄碱

【外文名称】Norpseudoephedrine

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

药物药理信息

【药理毒理】本品为拟交感神经药，有收缩血管的作用，可用作畏食剂，也可用于外消旋酸性化合物光学拆分。

HY001648 去甲西泮

【外文名称】Nordazepam

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

药物药理信息

【药理毒理】本品具有抗焦虑、镇静、肌肉松弛及抗惊厥等作用，口服吸收快而完全。经肝代谢成奥沙西伴，仍有抗焦虑作用。临床上用于治疗各型焦虑症。

【药代动力学】血浆蛋白结合率为97%。平均$t_{1/2}$为65小时。

【不良反应】

1. 少数病人可出现嗜睡、乏力、近事遗忘、恶心、呕吐、震颤等。

2. 长期用药勿突然停药，以免发生戒断症状，大剂量更易发生。

3. 妊娠头3个月避免使用本品，孕期后3个月避免增加剂量，以免造成新生儿肌张力减退、低烧或呼吸困难。

HY001649 去甲左啡诺

【外文名称】Norlevorphanol

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY001650 去羟肌苷

【其他名称】二脱氧肌苷、VIDEX

【外文名称】Didanosine

药物理化信息

【化学名】2′,3′-双脱氧次黄嘌呤核苷

【分子式】$C_{10}H_{12}N_4O_3$

【分子量】236.20

药物药理信息

【药理毒理】

1. 作用机制：去羟肌苷是人工合成的核苷类药物，与天然的腺苷相比，后者的3′-羟基变为氢。去羟肌苷被细胞激酶磷酸化后形成有活性的代谢物5′-三磷酸双脱氧腺苷。5′-三磷酸双脱氧腺苷抑制HIV逆转录酶，其机制包括与自然底物三磷酸脱氧腺苷竞争，以及掺入至病毒DNA，终止DNA链的延长。

2. 体外HIV敏感性：使用HIV1感染的成淋巴细胞和单核细胞/巨噬细胞培养，测定去羟肌苷体外抗病毒活性。对于成淋巴细胞，50%抑制病毒复制的药物浓度（IC_{50}）范围在2.5到10mM之间（1mM = 0.24mg/ml）。同样，对于单核细胞/巨噬细胞培养，IC_{50}范围在0.01到0.1icroM之间。尽管体外HIV对去羟肌苷的敏感性已确定，去羟肌苷对人体内HIV复制的抑制作用尚不明确。

3. 耐药性：从体外和经去羟肌苷治疗的病人中都分离出了对去羟肌苷敏感性减轻的HIV-1。对去羟肌苷治疗的病人中分离出的HIV进行遗传分析，发现其逆转录酶中有三个氨基酸发生了突变，即K65R、L74V和M184V。临床分离株L74V的突变发生率最高。从接受去羟肌苷单独治疗6~24个月的60个病人（其中有些患者先前曾接受过齐多夫定治疗）中分离出HIV-1病毒，对这些病毒进行表型分析发现，60个患者中有10个患者，其病毒对去羟肌苷的体外敏感性减弱了10倍。临床上分离出的敏感性降低的病毒，或多或少都发生了与去羟肌苷相关的突变。至于遗传型与表型在临床的相关性，目前尚未确定。

4. 交叉耐药：经齐多夫定和去羟肌苷联合治疗后，39个病人中分离出HIV-1，其中有2个体外对齐多夫定、去羟肌苷、扎西他滨和拉米夫定的敏感性降低。这些分离出的病毒在逆转录酶中有五个突变，即A62V、V751、F77L、F116Y和Q151M。这些发现的临床意义尚不明确。

5. 致癌作用和致突变作用：有一项去羟肌苷对小鼠和大鼠的终身致癌作用的研究，为期分别为22和24个月。在小鼠实验中，去羟肌苷的初始日剂量为120、800和1200mg/kg，雌雄两性同样剂量。8个月后，雌性的日剂量减少为120、210和210mg/kg，雄性的日剂量减少为120、300和600mg/kg。雌性小鼠不能耐受两个较高剂量；雄性小鼠不能耐受高剂量。按相对AUC比较，雌性小鼠所用的小剂量，相

当于人用最高剂量的 0.68 倍，雄性小鼠所用的中剂量相当于人的最高剂量的 1.7 倍。在大鼠实验中，去羟肌苷的初始日剂量为 100、250 和 1000mg/kg，18 个月后，高日剂量减少为 500mg/kg。雌雄两性大鼠所用的高剂量相当于人用最高剂量的 3 倍，最大耐受剂量时，去羟肌苷用在小鼠和大鼠均不增加肿瘤的发生率。

6. 去羟肌苷在下列遗传毒性实验中呈阳性：①大肠杆菌测试株 WP2uvrA 细菌突变实验；②L5178Y/ TK ± 小鼠淋巴瘤哺乳类细胞基因突变实验；③人类淋巴细胞培养的体外染色体畸变实验；④ 中华豚鼠肺细胞的体外染色体畸变实验；⑤ BALB/c3T3 体外转型实验。在 Ames 沙门菌突变实验和大鼠、小鼠体内微核实验试验中，未发现突变。

7. 动物毒理学：在小鼠和大鼠的为期大于 90 天的长期毒性实验中发现，当去羟肌苷剂量相当于人的吸收剂量的 1.2 至 12 倍时，出现剂量－限制性骨骼肌肉毒性，而在狗的长期毒性实验中，未发现此毒性。此发现与人服用去羟肌苷是否会发生肌肉病变的相关性，目前尚未明确。然而，已有报道服用去羟肌苷分散片或其他核苷类药物会发生肌肉病变。

【药代动力学】药物代谢动力学：去羟肌苷吸收迅速口服给药后一般在 0.25 至 1.5 小时内达血药峰浓度。在 500 到 400mg 剂量范围内，去羟肌苷血浆浓度与剂量成正比。稳态药物代谢动力学参数与一次给药的数据无明显差异。在体外，去羟肌苷与血清蛋白的结合微弱（ < 5%）。体外和动物实验表明，去羟肌苷在人体内的代谢与内源性的嘌呤的代谢一样。

食物对去羟肌苷吸收的影响：在用餐后 2 小时以内服用去羟肌苷分散片，去羟肌苷的血浆峰浓度和血浆时量曲线的曲线下面积降低 55%。在用餐 30 分钟以前，服用去羟肌苷分散片，其生物利用度无明显变化。因此，应在用餐 30 分钟以前，或在用餐 2 小时以后，空腹服用去羟肌苷分散片。

【药物相互作用】去羟肌苷分散片与 daspone、洛哌丁胺、甲氧氯普胺、奈韦拉平、雷尼替丁、利福布汀、利托那韦、司坦夫定、磺胺甲噁唑、甲氧苄啶和齐多夫定，在药物代谢动力学上均无临床的相互作用。其中，与 daspone、奈韦拉平、利福布汀、利托那韦、司坦夫定 和齐多夫定相互作用的研究是多剂量研究；与洛哌丁胺、甲氧氯普胺、雷尼替丁、磺胺甲噁唑和甲氧苄啶是单剂量研究，其稳态动力学的影响不明。

去羟肌苷分散片与已知对胰腺有毒性的药物合用，会增加胰腺毒性，需格外谨慎，只有当无其他治疗方案或必须使用时，方可采用此治疗方案。有神经病变病史的和同时使用如司坦夫定有神经毒性药物的患者，较易发生外周神经病变。

别嘌呤醇：在两个肾功能减退的患者（肌酐清除率分别为 15 和 18ml/min）单剂量 200mg 的去羟肌苷分散片与别嘌呤醇同时使用，结果去羟肌苷的 AUC 增加了 4 倍。至于在肾功能正常的患者，别嘌呤醇对去羟肌苷药物代谢动力学的影响不明。

抗酸药物：服用去羟肌苷分散片，同时服用含镁或铝的抗酸药物，两者的抗酸成分会加重不良反应。

吸收受胃中酸度影响的药物：诸如酮康唑和伊曲康唑需至少在服用去羟肌苷分散片前 2 小时服用。

更昔洛韦：在服用更昔洛韦前 2 小时或同时服用去羟肌苷分散片，后者稳态 AUC 将增加至 111%（ ± 14%）（n = 12）。在服用更昔洛韦前 2 小时服用去羟肌苷分散片，前者的稳态 AUC 减少 21%（ ± 17%），而同时服用对更昔洛韦的 AUC 无影响（n = 12）。

喹诺酮类抗生素：因抗酸成分如镁、钙和铝会降低环丙沙星的血浆浓度，去羟肌苷分散片应在服用环丙沙星后 2 小时或前 6 小时服用。在 8 个 HIV 感染的患者中，当环丙沙星在服用市售的去羟肌苷分散片 2 小时前服用，环丙沙星的稳态 AUC 下降 26%（95% 可信限为 14%，37%）。在 12 个健康受试者中，同时给予环丙沙星和去羟肌苷安慰剂，前者 AUC 下降 15 倍。有一个受试者在服用去羟肌苷安慰剂前服用环丙沙星，后者的 AUC 减少 50% 以上。

抗酸成分如镁、钙和铝会降低喹诺酮类抗生素的血浆浓度。若需服用去羟肌苷分散片，须参阅相应的喹诺酮包装里的说明书，以决定两药使用的间隔时间。

与其他抗病毒药物的相互作用：同时服用去羟肌苷分散片，会显著降低地拉韦啶（20%）和茚地那韦（84%）的 AUC。为避免此药物相互作用，地拉韦啶和茚地那韦应在服用去羟肌苷分散片前 1 小时给药。奈非那韦在服用去羟肌苷分散片后 1 小时给药，同时进少量食物，前者的药物代谢动力学不受影响。

【药物过量】本药用药过量目前尚无已知的解毒药。在 I 期临床研究中，初始剂量为目前推荐剂量的 10 倍，发生的毒性有：胰腺炎、外周神经病变、腹泻、高尿酸血症和肝功能减退。去羟肌苷不能通过腹膜透析排出，而血液透析能排出少量去羟肌苷。

【不良反应】本品的严重毒性是胰腺炎，其他重要的毒性还有乳酸性酸中毒，脂肪变性重度肝肿大，视网膜病变和和视神经炎，以及外周神经病变。在

临床实验中，发生率较高的不良反应有腹泻、神经病变、皮疹/瘙痒、腹痛、胰腺炎、头痛、恶心、呕吐。在临床实验中，发生率较高的实验室异常有：ALT或AST升高（大于正常上限值的5倍）、碱性磷酸酶升高（大于正常上限值的5倍）、淀粉酶升高（大于正常上限值的1.4倍）、尿酸升高（>12 mg/dl）、胆红素升高（大于正常上限值的2~2.6倍）、脂肪酶升高（大于正常上限值的2倍）。临床：全身反应：脱发、过敏反应、无力、疼痛、寒战和发热。消化系统：畏食、消化不良和腹泻。外分泌腺：胰腺炎、唾液腺炎、腮腺肿大、口干、眼干。造血系统：贫血、白细胞缺乏症、血小板缺乏症。肝脏：乳酸性酸中毒和肝脏脂肪变性，肝炎和肝功能衰竭。代谢：糖尿病、高血糖或低血糖。肌肉骨骼系统：肌肉疼痛（伴有或不伴有肌酸磷酸激酶升高）、引起肾功能衰竭而需血液透析的横纹肌溶解，关节痛和肌肉病变。儿童患者中发生的不良反应及严重的实验室检查异常的类型和发生率均与成人的相同。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
去羟肌苷肠溶胶囊	化学药	HZ003052
去羟肌苷分散片	化学药	HZ003053
去羟肌苷咀嚼片	化学药	HZ003054
去羟肌苷颗粒	化学药	HZ003055
去羟肌苷片	化学药	HZ003056

HY001651 去氢胆酸

【其他名称】Bil－Cholin、Bilidren、Biliton、Bilostat、biochol、Chetocolina、Chlenbil、Cholan－DH、Cholepatin、Decholin、Dehydocholin、Dicolan、Didrocolo、Dilabil、Dycholium、Eretil、Feloflux、Idrocrine、Ketochol、Neocholan、Oxycholin、Procholon、脱氢胆酸

【外文名称】Dehydrocholic Acid

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】3,7,12－三氧－5β－胆烷－24－酸

【分子式】$C_{24}H_{34}O_5$

【分子量】402.53

【性状及组成】本品为白色疏松粉末；无臭，味苦。本品在三氯甲烷中略溶，在乙醇中微溶，在水中几乎不溶；在氢氧化钠试液中溶解。

熔点：本品的熔点为231~242℃，熔距在3℃以内。

比旋度：取本品，精密称定，加二氧六环溶解并定量稀释制成每1ml中约含20mg的溶液，依法测定，比旋度应为+29.0°至+32.5°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：利胆药。

本品为胆酸的合成衍生物，可对肝细胞产生生理性刺激，使肝血流量增加，肝细胞新陈代谢旺盛，胆汁中的水分显著增加，因此胆汁分泌量亦增多。但不增加胆汁中的固体成分，从而使胆汁稀释，起到胆道内冲洗作用。此外本品亦有促进胆色素排泄和利尿的作用。胆道有炎症时，本品可使分泌大量低黏度的胆汁而消除淤滞，防止上行性胆道感染；胆道存在小结石时，阻碍胆汁的流出，本品尚有排除结石的作用，如同时应用解痉药或将硫酸镁灌入十二指肠内以松弛胆总管括约肌更有利于胆石的排出。

【药代动力学】本品口服后经小肠吸收。静脉注射后20~30分达最大效应，维持时间较短。

【不良反应】少数患者有口苦、皮肤瘙痒等不良反应。久用后胆汗分泌量减少，称“肝疲劳”。同时口服糖皮质激素或ATP，可预防之。胆道完全阻塞及严重肝炎患者禁用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
去氢胆酸钠注射液	化学药	HZ003057
去氢胆酸片	化学药	HZ003058

HY001652 去水卫矛醇

【其他名称】DAG、二去水卫矛醇、环氧乳醇、脱水半乳糖醇、卫康醇

【外文名称】Dianhydrodulcitol

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第15册

药物理化信息

【化学名】1,2,5,6－二去水卫矛醇或：1,2,5,6－二脱水半乳糖醇

【分子式】$C_6H_{10}O_4$

【分子量】146.14

【性状及组成】本品为白色粉末或疏松块状物；无臭；极易溶于水。本品在水中极易溶解，在乙醇、丙酮、乙酸乙酯中溶解。

药物药理信息

【药理毒理】本品为二溴卫矛醇溴化氢的双环氧化物，与烷化剂有交叉耐药性，可归为烷化剂类，但其作用机制不能完全以此来解释。对抑制DNA合

成的能力大于 RNA，更大于蛋白质，且易与 DNA 形成交联，能通过血脑屏障。本品对 L1210、P388、B16 黑色素瘤、脑室管膜细胞瘤等动物肿瘤有抑制作用，对 L1210 白血病的疗效较二溴卫矛醇强 3 倍。亦为细胞周期非特异性药物。

【不良反应】

1．骨髓抑制：可有白细胞、血小板减少，于用药后 7～18 日降到最低点；偶见贫血。

2．胃肠道反应：恶心、呕吐、口炎。

3．本品注射时，如药液外渗，可能引起局部组织坏死，形成溃疡，故使用时应防止药液外渗。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用去水卫矛醇	化学药	HZ004942

HY001653　去铁胺

【其他名称】除铁灵、Deferoxamine Mesylate、Desferrioxamine、甲磺酸去铁胺、去铁敏

【外文名称】Deferoxamine

药物药理信息

【药理毒理】本品为一种络合剂，主要与三价铁离子、三价铝离子结合为无毒的、稳定的络合物质，并排出体外。但对二价离子如亚铁离子、铜离子、锌离子、钙离子等亲和力较低。本品不能与转铁蛋白、血红蛋白或其他含氯高铁血红素物质中的铁离子结合，因此不会产生缺铁性贫血。

【药物相互作用】本品不能用氯化钠注射液直接溶解，应先用指定溶酶溶解后，再用氯化钠注射液稀释；本品与维生素 C 合用时，应先用本品治疗 1～2 周后才可用维生素 C，维生素 C 用量超过 50mg 时，可引发心功能紊乱。

【不良反应】注射局部有疼痛，并可有腹泻、视力模糊、腹部不适、腿部肌肉震颤等；静注速度过快，会引起虚脱，因此，输注速度不宜超过每小时 15mg；铁复合物排出可使尿液呈红色；应用本品可引发感染，应先用抗生素治疗感染后再用本品治疗。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
去铁胺注射液	化学药	HZ003059

HY001654　去纤酶

【外文名称】Defibrinogenase

【分子量】33500.00

【性状及组成】本品系从尖吻蝮蛇的蛇毒经分离纯化所获的一种酶制剂。是由 17 种氨基酸、263 个残基所组成的糖蛋白，分子量 33500。pH7.4 时较为稳定。

药物药理信息

【药理毒理】具有纤维蛋白溶解活性、能使血浆纤维蛋白原和纤维蛋白溶解，故能溶解血栓。此外，还能降低血液黏度，延长凝血酶原时间和凝血时间，但对其他凝血因子和血小板数量无明显影响。应用 1～3 日后，血浆纤维蛋白原减少，优球蛋白溶解试验时间缩短，全血黏度时间、凝血酶原时间和凝血时间延长，停用后约 3～12 日恢复正常。本品对出血时间无影响。

【不良反应】少数人有头晕、乏力、齿龈出血、皮下出血点，瘀斑及荨麻疹等，多在 24～48 小时出现，3～5 日内自行消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
去纤酶注射液	化学药	HZ003061

HY001655　去氧氟尿苷

【外文名称】Doxifluridine

药物理化信息

【化学名】5′－脱氧－5－氟尿嘧啶核苷

【分子式】$C_9H_{11}FN_2O_5$

【分子量】246.20

药物药理信息

【药理毒理】本品为新的氟化嘧啶系列药物之一，作为氟尿嘧啶（5－Fu）的前体药物，服用后在体内被嘧啶核苷磷酸化酶转换成游离的 5－Fu，从而发挥其抗肿瘤作用。动物肿瘤实验及临床检测均证明，肿瘤内嘧啶核苷磷酸化酶含量及活性显著高于正常组织，故本品在肿瘤组织内 5－Fu 的转化率亦明显高于各正常组织器官，依次为宫颈癌、膀胱癌、乳腺癌、大肠癌及胃癌，尤其大肠、胃及乳腺癌瘤组织内 5－Fu 浓度明显高于正常组织及血浆含量，从而可选择性地杀死肿瘤细胞，而对正常组织的损伤较小。分别影响 DNA 与 RNA 合成，主要作用于 S 期，对其他增殖期时相细胞亦有影响。

本品在肿瘤组织中具有高度活力的嘧啶核苷磷酸化酶（PyNPase）作用下转化为 5－Fu，经代谢后而抑制 DNA 的合成，同时也抑制 RNA 的功能，从而发挥抗肿瘤作用。有关资料表明，PyNPase 在胃癌、大肠癌、乳腺癌、膀胱癌等肿瘤组织中的活性组织内的浓度大大高于正常组织和血清中的浓度，所以

比其他氟大大高于其在正常组织中的活性，且专一性强。与以前的氟尿嘧啶衍生物的不同点是它在肿瘤组织内能有效地转化成5－Fu，故能选择地获得比正常组织内浓度高的5－Fu，因而5′－DFuR在肿瘤组织尿嘧啶类药物（5－Fu、FT－207、FuDR）显示出更强的抗肿瘤活性和更小的毒性及不良反应。

【药代动力学】口服800mg吸收迅速，未转换体的血清浓度1～2小时达峰值（1μg/ml，5－Fu的浓度也在1～2小时达峰值，其浓度为未转换体的1/10。肿瘤组织中氟尿嘧啶浓度较高，所有代谢物均由尿排出。

【药物相互作用】抗病毒药索立夫定与本品或氟尿嘧啶并用时，可阻碍后者代谢，导致血液中浓度升高，对骨髓抑制显著，出现严重血液毒性可导致死亡，故严禁并用。

【不良反应】

1．骨髓抑制主要为白细胞及血小板减少，偶见全血细胞减少。

2．消化系统：恶心、呕吐、食欲减退，时有腹痛、腹胀、便秘、口腔炎等，偶见胃溃疡、舌炎等。

3．精神神经系统：定向或听觉障碍，偶行路或感觉障碍，椎体外系征候以及麻痹、尿失禁等。偶见嗅觉异常。

4．心电图异常、脱发、色素沉着、荨麻疹等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
去氧氟尿苷胶囊	化学药	HZ003062
去氧氟尿苷片	化学药	HZ003063

HY001656 去氧麻黄碱

【外文名称】Metamfetamine

药物管理信息

【特殊管理分类】一类精神药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为精神药品，但我国未生产或使用。

HY001657 去氧麻黄碱外消旋体

【外文名称】Metamfetamine Racemate

药物管理信息

【特殊管理分类】一类精神药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为精神药品，但我国未生产或使用。

HY001658 去氧孕烯

【其他名称】地索高诺酮

【外文名称】Desogestrel

药物药理信息

【药理毒理】为口服强效孕激素，没有雄激素和雌激素活性。

实验证明，其孕激素活性较炔诺酮强18倍、较炔诺孕酮强1倍。最大特点是无雄激素作用，还可升高高密度脂蛋白（HDL）；抗雌激素活性亦强于炔诺酮和左炔诺孕酮。具有显著的排卵抑制作用，尚能改变宫颈黏液稠度、抑制子宫内膜发育等。本品及其3－酮代谢物与子宫内膜孕酮受体的亲和力高于黄体酮和炔诺酮。临床用作避孕药效果可靠，周期控制好，不降低HDL，有利于脂质代谢，不增加体重，无雄性症等副作用。

【药代动力学】口服$t_{1/2}$为21～42.5小时。

【药物相互作用】利福平、巴比妥类、苯妥英钠等可使去氧孕烯和炔雌醇活性降低。

【不良反应】可有不规则出血，开始发生率较高，半年后减少，尚可见恶心、头痛、闭经、乳胀、乏力、抑郁等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
去氧孕烯炔雌醇片	化学药	HZ003065

HY001659 去乙酰毛花苷

【外文名称】Deslanoside

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】3－［（*O*－β－D－葡吡喃糖基－（1→4）－*O*－2,6－二脱氧－β－D－核－己吡喃糖基－（1→4）－*O*－2,6－二脱氧－β－D－核－己吡喃糖基）氧化］－12,14－二羟基－心甾－20（22）－烯内酯

【分子式】$C_{47}H_{74}O_{19}$

【分子量】943.09

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；无臭，味苦；有引湿性。本品在甲醇中微溶，在乙醇中极微溶解，在水或三氯甲烷中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加无水吡啶溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 20mg 的溶液，依法测定，比旋度应为 +7°至 +9°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：强心药。

1．正性肌力作用：本品选择性地与心肌细胞膜 Na^+/K^+ - ATP 酶活性，使心肌细胞膜内外 Na^+ - K^+ 主动偶联转运受损，心肌细胞内 Na^+ 浓度升高，从而使肌膜上 Na^+ - Ca^{2+} 交换趋于活跃，使细胞浆内 Ca^{2+} 增多，肌浆网内 Ca^{2+} 储量亦增多，心肌兴奋时，有较多的 Ca^{2+} 释放；心肌细胞内 Ca^{2+} 浓度增高，激动心肌收缩蛋白从而增加心肌收缩力。

2．负性频率作用：由于其正性肌力作用，使衰竭心脏心输出量增加，血流动力学状态改善，消除交感神经张力的反射性增高，并增强迷走神经张力，因而减慢心率、延缓房室传导。此外，小剂量时提高窦房结对迷走神经冲动的敏感性，可增强其减慢心率作用。由于其负性频率作用，使舒张期相对延长，有利于增加心肌血供；大剂量（通常接近中毒量）则可直接抑制窦房结、房室结和希氏束而呈现窦性心动过缓和不同程度的房室传导阻滞。

3．心脏电生理作用：通过对心肌电活动的直接作用和对迷走神经的间接作用，降低窦房结自律性；提高普肯野氏纤维自律性；减慢房室结传导速度，延长其有效不应期，导致房室结隐匿性传导增加，可减慢心房纤颤或心房扑动的心室率；由于本药缩短心房有效不应期，当用于房性心动过速和房扑时，可能导致心房率的加速和心房扑动转为心房纤颤；缩短普肯野纤维有效不应期。

【药代动力学】系天然存在于毛花洋地黄中的强心苷，在提取过程中，其可经水解失去葡萄糖和乙酸而成地高辛，为一种速效强心苷，其作用较洋地黄、地高辛快，但比毒毛化苷 K 稍慢。静脉注射可迅速分布到各组织，10～30 分钟起效，1～3 小时作用达高峰，作用持续时间 2～5 小时。蛋白结合率低，为 25%。半衰期为 33～36 小时。3～6 日作用完全消失在体内转化为地高辛，经肾脏排泄。由于排泄较快，蓄积性较小。

【药物相互作用】

1．与两性霉素 B、皮质激素或失钾利尿剂如布美他尼（制品为丁尿胺）、依他尼酸等同用时，可引起低血钾而致洋地黄中毒。

2．与制酸药（尤其三硅酸镁）或止泻吸附药如白陶土、果胶、考来烯胺和其他阴离子交换树脂、柳氮磺吡啶或新霉素、对氨水杨酸同用时，可抑制洋地黄强心苷吸收而导致强心苷作用减弱。

3．与抗心律失常药、钙盐注射剂、可卡因、洋库溴胺、萝芙木碱、琥珀胆碱或拟肾上腺素类药同用时，可因作用相加而导致心律失常。

4．有严重或完全性房室传导阻滞且伴正常血钾者的洋地黄化患者不应同时应用钾盐，但噻嗪类利尿剂与本品同用时，常须给予钾盐，以防止低钾血症。

5．β－受体阻滞剂与本品同用，有导致房室传导阻滞发生严重心动过缓的可能，应重视。但并不排除 β－阻滞剂用于洋地黄不能控制心室率的室上性快速心律失常。

6．与奎尼丁同用，可使本品血药浓度提高约一倍，提高程度与奎尼丁用量相关，甚至可达到中毒浓度，即使停用地高辛，其血药浓度仍继续上升，这是奎尼丁从组织结合处置换出地高辛，减少其分布容积之故。两药合用时应酌减地高辛用量 1/2～1/3。

7．与维拉帕米、地尔硫䓬、胺碘酮合用，由于降低肾及全身对地高辛的清除率而提高其血药浓度，可引起严重心动过缓。

8．螺内酯可延长本品半衰期，需调整剂量或给药间期，随访监测本品的血药浓度。

9．血管紧张素转换酶抑制剂及其受体拮抗剂可使本品血药浓度增高。

10．依酚氯铵与本品合用可致明显心动过缓。

11．吲哚美辛可减少本品的肾清除，使本品半衰期延长，有中毒危险，需监测血药浓度及心电图。

12．与肝素同用，由于本品可能部分抵消肝素的抗凝作用，需调整肝素用量。

13．洋地黄化时静脉用硫酸镁应极其谨慎，尤其是也静注钙盐时，可发生心脏传导阻滞。

14．红霉素由于改变胃肠道菌群，可增加本品在胃肠道的吸收。

15．甲氧氯普胺因促进肠道运动而减少地高辛的生物利用度约 25%。普鲁本辛因抑制肠道蠕动而提高地高辛生物利用度约 25%。

【药物过量】西地兰起作用时是通过体内释放地高辛起作用，故中毒时是测地高辛中毒。

1．地高辛中毒浓度为 > 2.0ng/ml。

2．如给予负荷量，需了解患者在 2～3 周之前是否服用过任何洋地黄制剂，如有洋地黄残余作用，需减少地高辛剂量，以免中毒。

3．强心苷剂量计算应按标准体重，因脂肪组织不摄取强心苷。

4．推荐剂量只是平均剂量，必须按照患者需要调整每次剂量。

5．肝功能不全者，应选用不经肝脏代谢的地高辛。

6. 肾功能不全者，不宜应用地高辛，应选用洋地黄毒苷。

7. 洋地黄化患者常对电复律极为敏感，应高度警惕。

8. 透析不能从体内迅速去除本品。

9. 在本品引起严重或完全性房室传导阻滞时，不宜补钾。

10. 肾功能不全、老年及虚弱者在常用剂量及血药浓度时就可有中毒反应。婴幼儿尤其是早产儿和发育不全儿，要在血药浓度及心电监测下调整剂量。

11. 传统的治疗心力衰竭是在数日（1～3日）内给本品较大剂量（负荷量）以达到洋地黄化，然后逐日给以维持量来弥补消除量。目前认为，半衰期较短的本品（半衰期平均为36小时），一日口服0.25mg，经5个半衰期（约6～8日）亦可达到最终血药浓度（洋地黄化）的96%，既达到治疗效果，又避免洋地黄中毒。如不能达到治疗效果，可适当增加剂量。如病情较急，为较快达到有效浓度，仍需先给负荷量，但剂量需个体化。

12. 当患者由强心苷注射液改为本品时，为补偿药物间药动学差别，需要调整剂量。

13. 应静脉给药，因为肌内注射有明显局部反应，且作用慢、生物利用度差。

14. 本品过量及毒性反应的处理：轻度中毒者，停用本品及利尿治疗，如有低钾血症而肾功能尚好，可给以钾盐。心律失常者可用：①氯化钾静脉滴注，对消除异位心律往往有效。②苯妥英钠，该药能与强心苷竞争性争夺 $Na^+ - K^+ - ATP$ 酶，因而有解毒效应。成人用100～200加注射用水20ml缓慢静注，如情况不紧急，亦可口服，每次0.1mg，每日3～4次。③利多卡因，对消除室性心律失常有效，成人用50～100mg加入葡萄糖注射液中静脉注射，必要时可重复。④阿托品，对缓慢性心律失常者可用。成人用0.5～2mg皮下或静脉注射。⑤心动过缓或完全房室传导阻滞有发生阿斯综合征的可能时，可安置临时起搏器。异丙肾上腺素，可以提高缓慢的心率。⑥依地酸钙钠，以其与钙螯合的作用，也可用于治疗洋地黄所致的心律失常。⑦对可能有生命危险的洋地黄中毒可经膜滤器静脉给与地高辛免疫Fab片段，每40mg地高辛免疫Fab片段，大约结合0.6mg地高辛或洋地黄毒苷。⑧注意肝功能不良时应减量。同时服用苯妥英钠、苯巴比妥、保泰松、利福平会使血中洋地黄毒苷浓度降低50%。

【不良反应】

1. 常见的不良反应包括：新出现的心律失常、胃纳不佳或恶心、呕吐（刺激延髓中枢）、下腹痛、异常的无力、软弱。

2. 少见的反应包括：视力模糊或“黄视”（中毒症状）、腹泻、中枢神经系统反应如精神抑郁或错乱。

3. 罕见的反应包括：嗜睡、头痛及皮疹、荨麻疹（过敏反应）。

4. 在洋地黄的中毒表现中，心律失常最重要，最常见者为室性早搏，约占心脏反应的33%。其次为房室传导阻滞，阵发性或加速性交界性心动过速，阵发性房性心动过速伴房室传导阻滞，室性心动过速、窦性停搏、心室颤动等。儿童中心律失常比其他反应多见，但室性心律失常比成人少见。新生儿可有P－R间期延长。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
去乙酰毛花苷注射液	化学药	HZ003066

HY001660 炔雌醇

【其他名称】 Digyn－E、EE、Estinyl、Ethidol、Eticyclin、Etivex、Linoral、Loestrin、乙炔雌二醇

【外文名称】 Ethinylestradiol

药物管理信息

【依据标准】 中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】 3－羟基－19－去甲－17α－孕甾－1,3,5（10）－三烯－20－炔－17－醇

【分子式】 $C_{10}H_{24}O_2$

【分子量】 296.41

【性状及组成】 本品为白色或类白色的结晶性粉末；味臭。本品在乙醇、丙醇或乙醚中易溶，在三氯甲烷中溶解，在水中不溶。

熔点：本品的熔点为180～186℃。

比旋度：取本品，精密称定，加吡啶溶液并定量稀释制成每1ml中约含10mg的溶液，依法测定，比旋度为－26°至－31°。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：雌激素类药。炔雌醇对下丘脑和垂体有正、负反馈作用。小剂量可刺激促性腺素分泌；大剂量则抑制其分泌，从而抑制卵巢的排卵，达到抗生育作用。

【药代动力学】 炔雌醇为作用较强的口服有效的雌激素。其活性较雌二醇大10～39倍，口服后能被迅速吸收，60～90分钟可达血药峰值。生物利用度40%～50%左右，有明显个体差异。首过效应可达58%，主要代谢产物经过肝肠循环可被再吸收。醋

酸甲羟孕酮平均半衰期为 38 小时。代谢和清除主要在肝脏，羟基化后经肾脏排除。

【药物相互作用】 口服 1g 维生素 C 能使单次口服炔雌醇生物利用度提高到 60% ~ 70%。与孕激素类药合用，具有抑制排卵的协同作用，可用作避孕药。

【不良反应】

1. 可有恶心、呕吐、头痛、乳房胀痛、腹胀等。

2. 偶有阴道不规则流血、闭经、尿频、尿痛、头痛、血压升高、皮疹、乳腺小肿块等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
醋酸甲羟孕酮复合胶囊	化学药	HZ000578
复方八维甲睾酮胶囊	化学药	HZ001076
复方醋酸甲地孕酮片	化学药	HZ001116
复方炔雌醇甲羟孕酮胶囊	化学药	HZ001354
复方炔诺酮膜	化学药	HZ001355
复方炔诺酮片	化学药	HZ001356
复方炔诺孕酮滴丸	化学药	HZ001357
复方炔诺孕酮片	化学药	HZ001358
复方孕二烯酮片	化学药	HZ001484
复方左炔诺孕酮滴丸	化学药	HZ001489
复方左炔诺孕酮片	化学药	HZ001490
去氧孕烯炔雌醇片	化学药	HZ003065
炔雌醇环丙孕酮片	化学药	HZ003067
炔雌醇片	化学药	HZ003068
三相避孕片	化学药	HZ003168
左炔诺孕酮炔雌醇（三相）片	化学药	HZ005157

HY001661　炔雌醚

【其他名称】 3 - 炔雌醇环戊醚、CEE、Estrovis、环戊炔雌醚、炔雌醇环戊醚

【外文名称】 Quinestrol

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 17α - 乙炔基雌烷二醇，3 - 环戊醚

【分子式】 $C_{25}H_{32}O_2$

【分子量】 364.50

【性状及组成】 本品为白色或几乎白色的结晶或结晶性粉末。

本品在乙醇、丙酮、乙酸乙酯或三氯甲烷中溶解，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 106 ~ 112 ℃。

比旋度：取本品，精密称定，加二氧六环制成每 1ml 中约含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为 0° 至 + 5°。

药物药理信息

【药理毒理】 为作用较强的口服长效雌激素，其活性为炔雌醇的 4 倍。

从脂肪释出后主要代谢为炔雌醇形式后再起作用，故其作用机制同炔雌醇。

本品为长效口服复方避孕片中的雌激素成分。与孕激素合用可作为口服长效避孕药。

【药代动力学】 口服后很快在消化道内吸收进入血液循环，并维持在血液内的高浓度，然后贮藏于脂肪组织中，缓慢释放，起长效作用。作用可维持一个月以上。代谢物与葡萄糖醛酸结合缓慢从尿中排泄。

【不良反应】 可有恶心、呕吐、乳房胀痛、白带增多等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
炔诺孕酮炔雌醚片	化学药	HZ003072
左炔诺孕酮炔雌醚片	化学药	HZ005158

HY001662　炔诺酮

【其他名称】 Norluten、Norlutin、Primolut N

【外文名称】 Norethisterone

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 17β - 羟基 - 19 - 去甲 - 17α - 孕甾 - 4 - 烯 - 20 - 炔 - 3 - 酮

【分子式】 $C_{10}H_{26}O_2$

【分子量】 298.43

【性状及组成】 本品为白色或类白色的结晶性粉末；无臭，味微苦。本品在三氯甲烷中溶解，在乙醇中微溶，在丙酮中略溶，在水中不溶。

熔点：本品的熔点为 202 ~ 208℃。

比旋度：取本品，精密称定，加氯仿溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为 - 22°至 - 28°。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：孕激素类药。

本品有较强的孕激素样作用，能使子宫内膜转

化为蜕膜样变，其抑制垂体分泌促性腺激素作用呈明显剂量关系，并有一定的抗雌激素作用，具有较弱的雄激素活性和蛋白同化作用。宫颈黏液变稠，有利于精子穿透。

【药代动力学】口服可从胃肠道吸收，t_{max}为0.5～4小时，平均1.17小时，半衰期为5～14小时，血浆蛋白结合率为80%，作用持续至少24小时，吸收后大多与葡萄糖醛酸结合，由尿排出。

【药物相互作用】利福平、氯霉素、氨苄青霉素、苯巴比妥、苯妥英钠、扑米酮、甲丙氨酯、氯氮䓬、对乙酰氨基酚及吡唑酮类镇痛药（保泰松）等同服可产生肝微粒体酶效应，加速炔酮在体内的代谢，导致避孕失败、突破性出血发生率增高，应于注意。

【不良反应】主要为恶心、头晕、倦怠；突破性出血。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方炔诺酮膜	化学药	HZ001355
复方炔诺酮片	化学药	HZ001356
复方戊酸雌二醇片	化学药	HZ001435
炔诺酮滴丸	化学药	HZ003069
炔诺酮片	化学药	HZ003070

HY001663 炔诺孕酮

【外文名称】Norgestrel

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】13－乙基－17－羟基－18,19－二去甲－17α－孕甾－4－烯－20－炔－3－酮

【分子式】$C_{21}H_{28}O_2$

【分子量】312.45

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末；无臭，无味。

本品在三氯甲烷中溶解，在甲醇中微溶，在水中不溶。

熔点：本品的熔点为204～212 ℃，熔距在5℃以内。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：孕激素类药。

主要作用于下丘脑和垂体，使月经中期血中的促卵泡激素和促黄体生成激素水平高峰降低或消失，促使卵巢不排卵。有明显的抗雌激素活性，使宫颈黏液变稠，阻碍精子穿透，又可使子宫内膜变薄，分泌功能不良，不利于孕卵着床。

【药代动力学】口服易自胃肠道吸收。曾试验单次口服消旋炔诺孕酮1mg，2小时、8小时及24小时测定血药浓度依次为11.1ng/ml、3.3ng/ml及1.1ng/ml，消旋体的半衰期为3.4～10.3小时。在肝内代谢，代谢物主要为3α，5β－四氢甲基炔诺酮，由尿及粪中排出，排出的代谢物大多为葡萄糖醛酸及硫酸的结合物。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方炔诺孕酮滴丸	化学药	HZ001357
复方炔诺孕酮片	化学药	HZ001358
炔诺孕酮片	化学药	HZ003071
炔诺孕酮炔雌醚片	化学药	HZ003072

HY001664 炔已蚁胺

【外文名称】Ethinamatum

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

药物药理信息

【药理毒理】本品为非巴比妥类短时间（2～4小时）作用的催眠药。用于不易入睡者、对巴比妥类过敏或肝病失眠者。

HY001665 炔孕酮

【其他名称】Ethinyltestosterone、Progestoral、妊娠素、乙炔睾酮

【外文名称】Ethisterone

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】17β－羟基－17α－乙炔基－雄甾－4－烯－3－酮

【分子式】$C_{21}H_{28}O_2$

【分子量】312.45

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶性粉末；无臭或几乎无臭。本品在吡啶中略溶，在三氯甲烷中微溶，在水中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加吡啶溶解并定量稀释制成每1ml中约含10mg的溶液，依法测定，比旋度为+28°至+33°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：孕激素类药。

其作用与黄体酮相似，能使增生期子宫内膜转化为分泌期，并促进乳腺发育。抑制 LH、抑制排卵、子宫内膜萎缩，抑制子宫肌肉收缩作用，口服比黄体酮强 15 倍，而雄激素作用很小，为睾丸素的 1/10。

【药代动力学】本品亦易从口腔黏膜吸收，因此舌下含用也有效，合成孕激素在肝内破坏缓慢，作用时间比孕酮长，部分孕激素代谢物可从胆道分泌入肠中，少量由粪便排出。

【不良反应】可有恶心、呕吐、畏食等胃肠道反应及头痛、嗜睡、水肿、体重增加、肝功能障碍等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
炔孕酮片	化学药	HZ003073

HY001666　群多普利

【外文名称】Trandolapril

药物药理信息

【药理毒理】本品为不含巯基的 ACEI。生效快，持久。适用于各种程度的高血压。

HY001667　人参多糖

【外文名称】Ginseng Polysacchride

药物药理信息

【药理毒理】

1．本品能诱生内源性肿瘤坏死因子（TNF），对肿瘤细胞有杀伤和抑制作用，对正常小鼠及荷瘤小鼠机体免疫功能有增强和激活作用。

2．本品对小 S180 鼠肉瘤有明显的抑制作用；对环磷酰胺化疗有明显的抑瘤增效作用；对环磷酰胺化疗所致的白细胞总数减少，有明显的升白作用；并能明显提 S180 高肉瘤荷瘤小白鼠腹腔巨噬细胞吞噬功能，促进血清溶血素生成，具有增强非特异免疫功能和体液免疫功能的作用。

3．通过对受 7.5～8.5Gy X 线一次全身照射小鼠预防给药试验，表现本品对受照动物有减轻造血系统损伤、促进造血功能恢复的抗辐射损伤作用。

4．本品对 D－氨基酸半乳糖所致的肝损伤具有明显的保护作用。其作用机制是稳定和加强肝细胞膜、保护肝细胞线粒体及维持肝组织 cAMP/cGMP 比值的相对稳定。

5．本品肌内注射及静脉注射给药均未见急性毒性反应。

【不良反应】偶有用药部位局部疼痛感，可自行缓解。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方氟尿嘧啶口服液	化学药	HZ001167
复方氟脲嘧啶注射液	化学药	HZ001169
人参多糖注射液	化学药	HZ003076

HY001668　人参茎叶皂苷

【外文名称】Ginserg Stem and Leaf Faponins

【性状及组成】人参茎叶主要成分为人参总皂苷。在总皂苷中可分三类皂苷：一是人参二醇皂苷，含有单体皂苷 Ra_1、Ra_2、Ra_3、Rb_1、Rb_2、Rb_3、Rc、Rd、Rg_3、Rh_2、RF_2 等；二是人参三醇皂苷，含有单体皂苷 Rg_1、Rg_2、Re、Rh_1 等；三是齐墩果酸—有单体皂苷 Ro。单体皂苷含量高低依次为 Re、Rd、Rc、Rg_1、Rb_2、Rb_1。

药物药理信息

【药理毒理】齐墩果酸型如人参皂苷 R_0，主要有抗炎、抗血小板释放作用。人参二醇型如人参皂苷 Rb_1 和 Rb_2 表现为中枢神经抑制、降低细胞内钙、抗氧化、清除自由基和改善心肌缺血再灌注损伤等作用，原人参二醇组皂苷无溶血活性。人参三醇皂苷有溶血活性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方环磷酰胺片	化学药	HZ001206
复方甲硝唑泡腾片	化学药	HZ001223
复方甲硝唑栓	化学药	HZ001225
参雄温阳胶囊	民族药	MZ000497
长白复尔春胶囊	中成药	ZC000517
复方树舌片	中成药	ZC001517
活力源口服液	中成药	ZC002318
活力源片	中成药	ZC002319
减肥胶囊	中成药	ZC002441
降糖胶囊	中成药	ZC002559
救心丸	中成药	ZC002895
雷龙片	中成药	ZC003171
鹿鞭回春胶囊	中成药	ZC003395
强肾颗粒	中成药	ZC003992
强肾片	中成药	ZC003993

续表

制剂名称	类别	序号
人参茎叶皂苷胶囊	中成药	ZC004317
人参茎叶皂苷片	中成药	ZC004318
人参茎叶总皂苷注射液	中成药	ZC004319
蓉蛾益肾口服液	中成药	ZC004358
麝香心脑乐胶囊	中成药	ZC004716
麝香心脑乐片	中成药	ZC004717
参柴肝康片	中成药	ZC004738
参棘软膏	中成药	ZC004767
参胶胶囊	中成药	ZC004768
参芪降糖胶囊	中成药	ZC004825
参芪降糖颗粒	中成药	ZC004826
参芪降糖片	中成药	ZC004827
参芍胶囊	中成药	ZC004903
参芍片	中成药	ZC004904
参芝安神口服液	中成药	ZC004925
维肝福泰片	中成药	ZC005673
消糜栓	中成药	ZC006084
心欣舒胶囊	中成药	ZC006463
益心宁神片	中成药	ZC006917

HY001669 人参皂苷

【外文名称】Ginsenoside

【性状及组成】人参皂苷是14种以上皂苷的混合物。分别称为人参皂苷 R_0、Ra_1、Ra_2、Rb_1、Rb_2、Rb_3、Rc、Rd、Re、Rf、R_{20} - gluco - f、Rg_1、Rg_2、Rh_1 等，均为三萜皂苷。其中四环三萜的达玛脂烷系皂苷为主要活性成分，加酸水解最后产物为人参二醇，如人参皂苷 Ra_1、Ra_2、Rb_1、Rb_2、Rb_3、Rc、Rd 等；有的水解产生人参三醇，如人参皂苷 Re、Rf、Rg_1、Rg_2、Rh_1 等。其次为五环三萜的齐墩果烷系皂苷，其苷元为齐墩果酸，如人参皂苷 R_0。

药物药理信息

【药理毒理】齐墩果酸型如人参皂苷 R_0，主要有抗炎、抗血小板释放作用。人参二醇型如人参皂苷 Rb_1 和 Rb_2 表现为中枢神经抑制、降低细胞内钙、抗氧化、清除自由基和改善心肌缺血再灌注损伤等作用，原人参二醇组皂苷无溶血活性。人参三醇皂苷有溶血活性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方八维甲睾酮胶囊	化学药	HZ001076
力加寿片	中成药	ZC003181
七生静片	中成药	ZC003821
血栓心脉宁胶囊	中成药	ZC006603
血栓心脉宁片	中成药	ZC006604

HY001670 人参皂苷 Rg_1

【外文名称】Ginsenoside Rg_1

药物药理信息

【药理毒理】

1. 调节中枢神经的兴奋与抑制呈双向作用：人参对中枢神经系统有兴奋与抑制的双向作用，人参皂苷 Rg 类有中枢兴奋作用。

2. 增强学习与记忆功能：人参皂苷 Rg_1 缩短已经学习的大鼠反应潜伏时间和走行时间，且可促进学习和逆转学习的获得，对小鼠学习行为的减退有预防效果。人参皂苷 Rg_1 可明显改善 β - AP 所致小鼠被动回避、空间学习记忆能力及皮层海马组织 ChAT 活性的下降。对 β - AP（25 ~ 35）所致的小鼠学习记忆障碍有显著改善作用，其对胆碱能系统的影响是 Rg_1 重要作用机制之一。人参皂苷 Rg_1、Rb_1 是人参促智的主要有效成分，它们能增加脑突触体对 ^3H - 胆碱的摄取，增加乙酰胆碱的合成和释放，提高中枢 M 胆碱受体的密度。

3. 抗神经细胞凋亡：人参皂苷 Rg_1 能增强细胞活性，降低 LDH 的释放，减轻细胞核形态的改变，减少 DNA 断裂，增加细胞膜流动性，抑制细胞凋亡。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
七生力片	民族药	MZ000382

HY001671 人参皂苷 Rg_3

【外文名称】Ginsenoside Rg_3

药物药理信息

【药理毒理】人参皂苷 Rg_3 单独口服，对实体瘤抑制率达60%，对多种动物和人体肿瘤肺转移、肝转移的抑制率为60% ~ 70%；人参皂苷 Rg_3 能调节免疫功能，合并化疗有增效减毒作用、防止白细胞下降、脱发等。抗转移机制研究表明，人参皂苷 Rg_3 对多种高转移恶性肿瘤浸润生长的直接抑制率为

90%以上，人参皂苷 Rg_3 能阻断肿瘤细胞对纤维粘连蛋白和层粘连蛋白的结合，破坏肿瘤细胞在血管壁的着床，明显抑制肿瘤内皮细胞的增殖生长和新生血管的形成。

【不良反应】

1．少数患者服药后可出现口咽干燥、口腔溃疡。如果过量服用可能出现咽痛、头晕、耳鸣、鼻血、胸闷、多梦等。

2．Ⅰ期试验中，高剂量组有1例受试者用药期间出现转氨酶轻度异常，但尚不明确定是否与服用本品有关。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
参一胶囊	中成药	ZC004923

HY001672　壬苯醇醚

【外文名称】 Nonoxinol

药物管理信息

【依据标准】 中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】 壬基苯酚和环氧乙烷缩聚而成的无水混合物

【分子式】 $C_9H_{19}C_6H_4(OCH_2CH_2)_NOH$（式中N的平均值为9）

【性状及组成】 本品为壬基苯酚和环氧乙烷缩聚而成的无水混合物。

本品为无色或淡黄色黏稠液体；无臭，10℃以下易凝结。本品在乙醇中极易溶解，在水中易溶。

浊点：取本品1.0g，置250ml烧杯中，加水100ml，将温度计浸入溶液中央，在不断搅拌下，置水浴中加热至溶液浑浊后，继续升温10℃，移去水浴，不断搅拌，至溶液澄明（温度计水银球完全清晰可见）时，记录该点温度，应为52～56℃。

酸值：本品的酸值不大于0.2。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：表面活性剂，杀精子药。

本品系非离子型表面活性剂，通过降低精子的脂膜表面张力，改变精子渗透压而杀死精子或使它们不能游动，难于穿透宫颈口而无法使卵子受精，达到避孕效果。

【药物相互作用】 如正在使用其他药品，尤其是口服避孕药时，在使用本品前应咨询医师或药师。

【不良反应】

1．偶见过敏反应，可使女性外阴或阴道，甚至男性阴茎发生较严重的刺激症状，如局部瘙痒、疼痛。

2．少数患者局部有轻度刺激症状，阴道分泌物增多。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
壬苯醇醚膜	化学药	HZ003078
壬苯醇醚凝胶	化学药	HZ003079
壬苯醇醚栓	化学药	HZ003080
壬苯醇醚阴道片	化学药	HZ003081

HY001673　绒促性素

【其他名称】 A．P．L、Follutein、普罗兰、Pregnyl、Profasi HP、绒膜激素、人绒毛膜促性腺激素（Chorionic Gonadotrophin，human）

【外文名称】 Chorionic Gonadotrophin

药物管理信息

【依据标准】 中国药典2005年版·第2部

【性状及组成】 本品为孕妇尿中提取的绒毛膜促性腺激素。按干燥品计算，每1mg的效价不得少于2500单位。

本品为白色或类白色的粉末。本品在水中溶解，在乙醇、丙酮或乙醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：促性腺激素药。

对女性能促进和维持黄体功能，使黄体合成孕激素。可促进卵泡生成和成熟，并可模拟生理性的促黄体生成素的高峰而促发排卵。对男性能使垂体功能不足者的睾丸产生雄激素，促使睾丸下降和男性第二性征的发育。

【药代动力学】 $t_{1/2}$ 为双相，分别为11和23小时，血药浓度达峰时约为12小时，120小时后降至稳定的低浓度，给药32～36小时内发生排卵。24小时内10%～12%的原形经肾随尿排出。

【药物相互作用】 与脑下垂体促性腺激素合并用药时（如HMG），可能使不良反应增加，应慎用。

【不良反应】

1．用于促排卵时，较多见者为诱发卵巢囊肿或轻到中度的卵巢肿大，伴轻度胃胀、胃痛、盆腔痛，一般可在2～3周内消退，少见者为严重的卵巢过度刺激综合征，由于血管通透性显著提高而致体液在胸腔、腹腔和心包腔内迅速大量积聚引起多种并发症，如血容量降低、电解质紊乱、血液浓缩、腹腔出血、血栓形成等。临床表现为腹部或盆腔部剧烈

疼痛、消化不良、水肿、尿量减少、恶心、呕吐或腹泻，气促、下肢肿胀等。往往发生在排卵后 7～10 天或治疗结束后，反应严重可危及生命。

2. 用于治疗隐睾症时偶可发生男性性早熟，表现为痤疮、阴茎和睾丸增大、阴毛生长增多、身高生长过快。

3. 较少见的不良反应有：乳房肿大、头痛、易激动、精神抑郁、易疲劳。

4. 偶有注射局部疼痛、过敏性皮疹。

5. 用本品促排卵可增加多胎率或新生儿发育不成熟、早产等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用绒促性素	化学药	HZ004943

HY001674 溶菌酶

【外文名称】Lysozyme

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（生化药品）·第 1 册

【性状及组成】本品系自新鲜鸡蛋清中提取的一种能分解粘多糖的碱性蛋白酶，常与氯离子结合成为溶菌酶氯化物。按干燥品计算，每 1mg 的效价不得少于 6250 单位。

本品为白色或微黄色的结晶性或无定形粉末；无臭，味甜；水溶液遇碱易破坏。

本品在水中易溶，在丙酮或乙醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品是在生物体内广泛分布的一种黏多糖水解酶，能液化革兰阳性菌细胞壁的不溶性多糖，将其水解成可溶性黏肽，是一种具杀菌作用的天然抗感染物质，具有抗菌、抗病毒、抗炎、增强抗生素疗效及加快组织恢复的作用。

本品还能分解稠厚的粘蛋白，使炎性分泌物和痰液液化而易排出。

【药代动力学】口服容易吸收，血中有效浓度可维持 10～12 小时。

【不良反应】口服不良反应少，偶见过敏反应，有皮疹等表现。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
溶菌酶肠溶片	化学药	HZ003082
溶菌酶含片	化学药	HZ003083
溶菌酶口腔药膜	化学药	HZ003084

HY001675 鞣酸

【其他名称】单宁、单宁酸、鞣质、Tannin

【外文名称】Tannic Acid

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第 1 册

【性状及组成】本品系自五倍子中提制的一种鞣质。

本品为淡黄色至浅棕色粉末，或疏松有光泽的鳞片，遇光颜色加深；微有特臭，味极涩；水溶液显酸性反应，久置则缓缓分解。

本品在水、乙醇或稀乙醇中极易溶解，在甘油中易溶，在无水乙醇中微溶，在乙醚、苯、三氯甲烷或石油醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品能沉淀蛋白质，具有收敛作用，能使皮肤变硬，从而保护黏膜、制止过分分泌及止血；能减少局部疼痛，减少受伤处的血浆渗出，并有防止细菌感染的作用。主要用于褥疮，也可用于湿疹、痔疮及新生儿尿布疹等。

本品亦用于解毒，对去水吗啡、士的宁、洋地黄、铅、银、铜、锌等中毒时，可用其溶液洗胃，现已用其他解毒药代替；用于结肠造影时，于硫酸钡灌肠剂中加入本品 0.25%～0.5%灌肠，用以清洁结肠，便于显影。

【药物相互作用】本品与重金属及蛋白质有配伍禁忌，故忌与铁器接触。

【不良反应】本品口服对胃黏膜有刺激性，可引起恶心、呕吐；用于局部破损处，如大面积烧伤或加于硫酸钡灌肠剂灌肠时，易吸收中毒，对肝脏有剧烈的毒性，严重时造成肝坏死，并加深创面，延缓愈合，故不宜大面积或长期使用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方马勃水杨酸散	化学药	HZ001315
鞣柳硼三酸散	化学药	HZ003087
消痔灵注射液	中成药	ZC006143
痔特佳颗粒	中成药	ZC007449
痔特佳片	中成药	ZC007450

HY001676 鞣酸蛋白

【其他名称】Albutannin、Bistabin、Tannalbin

【外文名称】Albumin Tannate

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第 1 册

【性状及组成】本品为黄棕色粉末；微臭，味微涩。

本品在水、乙醇、三氯甲烷或乙醚中几乎不溶，在氢氧化碱溶液或碳酸碱溶液中即分解。

药物药理信息

【药理毒理】本品为鞣酸与蛋白质的结合物，含鞣酸 50%。口服后对胃无刺激，在胃内不分解，至小肠遇碱性肠液，经胰蛋白酶分解，缓慢释放出鞣酸，与肠黏膜表层内的蛋白质反应，凝固，形成一层保护膜，减轻刺激；同时，鞣酸还能使肠黏膜血管收缩，呈收敛作用，降低炎症渗出物，减少肠蠕动，有助于收敛、止血。

【药物相互作用】

1. 本品能影响胰酶、胃蛋白酶、乳酶生等的药效，不宜同服。

2. 本品不应与碱性药物同服，因 B 族维生素可能被破坏。

【不良反应】大量服用引起便秘。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方小檗碱鞣酸蛋白胶囊	化学药	HZ001443
鞣酸蛋白酵母散	化学药	HZ003088
鞣酸蛋白片	化学药	HZ003089

HY001677　鞣酸加压素

【其他名称】长效尿崩停、Vasopressin Tannate

【外文名称】Vasopressin Tannic Acid

药物理化信息

【化学名】加压素和鞣酸的结合物。

药物药理信息

【药理毒理】抗利尿激素药。本品能促进远端肾小管及集合管对水分的重吸收而具有抗利尿作用。

【药代动力学】本品肌内注射后，缓慢吸收，多数在体内破坏，小部分由肾排出。

【不良反应】剂量过大可发生水中毒及突发性严重多尿，少数病例发生严重过敏皮疹，注射部位硬结。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
鞣酸加压素吸入剂	化学药	HZ003090
鞣酸加压素注射液	化学药	HZ003091

HY001678　鞣酸苦参碱

【其他名称】无味苦参总碱

【外文名称】Sophora Alkaloidi Tannate

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 10 册

药物理化信息

【化学名】鞣酸苦参碱

药物药理信息

【药理毒理】本品为豆科植物苦参的根提取的总生物碱与五倍子提取的鞣质经反应而得的一种有机鞣酸弱碱盐。经口服后，在肠道游离出苦参总生物碱和鞣质而发挥药理活性。苦参总生物碱中的苦参碱、氧化苦参碱等多种活性成分，具有升高白细胞数、加强机体免疫力而起抗菌作用，鞣酸可使肠黏膜表层内的蛋白质沉淀，形成一层保护膜而减轻刺激，降低炎症渗透物和减少肠蠕动，起收敛止泻作用。

【药物相互作用】

1. 本品能影响胰酶、胃酶、乳酶生等的药效，不宜同服。

2. 如正在服用其他药品，服用本品前请咨询医师或药师。

【不良反应】少数病人有头昏、嗜睡、恶心等症状。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
鞣酸苦参碱胶囊	化学药	HZ003092
鞣酸苦参碱片	化学药	HZ003093
舒肤特	化学药	HZ003212

HY001679　鞣酸小檗碱

【其他名称】无味黄连素

【外文名称】Berberine Tannate

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 11 册

【分子式】$C_{10}H_{19}NO_5$

【分子量】353.37

药物药理信息

【药理毒理】鞣酸小檗碱在肠道中分解成小檗碱

和鞣酸，前者有抗菌作用，后者有收敛作用。小檗碱有抗菌作用，体外对多种革兰阳性及革兰阴性菌均具抑制作用，其中对溶血性链球菌、金黄色葡萄球菌、霍乱弧菌、脑膜炎球菌、志贺菌属、伤寒杆菌、白喉杆菌等有较强抑制作用。

体外试验证实小檗碱能增强白细胞及肝脏网状内皮系统的吞噬能力。志贺菌属、溶血性链球菌、金黄色葡萄球菌等极易对本品耐药性。

对阿米巴原虫也有一定作用。鞣酸能沉淀蛋白质，有收敛止血的作用。

【药代动力学】 口服吸收差。药物分布广，以心、骨、肝、肺等组织中为多。在组织中滞留的时间短暂，24 小时后仅剩微量，绝大部分药物在体内代谢清除，48 小时内以原形排出仅占给药量的 5% 以下。

【药物相互作用】 不宜与胰酶、胃蛋白酶、乳酶生同服；与铁剂等药不宜合用。

【不良反应】 局部用药偶有阴道烧灼感及分泌物增加，继续治疗随病情好转而逐渐消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
鞣酸小檗碱膜	化学药	HZ003094
小儿鞣酸小檗碱片	化学药	HZ003767

HY001680 肉豆蔻酸异丙酯

【外文名称】 Isopropyl Myristate

药物理化信息

【化学名】 四烷酸 - 1 - 甲基乙酯

【分子式】 $C_{17}H_{34}O_2$

【分子量】 270.51

【性状及组成】 本品为无色、透明、几无臭的液体，黏度较低，在约 3℃可凝冻。它是由 2 - 丙醇和高分子量的饱和脂肪酸（主要是肉豆蔻酸）形成的酯。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：润肤剂；经皮渗透促进剂；溶剂。

肉豆蔻酸异丙酯是非脂性润肤剂，极易被皮肤吸收。是半固体基质的组分之一，也可作为局部给药制剂中许多物质的溶剂。它应用于各种局部制剂和化妆品，包括浴油、化妆品、护发护甲产品、面霜、洗剂、护唇膏、剃须膏、润肤剂、除臭剂、耳部用混悬剂、阴道霜剂。例如，肉豆蔻酸异丙酯在某一冷霜处方中是一种自乳化成分，而这种冷霜处方可作为许多药物和皮肤用药物的基质；在化妆品中，其在水和甘油的稳定混合液中也有应用。

肉豆蔻酸异丙酯可作为透皮吸收制剂中的穿透促进剂，可与治疗用超声波和离子导入结合一起使用。肉豆蔻酸异丙酯在水 - 油凝胶缓释乳中可作为油相的主要成分。

【药物相互作用】 肉豆蔻酸异丙酯和橡胶接触时，橡胶溶胀，部分溶解，黏度降低；和塑料类（例如尼龙和聚乙烯）相接触时，会使这些材料溶胀。肉豆蔻酸异丙酯和固体石蜡有配伍禁忌并形成颗粒状混合物，也不宜与强氧化剂配伍。

【不良反应】 肉豆蔻酸异丙酯在化妆品和局部用制剂中应用广泛。一般认为肉豆蔻酸异丙酯是无毒、无刺激性的材料。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
参皇软膏	中成药	ZC004765

HY001681 乳果糖

【其他名称】 半乳醣甘果糖

【外文名称】 Lactulose

药物理化信息

【化学名】 4 - *O* - β - D 吡喃半乳糖基 - D - 呋喃果糖

【分子式】 $C_{12}H_{22}O_{11}$

【分子量】 342.30

药物药理信息

【药理毒理】

1. 乳果糖系人工合成的不吸收性双糖，在肠道内不被吸收，可被结肠细菌分解成乳酸和醋酸，使肠道 pH 值降至 6 以下，从而可阻断氨的吸收，减少内毒素的蓄积和吸收，使患者血氨恢复正常，并由昏迷转为清醒。

2. 乳果糖在小肠中不被吸收，在结肠中分解生成的酸性代谢物仅小部分被吸收，因此导致肠腔内渗透压升高，水和电解质潴留，肠容积增大，对肠壁产生机械性刺激，再加之酸性代谢物的化学性刺激，从而导泻。

【药物过量】 剂量过大可引起腹部不适、胃肠剂量过大可引起腹部不适、胃肠胀气、畏食、恶心、呕吐及腹泻，腹泻严重时应减少剂量，治疗初期容易发生。如服用过量，请立即向医务人员求助。

【不良反应】 经临床使用除个别患者服用后稍感恶心外，无其他不适，经继续服药或用一倍水稀释后可消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乳果糖口服溶液	化学药	HZ003095
乳果糖散	化学药	HZ003096
乳果糖糖浆	化学药	HZ003097

HY001682　乳酶生

【外文名称】Lactasin

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（生化药品）·第1册

【性状及组成】本品系乳酸菌制剂。每1g含活肠链球菌数不得少于1000万个。

本品为白色或淡黄色的干燥粉末，无腐败臭或其他恶臭。

药物药理信息

【药理毒理】本品在肠内能分解糖类产生乳酸，从而使肠内酸性增加，抑制肠内病原菌的生长繁殖。同时它还有防止蛋白质发酵和减少肠内的产气作用。因此，乳酶生常用来治疗消化不良、肠胀气及小儿饮食失调所引起的腹泻等症。

由于长期使用抗生素会抑制人体肠道中正常寄生的大量乳酸杆菌，使之比例失调而引起消化不良、胀气、腹泻等症状。也可作为长期使用广谱抗生素所引起的菌群失调症的辅助治疗。

【药物相互作用】

1．不宜与制酸药、抑菌剂、抗生素合用，至少应间隔3小时。

2．铋剂、鞣酸、活性炭、酊剂等能抑制、吸附或杀灭乳酸杆菌，故不可合用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方胰酶散	化学药	HZ001471
乳酶生片	化学药	HZ003098

HY001683　乳酸

【其他名称】Acidium Lacticum、α－Hydroxypropionic Acid、α－羟基丙酸

【外文名称】Lactic Acid

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】2－羟基丙酸及其缩合物的混合物

【分子式】$C_3H_6O_3$

【分子量】90.08

【性状及组成】本品为无色澄清或微黄色的黏性液体；几乎无臭，味微酸；有引湿性；水溶液显酸性反应。本品与水、乙醇或乙醚能任意混合，在三氯甲烷中不溶。

相对密度：本品的相对密度为1.20～1.21。

药物药理信息

【药理毒理】消毒防腐药。

【不良反应】高浓度对皮肤黏膜有刺激性及腐蚀性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方乳酸软膏	化学药	HZ001363
葡萄糖酸钙口服液	化学药	HZ002886
乳酸亚铁口服液	化学药	HZ003119
水杨酸复合洗剂	化学药	HZ003293

HY001684　乳酸氟罗沙星

【外文名称】Fleroxacin Lactale

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第59册

药物理化信息

【化学名】6，8－二氟－1－（2－氟乙基）－1，4－二氢－7－（4－甲基－1－哌嗪）－4－氧－3－喹啉羧酸的乳酸盐

【分子式】$C_{17}H_{18}F_3N_3O_3 \cdot C_3H_6O_3$

【分子量】459.42

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末；无臭、味微苦。

本品在水中微溶，在乙醇、醋酸乙酯或三氯甲烷中几乎不溶，在冰醋酸或氢氧化钠溶液中易溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品的作用机制是通过抑制细菌的DNA旋转酶而起杀菌作用。

本品为广谱抗菌药，对革兰阴性菌，包括大肠杆菌、肺炎杆菌、变形杆菌属、伤寒杆菌、副伤寒杆菌、志贺菌属、阴沟肠杆菌、产气肠杆菌、枸橼酸菌属、黏质沙雷菌、铜绿假单胞菌、脑膜炎双球菌、流感嗜血杆菌、摩拉卡他菌、嗜肺军团菌、淋球菌等均有较强的抗菌作用。对葡萄球菌属、溶血链球菌等革兰阳性球菌亦具有中等抗菌作用。

本品属喹诺酮类抗菌药物，适用于肠杆菌科细菌如肺炎克雷伯菌、变形杆菌、沙门菌、大肠埃希

菌、甲氧西林敏感葡萄球菌等敏感菌引起的中、重度呼吸系统、泌尿系统、消化系统以及皮肤软组织感染、败血症、妇科感染等。

【药代动力学】据资料报道，静脉缓慢滴注本品100mg和400mg后，血浆峰浓度分别为2.9mg/L和5.75mg/L。本品体内组织渗透性好，分布广，在多数组织中的浓度等于或高于同期血浓度。血中清除半衰期为9到15小时，蛋白结合率低，约23%。本品在中性粒细胞，巨噬细胞内有蓄积现象。给药量60%～70%以原形及代谢产物经肾脏排泄。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乳酸氟罗沙星片	化学药	HZ003099

HY001685 乳酸钙

【其他名称】Calcinol、奶酸钙

【外文名称】Calcium Lactate

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】α－羟基丙酸钙五水合物

【分子式】$C_6H_{10}CaO_6 \cdot 5H_2O$

【分子量】308.30

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性或颗粒性粉末；几乎无臭；微有风化性。

本品在热水中易溶，在水中溶解，在乙醇、三氯甲烷或乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为补钙剂，具有促进骨骼及牙齿的钙化形成、维持神经与肌肉的正常兴奋性和降低毛细血管通透性等作用。

【药物相互作用】

1．本品不宜与洋地黄类药物合用。

2．大量饮用含酒精和咖啡因的饮料以及大量吸烟，均会抑制钙剂的吸收。

3．大量进食富含纤维素的食物能抑制钙的吸收，因钙与纤维素结合成不易吸收的化合物。

4．本品与苯妥英钠及四环素类同用，二者吸收减少。

5．维生素D、避孕药、雌激素能增加钙的吸收。

6．含铝的抗酸药与本品同服时，铝的吸收增多。

7．本品与噻嗪类利尿药合用时，易发生高钙血症（因增加肾小管对钙的重吸收）。

8．本品与含钾药物合用时，应注意心律失常的发生。

【不良反应】可见嗳气，便秘，腹部不适，大剂量服用可见高钙血症：表现为畏食、恶心、呕吐，便秘，腹痛，肌无力，心律失常以及骨石灰沉着等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
多维元素片（25）	化学药	HZ000809
复方地巴唑氢氯噻嗪胶囊	化学药	HZ001128
复方葡萄糖酸钙口服溶液	化学药	HZ001338
乳酸钙咀嚼片	化学药	HZ003100
乳酸钙颗粒	化学药	HZ003101
乳酸钙口服液	化学药	HZ003102
乳酸钙片	化学药	HZ003103
三合钙咀嚼片	化学药	HZ003151
三维钙片	化学药	HZ003161
维B_1乳酸钙片	化学药	HZ003516
维D_2乳酸钙片	化学药	HZ003524
枯草杆菌/肠球菌二联活菌多维颗粒剂	生物制品	SW000148
龙牡壮骨咀嚼片	中成药	ZC003355
龙牡壮骨颗粒	中成药	ZC003356

HY001686 乳酸环丙沙星

【外文名称】Ciprofloxacin Lactate

药物管理信息

【依据标准】中国药典2000年版·2004年增补本

药物理化信息

【化学名】1－环丙基－6－氟－1，4－二氢－4－氧代－7－（1－哌嗪基）－3－喹啉羧酸乳酸盐

【分子式】$C_{17}H_{18}FN_3O_3 \cdot C_3H_6O_3$

【分子量】421.43

【性状及组成】本品为类白色或微黄色结晶性粉末；无臭，味苦；有引湿性。

本品在水中易溶，在甲醇中极微溶解，在乙醇、乙酸乙酯、石油醚或二氧六环中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品具广谱抗菌作用，尤其对需氧革兰阴性杆菌的抗菌活性高，对下列细菌在体外具良好抗菌作用：肠杆菌科的大部分细菌，包括枸橼酸杆菌属、阴沟、产气肠杆菌等肠杆菌属、大肠埃希菌、克雷伯菌属、变形杆菌属、沙门菌属、志贺

菌属、弧菌属、耶尔森菌等。常对多重耐药菌也具有抗菌活性。对青霉素耐药的淋病奈瑟菌、产酶流感杆菌和莫拉菌属均具有高度抗菌活性。对铜绿假单胞菌等假单胞菌属的大多数菌株具抗菌作用。本品对甲氧西林敏感葡萄球菌具抗菌活性，对肺炎链球菌、溶血性链球菌和粪肠球菌仅具中等抗菌活性。对沙眼衣原体、支原体、军团菌具良好抗微生物作用，对结核杆菌和非典型分枝杆菌也有抗菌活性。对厌氧菌的抗菌活性差。

环丙沙星为杀菌剂，通过作用于细菌 DNA 螺旋酶的 A 亚单位，抑制 DNA 的合成和复制而导致细菌死亡。

【药代动力学】 静脉滴注本品 0.2g 和 0.4g 后，其血药峰浓度分别为 2.1μg/ml 和 4.6μg/ml。广泛分布至各组织、体液（包括脑脊液）中，组织中的浓度常超过血药浓度，蛋白结合率约为 20% ~ 40%，静脉给药后排出给药量的 50% ~ 70%，以代谢物形式排出约 15%，同时亦有相当数量的药物经胆汁和粪便排泄。

滴眼只有少量吸收。据文献报道，多次滴眼后的血药峰浓度小于 5ng/ml，平均浓度一般低于 2.5ng/ml。

【药物相互作用】

1. 尿碱化剂可减低本品在尿中的溶解度，导致结晶尿和肾毒性。

2. 本品与茶碱类合用时可能由于与细胞色素 P450 结合部位的竞争性抑制，导致茶碱类的肝清除明显减少，血消除半衰期延长，血药浓度升高，出现茶碱中毒症状，如恶心、呕吐、震颤、不安、激动、抽搐、心悸等，故合用时应测定茶碱类血药浓度和调整剂量。

3. 环孢素与本品合用，可使前者的血药浓度升高，必须监测环孢素血药浓度，并调整剂量。

4. 本品与抗凝药华法林合用时可增强后者的抗凝作用，合用时应严密监测患者的凝血酶原时间。

5. 丙磺舒可减少本品自肾小管分泌约 50%，合用时可因本品血药浓度增高而产生毒性。

6. 本品干扰咖啡因的代谢，从而导致咖啡因清除减少，血消除半衰期延长，并可能产生中枢神经系统毒性。

【药物过量】 急性药物过量时应仔细观察病情变化，予以对症处理及支持疗法。并维持适当的补液量。血液透析或腹膜透析时只有少量药物（< 10%）排出体外。

【不良反应】

1. 胃肠道反应较为常见，可表现为腹部不适或疼痛、腹泻、恶心或呕吐。

2. 中枢神经系统反应可有头昏、头痛、嗜睡或失眠。

3. 过敏反应：皮疹、皮肤瘙痒，偶可发生渗出性多形红斑及血管神经性水肿。少数患者有光敏反应。

4. 偶可发生：①癫痫发作、精神异常、烦躁不安、意识混乱、幻觉、震颤。②血尿、发热、皮疹等间质性肾炎表现。③静脉炎。④结晶尿，多见于高剂量应用时。⑤关节疼痛。

5. 少数患者可发生血清氨基转移酶升高、血尿素氮增高及周围血常规白细胞降低，多属轻度，并呈一过性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乳酸环丙沙星滴眼液	化学药	HZ003104
乳酸环丙沙星氯化钠注射液	化学药	HZ003105
乳酸环丙沙星阴道泡腾片	化学药	HZ003106
乳酸环丙沙星注射液	化学药	HZ003107
注射用乳酸环丙沙星	化学药	HZ004944

HY001687　乳酸菌素

【外文名称】 Lacidophilin

药物管理信息

【依据标准】 卫生部颁药品标准（二部）·第 6 册

【性状及组成】 本品系脱脂牛乳经嗜酸性乳酸杆菌发酵制成的粉末，按干燥品计算，含总酸量按乳酸（$C_3H_6O_3$）计不得少于 10.0%，含蛋白质不得少于 28.0%。

本品为淡黄色粉末；有特臭和酸味，应无酸败的臭味。

药物药理信息

【药理毒理】 本品在肠道形成保护层，阻止病原菌、病毒的侵袭；刺激肠道分泌抗体，提高肠道免疫力；选择性杀死肠道致病菌，保护促进有益菌的生长；调节肠黏膜电解质、水分平衡；促进胃液分泌，增强消化功能。

口服后生成的乳酸可增加胃内酸度，促使主细胞分泌的胃蛋白酶原转变为胃蛋白酶，还能提高胃蛋白酶活性；在肠内分解糖产生乳酸，使肠内酸度增高，从而肠内抑制腐败菌的繁殖，防止蛋白质发酵，减少肠内产气。

【药物相互作用】

1. 铋剂、鞣酸、药用炭、酊剂等能吸附本品、

不宜合用。

2. 如正在服用其他药品，服用本品前请咨询医师或药师。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乳酸菌素颗粒剂	化学药	HZ003110
乳酸菌素片	化学药	HZ003111
乳酸菌素散	化学药	HZ003112
小儿乳酸菌素片	化学药	HZ003768

HY001688 乳酸钠

【外文名称】Sodium Lactate

药物理化信息

【化学名】乳酸钠

【分子式】$C_3H_5NaO_3$

【分子量】112.06

药物药理信息

【药理毒理】人体在正常情况下血液中含有少量乳酸，主要由肌肉、皮肤、脑及细胞等组织中的葡萄糖或糖原酵解生成。乳酸生成后或再被转化为糖原或丙酮酸，或进入三羧酸循环被分解为水及二氧化碳。因此，乳酸钠的终末代谢产物为碳酸氢钠，可用于纠正代谢性酸中毒。高钾血症伴酸中毒时，乳酸钠可纠正酸中毒并使钾离子自血及细胞外液进入细胞内。乳酸降解的主要脏器为肝及肾脏，当体内乳酸代谢失常或发生障碍时，疗效不佳；此外，乳酸钠的作用不如碳酸氢钠迅速。

【药代动力学】乳酸钠的 pH 为 6.5～7.5，口服后很快被吸收，在 1～2 小时内经肝脏氧化，代谢转变为碳酸氢钠，但一般以静脉注射为常用，用乳酸钠替代醋酸钠作腹膜透析液的缓冲剂可减少腹膜刺激，对心肌抑制和周围血管阻力影响也可有所减少。

本品静脉注射后直接进入血液循环。乳酸钠在体内经肝脏氧化生成二氧化碳和水，两者在碳酸酐酶催化下生成碳酸，再解离成碳酸氢根离子而发挥作用。

【药物相互作用】乳酸钠与新生霉素钠、盐酸四环素、磺胺嘧啶钠呈配伍禁忌。

【药物过量】药物过量可致碱中毒、钠潴留等。

【不良反应】

1. 有低钙血症者（如尿毒症），在纠正酸中毒后易出现手足发麻、疼痛、搐搦、呼吸困难等症状，是由于血清钙离子浓度降低所致。

2. 心率加速、胸闷、气急等肺水肿、心力衰竭表现等。

3. 血压升高。

4. 体重增加、水肿。

5. 逾量时出现碱中毒。

6. 血钾浓度下降，有时出现低钾血症表现。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方电解质葡萄糖 MG3 注射液	化学药	HZ001140
复方电解质葡萄糖 R2A 注射液	化学药	HZ001141
复方电解质葡萄糖注射液 M3A	化学药	HZ001142
复方电解质葡萄糖注射液 M3B	化学药	HZ001143
复方电解质葡萄糖注射液 R4A	化学药	HZ001144
复方乳酸钠葡萄糖注射液	化学药	HZ001361
复方乳酸钠山梨醇注射液	化学药	HZ001362
复方右旋糖酐 40 注射液	化学药	HZ001479
腹膜透析液（乳酸盐）	化学药	HZ001528
钠钾葡萄糖注射液	化学药	HZ002729
乳酸钠林格注射液	化学药	HZ003113
乳酸钠溶液	化学药	HZ003114
乳酸钠注射液	化学药	HZ003115
羧甲基纤维素钠滴眼液	化学药	HZ003326
血液滤过置换液	化学药	HZ003818
转化糖电解质注射液	化学药	HZ005138

HY001689 乳酸诺氟沙星

【外文名称】Norfloxacin Lactate

药物理化信息

【化学名】乳酸诺氟沙星

药物药理信息

【药理毒理】本品为一种广谱抗菌药，对革兰阳性及阴性菌均有作用。细菌对本品不易形成耐药性。在同类药物及抗生素之间也不存在交叉耐药性。

本品对革兰阴性杆菌有强大的抗菌活性。特别是肠道杆菌科的细菌，如大肠杆菌、志贺菌属、克雷伯菌属、变形杆菌属、产气肠杆菌、沙雷菌属、枸橼酸菌属等对本品高度敏感。最低抑菌浓度一般低于 0.5μg/ml。流感杆菌对本品亦高度敏感。淋球菌对本品敏感，最低抑菌浓度为 0.125μg/ml。本品对铜绿假单胞菌及其他假单孢菌亦有作用，但需要较高的浓度，最低抑菌浓度在 4～32μg/ml；由于本品在尿中浓度超过上述浓度数倍至十多倍，用于治疗铜绿假单胞菌泌尿系统感染仍然有效。在革兰阳

性球菌中，本品对金黄色葡萄球菌及表皮葡萄球菌较敏感，抑制90%细菌的最低浓度约为1～2μg/ml。对肠球菌和肺炎球菌的抑制90%细菌的最低浓度约为4μg/ml和16μg/ml。

【不良反应】少数患者可有腹部不适、恶心、呕吐等消化道症状。个别患者有头痛、头晕、皮疹、瘙痒等症状，偶见血清谷丙转氨酶升高，停药后症状可消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乳酸诺氟沙星注射液	化学药	HZ003116
注射用乳酸诺氟沙星	化学药	HZ004945

HY001690　乳酸普尼拉明

【其他名称】Bismethin、Coredamin、Crepasin、Epocol、FALICOR、Hosaginan、解冠痉、解冠镇、Lactimine、Rausetin、双苯丙胺、Secidin、Segontin、Wasahgor、西固丁、心可定、仙纳特灵

【外文名称】Prenylamine Lactate

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，味苦麻。易溶于水。

熔点：本品的熔点为140～142℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为普尼拉明类钙拮抗药的代表药物。

本品除具有阻滞Ca^{2+}内流作用外，尚具有抑制磷酸二酯酶和抗交感神经作用。降低心肌收缩力和松弛血管平滑肌，可增加冠脉流量，同时能降低心肌氧耗量。另有促进侧枝循环的作用，可用于心绞痛的防治。又能抑制心室的传导和减弱心肌收缩力，对早搏和室性心动过速有一定效果。

主要用于心绞痛，对早搏及室性心动过速也有较好的治疗效果。此外，还用于镇静。

【药代动力学】本品口服易吸收，口服200mg片剂后，t_{max}为2.6小时，C_{max}为9.2ng/ml，AUC为166ng·h/ml，t1/2为24小时。大部分在肝脏代谢，主要由尿排泄。

【药物相互作用】

1．与降压药合用，有协同作用。

2．与巴比妥合用，可增强镇静作用。

【不良反应】可出现悉心、呕吐、食欲减退、皮肤发红、皮疹等不良反应。

HY001691　乳酸心可定

【外文名称】Prenylamine Lactic Acid

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第1册

药物理化信息

【化学名】N－（3,3－二苯丙基）－α－甲基－苯乙胺乳酸盐

【分子式】$C_{24}H_{27}N \cdot C_3H_6O_3$

【分子量】419.56

【性状及组成】本品为白色细微粉末；无臭，味苦，口尝有麻痹感。

本品在三氯甲烷中易溶，在乙醇中溶解，在丙酮中略溶，在水或乙醚中微溶。

熔点：本品的熔点为139～143℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品具有抑制Ca^{2+}内流和抗交感神经作用。降低心肌收缩力和松弛血管平滑肌，可增加冠脉流量，同时能降低心肌氧耗量。另尚有促进侧支循环的作用，可用于心绞痛的防治。LD_{50}（口服）：小鼠0.2/kg，大鼠：1g/kg。

【药代动力学】本品血浆半衰期为14.1小时，生物利用度为82.2%。

【不良反应】本品服后有的病人产生食欲减退，皮疹，疲劳感等，减量后可逐渐消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乳酸心可定片	化学药	HZ003117

HY001692　乳酸亚铁

【外文名称】Ferrous Lactate

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第24册

药物理化信息

【化学名】二（α－羟基丙酸）亚铁盐三水合物

【分子式】$C_6H_{10}FeO_6 \cdot 3H_2O$

【分子量】288.04

【性状及组成】本品为微黄绿色结晶性粉末；有微弱的特异臭味，微有甜涩味；有引湿性在空气中易氧化，表面生成黄棕色铁盐。

本品在沸水中溶解，在水中略溶，在乙醇中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为铁元素补充剂。铁为血红蛋白及肌红蛋白的主要组成成分。血红蛋白为红细胞中主要携氧者，肌红蛋白系肌肉细胞贮存氧的部位，为肌肉运动时提供氧的需要。与三羧酸循环有关的大多数酶和因子均含铁，或仅在铁存在时才发挥作用。机体缺乏铁，可引起缺铁性贫血或其他各种缺铁的有关症状，如生长迟缓，行为异常，体力不足，黏膜组织变化以及皮肤、指甲病变等。乳酸亚铁吸收率较高，可作为铁元素的补充剂。

【药代动力学】本品口服后主要在十二指肠降部及空肠近端吸收。铁吸收后与转铁蛋白结合后进入血循环，以供造红细胞所用，也可以铁蛋白或含铁血黄素形式贮存在肝、脾、骨髓及其他单核－巨噬系统内，口服铁剂不能自肠道吸收者均随粪便排出。经机体代谢的铁，主要通过肾脏排泄，经汗腺和上皮细胞也排泄一部分。

【药物相互作用】

1．本品与制酸药如碳酸氢钠，磷酸盐类及含鞣酸的药物或饮料同用，易产生沉淀而影响吸收。

2．本品与西咪替丁、去铁胺、二巯丙醇、胰脂肪酶等同用，可影响铁的吸收；本品可影响四环素类药物，氟喹诺酮类，青霉胺及锌制剂的吸收。

3．维生素C与本品同服有利于吸收。

4．本品可减少左旋多巴、卡比多巴、甲基多巴及喹诺酮类药物吸收，不宜同服。

【不良反应】偶有上腹部不适，食欲减退，恶心呕吐等胃肠道刺激症状。本品可减少肠蠕动而引起便秘，并排黑便。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乳酸亚铁胶囊	化学药	HZ003118
乳酸亚铁口服液	化学药	HZ003119
乳酸亚铁片	化学药	HZ003120
乳酸亚铁糖浆	化学药	HZ003121

HY001693 乳酸依沙吖啶

【其他名称】利凡诺、雷佛奴尔

【外文名称】Ethacridine Lactate

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】6，9－二氨基－2－乙氧基吖啶乳酸盐水合物

【分子式】$C_{15}H_{15}N_3O \cdot C_3H_6O_3 \cdot H_2O$

【分子量】361.40

【性状及组成】本品为黄色结晶性粉末；无臭，味苦。本品在热水中易溶，在沸无水乙醇中溶解，在水中略溶，在乙醇中微溶，在乙醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：消毒防腐药。

本品经羊膜腔内给药和宫腔内给药。药物可引起子宫内蜕膜组织坏死而产生内源性前列腺素，引起子宫收缩。依沙吖啶直接对子宫肌肉也有兴奋作用。

【药物相互作用】使用本品引产时注意慎用其他引产药。本品外用不得与含氯溶液、氯化物、碘化物、苯酚、以及碱性药物合用。

【药物过量】极量为120mg，中毒剂量为500mg，使用时应注意，以免过量。

【不良反应】

1．中毒时表现为少尿、无尿及黄疸，肝肾功能严重损害。

2．约有3%～4%孕妇发烧达38℃以上。

3．出血，利凡诺引产容易发生胎盘滞留或部分胎盘、胎膜残留而引起大量出血。

4．软产道损伤发生率为0.5%～3%，常见为宫颈撕裂或宫颈管前壁或后壁穿孔。

5．极个别孕妇有过敏反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方小檗碱鞣酸蛋白胶囊	化学药	HZ001443
乳酸依沙吖啶溶液	化学药	HZ003122
乳酸依沙吖啶软膏	化学药	HZ003123
乳酸依沙吖啶贴	化学药	HZ003124
乳酸依沙吖啶注射液	化学药	HZ003125
注射用乳酸依沙吖啶	化学药	HZ004946
愈伤膏	中成药	ZC007116

HY001694 乳酸乙酯

【其他名称】2－羟基丙酸乙酯、α－羟基丙酸乙酯、α－羟基初油酸乙酯、羟基丙酸乙酯

【外文名称】Ethyl Lactate

【性状及组成】无色液体。易溶于醇、醚、酮类、酯类、油类，与水混溶并部分分解。

熔点－25℃，沸点154℃，折光率1.4125。闪点48℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品在药剂中用作载体溶剂、透皮促进剂、稳定剂和芳香矫味剂，用于制造软膏剂、注射剂、合剂、酊剂等多种剂型和制剂。在食品工业中用作食用香料。用于配制奶油、椰子、葡萄等型香精。

【不良反应】本品无毒，一般公认是安全的，一日允许摄入量未作限制性规定。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
百宝丹搽剂	中成药	ZC000178

HY001695　乳酸左氧氟沙星

【外文名称】Levofloxacin Lactate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2000 年版·2004 年增补本

药物理化信息

【化学名】*S*－（－）－9－氟－2,3－二氢－3－甲基－10－（4－甲基－1－哌嗪基）－7－氧代－7*H*－吡啶并［1,2,3－*de*］－［1，4］－苯并噁嗪－6－羧酸乳酸盐半水合物

【分子式】$C_{18}H_{20}FN_3O_4 \cdot C_3H_6O_3 \cdot 1/2H_2O$

【分子量】460.41

【性状及组成】本品为类白色或微黄色针状结晶；无臭，微苦；有引湿性。

本品在水中易溶，在甲醇中略溶，在乙酸乙酯中几乎不溶；在冰醋酸或稀盐酸中易溶。

比旋度：取本品适量，精密称定，加水溶解并定量稀释成每 1ml 中约含 10mg 溶液，依法测定测定，比旋度应为－41°至－44°

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理：本品为氧氟沙星的左旋体，其抗菌活性约为氧氟沙星的 2 倍，它的主要作用机制为抑制细菌 DNA 旋转酶（细菌拓扑异构酶Ⅱ）的活性，阻碍细菌 DNA 的复制。

本品具有抗菌谱广、抗菌作用强的特点．对大多数肠杆菌科细菌，如大肠埃希菌、克雷伯菌属、沙雷菌属、变形杆菌属、志贺菌属、沙门菌属、枸橼酸杆菌、不动杆菌属以及铜绿假单胞菌、流感嗜血杆菌、淋病奈瑟菌等革兰阴性细菌有较强的抗菌活性。对部分甲氧西林敏感葡萄球菌、肺炎链球菌、化脓性链球菌、溶血性链球菌等革兰阳性菌和军团菌、支原体、衣原体也有良好的抗菌作用，但对厌氧菌和肠球菌的作用较差。

2．毒理

（1）急性毒性：经口投药时 LD_{50}，小鼠为 1881mg/kg，大鼠为 1478 mg/kg，猕猴为 250mg/kg 以上。

（2）亚急性毒性：对大鼠经口投药 4 周，对一般状态、血液、尿、脏器进行检查，在用量为 50mg/kg 以及 200mg/kg 用药组中，未出现与投药相关的毒性变化。但在 800mg/kg 用药组中，伴随中性白细胞的减少出现骨髓 M/E 的上升，在病理组织学上，在肢关节表面出现轻度的变性性变化。对猕猴经口投药 4 周后进行检查，在 10mg/kg 以及 30mg/kg 时，未出现与投药相关的毒性变化，但在 100mg/kg 时出现流涎、腹泻、体重轻度减少和尿中 pH 降低的现象。

（3）慢性毒性：对大鼠经口投药 26 周后进行检查，在 20mg/kg 时未出现与投药相关的毒性变化，但在 80mg/kg 以及 320mg/kg 时，出现流涎、尿中 pH 高值的现象。在 320mg/kg 时，排粪量增加，盲肠黏膜的杯状细胞出现肿大现象。对猕猴经口投药 26 周时，在 10mg/kg、25mg/kg 以及 62.5mg/kg 时均未出现明显毒性变化。

（4）生殖毒性：妊娠前、妊娠初期投药试验，对大鼠经口投药至 360mg/kg 时，均不影响雌雄的生殖能力，也不影响胎儿。

（5）器官形成期投药试验：对大鼠经口投药至 90mg/kg 时，对胎儿和出生儿均未产生影响。对家兔经口投药 50mg/kg 时，未出现胚胎、胎儿致死作用以及迟缓胎儿生长作用，也未出现致畸作用。

（6）围产期、授乳期投药试验：对大鼠经口投药至 360mg/kg 时，对母动物的分娩、授乳以及出生儿均未出现任何影响。

（7）对关节软骨的影响：对幼、幼成大鼠（3～4 周龄）和猎兔犬（4 月龄）经口投药 7 日时，大鼠在 300mg/kg 以上、猎兔犬在 10mg/kg 以上出现关节软骨病变，并在幼、年轻猎兔犬中易发现关节毒性。对幼成犬（13 月龄）经口投药 7 日时，在 40mg/kg 剂量时出现极轻度的关节毒性。但 18 月龄成犬静脉注射（14 日），在 30mg/kg 时未出现有关节毒性。

（8）光毒性试验：照射长波长紫外线（320～400nm），以小鼠耳廓厚度变化为指标进行光毒性时，结果经口投药 200mg/kg 时无明显变化。

【药代动力学】口服后吸收完全，单剂量口服 0.2g 后，血药峰浓度约为 1.6mg/L，达峰时间约为 1 小时。血消除半衰期约为 6 小时。蛋白结合率约为 30%～40%。

本品吸收后广泛分布至各组织、体液，在扁桃体、前列腺组织、痰液、泪液、女性生殖道、皮肤

和唾液等组织和体液中的浓度与血药浓度之比约在1.1～2.1之间。

健康人恒速静脉滴注乳酸左氧氟沙星注射液0.2g（以$C_{18}H_{20}FN_3O_4$计），滴注时间为1小时，血药峰浓度为3.40（2.8～4.0）μg/ml，12小时后血药浓度为0.55（0.3～0.7）μg/ml，消除相半衰期约为5.2小时，清除率约11.2L/小时。

本品主要以原形自肾排泄，在体内代谢甚少。口服48小时内尿中排出量约为给药量的80%～90%。本品以原形自粪便中排出少量，给药后72小时内累积排出量少于给药量的4%。

国外资料单次静脉滴注左氧氟沙星0.3g和相同剂量口服给药的药代动力学参数相似，多剂量研究中（0.3g每日2次静脉滴注，共6天），其血药浓度于24～48小时达稳态。首次及末次剂量后的血药峰浓度分别为5.35和6.12μg/ml，表明无明显蓄积。

【药物相互作用】

1．尿碱化剂可减低本品在尿中的溶解度，导致结晶尿和肾毒性。

2．喹诺酮类抗菌药与茶碱类合用时可能由于与细胞色素P450结合部位的竞争性抑制，导致茶碱类的肝消除明显减少，血消除半衰期延长，血药浓度升高，出现茶碱中毒症状，如恶心、呕吐、震颤、不安、激动、抽搐、心悸等。本品对茶碱的代谢虽影响较小，但合用时仍应测定茶碱类血药浓度和调整剂量。

3．本品与环孢素合用，可使环孢素的血药浓度升高，必须监测环孢素血浓度，并调整剂量。

4．本品与抗凝药华法林合用时虽对后者的抗凝作用增强较小，但合用时也应严密监测患者的凝血酶原时间。

5．丙磺舒可减少本品自肾小管分泌约50%，合用时可因本品血浓度增高而产生毒性。

6．本品可干扰咖啡因的代谢，从而导致咖啡因消除减少，血消除半衰期延长，并可能产生中枢神经系统毒性。

7．含铝、镁的制酸药、铁剂均可减少本品的口服吸收，不宜合用。

8．本品与非甾体类抗炎药芬布芬合用时，偶有抽搐发生，因此不宜与芬布芬合用。

9．本品与口服降血糖药合用可能引起血糖失调，因此用药过程中应注意监测血糖浓度，一旦发生低血糖时应立即停用本品，并给予适当处理。

【药物过量】喹诺酮类药物过量时，可出现以下症状：恶心、呕吐、胃痛、胃灼热、腹泻、口渴、口腔炎、蹒跚、头晕、头痛、全身倦怠、麻木感、发冷、发热、锥体外系症状、兴奋、幻觉、抽搐、谵狂、小脑共济失调、颅内压升高（头痛、呕吐、淤血性乳头症状）、代谢性酸中毒、血糖增高、AST/ALT/ALP增高、血细胞减少、嗜酸粒细胞增加、血小板减少、溶血性贫血、血尿、软骨/关节障碍、白内障、视力障碍、色觉异常及复视。

【不良反应】

1．胃肠道反应：腹部不适或疼痛、腹泻、恶心或呕吐。

2．中枢神经系统反应可有头昏、头痛、嗜睡或失眠。

3．过敏反应：皮疹、皮肤瘙痒，偶可发生渗出性多形性红斑及血管神经性水肿。光敏反应较少见。

4．偶可发生：①癫痫发作、精神异常、烦躁不安、意识混乱、幻觉、震颤。②血尿、发热、皮疹等间质性肾炎表现。③静脉炎。④结晶尿，多见于高剂量应用时。⑤关节疼痛。

5．少数患者可发生血清氨基转移酶升高、血尿素氮增高及周围血常规白细胞降低，多属轻度，并呈一过性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乳酸左氧氟沙星滴眼液	化学药	HZ003126
乳酸左氧氟沙星胶囊	化学药	HZ003127
乳酸左氧氟沙星氯化钠注射液	化学药	HZ003128
乳酸左氧氟沙星片	化学药	HZ003129
乳酸左氧氟沙星葡萄糖注射液	化学药	HZ003130
乳酸左氧氟沙星注射液	化学药	HZ003131
注射用乳酸左氧氟沙星	化学药	HZ004947

HY001696 乳糖

【外文名称】Lactose

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】4－*O*－β－D－吡喃半乳糖基－D－葡萄糖一水合物

【分子式】$C_{12}H_{22}O_{11}\cdot H_2O$

【分子量】360.31

【性状及组成】本品为白色的结晶性颗粒或粉末；无臭，味微甜。

本品在水中易溶，在乙醇、三氯甲烷或乙醚中不溶。

比旋度：取本品，在80℃干燥2小时后，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每1ml中含本品

0.10g 与氨试液 0.02ml 的溶液，依法测定，比旋度为 +52.0°至 +52.6°。

药物药理信息

【药理毒理】 药用辅料，赋形剂。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方多维元素片（23）	化学药	HZ001152
富马酸酮替芬分散片	化学药	HZ001514
含糖胃蛋白酶	化学药	HZ001680
烯丙雌醇片	化学药	HZ003646
盐酸氨溴索泡腾片	化学药	HZ003877
尿清舒颗粒	民族药	MZ000369
柴石退热颗粒	中成药	ZC000491
产复欣颗粒	中成药	ZC000510
复方满山白颗粒	中成药	ZC001453
感冒清片	中成药	ZC001740
龙血竭肠溶胶囊	中成药	ZC003366
芦笋胶囊	中成药	ZC003385
芦笋颗粒	中成药	ZC003386
乳安片	中成药	ZC004370
脂必妥片	中成药	ZC007311

HY001697　乳糖酸阿奇霉素

【外文名称】 Azithromycin Lactobionate

药物管理信息

【依据标准】 国家药品标准新药转正标准·第 49 册

药物理化信息

【化学名】（2*R*，3*S*，4*R*，5*R*，8*R*，10*R*，11*R*，12*S*，13*S*，14*R*）－13－［（2,6－二脱氧－3－*C*－甲基－3－*O*－甲基－α－L－核－己吡喃糖基）氧］－2－乙基－3,4,10－三羟基－3,5,6,8,10,12,14－七甲基－11－［［3,4,6－三脱氧－3－（二甲氨基）－β－D－木－己吡喃糖基］氧］－1－氧杂－6－氮杂环十五烷－15－酮乳糖酸盐

【分子式】 $C_{38}H_{72}N_2O_{12}\cdot 2C_{12}H_{22}O_{12}$

【分子量】 1465.58

【性状及组成】 本品为白色或类白色的结晶或粉末或疏松块状物；无臭、味苦。有引湿性。

本品在水中极易溶解，在甲醇或乙醇中微溶，在丙酮或三氯甲烷中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】 阿奇霉素为 15 元环大环内酯类抗生素。体外试验证明阿奇霉素对临床上多种常见致病菌有抗菌作用，包括：革兰阳性需氧菌：金黄色葡萄球菌、酿脓链球菌（A 组 β 溶血性链球菌）、肺炎（链）球菌、α 溶血性链球菌（草绿色链球菌）和其他链球菌、白喉（棒状）杆菌。本品对于耐红霉素的革兰阳性细菌，包括粪链球菌（肠球菌）以及耐甲氧西林的多种葡萄球菌菌株呈现交叉耐药性。革兰阴性需氧菌：流感嗜血杆菌、副流感嗜血杆菌、卡他摩拉菌、不动杆菌属、耶尔森菌属、嗜肺军团菌、百日咳杆菌、副百日咳杆菌、志贺菌属、巴斯德菌属、霍乱弧菌、副溶血性杆菌、类志贺吡邻单胞菌。

本品对下列革兰阴性菌的活性视菌株而定，并需作敏感性测定：大肠埃希菌、伤寒沙门菌、肠肝菌属、亲水性单胞菌、克雷白菌属。厌氧菌：脆弱类杆菌、类杆菌属、产气荚膜杆菌、消化链球菌属、坏死梭杆菌、痤疮丙酸杆菌。性传播疾病微生物：梅毒螺旋体、淋病奈瑟菌、杜克嗜血杆菌。其他微生物：包括特南包柔螺旋体（Lyme 病体）、肺炎支原体、人型支原体、解脲支原体、沙眼衣原体、卡氏肺孢子虫、鸟分枝杆菌属、弯曲菌属、单核细胞增多性李斯德杆菌。

下列革兰阴性菌通常是耐药的：变形杆菌属、沙雷菌属、糜根杆菌、假单胞杆菌。

作用机制与红霉素相同，主要与细菌核糖体的 50S 亚单位结合，抑制依赖于 RNA 的蛋白合成。

【药代动力学】 每日静脉滴注阿奇霉素 0.5g，连续 2～5 日，平均血浆峰浓度为 3.63 ± 1.60μg/ml，平均血浆谷浓度为 0.20 ± 0.15μg/ml，AUC_{24} 为 9.60 ± 4.80μg·h/ml。单次静脉滴注阿奇霉素 1～4g，滴注时间大于 2 小时，其清除率和表观分布体积分别为 10.18ml/（min·kg）和 33.3L/kg。阿奇霉素在体内分布广泛，在各组织内浓度可达同期血浓度的 10～100 倍，在巨噬细胞及纤维母细胞内浓度高，前者能将阿奇霉素转运至炎症部位。每日静滴阿奇霉素 0.5g，连续 5 日，第 1 次给药后的 24 小时内约 11% 的给药量以原形从尿液中排出，第 5 次给药后排到尿液中的阿奇霉素约为 14%。此外，阿奇霉素可经胆道以原形（胆汁内可见高浓度的阿奇霉素）及 10 种代谢物排出。阿奇霉素的血清蛋白结合率随血药浓度的增加而减低，当血药浓度为 0.02μg/ml 时，血清蛋白结合率为 15%；当血药浓度为 2μg/ml 时，血清蛋白结合率为 7%。阿奇霉素单剂给药后的血消除半衰期为 35～48 小时。

【药物相互作用】

1．与茶碱合用时能提高后者在血浆中的浓度，应注意检测血浆茶碱水平。

2. 与华法林合用时应注意检查凝血酶原时间。

3. 与下列药物同时使用时，建议密切观察患者。①地高辛：使地高辛水平升高。②麦角胺或二氢麦角胺：急性麦角毒性，症状是严重的末梢血管痉挛和感觉迟钝（触物感痛）。③三唑仑：通过减少三唑仑的降解，而使三唑仑的药理作用增强。④细胞色素 P450 系统代谢药：提高血清中卡马西平、特非那定、环孢素、环已巴比妥、苯妥英的水平。

4. 与利福布汀合用会增加后者的毒性。

【不良反应】

1. 本品常见不良反应有：①胃肠道反应：腹泻、腹痛、稀便、恶心、呕吐等。②局部反应：注射部位疼痛、局部炎症等。③皮肤反应：皮疹、瘙痒。④其他反应：如畏食、头晕或呼吸困难等。

2. 本品也可引起下列反应：①消化系统：消化不良、胃肠胀气、黏膜炎、口腔念珠菌病、胃炎等。②神经系统：头痛、嗜睡等。③过敏反应：支气管痉挛等。④其他反应：味觉异常等。⑤实验室检查：血清氨基转移酶、肌酐、乳酸脱氢酶、胆红素及碱性磷酸酶升高，白细胞、中性粒细胞及血小板计数减少。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乳糖酸阿奇霉素注射液	化学药	HZ003132
注射用乳糖酸阿奇霉素	化学药	HZ004948

HY001698 乳糖酸红霉素

【外文名称】 Erythromycin Lactobionate

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 红霉素的乳糖醛酸盐

【分子式】 $C_{37}H_{67}NO_{13}\cdot C_{12}H_{22}O_{12}$

【分子量】 1092.24

【性状及组成】 本品为白色或类白色的结晶或粉末；无臭，味苦。本品在水或乙醇中易溶，在丙酮或三氯甲烷中微溶，在乙醚中不溶。

本品按干燥品计算，每 1mg 的效价不得少于 610 红霉素单位。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：大环内酯类抗生素。

本品属大环内酯类抗生素，为水溶性的红霉素乳糖醛酸酯。

本品系抑菌剂，但在高浓度时对某些细菌也具杀菌作用。本品可透过细菌细胞膜，在接近供位（“P”位）处与细菌核糖体的 50S 亚基成可逆性结合，阻断了转移核糖核酸（t－RNA）结合至“P”位上，同时也阻断了多肽链自受位（“A”位）至“P”位的位移，因而细菌蛋白质合成受抑制。红霉素仅对分裂活跃的细菌有效。

【药代动力学】 静脉滴注后立即达血药浓度峰值，24 小时内静滴 2g，平均血药浓度为 2.3～6.8mg/L，但个体差异较大。每 12 小时连续静脉滴注本品 1g，则 8 小时后的血药浓度可维持于 4～6mg/L。乳糖酸红霉素除脑脊液和脑组织外，广泛分布于各组织和体液中，尤以肝、胆汁和脾中的浓度为最高，在肾、肺等组织中的浓度可高出血药浓度数倍，在胆汁中的浓度可达血药浓度的 10～40 倍以上。在皮下组织、痰及支气管分泌物中的浓度也较高，痰中浓度与血药浓度相仿；在胸、腹水、脓液等中的浓度可达有效水平。本品有一定量（约为血药浓度的 33%）进入前列腺及精囊中，但不易透过血－脑脊液屏障，脑膜有炎症时脑脊液中浓度仅为血药浓度的 10%左右。可进入胎血和排入母乳中，胎儿血药浓度为母体血药浓度的 5%～20%，母乳中药物浓度可达血药浓度的 50%以上。表观分布容积为 0.9L/kg。蛋白结合率为 70%～90%。游离红霉素在肝内代谢，血消除半衰期为 1.4～2 小时，口服量 10%～15%的注入量自肾小球滤过排除，尿中浓度可达 10～100mg/L。粪便中也含有一定量。血液透析或腹膜透析后极少被清除，故透析后无需加用。

【药物相互作用】

1. 本品可抑制卡马西平和丙戊酸等抗癫痫药的代谢，导致后者血药浓度增高而发生毒性反应。本品与阿芬太尼合用可抑制后者的代谢，延长其作用时间。本品与阿司咪唑或特非那定等抗组胺药合用可增加心脏毒性，与环孢素合用可使后者血药浓度增加而产生肾毒性。

2. 本品与氯霉素和林可酰胺类有拮抗作用，不推荐合用。

3. 本品为抑菌剂，可干扰青霉素的杀菌效能，故当需要快速杀菌作用如治疗脑膜炎时，两者不宜合用。

4. 长期服用华法林的患者应用本品时可导致凝血酶原时间延长，从而增加出血的危险性，老年病人尤应注意。

5. 除二羟丙茶碱外，本品与黄嘌呤类合用可使氨茶碱的肝清除减少，导致血清氨茶碱浓度升高和（或）毒性反应增加。这一现象在合用 6 日后较易发生，氨茶碱清除的减少幅度与本品血清峰值成正比。因此在两者合用疗程中和疗程后，黄嘌呤类的剂量

应予调整。

6. 本品与其他肝毒性药物合用可能增强肝毒性。

7. 大剂量本品与耳毒性药物合用，尤其肾功能减退患者可能增加耳毒性。

8. 本品与洛伐他丁合用时可抑制其代谢而使血药浓度上升，可能引起横纹肌溶解，与咪达唑仑或三唑仑合用时可减少二者的清除而增强其作用。

【药物过量】应及时停药，给予对症和支持治疗。血或腹膜透析后极少被消除。

【不良反应】

1. 胃肠道反应多见，有腹泻、恶心、呕吐、中上腹痛、口舌疼痛、胃纳减退等，其发生率与剂量大小有关。

2. 肝毒性少见，患者可有乏力、恶心、呕吐、腹痛、发热及肝功能异常，偶见黄疸等。

3. 大剂量（≥一日 4g）应用时，尤其肝、肾疾病患者或老年患者，可能引起听力减退，主要与血药浓度过高（>12mg/L）有关，停药后大多可恢复。

4. 过敏反应表现为药物热、皮疹、嗜酸粒细胞增多等，发生率约 0.5%～1%。

5. 其他：偶有心律失常、口腔或阴道念珠菌感染。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用乳糖酸红霉素	化学药	HZ004949

HY001699　乳糖酸克拉霉素

【外文名称】Clarithromycin Lactobionate

【分子式】$C_{38}H_{69}NO_{13}\cdot C_{12}H_{22}O_{12}$

【分子量】1106.27

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理作用：克拉霉素属于半合成的大环内酯类抗生素。克拉霉素与细菌核糖体 50S 亚基结合，从而抑制其蛋白合成而产生抗菌作用。在体外，其对标准菌株和临床分离株均具有很好的抗菌活性，对多种需氧和厌氧的革兰阳性或革兰阴性菌均具有很号的抗菌作用。通常，克拉霉素的最低抑菌浓度（MIC）为红霉素最低抑菌浓度的对数稀释浓度。

体外药效学研究结果表明，克拉霉素能抑制嗜肺军团菌和肺炎支原体，杀灭幽门螺杆菌，其中性条件下的活性强于酸性条件下。体内外数据表明，本品对分枝杆菌的临床作用显著。体内数据显示，肠杆菌属、假单胞菌属和其他非乳糖代谢的革兰阴性菌对克拉霉素不敏感。

体外药效学研究和临床观察资料均证实克拉霉素对下列细菌有抗菌活性，对其引起的感染有效。①需氧革兰阳性菌：金黄色葡萄球菌，肺炎链球菌，化脓链球菌和单核细胞增多性李斯特菌。②需氧革兰阴性菌：流感嗜血杆菌，副流感嗜血杆菌，卡他摩拉克菌，淋球菌，嗜肺性军团菌。③其他：肺炎支原体，肺炎衣原体。④分枝杆菌：麻风分枝杆菌，堪萨斯分枝杆菌，海龟分枝杆菌，偶发分枝杆菌，鸟型分枝杆菌和胞内分枝杆菌。

注意：β－内酰胺酶的产生不影响克拉霉素的活性。但大多数耐新青霉素Ⅰ和Ⅱ的菌株对克拉霉素均有耐药性。⑤螺杆菌：幽门螺杆菌。104 名病人于治疗前分离、培养幽门螺杆菌后，经 MIC 水平的克拉霉素治疗，其中，4 名有耐药菌株，2 名有中度易感菌株，98 名有易感菌株。

体外药效学研究证实克拉霉素素对下细菌有抗菌活性，但由于缺乏足够的临床试验，其用于临床感染治疗的安全性和有效性有特确定。①需氧革兰阳性菌：无乳链菌，链球菌（C、F、G 族），草绿色链球菌。②需氧革兰阴性菌：梭菌属、尼日尔脒球、痤疮丙酸杆菌。③厌氧革兰阳性菌：黑色素原拟杆菌。④螺旋菌：伯氏疏螺旋体，苍白球密螺旋体。⑤弯曲杆菌：空肠弯曲杆菌。⑥克拉霉素在人类和其他灵长类动物体内主要代谢为具有生物活性的 14－OH 克拉霉素，代谢物对多数微生物的活性与克拉霉素一样或仅为其 1/2 或 1/4，但对副流感嗜血杆菌的活性却是克拉霉素的 2 倍。在体外或体内，对流感嗜血杆菌的不同菌株，克拉霉素和 14－OH 克拉霉素有叠加或协同作用。

在多个动物感染模型中发现，克拉霉素的活性是红霉素的 2～10 倍。例如，在小鼠全身感染、小鼠皮下脓肿和由链球菌、金黄色葡萄球菌、化脓性链球菌和流感嗜血杆菌引起的小鼠呼吸道感染中，克拉霉素的活性均较红霉素高，在豚鼠军团菌感染中更显著，即克拉霉素腹腔给药日剂量为 1.6mg/kg，较红霉素 50mg/kg 更有效。

2. 毒理学

（1）亚慢性和长期毒性：分别进行了小鼠、大鼠、狗和猴单剂和 6 个月口服克拉霉素的毒性研究实验。

灵长类动物在日剂量为 100mg/kg，给药 14 天和日剂量为 35mg/kg，给药 1 个月时无毒副作用。同样，大鼠在日剂量为 75mg/kg，给药 1 个月；35mg/kg，给药 3 个月或 8mg/kg，给药 6 个月时无毒性及不良反应。狗对克拉霉素较敏感，无毒性及不良反应的耐受日剂量为 50mg/kg，给药 14 天；10mg/kg，

给药 1～3 个月或 4mg/kg 天，给药 6 个月。

在猴长期毒性试验中，在中毒剂量时，主要的临床表现为呕吐、虚弱、食欲减退、体重减轻、流涎、虚脱和好动。400mg/kg 日剂量组，10 只猴中有 2 只在第八天死亡；存活至 28 天的猴的粪便为黄色脱色状。

所有物种中，毒性的主要靶向器官为肝脏。肝毒性表现为碱性磷酸酶、丙氨酸和天冬氨酸氨基酸转移酶、γ－谷丙转氨酶和（或）乳酸脱氢酶的血清浓度升高。停药后，这些参数通常能恢复或趋于正常。

研究表明，克拉霉素对其他组织如胃、胸腺及其他淋巴器官和肾的影响不大。治疗剂量时，只有狗出现结膜充血和流泪。大日剂量 400mg/kg 时一些猴出现角膜浑浊和（或）水肿。

（2）生育能力、生殖和致畸性：对生育能力和生殖的影响实验研究表明，日服 150～160mg/kg 剂量对雄性和雌性大鼠的性欲、生育力、分娩和子代的数量和发育无不良反应。Wistar 和 Sprague－Dawle 大鼠（口服和静注）以及新西兰白兔和猕猴的致畸性均未能发现克拉霉素有任何致畸作用。仅在一项补充的 Sprague－Dawle 大鼠实验中出现过少见且无统计学意义的心血管异常（6%），这主要是由于群体内基因自然表达的改变。对小鼠的两项研究也表明，70 倍于人日常临床剂量（500mg，日服 2 次）时，出现上腭分裂现象（3%～30%），但 35 倍于人最大日服临床剂量时，无此现象，这一结果提示，其为继发于母体毒性的胚胎毒性而非致畸性。

怀孕 20 天后，给予猴 10 倍于人日常临床较高剂量（500mg，日服 2 次）的克拉霉素，会导致流产。主这要是由极高剂量的药物毒性所致。这一项补充的实验中，给予猴 2.5～5 倍于最大日常剂量的克拉霉素，没有危及胚胎。

小鼠显性致死实验（1000mg/kg）日剂量，约 70 倍于人最大日服临床剂量）中，致突变结果为阴性，而且，大鼠 I 期生殖毒性实验中，500mg/kg 日剂量（约 35 倍于人最大日服临床剂量）给药 80 天，未发现雄性大鼠因长期服用高剂量克拉霉素出现性功能损伤。

（3）致突变：为评价克拉霉素的致突变力，加和未加代谢活化系统的 Ames 实验结果表明，药物浓度为每碟 25mg 或更低时，无致突变能力。浓度为 50mg 时，对所有实验菌株产生毒性。

【药代动力学】国内 24 例健康志愿者的生物利用度研究表明，本品与克拉霉素具有生物等效性。

成人口服克拉霉素后的药物动力学研究结果表明，克拉霉素口服吸收快，绝对生物利用度为 50%。多剂量无蓄积，且代谢不变。进食能增加生物利用度约 25%，但这种增加对在推荐剂量范围内无临床意义。食物对克拉霉素的药动学无影响。

体外研究表明，浓度为 0.45～4.5mg/ml 时，克拉霉素的人血浆蛋白平均结合率为 70%；浓度为 45mg/ml 时，结合率下降为 41%，提示结合位点饱和，但该浓度远远高于药物治疗浓度。

健康受试者：克拉霉素 250mg，日服 2 次，2～3 天可达稳态峰值血药浓度，克拉霉素和 14－OH 克拉霉素的稳态峰值浓度 C_{max} 分别为 1 和 0.6mg/ml，半衰期分别为 3～4 和 5～6 小时。500mg，日服 2 次，克拉霉素及其 14－OH 代谢物在第 5 剂时可达稳态峰值血药浓度。第 5 和第 7 剂后，克拉霉素的稳态峰值浓度 C_{max} 分别为 2.7 和 2.9mg/ml，14－OH 克拉霉素的稳态峰值浓度 C_{max} 分别为 0.88 和 0.83mg/ml，半衰期分别为 4.5～4.8 和 6.9～8.7 小时。

稳态时，14－OH 克拉霉素浓度不随克拉霉素剂量成比例增加。克拉霉素及其 14－OH 克拉霉素浓度不随克拉霉素剂量成比例增加。克拉霉素及其 14－OH 代谢物的半衰期在高剂量时明显延长。高剂量，克拉霉素的非线性药物动力学行为及其 14－OH 和 N－脱甲基产物的减少预示着克拉霉素的非线性代谢在高浓度时变得更显著。

成人口服单剂量克拉霉素 250 或 1200mg 时，肾排泄分别为 37.9%和 46.0%，粪便排泄分别为 40.2%和 29.1%（包括一个 14.1%的受试者的数据）。

克拉霉素及其 14－OH 代谢物极易在组织和体液中分布，少数病例的数据提示，口服克拉霉素后，脑脊液中的药物浓度不能达到有效血浓度，即由于血脑屏障，脑脊液中的药物浓度仅血清中的 1%～2%。通常，组织中药物浓度较血清中高数倍。口服 250mg 克拉霉素，扁桃体和血清中浓度分别为 1.6 和 0.8mg/ml，肺和血清中浓度分别为 8.8 和 1.7mg/ml。

肝功能不全者：在对比健康受试组与肝功能不全组的研究中，250mg 克拉霉素，口服 2 次，服用 2 天，第三天服 1 次，结果表明，两组间克拉霉素的稳态血药浓度和系统清除率无显著差异。然而，肝功能不全组 14－OH 克拉霉素的稳态浓度明显较低。14－OH 克拉霉素代谢消除的减少部分被原形药物肾清除率增加所抵消。这表明，对于肝功能不全但肾功能正常者不必改变给药剂量。

肾功能不全者：研究中，对比了肾功能正常和不全者服用多剂量 500mg 克拉霉素的药动学曲线，发现肾功能不全组克拉霉素及其 14－OH 代谢物的血药浓度、半衰期、C_{max}、C_{min}和 AUC 均高于肾功能正常组，清除速率常数 Kelim 和肾排泄较低，这一变化与肾功能程度有关，肾功能越弱，差异越明显。

老年患者：研究中，对比了健康老年男性和女性受试组与健康青壮年男性受试组服用多剂量500mg克拉霉素的安全性和药动学曲线，结果表明，老年受试者较青壮年受试组的克拉霉素及其14－OH代谢物的血药浓度高，清除速率慢。但当肾清除与肌酐清除率相关时，两组间无差异。由此可见，克拉霉素的体内行为与肾功能有关，与年龄无关。

鸟型分枝杆菌感染者：500mg克拉霉素，日服2次，成年HIV患者与健康受试者的稳态血浓相似。但鸟型分枝杆菌感染需高剂量治疗，克拉霉素浓度比采用常用剂量时高得多。成年HIV感染受试者日服1000～2000mg（每天2次），克拉霉素稳态浓度C_{max}分别为2～4mg/ml和5～10mg/ml。高剂量时消除半衰期延长。高血药浓度和消除半衰期延长与已知的克拉霉素的非线性药物动力学特性相一致。

与奥美拉唑联用：研究了500mg克拉霉素日服3次，和40mg奥美拉唑日服4次的药物动力学。单服500mg克拉霉素，其平均稳态C_{max}和C_{min}分别为3.8和1.8mg/ml，AUC_{0-8}为22.9mg/（h·ml），t_{max}和半衰期分别为2.1和5.3小时。

同时，研究了500mg克拉霉素日服3次，与40mg奥美拉唑日服4次联用的药物动力学。奥美拉唑的半衰期延长和AUC_{0-8}变大，与单服奥美拉唑相比，AUC_{0-24}和$t_{1/2}$分别增加89%和34%；与克拉霉素和安慰剂联用组相比，克拉霉素的稳态C_{max}、C_{min}和AUC_{0-8}分别增加10%、27%和25%。稳态时，给药6小时后，克拉霉素联用奥美拉唑组的克拉霉素的胃黏液浓度较克拉霉素组高25倍，克拉霉素的胃组织浓度较克拉霉素和安慰剂联用组高2倍。

【药物相互作用】

1．与细胞色素P450代谢的药物的相互作用。

有数据表明，克拉霉素主要由肝细胞色素P4503A（CYP3A）同工酶代谢，这是导致许多药物相互作用的重要机制。该机制下，与克拉霉素同时使用的其他药物的代谢受到抑制，从而其血清中的药物浓度升高。

下列一些或一类药物已知或有可能是通过肝细胞色素P4503A（CYP3A）同工酶代谢途径：阿司咪唑、卡马西平、西洛他唑、西沙必利、环孢菌素、丙吡胺、麦角生物碱、洛伐他丁、甲泼尼龙、咪达唑仑、奥美拉唑、口服抗凝药（如华法林）、匹莫齐特、奎尼丁、利发布丁、西地那非、辛伐他丁、他克莫司、特非那丁、三唑仑和长春碱。通过细胞色素P450系统中其他同功酶代谢的、机制相似的药物还有苯妥因、茶碱及丙戊酸钠类抗癫痫药。

2．临床研究表明，当茶碱或卡马西平与克拉霉素合用时，其在循环系统的浓度轻度升高且有统计学意义（$P<0.05$）。当克拉霉素与奎尼丁、丙吡胺合用时应检测血药浓度。

3．克拉霉素与HMG－CoA还原酶抑制剂（如洛伐他丁和辛伐他丁）合用时，极少有横纹肌溶解的报道。

4．西沙必利与克拉霉素合用会使病人血液中西沙必利浓度升高，导Q－T间期延长，心律失常如室性心动过速、室颤和充血心力衰竭。克拉霉素与匹莫齐特合用也会有此作用。

5．大环内酯类药物能改变特非那丁的代谢而升高其血浓度，导致心律失常如室性心动过速，室颤和充血性心力衰竭。对14名健康受试者的研究发现，克拉霉素与特非那丁合用引起特非那丁的酸性代谢物血浓度升高2～3倍，导致Q－T间期延长，但无任何临床症状。克拉霉素与阿司咪唑合用也会有此作用。

6．与其他药物的相互作用：克拉霉素与地高辛合用会引起地高辛血药浓度升高，故应进行血药浓度临测。

7．与抗逆转录病毒药物的相互作用：HIV感染的成年人同时口服克拉霉素与齐多夫定会引起齐多夫定稳态血药浓度下降。这主要是由于克拉霉素会干扰齐多夫定的吸收，故错开服用时间可避免这种影响。但HIV感染的儿科病人同时服用克拉霉素混悬剂和齐多夫定或二脱氧肌苷时未出现上述相互影响。

药动学研究表明，利托那韦（200mg，每天3次）和克拉霉（500mg，每天2次）合用，克拉霉素代谢会明显被抑制，克拉霉素的C_{max}、C_{min}和AUC分别增加31%、182%和77%。14－OH克拉霉素治疗窗较大，当病人肾功能正常时，无需减少剂量，但对肾功能损伤的病人，应按以下方法进行剂量调整：肌酐清除率为30－60ml/min的患者，克拉霉素剂量减少50%；肌酐清除率小于30ml/min的患者，克拉霉素剂量减少75%。克拉霉素每天剂量大于1g，不应与利托那韦合用。

【药物过量】报告表明，摄入过量的克拉霉素会产生胃肠道症状。一名精神紊乱患者曾一次服用8g克拉霉素，导致精神状态改变、偏执、低血钾和血氧过少。对因过量所致的不良反应，应及时地排除未吸收的药物并采取一定的治疗。与其他大环内酯药物一样，血液或腹膜透析不能降低克拉霉素的血浓度。

【不良反应】临床研究中，成人最常见的不良反应是胃肠不适，如恶心、消化不良、腹痛、呕吐和腹泻，其他不良反应包括头痛、味觉异常和肝转氨酶短暂升高。

有报道称克拉霉素造成肝功能异常，如肝转氨酶升高，黄疸或无黄疸的肝细胞性和（或）胆汁淤积性（药物性）肝炎，这种异常可能会很严重但经常是可逆转的。极少数有肝坏死的报道，且多与严重疾病和（或）同服其他药物有关。罕见胰腺炎和惊厥报告。

极少病例引起血清肌酐浓度升高，但原因不明。

口服克拉霉素，曾有发生过敏反应报告，轻者为荨麻疹和轻度皮疹，重者为过敏性休克和 Stevens – Johnson 综合征或毒性表皮坏死。曾有发生短暂性中枢神经系统的不良反应报告，包括头昏、眩晕、焦虑、失眠、噩梦、耳鸣、意识模糊、定向力障碍、幻觉和精神病，但因果关系不清楚。

有报告表明，克拉霉素会导致可逆转的失聪、味觉改变和味觉失调。

克拉霉素治疗期间，会发生舌炎、胃炎、口腔念珠菌病和舌无色，也有牙变色的报告，但牙变色可通过专业牙科逆转。

极少有发生低血糖症的报告，有些是同时使用降血糖药或胰岛素造成。

极少会发生白细胞和血小板减少症。

与其他大环内酯类药物类似，克拉霉素很少会导致 Q – T 间期延长、心律失常（如室性心动过速、室颤）和充血性心力衰竭。

免疫低下患者：对 AIDS 和其他免疫低下的病人采用较高剂量的克拉霉素长期治疗分枝杆菌感染时，很难区分不良反应究竟是克拉霉素造成还是 HIV 病症或并发症。

对成年患者，克拉霉素每天总剂量为 1g 时的最常见不良反应是：恶心、呕吐、味觉失调、腹痛、腹泻、皮疹、胃气胀、头痛、便秘、听觉障碍、AST 和 ALT 升高、白细胞和血小板数减少。较少患者还出现 BUN 升高。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乳糖酸克拉霉素胶囊	化学药	HZ0003133

HY001700 软皂

【其他名称】钾肥皂、绿肥皂（Green Soap）

【外文名称】Soft Soap

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

【性状及组成】本品为适宜的植物油用氢氧化钾皂化制成。

本品为黄白色、黄棕色或黄绿色、透明或半透明、均匀、黏滑的软块；微有特臭；水溶液遇酚酞指示液显碱性反应。本品在水或乙醇中溶解。

药物药理信息

【药理毒理】去垢剂。用以配制清洁液、皂化剂或灌肠剂。

HY001701 瑞巴派特

【外文名称】Rebamipide

药物药理信息

【药理毒理】

1. 对实验性胃溃疡的抑制作用及促进治愈的作用：本品可抑制大白鼠的水浸刺激溃疡、阿司匹林溃疡、吲哚美辛溃疡、组胺溃疡、血清基溃疡、幽门结扎溃疡及与活性氧有关的缺血 – 再灌注、血小板活化因子（FAF）、二乙基二硫代氨基甲酸盐（DDC）、应激反应、吲哚美辛等引起的胃黏膜损伤，还可以促进大白鼠醋酸溃疡的治愈，并抑制溃疡形成后第 120 ~ 140 天的复发。

2. 对实验性胃炎的抑制作用及促进治愈的作用：本品不仅抑制牛磺胆酸诱发的大白鼠实验性胃炎的发生，而且具有促进治愈的效果。

3. 增加胃黏膜前列腺素的作用：本品使大白鼠胃黏膜内前列腺素 E2 含量增加，并使胃液中前列腺素 E2、前列腺素 I2 增加，同时也使前列腺素 E2 的代谢产物 15 – 酮基 – 13，14 – 二氢（化）前列腺素 E2 增加。本品使健康成年男子的胃黏膜中前列腺素 E2 含量增加，并显示它对乙醇负荷引起的胃黏膜损伤有抑制作用。

4. 保护胃黏膜的作用：本品可抑制乙醇、强酸及强碱导致大白鼠的胃黏膜损伤，还可以抑制阿司匹林及牛磺胆酸对家兔胎仔的胃黏膜上皮细胞的损伤，抑制阿司匹林、乙醇、盐酸 – 乙醇负荷对健康成年男子的胃黏膜损伤。

5. 增加胃黏液量的作用：本品可提高大白鼠黏液高分子糖蛋白的生物合成酶活性，使胃黏膜表层黏液量及可溶性黏液量增加。可溶性黏液增加作用与内源性前列腺素无关。

6. 增加胃黏膜血流量的作用：本品使大白鼠黏膜血流量增加，可改善失血造成的血液循环障碍。

7. 对胃黏膜屏障的作用：本品对大白鼠的胃黏膜电位差几乎不显示作用，但它可以抑制乙醇引起的胃黏膜电位差低下。

8. 对胃碱性物质分泌亢进作用：本品使大白鼠的胃碱性物质分泌亢进。

9. 促进胃黏膜细胞再生的作用：本品使大白鼠的胃黏膜细胞再生能力加强，增加表层上皮细胞数。

10. 修复损伤胃黏膜的作用：本品可以使家兔的培养胃黏膜上皮细胞创伤修复模型因胆汁酸及过氧化氢而使拖延的修复过程正常化。

11. 对胃酸分泌的作用：本品对大白鼠的基础胃液分泌几乎不起作用，而且对刺激胃酸分泌来显示出抑制作用。

12. 对活性氧的作用：本品具有消除羟基自由基的作用，并抑制多形核白细胞的过氧化物的产生。在体外抑制幽门螺杆菌引起的中性白细胞的活性氧产生造成的胃黏膜损伤。本品在抑制应激反应、吲哚美辛负荷大白鼠的胃黏膜损伤的同时，使胃黏膜中过氧化脂质含量降低。

13. 对胃黏膜炎性细胞浸润的作用：通过大鼠的牛磺胆酸诱发胃炎模型、NSAIDs 胃黏膜损伤模型、缺血－再灌注模型研究后发现，本品可抑制炎性细胞浸润。

14. 对胃黏膜炎性细胞因子（白介素－8）的作用：本品可以抑制幽门螺杆菌引起的人胃黏膜上皮细胞白介素－8（IL－8）产生的增加，而且可以抑制上皮细胞内 NF－xB 的活化及 IL－8mRNA 的出现（体外）。

【药代动力学】健康成年男子 12 例口服 100mg 瑞巴派特，通过消化道迅速吸收，给药后 2 小时达到最高血药浓度（210ng/ml），半衰期约为 1.5 小时，即使连续给药未发现蓄积性。健康成年男子 6 例口服 150mg 瑞巴派特时，发现了饮食造成的吸收延迟倾向，但对生物利用度没有影响。肾功能障碍患者单次口服 100mg 瑞巴派特，研究药物动态时发现，患者与健康正常人相比，血药浓度上升，而且半衰期延长。透析患者连续给药达到稳态时的血药浓度与单次给药时推测的血药浓度一致。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
瑞巴派特片	化学药	HZ003134

HY001702　瑞格列奈

【外文名称】Repaglinide

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 43 册

药物理化信息

【化学名】S（＋）－2－乙氧基－4－｛2－［（3－甲基－1（2－（1－哌啶基）苯基）丁基）氨基］－2－氧代乙基）苯甲酸

【分子式】$C_{27}H_{36}N_2O_4$

【分子量】452.59

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末；无臭。

本品在三氯甲烷中易溶，在乙醇或丙酮中略溶，在水中几乎不溶，在 0.1mol/L 盐酸溶液中微溶。

熔点：本品的熔点为 128～132℃。

比旋度：取本品，精密称定，加乙醇溶解并制成每 1ml 中含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为＋7.6°至＋9.2°

吸收系数：取本品适量，精密称定，加 0.1mol/L 盐酸溶液溶解并制成每 1ml 中含 20μg 的溶液，照分光光度法，在 243nm 波长处测定吸光度，吸收系数为 221～235。

药物药理信息

【药理毒理】非磺酰脲类促胰岛素分泌剂，本品与胰岛 β 细胞膜外依赖 ATP 的钾离子通道上的 36KDA 蛋白特异性结合，使钾通道关闭，β 细胞去极化，钙通道开放，钙离子内流，促进胰岛素分泌，其作用快于磺酰脲类，故餐后降血糖作用较快。

【药代动力学】据国外文献报道：瑞格列奈片经胃肠道快速吸收、导致血浆药物浓度迅速升高。服药后 1 小时内血浆药物浓度达峰值。然后血浆浓度迅速下降，4～6 小时内被清除。血浆半衰期约为 1 小时。瑞格列奈与人血浆蛋白的结合大于 98%。瑞格列奈几乎全部被代谢，代谢物未见有任何临床意义的降血糖作用。瑞格列奈及其代谢产物主要自胆汁排泄，很小部分（小于 8%）代谢产物自尿排出。粪便中的原形药物少于 1%。

【药物相互作用】

1. 下列药物可增强瑞格列奈的降血糖作用：单胺氧化酶抑制剂（MAOI），非选择性 β－受体阻滞剂，ACE 抑制剂，非甾体抗炎药，水杨酸盐，奥曲肽，酒精以及促合成代谢的激素。β－受体阻滞剂可能会掩盖低血糖症状。酒精可能会加重或延长由瑞格列奈所致的低血糖症状。

2. 下列药物可减弱瑞格列奈片的降血糖作用：口服避孕药，噻嗪类药，皮质激素，达那唑，甲状腺激素和拟交感神经药。

3. 瑞格列奈片不影响地高辛、茶碱和华法林的药代动力学特性，西咪替丁也不影响瑞格列奈的药代动力学特性。

4. 体外研究结果显示瑞格列奈片主要由 P450（CYP3A4）诱导剂代谢。所以，CYP3A4 抑制剂如酮康唑、伊曲康唑、红霉素、氟康唑、米比法地尔可能升高瑞格列奈血浆水平。而能诱导 CYP3A4 的化合物如利福平或苯妥英钠可能降低瑞格列奈片血浆水平。因不了解其诱导或抑止的程度，应禁忌上述药

物与瑞格列奈合并使用。

【不良反应】

1. 低血糖这些反应通常较轻微，通过给予碳水化合物较易纠正。若较严重，可输入葡萄糖。

2. 视觉异常：已知血糖水平的改变可导致暂时性视觉异常，尤其是在治疗开始时。只有极少数病例报告瑞格列奈治疗开始时发生上述的视觉异常，但在临床试验中没有因此而停用瑞格列奈的病例。

3. 胃肠道临床试验中有报告发生胃肠道反应，如腹痛、腹泻、恶心、呕吐和便秘。同其他口服降血糖药物相比，这些症状出现的频率以及严重程度均无差别。

4. 肝酶系统个别病例报告用瑞格列奈治疗期间肝功酶指标升高。多数病例为轻度和暂时性，因酶指标升高而停止治疗的病人极少。

5. 过敏反应可发生皮肤过敏反应，如瘙痒、发红、荨麻疹。由于化学结构不同，没有理由怀疑可能发生与磺脲类药物之间的交叉过敏反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
瑞格列奈片	化学药	HZ003135

HY001703 瑞卡南

【外文名称】Recainam

药物药理信息

【药理毒理】本品兼有 IA、IB、IC 类抗心律失常药特点。可减慢心房、房室结传导，但不影响窦房结功能，对心脏传导的作用类似 IA 类抗心律失常药，但它缩短 Q－T 间期的作用，则属于 IB 类活性。本品对室性心律失常有效。

【药代动力学】口服吸收良好，消除半衰期约 7 小时，作用可持续 8 小时，有效血药浓度 1.2mg/L。

【不良反应】不良反应少而轻，有短暂头晕、面红等。

HY001704 瑞莫必利

【外文名称】Remoxipride

药物药理信息

【药理毒理】本品对脑内 D_2－多巴胺受体有较高的选择性阻滞作用，而对 5－HT、NA、ACG、组胺与 GABA 等受体几乎无作用，因此不良反应很少。

本品适用于治疗急性和慢性精神分裂症和以妄想、幻觉和思维紊乱为主要症状的其他精神病。

【药代动力学】口服后吸收迅速而完全，2 小时达血药峰浓度，C_{max}和 AUC 均随比例增加，药动学呈线性变化。生物利用度高，无首关效应，吸收后迅速透过血脑屏障，脑脊液中药物浓度相当于血游离浓度。部分经肝脏代谢，最后经肾脏排出，还可自乳汁排出。血浆 $t_{1/2}$为 4～7 小时。老年患者（71～89 岁）的血浆 $t_{1/2}$是常人的 2 倍。

【不良反应】本品不良反应轻微，且多数是暂时的。据报道有恶心、呕吐、头痛、头昏、体重改变。锥体外系症状比氟哌啶醇少。少见嗜睡、失眠、注意力不能集中、多动、焦虑、口干、便秘、排尿困难、视物模糊等。罕见低血压、男子溢乳与 ALT 轻度升高。

HY001705 瑞舒伐他汀

【其他名称】Crestor、罗苏伐他汀

【外文名称】Rosuvastatin

药物药理信息

【药理毒理】新型他汀类药物，比目前市场上他汀类药物在降低 LDL 胆固醇水平和升高 HDL 胆固醇水平方面具有更好的作用。

【药代动力学】口服生物利用度约为 20%，单剂量口服本品 20mg，约 5 小时达峰，C_{max}为 6.1ng/ml。多次给药，3 小时后稳态 C_{max}为 9.7ng/ml。本品与血浆蛋白呈可逆性结合，结合率为 88%。稳态分布容积为 134L。约 10%经肝脏代谢为活性减半的 N－去甲基化物和活性与原形相当的内酯化物。90%经胆汁排泄，10%经尿排泄。$t_{1/2}$为 20 小时。

【不良反应】主要有咽炎（12.2%）、头痛（6.6%）、流感样症状（5.3%）和肌肉痛（5.1%）。

有报告称服用本品者发生横纹肌溶解、蛋白尿、肾病或肾衰的比例较其他他汀类药物多，治疗过程中出现任何不明原因的肌肉痛、肌无力或抽筋、任何褐色或变色尿，应立即就诊、并检测 CK 水平。

HY001706 瑞香素

【外文名称】Daphnetin

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 13 册

【分子式】$C_9H_6O_4$

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
瑞香素胶囊	化学药	HZ003136

HY001707　塞克硝唑

【外文名称】Secnidazole

药物理化信息

【化学名】α，2－二甲基－5－硝基－1*H*－咪唑－1－乙醇

或1－（2－羟基丙基）－2－甲基－5－硝基－1H－咪唑

药物药理信息

【药理毒理】本品为5－硝基咪唑类抗原虫和厌氧菌药物，作用于原虫或厌氧菌的生长期，破坏DNA链或抑制DNA的合成，导致原虫和厌氧菌死亡。本品对泌尿生殖器内滴虫、肠道及组织内阿米巴原虫和贾第鞭毛虫等有较强的杀灭作用。

【药代动力学】本品口服吸收迅速完全，一般口服2小时内血药浓度达到峰值，在给药剂量0.5～2.0g范围内血药浓度与给药剂量呈线性关系，最大血浆药物浓度为35.7～46.3mg/L，血浆蛋白结合率为血浆药物浓度的15%，生物利用度为100%（±26%），表观分布容积为49.2 L，有效药物浓度可持续48小时，消除半衰期为17～29小时，男性约20小时，女性约14小时，给药72小时后仍可从尿液中检测到药物浓度，从尿液中排泄的量为药物的10%～25%。

【药物相互作用】与抗凝药如华法林并用时能增强抗凝药的药效，应注意观察凝血酶原时间并调整给药剂量。

【药物过量】尚未见药物服用过量的文献报道，应避免使用过量或遵医嘱。

【不良反应】可有食欲减退、恶心、呕吐等胃肠道反应，少数有腹泻，口中常有刺鼻金属味。偶见头痛、失眠、皮疹、白细胞减少和血尿氮增加等，停药后迅速恢复。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
塞克硝唑分散片	化学药	HZ003137
塞克硝唑胶囊	化学药	HZ003138
塞克硝唑氯化钠注射液	化学药	HZ003139
塞克硝唑片	化学药	HZ003140

HY001708　塞来昔布

【外文名称】Celecoxib

药物药理信息

【药理毒理】是一种新一代的化合物，具有独特的作用机制即特异性地抑制环氧化酶－2（COX－2）。炎症刺激可诱导COX－2生成，因而导致炎性前列腺素类物质的合成和聚积，尤其是前列腺素E2，引起炎症、水肿和疼痛。塞来昔布可通过抑制COX－2阻止炎性前列腺素类物质的产生，达到抗炎、镇痛及退热作用。

【药代动力学】空腹给药的塞来昔布吸收良好，约2～3小时达到血浆峰浓度，胶囊口服后的生物利用度为口服混悬后生物利用度的99%（混悬液为口服利用的最佳剂型）。在整个治疗剂量范围内，塞来昔布具有线性、且与剂量成正比的药代动力学特征。本药的血浆蛋白结合率与浓度无关，在治疗血浆浓度时，血浆蛋白结合率约为97%。药物在血中并不是优先与红细胞结合。与进食（高脂食物）同时给药，则本药的延迟吸收，t_{max}延至4个小时，生物利用度增加约20%。健康受试者一日1次或分2次口服400mg本品后其生物利用度相同。而在骨关节炎患者，每日1次或分2次口服200mg本品后，其临床疗效及安全性相当。代谢主要通过细胞色素P450－CYP2C9。原形药具有药理活性，循环中其主要代谢产物未测得COX－1和COX－2抑制活性。本品的清除主要通过肝脏进行，少于1%剂量的药物以原形从尿中排出。多剂服药后清除半衰期为8～12小时，清除率约为500ml/min。连续给药5天内达到其稳态分布容积均值，约为500L/70kg，表明塞来昔布在组织中的广泛分布。临床前研究表明本药可通过血脑屏障。

【药物相互作用】可与甲氨蝶呤、酮康唑、抗酸剂（铝剂和镁剂）、苯妥英钠、格列苯脲、甲苯磺丁脲联合使用。在本品制剂和华法林或其他类似药物联合应用的头几天，或本品制剂的剂量改变后数天内，应密切监测其抗凝血作用。

【不良反应】主要有头痛、眩晕、便秘、恶心、腹痛、腹泻、消化不良、胀气、呕吐等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
塞来昔布胶囊	化学药	HZ003141

HY001709　塞曲司特

【外文名称】Seratrodast

药物理化信息

【化学名】±－ζ－（2,4,5－三甲基－3,6－二羰基－1,4－环己二烯－1－基）苯庚酸

【分子式】$C_{22}H_{26}O_4$

【分子量】354.45

【性状及组成】本品为黄色结晶性粉末；无臭。本品在乙酸乙酯和甲苯中溶解，在乙醇中略溶，在水中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理作用：本品为血栓素 A2 受体拮抗剂，具有抑制各种化学递质（血栓素 A2，白三烯 D4，血小板活化因子）引起的支气管收缩反应，并有抑制因抗原吸入而诱发的速发型和迟发型过敏反应，改善肺功能的作用。

2. 毒理研究：

（1）重复给药毒性：大鼠连续 52 周给予塞曲司特 10、30 和 100mg/（kg·d），大剂量组动物体重增长有抑制，红细胞、血红蛋白和红细胞比容（雄鼠）下降，总胆红素、血小板（雄鼠）和网织红细胞（雌鼠）增加，肾和肝脏重量增加；组织病理学检查见肝细胞肥大、近曲小管上皮有透明小泡，肾小管再生率增加及雄鼠单核细胞浸润，本试验的无毒性剂量为 10mg/（kg·d）。Beagle 犬连续 52 周灌服塞曲司特 30、100 和 300mg/（kg·d），大剂量组有 1 例动物给药后 13 周时红细胞、红细胞比容及血红蛋白值下降，组织学检查发现脾脏淤血及髓外造血，骨髓细胞亢进，肝窦细胞和肾小管上表皮细胞有铁色素沉着，从上述症状提示本品会引起贫血；另外塞曲司特 100mg/kg 组也偶见脾脏淤血、骨髓细胞亢进和肝窦细胞铁色素沉积，这些与贫血有关的症状是药物引起的变化，本试验的无毒性剂量为 30mg/（kg·d）。

（2）遗传毒性：塞曲司特 Ames 试验、中国仓鼠肺细胞染色体畸变试验和小鼠微核试验结果均为阴性。

（3）生殖毒性：塞曲司特 30mg/（kg·d）对亲代无不良反应，100mg/（kg·d）对亲代的生育力无影响，对胎鼠的形成和乳鼠的发育无影响。新西兰兔在致畸敏感期灌胃给予塞曲司特，30mg/（kg·d）对母兔无影响，100mg/（kg·d）未见致畸性；大鼠致畸敏感期灌胃给予塞曲司特，30mg/（kg·d）对胎鼠未见影响，100mg/（kg·d）对子鼠无影响。

【药代动力学】

1. 血药浓度：健康成年男子早饭后一次口服本品 80mg，其血液中检测出来的主要为塞曲司特原药，约 2～3 小时达到最高血药浓度，血浆半衰期为 25 小时左右。老年患者一日给予本品 40mg 和 80mg 时，与健康成年人相比，发现其 AUC 和半衰期增加或延长 1.5～2 倍，达峰时间滞后。

2. 排泄：健康成年男子早饭后 1 次口服塞曲司特 80mg，其 72 小时的尿排泄量约占给药量的 16%。尿内的原药和大部分代谢物都是结合体。老年患者 1 次给予本品 40mg 和 80mg 后，72 小时内的尿排泄量约占给药量的 11%～12%，比健康成年人略少。

3. 重复给药时的血药浓度：健康成年男子连续 7 日不间断给药，一日 1 次，每次 80mg，未发现蓄积毒性。同时对老年支气管哮喘患者连续 12 周不间断给药，每日 1 次，从 40mg/次开始，根据症状增至一次 80mg，也未发现蓄积毒性。

【药物相互作用】

1. 可导致溶血性贫血性质的药物：非那西丁等解热消炎镇痛药、头孢类系列抗生素，在大鼠、狗及猴的亚急性及长期毒性试验中，高剂量组［大鼠为 100mg/（kg·d）、狗及猴为 300mg/（kg·d）］发现溶血性贫血症状。所以，若与会引发溶血性贫血的药物合用会导致溶血性贫血发生的危险性大大升高。因此在药物合用时需仔细观察，一旦发现异常症状，应立即停药并采取适当措施。

2. 阿司匹林体外研究对人体血浆蛋白结合的相互作用发现：添加阿司匹林后本品的游离浓度上升 26%。

【不良反应】极少数病人（小于 0.1%）偶见伴随着黄疸，ALT、AST 升高的肝功能障碍，还有报道有急性肝炎患者，均应作停药处理。少数病人（在 0.1%～5%之内）可能出现：①过敏性症状，如皮疹、瘙痒，可停药处理；②消化系统，如恶心、呕吐、食欲减退、胃部不适、腹痛、腹泻、便秘、口渴；③血液系统：鼻出血、皮下出血、贫血、嗜酸粒细胞增多；④精神系统：嗜睡、头痛、头晕等；⑤其他：倦怠、水肿、心悸。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
塞曲司特片	化学药	HZ003142
赛曲司特颗粒	化学药	HZ003148

HY001710 塞他洛尔

【其他名称】醋胺洛尔

【外文名称】Cetamolol

药物药理信息

【药理毒理】选择性 β_1－受体阻断剂，有内在拟交感活性，无膜稳定作用。其阻断选择性 β_1 和 β_2－受体的比率为 13:1，对 β_1－受体的选择程度介于阿替洛尔和美托洛之间。对静息时的心率影响很小，无显著的血管舒张作用。用于高血压。

【药代动力学】血药浓度达峰时间为 1.5～2.2 小

时，$t_{1/2}$为6~6.8小时。

【不良反应】可见乏力、嗜睡、头晕、失眠、恶心、腹胀、皮疹、晕厥、低血压、心动过缓等。

HY001711　塞替派

【外文名称】Thiotepa

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】1,1′,1″－硫次膦基三氮丙啶

【分子式】$C_6H_{12}N_3PS$

【分子量】189.22

【性状及组成】本品为白色鳞片状结晶或结晶性粉末；无臭或几乎无臭。本品在水、乙醇或三氯甲烷中易溶，在石油醚中略溶。

熔点：本品的熔点为52~57℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗肿瘤药。

塞替派为细胞周期非特异性药物，在生理条件下，形成不稳定的亚乙基亚胺基，具有较强的细胞毒作用。塞替派是多功能烷化剂，能抑制核酸的合成，与DNA发生交叉联结，干扰DNA和RNA的功能，改变DNA的功能，故也可引起突变。体外试验显示可引起染色体畸变，在小鼠的研究中可清楚看到有致癌性，但对人尚不十分清楚。近年来证明本品对人垂体促卵泡激素含量有影响。

【药代动力学】本品不易从消化道吸收。注射后广泛分布在各组织内，1~4小时后血浆浓度下降90%，24~48小时大部分药物通过肾脏排出。血浆蛋白结合率为10%，主要和白蛋白、脂蛋白结合，对白蛋白亲和力最大。$t_{1/2}$约3小时。尚无资料表明药物能否通过胎盘屏障。

【药物相互作用】

1．塞替派可增加血尿酸水平，为了控制高尿酸血症可给予别嘌呤醇。

2．与放疗同时应用时，应适当调整剂量。

3．与琥珀胆碱同时应用可使呼吸暂停延长，在接受塞替派治疗的病人，应用琥珀胆碱前必须测定血中假胆碱酯酶水平。

4．与尿激酶同时应用可增加塞替派治疗膀胱癌的疗效，尿激酶为纤维蛋白溶酶原的活化剂，可增加药物在肿瘤组织中的浓度。

【药物过量】药物过量后没有解毒药物。以往出现骨髓毒性后建议输注全血或白细胞、血小板悬液。目前，白细胞下降可使用粒细胞集落刺激因子。

【不良反应】

1．骨髓抑制是最常见的剂量限制毒性，多在用药后1~6周发生，停药后大多数可恢复。有些病例在疗程结束时开始下降，少数病例抑制时间较长。亦可有食欲减退、恶心及呕吐等胃肠反应。

2．少见过敏，个别有发热及皮疹。有少量报告有出血性膀胱炎，注射部位疼痛，头痛、头晕，闭经及影响精子形成。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
塞替派注射液	化学药	HZ003143

HY001712　噻苯唑

【外文名称】Tiabendazole

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】2－（4－噻唑基）－1*H*－苯并咪唑

【分子式】$C_{10}H_7N_3S$

【分子量】201.25

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末；味微苦，无臭。本品在水中微溶，在三氯甲烷或苯中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：驱肠虫药。

本品为广谱抗蠕虫药，对粪类圆线虫、蛲虫、钩虫、蛔虫、旋毛虫等均有作用，但作用机制不明，可能是抑制虫体的延胡索酸还原酶。通过抑制粪类圆线虫微管的形成，而抑制其胆碱酯酶分泌。低浓度时对幼虫有杀灭作用，对旋毛虫而言，能杀灭小肠内的成虫使之不再排出幼虫，对组织内的幼虫也有一定的杀灭作用。

【药代动力学】口服后迅速由胃肠道吸收，也可以从皮肤表面及眼睛吸收。服药1~2小时后血药浓度达峰值。本品在体内代谢成5－羟噻苯咪唑，主要以与葡萄糖醛酸或硫酸结合形式由尿中排出，在48小时内排出90%左右，其余部分由粪便排出。也可由乳汁中排泄。

【药物相互作用】该药可能使氨茶碱（或黄嘌呤类药物）血浓度增高。服该药者在输入氨茶碱时曾发生严重恶心、嗜睡及全身不适等症状。

【不良反应】常规剂量下，其不良反应率为5%~30%，多发生在服药后3~4小时，可持续2~8小时。

1．常见的反应有：畏食、恶心、呕吐、眩晕、上腹不适。

2. 较少见的有：腹泻、瘙痒、疲倦、嗜睡、手足麻木、头晕、头痛、耳鸣、高血糖、脉搏徐缓、低血压、虚脱、暂时性肝功能异常。

3. 少见的有：发热、脸潮红、结膜充血、血管神经性水肿、淋巴结肿、皮疹。偶见幻视、嗅觉障碍、重症多型性红斑、尿结晶、暂时性白细胞减少及肝内胆汁郁积。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
噻苯唑片	化学药	HZ003144

HY001713 噻加宾

【外文名称】Tiagabine

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

【性状及组成】本品为白色或无色、无臭的结晶性粉末，在水中的溶解度为3%，不溶于己烷。

熔点：本品的熔点为192℃（分解）。

药物药理信息

【药理毒理】本品通过对神经元及神经胶质细胞对γ-氨基丁酸（GABA）再摄取的阻滞，增加突触部位GABA的水平，而达到抗惊厥作用。

一般作为辅助治疗，用于成人及12岁以上儿童难治性部分性癫痫发作。

【药代动力学】本品口服吸收快，0.5～2小时可达血药浓度峰值，生物利用度为90%～95%，血浆蛋白结合率为96%，平均消除半衰期为5～8小时。本品通过肝脏细胞色素P450酶系统代谢，合并使用酶诱导剂可增加本品的消除，使其半衰期缩短。肝功能不全者，其代谢降低。约63%经粪便排出，25%经尿排出。

【不良反应】可见困倦、头晕、头痛、疲乏、咽炎、呕吐、腹泻、易怒、注意力不集中。少见有弱视、口炎、肌无力、肌痛、失眠、精神混乱、抑郁、瘙痒、共济失调、感觉障碍。罕见有健忘、情绪不稳、兴奋、眼震、皮疹等。

HY001714 噻美尼定

【外文名称】Tiamenidine

药物药理信息

【药理毒理】本品的化学结构、作用机制、降压效果、不良反应等均与可乐定相似。

【药代动力学】口服后吸收迅速、完全。由肾排泄，$t_{1/2}$约4小时。

【不良反应】常见的不良反应为口干。突然停药可产生血压反跳现象。

HY001715 噻奈普汀钠

【其他名称】达体朗、Tatinol

【外文名称】Tianeptine Sodium

药物理化信息

【化学名】7-［（3-氯-6，11-二氢-5，5-二氧-6-甲基二苯-［c，f］［1，2］噻唑平-11-基）氨基］庚酸钠盐

【分子式】$C_{21}H_{24}Cl_2NaO_4S$

【分子量】458.90

药物药理信息

【药理毒理】噻奈普汀是一种抗抑郁药。噻奈普汀对人体具有如下作用特点：对心境紊乱的作用，在镇静性和兴奋性抗抑郁药的二种分类之中，本药作用介于二者之中。对躯体不适症状具有显著作用，特别是对与焦虑和心境紊乱有关的胃肠道不适症状。对酒精依赖病人在戒断过程中出现的性格和行为异常有缓解作用。噻奈普汀无下列毒性作用：对睡眠和注意力，心血管系统，胆碱能神经系统（无抗胆碱能征象），药物成瘾。

【药代动力学】噻奈普汀钠的消化道吸收迅速并完全。分布迅速，同时蛋白结合率高达94%。本药在肝脏通过β-氧化作用和N-脱甲基作用代谢完全。噻奈普汀的清除终末半衰期短，为2小时30分，极少量原形化合物（8%）自肾脏排出，主要是其代谢物自尿道排出。老年人：年龄超过70岁的老年人长期服用本药，研究其药代动力学发现其清除半衰期延长1小时。肝功能不全病人：研究慢性酒精中毒甚至与肝硬化有关的肝功不全病人发现，本药对药代动力学参数无不良影响。肾功能不全病人：研究发现清除半衰期延长1小时。

【药物相互作用】避免与非选择性MAOI合用，因为有出现休克或阵发性高血压、高温、惊厥、死亡的危险性。使用MAOI的病人必须停药2周后方能服用噻奈普汀；而停用噻奈普汀24小时后，即可使用MAOI。水杨酸可以降低本药的蛋白结合率，故同时服用高剂量水杨酸时，推荐减少本药的用量。

【药物过量】如无意或有意过量服药，需立即请医师会诊并提供所有资料，治疗措施包括：洗胃，心肺、代谢和肾脏监察，针对出现的临床表现对症治疗，特别注意通气和纠正代谢和肾脏功能紊乱。

【不良反应】罕见，通常是轻度上腹不适、腹痛、口干、畏食、恶心、呕吐、便秘、气胀；失眠、瞌睡、恶梦、无力；心动过速、期前收缩、胸骨后

疼痛；眩晕、头痛、晕厥、震颤、发热脸红；呼吸困难、咽部发痒；肌痛、腰痛。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
噻奈普汀钠片	化学药	HZ003145

HY001716　噻帕米

【外文名称】Tiaparnil

药物药理信息

【药理毒理】本品为维拉帕米类钙拮抗药，对心肌缺血有保护作用，能减少室性早搏的发生率，可缩小心肌梗死面积。可用于心律失常（阵发性室上性心动过速、室上性或室性早搏），也可用于心绞痛和高血压。

【不良反应】不良反应较少，有时可发生头痛、头晕、疲劳、恶心、上腹部不适，颜面潮红、心悸等。

HY001717　噻托溴铵

【外文名称】Tiotropium Bromide

药物理化信息

【化学名】（1α，2β，4β，5α，7β）3－噁－9氮翁三环［3,3,1,02,4］壬烷，7－［（羟基－二－2－噻吩乙酰）氧基］－9,9－二甲基，溴，一水合物。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理学特性：噻托溴铵是一个长效，特异性的抗毒蕈碱药物，临床上通常称作为抗胆碱能药物。通过和支气管平滑肌上的毒蕈碱受体结合，噻托溴铵可抑制副交感神经末端所释放的乙酰胆碱的胆碱能（支气管收缩）作用。其对素蕈碱受体亚型 M_1～M_5 有相似的亲和力。在呼吸道中，噻托溴铵竞争性且可逆性的抑制 M_3 受体，可引起平滑机松弛。此作用呈剂量依赖性，并可持续 24 小时以上，作用时间长可能是由于其与 M_3 受体解离非常慢，其解离半衰期显著长于异丙托溴铵。作为四价铵抗胆碱能药物，噻托溴铵在吸入给药时是局部（支气管）选择性的，由此可达到治疗效果而不致于产生全身性抗胆碱能作用。其支气管扩张作用基本上是局部性（气道）作用，而非全身性作用。

噻托溴铵与 M_2 受体的解离比与 M_3 受体快，在体外研究中，其对 M_3 的受体亚型选择性高于 M_2。高效而且与受体解离缓慢使得噻托溴铵在临床上成为慢性阻塞性肺疾病（COPD）患者显著而长效的支气管扩张药。

临床研究包括：对总数为 2663 例患者进行的 4 个为期 1 年，和 2 个为期 6 个月的随机、双盲研究（其中 1308 例授受噻托溴铵治疗）。为期 1 年的研究由两个安慰剂对照试验和两上异丙托溴铵对照试验组成；两个为期 6 个月的试验均用沙美特罗和安慰剂作对照。这些研究包括对肺功能以及对呼吸困难、病情加重和与健康相关的生活质量的测定。

上述研究中，噻托溴铵一日 1 次给药，在首次给药后 30 分钟内使肺功能［1 秒钟用力呼气容积（FEV1）］和用力肺活量（FVC））得到显著改善，并持续 24 小时。用药第三天时，支气管扩张效应基本达到稳态，药效学稳态在一周内达到。根据患者每日测定的结果，表明噻托溴铵显著改善早、晚的 PEFR（峰值呼气流速）。噻托溴铵在一年的给药期内一直保持其支气扩张作用，而无耐受现象发生。

对 96 例慢性阻塞肺疾病（COPD）患者进行的随机、安慰剂对照临床研究证明，与安慰剂相比，治疗组在给药的 24 小时间隔期间支气管保持扩张，无论噻托溴铵的给药时间是在早上还是晚上。

长期临床试验（为期 6 个月和 1 年）证明了下列结果：噻托溴铵显著改善呼吸困难（用马哈拉转换呼吸困难指数评价），这种改善在整个治疗期间一直保持。

2．临床前安全性资料（毒理学）：常规的安全药理学（一般药理学）试验、长期毒性试验和生殖毒性试验等研究所观察到的结果均可由噻托溴铵的抗胆碱能特性来解释，特别如动物摄食量下降、体重增加受抑制、口干和鼻干、泪液和唾液分泌减少、瞳孔放大和心率增加等反应。长期毒性试验观察到其他有关作用的：大鼠和小鼠的轻度呼吸道刺激反应表现为鼻炎和鼻腔及鼻咽部的上皮改变，大鼠前列腺炎伴随膀胱蛋白沉积和结石。

只有在产生母体毒性的剂量水平，才能观察到对妊娠、胚胎/胎儿的发育、分娩或围产期发育的有害作用。

前列腺炎和生殖毒只在局部或全身给药剂量超过治疗剂量的 5 倍以上才观察到。基因毒性和致癌性研究未观察到对人类的危害。

【药代动力学】噻托溴铵是非手性四价铵化合物，在水中少量溶解。噻托溴铵以干粉吸入给药。一般采用吸入途径给药时，大部分药物沉积在胃肠道，只有少量药物到达靶器官肺。下面所述的药代动力学资料许多是用于高于推荐治疗的高剂量得来的。

1．吸收：给年轻的健康志愿者吸入干粉后，测得的绝对生物利用度为 19.5%，提示到达肺的部分

生物利用度很高。根据该药的化学结构（四价铵化合物）和体外试验结果可以推测，噻托溴铵在胃肠道吸收差（10%～15%）。噻托溴铵的口服溶液的绝对生物利用度只有2%～3%。噻托溴铵在吸入5分钟后达到最高血药浓度。由于其四价铵化合物的特性，食物不影响吸收。

2. 分布：该药与血浆蛋白结合率达72%，分布容积为32L/kg。在稳态时，COPD患者吸入18μg的干粉后5分钟测得的血药峰浓度为17～19pg/ml，其后以多室模型的方式迅速下降，稳态的血药谷浓度为3～4pg/ml。肺的局部浓度未知，但从给药方式可以看出肺的实际药物浓度较高。对大鼠进行研究表明，噻托溴铵不能通过血脑屏障。

3. 生物转化：生物转化的程度非常小，年轻健康志愿者静注药物后有74%的剂量以原形从肾脏排泄，从而证明了这一点。噻托溴铵是酯，经非酶方式分解为醇（N－甲基东莨菪醇）和酸（二噻吩羟基乙酸），二者均不能与毒蕈碱受体结合。在体外用人肝微粒体和人肝细胞进行的实验表明，一些药物（小于静注剂量的20%）经依赖于细胞色素P450的氧化及随后与谷胱甘肽结合成为各种Ⅱ相代谢物。体外肝微粒体试验表明，这一酶解通路可被CYP 2D6（和3A4）抑制剂、奎尼丁、酮康唑和孕二烯酮抑制。

因此CYP 2D6和3A4包含在代谢通路中，参与了较小部分药物的消除。噻托溴铵即使在高于治疗浓度时也不抑制肝微粒体中的细胞色素CYP 1A1、1A2、2B6、2C9、2D6、2E1或3A。

4. 消除：噻托溴铵的终末消除半衰期在吸入后5和6天之间。年轻健康志愿者静注后总消除率为880ml/min，个体之间变异性为22%。

静注给予噻托溴铵后主要以原药的形式经尿液排泄（74%）。吸入干粉后14%的剂量经尿排出，其余药物主要为在肠道未被吸收的药物，经粪便排泄。噻托溴铵的肾脏消除率超过了肌酐清除率，表明药物是分泌入尿液。COPD患者连续一日1次吸入，2～3周后达到药代动力学稳态，其后无进一步的药物累积。

线性/非线性：静注和干粉吸入给药后在治疗范围内，噻托溴铵的药代动力学证明为线性药代动力学。

老年患者：正如所有主要经肾脏排泄的药物一样，老年患者噻托溴铵的肾清除率下降（年龄小于58岁的COPD患者，清除率为326ml/min；年龄大于70岁的COPD患者，清除率为163ml/min）。这可能与肾功能下降有关。噻托溴铵吸入后经尿液的排泄由14%（年轻健康志愿者）下降至约7%（COPD患者），然而，与患者个体之间和个体内变异性（干粉吸入后AUC_{0-4}增加了43%）相比，COPD患者的血药浓度并没有随年龄的增加而出现显著改变。

肾功能不全患者：与所有其他主要经肾脏排泄的药物相同，肾功能不全时静注或干粉吸入血药浓度均有增加且药物的肾脏清除率下降。在老年人较常见的轻度肾功能不全（肌酐清除率50～80ml/min），可使噻托溴铵血药浓度轻度增加（静注后AUC0～4增加39%）。在中重度肾功能不全的COPD患者（肌酐清除率<50ml/min，静注给予噻托溴铵后血药浓度加倍（AUC_{0-4}增加82%），干粉吸入后的血药浓度亦增加。

肝功能不全患者：肝功能不全对噻托溴铵的药代动力学无影响。

噻托溴铵主要经肾脏排泄清除（年轻健康志愿者为74%），少量以非酶酯分解成无药理活性的产物。

【药物相互作用】尽管未进行过正式的药物相互作用研究，但噻托溴铵吸入性粉末与其他药物同时使用未发现不良反应，这些药物包括拟交感的支气管扩张剂，甲基黄嘌呤、口服或者吸入性甾体类药物等，为通常用于治疗慢性阻塞性肺疾病（COPD）的药物。

噻托溴铵与其他抗胆碱能药物合用未进行过研究，因此不推荐与其他抗胆碱能药物合用。

【药物过量】高剂量的噻托溴铵可能引起抗胆碱能的症状和体征。然而，健康志愿者单次吸入达340μg的噻托溴铵后未出现全峰性的抗胆碱能不良作用。另外，健康志愿者一日1次吸入170μg的噻托溴铵，用药7天，除口干，未见其他相关不良反应。在对慢性阻塞性肺疾病（COPD）患者进行的多剂量研究中，当用每日最高剂量为43μg的噻托溴铵治疗4周后，未观察到显著的不良反应，由于疏忽而经口服入噻托铵胶囊引起急性中毒是不太可能的，因其口服生物利用度很低。

【不良反应】

1. 在共有906例患者接受噻托溴铵治疗1年的临床试验中，最经常发生的不良反应为口干。大约14%的患者发生口干。口干反应通常较轻微且随着持续治疗该反应会消失。

2. 下列是该种不良反应的报告率，这些资料来自患者接受噻托溴铵治疗1年的临床试验（根据WHO器官系统分级）：

全身过敏反应，口干，便秘，心动过速，心悸，念珠菌感染，鼻窦炎，咽炎，排尿困难，尿潴留。

上市后经验：已收到关于恶心，声音嘶哑和头晕的自发性不良反应报告。

3. 关于个别严重和（或）经常发生的不良

反应。

（1）COPD患者抗胆碱能治疗最常见的不良反应为口干。大部分病例口干症状较轻微。总的来说，口干发生在治疗后的第3至第5周。口干症状通常在患者持续治疗后消失。在906名患者用药1年的临床试验中，因口干不良反应而终止试验的有3名患者（占总治疗患者数的0.3%）。

（2）在用药1年的临床试验中，个别病例所报告的严重且持续的不良反应为便秘和尿潴留。尿潴留只见于有易患因素的老年男性（如前列腺肥大）。

（3）应用噻托溴铵后有个别例发生室性心动过速和房颤，通常见于易感病人。

（4）和所有吸入治疗一样，噻托溴铵可能引起吸入刺激导致的支气管痉挛。

（5）自发性不良反应报告的过敏反应包括血管性水肿、皮疹、风疹和皮肤瘙痒。

4．不良反应的药理学分类：有许多器官系统和功能是受副交感神经系统控制的，因此易受抗胆碱能制剂的影响。全身性抗胆碱能作用可能有关的不良反应包括口干、咽干、心率增加、视力模糊、青光眼、排尿困难、尿潴留和便秘。另外，吸入噻托溴铵患者可发生上呼吸道刺激现象。口干和便秘的发生率随年龄增长而增加。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
噻托溴铵粉吸入剂	化学药	HZ003146

HY001718　赛庚啶

【外文名称】Cyproheptadine

药物理化信息

【化学名】1－甲基－4－（5H－二苯并［*a*，*d*］环庚三烯－5－亚基）哌啶盐酸盐倍半水合物

【分子式】$C_{21}H_{21}N \cdot HCl \cdot 3/2H_2O$

【分子量】350.89

药物药理信息

【药理毒理】盐酸赛庚啶为H_1受体阻断药，作用较氯苯那敏、异丙嗪强，并且有轻、中度的抗5－羟色胺作用和抗胆碱作用，临床上用于治疗过敏性疾病。

【不良反应】偶可发生接触性皮炎，出现局部红肿，原有皮炎加重，瘙痒等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
赛庚啶乳膏	化学药	HZ003147

HY001719　赛洛西宾

【外文名称】Psilocybine

药物管理信息

【特殊管理分类】一类精神药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为精神药品，但我国未生产或使用。

HY001720　赛洛新

【外文名称】Psilocine

药物管理信息

【特殊管理分类】一类精神药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为精神药品，但我国未生产或使用。

HY001721　三苯双脒

【外文名称】Tribendimidine

药物理化信息

【化学名】*N*，*N*′－双－［4′－（1－二甲氨基乙亚氨基）苯基］－1,4－苯二甲亚胺

【分子式】$C_{28}H_{32}N_6$

【分子量】452.60

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：临床研究显示，本品对多种肠道寄生虫有驱除作用，成人单次口服本品0.4g，对单纯十二指肠钩虫、单纯美洲钩虫和混合钩虫感染的治愈率分别为84.21%、89.83%和82.89%，成人单次口服本品0.3g，对蛔虫感染的治愈率为96.13%。本品服用后8～12小时开始排虫，24～36小时达到高峰。

非临床研究提示，本品对美洲钩虫、巴西日本圆线虫、犬钩虫、犬弓蛔虫有一定的驱除作用，对节片戴纹绦虫和楔形变带绦虫也有一定的作用。本品在一定浓度范围内，可诱发豚鼠离体十二指肠和回肠收缩；本品口服给药未观察到对小鼠小肠蠕动有促进或抑制作用。

2．毒理研究

（1）重复给药毒性：大鼠和犬连续给药14天，可引起小肠充血、肠黏膜上皮细胞脱落和肝细胞水

肿，上述病理性改变具有可逆性，提示本品重复给药对消化系统有可逆毒性作用。

（2）遗传毒性：本品 Ames 试验、中国仓鼠肺细胞（CHL）染色体畸变试验以及小鼠微核试验的结果均为阴性。

（3）生殖毒性：雄性大鼠于交配前 60 天至整个交配期间，雌鼠于交配前 14 天至妊娠 17 天，口服本品 60mg/kg 对雌雄大鼠的生育力没有影响，也未发现对胎鼠有致畸作用，大鼠于妊娠 6～16 天，口服本品 120mg/kg 及以上剂量时，胚胎死亡增加；妊娠大鼠口服本品每日 250mg/kg 时，侧脑室扩大的胎鼠数量明显增加，未见其他畸形。妊娠大鼠于妊娠第 15 天至分娩后 28 天，连续口服本品每日 60mg/kg 对母鼠的体重增长以及仔鼠的生长发育、生育力未见影响。

【药代动力学】口服三苯双脒肠溶片 0.4g，尿中 24 小时和总累积排泄量分别为 0.115 ± 0.121mg 和 0.126 ± 0.125mg，口服三苯双脒肠溶片 0.6g，尿中 24 小时和总累积排泄量分别为 0.415 ± 0.449mg 和 0.461 ± 0.492mg。试验结果显示绝大多数血浆样本中未能检测到三苯双脒，且尿中药物排泄也极少（不到 0.1%）。

口服 0.4g 和 0.6g 三苯双脒肠溶片后三苯双脒的吸收半衰期分别为 3.01 ± 2.35 小时和 3.23 ± 1．60 小时，表明三苯双脒的吸收较慢，且吸收速率与剂量大小无关。

口服 0.4g 和 0.6g 三苯双脒肠溶片后三苯双脒的消除半衰期分别为 5.75 ± 3.32 小时和 4.29 ± 2.10 小时，表明三苯双脒在体内的消除可能随剂量增大而加快。

【不良反应】恶心、腹痛、腹泻、头晕、头痛、困倦，程度较轻，无需特殊处理。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
三苯双脒肠溶片	化学药	HZ003149

HY001722 三氟丙嗪

【外文名称】Triflupromazine

药物药理信息

【药理毒理】抗精神病作用较氯丙嗪强。用于治疗精神分裂症。亦用于镇吐。

【不良反应】主要是锥体外系反应，其他有困倦、体位性低血压、口干、视力模糊等等不良反应。

HY001723 三氟哌多

【其他名称】三氟哌丁苯、三氟哌啶醇、THIPERIDOL

【外文名称】Trifluperidol

药物药理信息

【药理毒理】药理作用同氟哌啶醇，大剂量时，能控制兴奋躁动、行为紊乱，对精神运动疗效满意，且作用快而强，较为安全。此外，能抑制条件性反射、抗呕吐和抗肾上腺作用，以及弱的抗组胺和强的抗 5－HT 作用。用于急、慢性精神分裂症，对改善孤独、淡漠、缄默、迟钝、退缩等症状具有较好疗效。

【不良反应】不良反应以锥体外系反应为主，偶见白细胞减少。可见胃肠反应、失眠和暂时性血清谷丙氨基转移酶增高。大剂量长期使用可引起心律失常、心肌损伤。曾有致畸报道，孕妇忌服。

HY001724 三硅酸镁

【外文名称】Magnesium Trisilicate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

【性状及组成】本品为组成不定的含水硅酸镁。含 MgO 不得少于 20.0%，含 SiO_2 不得少于 45.0%；SiO_2 与 MgO 含量的比值应为 2.1 ～2.3 。

本品为无砂性感觉的白色细粉；无臭，无味；微有引湿性。本品在水或乙醇中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗酸药。

本品对胃酸起中和或缓冲作用。在中和胃酸时产生胶状二氧化硅，可以覆盖在胃、十二指肠溃疡的表面，除机械保护作用外还能吸附游离酸。本品对胃酸的分泌无直接影响。其缓冲作用可导致胃内 pH 值升高，从而使胃酸过多症状得以缓解。其轻泻作用可能因肠黏膜释放胆囊收缩素，刺激结肠收缩而排便。

【药代动力学】本品口服吸收少而缓慢，约 10% 的镁自肠道吸收。作用时效一般在服药后 2～8 小时开始，持续时间较长。

【药物相互作用】

1．与抗 M 胆碱药物并用时，后者吸收可能降低而影响疗效，因此必须将服用时间隔开。

2．与地高辛并用时，后者吸收可被抑制，血药浓度降低。

3．与苯二氮䓬类药物并用时，后者吸收率

降低。

4. 与异烟肼并用时，后者吸收可能延迟与减少，一般异烟肼应于制酸药摄入前 1 小时服用。

5. 与左旋多巴并用时，吸收可能增加，胃排空缓慢者尤其明显。

6. 应避免氯丙嗪类药与三硅酸镁同时并用，后者可抑制前者的吸收。

【不良反应】

1. 长期服用，偶可发生肾硅酸盐结石。

2. 肾功能不全患者长期大剂量服用可出现眩晕、昏厥、心律失常或精神症状，以及异常疲乏无力（高镁血症或其他电解质失调）。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方地巴唑氢氯噻嗪胶囊	化学药	HZ001128
复方颠茄铋镁片	化学药	HZ001135
复方芦荟维 U 片	化学药	HZ001287
复方罗布麻片Ⅰ	化学药	HZ001311
复方罗布麻片Ⅱ	化学药	HZ001312
复方木香铝镁片	化学药	HZ001322
复方氢氧化铝片	化学药	HZ001351
复方三嗪芦丁片	化学药	HZ001365
复方维生素 U 胶囊	化学药	HZ001423
复方溴丙胺太林铝镁片	化学药	HZ001448
盖胃平片	化学药	HZ001534
甘镁颠茄片	化学药	HZ001561
海藻酸铝镁颗粒	化学药	HZ001679
三硅酸镁片	化学药	HZ003150
维 U 颠茄铝镁胶囊	化学药	HZ003589
维 U 颠茄铝镁片	化学药	HZ003590
维 U 颠茄铝镁片Ⅱ	化学药	HZ003591
复方猴头颗粒	中成药	ZC001390
救必应胃痛片	中成药	ZC002888
罗已降压片	中成药	ZC003443
胃宁散	中成药	ZC005723

HY001725　三甲利定

【外文名称】 Trimeperidine

药物管理信息

【特殊管理分类】 麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】 国食药监安［2007］633 号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY001726　三甲氧基安非他明

【其他名称】 TMA

药物管理信息

【特殊管理分类】 一类精神药

药物药理信息

【药理毒理】 国食药监安［2007］633 号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为精神药品，但我国未生产或使用。

HY001727　三尖杉酯碱

【其他名称】 粗榧碱、高哈林通碱、后哈莫林通碱、哈林通碱、HRT、三尖杉碱

【外文名称】 Harringtonine

药物管理信息

【依据标准】 化学药品地标升国标·第 5 册

药物理化信息

【化学名】 ［3（*R*）］－2－羟基－2－（3－（羟基－3－甲基丁基）－粗榧碱丁二酸 4－甲酯

【分子式】 $C_{28}H_{37}NO_9$

【分子量】 531.60

【性状及组成】 本品为从粗榧科植物三尖杉或其同属植物提取得到的生物碱。

药物药理信息

【药理毒理】 抗肿瘤药。本品为细胞周期非特异性药物，但对 S 期作用较明显，对 G_1 期细胞增加，S 期和 G_2 + M 期细胞减少。其作用机制为抑制蛋白质合成的起始阶段，抑制 DNA 聚合酶 α 活性，导致 DNA 合成下降，对蛋白质合成严重抑制。本品还有诱导细胞分化，提高 cAMP 含量，抑制糖蛋白质合成的作用。

用于治疗急性粒细胞性白血病，急性单核细胞性白血病，对骨髓增生不良综合征（MDS）、真性红细胞增多症，慢性粒细胞性白血病亦有一定的疗效。

【药代动力学】 动物试验表明本品静注 15 分钟后分布于肾、肝、骨髓、肺、心、胃肠等脏器，2 小时后各脏器中药物浓度下降很快，但骨髓中下降较慢。在血液中分布半衰期为 3.5 分钟，消除半衰期为 50 分钟，24 小时尿中排出原形药约 12.9%，粪便中排出的原形药约 1.6%。

【药物相互作用】

1. 本品与其他可能抑制骨髓功能的抗癌药物或

放射疗法合并应用时应调节本品的剂量与疗程。

2. 蒽环类抗生素有心肌毒性作用，老年患者及已反复采用阿霉素或柔红霉素等蒽环类抗生素治疗的患者使用三尖杉酯碱应慎用或不用，以免增加心脏毒性。

【不良反应】

1. 骨髓抑制：主要为白细胞和血小板减少，属可恢复性的。

2. 胃肠道反应：食欲减退、恶心、呕吐。

3. 心脏毒性：心动过速、胸闷、心悸，偶有心律失常，甚至心衰。若引起心房扑动应立即停药，部分病例有心肌损害。

4. 其他：头晕、乏力、注射局部疼痛。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
三尖杉酯碱注射液	化学药	HZ003153

HY001728 三磷酸胞苷二钠

【外文名称】Cytidine Disodium Triphosphate

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第16册

药物理化信息

【化学名】胞嘧啶核苷－5－三磷酸酯二钠

【分子式】$C9H_{14}N_3Na_2O_{14}P_3$

【分子量】527.14

药物药理信息

【药理毒理】为辅酶类药，是核苷酸衍生物，在机体内参与磷脂类及核酸的合成和代谢，是脑磷脂合成与核酸代谢的中间产物和能量来源。

【不良反应】偶有发热、皮疹，停药后症状消失。极少数病人出现一过性轻度谷丙转氨酶升高，停药后恢复正常。本药对窦房结有明显抑制作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
三磷酸胞苷二钠注射液	化学药	HZ003154
注射用三磷酸胞苷二钠	化学药	HZ004950

HY001729 三磷酸钙

【外文名称】Calcium Triphosphate

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肠内营养粉剂（TP）	化学药	HZ000518

HY001730 三磷酸腺苷二钠

【外文名称】Adenosine Disodium Triphosphate

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】腺嘌呤核苷－5－三磷酸酯二钠盐三水合物

【分子式】$C_{10}H_{14}N_5Na_2O_{13}P_3 \cdot 3H_2O$

【分子量】605.19

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末或块状物；无臭，味咸；有引湿性。

本品在水中易溶，在乙醇、三氯甲烷或乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：细胞代谢改善药。

本品为一种辅酶，有改善机体代谢的作用，参与体内脂肪、蛋白质、糖、核酸以及核苷酸的代谢。同时又是体内能量的主要来源，当体内吸收、分泌、肌肉收缩及进行生化合成反应等需要能量时，三磷酸腺苷即分解成二磷酸腺苷及磷酸基，同时释放出能量。动物试验证明本品可抑制慢反应纤维的慢钙离子内流，阻滞或延缓房室结折返途径中的前向传导，大剂量还可能阻断或延缓旁路的前向和逆向传导；另外还具有短暂性的增强迷走神经的作用，因而能终止房室结折返和旁路折返机制引起的心律失常。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
三磷酸腺苷二钠氯化镁注射液	化学药	HZ003155
三磷酸腺苷二钠片	化学药	HZ003156
三磷酸腺苷二钠注射液	化学药	HZ003157
注射用三磷酸腺苷二钠	化学药	HZ004951
注射用三磷酸腺苷二钠氯化镁	化学药	HZ004952
注射用三磷酸腺苷辅酶胰岛素	化学药	HZ004953

HY001731 三氯福司

【其他名称】三氯磷脂钠、三氯乙磷酸钠、Triclos

【外文名称】Triclofos

药物药理信息

【药理毒理】为水合氯醛的衍生物，具有镇静、催眠作用，在体内分解成三氯乙醇而起作用。作用

相似与水合氯醛，但无其不快气味，且对胃刺激性小。用为镇静、催眠药。

【不良反应】同水合氯醛。

HY001732　三氯生

【外文名称】Triclosan

药物药理信息

【药理毒理】本品是一种含多个氯的苯氧基酚，其抗菌谱很广。在其最小抑菌浓度范围（MIC）约10^{-2}至10μg/ml有抗菌作用的包括：革兰阳性菌如葡萄球菌（包括金黄色葡萄球菌）、链球菌、梭状芽胞杆菌、革兰阴性菌例如大肠杆菌、普通为形杆菌、奇异变形杆菌、沙门菌、志贺菌、摩拉克菌、布鲁杆菌、弧菌属、港卡菌属、放线菌属、链球菌、刚果嗜皮菌。对于表皮真菌类（如表皮真菌、毛发癣菌、小孢子菌属）及霉菌（念珠菌属），它的抑菌活性较弱些（MIC：1～33μg/ml）。对本品无效的菌属为：产碱杆菌、霉浆菌、尺变形菌、锯杆菌、铜绿假单胞菌、结核杆菌、棒状杆菌、人型链球菌。

三氯生于上述低浓度及高滴度细菌时（＞1μg/ml）具有抑菌活性，可能是因为对细菌细胞膜的损伤。

【药代动力学】在健康志愿者背部的400cm²皮肤上局部地搽用“新适确得”乳膏2g，并加以密封包扎。由尿中排出的葡醛化三氯生代谢物来判定，约20%三氯生被吸收，所吸收剂量的75%在48小时内主要以葡醛化合物形式从尿中排泄。

【药物相互作用】尚未发现三氯生对于卤米松的经皮肤吸收有任何的影响。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
卤米松三氯生软膏	化学药	HZ002457

HY001733　三氯叔丁醇

【其他名称】Chlorbutanol Hydrate、Chlorbutol、Methaform、三氯丁醇、Trichlorbutanol

【外文名称】Chlorobutanol

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】2－甲基－1,1,1－三氯－2－丙醇半水合物

【分子式】$C_4H_7Cl_3O \cdot 1/2H_2O$

【分子量】186.47

【性状及组成】本品为白色结晶；有微似樟脑的特臭；易挥发。本品在乙醇、三氯甲烷、乙醚或挥发油中易溶，在水中微溶。

熔点：本品不经干燥，依法测定，熔点不低于77℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料，防腐剂。

用于：①在注射剂及滴眼液中作防腐剂。②皮肤瘙痒及其他皮肤刺激性疾患。③晕动病及呕吐。④鼻炎。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
薄荷喉片	化学药	HZ000453
复方三氯叔丁醇气雾剂	化学药	HZ001364
复方熊胆薄荷含片	化学药	HZ001447
消痔灵注射液	中成药	ZC006143

HY001734　三七总皂苷

【外文名称】Sonqi Total Saponins

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（中药成方制剂）·第19册

【性状及组成】本品为五加科植物三七的芦头按一定的工艺提制的总皂苷。

本品为淡黄色无定形粉末；味苦、微甘。

本品易溶于甲醇、乙醇和水，难溶于丙酮、乙醚和苯，易吸潮。

药物药理信息

【药理毒理】活血祛瘀，通脉活络，具有抑制血小板聚集和增加心脑血流量的作用。用于心脑血管疾病。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
二维三七桂利嗪胶囊	化学药	HZ000859
三七通舒胶囊	中成药	ZC004487
小儿脾健灵糖浆	中成药	ZC006278
血塞通胶囊	中成药	ZC006594
血塞通颗粒	中成药	ZC006595
血塞通片	中成药	ZC006596
血塞通软胶囊	中成药	ZC006597
血塞通注射液	中成药	ZC006598

续表

制剂名称	类别	序号
血栓通胶囊	中成药	ZC006601
血栓通注射液	中成药	ZC006602
注射用血塞通	中成药	ZC007520
注射用血栓通	中成药	ZC007521

HY001735 三氧化二砷

【外文名称】Arsenous Acid Anhydride

药物管理信息

【特殊管理分类】医疗用毒性药品

药物理化信息

【化学名】三氧化二砷

【分子式】As_2O_3

【分子量】198.00

药物药理信息

【药理毒理】本品对急性早幼粒细胞白血病（APL）有一定疗效，其作用机制尚不明确。目前的研究显示，染色体t易位（15：17）是急性早幼粒细胞性白血病的重要细胞遗传学特征，该易位导致早幼粒细胞白血病基因PML和维甲酸受体α（RARα）基因融合，表达PML－RARα蛋白，这种融合蛋白的过度表达是APL发病的主要机制之一，过度表达的PML－RARα可抑制细胞的分化凋亡。实验发现，三氧化二砷通过调节NB4细胞内PML－RARα的水平，使细胞重又纳入程序化死亡的正常轨道。

经维甲酸预处理的NB4细胞，三氧化二砷诱导其发生凋亡的作用并没有受到影响，这说明该药以一种不依赖于维甲酸调节途径的方式在发挥作用，二者之间不存在交叉耐药。

三氧化二砷可显著抑制人肝癌细胞株SMMC－7721细胞生长，其机制与诱导肝癌细胞发生凋亡有关，且凋亡呈剂量依赖性和时间依赖性。细胞周期分析显示，1μg/ml三氧化二砷作用24～72小时，使该细胞生长阻止于G2/M期。经三氧化二砷处理4天的食管癌细胞株EC8712和EC1.71出现显著的凋亡特征，并表现为剂量和时间依赖关系。

动物毒性试验结果表明：比格犬以0.1、0.3、3.0 mg/kg连续静脉注射给药90天，低、中剂量组动物在给药末期出现心率下降；高剂量组动物红细胞和血红蛋白均显著降低。停药时进行病理组织学检查见该组动物多数出现肝细胞变性，少数发生肝细胞坏死，肾小球萎缩，肾小球囊内可见嗜酸性细胞、坏死细胞及炎性细胞浸润。睾丸中大部分曲细精管细胞层次减少、精子生成受抑制。

【药代动力学】本品静脉给药，组织分布较广，停药时检测组织中砷含量由高到低依次为皮肤、卵巢、肝脏、肾脏、脾脏、肌肉、睾丸、脂肪、脑组织等。停药4周后检测，皮肤中砷含量与停药时基本持平，脑组织中含量有所增加，其他组织中砷含量均有所下降。8例APL患者的药代动力学参数显示，在开始静滴后4小时达到峰浓度，随即被血浆快速清除，每日尿砷排泄量约为每日药物剂量的1%～8%。停药后尿砷即开始下降，停药1～2个月尿砷排泄可下降25%～75%不等。

【药物相互作用】在本品的使用过程中，未发现与其他药品之间有药物相互作用。

【药物过量】尚未发现因亚砷酸注射液用药过量引起不良反应的报道。如使用本品过量引起急性中毒，可用二巯基丙醇抢救。

【不良反应】主要不良反应为皮肤干燥、丘疹、红斑或色素沉着，恶心，胃肠胀满，指尖麻木，血清转氨酶升高。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
亚砷酸氯化钠注射液	化学药	HZ003822

HY001736 三乙醇胺

【外文名称】Trolamine

药物理化信息

【化学名】2,2′,2″－次氮基三乙醇

药物药理信息

【药理毒理】三乙醇胺可通过渗透和毛细管作用原理，起到清洁和引流的双重作用。

本品具有深部水合作用，可增加皮肤血流速度，帮助排除渗出物，还可改变白细胞介素Ⅰ和白细胞介素Ⅵ之间的比例，刺激成纤维细胞增生，增加胶原的合成。

【药代动力学】大鼠试验的研究显示，本品施于烧伤的皮肤之后，可通过楔合效应减少局部创伤皮肤的水分丢失（约75%），并可将本品中的部分水分（约24%）转移至皮肤表层。对豚鼠的研究显示，本品可加快皮肤的微循环速度：2小时潜伏期过后，血流在2小时之内增加25%，在24小时之内增加50%。

【不良反应】本品耐受良好。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
三乙醇胺乳膏	化学药	HZ003170
消白软膏	民族药	MZ000661
冰黄软膏	中成药	ZC000358
丹芎跌打膏	中成药	ZC000755
肤螨灵软膏	中成药	ZC001149
参皇软膏	中成药	ZC004765
新肤螨软膏	中成药	ZC006474
治伤软膏	中成药	ZC007431

HY001737　三唑巴坦钠

【其他名称】三唑克坦、他巴克坦、他唑巴克坦、泰唑巴坦、他佐巴坦、他唑巴坦钠（Tazobactam）、Zosyn

【外文名称】Tazobactam Sodium

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第37册

药物理化信息

【化学名】[2*S*－（2α，2β，5α）]－3－甲基－7－氧代－3－（1*H*－1,2,3－三唑－1－甲基）－4－硫杂－1－氮杂双环（3,2,0）－庚烷－2－羧酸－4,4－二氧化物一水合物

【分子式】$C_{10}H_{12}N_4O_5S$

【分子量】300.30

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末；无臭，味苦，易引湿。

本品在二甲基甲酰胺中极易溶解，在甲醇中易溶，在丙酮、乙醇中略溶，在水中微溶。

比旋度：取本品，精密称定，加甲醇－水（1∶1）溶解并定量稀释制成每1ml中含10mg的溶液，依法测定，比旋度为＋127°至＋139°。

药物药理信息

【药理毒理】本品为不可逆竞争性β－内酰胺酶抑制剂，对金葡菌产生的青霉素酶和革兰阴性杆菌产生的β－内酰胺酶均具较强抑制作用，抑酶作用优于克拉维酸和舒巴坦。

【药代动力学】本品静注给药后在胃肠道、胆囊、胆汁、前列腺液及皮肤组织中均有较高浓度。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用哌拉西林钠他唑巴坦钠	化学药	HZ004918
注射用头孢哌酮他唑巴坦钠	化学药	HZ004985

HY001738　三唑仑

【其他名称】Halcion、海乐神、海乐欣、酣乐欣、三唑安定、三唑苯二氮䓬、Trizolin

【外文名称】Triazolam

药物管理信息

【特殊管理分类】一类精神药

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】1－甲基－8－氯－6－（2－氯苯基）－4*H*－［1，2，4］三氮唑［4，3－α］［1，4］苯并二氮杂䓬

【分子式】$C_{17}H_{12}Cl_2N_4$

【分子量】343.21

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末；无臭。本品在冰醋酸或三氯甲烷中易溶，在甲醇中略溶，在乙醇或丙酮中微溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为239～243℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗焦虑药。

本品为苯二氮䓬类安定药。该药具有抗惊厥、抗癫痫、抗焦虑、镇静催眠、中枢性骨骼肌松弛和暂时性记忆缺失（或称遗忘）作用。本类药物作用于中枢神经系统的苯二氮䓬受体（BZR），加强中枢抑制性神经递质γ－氨基丁酸（GABA）与GABA受体的结合，增强GABA系统的活性。BZR分为Ⅰ型和Ⅱ型，据认为Ⅰ型受体兴奋可以解释BZ类药物的抗焦虑作用，而Ⅱ型受体与该类药物的镇静和骨骼肌松弛等作用有关。随着用量的加大，临床表现可自轻度的镇静到催眠甚至昏迷。三唑仑可引起依赖性，表现为身体依赖和心理依赖，停药后出现撤药症状。

【药代动力学】口服吸收快而完全。口服15～30分钟生效，2小时血药浓度达峰值。血浆蛋白结合率约为90%，$t_{1/2}$为1.5～5.5小时。大部分经肝脏代谢，代谢产物经肾排泄，仅少量以原形排出。多次服用很少体内蓄积。可通过胎盘，分泌入乳汁。

【药物相互作用】

1．与中枢抑制药合用可增加呼吸抑制作用。

2．与易成瘾和其他可能成瘾药合用时，成瘾的危险性增加。

3．与酒及全麻药、可乐定、镇痛药、吩噻嗪类、单胺氧化酶A型抑制药和三环类抗抑郁药合用时，可彼此增效，应调整用量。阿片类镇痛药的用量至少应减至1/3，而后按需逐渐增加。

4．与抗高血压药和利尿降压药合用，可使降压

作用增强。

5. 与西咪替丁、红霉素合用，可抑制本品在肝脏的代谢，引起血药浓度升高，必要时减少药量。

6. 与扑米酮合用由于减慢后者代谢，需调整扑米酮的用量。

7. 与左旋多巴合用时，可降低后者的疗效。

8. 与利福平合用，增加本品的消除，血药浓度降低。

9. 异烟肼抑制本品的消除，致血药浓度增高。

10. 与地高辛合用，可增加地高辛血药浓度而致中毒。

【药物过量】过量可出现持续的精神错乱、严重嗜睡、抖动、语言不清、蹒跚、心跳异常减慢、呼吸短促或困难、严重乏力。超量或中毒宜及早对症处理，包括催吐或洗胃以及呼吸循环方面的支持疗法，苯二氮䓬受体拮抗剂氟马西尼可用于该类药物过量中毒的解救和诊断。中毒出现兴奋异常时，不能用巴比妥类药。

【不良反应】较多见：头晕、头痛、倦睡。较少见：恶心、呕吐、头昏眼花、语言模糊、动作失调。少数可发生昏倒、幻觉。本药所致的记忆缺失较其他苯二氮䓬类药物更易发生。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
三唑仑片	化学药	HZ003171

HY001739 色氨酸

【其他名称】L－色氨酸、L－Tryptophan

【外文名称】Tryptophan

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】L－2－氨基－3（β－吲哚）丙酸

【分子式】$C_{11}H_{12}N_2O_2$

【分子量】204.23

【性状及组成】本品为白色或微黄色结晶或结晶性粉末；无臭，味微苦。

本品在水中微溶，在乙醇中极微溶解，在三氯甲烷中不溶，在甲酸中易溶，在氢氧化钠试液或稀盐酸中溶解。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并稀释成每 1ml 中约含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为 －30.0°至 －32.5°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：氨基酸类药。

是重要的营养剂。医药上用作癜皮病的防治剂。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
11 氨基酸注射液－833	化学药	HZ000212
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
低分子右旋糖酐氨基酸注射液	化学药	HZ000673
复方氨基酸胶囊（8－11）	化学药	HZ001047
复方氨基酸颗粒（14AA）	化学药	HZ001049
复方氨基酸口服溶液（14AA）	化学药	HZ001050
复方氨基酸（15）双肽（2）注射液	化学药	HZ001051
复方氨基酸注射液（9AA）	化学药	HZ001054
复方氨基酸注射液（14AA）	化学药	HZ001055
复方氨基酸注射液（15AA）	化学药	HZ001056
复方氨基酸注射液（15－HBC）	化学药	HZ001057
复方氨基酸注射液（17AA）	化学药	HZ001058
复方氨基酸注射液（17AA－Ⅰ）	化学药	HZ001059
复方氨基酸注射液（17AA－H）	化学药	HZ001060
复方氨基酸注射液（17 种氨基酸）	化学药	HZ001061
复方氨基酸注射液（18）	化学药	HZ001062
复方氨基酸注射液（18AA）	化学药	HZ001063
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅰ）	化学药	HZ001064
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅱ）	化学药	HZ001065
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅲ）	化学药	HZ001066
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅳ）	化学药	HZ001067
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅴ）	化学药	HZ001068
复方氨基酸注射液（18AA－N）	化学药	HZ001069
复方氨基酸注射液（18－B）	化学药	HZ001070
复方氨基酸注射液（20AA）	化学药	HZ001071
核酪口服溶液	化学药	HZ001690
核酪注射液	化学药	HZ001691
小儿复方氨基酸注射液（18AA－Ⅰ）	化学药	HZ003749
小儿复方氨基酸注射液（18AA－Ⅱ）	化学药	HZ003750
小儿复方氨基酸注射液（19AA－Ⅰ）	化学药	HZ003751
脂肪乳氨基酸葡萄糖注射液	化学药	HZ004653

HY001740　色甘酸钠

【其他名称】 Aarane、Acid cromoglicigue、Acidum cromog licicum、Alercrom、Cromo - Asma Aerosol、Cromolyn、咳乐钠、色甘酸二钠、咽泰

【外文名称】 Sodium Cromoglicate

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 5，5′ - 〔（2 - 羟基 - 1，3 - 亚丙基）二氧〕双（4 - 氧代 - 4*H* - 1 - 苯并吡喃 - 2 - 羧酸）二钠盐

【分子式】 $C_{23}H_{14}Na_2O_{11}$

【分子量】 512.34

【性状及组成】 本品为白色结晶性粉末；无臭，初无味，后微苦；有引湿性；遇光易变色。本品在水中溶解，在乙醇或三氯甲烷中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：抗过敏药。

本品无松弛支气管平滑肌作用和 β - 受体激动作用，亦无抗组胺、白三烯等过敏介质作用和抗炎症作用。但在抗原攻击前给药，可预防速发型和迟发型过敏性哮喘，亦可预防运动和其他刺激诱发的哮喘。其平喘作用机制尚未全阐明。曾认为本品可抑制人或动物肺组织肥大细胞中磷酸二酯酶活性，致使肥大细胞中 cAMP 水平增高，减少 Ca^{2+} 向细胞内转运，从而稳定肥大细胞膜，抑制肥大细胞裂解、脱颗粒，阻止过敏介质释放，预防哮喘发作。近来发现本品抑制肥大细胞磷酸二酯酶的作用与其抑制肥大细胞释放过敏介质之间缺乏平行关系，前一作用所需剂量较后一作用所需剂量高 800 倍。还发现至少有 20 种肥大细胞膜稳定剂对动物模型有效，而对哮喘患者无平喘作用。

目前认为本品的平喘作用尚有以下几种可能：①直接抑制由于兴奋刺激感受器而引起的神经反射，抑制反射性支气管痉挛。②抑制非特异性支气管高反应性。③抑制血小板活化因子（PAF）引起的支气管痉挛。

【药代动力学】 本品极性高，口服吸收极少（0.5% 左右）。因此治疗哮喘用吸入法给药，干粉（直径约 5μm）喷雾吸入时，有 10% 可进入肺部深处并吸收入其液，生物利用度约 10%。吸入剂量的 80% 以上沉着于口腔和咽部，并被吞咽入胃肠道，吸入后 10 ~ 20 分钟即达峰血浆浓度（正常人为 14 ~ 91ng/ml，哮喘患者为 1 ~ 36ng/ml）。血浆蛋白结合率为 60% ~ 75%。迅速分布到组织中，特别是肝和肾。分布容积为 0.13L/kg。血浆 $t_{1/2}$ 为 1 ~ 1.5 小时。经胆汁和尿排泄，体内无蓄积。

【不良反应】

1. 少数患者因吸入的干粉刺激，出现口干、咽喉干痒、呛咳、胸部紧迫感，甚至诱发哮喘，同时吸入异丙肾上腺素可避免其发生。

2. 原来用肾上腺皮质激素或其他平喘药治疗者，用本品后应继续用原药至少 1 周或症状明显改善后，才能逐渐减量或停用原用药物。

3. 获明显疗效后，可减少给药次数。如需停药，亦应逐步减量后再停。不能突然停药，以防哮喘复发。

4. 如在开始时因刺激而出现哮喘加重，可加少量异丙肾上腺素同时吸入。

5. 吸入治疗时，由于含有抛射剂氟里昂，对冠心病和心律失常者慎用。试用 1 个月无效者应停止治疗。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方麻黄碱色甘酸钠贴膜	化学药	HZ001313
色甘酸钠滴鼻液	化学药	HZ003172
色甘酸钠滴眼液	化学药	HZ003173
色甘酸钠气雾剂	化学药	HZ003174
吸入用色甘酸钠	化学药	HZ003642

HY001741　色羟丙钠

【其他名称】 司敏

【外文名称】 Sodium Hydroxypropylcromate

药物药理信息

【药理毒理】 本品为色甘酸钠异构体，通过抑制细胞内磷酸二酯酶，致使细胞内环磷腺苷的浓度增加，阻止钙离子转运入肥大细胞内，从而稳定肥大细胞的细胞膜，抑制和阻止组胺、5 - 羟色胺、慢性反应介质等的释放，而产生药理作用。

【药代动力学】 滴鼻后，约 7% 吸收入血，由胃肠道吸收的不足 2%，色羟丙钠在体内不被代谢，吸收量中，约 50% 由尿排出，其余半数进入胆汁。血浆半衰期 1 ~ 1.5 小时。

【药物相互作用】 如正在使用其他药品，使用本品前请咨询医师或药师。

【药物过量】 药物过量可出现以下症状：①局部反应性症状（鼻刺痛、烧灼感、激惹、喷嚏等）。②神经症状（头痛、味觉不良等）。③急性肝、肾功能不全。④皮疹及过敏反应。

【不良反应】约 2% ~ 10% 的病例发生鼻刺痛、烧灼感、激惹、喷嚏等局部反应。头痛及味觉不良约见于 2% 的患者，鼻出血发生率不足 1%。皮疹及过敏反应则极罕见。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
色羟丙钠滴鼻液	化学药	HZ003175
色羟丙钠滴眼液	化学药	HZ003176

HY001742 沙丁胺醇

【外文名称】Salbutamol

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】1 - （4 - 羟基 - 3 - 羟甲基苯基） - 2 - （叔丁氨基）乙醇

【分子式】$C_{13}H_{21}NO_3$

【分子量】239.31

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；无臭，几乎无味。本品在乙醇中溶解，在水中略溶，在乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为 154 ~ 158℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：β_2 肾上腺素受体激动药。

本品为选择性 β_2 受体激动剂，能选择性激动支气管平滑肌的 β_2 受体，有较强的支气管扩张作用。气雾吸入时对心脏的兴奋作用比异丙肾上腺素小。

【药代动力学】吸入本品 200μg，血药浓度峰值为 2.95 和 3.57mmol/L，吸入 400μg 则为 1.41 和 5.69mmol/L。峰浓度出现于吸入后的 3 ~ 4 小时，平均半衰期为 4.6 小时，48 小时从尿排出 77.5% ~ 96.8%，代谢物和原形物各半。

【药物相互作用】

1. 同时应用其他肾上腺素受体激动剂者，其作用可增加，不良反应也可能加重。

2. 并用茶碱类药时，可增加松弛支气管平滑肌的作用，也可能增加不良反应。

【药物过量】过量中毒的早期表现：胸痛，头晕，持续、严重的头痛，严重高血压，持续恶心、呕吐，持续心悸，情绪烦躁不安等。反复过量使用偶可引起支气管痉挛，如有发生，应立即停用并在医师指导下调整治疗方案。

【不良反应】少数病例可见肌肉震颤，外周血管舒张及代偿性心率加速，头痛，不安，过敏反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
茶碱沙丁胺醇缓释片	化学药	HZ000507
沙丁胺醇口腔崩解片	化学药	HZ003178
沙丁胺醇气雾剂	化学药	HZ003179

HY001743 沙棘油

【外文名称】Hippophae

【性状及组成】本品为沙棘的种子中提取出的植物油。

药物药理信息

【药理毒理】沙棘油有抑制胃收缩功能，抑制胃液分泌及蛋白酶活性。对醋酸法和慢性利血平法所致的溃疡有良好的促进愈合作用。沙棘籽油对病毒性肝炎的治疗作用比较明显。在心血管系统方面，沙棘籽油能延迟突发性血栓形成，不仅具有一定的抗凝作用，而且有促纤溶作用。临床上发现沙棘籽油在一定程度上起到了防治高血脂、动脉粥样硬化症、缓解冠心病、心绞痛的作用。

沙棘籽油对金黄色葡萄球菌，厌氧菌和幽门螺杆菌均有明显的抑制作用，具有促进组织上皮再生、止血、镇痛的功效。

沙棘籽油还被观察到具有降低抗癌药物对骨髓造血的毒性，减轻化疗所致的消化道不良反应，预防化疗后所引起的消化道黏膜溃疡。

沙棘籽油还在抗脂质过氧化，抗辐射，提高造血功能和防治耳聋、风湿性关节炎、慢性支气管炎、便秘、沙眼、心肌损伤、结膜炎、银屑病等临床研究中体现出乐观的效果。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方沙棘籽油栓	化学药	HZ001371
双磺沙棘桉青软膏	化学药	HZ003230
沙棘籽油胶丸	中成药	ZC004557
参棘软膏	中成药	ZC004767

HY001744 沙拉新

【其他名称】肌丙抗增压素

【外文名称】Saralasin

药物药理信息

【药理毒理】主要用于治疗伴有高肾素型恶性高

血压及高血压危象，可用于诊断高血压病肾素水平高低的分型。

【药物过量】过量可引起低血压。

HY001745　沙利度胺

【其他名称】反应停、太胺哌啶酮、太谷酰亚胺、酞咪哌啶酮、太咪哌啶酮

【外文名称】Thalidomide

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第11册

药物理化信息

【化学名】*N*－（2,6－二氧代－3－哌啶基）－邻苯二甲酰亚胺

【分子式】$C_{13}H_{10}N_2O_4$

【分子量】258.24

【性状及组成】本品为白色至类白色结晶性粉末；无臭无味。

本品在二甲基甲酰胺或吡啶中溶解，在水、甲醇或乙醇中极微溶解，在乙醚、三氯甲烷或苯中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】皮肤病治疗药。

本品为谷氨酸衍生物，对麻风病无治疗作用，与抗麻风病药同用以减少麻风反应，治疗各型麻风反应，如淋巴结肿大、结节性红斑、发热、关节痛及神经痛等疗效较好。

本品作用机制推测有免疫抑制、免疫调节作用，通过稳定溶酶体膜，抑制中性粒细胞趋化性，产生抗炎作用。尚有抗前列腺素、组胺及5－羟色胺作用等。

【药物相互作用】能增强其他中枢抑制剂，尤其是巴比妥类药的作用。

【不良反应】口鼻黏膜干燥，头昏，倦怠，嗜睡，恶心，腹痛，便秘，面部水肿，面部红斑、过敏反应及多发性神经炎等。

本品可致胎儿畸形。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
沙利度胺片	化学药	HZ0003180

HY001746　鲨肝醇

【外文名称】Batilol

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第1册

药物理化信息

【化学名】3－（十八烷氧基）－1,2－丙二醇

【分子式】$C_{21}H_{44}O_3$

【分子量】344.58

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；有微臭。

本品在三氯甲烷中溶解，在乙醚或丙酯中微溶，在苯中极微溶解，在石油醚或水中不溶。

熔点：本品的熔点应为68～72℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品即α－正十八碳甘油醚，为动物体内固有物质，在骨髓造血组织中含量较多，可能是体内造血因子之一。有促进白细胞增生及抗放射线的作用，还可对抗由于苯中毒和细胞毒类药物引起的造血系统抑制。

【药物过量】剂量过大可引起腹泻（具体剂量范围不明确）。

【不良反应】治疗剂量偶见口干、肠鸣亢进。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
鲨肝醇片	化学药	HZ0003183

HY001747　山梨醇

【其他名称】D－Glucitol、Diakarmon、Nivitin、Sorbol

【外文名称】Sorbitol

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】D－山梨糖醇

【分子式】$C_6H_{14}O_6$

【分子量】182.17

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；无臭，味甜；有引湿性。本品在水中易溶，在乙醇中微溶，在三氯甲烷或乙醚中不溶。

比旋度：取本品5g，精密称定，置50ml量瓶中，加硼砂6.4g与水适量，振摇使完全溶解，并稀释至刻度（如溶液不澄明，应滤过），依法测定，比旋度为＋4.0°至＋7.0°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：脱水药。

山梨醇单糖为甘露醇的异构体，作用与甘露醇相似但较弱，静脉注入本品浓溶液（25%）后，除小部分转化为糖外，大部以原形经肾排出，因形成

血液高渗，可使周围组织及脑实质脱水而随药物从尿液排出，从而降低颅内压，消除水肿。注射后 2 小时出现高效，明显地使脑水肿逐渐平复，紧张状态消失，脑脊液压下降，在体内不被代谢，经肾小球滤过后在肾小管内甚少被重吸收，起到渗透利尿作用。

1．组织脱水作用。提高血浆胶体渗透压，导致组织内（包括眼、脑、脑脊液等）水分进入血管内，从而减轻组织水肿，降低眼内压、颅内压和脑脊液容量及其压力。

2．利尿作用。利尿作用机制分两个方面。①增加血容量，并促进前列腺素 I2 分泌，从而扩张肾血管，增加肾血流量包括肾髓质血流量。肾小球入球小动脉扩张，肾小球毛细血管压升高，皮质肾小球滤过率升高。②本药自肾小球滤过后极少（＜10%）由肾小管重吸收，故可提高肾小管内液渗透浓度，减少肾小管对水及 Na^+、Cl^-、K^+、Ca^{2+}、Mg^{2+} 和其他溶质的重吸收。过去认为本药主要作用于近端小管，但经穿刺动物实验发现，应用大剂量山梨醇后，通过近端小管的水和 Na^+ 仅分别增多 10%～20%和 4%～5%；而到达远端小管的水和 Na^+ 则分别增加 40%和 25%。提示亨氏袢重吸收水和 Na^+ 减少在山梨醇利尿作用中占重要地位。此可能是由于肾髓质血流量增加，髓质内尿素和 Na^+ 流失增多，从而破坏了髓质渗透压梯度差。

由于输注山梨醇后肾小管液流量增加，当某些药物和毒物中毒时，这些物质在肾小管内浓度下降，对肾脏毒性减小，而且经肾脏排泄加快。

【药代动力学】静脉注射后迅速进入细胞外液而不进入细胞内。利尿作用于静注后 0.5～1 小时出现，维持 3 小时。降低眼内压和颅内压作用于静注后 15 分钟内出现，达峰时间为 30～60 分钟，维持 3～8 小时。本药可由肝脏生成糖原。但由于静脉注射后迅速经肾脏排泄，故一般情况下经肝脏代谢的量很少。本药 $t_{1/2}$为 100 分钟，当存在急性肾功能衰竭时可延长至 6 小时。肾功能正常时，静脉注射山梨醇 100g，3 小时内 80%经肾脏排出。

【药物相互作用】

1．可增加洋地黄毒性作用，与低钾血症有关。

2．增加利尿药及碳酸酐酶抑制剂的利尿和降眼内压作用，与这些药物合并时应调整剂量。

【药物过量】给大剂量山梨醇不出现利尿反应，但可使血浆渗透浓度高，警惕血高渗发生。

【不良反应】

1．水和电解质紊乱。最为常见。

（1）快速大量静注山梨醇可引起体内山梨醇积聚，血容量迅速大量增多，导致心力衰竭（尤其有心功能损害时），稀释性低钠血症，偶可致高血症。

（2）不适当的过度利尿导致血容量减少，加重少尿。

2．寒战、发热。

3．排尿困难。

4．血栓性静脉炎。

5．山梨醇外渗可致组织水肿、皮肤坏死。

6．过敏引起皮疹、荨麻疹、呼吸困难、过敏性休克。

7．头晕、视力模糊。

8．高渗引起口渴。

9．渗透性肾病，主要见于大剂量快速静脉滴注时。其机制尚未完全阐明，可能与山梨醇引起肾小管液渗透压上升过高，导致肾小管上皮细胞损伤。病理表现为肾小管上皮细胞肿胀，空泡形成，临床上出现尿量减少，甚至急性肾功能衰竭。渗透性肾病常见于老年肾血流量减少及低钠、脱水患者。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
多种微量元素注射液（Ⅰ）	化学药	HZ0000815
复方氨基酸注射液（17AA）	化学药	HZ0001058
复方氨基酸注射液（17AA－Ⅰ）	化学药	HZ0001059
复方氨基酸注射液（18）	化学药	HZ0001062
复方氨基酸注射液（18AA）	化学药	HZ0001063
复方乳酸钠山梨醇注射液	化学药	HZ0001362
开塞露	化学药	HZ0002077
山梨醇滴眼液	化学药	HZ0003184
山梨醇注射液	化学药	HZ0003186
博性康药膜	民族药	MZ0000059
貂胰防裂软膏	民族药	MZ0000093
日晒防治膏	民族药	MZ0000451
消痔洁肤软膏	民族药	MZ0000669
关节镇痛巴布膏	中成药	ZC0001916

HY001748 山梨醇铁

【外文名称】Iron Sorbitex

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：山梨醇铁属于抗贫血药，1ml 含铁量 50mg。铁为人体必须元素，是构成血红蛋白、肌红蛋白、铁蛋白、细胞色素和某些组织酶的组分之一。急性失血、慢性失血、铁需要相对增加、以

及胃肠道铁吸收障碍时，都可因铁的消耗与摄取不平衡而发生缺铁性贫血。对缺铁患者补充铁剂后，除血红蛋白合成加速外，与组织缺铁和含铁酶活性降低症状有关如：生长迟缓、行为异常、体力不足、黏膜组织变化及皮肤、指甲病变也都能逐渐得以纠正。

2. 毒理作用：尚无有关动物实验资料。

【药代动力学】山梨醇铁是三价铁，仅供肌内注射，注射后吸收迅速，2小时后血药浓度达到最高峰，24小时内从尿中排出给药量的20%～30%。不可静脉注射。如注射量超过血液的铁结合力，血浆中游离铁对机体有毒性作用，因此该药不能与口服铁盐同时应用。

【药物相互作用】如注射量过大，因吸收量超过血液的铁结合力，血浆中游离铁对机体有毒性作用，因此该药不能与口服铁盐同时应用。

【不良反应】注射后有金属味，注射局部疼痛及药物外渗；少数患者可有发热、心动过速及关节痛等过敏反应；有报道，个别病人因肌内注射本品出现过敏性休克和（或）心脏毒性而死亡。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
山梨醇铁注射液	化学药	HZ003185

HY001749　山梨酸

【外文名称】Sorbic Acid

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】（*E*，*E*）－2,4－已二烯酸

【分子式】$C_6H_8O_2$

【分子量】112.13

【性状及组成】本品为白色或微黄白色结晶性粉末；有特臭。

本品在乙醇中易溶，在乙醚中溶解，在水中极微溶解。

熔点：本品的熔点为132～136℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料，防腐药。

山梨酸（钾）能有效地抑制霉菌，酵母菌和好氧性细菌的活性，还能防止肉毒杆菌、葡萄球菌、沙门菌等有害微生物的生长和繁殖，但对厌氧性芽孢菌与嗜酸乳杆菌等有益微生物几乎无效，其抑制发育的作用比杀菌作用更强。

本品主要用于药品和化妆品作抑菌防腐剂，用量为0.05%～0.2%。由于本品稳定性较差，常与其他抑菌防腐剂或乙二醇类联合使用，相互能产生协同作用。

【药物相互作用】当非离子型表面活性剂存在或在塑料容器中，本品抑菌活性有所降低。丙烯和乙二醇能增加其活性。本品易被氧化剂氧化，重金属能起催化作用加速其氧化。

【不良反应】本品连续用于皮肤之后有过敏反应和刺激作用发生。一日允许摄入量0～25mg/kg（FAO/WHO 1985），LD_{50} > 36g/kg（大鼠，经口）在体内极易被氧化分解而排出体外。一般公认是安全的。但本品粉尘对眼和呼吸道黏膜有刺激性，使用时，要适当采取保护措施。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
鼻宁喷雾剂	民族药	MZ000051
当归补血口服液	中成药	ZC000786
阿胶口服液	中成药	ZC000964
复方高山红景天口服液	中成药	ZC001369
复方熊胆通鼻喷雾剂	中成药	ZC001577
骨松康合剂	中成药	ZC001868
海龙胶口服液	中成药	ZC002049
健儿消食合剂	中成药	ZC002462
景志安神口服液	中成药	ZC002851
麻杏止咳糖浆	中成药	ZC003470
玫果口服液	中成药	ZC003530
驱毒养颜口服液	中成药	ZC004232
参苓口服液	中成药	ZC004791
参枣健脑口服液	中成药	ZC004924
十全大补口服液	中成药	ZC005076
乌梅人丹	中成药	ZC005807
消咳平喘口服液	中成药	ZC006068
银丹心脑通软胶囊	中成药	ZC006962
植麦健脾颗粒	中成药	ZC007203
振源口服液	中成药	ZC007255
枳陈消食口服液	中成药	ZC007399

HY001750　山梨酸钾

【外文名称】Potassium Sorbate

药物理化信息

【化学名】2，4－已二烯酸钾

【分子式】$C_6H_7O_2K$

【分子量】150.22

【性状及组成】山梨酸钾是具有轻微异臭的白色结晶性粉末。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗菌防腐剂。

山梨酸钾是一种抗菌防腐剂、在药剂、食品、肠溶制剂和化妆品中应用具有抗细菌和抗真菌的性质。通常在口服和局部用药，特别是含有非表面活性剂的制剂中，使用浓度是0.1%～0.2%。

山梨酸钾由于在水中有较大的溶解度和较好的稳定性，在制剂中的用量差不多是山梨酸的2倍。与山梨酸一样，在pH6以上时，山梨酸钾的抗菌性最低。

【药物相互作用】当非离子型表面活性剂存在或在塑料容器中，本品抑菌活性有所降低。丙烯和乙二醇能增加其活性。本品易被氧化剂氧化，重金属能起催化作用加速其氧化。

【不良反应】山梨酸钾作为抗菌防腐剂用于口服和局部用制剂中，一般认为它是相对无毒的材料。但是，也有一些关于山梨酸钾不良反应的报道，包括皮肤刺激性、过敏性或超敏性反应。口服山梨酸钾未见系统不良反应的报道。

WHO估算山梨酸、山梨酸钙、山梨酸钾和山梨酸钠的一日摄入量（以山梨酸为标准）为每千克体重25mg。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
白沙糖浆	民族药	MZ000043
博落回肿痒酊	民族药	MZ000058
丹莪妇康煎膏	民族药	MZ000083
复方 -枝黄花喷雾剂	民族药	MZ000176
金刺参九正合剂	民族药	MZ000253
乳癖安消口服液	民族药	MZ000458
润伊容口服液	民族药	MZ000461
山楂内金口服液	民族药	MZ000489
归芎花粉口服液	中成药	ZC001983
猴菇饮	中成药	ZC002161
咳喘安口服液	中成药	ZC003024
杞茸助阳口服液	中成药	ZC003893
杞天口服液	中成药	ZC003898
清热疏肝口服液	中成药	ZC004160
参锁巴戟口服液	中成药	ZC004915
四磨汤口服液	中成药	ZC005326
四物膏	中成药	ZC005339
蚊陈固涩口服液	中成药	ZC006804

HY001751 蛇毒血凝酶

【其他名称】Batroxobin、巴曲酶、蝮蛇血凝酶、Haemocoagulase、Reptilase

【外文名称】Hemocoagulase

【性状及组成】血凝酶据第16版《新编药物学》和《马丁代尔大药典》中记载，是指从巴西矛头蝮蛇蛇毒内分离提取的巴曲酶制剂，含微量的磷脂依赖性凝血因子X激活物（FXA）。

国产蛇毒血凝酶也有从蝰蛇蛇毒中进提取的血凝酶。

药物药理信息

【药理毒理】注射1单位的蛇毒血凝酶后20分钟，健康正常成年人的出血时间测定会缩短至1/2或1/3。这种止血能保存2～3天。蛇毒血凝酶仅具有止血功能，并不影响血液的凝血酶原数目，因此，使用本品无血栓形成危险。

【药代动力学】肌内、皮下及腹腔注射后20～30分钟起效，作用持续24～48小时；静注后5～10分钟药物作用达峰，持续24小时，用药出血时间缩短40%～70%、半衰期为3～10小时。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
蛇毒血凝酶注射液	化学药	HZ003190
注射用蛇毒血凝酶	化学药	HZ004954

HY001752 舍雷肽酶

【其他名称】中性蛋白酶

【外文名称】Serrapeptase

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第16册

【性状及组成】由沙雷菌属产生的蛋白分解酶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为沙雷菌属细菌所产生的蛋白分解酶口服制剂，能够抑制烫伤大鼠的纤溶活性亢

进及血管通透性亢进；抑制某些致炎物质所致大鼠的炎性肿胀；降低支气管炎家兔痰液的黏稠度；提示本品具有消肿和祛痰作用。

【药物相互作用】

1. 因本品可强效溶解纤维蛋白和纤维蛋白原，从而增强抗凝药的作用，所以与抗凝药联合使用时应慎重，已使用者应注意密切观察。

2. 本品与抗生素类药、化疗药、非甾体类抗炎药并用可引起下列反应：①皮肤黏膜眼综合征及中毒性表皮坏死症。②间质性肺炎、嗜酸细胞肺浸润、综合征。③休克。

【不良反应】本品偶见以下不良反应。

1. 过敏反应：如皮疹、瘙痒、皮肤潮红等。

2. 消化道反应：如食欲减退、胃部不适、恶心、呕吐、腹泻等。

3. 其他：如鼻出血、痰中带血等出血症状，以及出现黄疸、谷氨酸草酰乙酸转氨酶（AST）、谷氨酸丙酮酸转氨酶（ALT）、碱性磷酸酶（ALP）、γ－谷氨酸丙酮酸转氨酶（γ－GTP）等上升。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
舍雷肽酶片	化学药	HZ003191

HY001753　舍吲哚

【其他名称】塞丁道尔、SERDOLECT

【外文名称】Sertindole

药物药理信息

【药理毒理】本品为苯吲哚衍生物，对5－HT2A、5－HT2C受体、多巴胺D_2受体、α_1－肾上腺素能受体均有较强的亲和力。控制精神分裂症阳性症状与氟哌啶醇相似，同时有较强的改善阴性症状的作用。适用于治疗精神分裂症的阳性及阴性症状。极少见锥体外系反应。

【药代动力学】本品口服后达峰时间长，约10小时，多次给药消除半衰期为1～4天，老年人及肾功能损害的患者对本药的药动学无影响。

【不良反应】可见QTc间期延长，体重增加。

HY001754　麝香草酚

【其他名称】百里酚、THYMOLUM

【外文名称】Thymol

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第1册

药物理化信息

【化学名】5－甲基－2－异丙基苯酚

【分子式】$C_{10}H_{14}O$

【分子量】150.22

【性状及组成】本品为无色结晶或白色结晶性粉末；有麝香草的特臭，味辛辣。

本品在乙醇、三氯甲烷或乙醚中极易溶解，在冰醋酸中易溶，在液体石蜡中溶解，在水中极微溶解。

凝点：本品的凝点不低于49℃。

药物药理信息

【药理毒理】消毒防腐药。主用于霉菌感染。

【不良反应】本品对黏膜有刺激作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
薄荷麝香草酚搽剂	化学药	HZ000456
充填用复方麝香草酚散甲酚甲醛溶液复合制剂	化学药	HZ000529
氟烷	化学药	HZ001007
复方薄荷柳酯搽剂	化学药	HZ001099
复方薄樟桉油溶液	化学药	HZ001103
复方甘菊利多卡因凝胶	化学药	HZ001186
复方枸橼酸喷托维林颗粒	化学药	HZ001243
复方硼砂漱口片	化学药	HZ001335
复方麝香草酚撒粉	化学药	HZ001374
复方水杨酸甲酯苯海拉明喷雾剂	化学药	HZ001389
复方硝酸咪康唑软膏	化学药	HZ001441
无极膏	化学药	HZ003600
小儿复方麝香草酚撒粉	化学药	HZ003759
百花活血跌打膏	中成药	ZC000191
桉树油	中成药	ZC000979
耳炎液	中成药	ZC001013
风痛灵	中成药	ZC001123
复方牵正膏	中成药	ZC001475
关节解痛膏	中成药	ZC001913
黑鬼豆油	中成药	ZC002112
活血镇痛膏	中成药	ZC002351
岭南黑鬼油	中成药	ZC003275
清凉止痒搽剂	中成药	ZC004115
麝香拔湿膏	中成药	ZC004689
麝香祛风湿膏	中成药	ZC004707

续表

制剂名称	类别	序号
狮马龙活络油	中成药	ZC005047
消炎镇痛膏	中成药	ZC006128
小儿清凉止痒酊	中成药	ZC006297
止痒消炎水	中成药	ZC007396
紫松皮炎膏	中成药	ZC007614

HY001755 麝香酮

【外文名称】Muscone

药物理化信息

【化学名】3－甲基十五烷酮。

【性状及组成】本品为麝香的主要成分，现可人工合成。

微黄色油状液体，有特殊香味。沸点328℃。极微溶于水，能与乙醇混溶。

药物药理信息

【药理毒理】具有芳香开窍、通经活络、消肿止痛作用，小剂量对中枢神经有兴奋作用，大剂量则有抑制作用。对离体蛙心脏有兴奋作用，并有雄性激素样作用及抗炎作用。临床上用于冠心病心绞痛、血管性头痛、坐骨神经痛、白癜风等。

具有扩张冠状动脉及增加冠脉血流量的作用，对心绞痛有一定疗效。一般于用药（舌下含服、气雾吸入）后5分钟内见效，缓解心绞痛的功效与硝酸甘油略相近似。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乳香风湿气雾剂	中成药	ZC004398
麝香祛风湿油	中成药	ZC004708
天和追风膏	中成药	ZC005432

HY001756 肾上腺色腙

【其他名称】安络血、CARBAZOCHROMUM、卡巴克络

【外文名称】Carbazochrome

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第1册

药物理化信息

【化学名】3－羟基－1－甲基二氢吲哚－5，6－二酮缩氨脲

【分子式】$C_{10}H_{12}N_4O_3$

【分子量】236.23

【性状及组成】本品为橘红色结晶或结晶性粉末；无臭，无味。

本品在水或乙醇中极微溶解，在乙醚或三氯甲烷中不溶。

熔点：本品的熔点应不低于220℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】本品为肾上腺素的氧化衍生物，无拟肾上腺素作用，因此不影响血压和心率，但能增强毛细血管对损伤的抵抗力，稳定血管及其周围组织中的酸性粘多糖，降低毛细血管的通透性，增强受损毛细血管端的回缩作用，使血块不易从管壁脱落，从而缩短止血时间，但不影响凝血过程。

【药物相互作用】抗组胺药、抗胆碱药的扩血管作用可影响本品的止血效果，如合并用药应加大本品剂量。忌与四环素类药物在同一溶液内给药。

【药物过量】大量使用者可引起精神紊乱，并易引起水杨酸样反应。

【不良反应】本品毒性低，可产生水杨酸样反应，如恶心、呕吐、头晕、耳鸣、视力减退等。对癫痫病人可引起异常脑电活动。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肾上腺色腙片	化学药	HZ003196
肾上腺色腙注射液	化学药	HZ003197

HY001757 肾上腺素

【其他名称】Epirenamine、副肾素、Levorenin、Suprarenine

【外文名称】Adrenaline

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】（*R*）－4－［2－（甲氨基）－1－羟基乙基］－1,2－苯二酚

【分子式】$C_9H_{13}NO_3$

【分子量】183.21

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末；无臭，味苦；与空气或日光接触，易氧化变质；在中性碱性水溶液中不稳定；饱和水溶液显弱碱性反应。本品在水中极微溶解，在乙醇、三氯甲烷、乙醚、脂肪油或挥发油中不溶；在矿酸或氢氧化钠溶液中易溶，在氨溶液或碳酸钠溶液中不溶。

熔点：本品的熔点为 206 ~ 212℃，熔融时同时分解。

比旋度：取本品，精密称定，加盐酸溶液（9→200）溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 20mg 的溶液，依法测定，比旋度为 - 50.0°至 - 53.5°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：肾上腺素能受体激动药。

【不良反应】常见有心悸、头痛、激动不安。如血压剧升有发生脑溢血的危险，故老年人慎用。本品使心肌兴奋性提高，如静脉注射过快或剂量过大可致心律失常，甚至心室颤动。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方次没食子酸铋栓Ⅱ	化学药	HZ001111
普鲁卡因肾上腺素注射液	化学药	HZ002919

HY001758　升华硫

【外文名称】Sublimed Sulfur

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】硫

【分子式】S

【分子量】32.06

【性状及组成】本品为黄色结晶性粉末；有微臭。

本品在水或乙醇中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】杀虫药。有杀菌（包括真菌）及杀疥虫的作用。本身并无此作用，与皮肤接触后变为硫化氢与五硫磺酸后显效。硫磺对皮肤有溶解角质作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
达克罗宁氯己定硫软膏	化学药	HZ000615
复方氯己定撒粉	化学药	HZ001304
复方麝香草酚撒粉	化学药	HZ001374
硫磺苯甲酸苄酯乳膏	化学药	HZ002319
硫软膏	化学药	HZ002327
升华硫氯化氨基汞洗剂	化学药	HZ003198
氧化锌硫软膏	化学药	HZ004423

续表

制剂名称	类别	序号
氧化锌升华硫软膏	化学药	HZ004425
喘舒片	中成药	ZC000637
消炎癣湿药膏	中成药	ZC006127

HY001759　生物素

【其他名称】辅酶 R、维生素 B_7、维生素 H

【外文名称】Biotin

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 11 册

【分子式】$C_{10}H_{16}N_2O_3S$

【性状及组成】无臭，无味，难溶于水，极难溶于乙醇，几乎不溶于醚及三氯甲烷。

熔点：本品的熔点为 228 ~ 232 ℃。

药物药理信息

【药理毒理】生物素是一种水溶性含硫维生素，天然存在的均为 *D* 异构体，*L* 型没有生物学活性。

生物素是许多需 ATP 的羧化反应中羧基的载体，羧基暂时与生物素双环系统上的一个氮原子结合，如在丙酮酸羧化酶催化丙酮酸羧化成草酰乙酸的反应中。

其生理作用主要是由生物素酶引起的固碳作用及羧基转移反应。通过丙酰辅酶 A 羧化酶，乙酰辅酶 A 羧化酶，甲基丙二酸单酰 CoA 羧基转移酶等反应参与糖和脂肪的代谢。在这些酶促反应中形成的 N - 羧基生物素作为中间产物。此外，作用机制虽不清楚，但可参与尿素合成、嘌呤合成和油酸的生物合成。

在正常情况下，人类肠细菌合成的生物素足够需要，不会发生生物素缺乏症。

缺乏生物素症状：汩丧；皮肤干燥；疲劳；皮肤稍带灰色；失眠症；肌肉苍白；食欲减退。用人做试验时，4 周时会出现中度性的皮肤炎，到 7 ~ 8 周后形成脱屑性皮肤病，尤其在四肢手脚部分，带有鳞片似地灰斑。舌状乳突萎缩、反胃、食欲减退等毛病。肌肉苍白、神经过敏症、厌倦、疲乏、贫血亦会发生。皮脂溢出性的皮肤炎、脱屑性的红皮症等与生物素缺乏有关。

【药物相互作用】卵蛋白质含有能与生物素紧密结合的抗生物素蛋白。如大量食用生鸡蛋，因妨碍生物素的吸收，可导致人类生物素缺乏症。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
肠内营养粉剂（TP）	化学药	HZ000518
多维元素片	化学药	HZ000804
多维元素片（25）	化学药	HZ000809
多维元素片（29）	化学药	HZ000810
多种维生素片	化学药	HZ000817
复方多维元素片（21）	化学药	HZ001151
复方多维元素片（23）	化学药	HZ001152
复方四维女贞子胶囊	化学药	HZ001399
复合维生素片	化学药	HZ001497
克补片	化学药	HZ002094
善存液	化学药	HZ003188
善存银片	化学药	HZ003189
五维甘草那敏胶囊	化学药	HZ003605
注射用水溶性维生素	化学药	HZ004960
注射用12种复合维生素	化学药	HZ005133
乙诺奇片	中成药	ZC006803

HY001760 生长激素释放抑制激素

【其他名称】施他宁

【外文名称】Somatostatin

药物药理信息

【药理毒理】生长抑素是人工合成的环状十四氨基酸肽，其与天然生长抑素在化学结构和作用机制上完全相同。生理性生长抑素主要存在于下丘脑下部和胃肠道。

1．可以抑制生长激素、甲状腺刺激激素、胰岛素、胰高血糖素的分泌。

2．可以抑制由试验餐和5肽胃泌素刺激的胃酸分泌，可抑制胃蛋白酶、胃泌素的释放。

3．可以显著减少内脏血流，降低门静脉压力，降低侧枝循环的血流和压力，减少肝脏血流量。

4．减少胰腺的内外分泌以及胃小肠和胆囊的分泌，降低酶活性，对胰腺细胞有保护作用。

5．抑制胰高血糖素的分泌。

6．可影响胃肠道吸收和营养功能。

【药代动力学】健康人内源性生长抑素在血浆中的浓度很低，一般在175ng/L以下。在静脉注射给药后，生长抑素显示出非常短的血浆半衰期，依据放射性免疫测定结果，其半衰期一般大约在1.1～3分钟之间；对于肝脏病人，其半衰期在1.2～4.8分钟之间；对于慢性肾衰病人，其半衰期大约在2.6分钟至4.9分钟之间。以每小时75μg的速度静脉滴注生长抑素之后，在15分钟内浓度达峰为1250ng/L，代谢清除率为每分钟1L，半衰期为2.7分钟左右。在静脉注射2μg的^{125}I甲状腺素生长抑素之后，4小时后40%经尿排出，24小时后排泄70%。生长抑素在肝脏中通过肽链内切酶和氨基肽酶裂解分子中的N－末端和环化部分，迅速在肝内代谢。通过静脉注射生长抑素可抑制生长激素、甲状腺刺激激素、胰岛素和胰高血糖素的分泌，并抑制胃酸的分泌。它还影响胃肠道的吸收、动力、内脏血流和营养功能。生长抑素可抑制胃泌素和胃酸以及胃蛋白酶的分泌，从而治疗上消化道出血，可以明显减少内脏器官的血流量，而又不引起体循环动脉血压的显著变化，因而在治疗食管静脉曲张出血方面有一定的价值。生长抑素可减少胰腺的内分泌和外分泌，用以预防和治疗胰腺外科手术后并发症。生长抑素还可以抑制胰高血糖素的分泌，从而有效地治疗糖尿病酮症酸中毒。

【药物相互作用】本品可以延长环己巴比妥的催眠作用时间，加剧戊烯四唑的作用，不宜同时使用。应单独给药，本品不宜与其他药物配伍给药。

【不良反应】

1．少数患者产生眩晕、耳鸣、脸红。

2．注射本品的速度超过每分钟50μg时，则会产生恶心、呕吐。

3．给药开始时可引起暂时性血糖下降。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用生长抑素［14肽］	化学药	HZ004955

HY001761 圣约翰草提取物

【外文名称】Extract of St．Johns Wort

药物药理信息

【药理毒理】可同时抑制突触前膜对去甲肾上腺素5－羟色胺和多巴胺的重吸收，使突触间隙内三种神经递质的浓度增加。同时还有轻度抑制单胺氧化酶和儿茶酚氧位甲基转移酶的作用，从而抑制神经递质的过多破坏。

【药物相互作用】

1．有可能使环孢菌素或香豆素类抗凝药（如华法林、苯丙羟基香豆素）治疗效果下降。在个别病例中，合用口服避孕药可导致患者皮下出血。

2．在艾滋病治疗期间，应避免与indinavir（羟基乙烯戊胺）和其他蛋白酶抑制剂同时服用，因为

圣约翰草提取物可能会降低蛋白酶抑制剂的血药浓度。

【不良反应】

1. 圣·约翰草提取物可引起皮肤对光的敏感性增加，故暴露在强阳光下可能出现类似晒伤的反应。特别是皮肤有过敏素质者较为明显。

2. 罕见胃肠道不适、过敏反应（如皮肤红、肿、痒）、疲劳或不安的发生。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
圣约翰草提取物片	化学药	HZ0003200

HY001762　十八醇

【其他名称】硬脂醇（Octadecyl Alcohol）

【外文名称】Otadecanol

【分子式】$C_{18}H_{37}OH$

【性状及组成】本品为白色、滑腻的蜡质块状或颗粒，有微弱的特殊臭气、味平淡。不溶于水，可溶于乙醇、三氯甲烷、乙醚和植物油。熔程 55 ~ 60℃，具有醇的通性。

药物药理信息

【药理毒理】本品在制药、日化工业中具有与鲸蜡醇相似的性质和相同的使用目的及用途。在药剂制造中，主要用作乳膏基质，用本品制得的乳膏比用鲸蜡醇制的较硬。在日化工业中主要用于制造霜剂、香波、洗涤剂等。

【药物相互作用】本品遇氧化剂、酸、碱发生氧化、酯化、分解等反应。

【不良反应】本品无毒、对皮肤和黏膜无刺激性，一般公认是安全的、LD_{50} > 20g/kg（大鼠，口服）。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
日晒防治膏	民族药	MZ000451
消痔洁肤软膏	民族药	MZ000669
貂油治裂软膏	中成药	ZC000857
玫芦消痤膏	中成药	ZC003531
参棘软膏	中成药	ZC004767
新肤螨软膏	中成药	ZC006474

HY001763　十二烷基硫酸钠

【其他名称】发泡粉、十二醇硫酸钠、十二醇硫酸钠、十二烷基硫酸酯钠盐、月桂醇硫酸钠

【外文名称】Sodium Lauryl Sulfate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】十二烷基硫酸钠

【分子式】$C_{12}H_{25}NaO_4S$

【分子量】288.38

【性状及组成】本品为以十二烷基硫酸钠为主的烷基硫酸钠混合物。

本品为白色或淡黄色结晶或粉末；有特征性微臭。

本品在水中易溶，在乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料。

本品为阴离子表面活性剂，具有乳化、去垢、分散、湿润、起泡等作用，在酸、碱性溶液和硬水中均有效，故广泛用于医药、日化、纺织等工业。在药剂制造中广泛用作乳化剂、去污剂、分散剂、润湿剂、起泡剂，用于制片剂、颗粒剂、胶囊剂、乳膏剂、药物香波、皮肤清洁剂等，在日化工业中广泛用于制造药物牙膏、冷霜、洗涤剂等。

【药物相互作用】本品与阳离子表面活性剂反应失去作用，即使低浓度也会使其沉淀。它不像肥皂，能与稀酸、钙、镁离子配伍。与 pH 低于 2.5 的酸、某些生物碱盐类有配伍反应，遇铅盐会沉淀。易使镀锡气雾剂容器腐蚀和穿孔。

【不良反应】本品无毒、安全。急性毒性实验：LD_{50}1.0 ~ 2.7g/kg（大鼠、口服）、210mg/kg（大鼠，腹腔注射）、250mg/kg（小鼠，腹腔注射）。不能用于人体静脉注射配方，高浓度（> 10%）对皮肤有刺激，低浓度则无刺激，未发现引起变应源皮肤过敏。按 Draize 法试验，眼能耐受的最大浓度为 20%，粉尘对眼及上呼吸道有刺激作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
丁硼乳膏	化学药	HZ000741
复方多维元素片（23）	化学药	HZ001152
肝素钠乳膏	化学药	HZ001578
磷酸雌莫司汀胶囊	化学药	HZ002287
鹿仙补肾片	民族药	MZ000343
七味解毒活血膏	民族药	MZ000390
百宝丹搽剂	中成药	ZC000178
貂油治裂软膏	中成药	ZC000857

续表

制剂名称	类别	序号
青柏洁身洗液	中成药	ZC004018
赛霉安乳膏	中成药	ZC004430
参棘软膏	中成药	ZC004767
十二味齿龈康散	中成药	ZC005065

HY001764 十六醇

【其他名称】1－十六烷醇、鲸蜡醇、棕榈醇、正十六烷醇

【外文名称】Hexadecanol

【分子式】$C_{16}H_{34}O$

【分子量】242.44

【性状及组成】本品呈蜡状、白色鳞片状、颗粒状、立方体状或块状物。微有微臭和平淡的味道。不溶于水，溶于乙醇、乙醚、三氯甲烷。

熔点：49.6℃。沸点：344℃，190℃（2kPa）。相对密度：0.8176（50/4℃）。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：包衣剂；乳化剂；增稠剂。

十六醇广泛用于化妆品及制剂处方中，如栓剂、调节释放速度的固体剂型、乳剂、洗剂、乳膏和软膏等。

在栓剂中，十六醇被用来增加基质的熔点，在调节释放速度的剂型中它可被用来形成一道渗透压的衣膜。在洗剂、乳膏和软膏中，利用其润滑性、可吸水性及乳化性等特性，来提高制剂的稳定性，改善质地，增加稠度。十六醇的润肤性质来源于其在表皮中的吸收和滞留；它可润滑与软化皮肤，并同时赋予皮肤一种“天鹅绒般”质感。

十六醇也因吸水性而用于W/O型乳剂中。例如，石蜡与鲸蜡醇的混合物（19:1）可吸收其自身重量40%～50%的水。十六醇作为一种W/O型弱乳化剂，可以减少处方中的其他乳化剂的用量。也有报道说，十六醇可以增加W/O型乳剂的稠度。

在O/W型乳剂中，有报道称十六醇与水溶性乳化剂合用可以提高乳剂稳定性。它与复合乳化剂合用可在油－水界面产生一层紧密排列的、单分子层的机械屏障，以防止油滴聚结。

在半固态乳剂中，过量的十六醇与乳化剂水溶液合用形成一黏弹性的连续相，赋予乳剂以半固体的特性，并阻止小油滴聚结。因此，十六醇有时被称为“增稠剂”或“形体增强剂”、但是须将其与亲水性乳化剂合用才能赋予其此性质。

纯的或药典级的十六醇不能形成稳定的半固态乳剂，也不与含有大量相似醇的不同级别的十六醇表现出相同的物理特性。

【药物相互作用】与强氧化剂有配伍禁忌。十六醇能降低布洛芬的熔点，这在布洛芬晶体薄膜包衣过程中将导致粘连。

【不良反应】十六醇主要用于局部制剂中，但也用于口服及直肠给药的制剂中。

在患有郁积性皮炎的病人中，十六醇与变应性迟发型超敏反应的发生有关。与十八醇、羊毛脂和硬脂醇的交叉致敏作用也见于报道。过敏反应的发生可能是因为工业级的十六醇中的杂质引起，因为高度提纯的十六醇（99.5%）不会引起过敏反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
七味解毒活血膏	民族药	MZ000390
新肤螨软膏	中成药	ZC006474

HY001765 十一酸睾酮

【外文名称】Testosterone Undecanoate

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】17β－羟基雄甾－4－烯－3－酮十一烷酸酯

【分子式】$C_{30}H_{48}O_3$

【分子量】456.71

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末；无臭。本品在三氯甲烷或苯中极易溶解，在乙醇中溶解，在植物油中略溶，在水中不溶。

熔点：本品的熔点为60～63℃。

比旋度：取本品，精密称定，加二氧六环溶解并定量稀释制成每1ml中含14mg的溶液，依法测定，比旋度为+68°至+72°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：雄激素类药。

本品为睾酮的十一酸酯。为睾酮衍生物，促进男性生长和副性征的发育，对睾丸和副性腺结构促进发育作用，促进蛋白质合成，减少分解代谢。增强免疫功能，促进骨骼生长。促进红细胞生成，反馈性抑制促性腺激素分泌，抑制雌激素分泌。

【药代动力学】本品肌注为长效雄激素。肌注可避免首过效应。单剂肌注后血清睾酮达峰时间约在7天，21天以后恢复到肌注前水平。

口服本品后，十一酸睾酮油溶液可经小肠－淋

巴系统吸收，避开肝脏的灭活作用。体内的分布以肝、肾、脂肪组织为主，提肛肌、附睾、前列腺其次。十一酸睾酮大部分在体内水解成睾酮，以原形从尿中排泄的约占总量的7.2%。

【药物相互作用】为提高疗效，宜同时服用适量蛋白质、糖和维生素等。如正在使用其他药品，使用本品前请咨询医师或药师。

【不良反应】女性男性化，水钠潴留，红细胞增多，恶心呕吐，皮疹，哮喘，神经血管性水肿，肝功能异常、HDL－C水平升高，欣快感，情绪不稳定，暴力倾向等。

每月1次250mg时，未见明显不良反应，当每月注射1～1.5g，可引起雄激素过多样不良反应，但反复多次注射不会引起注射部位组织变性，也不会引起肝功能损害。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
十一酸睾酮胶囊	化学药	HZ003203
十一酸睾酮注射液	化学药	HZ003204

HY001766　十一烯酸

【其他名称】Undecenoic Acid

【外文名称】Undecylenic Acid

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】10－十一烯酸

【分子式】$C_{11}H_{20}O_2$

【分子量】184.28

【性状及组成】本品为淡黄色至黄色的液体，遇冷则成乳白色的结晶性团块；有特臭。本品能与乙醇、三氯甲烷、乙醚、脂肪油或挥发油任意混溶，在水中几乎不溶。

相对密度：本品的相对密度在25℃时为0.910－0.913。

凝点：本品的凝点不低于21℃。

折光率：本品的折光率在25℃时为1.448～1.450。

碘值：本品的碘值为131～140。

药物药理信息

【药理毒理】消毒防腐药。治疗皮肤黏膜的真菌感染，如脚癣。

【不良反应】浓度过大时对组织有刺激性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方十一烯酸锌曲安奈德软膏	化学药	HZ001375
复方十一烯酸锌软膏	化学药	HZ001376
脚气灵膏	化学药	HZ001955
十一烯酸软膏	化学药	HZ003205
十一烯酸外用液体	化学药	HZ003206

HY001767　十一烯酸锌

【外文名称】Zinc Undecylenate

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】10－十一烯酸锌盐

【分子式】$C_{22}H_{38}O_4Zn$

【分子量】431.92

【性状及组成】本品为白色无定形粉末。

本品在水或乙醇中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为116～121℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品有抗菌作用，能抑制真菌繁殖。用于皮肤真菌感染，治疗各种癣症、霉菌性阴道炎、皮肤霉菌感染等。

【不良反应】浓度过大时对组织有刺激性，用于黏膜的浓度不宜大于1%。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方十一烯酸锌曲安奈德软膏	化学药	HZ001375
复方十一烯酸锌软膏	化学药	HZ001376
脚气灵膏	化学药	HZ001955

HY001768　石蜡

【外文名称】Paraffin

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

【性状及组成】本品系自石油或页岩油中得到的各种固形烃的混合物。

本品为无色或白色半透明的块状物，常显结晶状的构造；无臭、无味；手指接触有滑腻感。

本品在三氯甲烷或乙醚中溶解，在水或乙醇中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为50～65℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料，软膏基质。

石蜡主要作为乳膏和软膏的组分用于局部用药物处方中。在软膏中，石蜡常用来提高熔点或增加硬度。此外石蜡还被用作胶囊剂及片剂的包衣材料和用于食品工业。离子交换树脂颗粒用石蜡包衣也可用以影响药物从其中的释放。

【不良反应】通常认为石蜡作为局部用软膏成分和片剂及胶囊剂包衣材料时无毒、无刺激性。但是，为美容或为减轻疼痛而将石蜡注射到组织中时，仍有可能出现肉芽肿反应（石蜡瘤）。长时间吸入雾化石蜡可能会导致间质性肺病。曾有因大量摄入白色软石蜡而导致肠梗阻的一病例。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方木芙蓉涂鼻膏	民族药	MZ000164
薄荷锭	中成药	ZC000382
复方南星止痛膏	中成药	ZC001463
清凉油（白色）	中成药	ZC004113
清凉油（棕色）	中成药	ZC004114
乌鸡白凤胶囊	中成药	ZC005787
愈伤膏	中成药	ZC007116

HY001769 石杉碱甲

【外文名称】Huperzine A

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（5*R*，9*R*，11*E*）－5－氨基－11－亚乙基－5,8,9,10－四氢－7－甲基－5,9－亚甲基环辛四烯并［*b*］吡啶－2－（1*H*）－酮

【分子式】$C_{15}H_{18}N_2O$

【分子量】242.32

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶性粉末；无臭，味微苦；有引湿性。

本品在甲醇中易溶，在乙醇中溶解，在水中不溶；在 0.01mol/L 盐酸溶液中微溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：胆碱酯酶抑制剂。

本品是从天然植物千层塔中提取的生物碱，生物活性高，是一种对真性胆碱酯酶具有高度选择性的可逆性胆碱酯酶抑制剂。本品有较高的脂溶性，分子小，易透过血脑屏障，进入中枢后较多地分布于大脑的额叶、颞叶、海马等与学习和记忆有密切联系的脑区，在低剂量下对乙酰胆碱酯酶有强大的抑制作用，使分布区内神经突触间隙的乙酰胆碱含量明显升高，从而增强神经元兴奋传导，强化学习与记忆脑区的兴奋作用，起到提高认知功能、增强记忆保持和促进记忆再现的作用。

本品适用于良性记忆障碍，可提高患者指向记忆、联想学习、图像回忆、无意义图形再认及人像回忆等能力，对正常人的学习与记忆也有增强作用；本品对痴呆患者和脑器质性病变引起的记忆障碍亦有改善作用。

【药代动力学】由于本品用量极小，口服后吸收分布快而完全，10～30 分钟可达血药峰浓度，生物利用度可达 95%以上，吸收后脑内以皮层、海马等区域分布较高，外周以肝、肾分布较高。本品 $t_{1/2}\alpha$ 为 9.8 分钟，排泄缓慢，半衰期 $t_{1/2}\beta$ 为 247.5 分钟，主要从肾脏排出，24 小时排出给药量的 73.6%，有效作用时间可达 6 小时。

【不良反应】一般不明显，剂量过大时可引起头晕、恶心、胃肠道不适、乏力等反应，一般可自行消失，反应明显时减量或停药后缓解、消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
石杉碱甲胶囊	化学药	HZ003207
石杉碱甲片	化学药	HZ003208
石杉碱甲注射液	化学药	HZ003209
注射用石杉碱甲	化学药	HZ004956

HY001770 舒巴坦钠

【其他名称】青霉烷砜钠

【外文名称】Sulbactam Sodium

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（2*S*，5*R*）－3,3－二甲基－7 氧代－4－硫杂－1－氮杂双环［3.2.0］庚烷－2－羧酸钠－4,4 二氧化物

【分子式】$C_8H_{10}NNaO_5S$

【分子量】255.23

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末或结晶性粉末；微有特臭；味微苦。

本品在水中易溶，在甲醇中微溶，在乙醇、丙酮或乙酸乙酯中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并制成每 1ml 中含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为 +

223°至 + 237°。

药物药理信息

【药理毒理】本品为半合成 β - 内酰胺酶抑制药，对淋病奈瑟菌、脑膜炎奈瑟菌和乙酸钙不动杆菌有较强抗菌活性，对其他细菌的作用均甚差，但对金黄色葡萄球菌和多数革兰阴性菌所产生的 β - 内酰胺酶有很强的不可逆的竞争性抑制作用。2mg/L 的浓度对 Richmond 分类Ⅱ、Ⅲ、Ⅳ和Ⅴ型 β - 内酰胺酶抑制作用甚强，但对Ⅰ型 β - 内酰胺酶作用较差。与青霉素类和头孢菌素类合用时，使因产酶而对前两类抗生素耐药的金黄色葡萄球菌、流感嗜血杆菌、大肠埃希菌、脆弱拟杆菌等的 MIC 降到敏感范围之内。

本品对奇异杆菌的 PBP1 和乙酸钙不动杆菌的 PBP2 有较强的亲和力。

【药代动力学】本品肌内注射 0.5g 和 1.0g 半小时后血药峰浓度分别为 13mg/L 和 28mg/L，静脉滴注 0．5g 和 1.0g，血药峰浓度分别为 30mg/L 和 68mg/L。血消除半衰期为 1 小时。蛋白结合率为 38%。给药后 24 小时经尿排出给药量的 85%。组织间液和腹腔液的药物浓度与血药浓度相当。本品可透入有炎症的脑膜。可透过胎盘进入胎儿体内，乳汁中亦含有本品。

【药物相互作用】

1．丙磺舒、阿司匹林、吲哚美辛、保泰松、磺胺药可减少本品自肾脏排泄，因此与本品合用时使其血药浓度增高，排泄时间延长，毒性也可能增加。

2．本品与双硫仑（乙醛脱氢酶抑制药）也不宜合用。

【不良反应】本品与氨苄西林联合应用，不良反应发生率约 10%以下，中止治疗者仅 0.7%。注射部位疼痛 3.6%，静脉炎、腹泻、恶心等反应偶有发生，皮疹发生率 1% ~ 6%。偶见一过性嗜酸粒细胞增多、血清氨基转移酶升高等。极个别病例发生剥脱性皮炎、过敏性休克。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用阿莫西林钠舒巴坦钠	化学药	HZ004670
注射用氨苄西林钠舒巴坦钠	化学药	HZ004681
注射用美洛西林舒巴坦钠	化学药	HZ004894
注射用哌拉西林钠舒巴坦钠	化学药	HZ004917
注射用舒巴坦钠	化学药	HZ004957
注射用头孢哌酮钠舒巴坦钠	化学药	HZ004984
注射用头孢噻肟舒巴坦钠	化学药	HZ004990

HY001771　舒巴坦匹酯

【外文名称】Sulbactam Pivoxil

【分子式】$C_{14}H_{21}NO_7S$

【分子量】347.39

【性状及组成】本品为白色至微黄色结晶性粉末。

药物药理信息

【药理毒理】舒巴坦匹酯为 β - 内酰胺酶抑制剂舒巴坦的前体药物，口服吸收后迅速水解为舒巴坦而起到抑酶作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
阿莫西林舒巴坦匹酯片	化学药	HZ000045

HY001772　舒必利

【其他名称】Abilit、Aigdonyl、Championyl、Dogmatil、Ekilid、硫苯酰胺、舒必林、舒宁、消呕宁、止呕灵

【外文名称】Sulpiride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】*N* - ［甲基 - （1 - 乙基 - 2 - 吡咯烷基）］ - 2 - 甲氧基 - 5 - 氨基磺酰基） - 苯甲酰胺

【分子式】$C_{15}H_{23}N_3O_4S$

【分子量】341.42

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末；无臭，味微苦。本品在乙醇或丙酮中微溶，在三氯甲烷中极微溶解，在水中几乎不溶；在氢氧化钠溶液中极易溶解。

熔点：本品的熔点为 177 ~ 180℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品属苯甲酰胺类抗精神病药，作用特点是选择性阻断中脑边缘系统的多巴胺（DA_2）受体，对其他递质受体影响较小，抗胆碱作用较轻，无明显镇静和抗兴奋躁动作用，本品还具有强止吐和抑制胃液分泌作用。

【药代动力学】本品自胃肠道吸收，2 小时可达血药浓度峰值，口服本品 48 小时，口服量的 30%从尿中排出，一部分从粪中排出。血浆半衰期为 8 ~ 9 小时，动物实验显示本品可透过胎盘屏障进入脐血循环。本品主要经肾脏排泄。可从母乳中排出。

【药物相互作用】除氯氮平外，几乎所有抗精神

病药和中枢抑制药均与其存在相互作用，应充分注意。

【药物过量】

1. 中毒症状。①中枢神经系统症状：严重意识障碍，从嗜睡、注意力不集中到昏睡，最后进入昏迷。检查时可发现瞳孔缩小，对光反应迟钝。同时伴有中枢性体温过低。②心血管系统症状：体位性低血压、心率加快、脉细数、偶见心律不齐，严重时导致低血容量性休克。③血液系统症状：中性粒细胞减少、过敏性紫癜。

2. 处理：洗胃、导泻、输液。并依病情给予对症治疗及支持疗法。

【不良反应】

1. 常见有失眠、早醒、头痛、烦躁、乏力、食欲减退等。可出现口干、视物模糊、心动过速、排尿困难与便秘等抗胆碱能不良反应。

2. 剂量大于一日 600mg 时可出现锥体外系反应，如震颤、僵直、流涎、运动迟缓、静坐不能、急性肌张力障碍。

3. 较多引起血浆中泌乳素浓度增加，可能有关的症状为：溢乳、男子女性化乳房、月经失调、闭经、体重增加。

4. 可出现心电图异常和肝功能损害。

5. 少数患者可发生兴奋、激动、睡眠障碍或血压升高。

6. 长期大量服药可引起迟发性运动障碍。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
舒必利片	化学药	HZ003210
舒必利注射液	化学药	HZ003211

HY001773 舒林酸

【其他名称】Clinoril、硫茚酸、奇诺力、苏灵太

【外文名称】Sulindac

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（*Z*）－2－甲基－1－［(4－甲基磺酰苯基）亚甲基］－5－氟－1*H*－茚－3－乙酸

【分子式】$C_{10}H_{17}FO_3S$

【分子量】356.41

【性状及组成】本品为橙黄色结晶性粉末；无臭，味微苦。本品在三氯甲烷或甲醇中略溶，在乙醇或乙酸乙酯中微溶，在水中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：消炎镇痛药。

本品为一活性极小的前体药，口服吸收后在体内代谢成为硫化物后才具有明显抗炎、镇痛作用，硫化物为选择性的环氧化酶抑制剂，可减少前列腺素的合成，其作用较舒林酸本身强 500 倍，但对肾脏中生理性前列腺素的合成影响不大。由于其以非活性形式通过胃肠道，因此对胃肠道刺激性小，对肾血流量和肾功能影响亦较少。本品还能抑制 5－羟色胺的释放，以及抑制胶原诱发的血小板聚集作用，延长出血时间。

【药代动力学】口服后约 90% 被吸收，吸收迅速，服药后血药浓度达峰值时间为 1～2 小时，食物可延缓其吸收，达峰值时间为 4～5 小时。分布以血浆中浓度最高，其次是肝、胃、肾、小肠及其他组织。本品 95% 与血浆蛋白结合，舒林酸半衰期为 7 小时，活性物半衰期为 18 小时。药物最终以母药或无活性代谢物或葡萄糖醛酸结合物形式通过粪便和尿液排出，有活性成分大部分转回母药。代谢物从尿中排泄约占服用量的 74%，另 26% 以各种未鉴定物从粪中排出。

【药物相互作用】

1. 与抗凝药华法林同时服用时可致凝血酶原时间延长。

2. 与降糖药（甲磺丁脲等）同服可使空腹血糖下降明显。

3. 与阿司匹林同服可降低本药活性，使本品的疗效反而降低，且可能出现周围神经病变。

【药物过量】药物超量中毒时应给予紧急处理包括洗胃、催吐、服用活性炭，同时予以对症支持治疗。

【不良反应】

1. 常见不良反应为胃肠道反应，包括上腹痛、腹胀、消化不良、恶心、腹泻、便秘、纳差等，发生消化道溃疡者较少。

2. 中枢神经系统症状一般极少发生，主要有头晕、头痛、嗜睡、失眠。

3. 骨髓抑制、急性肾功能衰竭、心力衰竭、无菌性脑膜炎、肝损害和 Stevens－Johnson 综合征则罕见。

4. 其他：偶见皮疹、瘙痒、急躁、忧郁等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
舒林酸片	化学药	HZ003213

HY001774 舒噻美

【其他名称】磺斯安、硫斯安、硫噻嗪、舒噻

胺、舒噻嗪、Sulthiame、Sulthiamine

【外文名称】Sultiame

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭或几乎无臭；极微溶于水，微溶于乙醇、三氯甲烷和乙醚。

药物药理信息

【药理毒理】本药具有抗癫痫作用，除小发作外，对其他各型癫痫均有效，其中对精神运动性发作、局限性发作和运动过度行为的控制较对大发作更为有效。其作用机制可能是由于其强大的抑制脑内碳酸酐酶之作用，使脑细胞外、内的钠比率增大，而稳定了细胞膜之结果。

临床用于治疗除小发作外的各类癫痫。

【药代动力学】口服易吸收，主要经肾排泄。临床药理研究证明，长期用本品，一次口服后1~5小时血浓度达高峰；24小时内约60%以原形，部分以代谢产物排出。

【不良反应】面部和肢端感觉异常、共济失调、食欲减退；代谢性酸中毒可导致呼吸过快及呼吸困难，特别是青年人。个别病例头痛、眩晕、体重下降、精神病性反应、失眠、视物模糊、皮疹、眼睑下垂、语言不清、失眠、白细胞减少。剂量过大有结晶尿。

HY001775　舒他西林

【外文名称】Sultamicillin

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第47册

药物理化信息

【化学名】[（+）羟甲基-（2*S*，5*R*，6*R*）-6-（*R*）-2-氨基-2-苯基乙酰胺基]-3,3-二甲基-7-氧代-4-硫杂双环[3,2,0]正庚烷-2-羟酸酯-2*S*，5*R*-3,3-二甲基-7-氧代-4-硫杂-1-氮杂双环[3,2,0]正庚烷-2-羧酸酯，*S*,*S*-二氧化物

【分子式】$C_{25}H_{30}N_4O_9S_2$

【分子量】594.67

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶或粉末；微臭，味微苦。

本品在二氧六环中易溶，在甲醇中微溶，在水中和乙醇中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加二氧六环溶解并稀释成每1ml中含10mg的溶液，依法测定比旋度为+190°~+204°。

药物药理信息

【药理毒理】青霉素类药。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
舒他西林干混悬剂	化学药	HZ003214

HY001776　舒托必利

【其他名称】Barnetyl、吡乙磺苯酰胺、舒多普利、乙基舒必利

【外文名称】Sultopride

药物药理信息

【药理毒理】本品是舒必利后又一种苯甲酰胺类抗精神病新药。作用于多巴胺D_2受体，为多巴胺受体阻断剂。其镇静作用较舒必利强，对躁狂、幻觉、妄想及精神运动性兴奋有抑制作用。

本品与氯丙嗪、氟哌啶醇及锂相比具有作用速度快、强、毒性及不良反应小，故在控制急性精神兴奋状态方面有特点。对抑郁、焦虑及动作迟滞效果不明显。

本品用于急性精神分裂症的控制。

【不良反应】

1. 主要不良反应为锥体外系反应，发生率较氟哌啶醇低而较舒必利为高。

2. 尚可有月经异常、泌乳、射精不能、体重增加、失眠、焦躁、不安、兴奋、困倦、口渴、头痛、发热、出汗、排尿困难、运动失调、胃肠道反应等。

HY001777　薯蓣皂苷

【其他名称】穿龙冠心宁、地奥配质、Dioscin

【外文名称】Diosgenin

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第5册

药物理化信息

【分子式】$C_{45}H_{72}O_{16}$

【分子量】869.08

【性状及组成】白色或微黄的结晶性粉末。不溶于水、石油醚、苯，可溶于甲醇、乙醇、醋酸，微溶于丙酮、戊醇。

分解点：275~277℃。

旋光度：-115°（*c*=0.373，乙醇）。

药物药理信息

【药理毒理】有止咳、祛痰、脱敏、消炎作用。可用于气管炎的治疗。亦有杀昆虫和抗须癣毛菌等真菌的作用。可作为合成甾体激素及避孕药的原料。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
薯蓣皂苷片	中成药	ZC005229

HY001778 双半胱氨酸

【外文名称】Ethylene Dicysteine

药物理化信息

【化学名】*N*,*N*′-1,2-*Z* 撑一双（L-半胱氨酸）

药物药理信息

【药理毒理】本品不直接使用，无单独的药理毒理作用。仅用于制备锝［^{99m}Tc］双半胱氨酸注射液。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
亚锡双半胱氨酸冻干品	化学药	HZ003824
注射用亚锡双半胱氨酸	化学药	HZ005036

HY001779 双贝特

【其他名称】安妥明丙二醇酯、安妥明丙二酯、冠心平Ⅱ号、降脂丙醇、降脂丙二醇、双安妥明、双氯苯丁酯

【外文名称】Simfibrate

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第10册

药物药理信息

【药理毒理】作用比氯贝丁酯强而持久，能使高脂蛋白血症患者血中的极低密度脂蛋白及甘油三酯的浓度明显下降，而对低密度脂蛋白和胆固醇的作用较弱。适用于治疗高脂血症，尤适用Ⅳ型高脂血症的治疗。

【不良反应】

1. 偶有恶心、腹胀、腹泻、嗜睡、无力、脱发、白细胞减少、皮疹、瘙痒、肌强直、肌痉挛、肌酸磷酸激酶及谷草转氨酶升高等。

2. 长期服用能增加胆石症、胆囊炎、肺栓塞、室性心律、失常及心绞痛的发生率。

3. 据报道，有致癌作用及对肝脏有较显著的损害作用，某些国家已禁用该药及其复方制剂。

HY001780 双醋瑞因

【外文名称】Diacerein

【分子式】$C_{19}H_{12}O_8$

【分子量】368.30

药物药理信息

【药理毒理】本品为骨关节炎IL-1的首要抑制剂。经细胞实验及动物实验证实：①本品可诱导软骨生成、具有止痛、抗炎及退热作用；②不抑制前列腺素合成；③对骨关节炎有延缓疾病进程的作用。

毒理作用：小鼠和大鼠单次给药的最大耐受量超过人用剂量的190和410倍，狗的最大耐受量超过人用剂量的600倍（按体表面积给药量计算）。亚急性、慢性和胎儿毒性实验，生育力实验，围产期和产后毒性实验，致癌和致畸实验均表明本品具有良好的安全性。

【药代动力学】在动物和人体内，口服的本品在进入体循环前经脱乙酰基作用成活性代谢产物大黄酸。健康成人单次口服给药达峰时间约为2.4小时，血浆蛋白结合率大于99%，血浆半衰期约为4.2小时，本品表观生物利用度为35%～56%。代谢产物大黄酸主要经肾脏排泄，小部分也经胆汁排泄。

【药物相互作用】在服用改善肠道转运和（或）肠道内容物性质的药物时，禁服本药。为提高双醋瑞因的生物利用度应避免同时服用含有氢氧化铝和（或）氢氧化镁的药物。服用双醋瑞因后会增加使用抗生素和（或）化学疗法的病人患小肠结肠炎的可能性，因为抗生素和化学疗法会影响肠道的菌群。

【药物过量】意外或自发过量服用本品会导致腹泻。无特殊解决方法。若腹泻持续，需请医师处理。紧急处理时需反复检测体内的水和电解质平衡。

【不良反应】轻度腹泻是应用本品治疗最常见的不良反应（发生率约7%），一般会在治疗后的最初几天内出现，多数情况下会随着继续治疗而自动消失。上腹疼痛的发生率为3%～5%，恶心或呕吐则少于1%。服用本品偶尔会导致尿液颜色变黄，这是本品的特性，无任何临床意义。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
双醋瑞因胶囊	化学药	HZ003220

HY001781 双碘喹啉

【其他名称】迪安都喹、DIODOQUIN、Diodoxyquindine、Embequin、Iodoxine、双碘方、双碘喹、双碘羟喹、Zoaquin

【外文名称】Diiodohydroxyquinoline

【性状及组成】本品为淡黄色或黄棕色微结晶性粉末，无味，几乎无臭，不溶于水，溶于乙醇、丙酮、乙醚。

药物药理信息

【药理毒理】本品为卤化喹啉类，作用于阿米巴包囊的抗阿米巴药。本品能抑制肠内阿米巴共生菌，使阿米巴生长繁殖受到抑制而起抗阿米巴作用，临床可用于轻型或无症状阿米巴痢疾。也可用于阴道滴虫病。

【药代动力学】部分不规则地从胃肠道吸收。

【药物相互作用】对急性阿米巴痢疾较顽固病人，宜与依米丁、甲硝唑合用，可收到根治的效果。

【不良反应】口服给药可引起胃肠道反应，如引起腹部痉挛、恶心、腹泻、瘙痒、皮疹。甲状腺肿大与药品中含碘有关。也可发生发热、寒战、头痛和眩晕。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
双碘喹啉片	化学药	HZ003221

HY001782　双环铂

【其他名称】安托可金、DCP

【外文名称】Dicycloplatin

【分子式】$C_{12}H_{18}N_2O_8PT$

【分子量】513.36

药物药理信息

【药理毒理】临床试验结果证明本品安全性良好，其胃肠道反应及肾毒性低于顺铂，血液毒性低于卡铂，无明显肾功能损伤；最大耐受量（MTD）650mg/m^2；蛋白质结合率低。双环铂是基于分子生物学观点，利用癌细胞 DNA 空间构型异常特性，设计并制造成功的一种带“分子开关”的铂类抗癌新药。

双环铂是一类全新的超分子笼状化合物，可以在人体内导向性的与异常 DNA 的碱基络合（即双环铂中 Pt 原子 d 空穴轨道与碱基中 N 中孤对电子络合，遵循量子力学泡利不相容原理），将复制癌细胞的机构摧毁，发挥治疗作用。

【药代动力学】双环铂注射后，90%药物以游离形式存在；消除半衰期长，$t_{1/2\beta}$为 80.09 ± 17.48 小时。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
双环铂胶囊	化学药	HZ003226
双环铂注射液	化学药	HZ003227

HY001783　双环醇

【其他名称】百赛诺、百塞诺

【外文名称】Bicyclol

药物理化信息

【化学名】4,4′－二甲氧基－5,6,5′,6′－双（亚甲二氧基）－2－羟甲基－2′－甲氧羰基联苯

【分子式】$C_{19}H_{18}O_9$

【分子量】390.34

药物药理信息

【药理毒理】双环醇具有显著保肝作用和一定抗肝炎病毒效果，表现为对四氯化碳、D－氨基半乳糖胺、对乙酰氨基酚引起的小鼠急性肝损伤以及小鼠免疫性肝炎等 4 种动物模型均有显著的降低血清转氨酶水平的作用，肝脏组织病理形态学损害有不同程度的减轻。此外，对大鼠慢性四氯化碳肝损伤模型，双环醇除有降低血清转氨酶作用外，兼有改善血清白蛋白/球蛋白比值及肝脏脯氨酸含量的效果，即有减轻肝纤维化的作用。

用人肝癌细胞转染人乙肝病毒的 2.2.15 细胞株进行试验，双环醇具有抑制 HBeAg、HBV－DNA 及 HBsAg 分泌的效果，双环醇在大鼠和犬长期慢性毒性试验中未发现有毒性，亦无致畸胎和致突变的毒性。

【药代动力学】健康志愿者口服双环醇片剂（一次 25mg）的药代动力学特征符合一房室模型及一级动力学消除规律。吸收半衰期为 0.84 小时，消除半衰期为 6.26 小时，药峰时间为 1.8 小时，药峰浓度为 50ng/ml。峰浓度和浓度－时间曲线下面积与剂量成正比，而其他药代动力学参数如吸收半衰期、消除半衰期、分布容积、清除率 及达峰时间均不随剂量明显改变，符合线性动力学特征。

多次给药与单次给药相比，药代动力学参数无显著性差异，提示常用剂量多次重复给药体内药量无过量蓄积现象。餐后口服双环醇可使峰浓度升高，对其他动力学参数无影响。该药在人体内主要代谢产物为 4′－ 羟基和 4－ 羟基双环醇。

【药物相互作用】目前尚无本品与其他药物相互作用的研究资料。

【药物过量】本品动物毒性试验提示给药相当于人用量 150 倍至 400 倍，未出现毒性反应，如误服大量药物出现不良反应，可对症处理。

【不良反应】患者对本品有很好的耐受性，极个别患者有皮疹发生。皮疹明显者可停药观察，必要时可服用抗过敏药。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
双环醇片	化学药	HZ003228
双环醇注射液	化学药	HZ003229

HY001784 双氯非那胺

【其他名称】 Antidrasi、Daranide、二氯苯二磺酰胺、二氯苯磺胺（Dichorphenamide）、二氯磺胺、Fenamide、Glauconide、Hipotensor、Oftalmico、Oralcon、Oratrol、双氯磺酰胺

【外文名称】 Diclofenamide

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 4，5－二氯间苯二磺酰胺

【分子式】 $C_6H_6Cl_2N_2O_4S_2$

【分子量】 305.15

【性状及组成】 本品为白色或几乎白色的结晶性粉末；几乎无臭，味微苦。本品在乙醇中溶解，在水或三氯甲烷中几乎不溶；在碱性溶液中易溶.

熔点：本品的熔点为 238～242℃。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：碳酸酐酶抑制药。

在其分子中含有 2 个磺酰胺基团，故具有较强的碳酸酐酶抑制功能，除抑制 Na^+、K^+ 再吸收外，还增加 Cl^- 的排出，故代谢性酸中毒的发生缓慢。本品 50mg 的疗效与 250mg 乙酰唑胺相当。本品可减少房水生成量的 39%，从而使眼压下降。无论正常眼及青光眼均可使其眼压下降，正常眼平均下降 0.32kPa（2.4mmHg），青光眼平均下降 1.08kPa（8.1mmHg）。但房水流出易度不变，即本品没有增加房水排出的功能。

【药代动力学】 口服吸收迅速。用药后 0.5～1 小时眼压开始下降，2～4 小时达峰，峰值维持时间 6～12 小时。

【药物相互作用】

1. 与促肾上腺皮质激素、糖皮质激素尤其与盐皮质激素联合使用，可以导致严重的低血钾，在联合用药时应注意监护血清钾的浓度及心脏功能。亦应估计到长期同时使用有增加低血钙的危险，可以造成骨质疏松，因为这些药都能增加钙的排泄。

2. 与苯丙胺、抗 M 胆碱药、尤其是和阿托品、奎尼丁联合应用时，由于形成碱性尿，本品排泄减少，会使不良反应加重或延长。

3. 与抗糖尿病药（如胰岛素）联合应用时，可以减少低血糖反应，因为本品可以造成高血糖和尿糖，故应调整剂量。

4. 与苯巴比妥、卡马西平或苯妥英钠等联合应用，可引起骨软化发病率上升。

5. 洋地黄苷类与本品合用，可提高洋地黄的毒性，并可发生低钾血症。

6. 与甘露醇或尿素联合应用，在增强降低眼内压作用的同时，可增加尿量。

【不良反应】 一般用药后常见的不良反应有：①四肢麻木及刺痛感；②全身不适症候群：疲劳、体重减轻、困倦抑郁、嗜睡、性欲减低等；更易出现精神错乱。③胃肠道反应：金属样味觉、恶心、消化不良、腹泻；更易出现畏食。④肾脏反应：多尿、夜尿、肾及泌尿道结石等。⑤可出现暂时性近视，也可发生磺胺样皮疹，剥脱性皮炎。

少见的有：①电解质紊乱：代谢性酸中毒、低钾血症，补充碳酸氢钠及钾盐有可能减轻症状；②听力减退；③最严重的不良反应是造血系统障碍：急性溶血性贫血、粒细胞减少症、血小板减少症、嗜伊红细胞增多症、再生障碍性贫血；肾功能衰竭。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
双氯非那胺片	化学药	HZ003232

HY001785 双氯芬酸

【外文名称】 Diclofenac

药物理化信息

【化学名】 2－［（2,6－二氯苯基）氨基］苯乙酸

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理作用：双氯芬酸是一种衍生于苯乙酸类的非甾体消炎镇痛药，其作用机制为抑制环氧化酶活性，从而阻断花生四烯酸转化前列腺素。同时，它也能促进花生四烯酸与甘油三酯（三酰甘油）结合，降低细胞内游离的花生四烯酸浓度，而间接抑制白三烯的合成。

双氯芬酸是非甾体消炎药中作用较强的一种，它对前列腺素合成的抑制作用强于阿司匹林和吲哚美辛等。

2. 非临床毒理研究：给大鼠口服双氯芬酸达每日 2mg/kg，长期观察，没有发现肿瘤发生率增加。一项对小鼠 2 年的研究中，每日用药 2mg/kg，也未见到任何肿瘤易发倾向。各种突变研究没有发现双氯芬酸诱发基因突变。给大鼠用药每日 4mg/kg，雌雄均未发生不育。

【药代动力学】 口服吸收完全。与食物同服降低

吸收率。缓释口服药在约4小时后血药浓度达峰值，表观分布容积0.12～0.55L/kg。药物半衰期约2小时。血浆蛋白结合率为99%。在乳汁中药浓度极低而可忽略。大约50%在肝脏代谢，40%～65%从肾排出，35%从胆汁、粪便排出。长期应用无蓄积作用。

【药物相互作用】

1. 饮酒或与其他非甾体抗炎药同用时增加胃肠道不良反应，并有致溃疡的危险。长期与对乙酰氨基酚同用时可增加对肾脏的毒性及不良反应。

2. 与肝素、双香豆素等抗凝药及血小板聚集抑制药同用时有增加出血的危险。

3. 与呋塞米同用时，后者的排钠和降压作用减弱。

4. 与维拉帕米、硝苯地平同用时，本品的血药浓度增高。

5. 本品可增高地高辛的血浓度，同用时须注意调整地高辛的剂量。

6. 本品与抗糖尿病药同用时，可影响后者的疗效，故需慎重考虑。

7. 本品与抗高血压药同用时可影响后者的降压效果。

8. 丙磺舒可降低本品的排泄，增加血药浓度，从而增加毒性，故同用时宜减少本品剂量。

9. 本品可降低甲氨蝶呤的排泄，增高其血浓度，甚至可达中毒水平，故本品不应与中或大剂量甲氨蝶呤同用。

10. 与保钾利尿药同用时可引起高钾血症。

【药物过量】药物过量时应采用下列治疗措施：应尽快采取洗胃和活性炭处理，以阻止其进一步被吸收。对并发症，例如血压过低、肾衰竭、惊厥、胃肠刺激、呼吸抑制，应进行支持治疗和对症治疗。

【不良反应】

1. 胃肠道反应：为最常见的不良反应，主要为胃不适、腹痛、烧灼感、反酸、纳差、便秘恶心等，其中少数患者可出现溃疡、出血、穿孔。

2. 神经系统表现有头痛、眩晕、嗜睡、兴奋等。

3. 可引起水肿、少尿、电解质紊乱等严重不良反应。

4. 其他少见的有血清氨基转移酶一过性升高，极个别患者出现黄疸、皮疹、心律失常、粒细胞减少、血小板减少等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方愈酚麻黄糖浆	化学药	HZ001482
双氯芬酸缓释胶囊	化学药	HZ003235

HY001786　双氯芬酸二乙胺

【外文名称】Diclofenac Diethylamine

药物理化信息

【化学名】2-［（2，6-二氯苯基）氨基］苯乙酸钠

【分子式】$C_{14}H_{11}Cl_2NO_2 \cdot C_4H_{11}N$

【分子量】369.27

药物药理信息

【药理毒理】本品为外用非甾体抗炎药，局部应用后可以有效穿透皮肤达到炎症区域，缓减急慢性炎症反应，具有抗炎、镇痛作用，其作用机制与抑制前列腺素的合成有关。

【药代动力学】本品从局部皮肤少量吸收，吸收后血浆蛋白结合率达99%以上，血浆消除半衰期为1～2小时，双氯芬酸及其代谢产物主要从尿中排泄。

【不良反应】局部使用本品而导致全身性反应的情况较少出现。若将其用于较大范围的皮肤并长期应用，不能完全排除引起全身性反应的可能性。

1. 局部反应：偶然出现过敏或非过敏性皮炎，如丘疹、皮肤发红、水肿、瘙痒、小水疱、大水疱或鳞屑等。

2. 全身性反应：个别病人会出现全身性皮疹、过敏性反应（如哮喘发作、血管神经性水肿）、光过敏反应等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
双氯芬酸二乙胺凝胶	化学药	HZ003233
双氯芬酸二乙胺乳胶剂	化学药	HZ003234

HY001787　双氯芬酸钾

【外文名称】Diclofenac Potassium

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第57册

药物理化信息

【化学名】［邻-（2,6-二氯苯胺）］苯乙酸钾

【分子式】$C_{14}H_{10}Cl_2NKO_2$

【分子量】334.25

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末；有刺鼻感和引湿性。

本品在甲醇中易溶，在乙醇中溶解，在水中略溶，在三氯甲烷中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理作用：双氯芬酸钠是一种衍生于苯乙酸类的非甾体消炎镇痛药，其作用机制为抑制环氧化酶活性，从而阻断花生四烯酸向前列腺素的转化。同时，它也能促进花生四烯酸与甘油三酯结合，降低细胞内游离的花生四烯酸浓度，而间接抑制白三烯的合成。

双氯芬酸钠是非甾体消炎药中作用较强的一种，它对前列腺素合成的抑制作用强于阿司匹林和消炎痛等。

2. 非临床毒理研究：给大鼠口服双氯芬酸钠达每日 2mg/kg，长期观察，没有发现肿瘤发生率增加。一项对小鼠 2 年的研究中，每日用药 2mg/kg，也未见到任何肿瘤易发倾向。各种突变研究没有发现双氯芬酸钠诱发基因突变。给大鼠用药每日 4mg/kg，雌雄均未发生不育。

【药代动力学】口服吸收快，完全。与食物同服降低吸收率。血药浓度空腹服药平均 1～2 小时达峰值，与食物同服时 6 小时达峰值，血浆浓度降低。药物半衰期约 2 小时。血浆蛋白结合率为 99%。表观分布容积 0.1～0.55L/kg。在乳汁中药浓度极低而可忽略，在关节滑液中，服药 4 小时，其水平高于当时血清水平并可维持 12 小时。大约 50%在肝脏代谢，40%～65%从肾排出，35%从胆汁，粪便排出 1.2～2 小时排泄完。长期应用无蓄积作用。

【药物相互作用】

1. 饮酒或与其他非甾体抗炎药同用时增加胃肠道不良反应，并有致溃疡的危险。长期与对乙酰氨基酚同用时可增加对肾脏的毒性及不良反应。

2. 与肝素、双香豆素等抗凝药及血小板聚集抑制药同用时有增加出血的危险。

3. 与保钾利尿药同用时可引起高钾血症。

4. 与维拉帕米、硝苯地平同用时，本品的血药浓度增高。

5. 本品可增高地高辛、锂制剂的血浓度，同用时须注意调整地高辛、锂制剂的剂量。

6. 本品与抗糖尿病药同用时，可影响后者的疗效，故需慎重考虑。

7. 本品与抗高血压药同用时可影响后者的降压效果。

8. 本品可降低甲氨蝶呤的排泄，增高其血浓度，甚至可达中毒水平，故本品不应与中或大剂量甲氨蝶呤同用。

9. 本品与环孢霉素合用时，可增加后者的毒性。

【药物过量】药物过量时应采用下列治疗措施：应尽快采取洗胃和活性炭处理，以阻止其进一步被吸收。对并发症，例如血压过低、肾衰竭、惊厥、胃肠刺激、呼吸抑制，应进行支持治疗和对症治疗。

【不良反应】

1. 偶见上腹部疼痛以及恶心、呕吐、腹泻、腹部痉挛、消化不良、腹部胀气、畏食。罕见胃肠道出血、呕血、黑便、胃肠道溃疡、穿孔、出血性腹泻。

2. 偶见头痛、头晕、眩晕。罕见困睡。

3. 偶见皮疹。罕见荨麻疹。

4. 偶见血清转氨酶（AST，ALT）升高，罕见肝炎。

5. 罕见过敏反应，如哮喘等。

6. 罕见水肿。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
双氯芬酸钾分散片	化学药	HZ003236
双氯芬酸钾胶囊	化学药	HZ003237
双氯芬酸钾凝胶	化学药	HZ003238
双氯芬酸钾喷雾剂	化学药	HZ003239
双氯芬酸钾片	化学药	HZ003240

HY001788 双氯芬酸钠

【其他名称】Olfen、双氯灭痛

【外文名称】Diclofenac Sodium

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】2－［（2,6－二氯苯基）氨基］苯乙酸钠

【分子式】$C_{14}H_{10}Cl_2NNaO_2$

【分子量】318.13

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末；有刺鼻感与引湿性。本品在乙醇中易溶，在水中略溶，在三氯甲烷中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：消炎镇痛非甾体抗炎药。

双氯芬酸钠是一种衍生于苯乙酸类的非甾体消炎镇痛药，其作用机制为抑制环氧化酶活性，从而阻断花生四烯酸向前列腺素的转化。同时，它也能促进花生四烯酸与甘油三酯结合，降低细胞内游离的花生四烯酸浓度，而间接抑制白三烯的合成。在动物试验和人的临床实践中都证实本品有解热作用。双氯芬酸钠是非甾体消炎药中作用较强的一种，它

对前列腺素合成的抑制作用强于阿司匹林和消炎痛等。

急性毒性试验结果：大鼠经口 LD_{50}为 150mg/kg；小鼠经口 LD_{50}为 390mg/kg。非临床毒理研究：给大鼠口服双氯芬酸钠达一日 2mg/kg，长期观察，没有发现肿瘤发生率增加。一项对小鼠二年的研究中，每日用药 2mg/kg，也未见到任何肿瘤易发倾向。各种突变研究没有发现双氯芬酸钠诱发基因突变。给大鼠用药一日 4mg/kg，雌雄均未发生不育。

动物实验证实，前列腺素是引起眼内炎症的介质之一，能导致血－房水屏障崩溃、血管扩张、血管通透性增加、白细胞趋化、非胆碱能机制性瞳孔缩小等。双氯芬酸钠滴眼液对机械、化学、生物等刺激引起的血－房水屏障崩溃有较强的抑制作用。临床研究显示，0.1%双氯芬酸钠治疗白内障术后炎症，可降低前房的闪辉和细胞数；应用于角膜放射状切开术或激光屈光角膜切削术的病人，能缓解术后疼痛和畏光，优于安慰剂。

【药代动力学】口服吸收快，完全。与食物同服降低吸收率。血药浓度空腹服药平均 1～2 小时达峰值，与食物同服时 6 小时达峰值，血浆浓度降低。药物半衰期约 2 小时。血浆蛋白结合率为 99%。在乳汁中药浓度极低而可忽略，按每隔 8 小时口服 50mg 的剂量给药，本品活性物质进入乳汁的量非常少，不会对婴儿产生不良影响。在关节滑液中，服药 4 小时，其水平高于当时血清水平并可维持 12 小时。大约 50% 在肝脏代谢，40%～65% 从肾排出，35%从胆汁，粪便排出，1.2～2 小时排泄完。长期应用无蓄积作用。

缓释口服药在约 4 小时后血药浓度达峰值，表观分布容积 0.12～0.55L/kg。药物半衰期约 2 小时。血浆蛋白结合率为 99%。在乳汁中药浓度极低而可忽略，表现分布容积 0.12～55L/kg。

直肠给药吸收快、完全。0.5～2 小时可达峰值。药物半衰期约 2 小时。血浆蛋白结合率为 99%。在乳汁中药浓度极低而可忽略，在关节滑液中，用药 4 小时，其水平高于当时血清水平并可维持 12 小时。

给人 0.1% 双氯芬酸钠 50ml 滴眼后，10 分钟在房水中即可检测到药物，2.4 小时达到高峰值，为 82 ng/ml；浓度保持在 20 ng/ml 以上的持续时间超过 4 个小时，而维持在 3～16ng/ml 水平可超过 24 小时；房水平均药物滞留时间为 7.4 小时。如果一次滴眼多滴，房水药物水平将增加，达峰时间可提前至 1 小时左右。给人两眼同时滴 0.1%双氯芬酸钠各二滴后，4 个小时内未检测到血浆内药物（最低检测限为 10ng/ml），表明药物滴眼后的全身吸收是非常有限的。

本品肌注后，血浆蛋白结合率为 99.5%，大约 50%在肝脏代谢，40%～65%从肾脏排出，35%从胆汁、粪便排出。

【药物相互作用】

1. 饮酒或与其他非甾体抗炎药同用时增加胃肠道不良反应，并有致溃疡的危险。长期与对乙酰氨基酚同用时可增加对肾脏的毒性及不良反应。

2. 与阿司匹林或其他水杨酸类药物同用时，药效不增强，而胃肠道不良反应及出血倾向发生率增高。

3. 与肝素、双香豆素等抗凝药及血小板聚集抑制药同用时有增加出血的危险。

4. 与呋塞米同用时，后者的排钠和降压作用减弱。

5. 与维拉帕米、硝苯啶同用时，本品的血药浓度增高。

6. 本品可增高地高辛的血浓度，同用时须注意调整地高辛的剂量。

7. 本品可增强抗糖尿病药（包括口服降糖药）的作用。

8. 本品与抗高血压药同用时可影响后者的降压效果。

9. 丙磺舒可降低本品的排泄，增加血药浓度，从而增加毒性，故同用时宜减少本品剂量。

10. 本品可降低甲氨蝶呤的排泄，增高其血浓度，甚至可达中毒水平，故本品不应与中或大剂量甲氨蝶呤同用。

11. 本品可降低胰岛素和其他降糖药作用，使血糖升高。

12. 与保钾利尿药同用时可引起高钾血症，所以有必要监测血钾。

13. 阿司匹林可降低本品的生物利用度。

14. 与锂剂或地高辛制剂合用时，双氯芬酸可能会增高他们的血浓度。

15. 与某些非甾体抗炎药或糖皮质激素类药，全身性合并用药时，可能会增加不良反应的发生。

【药物过量】药物过量时应采用下列治疗措施：应尽快采取洗胃和活性炭处理，以阻止其进一步被吸收。对并发症，例如血压过低、肾衰竭、惊厥、胃肠刺激、呼吸抑制，应进行支持治疗和对症治疗。

【不良反应】

1. 胃肠反应：为最常见的不良反应，约见于 10%服药者，主要为胃不适、烧灼感、反酸、纳差、恶心等，停药或对症处理即可消失。其中少数可出现溃疡、出血、穿孔。

2. 神经系统表现有头痛、眩晕、嗜睡、兴奋等。

3. 引起水肿、少尿，电解质紊乱等不良反应，轻者停药并相应治疗后可消失。

4. 其他少见的有血清转氨酶一过性升高，极个别出现黄疸、皮疹、心律不齐、粒细胞减少、血小板减少等，停药后均可恢复。

5. 滴眼有短暂烧灼、刺痛、流泪等，极少数可有结膜充血、视物模糊。不足3%患者可出现乏力、困倦、恶心等全身反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方双氯芬酸钠注射液	化学药	HZ001380
氯芬待因片	化学药	HZ002476
氯酚黄敏片	化学药	HZ002477
双氯芬酸钠搽剂	化学药	HZ003241
双氯芬酸钠肠溶片	化学药	HZ003242
双氯芬酸钠滴眼液	化学药	HZ003243
双氯芬酸钠缓释胶囊	化学药	HZ003244
双氯芬酸钠缓释片	化学药	HZ003245
双氯芬酸钠缓释微丸	化学药	HZ003246
双氯芬酸钠利多卡因注射液	化学药	HZ003247
双氯芬酸钠凝胶	化学药	HZ003248
双氯芬酸钠喷雾剂	化学药	HZ003249
双氯芬酸钠片	化学药	HZ003250
双氯芬酸钠气雾剂	化学药	HZ003251
双氯芬酸钠乳膏	化学药	HZ003252
双氯芬酸钠栓	化学药	HZ003253
双氯芬酸钠双释放肠溶胶囊	化学药	HZ003254
双氯芬酸钠注射液	化学药	HZ003255
注射用双氯芬酸钠盐酸利多卡因	化学药	HZ004958

HY001789 双氯西林

【其他名称】双氯苯异噁唑青霉素、双氯苯唑青霉素、双氯青霉素、Veracillin

【外文名称】Dicloxacillin

药物药理信息

【药理毒理】本品为半合成青霉素，抗菌谱与氯苯唑青霉素相似，其血浓度和血清蛋白结合率较高。主要用于对青霉素耐药的葡萄球菌感染，包括败血症、心内膜炎、骨髓炎、呼吸道感染及创面感染等。

【药代动力学】空腹口服或肌注30分钟～1小时就能达到高浓度血药峰。毒性低，与血清蛋白结合率为94%。

【不良反应】常有过敏反应，如皮疹、荨麻疹、痒疹等；偶有恶心、呕吐、食欲减退、腹胀、腹泻、转氨酶升高等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
阿莫西林双氯西林胶囊	化学药	HZ000046
阿莫西林双氯西林钠片	化学药	HZ000047

HY001790 双嘧达莫

【其他名称】Agacore、Anginal、Apricor、Cardioflux、Cleridium、Coribon、Coronarine、Coroxin、Dipramol、Dipyrida、Functiocardon、Novodil、哌醇定、Peridamol、Persantin、Prandiol、潘生丁、双嘧啶胺醇、Stenocardil、Stenocor、Stimolcardil

【外文名称】Dipyridamole

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】2,2′,2″,2‴－［(4,8－二哌啶基嘧啶并［5,4－d］嘧啶－2，6－二基）双次氮基］－四乙醇

【分子式】$C_{24}H_{40}N_8O_4$

【分子量】504.63

【性状及组成】本品为黄色结晶性粉末；无臭；味微苦。本品在三氯甲烷中易溶，在乙醇中溶解，在丙酮中微溶，在水中几乎不溶；在稀酸中易溶。

熔点：本品的熔点为162～168℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗血小板聚集药、冠状动脉扩张药。

具有抗血栓形成作用。双嘧达莫抑制血小扳聚集，高浓度（50μg/ml）可抑制血小板释放。作用机制可能为①抑制血小板、上皮细胞和红细胞摄取腺苷，治疗浓度（0.5～1.9μg/dl）时该抑制作用成剂量依赖性。局部腺苷浓度增高，作用于血小板的A2受体，刺激腺苷酸环化酶，使血小板内环磷酸腺苷（cAMP）增多。通过这一途径，血小板活化因子（PAF）、胶原和二磷酸腺苷（ADP）等刺激引起的血小板聚集受到抑制。②抑制各种组织中的磷酸二酯酶（PDE）。治疗浓度抑制环磷酸鸟苷磷酸二酯酶（cGMP－PDE），对cAMP－PDE的抑制作用弱，因而强化内皮舒张因子（EDRF）引起的cGMP浓度增高。③抑制血栓烷素A2（TXA2）形成，TXA2是血小板活性的强力激动剂。④增强内源性PGI2的作用。

双嘧达莫对血管有扩张作用。犬经十二指肠给予双嘧达莫0.5～4.0 mg/kg产生剂量相关性体循环

和冠状血管阻力降低，体循环血压降低和冠脉血流增加。给药后24分钟起效，作用持续约3小时。在人观察到相同的血流动力学效应。但急性静脉给药可使狭窄冠脉远端局部心肌灌注减少。

在小鼠111周和大鼠128～142周口服试验中，8、25和75 mg/kg（1、3.1和9.4倍于人一日最大推荐剂量）双嘧达莫未产生明显致癌效应。致突变试验的结果为阴性。大鼠生殖试验使用60倍于人每日最大推荐剂量双嘧达莫，未显示生殖受损的证据。但在115倍于人一日最大推荐剂量时，黄体数量明显减少，活胎种植减少。小鼠、大鼠和兔试验未显示双嘧达莫损害胎儿的证据。

小鼠口服LD_{50}为2150mg/kg；单次口服致死量在大鼠为6000mg/kg，在犬为350mg/kg。

【药代动力学】口服吸收迅速，平均达峰浓度时间约75分钟，血浆半衰期为2～3小时。与血浆蛋白结合率高。在肝内代谢，与葡萄糖醛酸结合，从胆汁排泌。

缓释胶囊口服后血浆浓度达峰时间约2小时，血浆稳态峰浓度为1.98μg/ml（1.01～3.99μg/ml），稳态谷浓度为0.53 μg/ml（0.18～1.01μg/ml）与血浆蛋白结合率为99%，半衰期约为12小时。在肝内代谢，与葡萄糖苷酸结合后从胆汁排泌。

【药物相互作用】与阿司匹林有协同作用。与肝素合用可引起出血倾向。与双香豆素类抗凝药同用时出血并不增多或增剧。

【药物过量】如果发生低血压，必要时可用升压药。急性中毒症状在啮齿动物有共济失调、运动减少和腹泻，在狗中有呕吐、共济失调和抑郁。双嘧达莫与血浆蛋白高度结合，透析可能无益。

【不良反应】治疗剂量时不良反应轻而短暂，长期服用最初的副作用多消失。常见的不良反应有头晕，头痛、呕吐、腹泻、脸红，皮疹和瘙痒，罕见心绞痛和肝功能不全。不良反应持续或不能耐受者少见，停药后可消除。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
阿司匹林双嘧达莫缓释胶囊	化学药	HZ000082
阿司匹林双嘧达莫缓释片	化学药	HZ000083
阿司匹林双嘧达莫片	化学药	HZ000084
双嘧达莫缓释胶囊	化学药	HZ003256
双嘧达莫氯化钠注射液	化学药	HZ003257
双嘧达莫片	化学药	HZ003258
双嘧达莫注射液	化学药	HZ003259

续表

制剂名称	类别	序号
注射用双嘧达莫	化学药	HZ004959
银杏达莫注射液	中成药	ZC007010
注射用银杏达莫	中成药	ZC007522

HY001791　双羟萘酸奥克太尔

【其他名称】酚嘧啶、间酚嘧啶、Meta－Oxantel、P1445、Telopar

【外文名称】Oxantel Pamoate

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第11册

药物理化信息

【化学名】反式－间位－［2－（1,4,5,6－四氢－1－甲基－2－嘧啶基）乙烯基］酚的4,4′－甲撑－双（3－羟基－2－萘酸）盐

【分子式】$C_{13}H_{16}N_2O \cdot C_{23}H_{16}O_6$

【性状及组成】本品为微黄色粉末；无臭，无味。

本品在二甲基亚砜中略溶。在水、甲醇、乙醇、三氯甲烷或二氧六环中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】为一疗效较好的驱鞭虫新药。动物急性及亚急性毒性试验证明，无明显毒性反应。

国内应用本品的不同剂量治疗鞭虫病患者423例，虫卵转阴率可达70%，疗效高于甲苯咪唑。

【不良反应】服药后少数病人有轻度头昏、恶心、腹痛及腹部不适感，多在服药后5～6小时出现，短时间（2～3小时后）内可自行消失。个别病人有较轻的心电图变化，亦可自行恢复。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
酚嘧啶片	化学药	HZ000931

HY001792　双羟萘酸噻嘧啶

【其他名称】Antiminth、驱虫灵、双羟萘酸噻吩嘧啶

【外文名称】Pyrantel Pamoate

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】（*E*）－1,4,5,6－四氢－1－甲基－2－［2－（2－噻吩基）乙烯基］嘧啶－4,4′－亚甲基

-双（3-羟基-2-萘甲酸盐）

【分子式】 $C_{11}H_{14}N_2S \cdot C_{23}H_{16}O_6$

【分子量】 594.68

【性状及组成】 本品为淡黄色粉末；无臭，无味。

本品在二甲基甲酰胺中略溶，在乙醇中极微溶解，在水中几乎不溶。

吸收系数：避光操作。取本品约 20mg，精密称定，加二氧六环-0.1%浓氨溶液（1∶1）8ml 使溶解，加盐酸溶液（9→1000）稀释至 100ml，摇匀，滤过，精密量取续滤液 5ml，用盐酸溶液（9→1000）稀释至 50ml，照紫外-可见分光光度法，在 311nm 的波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为 302～324。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：驱肠虫药。

本品为一合成的广谱、高效驱肠虫药。本品是去极化神经肌肉阻滞剂，具有明显的烟碱样活性，也能抑制胆碱酯酶，使乙酰胆碱堆积，导致虫体痉挛性麻痹而排出体外；另外，它可使虫体单个细胞去极化，峰电位发放频率增加，肌张力亦增加，使虫体失去自主活动。与哌嗪不同的是其作用快，先显著收缩，其后麻痹不动。

【药代动力学】 口服很少吸收。口服后 1～3 小时血药浓度达峰值，一次口服 11mg/kg 时，血药峰值为 0.05～0.13mg/L。50%～75%以上以原形药由粪便排出，约 7%以原形药从胆管及尿中排出。

【药物相互作用】 本品与哌嗪类相互拮抗，不能合用。

【药物过量】 在过量服用后数小时内催吐及洗胃。

【不良反应】 口服本品仅于大剂量时才表现出毒性，治疗剂量时毒性很低，发生率约 17%，可有恶心、呕吐、食欲减退、腹痛和腹泻等消化道症状，少数病人发生头痛、眩晕、嗜睡、胸闷、皮疹等，一般为时短暂，可以忍受，不需处理，偶有门冬氨酸氨基转移酶升高者。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方阿苯达唑片	化学药	HZ001017
双羟萘酸噻嘧啶宝塔糖	化学药	HZ003264
双羟萘酸噻嘧啶颗粒	化学药	HZ003265
双羟萘酸噻嘧啶片	化学药	HZ003266
双羟萘酸噻嘧啶软膏	化学药	HZ003267
双羟萘酸噻嘧啶栓	化学药	HZ003268

HY001793 双氢吗啡

【外文名称】 Dihydromorphine

药物管理信息

【特殊管理分类】 麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】 国食药监安［2007］633 号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY001794 双氢青蒿素

【外文名称】 Dihydroartemisinin

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 （3*R*，5a*S*，6*R*，8a*S*，9*R*，12*S*，12a*R*）-八氢-3,6,9 三甲基-3,12-桥氧-12H-吡喃并［4,3-*j*］-1,2-苯并二塞平-10（3*H*）醇

【分子式】 $C_{15}H_{24}O_5$

【分子量】 284.35

【性状及组成】 本品为白色针状结晶；无臭，味苦。

本品在三氯甲烷中易溶，在丙酮中溶解，在甲醇或乙醇中略溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 145～150℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：抗疟药。

1. 药理学：本品为青蒿素的衍生物对疟原虫红内期有强大且快速的杀灭作用，能迅速控制临床发作及症状。青蒿素的作用机制尚不十分清楚，主要是干扰疟原虫的表膜一线粒体功能。青蒿素通过影响疟原虫红内期的超微结构，使其膜系结构发生变化。由于对食物泡膜的作用，阻断了疟原虫的营养摄取，当疟原虫损失大量胞浆和营养物质，而又得不到补充，因而很快死亡。其作用方式是通过其内过氧化物（双氧）桥，经血红蛋白分解后产生的游离铁所介导，产生不稳定的有机自由基及（或）其他亲电子的中介物，然后与疟原虫的蛋白质形成共价加合物，而使疟原虫死亡。蒿甲醚的抗疟活性较青蒿素大 6 倍。

2. 毒理学：在动物生殖毒性方面的研究证明，小鼠妊娠感应期给药，能增加胚胎吸收，但未见致畸作用。

【药代动力学】 口服吸收良好，起效迅速。口服

双氢青蒿素 2mg/kg 后，1.33 小时血药浓度达峰值，最大血浓度为 0.71mg/L。血浆 $t_{1/2}$为 1.57 小时。体内分布广，排泄和代谢迅速。

【不良反应】推荐剂量未见不良反应，少数病例有轻度网织红细胞一过性减少。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方双氢青蒿素片	化学药	HZ001382
双氢青蒿素哌喹片	化学药	HZ003272
双氢青蒿素片	化学药	HZ003273

HY001795　双炔失碳酯

【外文名称】Anorethidrane Dipropionate

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 5 册

药物理化信息

【化学名】雄甾烷 - A - 失碳 - 2a，17a - 双乙炔基 - 2β，17β - 二醇双丙酸酯

【分子式】$C_{28}H_{38}O_4$

【分子量】438.66

【性状及组成】本品为白色或微黄色的结晶性粉末；无臭，无味。

本品在三氯甲烷或乙醚中易溶，在乙醇中溶解，在水中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为雄甾烷 A 环上失一碳原子成环戊烷的双丙酸酯双乙炔基化合物。具有抗着床作用的口服避孕药，并无孕激素活性。能促使子宫内膜与受精卵发育不同步，影响受精卵在输卵中的运行和发育，造成不利于着床。还有推迟排卵及抗早孕作用。特点是毋需每天服药，仅于房事后女方立即服药，即可避孕。

【不良反应】

1. 服药初期常见有恶心、呕吐、头晕、乏力、嗜睡等类早孕反应，必要时可对症处理，每日服用 20mg 维生素 B_6 或 100mg 维生素 C。偶有阴道出血、白带增多、乳胀、乳头发深色、腹胀、食欲减退、口干等不良反应。

2. 少数人月经周期、经量有不同程度改变。对月经周期延长或闭经者，可加服甲孕酮 25mg 和炔雌醇 0.015mg。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方米非司酮片	化学药	HZ001319
复方双炔失碳酯肠溶片	化学药	HZ001383

HY001796　双水杨酯

【其他名称】Dinuclan、Diplosal、Disalcid、Nobacid、Salysal、双水杨酸、双水杨酸酯

【外文名称】Salsalate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】2 - 羟基苯甲酸 - 2 - 羧基苯酯

【分子式】$C_{14}H_{10}O_5$

【分子量】258.22

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；无臭，味微苦。本品在乙醇或乙醚中易溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 140 ~ 146℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：消炎镇痛非甾体抗炎药。

本品属非乙酰化水杨酸。抗炎、镇痛作用类似阿司匹林，但不具有抑制血小板聚集的作用。

【药代动力学】口服后不溶于胃液，但溶于小肠液中，并在肠道内逐渐分解出二分子水杨酸而起治疗作用。

【药物相互作用】

1. 双水杨酯可加强磺酰脲类药品的降血糖作用；并能由蛋白质的结合部位置换甲氨蝶呤，故与这类药物合用时应降低后者的剂量。

2. 与抗凝血药（肝素钠、华法林钠）合用应密切注意凝血反应。

【不良反应】本品对胃刺激性较阿司匹林为小，与其他非甾体抗炎药发生交叉过敏反应较阿司匹林为低。大剂量与口服抗凝药合用时，有发生出血的可能性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
双水杨酯片	化学药	HZ003274

HY001797　双香豆素

【其他名称】败坏翘摇素、Bishydroxycoumarin、Dicoumarin

【外文名称】Dicoumarol

药物理化信息

【化学名】3,3′－亚甲基双［4－羟基－2*H*－1－苯并吡喃－2－酮］

【分子式】$C_{19}H_{12}O_6$

【分子量】336.31

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末；微有佳香，味微苦。本品在水、乙醇或乙醚中几乎不溶，在三氯甲烷中微溶；在强碱溶液中溶解。

药物药理信息

【药理毒理】本品为人工合成的抗凝血药物。其抗凝血作用与肝素不同，主要与维生素K发生可逆性竞争，抑制依赖维生素K的Ⅱ、Ⅶ、Ⅸ、Ⅹ凝血因子在肝细胞中的合成，使凝血酶原含量降低，防止血栓的形成。由于本品对已合成的凝血因子无直接作用，故起效缓慢，一般口服给药后3～5天作用达高峰；又由于本品停用后须待凝血因子恢复到一定水平后作用才消失，故在低凝血酶原血症出现时停药，作用仍可维持2～10天。本品还能降低凝血酶诱导的血小板聚集反应，但无体外抗凝血作用。

【药代动力学】口服吸收慢，不规则、不完全，并受食物影响。药物与血浆蛋白结合率高达90%～99%。主要在肝内缓慢代谢，其代谢物经肾排泄。本品能通过胎盘，并出现于乳汁中。血浆消除$t_{1/2}$为24～100小时，与剂量有关，剂量越大，$t_{1/2}$越长。

【药物相互作用】本品与保泰松、水杨酸类、羟基保泰松、吲哚美辛、对氨基水杨酸、甲芬那酸、氯苯丁酯、水合氯醛、奎宁、奎尼丁、同化激素、氯霉素、四环素类、磺胺类、甲磺丁脲、氯贝丁酯、考来烯胺合用时，因竞争血浆蛋白结合，使本品血中游离型增加，增强了本品的抗凝血作用，增加出血倾向。本品与导眠能、灰黄霉素、苯巴比妥、苯妥英钠、利福平、维生素K、口服避孕药、肾上腺皮质激素、雌激素等合用时，因肝药酶活性被诱导，增加本品降解，故降低本品的疗效，应调整本品的用量。

【药物过量】本品过量引起自发性出血时，可用维生素K对抗之；大出血时，立即输血，可迅速得到控制。

【不良反应】过量易致出血，最常见的是无症状的血尿、瘀斑、鼻衄、齿龈出血和咯血。个别病人可出现头昏、恶心、腹泻、皮肤过敏反应、严重持续性头疼、腹疼、背疼。长期服用如突然停药，部分病人于1～3个月内可加重冠状动脉闭塞及栓塞形成。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
双香豆素片	化学药	HZ003275

HY001798 水飞蓟宾

【其他名称】Hepagerina、Laragon、利肝隆（Lagalon）、利肝素、奶蓟素、Sematron、水飞蓟素（Silybin Silymarin）、水飞蓟总黄酮、Silgen、Silibancol、Silimarin、Siliver、Silybin、Silymarin、Silymarn、西利宾胺、西利马林、益肝灵

【外文名称】Silibinin

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第55册

药物理化信息

【化学名】2α－［2,3－反式－2,3－二氢－3－(4－羟基－3－甲氧基苯基）－2－羟甲基－1,4－苯并二氧六环－6－基］－2,3－二氢－3β,5,7－三羟基－4*H*－1－苯并吡喃－4－酮－水合物

【分子式】$C_{25}H_{22}O_{10}\cdot H_2O$

【分子量】500.47

【性状及组成】本品为类白色或淡黄色的粉末，无臭，无味。

本品在丙酮中微溶，在甲、乙醇中极微溶，在水、三氯甲烷或正己烷中几乎不溶，在0.1mol/L氢氧化钠溶液中微溶，在稀盐酸中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为181～185℃，熔融时同时分解。

比旋度：取本品适量（约100mg）置10ml量瓶中，加丙酮适量，超声使溶解，加丙酮稀释至刻度，依法测定，比旋度应为+5°至+15°。

药物药理信息

【药理毒理】水飞蓟宾能够稳定肝细胞膜，保护肝细胞的酶系统，清除肝细胞内的活性氧自由基，从而提高肝脏的解毒能力，避免肝细胞在长期接触毒物、服用肝毒性药物、吸烟、饮酒等情况下受到损伤。

1．药理：动物实验显示：本品可增高肝细胞的微粒体酶活性，加速肝的解毒能力；也可降低四氯化碳引起的大鼠血清谷－丙氨基转移酶增高作用；还可稳定四氯化碳、鬼笔碱、硫化乙酰胺、猪屎豆碱等肝脏毒物引起的各种类型的肝损伤的细胞膜，而达到明显的肝脏保护作用。

2．毒理：①小白鼠急性毒性试验的LD_{50}值口服未能测出。②狗的亚急性毒性试验：经口给药后，心、肺、肝、肾、胰、脾、肠、肾上腺等组织，均

未见显著的变化。

【药代动力学】据文献报道，健康人口服水飞蓟宾卵磷脂复合物360mg（以水飞蓟宾计）后，游离血药浓度峰值为298±96ng/ml，达峰时间为1.6±0.3小时，血中的平均残留时间为3.6±0.4小时，AUC（0~12小时）为：881±207ng/（ml·h）。

【不良反应】主要表现为轻微的胃肠道症状（恶心、呃逆）和胸闷等。妊娠、哺乳期妇女用药的安全性尚未确定。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
水飞蓟宾胶囊	化学药	HZ003280
水飞蓟宾片	化学药	HZ003281
水飞蓟素胶囊	化学药	HZ003283
胆宁片（1）	中成药	ZC000772
复方丹栀颗粒	中成药	ZC001326
复方益肝灵片	中成药	ZC001600
益肝灵胶囊	中成药	ZC006826
益肝灵片	中成药	ZC006827
益肝灵软胶囊	中成药	ZC006828

HY001799　水飞蓟宾葡甲胺

【外文名称】Silibinin－n－methylglucamine

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第10册

药物理化信息

【化学名】2－［2,3－Dihydro－2－（4－hydroxy－3－methoxyphenyl）－3－（hydroxymethyl）－1,4－benzodioxin－6－yl］－2,3－dihydro－3,5,7－trihydroxy－4H－1－benzopyran－4－one的葡甲胺盐

【分子式】$C_{32}H_{39}O_{15}N$

【分子量】677.66

【性状及组成】本品系水飞蓟宾与葡甲胺结合而成，为黄色无定形粉末；几乎无臭，味微苦带涩；有引湿性。

本品在水中溶解，在甲醇或乙醇中略溶，在丙酮中微溶，在三氯甲烷中极微溶解。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理：动物实验显示：本品可增高肝细胞的微粒体酶活性，加速肝的解毒能力；也可降低四氯化碳引起的大鼠血清谷－丙氨基转移酶增高作用；还可稳定四氯化碳、鬼笔碱、硫化乙酰胺、猪屎豆碱等肝脏毒物引起的各种类型的肝损伤的细胞膜，而达到明显的肝脏保护作用。

2．毒理：①小白鼠急性毒性试验的LD_{50}值口服未能测出。②狗的亚急性毒性试验：经口给药后，心、肺、肝、肾、胰、脾、肠、肾上腺等组织，均未见显著的变化。

【不良反应】偶见有头晕，上腹部不适等反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
水飞蓟宾葡甲胺片	化学药	HZ003282

HY001800　水合氯醛

【其他名称】chloraldurat、Chloralete、Chloralum Hydratum、Dormal Chloradorm、含水氯醛、Kloralhydrat、氯氧水、Nycton、水化氯醛（Chlorali Hydras）、水合三氯乙醛、Somnos

【外文名称】Chloral Hydrate

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】2,2,2－三氯－1,1－乙二醇

【分子式】$C_2H_3Cl_3O_2$

【分子量】165.40

【性状及组成】本品为白色或无色透明的结晶；有刺激性特臭，味微苦；在空气中渐渐挥发。

本品在水中极易溶解，在乙醇、三氯甲烷或乙醚中易溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：催眠药、抗惊厥药。

本品为催眠药、抗惊厥药。催眠剂量30分钟内即可诱导入睡，催眠作用温和，不缩短REMS睡眠时间，无明显后遗作用。催眠机制可能与巴比妥类相似，引起近似生理性睡眠，无明显后作用。较大剂量有抗惊厥作用，可用于小儿高热、破伤风及子痫引起的惊厥。大剂量可引起昏迷和麻醉。抑制延髓呼吸及血管运动中枢，导致死亡。曾作为基础麻醉的辅助用药，现已极少应用。

【药代动力学】消化道或直肠给药均能迅速吸收，1小时达高峰，维持4~8小时。脂溶性高，易通过血脑屏障，分布全身各组织。血浆$t_{1/2}$为7~10小时。在肝脏迅速代谢成为具有活性的三氯乙醇。三氯乙醇的蛋白结合率为35%~40%，三氯乙醇$t_{1/2}$约为4~6小时。口服水合氯醛30分钟内即能入睡，持续时间为4~8小时。三氯乙醇进一步与葡萄醛酸结合而失活，经肾脏排出，无滞后作用与蓄积性。本药可通过胎盘和分泌入乳汁。

【药物相互作用】

1. 中枢神经抑制药、中枢抑制性抗高血压药（如可乐定、硫酸镁、单胺氧化酶抑制药、三环类抗抑郁药）与本品合用时可使水合氯醛的中枢性抑制作用更明显。

2. 与抗凝血药同用时，抗凝效应减弱，应定期测定凝血酶原时间，以决定抗凝血药用量。

3. 服用水合氯醛后静注呋塞米注射液，可导致出汗、烘热（hotflashes）、血压升高。

【药物过量】可产生持续的精神错乱、吞咽困难、严重嗜睡、体温低、顽固性恶心、呕吐、胃痛、癫痫发作、呼吸短促或困难、心率过慢、心律失常、严重乏力，并可能有肝肾功能损害。4～5g可引起急性中毒。致死量为10g左右。中毒抢救：维持呼吸和循环功能，必要时行人工呼吸，气管切开。在因水合氯醛过量中毒的病人，用氟马西尼可改善清醒程度、扩瞳、恢复呼吸频率和血压。

【不良反应】

1. 对胃黏膜有刺激，易引起恶心、呕吐。

2. 大剂量能抑制心肌收缩力，缩短心肌不应期，并抑制延髓的呼吸及血管运动中枢。

3. 对肝、肾有损害作用。

4. 偶有发生过敏性皮疹，荨麻疹。

5. 长期服用，可产生依赖性及耐受性，突然停药可引起神经质、幻觉、烦躁、异常兴奋、瞻妄、震颤等严重撤药综合征。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
水合氯醛溶液	化学药	HZ003284
樟脑水合氯醛酊	化学药	HZ004648

HY001801 水解蛋白

【外文名称】Protein Hydrolysate

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第9册

【性状及组成】本品系以酸或酶水解卵蛋白、乳酪素或动物血浆蛋白而制得。

本品为白色或黄白色粉末，有特殊气味，露置空气中稍有引湿性，内含多种氨基酸。

药物药理信息

【药理毒理】成人一日需要食物蛋白1g/kg以维持体内氮的平衡。当重症感染、胃肠道外科手术、胃肠溃疡、肝胰疾病而致食物蛋白消化或吸收障碍时，或因肾病而致蛋白质大量排出体外时，均可出现氮的不平衡，产生低蛋白血症。

本品用于各种原因的蛋白质缺乏和衰弱患者以及对一般蛋白质消化吸收障碍的病例。用量视病情酌定。

【药物相互作用】

1. 禁与磺胺类药配伍。

2. 不能使用曾输过血浆的注射器具。

【不良反应】静脉滴注速度不可过快，每分钟30～40滴。如出现腹痛、抽搐、注射部位局部肿胀时应停药。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
口服水解蛋白	化学药	HZ002139
水解蛋白口服溶液	化学药	HZ003285
水解蛋白注射液	化学药	HZ003286
芪元益气补血口服液	中成药	ZC003870

HY001802 水溶性奥

【其他名称】奥磺酸钠、呱仑酸钠

药物理化信息

【化学名】1,4－二甲基－7－异丙奥－3－磺酸钠

【性状及组成】本品系深蓝色鳞片状结晶，无味，略有气味。易溶于水，不易溶于乙醇。

药物药理信息

【药理毒理】本品是菊科植物（春黄菊）的提取物，春黄菊是欧洲等地方的民间传统药物。该成分有极好的抗炎效果，可用来治疗各种疾病，包括胃溃疡和结膜炎。

近年研究发现其具有下述作用：抑制多种致炎物质引起的炎症，且作用较为持久；通过局部直接作用抑制炎性细胞释放组胺；增加黏膜内前列腺素E_2的合成，促进肉芽形成和上皮细胞新生；降低胃蛋白酶的活性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方谷氨酰胺颗粒	化学药	HZ001196

HY001803 水杨酸

【外文名称】Salicylic Acid

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】2－羟基苯甲酸

【分子式】 $C_7H_6O_3$

【分子量】 138.12

【性状及组成】 本品为白色细微的针状结晶或白色结晶性粉末；无臭或几乎无臭，味微甜，后转不适；水溶液显酸性反应。

本品在乙醇或乙醚中易溶，在沸水中溶解，在三氯甲烷中略溶，在水中微溶。

熔点：本品的熔点为 158～161℃。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：消毒防腐药。

本品浓度不同药理作用各异。1%～3%浓度具有角质促成作用，可使皮肤角质层恢复正常，同时有止痒作用；5%～10%具有角质溶解作用，通过溶解细胞间黏结物而减少角质层细胞间黏附，或通过降低角质层的 pH 而提高水合作用和软化作用导致角质松解而脱屑。≤0.3%水杨酸对革兰阳性和革兰阴性细菌及致病性酵母菌有抑菌作用，水杨酸的抗真菌作用由抑制真菌生长及去除角质层两方面产生。此外，浓度≥0.1%还有光保护作用。本品还能对其他药物的穿透性有帮助。

【药物相互作用】 本品与皮质类固醇合用可增加后者对皮肤的穿透力，从而增加疗效。本品与地蒽酚合用可增加后者的稳定性，防止地蒽酚氧化。本品与外用痤疮制剂或含有脱皮药物制剂如过氧化苯甲酰、雷琐辛或维 A 酸类等合用可引起或加重皮肤刺激作用。水杨酸遇铁呈紫色，遇铜呈绿色。多种金属离子能促使水杨酸氧化为醌式结构的有色物质，故本品的配制及贮存时，禁与金属器皿接触。

【药物过量】 如每日应用水杨酸软膏，治疗 5 天，虽然约 60%的水杨酸被吸收，但血清中水杨酸盐的水平不超过 50μg/ml，亦未显示毒性。但长期的大面积应用有增加水杨酸盐毒性的危险，当血清水平达到 300～400μg/ml 时，会出现全身的毒性反应。

【不良反应】 本品可引起接触性皮炎。大面积使用吸收后可出现水杨酸全身中毒症状，如头晕、神志模糊、呼吸急促、持续性耳鸣、剧烈或持续头痛。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方阿司匹林搽剂	化学药	HZ001020
复方苯甲酸酊	化学药	HZ001087
复方薄荷酊	化学药	HZ001098
复方薄荷柳酯搽剂	化学药	HZ001099
复方醋酸氟轻松酊	化学药	HZ001115
复方醋酸曲安奈德溶液	化学药	HZ001122

续表

制剂名称	类别	序号
复方地蒽酚软膏	化学药	HZ001129
复方呋喃西林散	化学药	HZ001164
复方间苯二酚水杨酸酊	化学药	HZ001228
复方联苯苄唑溶液	化学药	HZ001264
复方柳唑气雾剂	化学药	HZ001283
复方马勃水杨酸散	化学药	HZ001315
复方人参间苯二酚搽剂	化学药	HZ001359
复方珊瑚姜溶液尿素咪康唑软膏复合制剂	化学药	HZ001373
复方麝香草酚撒粉	化学药	HZ001374
复方水杨酸苯甲酸搽剂	化学药	HZ001385
复方水杨酸苯甲酸搽剂Ⅰ	化学药	HZ001386
复方水杨酸冰片软膏	化学药	HZ001387
复方水杨酸搽剂	化学药	HZ001388
复方水杨酸溶液	化学药	HZ001392
复方水杨酸土槿皮酊	化学药	HZ001393
复方水杨酸樟碘溶液Ⅰ	化学药	HZ001394
复方水杨酸樟碘溶液Ⅱ	化学药	HZ001395
复方土槿皮酊	化学药	HZ001413
复方五倍子水杨酸搽剂	化学药	HZ001432
复方氧化锌水杨酸散	化学药	HZ001468
复方紫荆皮水杨酸溶液	化学药	HZ001488
鞣柳硼三酸散	化学药	HZ003087
水杨酸苯酚贴膏	化学药	HZ003287
水杨酸苯甲酸松油搽剂	化学药	HZ003288
水杨酸苯佐卡因软膏	化学药	HZ003289
水杨酸复合洗剂	化学药	HZ003293
水杨酸凝胶	化学药	HZ003300
水杨酸软膏	化学药	HZ003301
水杨酸氧化锌软膏	化学药	HZ003302
小儿复方麝香草酚撒粉	化学药	HZ003759
氧化铅外用散	化学药	HZ004422
薄荷止痒酊	中成药	ZC000385
丁芎癣药水	中成药	ZC000894
妇洁舒洗液	中成药	ZC001183
复方苦参水杨酸散	中成药	ZC001425
华佗膏	中成药	ZC002212

续表

制剂名称	类别	序号
清凉止痒搽剂	中成药	ZC004115
珊瑚癣净	中成药	ZC004603
顽癣净	中成药	ZC005638
小儿清凉止痒酊	中成药	ZC006297
疣迪搽剂	中成药	ZC007050
止痒消炎水	中成药	ZC007396
足光散	中成药	ZC007622

HY001804 水杨酸毒扁豆碱

【外文名称】Physostigmine Salicylate

药物管理信息

【特殊管理分类】医疗用毒性药品

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第1册

药物理化信息

【化学名】1,2,3,3*a*－六氢－1,3*a*,8－三甲基吡咯并［2,3－*b*］吲哚－5－酚甲基氨基甲酸酯水杨酸盐

【分子式】$C_{15}H_{21}N_3O_2 \cdot C_7H_6O_3$

【分子量】413.47

【性状及组成】本品为无色或微带淡黄色、有光泽的结晶或粉末；无臭，味苦；长时间遇空气与日光渐变为淡红色。

本品在三氯甲烷中易溶，在乙醇中溶解，在水中略溶，在乙醚中极微溶解。

熔点：本品的熔点为184～187℃，熔融时同时分解。

比旋度：取本品精密称定，加水制成每1ml中含10mg的溶液，依法测定，比旋度为－91°至－94°。

药物药理信息

【药理毒理】本品能可逆性地抑制胆碱脂酶，使胆碱能神经末梢所释放的乙酰胆碱免遭此酶的水解，从而表现为乙酰胆碱的毒蕈碱样和烟碱样作用。局部点眼能缩小瞳孔，降低眼压，收缩睫状肌而引起调节痉挛等。作用较毛果芸香碱强而持久，但刺激性较大。又由于收缩睫状肌的作用较强，可引起眼痛、头痛。对去除副交感神经支配的组织，本品丧失其原有作用。

本品注射给药的致死量为6～10 mg，致死原因主要为呼吸麻痹。小鼠腹腔注射LD_{50}为0.64mg/kg。

【药代动力学】本品口服及注射都易吸收，在外周出现拟胆碱作用，也易透过血－脑脊液屏障。对中枢神经系统，小剂量兴奋，大剂量抑制。大部分在体内为胆碱酯酶水解，经肾排出量很少。一次皮下注射剂量的大部分在2小时内被破坏，仅小部分以原形从尿液排出。

本品点眼后5～10分钟即出现缩瞳、降眼压，4小时达作用最大值，有时作用可维持约一天。

【药物过量】本品过量引起“胆碱能危象”，有出汗、流泪、大小便失禁、瞳孔缩小、睫状肌痉挛、心动过缓、低血压等征状，重者可因呼吸衰竭死亡。重症肌无力病人药物过量所致“胆碱能危象”，常以肌无力症状加剧为主，其他症状较轻。口服本品6mg和静脉注射1.2mg以后曾有死亡者。

【不良反应】主要表现为胆碱能神经过度兴奋的症状，流涎、恶心、呕吐、腹痛、腹泻等，可用阿托品对抗。

本品点眼后可引起眼睑痉挛，药物通过皮肤吸收使眼睑内胆碱酯酶灭活和调节痉挛均引起此不良反应。年青人及儿童更常见。

睫状肌痉挛性头痛、眼痛、睫状体充血甚为常见。此外尚有调节痉挛性近视。长期用药偶见接触性过敏皮炎。

本品点眼后引起全身毒性反应极罕见，偶见流涎、流泪、出汗、恶心、呕吐、腹痛、细支气管痉挛、血压下降等全身毒性反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
水杨酸毒扁豆碱眼膏	化学药	HZ003290
水杨酸毒扁豆碱注射液	化学药	HZ003291

HY001805 水杨酸二乙胺

【其他名称】二乙胺水杨酸

【外文名称】Diethylamine Salicylate

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】2－羟基苯甲酸二乙胺盐

【分子式】$C_{11}H_{17}NO_3$

【分子量】211.26

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；无臭，味甜微苦；有引湿性。

本品在水中极易溶解，在乙醇、三氯甲烷或丙酮中易溶，在乙醚中微溶。

熔点：本品的熔点为99～102℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：消炎镇痛药。

本品为前列腺素合成抑制剂、具有抗炎、镇痛作用。局部应用其有效成分可穿透皮肤到达炎症区域，缓解急、慢性炎症反应，对因外伤或风湿病引起的炎症，本品可使疼痛缓解。

【不良反应】本品软膏涂擦过多时可出现皮肤痛痒、脱屑。停药后可自行消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方七叶皂苷钠凝胶	化学药	HZ001341
七叶皂苷二乙胺水杨酸凝胶	化学药	HZ002928
水杨酸二乙胺乳膏	化学药	HZ003292

HY001806　水杨酸甲酯

【其他名称】冬绿油、冬青油、柳酸甲酯、Methylsalicylate、Winter Greenoil

【外文名称】Methyl Salicylate

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第1册

药物理化信息

【化学名】2－羟基苯甲酸甲酯

【分子式】$C_8H_8O_3$

【分子量】152.15

【性状及组成】本品为无色或带淡黄色的液体；有特殊的香气，味甜而辣。

本品与乙醇或冰醋酸能任意混合，在水中微溶。

相对密度：本品的相对密度在25℃时为1.180～1.185。

沸程：本品的沸程为218～224℃，沸腾时部分分解。

折光率：本品的折光率为1.5360～1.5380。

药物药理信息

【药理毒理】药用作用类别：外用局部发赤剂。具有局部刺激作用，可促进局部血液循环，外用或局部涂擦可产生皮肤血管扩张，肤色发红等刺激反应，并反射性地影响相应部位的皮肤、肌肉、神经及关节，借以消肿、消炎和镇痛，亦有止痒之效。

【不良反应】局部涂擦的时间不宜过长，一般以皮肤发红为限，否则易发生水泡或破溃。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
冰樟桉氟轻松贴膏	化学药	HZ000419
复方薄荷柳酯搽剂	化学药	HZ001099

续表

制剂名称	类别	序号
复方薄荷脑鼻用吸入剂	化学药	HZ001100
复方薄荷脑软膏	化学药	HZ001101
复方达克罗宁薄荷溶液	化学药	HZ001124
复方磺胺氧化锌软膏	化学药	HZ001218
复方间苯二酚水杨酸酊	化学药	HZ001228
复方辣椒碱乳膏	化学药	HZ001256
复方柳唑气雾剂	化学药	HZ001283
复方氢溴酸东莨菪碱贴膏	化学药	HZ001347
复方水杨酸苯胺甲酯乳膏	化学药	HZ001384
复方水杨酸搽剂	化学药	HZ001388
复方水杨酸甲酯苯海拉明喷雾剂	化学药	HZ001389
复方水杨酸甲酯薄荷脑油	化学药	HZ001390
复方水杨酸甲酯乳膏	化学药	HZ001391
复方水杨酸溶液	化学药	HZ001392
复方水杨酸土槿皮酊	化学药	HZ001393
复方硝酸咪康唑软膏	化学药	HZ001441
复方氧化锌软膏	化学药	HZ001467
复方樟脑乳膏	化学药	HZ001487
驱风油	化学药	HZ003048
双磺沙棘桉青软膏	化学药	HZ003230
水杨酸甲酯气雾剂	化学药	HZ003294
水杨酸氧化锌软膏	化学药	HZ003302
无极膏	化学药	HZ003600
樟脑薄荷柳酯乳膏	化学药	HZ004644
复方伤复宁膏	民族药	MZ000168
消肿橡胶膏	民族药	MZ000671
安阳精制膏	中成药	ZC000072
按摩乳	中成药	ZC000076
疤痕止痒软化膏	中成药	ZC000127
白花油	中成药	ZC000147
百花活血跌打膏	中成药	ZC000191
保济油	中成药	ZC000266
薄荷通吸入剂	中成药	ZC000384
跌打按摩药膏	中成药	ZC000859
跌打万花油	中成药	ZC000878
跌打镇痛膏	中成药	ZC000880
跌伤灵贴膏	中成药	ZC000884
冻可消搽剂	中成药	ZC000922

续表

制剂名称	类别	序号
风寒止痛膏	中成药	ZC001079
风湿伤痛膏	中成药	ZC001112
风痛灵	中成药	ZC001123
风油精	中成药	ZC001128
斧标驱风油	中成药	ZC001174
附桂风湿膏	中成药	ZC001259
复方丁香罗勒油	中成药	ZC001338
复方南星止痛膏	中成药	ZC001463
狗皮膏［改进型］	中成药	ZC001830
骨健灵膏	中成药	ZC001856
骨友灵巴布膏	中成药	ZC001877
骨友灵贴膏	中成药	ZC001879
关节解痛膏	中成药	ZC001913
关节炎膏	中成药	ZC001915
关节镇痛巴布膏	中成药	ZC001916
关节镇痛膏	中成药	ZC001917
关节止痛膏	中成药	ZC001918
归麻止痛膏	中成药	ZC001962
和兴白花油	中成药	ZC002097
黑鬼豆油	中成药	ZC002112
红花油	中成药	ZC002126
红药贴膏	中成药	ZC002139
黄花油	中成药	ZC002259
活络酊	中成药	ZC002320
活血镇痛膏	中成药	ZC002351
活血止痛膏	中成药	ZC002353
肩痹膏	中成药	ZC002440
接骨灵贴膏	中成药	ZC002593
解痉镇痛酊	中成药	ZC002634
金龙驱风油	中成药	ZC002716
金龙伤湿止痛膏	中成药	ZC002717
金牌风油精	中成药	ZC002726
筋骨宁膏	中成药	ZC002793
精制狗皮膏	中成药	ZC002829
均隆驱风油	中成药	ZC002925
克痒敏酯	中成药	ZC003074
岭南黑鬼油	中成药	ZC003275

续表

制剂名称	类别	序号
岭南万应止痛膏	中成药	ZC003276
岭南正红花油	中成药	ZC003277
罗浮山百草油	中成药	ZC003433
气管炎橡胶膏	中成药	ZC003902
清风油	中成药	ZC004055
清凉鼻舒吸入剂	中成药	ZC004105
清凉止痒搽剂	中成药	ZC004115
驱风保济油	中成药	ZC004233
祛风骨痛巴布膏	中成药	ZC004243
乳香风湿气雾剂	中成药	ZC004398
瑞草油	中成药	ZC004406
瑞花油	中成药	ZC004407
砂仁驱风油	中成药	ZC004563
山莨菪麝香膏	中成药	ZC004581
伤疖膏	中成药	ZC004612
伤科万花油	中成药	ZC004620
伤湿宝珍膏	中成药	ZC004624
伤湿解痛膏	中成药	ZC004626
伤湿祛痛膏	中成药	ZC004627
伤湿镇痛膏	中成药	ZC004629
伤湿止痛膏	中成药	ZC004630
伤痛宁膏	中成药	ZC004633
伤痛舒	中成药	ZC004636
少林跌打止痛膏	中成药	ZC004653
少林风湿跌打巴布膏	中成药	ZC004654
少林风湿跌打膏	中成药	ZC004655
麝香拔湿膏	中成药	ZC004689
麝香跌打风湿膏	中成药	ZC004691
麝香风湿跌打膏	中成药	ZC004693
麝香关节止痛膏	中成药	ZC004697
麝香海马追风膏	中成药	ZC004698
麝香祛风湿膏	中成药	ZC004707
麝香祛风湿油	中成药	ZC004708
麝香伤湿解痛膏	中成药	ZC004712
麝香心痛膏	中成药	ZC004718
麝香镇痛膏	中成药	ZC004721
麝香止痛贴膏	中成药	ZC004723

续表

制剂名称	类别	序号
麝香壮骨膏	中成药	ZC004725
麝香追风膏	中成药	ZC004727
麝香追风止痛膏	中成药	ZC004728
神农镇痛膏	中成药	ZC004943
沈阳红药贴膏	中成药	ZC004954
狮马龙活络油	中成药	ZC005047
十灵油	中成药	ZC005070
舒筋健络油	中成药	ZC005185
双灵油	中成药	ZC005265
双龙风湿跌打膏	中成药	ZC005267
四季油	中成药	ZC005319
损伤止痛膏	中成药	ZC005381
特制狗皮膏	中成药	ZC005422
天和追风膏	中成药	ZC005432
田七镇痛膏	中成药	ZC005479
脱苦膏	中成药	ZC005616
外伤止痛膏	中成药	ZC005630
外用跌打止痛膏	中成药	ZC005631
蜈蚣追风膏	中成药	ZC005823
香桂活血膏	中成药	ZC005982
香荷止痒软膏	中成药	ZC005985
消伤痛搽剂	中成药	ZC006089
消炎镇痛膏	中成药	ZC006128
小儿清凉止痒酊	中成药	ZC006297
新型狗皮膏	中成药	ZC006483
熊胆跌打膏	中成药	ZC006519
腰肾膏	中成药	ZC006735
叶绿油	中成药	ZC006763
一枝蒿伤湿祛痛膏	中成药	ZC006781
依马打正红花油	中成药	ZC006786
玉龙油	中成药	ZC007073
镇江橡胶膏	中成药	ZC007258
正红花油Ⅱ	中成药	ZC007282
止痛消炎软膏	中成药	ZC007372
壮骨麝香止痛膏	中成药	ZC007529
祖师麻关节止痛膏	中成药	ZC007625

HY001807　水杨酸镁

【其他名称】Analate

【外文名称】Magnesium Salicylate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】双（2－羟基苯甲酸－O^1,O^2）镁四水合物

【分子式】$C_{14}H_{10}MgO_6 \cdot 4H_2O$

【分子量】370.60

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；无臭；有风化性；水溶液显微酸性反应。本品在乙醇中易溶，在水中溶解。

药物药理信息

【药理毒理】本品为非甾体解热镇痛药。具有解热、镇痛和抗炎作用。本品 545mg 相当于 650mg 阿司匹林的水杨酸含量。对血小板聚集几无影响。

【药代动力学】本品口服后吸收迅速、完全，可分布于全身各组织，也能渗入关节腔和脑脊液。在肝脏代谢，代谢产物主要为水杨酸和葡萄糖醛酸结合物，小部分为龙胆酸。血浆蛋白结合率为 65%～90%。从肾脏排泄，小剂量服用时 $t_{1/2}$为 2～3 小时，大剂量时则可达 20 小时以上。

【药物过量】除阿司匹林的一般毒性外，还可引起高镁血症，严重时可致骨胳肌麻痹，呼吸抑制。

【不良反应】少数病人有上腹部不适、恶心，偶有耳鸣、眩晕等现象。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
水杨酸镁胶囊	化学药	HZ003295
水杨酸镁片	化学药	HZ003296

HY001808　水杨酸咪唑

【外文名称】Lmidazole Salicylate

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 58 册

药物理化信息

【化学名】咪唑 2－羟基苯甲酸盐

【分子式】$C_7H_6O_3 \cdot C_3H_4N_2$

【分子量】206.20

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶性粉末；无臭，味微苦。

本品在水中极易溶解，在乙醇中易溶，在三氯甲烷或乙醚中微溶。

熔点：本品的熔点为125～130℃，熔距在3℃以内。

药物药理信息

【药理毒理】本品具有抗炎、镇痛和解热作用，动物实验证实本品能选择性和可逆地抑制血栓烷 A_2 合成酶，但不阻断前列腺素的生物合成，故本品对胃的刺激性较小。

急性毒性试验结果：LD_{50}在雄性、雌性大鼠中，口服分别为1211mg/kg、1430mg/kg；在雄性、雌性小鼠中，口服分别为1034mg/kg、1091mg/kg。

【不良反应】有胃肠功能紊乱、眩晕和凝血时间延长等不良反应。偶有出血现象，有过敏史患者可出现皮疹、鼻塞、哮喘、血管神经性水肿，偶见过敏性休克。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
水杨酸咪唑片	化学药	HZ003297

HY001809 水杨酸钠

【其他名称】Sodium Salicylate

【外文名称】Natrii Salicylas

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第1册

药物理化信息

【化学名】水杨酸钠

【分子式】$C_7H_5NaO_3$

【分子量】160.10

【性状及组成】本品为白色或微显淡红色的细微鳞片，或白色粉末及球状颗粒；无臭或微带特臭，味甜带咸；遇光易变质。

本品在水中易溶，在乙醇中溶解。

药物药理信息

【药理毒理】本品活性成分为水杨酸，其作用机制与阿司匹林相似，通过抑制环氧酶，减少抑制前列腺素的合成，起到抗炎、抗风湿和解热镇痛作用，其抗炎抗风湿作用与阿司匹林相似，但解热、镇痛作用较弱。本品无抗血小板聚集作用。

急性毒性试验结果：大鼠腹腔注射 LD_{50} 为780mg/kg。

【药代动力学】本品为阿司匹林的代谢产物，口服后吸收迅速、完全。可分布于全身各组织，也能渗入关节腔和脑脊液。在肝脏代谢，代谢产物主要为水杨尿酸和葡萄糖醛酸结合物、小部分为龙胆酸。本品为阿司匹林的代谢产物，根据阿司匹林的药代动力学研究发现，水杨酸的血浆蛋白结合率为65%～90%，主要从肾脏排泄，小剂量使用时 $t_{1/2}$ 为2～3小时，大剂量时则可达20小时以上。

【药物相互作用】

1．本品与其他水杨酸类药物合用时，可增强它们的毒性。

2．本品与双香豆素合用时，因从血浆蛋白结合部位置换后者，提高游离型双香豆素血浓度，增强其抗凝作用，易致出血。

3．本品也可置换磺脲类降血糖药甲磺丁脲，增强其降血糖作用，易致低血糖反应。

4．与肾上腺皮质激素合用，也因蛋白置换而使激素抗炎作用增强，但诱发溃疡的作用也增强。

5．本品减少甲氨蝶呤从肾小管分泌而增强其毒性。

6．与呋塞米合用，因竞争肾小管分泌系统而使水杨酸排泄减少，造成蓄积中毒。

【不良反应】本品的主要不良反应是胃肠道反应和水杨酸反应，表现为恶心、呕吐、头痛、眩晕、耳鸣及听力、视力减退。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
水杨酸钠碘化钠注射液	化学药	HZ003298
水杨酸钠片	化学药	HZ003299

HY001810 水杨酸乙酯

【其他名称】柳酸乙酯

【外文名称】Ethyl Salicylate

药物理化信息

【化学名】邻羟基苯甲酸乙酯

【分子式】$C_9H_{10}O_3$

【分子量】166.18

【性状及组成】本品为无色液体。见光或久置变成浅棕黄色。微有香味。能与醇、醚相混溶；不溶于水。

熔点：2～3℃。

沸点：231～234℃。

药物药理信息

【药理毒理】急性毒性：口服，大鼠 LD_{50} 为1320mg/kg。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
瑞草油	中成药	ZC004406

HY001811　水杨酰胺

【其他名称】邻羟基苯甲酰胺

【外文名称】Salicylamide

药物理化信息

【化学名】邻羟基苯甲酰胺

【分子式】$C_7H_7O_2N$

【性状及组成】为白色结晶或粉末，无臭、无味，微溶于乙醇或丙二醇、甘油，难溶于乙醚和三氯甲烷，更难溶于水。溶于氢氧化钠溶液，水溶液呈酸性反应。

熔点：139～142℃

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：解热镇痛药。本品用于发热头痛、神经痛、关节痛及活动性风湿症等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氨酚曲麻片	化学药	HZ000179
氨咖柳胺片	化学药	HZ000229
复方水杨酸苯胺甲酯乳膏	化学药	HZ001384
柳酚咖敏片	化学药	HZ002443

HY001812　顺苯磺酸阿曲库铵

【外文名称】Cisatracurium Besylate

药物理化信息

【化学名】（1*R*，1′*R*，2*R*，2′*R*）－2，2′－（3，11－二氧代－4，10－二氧十三烷撑）二（1，2，3，4－四氢－6，7－二甲氧－2－甲基－1－藜芦基异喹啉）二苯磺酸盐

【分子式】$C_{65}H_{82}N_{20_{18}}S_2$

【分子量】1243.49

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用

顺式阿曲库铵为阿曲库铵同分异构体中的一种，为顺式旋光异构体，与运动终板的胆碱能受体竞争性结合，肌松强度为阿曲库铵的3倍左右。具有作用强，起效快，恢复迅速，无蓄积作用，不释放组胺，对心血管影响轻微，且代谢产物无毒性亦无肌松效应等特点。

顺苯磺酸阿曲库铵是中效的、非去极化的、具异喹啉镒苄酯结构的骨骼肌松弛剂。

人体临床研究表明，本品与剂量依赖的组胺释放无关，甚至在剂量高达 ED_{95} 的8倍时亦是如此。

顺苯磺酸阿曲库铵在运动终板上与胆碱能受体结合，以拮抗乙酰胆碱的作用，从而产生竞争性的神经肌肉传导阻滞作用。这种作用很容易被抗胆碱酶药物如新斯的明或腾喜龙拮抗。

当以阿片类药物麻醉时，顺阿曲库铵的 ED_{95}（刺激尺神经引起的拇内收肌颤搐反应受到95%抑制所需的药量）大约为0.05mg/kg体重。

以氟烷麻醉时，儿童顺阿曲库铵的 ED_{95} 为0.04mg/kg体重。

2．毒理作用

（1）急性毒性：阿曲库铵的有意义的急性毒性研究无法进行。亚急性毒性：狗和猴为期3周的重复给药研究表明没有化合物特异性中毒征象。

（2）致突变性：当顺阿曲库铵浓度达5000μg/板时，体外微生物致突变试验未表明有致突变作用。大鼠的体内细胞遗传试验中，皮下注射剂量为4mg/kg体重时，未观察到明显的染色体异常。当顺阿曲库铵的浓度为40μg/ml或更高时，小鼠的体外淋巴细胞致突变试验表明有致突变性。很少和/或短暂使用药物出现的个别致突变阳性结果，其临床相关性尚有疑问。

（3）致癌性：致癌研究尚未进行。

（4）局部耐受性：对家兔进行的颈动脉内研究结果表明，本品耐受性良好，且未观察到与药物有关的变化。

【药代动力学】顺阿曲库铵主要是通过在生理pH及体温下发生的Hofmann清除（化学过程）而降解为劳丹素和单季铵盐丙烯酸盐代谢物，后者通过非特异性酶水解而形成单季铵盐乙醇代谢物。顺阿曲库铵的清除具有较强的器官依赖性。肝和肾为代谢物的主要清除途径。这些代谢物不具有神经肌肉传导阻滞作用。

成年患者的药代动力学：在0.1～0.2mg/kg剂量范围内（即2～4倍的 ED_{95}）的研究表明，顺阿曲库铵非房室药代动力学与剂量无关。

群体药代动力学证实上述现象并将剂量延伸至0.4mg/kg（ED_{95} 的8倍）。健康成年手术患者给予本品0.1～0.2mg/kg的药代动力学参数如下：清除率：4.7～5.7ml/（min·kg），稳态分布容积：121～161ml/kg，清除半衰期：22～29分钟。

老年患者的药代动力学：未见老年和青年患者药代动力学具有临床意义的差别。其恢复情况亦无明显变化。

肝肾损害患者的药代动力学：未见肾衰晚期和肝脏疾病晚期患者的药代动力学与成人患者（无肝肾疾患）有明显差别。其恢复情况亦无明显变化。

输注过程中的药代动力学：静脉输注顺阿曲库铵与单次注射给药的药代动力学相似。本品的恢复情况不依赖于输注时间，亦与单次注射给药相似。

重症监护病房（ICU）患者的药代动力学：延长输注时间的 ICU 患者，顺阿曲库铵的药代动力学与输注或单次注射给药的健康者类手术成年患者类似。此类患者的恢复情况不依赖于输注时间。

肝/肾功能异常的 ICU 患者的代谢物浓度较高。此代谢物无神经肌肉传导阻滞作用。

【药物相互作用】很多药物显示影响非去极化神经肌肉阻断剂的作用和/或持续时间。

增强效果：麻醉剂（如恩氟烷、异氟烷、氟烷、克他命），其他的非去极化神经肌肉阻断剂，其他药物如抗生素（包括氨基糖苷类、多黏菌素、壮观霉素、四环素、林可霉素、克林霉素）、抗心律失常药物（包括普萘洛尔、钙通道阻滞剂、利诺卡因、普鲁卡因胺、奎尼丁）、利尿药（包括呋塞米、噻嗪类药物、甘露醇、乙酰唑胺）、镁盐、锂盐和神经节阻断药（咪噻吩、六甲季铵）。

长期服用苯妥英或卡马西平后降低本品的效果。

静脉快速注射或按所需速度静滴本品时，预先使用琥珀胆碱不影响神经肌肉阻断持续时间，使用琥珀胆碱对非去极化神经肌肉阻断剂的延长效果来说可导致更长和更复杂的阻断，以致用抗胆碱酯酶反转困难。

某些药物可加重或引发潜在的重症肌无力病情或肌无力症状，这很罕见；增强非去极化神经肌肉阻断剂敏感性的药物可能会导致上述情况。这些药物包括各种抗菌素、β－受体阻滞剂（普萘洛尔、氧烯洛尔）、抗心律失常药物（普鲁卡因胺、奎尼丁）、抗风湿药（氯喹、D－青霉胺）、咪噻吩、氯丙嗪、类固醇、苯妥英和锂盐。

因顺苯磺阿曲库铵在乳酸林格氏注射液和 5% 葡萄糖乳酸林格氏注射液中降解迅速，故不能用来稀释。由 Y－site 注射装置模拟静注的混合试验，结果显示顺阿曲库铵与围手术期药物（盐酸阿芬太尼、氟哌利多、枸橼酸芬太尼、盐酸咪达唑仑和枸橼酸舒芬太尼）相容；在和其他药物经由同一个留置针头或套管给药时，建议每个药物均应用相配的静注液体（如 0.9% 氯化钠注射液）充分冲洗。

【药物过量】肌肉松弛时间延长是顺苯磺阿曲库铵过量的主要症状。本品过量时维持肺部通气和动脉给氧是必要的，直到恢复自然呼吸为止。自发恢复开始后可使用抗胆碱酯酶加速恢复。

【不良反应】使用本品的不良反应主要是皮肤潮红或皮疹、心搏徐缓、血压过低和支气管痉挛。在使用神经肌肉阻断剂后可发生不同程度的严重的过敏反应，但本品联合一个或多个麻醉剂应用导致严重的过敏反应的报告很罕见。

ICU 的重症患者延时应用肌松药有导致肌弱和（或）肌病的报告，但大多数病人同时应用了皮质激素，与本品联合使用或与本品有关的报告罕见。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
顺苯磺阿曲库铵注射液	化学药	HZ003303
注射用顺苯磺阿曲库铵	化学药	HZ004961

HY001813 顺铂

【其他名称】Cis－Diaminodichloroplatin Platinol、DDP、PDD、顺氯氨铂、顺－双氯双氨络铂

【外文名称】Cisplatin

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（顺）二氨二氯铂

【分子式】$Cl_2H_6N_2Pt$

【分子量】300.05

【性状及组成】本品为亮黄色或橙黄色的结晶性粉末；无臭。本品在二甲基亚砜中易溶，在二甲基甲酰胺中略溶，在水中微溶，在乙醇中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗肿瘤药。

本品为铂的金属络合物，作用似烷化剂，主要作用靶点为 DNA，作用于 DNA 链间及链内交链，形成 DDP－DNA 复合物，干扰 DNA 复制，或与核蛋白及胞浆蛋白结合。属周期非特异性药。

【药代动力学】静脉注射、动脉给药或腔内注射吸收均极迅速。注射后广泛分布于肝、肾、前列腺、膀胱、卵巢，亦可达胸、腹腔，极少通过血脑屏障。$t_{1/2}$两日以上，若并用利尿剂 $t_{1/2}$可明显缩短。本品主要由肾排泄，通过肾小球过滤或部分由肾小管分泌，用药后 96 小时内 25%～45% 由尿排出。腹腔内注射后腔内器官浓度为静脉注药的 2.5～8.0 倍。

【药物相互作用】氨基糖苷类抗生素、两性霉素 B 或头孢噻吩等与本品并用，有肾毒性叠加作用；MTX 及 BLM 主要由肾脏排泄，本品所致的肾损害会延缓上述两种药物的排泄，导致毒性增加。丙磺舒与本品并用时，可致高尿酸血症；氯霉素或其呋喃苯胺酸或利尿酸钠增加本品耳毒性；抗组胺药可掩盖本品所致的耳鸣、眩晕等症状。

【药物过量】药物剂量超过 120mg/m^2，其毒性增加，尤其是肾毒性、骨髓毒性。

【不良反应】

1. 消化道反应：严重的恶心、呕吐为主要的限制性毒性。急性呕吐一般发生于给药后 1～2 小时，可持续 1 周左右。故用本品时需并用强效止吐剂，如 5－羟色胺 3（$5-HT_3$）受体拮抗止吐剂恩丹西酮等，基本可控制急性呕吐。

2. 肾毒性：累积性及剂量相关性肾功不良是顺铂的主要限制性毒性，一般剂量一日超过 90mg/m² 即为肾毒性的危险因素。主要为肾小管损伤。急性损害一般见于用药后 10～15 天，血尿素氮（BUN）及肌酐（Cr）增高，肌酐清除率降低，多为可逆性，反复高剂量治疗可致持久性轻至中度肾损害。目前除水化外尚无有效预防本品所致的肾毒性的手段。

3. 神经毒性：神经损害如听神经损害所致耳鸣、听力下降较常见。末梢神经毒性与累积剂量增加有关，表现为不同程度的上下肢感觉异常，有时出现肢端麻痹、躯干肌力下降等，一般难以恢复。癫痫及视神经乳头水肿或球后视神经炎则较少见。

4. 骨髓抑制：骨髓抑制［白细胞和（或）血小板下降］一般较轻，发生几率与每疗程剂量有关，若≤100mg/m²，发生几率约 10%～20%，若剂量≥120mg/m²，则约 40%，但亦与联合化疗中其他抗癌药骨髓毒性的重叠有关。

5. 过敏反应：可出现脸肿、气喘、心动过速、低血压、非特异斑丘疹类皮疹。

6. 其他：心脏功能异常、肝功能改变少见。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
顺铂氯化钠注射液	化学药	HZ003304
顺铂注射液	化学药	HZ003305
注射用顺铂	化学药	HZ004962

HY001814　丝氨酸

【外文名称】Serine

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】L－2－氨基－3－羟基丙酸

【分子式】$C_3H_7NO_3$

【分子量】105.09

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末；无臭，味甜。

本品在水中易溶，在乙醇、丙酮或乙醚中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加 2mol/L 盐酸溶液溶解并释稀成每 1ml 中含 0.1g 的溶液，依法测定，比旋度为＋14.0°至＋16.0°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：氨基酸类药。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
复方氨基酸颗粒（14AA）	化学药	HZ001049
复方氨基酸口服溶液（14AA）	化学药	HZ001050
复方氨基酸（15）双肽（2）注射液	化学药	HZ001051
复方氨基酸注射液（14AA）	化学药	HZ001055
复方氨基酸注射液（15AA）	化学药	HZ001056
复方氨基酸注射液（15－HBC）	化学药	HZ001057
复方氨基酸注射液（17AA）	化学药	HZ001058
复方氨基酸注射液（17AA－Ⅰ）	化学药	HZ001059
复方氨基酸注射液（17AA－H）	化学药	HZ001060
复方氨基酸注射液（17 种氨基酸）	化学药	HZ001061
复方氨基酸注射液（18）	化学药	HZ001062
复方氨基酸注射液（18AA）	化学药	HZ001063
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅰ）	化学药	HZ001064
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅱ）	化学药	HZ001065
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅲ）	化学药	HZ001066
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅳ）	化学药	HZ001067
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅴ）	化学药	HZ001068
复方氨基酸注射液（18AA－N）	化学药	HZ001069
复方氨基酸注射液（18－B）	化学药	HZ001070
复方氨基酸注射液（20AA）	化学药	HZ001071
小儿复方氨基酸注射液（18AA－Ⅰ）	化学药	HZ003749
小儿复方氨基酸注射液（18AA－Ⅱ）	化学药	HZ003750
小儿复方氨基酸注射液（19AA－Ⅰ）	化学药	HZ003751
脂肪乳氨基酸葡萄糖注射液	化学药	HZ004653

HY001815　丝裂霉素

【其他名称】Ametycine、MIT－C、MMC、Mutamycin、自力霉素

【外文名称】Mitomycin

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】5 - 氨基 - 3 - 氨基甲酰氧甲基 - 2 - 甲氧基 - 2,3 - 二氢 - 4,7 - 吲喹醌骈（1,2）- 吡咯烷骈 -（9,10）- 氮丙啶

【分子式】$C_{15}H_{18}N_4O_5$

【分子量】334.33

【性状及组成】本品为深紫色结晶性粉末；无臭；在酸、碱及日光下均不稳定。本品在水、甲醇、乙醇中微溶，在乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗肿瘤抗生素类药。

本品为细胞周期非特异性药物。丝裂霉素对肿瘤细胞的 G1 期、特别是晚 G1 期及早 S 期最敏感，在组织中经酶活化后，它的作用似双功能或三功能烷化剂，可与 DNA 发生交叉联结，抑制 DNA 合成，对 RNA 及蛋白合成也有一定的抑制作用。

大鼠皮下注射 200mg/kg，在 60 日以内引起死亡，组织学上在肝脏、肾脏及骨髓发现有淤血现象。

妊娠 10～14 日的小鼠，单次静脉注射给药 2.0～10.0mg/kg，发现生存胎仔有明显的发育障碍。7.5mg/kg 的给药群，有腭裂、尾短小、小颌症、欠趾症等畸形。

【药代动力学】本品主要在肝脏中生物转化，不能通过血脑屏障。$t_{1/2}$分别为 5～10 分钟及 50 分钟，主要通过肾脏排泄。

【药物过量】丝裂霉素与阿霉素同时应用可增加心脏毒性，建议阿霉素的总量限制在按体表面积 450mg/m^2 以下。

【不良反应】

1. 骨髓抑制是最严重的毒性，可致白细胞及血小板减少，白细胞减少常发生于用药后 28～42 日，一般在 42～56 日恢复。

2. 恶心、呕吐发生于给药后 1～2 小时，呕吐在 3～4 小时内停止，而恶心可持续 2～3 日。

3. 对局部组织有较强的刺激性，若药液漏出血管外，可引起局部疼痛、坏死和溃疡。

4. 少见的副作用有间质性肺炎、不可逆的肾功能衰竭等。

5. 心脏：本品与阿霉素同时应用可增加心脏毒性，建议阿霉素总量限制在按体表面积 450mg/m^2 以下。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用丝裂霉素	化学药	HZ004963

HY001816 司可巴比妥钠

【其他名称】Barbosec、Bazual、丙烯巴比妥、Dormand、Evronal Sodium、Imesonal、Quinalspam Soluble Secobarbital、速成可眠、Secobarbitone、Seconal、Seotal、速可巴比妥、速可眠钠、舍可那、Synate、西可巴比妥、西康尔

【外文名称】Secobarbital Sodium

药物管理信息

【特殊管理分类】一类精神药

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】5 -（1 - 甲基丁基）- 5 -（2 - 丙烯基）- 2,4,6 -（1*H*,3*H*,5*H*）- 嘧啶三酮的钠盐

【分子式】$C_{12}H_{17}N_2NaO_3$

【分子量】260.27

【性状及组成】本品为白色粉末；无臭，味苦；有引湿性。本品在水中极易溶解，在乙醇中溶解，在乙醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：催眠药。

本品为短时巴比妥类催眠药。对中枢的抑制作用随着剂量加大，表现为镇静、催眠、抗惊厥及抗癫痫。大剂量对心血管系统、呼吸系统有明显的抑制。过量可麻痹延髓呼吸中枢致死。体外电生理实验见本类药物使神经细胞的氯离子通道开放，细胞超极化，拟似 γ - 氨基丁酸（GABA）的作用。治疗浓度的司可巴比妥可降低谷氨酸的兴奋作用、加强 γ - 氨基丁酸的抑制作用，抑制中枢神经系统单突触和多突触传递，抑制痫灶的高频放电及其向周围扩散。可减少胃液分泌，降低胃张力。通过诱导葡萄糖醛酸转移酶结合胆红素从而降低胆红素的浓度。可产生依赖性，包括精神依赖和身体依赖。

【药代动力学】本品口服易由消化道吸收，脂溶性比较高，易通过血脑屏障，服后 15 分钟生效，持续约 2～3 小时，本品与血浆蛋白结合率约为 46%～70%。成人 $t_{1/2}$为 20～28 小时。在肝脏代谢，与葡萄糖醛酸结合由肾排出，仅少量（约 5%）以原形由肾排出。

【药物相互作用】

1. 本品为肝药酶诱导剂，提高药酶活性，长期用药不但加速自身代谢，还可加速其他药物代谢。如饮酒、全麻药、中枢性抑制药或单胺氧化酶抑制

药等与巴比妥类药合用时，可相互增强效能。

2．与口服抗凝药合用时，可降低后者的效应，这是由于肝微粒体酶的诱导，加速了抗凝药的代谢，应定期测定凝血酶原时间，从而决定是否调整抗凝药的用量。

3．与口服避孕药或雌激素合用，可降低避孕药的可靠性，因为酶的诱导可使雌激素代谢加快。

4．与皮质激素、洋地黄类（包括地高辛）、土霉素或三环抗抑郁药合用时，可降低这些药物的效应，因为肝微粒体酶的诱导，可使这些药物代谢加快。

5．与环磷酰胺合用，理论上可增加环磷酰胺烷基化代谢产物，但临床上的意义尚未明确。

6．与奎尼丁合用时，由于增加奎尼丁的代谢而减弱其作用，应按需调整后者的用量。

7．与钙离子拮抗剂合用，可引起血压下降。

8．与氟哌丁醇合用，可引起癫痫发作形式改变，需调整用量。

9．与吩噻嗪类和四环类抗抑郁药合用时可降低抽搐阈值，增加抑制作用；与布洛芬类合用，可减少或缩短半衰期而减少作用强度。

【药物过量】主要表现为深度昏迷、血压和体温下降、可并发肺炎、休克及肾功衰竭、高度呼吸抑制。深度呼吸抑制是急性中毒的直接死亡原因。解救措施中最重要的是维持呼吸和循环功能，施行有效的人工呼吸，必要时行气管切开，并辅之以有助于维持和改善呼吸和循环的药物。经口服中毒者，在3～5小时内可用高锰酸钾（1∶2000）溶液洗胃。用10～15g硫酸钠溶液导泄（禁用硫酸镁）。为加速排泄可给甘露醇等渗透压利尿药，如肾功能正常可用速尿。可用碳酸氢钠、乳酸钠碱化尿液加速排泄，严重者可透析。极度过量时，大脑一切电活动消失，脑电图变为一条平线，并不一定代表为临床死亡，若不并发缺氧性损害，尚有挽救的希望。

【不良反应】

1．对巴比妥类过敏的患者可出现皮疹以及哮喘，严重者发生剥脱性皮炎和Stevens－Johnson综合征，可致死，一旦出现皮疹，应当停药。

2．长时间使用可发生药物依赖，或心因性依赖、戒断综合征；停药后易发生停药综合征。

3．较少发生的不良反应有：过敏而出现意识糊涂，抑郁或逆向反应（兴奋）以老年、儿童患者及糖尿病患者为多。

4．偶有粒细胞减少，皮疹、环行红斑，眼睑、口唇、面部水肿；幻觉、低血压；血小板减少；肝功能损害、黄疸；骨头疼痛、肌肉无力。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
司可巴比妥钠胶囊	化学药	HZ003306

HY001817　司莫司汀

【外文名称】Semustine

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】1－（2－氯乙基）－3－（4－甲基环己基）－1－亚硝脲

【分子式】$C_{10}H_{18}ClN_3O_2$

【分子量】247.72

【性状及组成】本品为淡黄色略带微红的结晶性粉末，对光敏感。本品在三氯甲烷中极易溶解，在乙醇或环己烷中溶解，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为71～75℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗肿瘤药。

本品为细胞周期非特异性药物，对处于G1－S边界，或S早期的细胞最敏感，对G2期也有抑制作用。本品进入体内后其分子从氨甲酰胺键处断裂为两部分，一部分为氯乙胺，将氯解离形成乙烯碳正离子，发挥烃化作用，使DNA链断裂，RNA及蛋白质受到烃化，这与抗肿瘤作用有关；另一部分为氨甲酰基部分变为异氰酸酯，或再转化为氨甲酸，以发挥氨甲酰化作用，主要与蛋白质特别是其中的赖氨酸末端的氨基等反应，这主要与骨髓毒性作用有关，氨甲酰化还破坏一些酶蛋白使DNA被破坏后难以修复，这有助于抗癌作用。本品与其他烷化剂并无交叉耐药性。

【药代动力学】本品入血后迅速分解，口服120～290mg/m^2。用^{14}C分别标记氯乙基部分及4－甲基环乙基部分的本品，10分钟后血浆中即可以测到两部分放射性物质，氯乙烯部分6小时达峰浓度，环乙基部分3小时达峰浓度。本品与血浆蛋白结合，存在肝肠循环，故口服34小时后血中仍可测到放射性。代谢产物在血浆中浓度持续时间长，这可能是该药延迟性毒性的原因。给药30分钟及可在脑脊液中测到相当强的放射活性，约为血浆中浓度的15%～30%。24小时内约有47%的标记物从尿中排泄，粪便排泄＜5%，其中＜10%自呼吸道排出。

【药物相互作用】选用本品进行化疗时应避免同时联合其他对骨髓抑制较强的药物。

【药物过量】目前没有药物可对抗本药过量，如出现骨髓抑制，可输注成分血或使用粒细胞集落刺

激因子。

【不良反应】骨髓抑制，呈延迟性反应，有累计毒性。白细胞或血小板减少最低点出现在 4～6 周，一般持续 5～10 天，个别可持续数周，一般 6～8 周可恢复；服药后可有胃肠道反应；肝肾器官与较高浓度药物接触，可影响器官功能；乏力，轻度脱发；偶见全身皮疹，可抑制睾丸与卵巢功能，引起闭经及精子缺乏。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
司莫司汀胶囊	化学药	HZ003307

HY001818 司帕沙星

【其他名称】司氟沙星

【外文名称】Sparfloxacin

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】5－氨基－1－环丙基－7－（顺－3，5－二甲基－1－哌嗪基）－6，8－二氟－1，4－二氢－4－氧代－喹啉－3－羧酸

【分子式】$C_{19}H_{22}F_2N_4O_3$

【分子量】392.41

【性状及组成】本品为黄色结晶性粉末；无臭，味苦。

本品在三氯甲烷中略溶，在乙腈、甲醇或乙酸乙酯中微溶，在乙醇中极微溶解，在水中几乎不溶；在 0.1mol/L 氢氧化钠溶液中溶解，在冰醋酸中略溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：喹诺酮类抗菌药。

1．药理学：本品为喹诺酮类抗菌药。系广谱抗菌药，对革兰阳性细菌包括金黄色葡萄球菌、表皮葡萄球菌、化脓性链球菌、肺炎链球菌、粪肠球菌有明显抗菌作用；对革兰阴性菌大肠埃希菌、克雷伯菌属、沙门菌属、志贺菌属、副溶血弧菌、变形杆菌属、肠杆菌属、假单胞菌属、不动杆菌属、奈瑟菌属（淋病奈瑟菌等）亦具有很好的抗菌作用。本品还对支原体、衣原体、军团菌、厌氧菌包括脆弱类杆菌和分枝杆菌属也有很好的抗菌作用。

本品的作用机制是抑制细菌 DNA 合成过程中的 DNA 旋转酶的作用而起杀菌作用。

2．毒理学：小鼠、大鼠按体表面积口服本品，剂量为人用剂量（400mg）的 3.5～6.2 倍，共 104 周，未见致癌作用。本品对沙门菌株 TA98、TA100、TA1535、TA1537 和大肠埃希菌株 WP2 未见致突变作用，但对沙门菌株 TA102 有致突变作用，会引起大肠埃希菌 DNA 修补整理；体外细胞毒浓度下可引起中国鼠肺细胞染色体失常。雌雄大鼠按体表面积口服本品为人用剂量（400mg）的 15.4 倍，对其生育力、生殖力无明显影响。

【药代动力学】健康成人空腹单次口服本品 0.4g，服药后 4 小时左右达血药峰浓度（C_{max}），血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）约为 16 小时左右，口服后主要在小肠吸收，在胃内几乎不吸收。本品血浆蛋白结合率为 42%～44%。高龄者单次口服 150 mg，血药峰浓度为 1.72μg/ml，平均血消除半衰期约为 26 小时左右。本品口服吸收后体内分布广泛，主要分布于胆囊（约为血药浓度的 7 倍）；其次为皮肤、前列腺、子宫、卵巢、耳、鼻、喉、痰液、前列腺液、尿液及乳汁中（约为血药浓度的 1.5 倍）；再次为唾液、泪液（约为血药浓度的 0.7～0.8 倍）；最低为眼房水及脊髓液。健康成人单次口服本品 200 mg 后 72 小时，用药量的 12%以原形药物及 29%以葡萄糖醛酸共轭物从尿中排泄，51%以原形药物从粪便中排泄。

【药物相互作用】

1．同依诺沙星、诺氟沙星、环丙沙星一样，本品与非甾体抗炎药（如联苯丁酮酸、丙酸衍生物等）合用时，罕有引起痉挛的报告。

2．本品与含有铝、镁、铁的抗酸药和硫糖铝合用时，可降低本品的吸收，从而降低疗效，若需服用应间隔 4 小时。

3．本品与茶碱、咖啡因、华法林、西咪替丁合用时不影响后者血浆浓度。

4．与地高辛、丙磺舒合用不影响本品的药代动力学。

5．服用本品 4 小时后才可服用含金属离子的营养剂和含锌、铁、钙的维生素。

6．本品不宜与阿司咪唑、特非那丁、西沙必利、红霉素、喷他脒、吩噻嗪、三环类抗忧郁药、丙吡胺、胺碘酮合用。

【药物过量】本品过量无已知的解毒剂。若过量，医师应密切监测患者情况，并用 ECG 监测 QTc，5 天内避免接触日光、暴晒。

啮齿动物口服本品 5000mg/kg、狗口服本品 600mg/kg 后观察 14 天未见死亡，但啮齿动物出现腹泻，狗出现活动度降低、呕吐、流涎、震颤。

【不良反应】

1．消化系统反应：如恶心、呕吐、食欲减退、上腹部不适、软便、腹泻、腹胀、便秘、血便、口腔炎等。

2．过敏反应：如皮疹、发热、局部发红、水肿、瘙痒、水疱、红斑、光敏反应、充血等。

3. 中枢神经系统：头痛、头昏、烦躁、失眠、痉挛、震颤等。

4. 实验室检查：AST、ALT、ALP、LDH、BUN、γ-GTP、血肌酐及总胆红素升高，也可致嗜酸粒细胞增多及白细胞、红细胞、血红蛋白和血小板降低等；国外有QT轻度延长的报告。

5. 其他：偶见肌腱炎、伪膜性肠炎、间质性肺炎、休克、过敏综合征（呼吸困难、水肿、声音嘶哑、潮红、瘙痒症等）、眼黏膜综合征（史蒂文斯-约翰逊综合征）、低血糖、麻木感、不舒服感、疲倦感等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
司帕沙星分散片	化学药	HZ0003308
司帕沙星胶囊	化学药	HZ0003309
司帕沙星片	化学药	HZ0003310

HY001819　司盘80

【其他名称】失水山梨醇单油酸酯（Span-80）

【外文名称】Spanum 80

【分子式】$C_{24}H_{44}O_6$

【分子量】428.59

【性状及组成】本品为琥珀色黏性油状液体，具特殊的脂肪臭味。不溶于水，但能在热水中分散成乳状液，能与乙醇混合，微溶于乙醚，溶于液状石蜡或不挥发油，但溶液浑浊。HLB为4.3。

药物药理信息

【药理毒理】本品为非离子表面活性剂，具有乳化、分散、增溶等作用。在制药、食品、日化和纺织等工业中均有广泛的用途。在药剂中，主要用作水/油型乳化剂和增溶剂，用于乳剂、霜剂、栓剂、乳膏剂等的制造。

【不良反应】本品一般公认为是安全无毒的。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
貂胰防裂软膏	民族药	MZ000093
日晒防治膏	民族药	MZ000451
消痔洁肤软膏	民族药	MZ000669
参皂软膏	中成药	ZC004765

HY001820　司他夫定

【其他名称】d4T、赛瑞特、司坦夫定、Strvudine、沙之、Zerit

【外文名称】Stavudine

药物药理信息

【药理毒理】作用机制：司他夫定是胸苷、核苷类似物，可抑制HIV病毒在人体细胞内的复制。司他夫定通过细胞激酶磷酸化，形成司他夫定三磷酸盐而发挥抗病毒活性。司他夫定三磷酸盐通过以下两种机制抑制HIV的复制：①通过与天然底物三磷酸脱氧胸苷酸竞争，抑制HIV逆转录酶的活性（Ki=0.0083~0.032μmol/L）；②由于司他夫定缺乏DNA延伸所必需的3′-羟基，因此可通过终止DNA链抑制了病毒DNA链的延伸。此外，司他夫定三磷酸盐也抑制了细胞DNA聚合酶β和γ，并显著地减少线粒体DNA的合成。

在体外对HIV敏感性：司他夫定抗HIV活性在体外与人体内二者之间的关系未建立。司他夫定在体外抗HIV活性是用外周血液单核细胞、单核细胞及淋巴细胞系来评价的。实验及临床表明ED_{50}范围为0.009~4mmol/L。在体外测试，司他夫定分别与去羟肌苷及扎西他宾联合用药，可增强或协同抗HIV的活性。司他夫定与齐多夫定联合用药增强或对抗活性取决于因素测试的摩尔浓度比。司他夫定在体外对HIV的敏感性及人体内抑制HIV的复制之间的关系还未建立。

耐药性：对司他夫定敏感性降低的HIV病毒的分离在体外及病人中进行。司他夫定治疗患者HIV的表型分析说明，20例中有3例分离，司他夫定的体外敏感性降低了4至12倍。引起这些敏感性变化的遗传因素还未得到证实。

交叉耐药性：11例中有5例在司他夫定治疗后对齐多夫定有中度的耐药性，而11例中有3例对去羟肌苷有中度耐药性。这些发现与临床的关系还未知。

致癌作用、致突变作用和生育力损害：一项为期两年的致癌作用的研究中，司他夫定用在小鼠和大鼠的剂量分别为临床推荐剂量的39倍和168倍时（此倍数系据两者总吸收量，即AUC的比例），均无发现致癌作用。当司他夫定用在小鼠和大鼠的剂量分别达到临床推荐剂量的250倍和732倍时，小鼠和大鼠中出现良性和恶性肝脏肿瘤，雄性大鼠出现尿路膀胱肿瘤。

在Ames试验、大肠杆菌反向突变试验和CHO/HGPRT哺乳类细胞前向突变试验，无论有无代谢活化，司他夫定均无致突变作用。在体外人类淋巴细胞致畸变试验、小鼠成纤维细胞试验和体内小鼠微核试验，司他夫定均呈阳性。无代谢活化的情况下，司他夫定浓度在25μg/ml至250μg/ml之间，能增加

人类淋巴细胞染色体畸变的发生频率；在25μg/ml至2500μg/ml之间，能增加小鼠成纤维细胞转型灶的发生频率。体内微核试验显示，小鼠口服剂量在600至2000mg/（kg·d）的司他夫定三日后，骨髓细胞发生突变。

按临床剂量1mg/（kg·d）形成的最高浓度折算，216倍的司他夫定在大鼠试验没有造成生育力损害。

怀孕：属“C类”生殖试验。按临床剂量1mg/(kg·d)形成的最高浓度折算，339倍的司他夫定在大鼠无致畸形作用。同样，183倍的司他夫定在家兔生殖实验中也无致畸作用。大鼠实验中发现，216倍剂量的司他夫定不影响胎仔的骨骼发育，而剂量为399倍时，常见的骨骼变化、胸骨骨化不全和未骨化均较多发生。135倍剂量不影响着床后流产率，而216倍剂量能使其轻度增加。135倍剂量时，大鼠新生幼仔（仔龄4天）死亡率不受影响。而399倍剂量增加新生幼仔死亡率。有实验显示，司他夫定能通过大鼠胎盘传给胎儿，药物在胎儿组织的浓度为母体血浆浓度的一半。

【药代动力学】已在HIV感染的成人和儿童患者中研究了司他夫定的药代动力学。无论是单剂量给药，还是多剂量给药，在0.03～4mg/kg剂量范围内，血浆峰浓度和曲线下面积与剂量成正比。每隔6、8或12小时重复给药，均无显著的司他夫定蓄积。

1．吸收：司他夫定口服吸收迅速，通常在1小时内达到血药峰浓度。

2．分布：司他夫定在浓度范围为0.01～11.4μg/ml时，蛋白结合率可以忽略。在红细胞和血浆中平均分布。

3．代谢：司他夫定在人体内的代谢途径及代谢产物还未了解。

4．排泄：肾清除率占总剂量的40%。

5．特殊人群

（1）肾功能不全者：研究显示司他夫定的表观口服消除率降低，消除终点的半衰期延长而肌酐的消除率降低。肾功不全者的C_{max}和t_{max}的变化不明显。mean ± SD血透清除值为120 ± 18ml/min（n = 12）；mean ± SD透析（用药后2～6小时）中司他夫定的回收率为31% ± 5%。基于上述发现，对肌酐消除率降低及接受血透的患者应进行剂量的修正。

（2）老年患者：药代动力学研究未在大于65岁患者中进行。

（3）性别：群体药代动力学研究表明无性别差异。

【药物相互作用】药物相互作用研究证明以下药物与司他夫定没有显著的临床药代动力学影响：去羟肌苷、拉米夫定、奈韦拉平。齐多夫定会竞争性抑制司他夫定的磷酸酰化，因此禁止与齐多夫定联合用药。

【药物过量】曾报道成年患者服用12～24倍推荐剂量未显示任何剧烈的毒性。长期过量服用会引起周围神经痛及肝功能损害。司他夫定可由血液透析除去，但腹膜透析能否除去还未研究。

【不良反应】本药的主要毒性为外周神经病变，其主要表现为手足麻木刺痛。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
司他夫定胶囊	化学药	HZ003311
司他夫定片	化学药	HZ003312

HY001821 司坦唑醇

【外文名称】Stanozolol

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】17－甲基－2H－5α－雄甾－2－烯－[3，2－c]吡唑－17β－醇

【分子式】$C_{21}H_{32}N_2O$

【分子量】328.50

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；无臭。

本品在乙醇、三氯甲烷中略溶，在乙酸乙酯或丙酮中微溶，在苯中极微溶解，在甲醇或水中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加无水乙醇溶解并定量稀释制成每1ml中含20mg的溶液，依法测得比旋度为+34°至+40°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：同化激素药。

本品为蛋白同化类固醇类药，具有促进蛋白质合成、抑制蛋白质异生、降低血胆固醇和三酰甘油、促使钙磷沉积和减轻骨髓抑制等作用，能使体力增强、食欲增进、体重增加。本品的蛋白同化作用较强，为甲睾酮的30倍，雄激素活性约为甲睾酮的25%。

【药物相互作用】如正在使用其他药品，使用本品前请咨询医师或药师。

【不良反应】

1．女性：长期使用可能会有痤疮、多毛、阴蒂肥大、闭经或月经紊乱等症状。

2．男性：长期使用可能会有痤疮、精子减少、精液减少。

3．肝脏：GOP、GTP上升，黄疸。

4. 消化系统：恶心、呕吐、消化不良、腹泻。

5. 电解质：水钠潴留、水肿。

6. 皮肤：皮疹、颜面潮红。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
司坦唑醇片	化学药	HZ003313

HY001822　四环素

【外文名称】Tetracycline

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（抗生素药品）·第1册

药物理化信息

【化学名】6－甲基－4－（二甲氨基）－3,6,10,12,12*a*－五羟基－1,11－二氧代－1,4,4*a*,5,5*a*,6,11,12*a*－八氢－2－并四苯甲酰胺

【分子式】$C_{22}H_{24}N_2O_8$

【分子量】444.44

【性状及组成】本品为淡黄色结晶性粉末；无臭；放置后色渐变深，在日光下颜色迅速变深，在碱性溶液中易破坏失效。

本品在乙醇中微溶，在水中极微溶，在三氯甲烷或乙醚中不溶，在稀酸中溶解。

本品按干燥品计算，每1mg的效价不得少于975盐酸四环素单位。

吸收系数：取本品10mg，精密称定，置100ml量瓶中，加盐酸液（0.1mol/L）10ml溶解，用水稀释至刻度，精密量取10ml，加水75ml与氢氧化钠液（2mol/L）12ml，用水稀释至100ml，混匀。照紫外－可见分光光度法，在（380±1）nm的波长处测定，自加氢氧化钠液（2mol/L）起6分钟时，其吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）应为390～420。

药物药理信息

【药理毒理】本品为广谱抑菌剂，高浓度时具杀菌作用。除了常见的革兰阳性菌、革兰阴性菌以及厌氧菌外，多数立克次体属、支原体属、衣原体属、非典型分枝杆菌属、螺旋体也对本品敏感。本品对革兰阳性菌的作用优于革兰阴性菌，但肠球菌属对其耐药。其他如放线菌属、炭疽杆菌、单核细胞增多性李斯特菌、梭状芽孢杆菌、奴卡菌属等对本品敏感。本品对淋病奈瑟菌具一定抗菌活性，但耐青霉素的淋球菌对四环素也耐药。本品对弧菌、鼠疫杆菌、布鲁菌属、弯曲杆菌、耶尔森菌等革兰阴性菌抗菌作用良好，对铜绿假单胞菌无抗菌活性，对部分厌氧菌属细菌具一定抗菌作用，但远不如甲硝唑、克林霉素和氯霉素，因此临床上并不选用。多年来由于四环素类的广泛应用，临床常见病原菌包括葡萄球菌等革兰阳性菌及肠杆菌属等革兰阴性杆菌对四环素多数耐药，并且，同类品种之间存在交叉耐药。本品作用机制在于药物能特异性地与细菌核糖体30S亚基的A位置结合，阻止氨基酰－tRNA在该位上的连结，从而抑制肽链的增长和影响细菌蛋白质的合成。

【药代动力学】本品为四环素碱，口服可吸收但不完全，约30%～40%的给药量可从胃肠道吸收。口服吸收受食物和金属离子的影响，后者与药物形成络合物使吸收减少。单剂口服本品250mg后，血药峰浓度（C_{max}）为2～4mg/L。多剂口服该药250mg或500mg（每6小时服药1次后），稳态血药浓度分别可达1～3mg/L和1.5～5mg/L。吸收后广泛分布于体内组织和体液，易渗入胸水、腹水、胎儿循环，但不易透过血－脑脊液屏障，能沉积于骨、骨髓、牙齿及牙釉质中。本品可分泌至乳汁，乳汁中浓度可达母血浓度的60%～80%。蛋白结合率为55%～70%，本品主要自肾小球滤过排出体外，肾功能正常者血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为6～11小时，无尿患者可达57～108小时，其未吸收部分自粪便以原形排出，少量药物自胆汁分泌至肠道排出，故肾功能减退时可明显影响药物的清除。本品可自血液透析缓慢清除，约可清除给药量的10%～15%。

【药物相互作用】

1. 与制酸药如碳酸氢钠同用时，由于胃内pH增高，可使本品吸收减少，活性减低，故服用本品后1～3小时内不应服用制酸药。

2. 含钙、镁、铁等金属离子的药物，可与本品形成不溶性络合物，使本品吸收减少。

3. 与全身麻醉药甲氧氟烷合用时，可增强其肾毒性。

4. 与强利尿药如呋塞米等药物合用时可加重肾功能损害。

5. 与其他肝毒性药物（如抗肿瘤化疗药物）合用时可加重肝损害。

6. 降血脂药考来烯胺或考来替泊可影响本品的吸收，必须间隔数小时分开服用。

7. 本品可降低避孕药效果，增加经期外出血的可能。

8. 本品可抑制血浆凝血酶原的活性，所以接受抗凝治疗的患者需要调整抗凝药的剂量。

【药物过量】本品无特异性拮抗剂，药物过量时主要是对症疗法和支持疗法，如洗胃、用催吐药及补液等。

【不良反应】

1. 胃肠道症状如恶心、呕吐、上腹不适、腹胀、腹泻等，偶可引起胰腺炎、食管炎和食管溃疡的报道，多发生于服药后立即卧床的患者。

2. 本品可致肝毒性，通常为脂肪肝变性，妊娠期妇女、原有肾功能损害的患者易发生肝毒性，但肝毒性亦可发生于并无上述情况的患者。四环素所致胰腺炎也可与肝毒性同时发生，患者并不伴有原发肝病。

3. 变态反应：多为斑丘疹和红斑，少数患者可出现荨麻疹、血管神经性水肿、过敏性紫癜、心包炎以及系统性红斑狼疮皮疹加重，表皮剥脱性皮炎并不常见。偶有过敏性休克和哮喘发生。某些用四环素的患者日晒时会有光敏现象。所以，应建议患者服用本品期间不要直接暴露于阳光或紫外线下，一旦皮肤有红斑应立即停药。

4. 血液系统：偶可引起溶血性贫血、血小板减少、中性粒细胞减少和嗜酸粒细胞减少。

5. 中枢神经系统：偶可致良性颅内压增高，可表现为头痛、呕吐、视神经乳头水肿等。

6. 肾毒性：原有显著肾功能损害的患者可能发生氮质血症加重、高磷酸血症和酸中毒。

7. 二重感染：长期应用本品可发生耐药金黄色葡萄球菌、革兰阴性杆菌和真菌等引起的消化道、呼吸道和尿路感染，严重者可致败血症。

8. 四环素类的应用可使人体内正常菌群减少，导致维生素 B 缺乏、真菌繁殖，出现口干、咽炎、口角炎、舌炎、舌苔色暗或变色等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
四环素片	化学药	HZ003315
四环素软膏	化学药	HZ003316
四环素眼膏	化学药	HZ003317

HY001823 三甲氧奋乃静

【外文名称】Methophenazin

【分子式】$C_{31}H_{36}ClN_3O_5S$

药物药理信息

【药理毒理】

药品作用类别：抗精神病药。

HY001824 δ-9-四氢大麻酚

【外文名称】Delta-9-tetrahydrocannabinol

药物管理信息

【特殊管理分类】一类精神药

【药理毒理】国食药监安［2007］633 号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为精神药品，但我国未生产或使用。

HY001825 四氢大麻酚

【外文名称】Tetrahydrocannabinol

药物管理信息

【特殊管理分类】一类精神药

药物药理信息

【药理毒理】历史上大麻曾被用作麻醉剂，其麻醉成分就是四氢大麻酚，后被停止使用。本品还有抗癌、抗菌、抗呕吐、利尿等作用。

HY001826 四氢西泮

【外文名称】Tetrazepam

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

药物药理信息

HY001827 松馏油

【其他名称】木馏油、松焦油

【外文名称】Pine Tar

【性状及组成】本品为黑棕色或类黑色、极黏稠的液体，薄层半透明，但历时稍久，即析出结晶变为不透明。有似松节油的特异臭气，带焦性。能与乙醇、乙醚、三氯甲烷、冰醋酸、脂肪油或挥发油任意混合（溶解度均＜1），微溶于水。饱和水溶液呈酸性。

药物药理信息

【药理毒理】本品含酚类化合物，有溶解角质、止痒、消炎、收敛及促进吸收等作用。用于慢性皮炎、湿疹、脂溢性皮炎等。

【不良反应】对皮肤有局部刺激作用，不能用于有炎症或破损的皮肤表面。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
水杨酸苯甲酸松油搽剂	化学药	HZ003288

HY001828 苏氨酸

【其他名称】L-苏氨酸、L-Threonine

【外文名称】Threonine

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】L-2-氨基-3-羟基丁酸

【分子式】$C_4H_9NO_3$

【分子量】119.12

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末；无臭，味微甜。

本品在水中溶解，在甲醇中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并稀释成每1ml中约含60mg的溶液，依法测定，比旋度为-26.0°至-29.0°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：氨基酸类药。

本品是一种重要的营养强化剂，可以强化谷物、糕点、乳制品，和色氨酸一样有缓解人体疲劳，促进生长发育的效果。苏氨酸的结构中含有羟基，对人体皮肤具有保持水分作用，与寡糖链结合，对保护细胞膜起重要作用，在体内能促进磷脂合成和脂肪酸氧化。其制剂具有促进人体发育，抗脂肪肝等药用功能。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
11氨基酸注射液-833	化学药	HZ000212
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
低分子右旋糖酐氨基酸注射液	化学药	HZ000673
复方氨基酸胶囊（8-11）	化学药	HZ001047
复方氨基酸颗粒（14AA）	化学药	HZ001049
复方氨基酸口服溶液（14AA）	化学药	HZ001050
复方氨基酸（15）双肽（2）注射液	化学药	HZ001051
复方氨基酸注射液（9AA）	化学药	HZ001054
复方氨基酸注射液（14AA）	化学药	HZ001055
复方氨基酸注射液（15AA）	化学药	HZ001056
复方氨基酸注射液（15-HBC）	化学药	HZ001057
复方氨基酸注射液（17AA）	化学药	HZ001058
复方氨基酸注射液（17AA-Ⅰ）	化学药	HZ001059
复方氨基酸注射液（17AA-H）	化学药	HZ001060
复方氨基酸注射液（17种氨基酸）	化学药	HZ001061
复方氨基酸注射液（18）	化学药	HZ001062
复方氨基酸注射液（18AA）	化学药	HZ001063
复方氨基酸注射液（18AA-Ⅰ）	化学药	HZ001064

续表

制剂名称	类别	序号
复方氨基酸注射液（18AA-Ⅱ）	化学药	HZ001065
复方氨基酸注射液（18AA-Ⅲ）	化学药	HZ001066
复方氨基酸注射液（18AA-Ⅳ）	化学药	HZ001067
复方氨基酸注射液（18AA-Ⅴ）	化学药	HZ001068
复方氨基酸注射液（18AA-N）	化学药	HZ001069
复方氨基酸注射液（18-B）	化学药	HZ001070
复方氨基酸注射液（20AA）	化学药	HZ001071
小儿复方氨基酸注射液（18AA-Ⅰ）	化学药	HZ003749
小儿复方氨基酸注射液（18AA-Ⅱ）	化学药	HZ003750
小儿复方氨基酸注射液（19AA-Ⅰ）	化学药	HZ003751
脂肪乳氨基酸葡萄糖注射液	化学药	HZ004653

HY001829　苏洛明钠

【其他名称】苏拉明

【外文名称】Suramine

药物药理信息

【药理毒理】本品为尿素的衍生物，具有杀非洲锥虫和盘尾丝虫成虫的作用，但对微丝蚴无效。杀虫机制可能是它的多个阴离子负电荷与虫体蛋白的阳极结合形成牢固的复合物。此外，它还能抑制虫体的糖代谢。

近些年研究发现苏拉明对癌症和肿瘤细胞增殖、浸润、转移等有一定的抑制作用。体内外研究证实苏拉明对多种恶性癌症和肿瘤有抗癌症和肿瘤活性。它既能抑制某些与肿瘤有关的生长因子，如表皮生长因子、转化生长因子、血小板衍生生长因子、胰岛素样生长因子，又能抑制诸多酶的活性，如特异性地作用于参与DNA和RNA代谢的酶，非特异性地与各种酶及蛋白和大分子结合等。

【药代动力学】本品由于为多阴离子化合物，口服后肠道吸收差，故须静脉注射。本品不能透过血脑屏障。主要随尿排泄，末次用药3个月后还可从尿液中测得未经代谢的原药。

【不良反应】较为常见的不良反应为：用药早期的疲劳、乏力、恶心、呕吐、多尿、口喝、瘙痒、荨麻疹、手掌和足底触痛等，较轻微。严重的不良反应为：首次注射时出现的虚脱、胃溃疡、剥脱性皮炎、重症腹泻、长期高热和衰竭以及用药后期出

现的蛋白尿、粒细胞缺乏症、溶血性贫血等。杀死寄生虫后的过敏反应为：成虫寄生部位肿痛、皮疹和脓肿形成。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用苏洛明钠	化学药	HZ004964

HY001830 苏子油

【外文名称】Perilla Oil

【性状及组成】由白苏子（白苏 *Perilla frutescens* 的籽实，含油约35%～45%）所得的干性油。

相对密度：0.930～0.937（15/15℃）。

碘值：193～208。

药物药理信息

【药理毒理】本品为主含亚油酸和亚麻酸的甘油酯；具有抗血栓作用，抑制过敏反应作用，降低血压、血脂、胆固醇作用，抑制肿瘤作用以及对视觉功能和学习行为活动有促进作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
维E三油胶丸	化学药	HZ003525

HY001831 羧苄西林钠

【外文名称】Carbenicillin Sodium

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（抗生素药品）·第1册

药物理化信息

【化学名】6－（2－羧基－苯乙酰氨基）青霉烷酸的二钠盐

【分子式】$C_{17}H_{16}N_2Na_2O_6S$

【分子量】422.36

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末；引湿性强，对热不稳定。

本品在水中易溶，在甲醇、苯或冰醋酸中溶解，在三氯甲烷或乙醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为广谱青霉素类抗生素，通过抑制细菌细胞壁合成发挥杀菌作用。对大肠埃希菌、变形杆菌属、肠杆菌属、枸橼酸菌属、沙门菌属和志贺菌属等肠杆菌科细菌，以及铜绿假单胞菌、流感嗜血杆菌、奈瑟菌属等其他革兰阴性菌具有抗菌作用。对溶血性链球菌、肺炎链球菌以及不产青霉素酶的葡萄球菌亦具抗菌活性。脆弱拟杆菌、梭状芽孢杆菌等许多厌氧菌也对本品敏感。

【药代动力学】肌内注射本品1g后1小时达血药峰浓度（C_{max}），为34.8mg/L，4小时后血药浓度为10mg/L。静脉推注本品5g后15分钟和2小时的血药浓度分别为300mg/L和125mg/L。新生儿肌内注射100mg/kg后，血药峰浓度可达147mg/L。

本品的分布容积（V_d）为0.18 L/kg，血清蛋白结合率约为50%。本品难以透过正常血脑屏障，但肺炎链球菌脑膜炎患儿每6小时静脉滴注69～103mg/kg本品后，第2日至第17日脑脊液内药物浓度为2.3～24.5mg/L。约2%在肝内代谢，血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为1～1.5小时。大部分以原形通过肾小球滤过和肾小管分泌清除，小部分经胆道排泄。血液透析可清除本品，腹膜透析则仅可部分清除本品。

【药物相互作用】

1．本品与琥珀氯霉素、琥乙红霉素、盐酸土霉素、盐酸四环素、卡那霉素、链霉素、庆大霉素、妥布霉素、两性霉素B、维生素B族、维生素C、苯妥英钠、拟交感类药物、异丙嗪等有配伍禁忌。

2．本品在体外与氨基糖苷类药物（阿米卡星、庆大霉素或妥布霉素）对铜绿假单胞菌、部分肠杆菌科细菌具有协同抗菌作用。

3．本品与氨基糖苷类抗生素同瓶滴注，可导致两者的抗菌活性明显减弱。

4．大剂量本品与肝素等抗凝药、血栓溶解药、水杨酸制剂、苯磺唑酮或血小板聚集抑制药合用可增加出血危险。

5．与磺胺类合用可使本品的血药浓度增高，故须适当减少本品的剂量。

【不良反应】

1．过敏反应：青霉素类药物的过敏反应较常见，包括荨麻疹等各类皮疹、白细胞减少、间质性肾炎、哮喘发作和血清病型反应（Ⅲ型变态反应）。严重者偶可发生过敏性休克，过敏性休克一旦发生，必须就地抢救，予以保持气道畅通、吸氧及肾上腺素、糖皮质激素等治疗措施。

2．消化道反应：恶心、呕吐和肝肿大等，ALT、AST、肌酐升高。

3．大剂量静脉注射本品时可出现抽搐等神经系统反应、高钠和低钾血症。

4．本品为弱酸，故血药浓度过高时可发生急性代射性酸中毒，此反应尤多见于肾病病人且已有酸中毒者。

5．其他：念珠菌二重感染，出血等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用羧苄西林钠	化学药	HZ004965

HY001832　羧甲淀粉钠

【其他名称】羧甲基淀粉钠

【外文名称】Carboxymethylstarch Sodium

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

【性状及组成】本品为淀粉在碱性条件下与氯乙酸作用生成的淀粉羧甲基醚的钠盐。按干燥品计算，含钠（Na）应为 2.0%～4.0%。

本品为白色或类白色粉末，无臭，在空气中有引湿性。

本品在水中分散成黏稠状胶体溶液，在乙醇或乙醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料。

1．赋形剂。

2．免疫调节药。本品能改善儿童免疫功能，增强抵抗力。对反复性呼吸道感染及哮喘的有效率分别达到 87%及 82%。可用于儿童反复呼吸道感染、气管炎、呼吸性气管炎、哮喘、营养不良等免疫功能低下疾病。长期服用无不良反应。增加用量也可用于成年患者。

（1）小儿反复呼吸道感染：当病因主要为免疫功能低下时，羧甲淀粉钠通过以下方面增强机体免疫功能，起治疗作用。①使机体的免疫器官“胸腺”增大和细胞增多；②选择性刺激 T 细胞；③促进淋巴母细胞转化；④提高血清 IgG、IgA 浓度。

（2）小儿哮喘：当病因主要为免疫功能亢进和紊乱时，羧甲淀粉钠通过以下方面调节机体免疫功能，起治疗作用。①降低血浆中与哮喘发病有关的 IgE 类致敏特异抗体含量；②降低血浆中 IgM 含量；③降低嗜碱性粒细胞含量，减少嗜碱粒细胞表面的受体和 IgE 结合所产生与哮喘发病有关的致敏反应。

【不良反应】不良反应少见，少数患者服用初期大便次数可能增多或成糊状。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
羧甲淀粉钠溶液	化学药	HZ003324
肠舒片	民族药	MZ000068
丹参益心胶囊	民族药	MZ000085
驱白巴布期片	民族药	MZ000441

续表

制剂名称	类别	序号
补血宁神片	中成药	ZC000444
穿王消炎片	中成药	ZC000626
东山感冒片	中成药	ZC000911
肺毒清片	中成药	ZC001061
复方降脂片	中成药	ZC001411
复方金蒲片	中成药	ZC001414
复方玄驹益气片	中成药	ZC001581
甘桔冰梅片	中成药	ZC001664
肝悦片	中成药	ZC001722
绞股蓝总苷分散片	中成药	ZC002586
金槐冠心片	中成药	ZC002685
蓝蒲解毒片	中成药	ZC003148
龙血竭肠溶胶囊	中成药	ZC003366
毛冬青片	中成药	ZC003525
人工牛黄片	中成药	ZC004299
乳安片	中成药	ZC004370
山蜡梅叶片	中成药	ZC004580
四黄泻火片	中成药	ZC005307
天王补心片	中成药	ZC005462
五酯片	中成药	ZC005884

HY001833　羧甲基纤维素钠

【外文名称】Carboxymethylcellulose Sodium

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 5 册

药物理化信息

【化学名】纤维素羧甲基醚钠盐

【性状及组成】本品为白色或微黄色纤维状粉末；无臭、无味、具吸湿性。

本品在水中溶解成黏稠胶体。在乙醇、乙醚或三氯甲烷中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料。

本品具有黏合、助悬、增稠、乳化、缓释等作用，主要由于其增黏的特性，羧甲纤维素钠广泛用于口服和局部用药物制剂。它的黏稠水溶液在局部、口服或注射用制剂中用做助悬剂。在半固体制剂中作凝胶基质。在片剂中用作黏合剂、崩解剂及缓释辅料。

通常高浓度（3%～6%）的中等黏度级别的羧

甲纤维素钠可以制成凝胶作为制剂的基质或糊剂。此类凝胶中常加入二醇类以防止干燥。此外，羧甲纤维素钠还是自黏合造漏术、伤口护理材料和皮肤用贴剂中的主要成分之一，可吸收伤口的分泌物或皮肤的汗水。

羧甲纤维素钠也用于日用化妆品，以及小便失禁、个人卫生用品和食品。

【药物相互作用】 羧甲纤维素钠与强酸溶液、可溶性铁盐以及一些其他金属如铝、汞和锌等有配伍禁忌。pH < 2 时，以及与 95% 的乙醇混合时，会产生沉淀。

羧甲纤维素钠与明胶及果胶可以形成共凝聚物，也可以与胶原形成复合物，能沉淀某些带正电的蛋白。

【不良反应】 羧甲纤维素钠可用于口服、局部以及注射用制剂中，同时也广泛用于化妆品、食品中。通常被认为是没有毒性和刺激性的物质。但当大量服用时有缓泻作用，临床上，一日分剂量服用 4 ~ 10g 的中黏度或高黏度的羧甲纤维素钠可作为容积性泻药。

由于上述作用所需的量对人体健康无害，世界卫生组织没有确定羧甲纤维素钠可接受的日摄入量。然而动物试验的研究表明，皮下注射能够使动物产生炎症，重复注射的注射部位有时出现组织纤维化。

超过敏和变态反应只见于牛和马等动物，主要是由于羧甲纤维素钠是一些注射剂如疫苗、青霉素处方中的成分所致。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
丁硼乳膏	化学药	HZ000741
复方龙胆碳酸氢钠片	化学药	HZ001284
复方十一烯酸锌曲安奈德软膏	化学药	HZ001375
六合氨基酸颗粒	化学药	HZ002444
羧甲基纤维素钠滴眼液	化学药	HZ003326
羧甲基纤维素钠颗粒	化学药	HZ003327
参贝止咳颗粒	民族药	MZ000495
关节镇痛巴布膏	中成药	ZC001916
归芍调经片	中成药	ZC001979
桔贝止咳祛痰片	中成药	ZC002645
藏茵陈片	中成药	ZC007184
珍牡肾骨胶囊	中成药	ZC007232

HY001834 羧甲司坦

【其他名称】 化痰片、Loviscol、美咳片、Mucilar、羟甲半胱氨酸、强利痰灵、S - CMS、羧甲基半胱氨酸

【外文名称】 Carbocisteine

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 *S* -（羧甲基）- 半胱氨酸

【分子式】 $C_5H_9NO_4S$

【分子量】 179.19

【性状及组成】 本品为白色结晶性粉末，无臭。本品在热水中略溶，在水中极微溶解，在乙醇或丙酮中不溶；在酸或碱溶液中易溶。

比旋度：取本品 5g，精密称定，加水与 5mol/L 氢氧化钠溶液各 10ml 使溶解，溶液应澄清，用 2mol/L 盐酸溶液中和至 pH 为 6.0，溶液转移至 50ml 量瓶中，加水至刻度，摇匀，依法测定，比旋度为 - 32.5°至 - 36.0°。

药物药理信息

【药理毒理】 本品为黏液调节剂，主要作用于支气管腺体的分泌，使低黏度的唾液黏蛋白分泌增加，高黏度的岩藻黏蛋白产生减少，因而使痰液的黏稠性降低而易于咳出。

【药物相互作用】 应避免同时服用强镇咳药，以免痰液堵塞气道。

【不良反应】 偶有轻度头晕、恶心、胃部不适、腹泻、胃肠道出血和皮疹。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
美羧伪麻颗粒	化学药	HZ002647
羧甲基半胱氨酸泡腾散	化学药	HZ003325
羧甲司坦颗粒	化学药	HZ003329
羧甲司坦口服溶液	化学药	HZ003330
羧甲司坦泡腾片	化学药	HZ003331
羧甲司坦片	化学药	HZ003332
小儿羧甲司坦片	化学药	HZ003777

HY001835 缩宫素

【其他名称】 催产素

【外文名称】 Oxytocin

药物管理信息

【依据标准】 化学药品地标升国标·第 9 册

药物理化信息

【分子式】 $C_{43}H_{66}N_{12}O_{12}S_2$

【分子量】 1007.19

【性状及组成】本品系化学合成九肽。每1ml含缩宫素的效价不得少于150单位。为无色澄明液体，pH应为3.0～4.0（缩宫素溶液）。

药物药理信息

【药理毒理】本品为多肽类激素子宫收缩药。

1．刺激子宫平滑肌收缩，模拟正常分娩的子宫收缩作用，导致子宫颈扩张，子宫对缩宫素的反应在妊娠过程中逐渐增加，足月时达高峰。

2．刺激乳腺的平滑肌收缩，有助于乳汁自乳房排出，但并不增加乳腺的乳汁分泌量。

【药代动力学】口服极易被消化液所破坏，故口服无效；滴鼻经黏膜则很快吸收，作用时效约20分钟；肌内注射在3～5分钟起效，作用持续30～60分钟；静脉滴注立即起效，15～60分钟内子宫收缩的频率与强度逐渐增加，然后稳定，滴注完毕后20分钟，其效应渐减退。$t_{1/2}$一般为1～6分钟。本品经肝、肾代谢，经肾排泄，极少量是原形物。

【药物相互作用】

1．环丙烷等碳氢化合物吸入全麻时，使用缩宫素可导致产妇出现低血压、窦性心动过缓或（和）房室节律失常。恩氟烷浓度＞1.5%，氟烷浓度＞1.0%吸入全麻时，子宫对缩宫素的效应减弱。恩氟烷浓度＞3.0%可消除反应，并可导致子宫出血。

2．其他宫缩药与缩宫素同时用，可使子宫张力过高，产生子宫破裂或（和）宫颈撕裂。

【不良反应】偶有恶心、呕吐、心率加快或心律失常。大剂量应用时可引起高血压或水滞留。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方萘普生栓	化学药	HZ001325
缩宫素鼻喷雾剂	化学药	HZ003333
缩宫素注射液	化学药	HZ003334
注射用缩宫素	化学药	HZ004966

HY001836　缩合葡萄糖

【外文名称】Polyglucose

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第1册

【性状及组成】本品系由葡萄糖经缩合而成的高分子多糖。

本品为淡棕色或淡黄色颗粒状粉末，无臭，无味，有引湿性。本品在水中溶解，在乙醇、三氯甲烷或乙醚中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水制成每1ml中含30mg的溶液，滤过，弃去初滤液，取续滤液，依法测定，按干燥品计算，比旋度为＋67°至＋85°。

药物药理信息

【药理毒理】缩合葡萄糖有一定的胶体渗透压，可在血管内保持血容量；排泄较慢，但又不持久的蓄积在体内。钠和氯是机体重要的电解质，主要存在于细胞外液，对维持正常的血液和细胞外液的容量和渗透压起着非常重要的作用。本品无抗原性，可以改善微循环。

【不良反应】偶见皮肤瘙痒。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
缩合葡萄糖氯化钠注射液	化学药	HZ003335

HY001837　索布佐山

【其他名称】Perazolin、索布佐生

【外文名称】Sobuzoxane

药物药理信息

【药理毒理】本品及其代谢产物具有抗肿瘤活性，用于细胞周期的G_2期（DNA合成后间歇）。由于阻抑拓扑异构酶Ⅱ，不能切断DNA链，而杀死肿瘤细胞。体内试验显示，对小鼠试验性肿瘤，对裸鼠移植的人体肿瘤都具有抗肿瘤活性。

在体外，本品活性代谢产物对小鼠肿瘤细胞1株，人体肿瘤细胞14株（肾癌1株、白血病7株、肺癌1株、胃癌3株，结肠癌1株、子宫癌1株），除几株外，抑制肿瘤细胞生长50%浓度（IC_{50}）都在1×10^{-5}～1×10^{-6}mol/L浓度。

在体内对小鼠试验性肿瘤P388白血病、L1210白血病、Lewis肺癌、B16黑色素瘤、Colon 38及Colon 26结肠癌、M5076肉瘤和裸鼠移植性人乳癌MX－1、小细胞性肺癌LX－1、结肠癌CO4都呈强力抗肿瘤效果。而且对抗癌药耐药的6株肿瘤细胞，除与阿霉素（ADM）耐药株有轻度交叉耐药性外，与其他5种药物：丝裂霉素（MMC）、长春新碱（VCR）、氟脲嘧啶（5－FU）、顺铂（CDDP）、环磷酰胺（CPA）无交叉耐药性。

本品单次间歇给药、连续给药或一日2次连续给药都有强力抗肿瘤效果。

本品短时间接触，不作用于核酸合成系统，也无DNA链切断修复作用。但对死亡细胞观察形态改变，发现细胞形态出现异常膨胀、矮小细胞、发育不全的有丝分裂等。提示本品作用是多方面的。对拓扑异构酶显示阻滞拓扑异构酶Ⅱ的活性，但不伴

有 DNA 链的切断。因此，提示与已往的拓扑异构酶阻滞剂的作用机制不同。

【药代动力学】以^{14}C 标记的本品给大鼠口服，血药浓度存留时间较长，尿中全部以代谢产物排出，无原形药物。本品在组织中分布以肾、肝、消化道最多，120 小时后几乎完全消失。由粪便排泄 60%，由尿排泄 30%，胆汁也有排泄。向乳汁分布较多。人体的药代动力学情况与动物大体一致。

【药物相互作用】本品与 MMC、ADM、CDDP 有相乘的效果，与 CPA、阿糖胞苷（Ara－c）有相加的效果，而与 5－FU、6－巯基嘌呤（6－MP）、6－硫鸟嘌呤（6－TG）有拮抗作用。

与其他抗癌药或放射疗法并用，可加重骨髓抑制，应减量。

【不良反应】主要为消化系症状如食欲减退，恶心、呕吐，腹泻。此外少数人有出血倾向和脱发、味觉异常、疲倦、皮炎、热感等。不良反应发生率伴随剂量增大而增多。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
索布佐山颗粒	化学药	HZ003336

HY001838 他达拉非

【外文名称】Tadalafei

【分子式】$C_{22}H_{19}N_3O_4$

【分子量】389.41

药物药理信息

【药理毒理】药物治疗组：药物用于勃起功能障碍（ATC 编码 G04BE）

他达拉非是环磷酸鸟苷（cGMP）特异性磷酸二酯酶 5（PDE5）的选择性可逆抑制剂，当性刺激导致局部释放一氧化氮，PDE5 受到他达拉非抑制，使阴茎海绵体内 cGMP 水平提高，这导致平滑肌松弛，血液流入阴茎组织，产生勃起。如无性刺激，他达拉非不发生作用。

体外研究显示他达拉非是 PDE5 的选择性抑制剂。PDE5 是存在于阴茎海绵体平滑肌、血管和肌内平滑肌、骨胳肌、血小板、肾脏、肺和大脑内的一种酶。他达拉非对 PDE5 的作用比对其他磷酸二酯酶的作用强。他达拉非对 PDE5 的作用比对心脏、脑、血管、肝和其他脏器中发现的 PDE1、PDE2、PDE4 等的作用强 10000 倍以上，他达拉非大量对 PDE5 的作用比对心脏、血管中发现的 PDE3 的作用强 10000 倍以上．对 PDE5 的选择性超过 PDE3 很重要，因为 PDE3 与心肌收缩力有关．此外，他达拉非对 PDE5 的作用强度是对 PDE6 的近 700 倍，后者存在于视网膜，参与光传导。他达拉非对 PDE5 的作用强度比对 PDE7－10 高 10000 倍以上。

1054 名患者在家参与的三项研究确定了患者对他达拉非的反应时间。与安慰剂相比，本品被证实了在服药后短至 16 分钟、长达 36 小时内对勃起功能、进行成功性交的能力、达到和维持成功性交的勃起的能力均有统计学意义上的显著改善。

与安慰剂比较，健康受试者服用他达拉非后卧位收缩压和舒张压（平均最大降幅分别为 1.6/0.8mmHg）和站立位收缩压和舒张压（平均最大降幅分别为 0.2/4.6mmHg）均无显著差别，心率无显著变化。

在评价他达拉非对视觉影响的研究中，使用 Farnsworth－Munsell 100－hue 颜色试验未发现色觉分辨能力（蓝/绿色）的损害。这一结果与他达拉非对 PDE6 的新和性低于 PDE5 是一致的。在所有临床试验中，对颜色视觉变化的报告罕见（<0.1%）。

在男性中进行了两项试验，每天服用他达拉非 10mg 和 20mg，连续 6 个月来研究他达拉非对精子生成的影响。结果表明，精子浓度减少 50%甚至更多的男性比例，他达拉非与安慰剂相比没有明显差别。另外，与安慰剂相比，在精子数量、精子形态、精子活力等方面，任何一种剂量的他达拉非都没有明显的副作用。然而，在一项研究中，每天服用本品 10mg，连续 6 个月，结果显示与安慰剂相比，试验组精子浓度有所减低。但是每天服用他达拉非 20mg 连续 6 个月的实验中没有发现这一结果。另外与安慰剂相比，每天服用本品 10mg 或 20mg，不会影响睾丸激素、成黄体激素和滤泡刺激激素的平均浓度。长期服用的结果尚未确定。

在总共 3250 名患者参加的 16 个临床试验评估中了他达拉非 2～100mg 剂量的效果。这些勃起功能障碍患者有不同的严重程度（轻度、中度和重度）。病因、年龄（21～86 岁）和种族。绝大部分患者报告患勃起功能障碍至少 1 年。在一般人群的初始疗效研究中，有 81%的患者报告他达拉非改善了勃起，对照组是 35%，（轻度、中度和重度分别为 86%、83%和 72%，而对照组分别是 45%、42%和 19%）。在初始疗效研究中，用本品治疗的患者 75%性交尝试取得了成功，而服用安慰剂后，只有 32%是成功的。

基于传统的药理学安全性、致畸性、致癌性和生殖毒性的研究，临床前资料显示他达拉非对人体没有特殊危害。

给予小鼠或大鼠最高剂量 1000mg/（kg·d）的他达拉非，未见致畸、胚胎毒性或胎儿毒性。在大鼠

的研究中，观测不到效应的剂量是 30mg/（kg·d）。给予怀孕的大鼠相同剂量，其 AUC 是人类服用 20mg 的剂量 AUC 的 18 倍。

没有发现雌性、雄性大鼠的生育功能受损。给予狗他达拉非以 25mg/（kg·d）的剂量甚至更多［比人 20mg/（kg·d）的剂量至少多 3 倍的 AUC（3.7～18.6）］；连续 6～12 个月，发现有的狗的输精管上皮细胞发生退化，并由此导致的精子生成数量出现降低。

【药代动力学】

1．吸收：他达拉非于口服后快速吸收，服药后中位时间 2 小时达到平均最大观测血浆浓度（C_{max}）。口服本品后的绝对生物利用度尚未明确。

他达拉非的吸收率和程度不受食物的影响，所以本品可以与或不与食物同服。服药时间（早晨或晚上）对吸收率和程度没有临床意义的影响。

2．分布：平均分布容积约 63L，说明他达拉非分布进入组织。在治疗浓度、血浆内 94% 的他达拉非与蛋白结合。蛋白结合不受肾功能损害的影响。

在健康受试者，仅有不到 0.0005% 服药剂量的药物出现在精液内。

3．生物转化：他达拉非主要由细胞色素 P450（CYP）3A4 异构体代谢。主要的循环代谢产物是葡萄糖醛酸甲基儿茶酚。这一代谢产物对 PDE5 的作用比他达拉非至少弱 13000 倍。因此，在观察到的代谢产物浓度不具有临床活性。

4．清除：在健康受试者口服他达拉非平均清除率为 2.5L/h，平均半衰期为 17.5 小时。他达拉非主要以无活性的代谢产物形式排泄，主要从粪便（约 61% 的剂量），少部分从尿中排出（约 36% 的剂量）。

5．线性/非线性：在健康受试者，他达拉非的药代动力学的时间和剂量呈线性关系。在 2.5～20mg 剂量范围以上，AUC 随剂量成比例地提高，一日用药一次，在 5 天内达到稳态血药浓度。

勃起功能障碍患者人群测得的药代动力学特性与无勃起功能障碍的受试者相似。

特殊人群

（1）老年人：健康老年受试者（65 岁以上）口服他达拉非清除率较低。使得 AUC 比，19～45 岁的健康受试者高 25%。这一年龄的影响无临床意义，且无须调整剂量。

（2）肾功能不全者：在单剂量他达拉非（5～20mg）临床药理学研究中，他达拉非的暴露量（AUC）在轻度（肌酐清除率 51～80ml/min）或中度（肌酐清除率 31～50ml/min）肾功能不全患者和肾病晚期使用透析的患者中大约增加一倍。在血液透析的患者中观察到，C_{max}比健康受试者高 41%。血液透析对他达拉非的清除帮助不大。

（3）肝功能不全者：在轻度和中度肝功能损害受试者（Child－Pugh A 级和 B 级），他达拉非的 AUC 与健康受试者相似。因此无须调整剂量。关于重度肝功能不全（Child－Pugh 分级 C）患者使用本品的临床安全性住处有限，如果对此类患者开处方，需要处方医生对每位患者进行认真的利益/风险评估。对肝功能不全的患者每日服用超过 10mg 他达拉非的情况，目前尚无资料。

（4）糖尿病患者：糖尿病患者他达拉非的 AUC 比健康受试者约低 19%。尽管存在这一差别，但无须调整剂量。

【药物相互作用】下述的相互作用研究中使用了 10mg 和（或）20mg 他达拉非。由于研究中使用的剂量是 10mg 他达拉非，因此临床上使用较大剂量时，不能完全排除临床上发生有关的药物相互作用。

1．其他药物对他达拉非的作用

他达拉非主要通过 CYP3A4 代谢。与单用他达拉非的 AUC 值和 C_{max}相比，CYP3A4 的选择性抑制剂酮康唑（每天 200mg）可使他达拉非（10mg）的暴露量（AUC）增加 2 倍，C_{max}增加 15%。酮康唑（每天 400mg）可使他达拉非（20mg）的暴露量增加 4 倍，C_{max}增加 22%。蛋白酶抑制剂利托那韦（200mg，每天 2 次）是 CYP3A4、CYP2C9、CYP2C19 和 CYP2D6 抑制剂，可使他达拉非（20mg）的暴露量增加 2 倍，对 C_{max}没有影响，尽管尚未进行特殊的相互作用研究。其他的蛋白酶抑制剂，如沙奎那韦和其他 CYP3A4 抑制剂，如红霉素、甲红霉素、伊曲康唑以及柚子汁等都有可能增加他达拉非在血浆中的浓度。所以无法预测的不良反应的发生率可能会增加。

运输因子（例如 P－糖蛋白）对他达拉非的分布的作用还不清楚。因此有可能发生运输因子的抑制剂所导致的药物的相互作用。

与单用他达拉非（10mg）的 AUC 值相比，CYP3A4 的诱导剂利福平可降低他达拉非的 AUC 至 88%。据此推测，与其他 CYP3A4 的诱导剂的联合应用也可以减少血浆中他达拉非的浓度如：苯巴比妥、苯妥英、酰胺咪嗪。

2．他达拉非对其他药物的作用

临床研究显示，他达拉非（10mg 和 20mg）可增强硝酸盐类药物的降压作用。因此，正在服用任何形式的硝酸盐类药物的患者禁止服用本品。基于一项在 150 名受试者中进行的临床研究结果，每天在不同时间给予他达拉非 20mg，持续 7 天和舌下含服硝酸甘油 0.4mg，这种相互作用持续超过 24 小时，给予他达拉非最后一个剂量 48 小时后不再会有相互作用，因此对于使用他在拉非的患者，给予硝酸盐

的时机应依据治疗的需要和情况而决定。应至少在使用他达拉非最后一个剂量后的 48 小时再考虑给予硝酸盐。这种情况，只能在有严密的医疗监控和适当的血液动力学检测下才可以给予硝酸盐类药物。

他达拉非不会经 CYP450 异构体代谢的药物清除而产生有临床意义的抑制和诱导。研究证实他达拉非不会对 CYP450 异构体产生抑制或诱导，如 CYP3A4、CYP1A2、CYP2D6、CYP2E1、CYP2C9 和 CYP2C19。

他达拉非（10mg 和 20mg）对 *S* - 华法林或 *R* - 华法林（CYP2C9 的底物）的分布（AUC）不会产生有临床意义的影响。他达拉非对华法林诱导的凝血酶原时间的变化也无影响。

他达拉非（10mg 和 20mg）不增强乙酰水杨酸导致的出血时间延长。

临床药理学研究了他达拉非增强抗高血压的降压作用的潜力。对主要的抗高血压药物种类进行了研究，包括钙离子通道阻滞剂（氨络地平）、血管紧张素转移酶（ACE）抑制剂（依那普利）、β 肾上腺受体拮抗剂（美托洛尔）、噻嗪类利尿剂（苄氟噻嗪）、血管紧张素Ⅱ受体抑制剂（不同类型和剂量、单独或与噻嗪类、钙通道阻滞剂、β 受体拮抗剂、和/或 α 受体抑制剂合用）。他达拉非（血管紧张素Ⅱ受体抑制剂的研究剂量为 10mg、氨氯地平的研究剂量为 20mg）与上述任何一种药物均无临床意义的相互作用。在另一项临床药理研究中，对他达拉非（20mg）和 4 类抗高血压药物联合使用进行研究。使用多种抗高血压药的受试者，活动后血压变化表现出与血压控制程度相关联。在这方面，血压得到良好控制的参加研究的受试者，血压下降很小，与健康受试者相近，血压没有得到控制的受试者，血压下降很大，虽然这种下降在大多数受试者中表现与低血压症状无关。一般而言，在同时使用抗高血压药物的患者中，他达拉非 20mg 促使血压下降（α 受体阻滞剂除外）是很少或不可能有临床相关性。Ⅲ期临床研究信息的分析显示：给予他达拉非的患者联合使用或不使用抗高血压药物，在不良事件方面没有区别。但是，应告知正在使用抗高血压药物的患者，联合使用有降低血压的可能性。

酒精浓度（平均最大血药浓度 0.08%）不受同时服用他达拉非（10mg 或 20mg）的影响。与酒精同时服用 3 小时后他达拉非的浓度无变化。以最大酒精吸收率的方式给予酒精（前一天晚上禁食直至给予酒精 2 小时后），他达拉非（20mg）没有表现出因酒精［0.7g/kg 或 40% 酒精（伏特加酒）给予一名 80kg 的男性大约 180ml］诱发的增加平均血压的下降。但是一些受试者观察到体位性眩晕和直立性低血压。但他达拉非与低剂量的酒精（0.6g/kg）联合使用。没有观察到低血压，眩晕的发生频率与单独使用酒精时相近。酒精对认知功能的影响不因联合使用他达拉非（10mg）而增加。

他达拉非已被证实可以导致口服乙炔基雌二醇后其生物利用度增加。可以推测他达拉非也能导致口服应用的叔丁喘宁生物利用度增加，但是这种临床效应目前尚不清楚。在临床药理学试验中，把他达拉非［10mg 与茶碱（一种非选择性的硝酸三酯酶抑制剂］一起应用，没有发现药代动力学上的相互作用。惟一的药代动力学的影响就是使心率轻微增加（3.5 次/分钟）。尽管这种效应很少并且在这个临床试验中没有显著的意义，在联用时仍予以考虑。尚未进行他达拉非与降糖药物的联合应用时的相互作用的研究。

【药物过量】在健康受试者单次剂量高达 500mg，患者一日多次服药总剂量曾达 100mg，其不良事件与较低剂量时类似。如发生药物过量，应采用标准的支持治疗。血液透析对他达拉非的清除帮助不大。

【不良反应】通常报道最多的不良反应是头痛和消化不良。常见的副反应还有：头晕眼花，充血、脸红，鼻腔充血，背痛，肌痛等。

眼睑肿胀或者描述为眼痛和结膜充血是非常少见的副反应。报告显示由他达拉非所引起的副反应是短暂的、轻微的或者是中度的。这些副反应是数据只对年龄在 75 以下的病人适用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
他达拉非片	化学药	HZ003337

HY001839 他卡西醇

【外文名称】Tacalcitol

药物药理信息

【药理毒理】本品对表皮培养细胞及正常人或银屑病人患部而取材的人表皮培养细胞的作用，他卡西醇有 DNA 合成及抑制细胞增殖作用。对 TPA 涂抹而引起细胞增殖的无我白鼠的表皮的作用，细胞增殖指标 ODC（鸟氨酸脱羧酶）的活性被抑制。给银屑病患者涂抹软膏 4 周，发现对 DNA 合成及细胞分裂有抑制作用对 S 期细胞作用减少对表皮细胞增殖有抑制作用 。对表皮细胞的分化诱导作用：对白鼠表皮培养细胞，发现他卡西醇可以促进细胞内不溶生膜的形成及增加转谷氨酰胺酶的活性。对无毛白鼠的表皮，使 Tgase 活性上升作用。对正常人表皮培养细胞，他卡西醇对细胞内不溶性膜的前驱蛋白质

合成有促进作用。另外，对银屑病患者涂抹后的病灶部位的皮肤进行电子显微镜观察，发现角质层蛋白模型的形成及表皮透明角质蛋白颗粒层的形成等，倾向于正常角化。对表皮细胞的 1α，25（OH）2D3 特异蛋白受体的亲和性：对白鼠及常人表皮细胞中的受体，他卡西醇有很强的亲和性。

【药代动力学】对健康成年男子及银屑病患者，进行一次 20～80μg 或进行每日 40～80μg 连续 7 天的经皮给药试验，大多数健康成年男子及患者的血清他卡西醇均在检出界限以下。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
他卡西醇软膏	化学药	HZ003338

HY001840　他克林

【外文名称】Tacrine

药物药理信息

【药理毒理】本品为乙酰胆碱酯酶抑制剂，可抑制乙酰胆碱水解，提高脑胆碱能神经元功能，改善脑的代谢功能，增强认识能力，能够缓解阿尔茨海默病（早老性痴呆症）。

本品的作用机制是通过抑制乙酰胆碱酯酶减缓大脑皮层中胆碱能神经释放的乙酰胆碱的降解，从而增加乙酰胆碱的浓度。是一种可逆性乙酰胆碱酯酶抑制剂。

【药代动力学】本品口服后吸收迅速，绝对生物利用度约 17%，食物降低生物利用度 30%～40%。在体内主要由细胞色素 P450 酶系统代谢。患者的年龄及肾脏不影响代谢物的清除。本品通过首过代谢，半衰期为 2～4 小时。

【不良反应】

1. 最常见的是肝酶水平显著升高，约发生于 21%的患者，当停止用药后，可恢复正常。故使用本品初期至少 18 周内，每周都必须检测肝酶水平，此后每月检测一次。

2. 其他反应有恶心、呕吐、腹泻、胃痛（因本品增加胆碱活性，增加胃酸分泌）、食欲减退等。

HY001841　他克莫司

【其他名称】大环哌南、FK506、普乐可复、Prograf

【外文名称】Tacrolimus

药物理化信息

【化学名】[3*S*－［3*R**,4*S**,5*R**,8*S**,9*E*,12*R**,14*R**,15*S**,16*R**,18*S**,19*S**,26a*R**］］－5,6,8,11,12,13,14,15,16,17,18,19,24,25,26,26a－十六氢－5,19－二羟基－3－－14,16－二甲氧基－4,10,12,18－四甲基－8－（2－丙烯基）－15,19－环氧－3*H*－吡啶并氧杂氮杂环二十三碳烯－1,7,20,21（4*H*,23*H*）－四酮，一水合物

【分子式】$C_{44}H_{69}NO_{12}\cdot H_2O$

【分子量】822.05

药物药理信息

【药理毒理】在分子水平，他克莫司的作用显然是利用与细胞性蛋白质（FKBP12）相结合，而在细胞内蓄积产生效用。FKBP12－他克莫司复合物会专一性地结合以及抑制 calcinurin，其会抑制 T 细胞中所产生钙离子依赖型讯息传导路径作用，因此防止不连续性淋巴因子基因的转录。本药是具有高度免疫抑制的药物，其活性在体外及体内实验中都已被证实。本药抑制形成主要移值排斥作用之细胞毒性淋巴球的生成。本药是具有高度免疫抑制的药物，其活性在体外及体内实验中都已被证实。本药抑制形成主要移植排斥作用之细胞毒性淋巴球的生成。本药抑制 T 细胞的活化作用以及 T 辅助细胞依赖 B 细胞的增生作用。也会抑制如白介素－2、白介素－3 及 γ－干扰素等淋巴因子的生成与白介素－2 受体的表达。在分子水平，本药的效应似乎是由结合到细胞性蛋白质（FKBP）所产生，此蛋白质也会造成该化合物累积在细胞间。在体内试验中发现，本药显示出对肝脏及肾脏移植有效。

本品作用机制和环孢素相同，主要是抑制白细胞介素－2 的合成，作用于辅助 T 细胞，抑制 T 细胞活化基因的产生（对 γ－干扰素和白细胞介素－2 等淋巴因子的 mRNA 转录有抑制作用），同时还抑制白细胞介素－2 受体的表达，但不影响抑制型 T 细胞的活化。在这种免疫抑制作用中，均有肽基脯氨酰顺反异构酶（旋转异构酶）作为同工酶参与，所以可使 β 细胞产生抗体的能力保持正常。

与环孢素相比，本品有如下特点：①该药的免疫抑制作用无论在体外还是在体内试验都是环孢素的数十倍到数百倍。在临床上本品 1%的浓度就有效。另外对已发生排异反应的抑制作用也比环孢素好。②以往以环孢素为基础的免疫抑制方案中，不可逆的慢性排斥反应问题依然如旧，增加剂量虽然有进一步效果，但是带来严重的不良反应，本品可望能减少肝肾移植受体的急、慢性排斥反应。③用本品的患者，细菌和病毒感染率也较环孢素治疗者低，尤其是本品有较强的亲肝性，对肝移植的功效高 100 倍，因而大大降低了临床使用剂量，可降低原治疗费用 1/3～1/2（因使用本品的患者可在术后 2

周出院而使用环孢素者则要4周），同时不良反应也明显降低，它具有低死亡率、高移植存活率、移植物具良好成功率及对类甾醇的相对非依赖性等优点。

【药代动力学】综合对49例成年特应性皮炎患者进行的两项药代动力学研究的结果表明，局部应用0.1%浓度的本品后，他克莫司会被吸收。单次或多次应用0.1%浓度的本品后，血中他克莫司峰浓度介于检测不出至20 ng/ml之间，49例患者中有45例血药峰浓度值低于5 ng/ml。对20例儿童特应性皮炎患者（年龄6～13岁）进行的药代动力学研究结果表明，应用0.1%浓度的本品后，所有患者血中他克莫司峰浓度均低于1.6 ng/ml。

从血药浓度来看，间歇性局部应用本品长达一年也不会导致他克莫司在全身蓄积。局部应用他克莫司的绝对生物利用度尚不清楚。以静脉注射他克莫司的历史数据作对比，特应性皮炎患者局部应用本品的相对生物利用度低于0.5%。在平均治疗体表面积（BSA）达53%的成人中，局部应用本品后的吸收量（即AUC）约比肾或肝移植患者将他克莫司作为免疫抑制剂口服的吸收量低30倍。能引起全身性作用的他克莫司最低血药浓度目前尚不清楚。

【药物相互作用】

1. 凡是由细胞色素P450代谢的药物如咪唑类抗真菌药、大环内酯类抗生素、特拉唑嗪、奥美拉唑、甲泼尼龙等与本品合用均可产生相互作用，应尽量避免。

2. 避免与保钾利尿剂和补钾剂合用，也不宜与两性霉素B和布洛芬合用，本品可改变避孕药物的代谢，也可影响免疫接种之效果，血清蛋白结合率高的药物可以使其游离率增加，尽量避免与上述药物合用。

【不良反应】由于大部分用药者存在有严重的疾病和同时并用多种其他药物，常很难确定与免疫抑制药物有关的不良反应。有证据显示，下列许多药物不良反应是可逆转的，并且可经由剂量降低而改善。经常性：高血压。偶发生：心绞痛、心悸、渗液（例如心包积液、胸膜积液）。罕见性：包含休克之低血压、心电图异常、心律失常、心房/心室纤颤以及心跳停止、血栓静脉炎、出血（例如胃肠道、大脑）、心力衰竭、心脏扩大、心跳缓慢。和静脉给药相比，口服给药发生不良反应的频率明显地较低。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
他克莫司胶囊	化学药	HZ003339
他克莫司软膏	化学药	HZ003340
他克莫司注射液	化学药	HZ003341

HY001842 他扎罗汀

【外文名称】Tazarotene

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第43册

药物理化信息

【化学名】6－［（3，4－二氢－4，4－二甲基－2H－1－苯并噻喃－6－基）乙炔基］－3－吡啶羧酸乙酯

【分子式】$C_{21}H_{21}NO_2S$

【分子量】351.46

【性状及组成】本品为淡黄色结晶或结晶性粉末，无臭。

本品在苯甲醇中易溶，再乙酸乙酯中溶解，在乙腈中略溶，在乙醇中微溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点应为102～105℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为皮肤外用的类维生素A的前体药，具有调节表皮细胞分化和增殖等作用。在大多数生物系统中通过快速的脱酯作用而被转化为活性形式即他扎罗汀的同源羧酸，该活性产物可相对选择性地与维A酸受体的β和γ亚型结合，但其治疗银屑病的确切机制尚不清楚。

【药代动力学】外用他扎罗汀凝胶，其结构中的酯被水解生成活性代谢物AGN 190299，在血浆中几乎不能检测出原药。AGN 190299与血浆蛋白高度结合（＞99%）。他扎罗汀和其活性代谢物AGN 190299，最终代谢成为砜、亚砜以及其他极性化合物，所有这些代谢物均通过尿和粪便排泄。无论健康人体或银屑病患者外用他扎罗汀凝胶时，AGN 190299的半衰期相似，均为18小时。

以下描述的人体试验，均按大约2mg/cm^{2}涂抹他扎罗汀凝胶，且该药保留在皮肤外时间为10～12小时。血浆峰浓度（C_{max}）和药时曲线下面积（AUC）都按活性代谢物计。

有两项独立的用^{14}C标记外用他扎罗汀凝胶的试验。利用排泄物的放射活性分析，测得6名银屑病患者系统吸收小于应用剂量（没有包合）的1%；6名健康受试者系统吸收量为应用剂量（有包合）的5%。采用非放射性标记试验，比较六名健康受试者使用0.05%和0.1%的凝胶后，发现0.1%凝胶的C_{max}和AUC都比0.05%凝胶高40%。

24例健康受试者，在20%的体表面积处涂抹0.1%他扎罗汀凝胶，7天后，在最后一次涂抹9小时后，血药浓度达峰值，C_{max}为（0.72±0.58）ng/ml

（平均值±平均偏差），AUC_{0-24}为（10.1±7.2）ng·h/ml。应用剂量下的系统吸收为（0.91±0.67）%。

对五名银屑病患者14天的研究，将测量剂量的0.1%他扎罗汀凝胶每天涂于患者皮肤［占体表总面积的8%～18%；平均值±偏差：（13±5）%］。最后一个剂量6小时后，C_{max}为（12.0±7.6）ng/ml，$AUC_{0\to24}$为（105±55）ng·h/ml。应用剂量下，系统吸收为（14.8±7.6）%。外推这些数据来代表涂抹在20%身体皮肤的剂量，结果估计C_{max}为（18.9±10.6）ng/ml，$AUC_{0\to24}$为（172±88）ng·h/ml。

在体外经皮吸收试验研究中，以人体活性皮肤或人尸体皮肤为模型，涂抹放射性标记的凝胶。在涂抹凝胶24小时后，有大约4%～5%应用剂量在角质层（他扎罗汀：AGN 190299=5:1）；2%～4%的应用剂量在活性表皮－真皮层（他扎罗汀:AGN 190299=2:1）。

【药物相互作用】

1．患者在同时服用具有光敏性药物时（例如四环素、氟喹诺酮、吩噻嗪、磺胺），应小心使用。

2．应避免同时使用能使皮肤变干燥的药物和化妆品。

【药物过量】过量使用本品不会加快皮损好转，还会产生皮肤发红、脱皮及其他不适。

【不良反应】本品外用后，主要不良反应为皮肤反应，表现为瘙痒、灼热、刺痛、红斑、刺激感、皮肤疼痛、湿疹、脱屑、皮炎、开裂、水肿、脱色、出血和干燥等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
他扎罗汀凝胶	化学药	HZ003342

HY001843　泰利霉素

【其他名称】HMR－3647、红霉酮、替利霉素、特利霉素

【外文名称】Teltihromycin

药物药理信息

【药理毒理】本品是半合成大环内酯类，属酮酯类抗生素。作用机制与大环内酯类抗生素相似，主要通过直接与细菌核糖体的50S基结合，抑制蛋白质的合成，并阻抑其翻译和装配。

本品与大环内酯类抗生素均可与23S核糖体RNA的Ⅱ和Ⅴ结合区的核糖酸结合，但本品作用机制的最大区别在于它对野生型核糖体的结合力较红霉素克拉霉素分别强10倍和6倍；本品与Ⅱ、Ⅴ结构区的强大结合，使其成为一种可以覆盖所有大环内酯耐药菌的有效、广谱抗生素。

【药代动力学】本品口服生物利用度约57%，食物不影响其吸收。当剂量为一日600mg或800mg时，约5天即可在扁桃体、肺、支气管和体液中达最高浓度。用药3小时后，扁桃体内浓度是血浆浓度的3倍，持续用药24小时后，则可高达13倍。在中耳和副鼻窦黏膜中的分别是血浆浓度的2.4倍和4倍。口服量的70%在肝脏被浓度CYP3A4代谢为4种产物（泰利醇、泰利酸、*N*－去甲脱氧酰胺衍物、*N*－氧吡啶衍生物）。$t_{1/2}$为9.81小时，肾清除率为12.5L/h。排泄途径：13%以原形从尿中排泄，3%以原形从粪便排泄，代谢产物有37%从肝脏排泄。老年人的药动学参数略大于青年人，而肾清除率则较年轻人稍低。肝功能不全者，$t_{1/2}$较正常人延长1.4倍，代谢率减少，但可被清除率的增加而代偿。

【药物相互作用】

1．CYP3A4抑制剂伊曲康唑、酮康唑可抑制本品代谢，使本品C_{max}和AUC升高。

2．CYP3A4诱导剂苯妥英钠、卡马西平、巴比妥，可使本品血药浓度降低，疗效降低。

3．经细胞色素P450系统代谢的药物卡马西平、环孢素A、他克莫司、西罗莫司、苯妥英钠与本品合用时，血药浓度增加，作用增强，不良反应增多。

4．本品为强效CYP3A4抑制剂，能抑制西沙必利、匹莫齐特的代谢，使血药浓度升高，禁止合用。

5．本品能增加辛伐他汀的AUC和C_{max}，且与HMG－CoA抑制剂合用增加肌病危险，禁止与辛伐他汀、洛伐他汀、阿托伐他汀合用。对普伐他汀、氟伐他汀无影响。

6．本品可使咪达唑仑血药浓度增加，合用时应监测咪达唑仑的血药浓度并调整剂量。

7．与地高辛合用可使地高辛峰浓度和谷浓度分别升高73%和21%。合用时应监测地高辛浓度。

8．与茶碱合用，茶碱的稳态血药浓度及AUC增加，胃肠道不良反应（如恶心、呕吐）增加，尤其女性患者。合用时应间隔1h用药。

9．本品不能与利福平合用。

10．本品可使口服避孕药作用增强。

11．与麦角碱衍生物合用时，外周血管痉挛、感觉迟钝发生率增加，不宜合用。

【不良反应】不良反应多为轻到中度。

1．消化系统腹胀、消化不良、胃肠道不适、肠胃胀气、便泌、胃肠炎、食欲减退、口腔念珠菌感染、舌炎、口腔炎、水样便。

2．肝、胆丙氨酸氨基转移酶（ALT）升高、天冬氨酸氨基转移酶（AST）升高，多无症状并可逆。

3．神经系统　口干、瞌睡、失眠、眩晕、

出汗。

4. 全身：腹痛、疲乏。

5. 眼常见视力模糊、复视、聚焦困难，多为轻度、中度，也有严重不良反应报道，多于首次或第二次用药时出现。

6. 生殖系统：阴道炎、真菌性阴道病。

7. 其他：焦虑、心动过缓、湿疹、血胆红素升高、多形性红斑面部发红、低血压、血液碱性磷酸酶升高、嗜酸粒细胞增多、血小板增多、感觉异常、瘙痒、荨麻疹。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
泰利霉素片	化学药	HZ003344

HY001844 酞丁安

【其他名称】6133、增光素

【外文名称】Ftibamzone

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】3－邻苯二甲酰胺基－2－氧代丁醛－1，2－双缩氨基硫脲

【分子式】$C_{14}H_{15}N_7O_2S_2$

【分子量】377.45

【性状及组成】本品为黄色结晶性粉末，无臭，味微苦，遇光颜色渐变深。本品在二甲基甲酰胺中易溶，在二氧六环中微溶在水、乙醇或乙醚中几乎不溶，在氢氧化钠溶液中易溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗病毒药。

本品能抑制感染性单纯疱疹病毒Ⅰ型和Ⅱ型的复制，而不影响病毒从 Vero 细胞内的释放。其作用机制是明显抑制病毒 DNA 合成，而对正常细胞 DNA 合成的影响甚微，又经试验证明其还具有较好的抗真菌作用和止痒作用。具有抗沙眼衣原体和抗疱疹病毒活性。

【不良反应】偶见过敏反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
酞丁安搽剂	化学药	HZ003345
酞丁安滴眼液	化学药	HZ003346
酞丁安乳膏	化学药	HZ003347

HY001845 酞磺胺噻唑

【其他名称】PST、羧苯甲酰磺胺噻唑、Sulfathalidine、Taleudron、Talidine、Talisulfazol、Thalazole、酞磺噻唑、泻痢定

【外文名称】Phthalylsulfathiazole

药物理化信息

【化学名】2－［［［4－［（2－噻唑氨基）磺酰基］苯基］氨基］羰基］苯甲酸

【分子式】$C_{17}H_{13}N_3O_5S_2$

【分子量】403.43

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶性粉末，无臭。本品在乙醇中微溶，在水或三氯甲烷中几乎不溶；在氢氧化钠溶液中易溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为磺胺类抗菌药，口服后吸收量极少，在肠道内缓慢分解出磺胺噻唑而发挥其较强的抑菌作用，本品对革兰阳性和阴性菌均具抗菌作用，但目前细菌对该类药物的耐药现象普遍，肠杆菌科等细菌对其耐药菌株增多。

本品为广谱抑菌剂，其作用机制为在结构上类似对氨基苯甲酸（PABA），可与 PABA 竞争性作用于细菌体内的二氢叶酸合成酶，从而阻止 PABA 作为原料合成细菌所需的叶酸，减少了具有代谢活性的四氢叶酸的量，而后者则是细菌合成嘌呤、胸腺嘧啶核苷酸和脱氧核糖核酸（DNA）的必需物质，因此抑制了细菌的生长繁殖。

【药代动力学】本品口服后仅少量吸收，约 95% 残留在肠道内缓慢分解出磺胺噻唑而发挥其抑菌作用，仅 5% 缓慢水解为磺胺甲噁唑而被吸收。血内磺胺浓度一般低于 15μg/ml，但也有高达 60μg/ml。

【药物相互作用】

1. 不能与对氨基苯甲酸合用，对氨基苯甲酸可代替本品被细菌摄取，两者相互拮抗。

2. 下列药物与本品同用时，本品可取代这些药物的蛋白结合部位，或抑制其代谢，以致药物作用时间延长或发生毒性反应，因此当这些药物与磺胺药同时应用，或在应用本品之后使用时需调整其剂量。此类药物包括口服抗凝药、口服降血糖药、甲氨蝶呤、苯妥英钠和硫喷妥钠。

3. 与避孕药（雌激素类）长时间合用可导致避孕的可靠性减小，并增加经期外出血的机会。

4. 与溶栓药物合用时，可能增大其潜在的毒性作用。

5. 与肝毒性药物合用时，可能引起肝毒性发生率的增高。对此类患者尤其是用药时间较长及以往

有肝病史者应监测肝功能。

6. 与光敏药物合用时，可能发生光敏作用相加。

7. 接受本品治疗者对维生素 K 的需要量增加。

8. 不宜与乌洛托品合用，因乌洛托品在酸性尿中可分解产生甲醛，后者可与本品形成不溶性沉淀物，使发生结晶尿的危险性增加。

9. 本品可取代保泰松的血浆蛋白结合部位，当两者同用时，可增强保泰松的作用。

10. 磺吡酮与本品合用时可减少后者自肾小管的分泌，导致血药浓度升高而持久，易产生毒性反应，因此在应用磺吡酮期间或在应用其治疗后可能需要调整本品的剂量。当磺吡酮疗程较长时，对磺胺药的血药浓度宜进行监测，有助于剂量的调整，保证安全用药。

11. 与尿碱化药合用可增加本品在碱性尿中的溶解度，使排泄增多。

12. 与骨髓抑制药合用可能增强此类药物对造血系统的不良反应。如白细胞、血小板减少等，如确有指征需两药同用时，应严密观察可能发生的毒性反应。

【药物过量】磺胺血浓度不应超过 200μg/ml，超过此浓度，不良反应发生率增高，毒性增强。

【不良反应】本品吸收少，故不良反应小。偶见皮疹、药物热及其他变态反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
酞磺胺噻唑片	化学药	HZ003349

HY001846　弹性酶

【其他名称】弹性蛋白酶、胰弹性蛋白酶、胰太酶 E

【外文名称】Elastase

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（生化药品）·第 1 册

【性状及组成】本品系自猪胰脏提取制得的弹性蛋白水解酶。按干燥品计算，每 1mg 的效价不得少于 25 活力单位。

本品为类白色或浅黄色粉末。

药物药理信息

【药理毒理】本品为一肽链内切酶，能水解弹性蛋白、胶原蛋白和糖蛋白，增强脂蛋白酯酶活性，阻止胆固醇的体内合成并促其转化为胆酸，降低血浆胆固醇、LDL、VLDL 和甘油三酯，升高 HDL，阻止脂质向动脉壁沉积，分解陈旧的弹性蛋白并促进新的弹性蛋白合成，维持血管弹性，抑制肾小球基底膜肥厚，降低肾脏微量蛋白的排泄。临床适用于糖尿病并发的大小血管病变，动脉硬化和高脂血症的治疗。

外用可去除烫伤皮肤溃疡的坏死组织、促进肉芽生长、创伤愈合和使瘢痕软化。

小鼠腹腔注射 LD_{50}为 101.6 ± 14.1mg/kg，犬按 300 单位/kg 分别口服和注射，4 周后，经血常规、肝功、肾功等生化指标及病理学检查未见异常。小鼠孕期连续经灌胃给本品 750、7500、75000 单位/kg，未见造成死胎、畸形等。

【药代动力学】成年人空腹口服本品 6 片，12 小时达血浆峰值浓度 0.83ng/ml，$t_{1/2}$19.4 小时。

【不良反应】偶见过敏反应，可出现轻度胃肠症状，如腹胀、食欲减退等，尚可见肝区痛、口干、嘴唇发麻。一般无须治疗，可自愈。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
弹性酶肠溶片	化学药	HZ003351
貂胰防裂软膏	民族药	MZ000093

HY001847　碳酸钙

【外文名称】Calcium Carbonate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】碳酸钙

【分子式】$CaCO_3$

【分子量】100.09

【性状及组成】本品为白色极细微的结晶性粉末，无臭，无味。本品在水中几乎不溶，在乙醇中不溶；在含铵盐或二氧化碳的水中微溶，遇稀醋酸、稀盐酸或稀硝酸即发生泡沸并溶解。

药物药理信息

【药理毒理】本品为补钙剂，是重要的骨代谢调节剂，具有促进骨骼及牙齿钙化形成的作用，并能维持神经与肌肉的正常兴奋性和降低毛细血管的通透性。

本品为中和胃酸药。可中和或缓冲胃酸，但对胃酸分泌无直接抑制作用。

【药物相互作用】

1. 本品不宜与洋地黄类药物合用。

2. 大量饮用含酒精和咖啡因的饮料以及大量吸烟，均会抑制钙剂的吸收。

3. 大量进食富含纤维素的食物能抑制钙的吸收，因钙与纤维素结合成不易吸收的化合物。

4. 本品与苯妥英钠及四环素类同用，二者吸收减少。

5. 维生素 D、避孕药、雌激素能增加钙的吸收。

6. 含铝的抗酸药与本品同服时，铝的吸收增多。

7. 本品与噻嗪类利尿药合用时，易发生高钙血症（因增加肾小管对钙的重吸收）。

8. 本品与含钾药物合用时，应注意心律失常的发生。

【不良反应】可见嗳气，便秘，腹部不适，大剂量服用可见高钙血症，表现为畏食、恶心、呕吐，便秘，腹痛，肌无力，心律失常以及骨石灰沉着等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
丁硼乳膏	化学药	HZ000741
法莫替丁钙镁咀嚼片	化学药	HZ000874
复方颠茄氢氧化铝散	化学药	HZ001137
复方法莫替丁咀嚼片	化学药	HZ001160
复方甘草浙贝氯化铵片	化学药	HZ001185
复方酵母碳酸铋片	化学药	HZ001232
复方木香铝镁片	化学药	HZ001322
复方碳酸钙咀嚼片	化学药	HZ001400
复方碳酸钙泡腾颗粒	化学药	HZ001401
复方碳酸钙泡腾片	化学药	HZ001402
复方胃膜素胶囊	化学药	HZ001430
钙尔奇 $D_3$00 咀嚼片	化学药	HZ001532
钙尔奇 D600 片	化学药	HZ001533
碳酸钙 D_3 咀嚼片	化学药	HZ003352
碳酸钙二甲硅油咀嚼片	化学药	HZ003353
碳酸钙甘氨酸胶囊	化学药	HZ003354
碳酸钙胶囊	化学药	HZ003355
碳酸钙咀嚼片	化学药	HZ003356
碳酸钙颗粒剂	化学药	HZ003357
碳酸钙口服混悬液	化学药	HZ003358
碳酸钙泡腾颗粒剂	化学药	HZ003359
碳酸钙片	化学药	HZ003360
维 D 钙咀嚼片	化学药	HZ003520
维生素 D_3 碳酸钙片	化学药	HZ003571

续表

制剂名称	类别	序号
驱白巴布期片	民族药	MZ000441
百日咳片	中成药	ZC000201
冰霜痱子粉	中成药	ZC000366
妇科十味片	中成药	ZC001206
复方五仁醇胶囊	中成药	ZC001554
甘芍消渴片	中成药	ZC001673
肝喜乐片	中成药	ZC001716
全鹿片	中成药	ZC004275
胃乐胶囊	中成药	ZC005709
消咳宁片	中成药	ZC006067
珍黄胃片	中成药	ZC007226

HY001848 碳酸钾

【其他名称】粗碳酸钾、钾碱、结晶碳酸钾、无水碳酸钾、珍珠灰

【外文名称】Potassium Carbonate

【性状及组成】本品为白色结晶粉末，溶于水，水溶液呈碱性，不溶于乙醇、丙酮和乙醚。吸湿性强，暴露在空气中能吸收二氧化碳和分，转变为碳酸氢钾。水合物有一水物、二水物、三水物。

密度：2.428g/cm^3。熔点 891℃。沸点时分解。

药物药理信息

【药理毒理】本品作碱化剂、pH 调节剂和浸出辅助剂。本品也是食品添加剂，在食品工业中用于制造面食、奶油、果酱、果冻、巧克力等食品。

【药物相互作用】本品遇酸生成盐和水，并放出二氧化碳。

【不良反应】本品的水溶液碱性较强，浓缩液对皮肤和黏膜有腐蚀性。本品 LD_{50}为 10～15g/kg（狗），无毒，内服一般认为是安全的，一日允许摄入量未作限制规定。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
硼砂甘油钾溶液	化学药	HZ002855

HY001849 碳酸锂

【其他名称】Camcolit、Eskalith、Hypnore、Lithane、Manialith、Piadel、Plenur Comcolit

【外文名称】Lithium Carbonate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】碳酸锂

【分子式】Li_2CO_3

【分子量】73.89

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；无臭，无味；水溶液显碱性反应。本品在水中微溶，在乙醇中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品以锂离子形式发挥作用，其抗躁狂发作的机制是能抑制神经末梢 Ca^{2+} 依赖性的去甲肾上腺素和多巴胺释放，促进神经细胞对突触间隙中去甲肾上腺素的再摄取，增加其转化和灭活，从而使去甲肾上腺素浓度降低，还可促进 5－羟色胺合成和释放，而有助于情绪稳定。本品不良反应较多，但仍为治疗躁狂症的首选药。

【药代动力学】口服吸收快而完全，生物利用度为 100%，表观分布容积（V_d）0.8L/kg，血浆清除率（Cl）0.35ml/（min·kg），单次服药后经 4 小时血药浓度达峰值。按常规给药约 5～7 日达稳态浓度，脑脊液达稳态浓度则更慢。锂离子不与血浆和组织蛋白结合，随体液分布于全身，各组织浓度不一，甲状腺、肾浓度最高，脑脊液浓度约为血浓度的一半。碳酸锂在成人体内的半衰期（$t_{1/2}$）为 12～24 小时，少年为 18 小时，老年人为 36～48 小时。本品在体内不降解，无代谢产物，绝大部分经肾排出，80%可由肾小管重吸收，锂的肾廓清率颇稳定为 15～30ml/min，随着年龄的增加，排泄时间减慢，可低至 10～15ml/min，消除速度因人而异，特别与血浆内的钠离子有关，钠盐能促进锂盐经肾排出，有效血清锂浓度为 0.6～1.2mmol/L。可自母乳中排出。晚期肾病患者半衰期延长，肾衰时需调整给药剂量。

【药物相互作用】

1．本品与氨茶碱、咖啡因或碳酸氢钠合用，可增加本品的尿排出量，降低血药浓度和药效。

2．本品与氯丙嗪及其他吩噻嗪衍生物合用时，可使氯丙嗪的血药浓度降低。

3．本品与碘化物合用，可促发甲状腺功能低下。

4．本品与去甲肾上腺素合用，后者的升压效应降低。

5．本品与肌松药（如琥珀胆碱等）合用，肌松作用增强，作用时效延长。

6．本品与吡罗昔康合用，可导致血锂浓度过高而中毒。

【药物过量】

1．中毒症状：可出现脑病综合征，如意识模糊、震颤、反射亢进、癫痫发作乃至昏迷、休克、肾功能损害。当血锂浓度 > 1.5mmol/L，会出现不同程度的中毒症状；血锂浓度 1.5～2.0mmol/L 以上危及生命。老年或易感病人，易出现中毒症状，应谨慎。早期表现为恶心、呕吐、腹泻、畏食等消化道症状，继而出现肌无力，四肢震颤、共济失调、嗜睡、意识模糊或昏迷。

2．处理：一旦发现中毒征象，应立即停药，并依病情给予对症治疗及支持疗法。

【不良反应】常见不良反应：口干、烦渴、多饮、多尿、便秘、腹泻、恶心、呕吐、上腹痛。神经系统不良反应有双手细震颤、萎靡、无力、嗜睡、视物模糊、腱反射亢进。可引起白细胞升高。上述不良反应加重可能是中毒的先兆，应密切观察。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
碳酸锂缓释片	化学药	HZ003361
碳酸锂片	化学药	HZ003362

HY001850　碳酸镁

【外文名称】Magnesium Carbonate

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（二部）·第 5 册

药物理化信息

【化学名】无水碳酸镁

【分子式】$XMgCO_3 \cdot YMg(OH)_2 \cdot ZH_2O$

【分子量】84.31

【性状及组成】本品为白色颗粒性的粉末，是一种含水碱式盐。含量以氧化镁（MgO）计算应为 40%～43.5%。有轻质碳酸镁（15g 约 200ml 体积）和重质碳酸镁。溶于稀酸中并放出二氧化碳。几乎不溶于水或乙醇。能使水呈弱碱性。无毒。无臭。无味。在空气中稳定。加热至 300℃以上能分解生成水、氧化镁和二氧化碳。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：中和胃酸药。

本品口服后在胃内与盐酸作用生成氯化镁和二氧化碳，起到中和胃酸的作用，作用比氧化镁弱，用于胃及十二指肠溃疡。也有轻泻作用。

本品作为辅料，碳酸镁主要用作直接压片的稀释剂，最大用量 45%（W/W）。重质碳酸镁压制的片剂具有高硬度、低脆性和良好的崩解性，然而。碳酸镁对溶出性和崩解性有不同的影响，碳酸镁也用在压片过程中吸收液体，如作为香料的吸收剂。

在食品中，碳酸镁为食品添加剂，临床上用作抗酸剂。

【药物相互作用】忌与酸性药物配伍。与苯巴比妥钠，pH≥5 的地西泮溶液，某些两元混合物（粉末）及兰索拉唑配伍禁忌。酸可以溶解碳酸镁并释放二氧化碳。其水溶液稍带碱性。碳酸镁在 pH1.12 时可增加乙酰唑胺的溶解度，在 pH7.4 时阻滞其溶解。

【不良反应】碳酸镁作为口服固体制剂的辅料，通常被认为无毒、无刺激性，但肾损伤的患者忌用。

碳酸镁与胃酸反应，生成氯化镁和 CO_2，可有腹泻，腹胀，嗳气。因此，对于不能忍受胃中 CO_2 作用的患者来说，不可用作抗酸剂。某些镁吸收后由尿排泄。与其他镁盐一样，碳酸镁有轻微通便作用，可以引起腹泻。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
铋镁豆蔻片	化学药	HZ000408
复方次硝酸铋片	化学药	HZ001112
复方颠茄氢氧化铝散	化学药	HZ001137
复方碱式硝酸铋片	化学药	HZ001229
鼠李铋镁片	化学药	HZ003218
陈香露白露片	中成药	ZC000560
复方陈香胃片	中成药	ZC001293
肝悦片	中成药	ZC001722
活胃胶囊	中成药	ZC002328
活胃散	中成药	ZC002329
胃散	中成药	ZC005726

HY001851 碳酸钠

【外文名称】Sodium Carbonate

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（二部）·第 5 册

药物理化信息

【化学名】碳酸钠

【分子式】$Na_2CO_3 \cdot 10H_2O$

【分子量】286.15

【性状及组成】本品为无色、透明的斜方形结晶，无臭，有风化性，水溶液遇酚酞指示液显碱性反应。

本品在水中易溶，在乙醇中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】外用抗酸药。用于酸类腐蚀的溃疡。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用复方三维 B	化学药	HZ004763
注射用硫喷妥钠	化学药	HZ004858
注射用美罗培南	化学药	HZ004892
五妙水仙膏	中成药	ZC005860

HY001852 碳酸氢钙

【外文名称】Calcium Bicarbonate

药物药理信息

【药理毒理】本品为补钙剂。能促进骨骼和牙齿的钙化，补充钙质的不足。也可配合体液电解质输液应用，以提高血钙浓度，具有消炎、消肿和抗过敏作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方木麻黄片	中成药	ZC001459

HY001853 碳酸氢钾

【外文名称】Potassium Bicarbonate

药物理化信息

【化学名】碳酸氢钾

【分子式】$KHCO_3$

【分子量】100.11

【性状及组成】本品为无色透明单斜晶系结晶或白色颗粒或结晶粉末，无臭、有咸味或轻微的碱味。密度 2.17g/cm³。100℃时开始分解，200℃时完全分解。溶于水，因水解而呈弱碱性。难溶于酒精。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料，碱化剂。

作为辅料，碳酸氢钾通常以 25% ~ 50%（*W*/*W*）的浓度作为泡腾剂中二氧化碳的来源。不适合用碳酸氢钠时，如制剂中不希望或不得有钠离子，可用碳酸氢钾。碳酸氢钾经常与枸橼酸或酒石酸一起制备泡腾片剂或颗粒，遇水后，发生化学反应释放出二氧化碳，制剂随之崩解。有时，在片剂处方中单独使用碳酸氢钾也是有效的，因为与胃酸发生反应也足以泡腾，使制剂崩解。

最近，碳酸氢钾被研究用作海藻酸盐的漂浮系

统的气体发生剂。

碳酸氢钾也用在食品中作为碱和发酵剂，是发酵粉的组分。

在治疗上，碳酸氢钾可替代碳酸氢钠用于某些代谢性酸中毒的治疗；也可用作抗酸剂，中和胃肠道中胃酸分泌；还可用来补充钾。

【药物相互作用】碳酸氢钾与酸或酸式盐产生反应并产生二氧化碳。

【不良反应】碳酸氢钾可用于化妆品、食品以及口服制剂中，一般认为碳酸氢钾用作辅料时相对无毒、无刺激性；但过多的摄取碳酸氢钾或其他钾盐可引起高钾血症。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方氯化钾颗粒	化学药	HZ001296
复方氯化钾泡腾片	化学药	HZ001297

HY001854　碳酸氢钠

【其他名称】重碳酸钠、酸式碳酸钠、小苏打、重曹

【外文名称】Sodium Bicarbonate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】碳酸氢钠

【分子式】$NaHCO_3$

【分子量】84.01

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；无臭，味咸；在潮湿空气中即缓缓分解；水溶液放置稍久，或振摇，或加热，碱性即增强。本品在水中溶解，在乙醇中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】

1．治疗代谢性酸中毒，本品使血浆内碳酸根浓度升高，中和氢离子，从而纠正酸中毒；

2．碱化尿液，由于尿液中碳酸根浓度增加后 pH 升高，使尿酸、磺胺类药物与血红蛋白等不易在尿中形成结晶或聚集；

3．制酸，口服能迅速中和或缓冲胃酸，而不直接影响胃酸分泌。因而胃内 pH 迅速升高缓解高胃酸引起的症状。

【药代动力学】本品经静脉滴注后直接进入血液循环。血中碳酸氢钠经肾小球滤过，进入尿液排出。部分碳酸氢根离子与尿液中氢离子结合生成碳酸，再分解成二氧化碳和水。前者可弥散进入肾小管细胞，与胞内水结合，生成碳酸，解离后的碳酸氢根离子被重吸收进入血循环。血中碳酸氢根离子与血中氢离子结合生成碳酸，进而分解成二氧化碳和水，前者经肺呼出。

【药物相互作用】

1．合用肾上腺皮质激素（尤其是具有较强盐皮质激素作用者）、促肾上腺皮质激素、雄激素时，易发生高钠血症和水肿。

2．与苯丙胺、奎尼丁合用，后两者经肾排泄减少，易出现毒性作用。

3．与抗凝药如华法林和 M 胆碱酯酶药等合用，后者吸收减少。

4．与含钙药物、乳及乳制品合用，可致乳－碱综合征。

5．与西咪替丁、雷尼替丁等 H_2 受体拮抗剂合用，后者的吸收减少。

6．与排钾利尿药合用，增加发生低氯性碱中毒的危险性。

7．本品可使尿液碱化，影响肾对麻黄碱的排泄，故合用时麻黄碱剂量应减小。

8．钠负荷增加使肾脏排泄锂增多，故与锂制剂合用时，锂制剂的用量应酌情调整。

9．碱化尿液能抑制乌洛托品转化成甲醛，从而抑制后者治疗作用，故不主张两药合用。

10．本品碱化尿液可增加肾脏对水杨酸制剂的排泄。

11．减少口服铁剂的吸收，两药服用时间应尽量分开。

12．增加左旋多巴的口服吸收。

【不良反应】

1．大量注射时可出现心律失常、肌肉痉挛、疼痛、异常疲倦虚弱等，主要由于代谢性碱中毒引起低钾血症所致。

2．剂量偏大或存在肾功能不全时，可出现水肿、精神症状、肌肉疼痛或抽搐、呼吸减慢、口内异味、异常疲倦虚弱等。主要由代谢性碱中毒所致。

3．长期应用时可引起尿频、尿急、持续性头痛、食欲减退、恶心呕吐、异常疲倦虚弱等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
铋镁碳酸氢钠片	化学药	HZ000409
大黄碳酸氢钠片	化学药	HZ000618
复方次硝酸铋片	化学药	HZ001112
复方颠茄铋镁片	化学药	HZ001135
复方颠茄氢氧化铝散	化学药	HZ001137

续表

制剂名称	类别	序号
复方电解质眼内冲洗液	化学药	HZ001145
复方甘铋镁片	化学药	HZ001172
复方碱式硝酸铋片	化学药	HZ001229
复方酵母碳酸铋片	化学药	HZ001232
复方聚乙二醇电解质散	化学药	HZ001246
复方龙胆碳酸氢钠片	化学药	HZ001284
复方芦荟维 U 片	化学药	HZ001287
复方铝酸铋胶囊	化学药	HZ001289
复方铝酸铋颗粒	化学药	HZ001290
复方铝酸铋片（1）	化学药	HZ001291
复方铝酸铋片（2）	化学药	HZ001292
复方氯化钠滴眼液	化学药	HZ001298
复方硼砂含漱液	化学药	HZ001334
复方硼砂漱口片	化学药	HZ001335
复方石菖蒲碱式碳酸铋片	化学药	HZ001377
复方碳酸氢钠片	化学药	HZ001403
口服补液盐Ⅰ	化学药	HZ002135
龙胆碳酸氢钠片	化学药	HZ002449
龙胆碳酸氢钠散	化学药	HZ002450
神黄钠铝胶囊	化学药	HZ003195
鼠李铋镁片	化学药	HZ003218
双重造影产气剂	化学药	HZ003219
碳酸利多卡因注射液	化学药	HZ003363
碳酸氢钠颠茄胶囊	化学药	HZ003364
碳酸氢钠片	化学药	HZ003365
碳酸氢钠栓	化学药	HZ003366
碳酸氢钠注射液	化学药	HZ003367
小儿双嘧啶片	化学药	HZ003773
盐酸氨溴索泡腾片	化学药	HZ003877
大黄三味片	民族药	MZ000081
七味胃痛胶囊	民族药	MZ000400
陈香露白露片	中成药	ZC000560
复方陈香胃片	中成药	ZC001293
复方田七胃痛胶囊	中成药	ZC001541
复方田七胃痛片	中成药	ZC001542
活胃胶囊	中成药	ZC002328
活胃散	中成药	ZC002329

续表

制剂名称	类别	序号
救必应胃痛片	中成药	ZC002888
脉络通颗粒	中成药	ZC003498
神曲胃痛片	中成药	ZC004945
舒肝快胃丸	中成药	ZC005158
胃宁散	中成药	ZC005723
胃散	中成药	ZC005726
胃痛片	中成药	ZC005738
香砂胃痛散	中成药	ZC006013
新健胃片	中成药	ZC006477
野苏颗粒	中成药	ZC006762
婴儿健脾胶囊	中成药	ZC007033
婴儿健脾颗粒	中成药	ZC007034
婴儿健脾口服液	中成药	ZC007035
婴儿健脾散	中成药	ZC007036
婴儿口服液	中成药	ZC007037
婴儿散胶囊	中成药	ZC007040
婴儿素	中成药	ZC007041
元和正胃片	中成药	ZC007124

HY001855 糖精

【其他名称】邻苯酰磺亚胺

【外文名称】Glucide

药物理化信息

【化学名】邻苯酰磺亚胺

【分子式】$C_7H_5NO_3S$

【分子量】183.18

【性状及组成】本品为白色无臭或微芬香的结晶性粉末，有极强的甜味，熔程 226～230℃。

本品 1 份可溶于 290 份水，25 份沸水，12 份丙酮，30 份乙醇和 30 份甘油，微溶于三氯甲烷和乙醚，易溶于稀氨溶液、氢氧化碱溶液以及碳酸碱和碳酸氢碱溶液中，溶于后两者会同时放出 CO_2，饱和水溶液对石蕊显酸性。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料，甜味剂。

本品在食品和制药工业中用作甜味剂，本品约比蔗糖甜 500 倍。但这取决于使用的浓度，其稀溶液的相对甜度最大。本品没有营养价值，一般使用其钠盐。常用浓度为 0.01%，建议每天摄入量不超

过1g。在药剂中常用于内服液体制剂和含漱剂，以及糖尿病人饮食中代替蔗糖。

【药物相互作用】本品遇酸及酸性药物（pH3.8以下）很不稳定，易分解；在碱性环境中也分解；加热时促进分解。在水溶液中加热也不稳定。糖精能同大分子化合物反应产生沉淀。

【不良反应】本品 LD_{50} 为 17.5g/kg（小鼠，经口），一般认为是安全的，一日允许剂量 0～2.5mg/kg（FAO/WHO，1984 暂定值）。有长期服用导致膀胱癌的报道，但有争议，证据不足。1992 年 FDA 已否定了致癌作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
六合氨基酸颗粒	化学药	HZ002444
清热解毒口服液	中成药	ZC004143
乌梅人丹	中成药	ZC005807

HY001856　糖精钠

【其他名称】可溶性糖精、水溶性糖精

【外文名称】Saccharin Sodium

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】1,2－苯并异噻唑－3（2*H*）－酮 1,1－二氧化物钠盐二水合物

【分子式】$C_7H_4NNaO_3S\cdot 2H_2O$

【分子量】241.19

【性状及组成】本品为无色结晶或白色结晶性粉末。无臭或微有香气，味浓甜带苦；易风化。本品在水中易溶，在乙醇中略溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品标准类别：药用辅料，甜味剂。

本品比糖精在水中更易溶解，更常用于药物制剂中。作为甜味矫味剂，其甜度相当于蔗糖的 200～700 倍，使用浓度约 0.01%，可用以掩盖厌人的味道。在糖尿病人用药中作蔗糖代用品。诊断用药、矫味剂另外本品为注射剂用于测量臂到舌（arm－to－rongue）的循环时间，静脉注射，一次 1g，用灭菌注射用水制成 50% 注射液。本品也用于漱口药水和维生素制剂中。

【药物相互作用】本品遇酸或酸性药物，在加热下不稳定，分解而失去甜味。

【不良反应】摄入糖精钠后在体内不分解，随尿排出，不供给热能，无营养价值，LD_{50}为 17500mg/kg（小白鼠，腹腔注射），无毒，一般公认是安全的，一日摄入量暂定 0～0.5mg/kg（FAO/WHO，1984）。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
丁硼乳膏	化学药	HZ000741
复方甘菊利多卡因凝胶	化学药	HZ001186
复方氯己定含漱液	化学药	HZ001302
复方四环素泼尼松膜	化学药	HZ001397
复方五味子糖浆	化学药	HZ001434
复方枇杷喷托维林颗粒	中成药	ZC001465
裸花紫珠合剂	中成药	ZC003447
苑叶止咳糖浆	中成药	ZC007138

HY001857　特非那定

【其他名称】特非那丁

【外文名称】Terfenadine

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 11 册

药物理化信息

【化学名】α－［4－（1,1－二甲基乙基）苯基］－4－（羟基－二苯甲基）－1－哌啶丁醇

【分子式】$C_{32}H_{41}NO_2$

【分子量】471.68

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭、无味。

本品在三氯甲烷中易溶，在丙酮中溶解，在甲醇或乙醇中略溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 147～151℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为 H_1 受体拮抗剂，具有特异的外周 H_1 受体拮抗作用，有抗 5－羟色胺、抗胆碱和抗肾上腺素的作用，有轻度的支气管扩张作用，用药后 1～2 小时开始作用、3～4 小时达最大效应、并维持作用 12 小时以上。本品及其代谢物不能通过血脑屏障，因而基本上无中枢神经系统的不良反应。

【药代动力学】本品在消化道吸收良好（约 70% 吸收），有明显的首过效应，约 99%药物生成羧酸代谢物和无活性的去烃基物。基羧酸代谢物具有抗组胺活性，口服后半小时内即在血浆中出现，2.5 小时血药浓度达峰值平均 263ng/ml，有效浓度可持续 12 小时以上。本品主要以代谢物形式（60%）经胆汁随粪便排泄，尚有 40%代谢物由尿排泄。肝功能不

足者代谢受阻。老年人的清除率可降低 25%。2 小时可达血药峰浓度。

【药物相互作用】抑制肝药物代谢酶功能的药物可使本品代谢减慢，如伊曲康唑、酮康唑。

【药物过量】禁忌超量服用。

【不良反应】

1. 心血管系统　根据国外文献报道罕见有下列不良反应发生。如：室性心律不齐、尖端扭转性室速、室性心动过速、心室颤动、心脏骤停、低血压、心房扑动、晕厥、眩晕、Q－T 间期延长等，以上反应多数由于药物相互作用引起。

2. 中枢神经系统：如头痛、头晕、疲乏等。

3. 胃肠系统：腹部不适、恶心、呕吐、食欲增加、大便习惯改变等。

4. 其他：口干、鼻干、咽干、皮疹等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
特非那定分散片	化学药	HZ0003368
特非那定胶囊	化学药	HZ0003369
特非那定颗粒	化学药	HZ0003370
特非那定片	化学药	HZ0003371
特酚伪麻片	化学药	HZ0003372
特洛伪麻胶囊	化学药	HZ0003373

HY001858　蹄甲多肽

【外文名称】Hoof Nail Polypeptide

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 9 册

【性状及组成】本品主要成分为猪蹄甲提取物，是角蛋白部分水解生成的多肽。

药物药理信息

【药理毒理】本品可兴奋子宫，增加子宫收缩的频率和幅度，节律性地兴奋子宫肌影响内膜的血管，使血管呈扩张和收缩的双相变化，从而改善功能性子宫出血（功血）的子宫内膜血管血流障碍；可调节内分泌，通过促进肾上腺束状带分泌糖皮质激素，抑制纤维蛋白溶解，减少血管通透性，稳定溶酶体膜等作用，从而改善或制止（功血）时出血。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
蹄甲多肽片	化学药	HZ0003374

HY001859　替苯丙胺

【外文名称】Tenamfetamine

药物管理信息

【特殊管理分类】一类精神药

药物药理信息

【药理毒理】本品为中枢神经兴奋药。国食药监安［2007］633 号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为精神药品。

HY001860　替比夫定

【外文名称】Telbivudine

药物理化信息

【化学名】1－（（2*S*,4*R*,5*S*）－4－羟基－5－羟甲基四氢呋喃－2－yl）－5－甲基－1*H*－嘧啶－2,4－二酮

【分子式】$C_{10}H_{14}N_2O_5$

【分子量】242.23

【性状及组成】本品为白色略带极微黄色的粉末，易溶于水，微溶于乙醇和 noctanol。

药物药理信息

【药理毒理】本品为天然胸腺嘧啶脱氧核苷的自然 L－对映体，是人工合成的胸腺嘧啶脱氧核苷类抗乙肝病毒 HBV 药物。

1. 作用机制：替比夫定为天然胸腺嘧啶脱氧核苷的自然 L－对映体，是人工合成的胸腺嘧啶脱氧核苷类抗乙肝病毒（HBV）DNA 多聚酶药物。替比夫定在细胞激酶的作用下被磷酸化为有活性的代谢产物——腺苷，腺苷的细胞内半衰期为 14 小时。替比夫定 5′－腺苷通过与 HBV 中自然底物胸腺嘧啶 5′－腺苷竞争，从而抑制 HBV－DNA 多聚酶的活性；通过整合到 HBV－DNA 中造成乙肝病毒（HBV）DNA 链延长终止，从而抑制乙肝病毒的复制。替比夫定同时抑制乙肝病毒（HBV）DNA 第一链（EC_{50} 为（1.3 ± 1.6）μmol/L）和第二链（EC_{50} 为（0.2 ± 0.2）μmol/L）的合成。替比夫定 5′－腺苷浓度≤100μmol/L 时不会抑制人体细胞 DNA 多聚酶，浓度≤10μmol/L 时未观察到明显的细胞线粒体毒性。

2. 抗病毒作用：在鸭乙型肝炎病毒感染的鸭肝细胞中和 HBV 病毒表达的人类肝细胞株 2.2.15 中观察替比夫定的抗病毒作用，结果为：替比夫定抑制 50%病毒 DNA 复制的浓度（IC_{50}）在两类细胞系统中为 0.2μmol/L 左右。在细胞培养中，替比夫定的抗病毒作用不被核苷类 HIV 逆转录酶抑制剂（NRTIs）－去羟肌苷 Didanosin 和司他夫定抵抗，而与阿德福韦

联用具有协同效果。替比夫定抗 HIV－1 病毒的作用低（EC_{50} value ＞ 100 μmol/L），但不抵抗阿巴卡韦、去羟肌苷、恩曲他滨、拉米夫定、司他夫定、泰诺福韦（Tenofovir）和齐多夫定。

3．耐药性：对一项三期全球登记试验（007 GLOBE－study）中实际治疗（as－treated）的分析发现，接受替比夫定每天口服 600mg 的患者 52 周后，血清中未发现可检测的 HBV－DNA 的比例分别为 59%（252/430）和 89%（202/227）。第 52 周，接受替比夫定治疗的 HBeAg 阳性和 HBeAg 阴性患者血清中 HBV－DNA 水平≥1000 copies/ml 的比例分别为（34%）和 19/227（8%）。基因型分析发现含有可扩增 HBV 病毒 DNA 而且治疗超过 16 周的 HBeAg 阳性和 HBeAg 阴性患者中出现一个或多个氨基酸替换和病毒学衰退（rtM204I，rtL80I/V，rtA181T，rtL180M，rtL229W/V）的比例分别是 49/103 和 12/12。在 46 例发生变异的患者中，其中的 34 例中 rtM204I 替换是最常发生的变异而且与病毒学反弹有关。

4．交叉耐药性：核苷类抗乙肝病毒（HBV）药物具有交叉耐药的特点。发生 rtM204I 变异或者 rtL180M/rtM204V 双变异的对拉米夫定耐药的 HBV 病毒对替比夫定抗病毒应答率（效果）降低超过 1000 倍。替比夫定对与 rtM204V 变异有关的拉米夫定耐药的病毒仍有效（效果降低 1.2 倍），表现出中度的抗病毒活性。替比夫定对 rtM204V 变异的 HBV 病毒的作用还没有临床试验作参考。在细胞培养中，与阿德福韦酯耐药有关的 rtA181V 变异的病毒对替比夫定的敏感度减低 3 到 5 倍；与阿德福韦酯耐药有关的 N236T 变异的病毒对替比夫定仍然敏感。

【药代动力学】健康志愿者与慢性乙肝病人服用替比夫定的药代动力学相似。在服用 1～4 小时（中值为 2 小时）后，替比夫定最大血药浓度（C_{max}）为（3.69 ± 1.25）μg/ml（mean ± SD），$AUC_{0-\infty}$ 为（26.1 ± 7.2）μg·h/ml（mean ± SD），低谷血药浓度（ctrough）为 0.2～0.3μg/ml。每天一次 600mg，连续给药 5～7 天后达到稳态浓度，药物半衰期为 15 小时。单剂 600mg 服用时，食物（高脂肪、高能量）不影响替比夫定的药代动力学。体外试验表明替比夫定与人血浆蛋白结合率低（3.3%），口服后，替比夫定在血液中被血浆和血细胞分开，并迅速在周围组织中分布。替比夫定对任何一种下列常见的人体 CYP450 酶都无抑制作用：CYP1A2、CYP2C9、CYP2C19、CYP2D6 和 CYP3A4。替比夫定不是这些酶的作用底物。替比夫定通过被动扩散的方式以原药的形式通过肾脏排出，因为肾脏分泌是替比夫定清除的最主要途径，所以中重度肾功能不全者或正进行血液透析应相应调整剂量和服用方法。

【药物相互作用】替比夫定通过肾小球滤过和肾小管被动扩散的方式经肾脏排泄，故与其他经肾小管分泌的药物发生相互作用的可能性很小。替比夫定与其他经肾小管分泌的药物或改变肾小管分泌功能的药物合用可以增加替比夫定或合用药物的血清浓度。

【不良反应】国外临床研究中常见不良反应为虚弱、头痛、腹痛、恶心、胃肠气胀、腹泻和消化不良。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
替比夫定片	化学药	HZ003375

HY001861　替勃龙

【外文名称】Tibolone

药物药理信息

【药理毒理】替勃龙（7－甲基异炔诺酮）是一种具有组织特异性的合成类固醇，本身无生物活性，其作用来自于它的代谢物。替勃龙口服后被迅速代谢为另外的三种留体，即 Δ4 异构体、3α－羟基替勃龙和 3β－羟基替勃龙。这些代谢物与雌激素、孕激素和雄激素受体有不同程度结合，产生雌激素、孕激素及轻微的雄激素作用。临床上用于妇女自然绝经和手术绝经所引起的各种症状。

本品是一种组织选择性雌激素活性调节剂，对心血管和骨组织可发挥雌激素的保护作用，并可有效抑制血管舒缩症状，重建脑内啡肽正常水平，治疗更年期综合征相关的神经和精神症状。

本品对乳腺和子宫内膜无促生长作用，不增加子宫内膜癌和乳腺癌的风险，但对乳腺也无保护作用。本品不增加静脉血栓的发生，所致阴道出血发生率较低，且多发生于用药头 6 个月，长期服用者 66%～70%发生闭经。其主要不良反应有体重增加、眩晕、毛发生长、油脂分泌和胃肠道不适等。绝经前妇女应用本品可能抑制排卵，干扰正常月经周期，但不能作为避孕药。而且，本品可能增强纤溶系统活性，和抗凝剂同时使用时可增强抗凝剂疗效，故肝功能不良和凝血功能异常患者应慎用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
替勃龙片	化学药	HZ003376

HY001862　替加氟

【其他名称】呋氟尿嘧啶、喃氟啶、四氢呋喃氟

尿嘧啶

【外文名称】Tegafur

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】1 - （四氢 - 2 - 呋喃基） - 5 - 氟 - 2,4（1*H*,3*H*） - 嘧啶二酮

【分子式】$C_8H_9FN_2O_3$

【分子量】200.17

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭。

本品在甲醇、丙醇或三氯甲烷中溶解，在水或乙醇中略溶，在苯或乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 164 ~ 169℃。

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理：本品为氟尿嘧啶的衍生物，在体内经肝脏活化逐渐转变为氟尿嘧啶而起抗肿瘤作用，在体内干扰、阻断 DNA、RNA 及蛋白质合成，是抗嘧啶类的细胞周期特异性药物，主要作用于细胞增殖周期的 S 期。对 G1/S 转换期也有延续作用。化疗指数为氟尿嘧啶的 2 倍，毒性仅为氟尿嘧啶的 1/4 ~ 1/7。

2. 毒理：动物的慢性毒性实验中未见到严重的骨髓抑制，对免疫功能的影响轻微。

【药代动力学】本品口服吸收良好，给药后 2 小时作用达最高峰，持续时间较长，为 12 ~ 20 小时。血浆 $t_{1/2}$为 5 小时，静注后均匀地分布于肝、肾、小肠、脾和脑，以肝、肾中的浓度为最高。由于本品具有较高的脂溶性，可通过血脑屏障，在脑脊液中浓度比氟尿嘧啶高。本品经肝脏代谢，主要由尿和呼吸道排出，给药后 24 小时内由尿中以原形排出 23%，由呼吸道以 CO_2 形式排出 55%。

静注后，均匀分布于肝、肾、小肠、脾和脑，而以肝、肾浓度较高，且可通过血脑屏障，脑脊液中浓度比氟尿嘧啶高，血 $t_{1/2}$ 5 小时，24 小时后尿排出原形 23%，55%从肺经呼吸排出。

【药物相互作用】本品呈碱性且含碳酸盐，避免与含钙、镁离子及酸性较强的药物合用。

【不良反应】轻度骨髓抑制表现为白细胞和血小板减少。轻度胃肠道反应以食欲减退、恶心为主，个别病人可出现呕吐、腹泻和腹痛，停药后可消失。其他反应有乏力、寒战、发热、头痛、眩晕、运动失调、皮肤瘙痒、色素沉着、黏膜炎及注射部位血管疼痛等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
尿嘧啶替加氟胶囊	化学药	HZ002802
尿嘧啶替加氟片	化学药	HZ002803
替吉奥胶囊	化学药	HZ003377
替加氟胶囊	化学药	HZ003378
替加氟氯化钠注射液	化学药	HZ003379
替加氟片	化学药	HZ003380
替加氟栓	化学药	HZ003381
替加氟注射液	化学药	HZ003382
注射用替加氟	化学药	HZ004968

HY001863 替卡西林

【其他名称】的卡西林、噻卡青霉素、羧噻吩青霉素钠

【外文名称】Ticarcillin

【性状及组成】常用其钠盐，为白色或类白色结晶性粉末（冻干制品为饼状物），易溶于水。

药物药理信息

【药理毒理】本品对革兰阳性菌的抑菌作用低于青霉素 G。对革兰阴性菌的抑制作用较羧苄西林强数倍。绿脓杆菌、变形杆菌、肠杆菌属、大肠杆菌对本品较敏感，沙雷杆菌对本品耐药。口服不易吸收。

【药物相互作用】本品与庆大霉素合用以提高疗效，但二者不宜放于同一滴注瓶内应用，以防相互影响疗效。

【不良反应】本品的不良反应与羧苄西林相似，当用药时间长及药量大时，可使出血时间延长和电解质紊乱、血钾降低。对肾功能不全的病人，使用本品的双钠盐，可使钠负荷增加。肌注后偶有局部疼痛和静注后发生静脉炎等。亦有血清转氨酶增高出现，但停药后会恢复。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用替卡西林钠克拉维酸钾	化学药	HZ004969

HY001864 替考拉宁

【其他名称】壁霉素、他格适、肽可霉素

【外文名称】Teicoplanin

药物药理信息

【药理毒理】本品为与万古霉素类似的新糖肽抗生素，其抗菌谱及抗菌活性与万古霉素相似。对金黄色葡萄球菌的作用比万古霉素更强，不良反应更

少。本品对革兰阳性菌如葡萄球菌、链球菌、肠球菌和大多厌氧性阳性菌敏感。

1. 药效学：替考拉宁为一种新型糖肽类非肠道给药抗生素，具有强的杀菌活性。可供每天一次静脉或肌内注射。

本药抑制细胞壁合成的途径与万古霉素一样，干扰肽聚糖中新的部分的合成过程。本药通过与肽聚糖亚单位中的氨基酰－D－丙氨酰－D－丙氨酸部分结合而起效应，这种结合将正常可被细菌细胞延长和交叉－桥酸识别的部位隐藏起来。

这种结合抑制两个方面：形成细胞壁链的亚单位的生长或延长将新链接到细胞壁的最终穿越一桥步骤。因此，细胞壁的整合和牢固遭损坏，细胞生长停止，细胞最后死亡。由于替考拉宁独特的作用机制，很少出现耐替考拉宁的菌株。所以对青霉素类及头孢菌素类、大环内酯类、四环素和氯霉素、氨基糖苷类和利福平耐药的革兰阳性菌，仍对替考拉宁敏感。

2. 药动学

（1）吸收：替考拉宁口服不吸收，肌注后的生物利用度为94%。

（2）分布（血清浓度）：对人静注后其血清浓度显示出两相的分布（一相快速的分布紧接着是一相较慢的分布），其半衰期分别为0.3和3小时左右。该相分布跟随一个缓慢的排泄，其半衰期为70～100小时。

【药代动力学】本品口服不吸收。肌内注射 t_{max} 约2小时。PB约90%。几乎全由肾脏排泄，肾功能正常成年人 $t_{1/2}$ 约45～60小时，肾功能障碍时延长，无尿患者可长达163小时。

【药物相互作用】临床实践中，本药常与其他类药物同时使用，包括其他抗生素、降压药、麻醉剂、心脏病药、降糖药等，但未发现有不良的交叉反应。

配制好的溶液为pH7.5的等渗液，可直接注射，也可用下述溶剂稀释药粉：0.9%氯化钠注射液，复方乳酸钠溶液（林格－乳酸溶液，哈特曼溶液），5%葡萄糖注射液，0.18%氯化钠和4%葡萄糖注射液，含1.36%或3.86%葡萄糖的腹膜透析液。

替考拉宁和氨基糖苷类两种溶液直接混合是不相容的，因此注射前不能混合。

【不良反应】可引起注射处持久的疼痛。亦具有耳毒性。

人们对本药耐受性良好，不良反应一般轻微且短暂，很少需要中断治疗，严重不良反应罕见，已报道主要有以下不良反应。

1. 局部反应：红斑、局部疼痛、血栓性静脉炎。

2. 变态反应：皮疹、瘙痒、发热、支气管痉挛、过敏反应。

3. 胃肠道症状：恶心、呕吐、腹泻。

4. 血液学：嗜酸粒细胞增多、白细胞减少、中性粒细胞减少、血小板减少、血小板增多。

5. 肝功能：血清转氨酶和（或）血清碱性磷酸酶增高。

6. 肾功能：血清肌酐短暂升高。

7. 中枢神经系统：头晕、头痛。

8. 其他虽已报道，但尚未明确与本药是否有关的不良反应有：轻度听力下降，耳鸣和前庭功能紊乱。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用替考拉宁	化学药	HZ0004970

HY001865　替利定

【外文名称】Tilidine

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】本品为麻醉药，镇痛药。

HY001866　替马西泮

【其他名称】Levanxol、羟基安定、Restoril

【外文名称】Temazepam

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

药物药理信息

【药理毒理】本品为地西泮的代谢产物，其作用与硝西泮相似，有催眠作用，自体内消除快。本品还有较好的抗焦虑作用。适用于失眠、焦虑症及术前给药。

【不良反应】不良反应少、长期用药有依赖性。孕妇头3个月不得用本品。

HY001867　替米哌隆

【其他名称】硫米哌隆、硫米哌酮、Tolopelon

【外文名称】Timiperone

药物药理信息

【药理毒理】本品为丁酰苯类抗精神病药，具有较强的抗去氧麻黄碱作用、抗阿扑吗啡作用及条件回避反应抑制作用；而对锥体外系有关的致强直性

昏厥作用、协调运动抑制作用等非特异性作用则较弱；能促进脑内多巴胺代谢周转，具有多巴胺受体阻断作用。提示本品具有较强的抗精神病作用，而其锥体外系或运动系统的副作用则较小。其作用机制与其对脑内多巴胺能神经的抑制作用有关。

本品适用于治疗精神分裂症。

【药代动力学】本品口服后吸收缓慢而良好，约在4小时达血药峰浓度，其生物半衰期为4.4小时。大鼠口服^{14}C标记的本品，在脑内多巴胺能神经系统内分布浓度较高，在肝脏、甲状腺、肾中分布较多，肌肉、脂肪中较少。可透过胎盘屏障。本品经肝脏代谢，最后自肾脏排出。亦可经乳汁排泄。

【药物相互作用】

1. 可逆转肾上腺素的作用而致血压下降，故不宜合用。

2. 并用巴比妥类或饮酒时，作用可相互增强，故不宜饮酒，合用巴比妥类时应减量。

【不良反应】本品不良反应较多，用药时应注意。常见的有以下内容。

1. 心血管系统：偶见血压下降或上升、心动过速或过缓、胸闷、心电图改变（窦性心动过速或过缓、ST低下、T波低平、PQ延长、Q－T延长等）。

2. 马林氏综合征：如出现无动性缄默、强烈固缩、心动过速、出汗、发热等，应停药。

3. 肝脏：偶见ALT、AST、总胆固醇升高。

4. 锥体外系症状：帕金森综合征、运动障碍（痉挛性斜颈、颜面颈部挛缩、角弓反张、眼球震颤等运动障碍）、静坐不能；长期用药罕见口周等不随意运动，停药后仍继续。

5. 眼：偶见视力调节障碍。

6. 过敏：偶见皮疹等，需停药。

7. 血液：偶见贫血、白细胞增加或减少、粒细胞减少、血小板增加或减少、血糖下降或升高等。

8. 消化道：恶心、便秘、口渴、食欲减退，偶见呕吐、腹泻、食欲亢进等。

9. 内分泌：月经异常、泌乳、乳房痛。

10. 神经系统：睡眠障碍、焦虑不安、易激动、困倦、兴奋、躯体摇晃，偶见头痛、头重、感觉异常、错乱、冲动行为、性欲亢进、意识障碍等。

11. 其他：有时倦怠、无力、起立时头晕，偶见鼻塞、出汗、耳鸣、发热、水肿、鼻血、血尿素氮升高、肌酸酐上升，尿蛋白、尿胆素原、尿糖假阳性或阳性。

HY001868 替米沙坦

【其他名称】Micardis、美卡素

【外文名称】Telmisartan

药物理化信息

【化学名】4′－［4－甲基－6－（1－甲基－1*H*－苯并咪唑－2－基）－2－丙基－1H－苯并咪唑－1－基甲基］联苯基－2－羧酸

【分子式】$C_{33}H_{30}N_4O_2$

【分子量】514.63

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理作用：替米沙坦是一种口服起效的、特异性血管紧张素Ⅱ受体（AT1型）拮抗剂，与血管紧张素Ⅱ受体AT1亚型（已知的血管紧张素Ⅱ作用位点）呈高亲和性结合，该结合作用持久，但无任何部分激动剂效应。由于替米沙坦导致血管紧张素Ⅱ水平增高，从而可能引起的受体过度刺激效应亦不可知。替米沙坦可致血醛固酮水平下降。替米沙坦不抑制人体血浆肾素，亦不阻断离子通道。血管紧张素转换酶（激酶Ⅱ）亦可降解缓激肽，由于替米沙坦不抑制血管紧张素转换酶，故不会出现缓激肽作用增强导致的不良反应。替米沙坦对其他受体（包括AT2和其他特征更少的AT受体，功能尚不清楚）无亲和力。

在人体，给予80mg替米沙坦几乎可完全抑制血管紧张素Ⅱ引起的血压升高，抑制效应持续24小时，在48小时仍可测到。

首剂替米沙坦后3小时内降压效应逐渐明显。在治疗开始后4周可获得最大降压效果，并可在长期治疗中维持。

动态血压检测显示，服药后降压效果持续超过24小时，包括下次给药前的4小时。这一结果在安慰剂对照的临床实验研究中得到证实：服用替米沙坦40mg和80mg后波谷与波峰的比值持续地在80%以上。恢复到基线SBP有明显的剂量－时间依赖关系。此方面关于DBP的数据不一致。

对于高血压患者，替米沙坦可降低收缩压及舒张压而不影响心率。替米沙坦的抗高血压效果与其他类型的抗高血压代表药物具有可比性。（临床实验研究进行了替米沙坦与氨氯地平，阿替洛尔，伊那普利，双氢氯噻嗪，氯沙坦和赖诺普利的比较。）

替米沙坦治疗如突然中断，数天后血压逐渐恢复到治疗前水平，不出现反跳性高血压。

在直接比较两种抗高血压药物的临床实验研究中，替米沙坦治疗组的患者干咳发生率显著低于血管紧张素转换酶抑制治疗组。

替米沙坦对于改善死亡率和心血管疾病患病率的作用目前尚未可知。

2. 毒理学：在临床前安全性研究中所用的剂

量，与临床治疗剂量相当，能引起红细胞指数（红细胞，血红蛋白，红细胞压积）降低和肾脏血流动力学改变（血尿素氮与肌酐增加）以及血压正常的动物血钾升高。在狗可见肾小管扩张及萎缩。大鼠和狗也可见消化道黏膜损伤（糜烂、溃疡或炎症）。这些药理学不良反应，从临床前研究得知是血管紧张素转换酶抑制剂和血管紧张素Ⅱ拮抗剂共有的反应，可以使用口服盐类补充剂预防。

在上述两种属都可见血浆肾素活性增高与肾小球近球细胞肥厚/增生。上述变化，亦是血管紧张素转换酶抑制剂和其他血管紧张素Ⅱ拮抗剂共有的反应，无临床特异性。

动物实验显示，替米沙坦对于胎仔产后发育有些潜在的不良影响，包括体重减轻，睁眼延迟，死亡率增高。

体外实验未发现致突变性和相关的诱变活性，在小鼠和大鼠试验中未发现致癌性。

【药代动力学】

1．吸收：口服后，替米沙坦被迅速吸收，绝对生物利用度平均值约为50%。替米沙坦与食物同时摄入时，药时曲线下面积（$AUC_{0\to\infty}$）减少6%（40mg剂量）~19%（160mg剂量）。空腹或饮食状态下服用替米沙坦3小时后血浆浓度近似。AUC的轻度降低不会引起疗效降低。

剂量和血浆水平无线性关系。在40mg以上剂量时出现C_{max}与AUC轻度的不成比例增高。

性别不同，血浆浓度不同。女性与男性相比C_{max}与AUC分别高出近2~3倍。

2．分布：替米沙坦大部分与血浆蛋白结合（>99.5%），主要是白蛋白与α-1酸糖蛋白。平均稳态表观分布容积（V_{SS}）约为500L。

3．代谢：替米沙坦通过母体化合物与葡萄糖苷酸结合代谢。结合产物无药理学活性。

4．消除：替米沙坦按照二次幂药代动力学消除，最终清除半衰期>20小时。最大血浆浓度（Cmax）不随剂量增加而成比例增加，药时曲线下面积（AUC）也不完全随剂量增加而成比例增加。以推荐剂量服用时，未见临床相关的替米沙坦蓄积作用。血浆浓度女性高于男性，但对疗效无影响。

口服（或静注）时替米沙坦几乎完全随粪便排泄，主要以未改变的化合物形式排出。累积尿液排泄小于剂量的2%。总血浆清除率约1000ml/min与肝血流（约1500ml/min）相比较高。

5．老年人：替米沙坦药代动力学在老年人和年轻人无差别。

6．肾功能不全患者：进行透析的肾功能不全患者血浆浓度较低。替米沙坦在肾功能不全患者与血浆蛋白高度结合，透析不能清除。肾功能不全患者替米沙坦半衰期不变。

7．肝功能不全患者：药代动力学研究显示肝功能不全患者绝对生物利用度增加约为100%。清除半衰期在肝功能不全患者不变。

【药物相互作用】

1．锂剂：锂剂与血管紧张素转换酶抑制剂合用，可引起可逆性的血锂水平升高和毒性反应。也有个别病例是锂剂与血管紧张素Ⅱ受体拮抗剂合用引起的。因此，锂剂和本品合用须慎重。如需合用，则合用期间应监测血锂水平。

2．有些药物可影响血钾水平或引起高血钾症（如ACE抑制剂、保钾类利尿药、钾离子补充剂、含钾的盐替代品、环孢菌素A或其他药物如肝素钠）；如果本品需与这些药物合用，建议监测血钾水平。基于使用其他影响肾素-血管紧张素系统药物的经验，本品与上述药物合用，可致血钾水平升高。

3．药代动力学试验已经研究了本品与地高辛、华法林、氢氯噻嗪、格列苯脲、布洛芬、扑热息痛、氨氯地平等药物的相互作用。可升高地高辛平均波谷血药浓度20%（个别病例升高39%），因此须监测地高辛血浆浓度。

4．本品可加强其他抗高血压药物的降压效果。其他临床上有意义的相互作用尚不能证实。

5．基于其药理学特性，下述药物可加强抗高血压药物包括替米沙坦的降压效果：巴氯芬、氨磷汀。另外，酒精、巴比妥类药物、镇静安眠药或抗抑郁剂可增强体位性低血压效应。

6．当与替米沙坦合用时，辛伐他汀代谢物（辛伐他汀酸）的C_{max}有轻度升高（1.34倍）且消除加速。

7．噻嗪类利尿药如氢氯噻嗪与本品有协同降压作用。因替米沙坦在疗程开始后4~8周本品才能发挥最大药效，因此若欲加大药物剂量时，应对此予以考虑。

【药物过量】尚无过量使用的病例报告。替米沙坦过量最可能的表现是低血压和心动过速；心动过缓也可能发生。替米沙坦不能经血液透析消除。一旦发生过量，应对患者做密切观察，并做对症和支持治疗。治疗应根据服药的时间和症状的严重性。推荐的措施包括催吐和（或）洗胃。活性炭治疗过量可能有效。应密切监测血电解质和肌酐。若发生低血压，患者应平卧，并尽快补充盐分和扩容。

【不良反应】在安慰剂对照试验中，替米沙坦（41.4%）的不良事件总发生率和安慰剂（43.9%）相似。不良事件的发生和剂量无相关性，与患者性别、年龄和种族亦无关。

以下所列的不良反应是从临床试验中接受替米

沙坦治疗的5788名高血压患者累计得到的。

不良反应按发生频率分为：非常常见（>1/10）；常见（>1/100，<1/10）；少见（>1/1000，<1/100）；罕见（>1/10000，<1/1000）；非常罕见（<1/10000）

全身反应：常见，后背痛（如坐骨神经痛）、胸痛、流感样症状、感染症状（如泌尿道感染包括膀胱炎）；少见，视觉异常、多汗。中枢和外周神经系统：常见，眩晕。

胃肠道系统：常见，腹痛、腹泻、消化不良、胃肠功能紊乱；少见，口干、胃肠胀气。

肌肉骨骼系统：常见，关节痛、腿痉挛或腿痛、肌痛；少见，腱鞘炎样症状。

神经系统：少见，焦虑。

呼吸系统：常见，上呼吸道感染包括咽炎和鼻炎。

皮肤和附件系统：常见，皮肤异常如湿疹。另外，自替米沙坦上市后，个别病例报告发生红斑、瘙痒、晕厥、失眠、抑郁、胃部不适、呕吐、低血压、心动过缓、心动过速、呼吸困难、嗜酸粒细胞增多症、血小板减少症、虚弱、工作效率下降。与其他血管紧张素Ⅱ拮抗剂相似，极少数病例报道出现血管性水肿、荨麻疹和其他相关不良反应。

实验室发现：与安慰剂相比，替米沙坦治疗组偶有发现血红蛋白下降或尿酸升高。血肌酐或肝脏酶的升高替米沙坦和安慰剂相似或低于安慰剂。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方替米沙坦片	化学药	HZ001404
替米沙坦胶囊	化学药	HZ003383
替米沙坦片	化学药	HZ003384

HY001869 替莫唑胺

【外文名称】 Temozolomide

药物理化信息

【化学名】 3，4－二氢－3－甲基－4－氧代咪唑［5，1－*d*］并1，2，3，5－四嗪－8－甲酰胺

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：替莫唑胺在生理pH条件下经快速非酶催化转变为活性化合物MTIC，MTIC主要通过DNA鸟嘌呤的O6和N2位点上的烷基化（甲基化）发挥细胞毒作用。

2．毒理作用

（1）遗传毒性：替莫唑胺对体外细菌有致突变作用（Ames试验），对哺乳细胞染色体有致裂变作用（人外周血清淋巴细胞试验）。

（2）生殖毒性：目前尚未进行替莫唑胺的生殖毒性研究，但大鼠和狗的重复给药毒性研究表明，大鼠和狗给药剂量分别为50mg/m^{2}和125mg/m^2（按体表面积计算，分别约相当于最大推荐人日用量的1/4和5/8）时，本品对动物睾丸有毒性，表现为合胞体细胞（即未成熟精子）出现和睾丸萎缩。

（3）致癌性：尚未进行替莫唑胺的常规致癌试验。给大鼠每隔28天连续5天给予替莫唑胺125mg/m^2（按体表面积计算、与最大推荐人日用量相当），给药3个周期后，雌性和雄性大鼠均产生乳腺癌。以25、50、125mg/m^2（按体表面积计算，大约相当于最大推荐人日用量的1/8～1/2）给药6个周期后，所有剂量组动物均出现乳腺癌：高剂量组在心脏、眼、精囊、唾液腺、腹腔、子宫及前列腺等组织出现纤维肉瘤，还出现精囊癌、心脏神经鞘瘤、视神经癌、哈德氏腺癌，另外可见动物皮肤、肺、垂体、甲状腺等产生腺瘤。

【药代动力学】 本品口服吸收完全，1.0小时后达血药浓度峰值。进食高脂肪早餐后服用本品，平均最高血药浓度与AUC分别减少32%与9%，t_{max}增加2倍（从1.1小时到2.25小时）。平均消除半衰期为1.8小时且在治疗剂量范围内呈线性。平均表观分布容积为0.4L/kg（CV=13%）。血浆蛋白结合率平均为15%。

在生理pH条件下，本品能迅速地分解为活性物质5－（3－甲基三嗪－1－基）咪唑－4－酰胺（MTIC）和酸性代谢物。MTIC进一步的分解为5－氨基－咪唑－4－酰胺（AIC）与重要甲烷，AIC为核酸与嘌呤生物合成的中间体，而重氮甲烷则为活性烷基化物质。在替莫唑胺及MTIC代谢过程中细胞色素P450酶作用很小。MTIC及AIC的AUC分别为替莫唑胺的2.4%及23%。7天后，可回收大约38%的替莫唑胺，其中37.7%由尿液回收，0.8%由粪便回收。尿液中大部分为替莫唑胺原形药物（5.6%）、AIC（12%）、替莫唑胺酸代谢物（2.3%）及未知极性代谢物（17%）。替莫唑胺清除率为5.5L/（h·m^2）。

【药物相互作用】 服用雷尼替丁不改变替莫唑胺及MTIC和C_{max}及AUC，服用丙戊酸可使替莫唑胺消除率降低5%；不明确服用地塞米松、丙氧拉嗪、苯妥英、卡马西平、昂丹司琼、H_2受体拮抗剂或苯巴比妥对口服替莫唑胺消除率的影响。

【药物过量】 服药过量应进行血液学检查并采取相应措施。

【不良反应】 最常见的不良反应为恶心、呕吐。可能会出现骨髓抑制，但可恢复，病人应定期地检

测血常规。其他的常见的不良反应为疲惫、便秘和头痛、眩晕、呼吸短促、脱发、贫血、发热、免疫力下降等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
替莫唑胺胶囊	化学药	HZ003385

HY001870　替尼泊苷

【外文名称】Teniposide

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第45册

药物理化信息

【化学名】4′－去甲基表鬼臼毒素－β－D－噻吩亚甲基吡喃葡萄糖苷

【分子式】$C_{32}H_{32}O_{13}S$

【分子量】656.67

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶粉末，无臭。

本品在二甲基甲酰胺中易溶，在丙酮或乙腈中微溶，在三氯甲烷或甲醇中极微溶解，在乙醇或水中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加三氯甲烷－甲醇（9:1）溶解并制成每1ml中含4mg的溶液，依法测定，比旋度为－107°～－113°。

药物药理信息

【药理毒理】本品为周期特异性细胞毒药物，抑制拓扑异构酶Ⅱ，引起DNA断裂，阻断有丝分裂于细胞周期S期和G2期。对实验性鼠肿瘤，替尼泊苷在其体内具有较广谱的抗肿瘤活性。体外和体内研究显示与依托泊苷具有完全交叉耐药性。

【药代动力学】在一定剂量范围内，替尼泊苷药代动力学参数呈线性，药物在体内不发生蓄积。静脉注射后，药物从中央室1相清除，分布相半衰期约1小时。在体内与蛋白的结合率高。替尼泊苷能通过血脑屏障，在脑脊液的浓度低于血药浓度。药物的肾脏清除率仅占总清除率的10%。替尼泊苷清除半衰期约为6～20小时。

【药物相互作用】苯巴比妥和苯妥英钠可增加替尼泊苷的清除，合并用药时可能应增加替尼泊苷的剂量。甲苯磺丁脲、水杨酸钠和磺胺甲噻二唑降低替尼泊苷的与蛋白结合率，导致游离药物增加，增加药物作用和毒性反应。

【药物过量】目前没有替尼泊苷的解毒药物。可预见的药物过量出现合并症通常继发于骨髓抑制。治疗包括输注血制品和抗生素治疗的支持治疗。

【不良反应】

1．骨髓毒性为剂量限制毒性，用药7～14日后常见白细胞和血小板降低。

2．胃肠道反应：恶心呕吐是最常见的消化道不良反应，但通常是轻度和中度的。

3．脱发也较常见。

4．低血压：快速输注时会发生一过性的低血压。

5．过敏反应：可发生急性过敏反应：寒战，发热，心动过速，支气管痉挛，呼吸困难，低血压，潮红，出汗，水肿，高血压和荨麻疹。

6．其他：口腔炎，头痛和精神障碍罕见。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
替尼泊苷注射液	化学药	HZ003386

HY001871　替诺环定

【外文名称】Tenocyclidine

药物管理信息

【特殊管理分类】一类精神药

药物药理信息

【药理毒理】本品为抗副交感神经药。国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为精神药品。

HY001872　替培啶

【其他名称】Antupex、安嗽灵、Asverin、阿斯维林、必咳定、必嗽定、双噻甲哌啶、双噻哌啶、压嗽灵

【外文名称】Tipepidine

药物药理信息

【药理毒理】本品有较强的镇咳作用，同时也有祛痰作用，能促进支气管分泌及气管纤毛的运动而使痰液变稀并易于咯出。适用于急慢性支气管炎引起的咳嗽。无呼吸抑制，无镇痛效果，不产生耐药和成瘾性。

【不良反应】偶有头晕、胃不适、嗜睡、瘙痒等不良反应。

HY001873　替普瑞酮

【外文名称】Teprenone

【分子式】$C_{23}H_{38}O$

【分子量】330.55

【性状及组成】本品系无色或微黄色透明的油状液体，稍有特异的臭味或无味。本品可与甲醇、乙醇、丙酮、三氯甲烷及己烷混溶，几乎不溶于水。遇空气可发生变化。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用

替普瑞酮是萜烯（teprene）的衍生物，具有广谱抗溃疡作用，本药对各种实验性溃疡及胃黏膜病变有较强的抗溃疡作用和胃黏膜病变的改善作用。

本药具有广谱的抗溃疡作用，不影响胃液分泌及胃运动等生理功能，对各种实验性溃疡（寒冷拘束应激性溃疡、消炎痛致溃疡、阿司匹林致溃疡、利血平致溃疡、醋酸以及烧灼致溃疡），及各种实验性胃黏膜病变（盐酸阿司匹林、乙醇、放射线）均确认了较强的抗溃疡作用和胃黏膜病变的改善作用。本药促进胃黏膜、胃黏液中主要的再生防御因子、高分子糖蛋白、磷脂质的合成和分泌，同时确认了提高胃黏液中的重碳酸盐作用。本药可以改善氧化可的松诱发溃疡中，胃黏膜增生区细胞增生能力的降低，维持黏膜增生细胞的平衡，故可促进胃黏膜损伤的治愈，还可以提高正常大鼠胃体及幽门部黏膜中前列腺素的生物合成能力。本药也可以改善由脱血应激性，水浸拘束应激性实验所造成的胃黏膜血流降低。

2．临床效果：本药在急性胃炎、慢性胃炎的急性加重期为对象的双盲试验中证明了本药的有效性。本药对胃炎的总有效率为 68.6%（448/653），对胃溃疡的有效率为 81.0%（438/541）。双盲试验证明了本药对所谓难治性溃疡病例的疗效甚佳。

3．毒理研究

（1）急性毒性 LD_{50}：大小白鼠（口服），> 15000mg/kg。狗，> 1000mg/kg。

亚急性毒性：大鼠以 62.5，250，1000 及 4000mg/（kg·d）剂量，连续口服给药 13 周。结果：250 mg/kg 以上剂量时，观察到肝脏以及肾脏出现轻度的异常变化，停止给药后即恢复。狗以 62.5，250，1000mg/（kg·d）剂量连续口服给药 5 周。结果：250mg/kg 以上剂量时，可见呕吐，皮毛光泽增加，肝脏重量增加。经病理组织学检查认为，并不是由于给予本剂所引起的变化。

（2）慢性毒性：大鼠以 31.3，62.5，250 及 1000mg/（kg·d）剂量连续口服给药 52 周。结果：250mg/kg 以上剂量时，可见轻度肝脏影响。狗以 10，100及 1000mg/（kg·d）剂量连续口服给药 52 周。结果：100mg/kg 以下剂量时，未见发生异常。1000mg/kg 剂量时，肝药物代谢酶有所增加。此外未见由于给予本剂所产生的任何变化。

（3）生殖试验：妊娠前、妊娠初期给药试验，大鼠以 100，500，1000 及 4000mg/（kg·d）剂量口服给药，结果对大鼠的生殖能力及鼠仔的出生未见产生任何影响。

（4）器官形成期给药试验：大鼠以 100，500，2000，4000mg/（kg·d）剂量口服给药。结果：对鼠仔的出生两种动物均未见产生任何影响。但对新生仔的发育，大鼠 500mg/kg 以上剂量时，可见肾上腺组织发生变化。对生后发育，离乳期未产生影响。

（5）围产期、哺乳期给药试验：大鼠以 100，500，2000 及 4000 mg/（kg·d）剂量口服给药。结果：500mg/kg 以上剂量时，新生鼠仔可见发育迟缓，但对分娩及哺育未产生任何影响。

【药代动力学】12 名健康成人按交叉法饭后服用替普瑞酮 150mg（3 粒或 1.5g 细粒），血中浓度在服用后 5 小时达到峰值，胶囊剂为 1669ng/ml，细粒剂为 1296ng/ ml，以后降低，但在服用后 10 小时又出现一个峰值（胶囊剂为 675 ng/ ml，细粒剂为 604ng/ ml），即呈双峰形曲线，这被认为是由于达峰浓度的时间散乱所造成的结果，从以上结果可见，两种剂型的生物利用度无差异。

大鼠口服给予 ^{14}C 替普瑞酮 125 mg/kg，经门脉（27%）和淋巴吸收。组织中的放射性分布结果表明：肝、消化道（黏膜上原形物）、肾上腺、肾、胰等组织药物浓度高于血中药物浓度，脑和睾丸中药物浓度则与血中药物浓度相同。给药后 4 天内，22.7%经尿排出，29.3%经粪排出，给药后 3 天内 27.7%经肺呼出（$^{14}CO_2$）。

【药物相互作用】本药与 H_2 受体拮抗剂合用，能够提高疗效。

【不良反应】偶见便秘，腹胀感，腹痛，腹泻，口干，恶心，皮疹，瘙痒，血清总胆固醇水平升高，可见 AST 及 ALT 轻度升高。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
替普瑞酮胶囊	化学药	HZ003387
替普瑞酮细粒剂	化学药	HZ003388

HY001874 替沃噻吨

【其他名称】氨砜噻吨、甲哌硫丙硫蒽

【外文名称】Tiotixene

药物药理信息

【药理毒理】抗精神病作用较强，适用于治疗

急、慢性精神病的淡漠、孤独、主动性减退症状，亦可用于治疗焦虑症。

【不良反应】锥体外系反应少见。

HY001875　替硝唑

【其他名称】Fasigyn、磺甲硝咪唑、甲硝磺酰咪唑、甲硝乙基磺酰咪唑

【外文名称】Tinidazole

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】2－甲基－1－［2－（乙基磺酰基）乙基］－5－硝基－1*H*－咪唑

【分子式】$C_8H_{13}N_3O_4S$

【分子量】247.28

【性状及组成】本品为白色或淡黄色结晶或结晶性粉末，味微苦。本品在丙酮或三氯甲烷中溶解，在水或乙醇中微溶。

熔点：本品的熔点为 125～129℃。

吸收系数：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 12μg 的溶液，照紫外－可见分光光度法，在 317nm 的波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为 352～378。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗厌氧菌、抗滴虫药。

本品对原虫及厌氧菌有较高活性。对脆弱拟杆菌等拟杆菌属、梭杆菌属、梭菌属、消化球菌、消化链球菌、韦容球菌属及加得纳菌等具抗菌活性，2～4mg/L 的浓度可抑制大多数厌氧菌；微需氧菌、幽门螺杆菌对其敏感；对阴道滴虫的 MIC 与甲硝唑相仿，其代谢物对加得纳菌的活性较替硝唑为强。

本品的作用机制尚未完全阐明，厌氧菌的硝基还原酶在敏感菌株的能量代谢中起重要作用。本品的硝基被还原成一种细胞毒，从而作用于细菌的 DNA 代谢过程，促使细菌死亡。耐药菌往往缺乏硝基还原酶而对本品耐药。本品抗阿米巴原虫的机制为抑制其氧化还原反应，使原虫的氮链发生断裂，从而杀死原虫。

【药代动力学】本品口服后吸收完全，健康女性单剂量口服 2g 后达峰时间（t_{max}）为 2 小峰浓度（C_{max}）为 51mg/L。替硝唑排泄缓慢，口服 2g 后 24 小时、48 小时及 72 小时血药浓度分别为 19.0mg/L、4.2mg/L 及 1.3mg/L。口服一日给药 1g，血药浓度可维持在 8mg/L 以上。

本品静脉滴注 0.8g 及 1.6g 后血药峰浓度分别为 14～21mg/L 及 32mg/L。静脉每日给药 1g，血药浓度可维持在 8mg/L 以上。

替硝唑在体内的分布广泛，在生殖器官、肠道、腹部肌肉、乳汁中可达较高浓度，在肝脏、脂肪中的浓度低，在胆汁、唾液中的浓度与同期血药浓度相仿，对血脑屏障的穿透性较甲硝唑高，脑膜无炎症时脑脊液中的浓度为同期血药浓度的 80%，这与替硝唑的脂溶性较高有关。替硝唑可通过血胎盘屏障，在胎儿及胎盘中可达高浓度。蛋白结合率为 12%。在肝脏代谢，单剂量口服 0.25g 后约 16% 以原形从尿中排出。血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为 11.6～13.3 小时，平均为 12.6 小时。

【药物相互作用】

1．本品能抑制华法林和其他口服抗凝血药的代谢，加强它们的作用，引起凝血酶原时间延长。

2．与苯妥英钠、苯巴比妥等诱导肝微粒体酶的药物合用时，可加强本品代谢，使血药浓度下降，并使苯妥英钠排泄减慢。

3．与西咪替丁等抑制肝微粒体酶活性的药物合用时，可减慢本品在肝内的代谢及其排泄，延长本品的血消除半衰期，应根据血药浓度测定的结果调整剂量。

4．本品干扰双硫仑代谢，两者合用时，患者饮酒后可出现精神症状，故 2 周内应用双硫仑者不宜再用本品。

5．本品可干扰血清氨基转移酶和乳酸脱氢酶测定结果，可使胆固醇、三酰甘油水平下降。

6．与土霉素合用时，土霉素可干扰本品清除阴道滴虫的作用。

【不良反应】不良反应少见而轻微，主要为恶心、呕吐、上腹痛、食欲下降及口腔金属味，可有头痛、眩晕、皮肤瘙痒、皮疹、便秘及全身不适。此外还可有中性粒细胞减少、双硫仑样反应及黑尿。高剂量时也可引起癫痫发作和周围神经病变。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
枸橼酸铋钾克拉霉素替硝唑片	化学药	HZ001982
浓替硝唑含漱液	化学药	HZ002823
替硝唑含片	化学药	HZ003389
替硝唑胶囊	化学药	HZ003390
替硝唑片	化学药	HZ003391
替硝唑葡萄糖注射液	化学药	HZ003392
替硝唑漱口液	化学药	HZ003393
替硝唑栓	化学药	HZ003394
替硝唑阴道泡腾片	化学药	HZ003395
替硝唑注射液	化学药	HZ003396

HY001876 天麻素

【外文名称】Gastrodin

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第16册

药物理化信息

【化学名】4－羟甲基苯－β－D－吡喃葡萄糖苷半水合物

【分子式】$C_{13}H_{18}O_7 \cdot 1/2H_2O$

【分子量】295.38

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理实验表明天麻素可恢复大脑皮质兴奋与抑制过程间的平衡失调，具有镇静、安眠和镇痛等中枢抑制作用。

2．急性毒性实验：小鼠口服或尾静脉注射天麻素，剂量用到5000mg/kg，观察3天，未见中毒及死亡。

3．亚急性毒性实验：犬及小鼠给药4～6天后，经血液化验，对红细胞、白细胞及血小板计数无影响。血液化验测定对谷丙转氨酶、非蛋白质及胆固醇均无影响。用动物的心、肺、脾、肝、肾、胃及肠作组织切片镜检，未见细胞变性。以上结果表明，天麻素对造血系统、肝、肾功能及血脂均无影响。

【药代动力学】小鼠灌服天麻素后，从胃肠道消失很快，2小时后仅存剂量的5.2%，血中上升很快，$t_{1/2\alpha}$仅为6分钟，在1小时前后维持较高水平，与小鼠镇静作用时间一致，消除半衰期静注为4.44小时，口服为7.47小时。在体内分布以肾最高，其次为肝、肺、心、脾及脑。主要从尿中排出，灌胃后24小时从尿、粪便及胆汁排出的总量为给药剂量的76.8%，其中尿排出97%，主要在前2小时，胆汁和粪便排出很少。注射给药后，血药浓度高低与镇静作用时间一致，消除半衰期为4.44小时。

【药物过量】尚缺乏本品药物过量的报道。一旦过量，应进行对症和支持治疗。

【不良反应】不良反应轻微，有少数病人出现口鼻干燥、头昏、胃不适等症状，但不致影响病人接受用药，也无需特殊处理。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
天麻素胶囊	化学药	HZ003398
天麻素片	化学药	HZ003399
天麻素注射液	化学药	HZ003400
注射用天麻素	化学药	HZ004971

HY001877 甜菊素

【其他名称】Stevioside、甜菊甙、甜菊苷

【外文名称】Steviosin

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】本品是以甜菊素为主的混合苷

【分子式】$C_{38}H_{60}O_{18}$

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末，无臭，味浓甜微苦。

本品在乙醇中溶解，在水中微溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料，矫味剂。

本品有甜味，无热值，适用于糖尿病、肥胖症等患者代糖使用。本品还有降血糖、降血压、促进新陈代谢、治疗胃酸过多、强壮身体等作用。

【不良反应】按我国GB2760－86规定使用范围为液体或固体饮料、糖果、糕点。$LD_{50} > 8.2g/kg$（小鼠、大鼠，经口）。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
富马酸酮替芬分散片	化学药	HZ001514
葡萄糖酸钙口服液	化学药	HZ002886
白沙糖浆	民族药	MZ000043
茯蚁参酒	民族药	MZ000150
复方草玉梅含片	民族药	MZ000155
复方一枝黄花喷雾剂	民族药	MZ000176
金刺参九正合剂	民族药	MZ000253
咳康含片	民族药	MZ000284
咳痰合剂	民族药	MZ000289
山楂内金口服液	民族药	MZ000489
通淋舒颗粒	民族药	MZ000608
欣力康颗粒	民族药	MZ000681
脂欣康颗粒	民族药	MZ000744
柴石退热颗粒	中成药	ZC000491
产复欣颗粒	中成药	ZC000510
垂阴茶颗粒	中成药	ZC000646
二丁颗粒	中成药	ZC001018
复方两面针含片	中成药	ZC001432
复方芩兰口服液	中成药	ZC001476

续表

制剂名称	类别	序号
肝康颗粒	中成药	ZC001692
骨松康合剂	中成药	ZC001868
桂林西瓜霜	中成药	ZC002016
健肾益肺口服液	中成药	ZC002526
静心口服液	中成药	ZC002855
灵芝绞股蓝口服液	中成药	ZC003268
盆炎净口服液	中成药	ZC003766
轻舒颗粒	中成药	ZC004041
十二味齿龈康散	中成药	ZC005065
十全大补合剂	中成药	ZC005073
苏菲咳糖浆	中成药	ZC005356
五加芪菊颗粒	中成药	ZC005839
小儿秘通口服液	中成药	ZC006269
小儿清毒糖浆	中成药	ZC006287
血生口服液	中成药	ZC006599
银柴颗粒	中成药	ZC006961
贞蓉丹合剂	中成药	ZC007218
痔炎消颗粒	中成药	ZC007453

HY001878　铁元素

【外文名称】Iron

药物药理信息

【药理毒理】铁是人体必需的化学元素之一。它是人体许多生理过程中不可缺少的物质，也是血红蛋白的核心部分。铁与原卟啉结合成血红素，血红素与珠蛋白结合成血红蛋白肌红蛋白和细胞中许多有重要功能的酶，如细胞色素 C、细胞色素氧化酶、细胞色素还原酶、过氧化物酶、过氧化氢酶、还原型烟酰胺腺嘌呤二核苷酸（NADH）脱氢酶等，均含有与蛋白质结合的铁。

正常成人体内铁的总量约为 2～4g，或男子约 50mg/kg，女子约 35mg/kg，其中 2/3～4/5 为血红蛋白铁，其余均为贮存铁。

缺铁可使人疲乏、无力、注意力不集中、失眠、食欲减退、皮肤、毛发干燥、无光泽并可导致缺铁性贫血、抵抗力下降、易患感染。

【药代动力学】铁在体内吸收的机制较为复杂。一般认为，整个肠道对简单的铁化合物均能吸收，但以十二指肠的吸收能力最强。人体对铁的排泄是相当稳定的，因此人体不是通过排泄而是依靠吸收来调节体内铁的平衡。如体内缺铁时，铁的吸收增多。缺氧、贫血、红细胞生成加速均促进铁的吸收增加；而体内铁过多时，铁的吸收能自动减少。

从肠道吸收进入血浆的铁，或从红细胞破坏释放出来的铁，在血浆铜蓝蛋白的催化下变成 Fe^{3+}，才能与血浆转铁蛋白结合，然后被输送至骨髓中幼红细胞或其他各需铁组织。

铁进入肠道，被肠黏膜细胞吸收后，部分铁进入血浆，部分铁留在肠黏膜细胞内，随着肠黏膜细胞衰老、脱落而进入肠腔，随粪便排出体外。这是铁的主要排泄途径。此外，铁也通过尿、汗等排出，但量极微小。出血也可使铁丧失。妇女在来月经时、妊娠和分娩、哺乳时都丧失较多的铁。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
多维元素胶囊（13）	化学药	HZ000801
多维元素片（14）	化学药	HZ000805
多维元素片（16）	化学药	HZ000806
多维元素片（16－Ⅱ）	化学药	HZ000807
多维元素片（21）	化学药	HZ000808
多维元素片（29）	化学药	HZ000810
多种维生素片	化学药	HZ000817
复方多维元素片（21）	化学药	HZ001151
复方多维元素片（23）	化学药	HZ001152
复方营养混悬剂	化学药	HZ001478
复合维生素片	化学药	HZ001497
善存银片	化学药	HZ003189

HY001879　铜元素

【外文名称】Cupper

药物药理信息

【药理毒理】铜是必需微量元素之一，在人体中的含量仅为 100～200mg。其主要功能为辅助造血，即催化血红蛋白的合成。铜不足可影响铁的吸收，从而导致血红蛋白合成减少。铜还是碳水化合物代谢中的催化剂，也是多种酶的活性组成部分。因此，缺铜将使体内重要的酶活性降低，并可导致骨骼生成障碍，造成骨质疏松。缺铜还可发生脱发症以及白化病等，如常见的白癜风就跟血清中缺少铜离子有关系。铜还以脑铜蛋白的形式存在于中枢神经系统，所以缺铜会影响脑发育。

人和动物的血液中有铜蓝蛋白，这种多功能的氧化酶，其重要作用之一是催化 Fe^{2+} 氧化为 Fe^{3+}，

从而有利于体内贮备铁的功用和食物中铁的吸收。

铜过氧化物歧化酶（SOD）的组分，它具有抗脂质过氧化作用。

缺乏铜会影响结缔组织和弹性组织的结构。赖氨酸氧化酶也是一种铜酶，是胶原交联时不可缺少的物质，而胶原与结缔组织的形成以及弹性组织有密切的关系。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
多维元素片	化学药	HZ000804
多维元素片（16）	化学药	HZ000806
多维元素片（16－Ⅱ）	化学药	HZ000807
多维元素片（21）	化学药	HZ000808
多维元素片（25）	化学药	HZ000809
多维元素片（29）	化学药	HZ000810
多种维生素片	化学药	HZ000817
复方多维元素片（21）	化学药	HZ001151
复方多维元素片（23）	化学药	HZ001152
复方营养混悬剂	化学药	HZ001478
复合维生素片	化学药	HZ001497
善存银片	化学药	HZ003189

HY001880 酮康唑

【其他名称】Fungarest、Fungoral、Ketoderm、里素芬、力素芬、霉康灵、Nizoral、尼唑啦

【外文名称】Ketoconazole

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】1－乙酰基－4［4－［2－（2,4－二氯苯基）－2（1*H*－咪唑－1－甲基）－1,3 二氧戊环－4－甲氧基］苯基］－哌嗪

【分子式】$C_{26}H_{28}Cl_2N_4O_4$

【分子量】531.44

【性状及组成】本品为类白色结晶性粉末，无臭，无味。本品在三氯甲烷中易溶，在甲醇中溶解，在乙醇中微溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 147～151℃。

比旋度：取本品，精密称定，加甲醇制成每 1ml 中含 40mg 的溶液，依法测定，按干燥品计算，比旋度应为－1°至＋1°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗真菌药。

1．药理：本品属吡咯类抗真菌药，对深部感染真菌如念珠菌属、着色真菌属、球孢子菌属、组织浆胞菌属、孢子丝菌属等均具抗菌作用，对毛发癣菌等亦具抗菌活性。本品对曲霉、申克氏孢子丝菌、某些暗色孢科、毛霉属等作用差。

本品通过干扰细胞色素 P450 的活性，从而抑制真菌细胞膜主要固醇类——麦角固醇的生物合成，损伤真菌细胞膜并改变其通透性，以致重要的细胞内物质外漏。本品可抑制真菌的三酰甘油和磷脂的生物合成，抑制氧化酶和过氧化酶的活性，引起细胞内过氧化氢积聚导致细胞亚微结构变性和细胞坏死。对白色念珠菌则可抑制其自芽孢转变为侵袭性菌丝的过程。

2．毒理：动物长期毒性实验表明，本品可使碱性磷酸酶明显上升，肝细胞变性。

【药代动力学】本品在胃酸内溶解吸收，胃酸酸度减低时可使吸收减少，餐后服用可使其吸收增加。本品餐后服用的生物利用度为 75%。单剂口服本品 200mg 和 400mg 后，血药峰浓度分别为（3.6±1.65）mg/L 和（6.5±1.44）mg/L。达峰时间为 1～4 小时。本品吸收后在体内分布广泛，可至炎症的关节液、唾液、胆汁、尿液、肌腱、皮肤软组织、粪便等。对血－脑脊液屏障穿透性差，大多数情况下，脑脊液药物浓度低于 1mg/L。本品亦可透过血胎盘屏障。血清蛋白结合率约为 90%以上。消除半衰期为 6.5～9 小时。部分药物在肝内代谢，降解为无活性的咪唑环和哌嗪环。代谢物及原型药主要由胆汁排泄，经肾脏排出仅占给药量的 13%，其中约 2%～4%为药物原型，本品亦可分泌至乳汁中。

酮康唑在健康志愿者胸、背和臀部皮肤涂抹 1 次，72 小时内血中未检出（低于 5ng/ml 的检测限）。

【药物相互作用】

1．酒精和肝毒性药物与本品合用时，肝毒性发生机会增多。

2．本品与华法林、香豆素、茚满二酮衍生物等抗凝药同时应用可增强其作用，导致凝血酶原时间延长，对患者应严密观察，监测凝血酶原时间，调整抗凝药的剂量。

3．环孢素与本品同时使用会升高前者的血药浓度，并可能使肾毒性发生的危险性增加。当两药同时使用时，应对环孢素的血药浓度进行监测。

4．制酸药、抗胆碱能药物、解痉药、组胺 H_2 受体阻滞药、奥美拉唑、硫糖铝等同时应用时可使本品吸收明显减少，因此应于服用本品 2 小时后应用此类药物。

5．利福平与本品同时服用时，前者会降低后者的血药浓度，增加肝脏毒性，因此两药不应同时服

用。与异烟肼同用时可降低本品的血药浓度，故应谨慎合用。

6. 苯妥因与吡咯类合用时，可使苯妥因的代谢减缓，导致苯妥因血药浓度升高，同时使吡咯类血药浓度降低。

7. 本品与西沙必利、阿司咪唑、特非那定合用属禁忌，因合用时抑制细胞色素 P450 代谢通道，可导致心律紊乱。

8. 去羟肌苷所含缓冲剂可使消化道 pH 升高，影响本品吸收，必须合用时需间隔 2 小时以上。

9. 本品与两性霉素 B 有拮抗作用，合用时疗效减弱。

【药物过量】逾量服用本品，无特殊解毒剂，仅为对症处理及支持疗法。

【不良反应】

1. 肝毒性：本品可引起血清氨基转移酶升高，属可逆性。偶有发生严重肝毒性者，主要为肝细胞型，其发生率约为 0.01%，临床表现为黄疸、尿色深、异常乏力等，通常停药后可恢复，但也有死亡病例报道，儿童中亦有肝炎样病例发生。

2. 胃肠道反应，如恶心、呕吐、纳差等。

3. 男性乳房发育及精液缺乏，此与本品抑制睾酮和肾上腺皮质激素合成有关。

4. 其他尚有皮疹、头晕、嗜睡、畏光等不良反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方酮康唑发用洗剂	化学药	HZ001405
复方酮康唑乳膏	化学药	HZ001406
复方酮康唑软膏	化学药	HZ001407
萘替芬酮康唑乳膏	化学药	HZ002763
酮康他索乳膏	化学药	HZ003403
酮康唑混悬液	化学药	HZ003404
酮康唑胶囊	化学药	HZ003405
酮康唑片	化学药	HZ003406
酮康唑乳膏	化学药	HZ003407
酮康唑洗剂	化学药	HZ003408

HY001881　酮咯酸氨丁三醇

【其他名称】Ketanov、Ketorol、Ketorolac、酮咯酸三羟甲氨基甲基烷、痛力克、酮洛来克、痛力消、Toradol、Toratex、Tromethamine

【外文名称】Ketorolac Tromethamine

药物理化信息

【化学名】（±）-5-苯甲酰-2、3-二氢-1H-吡咯嗪-1-羧酸与 2-氨基-2-羟甲基-1、3-丙二醇盐（1:1）复合物

【分子量】376.41

【性状及组成】酮咯酸氨丁三醇（KT）0.5%水溶液的 pH 为 7.4。本品有 3 种结晶型，均可溶于水。如较长时间暴露于光线下，本品白色或灰白色的结晶物可变色。

药物药理信息

【药理毒理】本品是一种非类固醇抗炎药。用于一切痛症，适用于短期消除创伤和术后疼痛、肿痛、剧烈痛及各种原因引起的疼痛。片剂或注射液可用于缓解中度至剧烈的术后疼痛，包括腹部、胸部、妇科、口腔、矫形及泌尿科手术。此外，亦可缓解急性肾胶痛、胆绞痛、牙痛、创伤痛、三叉神经痛、癌症内脏痛，以及以往一切需用吗啡或哌替啶才能生效的各种疼痛症。眼部应用可降低房水内前列腺素 E_2 的水平。

【药物相互作用】

1. 尚无研究资料明确证实本品和华法林、地高辛、水杨酸盐及肝素之间的相互作用，但对使用抗凝剂的病人给予本品时需极其慎重，并需对病人进行密切观察。

2. 本品口服制剂和丙磺舒联合用药能降低酮咯酸的清除率，并明显增加了酮咯酸的血浆浓度水平［总 AUC 从 5.4μg/（h·ml）增至 17.8μg/（h·ml），约增高三倍］，半衰期约延长 2 倍，从 6.6 小时延长至 15.1 小时，因此，本品禁与丙磺舒联合应用。

3. 对血量正常的健康受试者静注/肌注本品时，呋塞米的利尿效果降低约 20%。

4. 有报道表明，同时给予氨甲蝶呤和一些非甾体抗炎药将降低氨甲蝶呤的清除率，使其毒性加大。但本品对氨甲蝶呤清除率的影响尚未进行研究。

5. 有报道表明，前列腺素合成抑制药抑制肾脏中锂的清除，导致血浆中锂浓度的升高。目前，尚无本品对血浆锂的作用的研究资料，但使用酮咯酸氨丁三醇时出现血浆中锂浓度升高的事件已有报道。

6. 本品与非去极化肌肉松弛药可能发生相互作用，而导致呼吸暂停，但尚缺乏这方面的正式研究资料。

7. 本品和 ACE 抑制剂联合用药有增加肾功能损伤的可能性，尤其是对血容衰竭的病人这种危险性更大。

8. 本品和抗癫痫药物（苯妥英、卡马西平）联合用药时可能发生癫痫，但这种可能性极小。

9. 本品与神经系统药物（氟西汀、替沃噻吨、

阿普唑仑）联合用药时，有使患者产生幻觉的可能性。

10. 本品与吗啡联合用药治疗术后疼痛未见不良相互作用；但勿将本品和吗啡混合在同一个注射器中注射。

11. 无动物或人体试验证明本品诱导或抑制肝药酶，以及肝药酶影响酮咯酸氨丁三醇或其他药物的代谢。

【药物过量】本品与其他非甾体抗炎药一样，使用过量时可能出现嗜睡、昏睡、恶心、呕吐和上腹痛等一般症状，通常进行支持性护理即可消除。使用本品过量还有可能出现胃肠道出血。极少情况出现高血压、急性肾功能衰竭、呼吸抑制、昏迷和发生过敏样反应。

曾有报道多次过量注射本品导致腹痛和消化性溃疡，停药后恢复正常。代谢性酸中毒亦有报道。单次过量给予酮咯酸氨丁三醇分别出现腹痛、恶心、呕吐、气喘、消化性溃疡和/或糜烂性胃炎、肾功能障碍，这些症状在停药后消失。

使用本品过量的病人必须对症给予支持性护理。无指定解毒药。血液透析不能很好地清除本品。

【不良反应】

1. 本品临床治疗过程中可能会发生的并发症有：胃肠道溃疡、出血、穿孔，手术后出血，肾功能衰竭，过敏及过敏样反应和肝功能衰竭。

2. 临床报道的可能与酮咯酸氨丁三醇有关的不良反应如下。

（1）发生率1%以上的

全身性的：水肿（4%）。心血管：高血压。皮肤病：瘙痒、药疹。胃肠道：恶心（12%），消化不良（12%），胃肠的疼痛（13%），腹泻（7%），便秘，胃气胀，胃肠胀痛，呕吐，口腔炎。血液和淋巴系统：紫癜。神经系统：头痛（17%），嗜睡（6%），头晕（7%），出汗。注射部位痛：在多次给药研究中，约有2%的病人出现此不良反应。

（2）发生率1%或以下的

全身性的：体重增加，发热，感染，无力。心血管：悸动，苍白，晕厥，血管扩张。皮肤病：风疹。胃肠道：胃炎，直肠出血，嗳气，食欲减退，食欲增强。血液和淋巴系统：鼻出血，贫血，嗜酸性细胞增多。神经系统：震颤，恶梦，幻觉，欣快感，锥体外系症状，眩晕，感觉异常，抑郁，失眠，神经质，口干，异常思维，注意力无法集中，运动机能亢进，麻痹。呼吸系统：呼吸困难，肺水肿，鼻炎，咳嗽。特殊感觉：味觉异常，视觉异常，视力模糊，耳鸣，丧失听觉。泌尿生殖系统：血尿，蛋白尿，少尿，尿潴留，多尿，尿频。

3. 用药不当或增加剂量会增加不良反应发生率。

4. 上市后不良反应监测

全身性的：过敏性反应，喉水肿，舌水肿，血管性水肿，肌痛。心血管系统：低血压，潮红。皮肤病：莱尔综合征（Lyell's syndrome），史－约综合征（Stevens－Johnson syndrome），脱落性皮肤炎，斑丘疹，风疹。胃肠道：消化性溃疡，胃肠道出血，胃肠道穿孔，黑粪，急性胰腺炎，呕血，食管炎。血液和淋巴系统：术后伤口出血，血小板数减少，白细胞数减少。肝：肝炎，肝衰竭，胆汁淤积性黄疸。

神经系统：惊厥，精神病，无菌性脑膜炎。

呼吸系统：气喘，支气管痉挛。

泌尿生殖系统：急性肾功能衰竭，肋痛（伴有或无血尿或氮质血症），间质性肾炎，低钠血症，高钾血症，溶血尿毒症综合征。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
酮咯酸氨丁三醇滴眼液	化学药	HZ003409
酮咯酸氨丁三醇胶囊	化学药	HZ003410
酮咯酸氨丁三醇片	化学药	HZ003411
酮咯酸氨丁三醇注射液	化学药	HZ003412

HY001882 酮洛芬

【其他名称】Alrheunun、苯酮苯丙酸、凯托洛芬、Orudis、Profenid、酮基布洛芬、优洛芬

【外文名称】Ketoprofen

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】α－甲基－3－苯甲酰基－苯乙酸

【分子式】$C_{16}H_{14}O_3$

【分子量】254.29

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭或几乎无臭。本品在甲醇中极易溶，在乙醇、丙酮或乙醚中易溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为93～96℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：消炎镇痛药。

本品为芳香基丙酸衍生物，属非甾体抗炎镇痛药。本品除抑制环氧酶外尚有一定抑制脂氧酶及减少缓激肽的作用，从而减轻炎症损伤部位疼痛感觉。因缓激肽与前列腺素一起可引起疼痛。缓激肽还可引起子宫收缩，故本品用于痛经，主要是通过抑制

缓激肽，从而抑制子宫收缩和镇痛而起到疗效。本品尚有一定的中枢性镇痛作用。

急性毒性试验结果：大鼠经口 LD_{50}为 101mg/kg。

【药代动力学】本品口服易吸收。与食物、奶类同服时吸收减慢，但吸收仍较完全。一次给药后约 0.5～2 小时血药浓度达峰值。血浆蛋白结合率为 99%（老年人可较低）。$t_{1/2}$为 1.6～4 小时（平均 3 小时），60%于 24 小时内自尿中排出，主要以葡萄糖醛酸结合物形式排出，以原形物排出可达 10%。老年人、肝肾功能不全者其清除率下降 22%～50%。健康受试者单次服用缓释片 150mg，在给药后 2～3 小时血药浓度达峰值，半衰期（$t_{1/2}$）为 2.61 小时，达峰时间（t_{max}）为 2.03 小时，峰浓度（C_{max}）为 5.401μg/ml，曲线下面积（AUC）为 33.136μg/（ml·小时），本品在血浆中主要以原形药、羟化代谢物和相应的葡萄甘酸代谢物形式存在。本品与血浆中白蛋白结合率为 99%，约 60%的药物主要以葡萄糖醛酸结合物形式从尿中排泄。

【药物相互作用】

1．饮酒或与其他非甾体抗炎药同用时增加胃肠道不良反应及出血倾向。长期与对乙酰氨基酚同用时可增加对肾脏的毒副作用。

2．与肝素、双香豆素等抗凝血药及血小板聚集抑制药同用时有增加出血的危险。

3．与呋塞米同用时，后者的排钠和降压作用减弱。

4．与维拉帕米、硝苯地平同用时，本品的血药浓度增高。

5．本品可增高地高辛的血浓度，同用时须注意调整地高辛的剂量。

6．本品可增强口服抗糖尿病药的作用。

7．本品与抗高血压药同用时可影响后者的降压效果。

8．本品不应与丙磺舒同用，因后者可明显降低本品肾脏清除率（降低 66%）和蛋白结合率（降低 28%），导致血药浓度增高，而有引起中毒的危险。

9．本品可降低甲氨蝶呤的排泄，增高其血浓度，甚至可达中毒水平，故本品不应与中或大剂量甲氨蝶呤同用。

【药物过量】服用常规剂量的 5～10 倍可导致嗜睡、恶心、呕吐和上腹部疼痛。大剂量的酮洛芬可引起呼吸抑制和昏迷。胃肠道出血、低血压、高血压或急性肾功能衰竭也可发生，但较少见。服药超量时应作紧急处理，包括催吐或洗胃、口服活性炭、抗酸药或（和）利尿剂，并给予检测及其他支持治疗。

【不良反应】

1．胃肠道反应较常见，如胃部疼痛或不适、胀气、恶心、呕吐、食欲减退、腹泻、便秘等，严重者可出现上消化道溃疡、出血及穿孔。

2．过敏反应：过敏性皮炎、皮肤瘙痒、剥脱性皮炎、喉头水肿、支气管痉挛（过敏性）等。

3．眼：视力模糊、视网膜出血。

4．心血管系统：心律不齐、血压升高、心悸。

5．中枢神经系统：头晕、头痛、耳鸣、听力下降、精神紧张、精神抑郁、幻觉、嗜睡、四肢麻木等。

6．肝肾：肝损害、肾功能下降、间质性肾炎、肾病。

7．血液系统：鼻衄、粒细胞减少、血小板减少、溶血性贫血等。

8．其他：水潴留（体重增加快、尿量减少、面部水肿等）、口腔炎、多汗等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
酮洛芬搽剂	化学药	HZ003413
酮洛芬肠溶胶囊	化学药	HZ003414
酮洛芬肠溶片	化学药	HZ003415
酮洛芬缓释胶囊	化学药	HZ003416
酮洛芬缓释片	化学药	HZ003417
酮洛芬胶囊	化学药	HZ003418
酮洛芬凝胶	化学药	HZ003419
酮洛芬片	化学药	HZ003420
酮洛芬栓	化学药	HZ003421
酮洛芬贴片	化学药	HZ003422

HY001883　酮色林

【其他名称】凯坦色林、Ritanserin、Serefrex、Sufrexal

【外文名称】Ketanserin

药物药理信息

【药理毒理】本品为 5－羟色胺受体阻断药，对 5－HT_2受体有选择性阻滞作用，亦有较弱的 α 和 H 受体拮抗作用。有降低高血压患者的外周阻力，肾血管阻力的下降更明显，对正常人无降压作用。对有阻塞性血管病变者，可改善下肢血流供应。对雷诺病者可改善组织的血流灌注、使皮肤血流增加。静脉注射后可降低右房压、肺动脉压及肺毛细管楔压。

本品用于各型高血压，也用于充血性心力衰竭，

雷诺病及间歇性破行。

【药代动力学】本品口服吸收迅速完全，0.5～2小时血药浓度达蜂值。与血浆蛋白结合率95%。生物利用度约50%。在肝内代谢。$t_{1/2}$约15小时。食物不影响其吸收。

【不良反应】有头晕、疲乏、水肿、口干、体重增加及Q－Tc延长（易发生于低血钾时）。

HY001884 头孢氨苄

【其他名称】Alfaspoven、Ausocef、苯甘孢霉素、Cefadine、Cefadros、Cefalival、Cefaloto、Cefexin、Cefibacter、Cepexin、Cephalexin、斯宝力克（Sporidex）、头孢力新、头孢立新、西保力、先锋霉素Ⅳ

【外文名称】Cefalexin

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】（6*R*,7*R*）－3－甲基－7－［（*R*）－2－氨基－2－苯乙酰氨基］－8－氧代－5－硫杂－1－氮杂双环［4.2.0］辛－2－烯－2－甲酸一水合物

【分子式】$C_{16}H_{17}N_3O_4S \cdot H_2O$

【分子量】365.41

【性状及组成】本品为白色或乳黄色结晶性粉末，微臭。本品在水中微溶，在乙醇、三氯甲烷或乙醚中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并稀释成每1ml中含5mg的溶液，依法测定，比旋度为+144度至+158度。

吸收系数：取本品，精密称定，加水溶解并稀释成每1ml中约含20μg的溶液，照分光光度法，在262nm的波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为220～245。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：β－内酰胺类抗生素，头孢菌素类。

头孢氨苄属第一代头孢菌素，为半合成头孢菌素类广谱抗生素。抗菌谱与头孢噻吩相似，但抗菌活性较头孢噻吩差。本品对葡萄球菌所产生的青霉素酶稳定，因此对耐青霉素的金黄色葡萄球菌有良好的抗菌作用。除肠球菌属、甲氧西林耐药葡萄球菌外，多数革兰阳性球菌对本品敏感。本品对奈瑟菌属有较好抗菌作用，对部分大肠埃希菌、奇异变形杆菌、肺炎克雷伯菌、沙门菌属有抗菌作用；对流感嗜血杆菌的作用较差；其他肠杆菌科细菌、不动杆菌属和铜绿假单胞菌及脆弱拟杆菌均对本品耐药。

本品的作用机制是抑制细菌细胞壁的合成。

【药代动力学】空腹口服本品500mg，约1小时达血药峰浓度（C_{max}），约为18mg/L。幼儿乳糜泻和小肠憩室患者对本品的吸收可增加；在克隆病和肺囊性纤维化患者则延缓和减少；老年人的血药浓度较青年人持久；新生儿喂奶后2小时口服本品15mg/kg，平均血药峰浓度于6小时后达到，约为4.5mg/L。

每6小时口服本品500mg后的痰液中平均浓度为0.32mg/L，脓性痰中浓度较高。脓液和骨髓炎瘘管内的浓度与血药浓度基本相等，关节腔渗出液中浓度约为血药浓度一半。孕妇口服本品500mg后，羊水和脐带血中均可获得有效浓度；哺乳期妇女口服本品500mg后乳汁中浓度约为5mg/L。胆汁中浓度为血药浓度的1～4倍。本品难以透过血－脑脊液屏障。分布容积（V_d）约为0.26L/kg。蛋白结合率为10%～15%。血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为0.6～1.0小时，肾衰竭时$t_{1/2\beta}$可延长至5～30小时，新生儿$t_{1/2\beta}$约为6.3小时。

本品在体内不代谢，以原形经肾小球滤过和肾小管分泌排出。24小时尿中排出量为给药量的80%。口服本品500mg后尿中峰浓度可达2200mg/L。约5%由胆汁排出，粪中含量很低。本品可被血液透析和腹膜透析清除。

健康成年人餐后半小时口服缓释胶囊0.5g后，血药峰浓度约为5μg/ml，半衰期为1.5小时。血浆中药物浓度维持≥3.14μg/ml的时间可达4小时以上。除脑和脑脊液外，本品的组织分布良好。

【药物相互作用】

1．呋塞米、依他尼酸、布美他尼等强利尿药，卡氮芥、链佐星等抗肿瘤药及氨基糖苷类抗生素等肾毒性药物与本品合用有增加肾毒性的可能。

2．克拉维酸可增强本品对某些因产生β内酰胺酶而对本品耐药的革兰阴性杆菌的抗菌活性。

3．丙磺舒可延迟本品经肾的排泄，使本品的血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）延长至107分钟；但也有报告认为丙磺舒可增加本品在胆汁中的排泄。

4．本品与考来烯胺（消胆胺）合用时，本品的平均血药峰浓度可降低。

【不良反应】

1．多见胃肠道反应：软便、腹泻、胃部不适、食欲减退、恶心、呕吐、嗳气等。

2．少见皮疹、药物热等过敏反应和头晕、复视、耳鸣、抽搐等神经系统反应。

3．个别心内膜炎患者高剂量（一日20～40g，尚加用丙磺舒）服用本品时，可出现血尿、嗜酸粒细胞增多和血清肌酐增高，但停药后上述反应可迅速消失。

4. 偶见血清氨基转移酶增高、抗球蛋白（Coombs）试验阳性、粒细胞减少和假膜性结肠炎，罕见溶血性贫血。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
头孢氨苄干混悬剂	化学药	HZ003423
头孢氨苄缓释胶囊	化学药	HZ003424
头孢氨苄缓释片	化学药	HZ003425
头孢氨苄甲氧苄啶胶囊	化学药	HZ003426
头孢氨苄甲氧苄啶颗粒	化学药	HZ003427
头孢氨苄甲氧苄啶片	化学药	HZ003428
头孢氨苄胶囊	化学药	HZ003429
头孢氨苄颗粒	化学药	HZ003430
头孢氨苄泡腾片	化学药	HZ003431
头孢氨苄片	化学药	HZ003432

HY001885　头孢丙烯

【外文名称】Cefprozil

药物理化信息

【化学名】(6*R*,7*R*) -7-*L*(*R*) -2-氨基-2-(对羟基苯基)乙酰氨基1-8-氧代-3-丙烯-5-琉杂-1-氮杂双环-[4.2.0]辛-2-烯-2-羧酸一水合物

【分子式】$C_{18}H_{19}N_3O_5SO \cdot H_2O$

【分子量】407.45

药物药理信息

【药理毒理】本品为第二代头孢菌素类抗生素，具广谱抗菌作用。体外试验证明，本品对革兰阳性需氧菌中的金黄色葡萄球菌（包括产β-内酰胺酶菌株）、肺炎链球菌、化脓性链球菌的作用明显，对坚忍肠球菌、单核细胞增多性李斯特菌、表皮葡萄球菌、腐生葡萄球菌、Warnei葡萄球菌、无乳链球菌、溶血性链球菌和草绿色链球菌具抑制作用。对耐甲氧西林葡萄球菌和粪肠球菌无效。对革兰阴性需氧菌的流感嗜血杆菌（包括产β-内酰胺酶菌株）、卡他莫拉菌（包括产β-内酰胺酶菌株）高度敏感；可抑制Diversus枸橼酸菌、大肠杆菌、肺炎克雷伯菌、淋病奈瑟菌（包括产β-内酰胺酶菌株）、奇异变形杆菌、沙门菌属，志贺菌和弧菌的繁殖；对不动杆菌属、肠杆菌属、普通变形杆菌、普罗威登菌属、假单孢菌属的多数菌株无抗菌作用。本品对厌氧菌中的黑色素类杆菌、艰难梭杆菌、产气荚膜杆菌、梭杆菌属、消化链球菌和痤疮丙酸杆菌具一定抑制作用，对多数脆弱杆菌株无抗菌作用。

本品的作用机制是抑制细菌细胞壁的合成，使细菌迅速破裂溶解。

【药代动力学】国内试验已经证明空腹口服头孢丙烯片剂和混悬剂具生物等效。

据文献报道，受试者空腹口服本品，给药量的约95%可被吸收。健康者的平均血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）约1.3小时，稳态分布容积（V_d）约0.23L/kg。总清除率和肾清除率分别为3ml/min/kg和2.3ml/min/kg左右。受试者空腹口服本品250mg、500mg、1g后约1.5小时达血药峰浓度（C_{max}），平均血药峰浓度分别为6.1 mg/L、10.5 mg/L和18.3mg/L。尿回收率约为服药量的60%。口服本品250mg、500mg和1g后最初4小时，尿中平均浓度分别为700 mg/L、1000 mg/L和2900 mg/L。与食物同服不影响本品的药-时曲线下面积（AUC）和血药峰浓度，但达峰时间可延长0.25~0.75小时。血浆蛋白结合率约为36%，当血药浓度在2~20 mg/L范围内时，血浆蛋白结合率与血药浓度的变化无关。

肾功能正常者口服本品一次1000mg，每8小时1次，连续10天，未见有药物血浆蓄积现象。

对于肾功能减退患者，根据肾功能损害程度的不同，本品的血消除半衰期可延长至5.2小时；肾功能完全丧失患者，血消除半衰期可达5.9小时。血液透析时，半衰期缩短。肝功能损害患者本品的血消除半衰期可延长至2小时左右，但这种改变并不说明肝功能损伤患者需调整剂量。

在老年人（≥65岁），本品的平均药-时曲线下面积（AUC）相对于年轻成人约增高35%~60%，女性AUC较男性AUC高15%~20%。

哺乳期妇女一次口服本品1g，可在乳汁中测得少量药物（<给药量的0.3%）。24小时平均浓度为0.25~3.3mg/L。

【药物相互作用】

1. 呋塞米、依他尼酸、布美他尼等强利尿药，卡氮芥、链佐星等抗肿瘤药及氨基糖苷类抗生素等肾毒性药物与本品合用有增加肾毒性的可能。

2. 克拉维酸可增强本品对某些因产生β-内酰胺酶而对本品耐药的革兰阴性杆菌的抗菌活性。

3. 本品与丙磺舒合用可使本品的药时曲线下面积（AUC）增加一倍。

【药物过量】本品主要经肾脏清除，对严重过量，尤其是肾功能损伤患者，血液透析有助于清除本品。

【不良反应】

1. 多见胃肠道反应：软便、腹泻、胃部不适、食欲减退、恶心、呕吐、嗳气等。

2. 血清病样反应：典型症状包括皮肤反应和关节痛。

3. 过敏反应：皮疹、荨麻疹、嗜酸性粒细胞增多、药物热等。小儿发生过敏反应较成人多见，多在开始治疗后几天内出现，停药后几天内消失。

4. 其他：血胆红素、血清氨基转移酶、尿素氮及肌酐轻度升高、血红蛋白降低、伪膜性肠炎、蛋白尿、管型尿等。尿布疹和二重感染、生殖器瘙痒和阴道炎。

5. 中枢神经系统症状：眩晕、活动增多、头痛、精神紧张、失眠。偶见神志混乱和嗜睡。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
头孢丙烯分散片	化学药	HZ003433
头孢丙烯干混悬剂	化学药	HZ003434
头孢丙烯胶囊	化学药	HZ003435
头孢丙烯颗粒	化学药	HZ003437
头孢丙烯片	化学药	HZ003438

HY001886 头孢泊肟酯

【其他名称】 Cepodem

【外文名称】 Cefpodoxime Proxetil

药物理化信息

【化学名】（6*R*, 7*R*）-7-［2-（2-氨基噻唑-4-基）-2-（*Z*）-（甲氧亚氨基）-乙酰胺基］-3-甲氧甲基-8-氧-5-硫-1-氮杂双环-［4.2.0］辛-2-烯-2-甲酸异丙氧羰氧乙基酯

【分子式】 $C_{21}H_{27}N_5O_9S_2$

【分子量】 557.61

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理作用：头孢泊肟酯为口服广谱第三代头孢菌素，进入体内后经非特异性酯酶水解为头孢泊肟发挥抗菌作用，对革兰阳性菌和阴性菌均有效。本品的作用机制是通过抑制微生物细胞壁的生物合成而达杀菌作用。本品对 β-内酰胺酶稳定，所以对青霉素和头孢菌素类耐药的许多产 β-内酰胺酶的微生物对本品仍敏感。本品对某些超广谱 β-内酰胺酶无效。

（1）体外和临床感染研究均证实本品对以下大多数微生物有活性

①需氧革兰阳性微生物：金黄色葡萄球菌（包括产青霉素酶的菌株，但是对耐甲氧西林的葡萄球菌无效）、腐生性葡萄球菌、肺炎链球菌（除耐青霉素菌株）、化脓性链球菌。

②需氧革兰阴性微生物：大肠杆菌、肺炎克雷伯杆菌、奇异变形杆菌、绿脓杆菌、流感嗜血杆菌（包括产 β-内酰胺酶菌株）、卡他莫拉菌、淋球菌（包括产青霉素酶菌株）。

（2）本品体外对以下大多数微生物有活性，但是其临床意义尚不清楚

①需氧革兰阳性微生物：无乳链球菌、链球菌（C、F、G组）。本品对肠球菌无效。

②需氧革兰阴性微生物：异形枸橼酸菌、催产克雷伯菌、普通变形杆菌、雷氏普罗维登斯菌、副流感嗜血杆菌。本品对多数假单胞菌属和肠杆菌属无活性。

③厌氧革兰阳性微生物：大消化链球菌属。

2. 毒理研究

（1）遗传毒性：体内、外的研究（包括 Ames 试验、染色体畸变试验、非程序 DNA 合成试验、有丝分裂重组、基因回复、正向基因突变试验和体内微核试验）结果均未发现本品有遗传毒性。

（2）生殖毒性：当大鼠经口给予本品剂量约为 100mg/（kg·d）（以体表面积计，为人用剂量的 2 倍），均未见本品对动物生育力和生殖功能有任何影响。无致畸和胚胎毒性。家兔剂量达 30mg/（kg·d）（以体表面积计，为人用剂量的 1～2 倍）时，也未见致畸和胚胎毒性。

【药代动力学】

1. 血清浓度：健康成人单剂量口服头孢泊肟酯后迅速吸收，表现为血清头孢泊肟浓度很快增高。饭后服药的吸收性较空腹为好。

2. 分布：头孢泊肟分布于患者痰液、扁桃体组织、上颌窦黏膜、皮肤组织等。

3. 代谢、排泄：头孢泊肟酯在吸收时被肠管壁酯酶水解为具有抗菌活性的头孢泊肟。头孢泊肟几乎不经代谢而主要从尿中排泄。健康成人饭后 1 次口服头孢泊肟酯 100mg、200mg 时，头孢泊肟的尿中排泄率（0～12 小时）约为 90%。未被吸收的极少部分头孢泊肟酯经粪便排泄。头孢泊肟的肾清除率约 90ml/min。连续给头孢泊肟酯 200mg，每 12 小时 1 次，共 14 天，未见蓄积性。

4. 肾功能损害时的血清中浓度及尿中排泄：肾功能不全患者饭后口服头孢泊肟酯随肾功能损害程度其头孢泊肟的 $t_{1/2}$延长、C_{max}及 AUC 增加，尿排泄明显减少。

【药物相互作用】 在同制酸剂（如氢氧化铝）或 H_2 受体拮抗剂（如雷尼替丁）合用时，因胃酸被中和，服用头孢泊肟酯后可降低头孢泊肟的血浆浓度及药物吸收度。

【药物过量】大剂量给药未发现药物蓄积和中毒情况。本品过量时无特殊解救药物，可对症处理。

【不良反应】

1. 严重不良反应

(1) 休克：偶可引起休克反应，故应注意观察，若出现不适感、口舌异常感、喘鸣、眩晕、便意、耳鸣、出汗等应立即停药并予以进一步观察和必要处理。

(2) 偶可出现皮肤黏膜眼综合征（Stevens - Johnson 综合征）和中毒性表皮坏死症（Lyell 综合征），故注意观察，若出现相应异常，应停药并予以适当处理。

(3) 偶可出现伪膜性大肠炎等伴有血便的严重肠炎，若出现腹痛、频繁腹泻，应迅速停药并予以适当处理。

(4) 与其他头孢烯类抗生素相同，本品偶可引起全血细胞减少症、粒细胞缺乏症、溶血性贫血、急性肾功能衰竭、间质性肺炎等，故用药期间应定期检查血、尿常规，若出现异常应停药并给予适当处理；对出现原发病以外难以解释的咳嗽、呼吸困难时，则行胸部 X 线检查，如出现间质性肺炎表现，应停药并用肾上腺皮质激素治疗。

2. 其他不良反应

(1) 过敏反应：皮疹、荨麻疹、瘙痒、发热、淋巴结肿大、关节痛等。

(2) 消化系统：有时出现恶心、呕吐、腹泻、胃痛、腹痛、食欲减退、胃部不适感。

(3) 血液系统：有时出现嗜酸粒细胞增多、血小板减少、偶尔出现粒细胞减少。

(4) 肝功能：偶尔出现 AST、ALT、ALP、LDH 等升高。

(5) 肾功能：有时出现 BUN、Cr 升高。

(6) 维生素缺乏症：偶可出现维生素 K 缺乏症状（低凝血酶原血症、出血倾向等）、维生素 B 族缺乏症状（舌炎、口内炎、食欲减退、神经炎等）。

(7) 其他：偶尔出现眩晕、头痛、水肿。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
头孢泊肟酯分散片	化学药	HZ003439
头孢泊肟酯干混悬剂	化学药	HZ003440
头孢泊肟酯胶囊	化学药	HZ003441
头孢泊肟酯颗粒	化学药	HZ003442
头孢泊肟酯片	化学药	HZ003443

HY001887　头孢布烯

【其他名称】头孢布坦、头孢噻腾

【外文名称】Ceftibuten

药物药理信息

【药理毒理】本品为半合成第三代头孢霉素、耐酸、可以口服，具广谱抗菌活性，对肠杆菌属细菌有较强抗菌活性，特点是对 β - 内酰胺酶稳定。

反式头孢布烯的抗菌活性为顺式头孢布烯的 1/4 ~ 1/8。

体外和体内试验表明其对以下菌种有效，革兰阳性菌：化脓性链球菌，肺炎链球菌（不包括抗青霉素菌株）；革兰阴性菌：流感嗜血杆菌（β - 内酰胺酶阳性和阴性菌株），副流感嗜血杆菌（β - 内酰胺酶阳性和阴性菌株），卡他莫拉菌（其中大部分为 β - 内酰胺酶阳性），大肠杆菌，克雷伯杆菌类（包括肺炎杆菌和催产杆菌），吲哚阳性变形杆菌（普通变形杆菌）以及其他变形杆菌族（即普罗威登菌、奇异变形杆菌），肠杆菌属（包括腹泻肠杆菌和产气杆菌），沙门菌属，志贺菌属。

本品在体外对不动杆菌、博代杆菌（Bordetellae）、弯曲杆菌、肠杆菌、肠球菌、黄杆菌、哈夫尼亚菌、李斯特菌、假单胞菌、葡萄球菌及其他链球菌无抗菌作用。对大部分厌氧菌的抗菌活性不大，包括大部分的拟杆菌属。

临床主要用于上述敏感菌所致呼吸道感染，如慢性气管炎急性发作、咽炎、扁桃体炎、泌尿道感染等。

【药代动力学】本品口服吸收迅速，口服 400mg 胶囊，约 3 小时血药浓度接近 13.3μg/ml，一日 1 次连服 7 日，血药浓度可达 17.9μg/ml。食物可影响本品混悬剂的吸收，延迟达峰时间，并使 C_{max} 降低 18%，AUC 降低 8%。绝大部分药物经肾排泄，$t_{1/2}$ 4.4 小时。

【药物相互作用】

1. 本品不影响茶碱的体内代谢。

2. 抗酸药和 H_2 受体阻滞剂使胃中 pH 升高，而使本品的生物利用度增大，雷尼替丁 150mg，每日 2 次连服 3 日，可是本品的 C_{max} 增加 23%，AUC 增加 16%。

【不良反应】偶有皮疹等变态反应、恶心、呕吐、腹泻等胃肠道反应，亦有头痛、血尿素氮、肌酐、嗜酸细胞计数升高等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
头孢布烯干混悬剂	化学药	HZ003444
头孢布烯胶囊	化学药	HZ003445

HY001888 头孢地尼

【其他名称】全泽复

【外文名称】Cefdinir

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】(6*R*, 7*R*) -7- [[(2-氨基-4-噻唑基)-(肟基)乙酰基]氨基]-3-乙烯基-8-氧代-5-硫杂-1-氮杂双环[4.2.0]辛-2-烯-2-羧酸

【分子式】$C_{14}H_{13}N_5O_5S_2$

【分子量】395.42

【性状及组成】本品为微黄色至黄色结晶性粉末，有微臭。

本品在磷酸盐缓冲液（pH7.0）中微溶，在水、乙醇或乙醚中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加磷酸盐缓冲液（pH7.0）溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为 -58°至 -66°。

吸收系数：取本品，精密称定，加磷酸盐缓冲液（pH7.0）溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 10μg 的溶液，照紫外-可见分光光度法（附录Ⅳ A），在 287nm 的波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为 570~610。

药物药理信息

【药理毒理】本品为口服第三代头孢菌素，对革兰阳性菌和革兰阴性菌有广范围的抗菌谱，特别是对革兰阳性菌中的金黄色葡萄球菌属、链球菌属等，比以往的口服头孢菌素有更强的抗菌活性，其作用方式是杀菌性的。对各种细菌产生的 β-内酰胺酶稳定，对 β-内酰胺酶的产生菌也具有优异的抗菌活性。

作用机制为阻止细菌细胞壁的合成，其作用点因菌种而异，对青霉素结合蛋白（PBP）的 1（1a, 1bs）、2、3 位的亲和性强。

非临床毒理研究：在大鼠和犬等试验动物中对头孢地尼进行的急性和慢性毒性研究表明，头孢地尼可被很好耐受。未发现头孢地尼有致畸性和致突变性。

【药代动力学】1. 血药浓度：正常成人一次空腹口服 50、100、200mg（效价）时，约经 4 小时后可获得血药峰浓度，分别为 0.64、1.11 和 1.74μg/ml，其半衰期为 1.6~1.8 小时。有肾功能障碍时，依障碍程度，药物向尿中的排泄可能延迟，可见到血药浓度升高和半衰期延长。

正常成人一次空腹和进食后口服 100mg（效价），约经 4 小时后，可获得血药峰浓度，分别为 1.25、0.79μg/ml。进食后给药，其吸收稍有降低。

2. 分布：在患者痰液、扁桃体、上颌窦黏膜组织、中耳分泌物和皮肤组织等均有分布，尚不知是否在乳汁中有分布。

3. 代谢：人体血液、尿及粪便中未发现有抗菌活性的代谢产物。

4. 排泄：主要经肾脏排泄，正常成人（空腹）口服 50、100、200mg（效价）时，尿排泄率（0~12 小时）约为 26%~33%，4~6 小时的峰值浓度分别为 44.3、81.5 和 132μg/ml。

【药物相互作用】与铁剂合用可降低吸收，有减效的可能。

【不良反应】

1. 休克：偶有休克发生，要严密观察。当有不适感、口内异常感、喘鸣、眩晕、便意、耳鸣、出汗等症状时应停药。

2. 过敏症：当有皮疹、荨麻疹、红斑、瘙痒、发烧等过敏症状出现时，应停药并进行适当处理。

3. 血液：偶有粒细胞减少、嗜酸性白细胞增多，当发现有上述异常时应停药。此外，有报告其他的头孢类抗生素曾有溶血性贫血的发生。

4. 肝脏：偶有 S-GOT、S-GPT、ALP 升高。

5. 肾脏：偶有 BUN 升高。此外，有报告其他的头孢类抗生素偶可引起急性肾衰等重症肾功能障碍，当发现异常时，应停药进行适当处理。

6. 消化道：其他头孢类抗生素有引起伴有血便的伪膜性大肠炎等重症大肠炎的报告。此外，偶有发生恶心、腹泻、腹痛、胃部不适、烧灼感、食欲减退、便秘等。

7. 呼吸道：其他头孢类抗生素偶有伴发热、咳嗽、呼吸困难、胸部 X 射线异常、嗜酸粒细胞增多等的间质性肺炎、PIE 症候群等，当发现有上述异常时应停药，进行适当处理，如给予肾上腺皮质激素等。

8. 菌群失调：偶有口内炎、念珠菌症。

9. 维生素缺乏症：偶有维生素 K 缺乏症（低凝血酶原血症、出血倾向等）和 B 族维生素缺乏症（舌炎、口内炎、食欲减退、神经炎等）。

10. 其他：偶有头痛、眩晕、胸部压迫感。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
头孢地尼分散片	化学药	HZ003446
头孢地尼胶囊	化学药	HZ003447
头孢地尼颗粒	化学药	HZ003448

HY001889　头孢地嗪钠

【外文名称】Cefodizime Sodium

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第42册

药物理化信息

【化学名】（6*R*，7*R*）－7－［（2－氨基－4－噻唑基）－（甲氧亚氨基）乙酰胺基］－3－［［（5－羧甲基－4－甲基－2－噻唑基）硫］甲基］－8－氧代－5－硫杂－1－氮杂双环［4.2.0］辛－2－烯－2甲酸二钠盐

【分子式】$C_{10}H_{18}N_6Na_2O_7S_4$

【分子量】628.64

【性状及组成】本品为白色或类白色至微黄色的粉末，无臭或稍有特异性气味。

本品在水中极易溶解，在无水乙醇或乙醚中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并稀释成每1ml中含10mg的溶液，依法测定，比旋度为－55°至－62°。

吸收系数：取本品，精密称定，加水溶解并稀释成每1ml中约含20μg的溶液，照分光光度法，在260nm的波长处测定吸光度，吸收系数为305～335。

药物药理信息

【药理毒理】本品通过抑制细菌细胞壁的合成发挥杀菌作用。本品主要对多种革兰阳性和革兰阴性菌和厌氧菌有效。体外试验表明，本品对以下病原菌敏感：如金黄色葡萄球菌（不包括对甲氧西林耐药菌株）、链球菌属、肺炎球菌、淋病奈瑟菌、（包括产β－内酰胺酶的菌株）、脑膜炎奈瑟菌、卡他布兰汉菌、大肠埃希菌、志贺菌属、沙门菌属、枸橼酸杆菌属、克雷伯菌属、普通变形杆菌、普鲁威登菌属、摩氏摩根菌、嗜血流感杆菌、棒状杆菌属。本品对大多数细菌产生的β－内酰胺酶稳定。

本品对类杆菌属、不动杆菌属、粪肠球菌、李司特菌属、支原体、衣原体无效。

【药代动力学】单次静脉注射和滴注本品0.5～2g后，平均高峰血药浓度分别可达133～394mg/L，肌注后生物利用度可达90%～100%。平均消除半衰期多为2.5小时左右，老年患者和肾功能减退者半衰期可延长。本品平均蛋白结合率为81%～88%，随浓度增高而降低。本品可分布进入腹水、胆汁、脑脊液、肺、肾、子宫内膜及其他盆腔组织等各种体液和组织。在体内不被代谢，给药量的51%～94%于48小时内以原形从尿中排出。多次给药后，粪便中可排出给药量的11%～30%，胆汁中浓度甚高。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用头孢地嗪钠	化学药	HZ004972

HY001890　头孢呋肟钠

【外文名称】Cefuroxme Sodium

药物理化信息

【化学名】（6*R*,7*R*）－7－［2－（2－呋喃基）乙醛酰胺基］－3－（羟甲基）－8－氧－5－硫杂－1－氮杂双环［4,2,0］辛－2－稀－2－羧酸7－（*Z*）－（*O*－甲基肟）氨基甲酸脂－钠盐

【性状及组成】本品为白色或淡黄色的结晶性粉末。

药物药理信息

【药理毒理】头孢呋肟的抗菌作用机制是通过阻止细菌细胞壁的合成。其对革兰阳性球菌中的肺炎球菌、溶血性链球菌具有很强的抗菌作用。其对细菌产生的一些β－内酰胺酶相对稳定，因此对某些产酶菌亦可有效。

【药代动力学】肌注本品0.75g后，血药浓度达峰时间（0.40±0.10）小时，平均血药峰浓度为（25.0±2.97）mg/ml，消除半衰期为（1.03±0.45）小时。据文献报道本品在肌注8小时内的血药平均浓度1.3mg/ml，静注0.75g和1.5g后15分钟血药浓度分别为50和100mg/ml，消除半衰期约80分钟。用药后8小时，89%的原药由肾脏排出。本品的血清蛋白结合率约30%。

【不良反应】偶见皮疹及氨基转移酶升高，停药后症状消失。与青霉素有交叉过敏反应。据文献报道，长期使用本品可导致非敏感菌的增殖，胃肠失调，包括治疗中、后期甚少出现的伪膜性结肠炎，罕见病例出现短暂性的血红蛋白浓度减少，嗜酸性白细胞增多，白细胞和嗜中性白细胞减少，停药后症状消失。肌注时，注射部位会有暂时的痛感，剂量较大时尤其如此，可与1%的盐酸利多卡因配伍使用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用头孢呋肟钠	化学药	HZ004973

HY001891　头孢呋辛钠

【外文名称】Cefuroxime Sodium

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（6*R*,7*R*）－7－［2－呋喃基（甲氧亚氨基）乙酰氨基］3－氨基甲酰氧甲基－8－氧代－5－硫杂－1－氮杂二环［4.2.0］辛－2－烯－2－甲酸钠盐

【分子式】$C_{16}H_{15}N_4NaO_8S$

【分子量】446.37

【性状及组成】本品为白色、类白色或微黄色粉末或结晶性粉末；无臭，味苦；有引湿性。

本品在水中易溶，在甲醇中略溶，在乙醇或三氯甲烷中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并稀释成每 1ml 中含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为 +55°至 +65°。

吸收系数：取本品，精密称定，加水溶解并稀释成每 1ml 中含 10mg 的溶液，照分光光度法，在 274nm 的波长处测定吸光度，吸收系数为 390～425。

药物药理信息

【药理毒理】本品为第二代头孢菌素类抗生素。对革兰阳性球菌的抗菌活性与第一代头孢菌素相似或略差，但对葡萄球菌和革兰阴性杆菌产生的 β－内酰胺酶相当稳定。耐甲氧西林葡萄球菌、肠球菌属和李斯特菌属耐药，其他革兰阳性球菌（包括厌氧球菌）对本品均敏感。对金黄色葡萄球菌的抗菌活性较头孢唑林为差，1～2mg/L 可分别抑制对青霉素敏感和耐药的全部金黄色葡萄球菌。对流感嗜血杆菌有较强抗菌活性，大肠埃希菌、奇异变形杆菌等可对本品敏感；吲哚阳性变形杆菌、枸橼酸菌属和不动杆菌属对本品的敏感性差，沙雷菌属大多耐药，铜绿假单胞菌、弯曲杆菌属和脆弱拟杆菌对本品耐药。

其作用机制为与细菌细胞膜上的青霉素结合蛋白（PBPs）结合，使转肽酶酰化，抑制细菌中隔和细胞壁的合成，影响细胞壁黏肽成分的交叉连结，使细胞分裂和生长受到抑制，细菌形态变长，最后溶解和死亡。

【药代动力学】静脉注射本品 1g 后的血药峰浓度（C_{max}）为 144mg/L；肌内注射 0.75g 后的血药峰浓度为 27 mg/L，于给药后 45 分钟达到；静脉注射和肌内注射相同剂量后的曲线下面积（AUC）相似。本品在各种体液、组织液中分布良好，能进入炎性脑脊液，细菌性脑膜炎患者每 8 小时静脉滴注 3g 或 65～75mg/kg，脑脊液中浓度可达 0.1～22.8mg/L。每 8 小时肌内注射 0.75g 后，痰液中的药物浓度为 0.1～7.8mg/L；注射后 2.5 小时胆汁中药物浓度为 1.5～15 mg/L。肌内注射 0.75g 或静脉注射 1.5g 后骨组织中药物浓度可分别达 2.4mg/L 和 19.4mg/L。皮肤水泡液的药物浓度与血药浓度相接近。孕妇肌注后的羊水药物浓度与血药浓度相仿。本品亦能分布至腮腺液、房水和乳汁；血清蛋白结合率为 31%～41%。本品大部分于给药后 24 小时内经肾小球滤过和肾小管分泌排泄，尿药浓度甚高。本品血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为 1.2 小时，新生儿和肾功能减退者血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）延长，同时合用丙磺舒亦可延长。血液透析可降低本品血药浓度。

【药物相互作用】

1．本品与下列药物有配伍禁忌：硫酸阿米卡星、庆大霉素、卡那霉素、妥布霉素、新霉素、盐酸金霉素、盐酸四环素、盐酸土霉素、黏菌素甲磺酸钠、硫酸多黏菌素 B、葡萄糖酸红霉素、乳糖酸红霉素、林可霉素、磺胺异噁唑、氨茶碱、可溶性巴比妥类、氯化钙、葡萄糖酸钙、盐酸苯海拉明和其他抗组胺药、利多卡因、去甲肾上腺素、间羟胺、哌甲酯、琥珀胆碱等。偶亦可能与下列药物发生配伍禁忌：青霉素、甲氧西林、琥珀酸氢化可的松、苯妥英钠、丙氯拉嗪、维生素 B 族和维生素 C、水解蛋白。

2．本品不能以碳酸氢钠溶液溶解。

3．本品不可与其他抗菌药物在同一注射容器中给药。

4．本品与强利尿药合用可引起肾毒性。

【不良反应】

1．偶见皮疹及血清氨基转移酶升高，停药后症状消失。

2．与青霉素有交叉过敏反应。

3．据文献报道，长期使用本品可导致非敏感菌的增殖，胃肠失调，包括治疗中、后期甚少出现的伪膜性结肠炎。

4．罕见短暂性的血红蛋白浓度降低，嗜酸性粒细胞增多，白细胞和嗜中性粒细胞减少，停药后症状消失。

5．肌内注射时，注射部位会有暂时的疼痛，剂量较大时尤其如此。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用头孢呋辛钠	化学药	HZ004974

HY001892 头孢呋辛酯

【外文名称】Cefuroxime Axetil

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】(6*R*,7*R*) －7－［2－呋喃基（甲氧亚氨基）乙酰氨基］－3－氨基甲酰氧甲基－8－氧代－5－硫杂－1－氮杂双环［4.2.0］辛－2－烯－2－羧酸，(1RS) －1－乙酰氧基乙酯

【分子式】$C_{10}H_{22}N_4O_{10}S$

【分子量】510.48

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末，几乎无臭，味苦。

本品在丙酮中易溶，在三氯甲烷中溶解，在甲醇或乙醇中略溶，在乙醚中微溶，在水中不溶。

吸收系数：取本品适量，精密称定，加甲醇溶解并制成每 1ml 中含 15μg 的溶液，照紫外－可见分光光度法，在 276nm 的波长处测定吸光度，吸收系数为 390～420。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：β－内酰胺类抗生素，头孢菌素类。

本品为第二代头孢菌素类抗生素。口服经胃肠道吸收后，在酯酶作用下迅速水解为头孢呋辛而发挥抗菌作用。对革兰阳性球菌的活性与第一代头孢菌素相似或略差，但对葡萄球菌和革兰阴性杆菌产生的 β－内酰胺酶显得相当稳定。除耐甲氧西林葡萄球菌、肠球菌属和李斯特菌属外，其他阳性球菌（包括厌氧球菌）对本品均敏感。本品对金黄色葡萄球菌的抗菌活性较头孢唑啉差，1～2 mg/L 的本品可分别抑制对青霉素敏感和耐药的全部金黄色葡萄球菌。对流感嗜血杆菌有较强抗菌活性，大肠埃希菌、奇异变形杆菌等对本品敏感；吲哚阳性变形杆菌、枸橼酸菌属和不动杆菌属对本品的敏感性差，沙雷菌属多数耐药，铜绿假单胞菌、弯曲杆菌属和脆弱拟杆菌对本品耐药。

本品的作用机制是抑制细菌细胞壁的合成。

【药代动力学】本品脂溶性强，口服吸收良好，吸收后迅速在肠黏膜和门脉循环中被非特异性酯酶水解为头孢呋辛，分布至全身细胞外液；血清蛋白结合率约为 50%。餐后口服本品 250mg 和 500mg 后，血药峰浓度（C_{max}）于 2.5～3 小时到达，分别为 4.1mg/L 和 7.0mg/L。食物可促进本品吸收，空腹和餐后口服本品的绝对生物利用度分别为 37% 和 52%。饮用牛奶可使本品的药－时曲线下面积值（AUC）增高，增高幅度在儿童组较成人组更为显著。本品的血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为 1.2～1.6 小时，较头孢克洛、头孢氨苄和头孢拉定略长；新生儿和肾功能减退患者的 $t_{1/2\beta}$延长；老年（平均年龄 84 岁）患者的血清 $t_{1/2\beta}$可延长至约 3.5 小时。空腹和餐后口服本品 500mg 后，24 小时尿中排泄量分别为给药量的 32% 和 48%。血液透析可降低本品的血药浓度。

【药物相互作用】

1．呋塞米、依他尼酸、布美他尼等强利尿药，卡氮芥、链佐星等抗肿瘤药及氨基糖苷类抗生素等肾毒性药物与本品合用有增加肾毒性的可能。

2．克拉维酸可增强本品对某些因产生 β－内酰胺酶而对本品耐药的革兰阴性杆菌的抗菌活性。

3．本品与丙磺舒合用可使本品的药－时曲线下面积值（AUC）增加约 50%。

4．本品与抗酸药合用可减少本品的吸收。

【药物过量】过量使用本品可刺激大脑而导致抽搐。腹膜透析和血液透析能降低本品的血药浓度。

【不良反应】

1．常见腹泻、恶心和呕吐等胃肠反应。

2．少见皮疹、药物热等过敏反应。

3．偶见伪膜性肠炎、嗜酸粒细胞增多、血胆红素升高、血红蛋白降低、肾功能改变、Coombs 试验阳性和一过性肝酶升高。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
头孢呋辛酯分散片	化学药	HZ003449
头孢呋辛酯干混悬剂	化学药	HZ003450
头孢呋辛酯胶囊	化学药	HZ003451
头孢呋辛酯片	化学药	HZ003452

HY001893　头孢克洛

【外文名称】Cefaclor

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】(6*R*,7*R*) －7－［(*R*) －2－氨基－2－苯乙酰氨基］－3－氯－8－氧代－5－硫杂－1－氮杂双环［4.2.0］辛－2－烯－2－甲酸一水合物

【分子式】$C_{15}H_{14}ClN_3O_4S\cdot H_2O$

【分子量】385.82

【性状及组成】本品为白色、类白色或微黄色粉末或结晶性粉末，微臭，味苦。

本品在水中微溶，在甲醇、乙醇、三氯甲烷或二氯甲烷中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并稀释成每 1ml 中含 4mg 的溶液，依法测定，比旋度为 +105°至 +120°。

吸收系数：取本品，精密称定，加水溶解并定

量稀释制成每 1ml 中约含 20μg 的溶液，照紫外－可见分光光度法，在 264nm 的波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为 230～255。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：β－内酰胺类抗生素，头孢菌素类。

本品为广谱半合成头孢菌素类抗生素。对产青霉素酶金黄色葡萄球菌、A 组溶血性链球菌、草绿色链球菌和表皮葡萄球菌的活性与头孢羟氨苄相同，对不产酶金黄色葡萄球菌和肺炎球菌的抗菌作用较头孢羟氨苄强 2～4 倍。对革兰阴性杆菌包括对大肠埃希菌和肺炎克雷伯菌等的活性较头孢氨苄强，与头孢羟氨苄相仿，对奇异变形杆菌、沙门菌属和志贺菌属的活性较头孢羟氨苄强。2.9～8mg/L 的本品可抑制所有流感嗜血杆菌，包括对氨苄西林耐药的菌株。卡他莫拉菌和淋病奈瑟菌对本品很敏感。吲哚阳性变形杆菌、沙雷菌属、不动杆菌属和铜绿假单胞菌均对本品耐药。

本品的作用机制是抑制细菌细胞壁的合成。

【药代动力学】本品口服后迅速从肠道吸收，分布于全身组织中。口服本品 500mg 的血药峰浓度（C_{max}）约为 13.44 mg/L，达峰时间（t_{max}）约 0.56 小时，血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为 0.57 小时。本品在中耳脓液中可达到足够的浓度；在唾液和泪液中浓度高。本品的血清蛋白结合率约为 25%。给药量的约 15%在体内代谢。本品主要自肾排泄，8 小时内给药量的约 77%以原形自尿中排出，尿药浓度高；约 0.05%自胆汁排泄，胆汁中药物浓度较血药浓度低。血液透析能清除部分本品。

健康受试者 12 人，一次口服缓释片 750mg，血药浓度达峰时间为（1.02±0.58）小时，血药峰浓度为（7.28±1.34）mg/L，平均滞留时间为（2.52±0.39）小时。另据文献资料报道，一次口服本品 750mg，一日 2 次，无蓄积作用。

不管本品是否与食物同时服用，总吸收率相同。然而，当本品与食物同服时，达到的峰浓度为空腹者服用后观察到的峰浓度的 50%～75%，而且通常要延缓 45～60 分钟才出现，给空腹者服用 250mg，500mg 和 1g 后 30～60 分钟内，分别获得的平均血清峰浓度约为 7，13 和 23mg/L。在 8 小时内，约 60%～85%的药物以原形经肾从尿中排泄，大部分药物在头 2 小时内排出。口服 250mg，500mg 和 1g 的剂量后 8 小时内，尿中药物峰浓度分别约为 600，900 和 1900mg/L。本品在正常人体血清中的半衰期为 0.6～0.9 小时。对于肾功能受损病人，头孢克洛的血清半衰期稍微延长，对于肾功能完全受损的病人，本品原药的血浆半衰期为 2.3～2.8 小时。对于肾功能严重受损病人，本品的排泄途径尚未测出。血液透析使其半衰期缩短 25%～30%。

国内研究表明，18 名健康受试者口服 500mg 头孢克洛混悬液后峰浓度为（9.11±1.98）mg/ml，峰时间为（1.25±0.25）小时，估算的半衰期为（0.75±0.25）小时。

【药物相互作用】

1．呋塞米、依他尼酸、布美他尼等强利尿药，卡氮芥、链佐星等抗肿瘤药及氨基糖苷类抗生素等肾毒性药物与本品合用有增加肾毒性的可能。

2．克拉维酸可增强本品对某些因产生 β－内酰胺酶而对本品耐药的革兰阴性杆菌的抗菌活性。

3．口服丙磺舒可延迟本品的排泄。

【药物过量】

1．体征和症状：服用过量的头孢克洛后发生的毒性综合征包括：恶心、呕吐、上腹不适和腹泻，上腹不适和腹泻的严重程度与剂量有关。如果存在其他综合征，可能是继发于原有的疾病，过敏反应或其他中毒作用。

2．治疗：在治疗过量服用综合征时，要考虑多种药物过量的可能性、药物间相互作用以及病人药代动力学方面的差异。

除非服用了头孢克洛正常量的五倍，否则没有必要清除胃肠道中的过量药物。注意保护病人的气道，维持换气和灌注。在可接受的限度内，细致地监测和维持病人的生命体征、血气和血清电解质等。给予活性炭，可以降低药物经胃肠道的吸收，活性炭在许多情况下比呕吐和灌洗更有效。考虑用活性炭代替胃排空，或除了胃排空还给予活性炭。多次给予活性炭，可能加速某些已经吸收的药物的消除。行胃排空或给予活性炭时，要保护病人的气道。

强制性利尿、腹膜透析、血液透析或活性炭血液灌注，没有被证实对头孢克洛的过量服用有好处。

【不良反应】与头孢克洛治疗有关的不良反应有以下内容。

1．过敏反应：根据报道，约占病人的 1.5%，包括荨麻疹样皮疹（1%）。瘙痒、荨麻疹和库姆斯试验阳性，发生率均在 0.5%以下。

曾有报道，使用头孢克洛会发生血清病样反应。这种反应的特点是出现多形性红斑、皮疹及其他伴有关节炎/关节痛的皮肤表现，发热或无发热。与典型的血清病不同之处在于很少与淋巴结病和蛋白尿有关，没有进入循环的免疫复合物，并且无反应后遗症的迹象。人们正在进行深入的研究，血清病样反应似乎是由于过敏，常常发生于头孢克洛第二疗程期间或正在进入第二疗程时。据报道，儿童比成年人更常发生此类反应，总发生率在一次集中试验 200 例中有 1

例（0.5%），在总的临床试验8,346例中有2例（0.024%）〔在各次临床试验中儿童的发生率为0.055%，在副作用的自动报告38,000例中有1例（0.003%）〕。在治疗开始后几天出现的体征和综合征，停止治疗后几天消退。这类反应偶尔会导致病人住院，但住院时间通常很短（根据上市后监测研究，平均住院时间为2～3天）。在这些需要住院的病人中，入院时其综合征从轻微至严重不等，儿童中严重反应发生率较多。抗组胺剂和糖皮质激素似乎增强体征和综合征的缓解。未见有严重后遗症的报道。

更为严重的过敏反应（包括Stevens－Johnson综合征、毒性上皮坏死溶解和过敏症）罕见报道，有青霉素过敏史的病人，可能更常发生过敏反应。

2．胃肠道综合征：发生率约2.5%，其中包括腹泻（70例中占1例）。曾有恶心、呕吐的报道。

伪膜性结肠炎综合征，可能在抗生素治疗期间或之后出现。有报道，在使用大量广谱抗生素后，会引起伪膜性肠炎。暂时性肝炎，罕见于报道。胆汁淤积性黄疸曾有报道。

3．其他与治疗有关的不良反应包括：嗜酸粒细胞增多（50例中有1例）。生殖器瘙痒或阴道炎（100例中不足1例）；血小板减少或可逆性间质性肾炎有报道。念珠菌病曾有报道。

4．因果关系未明确

中枢神经系统不良反应：功能亢进、神经过敏、失眠、精神错乱、高血压、头晕、幻觉和嗜睡，这些均罕见于报道。

5．曾有报道，临床实验室试验结果存在暂时异常值。虽然其病因未明，仍列举于下，作为提请医师注意的信息。

（1）肝脏副作用：AST（SGOT），ALT（SGPT）或碱性磷酸酶值稍微升高（后者40例中有1例）。异常的肝功试验曾有报道。

（2）造血系统：正如对其他β－内酰胺类抗生素的报道一样，本品可引起短暂性淋巴细胞增多、白细胞减少。罕见引起溶血性贫血、再障性贫血。粒细胞缺乏症，中性粒细胞减少，嗜酸粒细胞增多，血管性水肿曾有报道。

（3）肾脏：BUN或血清肌酐水平稍微升高（后者人数不到0.2%）或尿分析异常（人数不到0.5%）。异常的肾功能试验曾有报道。

（4）某些头孢菌素可以引起癫痫病，特别是肾功能不全病人又未减少剂量时，如果发生与药物治疗有关的癫痫，应该停药。如果临床需要，可给予抗惊厥药。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方头孢克洛干混悬剂	化学药	HZ001410
复方头孢克洛胶囊	化学药	HZ001411
复方头孢克洛片	化学药	HZ001412
克洛己新干混悬剂	化学药	HZ002115
克洛己新片	化学药	HZ002116
头孢克洛分散片	化学药	HZ003453
头孢克洛干混悬剂	化学药	HZ003454
头孢克洛缓释胶囊	化学药	HZ003455
头孢克洛缓释片	化学药	HZ003456
头孢克洛混悬液	化学药	HZ003457
头孢克洛胶囊	化学药	HZ003458
头孢克洛咀嚼片	化学药	HZ003459
头孢克洛颗粒	化学药	HZ003460
头孢克洛泡腾片	化学药	HZ003461
头孢克洛片	化学药	HZ003462

HY001894　头孢克肟

【其他名称】氨噻肟烯头孢菌素、Cefspan、世福素

【外文名称】Cefixime

药物理化信息

【化学名】（6*R*,7*R*）－7－［（*Z*）－2－（2－氨基－4－噻唑基）－2－（羧甲氧亚胺基）乙酰氨基］－8－氧代－3－乙烯－5－硫杂－1－氮杂二环［4.2.0］－辛－2－烯－2－羧酸三水合物

或：7［［2－氨基－4－噻唑基（羟甲氧基）亚胺］－乙酰基］氨基－3－乙烯基－8－氧－5－硫杂－1－氮杂二环［4.2.0］］－2－辛稀－2－羧酸

【分子式】$C_{16}H_{15}N_5O_7S_2$

【分子量】453.44

【性状及组成】本品为白色至淡黄色结晶性粉末，无味，具轻微特异臭，易溶于甲醇、二甲亚砜，略溶于丙酮，难溶于乙醇，几不溶于水、乙酸乙酯、乙醚、己烷中。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理研究

口服三代头孢类抗生素，通过抑制细菌细胞壁的合成而达到杀菌作用。本制剂对各种β－内酰氨酶稳定，对革兰阳性、革兰阴性菌均有较广谱的抗菌谱，特别是对革兰阴性杆菌有优异的抗菌作用，其作用方式是杀菌性的。

头孢克肟对革兰阳性菌的链球菌与肺炎球菌等有较强的抗菌作用，对革兰阴性菌的淋球菌、大肠杆菌、变形杆菌、克雷伯氏杆菌、流感嗜血杆菌及沙雷氏菌属均有较强的抗菌作用。对 β－溶血性链球菌、脑膜炎球菌亦均有很强的抗菌活性。对铜绿假单胞菌、粪球菌则无效。

头孢克肟对革兰阳性菌的抗菌作用较弱，但对肺炎球菌、草绿色链球菌及化脓性葡萄球菌的抗菌作用，则比其他口服头孢类抗生素较强或基本相似。对革兰阴性菌，除对绿脓杆菌无效外，明显优于其他口服头孢类及羟安苄青霉素，尤对大肠杆菌、淋球菌、变形杆菌、流感嗜血杆菌、克雷伯菌属、沙雷菌属等，均具有强大的抗菌作用。

对耐头孢克罗的大肠杆菌、肺炎杆菌；耐头孢安苄的大肠杆菌、肺炎杆菌、奇异变形杆菌；耐羟安苄青霉素的大肠杆菌、肺炎球菌、奇异变形杆菌、淋球菌、流感嗜血杆菌及耐青霉素的淋球菌；及耐安苄青霉素的流感嗜血杆菌，头孢克肟均有显著的抗菌作用。同其他口服的头孢类抗生素相比，本品对各种细菌产生的 β－内酰氨酶高度稳定。对产生 β－内酰氨酶的细菌也有很强的抗菌活性。

2．毒理研究

生殖毒性：SD 大鼠在妊娠前和妊娠初期口服给药 100～1000mg/kg，在器官形成期、围产期、哺乳期口服给药 320～3200mg/kg，对大鼠生育力未见影响，未出现致畸作用，新生幼鼠的生长、发育和生殖能力也未发现异常。

【药代动力学】

1．据 PDR57 版：头孢克肟口服后，其绝对生物利用度为 40%～50%，不受饮食影响。头孢克肟片剂 200mg 单剂口服，血浆峰浓度为 3.7μg/ml，等剂量口服头孢克肟混悬液产生的峰浓度比片剂高出 25%～50%。头孢克肟 200mg 混悬液和 400mg 混悬液产生的平均峰浓度为 3μg/ml 和 4.6μg/ml，口服头孢克肟混悬液 100mg 至 400mg，时间－浓度曲线下面积比口服等剂量片剂高出 10%～25%，混悬液剂型替换片剂剂型应考虑到其增加的吸收量。单剂口服 200mg 片剂、400mg 片剂、400mg 混悬液的达峰时间为 2～6 小时，单剂口服 200mg 混悬液的达峰时间为 2～5 小时，24 小时内吸收药物的 50%以原形从尿中排出。血清蛋白结合率为 65%，连续服药 14 天，未发现头孢克肟在体内有蓄积作用，头孢克肟血浆半衰期为 3～4 小时，但在一些志愿者可达 9 小时，与剂型无关。

2．特殊人群药代动力学

（1）老年患者：稳态平均药时曲线下面积比正常成年人约有 40%的升高。

（2）肾功能不全受试者：肌酐清除率为 20～50ml/min 时，头孢克肟平均血清半衰期延长至 6.4 小时；肌酐清除率为 5～20ml/min 时，头孢克肟平均血清半衰期延长至 11.5 小时。

（3）血液透析和腹膜透析：头孢克肟不能有效地从血中清除。但也有文献提示，血液透析的患者，服用 400mg 剂量头孢克肟，其血中变化情况和肌酐清除率水平为 21～60ml/min 的受试者相似。

【药物相互作用】

1．本品与氨基糖苷类抗生素（庆大霉素和妥布霉素）联合用药时应对肠杆菌科细菌和绿脓杆菌的某些敏感菌株有协同作用。

2．本品与能产生低凝血酶原血症、血小板减少症或胃肠道溃疡出血的药物同时应用时，要考虑到这些药对凝血功能和出血危险的累加或多重影响。华法林和抗凝药物与本品合用时增加凝血酶原时间。

3．应用含有甲硫四氮唑侧链的头孢哌酮期间，饮酒或静脉注射含乙醇药物，将抑制乙醛去氢酶的活性，使血中乙醛积聚，出现双硫仑样反应。

4．卡马西平：与本品合用时可引起卡马西平水平升高，必须合用时应监测血浆中卡马西平浓度。

【药物过量】洗胃，无特殊解毒药物，血液透析和腹膜透析不能有效将本品清除。

【不良反应】

1．偶有呕吐、腹泻及食欲减退等。

2．少数患者有皮疹、瘙痒、发热等过敏反应。

3．有粒细胞减少、嗜酸粒细胞增多，肝、肾功能异常等不良反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
头孢克肟分散片	化学药	HZ003463
头孢克肟干混悬剂	化学药	HZ003464
头孢克肟胶囊	化学药	HZ003465
头孢克肟咀嚼片	化学药	HZ003466
头孢克肟颗粒	化学药	HZ003467
头孢克肟片	化学药	HZ003468

HY001895 头孢拉定

【其他名称】Anspor、Cefradex、Cefrag、Cefro、Cefrum、Celex、Cephradine、Cesporan、Citicef、Dicefalin、Dimacef、Ecosporina、环烯头孢菌素、环己烯胺头孢菌素、克必力、Medicef、Sefril、赛菲得、头孢环己烯、头孢雷定、先锋霉素Ⅵ

【外文名称】Cefradine

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（6*R*,7*R*）－7［（*R*）－2－氨基－2－(1,4－环己烯基）乙酰氨基］－3－甲基－8－氧代－5－硫杂－1－氮杂双环［4.2.0］辛－2－烯－2－羧酸

【分子式】$C_{16}H_{19}N_3O_4S$

【分子量】349.40

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，微臭。本品在水中略溶，在乙醇、三氯甲烷、乙醚中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加醋酸盐缓冲液（取醋酸钠 1.36g，加水约 50ml 溶解，用冰醋酸调节 pH 至 4.6，加水稀释至 100ml）溶解并制成每 1ml 中含 10mg 的溶液。依法测定，比旋度为 + 80°至 + 90°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：β－内酰胺类抗生素，头孢菌素类。

本品为第一代头孢菌素，对不产青霉素酶和产青霉素酶金黄色葡萄球菌、凝固酶阴性葡萄球菌、A 组溶血性链球菌、肺炎链球菌和草绿色链球菌等革兰阳性球菌的部分菌株具良好抗菌作用。厌氧革兰阳性菌对本品多敏感，脆弱拟杆菌对本品呈现耐药。耐甲氧西林葡萄球菌属、肠球菌属对本品耐药。本品对革兰阳性菌与革兰阴性菌的作用与头孢氨苄相似。本品对淋球菌有一定作用，对产酶淋球菌也具活性；对流感嗜血杆菌的活性较差。

【药代动力学】口服本品后吸收迅速，空腹口服 0.5g，于给药后 1 小时到达 11～18mg/L 的血药峰浓度（C_{max}），血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为 1 小时。本品在组织体液中分布良好。肝组织中的浓度与血清浓度相等。在心肌、子宫、肺、前列腺和骨组织中皆可获有效浓度。脑组织中药物浓度仅为同期血药浓度的 5%～10%，脑脊液中浓度更低。本品可透过血－胎盘屏障进入胎儿血循环，少量经乳汁排出。血清蛋白结合率为 6%～10%。口服 0.5g 后 6 小时累积排出给药量的 90%以上。少量本品可自胆汁排泄，后者的浓度可为血清浓度的 4 倍。本品在体内很少代谢，能为血液透析和腹膜透析清除。丙磺舒可减少本品经肾排泄。

静脉滴注本品 0.5g 5 分钟后血药浓度为 46mg/L，肌内注射 0.5g 后平均 6mg/L 的血药峰浓度于给药后 1～2 小时到达。肌内注射吸收较口服为差，但血药浓度维持较久。血消除半衰期为 0.8～1 小时。本品在组织体液中分布良好。肝组织中的浓度与血清浓度相等。在心肌、子宫、肺、前列腺和骨组织中皆可获有效浓度。脑脊液中药物浓度仅为同期血药浓度的 8%～12%。本品可透过血－胎盘屏障进入胎儿血循环，少量经乳汁排出。血清蛋白结合率为 6%～10%。静脉给药后 6 小时尿中累积排出量为给药量的 90%以上；肌内注射后 6 小时尿中累积排出给药量的 66%。尿中浓度甚高，多可超过 1000mg/L。少量本品可自胆汁排泄，后者的浓度可为血清浓度的 4 倍。本品在体内很少代谢，能为血液透析和腹膜透析清除。丙磺舒可减少本品经肾排泄。

【药物相互作用】

1．头孢菌素类可延缓苯妥英钠在肾小管的排泄。

2．保泰松与头孢菌素类抗生素合用可增加肾毒性。

3．与强利尿药合用，可增加肾毒性。

4．与美西林联合应用，对大肠埃希菌、沙门菌属等革兰阴性杆菌具协同作用。

5．丙磺舒可延迟本品肾排泄。

6．注射用本品与氨基糖苷类抗生素可相互灭活，当前述药物同时给予时，应在不同部位给药，两类药物不能混入同一容器内。

7．注射用本品不能与其他抗生素相混给药。

8．注射用本品中含有碳酸钠，因此与含钙溶液如复方氯化钠注射液有配伍禁忌。

【药物过量】应及时停药并予对症、支持治疗，可通过血液透析和腹膜透析清除头孢拉定。

【不良反应】本品不良反应较轻，发生率也较低，约 6%。恶心、呕吐、腹泻、上腹部不适等胃肠道反应较为常见。药疹发生率约 1%～3%，伪膜性肠炎、嗜酸粒细胞增多、直接 Coombs 试验阳性反应、周围血常规白细胞及中性粒细胞减少等见于个别患者。少数患者可出现暂时性血尿素氮升高，血清氨基转移酶、血清碱性磷酸酶一过性升高。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
头孢拉定分散片	化学药	HZ003469
头孢拉定干混悬剂	化学药	HZ003470
头孢拉定胶囊	化学药	HZ003471
头孢拉定颗粒	化学药	HZ003472
头孢拉定片	化学药	HZ003473
注射用头孢拉定	化学药	HZ004975
注射用头孢拉定精氨酸盐	化学药	HZ004976
注射用头孢拉定碳酸盐	化学药	HZ004977

HY001896　头孢雷特赖氨酸盐

【其他名称】氨苄唑头孢菌素、头孢氨甲苯唑、

头孢苄氨四唑

【外文名称】Ceforanide Lysinate

药物药理信息

【药理毒理】抗菌性质与第二代头孢菌素相近，主要用于革兰阴性菌感染。

HY001897 头孢硫脒

【外文名称】Cephathiamidine

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（6*R*，7*R*）－3－［（乙酰氧基）甲基］－7－［α－（*N*，*N*－二异丙基脒硫基）乙酰胺基］－8－氧代－5－硫杂－1－氮杂双环［4.2.0］辛－2－烯－2－甲酸内铵盐

【分子式】$C_{19}H_{28}N_4O_6S_2$

【分子量】472.59

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，几乎无臭，有引湿性。

本品在水中极易溶解，在乙醇中微溶，在丙酮、三氯甲烷或乙醚中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量制成每 1ml 中含 10mg 的溶液，依法测定比旋度为 + 135°至 + 145°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：β－内酰胺类抗生素，头孢菌素类。

本品对革兰阳性菌及部分阴性菌有抗菌活性。对肠球菌的最低抑菌浓度为 0.8～12.5μg/ml，对金黄色葡萄球菌、草绿色链球菌、溶血性链球菌、非溶血性链球菌、肺炎球菌、白喉杆菌、产气荚膜杆菌、破伤风杆菌和炭疽杆菌、流感杆菌、卡他细菌均有良好抗菌作用。

【药代动力学】本品口服不吸收，单剂量 0.5g 肌内注射，血浆药物浓度达峰时间为 60 分钟，血浆药物峰浓度为 26.2μg /ml；单剂量 0.5g 静滴，血浆峰浓度为 26.2μg/ml。吸收后广泛分布于各脏器组织中，在肝、肾、肺、胆汁中有较高浓度，可透过胎盘并向乳汁移行，不易透过正常的血脑屏障，但在脑膜有炎时可微量进入脑脊液。本品在体内几不代谢，主要以原形药物通过肾小管分泌，12 小时内排出剂量的 80%～90%，主要由尿液中排出，少量由胆汁中排出。肾脏功能不全者血浆半衰期可延长至 13.2h，24 小时内仅排出给药剂量的 3.2%，血浆透析可清除药物 20%～30%。

【药物相互作用】丙磺舒可延缓本品自肾小管排泄，并用丙磺舒 1g 顿服，12h 内排出量由 90% 减少为 65.7%。与强利尿剂和氨基糖苷抗生素联合应用可加重对肾脏的毒性。本品与阿米卡星、妥布霉素、卡那霉素、庆大霉素、盐酸四环素、黏菌素、红霉素乳糖酸盐、盐酸林可霉素、利多卡因、水解蛋白、甲氧西林、去甲肾上腺素、氨茶碱、巴比妥、苯妥英钠、间羟胺、氯化钙、葡萄糖酸钙、苯海拉明、琥珀胆碱、哌甲酯、维生素 B、维生素 C 等药物有配伍禁忌，不宜放置于同一容器内。

【不良反应】常见有过敏反应、哮喘、血清病、发热、寒战、瘙痒、皮疹、血管神经性水肿、过敏性休克；偶见非蛋白氮升高、出血、凝血障碍、溶血性贫血、ALT 或 AST 升高，少见发生二重感染。肌内注射可致局部疼痛、硬结、发热或压痛。静滴可致静脉炎。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用头孢硫脒	化学药	HZ004978

HY001898 头孢美唑钠

【其他名称】Cefmetazon、CMZ、氰唑甲氧头孢菌素、SKF83088、头孢甲氧氰唑、头孢美他唑、先锋密林、先锋美他醇

【外文名称】Cefmetazole Sodium

【性状及组成】常用其钠盐，本品为白色或微黄色粉末或团块；几无臭；极易溶于水，易溶于甲醇，略溶于丙酮，微溶于乙醇。露置空气中有引湿性。

药物药理信息

【药理毒理】本品为头孢菌素类半合成抗生素，性能与第三代头孢菌素相似。抗菌谱包括革兰阳性、阴性和厌氧菌，对葡萄球菌、大肠杆菌、克雷伯杆菌、吲哚阴性和阳性变形杆菌、脆弱拟杆菌等有良好的抗菌作用。本品的耐酶性能强，对一些已对头孢菌素耐药的病原菌也有效。对敏感菌所致的败血症、腹膜炎，以及呼吸道、胆道、尿路、子宫等感染，总有效率为 77.4%。应用其他它头孢菌素等抗生素治疗无效的感染，改用本品治疗后的有效率达 70%。

【药代动力学】本品注射给药可获得较高的血药浓度。肌注 0.5g 后，0.5 小时达血药浓度峰值 32.5μg/ml，相当于肌注 1g 头孢西丁的高峰血药浓度。静注 1g 后，10 分钟的血药浓度为 188μg/ml，23h 后胆汁中的药浓度为血药浓度的 5 倍。于 1 小时内静滴 1g，滴完时的即刻血药浓度为 76.9μg/ml，至 6h 为 2.7μg/ml。$t_{1/2}$为 0.8～1 小时。在体液和脏器内分

布良好。

【药物相互作用】

1. 饮酒会出现双硫醒样作用（颜面潮红、心悸、眩晕、头痛、欲吐等），给药期间及给药后至少1周避免饮酒。

2. 同时应用强利尿药（如呋塞米）可加重肾损伤。

【不良反应】不良反应少见，但在用药中可能发生：过敏性休克，皮疹、皮痒，急性肾功能衰竭，一过性肝功能异常、转氨酶升高，粒细胞、红细胞、血小板减少，间质性肺炎，二重感染。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用头孢美唑钠	化学药	HZ004979

HY001899　头孢孟多酯钠

【外文名称】Cefamandole Nafate

药物理化信息

【化学名】7-D-（2-甲酰氧苯乙酰胺）-3-[（1-甲基-1*H*-四唑-5基）硫甲基]-3-头孢烯-4-羧酸钠盐

【分子式】$C_{19}H_{17}N_6NaO_6S_2$

【分子量】512.38

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶粉末，无臭，味微苦，有引湿性。

药物药理信息

【药理毒理】本品为第二代头孢菌素类抗生素。头孢孟多酯钠的抗菌活性仅为头孢孟多的1/5～1/10，头孢孟多酯钠进入体内迅速水解为头孢孟多，所以两者在体内的抗菌作用基本相同。头孢孟多对多数革兰阳性球菌有较强的抗菌作用，其活性与头孢噻吩和头孢唑林相仿，肠球菌属和耐甲氧西林金黄色葡萄球菌对本品耐药。本品对白喉杆菌和革兰阳性厌氧菌（厌氧球菌和梭状芽孢杆菌）均有良好作用，对大肠埃希菌、奇异变形杆菌、肺炎克雷伯菌和流感嗜血杆菌的活性较头孢噻吩和头孢唑林为强，部分产气肠杆菌、吲哚阳性变形杆菌和普鲁威登菌均对本品敏感。伤寒沙门菌、志贺菌属、淋病奈瑟菌和脑膜炎奈瑟菌对本品也甚敏感，对脆弱拟杆菌的抗菌作用差。沙雷菌属、产碱杆菌属、不动杆菌属和铜绿假单胞菌对本品耐药。

其作用机制为与细菌细胞膜上的青霉素结合蛋白（PBPs）结合，使转肽酶酰化，抑制细菌中隔和细胞壁的合成，影响细胞壁黏肽成分的交叉连结，使细胞分裂和生长受到抑制，细菌形态变长，最后溶解和死亡。

【药代动力学】本品经肌内或静脉给药在体内迅速水解为头孢孟多。肌内注射头孢孟多1g（即注射相当于1g头孢孟多的头孢孟多酯钠，下同），血药峰浓度（C_{max}）于1小时后达到，为21.2mg/L，6小时的血药浓度为1.3mg/L。静脉注射和静脉滴注（滴注时间1小时）1g后即刻血药浓度分别为104.7mg/L和53.9mg/L，15分钟后皆约下降一半，4小时后仅有微量，分别为0.19mg/L和0.06mg/L。

头孢孟多的分布容积（V_d）为0.16L/kg。动物注射本品后，药物迅速分布于全身各组织器官中，心、肺、肝、脾、胃、肠、生殖器官等脏器中的浓度为血药浓度的8%～24%，肾、胆汁和尿中的药物浓度分别为血药浓度的2倍、4.6倍和145倍。胆汁中浓度为141～325mg/L，腹水、心包液和关节液中为5.5～25mg/L。当脑膜有炎症时，本品可透过血-脑脊液屏障，其脑脊液中浓度与蛋白量有关。细菌性脑膜炎病人按体重静脉注射33mg/kg，脑脊液蛋白低于或高于100mg/ml时，药物浓度分别为0～0.62mg/L和0.57～7.4mg/L。蛋白结合率为78%。

正常成人肌内注射和静脉给药的血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为0.5～1.2小时。肾功能中度和重度减退病人的血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）分别延长至3小时和10小时以上。本品在体内不代谢，经肾小球滤过和肾小管分泌，自尿中以原形排出。肌内注射1g后0～3小时的尿药浓度在3000mg/L以上，24小时的排出量为61%。静脉给药后24小时的尿排泄量为70%～90%。少量（0.08%）可经胆汁中排泄，胆汁中可达有效治疗浓度。口服丙磺舒可增加本品的血药浓度并延长半衰期。腹膜透析清除本品的效能差，透析12小时只能清除给药量的3.9%；血液透析的清除率较高，重度肾功能损害经血液透析后，半衰期可缩短至6.2小时。

【药物相互作用】

1. 本品制剂中含有碳酸钠，因而与含有钙或镁的溶液（包括复方氯化钠注射液或复方乳酸钠注射液）有配伍禁忌。两者不能混合在同一容器中；如必须合用时，应分开在不同容器中给药。

2. 头孢孟多与产生低凝血酶原血症、血小板减少症或胃肠道溃疡的药物同用，将干扰凝血功能和增加出血危险。

3. 头孢孟多与氨基糖苷类、多黏菌素类、呋塞米、依他尼酸合用，可增加肾毒性的可能。

4. 丙磺舒可抑制头孢菌素类的肾小管分泌，两者同时应用将增加头孢菌素类的血药浓度和延长其半衰期。

5. 红霉素可增加本品对脆弱拟杆菌的体外抗菌

活性100倍以上。与庆大霉素或阿米卡星合用，在体外对某些革兰阴性杆菌有协同作用。

【不良反应】不良反应发生率约为7.8%，可有肌内注射区疼痛和血栓性静脉炎，后者较头孢噻吩为重。过敏反应表现为药疹、嗜酸性粒细胞增多、Coombs反应阳性等，药物热偶见。少数病人出现血清门冬氨酸氨基转移酶、血清丙氨酸氨基转移酶、碱性磷酸酶、血清肌酐升高，多系暂时性。头孢孟多所致的可逆性肾病也有报告。

少数病人应用大剂量时，可出现凝血功能障碍所致的出血倾向，凝血酶原时间和出血时间延长，多见于肾功能减退病人，系由于本品干扰维生素K在肝中的代谢，导致低凝血酶原血症有关。因此，在停药和注射维生素K后，凝血功能即可恢复正常，同时给予维生素K可预防此反应的发生。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用头孢孟多酯钠	化学药	HZ0004980

HY001900 头孢米诺钠

【其他名称】Meicilin、美士灵

【外文名称】Cefminox Sodium

药物理化信息

【化学名】(6*R*,7*S*) -7*β*-［(*S*) -2-［(2-氨基-2-羧乙基）硫］乙酰氨基］-7*α*-甲氧基-3-［(1甲基-1*H*-四唑-5-基）硫］甲基］-8-氧-5-硫杂-1-氮杂双环［4.2.0］辛-2-烯-2-甲酸钠盐七水化合物

【性状及组成】本品为白色或微黄白色结晶性粉状末，无臭味或微有特异臭味，易溶于水，较难溶于甲醇，几乎不溶于乙醇或乙醚。

药物药理信息

【药理毒理】本品对革兰阳性菌和革兰阴性菌有广谱抗菌活性，特别对大肠杆菌、克雷伯杆菌属、流感嗜血杆菌、变形杆菌及脆弱拟杆菌有很强的抗菌作用。其作用机制是对*β*-内酰胺类抗生素通常作用点的青霉素结合蛋白显示很强亲和性，可抑制细胞壁合成，并与胎聚糖与脂蛋白结合以促进溶菌，在短时间内显示很强杀菌力。本品对细菌增殖期及稳定期初期显示抗菌作用，低于MIC浓度也有杀菌作用，短时间内溶菌。体内抗菌力比MIC的预测更强。本品注射200～1600mg/（kg·d）未见对大鼠母鼠生殖能力、仔鼠发育分化及生殖能力有影响。对家兔400～1600mg/（kg·d），共5日，在800mg/（kg·d）以上给药组，观察到肾毒性比头孢替唑啉弱，但较头孢噻吩略强。对小鼠、大鼠、豚鼠及家兔几乎未见抗原性。与头孢美唑、头孢唑啉、青霉素G、氨苄西林之间未见免疫学交叉性，也未见库姆斯氏反应阳性。

【药代动力学】本品对肾功能正常成人显示剂量依赖性，其平均血浆消除半衰期为2.5小时。本品慢性支气管炎患者的咳痰中、腹膜炎患者的腹水中以及其他患者的胆汁、子宫内膜、卵巢、输卵管中均能达到治疗浓度。

头孢米诺钠在人体内未见有抗菌活性代谢物。主要从肾排泄，12小时内尿中排泄率约为90%。不同程度的肾功能不全的患者其消除率半衰期延长，肾功能重度损害者（Ccr < 10）24小时内尿中排泄率为10%，中度损害者（Ccr≈48）12小时内尿中排泄率约为60%。

【药物相互作用】本品与氨茶碱、磷酸吡哆醛配伍会降低效价或着色，故不宜配伍；与呋喃硫胺、硫辛酸、氢化可的松琥珀酸钠及腺苷钴胺配伍后时间稍长变色，故配伍后应尽快使用；与利尿剂（呋喃苯胺酸等）合用有可能增加肾毒性，应谨慎用药。动物实验证实，本品影响酒精代谢，是血中乙醛浓度上升，显示双仑醒样作用，故用药期间或用药后应禁酒。

【不良反应】本品上市后观察到如下不良反应。

发生率：偶见0.1%，有时0.1%～5%，常见5%以上或不明频度。

1. 严重不良反应

（1）休克：偶引起休克，故注意观察，若出现不适感、口内异物感、喘鸣、眩晕、便意、耳鸣、发汗等，应停药并适当处置。

（2）全血细胞减少症：偶出现全血细胞减少症，故应定期进行检查，注意观察，若出现异常，应停药并适当处置。

（3）伪膜性大肠炎：偶出现伪膜性大肠炎并伴有血便的严重大肠炎，故注意观察，若出现腹痛、频繁腹泻，应速停药并适当处置。

2. 同类药观察到的严重不良反应

（1）皮肤黏膜眼综合征。（Stevens-Johnson综合征）、中毒性表皮坏死症（Lyell综合征）。其他头孢烯类抗生素有偶出现皮肤黏膜眼综合征（Stevens-Johnson综合征）、中毒性表皮坏死症（Lyell综合征）的报告，故注意观察，若出现异常，应停药并适当处置。

（2）急性肾功能衰竭：其他头孢烯类抗生素有偶出现急性肾功能衰竭等严重肾损害的报告，故出现异常时应停药并适当处置。

（3）溶血性贫血：其他头孢烯类抗生素有出现

溶血性贫血报告，故定期进行检查，注意观察，若出现异常，应停药并适当处置。

（4）间质性肺炎、PIE综合征：其他头孢烯类抗生素偶有出现伴有发热、咳嗽、呼吸困难、胸部X线异常、嗜酸粒细胞增多等的间质性肺炎、PIE综合征等的报告，若出现此类症状，应停药并给肾上腺皮质激素制剂等适当处置。

3．其他不良反应

（1）过敏症：有时出现皮疹，偶出现发红、瘙痒、发热等，若出现此类症状，应停药并适当处置。

（2）肾脏：偶出现BUN上升、血中肌酐上升、少尿、蛋白尿等肾损害所见，故应定期进行检查，注意观察，若出现少尿、血尿等及尿蛋白质、BUN上升、血中肌酐上升等检查所见，应停药并适当处置。

（3）血液：有时出现粒细胞减少、嗜酸粒细胞增多，偶出现红细胞减少、红细胞压积值降低、血红蛋白减少、血小板减少、凝血酶原时间延长等，故应定期进行检查，注意观察，若出现异常，应停药并适当处置。

（4）肝脏：有时候出现AST、ALT、ALP上升，偶出现γ－GTP、LAP、LDH、胆红素上升等及黄疸，故应定期进行检查，注意观察，若出现异常，应停药并适当处置。

（5）消化道：有时出现腹泻，偶出现恶心、呕吐、食欲减退等，故应定期进行检查，注意观察，若出现异常，应停药并适当处置。

（6）菌群交替症：偶出现口内炎、念珠菌病。

（7）维生素缺乏症：偶出现维生素K缺乏症状（低凝血酶原血症、出血倾向等）、维生素B群缺乏症状（舌炎、口内炎、食欲减退、神经炎等）。

4．其他　偶出现全身乏力感。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用头孢米诺钠	化学药	HZ0004981

HY001901　头孢尼西钠

【外文名称】Cefonicid Sodium

药物理化信息

【化学名】（6*R*,7*R*）－7－［（*R*）－α－羟基苯乙酰胺基］－3－［［［1－（磺酸甲基－1H－四唑－5－基）硫代］甲基］－8－氧代－5－硫杂－1－氮杂双环［4.2.0］辛－2－烯－2－羧酸二钠盐

【分子式】$C_{18}H_{16}N_6Na_2O_8S_3$

【分子量】586.53

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：头孢尼西钠为第二代广谱、长效的头孢类抗生素，通过抑制细菌细胞壁合成产生抗菌活性。对革兰阳性和阴性菌以及一些厌氧菌均有抗菌作用。对大多数β－内酰胺酶稳定。

（1）体外和临床试验证实头孢尼西对下列微生物有效。革兰阳性需氧菌：金黄色葡萄球菌（包括产和不产β－内酰胺酶菌株）、表皮葡萄球菌（对耐甲氧西林的葡萄球菌也耐药）、肺炎链球菌、化脓性链球菌（A组β溶血性链球菌）、无乳链球菌（B组链球菌）。革兰阴性需氧菌：大肠杆菌、肺炎克雷伯菌、维氏普罗维登斯菌属、摩氏摩根菌、普通变形杆菌、奇异变形杆菌、流感嗜血杆菌（包括对氨苄青霉素敏感菌和耐药菌株）。

（2）体外抗菌资料显示头孢尼西对下列微生物有效，但临床有效性尚未确定。革兰阴性需氧菌：卡他莫拉菌、催产克雷伯杆菌、产气肠杆菌、淋病奈瑟菌（包括青霉素敏感菌和耐药菌）、费氏枸橼酸杆菌、异性枸橼酸杆菌。革兰阳性厌氧菌：产气荚膜梭状芽孢杆菌、厌氧消化链球菌、大消化链球菌、普氏消化链球菌、痤疮丙酸杆菌。革兰阴性厌氧菌：具核梭杆菌、头孢尼西体外对假单胞菌属、沙雷菌属、肠球菌，及不动杆菌属、脆弱类杆菌属无效。

2．毒理研究

（1）遗传毒性：致突变研究（包括Amse试验、小鼠微核试验）结果均为阴性。

（2）生殖毒性：具有甲硫四氮唑侧链的β－内酰胺类抗生素曾出现导致青春期前的大鼠睾丸萎缩的情况，从而引起进入成熟期后精子发生减少和生育能力下降。头孢尼西含有一个甲硫四氮唑部分，在相同条件下使用对幼年、青春期及成年雄性大鼠的生殖系统无不良影响。

（3）致癌性：本品的动物长期致癌性研究尚未进行。

【药代动力学】静注头孢尼西1.0g后，平均血浆峰值为129～148mg/L。静注0.5g及2.0g血浆浓度峰值分别为91～95mg/L及270～341mg/L。肌注0.5g及1.0g，亦有较高的血浆浓度峰值分别为49～62mg/L及67～126mg/L。头孢尼西的表观分布容积为5.7～10.8L，与血浆蛋白结合率较高，约为98%。可在大量组织和液体中，包括外科伤口液体、子宫组织、骨、胆囊、胆汁、前列腺组织、心耳，以及脂肪组织达到治疗浓度。头孢尼西不被代谢，以原形经尿道排泄，24小时后尿液回收率为84%～98%。肾脏

消除率为 1.08～1.32L/小时，总血浆消除率为 1.26～1.38L/h。在正常肾功能患者中，静注及肌注本品后，其血浆半衰期分别为 2.6～4.6 小时及 4.5～7.2 小时。本品与丙磺舒联用后，可导致血浆浓度峰值升高，且半衰期延长至 7.5 小时。在严重肾衰竭患者中，头孢尼西的半衰期延长至 65～70 小时。

【药物相互作用】

1. 与其他头孢菌素及氨基糖苷类抗生素联用时曾报道有中毒性肾脏损害出现。不能与氨基糖苷类药物放于同一注射容器中给药。

2. 与丙磺舒联用时可减慢肾排泄，提高血药浓度水平，并导致毒性。

3. 与强效利尿药联用时，可能导致肾毒性增加。

4. 四环素、红霉素及氯霉素可降低该药物的作用。

5. 与酒精同时使用时，该药物可能引发代谢紊乱反应。

6. 头孢尼西可降低口服避孕药的作用，应采用其他有效避孕方法。

7. 对实验检查值的干扰，Coombs 试验假阳性率增高。

【药物过量】过量用药或频繁用药可导致恶心、呕吐、腹泻、癫痫发作，需对症治疗。当发生因药物过量引起的毒性反应时，尤其是有严重肾功能不全的患者，可通过腹膜或血液透析帮助药物清除。如发生药物过敏反应，应立即停药并根据过敏情况进行恰当的治疗（如抗组胺药、糖皮质激素、肾上腺素治疗）。

【不良反应】头孢尼西通常耐受较好，最常见的不良反应为肌内注射时的疼痛感。发生率大于 1% 的不良反应有以下内容。

注射部位反应：疼痛不适，静脉注射部位烧灼感、静脉炎。血液系统：血小板增加，嗜酸粒细胞增多。肝功能实验室检查异常：碱性磷酸酶增加、血清转氨酶（ALT、AST）增加、乳酸脱氢酶（LDH）增加，谷氨酰胺转肽酶（GGTP）增加。发生率小于 1% 的不良反应有：过敏反应：发热、皮疹、荨麻疹、瘙痒、红斑、肌痛、变态反应、Stevens－Johnson 综合征等。胃肠道：恶心、呕吐、腹泻、伪膜性结肠炎。血液系统：白细胞减少、中性粒细胞减少、血小板减少、溶血性贫血、Coombs 试验阳性。肾毒性：偶见血尿素氮、肌酐值升高，间质性肾炎，少有急性肾衰的报道。中枢神经：抽搐（大剂量或肾功能障碍时）、头痛、精神紧张。神经肌肉骨骼：关节疼痛。其他：念珠菌病。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用头孢尼西钠	化学药	HZ004982

HY001902 头孢哌酮

【其他名称】Cefobine、Cefobis、Cefosint、Farecef、羟哌唑头孢、头孢氧哌羟苯唑、头孢氧哌唑、Tomabef、先锋哌酮、先锋哌唑酮、先锋松、氧哌羟苯唑头孢、氧哌嗪头孢

【外文名称】Cefoperazone

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】(6*R*,7*R*) －3－［［（1－甲基－1H－四唑－5－基）硫］甲基］－7－［（*R*）－2－（4－乙基－2,3－二氧代－1－哌嗪碳酰氨基）－2－对羟基苯基－乙酰氨基］－8－氧代－5－硫杂－1－氮杂双环［4.2.0］辛－2－烯－2－甲酸

【分子式】$C_{25}H_{27}N_9O_8S_2$

【分子量】645.68

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，味微苦，有引湿性。

本品在丙酮或二甲亚砜中溶解，在甲醇或乙醇中微溶，在水或醋酸乙酯中极微溶解。

比旋度：取本品，精密称定，用磷酸盐缓冲液（取 1mol/L 磷酸二氢钾溶液，用 10mol/L 氢氧化钾溶液调节 pH 至 6.0）－乙腈（90:10）溶解并稀释成每 1ml 中含 30mg 的溶液，依法测定，比旋度为 －30°至 －38°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：β－内酰胺类抗生素，头孢菌素类。

HY001903 头孢哌酮钠

【其他名称】先锋必素

【外文名称】Cefoperazone Sodium

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】(6*R*,7*R*) －3－［［（1－甲基－1H－四唑－5 基）硫］甲基］－7－［（*R*）－2－（4－乙基－2,3－二氧代－1－哌嗪碳酰氨基）－2－对羟基苯基－乙酰氨基］－8－氧代－5－硫杂－1－氮杂双环［4.2.0］辛－2－烯－2－甲酸钠盐

【分子式】$C_{25}H_{26}N_9NaO_8S_2$

【分子量】667.66

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，有引湿性。本品在水中易溶，在甲醇中略溶，在乙醇中极微溶解，在丙酮和乙酸乙酯中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并稀释成每 1ml 中含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为 -15°至 -25°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：β-内酰胺类抗生素，头孢菌素类。

头孢哌酮为第三代头孢菌素，对大肠埃希菌、克雷伯菌属、变形杆菌属、伤寒沙门菌、志贺菌属、枸橼酸杆菌属等肠杆菌科细菌和铜绿假单胞菌有良好抗菌作用，对产气肠杆菌、阴沟肠杆菌、鼠伤寒杆菌和不动杆菌属等的作用较差。流感杆菌、淋病奈瑟菌和脑膜炎奈瑟菌对本品高度敏感。本品对各组链球菌、肺炎球菌亦有良好作用，对葡萄球菌（甲氧西林敏感株）仅具中度作用，肠球菌属耐药。头孢哌酮对多数革兰阳性厌氧菌和某些革兰阴性厌氧菌有良好作用，脆弱拟杆菌对本品耐药。

头孢哌酮对多数 β-内酰胺酶的稳定性较差。本品主要抑制细菌细胞壁的合成。

【药代动力学】正常成人肌内注射本品 1g 后，1～2 小时达血药峰浓度（C_{max}），血药峰浓度颌窦黏膜亦有良好分布。本品的蛋白结合率高，为 70%～93.5%。不同途径给药后的血消除半衰期（$t_{1/2}$）约 2 小时，肾功能严重减退时内生肌酐清除率 < 7mL/min　或严重肝病伴肝功能减退时，$t_{1/2}$将延长。血液透析可清除本品。出生时体重低的新生儿 $t_{1/2}$为 2.2 小时。本品在体内不代谢，主要经胆汁排泄，严重肝功能损害或有胆道梗阻者，尿中排泄量可达 90%。

【药物相互作用】

1. 本品与氨基糖苷类抗生素（庆大霉素和妥布霉素）联合应用时对肠杆菌科细菌和铜绿假单胞菌的某些敏感菌株有协同作用。

2. 本品能产生低凝血酶原血症、血小板减少症，与下列药物同时应用时，可能引起出血。抗凝药肝素，香豆素或茚满二酮衍生物、溶栓药、非甾体抗炎镇痛药（尤其阿司匹林、二氟尼柳或其他水杨酸制剂）及磺吡酮等。

3. 本品化学结样反应。因此在用药期间和停药后 5 天内，病人不能饮酒、口服或静脉输入含乙醇的药物。

4. 本品与氨基糖苷类抗生素联合用药时不可同瓶滴注，因可能相互影响抗菌活性。

5. 本品与下列药物注射剂有配伍禁忌：阿米卡星、庆大霉素、卡那霉素 B、多西环素、甲氯芬酯、阿马林（缓脉灵）、苯海拉明、门冬酸钾镁、盐酸羟嗪（安太乐）、普鲁卡因胺、氨茶碱、丙氯拉嗪、细胞色素 C、喷他佐辛（镇痛新）、抑肽酶等。

【药物过量】本品无特效拮抗药，药物过量时主要给予对症治疗和大量饮水及补液等。

【不良反应】

1. 皮疹较为多见，达 2.3%或以上。

2. 少数病人尚可发生腹泻、腹痛、嗜酸粒细胞增多，轻度中性粒细胞减少。

3. 暂时性血清氨基转移酶、碱性磷酸酶、尿素氮或血肌酐升高。

4. 血小板减少、凝血酶原时间延长等可见于个别病例。偶有出血者，可用维生素 K 预防或控制。

5. 菌群失调可在少数病人出现。

6. 应用本品期间饮酒或接受含酒精药物或饮料者可出现双硫仑（disulfiram）样反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用头孢哌酮钠	化学药	HZ004983
注射用头孢哌酮钠舒巴坦钠	化学药	HZ004984
注射用头孢哌酮他唑巴坦钠	化学药	HZ004985

HY001904　头孢匹胺钠

【外文名称】Cefpiramide Sodium

药物理化信息

【化学名】(6*R*,7*R*) -7-［(*R*) -2-（4-羟基-6-甲基-3-吡啶羰基氨基）-2-（对羟基苯基）乙酰氨基］-3-［［(1-甲基-1H-四唑-5-基）硫］甲基］-8-氧代-5-硫杂-1-氮杂双环［4.2.0］辛-2-烯-2-羧酸钠盐

【分子式】$C_{25}H_{23}N_8NaO_7S_2$

【分子量】634.62

药物药理信息

【药理毒理】

1. 抗菌作用

（1）对革兰阳性菌有很强的抗菌活性，对包括革兰阴性菌在内的细菌亦有广谱抗菌活性。同时，对铜绿假单胞菌等非葡萄糖发酵革兰阴性杆菌有很强的抗菌活性。本药的作用为杀菌，并对各种细菌产生的 β-内酰胺酶稳定。

（2）用于实验性感染（小鼠）时，呈现优良的治疗效果。

（3）对青霉素类、其他头孢菌素类或氨基糖苷类抗生素耐药的细菌，尤其是对铜绿假单胞菌敏感。

2. 作用机制：与青霉素结合蛋白（PBP）的1A、1B及3有很强的亲和性，抑制细菌细胞壁的合成，从而发挥杀菌作用。

【药代动力学】

1. 血中浓度：健康成人静注0.5g和1g时，血中浓度于5分钟后分别达到163μg/ml和264μg/ml，于12小时后分别降到10.7μg/ml和17.7μg/ml，血中浓度半衰期均为4.5小时。经1小时静滴1g和2g时，滴注结束时的血中浓度达到峰值，分别为215μg/ml和306μg/ml，滴注开始12小时后分别降到14.7μg/ml和30.6μg/ml。血中浓度高且呈持续性。连续给药无蓄积。

2. 排泄：健康成人静脉注射后24小时以内的尿中排泄率约23%，给药12～24小时后尿中仍保持约50μg/ml的高浓度。本品大部分由胆汁排泄，胆汁中头孢匹胺的浓度大于血浆中的10倍，丙磺舒不影响头孢匹胺的消除。

3. 在体液和组织内的分布：本品在肝胆组织的分布浓度很高，在女性生殖系统、腹腔内渗液、口腔组织、扁桃体组织、皮肤和烧伤组织及痰液中分布良好。

4. 肝肾功能障碍时的血中浓度：给肝功能障碍病人静注1g后，其血中浓度与健康成人相比稍呈持续性趋势，肝硬化代偿期病人的血中浓度半衰期约为健康成人的2倍，肝炎病人的血中浓度半衰期约为健康成人的1.2～1.9倍。给肾功能障碍病人静注0.5g后，其血中浓度与健康成人相比稍呈持续性趋势，然而即使是Ccr不到10ml/min的病例，其血中浓度半衰期也只延长约1.3倍，未证实同Ccr有密切关系。这种延长程度小于其他头孢菌素类抗生素。

Ccr（ml/min）	≥90	90～60	60～30	30～10	<10
$t_{1/2}$（小时）	4.06	6.22	4.44	7.5	5.18

本药用于重度肝肾功能障碍病人时，需要适宜调整剂量和给药间隔。

5. 代谢：在机体内几乎不代谢，尿中及粪中未发现抗菌活性代谢物。

6. 儿童的血中浓度及排泄：用于儿童时的药代动力学与成人相同，血中浓度半衰期为3.6～4小时，8小时以内的尿中排泄率为21%～25%。

【药物相互作用】

1. 禁止饮酒或含酒精性饮料。同时服用可出现颜面潮红、恶心、心动过速、多汗、头痛等症状。其机理尚不明确，可能是头孢结构上3位上连接的*N*－甲巯四唑硫代甲基引起的戒酒硫样症状。

2. 同服抗凝药可能会产生协同作用，导致出血。

3. 同时使用时注意事项：利尿药（呋喃苯氨酸、阿佐塞米、吡咯他尼、布美他尼等），据报告与其他头孢菌素抗生素联合应用时，加重肾功能障碍。机制尚未解明，考虑利尿药脱水作用引起的血液药物浓度上升所致。

【药物过量】过量用药或频繁用药可导致恶心、呕吐、腹泻、癫痫发作，需对症治疗。

【不良反应】据文献报道，本品在上市前及上市后所进行的临床研究统计分析15442例中，出现不良反应和实验室检查异常者617例（4%）。主要为少见的腹泻、恶心等消化道症状，以及皮疹等皮肤症状，白细胞减少、嗜酸性粒细胞增多等血常规异常，BUN、肌酸、肌酐升高等肾功能异常，AST、ALT升高等肝功能异常者。

1. 严重不良反应

（1）过敏性休克（<0.1%）：密切观察，出现症状时应停药，并进行适当处置。

（2）急性肾功能衰竭等严重肾功能障碍（<0.1%）：定期检查肾功能，密切观察，发现异常时，应停药并进行适当处置。

（3）伪膜性结肠炎等伴有血便的严重结肠炎（<0.1%）：出现腹痛、频繁腹泻等症状时，应立即停药，并进行适当处置。

（4）间质性肺炎、肺嗜酸性细胞浸润综合征（<0.1%）：出现发热、咳嗽、呼吸困难、胸部X线片异常、嗜酸性粒细胞增多等症状时，应停药，并给予皮质激素，进行适当处置。

2. 同类药物出现的严重不良反应

（1）恶性大疱性多形红斑（Stevens－Johnson综合征）、中毒性表皮坏死综合征（Lyell综合征）：据报告使用其他头孢菌素类抗生素时，偶见恶性大疱性多形红斑、中毒性表皮坏死综合征（Lyell综合征），应密切观察，出现异常时，应停药并进行适当处置。

（2）溶血性贫血：据报告使用其他头孢菌素类抗生素（CET、CER等）时，出现溶血性贫血，发现异常时，应停药并进行适当处置。

（3）其他不良反应：出现以下不良反应时，应根据需要采取减少剂量、停药等适当措施。

（1）过敏反应：皮疹、瘙痒、发热 荨麻疹、细斑、皮肤发红、关节痛等。

（2）血液系统：粒细胞减少、嗜酸粒细胞增多、贫血、血小板减少。

（3）肝脏：GOT、ALT、ALP、LDH升高 胆红素、γ－GPT升高。

（4）消化系统：腹泻、恶心、呕吐 食欲减退等。

（5）双重感染：口腔炎、念珠菌感染。

（6）维生素缺乏症：维生素 K 缺乏症状（低凝血酶原血症、出血倾向等），维生素 B 缺乏症状（舌炎，口腔炎，食欲减退、神经炎等）。

（7）其他：头痛，热感，全身倦怠感。

出现这类症状时，应停药等并进行适当处理。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用头孢匹胺钠	化学药	HZ004986

HY001905　头孢羟氨苄

【其他名称】Baxan、Bidocef、CDX、Cephamox、Duricef、Kefroxil、Oracefal、羟氨苄头孢菌素、Sedral、Utracef

【外文名称】Cefadroxil

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（6*R*,7*R*）－3－甲基－7－［（*R*）－2－氨基－2－（4－羟基苯基）乙酰氨基］－8－氧代－5－硫杂－1－氮杂双环［4.2.0］辛－2－烯－2－甲酸一水合物

【分子式】$C_{16}H_{17}N_3O_5S \cdot H_2O$

【分子量】381.41

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，有特异性臭味。本品在水中微溶，在乙醇、三氯甲烷或乙醚中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并稀释成每 1ml 中含 6mg 的溶液，依法测定，比旋度为 + 165°至 + 178°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：β－内酰胺类抗生素，头孢菌素类。

头孢羟氨苄为第一代口服头孢菌素，对革兰阳性菌有较好的抗菌作用，对革兰阴性菌和部分厌氧菌亦有一定的抗菌活性。

本品对除肠球菌外的革兰阳性菌和部分革兰阴性菌具有较好的抗菌作用。如产青霉素酶和不产青霉素酶的金黄色葡萄球菌、表皮葡萄球菌、肺炎球菌、A 组溶血性链球菌、大肠埃希菌、奇异变形杆菌对本品敏感；本品对沙门菌属、志贺菌属、流感嗜血杆菌、淋病奈瑟菌等也有抗菌作用。甲氧西林耐药葡萄球菌、肠球菌属、吲哚阳性变形杆菌、肠杆菌属、沙雷菌属及铜绿假单胞菌等对本品耐药。

其作用机制为与细菌细胞膜上的青霉素结合蛋白（PBPs）结合，使转肽酶酰化，抑制细菌中镉和细胞壁的合成，影响细胞壁黏肽成分的交叉连结，使细胞分裂和生长受到抑制，细菌形态变长，最后溶解和死亡。

头孢羟氨苄属低毒。给新生大鼠 12600mg/kg 的高剂量未发生死亡；犬一日口服本品 600mg/kg，大鼠每日口服本品 1000mg/kg，连续 6 个月，对各组织器官未产生毒性反应。

【药代动力学】空腹口服本品 0.5g 后，1.5 小时达血药峰浓度（C_{max}）为 16mg/L，12 小时尚有微量，血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为 1.5 小时。食物对血药峰浓度（C_{max}）和血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）无明显影响。头孢羟氨苄自胃肠道的吸收较头孢氨苄和头孢拉定缓慢，但血药浓度较后两者持久。空腹口服头孢羟氨苄、头孢氨苄和头孢拉定 0.5g 后的平均血药峰浓度分别为：16mg/L、21mg/L 和 18mg/L，4 小时后血药浓度为 5mg/L、1mg/L 和 1mg/L，血消除半衰期分别为 1.27 小时、0.57 小时和 0.61 小时。头孢羟氨苄和头孢氨苄的蛋白结合率分别为 20% 和 17%。口服本品 1g 后 2～5 小时的痰、胸水和肺组织中的浓度分别为 1.3mg/L、11.4mg/L 和 7.4mg/L，骨骼、肌肉和滑囊液中的浓度分别为同期血清浓度的 23%、31% 和 43%。胆汁中浓度一般较血清浓度为低。口服本品 1g 后 1～5 小时，前列腺中的浓度为 12.2 mg/kg。24 小时尿中排出给药量的 86%。本品可通过胎盘屏障，也可进入乳汁。本品能被血液透析清除。

【药物相互作用】丙磺舒可提高本品血药浓度，延缓肾排泄。

【不良反应】本品不良反应发生率约为 5%，以恶心、上腹部不适等胃肠道反应为主，少数患者尚可发生皮疹等过敏反应。偶可发生过敏性休克，也可出现尿素氮、血清氨基转移酶、血清碱性磷酸酶一过性升高。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
头孢羟氨苄分散片	化学药	HZ003474
头孢羟氨苄甲氧苄啶胶囊	化学药	HZ003475
头孢羟氨苄胶囊	化学药	HZ003476
头孢羟氨苄颗粒	化学药	HZ003477
头孢羟氨苄片	化学药	HZ003478

HY001906　头孢曲松钠

【外文名称】Ceftriaxone Sodium

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】(6*R*, 7*R*) -7- [[(2-氨基-4-噻唑基)(甲氧亚氨基)乙酰]氨基]-8-氧代-3-[[(1, 2, 5, 6-四氢-2-甲基-5, 6-二氧代-1, 2, 4-三嗪-3-基)硫代]甲基]-5-硫代-1-氮杂双环 [4.2.0] 辛-2-烯-2-羧酸二钠盐三倍半水合物

【分子式】$C_{18}H_{16}N_8Na_2O_7S_3O_3 \cdot 1/2H_2O$

【分子量】661.59

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭。

本品在水中易溶，在甲醇中微溶，在三氯甲烷或乙醚中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并制成每 1ml 中含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为 -153°至 -170°。

吸收系数：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 10μg 的溶液，照紫外-可见分光光度法，在 241nm 的波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为 495～545。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：β-内酰胺类抗生素，头孢菌素类。

本品为第三代头孢菌素类抗生素。对肠杆菌科细菌有强大活性。对大肠埃希菌、肺炎克雷伯菌、产气肠杆菌、氟劳地枸橼酸杆菌、吲哚阳性变形杆菌、普鲁威登菌属和沙雷菌属的 MIC_{90}介于 0.12～0.25mg/L 之间。阴沟肠杆菌、不动杆菌属和铜绿假单胞菌对本品的敏感性差。对流感嗜血杆菌、淋病奈瑟菌和脑膜炎奈瑟菌有较强抗菌作用，对溶血性链球菌和肺炎球菌亦有良好作用。对金黄色葡萄球菌的 MIC 为 2～4mg/L。耐甲氧西林葡萄球菌和肠球菌对本品耐药。多数脆弱拟杆菌对本品耐药。

【药代动力学】肌内注射本品 0.5g 和 1g，血药峰浓度（C_{max}）约于 2 小时后达到，分别为 43mg/L 和 80mg/L。肌内注射 0.5g 后 24 小时的血药浓度为 6.0mg/L，血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为 7.1 小时。1 分钟内静注 0.5g，即刻血药峰浓度为 150.9mg/L，24 小时后的血药浓度为 9.9mg/L，血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为 7.87 小时。30 分钟内静滴本品 lg，滴注结束时的即刻血药峰浓度为 150.7mg/L，24 小时的血药浓度为 9.3mg/L。给化脓性脑膜炎病人一日肌内注射 15～20mg/kg 后，6 小时的脑脊液浓度平均为 5.16mg/L，12 小时的浓度为 2.3mg/L。静脉滴注本品 1g 后 5 小时和 14 小时胆汁中浓度分别为 1600mg/L 和 13.5mg/L。蛋白结合率为 95%。头孢曲松在人体内不被代谢，约 40%的药物以原形自胆道和肠道排出，60%自尿中排出。丙磺舒不能增高本品血药浓度或延长其半衰期。

【药物相互作用】

1. 头孢菌素类静脉输液中加入红霉素、四环素、两性霉素 B、血管活性药（间羟胺、去甲肾上腺素等）、苯妥英钠、氯丙嗪、异丙醇、维生素 B 族、维生素 C 等时将出现混浊。由于本品的配伍禁忌药物甚多，所以应单独给药。

2. 应用本品期间饮酒或服含酒精药物时在个别病人可出现双硫仑样反应，故在应用本品期间和以后数天内，应避免饮酒和服含酒精的药物。

3. 本品不能加入哈特曼氏以及林格氏等含有钙的溶液中使用。本品与含钙剂或含钙产品合并用药有可能导致致死性结局的不良事件。

【不良反应】不良反应与治疗的剂量、疗程有关。局部反应有静脉炎（1.86%），此外可有皮疹、瘙痒、发热、支气管痉挛和血清病等过敏反应（2.77%），头痛或头晕（0.27%），腹泻、恶心、呕吐、腹痛、结肠炎、黄疸、胀气、味觉障碍和消化不良等消化道反应（3.45%）。实验室检查异常约 19%，其中血液学检查异常占 14%，包括嗜酸粒细胞增多，血小板增多或减少和白细胞减少。肝肾功能异常者为 5%和 1.4%。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用头孢曲松钠	化学药	HZ004987

HY001907 头孢噻吩钠

【外文名称】Cefalotin Sodium

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】(6*R*,7*R*) -3- [（乙酰氧基）甲基]-7- [2-（2-噻吩基）乙酰氨基]-8-氧代-5-硫杂-1-氮杂双环 [4.2.0] 辛-2-烯-2-甲酸钠盐

【分子式】$C_{16}H_{15}N_2NaO_6S_2$

【分子量】418.43

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，几乎无臭。本品在水中易溶，在乙醇中微溶，在三氯甲烷或乙醚中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释成每 1ml 中含 10mg 的溶液，在 25℃时，依法测定，比旋度为 +124°至 +134°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：β－内酰胺类抗生素，头孢菌素类。

本品为第一代头孢菌素，抗菌谱广，对革兰阳性菌的活性较强，产青霉素酶和不产青霉素酶金黄色葡萄球菌、凝固酶阴性葡萄球菌、化脓性链球菌、肺炎链球菌、B组溶血性链球菌、草绿色链球菌、表皮葡萄球菌、白喉杆菌、炭疽杆菌对本品皆相当敏感。肠球菌属、耐甲氧西林葡萄球菌、李斯特菌和奴卡菌耐药。流感嗜血杆菌、脑膜炎奈瑟菌、卡他莫拉菌和淋病奈瑟菌对本品高度敏感，部分大肠埃希菌、克雷伯菌属、沙门菌属、志贺菌属、变形杆菌属菌株对本品多中度敏感，其余革兰阴性杆菌则多数耐药。革兰阳性厌氧菌对本品敏感，脆弱拟杆菌对本品耐药。本品主要抑制细菌细胞壁的合成。

【药代动力学】肌内注射本品0.5g和1g后，血药峰浓度（C_{max}）于30分钟后到达，分别为10mg/L和20mg/L，4小时后血药浓度迅速下降。同时口服丙磺舒可使本品血药峰浓度提高近3倍，血药浓度维持时间亦较久。静脉注射1g后15分钟血药浓度为30～60mg/L，24小时内连续静脉滴注12g，血药浓度波动于10～30mg/L。

本品广泛分布于各种组织和体液中，在肾皮质、胸水、心肌、横纹肌、皮肤和胃中浓度较高，肾组织中浓度接近血药浓度，其余组织中的浓度仅为血药浓度的1/3左右，在支气管分泌物、前列腺可达血药浓度的25%。头孢噻吩特别容易进入炎性腹水中。本品在肝和脑组织中的浓度甚低，亦很难渗透至正常脑脊液。在细菌性脑膜炎病人的脑脊液中药物浓度为血药浓度的1%～10%。胆汁中药物浓度低于同期血药浓度。在骨组织中浓度甚低。本品可透过胎盘，胎儿血循环中药物浓度约为母体血浓度的10%～15%。乳汁中浓度约为血中浓度的30%。本品蛋白结合率50%～65%，血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为0.5～0.8小时，肾功能减退时可延长至3～8小时，出生1周内新生儿的$t_{1/2\beta}$为1～2小时。约60%～70%的给药量于给药后6小时内自尿中排出，其中70%为原形，30%为其代谢产物。头孢噻吩可为血液透析和腹膜透析清除，两者的清除率分别为50%～70%和50%。

【药物相互作用】

1．与下列药物有配伍禁忌：硫酸阿米卡星、庆大霉素、卡那霉素、妥布霉素、新霉素、盐酸金霉素、盐酸四环素、盐酸土霉素、黏菌素甲磺酸钠、硫酸多黏菌素B、葡萄糖酸红霉素、乳糖酸红霉素、林可霉素、磺胺异噁唑、氨茶碱、可溶性巴比妥类、氯化钙、葡萄糖酸钙、盐酸苯海拉明和其他抗组胺药、利多卡因、去甲肾上腺素、间羟胺、哌甲酯、琥珀胆碱等。偶亦可能与下列药品发生配伍禁忌：青霉素、甲氧西林、氢化可的松琥珀酸钠、苯妥英钠、丙氯拉嗪、维生素B族和维生素C、水解蛋白。

2．呋塞米、依他尼酸、布美他尼等强利尿药，卡氮芥、链佐星（streptozocin）等抗肿瘤药以及氨基糖苷类抗生素与本品合用有增加肾毒性的可能。

3．克拉维酸可增强本品对某些因产生β－内酰胺酶而对之耐药的革兰阴性杆菌的抗菌活性。

【药物过量】本品无特效拮抗药，药物过量时主要给予对症治疗和大量饮水及补液等。本品可为血液透析和腹膜透析清除。

【不良反应】

1．肌内注射局部疼痛较为多见，可有硬块、压痛和温度升高。大剂量或长时间静脉滴注头孢噻吩后血栓性静脉炎的发生率可高达20%。

2．较常见的不良反应为皮疹，嗜酸粒细胞增多、药物热、血清病样反应等过敏反应。过敏性休克极少发生。

3．粒细胞减少和溶血性贫血偶可发生。

4．高剂量时可发生惊厥和其他中枢神经系统症状，肾功能减退患者尤易发生。

5．恶心、呕吐等胃肠道不良反应少见。

6．可发生由艰难梭菌所致的腹泻和伪膜性肠炎。

7．大剂量使用本品可发生脑病。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用头孢噻吩钠	化学药	HZ004988

HY001908　头孢噻肟钠

【外文名称】Cefotaxime Sodium

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】(6*R*,7*R*)－3－［（乙酰氧基）甲基］－7－［2－氨基－4－噻唑基－（甲氧亚氨基）乙酰氨基］－8－氧代－5－硫杂－1－氮杂双环［4.2.0］辛－2－烯－2－甲酸钠盐

【分子式】$C_{16}H_{16}N_5NaO_7S_2$

【分子量】477.45

【性状及组成】本品为白色、类白色或淡黄白色结晶，无臭或微有特殊臭。本品在水中易溶，在乙醇中微溶，在三氯甲烷中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量

稀释成每 1ml 中含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为 +56°至 +64°。

吸收系数：取本品，精密称定，加 0.01mol/L 盐酸溶液溶解并定量稀释成每 1ml 中含 10μg 的溶液，照紫外 - 可见分光光度法，在 262nm 的波长处测定吸光度，按无水物计算，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为 400 ~ 440。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：β - 内酰胺类抗生素，头孢菌素类。

头孢噻肟为第三代头孢菌素，抗菌谱广，对大肠埃希菌、奇异变形杆菌、克雷伯菌属和沙门菌属等肠杆菌科细菌等革兰阴性菌有强大活性。对普通变形杆菌和枸橼酸杆菌属亦有良好作用。阴沟肠杆菌、产气肠杆菌对本品比较耐药。本品对铜绿假单胞菌和产碱杆菌无抗菌活性。头孢噻肟对流感杆菌、淋病奈瑟菌（包括产 β - 内酰胺酶株）、脑膜炎奈瑟菌和卡他莫拉菌等均有强大作用。本品对金黄色葡萄球菌的抗菌活性较差，对溶血性链球菌、肺炎链球菌等革兰阳性球菌的活性强，肠球菌属对本品耐药。

【药代动力学】 肌内注射本品 0.5g 或 1.0g 后，0.5 小时达血药峰浓度（C_{max}），分别为 12mg/L 和 25mg/L，8 小时后血中仍可测出有效浓度。于 5 分钟内静脉注射本品 1g 或 2g，即刻血药峰浓度分别为 102mg/L 和 215mg/L，4 小时后 2g 组尚可测得 3.3mg/L。30 分钟内静脉滴注 1g 后的即刻血药浓度为 41mg/L，4 小时的血药浓度为 1.5mg/L。头孢噻肟广泛分布于全身各种组织和体液中。正常脑脊液中的药物浓度很低；脑膜炎患者应用本品后，脑脊液中可达有效浓度。支气管分泌物、中耳溢液、胸腔积液、脓胸脓液、腹水、胆囊壁、胆汁、骨组织中亦均可达有效浓度。本品可透过血 - 胎盘屏障进入胎儿血循环，少量亦可进入乳汁。白内障病人静脉注射 2g 后，前房液中药物浓度为 0.3 ~ 2.3mg/L。蛋白结合率 30% ~ 50%。1/3 ~ 1/2 的药物在体内代谢成为去乙酰头孢噻肟（抗菌活性为头孢噻肟的 1/10）和其他无活性的代谢物。本品血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为 1.5 小时，老年人的 $t_{1/2\beta}$（2 ~ 2.5 小时）较年轻人为长，肾功能不全者 $t_{1/2\beta}$可延长为 14.6 小时。约 80%（74% ~ 88%）的给药量经肾排泄，其中约 50% ~ 60%为原形药，10% ~ 20%为去乙酰头孢噻肟，头孢噻肟经胆汁排泄的量甚少，约为给药量的 0.01% ~ 0.1%。丙磺舒可使头孢噻肟的肾清除减少 5%，$t_{1/2\beta}$延长 45%。血液透析能将 62.3%的药物自体内清除。腹膜透析对药物的清除量很少。

【药物相互作用】

1. 与庆大霉素或妥布霉素合用对铜绿假单胞菌均有协同作用；与阿米卡星合用对大肠杆菌、肺炎克雷伯菌和铜绿假单胞菌有协同作用。

2. 与氨基糖苷类抗生素联合应用时，用药期间应随访肾功能。

3. 大剂量头孢噻肟与强利尿药联合应用时，应注意肾功能变化。

4. 头孢噻肟可用氯化钠注射液或葡萄糖液稀释，但不能与碳酸氢钠液混合。

5. 与阿洛西林或美洛西林等合用，可使本品的总清除率降低，如两者合用需适当减低剂量。

【药物过量】 本品无特效拮抗药，药物过量时主要给予对症治疗和大量饮水及补液等。

【不良反应】 不良反应发生率低，约 3% ~ 5%。

1. 有皮疹和药物热、静脉炎、腹泻、恶心、呕吐、食欲减退等。

2. 碱性磷酸酶或血清氨基转移酶轻度升高、暂时性血尿素氮和肌酐升高等。

3. 白细胞减少、嗜酸粒细胞增多或血小板减少少见。

4. 偶见头痛、麻木、呼吸困难和面部潮红。

5. 极少数病人可发生黏膜念珠菌病。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用头孢噻肟钠	化学药	HZ004989
注射用头孢噻肟舒巴坦钠	化学药	HZ004990

HY001909 头孢他啶

【外文名称】 Ceftazidime

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 (6*R*,7*R*) -7- [[(2-氨基-4-噻唑基) - [(1-羧基-1-甲基乙氧基) 亚氨基] 乙酰基] 氨基] -2-羧基-8-氧代-5-硫杂-1-氮杂双环 [4.2.0] 辛-2-烯-3-甲基吡啶鎓内盐五水合物

【分子式】 $C_{22}H_{22}N_6O_7S_2 \cdot 5H_2O$

【分子量】 636.65

【性状及组成】 本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭或微有特臭。

本品在磷酸盐缓冲液（pH6.0）中略溶，在水或甲醇中微溶，在丙酮或三氯甲烷中不溶。

吸收系数：取本品，精密称定，加磷酸盐缓冲液（pH6.0）溶解并定量稀释制成每 1ml 中含 10μg 的溶液，照紫外 - 可见分光光度法，在 257nm 的波长

处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为400～430。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：β－内酰胺类抗生素，头孢菌素类。

本品为第三代头孢菌素类抗生素。对大肠埃希菌、肺炎杆菌等肠杆菌科细菌和流感嗜血杆菌、铜绿假单胞菌等有高度抗菌活性。对硝酸盐阴性杆菌、产碱杆菌等亦有良好抗菌作用。对于细菌产生的大多数β－内酰胺酶高度稳定，故其对上述革兰阴性杆菌中多重耐药菌株仍可具抗菌活性。肺炎球菌、溶血性链球菌等革兰阳性球菌对本品高度敏感，但本品对葡萄球菌仅具中度活性，肠球菌和耐甲氧西林葡萄球菌则往往对本品耐药。本品对消化球菌和消化链球菌等厌氧菌具一定抗菌活性，但对脆弱拟杆菌抗菌作用差。

其作用机制为与细菌细胞膜上的青霉素结合蛋白（PBPs）结合，使转肽酶酰化，抑制细菌中隔和细胞壁的合成，影响细胞壁黏肽成分的交叉连结，使细胞分裂和生长受到抑制、细菌形态变长，最后溶解和死亡。

【药代动力学】成人单次静脉滴注和静脉注射头孢他啶1g后，血药峰浓度（C_{max}）分别可达70～72mg/L和120～146mg/L。血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）约为1.5～2.3小时。给药后在多种组织和体液中分布良好，也可透过血－脑脊液屏障，脑膜有炎症时，脑脊液内药物浓度可达同期血浓度的17%～30%。血浆蛋白结合率为5%～23%。

本品主要自肾小球滤过排出，静脉给药后24小时内以原形自尿中排出给药量的84%～87%，胆汁中排出量少于给药量有1%。

中、重度肾功能损害者本品的消除半衰期延长，当内生肌酐清除率≤2ml/min时，消除半衰期可延长至14～30小时。在新生儿中的半衰期稍延长（平均4～5小时）。本品可通过血液透析清除。

【药物相互作用】

1．本品与下列药物有配伍禁忌：硫酸阿米卡星、庆大霉素、卡那霉素、妥布霉素、新霉素、盐酸金霉素、盐酸四环素、盐酸土霉素、黏菌素甲磺酸钠、硫酸多黏菌素B、葡萄糖酸红霉素、乳糖酸红霉素、林可霉素、磺胺异噁唑、氨茶碱、可溶性巴比妥类、氯化钙、葡萄糖酸钙、盐酸苯海拉明和其他抗组胺药、利多卡因、去甲肾上腺素、间羟胺、哌甲酯、琥珀胆碱等。偶亦可能与下列药物发生配伍禁忌：青霉素、甲氧西林、琥珀酸氢化可的松、苯妥英钠、丙氯拉嗪、维生素B族和维生素C、水解蛋白。

2．在碳酸氢钠溶液中的稳定性较在其他溶液中为差。

3．本品不可与氨基糖苷类抗生素在同一容器中给药。与万古霉素混合可发生沉淀。

4．本品与氨基糖苷类抗生素或速尿等强利尿剂合用时需严密观察肾功能情况，以避免肾损害的发生。

【不良反应】本品的不良反应少见而轻微。少数患者可发生皮疹、皮肤瘙痒、药物热；恶心、腹泻、腹痛；注射部位轻度静脉炎；偶可发生一过性血清氨基转移酶酶、血尿素氮、血肌酐值的轻度升高；白细胞、血小板减少及嗜酸性粒细胞增多等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用头孢他啶	化学药	HZ004991

HY001910　头孢特仑新戊酯

【其他名称】头孢特伦酯、托米伦、Tomiron

【外文名称】Cefteram Pivoxil

【分子式】$C_{22}H_{27}N_9O_7S_2$

【分子量】593.63

药物药理信息

【药理毒理】本品的作用机制是阻断细菌细胞壁的合成。头孢特仑与青霉素结合蛋白（PBP）中的3、1A、1Bs具有很强的结合性，从而发挥杀菌作用。

头孢特仑对革兰阳性菌、阴性菌均有抗菌作用。尤其对革兰阳性菌中的链球菌属、肺炎球菌，革兰阴性菌中的大肠杆菌、克雷伯菌属，淋球菌、流感嗜血杆菌及厌氧菌脓链球菌属等更显示很强的抗菌作用。对以往口服头孢制剂（先锋Ⅳ号、头孢克洛等）不敏感的沙雷菌属、吲哚阳性变形杆菌、肠杆菌属、柠檬酸菌属等显示良好的抗菌作用。头孢特仑对各种细菌产生的β－内酰胺酶稳定，故对产β－内酰胺酶的菌株有效。

【药代动力学】本品口服易吸收，生物利用度高；易清除，少积蓄，清除率达95%。

【药物相互作用】头孢菌素类药物可抑制肠道菌落，导致维生素K合成下降，建议营养不良或病情严重的患者长期使用抗凝剂、香豆素、13－茚满二酮衍生物、肝素、溶栓剂等药物时同时服用维生素K。

【药物过量】没有特效解毒剂，一般为对症处理和支持疗法。

【不良反应】通常少见且轻微。一般不良反应主要为腹泻、皮疹、食欲减退、胃部不适、GTP升高、GOP升高、嗜酸粒细胞增多。

1. 严重不良反应：可观察到下列严重不良反应，但频度不明。

（1）休克、速发性过敏反应（呼吸困难等）。

（2）中毒性表皮坏死综合征（Stevens - Johnson综合征）。

（3）急性肾功能衰竭。

（4）伪膜性肠炎。

出现以上严重不良反应时，应立即停药，妥善处置。

2. 同类药（头孢类抗菌素）可出现下列严重不良反应：

（1）溶血性贫血。

（2）伴有发热、咳嗽、呼吸困难、胸部X线异常、嗜酸性粒细胞增多等间质性肺炎、肺间质性水肿。

3. 其他不良反应有

（1）过敏反应：皮疹、红斑、关节痛（发生率0.1%～2%或不明）。荨麻疹、瘙痒、发热、水肿、淋巴腺肿胀（发生率小于0.1%）。

（2）血液系统：嗜酸性粒细胞增多（发生率0.1%～2%或不明）。粒细胞、血小板减少（发生率小于0.1%）。

（3）肝脏：AST、ALT升高、黄疸（发生率0.1%～2%或不明）。ALP、LDH升高（发生率小于0.1%）。

（4）消化系统：腹泻、软便、恶心、呕吐、食欲减退、胃部不适（发生率0.1%～2%或不明）。腹部胀满、烧心、腹痛（发生率小于0.1%）。

（5）菌群失调：念珠菌感染（发生率0.1%～2%或不明），口腔炎（发生率小于0.1%）。

（6）维生素缺乏症：维生素K缺乏症（低凝血酶原血症、出血倾向等）、维生素B缺乏症（舌炎、口腔炎、食欲减退、神经炎等）（发生率0.1～2%或不明）。

（7）CPK升高（发生率0.1%～2%或不明）。

（8）头痛、眩晕、全身倦怠（发生率小于0.1%）。

临床观察15,857例中，不良反应率占1.10%，主要表现为消化系统的轻微症状，如腹泻（0.32%），胃部不适（0.13%），食欲减退（0.12%）。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
头孢特仑新戊酯片	化学药	HZ0003479

HY001911 头孢替坦二钠

【其他名称】双硫唑甲氧头孢菌素

【外文名称】Cefotetan Disodium

药物理化信息

【化学名】[6*R*-（6α,7α）]-7-[[[[4-（2-氨基-1-羰基-2-氧代乙烯基）-1,3-二硫杂环丁烷-2-基]羰基]氨基]-7-甲氧基-3-[[（1-甲基-1*H*-四唑-5-基）硫]甲基]-8-氧代-5-硫杂-1-氮杂二环[4.2.0]辛-2-烯-2-羧酸二钠

【分子式】$C_{17}H_{15}N_7Na_2O_8S_4$

【分子量】619.57

【性状及组成】本品为白色或淡黄色的粉末，可溶于水。

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理

（1）本品属头霉素类，抗菌谱广，对多种β-内酰胺酶稳定，对革兰阴性菌作用强，对产酶革兰阴性菌和厌氧菌有较好作用。但不发生革兰阴性菌如绿脓杆菌和不动杆菌对本品耐药。

（2）对各种细菌产生的β-内酰胺酶稳定，对产生β-内酰胺酶的细菌具有强的抗菌活性。

（3）本品的作用机制：对细菌细胞壁合成的抑制作用。本品对青霉素结合蛋白1A、1Bs和3位点具有高的亲和力，发挥强的杀菌力。

2. 毒理

（1）急性毒性试验：静注时的LD_{50}值，雌雄小鼠分别为4.99和6.35g/kg；雌雄大鼠分别为6.79和8.48g/kg。

（2）长期毒性试验：大鼠3月重复腹腔注射给药的最大无毒剂量为300mg/kg；恒河猴26周重复静脉注射给药的最大无毒剂量为100mg/kg。

（3）生殖毒性试验：大鼠胚胎的器官形成期生殖毒性试验，头孢替坦对大鼠亲代动物一般毒理学的无毒剂量、对生殖功能无影响的剂量以及对其下一代无影响的剂量均为2000mg/kg。

（4）致突变试验：头孢替坦的细菌回复突变试验、小鼠微核试验和显性致死性突变试验均为阴性反应。

【药代动力学】

1. 吸收：肾功能正常成人静注本品，血中浓度存在用量依存性关系，半衰期约3h。

肾机能障碍患者以0.5g静注状况下，半衰期延长，清除率下降。

老年患者（血清肌酐值1.0mg/dl以下，年龄75岁以上），血中半衰期延长，约7.7h。肾功能障碍者或老年患者本品给药状况下，应注意调节给药量，给药间隔。肾机能正常小儿血中浓度半衰期约2.6h。

2. 分布：胆汁中浓度头孢替坦最高值为1040μg/ml（1g静注1小时后），6h后高的可达703μg/ml。胆囊组织内浓度最高值为228μg/g（1g静注2小时后）。子宫、卵巢及骨盆死腔液中浓度，头孢替坦以1g静注6小时后为5～10μg/g或ml。可见在皮肤，扁桃，喀痰的移行。可见羊水中及乳汁中的移行。小儿髓膜炎患者的髓液中浓度为1.1～4.8μg/ml（53～83mg/kg静脉内给药40～50分钟后）。

3. 代谢和排泄：尿中未见抗菌活性代谢物质。本品主要经过肾脏排泄，静脉内给药后，肾功能正常成人男子24小时后尿中回收率为77%～91%，肾机能正常的小儿，8小时后尿中回收率为70%。

【药物相互作用】

1. 与呋喃苯胺酸等利尿药并用应当慎重；

2. 用雅费氏反应进行肌酐检查时，表观肌酐值有可能示高值。

【药物过量】对症治疗，肾功能不良者采取血液透析。

【不良反应】

1. 罕见休克症状，偶有不快感，口内异物感、喘鸣，眩晕、便意、耳鸣、发汗等症状，应停药。

2. 皮疹、荨麻疹、红斑，瘙痒、发热等，应停药。

3. 偶见BUN上升，粒细胞减少，红细胞减少，嗜酸粒细胞增多，罕见血小板减少，罕见肌酐上升、无尿 、蛋白尿、AST、ALT上升，偶见ALP上升。

4. 胃肠道：罕见伴有发热、腹痛、白细胞增多、黏液血便的剧烈腹泻为主要症状的严重大肠炎，偶见腹泻，应停药。罕见恶心、呕吐、食欲减退。罕见口炎、念珠菌病、维生素K和B缺乏症和倦怠感。最好做皮试，用药后至少1周内不饮酒。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用头孢替坦二钠	化学药	HZ004992

HY001912　头孢替唑钠

【外文名称】Ceftezole Sodium

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】(6*R*,7*R*) －3－［［(1,3,4－噻二唑－2基）硫］甲基］－7－［（1*H*－四唑－1－基）乙酰氨基］－8－氧代－5－硫杂－1－氮杂双环［4.2.0］辛－2－烯－2甲酸钠盐

【分子式】$C_{13}H_{11}N_8O_4NaS_3$

【分子量】462.47

【性状及组成】本品为白色至淡黄色粉末或淡黄色结晶性粉末，无臭，有引湿性。

本品在水中易溶，在甲醇中微溶，在乙醇和乙醚中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并稀释成每1ml中含100mg的溶液，依法测定比旋度为－5°至－9°。

吸收系数：取本品，精密称定，加水溶解并稀释成每1ml中含16μg的溶液，照紫外－可见分光光度法，在272nm的波长处测定吸光度，吸收系数为270～300。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：β－内酰胺类抗生素，头孢菌素类。

头孢替唑钠为半合成的头孢菌素衍生物，其作用机制是通过抑制细菌细胞壁的合成而发挥抗菌活性。

头孢替唑钠对下列细菌有抗菌活性：（1）需氧革兰阳性菌：金黄色葡萄球菌、肺炎链球菌、化脓性链球菌。（2）需氧革兰阴性菌：大肠杆菌、肺炎克雷伯杆菌、变形杆菌。

【药代动力学】本品在体内分布广泛，其中以肾脏最高，依次为血清、肝脏、肺、心、脾。脑脊液中也有少量分布，但脑膜炎症时分布明显增加。在炎性渗出液中的分布，与头孢唑林、头孢噻啶和头孢噻吩相比，头孢替唑为最高，用药后5小时，在渗出液中仍还有相当量的头孢替唑，明显比血中浓度维持时间长。

本品健康成年人肌注0.5g，15～30分钟时血清浓度达峰值，血药峰浓度为24.9μg/ml，维持至4小时约2.6μg/ml，半衰期为56分钟，24小时尿中回收率为86.6%。健康成人一次静滴1g（加0.9氯化钠注射液500ml），1小时滴完。在开始静滴后15分钟血药浓度达峰值（38.75μg/ml），点滴过程中维持此浓度，点滴结束后15分钟血药浓度降至25μg/ml，30分钟为6.25μg/ml，半衰期为0.33小时。

【不良反应】

1. 休克：极少有休克发生，需进行严密观察。当有任何与本品使用有关的症状，如：不适感、口内异常感、哮喘、眩晕、突然排便异常、耳鸣、出汗等症状，应立即停止用药，并予必要处理。

2. 少数有过敏反应，如皮疹、荨麻疹、皮肤发

红、瘙痒、发热等，出现时停药即消失。

3. 罕见严重肾功能异常，偶见血肌酐升高，如发现异常应立即停药，进行必要处理。

4. 罕见粒细胞减少、白细胞减少、嗜酸粒细胞增多、血小板减少等，当发现有上述异常时，应停止用药。

5. 罕见 AST、ALT、碱性磷酸酶增加，有上述异常时，应立即停止用药。

6. 偶见胃肠道反应，如恶心、呕吐、腹泻等，罕见伪膜性肠炎，当有腹痛、腹泻出现时，应立即停药。

7. 菌群失调：罕见发生念珠菌症。

8. 维生素缺乏症：罕见发生维生素 K 缺乏症和 B 组维生素缺乏症。

9. 罕见间质性肺炎、毒理性发热、咳嗽、呼吸困难、胸部 X 线异常、嗜酸粒细胞增多，当出现上述症状时，应停止用药，并给予相应的治疗。

10. 其他：罕见头痛、全身不适感、发热、浅表性舌炎。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用头孢替唑钠	化学药	HZ004993

HY001913 头孢妥仑匹酯

【其他名称】头孢托仑匹酯

【外文名称】Cefditoren Pivoxil

药物理化信息

【化学名】（－）－（6*R*,7*R*）－2,2－二甲基丙酰氧甲基 7－［（*Z*）－2－（2－氨基－4－噻唑基）－2－甲氧基亚氨乙酰氨基］－3－［（*Z*）－2－（4－甲基－5－噻唑基）乙烯基］－8－氧代－5－硫杂－1－氮杂二环［4.2.0］辛－2－烯－2－羧酸酯

【分子式】$C_{25}H_{28}N_6O_7S_3$

【分子量】620.73

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理作用

（1）抗菌作用：①头孢妥仑匹酯吸收时，在肠管壁代谢成头孢妥仑而发挥抗菌力。②头孢妥仑在试管内，对革兰阳性菌及阴性菌具有广泛抗菌谱，尤其对葡萄球菌属，包括肺炎链球菌在内的链球菌属等革兰阳性菌，大肠杆菌、卡他布兰汉球菌、克雷伯杆菌属、变形杆菌属、流感嗜血杆菌等革兰阴性菌以及消化链球菌属、痤疮丙酸杆菌、拟杆菌属等厌氧菌显示很强抗菌力。③头孢妥仑在试管内，对各种细菌产生的 β－内酰胺酶稳定，对 β－内酰胺酶产生株也显示很强抗菌力。

（2）作用机制：头孢妥仑的作用机制为抑制细菌细胞壁合成，与各种细菌青霉素结合蛋白（PBPs）的亲和性高，发挥杀菌性作用。

（3）对实验性感染症的治疗效果：头孢妥仑匹酯对金黄色葡萄球菌、肺炎链球菌、大肠杆菌、肺炎克雷伯氏杆菌、变形杆菌属等引起的实验性感染症显示卓越治疗效果。另外，对 β－内酰胺酶产生株感染的治疗效果也与类药同等或卓越。

2. 长期毒性试验

（1）对大鼠口服给药（按头孢妥仑匹酯计算）125、250、500、1000mg/（kg·d），连续 28 天；31、63、125、250、500mg/（kg·d），连续 6 个月。主要现象推测是由于肠内菌群的变化的二重影响而导致的盲肠膨胀、AST 及 ALT 等的轻微上升、一时性的尿沉淀物内红细胞数的增加及肾重量的增加等。另外，未见特定内脏器官、组织的异常。最大耐受量均推定为 250mg/kg。

（2）对狗口服给药（按头孢妥仑匹酯计算）125、250、500、1,000mg/（kg·d），连续 28 天；125、250、500、1,000mg/（kg·d），连续 6 个月。主要结果为总胆固醇增加、GOT 及 ALT 上升、肝及肾重量的增加、有少数例观察到在肝细胞内有玻璃样的滴状物。最大耐受量分别推定为 250mg/kg、125mg/kg。

3. 生殖毒性试验：对妊娠前、妊娠初期及胚胎器官形成期小鼠口服给药（按头孢妥仑匹酯计算）125、250、500、1,000mg/（kg·d）；对围产期及哺乳期小鼠 90、250、750mg/（kg·d）；另外对胚胎器官形成期家兔 2、4、7.5、15、30mg/（kg·d）。其结果，未见对母鼠的生殖功能有影响。对于 500mg/（kg·d）以上给药群的胚胎器官形成期虽然观察到骶尾骨骨化数的减少，但未见有致畸性。未见对出生儿的成长、行动及生殖功能有影响。家兔 7.5mg/（kg·d）以上给药群里观察到流产及胚胎生存数减少，但未见致畸性。

4. 其他特殊毒性

（1）抗原性：用大鼠及豚鼠来检查的结果，使用头孢妥仑匹酯和佐剂虽然在豚鼠的皮下致敏实验中发现有免疫原性，但在小鼠的腹腔内致敏实验中未见有免疫原性。对豚鼠和小鼠进行的和临床给药途径相同的口服给药致敏反应中均未见有免疫原性。对于活性母体的头孢妥仑，几乎未见有免疫原性及诱导抗原性。

（2）关于与类似药交叉性，观察到与头孢特伦及头孢氨噻肟之间有微弱的交叉抗原性。另外，头孢妥仑的库姆斯氏实验阳性化作用也很弱。

【药代动力学】

1．吸收与分布

（1）血中浓度：健康成人空腹分别1次口服100mg、200mg、300mg时，头孢妥仑的血清中浓度有用量依存性。另外，饭后给药的吸收性较空腹时良好。

（2）体液、组织内浓度：分布于患者痰、扁桃体组织、上颌窦黏膜、皮肤组织、乳腺组织、胆囊组织、子宫阴道、子宫颈部、睑板腺组织、拔牙后创面等，但不分布于乳汁中。

2．代谢、排泄：头孢妥仑匹酯在吸收时代谢成具有抗菌活性的头孢妥仑。头孢妥仑几乎不经代谢而主要从尿及胆汁中排泄。健康成人饭后分别1次口服100mg、200mg、300mg时，头孢妥仑的尿中排泄率（0～24小时）为约20%。连续给本剂（200mg，每12小时1次，共7日），未见蓄积性。

3．肾功能损害时的血清中浓度及尿中排泄：肾功能降低患者（尤其Ccr < 30ml/min、或进行人工透析患者）与健康成人相比，尿中排泄延迟，半衰期延长，血清中浓度达约1～2.5倍，AUC约上升5～10倍。

【药物相互作用】与抗酸剂合用会使其吸收率降低，与丙磺舒合用会使其尿中排泄率降低。

【不良反应】

1．过敏反应：皮疹，瘙痒，荨麻疹和发热等。

2．消化系统：恶心，呕吐，腹泻，如其他广谱抗生素一样，会有罕见的伪膜性肠炎。

3．血液系统：嗜酸粒细胞增多症，白细胞减少症等。曾有报告应用头孢菌素类药物进行治疗时，出现库姆斯反应阳性。

4．肾功能：偶见BUN及血清肌酐上升。

5．肝功能：有时出现AST，ALT，AlP上升。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
头孢妥仑匹酯片	化学药	HZ003480

HY001914　头孢西丁钠

【其他名称】Cenomycin、甲氧头孢噻吩、甲氧头霉噻吩、Mefoxin、美福仙、MK－306、噻吩甲氧头孢菌素、头孢甲氧霉素、头孢甲氧噻吩、头霉甲氧噻吩、头霉噻吩、先锋美吩

【外文名称】Cefoxitin Sodium

药物理化信息

【化学名】（6*R*,7*S*）－3－羟甲基－7－甲氧基－8－氧代－7－2〔2（2－噻吩基）乙酰胺基〕－5－硫杂－1－杂氮双环－〔4.2.0〕－辛－2－烯－乙酰酐酯钠盐

【分子式】$C_{16}H_{16}N_3O_7S_2$

【分子量】449.43

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末，吸湿性强。

本品在水中极易溶解，在乙醇中略溶，在乙醚中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加甲醇溶解并稀释成每1ml中含10mg的溶液，依法测定比旋度为+206°至+214°。

吸收系数：取本品，精密称定，加水溶解并稀释成每1ml中含1mg的溶液，精密量取2ml，置100ml量瓶中，加4.2%碳酸氢钠溶液稀释至刻度，照分光光度法，在262nm的波长处测定吸光度，吸收系数为190～210。

药物药理信息

【药理毒理】头孢西丁钠是头霉素类抗生素，系是由链霉菌 *Streptomyces lactamdurans* 产生的甲氧头孢菌素C（Cephamycin C），经半合成制得的一类新型抗生素，其母核与头孢菌素相似，且抗菌性能也类似，习惯上也被列入第二代头孢菌素类中。作用机制：头孢西丁通过与一个或多个青霉素结合蛋白（PBPs）结合，抑制细菌分裂活跃的细胞的细胞壁生物合成，从而起抗菌作用。各菌种有其独特的青霉素结合蛋白，头孢西丁与各菌种青霉素结合蛋白的亲和力影响着该药物的抗菌谱。头孢西丁是一种头孢霉素衍生物，与头孢菌素不同之处在于其β－内酰胺环7号位上含有一个甲氧基。这种结构上的差异使头孢西丁在耐受革兰阴性菌所产生的β－内酰胺酶的降解作用方面与现有的头孢菌素衍生物不同。

本品为半合成第二代头孢菌素，特点为对革兰阴性菌有较强的抗菌作用，具有高度抗β－内酰胺酶性质。抗菌谱包括大肠杆菌、肺炎杆菌、吲哚阳性的变形杆菌和沙雷菌、克雷伯杆菌、流感杆菌、沙门菌、志贺菌等。对葡萄球菌和多种链球菌也有较好作用。对革兰阳性菌的抗菌性能弱。本品还对一些厌氧菌有良好的作用，如消化球菌、消化链球菌、梭状芽孢杆菌、拟杆菌对本品敏感。氯脓杆菌、肠球菌和阴沟杆菌的多数菌株对本品不敏感。

【药代动力学】头孢西丁钠口服不吸收，静脉或肌内注射后吸收迅速。健康成人静脉注射本品1g，约5分钟后达血药浓度峰值，约为60～65μg/ml。肌内注射本品0.5g，0.5小时后血药浓度达峰值，约为12～23μg/ml。药物吸收后可广泛分布于内脏组织、皮肤和肌肉、骨与关节、痰液及腹水、胸水、羊水、脐带血中。内脏器官以肾、肺含量较高。本品极少

向乳汁移行，也不易透过脑膜，但可透过胎盘屏障进入胎儿血循环。头孢西丁在体内几乎不发生生物代谢，其与血浆蛋白结合率约为37%，血清半衰期约为0.8小时。给药24小时后约80%～90%药物以原形随尿液排泄，极少量从胆汁排泄。正常人反复给药未见蓄积现象。肾功能不全者，尤其是尿毒症无尿时，药物排泄时间明显延长；新生儿早产儿的药物排泄时间较成人延长2～2.5倍。血液透析可将部分头孢西丁从血清中清除。

【药物相互作用】

1．头孢西丁钠与氨基糖苷类抗生素合用时，有协同抗菌作用，但合用时会增加肾毒性。

2．头孢西丁钠与速尿等强利尿剂合用时，可增加肾毒性。

3．头孢西丁钠与丙磺舒合用时可延迟本品的排泄，提高头孢西丁的血药浓度及延长半衰期。

4．头孢西丁钠可影响酒精代谢，使血中乙醛浓度上升，导致双硫仑样反应（面部潮红、头痛、眩晕、腹痛、胃痛、恶心、呕吐、气促、心率加快、血压降低，以及嗜睡、幻觉等）。

5．头孢西丁钠与阿米卡星、氨曲南、红霉素、非格司亭、庆大霉素、氢化可的松、卡那霉素、甲硝唑、新霉素、奈替米星、去甲肾上腺素等药物属配伍禁忌。

6．头孢西丁钠不宜用大量输液稀释，药液宜现配现用，不宜配制后久置。

【药物过量】药物过量的处理：主要是对症和支持治疗。

1．对于急性过敏，给予常用药物（抗组胺药、皮质类固醇、肾上腺素或其他升压的胺类物质），吸氧和保持气道通畅，包括气管插管。

2．对于抗生素相关的伪膜性结肠炎，中到重度者，可能需要补充液体、电解质和蛋白；必要时还可能需要口服甲硝唑、地衣杆菌素、消胆胺或万古霉素。但对于严重的水样腹泻，不宜使用减少蠕动的止泻药。

3．必要时可使用抗惊厥药。

4．血液透析有助于清除血清中药物。

【不良反应】

1．过敏反应皮疹发生率约2%，有时有胃肠道反应、白细胞减少、氮血症及转氨酶升高等。

2．主要由肾排泄，偶可引起肾功能损害，对肾功能不全者应减量。

3．与青霉素有时有交叉变态反应，对青霉素过敏者应慎用。对头孢菌素类过敏者应禁用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用头孢西丁钠	化学药	HZ004994

HY001915 头孢唑林钠

【外文名称】Cefazolin Sodium

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】(6*R*,7*R*) -3- [[(5-甲基-1,3,4-噻二唑-2-基) 硫] 甲基] -7- [(1*H*-四唑-1-基) 乙酰氨基] -8-氧代-5-硫杂-1-氮杂双环 [4.2.0] 辛-2-烯-2-甲酸钠盐

【分子式】$C_{14}H_{13}N_8NaO_4S_3$

【分子量】476.50

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末或结晶性粉末，无臭，味微苦，易引湿。本品在水中易溶，在甲醇中微溶，在乙醇、丙酮或苯中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释成每1ml中含50mg的溶液，依法测定，比旋度为-15°至-24°。

吸收系数：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释成每1ml中约含16μg的溶液，照紫外-可见分光光度法，在272nm的波长处测定吸光度，吸收系数为264～292。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：β-内酰胺类抗生素，头孢菌素类。

头孢唑啉为第一代头孢菌素，抗菌谱广。除肠球菌属、耐甲氧西林葡萄球菌属外，本品对其他革兰阳性球菌均有良好抗菌活性，肺炎链球菌和溶血性链球菌对本品高度敏感。白喉杆菌、炭疽杆菌、李斯特菌和梭状芽胞杆菌对本品也甚敏感。本品对部分大肠埃希菌、奇异变形杆菌和肺炎克雷伯菌具有良好抗菌活性，但对金黄色葡萄球菌的抗菌作用较差。伤寒杆菌、志贺菌属和奈瑟菌属对本品敏感，其他肠杆菌科细菌、不动杆菌和铜绿假单胞菌耐药。产酶淋球菌对本品耐药；流感嗜血杆菌仅中度敏感。革兰阳性厌氧菌和某些革兰阴性厌氧菌对本品多敏感。脆弱拟杆菌耐药。

【药代动力学】肌内注射本品500mg后，血药峰浓度（C_{max}）经1～2小时达38mg/L（32～42mg/L），6小时血药浓度尚可测得7mg/L。20分钟内静脉滴注本品0.5g，血药峰浓度为118mg/L，有效浓度维持8小时。本品难以透过血-脑脊液屏障，脑脊液中不能测出药物浓度。头孢唑林在胸水、腹水、心包液

和滑囊液中可达较高浓度。炎症渗出液中的药物浓度基本与血清浓度相等；胆汁中浓度等于或略超过同期血药浓度。胎儿血药浓度为母体血药浓度的70%～90%，乳汁中含量低。本品蛋白结合率为74%～86%。正常成人的血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为1.5～2小时，老年人中可延长至2.5小时。肾衰竭患者的$t_{1/2\beta}$可延长，内生肌酐清除率为12～17ml/min和低于5ml/min时分别为12小时和57小时。出生1周内新生儿的$t_{1/2\beta}$为4.5～5小时。本品在体内不代谢；原形药通过肾小球滤过，部分通过肾小管分泌自尿中排出。24小时内可排出给药量的80%～90%。丙磺舒可使血药浓度约提高30%，有效血药浓度时间延长。血液透析6小时后血药浓度减少40%～50%；腹膜透析一般不能清除本品。

【药物相互作用】

1. 本品与下列药物有配伍禁忌，不可同瓶滴注：硫酸阿米卡星、硫酸卡那霉素、盐酸金霉素、盐酸土霉素、盐酸四环素、葡萄糖酸红霉素、硫酸多黏菌素B、黏菌素甲磺酸钠，戊巴比妥、葡萄糖酸钙。

2. 本品与庆大霉素或阿米卡星联合应用，在体外能增强抗菌作用。

3. 本品与强利尿药合用有增加肾毒性的可能，与氨基糖苷抗生素合用可能增加后者的肾毒性。

4. 丙磺舒可使本品血药浓度提高，血半衰期延长。

【药物过量】本品无特效拮抗药，药物过量时主要给予对症治疗和大量饮水及补液等。

【不良反应】本品的不良反应发生率低。

1. 静脉注射发生的血栓性静脉炎和肌内注射区疼痛均较头孢噻吩少而轻。

2. 药疹发生率为1.1%，嗜酸粒细胞增高的发生率为1.7%，偶有药物热。

3. 个别病人可出现暂时性血清氨基转移酶、碱性磷酸酶升高。

4. 肾功能减退病人应用高剂量（一日12g）的本品时可出现脑病反应。

5. 白念珠菌二重感染偶见。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用头孢唑啉钠	化学药	HZ004995

HY001916　头孢唑肟钠

【外文名称】Ceftizoxime Sodium

药物理化信息

【化学名】[6*R*－[6*a*，7*b*（*Z*）]]－7[[[2,3－二氢－2－亚氨基－4－噻唑基）（甲氧亚氨基）乙酰基]氨基]－8－氧代－5－硫杂－1－氮杂双环[4.2.0]辛－2－烯－2－羧酸钠盐

【分子式】$C_{13}H_{12}N_5NaO_5S_2$

【分子量】405.38

【性状及组成】本品为白色或淡黄色结晶性粉末。

药物药理信息

【药理毒理】本品属第三代头孢菌素，具广谱抗菌作用，对多种革兰阳性菌和革兰阴性菌产生的广谱β－内酰胺酶（包括青霉素酶和头孢菌素酶）稳定。本品对大肠埃希菌、肺炎克雷伯菌、奇异变形杆菌等肠杆菌科细菌有强大抗菌作用，铜绿假单胞菌等假单胞菌属和不动杆菌属对本品敏感性差。头孢唑肟对流感嗜血杆菌和淋病奈瑟球菌有良好抗菌作用。本品对金黄色葡萄球菌和表皮葡萄球菌的作用较第一、第二代头孢菌素为差，耐甲氧西林金黄色葡萄球菌和肠球菌属对本品耐药，各种链球菌对本品均高度敏感。消化球菌、消化链球菌和部分拟杆菌属等厌氧菌对本品多呈敏感，艰难梭菌对本品耐药。

本品作用机制为本品通过抑制细菌细胞壁黏肽的生物合成而达到杀菌作用。

【药代动力学】肌内注射本品0.5g或1.0g后血药峰浓度（C_{max}）分别为13.7mg/L和39mg/L，于给药后1小时到达。静脉注射本品2g或3g，5分钟后血药峰浓度分别为131.8mg/L和221.1mg/L。头孢唑肟广泛分布于全身各种组织和体液中，包括胸水、腹水、胆汁、胆囊壁、脑脊液（脑膜有炎症时）、前列腺液和骨组织中均可达治疗浓度。蛋白结合率30%。本品血消除半衰期（t1/2β）为1.7小时。在体内不代谢，24小时内给药量的80%以上以原形经肾排泄，因此尿液中药物浓度高。丙磺舒可使头孢唑肟的肾清除减少，血药浓度增高。

【药物相互作用】虽然尚无本品与其他药物相互作用的报道，但有其他头孢菌素与氨基糖苷类抗生素联合应用时出现肾毒性的报道。

【不良反应】

1. 皮疹、瘙痒和药物热等过敏反应、腹泻、恶心、呕吐、食欲减退等。

2. 碱性磷酸酶、血清氨基转移酶轻度升高、暂时性血胆红素、血尿素氮和肌酐升高等。

3. 贫血（包括溶血性贫血）、白细胞减少、嗜酸粒细胞增多或血小板减少少见。

4. 偶见头痛、麻木、眩晕、维生素K和维生素B缺乏症、过敏性休克。

5. 极少数病人可发生黏膜念珠菌病。

6. 注射部位烧灼感、蜂窝织炎、静脉炎（静脉注射者）、疼痛、硬化和感觉异常等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用头孢唑肟钠	化学药	HZ004996

HY001917 透明质酸钠

【其他名称】玻璃酸钠

【外文名称】Sodium Hyaluronate

药物理化信息

【化学名】（1,4）－*O*－*β*－D 葡萄糖醛酸－（1－3）－2－乙酰氨基－2－脱氧－*β*－D 葡萄糖

【性状及组成】本品为白色至微黄色粉末，无臭。

本品在水中易溶，在乙醇、丙酮或乙醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品是从鸡冠提取的天然高分子黏多糖化合物，是一个由葡萄糖醛酸和乙酰氨基己糖组成双糖单位聚合而成的一种黏多糖。

透明质酸钠是细胞外基质的重要成分，具有黏性，对角膜可起保护作用。由于其具有保水性，可防止角膜干燥。加入纤维蛋白黏合剂（FN）对角膜上皮细胞基质有促进黏附的作用。从而对角膜上皮损伤具有保护作用。以家兔角膜上皮损伤模型进行药理试验。对碘蒸气及正庚醇引起的角膜上皮剥脱，用0.1%以上浓度的本品可使损伤22小时或24h以下的创面显著减小。对正庚醇引起的角膜上皮剥脱，24小时后的创面减小与用量呈剂量依赖性关系，本品0.05%以上浓度，可见创面显著缩小。手术造成的重症角膜上皮剥离（损伤达基底膜者），本品0.1%以上浓度也可使剥离24小时以下的创面明显缩小。对由于维生素A缺乏引起的大鼠角膜上皮损伤，本品0.3%浓度与基质剂相比，荧光素染色分数未见明显差别，但是可见饥饿组的染色分数比正常饲养组增加的期间有显著延长的倾向。对角膜上皮细胞的作用，在家兔角膜的组织培养中加入本品0.5mg/ml以上，可见明显的促进角膜上皮的伸延。在同等浓度的软骨素钠、硫酸角蛋白钠、硫酸类肝素钠中未见这种作用。与具有同样作用的FN及表皮生长因子（EGF）的作用相比，0.5mg/ml的本品作用与0.1mg/ml的FN相似，而比0.5mg/ml的表皮生长因子弱，以EGF10ng/ml，可促进角膜上皮细胞DNA的合成。1ng/ml以上可促进角膜上皮细胞FN受体的活性，但本品未见此种作用。对于基质加纤维蛋白黏合剂培养角膜细胞，本品0.1mg/ml以上时，基质的细胞明显促进附着，而未见其他葡萄糖胺聚糖的促进作用。对角膜上皮细胞的FN基质的黏附影响，根据对FN各碎片的抗体影响研究结果，本品的细胞黏附促进作用是通过FN的N末端纤维蛋白与肝磷脂结合而实现的。皮肤敏感性试验以豚鼠进行最大限度的试验，结果本品完全无皮肤过敏反应。眼刺激性试验以家兔进行连续点眼7d。用裂隙灯观察前房内闪光、荧光素染色，通过光学显微镜及电子显微镜观察，未见眼刺激性。家兔连续4周点眼试验结果，角膜上皮只看到如同正常眼那样的染色斑，前眼部、前房闪光、晶体、眼底都未见异常。而且，家兔26周试验组中，在基质剂组有1例（1/10）巩膜轻度钙沉着，本品0.3%组有1例（1/10）出现两眼轻度的细胞浸润外，未见其他异常。

高分子量玻璃酸钠溶液的高黏弹性及仿形性使它在手术中可作为保护工具和手术工具，广泛用于各种眼科手术、术中可协助器械将组织轻柔的分离、移动和定位。在眼前节手术中，药液注入前房后，前房加深便于手术操作，并可保护角膜内细胞及眼内组织，减少术后并发症，提高手术成功率。

玻璃酸钠为关节滑液的主要成分，是软骨基质的成分之一。在关节腔内起润滑作用，减少组织之间的摩擦，同时发挥弹性作用，缓冲应力对关节软骨的作用，发挥应有的生理功能。关节腔内注入高分子量、高浓度、高黏弹性的玻璃酸钠，能明显改善滑液组织的炎症反应，提高滑液中玻璃酸钠含量，增强关节液的黏稠性和润滑功能，保护关节软骨，促进关节软骨的愈合与再生，缓解疼痛，增加关节活动度。

【药代动力学】以^{14}C标记的本品0.1%滴眼液给家兔单眼滴入后，眼组织中的放射性在滴药眼的结膜、外眼肌、巩膜在0.5小时达峰值后渐减，最高的结膜也在24小时后只成为检出阈值以下。角膜、视网膜、脉络膜中，0.5小时后只能检出放射性，而房水、虹膜睫状体、晶体及玻璃体中则检不出放射性。在对照眼及血浆中也未能检出放射性。以同样浓度的滴眼液按临床用去（6次/天）连续19次点眼后，测定结膜、外眼肌、角膜、房水中都比根据单次点眼的放射性推定值高，提示放射性的蓄积性。

本品注入关节腔内24小时，即进入滑膜、软骨表面和相邻的部分肌肉组织以及肌间空隙，且在滑液、半月板及软骨表面的浓度达到峰值。给药72小时，在关节腔内的残留量约为投药量的10%，此时在血浆的浓度达到峰值，并且在肝、脾以及肾脏中均有分布，在以上脏器中的浓度可高于血浆浓度的2～6倍。给药9天后，可发现极少量的代谢产物从尿

中排出，绝大多数参加呼吸氧化产生二氧化碳而代谢。无论是单次给药还是多次给药，玻璃酸钠在体内的清除速率是相同的。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
阿昔洛韦滴眼液	化学药	HZ000107
复方硫酸新霉素滴眼液（2）	化学药	HZ001280
肝素钠乳膏	化学药	HZ001578
硫酸软骨素滴眼液	化学药	HZ002377
硫酸锌尿囊素滴眼液	化学药	HZ002411
氯化钠滴眼液	化学药	HZ002490
萘扑维滴眼液	化学药	HZ002745
色甘酸钠滴眼液	化学药	HZ003173
透明质酸钠滴眼液	化学药	HZ003481
透明质酸钠注射液	化学药	HZ003482
医用透明质酸钠凝胶	化学药	HZ004446
貂胰防裂软膏	民族药	MZ000093

HY001918　土霉素

【外文名称】Oxytetracycline

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（抗生素药品）·第1册

药物理化信息

【化学名】6－甲基－4－（二甲氨基）－3,5,6,10,12,12*a*－六羟基－1,11－二氧代－1,4,4*a*,5,5*a*,6, 11,12a－八氢－2－并四苯甲酰胺

或5－羟基四环素

【分子式】$C_{22}H_{24}N_2O_9$

【分子量】460.44

【性状及组成】本品为含不定量的水，按无水物计算，每1mg的效价不得少于930土霉素单位。

本品为淡黄色的结晶性或无定形粉末，无臭，在日光下颜色变暗，在碱溶液中易破坏失效。

本品在乙醇中微溶，在水中极微溶解，在稀酸和稀碱中溶解。

比旋度：取本品，精密称定，加盐酸液（0.1mol/L）制成每1ml中含10mg的溶液，1小时后，依法测定，按无水物计算，比旋度为－203°至－216°。

药物药理信息

【药理毒理】本品为四环素类抗生素。本品为广谱抑菌剂，许多立克次体属、支原体属、衣原体属、螺旋体对本品敏感。肠球菌属对其耐药。其他如放线菌属、炭疽杆菌、单核细胞增多性李斯特菌、梭状芽孢杆菌、奴卡菌属、弧菌、布鲁菌属、弯曲杆菌、耶尔森菌等对本品亦较敏感。多年来由于土霉素和四环素类的广泛应用，临床常见病原菌对土霉素素耐药现象严重，包括葡萄球菌等革兰阳性菌及多数革兰阴性杆菌。本品与四环素类抗生素的不同品种之间存在交叉耐药。

本品作用机制为药物能特异性与细菌核糖体30S亚基的A位置结合，抑制肽链的增长和影响细菌蛋白质的合成。

【药代动力学】本品口服后的生物利用度仅30%左右。单剂口服本品1小时后，2小时到达血药峰浓度（C_{max}），为2.5mg/L。本品吸收后广泛分布于肝、肾、肺等组织和体液，易渗入胸水、腹水，不易透过血－脑脊液屏障。本品蛋白结合率约为20%。肾功能正常者血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为9.6小时。本品主要自肾小球滤过排出，给药后96小时内排出给药量的70%，其不吸收部分以原形药随粪便排泄。

本品局部用药后很少吸收入血。

【药物相互作用】

1．与制酸药如碳酸氢钠同用时，由于胃内pH增高，可使本品吸收减少，活性减低，故服用本品后1～3小时内不应服用制酸药。

2．含钙、镁、铁等金属离子的药物，可与本品形成不溶性络合物，使本品吸收减少。

3．与全身麻醉药甲氧氟烷同用时，可增强其肾毒性。

4．与强利尿药如呋塞米等药物同用时可加重肾功能损害。

5．与其他肝毒性药物（如抗肿瘤化疗药物）同用时可加重肝损害。

6．降血脂药考来烯胺或考来替泊可影响本品的吸收，必须间隔数小时分开服用。

7．本品可降低避孕药效果，增加经期外出血的可能。

8．本品可抑制血浆凝血酶原的活性，所以接受抗凝治疗的患者需要调整抗凝药的剂量。

【药物过量】本品无特异性拮抗药，药物过量时应给予催吐、洗胃及大量饮水及补液等对症治疗及支持治疗。

【不良反应】

1．消化系统：胃肠道症状如恶心、呕吐、上腹不适、腹胀、腹泻，偶有胰腺炎、食管炎和食管溃疡的报道，多发生于服药后立即卧床的患者。

2．肝毒性：通常为脂肪肝变性，妊娠期妇女、原有肾功能损害的患者易发生肝毒性，但肝毒性亦

可发生于并无上述情况的患者。

3. 过敏反应：多为斑丘疹和红斑，此外可见荨麻疹、血管神经性水肿、过敏性紫癜、心包炎以及系统性红斑狼疮加重，表皮剥脱性皮炎并不常见。偶有过敏性休克和哮喘发生。某些用四环素的患者日晒时有光敏现象。所以，应建议患者不要直接暴露于阳光或紫外线下，一旦皮肤有红斑则立即停药。

4. 血液系统：偶可引起溶血性贫血、血小板减少、中性粒细胞减少和嗜酸粒细胞减少。

5. 中枢神经系统：偶可致良性颅内压增高，可表现为头痛、呕吐、视神经乳头水肿等。

6. 肾毒性：原有显著肾功能损害的患者可能发生氮质血症加重、高磷酸血症和酸中毒。

7. 二重感染：长期应用本品可发生耐药金黄色葡萄球菌、革兰阴性杆菌和真菌等的消化道、呼吸道和尿路感染，严重者可致败血症。

8. 本品可沉积在牙齿和骨骼中，致牙齿产生不同程度的变色黄染、牙釉质发育不良及龋齿，并可致骨骼发育不良。

9. 应用本品可使人体内正常菌群减少，导致维生素 B 缺乏，真菌繁殖，出现口干、咽痛、口角炎和舌炎等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
土霉素胶囊	化学药	HZ003483
土霉素片	化学药	HZ003484
土霉素软膏	化学药	HZ003485
土霉素眼膏	化学药	HZ003486

HY001919 豚脂

【其他名称】猪油（Lard）

【性状及组成】本品为白色或淡黄色蜡状固体，不溶于水，溶于三氯甲烷和二硫化碳。无异味。

相对密度为 0.915～0.923。

药物药理信息

【药理毒理】本品在药剂中主要用作软膏基质，用于配制油膏、乳膏、搽剂等制剂。本品作为食品添加剂，是食品工业的基本原料，用于制造各种食品。在日化工业中本品作化妆品的原料，用于制造雪花膏、冷霜、香波等化妆品。

【药物相互作用】本品遇氧化剂、酸、碱类易发生氧化水解、皂化反应。

【不良反应】本品为食用油脂，无毒，对皮肤和黏膜无刺激性，是安全的，一日允许摄入量未作限制性规定。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肤螨灵软膏	中成药	ZC001149

HY001920 托吡卡胺

【其他名称】托品酰胺

【外文名称】Tropicamide

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】*N*－乙基－2－苯基－*N*－（4－吡啶甲基）羟丙酰胺

【分子式】$C_{17}H_{20}N_2O_2$

【分子量】284.36

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭。本品在乙醇或三氯甲烷中易溶，在水中微溶，在稀盐酸或稀硫酸中易溶。

熔点：本品的熔点为 96～100℃。

吸收系数：取本品，精密称定，加 0.05mol/L 硫酸溶液溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 25μg 的溶液，照紫外－可见分光光度法，在 254nm 的波长处测定吸光度，吸收系数为 167～177。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：散瞳药。

本品为抗胆碱药，能阻滞乙酰胆碱引起的虹膜括约肌及睫状肌兴奋作用。其 0.5%溶液可引起瞳孔散大；1%溶液可引起睫状肌麻痹及瞳孔散大。

【药代动力学】本品为托品酸的合成衍生物。具有较低的解离常数，眼内通透性良好，组织扩散力强，可能是其起始迅速，维持时间短的原因。本品 0.5%、1%溶液滴眼后 20～30 分钟内散瞳及调节麻痹作用达高峰。随后作用逐渐降低，调节麻痹（残余的）2～6 小时。散瞳（残余的）约 7 小时。

本品的睫状肌调节麻痹作用强度与剂量密切相关，其 0.25%、0.5%、0.75%和 1%四种浓度均有调节麻痹作用。滴眼后，最大残余调节度数分别为 0.25% 3.17 屈光度、1% 1.30 屈光度。残余调节度数能保持在 2.0 屈光度或以下者，0.75%和 1%溶液可维持 40 分钟，0.5%约为 15 分钟。1%溶液 1 滴滴眼后隔 5～25 分钟再滴第二次，能获得更满意的睫状肌麻痹作用约 20～30 分钟。经 2～6 小时能阅读书报，调节功能于 6 小时内恢复至滴药前水平。

【不良反应】本品 0.5%溶液滴眼 1～2 次，每次 1 滴的不良反应罕见，1%溶液可能产生暂时的刺激

症状。因本品为类似阿托品的药物，故可使闭角型青光眼眼压急剧升高，也可能激发未被诊断的闭角型青光眼。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方托吡卡胺滴眼液	化学药	HZ001414
托吡卡胺滴眼液	化学药	HZ003487

HY001921　托吡酯

【外文名称】 Topiramate

药物理化信息

【化学名】 2,3：4,5－双－*O*－（1－甲基亚乙基）－β－D－吡喃果糖氨基磺酸酯

【分子式】 $C_{12}H_{21}NO_8S$

【分子量】 339.36

【性状及组成】 本品为白色晶体粉末，有苦味，极易溶于氢氧化钠或磷酸钠等 pH 为 9～10 的碱性溶液中，易溶于丙酮、三氯甲烷、二甲亚砜和乙醇。在水中的溶解度为 9.8mg/ml，其饱和溶液的 pH 为 6.3。

药物药理信息

【药理毒理】 托吡酯是一个由氨基磺酸酯取代单糖的新型抗癫痫药物。在培养的神经元中进行的电生理和生化研究得出与其抗癫痫作用有关的托吡酯的三个特性。由神经元持续去极化反复激发的动作电位被托吡酯以时间依赖模式阻断：表明托吡酯可阻断状态依赖的钠通道。托吡酯可提高 γ－氨基丁酸（GABA），激活 GABA 受体的频率，从而加强 GABA 诱导氯离子内流的能力：表明托吡酯的抗癫痫特性与苯并二氮䓬明显不同，它可能是调节苯并二氮䓬不敏感的 GABA 受体亚型。托吡酯可拮抗红藻氨酸（kainate）激活兴奋性氨基酸（谷氨酸）的 kainate/AMPA 亚型，但对 *N*－甲基－D－天冬氨酸（NMDA）的 NMDA 受体亚型无明显影响。托吡酯的上述作用在 1～200μmol/L 范围内与浓度相关。1～10μmol/L 为产生最小作用的浓度范围。此外，托吡酯可抑制一些碳酸酐酶同功的作用，这一药理作用比已知的碳酸酐酶抑制剂乙酰唑胺作用弱，并且不是托吡酯抗癫痫作用的主要特性。对小鼠进行的托吡酯与其他抗惊厥药物合用的研究表明：托吡酯与卡马西平或苯巴比妥服用时，显示协同抗惊厥作用，与苯妥英合用时，显示加合抗惊厥作用。在控制较好的合用治疗中，未观察到托吡酯最低血浆浓度与其临床疗效间的相关性。

【药代动力学】 托吡酯可迅速、完全地被吸收。健康受试者口服托吡酯 100mg 后，可在 2 小时达到平均血浆峰值浓度（C_{max}），为 1.5μg/ml。根据在尿中测定放射标记物的回收率，得出口服 100mg ^{14}C－托吡酯的平均吸收程度为 81%。食物对托吡酯的生物利用度无临床上显示的影响。一般来说，有 13%～17% 的托吡酯与血浆蛋白结合。托吡酯在红细胞上的结合位点容量较低。血浆浓度在 4μg/ml 以上时，即可使其饱和，分布容积与剂量成反比。单次给药剂量在 100～1200mg 范围内，其平均表观分布容积为 0.8～0.55μg/kg。

【药物相互作用】 在本项目中，改变不超过 15% 即被定义为无影响。

1．本品对其他抗癫痫药物的作用：托吡酯与其他抗癫痫药物（苯妥英、卡马西平、丙戊酸、苯巴比妥、扑痫酮）加用治疗时，除在极少数病人中发现托吡酯与苯妥英合用时可导致苯妥英血浆浓度增高外，托吡酯对其他药物的稳态血浆浓度无影响。对苯妥英的影响可能是由于对某种酶的多晶型异构体（CYP2Cmeph）的抑制作用导致的。因此，对任何服用苯妥英出现临床上的毒性症状或异常体征的患者均应监测其血浆苯妥英浓度。

一项对癫痫患者进行的药物相互作用药代动力学研究显示，使用拉莫三嗪时，加用日剂量为 100mg 至 400mg 的托吡酯不会增加拉莫三嗪的稳态血浆浓度。停用平均日剂量为 327mg 的拉莫三嗪不会影响托吡酯的稳态血浆浓度。

其他抗癫痫药物对本品的影响：苯妥英和卡马西平可降低托吡酯的血浆浓度。在托吡酯治疗时加用或停用苯妥英或卡马西平时可能需要调整托吡酯的剂量。这应以临床疗效为依据来进行调整。丙戊酸的加用或停用不会产生临床上明显的托吡酯血浆浓度的改变，因此不需调整托吡酯剂量。

2．与其他药物的相互作用

（1）地高辛：一项单剂量临床研究发现因同时服用托吡酯，地高辛血清药时曲线下面积下降 12%。但此观察结果有无临床意义尚不明确。服用地高辛治疗的患者加用或停用托吡酯时都应注意监测地高辛的血清浓度。

（2）口服避孕药：在一项与口服避孕药（1mg 炔诺酮/35μg 炔雌醇复方制剂）的药代动力学相互作用的研究中，只使用托吡酯一种抗癫痫药，且其剂量在 50～200mg/d 时，没有引起两种避孕药成分的血浆 AUC 值发生统计学意义的显著变化。在另外一项研究中发现，当托吡酯与丙戊酸合用，且托吡酯剂量为 200、400 及 800mg/d 时，炔雌醇的血浆 AUC 值显著降低，降低幅度分别为 18%、21% 及 30%。在这两项研究中（托吡酯剂量范围为 50～800mg/d），

托吡酯对炔诺酮的血浆 AUC 值均不产生显著影响。在200～800mg/d 托吡酯剂量范围内，炔雌醇血浆 AUC 值的降低与托吡酯给药剂量有相关性，但在 50～200mg/d 剂量范围内此关系却并不显著。但以上这些变化的临床意义并不显著。托吡酯与口服避孕药合用时，避孕药的疗效可能会降低，从而增加非月经性出血的可能。同时服用含雌激素成分避孕药的患者，应随时向医生报告阴道流血的任何改变特征，即使未发生阴道非正常流血，仍然存在避孕药效力降低的可能性。

（3）氢氯噻嗪：在一项对健康志愿者进行的药物相互作用研究中，评价了单独使用及合用氢氯噻嗪（每日 25mg）与托吡酯（每日 2 次、每次 96mg）的稳态药代动力学特性。研究结果显示，在使用托吡酯时加入氢氯噻嗪，会使托吡酯的 C_{max}升高 27%，AUC 增加 29%。尚不知此变化的临床意义。因此，在使用托吡酯时加入氢氯噻嗪，可能需要调整托吡酯的用药剂量。与托吡酯合用对氢氯噻嗪稳态药代动力学无显著影响。临床检验结果显示，单独使用托吡酯或氢氯噻嗪后，血钾浓度有所降低，其降低程度大于两药物合用造成的血钾降低程度。

（4）中枢神经抑制剂：未进行过本品与乙醇或其他中枢神经抑制剂同服的临床研究，但是建议本品不要与乙醇或其他中枢神经抑制剂同服。

（5）二甲双胍：一项在健康志愿者体内进行的药物相互作用研究显示了单独使用二甲双胍和二甲双胍与托吡酯合用时的两种药物血浆中的稳态药代动力学。研究结果显示，在与托吡酯合用时，二甲双胍 C_{max}和 $AUC_{0\to24}$的平均值分别增加了 18% 和 25%，而 CL/F 平均值下降了 20%，但托吡酯并不影响二甲双胍的 t_{max}。托吡酯对二甲双胍药动学的影响在临床上的意义尚不明确。与二甲双胍合用时，托吡酯的口服血浆清除率有所降低，尚不知改变的程度。二甲双胍对托吡酯药动学的影响在临床上的意义尚不明确。在接受二甲双胍治疗的患者，若增加或停止托吡酯的治疗，应密切注意常规监测以有效地控制其糖尿病病情。

（6）匹格列酮：在一项对健康志愿者进行的药物相互作用研究中，评价了单独使用及合用匹格列酮与托吡酯的稳态药代动力学特性。匹格列酮的 AUC 降低 15%，而 C_{max}未受影响。此发现不具有统计学意义。可注意到，活性羟基代谢产物的 C_{max}和 AUC 分别下降 13% 和 16%，活性酮基代谢产物的 C_{max}和 AUC 均下降 60%。尚不知这些现象的临床意义。当本品与匹格列酮合用时，应注意对患者糖尿病病情的适当控制。

（7）其他药物：与其他易引起肾结石的药物同时使用时，可能会增加肾结石的风险。因此，在使用本品时，应避免使用这类药物，因为这些药物可能产生一种增加肾结石形成风险的生理环境。

【药物过量】

（1）急性过量时，若为刚刚摄入，应立即采取洗胃或诱发呕吐胃排空法。在体外，活性炭不吸附托吡酯，因此过量时不宜用此法，适当应用支持疗法，血液透析是清除体内托吡酯的一种有效方法。然而急性过量时，即使在体内剂量超过 20g 时，亦不需要进行血液透析。

有报道显示，一些患者服用了 6～40g 托吡酯，出现的症状包括：头痛、激越、嗜睡、乏力、代谢性酸中毒和低钾血症，其临床后果并不严重，全部患者均已恢复。一名服用了 96～110g 托吡酯的患者因昏迷 20～24 小时被送入医院，3～4 天后完全恢复。

（2）治疗：应进行全身支持性疗法，并利用洗胃或活性炭将胃肠道中尚未吸收的药物清除。血液透析是清除体内托吡酯的一种有效方法。患者应大量饮水。

【不良反应】根据约 1800 名受试者和患者应用本药的经验，总结出本品在安全性方面的特性。依据标准 WHO－ART 词典对报道的不良反应进行了分类。由于本药通常与其他抗癫痫药合用，因此不可能确定是哪种药物或是哪几种药物与不良反应有关。然而，在快速调整剂量的安慰剂对照试验中：最常见的不良反应主要为中枢神经系统相关的症状，包括共济失调、注意力受损、意识模糊、头晕、疲劳、感觉异常、嗜睡和思维异常。不常见的不良反应包括焦虑、遗忘、食欲减退、眼球震颤、言语表达障碍、味觉倒错、视觉异常和体重减轻。罕见肾石症的报道。有个例血栓栓塞的报道。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
托吡酯胶囊	化学药	HZ003488
托吡酯片	化学药	HZ003489

HY001922 托卡朋

【外文名称】Tolcapone

药物理化信息

【化学名】3,4－二羟基－4′－甲基－5－硝基苯基苯甲酮

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：托卡朋是一种选择性和可逆性的儿茶酚－*O*－甲基转移酶（COMT）抑制剂。COMT 的功能是清除有生物活性的儿茶酚及其他一些羟基

代谢物，在脱羧酶抑制剂存在时，COMT为大脑和外周左旋多巴转化为3－甲基－4－羟基－L－苯丙氨酸（3－OMD）的主要代谢酶。

托卡朋的确切作用机制尚不清楚，但很可能与其抑制COMT并改变左旋多巴的血浆药代动力学特点有关。当托卡朋与左旋多巴和芳香族氨基酸脱羧酶抑制剂（如卡比多巴）联合使用时，血浆左旋多巴水平较单用左旋多巴和芳香族氨基酸脱羧酶抑制剂时的维持时间更长，可能因此导致大脑中更持久的多巴胺能激活，从而对帕金森病患者的体征和症状产生更强的缓解作用，并增加左旋多巴的不良作用，有时需因此降低左旋多巴的用量。托卡朋进入中枢神经系统的量很小，但在动物上已表现出对中枢COMT活性的抑制作用。

2．毒理研究

（1）遗传毒性：在代谢激活条件下，托卡朋的体外小鼠淋巴/胸苷激酶试验具有致染色体畸变作用。在Ames试验、体外V79/HPRT基因突变试验或程序外DNA合成试验上，托卡朋未显示致突变作用。在体外培养的人淋巴细胞或体内小鼠微核试验上未见致染色体畸变作用。

（2）生殖毒性：托卡朋大鼠给药剂量达300mg/（kg·d）（以mg/m^2计，为人用剂量的5.7倍）时，对生育力及一般生殖行为未见影响。

器官形成期怀孕大鼠和家兔托卡朋给药剂量分别为300mg/（kg·d）和400mg/（kg·d）（以mg/m^2计，分别为推荐日临床用量的5.7和15倍）时未见致畸作用。但是，100mg/（kg·d）及以上剂量时，家兔的流产率增加。大鼠300mg/kg及家兔400mg/kg剂量下可见母体毒性（体重增加减少、死亡）。雌性大鼠妊娠末期及哺乳期给予托卡朋250/150mg/（kg·d）（妊娠末期由于母体的高死亡率，剂量由250降至150mg/（kg·d）），出现窝仔数减小、雌性仔鼠生长和学习能力受损。

临床上往往将托卡朋与左旋多巴/卡比多巴联合使用，后者已知可引起家兔内脏及骨骼畸形。怀孕家兔器官形成期联合给予托卡朋［100mg/（kg·d）］与左旋多巴/卡比多巴（80/20mg/（kg·d）］后，与左旋多巴/卡比多巴单独应用比较，胎仔畸形发生率（主要是外部和足指骨骼缺陷）增加。此时托卡朋的暴露量（以AUC计）为人预期的0.5倍，左旋多巴的血浆暴露量高于治疗条件下人的6倍。在大鼠胚胎－胎仔发育研究中，托卡朋［10、30和50mg/（kg·d）］与左旋多巴/卡比多巴［120/30mg/（kg·d）］联合使用及左旋多巴/卡比多巴单独应用，结果胎仔体重降低，此时托卡朋的暴露量为人预期的0.5倍或更高，左旋多巴的暴露量为人预期的21倍或更高。单独给予托卡朋剂量高达50mg/（kg·d）（为人预期血浆暴露量的1.4倍）时未出现胎仔体重降低。

动物研究显示，托卡朋可经雌性大鼠乳汁分泌。尚不知托卡朋是否经人乳分泌。由于许多药物在人乳中分泌，哺乳妇女应慎用。

（3）致癌性：采用掺食法进行了托卡朋大、小鼠的致癌性研究。小鼠给药剂量为100、300、800mg/（kg·d）（相当于推荐日临床用量600mg时暴露量的0.8、1.6和4倍），给药周期为80（雌性）或95（雄性）周。大鼠给药剂量为50、250和450mg/（kg·d）（雄性大鼠托卡朋暴露量为人暴露量的1、6.3和13倍，雌性大鼠的为1.7、11.8和26.4倍），给药周期为104周。在暴露量相当于人的26.4倍时，雌性大鼠子宫腺癌的发生率增加。有证据显示大鼠出现了肾小管损伤和肾小管肿瘤形成。中、高剂量组雌性大鼠肾小管细胞腺瘤的发生率低，中、高剂量组雄性和高剂量组雌性大鼠出现了肾小管细胞癌，其中高剂量组雄性大鼠出现具有统计学意义的增加。暴露量为人暴露量的1（雄性）或1.7（雌性）倍时，未见有肾肿瘤。

【药代动力学】托卡朋的药代动力学在50mg至400mg剂量范围内呈线性，这不依赖于左旋多巴/卡比多巴联合给药。托卡朋的清除半衰期是2～3小时，且无明显药物蓄积。在100mg或200mg一日三次的剂量时，C_{max}分别约为3μg/ml和6μg/ml。

1．吸收：托卡朋吸收迅速，其t_{max}约为2小时。口服后，绝对生物利用度约65%。在给予托卡朋之前1小时或之后2小时内进食可降低相对生物利用度10%至20%。

2．分布：托卡朋的稳态分布容积很小（9L），因其高血浆蛋白结合率而不广泛分布人组织。在0.32至210μg/ml的浓度范围内，其血浆蛋白结合率>99.9%。体外试验已经显示托卡朋主要与血清白蛋白结合。

3．代谢和清除：托卡朋在排泄之前几乎完全被代谢，在尿中仅发现很小量（占使用剂量的0.5%）的原形。托卡朋的主要代谢途径是葡萄糖醛酸化；与葡萄糖醛酸轭合而失活。此外，这种化合物被儿茶酚－氧位－甲基转移酶（COMT）甲基化成为3－氧－甲基－托卡朋，托卡朋被代谢成为一种初级醇（甲基羟化），随后再被氧化成羟酸，体外试验提示可能被细胞色素P450 3A4和P4502S6所催化。仅在很小的程度上降解成胺及随后发生*N*－乙酰化作用。口服^{14}C标记的托卡朋后，60%的标记物随尿排出，40%随粪便排出。托卡朋是一种低排泄率的药物（排泄率＝0.15%），它具有中等度的系统清除率，约7L/h。

4. 特殊人群：托卡朋的药代动力学在不同性别、年龄、体重和种族中无明显差异。

5. 肾损害：尚未特别在肾脏损害患者中进行托卡朋的药代动力学研究，然而，在临床试验期间，已用群体药代动力学方法调查了肾功能与托卡朋药代动力学的关系。400 多例患者的资料已经肯定在很宽的肌酐清除率范围内（30ml/min 至 130ml/min），托卡朋的药代动力学不受肾脏功能的影响。这一点可由下列事实加以解释，即仅有可忽略不计的未经变化的托卡朋（0.5%）随尿排出。托卡朋的葡萄糖醛酸轭合物主要随尿排出，但也随胆汁排出，这种稳定的、无活性的代谢产物的积累，对于肌酐清除率在 25ml/min 以上肾损害患者，不会构成威胁。由于托卡朋有很高的蛋白结合率，血液透析不会明显清除托卡朋。

据文献报道在健康老年志愿者中进行托卡朋的药代动力学及药效学的研究结果表明，每次口服托卡朋 200mg，每天 3 次，C_{max}为 6 ~ 7mg·L^{-1}，AUC 约为 24 ~ 27mg·L^{-1}·h^{-1}；其药代动力学呈线性相关，且吸收和清除都很快，终末半衰期的为 2 小时。

【药物相互作用】

1. 蛋白结合率：虽然托卡朋的蛋白结合率很高，但体外研究已证明，治疗浓度的托卡朋（50μg/ml）并不从其他蛋白结合力较高的药物的结合位点上置换。已做过实验的药物包括：华法林（苄丙酮香豆素 0.5 ~ 7.2μg/ml），苯妥英（4.0 ~ 38.7μg/ml），甲苯磺丁脲（甲糖宁 24.5 ~ 96.1μg/ml）和地高辛（9.0 ~ 27.0μg/ml）。

2. 由 COMT 代谢的药物：托卡朋可以影响由 COMT 代谢的药物的药代动力学。然而 COMT 底物卡比多巴的药代动力学却未见受影响。托卡朋对此类型的其他药物的作用仍未评估，例如 α - 甲基多巴酚丁胺、阿扑吗啡和异丙肾上腺素。应考虑在与托卡朋合用时，减低这些药物的剂量。

3. 托卡朋对其他药物代谢的影响：体外试验已经评价了托卡朋与细胞色素 P450（CYP）的异构酶相互作用的可能性。体外试验未见托卡朋与 CYP2A6（华法林 coumadin）CYT 1A2（咖啡因），CYP 3A4（咪达唑仑 midazolam 特非那定 terhenadine 环孢素 cyclosprine），CYP2C19（S - mephengtoin）和 CYP2D6（去甲丙米嗪 desipramine）的底物之间的相互作用。托卡朋与脱甲丙咪嗪（一种由细胞色素 P4502D6 代谢的药物），并无相互作用，这也证实了在体实验的结果，即托卡朋不改变脱甲丙咪嗪的药代动力学。由于托卡朋与细胞色素 P450 2C9 在体外的亲和力，它可能会干拢那些清除需依赖于代谢途径的药物，例如，甲糖宁和华法林，然而，体内相互作用研究证实托卡朋不改变甲糖宁的药代动力学。因而托卡朋与细胞色素 P4502C9 之间似乎不可能有相互作用，同样托卡朋不影响去甲丙咪嗪的药代动力学，一种由细胞色素 P450 2D6 代谢的药物，提示托卡朋与依靠 P450 2D6 代谢的药物之间不可能有相互作用。鉴于华法林与托卡朋合用的临床资料有限，当两药合用时应监测凝血参数。

4. 可增加儿茶酚的药物：无论在休息或运动期间，托卡朋不影响麻黄碱（一种直接的拟交感神经药）的作用，不改变其血液动力学参数或血浆儿茶酚水平，鉴于托卡朋不改变麻黄碱的耐受性，两药可合用。

当托卡朋与左旋多巴、卡比多巴和去甲丙咪嗪合用时，其血压、脉率和去甲丙咪嗪的血浆浓度无明显改变。不良反应的发生频率稍有增加。根据这三种药物各自的不良反应，可以预见它们总的不良反应。因此，去甲丙咪嗪用于正接受托卡朋和左旋多巴/卡比多巴的帕金森氏病者时应谨慎。

在临床试验中，正在接受托卡朋/左旋多巴制剂的患者，无论其是否合用司来吉兰（selegiline，一种选择性的 MAO 抑制剂），也报告了相似的不良反应的概况。

【药物过量】一旦出现过量，患者可出现恶心、呕吐和头晕等多种表现，目前尚未发现托卡朋的特效拮抗剂。针对其过量应按照药物过量的常规处理原则进行对症、支持治疗。血液透析可能无效。

【不良反应】国外临床研究资料显示：

1. 上市后发生的与托卡朋相关的严重不良事件。在上市后的应用中已报告有肝细胞损伤，包括暴发性肝功能衰竭而导致死亡的病例。在 1998 年 10 月在近 60,000 名服用托卡朋的病例中有 3 例发生了致命性暴发性肝功能衰竭，在世界范围内每年大约有 40,000 名患者服用托卡朋。其发病率高于普通人群约 10 ~ 100 倍。服用托卡朋而增加肝功能损伤的问题不可忽视。

2. 上市前的临床研究中发现的不良事件。（以下所列不良事件与服用托卡朋是否有因果关系尚不明确。）

在随机双盲与安慰剂对照的临床研究中发现的不良事件如下：发生率 > 5% 的不良事件为，运动障碍、恶心、睡眠紊乱、肌张力障碍、多梦、畏食、肌肉痛性痉挛、直立性不适、嗜睡、腹泻、精神错乱、眩晕、头痛、幻觉、呕吐、便秘、疲劳、上呼吸道感染、虚脱、多汗、尿道感染、口干、腹痛、尿变色。

（常见事件的发生率为大于 1/100；偶见事件的发生率为 1/100 至 1/1000；罕见事件的发生率为小于 1/1000）。

神经系统：常见，抑郁、焦虑、嗜睡、感觉减退、震颤、语言障碍、眩晕、情绪不稳；偶见，神经痛、记忆缺失（遗忘症）、锥体外系症状、敌意、性欲增加、躁狂反应、神经过敏、类偏执妄想反应、脑缺血、脑血管意外、妄想、性欲减退、神经病、情感淡漠、舞蹈病、手足徐动症、肌阵挛、精神病、思维异常、抽搐；罕见，人格变态、谵妄、脑病、偏瘫、脑膜炎。

消化系统：常见，牙齿疾病；偶见，吞咽困难、胃肠道出血、胃肠炎、口腔溃疡、流涎增多、大便异常、食管炎、胆石病、结肠炎、舌疾、直肠疾病；罕见，胆囊炎、十二指肠溃疡、胃肠道肿瘤，胃张力缺乏。

全身性疾病：常见，胁部疼痛、意外损伤、腹痛、感染、虚弱、体重减轻；偶见，疝、疼痛、过敏反应、蜂窝织炎、真菌感染、病毒感染、癌症、寒战、细菌感染、赘生物、脓肿、面部水肿、罕见：死亡。

心血管系统：常见，心悸；偶见，高血压、血管扩张、心绞痛、心衰、心房纤颤、心动过速、偏头痛、主动脉狭窄、心律失常、动脉痉挛、心动过缓、脑出血、冠脉疾病、心脏骤停、心肌梗死、心肌缺血、肺栓塞；偶见，动脉硬化、心血管疾病、心包积液、血栓形成。

肌肉骨骼系统：常见，肌痛、关节痛、肢体痛、骨折；偶见，腱鞘炎、关节炎、关节疾病。

泌尿生殖系统：常见，尿淋漓、阳痿；偶见，前列腺疾病、排尿困难、夜尿症、尿频、尿潴留、子宫弛缓、子宫疾病、阴道炎；罕见，膀胱结石、卵巢癌、子宫出血。

呼吸系统：常见，支气管炎、咽炎、肺炎；偶见，咳嗽增多、鼻炎、哮喘、鼻出血、呼吸性碱中毒、喉炎、呃逆；罕见，窒息、缺氧、肺水肿。

皮肤及附属物：常见，皮疹；偶见，带状疱疹、瘙痒、脂溢性皮炎、皮肤褪色、湿疹、多形红斑、皮肤病、疖病、单纯疱疹、荨麻疹。

特殊感觉：常见，耳鸣、蓝视症、窦炎；偶见，复视、耳痛、眼出血、眼痛、流泪失常、中耳炎、嗅觉倒错；罕见，青光眼。

代谢和营养：常见，水肿、高胆固醇血症、口渴、脱水。

血液和淋巴系统：常见，贫血；罕见，白血病、血小板减少。

内分泌系统：偶见，糖尿病。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
托卡朋片	化学药	HZ0003490

HY001923　托拉塞米

【其他名称】Demadex、Toradiur、Torem、Torrem、拓赛、Unat

【外文名称】Torasemide

药物药理信息

【药理毒理】为高效髓袢利尿药，作用于髓袢升支粗段，抑制髓质部及皮质部对 Cl^- 的重吸收引起利尿，与其他利尿药相比，托拉塞米有以下特点：

1．利尿作用强：作用强度至少为呋塞米的 2 倍。

2．抗高血压作用强：降压作用比氢氯噻嗪强 5～10 倍，在利尿阈剂量下即可产生抗高血压作用。

3．作用持续时间长：本品只需日服一次。

4．口服生物利用度高，可达 76%～92%，约为呋塞米的 2 倍。

5．耐受性好、毒性及不良反应发生率低，排钾作用弱，长期使用不致低钾血症，无耳毒性作用。

托拉塞米通过阻止髓袢升支粗段对 Cl^-、Na^+ 的主动重吸收而发挥利尿及排钠作用，排尿量、排 Na^+ 及 Cl^- 量与药物剂量线性相关。

健康人静注本品 10～20mg，其利尿作用与呋塞米 40mg 相似。

【药代动力学】本品半衰期与剂量呈依赖性关系，大剂量可产生较长时间利尿作用，其肾排泄量也与剂量有关。

【药物相互作用】

1．原发性高血压患者可将本品与 β－受体阻断剂、ACE 抑制剂及钙通道阻断剂合用。充血性心衰患者将本品可与洋地黄毒苷、ACE 抑制剂和硝酸酯盐类合用，均未发现新的或预料之外的不良反应。

2．本品对格列苯脲、华法林与血浆蛋白的结合率无影响，对苯丙香豆素（相关的香豆素衍生物）的抗凝血作用无影响，对卡维地洛（血管扩张剂，β－受体阻滞剂）的药动学无影响。健康志愿者将本品与螺内酯合用，后者的肾清除率下降，AUC 值增加，但临床经验表明无需调整两药的剂量。

3．由于水杨酸类药物与本品竞争肾小管分泌，所以在与本品合用后，水杨酸高剂量组可观察到水杨酸毒性。尽管未对本品与非甾体抗炎药相互作用进行研究，但上述药物与呋塞米合用后偶尔可导致肾功能障碍。

4．与许多利尿剂一样，吲哚美辛会部分地抑制本品的促尿钠排泄作用。在限制钠摄取（50mEq/天）的患者中可观察到上述现象，但在钠摄正常（150mEq/天）的患者中未观察到此现象。

5. 西米替丁和螺内酯对本品的药动学及利尿作用均无影响。同时服用地高辛使本品的 AUC 值增加 50%，但勿需调整本品的剂量。

6. 未对合用本品和考来烯胺的人体药物相互作用进行过研究，但在动物试验中，考来烯胺使口服本品的吸收率下降，不推荐两药合用。

7. 同时服用丙磺舒使本品分泌到近曲小管的量减少，使本品的利尿作用下降。

8. 已知其他利尿剂可降低锂的肾清除率，使发生锂毒性的风险增加，所以两类药物合用必须慎重。未对本品与锂合用后的药物相互作用进行过研究。

9. 其他利尿剂可增加氨基糖苷类抗生素和依他尼酸的潜在耳毒性，尤其是肾功能损伤患者情况更为严重，未对本品与上述药物的相互作用进行过研究。

【药物过量】目前尚没有过量服用本品的报道，但若过量服用本品，预计症状主要有：脱水、血容量不足、低血压、低钠血症、低钾血症、低氯血性碱中毒、血液浓缩。过量服用本品后应采用补液和补充电解质。实验室测定本品及其代谢物的血清浓度的方法尚未广泛获得应用。没有数据表明一些生理的手段如调整尿液的 pH 可促进本品及其代谢物的消除。血液透析无法清除本品。

【不良反应】托拉塞米耐受性好，不良反应发生率低，且均为一过性反应，不需停药，主要不良反应为：头痛、头晕、恶心、胃肠道不适等。无呋塞米常见的耳毒性作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
托拉塞米胶囊	化学药	HZ003491
托拉塞米片	化学药	HZ003492
托拉塞米注射液	化学药	HZ003493
注射用托拉塞米	化学药	HZ004997

HY001924 托利洛尔

【其他名称】Betasantin、Doberol、甲苯心安、Toliprololum

【外文名称】Toliprolol

药物药理信息

【药理毒理】本品 β 受体阻断作用和普萘洛尔相同，无内在活性，有膜稳定作用。用于心绞痛和心律失常。

【不良反应】可见乏力、嗜睡、头晕、失眠、恶心、腹胀、皮疹、晕厥、低血压、心动过缓等。

HY001925 托洛尼定

【外文名称】Tolonidine

药物药理信息

【药理毒理】本品的降压作用、作用机制、应用及不良反应均与可乐定相似。

HY001926 托洛沙酮

【外文名称】Toloxatone

药物药理信息

【药理毒理】本品为具有新型结构的抗抑郁药，其作用机制为选择性地抑制 MAO－A 活性，从而阻止 5－HT 和 NA 的代谢，产生抗抑郁作用。其对 MAO－A 的选择性抑制作用是可逆的。适用于治疗神经官能性抑郁症、神经质和非神经质性抑郁、退化性抑郁症、躁狂抑郁性精神病人的抑郁症发作。亦可用于精神病的抑郁或痴呆期。

【药代动力学】口服后吸收迅速，经 30～60 分钟达峰浓度。体内代谢快，最后自尿中排出，以代谢产物为主，原形仅有 5%～10%。

【药物相互作用】禁止与其他 MAOI 合用。

【不良反应】偶见消化不良、恶心、呕吐、头痛、头晕等，精神病患者可出现谵妄。

HY001927 托萘酯

【其他名称】发癣退、杀癣灵

【外文名称】Tolnaftate

药物药理信息

【药理毒理】局部抗真菌药。用于浅表皮肤真菌感染，包括体癣、股癣、手足癣、药斑癣，但对毛发部及指甲的真菌感染无效。

HY001928 托瑞米芬

【其他名称】Fareston、法乐通

【外文名称】Toremifene

药物药理信息

【药理毒理】托瑞米芬的抗肿瘤作用主要是抗雌激素效应，还有其他抗肿瘤机制，包括改变肿瘤基因表达、分泌生长因子、诱导细胞凋亡及影响细胞动力学周期。

【不良反应】一般为轻微，多为激素样反应。常见有面部潮红、多汗、恶心、白带增多、头晕、水肿、疼痛和呕吐。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
托瑞米芬片	化学药	HZ003495

HY001929　托西酸舒他西林

【其他名称】甲苯磺酸舒他西林

【外文名称】Sultamicillin Tosilate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（+）羟甲基 -（2*S*，5*R*，6*R*）-6-［（*R*）-（2-氨基-2-苯乙酰氨基］-3，3-二甲基-7-氧代-4-硫杂-1-氮杂双环［3.2.0］正庚烷-2-羧酸酯，（2*S*，5*R*）-3，3-二甲基-7-氧代-4-硫杂-1-氮杂双环［3.2.0］正庚烷-2-羧酸酯 *S*，*S*-二氧化物对甲苯磺酸盐

【分子式】$C_{25}H_{30}N_4O_9S2\cdot C_7H_8O_3S$

【分子量】766.80

【性状及组成】本品为类白色或微黄色的结晶性粉末，微臭，味苦。

本品在甲醇中易溶，在乙醇中微溶，在水中极微溶解，在乙醚中几乎不溶。

比旋度：取本品适量，精密称定，加乙腈-水（2：3）溶解并定量稀释成每 1ml 中含 10mg 的溶液，依法测定比旋度为 +173°至 +187°。

药物药理信息

【药理毒理】本品口服后，经肠内酯酶水解成舒巴坦及氨苄西林。舒巴坦和氨苄西林同时存在时，不仅保护氨苄西林免受 β-内酰胺酶的水解破坏，而且还扩大了氨苄西林的抗菌谱，对葡萄球菌产酶株、不动杆菌属和脆弱拟杆菌等细菌也具有良好的抗菌活性。本品对包括产霉菌株在内的葡萄球菌、链球菌属、肺炎球菌、肠球菌属、流感嗜血杆菌、卡他莫拉菌、大肠埃希菌、克雷伯菌属、奇异变形杆菌、普通变形杆菌、淋病奈瑟菌、梭杆菌属、消化球菌属、消化链球菌属及包括脆弱拟杆菌在内的拟杆菌属均具抗菌活性。

氨苄西林为青霉素类抗生素，作用于细胞活性繁殖阶段，通过对细胞壁黏肽生物合成的抑制，而起杀菌作用。舒巴坦本身抑菌作用较弱，是一种竞争性、不可逆的 β-内酰胺酶抑制药，与 β-内酰胺类抗生素联合应用后，能获得良好的协同作用。

【药代动力学】本品口服后，在肠壁经肠内酯酶水解成舒巴坦及氨苄西林，克分子比为 1:1。生物利用度相当于等量的舒巴坦、氨苄西林静脉注射剂的 80%，饭后服用不影响其吸收。服用本品后，氨苄西林的血药峰浓度约相当于口服等量氨苄西林的 2 倍。舒巴坦、氨苄西林在正常人的血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）分别约为 0.75 小时和 1 小时；蛋白结合率分别约为 38% 和 28%；两者在组织体液中分布良好，均可通过有炎症的脑脊髓膜。氨苄西林、舒巴坦有 50%～75% 以原形经尿液排泄。

【药物相互作用】

1. 丙磺舒、阿司匹林、吲哚美辛、保泰松、磺胺药可减少本品在肾小管的排泄，因而使本品的血药浓度升高，血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）延长，毒性也可能增加。

2. 本品与别嘌醇合用时，皮疹发生率显著增高，故应避免合用。

3. 本品不宜与双硫仑等乙醛脱氢酶抑制药合用。

4. 本品与氯霉素合用于细菌性脑膜炎时，远期后遗症的发生率较两者单用时高。

5. 本品可刺激雌激素代谢或减少其肠肝循环，因此可降低口服避孕药的效果。

6. 氯霉素、红霉素、四环素类等抗生素和磺胺药等抑菌药可干扰本品的杀菌活性，因此不宜与本品合用，尤其在治疗脑膜炎或急需杀菌药的严重感染时。

7. 本品可加强华法林的作用。

【不良反应】

1. 过敏反应：斑丘疹、荨麻疹、皮肤瘙痒、偶可发生剥脱性皮炎及严重过敏反应（过敏性休克）等。

2. 消化道反应：腹泻、稀便、恶心、腹痛、痉挛、上腹痛及呕吐等。

3. 思睡、镇静、疲劳、不适及头痛等。

4. 贫血、血小板减少、嗜酸粒细胞增多等血液系统异常。

5. 肝功能异常：如血清氨基转移酶和血清胆红素增高。

6. 偶见间质性肾炎。

7. 二重感染：长期或大量应用本品可致耐青霉素金黄色葡萄球菌、革兰阴性杆菌或白色念珠菌感染。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
托西酸舒他西林分散片	化学药	HZ003496
托西酸舒他西林胶囊	化学药	HZ003497
托西酸舒他西林颗粒	化学药	HZ003498
托西酸舒他西林片	化学药	HZ003499

HY001930 托西溴苄铵

【外文名称】Bretylium Tosilate

药物药理信息

【药理毒理】本品被肾上腺素能神经末梢摄取，促进去甲肾上腺素排出，表现短暂的拟交感作用，然后阻滞去甲肾上腺素释放，呈持久的抗交感作用。对心肌细胞的直接作用是抑制 K^+ 通道，阻止动作电位复极，延长希浦系统和心室的不应期和动作电位时程，明显增强心肌收缩力和消除传导阻滞。

【药代动力学】口服吸收虽快但不完全，也不规则。肌注及静注后 20～120 分钟起效。作用维持 6～9 小时。约 90% 以原形经肾排出，$t_{1/2}$约 9.8 小时（4～17 小时）。血液透析可清除本品。

【药物相互作用】

1. 本品加重强心苷类药物引起的心律失常。

2. 并用Ⅰ类抗心律失常药（奎尼丁或普鲁卡因胺）有相互拮抗作用。

3. 三环类抗抑郁药可对抗本品的扩血管作用和低血压。

4. 合用肾上腺素，去甲肾上腺素及多巴胺可使血压明显升高。

【不良反应】静注初期发生短暂的血压升高和心率加速。50%～75% 发生低血压。快速静注可出现恶心和呕吐。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
托西溴苄铵注射液	化学药	HZ003500

HY001931 脱氧氟尿苷

【其他名称】5－氟尿嘧啶脱氧核苷、氟苷、氟尿嘧啶脱氧核苷、氟尿脱氧核苷

【外文名称】Doxifluridine

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 16 册

药物理化信息

【化学名】5－氟脲嘧啶－2,－脱氧核苷

【分子式】$C_9H_{11}FN_2O_5$

【分子量】246.19

【性状及组成】本品为白色结晶粉末、无嗅。易溶于二甲基甲酰胺，较易溶于水或甲醇，较难溶于乙醇，极难溶于乙醚。

药物药理信息

【药理毒理】本品为氟嘧啶类抗癌药，是氟尿嘧啶（5－Fu）的前体药物。其在人体肿瘤组织中的腺苷磷酸化酶作用下转化成 5－Fu，故能选择性地获得比正常组织内浓度高的 5－Fu。5－Fu 可有效地抑制 DNA 合成和 RNA 的功能，从而发挥抗肿瘤作用。本品对骨髓功能、细胞免疫及体液免疫的影响比其他氟嘧啶衍生物弱，免疫抑制作用也较小。

本品对小白鼠瘤源 HAC 腹水小鼠处死后癌细胞计数（1mg/只 × 3 天），癌细胞平均值 1.66×10^{-8}，抑瘤率 59%；10mg/只 × 3 天，癌细胞平均值 0.49×10^{-8}，抑癌率 99%。对动物瘤株 S180、Lewis 瘤剂量分别以 60 和 50mg/kg，腹腔给药 7 次和 10 次，瘤块抑制率达 76% 和 85%。

本品小鼠尾静脉注入 50mg/次，没有任何不良反应，腹腔注射 LD_{50}为 650mg/kg。其毒性是 5－氟尿嘧啶的 1/6～1/5 倍，疗效却大 2～3 倍。

本品对鸡胚胎、小鼠（2.5～100mg/kg）和大鼠（75～150mg/kg）有致畸作用，包括腭裂、骨骼缺损、异常附属物、爪和尾。对动物致畸的剂量是推荐人用剂量的 4.2～125 倍。

【药代动力学】本品口服后吸收迅速，1～2 小时达血药浓度峰值，5－Fu 在肿瘤组织中的浓度高于血中。口服后 12h 内可于尿中检出原药，5－Fu 及低代谢物脱氧－D－核糖醇。

本品在肝脏内代谢，以原形和氟尿嘧啶、α－氟－β－脲基丙酸、双氢氟脲嘧啶、α－氟－β－胍基丙酸及 α－氟－β－丙氨酸的形式由尿排泄，也以 CO_2 呼出。

【药物相互作用】据报道，在一些病例中，因合并使用抗病毒剂 sorivudine 及氟尿嘧啶系药物而显示出严重的造血障碍致死，故不得合并使用。

抗病毒剂 sorvudine 与氟尿嘧啶系药物（FT207、脱氧氟尿苷、5－Fu）合并使用，氟尿嘧啶系药物的代谢会受阻碍而引起严重的造血障碍，故给药时应确认尚未使用 sorivudine。

【药物过量】本品药物过量没有专门的解毒方法，但须血液监控四周以上。如出现异常，需进行对症治疗。

【不良反应】本品会引起骨髓功能严重抑制，须频繁进行临床检查（血液检查，肝功能、肾功能检查等），充分观察病人的状态。发现异常时，适当地减量或停药。充分注意感染症状、出血倾向的出现及恶化。向小儿给药时，须特别注意副作用，慎用。向小儿及育龄病人给药时，须考虑到对性腺的影响。对以下病人慎重给药：骨髓功能抑制的病人，肝、肾功能障碍的病人，并发感染症的病人，心疾患或既往史的病人，水痘病人（有可能导致致命性的全身障碍）。一般高龄者的生理功能低下，应慎用。据

动物实验（大鼠）报道有致畸作用，妊娠妇女或有妊娠可能的妇女不宜使用本品。据动物实验（大鼠）报道药物会进入乳汁，哺乳妇女用药时，应停止哺乳。对早产儿、新生儿、乳婴或小儿的安全性尚未确定（无使用经验）。据报道静脉注射时，可引起胸痛、心电图异常（ST段上升、T波倒置等）。给狗大量（10mg/kg以上）口服脱氧氟尿苷时，脑实质内出现多孔性变化，脑、脊髓出现小出血灶。

发现以下情况，应采取减量、停药等合宜的措施。白细胞减少，或有时出现血小板减少、贫血，或偶有全血细胞减少。有时有AST、ALT、ALP、BIL等的上升。有时有血尿、尿白尿、BUN上升等。腹泻、恶心、食欲减退，或有时腹痛、口腔炎、腹部不适、胃痛、腹胀、麻痹性肠梗阻、口渴、口角炎、心前区痛、便秘、肠胀气，偶有胃溃疡、舌炎等症状。有时有定向障碍、听觉障碍，或偶有健忘、步行障碍、感觉障碍、锥体外系症状、麻痹、尿失禁等类似于脑白质炎的征候。时有倦怠感、摇晃、味觉减弱，偶有嗅觉异常等。有时有色素沉积、瘙痒症、毛发脱。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
脱氧氟尿苷胶囊	化学药	HZ003501
注射用氟脎苷	化学药	HZ004753

HY001932　脱氧核苷酸钠

【外文名称】Sodium Deoxyribonucleotide

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第9册

【性状及组成】本品系由鱼精蛋白或小牛胸腺中提取的脱氧核糖核酸经酶解制成。按干燥品计算，含脱氧核苷酸钠（含脱氧核糖胞嘧啶核苷酸钠、脱氧核糖腺嘌呤核苷酸钠、脱氧核糖胸腺嘧啶核苷酸钠及脱氧核糖鸟嘌呤核苷酸钠）的总量不得少于70.0%。

本品为浅黄色或黄色的片状或粉末状物，引湿性强。

药物药理信息

【药理毒理】本品为免疫调节药，是一种具有遗传特性的化学物质，与蛋白质相结合成核蛋白，为生物体的基本物质。它在个体的生长、繁殖、遗传、变异等生理生化功能方面起着重要作用，通过核糖核酸（RNA）控制蛋白质的合成，尤其对某些关键性酶蛋白的合成，起协调体内的一系列代谢作用。因此有促进细胞生长，增强细胞活力的功能，促进造血功能、升高白细胞，以及改变机体代谢的作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
脱氧核苷酸钠片	化学药	HZ003502
脱氧核苷酸钠注射液	化学药	HZ003503
注射用脱氧核苷酸钠	化学药	HZ004998

HY001933　脱氧核糖核酸酶

【其他名称】阿法脱氧核糖核酸酶、DNA酶、链脱酶、Panceratic Dornase、Streptodornase、胰去氧核糖核酸酶

【外文名称】Deoxyribonuclease

【性状及组成】本品是从哺乳动物胰腺或溶血性链球菌培养基中分离提取的酶制品，它含有260个氨基酸，在排列顺序上与天然人的DNA酶完全一样。

药物药理信息

【药理毒理】本品直接作用于脓性痰，选择性切开细胞外的脱氧核糖核酸，迅速降低痰液黏度，使分泌物黏性降低并易于咳出。其次由于脓痰中脱氧核糖核酸与蛋白结合，使白细胞中的蛋白溶解酶不能发挥作用，减少了蛋白的自然溶解，而在本药溶解脱氧核糖核酸后。痰中蛋白失去保护，易被白细胞中的蛋白溶解酶分解。产生继发的蛋白溶解作用，这在黏痰的溶解中也起很大作用。本药不仅可使脓痰的黏度下降，而且与抗生素合用时，可使抗生素易于到达感染灶，能充分发挥作用。

本品不能穿透正常的细胞膜，因此它不损伤在活细胞内的DNA。

本品是采用雾化器和压缩器系统给药，适用于与常规治疗方法结合在一起治疗肺囊性纤维化。

【不良反应】本品在临床研究中，显示具有良好的耐受性，不良反应不比安慰剂多。接受本品一日1次的病人，最常见的不良反应为咽痛，声嘶，喉炎，胸痛，皮疹和结膜炎。大多数不良反应是轻微的，短暂的不需要调整剂量。

HY001934　脱脂棉

【外文名称】Gossypium Absorbens

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第1册

【性状及组成】本品为锦葵科草棉属植物成熟种子的毛茸，经除去夹杂物，脱脂漂白加工而成。

本品为柔软而富有弹性的白色纤维，无色斑，污点及异物；无臭，无味。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：医用敷料。

HY001935 脱脂纱布

【外文名称】Carbasus Absorbens

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第1册

【性状及组成】本品系用纯棉纱织成的平纹原布，经脱脂、漂白、精制而成的纱布，其中不得含有其他纤维和加工物质。

本品为白色柔软的细纱布；无臭，无味。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：医用敷料。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
愈伤膏	中成药	20007116

HY001936 妥布霉素

【外文名称】Tobramycin

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】*O*－3－氨基－3－脱氧－α－*O*－葡吡喃糖基－（1→6）－*O*－［2，6－二氨基－2，3，6－三脱氧－α－D－核－己吡喃糖基－（1→4）］－2－脱氧－D－链霉胺

【分子式】$C_{18}H_{37}N_5O_9$

【分子量】467.52

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末，有引湿性。

本品在水中易溶，在乙醇中极微溶解，在三氯甲烷或乙醚中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并稀释成每1ml中含40mg的溶液，依法测定，比旋度为+138°至+148°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：氨基糖苷类抗生素。

本品属氨基糖苷类抗生素。抗菌谱与庆大霉素近似，对大肠埃希菌、产气杆菌、克雷伯杆菌、奇异变形杆菌、某些吲哚阳性变形杆菌、铜绿假单胞菌、某些奈瑟菌、某些无色素沙雷杆菌和志贺菌等革兰阴性菌有抗菌作用；本品对铜绿假单胞菌的抗菌作用较庆大霉素强3～5倍，对庆大霉素中度敏感的铜绿假单胞菌对本品高度敏感。革兰阳性菌中，金黄色葡萄球菌（包括产β内酰胺酶株）对本品敏感；链球菌（包括化脓性链球菌、肺炎球菌、粪链球菌等）均对本品耐药。厌氧菌（拟杆菌属）、结核杆菌、立克次体、病毒和真菌亦对本品耐药。

大肠杆菌、绿脓杆菌及金黄色葡萄球菌对本品的敏感率达80%～90%；本品对流感杆菌、肺炎杆菌、产气杆菌、变异变形杆菌、吲哚阳性变形杆菌、沙雷菌、痢疾杆菌、产碱杆菌等，也均具良好的抗菌作用。

本品的作用机制是与细菌核糖体30S亚单位结合，抑制细菌蛋白质的合成。

【药代动力学】妥布霉素口服不吸收，一次肌注后30～90分钟可达血药峰浓度，有效血液浓度约持续6～8小时，一次肌注本品1mg/kg和1.5mg/kg，血药峰浓度分别可达4μg/ml和4～8μg/ml。一次静注本品1.5mg/kg后，血药浓度即由9.2μg/ml上升到29.8μg/ml，15分钟后下降至11μg/ml以下。本品在体内主要经肾小球滤过排泄，肾功能正常的病人可在8小时内从尿中排出给药量的84%以上，24小时可排出给药量的93%以上；肾功能障碍的病人血药浓度高，持续时间长。多次给药后在肾皮质内积聚，积聚量可为血药浓度的10～50倍。正常人肌注本品后，血半衰期为（2.1±0.1）小时，快速静注后血半衰期为（1.4±0.1）小时。本品血清蛋白结合率为0%～25%。本品在胆汁和脑脊液中浓度低。

本品滴眼后有少量被吸收进入全身血液循环。

【药物相互作用】本品不宜与β－内酰胺类药物同瓶静滴，以免影响本品的抗菌活性。

【不良反应】不良反应主要是对第八对脑神经及肾脏有毒性，可有听力减退、头昏、眩晕、耳鸣等，以及蛋白尿、管型尿、血尿素氮和血肌酐升高等肾损伤症状。

滴眼偶见局部刺激症状，如：眼睑灼痛或肿胀、结膜红斑等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方妥布霉素滴眼液	化学药	HZ001415
复方妥布霉素眼膏	化学药	HZ001416
硫酸妥布霉素氯化钠注射液	化学药	HZ002399
硫酸妥布霉素注射液	化学药	HZ002400
妥布霉素滴眼液	化学药	HZ003504

HY001937　妥拉洛尔

【其他名称】胺甲苯心安

【外文名称】Tolamolol

药物药理信息

【药理毒理】本品为选择性阻断 β_1 受体，无内在拟交感活性，作用强度与普萘洛尔相似。用于高血压、心绞痛。

【不良反应】可见乏力、嗜睡、头晕、失眠、恶心、腹胀、皮疹、晕厥、低血压、心动过缓等。

HY001938　微粉硅胶

【其他名称】胶态二氧化硅（Colloidal Silicon Dioxide）

【外文名称】Powdered Silica Gel

药物理化信息

【化学名】silica

【分子式】SiO_2

【分子量】60.08

【性状及组成】本品是采用气相法制备的亚微米大小的硅胶，粒径大约为 15nm，质轻、疏松、蓝白色、无臭、无味、无沙砾感的无定型粉末。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：吸附剂、防结块剂、乳剂稳定剂、助流剂、助悬剂，片剂崩解剂，热稳定剂，增黏剂。

本品广泛用于药剂、化妆品和食品中。小粒径和大比表面积使它具有期望的流动性，这一特点可在许多过程中用来改善干粉的流动性，比如压片过程。

本品也用于稳定乳剂，在凝胶和半固体制剂中作为触变性增黏剂和助悬剂。与其他具有相似折射率的组分一起可以形成透明的凝胶。其黏度的增加取决于液体的极性（极性液体需要微粉硅胶的浓度要高于非极性液体）。黏度不受温度的影响，但是体系 pH 的变化会影响黏度。

在非吸入用气雾剂中，本品常用于促进颗粒的悬浮性，以免产生坚硬的沉淀，减少喷口堵塞，本品也用作片剂的崩解剂，在散剂中作为液体的吸附分散剂。本品也经常用在含亲脂性基质的栓剂中以增加黏性，以免成型过程中沉淀，降低释放速率。

【药物相互作用】与二乙基己烯雌酚有配伍禁忌。

【不良反应】微粉硅胶广泛应用于口服和一些局部用制剂中，一般认为是无毒，无刺激的辅料。但腹腔和皮下注射可能导致局部组织坏死和肉芽肿，因此二氧化硅不宜用于注射。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
大发表胶囊	民族药	MZ000080
肝胆清胶囊	民族药	MZ000181
冻干蜂王浆胶囊	中成药	ZC000919
护肝胶囊	中成药	ZC002189
逍遥软胶囊	中成药	ZC006158
脂必妥片	中成药	ZC007311

HY001939　微晶纤维素

【外文名称】Microcrystalline Cellulose

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】微晶纤维素

【分子式】$(C_{12}H_{20}O_{10})_N$（$N \approx 110$）

【分子量】36000.00

【性状及组成】本品系纯棉纤维经水解制得的粉末。

本品为白色或类白色粉末，无臭，无味。

本品在水、乙醇、丙酮或甲苯中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料，赋形剂。

本品主要用作直接压片的黏合剂、崩解剂，也常用作中药浸膏片的崩解剂。因其具有良好的流动性和可压性，在片剂中还常用作黏合剂、助流剂、抗黏剂、吸附剂以及胶囊的稀释剂等。适量加入本品对改善片剂的溶出度、裂片等均有良好的作用。

【药物相互作用】微晶纤维素对强氧化剂有配伍禁忌。

【不良反应】本品广泛应用在口服药物制剂和食品中，是相对无毒和无刺激性的物质。

本品口服后不吸收，几乎没有潜在的毒性。大量使用可能会引起轻度腹泻，作为药剂辅料是安全的。滥用含有纤维素的某些制剂，如吸入或注射给药，都会导致纤维素肉芽肿。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
富马酸酮替芬分散片	化学药	HZ001514
肠舒片	民族药	MZ000068

续表

制剂名称	类别	序号
大发表胶囊	民族药	MZ000080
鹿仙补肾片	民族药	MZ000343
驱白巴布期片	民族药	MZ000441
益肾健骨片	民族药	MZ000719
银芩胶囊	民族药	MZ000726
穿心莲胶囊	中成药	ZC000627
胆黄片	中成药	ZC000763
灯台叶片	中成药	ZC000820
复方玄驹益气片	中成药	ZC001581
甘芍消渴片	中成药	ZC001673
龙血竭含片	中成药	ZC003367
龙血竭片	中成药	ZC003369
螺旋藻片	中成药	ZC003445
首乌延寿片	中成药	ZC005130
通脉刺五加胶囊	中成药	ZC005547
五味子片	中成药	ZC005874
益母草片	中成药	ZC006846
玉泉颗粒	中成药	ZC007083
藏茵陈片	中成药	ZC007184
珍牡肾骨胶囊	中成药	ZC007232
脂必妥片	中成药	ZC007311
紫花杜鹃胶囊	中成药	ZC007599

HY001940 维 A 酸

【其他名称】 Retinoic Acid、视黄酸、Vitamine A Acid、维甲酸、维生素 A 酸、维生素甲酸

【外文名称】 Tretinoin

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 3,7－二甲基－9－（2,6,6－三甲基环已烯）－2,4,6,8 全反式壬四烯酸

【分子式】 $C_{10}H_{28}O_2$

【分子量】 300.44

【性状及组成】 本品为黄色或淡橙色的结晶性粉末。本品在乙醇或三氯甲烷中微溶，在水中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】 本品为细胞诱导分化药。维 A 酸是维生素 A 的代谢中间体，主要影响骨的生长与上皮代谢。通过调节表皮细胞的有丝分裂和表皮细胞的更新，促进正常角化，影响上皮代谢，对上皮角细胞的生长和角质层的脱落有明显的促进作用，可促使已有的粉刺去除，同时又抑制新的粉刺；可阻止角质栓的堵塞，对角蛋白的合成有抑制作用。

本品是一种肿瘤细胞诱导分化剂，可使白血病细胞分化为具有正常表现型功能的血细胞，体外可抑制癌细胞增殖。

1．药理学：表皮角质形成细胞、黑色素细胞及真皮成纤维细胞都是维 A 酸作用重要的靶细胞。维 A 酸显著的药理活性之一是诱导表皮增生，使颗粒层和棘细胞层增厚，可能是维 A 酸对表皮细胞的直接作用，也可能是通过调节表皮生长因子的丝裂原作用，受作用的表皮细胞可见到 DNA 合成和丝分裂指数增加。另一个重要作用是在表皮细胞分化后期通过影响 K_1、K_{10}角蛋白酶解，影响丝聚蛋白原至丝聚蛋白过程及交联包膜形成促进表皮颗粒层细胞向角质层分化。维 A 酸可显著抑制实验性粉刺生成，通过调节毛囊皮脂腺上皮角化异常过程去除角质栓，从而起到防止及消除粉刺皮损作用。维 A 酸可影响黑色素细胞的黑色素生成，其作用是多位点的，对酪氨酸羟化酶、多巴氧化酶及二羟基吲哚氧化酶等三型催化酶活性都有抑制作用，从而降低黑色素形成、减轻皮肤色素沉着。维 A 酸对正常人黑色素细胞酪氨酸酶活性和黑色素成分都无影响。当皮肤发生生理性老化、或受药物、紫外线辐射及创伤伤害时，维 A 酸可纠正或预防有害因素对真皮结缔组织生化成分及形态结构引起的异常，刺激皮肤细胞外基质蛋白合成，在真皮上部加速形成新的结缔组织带，并可提高伤口部位的张力强度。维 A 酸对正常皮肤胶原合成无影响。此外，维 A 酸对白细胞趋化有抑制活性，从而起到抗炎作用。全反式维 A 酸对皮脂腺及其分泌无直接影响。

2．毒理学：口服维 A 酸对实验动物（包括小鼠、大鼠、地鼠、兔、猴等）和人都有很强的致畸作用。皮肤局部外用维 A 酸对处于胚胎敏感期的小鼠、大鼠、地鼠、兔母体有明确的胚胎毒性及致畸性，并可引起母体系统毒性。但迄今回顾性资料未发现人皮肤局部用药后引起畸胎。

维 A 酸对皮肤有刺激性。上述实验动物的皮肤反应较人反应显著为重，可随药物浓度和给药次数引起不同程度皮肤刺激性炎症，红肿、糜烂、削弱角质层屏障，使药物吸收增加，引起系统毒性。人皮肤外用虽有刺激性但并没有上述严重反应。可能由于动物和人的皮肤结构差异及对维 A 酸刺激的敏感性不同所致。所以有关动物维 A 酸局部给药的安

全性资料及对临床用药安全性的预测意义应慎重评估。

【药代动力学】口服吸收良好，2～3小时血药浓度达峰。吸收后与维生素A在体内的主要代谢产物和活性形式相同，主要是在葡萄糖醛酸转移酶的催化下生成葡萄糖醛酯代谢物而排出体外。本品主要在肝脏代谢，由胆汁和尿中排出。

口服吸收后，可通过肝脏与蛋白结合，被运转至全身，经胆汁排出，口服1mg/kg后，血药峰浓度可达0.3～0.5μg/ml。

【药物相互作用】

1．本品应避免与维生素A及四环素同服。

2．与光敏感药合用有增加光敏性的危险。

3．本品外用制剂与肥皂等清洁剂、含脱屑药制剂（如过氧苯甲酰、雷锁辛、水杨酸、硫磺等）、含乙醇制剂、异维A酸等共用，可加剧皮肤刺激或干燥，因此必须慎用。

【药物过量】内服本品出现不良反应时应控制剂量，减少使用剂量，或暂停使用。

【不良反应】

1．唇炎、黏膜干燥、结膜炎、甲沟炎 、脱发。

2．高血脂，多发生于治疗后2～3个月。

3．引起胚胎发育畸形。

4．肝功能受损。

5．其他：可出现头痛、头晕（50岁以下者较老年人多）、骨增厚、口干、脱屑以及对光过敏、皮肤色素变化等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方丙酸氯倍他索软膏	化学药	HZ001095
复方维A酸凝胶	化学药	HZ001419
维A酸胶囊	化学药	HZ003506
维A酸凝胶	化学药	HZ003507
维A酸片	化学药	HZ003508
维A酸乳膏	化学药	HZ003509
维A酸软膏	化学药	HZ003510

HY001941　维胺酯

【外文名称】Viaminate

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第2册

药物理化信息

【化学名】*N*－（4－乙氧羰基苯基）维甲酰胺

【分子式】$C_{29}H_{37}NO_3$

【分子量】447.62

药物药理信息

【药理毒理】本品为维A酸衍生物，结构式近似全反式维A酸，作用机制与13－顺维A酸及芳香维A酸较相似，但副作用较全反式维A酸轻。口服具有调节和控制上皮细胞分化与生长，抑制角化，减少皮脂分泌，抑制角质形成细胞的角化过程，使角化异常恢复正常，抑制痤疮丙酸菌的生长，并有调节免疫及抗炎作用。

本品局部使用具有促进上皮细胞分化与脱落，调节角化过程，抑制皮脂分泌，抗炎，抑制痤疮丙酸菌等作用。

急性毒性试验表明，维胺酯小鼠灌胃给药的LD_{50} > 10g/kg。

【药代动力学】本品口服后大部分经肠道吸收，经肝、胆代谢后由尿、便排出。健康男性空腹单次口服本品10mg，达峰时间为（2.612±0.778）小时，血药峰浓度为（17.496±8.992）μg/ml，半衰期为（2.378±0.871）小时。

【药物相互作用】

1．与异维A酸与四环素类抗生素合用时，可导致“假性脑瘤”引起脑压增高，头痛和视力障碍。

2．与维生素A合用时，可产生维生素A过量的相似症状。

3．与甲氨蝶呤合用时可使甲氨蝶呤的血药浓度增加而加重肝脏的毒性。维胺酯与异维A酸结构近似，亦应避免与上述药物同时使用。

【药物过量】本品局部使用过量时，病人患处皮肤可能会有灼热感等皮肤刺激症状。一般勿需特别处理，也可在医师指导下对症处理。

【不良反应】

1．本药的副作用与维生素A过量的临床表现相似，常见的副作用包括皮肤干燥、脱屑、瘙痒、皮疹、脆性增加、掌跖脱皮、瘀斑、继发感染等；口腔黏膜干燥、疼痛、结合膜炎、严重者角膜混浊、视力障碍、视乳头水肿，头痛、头晕、精神症状、抑郁、良性脑压增高。

2．骨质疏松、肌肉无力、疼痛、胃肠道症状、鼻衄等。

3．妊娠服药可导致自发性流产及胎儿发育畸形。

4．实验室检查可引起血沉快、肝酶升高、血脂升高、血糖升高、血小板下降等。

5．上述不良反应与异维A酸引起的副作用相似，但相对较轻，且大多为可逆性，停药后可逐渐得到恢复。不良反应的轻重与本药的剂量大小、疗程长短及个体耐受有关。

6. 轻度不良反应可不必停药，或减量使用，重度不良反应应立即停药，并去医院由医师作相应处理。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
维胺酯胶囊	化学药	HZ003512
维胺酯胶丸	化学药	HZ003513
维胺酯乳膏	化学药	HZ003514
维胺酯维E乳膏	化学药	HZ003515

HY001942 维丙胺

【外文名称】Diisopropylamine Ascorbate

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第6册

药物理化信息

【化学名】二异丙胺抗坏血酸盐

【分子式】$C_{12}H_{23}NO_6$

【分子量】275.30

【性状及组成】本品为白色或微黄色的结晶或结晶性粉末；无臭，味酸；其水溶液不稳定。

本品在水中极易溶解，在无水乙醇中微溶，在三氯甲烷中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为135.5～138.5℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】本品在体内解离析出维生素C而起作用，为抗体及胶原形成，组织修补，蛋白质合成的必需，参与解毒功能，改善肝脏功能和促进肝细胞再生能力。

【不良反应】偶有头晕，恶心，血压下降等反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
维丙胺胶囊	化学药	HZ003517
维丙胺注射液	化学药	HZ003518

HY001943 维库溴铵

【外文名称】Vecuronim Bromide

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第48册

药物理化信息

【化学名】溴化1－［3α，17β－二乙酰氧基2－β（1－哌啶基）－5α－雄甾烷－16β羟基］－1－甲基哌啶

【分子式】$C_{34}H_{57}Br_2N_2O_4$

【分子量】637.73

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末，无臭，味苦，有引湿性。

本品在乙醇中极易溶解，在水中略溶，在乙醚中几乎不溶；在稀盐酸中极易溶解。

比旋度：取本品，精密称定，加无水乙醇溶解并定量稀释制成每1ml中约含30mg的溶液，依法测定，比旋度为－16°～－21°。

药物药理信息

【药理毒理】本品为单季铵类固醇类中效非去极化肌松药，结构与泮库溴铵相似，通过与乙酰胆碱竞争位于横纹肌运动终板的烟碱样受体而阻断神经末梢与横纹肌之间的传导。与去极化神经肌肉阻断药，如琥珀酰胆碱不同，本品不引起肌纤维成束颤动。静脉注射0.08～0.1mg/kg于1分钟内显效，3～5分钟达高峰，维持时间30～90分钟。肌松效能较氯化筒箭毒碱强3倍；无阻断迷走神经作用，由于维库溴铵不引起心率增快，故适用于心肌缺血及心脏病人，但应用兴奋迷走神经药及β－受体阻断剂容易产生心动过缓。本品组胺释放作用弱，也有支气管痉挛及过敏反应，但很少见。

【药代动力学】静脉注射后体内迅速分布，主要分布于细胞外液，分布半衰期大约（2.2±1.4）分钟。主要经肝脏代谢为3－羟基衍生物约5%，保留部分活性（约为原形药物的50%），药物原形和代谢物主要由胆汁排泄。大约40%～80%以单季铵形式经胆汁排泄，15%～30%经肾排泄。消除半衰期约30～80分钟。肾功能衰竭时可通过肝脏消除来代偿。心血管疾病、高龄、水肿等导致分布容量增加，均可延长起效时间。

【药物相互作用】

1. 下列药物可增强本品效应：①吸入麻醉药如，氟烷、安氟醚、异氟醚等；②大剂量硫喷妥钠、甲乙炔巴比妥、氯胺酮、芬太尼、γ－基丁酸、乙托咪酯、异丙酚；③其他非去极化类肌肉松弛剂以及琥珀酰胆碱；④抗生素如氨基糖苷类、多肽类、酰氨青霉素类以及大剂量甲硝唑；⑤其他如利尿剂、β－肾上腺素能阻滞剂、硫胺、单胺氧化酶抑制剂、奎尼丁、鱼精蛋白、α－上腺素能阻滞剂、镁盐等。

2. 下列药物可使本品作用减弱：①新斯的明、腾喜龙、吡啶斯的明、氨基吡啶衍生物；②长斯使用皮质甾类药物或酰胺唑嗪后；③去甲肾上腺素、硫唑嘌呤（仅有短暂、有限的作用）、茶碱、氯化

钙。

3．下列药物可使本品作用变异：使用维库溴铵后，再给以去极化肌肉松弛药，如琥珀酰胆碱，可能加强或减弱其神经肌肉阻断作用。

【药物过量】在用药过量的情况下，病人应给予机械通气，并给予适当的胆碱酯酶抑制剂（如新斯的明、吡啶斯的明、腾喜龙）作为拮抗剂。当使用胆碱酯酶抑制剂不能恢复本品的神经肌肉作用时，机械通气应持续至自主呼吸恢复。反复使用胆碱酯酶抑制剂是危险的。

【不良反应】

1．过敏反应：①神经肌肉阻断药过敏反应已有报道，本品虽罕见，但应引起注意；②神经肌肉阻断药之间可发生交叉过敏反应，故对曾有过敏史者使用维库溴铵应特别慎重.

2．组胺释放与类组胺反应：临床可偶发局部或全身的类组胺反应.

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用维库溴铵	化学药	HZ004999

HY001944　维酶素

【外文名称】Vitacoenzyme

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第9册

【性状及组成】本品为黄色至棕黄色粉末，具有特异性臭。

药物药理信息

【药理毒理】本品以黄豆为主要原料，经生物发酵而得，含有多种维生素、多种氨基酸、黄素单核苷酸、黄素腺嘌呤二核苷酸以及多种微量元素。具有提高人体免疫力，增强解毒酶活性，抑制癌细胞氧化磷酸化和糖酵解以及组织癌变的作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
维酶素胶囊	化学药	HZ003527
维酶素片	化学药	HZ003528

HY001945　维生素 A

【其他名称】甲种维生素、抗干眼病维生素（Antixerophthalmic Vitamin）、抗干眼醇（Axerophtol）、视黄醇（Retimol）、维生素A醇、维生素甲、维他命甲

【外文名称】Vitamin A

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

【性状及组成】本品系用每1g含270万单位以上的维生素A醋酸酯结晶加精制植物油制成的油溶液。

本品为淡黄色油溶液，或结晶与油的混合物（加热至60℃应为澄明溶液）；无败油臭；在空气中易氧化，遇光易变质。本品与三氯甲烷、乙醚、环己烷或石油醚能任意混合，在乙醇中微溶，在水中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为维生素类药。具有促进生长、维持上皮组织如皮肤、结膜、角膜等正常功能的作用，并参与视紫红质的合成，增强视网膜感光力；参与体内许多氧化过程，尤其是不饱和脂肪酸的氧化。维生素A缺乏时，则生长停止，骨骼成长不良，生殖功能衰退，皮肤粗糙、干燥，角膜软化，并发生干燥性眼炎及夜盲症。

【药代动力学】口服极易吸收，食物中脂肪、蛋白质与体内的胆盐和维生素E对维生素A吸收有密切关系，缺乏上述物质则吸收降低。吸收后贮存于肝脏内，几乎全部在体内代谢分解，并由尿及粪便排出。哺乳妇女有部分维生素A分泌于乳汁中。

【药物相互作用】

1．口服避孕药可提高血浆维生素A的浓度。

2．与维生素E合用时，可促进本品中的维生素A吸收，增加肝内贮存量，加速利用和降低毒性，但大量维生素E服用可耗尽维生素A在体内的贮存。

3．制酸药（如氢氧化铝）可使小肠上段胆酸减少，影响本品中维生素A的吸收。

4．大量维生素A与抗凝药（如香豆素或茚满二酮衍生物）同服，可导致凝血酶原降低。

5．考来烯胺、矿物油、新霉素、硫糖铝能干扰本品中维生素A的吸收。

【药物过量】可致急性或慢性中毒（尤以6个月至3岁的婴幼儿发生率最高）。长期大剂量应用维生素A，表现为食欲减退，皮肤发痒，毛发干枯、脱发，口唇皲裂，易激动、骨痛、骨折、颅内压增高（头痛、呕吐、前囟宽而隆起），停药1～2周后可消失。成人一次剂量超过100万单位，小儿一次超过30万单位，可致急性中毒。须注意，不论成人或小儿，如连续每日服10万单位超过6个月，可致慢性中毒。

【不良反应】推荐剂量未见不良反应。但摄入过量维生素A可致严重中毒，甚至死亡。

急性中毒发生于大量摄入维生素A（成人超过150万单位，小儿超过7.5～30万单位）6小时后，

病人出现异常激动或骚动、头昏、嗜睡、复视、严重头痛、呕吐、腹泻、脱皮（特别是唇和掌），婴儿头部可出现凸起肿块，并有骚动、惊厥、呕吐等颅内压增高、脑积水、假性脑瘤表现。

慢性中毒可表现为骨关节疼痛、肿胀、皮肤瘙痒、口唇干裂、疲劳、软弱、全身不适、发热、头痛、呕吐、颅内压增高、视乳头水肿、皮肤对阳光敏感性增高、易激动、食欲减退、脱发、腹痛、夜尿增多、肝毒性反应、门静脉高压、溶血、贫血、小儿骨骺早愈合、妇女月经过少。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
八维钙锌片	化学药	HZ000287
醋酸甲羟孕酮复合胶囊	化学药	HZ000578
多维生素滴剂	化学药	HZ000799
多维元素胶囊（13）	化学药	HZ000801
多维元素胶囊（15）	化学药	HZ000802
多维元素胶囊（16）	化学药	HZ000803
多维元素片	化学药	HZ000804
多维元素片（14）	化学药	HZ000805
多维元素片（16）	化学药	HZ000806
多维元素片（16－Ⅱ）	化学药	HZ000807
多维元素片（21）	化学药	HZ000808
多维元素片（25）	化学药	HZ000809
多维元素片（29）	化学药	HZ000810
多种维生素片	化学药	HZ000817
复方氨基酸胶囊（8－11）	化学药	HZ001047
复方八维甲睾酮胶囊	化学药	HZ001076
复方多维元素片（21）	化学药	HZ001151
复方多维元素片（23）	化学药	HZ001152
复方炔雌醇甲羟孕酮胶囊	化学药	HZ001354
复方维生素注射液（4）	化学药	HZ001425
复方银耳鱼肝油	化学药	HZ001474
复方营养混悬剂	化学药	HZ001478
复合维生素片	化学药	HZ001497
九合维生素丸	化学药	HZ001965
九维片	化学药	HZ001966
九维鱼肝油乳	化学药	HZ001967
六维胶丸	化学药	HZ002448
葡萄糖鱼肝油乳	化学药	HZ002913
七维牛磺酸口服溶液	化学药	HZ002926

续表

制剂名称	类别	序号
三维鱼肝油乳（成人）	化学药	HZ003164
三维鱼肝油乳（儿童）	化学药	HZ003165
三维樟柳碱膜	化学药	HZ003166
参芪鱼肝油凝胶	化学药	HZ003192
十维片	化学药	HZ003201
十维铁咀嚼片	化学药	HZ003202
维生素 A 胶丸	化学药	HZ003530
维生素 A 糖丸	化学药	HZ003531
维生素 AD 滴剂	化学药	HZ003534
维生素 AD 滴剂（胶囊型）	化学药	HZ003535
维生素 AD 胶丸	化学药	HZ003536
维生素 AE 胶丸	化学药	HZ003537
五维赖氨酸口服溶液	化学药	HZ003607
小儿善存片	化学药	HZ003769
小儿善存液	化学药	HZ003770
小儿维生素咀嚼片	化学药	HZ003778
脂溶性维生素注射液Ⅰ	化学药	HZ004656
脂溶性维生素注射液Ⅱ	化学药	HZ004657
注射用脂溶性维生素（Ⅰ）	化学药	HZ005131
注射用 12 种复合维生素	化学药	HZ005133
复方蛇脂软膏	中成药	ZC001502
克痤隐酮凝胶	中成药	ZC003056
克痤隐酮乳膏	中成药	ZC003057
维尔康胶囊	中成药	ZC005671
益康胶囊	中成药	ZC006833

HY001946 维生素 A 醋酸酯

【外文名称】Retino Acetate（vitamin A Acetate）

药物理化信息

【化学名】全反式－3,7－二甲基－9－（2,6,6－三甲基－1－环己烯－1－基）－2，4，6，8－壬四烯－1－醇醋酸酯

【分子式】$C_{10}H_{30}O$

【分子量】286.46

药物药理信息

【药理毒理】本品具有促进生长、维持上皮组织如皮肤、结膜、角膜等正常功能的作用，并参与视紫红质的合成，增强视网膜感光力；参与体内许多氧化过程，尤其是不饱和脂肪酸的氧化。

【药代动力学】本品吸收后贮存于肝脏内，几乎全部在体内代谢分解，并由尿及粪便排出。哺乳妇女有部分维生素 A 分泌于乳汁中。

【药物相互作用】

1. 制酸药：氢氧化铝可使小肠上段胆酸减少，影响维生素 A 的吸收。

2. 抗凝药：大量维生素 A 与香豆素或茚满二酮衍生物同服，可导致凝血酶原降低。

3. 口服避孕药可提高血浆维生素 A 浓度。

4. 考来烯胺、矿物油、新霉素、硫糖铝能干扰维生素 A 吸收。

5. 与维生素 E 合用时，可促进维生素 A 吸收，增加肝内贮存量，加速利用和降低毒性，但大量维生素 E 服用可耗尽维生素 A 在体内的贮存。

【药物过量】可致急性或慢性中毒（尤以 6 个月至 3 岁的婴儿发生率最高）。长期大剂量应用维生素 A，表现为食欲减退，皮肤发痒，毛发干枯、脱发，口唇皲裂，易激动、骨痛、骨折、颅内压增高（头痛、呕吐、前囟宽而隆起），停药 1～2 周后可消失。成人一次剂量超过 100 万单位，小儿一次超过 30 万单位，可致急性中毒。

【不良反应】尚未见推荐剂量下的不良反应报道。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
祈富乐 T 片	化学药	HZ002937
善存银片	化学药	HZ003189
维生素 A 注射液	化学药	HZ003532

HY001947　维生素 A 棕榈酸酯

【其他名称】Retinol Palmitate、视黄醇棕榈酸盐、视黄醇棕榈酸酯

【外文名称】Vitamin A Palmitate

【分子式】$C_{36}H_{60}O_2$

【分子量】524.87

【性状及组成】淡黄色或浅红棕色晶体。几乎无臭。碱性条件下稳定，受热或遇铁、铜等重金属离子可促使其分解。不溶于水，在水中能乳化，溶于于乙醚、乙醇、石油醚、三氯甲烷和植物油等。

药物药理信息

【药理毒理】维生素 A 棕榈酸酯可替代维生素 A 使用于各种场合，它能够维持人体正常代谢，能够维持细胞膜的稳定和发育、维持生殖系统的正常功能，对视觉的形成、缓和组织的角化、增强细胞的免疫能力有明显的作用。

维生素 A（视黄醇）为上皮细胞正常分化所必需。视黄醇缺乏导致杯状细胞减少，上皮细胞萎缩和结膜基底细胞增殖。

【不良反应】一般无毒性，大量久服可引起食欲减退、腹泻、感觉过敏、眼球突出、毛发脱落、骨质增生等，停服后可消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
肠内营养粉剂（TP）	化学药	HZ000518
善存液	化学药	HZ003188
维生素 A 棕榈酸酯眼用凝胶	化学药	HZ003533
注射用脂溶性维生素（Ⅱ）	化学药	HZ005132

HY001948　维生素 B_1

【其他名称】抗神经炎素、硫胺、维生素乙 1、维他命乙 1、盐酸硫胺（Thiamine Hydrochloride）

【外文名称】Vitamin B_1

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】氯化 4－甲基－3－［（2－甲基－4－氨基－5－嘧啶基）甲基］－5－（2－羟基乙基）噻唑鎓盐酸盐

【分子式】$C_{12}H_{17}ClN_4OS\cdot HCl$

【分子量】337.27

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末；有微弱的特臭，味苦；干燥品在空气中迅即吸收约 4%的水分。本品在水中易溶，在乙醇中微溶，在乙醚中不溶。

吸收系数：取本品，精密称定，加盐酸溶液（9→1000）溶解并定量稀释制成每 1ml 约含 12.5μg 的溶液，照紫外－可见分光光度法，在 246nm 的波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为 406～436。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：维生素类药。

在体内与焦磷酸结合成辅酸酶。参与糖代谢中丙酮酸和 α－酮戊二酸的氧化脱羧反应，是糖类代谢所必需。缺乏时，氧化受阻形成丙酮酸，乳酸堆积，并影响机体能量供应。其症状主要表现在神经和心血管系统，出现感觉神经和运动神经均受影响的多发性周围神经炎，表现为感觉异常，神经痛，四肢无力，以及肌肉酸痛和萎缩等症状。心血管方

面由于血中丙酮和乳酸增多，使小动脉扩张，舒张压下降，心肌代谢失调，故易出现心悸，急促，胸闷，心脏肥大，肝肺充血和周围水肿等心脏功能不全的症状。消化道方面表现为食欲下降导致衰弱和体重下降等。

【药代动力学】胃肠道吸收，主要在十二指肠。吸收不良综合征或饮酒过多能阻止吸收。吸收后分布于各组织，半衰期为 0.35 小时。肝内代谢，经肾排泄，正常人一日可吸收维生素 B_1 5 ~ 15mg。肌注吸收迅速，在体内广泛分布各组织中，体内无蓄积，肝内代谢，经肾排泄，$t_{1/2}$为 0.35h。

【药物相互作用】维生素 B_1 在碱性溶液中易分解，与碱性药物如碳酸氢钠、枸橼酸钠配伍，易引起变质。

【不良反应】维生素 B_1 对正常肾功能者几乎无毒性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氨酚那敏片/维 B_1 那敏片	化学药	HZ000176
八维钙锌片	化学药	HZ000287
贝诺酯维 B_1 颗粒	化学药	HZ000323
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
肠内营养粉剂（TP）	化学药	HZ000518
胆汁槟榔维 B_1 胶囊	化学药	HZ000650
多维赖氨酸糖浆	化学药	HZ000797
多维生素滴剂	化学药	HZ000799
多维铁口服溶液	化学药	HZ000800
多维元素胶囊（13）	化学药	HZ000801
多维元素胶囊（15）	化学药	HZ000802
多维元素胶囊（16）	化学药	HZ000803
多维元素片	化学药	HZ000804
多维元素片（16 - Ⅱ）	化学药	HZ000807
多维元素片（21）	化学药	HZ000808
多维元素片（25）	化学药	HZ000809
多维元素片（29）	化学药	HZ000810
多种维生素片	化学药	HZ000817
儿童复方氨酚肾素片	化学药	HZ000833
二维钙赖氨酸片	化学药	HZ000854
二维葡钙片	化学药	HZ000856
二维葡醛内酯片	化学药	HZ000858
二维亚铁颗粒	化学药	HZ000860

续表

制剂名称	类别	序号
复方阿司匹林双层片	化学药	HZ001022
复方阿魏酸钠阿司匹林胶囊	化学药	HZ001024
复方氨酚肾素片	化学药	HZ001037
复方氨基丁酸维 E 胶囊	化学药	HZ001045
复方氨基酸胶囊（8 - 11）	化学药	HZ001047
复方八维甲睾酮胶囊	化学药	HZ001076
复方保泰松鸡血藤片	化学药	HZ001077
复方吡拉西坦脑蛋白水解物片	化学药	HZ001092
复方刺五加硫胺片	化学药	HZ001113
复方醋酸棉酚片	化学药	HZ001119
复方地巴唑氢氯噻嗪胶囊	化学药	HZ001128
复方地西泮片	化学药	HZ001134
复方淀粉酶口服溶液	化学药	HZ001147
复方多维元素片（21）	化学药	HZ001151
复方多维元素片（23）	化学药	HZ001152
复方肝浸膏胶囊	化学药	HZ001188
复方肝浸膏片	化学药	HZ001189
复方肝浸膏糖浆	化学药	HZ001190
复方胱氨酸片	化学药	HZ001199
复方含糖胃蛋白酶颗粒	化学药	HZ001202
复方枸橼酸铁铵糖浆	化学药	HZ001244
复方赖氨酸颗粒	化学药	HZ001257
复方利血平片	化学药	HZ001262
复方罗布麻片Ⅰ	化学药	HZ001311
复方罗布麻片Ⅱ	化学药	HZ001312
复方脑蛋白水解物片	化学药	HZ001326
复方牛磺酸胶囊	化学药	HZ001330
复方三嗪芦丁片	化学药	HZ001365
复方三维右旋泛酸钙糖浆	化学药	HZ001369
复方双嗪利血平片	化学药	HZ001381
复方四环素片	化学药	HZ001396
复方四嗪利血平片	化学药	HZ001398
复方四维女贞子胶囊	化学药	HZ001399
复方胃蛋白酶颗粒	化学药	HZ001428
复方五味子片	化学药	HZ001433
复方五味子糖浆	化学药	HZ001434
复方溴咖片	化学药	HZ001450

续表

制剂名称	类别	序号
复方营养混悬剂	化学药	HZ001478
复合维生素 BC 片	化学药	HZ001494
复合维生素 B 片	化学药	HZ001495
复合维生素 B 注射液	化学药	HZ001496
复合维生素片	化学药	HZ001497
谷维素双维 B 片	化学药	HZ001638
甲硫氨酸维 B_1 注射液	化学药	HZ001887
九合维生素丸	化学药	HZ001965
九维片	化学药	HZ001966
九维鱼肝油乳	化学药	HZ001967
枸橼酸铁铵维 B_1 糖浆Ⅰ	化学药	HZ002016
枸橼酸铁铵维 B_1 糖浆Ⅱ	化学药	HZ002017
克补片	化学药	HZ002094
口服四维葡萄糖	化学药	HZ002140
口服五维赖氨酸葡萄糖	化学药	HZ002142
口服五维葡萄糖	化学药	HZ002143
灵芝二维甲硫氨酸胶囊	化学药	HZ002315
六维胶丸	化学药	HZ002448
浓维磷糖浆	化学药	HZ002824
葡钙维 B_1 片	化学药	HZ002874
七维牛磺酸口服溶液	化学药	HZ002926
祈富乐 T 片	化学药	HZ002937
三维 B 注射液	化学药	HZ003160
三维钙片	化学药	HZ003161
三维葡磷钙咀嚼片	化学药	HZ003162
善存液	化学药	HZ003188
善存银片	化学药	HZ003189
十维片	化学药	HZ003201
十维铁咀嚼片	化学药	HZ003202
四维钙片	化学药	HZ003318
四维葡锌胶丸	化学药	HZ003319
四维他片	化学药	HZ003320
四维王浆葡萄糖颗粒	化学药	HZ003321
铁铵锌铜维 B_1 糖浆	化学药	HZ003402
维胺颗粒	化学药	HZ003511
维 B_1 乳酸钙片	化学药	HZ003516
维生素 B_1 片	化学药	HZ003538

续表

制剂名称	类别	序号
维生素 B_1 丸	化学药	HZ003539
维生素 B_1 注射液	化学药	HZ003540
维铁缓释片	化学药	HZ003584
维铁片	化学药	HZ003585
五维 B 颗粒	化学药	HZ003604
五维赖氨酸颗粒	化学药	HZ003606
五维赖氨酸片	化学药	HZ003608
五维牛磺酸口服液	化学药	HZ003609
五维葡钙口服溶液	化学药	HZ003610
五维他口服溶液	化学药	HZ003611
小儿贝诺酯维 B_1 咀嚼片	化学药	HZ003742
小儿贝诺酯维 B_1 颗粒	化学药	HZ003743
小儿复方赖氨酸颗粒	化学药	HZ003757
小儿复方四维亚铁散	化学药	HZ003760
小儿善存片	化学药	HZ003769
小儿善存液	化学药	HZ003770
小儿四维葡钙颗粒	化学药	HZ003775
小儿四维葡钙片	化学药	HZ003776
小儿维生素咀嚼片	化学药	HZ003778
小儿五维赖氨酸糖浆	化学药	HZ003781
注射用复合维生素 B	化学药	HZ004766
注射用甲硫氨酸维 B_1	化学药	HZ004813
注射用水溶性维生素	化学药	HZ004960
注射用 12 种复合维生素	化学药	HZ005133
枯草杆菌/肠球菌二联活菌多维颗粒剂	生物制品	SW000148
安神补脑片	中成药	ZC000040
安神补脑液	中成药	ZC000042
补肾安神口服液	中成药	ZC000405
复方北五味子片	中成药	ZC001283
复方刺五加片	中成药	ZC001308
肝精补血素口服液	中成药	ZC001690
更辰胶囊	中成药	ZC001799
更年灵胶囊	中成药	ZC001803
罗己降压片	中成药	ZC003443
脑力宝丸	中成药	ZC003623
脑力静糖浆	中成药	ZC003624

续表

制剂名称	类别	序号
强力蜂乳浆胶丸	中成药	ZC003971
人参补丸胶囊	中成药	ZC004306
参维冻干蜂王浆片	中成药	ZC004917
维尔康胶囊	中成药	ZC005671
温经活血片	中成药	ZC005759
乌阳补心糖浆	中成药	ZC005813
五加茸血口服液	中成药	ZC005840
益肺健脾颗粒	中成药	ZC006813
玉金方胶囊	中成药	ZC007071
玉金方片	中成药	ZC007072
枣参安神胶囊	中成药	ZC007189

HY001949 维生素 B_2

【其他名称】核黄素（Riboflavin）、卵黄素（Ovoflavin）、乳黄素（Lactoflavin）、维生素庚、维生素 G（Vitamin G）、维生素乙 2、乙 2 素

【外文名称】Vitamin B_2

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】7,8 - 二甲基 - 10［（2*S*,3*S*,4*R*）- 2,3,4,5 - 四羟基戊基］- 3,10 - 二氢苯并蝶啶 - 2,4 - 二酮

【分子式】$C_{17}H_{20}N_4O_6$

【分子量】376.37

【性状及组成】本品为橙黄色结晶性粉末；微臭，味微苦；溶液易变质，在碱性溶液中或遇光变质更速。本品在水、乙醇、三氯甲烷或乙醚中几乎不溶；在稀氢氧化钠溶液中溶解。

比旋度：避光操作。取本品，精密称定，加无碳酸盐的氢氧化钾溶液（取氢氧化钾 20g，加无醛乙醇制成 20% 的溶液，放置过夜后，吸取上清液，加无醛乙醇稀释成 0.1mol/L，经标定后，再精密量取 18ml，加新沸过的冷水至 100ml，摇匀）溶解并定量稀释制成每 1ml 中含 5mg 的溶液，依法测定，并严格控制温度，比旋度为 - 120°至 - 140°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：维生素类药。

维生素 B_2 是辅酶的组成成分，参与糖、蛋白质、脂肪的代谢，维持正常的视觉功能和促进生长。当缺乏时，可导致维生素 B_2 缺乏症，表现为唇炎、舌炎、口腔黏膜溃疡、畏光、阴囊炎、阴道炎、脂溢性皮炎。烟酸在体内转变为烟酰胺，参与体内生物氧化过程，缺乏时产生糙皮病。

维生素 B_2 转化为黄素单核苷酸（flavine mononucleotide，FMN）和黄素腺嘌呤二核苷酸（flavine adenine denucleotide，FAD），均为组织呼吸的重要辅酶，并可激活维生素 B_6，将色氨酸转换为烟酸，并可能与维持红细胞的完整性有关。

【药代动力学】由胃肠道吸收，主要在十二指肠，嗜酒可减少维生素 B_2 的吸收，吸收后分布到各种组织及乳汁，仅极少量贮于肝、脾、肾、心组织。蛋白结合率中等。半衰期为 66 ~ 84 分钟。肝内代谢，经肾排泄。血液透析可清除维生素 B_2，但比肾排泄慢。

【药物相互作用】饮酒可影响肠道对维生素 B_2 的吸收。同用吩噻嗪类药、三环类抗抑郁药、丙磺舒等药时，核黄素用量需增加。不宜与血管扩张剂合用。

【不良反应】水溶性维生素 B_2 在正常肾功能状况下几乎不产生毒性。大量服用时尿呈黄色。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
八维钙锌片	化学药	HZ000287
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
肠内营养粉剂（TP）	化学药	HZ000518
多维赖氨酸糖浆	化学药	HZ000797
多维片（6）	化学药	HZ000798
多维生素滴剂	化学药	HZ000799
多维铁口服溶液	化学药	HZ000800
多维元素胶囊（13）	化学药	HZ000801
多维元素胶囊（15）	化学药	HZ000802
多维元素胶囊（16）	化学药	HZ000803
多维元素片	化学药	HZ000804
多维元素片（14）	化学药	HZ000805
多维元素片（16）	化学药	HZ000806
多维元素片（16 - Ⅱ）	化学药	HZ000807
多维元素片（21）	化学药	HZ000808
多维元素片（25）	化学药	HZ000809
多维元素片（29）	化学药	HZ000810
多种维生素片	化学药	HZ000817
二维葡磷钙咀嚼片	化学药	HZ000857
复方氨基酸胶囊（8 - 11）	化学药	HZ001047

续表

制剂名称	类别	序号
复方八维甲睾酮胶囊	化学药	HZ001076
复方吡拉西坦脑蛋白水解物片	化学药	HZ001092
复方多维元素片（21）	化学药	HZ001151
复方多维元素片（23）	化学药	HZ001152
复方儿茶胶囊	化学药	HZ001154
复方肝浸膏胶囊	化学药	HZ001188
复方肝浸膏片	化学药	HZ001189
复方氯己定地塞米松膜	化学药	HZ001301
复方牛磺酸胶囊	化学药	HZ001330
复方三维右旋泛酸钙糖浆	化学药	HZ001369
复方维生素 B_2 片	化学药	HZ001420
复方锌铁钙颗粒	化学药	HZ001445
复方营养混悬剂	化学药	HZ001478
复合维生素 BC 片	化学药	HZ001494
复合维生素 B 片	化学药	HZ001495
复合维生素片	化学药	HZ001497
九合维生素丸	化学药	HZ001965
九维片	化学药	HZ001966
九维鱼肝油乳	化学药	HZ001967
克补片	化学药	HZ002094
口服四维葡萄糖	化学药	HZ002140
口服五维赖氨酸葡萄糖	化学药	HZ002142
口服五维葡萄糖	化学药	HZ002143
灵芝二维甲硫氨酸胶囊	化学药	HZ002315
六维胶丸	化学药	HZ002448
祈富乐 T 片	化学药	HZ002937
三维钙片	化学药	HZ003161
三维葡磷钙咀嚼片	化学药	HZ003162
善存银片	化学药	HZ003189
十维片	化学药	HZ003201
十维铁咀嚼片	化学药	HZ003202
四维钙片	化学药	HZ003318
四维葡锌胶丸	化学药	HZ003319
四维他片	化学药	HZ003320
四维王浆葡萄糖颗粒	化学药	HZ003321
维胺颗粒	化学药	HZ003511
维磷葡钙片	化学药	HZ003526

续表

制剂名称	类别	序号
维生素 B_2 片	化学药	HZ003541
维生素 B_2 注射液	化学药	HZ003542
维铁缓释片	化学药	HZ003584
维铁片	化学药	HZ003585
五维 B 颗粒	化学药	HZ003604
五维甘草那敏胶囊	化学药	HZ003605
五维赖氨酸颗粒	化学药	HZ003606
五维赖氨酸片	化学药	HZ003608
五维牛磺酸口服液	化学药	HZ003609
五维葡钙口服溶液	化学药	HZ003610
五维他口服溶液	化学药	HZ003611
小儿复方赖氨酸颗粒	化学药	HZ003757
小儿善存片	化学药	HZ003769
小儿善存液	化学药	HZ003770
小儿四维葡钙颗粒	化学药	HZ003775
小儿四维葡钙片	化学药	HZ003776
小儿维生素咀嚼片	化学药	HZ003778
小儿五维赖氨酸糖浆	化学药	HZ003781
注射用复合维生素 B	化学药	HZ004766
注射用水溶性维生素	化学药	HZ004960
注射用 12 种复合维生素	化学药	HZ005133
枯草杆菌/肠球菌二联活菌多维颗粒剂	生物制品	SW000148
决明降脂片	中成药	ZC002923
脑力静糖浆	中成药	ZC003624
强力蜂乳浆胶丸	中成药	ZC003971
参维冻干蜂王浆片	中成药	ZC004917
乙诺奇片	中成药	ZC006803
障翳散	中成药	ZC007212

HY001950　维生素 B_4

【其他名称】 6－氨基腺嘌呤磷酸盐、磷酸氨基嘌呤、磷酸腺嘌呤、腺嘌呤

【外文名称】 Vitamin B_4

药物管理信息

【依据标准】 卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第 1 册

药物理化信息

【化学名】6－氨基嘌呤的磷酸盐

【分子式】$C_5H_5N_5 \cdot H_3PO_4$

【分子量】233.12

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，味微酸。

本品在沸水中溶解，在冷水中微溶，在乙醇或三氯甲烷中不溶；在氢氧化钠试液中溶解，在稀盐酸中略溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品是合成核酸的前体物，也是体内的一种辅酶，在体内参与 RNA 和 DNA 合成，具有刺激白细胞增生的作用。具有刺激白细胞增生作用。用于肿瘤化学治疗、放射治疗及其他原因引起的白细胞减少症。

维生素 B_4 是核酸的组成部分，在体内参与 RNA 和 DNA 合成，当白细胞缺乏时，它能促进白细胞增生。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
高渗枸橼酸盐嘌呤液	化学药	HZ001586
维生素 B_4 片	化学药	HZ003543

HY001951 维生素 B_6

【其他名称】二盐吡哆胺、抗皮炎素、抗炎素、盐酸吡哆醇、盐酸吡哆辛（Pyridoxine Hydrochloride）

【外文名称】Vitamin B_6

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】6－甲基－5－羟基－3,4－吡啶二甲醇盐酸盐

【分子式】$C_8H_{11}NO_3 \cdot HCl$

【分子量】205.64

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶或结晶性粉末；无臭，味酸苦；遇光渐变质。本品在水中易溶，在乙醇中微溶，在三氯甲烷或乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为 205～209℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：维生素类药。

维生素 B_6 在红细胞内转化为磷酸吡哆醛，作为辅酶对蛋白质、碳水化合物、脂类的各种代谢功能起作用。维生素 B_6 还参与色胺酸转化成烟酸或 5－羟色胺。

【药代动力学】主要在空肠吸收。维生素 B_6 与血浆蛋白不结合，磷酸吡哆醛与血浆蛋白结合完全。半衰期长达 15～20 天。肝内代谢，经肾脏排泄。可经血液透析而排除。

【药物相互作用】

1．氯霉素、环丝氨酸、乙硫异烟胺、烟酸肼酞嗪、免疫抑制剂包括肾上腺皮质激素、环磷酰胺、环孢素、异烟肼、青霉胺等药物可拮抗维生素 B_6 或增加维生素 B_6 经肾排泄，可引起贫血或周围神经炎。

2．服用雌激素时应增加维生素 B_6 用量。

3．左旋多巴与小剂量维生素 B_6（一日 5mg）合用，可拮抗左旋多巴的抗震颤作用。

【不良反应】维生素 B_6 在肾功能正常时几乎不产生毒性。若每天应用 200mg，持续 30 天以上，曾报道可产生维生素 B_6 依赖综合征。一日应用 2～6g，持续几个月，可引起严重神经感觉异常，进行性步态不稳至足麻木、手不灵活，停药后可缓解，但仍软弱无力。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
八维钙锌片	化学药	HZ000287
斑蝥酸钠维生素 B_6 注射液	化学药	HZ000301
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
肠内营养粉剂（TP）	化学药	HZ000518
多维赖氨酸糖浆	化学药	HZ000797
多维片（6）	化学药	HZ000798
多维生素滴剂	化学药	HZ000799
多维铁口服溶液	化学药	HZ000800
多维元素胶囊（13）	化学药	HZ000801
多维元素胶囊（15）	化学药	HZ000802
多维元素胶囊（16）	化学药	HZ000803
多维元素片	化学药	HZ000804
多维元素片（14）	化学药	HZ000805
多维元素片（16）	化学药	HZ000806
多维元素片（16－Ⅱ）	化学药	HZ000807
多维元素片（21）	化学药	HZ000808
多维元素片（25）	化学药	HZ000809
多维元素片（29）	化学药	HZ000810
多种维生素片	化学药	HZ000817
二维芦丁片	化学药	HZ000855
二维三七桂利嗪胶囊	化学药	HZ000859
氟轻松维 B_6 乳膏	化学药	HZ001003

续表

制剂名称	类别	序号
复方氨基酸胶囊（8－11）	化学药	HZ001047
复方苯硝那敏片	化学药	HZ001088
复方吡拉西坦脑蛋白水解物片	化学药	HZ001092
复方醋酸棉酚片	化学药	HZ001119
复方地巴唑氢氯噻嗪胶囊	化学药	HZ001128
复方颠茄维 B_6 片	化学药	HZ001138
复方多维元素片（21）	化学药	HZ001151
复方多维元素片（23）	化学药	HZ001152
复方肝水解物片	化学药	HZ001191
复方果糖二磷酸钙片	化学药	HZ001200
复方枸橼酸铋钾甲硝唑胶囊	化学药	HZ001241
复方赖氨酸颗粒	化学药	HZ001257
复方利血平片	化学药	HZ001262
复方利血平氢氯噻嗪片	化学药	HZ001263
复方硫酸软骨素滴眼液（1）	化学药	HZ001274
复方罗布麻片Ⅰ	化学药	HZ001311
复方罗布麻片Ⅱ	化学药	HZ001312
复方毛冬青氯贝酸铝片	化学药	HZ001317
复方门冬维甘滴眼液	化学药	HZ001318
复方脑蛋白水解物片	化学药	HZ001326
复方尿维氨滴眼液	化学药	HZ001328
复方牛磺酸胶囊	化学药	HZ001330
复方普鲁卡因片	化学药	HZ001339
复方三嗪芦丁片	化学药	HZ001365
复方三维亚铁口服液	化学药	HZ001366
复方三维亚油酸胶丸Ⅰ	化学药	HZ001367
复方三维亚油酸胶丸Ⅱ	化学药	HZ001368
复方三维右旋泛酸钙糖浆	化学药	HZ001369
复方双嗪利血平片	化学药	HZ001381
复方双炔失碳酯肠溶片	化学药	HZ001383
复方四环素片	化学药	HZ001396
复方四嗪利血平片	化学药	HZ001398
复方四维女贞子胶囊	化学药	HZ001399
复方溴咖片	化学药	HZ001450
复方亚油酸钙片	化学药	HZ001451
复方盐酸普鲁卡因胶囊	化学药	HZ001461
复方盐酸赛克力嗪片	化学药	HZ001464

续表

制剂名称	类别	序号
复方营养混悬剂	化学药	HZ001478
复合维生素 BC 片	化学药	HZ001494
复合维生素 B 片	化学药	HZ001495
复合维生素 B 注射液	化学药	HZ001496
复合维生素片	化学药	HZ001497
谷维素双维 B 片	化学药	HZ001638
甲硝唑维 B_6 片	化学药	HZ001917
九合维生素丸	化学药	HZ001965
九维片	化学药	HZ001966
九维鱼肝油乳	化学药	HZ001967
克补片	化学药	HZ002094
口服五维赖氨酸葡萄糖	化学药	HZ002142
林可霉素维 B_6 软膏	化学药	HZ002261
七维牛磺酸口服溶液	化学药	HZ002926
祈富乐 T 片	化学药	HZ002937
溶菌酶口腔药膜	化学药	HZ003084
三维 B 注射液	化学药	HZ003160
善存液	化学药	HZ003188
善存银片	化学药	HZ003189
参维灵片	化学药	HZ003193
十维片	化学药	HZ003201
十维铁咀嚼片	化学药	HZ003202
四维葡锌胶丸	化学药	HZ003319
四维王浆葡萄糖颗粒	化学药	HZ003321
维胺颗粒	化学药	HZ003511
维生素 B_6 缓释片	化学药	HZ003544
维生素 B_6 片	化学药	HZ003545
维生素 B_6 软膏	化学药	HZ003546
维生素 B_6 注射液	化学药	HZ003547
维铁缓释片	化学药	HZ003584
维铁片	化学药	HZ003585
五维 B 颗粒	化学药	HZ003604
五维甘草那敏胶囊	化学药	HZ003605
五维赖氨酸颗粒	化学药	HZ003606
五维赖氨酸口服溶液	化学药	HZ003607
五维赖氨酸片	化学药	HZ003608
五维牛磺酸口服液	化学药	HZ003609

续表

制剂名称	类别	序号
五维葡钙口服溶液	化学药	HZ003610
五维他口服溶液	化学药	HZ003611
小儿复方四维亚铁散	化学药	HZ003760
小儿善存片	化学药	HZ003769
小儿善存液	化学药	HZ003770
小儿维生素咀嚼片	化学药	HZ003778
小儿五维赖氨酸糖浆	化学药	HZ003781
注射用复方三维 B	化学药	HZ004763
注射用复方三维 BⅡ	化学药	HZ004764
注射用复合维生素 B	化学药	HZ004766
注射用水溶性维生素	化学药	HZ004960
注射用维生素 B_6	化学药	HZ005000
注射用 12 种复合维生素	化学药	HZ005133
枯草杆菌/肠球菌二联活菌多维颗粒剂	生物制品	SW000148
更年灵胶囊	中成药	ZC001803
更年舒片	中成药	ZC001806
罗己降压片	中成药	ZC003443
脑力静糖浆	中成药	ZC003624
脑络通胶囊	中成药	ZC003631
舒络片	中成药	ZC005198
乙诺奇片	中成药	ZC006803

HY001952 维生素 B_{12}

【其他名称】 Betalin12、氰钴铵、氰钴胺素（Cyanocobalamine）、羟钴胺素（Hydroxycobalamine）、Sytobex

【外文名称】 Vitamin B_{12}

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 Coα - ［α - （5，6 - 二甲基苯并咪唑基）］ - Coβ - 氰钴酰胺

【分子式】 $C_{63}H_{88}CoN_{14}O_{14}P$

【分子量】 1355.38

【性状及组成】 本品为深红色结晶或结晶性粉末；无臭，无味；引湿性强。本品在水或乙醇中略溶，在丙酮、三氯甲烷或乙醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：维生素类药。

维生素 B_{12}参与体内甲基转换及叶酸代谢，促进 5 - 甲基四氢叶酸转变为四氢叶酸。缺乏时，导致 DNA 合成障碍，影响红细胞的成熟。本品还促使甲基丙二酸转变为琥珀酸，参与三羧酸循环。此作用关系到神经髓鞘脂类的合成及维持有髓神经纤维功能完整，维生素 B_{12}缺乏症的神经损害可能与此有关。

【药代动力学】 肌注后吸收迅速而完全，约 1 小时血药浓度达峰值；体内分布较广，但主要贮存于肝脏，成人总贮量为 4 ~ 5mg；大部分在 8 小时经肾脏排泄，剂量愈大，排泄愈多。

【药物相互作用】

1. 应避免与氯霉素合用，否则可抵消维生素 B_{12}具有的造血功能。

2. 体外实验发现，维生素 C 可破坏维生素 B_{12}。同时给药或长期大量摄入维生素 C 时，可使维生素 B_{12}血浓度降低。

3. 氨基糖苷类抗生素。对氨基水杨酸类、苯巴比妥、苯妥英钠、扑米酮等抗惊厥药及秋水仙碱等可减少维生素 B_{12}从肠道的吸收。

4. 消胆胺可结合维生素 B_{12}减少其吸收。

【不良反应】 肌注偶可引起皮疹、瘙痒、腹泻及过敏性哮喘，但发生率低，极个别有过敏性休克。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
肠内营养粉剂（TP）	化学药	HZ000518
多维片（6）	化学药	HZ000798
多维生素滴剂	化学药	HZ000799
多维元素胶囊（13）	化学药	HZ000801
多维元素胶囊（15）	化学药	HZ000802
多维元素胶囊（16）	化学药	HZ000803
多维元素片	化学药	HZ000804
多维元素片（14）	化学药	HZ000805
多维元素片（16）	化学药	HZ000806
多维元素片（16 - Ⅱ）	化学药	HZ000807
多维元素片（21）	化学药	HZ000808
多维元素片（25）	化学药	HZ000809
多维元素片（29）	化学药	HZ000810
多种维生素片	化学药	HZ000817
复方氨基酸胶囊（8 - 11）	化学药	HZ001047

续表

制剂名称	类别	序号
复方多维元素片（21）	化学药	HZ001151
复方多维元素片（23）	化学药	HZ001152
复方肝水解物片	化学药	HZ001191
复方牛胎肝提取物片	化学药	HZ001331
复方三维亚铁口服液	化学药	HZ001366
复方维生素 B_{12}溶液	化学药	HZ001421
复方营养混悬剂	化学药	HZ001478
复合维生素片	化学药	HZ001497
羔羊胃提取物维 B_{12}胶囊	化学药	HZ001581
克补片	化学药	HZ002094
赖氨肌醇维 B_{12}口服溶液	化学药	HZ002168
赖氨酸维 B_{12}颗粒	化学药	HZ002176
萘敏维滴眼液	化学药	HZ002741
萘扑维滴眼液	化学药	HZ002745
祈富乐 T 片	化学药	HZ002937
庆大霉素普鲁卡因维 B_{12}胶囊	化学药	HZ003012
庆大霉素普鲁卡因维 B_{12}颗粒	化学药	HZ003013
三维 B 注射液	化学药	HZ003160
三维亚铁咀嚼片	化学药	HZ003163
善存液	化学药	HZ003188
善存银片	化学药	HZ003189
十维片	化学药	HZ003201
十维铁咀嚼片	化学药	HZ003202
维胺颗粒	化学药	HZ003511
维生素 B_{12}滴眼液	化学药	HZ003548
维生素 B_{12}片	化学药	HZ003549
维生素 B_{12}溶液	化学药	HZ003550
维生素 B_{12}注射液	化学药	HZ003551
维铁片	化学药	HZ003585
小儿善存片	化学药	HZ003769
小儿维生素咀嚼片	化学药	HZ003778
注射用复方三维 B	化学药	HZ004763
注射用复方三维 BⅡ	化学药	HZ004764
注射用水溶性维生素	化学药	HZ004960
注射用 12 种复合维生素	化学药	HZ005133
枯草杆菌/肠球菌二联活菌多维颗粒剂	生物制品	SW000148
乙诺奇片	中成药	ZC006803

HY001953　维生素 C

【其他名称】丙种维生素、抗坏血酸（Ascorbic Acid）、维生素丙、维他命丙

【外文名称】Vitamin C

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】L－抗坏血酸

【分子式】$C_6H_8O_6$

【分子量】176.13

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末；无臭，味酸；久置色渐变微黄；水溶液显酸性反应。本品在水中易溶，在乙醇中略溶，在三氯甲烷或乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为 190～192℃，熔融时同时分解。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中含 0.10g 的溶液，依法测定，比旋度度为 +20.5°至 +21.5°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：维生素类药。

维生素 C 为抗体及胶原形成，组织修补（包括某些氧化还原作用），苯丙氨酸、酪氨酸、叶酸的代谢，铁、碳水化合物的利用，脂肪、蛋白质的合成，维持免疫功能，羟化与羟色胺，保持血管的完整，促进非血红素铁吸收等所必需。

【药代动力学】胃肠道吸收，主要在空肠。蛋白结合率低。以腺体组织、白细胞、肝、眼球晶体中含量较高。人体摄入维生素 C 一日推荐需要量时，体内约贮存 1500mg，如每日摄入 200mg 维生素 C 时，体内贮量约 2500mg。肝内代谢，极少量以原形或代谢产物经肾排泄。当血浆浓度大于 14μg/ml 时，尿内排出量增多。可经血液透析清除。

【药物相互作用】

1．口服大剂量（一日量大于 10g）维生素 C 可干扰抗凝药的抗凝效果。

2．与巴比妥或扑米酮等合用，可促使维生素 C 的排泄增加。

3．纤维素磷酸钠可促使维生素 C 代谢为草酸盐。

4．长期或大量应用维生素 C 时，能干扰双硫仑对乙醇的作用。

5．水杨酸类能增加维生素 C 的排泄。

6．与左旋多巴合用，可降低左旋多巴的药效。

7．与肝素或华法林并用，可引起凝血酶原时间

缩短。

8. 注射液不宜与碱性药物（如氨茶碱、碳酸氢钠、谷氨酸钠等）、核黄素、三氯叔丁醇、铜、铁离子（微量）的溶液配伍，以免影响疗效。

9. 注射液与维生素 K_3 配伍，因后者有氧化性，可产生氧化还原反应，使两者疗效减弱或消失。

【药物过量】 过量应用可引起不良反应：一日服 1～4g，可引起腹泻、皮疹、胃酸增多、胃液反流，有时尚可见泌尿系结石、尿内草酸盐与尿酸盐排出增多、深静脉血栓形成、血管内溶血或凝血等，有时可导致白细胞吞噬能力降低。每日用量超过 5g 时，可导致溶血，重者可致命。孕妇大剂量用药时，可能产生婴儿坏血病。

【不良反应】

1. 长期应用一日 2～3g 可引起停药后坏血病。

2. 长期应用大量维生素 C 偶可引起尿酸盐、半胱氨酸盐或草酸盐结石。

3. 大量应用（每日用量 1g 以上）可引起腹泻、皮肤红而亮、头痛、尿频（一日用量 600mg 以上时）、恶心呕吐、胃痉挛。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
阿司匹林维 C 肠溶胶囊	化学药	HZ000085
阿司匹林维 C 肠溶片	化学药	HZ000086
阿司匹林维生素 C 分散片	化学药	HZ000087
阿司匹林维生素 C 咀嚼片	化学药	HZ000088
阿司匹林维生素 C 泡腾片（1）	化学药	HZ000089
阿司匹林维生素 C 泡腾片（2）	化学药	HZ000090
八维钙锌片	化学药	HZ000287
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
肠内营养粉剂（TP）	化学药	HZ000518
多维生素滴剂	化学药	HZ000799
多维元素胶囊（13）	化学药	HZ000801
多维元素胶囊（15）	化学药	HZ000802
多维元素胶囊（16）	化学药	HZ000803
多维元素片	化学药	HZ000804
多维元素片（14）	化学药	HZ000805
多维元素片（16）	化学药	HZ000806
多维元素片（16－Ⅱ）	化学药	HZ000807
多维元素片（21）	化学药	HZ000808
多维元素片（25）	化学药	HZ000809
多维元素片（29）	化学药	HZ000810

续表

制剂名称	类别	序号
多种维生素片	化学药	HZ000817
二维芦丁片	化学药	HZ000855
二维亚铁颗粒	化学药	HZ000860
复方氨基酸胶囊（8－11）	化学药	HZ001047
复方八维甲睾酮胶囊	化学药	HZ001076
复方保泰松鸡血藤片	化学药	HZ001077
复方多维元素片（21）	化学药	HZ001151
复方多维元素片（23）	化学药	HZ001152
复方联苯双酯颗粒	化学药	HZ001265
复方硫酸亚铁颗粒	化学药	HZ001281
复方芦丁片	化学药	HZ001286
复方吗啉胍片	化学药	HZ001316
复方毛冬青氯贝酸铝片	化学药	HZ001317
复方忍冬藤阿司匹林片	化学药	HZ001360
复方三维亚油酸胶丸Ⅰ	化学药	HZ001367
复方三维亚油酸胶丸Ⅱ	化学药	HZ001368
复方碳酸钙泡腾片	化学药	HZ001402
复方维生素 C 钠咀嚼片	化学药	HZ001422
复方西吡氯铵含片	化学药	HZ001436
复方亚油酸钙片	化学药	HZ001451
复方银翘氨酚维 C 片	化学药	HZ001475
复方银翘氨敏胶囊	化学药	HZ001476
复方营养混悬剂	化学药	HZ001478
复合维生素 BC 片	化学药	HZ001494
复合维生素片	化学药	HZ001497
甲橙维 C 咀嚼片	化学药	HZ001831
九合维生素丸	化学药	HZ001965
九维片	化学药	HZ001966
九维鱼肝油乳	化学药	HZ001967
克补片	化学药	HZ002094
口服四维葡萄糖	化学药	HZ002140
口服五维葡萄糖	化学药	HZ002143
六维胶丸	化学药	HZ002448
七维牛磺酸口服溶液	化学药	HZ002926
祈富乐 T 片	化学药	HZ002937
三维钙片	化学药	HZ003161
三维亚铁咀嚼片	化学药	HZ003163

续表

制剂名称	类别	序号
三维鱼肝油乳（成人）	化学药	HZ003164
三维鱼肝油乳（儿童）	化学药	HZ003165
善存液	化学药	HZ003188
善存银片	化学药	HZ003189
十维片	化学药	HZ003201
十维铁咀嚼片	化学药	HZ003202
双扑口服液	化学药	HZ003260
四维钙片	化学药	HZ003318
四维他片	化学药	HZ003320
维胺颗粒	化学药	HZ003511
维C橙皮苷颗粒	化学药	HZ003519
维生素C含片	化学药	HZ003555
维生素C咀嚼片	化学药	HZ003556
维生素C颗粒	化学药	HZ003557
维生素C氯化钠注射液	化学药	HZ003558
维生素C泡腾片	化学药	HZ003560
维生素C泡腾颗粒	化学药	HZ003561
维生素C片	化学药	HZ003562
维生素C葡萄糖注射液	化学药	HZ003563
维生素C丸	化学药	HZ003564
维生素C注射液	化学药	HZ003565
维生素EC颗粒	化学药	HZ003573
维生素EC片	化学药	HZ003574
维铁缓释片	化学药	HZ003584
维铁片	化学药	HZ003585
五维赖氨酸口服溶液	化学药	HZ003607
小儿复方赖氨酸颗粒	化学药	HZ003757
小儿善存片	化学药	HZ003769
小儿善存液	化学药	HZ003770
小儿四维葡钙颗粒	化学药	HZ003775
小儿四维葡钙片	化学药	HZ003776
小儿维生素咀嚼片	化学药	HZ003778
注射用水溶性维生素	化学药	HZ004960
注射用维生素C	化学药	HZ005001
注射用12种复合维生素	化学药	HZ005133
枯草杆菌/肠球菌二联活菌多维颗粒剂	生物制品	SW000148

续表

制剂名称	类别	序号
复方忍冬野菊感冒片	中成药	ZC001486
肝舒片	中成药	ZC001705
冠通片	中成药	ZC001924
健脾生血片	中成药	ZC002500
金羚感冒片	中成药	ZC002712
决明降脂片	中成药	ZC002923
脉络通颗粒	中成药	ZC003498
脉平片	中成药	ZC003500
施保利通片	中成药	ZC005045
舒络片	中成药	ZC005198
速感宁胶囊	中成药	ZC005364
速克感冒胶囊	中成药	ZC005365
速克感冒片	中成药	ZC005366
维C银翘颗粒	中成药	ZC005668
维C银翘片	中成药	ZC005669
维尔康胶囊	中成药	ZC005671
温经活血片	中成药	ZC005759
乌梅人丹	中成药	ZC005807
新复方大青叶片	中成药	ZC006475
玉金方胶囊	中成药	ZC007071
玉金方片	中成药	ZC007072
愈肝片	中成药	ZC007113
枣参合剂	中成药	ZC007190
脂降宁片	中成药	ZC007312

HY001954　维生素C钙

【其他名称】抗坏血酸钙

【外文名称】Calcium Ascorbate

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】L－抗血酸钙二水合物

【分子式】$C_{12}H_{14}CaO_{12}\cdot 2H_2O$

【分子量】426.35

【性状及组成】本品为白色至淡黄色结晶性粉末，无臭。

本品在水中溶解，在乙醇中微溶，在乙醚中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量

稀释制成每 1ml 中含 0.10g 的溶液，依法测定，比旋度应为 +95.0°至 +97.0°。

药物药理信息

【药理毒理】维生素类药。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方氨基酸螯合钙胶囊	化学药	HZ001046
维生素 C 钙胶囊	化学药	HZ003554

HY001955 维生素 C 钠

【外文名称】Sodium Ascorbate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】L－抗坏血酸钠盐

【分子式】$C_6H_7NaO_6$

【分子量】198.11

【性状及组成】本品为白色或极微黄色结晶或结晶性粉末；无臭；在空气中较稳定，遇光色渐变暗。

本品在水中易溶，在乙醇中极微溶解，在三氯甲烷或乙醚中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中含 0.10g 的溶液，在 25℃时依法测定，比旋度为 +103°至 +108°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：维生素药。维生素 C 钠被用作营养增补剂和抗氧化剂，其作用与维生素 C 相同，用于补充维生素 C，该品 1g 的生理功能相当于 0.88g 维生素 C。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方维生素 C 钠咀嚼片	化学药	HZ001422
维生素 C 钠胶囊	化学药	HZ003559

HY001956 维生素 D

【外文名称】Vitamin D

【性状及组成】维生素 D 是具有胆骨化醇生物活性的类固醇衍生物，主要包括维生素 D_2 与维生素 D_3。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：维生素药。维生素 D 促进小肠黏膜刷状缘对钙的吸收及肾小管重吸收磷，提高血钙、血磷浓度，协同甲状旁腺激素（PTH）、降钙素（cT），促进旧骨释放磷酸钙，维持及调节血浆钙、磷正常浓度。维生素 D 促使钙沉着于新骨形成部位，使羟磷酸盐在骨中沉积，促进骨钙化及成骨细胞功能和骨样组织成熟。

妊娠动物摄入过量维生素 D 可致胎仔畸形。

【药代动力学】维生素 D 由小肠吸收，贮存于肝和脂肪。

维生素 D 摄入后，在肝细胞微粒体中受 25－羟化酶系统催化下，生成骨化二醇，经肾近曲小管细胞在 1－羟化酶系统催化下，生成具有生物活性的维生素 D，即骨化三醇（1－25－$(OH)_2D_3$）。作用开始时间 12～24 小时，治疗效应需 10～14 天。

维生素 D_2 及 D_3 的半衰期为 19～48 小时，在脂肪组织内可长期贮存。重复使用有累积作用。

【药物相互作用】

1．含镁的制酸药与维生素 D 同用，特别在慢性肾功能衰竭病人，可引起高镁血症。

2．巴比妥、苯妥英钠、抗惊厥药、扑米酮等可降低维生素 D 效应（通过诱导肝细胞微粒体酶，促进维生素 D 代谢而致），因此长期服用抗惊厥药时应补给维生素 D，以防骨软化。

3．降钙素与维生素 D 同用可抵消前者对高钙血症的疗效。

4．大量钙剂或利尿药与常用量维生素 D 并用，有发生高钙血症的危险。

5．考来烯胺、考来替泊、矿物油、硫糖铝等，均能减少小肠对维生素 D 的吸收。

6．洋地黄与维生素 D 同用时应谨慎，因维生素 D 如引起高钙血症，容易诱发心律失常。

7．大量的含磷药与维生素 D 同用，可诱发高磷血症。

【药物过量】误服大量维生素 D 或长期服用大量维生素 D 而引起的持续性高血钙症，继而发生各脏器组织钙盐沉积，影响其功能者为维生素 D 中毒，对维生素 D 敏感者易引起中毒。

临床症状：

1．轻症早期：畏食、恶心、倦怠、烦躁不安伴低热。

2．中度症状：呕吐、腹泻或顽固性便秘，多饮、多尿，肌张力低下，体重减轻，皮肤干燥。

3．重症：食欲完全消失，嗜睡和惊厥，心界扩大，心音低钝，心律不齐，心动过速，心脏杂音（收缩期）伴高血压，年长儿诉头痛、烦渴、尿频、夜尿，尿中出现蛋白质、红细胞、管型，肾钙化、肾功能障碍。肝脏亦可增大，偶有脾大者。

4．由于钙盐沉着在肾、小支气管及肺泡的操作

而易患泌尿系感染及呼吸道感染。如沉着在骨骼和大脑可以影响运动、体格和智力发育。检查眼角膜及巩膜上有钙沉着。

5. 实验室检查：血钙常超过 3mmol/L（12mg/dl）；正常应为 2.24～2.75mmol/L（9～11mg/dl）。血磷正常、升高或降低，碱性磷酸酶多降降低。

6. X 线检查：骨 X 线片，长骨干骺端临时钙化带增宽，致密，骨干皮质增厚，骨质疏松或骨硬化。

治疗维生素 D 过量，除停用外，应给以低钙饮食，大量饮水，保持尿液酸性，同时对症治疗和支持治疗，如高钙血症危象时需静脉注射氯化钠溶液，增加尿钙排出，必要时应用利尿药、皮质激素或降钙素，甚至作血液透析，并应避免暴晒阳光，直至血钙浓度降至正常时才改变治疗方案。

【不良反应】

1. 短期内摄入超量或长期服用大剂量维生素 D 可导致严重中毒反应。

2. 维生素 D 中毒引起的高钙血症，可引起全身性血管钙化、肾钙质沉淀及其他软组织钙化，而致高血压及肾功能衰竭，上述不良反应多发生于高钙血症和伴有高磷血症时。中毒剂量可因个体差异而不同，但每日应用 5 万单位超过 6 个月后，对正常人也可致毒性反应。维生素 D 中毒可因肾、心血管功能衰竭而致死。

3. 下列情况为维生素 D 中毒早期表现，治疗中发现下列情况需高度警惕。

（1）便秘、腹泻、持续性头痛、食欲减退、口内有金属味、恶心呕吐、口渴、疲乏、无力；

（2）骨痛、尿混浊、惊厥、高血压、眼对光刺激敏感度增加、心律失常、偶有精神异常、皮肤瘙痒、肌痛、严重腹痛（有时误诊为胰腺炎）、夜间多尿、体重下降。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
醋酸甲羟孕酮复合胶囊	化学药	HZ000578
多维元素胶囊（13）	化学药	HZ000801
多维元素胶囊（16）	化学药	HZ000803
多维元素片	化学药	HZ000804
多维元素片（21）	化学药	HZ000808
多维元素片（25）	化学药	HZ000809
多维元素片（29）	化学药	HZ000810
多种维生素片	化学药	HZ000817
复方氨基酸胶囊（8－11）	化学药	HZ001047
复方多维元素片（21）	化学药	HZ001151

续表

制剂名称	类别	序号
复方多维元素片（23）	化学药	HZ001152
复方炔雌醇甲羟孕酮胶囊	化学药	HZ001354
复方维生素注射液（4）	化学药	HZ001425
复方银耳鱼肝油	化学药	HZ001474
复方营养混悬剂	化学药	HZ001478
葡萄糖酸钙维 D_2 散	化学药	HZ002891
善存银片	化学药	HZ003189
十维片	化学药	HZ003201
十维铁咀嚼片	化学药	HZ003202
维 D 钙咀嚼片	化学药	HZ003520
维 D_2 磷酸氢钙片	化学药	HZ003523
维生素 AD 滴剂	化学药	HZ003534
维生素 AD 滴剂（胶囊型）	化学药	HZ003535
维生素 AD 胶丸	化学药	HZ003536
小儿善存片	化学药	HZ003769
小儿善存液	化学药	HZ003770
小儿维生素咀嚼片	化学药	HZ003778
复方蛇脂软膏	中成药	ZC001502

HY001957　维生素 D_2

【其他名称】 Ergocalciferol

【外文名称】 Vitamin D_2

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 9,10－开环麦角甾－5,7,10（19）,22－四烯－3β－醇

【分子式】 $C_{28}H_{44}O$

【分子量】 396.66

【性状及组成】 本品为无色针状结晶或白色结晶性粉末；无臭，无味；遇光或空气均易变质。本品在三氯甲烷中易溶解，在乙醇、丙酮或乙醚中易溶，在植物油中略溶，在水中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加无水乙醇溶解并定量稀释制成每 1ml 中含 40mg 的溶液，依法测定，比旋度为 +102.5°至 +107.5°（应于容器开启后 30 分钟内取样，并在溶液配制后 30 分钟内测定）。

吸收系数：取本品，精密称定，加无水乙醇溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 10μg 的溶液，照分光光度法，在 265nm 的波长处测定吸光度，吸收系

数（$E_{1cm}^{1\%}$）为 460～490。

药物药理信息

【药理毒理】 本品为维生素类药。维生素 D_2 促进小肠黏膜刷状缘对钙的吸收及肾小管重吸收磷，提高血钙、血磷浓度，协同甲状旁腺激素、降钙素，促进旧骨释放磷酸钙，维持及调节血浆钙、磷正常浓度。维生素 D_2 促使钙沉着于新骨形成部位，使枸橼酸盐在骨中沉积，促进骨钙化及成骨细胞功能和骨样组织成熟。维生素 D_2 摄入后，在细胞微粒体中受 25－羟化酶系统催化生成骨化二醇，经肾近曲小管细胞 1－羟化酶系统催化，生成具有生物活性的骨化三醇。

【药代动力学】 由小肠吸收，其吸收需胆盐与特殊 α－球蛋白结合后转运到身体其他部位，贮存于肝和脂肪。代谢、活化首先通过肝脏，其次为肾脏。作用开始时间为 12～24 小时，治疗效应需 10～14 天。$t_{1/2}$为 19～48 小时，在脂肪组织内可长期贮存。作用持续时间最长达 6 个月，重复给药有累积作用。

【药物相互作用】

1．制酸药中的镁剂与维生素 D 同用，特别对慢性肾功能衰竭病人可引起高镁血症。

2．巴比妥、苯妥英钠、抗惊厥药、扑米酮等可降低维生素 D_2 的效应，长期服用抗惊厥药时应补给维生素 D 以防骨软化症。

3．降钙素与维生素 D 同用可抵消前者对高钙血症的疗效。

4．大剂量钙剂或利尿药与常用量维生素 D 同用，有发生高钙血症的危险。

5．考来烯胺、考来替泊、矿物油、硫糖铝等均能减少小肠对维生素 D 的吸收。

6．洋地黄类与维生素 D_2 同用时应谨慎，因维生素 D_2 引起高钙血症，容易诱发心律失常。

7．大量的含磷药物与维生素 D 同用，可诱发高磷血症。

【药物过量】

1．短期内摄入大剂量或长期服用超剂量维生素 D_2，可导致严重中毒反应。

2．维生素 D_2 中毒引起的高钙血症，可引起全身性血管钙化、肾钙质沉淀及其他软组织钙化，而致高血压及肾功能衰竭，上述不良反应多发生于高钙血症和伴有高磷血症时。儿童可致生长停滞，屡见于长期应用维生素 D_2 每日 1800 单位后。中毒剂量可因个体差异而不同，即使每日应用 1 万单位超过数月后，对正常人亦可致毒性反应。维生素 D_2 中毒可因肾、心血管功能衰竭而致死。

3．治疗维生素 D_2 过量，除停用外，应给以低钙饮食，大量饮水，保持尿液酸性，同时进行对症和支持治疗，如高钙血症危象时需静脉给予氯化钠注射液，增加尿钙排出，必要时应用利尿药、皮质激素或降钙素，甚至作血液透析，并应避免曝晒阳光，直至血钙浓度降至正常时才改变治疗方案。

【不良反应】

1．便秘、腹泻、持续性头痛、食欲减退、口内有金属味、恶心呕吐、口渴、疲乏、无力；

2．骨痛、尿混浊、惊厥、高血压、眼对光刺激敏感度增加、心律失常、偶有精神异常、皮肤瘙痒、肌痛、严重腹痛（有时误诊为胰腺炎）、夜间多尿、体重下降。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
八维钙锌片	化学药	HZ000287
多维元素胶囊（15）	化学药	HZ000802
多维元素片（16）	化学药	HZ000806
多维元素片（16－Ⅱ）	化学药	HZ000807
二维钙赖氨酸片	化学药	HZ000854
二维葡钙片	化学药	HZ000856
二维葡磷钙咀嚼片	化学药	HZ000857
复方八维甲睾酮胶囊	化学药	HZ001076
九合维生素丸	化学药	HZ001965
九维片	化学药	HZ001966
口服四维葡萄糖	化学药	HZ002140
口服维 D_2 葡萄糖	化学药	HZ002141
口服五维葡萄糖	化学药	HZ002143
六维胶丸	化学药	HZ002448
葡萄糖酸钙维 D_2 咀嚼片	化学药	HZ002889
葡萄糖酸钙维 D_2 咀嚼片（Ⅱ）	化学药	HZ002890
祈富乐 T 片	化学药	HZ002937
三维葡磷钙咀嚼片	化学药	HZ003162
善存液	化学药	HZ003188
四维钙片	化学药	HZ003318
维 D_2 果糖酸钙注射液	化学药	HZ003521
维 D_2 磷葡钙片	化学药	HZ003522
维 D_2 乳酸钙片	化学药	HZ003524
维磷葡钙片	化学药	HZ003526
维生素 D 滴剂	化学药	HZ003566
维生素 D_2 胶丸	化学药	HZ003567
维生素 D_2 片	化学药	HZ003568
维生素 D_2 注射液	化学药	HZ003569

续表

制剂名称	类别	序号
五维赖氨酸口服溶液	化学药	HZ003607
五维牛磺酸口服液	化学药	HZ003609
五维葡钙口服溶液	化学药	HZ003610
小儿复方赖氨酸颗粒	化学药	HZ003757
小儿复方四维亚铁散	化学药	HZ003760
小儿四维葡钙颗粒	化学药	HZ003775
小儿四维葡钙片	化学药	HZ003776
脂溶性维生素注射液Ⅰ	化学药	HZ004656
脂溶性维生素注射液Ⅱ	化学药	HZ004657
注射用脂溶性维生素（Ⅰ）	化学药	HZ005131
注射用脂溶性维生素（Ⅱ）	化学药	HZ005132
龙牡壮骨咀嚼片	中成药	ZC003355
龙牡壮骨颗粒	中成药	ZC003356

HY001958　维生素 D_3

【外文名称】Vitamin D_3

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】9,10 - 开环胆甾 - 5,7,10（19） - 三烯 - 3β - 醇

【分子式】$C_{27}H_{44}O$

【分子量】384.65

【性状及组成】本品为无色针状结晶或白色结晶性粉末；无臭，无味；遇光或空气均易变质。

本品在乙醇、丙酮、三氯甲烷或乙醚中极易溶解，在植物油中略溶。

比旋度：取本品，精密称定，加无水乙醇溶解并定量稀释制成每 1ml 中含 5mg 的溶液，依法测定，比旋度为 + 105 至 + 112°（应于容器开启后 30 分钟内取样，并在溶液配制后 30 分钟内测定）。

吸收系数：取本品，精密称定，加无水乙醇溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 10 μg 的溶液，照紫外 - 可见分光光度法，在 265nm 的波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为 465 ~ 495。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：维生素类药。

本品为维生素类药。维生素 D_3 促进小肠黏膜刷状缘对钙的吸收及肾小管重吸收磷，提高血钙、血磷浓度，协同甲状旁腺激素、降钙素，促进旧骨释放磷酸钙，维持及调节血浆钙、磷正常浓度。维生素 D_3 促使钙沉着于新骨形成部位，使枸橼酸盐在骨中沉积，促进骨钙化及成骨细胞功能和骨样组织成熟。维生素 D_3 摄入后，在细胞微粒体中受 25 - 羟化酶系统催化生成骨化二醇（25 - OHD_3），经肾近曲小管细胞 1 - 羟化酶系统催化，生成具有生物活性的骨化三醇〔1,25 - $(OH)_2D_3$〕。

【药代动力学】维生素 D_3 的代谢、活化，首先通过肝脏，其次为肾脏。$t_{1/2}$为 19 ~ 48 小时，在脂肪组织内可长期贮存。

【药物相互作用】

1. 含镁的制酸药与维生素 D_3 同用，特别在慢性肾功能衰竭病人，可引起高镁血症。

2. 巴比妥、苯妥英钠、抗惊厥药、扑米酮等可降低维生素 D_3 的效应，因此长期服用抗惊厥药时应补给维生素 D_3，以防止骨软化症。

3. 降钙素与维生素 D_3 同用可抵消前者对高钙血症的疗效。

4. 大量钙剂或利尿药与常用量维生素 D_3 并用，有发生高钙血症的危险。

5. 洋地黄与维生素 D_3 同用时应谨慎，因维生素 D 如引起高钙血症，容易诱发心律失常。

6. 大量的含磷药与维生素 D_3 同用，可诱发高磷血症。

【药物过量】

1. 短期内超量摄入或长期大剂量摄入维生素 D_3 可导致严重中毒反应。

2. 中毒引起的高钙血症，可引起全身性血管钙化、肾钙质沉淀及其他软组织钙化，而致高血压及肾功能衰竭，上述不良反应多发生于高钙血症和伴有高磷血症时。儿童可致生长停滞，屡见于长期应用维生素 D_3 一日 1800 单位后。中毒剂量可因个体差异而不同，但每日应用 5 万单位超过 6 个月后，对正常人亦可致毒性反应。维生素 D_3 中毒可因肾、心血管功能衰竭而致死。

3. 治疗维生素 D_3 过量，除停用外，应给以低钙饮食，大量饮水，保持尿液酸性，同时进行对症和支持治疗，如高钙血症危象时需静脉注射氯化钠溶液，增加尿钙排出，必要时应用利尿药、皮质激素或降钙素，甚至作血液透析，并应避免曝晒阳光，直至血钙浓度降至正常时才改变治疗方案。

【不良反应】

1. 便秘、腹泻、持续性头痛、食欲减退、口内有金属味、恶心呕吐、口渴、疲乏、无力；

2. 骨痛、尿混浊、惊厥、高血压、眼对光刺激敏感度增加、心律失常、偶有精神异常、皮肤瘙痒、肌痛、严重腹痛（有时误诊为胰腺炎）、夜间多尿、体重下降。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
肠内营养粉剂（TP）	化学药	HZ000518
多维赖氨酸糖浆	化学药	HZ000797
多维生素滴剂	化学药	HZ000799
多维元素片（14）	化学药	HZ000805
复方氨基酸螯合钙胶囊	化学药	HZ001046
复方碳酸钙泡腾颗粒	化学药	HZ001401
复合维生素片	化学药	HZ001497
钙尔奇 $D_3$00 咀嚼片	化学药	HZ001532
钙尔奇 D600 片	化学药	HZ001533
九维鱼肝油乳	化学药	HZ001967
葡萄糖鱼肝油乳	化学药	HZ002913
三维鱼肝油乳（成人）	化学药	HZ003164
三维鱼肝油乳（儿童）	化学药	HZ003165
参芪鱼肝油凝胶	化学药	HZ003192
碳酸钙 D_3 咀嚼片	化学药	HZ003352
维生素 D_3 胶丸	化学药	HZ003570
维生素 D_3 碳酸钙片	化学药	HZ003571
维生素 D_3 注射液	化学药	HZ003572
注射用 12 种复合维生素	化学药	HZ005133

HY001959 维生素 E

【其他名称】α－生育酚、产妊酚、生育酚、Tocopherol

【外文名称】Vitamin E

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（±）－2,5,7,8－四甲基－2－(4,8,12－三甲基十三烷基）－6－苯并二氢吡喃醇醋酸酯

【分子式】$C_{31}H_{52}O_3$

【分子量】472.75

【性状及组成】本品为微黄色或黄色透明的黏稠液体，几乎无臭，遇光色渐变深。本品在无水乙醇、丙酮、乙醚或石油醚中易溶，在水中不溶。

折光率：本品的折光率为 1.494～1.499。

吸收系数：取本品，精密称定，加无水乙醇溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 0.1mg 的溶液，照紫外－可见分光光度法，在 284nm 的波长处测定吸光度，吸收系数为 41.0～45.0。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：维生素类药。

维生素 E 是一种基本营养素，确切功能尚不明，属于抗氧化剂，可结合饮食中的硒，防止膜及其他细胞结构的多价不饱和脂酸，使免受自由基损伤；保护红细胞免于溶血，保护神经与肌肉免受氧自由基损伤，维持神经、肌肉的正常发育与功能。亦可能为某些酶系统的辅助因子。

【药代动力学】50%～80%在肠道吸收（十二指肠），吸收需要有胆盐与饮食中脂肪存在以及正常的胰腺功能，与血中 β－脂蛋白结合，贮存于全身组织，尤其是在脂肪组织中，贮存量可高达供 4 年所需，肝内代谢，经胆汁和肾排泄。

【药物相互作用】

1．大量氢氧化铝可使小肠上段的胆酸沉淀，降低脂溶性维生素 E 的吸收。

2．避免香豆素及其衍生物与大量本品同用，以防止低凝血酶原血症发生。

3．降血脂药考来烯胺和考来替泊，矿物油及硫糖铝等药物可干扰本品的吸收。

4．缺铁性贫血补铁时对维生素 E 的需要量增加。

5．本品可促进维生素 A 的吸收，肝内维生素 A 的贮存和利用增加，并降低维生素 A 中毒的发生；但超量时可减少维生素 A 的体内贮存。

【药物过量】

1．长期超量使用（一日量 > 800mg），对维生素 K 缺乏病人可引起出血倾向，改变内分泌代谢（甲状腺、垂体和肾上腺），改变免疫机制，影响性功能，并有出现血栓性静脉炎或栓塞的危险。

2．本品超量时可减少维生素 A 的体内贮存。

【不良反应】

1．长期服用大量（一日量 400～800mg），可引起视力模糊、乳腺肿大、腹泻、头晕、流感样综合征、头痛、恶心及胃痉挛、乏力软弱。

2．长期服用超量（一日量大于 800mg），对维生素 K 缺乏病人可引起出血倾向，改变内分泌代谢（甲状腺、垂体和肾上腺），改变免疫机制，影响性功能，并有出现血栓性静脉炎或栓塞的危险。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
八维钙锌片	化学药	HZ000287
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517

续表

制剂名称	类别	序号
肠内营养粉剂（TP）	化学药	HZ000518
醋酸甲羟孕酮复合胶囊	化学药	HZ000578
多维赖氨酸糖浆	化学药	HZ000797
多维生素滴剂	化学药	HZ000799
多维铁口服溶液	化学药	HZ000800
多维元素胶囊（13）	化学药	HZ000801
多维元素胶囊（15）	化学药	HZ000802
多维元素胶囊（16）	化学药	HZ000803
多维元素片	化学药	HZ000804
多维元素片（14）	化学药	HZ000805
多维元素片（16）	化学药	HZ000806
多维元素片（16－Ⅱ）	化学药	HZ000807
多维元素片（21）	化学药	HZ000808
多维元素片（25）	化学药	HZ000809
多维元素片（29）	化学药	HZ000810
多种维生素片	化学药	HZ000817
二维三七桂利嗪胶囊	化学药	HZ000859
复方氨基丁酸维E胶囊	化学药	HZ001045
复方氨基酸胶囊（8－11）	化学药	HZ001047
复方八维甲睾酮胶囊	化学药	HZ001076
复方吡拉西坦脑蛋白水解物片	化学药	HZ001092
复方多维元素片（21）	化学药	HZ001151
复方多维元素片（23）	化学药	HZ001152
复方氟脲嘧啶注射液	化学药	HZ001169
复方甲硝唑泡腾片	化学药	HZ001223
复方甲硝唑栓	化学药	HZ001225
复方硫酸软骨素滴眼液（1）	化学药	HZ001274
复方尿维氨滴眼液	化学药	HZ001328
复方炔雌醇甲羟孕酮胶囊	化学药	HZ001354
复方三维亚油酸胶丸Ⅰ	化学药	HZ001367
复方三维亚油酸胶丸Ⅱ	化学药	HZ001368
复方四维女贞子胶囊	化学药	HZ001399
复方维生素注射液（4）	化学药	HZ001425
复方营养混悬剂	化学药	HZ001478
复合维生素片	化学药	HZ001497
肝素钠维E乳膏	化学药	HZ001579
九合维生素丸	化学药	HZ001965

续表

制剂名称	类别	序号
九维片	化学药	HZ001966
九维鱼肝油乳	化学药	HZ001967
克补片	化学药	HZ002094
尿素维E乳膏	化学药	HZ002811
七维牛磺酸口服溶液	化学药	HZ002926
祈富乐T片	化学药	HZ002937
三维樟柳碱膜	化学药	HZ003166
善存液	化学药	HZ003188
善存银片	化学药	HZ003189
十维片	化学药	HZ003201
十维铁咀嚼片	化学药	HZ003202
四维葡锌胶丸	化学药	HZ003319
四维王浆葡萄糖颗粒	化学药	HZ003321
维胺酯维E乳膏	化学药	HZ003515
维E三油胶丸	化学药	HZ003525
维参锌胶囊	化学药	HZ003529
维生素AE胶丸	化学药	HZ003537
维生素EC颗粒	化学药	HZ003573
维生素EC片	化学药	HZ003574
维生素E搽剂	化学药	HZ003575
维生素E胶丸	化学药	HZ003576
维生素E片	化学药	HZ003577
维生素E注射液	化学药	HZ003580
烯丙雌醇片	化学药	HZ003646
小儿善存液	化学药	HZ003770
小儿维生素咀嚼片	化学药	HZ003778
亚油酸胶丸	化学药	HZ003831
亚油酸维生素E胶丸	化学药	HZ003832
脂肪乳注射液（中链及长链复合剂）	化学药	HZ004655
脂溶性维生素注射液Ⅰ	化学药	HZ004656
脂溶性维生素注射液Ⅱ	化学药	HZ004657
注射用脂溶性维生素（Ⅰ）	化学药	HZ005131
注射用脂溶性维生素（Ⅱ）	化学药	HZ005132
注射用12种复合维生素	化学药	HZ005133
松根油吸入剂	民族药	MZ000598
貂油治裂软膏	中成药	ZC000857

续表

制剂名称	类别	序号
复方蛇脂软膏	中成药	ZC001502
复方参芪维E胶囊	中成药	ZC001504
更辰胶囊	中成药	ZC001799
抗脑衰胶囊	中成药	ZC003010
克痤隐酮凝胶	中成药	ZC003056
克痤隐酮乳膏	中成药	ZC003057
力加寿片	中成药	ZC003181
脑力宝丸	中成药	ZC003623
羌月乳膏	中成药	ZC003956
强力康颗粒	中成药	ZC003974
参芪力得康片	中成药	ZC004830
维尔康胶囊	中成药	ZC005671
温经活血片	中成药	ZC005759
益康胶囊	中成药	ZC006833
玉金方胶囊	中成药	ZC007071
玉金方片	中成药	ZC007072

HY001960 维生素E粉

【外文名称】Vitamin E Powder

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

【性状及组成】本品为维生素E与一种或多种惰性物质的均匀混合物。

本品为白色或类白色粉末或颗粒。易吸潮。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：维生素类药。维生素E是一种基本营养素，确切功能尚不明，属于抗氧化剂，可结合饮食中的硒，防止细胞膜及其他细胞结构的多价不饱和脂肪酸被氧化，使免受自由基损伤；保护红细胞免于溶血，保护神经与肌肉免受氧自由基损伤，维持神经、肌肉的正常发育与功能。亦可能为某些酶系统的辅助因子。

【药代动力学】50%～80%在肠道吸收（十二指肠），吸收需要有胆盐与饮食中脂肪协助，贮存量可高达供人体4年所需。本品由肝内代谢，经胆汁和肾排泄。

HY001961 维生素E琥珀酸单酯

【其他名称】琥珀酸维生素E

【外文名称】Monolauryl Sulfosuccinate

药物药理信息

【药理毒理】本品具有游离维生素E的生理活性，而且还具有优良的化学稳定性，常态下为固体粉末，从而方便了制作硬胶囊。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乙诺奇片	中成药	ZC006803

HY001962 维生素E烟酸酯

【其他名称】α－生育酚烟酸酯

【外文名称】Vitamin E Nicotinicate

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第5册

药物理化信息

【化学名】DL－2，5，7，8－四甲基－2－（4，8，12－三甲基十三烷基）色满醇－6－烟酸酯

药物药理信息

【药理毒理】本品为周围血管扩张药，能直接作用于血管壁，具有促进血液循环、持续稳定地增加血流量的作用，并能抑制胆固醇的生物合成。用于高血压、脑动脉硬化、脑中风、脑震荡及脑外伤后遗症，头痛头晕、中心视网膜炎等血管障碍性疾病，也可用于脂质代谢异常、冠状动脉不全和循环障碍引起的各种疾病。其疗效显著，毒性很低，不良反应小，无烟酸样面部潮红等。

【药代动力学】维生素E有50%～80%在肠道吸收（十二指肠），吸收需要有胆盐与饮食中脂肪存在以及正常的胰腺功能，与血中β－脂蛋白结合，贮存于全身组织，尤其是在脂肪组织中，贮存量可高达供4年所需，肝内代谢，经胆汁和肾排泄。烟酸在胃肠道吸收。口服后30～60分钟血药浓度达峰值，广泛分布到各组织。$t_{1/2}$约为45分钟。肝内代谢。治疗量的烟酸仅有小量以原形及代谢物由尿排出，用量超过需要时，绝大部分经肾排出。食物中色氨酸通过肠道细菌作用转化为烟酸。烟酸有周围血管扩张作用。本品还能抑制胆固醇的合成，大剂量可降低血清胆固醇及甘油三酯浓度。

【药物过量】

1．大量烟酸可导致腹泻、头晕、乏力、皮肤干燥、瘙痒、眼干燥、恶心、呕吐，胃痛等。

2．偶尔大量应用烟酸可致高血糖、高尿酸、心律失常、肝毒性反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
维生素E烟酸酯胶囊	化学药	HZ003578
维生素E烟酸酯胶丸	化学药	HZ003579

HY001963　维生素 K_1

【其他名称】叶绿醌、植物甲萘醌（Phytonadione）

【外文名称】Vitamin K1

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】2-甲基-3-（3,7,11,15-四甲基-2-十六碳烯基）-1,4-萘二酮的反式和顺式异构体混合物

【分子式】$C_{31}H_{46}O_2$

【分子量】450.71

【性状及组成】本品为黄色至橙色透明的黏稠液体，无臭或几乎无臭，遇光易分解。本品在三氯甲烷、乙醚或植物油中易溶，在乙醇中略溶，在水中不溶。

折光率：本品的折光率为1.525~1.528。

药物药理信息

【药理毒理】本品为维生素类药。维生素 K_1 可使凝血酶原（Ⅱ因子）及其他凝血因子、Ⅶ因子、Ⅸ因子和Ⅹ因子的前体物质羧化后转变成凝血酶原及相应因子。当血液中的凝血酶原及其他凝血因子缺乏时，血液的凝固就出现迟缓，这时给以维生素 K_1 就可促进肝脏合成Ⅱ因子、Ⅶ因子、Ⅸ因子及Ⅹ因子，以达到较快止血的作用。

【药代动力学】在胆汁的存在下，维生素 K_1 由胃肠道经小肠淋巴管吸收，用药后吸收良好，并在肝内迅速代谢和经肾及胆道排泄，一般不在体内积蓄。

肌内注射1~2小时起效，3~6小时止血效果明显，12~14小时后凝血酶原时间恢复正常。本品在肝内代谢，经肾脏和胆汁排出。

【药物相互作用】本品与苯妥英钠混合2小时后可出现颗粒沉淀，与维生素C、维生素 B_{12}、右旋糖酐混合易出现混浊。与双香豆素类口服抗凝剂合用，作用相互抵消。水杨酸类、磺胺、奎宁、奎尼丁等也影响维生素 K_1 的效果。

【药物过量】药物大剂量或超剂量可加重肝损害。

【不良反应】偶见过敏反应。静注过快，超过5mg/min，可引起面部潮红、出汗、支气管痉挛、心动过速、低血压等，曾有快速静脉注射致死的报道。肌注可引起局部红肿和疼痛。新生儿应用本品后可能出现高胆红素血症，黄疸和溶血性贫血。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
肠内营养粉剂（TP）	化学药	HZ000518
多维元素片	化学药	HZ000804
多维元素片（29）	化学药	HZ000810
复方维生素注射液（4）	化学药	HZ001425
复方营养混悬剂	化学药	HZ001478
善存银片	化学药	HZ003189
维生素 K_1 片	化学药	HZ003581
维生素 K_1 注射液	化学药	HZ003582
脂溶性维生素注射液Ⅰ	化学药	HZ004656
脂溶性维生素注射液Ⅱ	化学药	HZ004657
注射用脂溶性维生素（Ⅰ）	化学药	HZ005131
注射用脂溶性维生素（Ⅱ）	化学药	HZ005132

HY001964　维生素U

【其他名称】碘甲基蛋氨酸、碘甲基甲硫基丁氨酸

【外文名称】Vitamin U

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第7册

药物理化信息

【化学名】碘甲基甲硫基丁氨酸

【分子式】$C_6H_{14}NO_2IS$

【分子量】291.20

【性状及组成】为白色或类白色结晶性粉末；有特殊的臭气，味咸苦，遇光及露置空气中易分解，水溶液显酸性。易溶于水，不溶于乙醇或乙醚。

药物药理信息

【药理毒理】本品能促进胃肠道黏膜的创伤面修复愈合，还能改善胃肠道的运动功能。主要用于胃及十二指肠溃疡、溃疡性大肠炎、胃肠运动无力与慢性胃炎等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方芦荟维U片	化学药	HZ001287
复方维生素U胶囊	化学药	HZ001423

续表

制剂名称	类别	序号
复方维生素U片	化学药	HZ001424
复方维U颠茄铋片	化学药	HZ001426
复方胃膜素胶囊	化学药	HZ001430
三维樟柳碱膜	化学药	HZ003166
维U颠茄铝胶囊	化学药	HZ003586
维U颠茄铝胶囊Ⅱ	化学药	HZ003587
维U颠茄铝胶囊Ⅲ	化学药	HZ003588
维U颠茄铝镁胶囊	化学药	HZ003589
维U颠茄铝镁片	化学药	HZ003590
维U颠茄铝镁片Ⅱ	化学药	HZ003591
胃欣舒胶囊	民族药	MZ000627
溃疡宁片	中成药	ZC003120

HY001965 维四高丝

【外文名称】Viscose

药物理化信息

【化学名】葡聚糖

药物药理信息

【药理毒理】本品为生物合成的高分子黏多糖制剂，作为眼科手术辅助用药，具有充填前房便于手术操作及保护角膜内皮的作用。本品无致炎性和致敏性。

【不良反应】可引起暂时性眼压升高。可对症治疗。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
维四高丝注射液	化学药	HZ003583

HY001966 维替泊芬

【外文名称】Verteporfin

药物理化信息

【化学名】9-甲基（I）和13-甲基（II）反式-（±）-18-乙烯-4,4*a*-二氢-3,4-双（甲酯基）-4*a*,8,14,19-四甲基-23*H*,25*H*-苯卟啉-9,13-二丙酯

【分子式】$C_{41}H_{42}N_4O_8$

【分子量】718.80

药物药理信息

【药理毒理】治疗年龄相关性黄斑变性、病理性近视和可疑眼组织胞浆菌病综合征等疾病引起的脉络膜新生血管（CNV）。

维替泊芬治疗分两步，需要注射维替泊芬和非致热红光源。维替泊芬在血浆中主要被脂蛋白转运。在有氧环境下，维替泊芬一旦被光激活就会产生高度活性的、维持时间短暂的单氧和具有活性的氧自由基。被光激活的维替泊芬可以损伤局部新生血管内皮细胞，引起血管闭合。已知，受损的内皮细胞可以通过脂氧化酶（白三烯）和环氧化酶（类花生酸如血栓素）途径释放促凝因子和血管活性因子，引起血小板聚集纤维蛋白凝块形成和血管收缩。维替泊芬主要在新生血管包括脉络膜新生血管积聚，然而动物试验显示维替泊芬也出现于视网膜。因而在光动力学治疗的同时也会出现视网膜的损伤，包括视网膜色素上皮细胞和外核层。在人类，维替泊芬治疗引起脉络膜新生血管（CNV）暂时性闭合的疗效已经被荧光血管造影结果所证实致癌，致畸和对生殖功能的影响目前还没有对维替泊芬致癌性的研究。

有报道，光动力治疗（PDT）可以引起DNA损伤，包括DNA链断裂，出现碱基敏感位点，DNA降解和DNA-蛋白交联，从而引起染色体畸变、姐妹染色单体互换（SCE）和突变。另外，应用其他光动力学治疗药物后，经过可见光照射的中国仓鼠卵巢（CHO）细胞和经过近紫外光照射的中国仓鼠肺成纤维细胞出现姐妹染色单体互换的几率增加，在小鼠L5178细胞突变和DNA-蛋白交联增加，在人恶性子宫颈癌细胞DNA链断裂增加，而在正常细胞无此现象。在最后几个体系中，未对维替泊芬进行评估。PDT治疗药物对DNA的损伤作用对人类的潜在危险尚不清楚。在大鼠每天静脉给予维替泊芬10mg/kg，（分别给予雄性和雌性大鼠，根据AUC_{inf}值，人类6mg/ 暴露量的大约60和40倍剂量注射），未观察到对雄性或雌性大鼠生殖能力的影响。

【药代动力学】静脉输注维替泊芬后，维替泊芬以二指数形式清除，终末消除半衰期大约为5~6小时。剂量在6~20mg/m^{2}之间时，暴露量和最大血药浓度均与注射剂量成比例。在一定的剂量范围内，药物的药代动力学参数不受性别影响。维替泊芬经过肝和血浆酯酶代谢终产物苯卟啉衍生双酸。NADPH依赖的肝酶系统（包括细胞色素P450同工酶）不参与维替泊芬代谢。药物通过粪便排泄，只有不到0.01%的药物剂量可以在尿液中发现。在一项，轻度肝功能不全患者中（入选时有两项肝功能指标异常）进行的研究中，AUC和C_{max}与对照组相比无明显差异，但是半衰期明显延长，大约增加20%。

【药物相互作用】目前尚无人体内维替泊芬药物相互作用的研究。维替泊芬主要以原形通过肝脏快速排泄。药物代谢局限于肝和血浆酯酶。细胞色素P450并不参与维替泊芬的代谢。根据维替泊芬的作用机理，许多药物联合使用会影响维替泊芬的疗效。比如：钙通道阻断剂，多黏菌素B或放疗会增加血管内皮细胞摄取维替泊芬。其他光敏剂（如四环素，磺胺类药物，吩噻嗪，磺脲类降血糖药，噻嗪类利尿药和灰黄霉素）可以增加皮肤光敏反应性。可以消除活性氧类或清除自由基的复合物，如二甲基亚砜，β-胡萝卜素，乙醇，甲酸盐和甘露醇可能会降低维替泊芬的活性。减少凝血、血管收缩和血小板聚集的药物如血栓素A_2抑制剂，也可以降低维替泊芬的疗效。

【药物过量】治疗眼药物和/或激光过量可以引起正常视网膜血管无灌注，引起持续严重的视力下降。药物过量可以延长患者对强光过敏的时间。建议一旦发生过量，需根据患者过量的程度成比例的延长避光时间。

【不良反应】维替泊芬治疗报道最多的不良事件为头疼，注射局部反应（包括药液外渗和皮疹）和视力障碍（视物模糊，视敏度下降，视野缺损）。大约10%～30%的患者出现这些事件。以下不良事件是维替泊芬治疗最多见的反应，出现率高于安慰剂组，出现于1%～10%的患者。眼部：睑缘炎、白内障、结膜炎/结膜充血、干眼、眼痒、伴或不伴视网膜下或玻璃体出血的严重视力丧失。全身：衰弱，背痛（主要在药物输注时）、发热、流感样综合征、光敏反应。心血管系统：房颤、高血压、外周血管异常、静脉曲张。皮肤：湿疹。消化系统：便秘、胃肠癌、恶心。血液/淋巴系统：贫血、白细胞计数减少、白细胞计数增加。肝脏：肝功能检验指标异常。代谢/营养：蛋白尿、肌酐升高。骨骼肌：关节痛、关节病、肌无力。神经系统：感觉减退、睡眠障碍、眩晕。呼吸系统：咳嗽、咽炎、肺炎。特殊感觉：白内障、听力障碍、复视、流泪障碍。泌尿系统：前列腺障碍。已报告1%～5%的患者在治疗后7天内出现严重视力下降，相当于视力下降4行或以上。某些患者视力能部分恢复。光敏反应通常出现在治疗后皮肤暴露于日光下，以皮肤灼伤为表现形式。维替泊芬治疗组背痛的发生率较高，主要出现在输注时。以下不良事件在临床研究中发生率较低（<1%）或出现在临床应用过程中，来源于自发报道，报道来源的人群样本量不详，不能获得精确的发生率。这些不良事件的分类是基于一些因素，如其严重程度、报道频率，与维替泊芬治疗可能有关或是以上的总和。眼部：视网膜脱离（非孔源性），视网膜或脉络膜血管无灌注。非眼部事件：输注时出现胸痛或肌肉骨骼疼痛、过敏反应（可以很严重）、晕厥、严重过敏反应伴呼吸困难和潮红以及血管-迷走神经反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用维替泊芬	化学药	HZ0005002

HY001967　胃蛋白酶

【外文名称】Pepsin

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】胃蛋白酶

【性状及组成】胃蛋白酶系自猪、羊或牛的胃黏膜中提取的蛋白水解酶。本品为白色或淡黄色的粉末，无霉败臭，有引湿性，水溶液显酸性反应。

【检查】干燥失重：取本品，在100℃干燥4小时，减失重量不得过5.0%。

药物药理信息

【药理毒理】本品能使蛋白质分解成胨及胨，不能进一步使之分解成氨基酸，在含有0.2%～0.4%盐酸时消化力最强。由于胃蛋白酶缺乏症常伴胃酸缺乏，故单用难奏效，多与稀盐酸同时服用，以增进食欲，促进消化。

【药物相互作用】

1．本品在中性、碱性及强酸性时，消化力较弱。在含有0.2%～0.4%盐酸（pH1.5～2.5）时，消化力最强。

2．本品水溶液遇鞣酸、没食子酸或多数重金属溶液即发生沉淀。

3．忌与碱性药物配伍，不宜与抗酸药物同服。

4．本品与硫糖铝相拮抗，不宜合用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
多酶片	化学药	HZ000784
复方含糖胃蛋白酶颗粒	化学药	HZ001202
复方胃蛋白酶颗粒	化学药	HZ001428
复方胃蛋白酶散	化学药	HZ001429
复方消化酶胶囊	化学药	HZ001438
复方消化酶胶囊（Ⅱ）	化学药	HZ001439
含糖胃蛋白酶	化学药	HZ001680

续表

制剂名称	类别	序号
胃蛋白酶颗粒	化学药	HZ003594
胃蛋白酶片	化学药	HZ003595
复方活脑舒胶囊	中成药	ZC001405

HY001968 胃膜素

【外文名称】Gastric Mucin

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（生化药品）·第1册

【性状及组成】本品系猪胃黏膜消化提取制得的黏蛋白。按干燥品计算，含总氮应不得大于10.0%，含还原性物质应不得少于20.0%。

本品为白色或微黄色的粉末或微小颗粒；略具蛋白胨的特臭，与水研磨即膨胀成黏稠的乳浊液。

药物药理信息

【药理毒理】本品在人体胃肠环境中被活化成附着性很强的活性成分，有极强的黏附作用，可直接作用于消化道内壁，在胃及十二指肠溃疡面形成一层保护膜，减少胃酸对它的刺激，利于溃疡面的愈合；另一方面有润滑作用，使进入消化道的食物易于在消化道内移行，有利于减少某些物质对溃疡面的刺激。

【药代动力学】本品在饭前半小时服用，在体内受胃蛋白酶的影响小，体内滞留时间一般在6~8小时，降解成小分子物质后经体内吸收转化，由肾脏排泄，未降解者经消化道排出体外。

【药物相互作用】本品可减弱甲氧氯普胺、多潘立酮的作用，不宜同用。胃膜素可减少其他药物吸收，故应避免与其他药同服。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方胃膜素胶囊	化学药	HZ001430
复方胃膜素片	化学药	HZ001431
胃膜素胶囊	化学药	HZ003596

HY001969 乌苯美司

【外文名称】Ubenimex

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】*N*-［（2*S*，3*R*）-4-苯基-3-氨基-2-羟基丁酰］-L-亮氨酸

【分子式】$C_{16}H_{24}N_2O_4$

【分子量】308.37

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，味苦。

本品在水或甲醇中微溶；在冰醋酸中易溶，在0.1mol/L盐酸溶液或0.1mol/L氢氧化钠溶液中溶解。

比旋度：取本品，精密称定，加0.1mol/L盐酸溶液溶解并定量稀释制成每1ml中约含10mg的溶液，依法测定，比旋度为-15.0°至-18.0°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗肿瘤药。

从链霉菌属的培养液中分离所得的化合物，可竞争性地抑制氨肽酶B及亮氨酸肽酶。增强T细胞的功能，使NK细胞的杀伤活力增强，且可使集落刺激因子合成增加而刺激骨髓细胞的再生及分化。本品能干扰肿瘤细胞的代谢，抑制肿瘤细胞增生，使肿瘤细胞凋亡，并激活人体细胞免疫功能，刺激细胞因子的生成和分泌，促进抗肿瘤效应细胞的产生和增殖。

【药代动力学】本品口服吸收良好、迅速，1小时后血药浓度达峰值。约有15%在肝中被代谢为羟基乌苯美司。80%~85%呈原形自尿排出。

【不良反应】剂量超过200mg/d，可使T细胞减少。偶有皮疹、瘙痒、头痛、面部水肿和一些消化道反应，如恶心、呕吐、腹泻、软便。个别可出现一过性轻度AST升高。一般在口服过程中或停药后消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乌苯美司胶囊	化学药	HZ003597

HY001970 乌洛托品

【其他名称】Hexamethylenamine、Hexamine、环六亚甲基四胺、六甲烯胺、优洛托品（Urotropine）

【外文名称】Methenamine

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】六亚甲基四胺

【分子式】$C_6H_{12}N_4$

【分子量】140.19

【性状及组成】本品为无色、有光泽的结晶或白色结晶性粉末；几乎无臭，味初甜，后苦；遇火能

燃烧，发生无烟的火焰；水溶液显碱性反应。

本品在水中易溶，在乙醇或三氯甲烷中溶解，在乙醚中微溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：消毒防腐药。

本品口服吸收后，在酸性尿中缓慢分解成甲醛和氨，甲醛有杀菌作用。氨易使尿液碱化，服用时需加服酸化尿液药物，如氯化氨。用于对磺胺药及抗生素过敏，或产生耐药性的轻度尿路感染，如肾盂肾炎、膀胱炎及尿道炎等；外用可治疗腋臭、汗脚、体癣、脚癣等。

【药代动力学】本品口服后经胃肠道吸收，以原形由肾脏排出，遇酸性尿液分解释出甲醛。

【药物相互作用】碱性药物可使本药物吸收减少，应避免同服。

【不良反应】部分病人可引起膀胱刺激症状及血尿，停药后可缓解。本品对胃有刺激性，服用时间过长有时可能产生尿频、血尿等副作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乌洛托品片	化学药	HZ003598
乌洛托品溶液	化学药	HZ003599

HY001971　乌司他丁

【外文名称】Ulinastain

【性状及组成】本品系从人尿提取精制的糖蛋白，属蛋白酶抑制剂。

药物药理信息

【药理毒理】本品具有抑制胰蛋白酶等各种胰酶活性的作用，常用于胰腺炎的治疗。此外，本品尚有稳定溶酶体膜、抑制溶酶体酶的释放和抑制心肌抑制因子产生等作用，故而可用于急性循环衰竭的抢救治疗当中。

【药代动力学】健康正常男性30万单位/10ml静脉注射给药后，3小时内血药浓度直线下降，清除半衰期为40分钟；给药后6小时给药量的24%从尿中排泄。

【药物相互作用】本品避免与加贝酯或球蛋白制剂混合使用。

【不良反应】

1．血液系统：偶见白细胞减少或嗜酸粒细胞增多。

2．消化系统：偶见恶心、呕吐、腹泻，偶有AST、ALT上升。

3．注射部位：偶见血管痛、发红、瘙痒感、皮疹等。

4．偶见过敏，出现过敏症状应立即停药，并适当处理。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用乌司他丁	化学药	HZ005003

HY001972　无水硫酸钙

【外文名称】Anhydrous Calcium Sulfate

【分子式】$CaSO_4$

【分子量】136.14

【性状及组成】本品为白色或类白色，无臭、无味粉末或颗粒。

药物药理信息

【药理毒理】无水硫酸钙具有吸湿性，用作干燥剂。吸水能引起贮藏时片剂变硬而不崩解。口服片剂、胶囊剂或散剂的处方中不推荐使用本品。

医疗上，硫酸钙常用于牙科和面部手术。

【药物相互作用】有水分存在时，钙盐可能与有机胺、氨基酸、多肽和蛋白质有配伍禁忌，并可能形成复合物。钙盐将影响四环素类抗生素的生物利用度。据推测，硫酸钙可能与吲哚美辛、阿司匹林、门冬酰胺、头孢氨苄和红霉素有配伍禁忌，因为这些物质与其他钙盐有配伍禁忌。

高温状态下，硫酸钙可以与磷或铝粉发生剧烈反应，也能与重氮甲烷发生剧烈反应。

【不良反应】由于钙盐中的钙由消化道吸收受限，即使口服大剂量也不能产生高钙血症。

钙盐可溶于支气管分泌液中。纯净的盐不会引起尘肺病。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
障翳散	中成药	ZC007212

HY001973　无水硫酸钠

【外文名称】Anhydrous Sodium Sulfate

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（二部）·第5册

药物理化信息

【化学名】硫酸钠

【分子式】Na_2SO_4

【分子量】142.05

【性状及组成】本品为白色粉末，无臭，味苦、咸，有引湿性。

本品在水中易溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品不易为肠道吸收，易溶于水，可在肠内形成高渗盐溶液，从而保持水分，扩张肠道，增强蠕动，且同时还具有化学刺激作用，但不损害肠黏膜。小鼠一次灌胃无水硫酸钠的最大耐受量为7.2g/kg，说明本品是安全的。

【药代动力学】本品在肠道内不吸收，服用后随粪便排除。

【不良反应】本品口服尚未见不良反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方聚乙二醇电解质散	化学药	HZ001246
无水硫酸钠肠溶胶囊	化学药	HZ003601

HY001974 无水葡萄糖

【外文名称】Anhydrous Glucose

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】D-（+）-吡喃葡萄糖

【分子式】$C_6H_{12}O_6$

【分子量】180.16

【性状及组成】本品为无色结晶或白色结晶性粉末，无臭、味甜。

本品在水中易溶，在乙醇中微溶。

比旋度：取本品约10g，精密称定，置50ml量瓶中，加水适量与氨试液2.0ml溶解后，用水稀释至刻度，摇匀，放置60分钟，在25℃时依法测定，比旋度为+52.6°至+53.2°。

药物药理信息

【药理毒理】营养药。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
口服补液盐溶液	化学药	HZ002137
脂肪乳氨基酸葡萄糖注射液	化学药	HZ004653

HY001975 无水七叶素

【外文名称】Aescin

【性状及组成】马栗种子提取物是一种植物制剂，源自一种欧洲植物——马栗树。

药物药理信息

【药理毒理】马栗种子提取物多重药理机制：

1. 抗炎、抗渗出、抗肿胀
2. 调节前列腺素的合成
3. 抑制蛋白酶作用
4. 清除自由基
5. 降低毛细血管通透性
6. 改善静脉功能，促进组织液回流
7. 增加静脉张力，提高静脉流速，增加淋巴回流

耐受性良好，对胚胎及生殖发育无影响。无三致作用。

【药代动力学】口服马栗种子提取物缓释片1片后，达到最大血药浓度时间是1.87小时，最大血药浓度为9.41ng/ml，半衰期为17.8小时，由于采取缓释剂型，药物按一定时间释放，加大了胃肠吸收率，减少了胃肠刺激，有效最大血药浓度延长了药物半衰期，延长了有效血药浓度的持续时间，从而减少了服用次数和剂量，方便经济。

【药物相互作用】国外长期应用观察，无药物相互作用。

【不良反应】经国外4113例慢性静脉功能不全（CVI）患者应用，报道不良反应发生率仅为0.4%。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
马栗种子提取物缓释片	化学药	HZ002605

HY001976 无水亚硫酸钠

【其他名称】硫氧粉

【外文名称】Anhydrous Sodium Sulfite

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】亚硫酸钠

【分子式】Na_2SO_3

【分子量】126.04

【性状及组成】本品为白色结晶或粉末，无臭。

本品在水中易溶，在乙醇中极微溶解，在乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料。

本品在药剂中用作抗氧剂。常用于液体制剂。常用浓度为0.1%～0.5%。

【药物相互作用】本品水溶液显弱碱性，不宜与

酸性药物配伍，通常用作碱性药物的抗氧剂。

【不良反应】本品无毒，一般认为是安全的。人一日摄入量以 SO_2 计可达 700mg/kg 体重。但大量摄入对胃有刺激，可产生腹痛、腹泻、循环障碍、中枢神经系统抑制。本品有过敏性休克和引起急性气喘发作、意识丧失的报道。哮喘病人和过敏体质者慎用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方甘草酸铵注射液	化学药	HZ001178

HY001977　五氟利多

【其他名称】Semap

【外文名称】Penfluridol

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】1－［4，4－双（4－氟苯基）丁基］－4－［4－氯－3－（三氟甲基）苯基］－4－哌啶醇

【分子式】$C_{28}H_{27}ClF_5NO$

【分子量】523.97

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，无味。本品在甲醇、乙醇、丙醇或三氯甲烷中易溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 105～108℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗精神病药。

本品为口服长效抗精神病药。抗精神病作用与其阻断脑内多巴胺受体有关，还可阻断神经系统 α－肾上腺素受体，抗精神病作用强而持久，口服 1 次可维持数天至 1 周，亦有镇吐作用，但镇静作用较弱，对心血管功能影响较轻。

【药代动力学】口服吸收缓慢，8～16 小时血药浓度达峰值，7 日后仍可自血中检出。吸收后贮存于脂肪组织，缓慢释放，逐渐透入脑组织。大部分以原形从粪便中排出，少量经尿排出。

【药物相互作用】本品与乙醇或其他中枢神经系统抑制药合用，中枢抑制作用增强。本品与抗高血压药合用，有增加直立性低血压的危险。

【药物过量】

1．中毒症状：主要毒性反应为心肌受损及干扰心内传导，出现严重心律不齐、胸闷、气憋等。

2．处理：本品作用时间长，超量中毒时应特别注意对症治疗及支持疗法，无特殊解毒药。

【不良反应】主要为锥体外系反应，如静坐不能、急性肌张力障碍和类帕金森病。长期大量使用可发生迟发性运动障碍。亦可发生嗜睡、乏力、口干、月经失调、溢乳、焦虑或抑郁反应等。偶见过敏性皮疹、心电图异常、粒细胞减少及恶性综合征。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
五氟利多片	化学药	HZ003602

HY001978　五水头孢唑林钠

【外文名称】Cefazolin Sodium Pentahydrate

药物理化信息

【化学名】(6*R*,7*R*)－3－［［（5－甲基－1,3,4－噻二唑－2－基）硫］甲基］－7－［（1H－四唑－1－基）乙酰氨基］－8－氧代－5－硫杂－1－氮杂双环［4.2.0］辛－2－烯－2－甲酸钠盐五水合物

【分子式】$C_{14}H_{13}N_8NaO_4S_3 \cdot 5H_2O$

【分子量】566.57

药物药理信息

【药理毒理】本品为第一代头孢菌素，抗菌谱广。作用机制为与细胞膜上的青霉素结合蛋白结合，使转肽酶酰化，细菌生长受到抑制，以至溶解死亡。除肠球菌属、耐甲氧西林葡萄球菌属外，本品对其他革兰氏阳性球菌均有良好抗菌活性，肺炎链球菌和溶血性链球菌对本品高度敏感。白喉杆菌、炭疽杆菌、李斯特菌和梭状芽孢杆菌对本品也甚敏感。本品对部分大肠埃希菌、奇异变形杆菌和肺炎克雷伯菌具有良好抗菌活性，但对金黄色葡萄球菌的抗菌作用较差。伤寒杆菌、志贺菌属和奈瑟菌属对本品敏感，其他肠杆菌科细菌、不动杆菌和铜绿假单胞菌耐药。产酶淋球菌对本品耐药，流感嗜血杆菌仅中度敏感。革兰阳性厌氧菌和某些革兰阴性厌氧菌对本品多敏感。脆弱拟杆菌耐药。

【药代动力学】肌内注射本品 500mg 后，经 1～2 小时达血药峰浓度［C_{max} 38mg/L（32～42mg/L）］，6 小时血药浓度尚可测得 7mg/L。20 分钟内静脉滴注本品 0.5g，血药峰浓度为 118mg/L，有效浓度维持 8 小时。本品难以透过血－脑脊液屏障，脑脊液中不能测出药物浓度。头孢唑林在胸水、腹水、心包液和滑囊液中可达较高浓度。炎症渗出液中的药物浓度基本与血清浓度相等，胆汁中浓度等于或略超过同期血药浓度。胎儿血药浓度为母体血药浓度的 70%～90%，乳汁中含量低。本品蛋白结合率为 74%～86%。正常成人的血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为 1.5～2 小时，老年人中可延长至 2.5 小时。肾衰竭

患者的 $t_{1/2\beta}$可延长，内生肌酐清除率为 12～17ml/min 和低于 5ml/min 时分别为 12 小时和 57 小时。出生 1 周内新生儿的 $t_{1/2\beta}$为 4.5～5 小时。本品在体内几乎不代谢；原形药通过肾小球滤过，部分通过肾小管分泌自尿中排出。24 小时内可排出给药量的 80%～90%。丙磺舒可使血药浓度约提高 30%，有效血药浓度时间延长。血液透析 6 小时后血药浓度减少 40%～50%，腹膜透析一般不能清除本品。

【药物相互作用】

1. 本品与下列药物有配伍禁忌：硫酸阿米卡星、庆大霉素、卡那霉素、妥布霉素、新霉素、盐酸金霉素、盐酸四环素、盐酸土霉素、黏菌素甲磺酸钠、硫酸多黏菌素 B、葡萄糖酸红霉素、乳糖酸红霉素、林可霉素、磺胺异噁唑、氨茶碱、可溶性巴比妥类、氯化钙、葡萄糖酸钙、盐酸苯海拉明和其他抗组胺药、利多卡因、去甲肾上腺素、间羟胺、哌甲酯、琥珀胆碱等。偶亦可能与下列药品发生配伍禁忌：青霉素、甲氧西林、琥珀酸氢化可的松钠、苯妥英钠、丙氯拉嗪、维生素 B 族和维生素 C、水解蛋白。

2. 呋塞米、依他尼酸、布美他尼等强利尿药，卡氮芥、链佐星等抗肿瘤药以及氨基糖苷类抗生素与本品合用有增加肾毒性的可能。

3. 棒酸等 β－内酰胺酶抑制剂可增强本品对某些因产生 β－内酰胺酶而对之耐药的革兰阴性杆菌的抗菌活性。

【药物过量】本品无特效拮抗药，药物过量时主要给予对症治疗和大量饮水及补液等。

【不良反应】应用头孢唑林的不良反应发生率低，静脉注射发生的血栓性静脉炎和肌内注射区疼痛均较头孢噻吩少而轻。药疹发生率为 1.1%，嗜酸性粒细胞增高的发生率为 1.7%，单独以药物热为表现的过敏反应仅偶有报告。本品在实验动物中可产生肾小管损害。本品与氨基糖苷类抗生素合用是否能增加后者的肾毒性尚不能肯定。临床上本品无肝损害现象，但个别病人可出现暂时性血清氨基转移酶、碱性磷酸酶升高。肾功能减退病人应用高剂量（每日 12g）的头孢唑林时可出现脑病反应。白色念珠菌二重感染偶见。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用五水头孢唑林钠	化学药	HZ005004

HY001979 五肽胃泌素

【外文名称】Pentagastrin

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】*N*－［(1,1－二甲乙氧基）羰基］－β－丙氨酰－L－色氨酰－L－甲硫氨酰－L－门冬氨酰－L－苯丙酰胺

【分子式】$C_{37}H_{49}N_7O_9S$

【分子量】767.90

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末，无臭。本品在二甲基甲酰胺中溶解，在乙醇中微溶，在水中不溶，在稀氨溶液中溶解。

比旋度：取本品，精密称定，加二甲基甲酰胺溶解并定量稀释成每 1ml 中含 10mg 的溶液，依法测定。比旋度为－25.0°至－29.0°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：诊断用药。

本品能促进胃酸、胃蛋白酶及内因子的分泌，其促胃酸分泌作用相当于内源性胃泌素的 1/4，但强于磷酸组织胺和盐酸氨乙吡唑，作用可持续 10～40 分钟。

【不良反应】本品可引起恶心、潮红、头痛、眩晕、胃肠痉挛和低血压等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
五肽胃泌素注射液	化学药	HZ003603

HY001980 五味子乙素

【外文名称】γ－Schisandrin

药物药理信息

【药理毒理】五味子乙素与自由基相遇后很容易失去电子，同时转化为对人体无害的中性物质，从而中断自由基的链锁氧化反应。

研究表明，五味子乙素对内源氧自由基的清除作用大于维生素 E；同时五味子乙素可以激活内源谷胱甘肽、超氧化物歧化酶、过氧化氢酶的活性从而达到清除自由基的作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肝福颗粒	中成药	ZC001683

HY001981 戊巴比妥钠

【外文名称】Pentobarbitol Sodium

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

【依据标准】卫生部颁药品标准（二部）·第5册

药物理化信息

【化学名】5－乙基－5－（1－甲基丁基）－2,4,6（1H,3H,5H）－嘧啶三酮一钠盐

或5－乙基－5－（1－甲基丁基）巴比土酸钠

【分子式】$C_{11}H_{17}N_2NaO_3$

【分子量】248.26

【性状及组成】本品为白色结晶性颗粒或白色粉末；无臭，味微苦；有引湿性；水溶液遇酚酞指示液显碱性反应。

本品在水中极易溶解，在乙醇中易溶，在乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品对中枢神经系统有广泛抑制作用，随用量而产生镇静、催眠和抗惊厥效应，大剂量时则产生麻醉作用，作用机制认为主要与阻断脑干网状结构上行激活系统有关。

【药代动力学】本品口服易吸收，主要在肝脏代谢后经肾脏排泄，半衰期（$t_{1/2}$）为21～42小时。生物利用度100%，总清除率1.5L/h，表观分布容积（V_d）70L，蛋白结合率55%。

【药物相互作用】

1．本品与乙醇、全麻药、中枢性抑制药或单胺氧化酶抑制药等合用时，中枢抑制作用增强。

2．本品与口服抗凝药合用时，可降低后者的效应。

3．本品与口服避孕药或雌激素合用，可降低避孕药的可靠性。

4．本品与皮质激素、洋地黄类、土霉素或三环类抗抑郁药合用时，可降低这些药的效应。

5．本品与苯妥英钠合用，苯妥英钠的代谢加快，效应降低。

6．本品与卡马西平和琥珀酰胺类药合用时可使这二类药物的清除半衰期缩短而血药浓度降低。

7．本品与奎尼丁合用时，可增加奎尼丁的代谢而减弱其作用。

【药物过量】

1．中毒症状

（1）中枢神经系统：轻度中毒时，有头胀、眩晕、头痛、语言迟钝、动作不协调、嗜睡、感觉障碍、瞳孔缩小等。重度中毒可有一段兴奋期，病人可发生狂躁、谵妄、幻觉、惊厥、瞳孔散大（有时缩小）、肌肉松弛，角膜、咽、腱反射消失，昏迷逐渐加深。

（2）呼吸系统：轻度中毒时，一般呼吸正常或稍缓慢。重度中毒时，呼吸减慢、变浅不规则，或呈潮式呼吸，严重时可引起呼吸衰竭。

（3）循环系统：皮肤发绀、湿冷、脉搏快而微弱，少尿或无尿。血压下降甚至休克。

（4）黄疸及肝功能损害。

2．处理

（1）急性中毒者人工呼吸、给氧等支持治疗。

（2）服药5～6小时内的中毒者立即洗胃。一般可用1:5000高锰酸钾溶液，将胃内药物尽量洗出；洗胃后可留置硫酸钠溶液于胃内（成人20～30g），以促进药物排泄。

（3）应用利尿剂，加速毒物排泄，一般用20%甘露醇注射液或25%山梨醇注射液200ml静脉注射或快速滴注，3～4小时后可重复使用。但须注意水、电解质平衡。

（4）5%碳酸氢钠注射液静脉滴注以碱化尿液，加速排泄。

【不良反应】常有倦睡、眩晕、头痛、乏力、精神不振等延续效应。偶见皮疹、剥脱性皮炎、运动功能障碍、中毒性肝炎、黄疸等。也可见巨幼红细胞贫血，关节疼痛，骨软化。久用可产生耐受性与依赖性，突然停药可引起戒断症状，应逐渐减量停药。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
戊巴比妥钠片	化学药	HZ003612

HY001982　戊四氮

【其他名称】Corazole

【外文名称】Pentetrazole

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（二部）·第5册

药物理化信息

【化学名】6，7，8，9－四氢－5*H*－四唑并氮杂䓬

【分子式】$C_6H_{10}N_4$

【分子量】138.18

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，味微辛苦，水溶液显中性反应。

本品在水或乙醇中易溶，在乙醚或三氯甲烷中溶解。

熔点：本品的熔点为58～61℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品能直接兴奋呼吸中枢及血管运动中枢，使呼吸增加，血压微升。

【药代动力学】本品在肝内代谢，随尿排出。

【药物过量】

1. 中毒症状：狂躁、焦虑不安、亦有呕吐，反射增加，以至出现阵挛性及肌强直性惊厥。惊厥后出现昏迷、高热和肺水肿，最终中枢性呼吸衰竭。

2. 处理：洗胃、输液、利尿，以加快药物排泄，并依病情给予对症治疗和支持疗法。

3. 极量：口服一次 0.5g。

【不良反应】剂量较大时能引起反射亢进、惊厥。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
戊四氮注射液	化学药	HZ003613

HY001983 戊四硝酯

【外文名称】Pentaerithrityl Tetranitrate

药物理化信息

【化学名】四硝酸索戊四硝酯

【分子式】$C_5H_8N_4O_{12}$

【分子量】316.14

药物药理信息

【药理毒理】本品为血管扩张药，药理作用与硝酸甘油类似，但作用缓慢持久。硝酸甘油释放氧化氮（NO），NO 与内皮舒张因子相同，激活鸟苷酸环化酶，使平滑肌和其他组织内的环鸟苷酸（cGMP）增多，导致肌球蛋白轻链去磷酸化，调节平滑肌收缩状态，引起血管扩张。

硝酸甘油扩张动静脉血管床，以扩张静脉为主，其作用强度呈剂量相关性。外周静脉扩张，使血液潴留在外周，回心血量减少，左室舒张末压（前负荷）降低。扩张动脉使外周阻力（后负荷）降低。动静脉扩张使心肌耗氧量减少，缓解心绞痛。对心外膜冠状动脉分支也有扩张作用。

【药代动力学】本品一般在服药后 0.5～1.5 小时起作用，可维持 3～5 小时。

【药物相互作用】

1. 与其他降压药或血管扩张药合用可增强硝酸盐的降压作用。

2. 与枸橼酸西地那非（万艾可）合用加强有机硝酸盐的降压作用。

3. 本品为长效硝酸盐可降低硝酸甘油舌下用药的治疗作用。

4. 与乙酰胆碱、组胺及拟交感胺类药合用时，疗效可能减弱。

【药物过量】过量可引起严重低血压、心动过速、心动过缓、传导阻滞、心悸、循环衰竭导致死亡、晕厥、持续搏动性头痛、眩晕、视力障碍、颅内压增高、瘫痪和昏迷并抽搐、脸红与出汗、恶心与和呕吐、腹部绞痛与腹泻、呼吸困难与高铁血红蛋白血症。

如发生本品严重毒性反应，应给予血浆扩容剂及适当的电解质溶液以维持循环功能，如发生高铁血红蛋白血症，应静脉注射亚甲蓝。

【不良反应】

1. 常见的有：由体位性低血压引起的眩晕、头晕、昏厥、面颊和颈部潮红；严重时可出现持续的头痛、恶心、呕吐、心动过速、烦躁；皮疹、视力模糊，口干则少见。

2. 逾量时的临床表现，按发生率的多少，依次为：口唇指甲青紫、眩晕欲倒、头胀、气短、高度乏力，心跳快而弱、发热、甚至抽搐。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
戊四硝酯片	化学药	HZ003614

HY001984 戊四硝酯粉

【外文名称】Powdered Pentaerithrityl Tetranitrate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

【性状及组成】本品为四硝酸季戊四醇酯 1 份、乳糖 3 份与淀粉 1 份的混合物。

本品为白色粉末，无臭。

药物药理信息

【药理毒理】血管扩张药。

HY001985 戊酸雌二醇

【外文名称】Estradiol Valerate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】3－羟基雌甾－1，3，5（10）－三烯－17β－醇 17－戊酸酯

【分子式】$C_{23}H_{32}O_3$

【分子量】356.51

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭。本品在乙醇、丙酮或三氯甲烷中易溶，在植物油中微溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 145～150℃。

比旋度：取本品，精密称定，加二氧六环溶解

并定量稀释制成每 1ml 中含 10mg 的溶液，在 25℃时，依法测定，比旋度应为 +41°至 +47°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：雌激素类药。

本品能促使细胞合成 DNA、RNA 的相应组织内各种不同的蛋白质。雌激素可通过减少下丘脑促性腺激素释放激素（GnRH）的释放，导致卵泡刺激素（FSH）和黄体生成激素（LH）从垂体的释放减少，从而抑制排卵。男性 LH 分泌减少使睾丸分泌睾酮降低。

【药代动力学】本品在注射局部吸收缓慢，一次注射可维持数周。在血浆中与性激素结合球蛋白特异性结合，也可与血浆白蛋白非特异性结合。在血浆中以硫酸酯形式存在。雌二醇剂量的 50% ~ 80% 在给药后 4 ~ 6 天从尿排出。

【药物相互作用】

1. 与抗凝药同用时，雌激素可降低抗凝效应，必须同时用，应调整抗凝药用量。

2. 与卡马西平、苯巴比妥、苯妥英钠、扑米酮、利福平等同时使用，可减低雌激素的效应，这是由于诱导了肝微粒体酶，增快了雌激素的代谢所致。

3. 与三环类抗抑郁药同时使用，大量的雌激素可增强抗抑郁药的不良反应，同时降低其应有的效应。

4. 与抗高血压药同时用，可减低抗高血压的作用。

5. 降低他莫昔芬的治疗效果。

6. 增加钙剂的吸收。

【不良反应】可有血栓症、皮肤过敏、诱发精神障碍复发、高血压、钠潴留、阴道不规则流血、乳房胀痛、头痛、注射部位红肿、疼痛等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方庚酸炔诺酮注射液	化学药	HZ001194
复方己酸羟孕酮注射液	化学药	HZ001219
复方戊酸雌二醇片	化学药	HZ001435
戊酸雌二醇片	化学药	HZ003615
戊酸雌二醇片雌二醇环丙孕酮片复合包装	化学药	HZ003616
戊酸雌二醇贴片	化学药	HZ003617
戊酸雌二醇注射液	化学药	HZ003618

HY001986　西苯唑啉

【外文名称】Cibenzoline

药物药理信息

【药理毒理】本品为咪唑类衍生物，具有抗心律失常作用，既具Ⅰa类抗心律失常药的作用，又有Ⅲ类和Ⅴ类者的特点，即抑制 Na^+ 通道，减少 Na^+ 内流，降低 0 相最大上升速率和幅度，减慢传导速度；抑制钾通道，减少 K^+ 外流，延长动作电位过时程；抑制 Ca^{2+} 通道，减少 Ca^{2+} 内流，减弱心肌收缩力。

本品常用于防治室性或室上性心律失常，尤多在新发生的心肌梗死时应用。也用于心房颤动、心房扑动恢复节律后的维持治疗。

【药代动力学】本品口服吸收良好，生物利用度大于 90%。服药后 1 小时血药浓度达峰值。与血浆蛋白的结合率约 60%。约 60% 以原形药物自尿排泄。$t_{1/2}$为 7 小时。有效血药浓度 0.2 ~ 0.4mg/L，超过 1.8mg/L 则可能中毒。主要以原形经肾排泄，排泄较快，24h 可完全排泄，$t_{1/2}$为 7 ~ 15 小时。

【不良反应】常见的不良反应有消化道反应、头晕、视力模糊及肝功障碍。长期口服可引起低血糖、低血压。

HY001987　西吡氯铵

【外文名称】Cetylpyridinium Chloride

药物理化信息

【化学名】1 - 氯化十六烷基吡啶的一水合物

【分子式】$C_{21}H_{38}ClN \cdot H_2O$

【分子量】358.01

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理：西吡氯铵为阳离子季铵化合物，作为表面活性剂，主要通过降低表面张力而抑制和杀灭细菌。体外试验结果表明本品对多种口腔致病和非致病菌有抑制和杀灭作用，包括白色念珠菌。含漱后能减少或抑制牙菌斑的形成，具有保持口腔清洁、清除口腔异味的作用。

2. 毒理：动物试验结果表明本品对口腔黏膜无明显刺激性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方西吡氯铵含片	化学药	HZ001436
西吡氯铵含片	化学药	HZ003619
西吡氯铵含漱液	化学药	HZ003620

HY001988　西地磷酸苯丙哌林

【外文名称】Cydbenproperine Phosphate

药物理化信息

【化学名】1－［2－（2－苄基苯氧基）－1－甲基乙基］哌啶磷酸盐

药物药理信息

【药理毒理】本品为非成瘾性镇咳药，能抑制咳嗽中枢，也能抑制肺及胸膜牵张感受器引起的肺－迷走神经反射，且能舒张支气管平滑肌。即兼有中枢性和末梢性双重镇咳作用机制。

【药代动力学】本品口服易吸收，服药后10～20分钟即生效，镇咳作用可维持4～7小时。

【不良反应】服药后可出现一过性口、咽部发麻感觉。此外尚有乏力、头晕、上腹不适及皮疹等不良反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
西地磷酸苯丙哌林泡腾片	化学药	HZ003622

HY001989 西黄蓍胶

【外文名称】Gummi Tragacanthae

【性状及组成】本品为豆科植物西黄蓍胶树的干枝被割伤后渗出的树胶，经干燥而得。

本品为白色或黄白色粉末或半透明薄片，遇水膨胀成有粘性胶状物。本品黏度在pH5时最大，低于pH4.5或高于pH6黏度则显著下降。

药物药理信息

【药理毒理】本品为润滑剂、助悬剂、黏合剂及浮化剂等。其黏性较大，但乳化力较差，故常与阿拉伯胶配合应用。

【药物相互作用】勿与碱性溶液或碱式硝酸铋配伍。西黄蓍胶溶胶溶液加乙醇超过35%时，即析出沉淀。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方巴旦仁颗粒	民族药	MZ000154
降糖孜亚比提片	民族药	MZ000242
解毒苏甫皮赛尔塔尼胶囊	民族药	MZ000248
玛木然止泻胶囊	民族药	MZ000348
尿通卡克乃其片	民族药	MZ000370
热感赛比斯坦颗粒	民族药	MZ000448
止血开日瓦片	民族药	MZ000752

HY001990 西卡宁

【其他名称】癣可宁

【外文名称】Siccanin

药物药理信息

【药理毒理】本品对毛发癣菌、表皮癣菌和小孢子霉菌有较强抑制作用，抗真菌作用与灰黄霉素的相似。1%软膏或酊剂局部应用治疗皮肤癣病。

【不良反应】偶有局部刺激。

HY001991 西拉普利

【外文名称】Gilazapril

药物理化信息

【化学名】9（*S*）［［1（*S*）－（乙氧羰基）－3－苯丙基］氨基］－八氢－10－氧代－6*H*－哒嗪并［1,2］二氮䓬－1（S）羧酸－水合物

药物药理信息

【药理毒理】本品为血管紧张素转换酶抑制剂，口服吸收转化为药理活性的西拉普利拉，它使血管紧张素Ⅰ不能转换为血管紧张素Ⅱ，并使血浆肾素活性增高、醛固酮分泌减少，从而使血管舒张、血管阻力降低而产生降压作用。

【药代动力学】西拉普利能有效被吸收并迅速地被转化为具有药理活性的西拉普利拉。进食后服用会轻微减慢和降低其吸收率，但并不影响疗效。根据尿液回收资料分析，口服抑平舒后的西拉普利拉的生物利用度约为60%。用药后两小时内达到血药峰浓度，浓度与剂量有直接关系。

一日一次服用后，西拉普利拉的有效半衰期为9小时，并以原形从肾脏排除。肾功能不全病人，当肌酐清除率降低时，药物清除率也随之降低，故这类病人的西拉普利拉的血药浓度比肾功能正常的病人要高些。肾功能完全丧失者，肾脏失去清除能力，但可通过血液透析使西拉普利和西拉普利拉的血药浓度减低至一定范围之内。

肾功能正常的老年病人，其西拉普利拉血药浓度要比年轻病人高40%，药物清除率要较之低20%。中度到重度肝硬化病人的药代动力学改变和老年病人相似。

慢性心力衰竭病人的西拉普利拉清除率与肌酐清除率密切相关。所以剂量必需按照病人的肾功能进行调整（见特殊用药指导）。

【药物相互作用】

1．本品已与地高辛、硝酸盐类、呋塞米、噻唑类，口服抗糖尿病药物以及H_2受体阻断剂等合用过，未见有地高辛浓度增高及其他具有临床意义的药物相互作用。但当本品与其他降压药物合用时可能会引起相加作用。

2．本品与潴钾利尿剂合用，可引起血钾增高，

特别是在肾功能不全者。

3. 和其他血管紧张素转换酶抑制剂一样，与非甾体抗炎药物合用时，可能会降低本品的降压作用。在使用非甾体抗炎药物之前使用本品的病人则不发生以上情况。

【不良反应】最常报道的不良反应是头痛与头晕。其他发生率少于2%的不良反应包括乏力、低血压、消化不良、恶心、皮疹和干咳。大多数不良反应是短暂性的，轻度或中度，无需中止用药。服用慢性心力衰竭病人最常报道的不良反应是头晕及咳嗽。

特异性反应：与其他血管紧张素转换酶抑制剂一样，罕有血管神经性水肿的报道。但由于此症可能伴有喉头水肿，故一旦波及面部、口唇、舌、声带和（或）喉头时，必须立刻停用并进行适当治疗。

某些病人中有血红蛋白、红细胞压积和（或）白细胞计数降低的报告，但尚无病例证明与本品有明确关系。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
西拉普利片	化学药	HZ003623

HY001992　西罗莫司

【外文名称】Sirolimus

药物药理信息

【药理毒理】西罗莫司通过与其他免疫抑制剂截然不同的作用机制，抑制抗原和细胞因子（白介素IL－2，IL－4和IL－15）激发的T淋巴细胞的活化和增殖。西罗莫司亦抑制抗体的产生。在细胞中，西罗莫司与亲免蛋白，即FK结合蛋白－12（FKBP－12）结合，生成一个免疫抑制复合物。此西罗莫司FKBP－12复合物对钙神经素的活性无影响。此复合物与哺乳动物的西罗莫司靶分子（mTOR，一种关键的调节激酶）结合，并抑制其活性。此种抑制阻遏了细胞因子驱动的T细胞的增殖，即抑制细胞周期中G1期向S期的发展。实验模型研究表明，西罗莫司可延长小鼠、大鼠、猪和/或灵长目动物的同种异体移植物（肾、心、皮肤、胰岛、小肠、胰、十二指肠和骨髓）的存活期。西罗莫司可逆转大鼠的心和肾同种异体移植的急性排斥反应，并延长预敏感化大鼠的移植器官存活期。在一些研究中，西罗莫司的免疫抑制作用可持续至停止治疗后6个月。此种免疫耐受性作用是针对同种抗原的。在自体免疫疾病的啮齿类动物的模型中，西罗莫司抑制与下列疾病有关的免疫介导反应：系统性红斑狼疮、胶原蛋白引发的关节炎、自体免疫性Ⅰ型糖尿病、自体免疫性心肌炎、实验性过敏性脑脊髓炎、移植物抗宿主疾病和自体免疫性眼色素层视网膜炎。致癌、致突变和对生育能力的损伤：在体外微生物回复突变试验，中国仓鼠卵巢细胞染色体畸变试验，小鼠淋巴组织瘤细胞正向突变试验或体内小鼠微核试验中，西罗莫司均无基因毒性。在雌性小鼠和雌雄性大鼠中进行了致癌试验，但未在雄性小鼠中完成致癌试验。在为期86周的雌性小鼠试验中，剂量设置为0，12.5，25和50/6mg/（kg·d）［在第31周，因出现继发于免疫抑制的感染，而将剂量由50mg/（kg·d）降至6mg/（kg·d）］。与对照组相比，所有剂量组（按体表面积校正约为临床剂量的6～135倍）中恶性淋巴组织瘤均有统计学意义的显著增加。在为期104周的大鼠试验中，剂量设置分别为0，0.05，0.1和0.2mg/（kg·d），在0.2mg/（kg·d）组（按体表面积校正约为临床剂量的0.4～1倍）中，睾丸腺瘤的发生率有统计学意义的显著增加。雌性大鼠，服用西罗莫司的最高剂量达0.5mg/kg（按体表面积校正约为临床剂量的1～3倍），对其生育能力无影响。雄性大鼠，2mg/kg剂量组（为按体表面积校正的临床剂量的4～11倍）的生育率与对照组无差别。大鼠0.65mg/kg（按体表面积校正约为临床剂量的1～3倍）及以上各剂量组，猴的0.1mg/kg（按体表面积校正约为临床剂量的0.4～1倍）及以上各剂量组，出现睾丸重量下降和/或组织学损伤（如小管萎缩和小管巨大细胞）。雄性大鼠服用西罗莫司6mg/kg（按体表面积校正约为临床剂量的12～32倍），连续13周后，其精子数量减少，但在停药后3个月恢复。胚胎毒性：在大鼠0.1mg/kg及以上各剂量组（按体表面积校正约为临床剂量的0.2～0.5倍），西罗莫司对胚胎和胎儿有毒性，表现为死胎和胎儿体重减轻（同时伴有骨骼骨化延迟）。但无畸胎出现。合并使用环孢素的鼠的胚胎/胎儿死亡率高于单用本药。雌性毒性剂量0.05mg/kg的本药（按体表面积校正约为临床剂量的0.3～0.8倍）对兔的发育无影响。小鼠和大鼠的急性口服LD_{50}超过800mg/kg。

【药代动力学】在健康志愿者、儿童透析患者、肝功能损伤患者和肾移植患者中测定了口服后的西罗莫司药代动力学。

1. 吸收：西罗莫司口服后，迅速吸收。在健康志愿者中，单剂量口服后的平均达峰时间约为1小时。在肾移植受者中，多剂量口服后的平均达峰时间约为2小时。西罗莫司的系统利用度估计约为14%。在稳定的肾移植患者中，西罗莫司的浓度与剂量成比例，为3～12mg/m^2。食物的影响：在22例健康志愿者中，高脂早餐（1.88千卡，54.7%脂肪）

改变了西罗莫司的生物利用度特性：与禁食相比，西罗莫司血药峰浓度（C_{max}）下降了34%，达峰时间（tmax）增加了3.5倍，总的摄入量（AUC）增加35%。为尽可能地减少差异，本药应恒定地与或不与食物同服。

2. 分布：在稳定的肾移植受者中，西罗莫司的血液/血浆比的平均值（±SD）为36（±17.9），表明西罗莫司广泛分布入血液的有形成分中。西罗莫司的分布容积（Vss/F）的平均值为（12±7.52）L/kg。西罗莫司与人血浆蛋白广泛结合（约92%）。在男性中，西罗莫司的结合主要与血清白蛋白(97%)，α_1－酸性糖蛋白和脂蛋白有关。

3. 代谢：西罗莫司为细胞色素P450ⅢA4（CYP3A4）和P－糖蛋白的作用底物。西罗莫司经去甲基化和/或羟化被广泛代谢。在全血中可检测到7个主要代谢物，包括羟基化、去甲基化和羟基去甲基化代谢物。其中一些亦可在血浆、粪便和尿液中检测到。在所有的生物基质中，不存在葡萄糖醛酸和硫酸的结合物。在人的全血中，西罗莫司为主要成分，且其免疫抑制活性达总活性的90%以上。

4. 排泄：健康志愿者中单剂量服用［^{14}C］标记的西罗莫司后，放射活性的大部分（91%）在粪便中发现，仅少量（2.2%）经尿排泄。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
西罗莫司口服液	化学药	HZ003624
西罗莫司片	化学药	HZ003625

HY001993 西洛他唑

【其他名称】培达、Pletal

【外文名称】Cilostazol

药物理化信息

【化学名】6－［4－（1－环已基－1*H*－戊四唑－5－基）丁氧基］－3，4－二氢－2－喹啉酮

药物药理信息

【药理毒理】本品通过抑制血小板及血管平滑肌内磷酸二酯酶活性，从而增加血小板及平滑肌内cAMP浓度、发挥抗血小板作用及血管扩张作用。本品抑制ADP、肾上腺素、胶原及花生四烯酸诱导的血小板初期、二期聚集和释放反应，且呈剂量相关性。西洛他唑口服100mg对血小板体外聚集的抑制较相应量阿司匹林强7～78倍（阿司匹林对血小板初期聚集无效）。本品不干扰血管内皮细胞合成血管保护性前列环素，对慢性动脉闭塞患者，采用体积描记法显示本品能增加足、腓肠肌部位的组织血流量，使下肢血压指数上升、皮肤血流增加及四肢皮温升高，并改善间歇跛行。

【药代动力学】口服西洛他唑在肠内吸收，健康成年男子单次口服100mg，约3小时血药浓度达到峰值（736.9μg/L），血清半衰期呈二相性，α相为2.2小时，β相为18.0小时。血浆蛋白结合率为95%，主要代谢产物为环氧化物和环羟化物，动物试验本品体内无蓄积性。主要分布于胃、肝脏、肾脏，而在中枢神经系统的分布比其他组织低。本品主要经肾及粪便排出，部分自胆汁排泄。

【药物相互作用】

1. 前列腺素E1能与本品起协同作用，增加细胞内环腺苷一磷酸及增强疗效。

2. 与抗血小板药物及抗凝药合用，可加强抗凝作用。

【不良反应】

1. 主要的不良反应为血管扩张引起的头痛、头晕及心悸等，个别患者可出现血压偏高。

2. 其次为腹胀、恶心、呕吐、胃不适、腹痛等消化道症状。

3. 少数患者服药后出现肝功能异常、尿频，尿素氮、肌酐及尿酸值异常。

4. 过敏症状包括皮疹、瘙痒。

5. 其他偶有白细胞减少、皮下出血、消化道出血、鼻出血、血尿、眼底出血等报道。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
西洛他唑胶囊	化学药	HZ003626
西洛他唑片	化学药	HZ003627

HY001994 西马嗪

【其他名称】镇痛安

【外文名称】Simazin

药物药理信息

【药理毒理】本品镇痛作用较对乙酰氨基酚、安乃近强。用于术后、外伤性疼痛。

【不良反应】偶见有恶心、呕吐、胃部不适及出汗等，停药即消失。

HY001995 西咪替丁

【其他名称】甲氰咪胍、Tagamet、泰胃美

【外文名称】Cimetidine

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】1-甲基-2-氰基-3-［2［［（5-甲基咪唑-4-基）甲基］硫代］乙基］胍

【分子式】$C_{10}H_{16}N_6S$

【分子量】252.34

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，几乎无臭，味苦。本品在甲醇中易溶，在乙醇中溶解，在异丙醇中略溶，在水中微溶，在稀盐酸中易溶。

吸收系数：取本品，精密称定，加盐酸溶液（0.9→1000）溶解并定量稀释制成每1ml中约含8μg的溶液，照紫外-可见分光光度法，在218nm的波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为751～797。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：H_2受体阻滞药。

1．药理：为一种H_2受体拮抗剂，能明显地抑制食物、组胺、五肽胃泌素、咖啡因与胰岛素等刺激引起的胃酸分泌。本品对因化学刺激引起的腐蚀性胃炎有预防和保护作用，对应激性胃溃疡和上消化道出血也有明显疗效。本品有抗雄性激素作用，在治疗多毛症方面有一定价值。本品能减弱免疫抑制细胞的活性、增强免疫反应，从而阻抑肿瘤转移和延长存活期。

2．毒理：急性LD_{50}，小鼠口服为3190～3280mg/kg，大鼠口服为5840～7500mg/kg。大鼠和狗的亚急性、慢性中毒性试验证明本品有轻度抗雄激素作用可引起前列腺和精囊重量减少，出现乳汁分泌，但停药后消失。无致突变、致癌、致畸胎作用，亦无依赖性和抗药性。

【药代动力学】本品口服后迅速由小肠吸收，生物利用度约为60%～70%，半小时即达有效血药浓度（0.5μg/ml），45～90分钟达峰浓度，平均C_{max}为1.44μg/ml。有效血药浓度可保持4小时。血浆蛋白结合率为15%～20%，$t_{1/2}$约为2小时（慢性肾功能不全患者$t_{1/2}$明显延长，约为4.9小时，应注意减量或调整给药间隔），V_d为（2.1±1）L/kg，肾清除率为（12±3）ml/（kg·min）。本品在体内广泛分布于全身组织（除脑以外），在肝脏内代谢，主要经肾脏排出，44%～70%以原形从尿中排出，10%可从粪便排出，12小时可排除口服量的80%～90%。

口服后约60%～70%由肠道迅速吸收，血药浓度达峰时间（t_{max}）为45～90分钟。口服生物利用度（F）约为70%，年轻人对本品的吸收情况往往较老年人好。血浆蛋白结合率低。服用300mg平均峰浓度（C_{max}）为1.44μg/ml，可抑制基础胃酸分泌50%达4～5小时。本品广泛分布于全身组织（除脑以外），在肝脏内代谢，主要经肾排泄。24小时后口服量的约48%以原形自肾排出；10%可从粪便排出。本品可经血液透析清除。肾功能正常时半衰期（$t_{1/2}$）为2小时，肌酐清除率在20～50ml/min，半衰期为2.9小时，当<20ml/分时为3.7小时，肾功能不全时为5小时。本品可经胎盘转运和从乳汁排出。

【药物相互作用】

1．与制酸药伍用，对十二指肠溃疡有缓解疼痛之效，但西咪替丁的吸收可能减少，故一般不提倡。如必须与制酸药合用，两者应至少相隔1小时服用。

2．甲氧氯普胺（胃复安）与本品同时服用，可使本品的血药浓度降低，本品的剂量需适当增加。

3．由于硫糖铝需经胃酸水解后才能发挥作用，本品抑制胃酸分泌，两者合用可能使硫糖铝疗效降低。

4．本品抑制细胞色素P450催化的氧化代谢途径，并能降低肝血流量，故它与其他药物合用时本品可降低另一些药的代谢，致其药理活性或毒性增强。这些药物包括：

（1）与苯二氮䓬类药长期合用，肝内代谢可被抑制，导致后者的血药浓度升高，加重镇静及其他中枢神经抑制作用，并可发展为呼吸及循环衰竭。但是其中劳拉西泮、奥沙西泮、替马西泮似乎不受影响。

（2）与香豆素类抗凝血药合用时，凝血酶原时间可进一步延长，因此须密切注意病情变化，并调整抗凝血药用量。

（3）与苯妥英钠或其他乙内酰脲类合用，可能使后者的血药浓度增高，导致苯妥英钠中毒，必须合用时，应在5天后测定苯妥英钠血药浓度以便调整剂量，并注意定期复查周围血象。

（4）与普萘洛尔、美托洛尔、甲硝唑合用时，血药浓度可能增高。

（5）与茶碱、咖啡因、氨茶碱等黄嘌呤类药合用时，肝代谢降低，可导致清除延缓，血药浓度升高，可能发生中毒反应。

（6）本品可使维拉帕米（异搏定）的绝对生物利用度由26.3%±16.8%提高到49.3%±23.6%，由于维拉帕米可发生少见但很严重的副作用，因此应引起注意。

（7）本品可抑制奎尼丁代谢，患者同时服用地高辛和奎尼丁时，不宜再用本品。因为奎尼丁可将地高辛从其结合部位置换出来，结果奎尼丁和地高辛的血药浓度均升高。此时应对血药浓度进行监测。

（8）与其他肝内代谢药合用，如：利多卡因、三环类抗抑郁药，均应慎用。

5．与阿片类药物合用，有报道在慢性肾衰竭患者身上可产生呼吸抑制、精神混乱、定向力丧失等

不良反应。对此类病人应减少阿片类制剂的用量。

6. 由于本品使胃液 pH 升高，与四环素合用时，可致四环素的溶解速率下降，吸收减少，作用减弱（但本品的肝药酶抑作用却可能增加四环素的血浓度）；若与阿司匹林合用，则出现相反的结果，可使阿司匹林的作用增强。

7. 与酮康唑合用可干扰后者的吸收，降低其抗真菌活性，但同服一些酸性饮料可避免上述变化。

8. 本品与卡托普利合用有可能引起精神症状。

9. 由于本品有与氨基糖苷类抗生素相似的肌神经阻断作用，这种作用不被新斯的明所对抗，只能被氯化钙所对抗。因此，与氨基糖苷类合用时可能导致呼吸抑制或呼吸停止。

【药物过量】

1. 过量的临床征象为：呼吸短促或呼吸困难、心动过速。

2. 处理：首先清除胃肠道内尚未吸收的药物，并给予临床监护及支持疗法，出现呼吸衰竭者，立即进行人工呼吸，心动过速者可给予 β 肾上腺素阻滞药。

【不良反应】由于本品在体内分布广泛，药理作用复杂，故不良反应较多。

1. 消化系统反应：较常见的有腹泻、腹胀、口苦、口干、血清转氨酶轻度升高等，偶见严重肝炎、肝坏死、肝脂肪性变等。

2. 泌尿系统反应：近年来有不少关于本品引起急性间质性肾炎、导致肾功能衰竭的报道。但此种毒性反应是可逆的，停药后肾功能一般均可恢复正常。为避免肾毒性，用药期间应注意检查肾功能。

3. 造血系统反应：本品对骨髓有一定的抑制作用，少数患者可发生可逆性中等程度的白细胞或粒细胞减少，也有出现血小板减少以及自身免疫性溶血性贫血的，其发生率为用药者的 0.02‰。尚有报道本品可引起再生障碍性贫血。用药期间应注意检查血常规。

4. 中枢神经系统反应：本品可通过血脑屏障，具有一定的神经毒性。头晕、头痛、疲乏、嗜睡等较常见。少数患者可出现不安、感觉迟钝、语言含糊不清、出汗、局部抽搐或癫痫样发作、以及幻觉、妄想等症状。引起中毒症状和血药浓度多在 2μg/ml 以上，而且多发生于老人、幼儿或肝肾功能不全的患者，故宜慎用。

5. 心血管系统反应：可有心动过缓或过速、面部潮红等。静脉注射时偶见血压聚降、房性早搏、心跳呼吸骤停。

6. 对内分泌和皮肤的影响：由于具有抗雄性激素作用，用药剂量较大（一日剂量 > 1.6g）时可引起男性乳房发育、女性溢乳、性欲减退、阳痿、精子计数减少等，停药后即可消失。可抑制皮脂分泌，诱发剥脱性皮炎、皮肤干燥、皮脂缺乏性皮炎、脱发、口腔溃疡等。皮疹、巨型荨麻疹、药热等也有发生。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方丙谷胺西咪替丁片	化学药	HZ001094
西咪替丁缓释片	化学药	HZ003628
西咪替丁胶囊	化学药	HZ003629
西咪替丁咀嚼片	化学药	HZ003630
西咪替丁口服乳	化学药	HZ003631
西咪替丁氯化钠注射液	化学药	HZ003632
西咪替丁片	化学药	HZ003633
西咪替丁注射液	化学药	HZ003634
注射用西咪替丁	化学药	HZ005005

HY001996 西尼地平

【外文名称】Cilnidipine

药物理化信息

【化学名】（±）-3-（2-甲氧基乙基）-5-[3-苯基-2（*E*）-丙烯基]-2,6-二甲基-4-（3-硝基苯基）-1,4-二氢-3,5-吡啶二甲酸酯

药物药理信息

【药理毒理】本品为亲脂性的二氢吡啶类钙拮抗剂，能与血管平滑肌细胞膜上 L 型钙信道的二氢吡啶位点结合，抑制 Ca^{2+} 通过 L 型钙信道的跨膜内流，从而松弛、扩张血管平滑肌，起到降压作用。它还可通过抑制 Ca^{2+} 通过交感神经细胞膜上 N 型钙信道的跨膜内流而抑制交感神经末梢去甲肾上腺素的释放和交感神经活动。

该药通过抑制钙内流和抑制细胞内贮存钙的释放而降低血管张力；通过抑制二氢吡啶敏感性的和电压依赖性钙信道的钙内流表现出缓慢而持久的血管舒张作用；通过抑制与神经末梢去甲肾上腺素释放有关的 N 型钙信道的钙内流而抑制交感神经传递，也可能是在神经兴奋期间抑制 ATP 诱导的血管收缩。本品能增加椎动脉，冠状动脉和股动脉血流，但降低肾血流，且呈剂量依赖性，这些作用与同类化合物相似，但起效慢，作用持久。呈剂量依整性地增加肾血流，肾小球滤过率及利尿/尿钠排泄。本品与硝苯地平或尼卡地平相比，降血压作用起效缓慢而持久，长期用药后降压作用不变，且无停药后的反

跳现象。

【药代动力学】口服本品 10mg，2～3 小时可达血药浓度峰值，$t_{1/2}$为 8～9 小时，在胆囊、膀胱、肝脏、肾脏中的浓度较高，体外血浆蛋白结合力 > 87%，体内 > 86%。口服后 72 小时内有 18%～29% 由尿中排出，80%粪便排出；在 48 小时内有 44%由胆汁排出，11%由尿液排出。

【药物相互作用】与阿替洛尔或卡托普利合用，能增强抗高血压作用并延长作用时间。

【不良反应】可引起轻度面红，恶心等不良反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
西尼地平片	化学药	HZ003635

HY001997　西诺西泮

【其他名称】丙腈卓醇

【外文名称】Cinolazepam

【分子式】$C_{18}H_{13}ClFN_3O_2$

药物药理信息

【药理毒理】本品类似地西泮，用于失眠。

【药代动力学】$t_{1/2}$约 9 小时。

HY001998　西沙必利

【外文名称】Cisapride

药物药理信息

【药理毒理】

1．动物

（1）在分离的器官，能防止胃的弛缓，加速胃蠕动，协调胃窦－十二指肠、小肠和大肠的运动。

（2）在狗，可加强胃窦－十二指肠的消化活性，协调并加强胃排空，增加小肠、大肠的蠕动并缩短肠运动的时间，但不影响胃分泌。

（3）作用机制主要是促进肠肌间神经丛中乙酰胆碱的生理学释放。

（4）不刺激毒蕈碱及烟碱受体，也不抑制乙酰胆碱酯酶的活性。

（5）治疗剂量下无多巴胺受体阻断作用。

（6）主要分布于胃和肠组织中。

2．人类

（1）胃肠道动力效应

①食管：增强食管蠕动和下食管括约肌张力；防止胃内容物反流入食管，并改善食管的清除率。

②胃：增加胃和十二指肠收缩性与胃窦－十二指肠的协调性；减少十二指肠－胃反流，改善胃和十二指肠的排空。

③肠：加强肠的运动并促进小肠和大肠的转运。

3．其他效应

（1）由于缺乏拟胆碱效应，故不增加基础的及五肽胃泌素引起的胃酸分泌量。

（2）由于相对而言缺乏多巴胺拮抗剂性质，故几乎不影响血浆催乳激素水平。

（3）不影响精神运动性功能、血压、呼吸频率、体温、体重和抗凝血功能。

（4）药理作用开始于口服后 30～60 分钟。

【药代动力学】

1．口服后吸收迅速彻底，1～2 小时内达血药峰浓度，半衰期为 10 小时，经氧化脱烃基和芳香族的羟基化作用被广泛地代谢，几乎全部的代谢产物近似均等地经粪便、尿排泄，哺乳期乳汁排泄很少。

2．口服给药的绝对生物利用度约 40%，血药浓度随口服剂量（5～20mg）成比例增加。

3．在稳定状态下，口服 5mg 一日 3 次和 10mg 一日 3 次早晨服药前的血药浓度与晚上的血药峰浓度水平分别波动在 10～20ng/ml、30～60ng/ml 与 20～40ng/ml、50～100ng/ml 之间。

4．药代动力学和稳态血药浓度与治疗持续时间无关，伴用西咪替丁可以略微增加口服生物利用度。可以广泛地与血浆蛋白结合（97.5%）。

【不良反应】

1．药理活性相一致，瞬时性腹部痉挛、腹鸣和腹泻可能发生，服用 20mg 发生腹部痉挛时，可减半剂量；当腹泻发生在幼儿或婴儿时应酌减剂量。

2．偶有过敏、轻度短暂的头痛或头晕以及与剂量相关的尿频的报道。

3．罕见可逆性肝功能异常的报道，可伴或不伴胆汁郁积。虽然有男性乳房女性化和乳溢的病例报道，但在大规模的监测研究中发生率（<0.1%）未超过普通人群的常见值，所有这些事件都是可逆的。其因果关系尚不明确。

4．个别报道其影响中枢神经系统，即惊厥性癫痫、锥体外系反应和尿频。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
西沙必利胶囊	化学药	HZ003636
西沙必利片	化学药	HZ003637

HY001999　西司他丁钠

【外文名称】Cilastatin

药物药理信息

【药理毒理】亚胺培南是新型的 β－内酰胺抗菌素，受肾肽酶的影响而分解，在尿液中只能回收少量的原形药物，故不能单独应用。西司他丁是特异性肾肽酶抑制剂，保护亚胺培南在肾脏中不受破坏，因此在尿液中回收的原形药物可达 70%。且西司他丁能抑制亚胺培南进入肾小管上皮组织，因而减少亚胺培南的排泄并减轻药物的肾毒性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用亚胺培南西司他丁钠	化学药	HZ005024

HY002000 昔萘酸沙美特罗

【外文名称】Salmeterol Xinafoate

药物药理信息

【药理毒理】本品由选择性 β_2－受体激动剂沙丁胺醇衍生而得，具有沙丁胺醇的基本结构，即活性头部结构，而延长的侧链上连接一个苯环组成尾部。沙美特罗选择性作用于 β_2－肾上腺素受体，扩张支气管平滑肌，控制哮喘发作，具有作用持续时间长、肺外作用小、耐受性好的特点，为目前治疗哮喘夜间发作和哮喘维持治疗的理想药物。结构中长而无极性的侧链不影响其 β_2－受体激动剂活性，但可以紧贴细胞膜与 β_2－受体外位点结合，使分子的柔性头部自由地与受体的活性位点相互作用，激动或兴奋 β_2－受体。由于沙美特罗尾部结构与受体外位点结合，使之不易脱离细胞膜受体，从而作用强而持久（12 小时）。此外，哮喘并非呼吸道平滑肌疾病本身，而是与体内一系列炎性过程有关，如炎性介质释放、炎性细胞激活、浸润及水肿形成。沙美特罗通过持续抑制炎性介质释放，减缓炎性细胞激活，抑制炎性细胞浸润，防止水肿形成，从而显示抗炎和控制哮喘作用。离体豚鼠气管平滑肌实验证明，本品对电刺激引起的平滑肌收缩反应的抑制作用，在本品灌注后 30 分钟内逐渐发生，平滑肌收缩逐渐减弱直至松弛，约持续 7 小时以上。哮喘病人在用药后 10～20 分钟开始出现支气管扩张作用，最佳疗效能持续 12 小时。老年和肾衰病人沙美特罗体内代谢不发生改变，不必调整剂量方案。

【药物相互作用】本品勿与选择性 β－受体阻断剂共用于哮喘的治疗。

【药物过量】沙美特罗不宜频繁或大剂量应用。超过推荐吸入或口服剂量有诱发 Q－T 间隔延长和心率失常而致死的危险。

【不良反应】常见震颤、心悸、心痛，但极少发生，与剂量有关，呈一过性，可在用药期间自行消失。发生率与安慰剂无显著差异。亦见咽部痉挛、刺激感、肿胀等上呼吸道症状。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氟替卡松沙美特罗气雾剂	化学药	HZ001006
沙美特罗碟式吸入剂	化学药	HZ003181
沙美特罗替卡松粉雾剂	化学药	HZ003182
昔萘酸沙美特罗气雾剂	化学药	HZ003645

HY002001 烯丙雌醇

【其他名称】多力妈

【外文名称】Allylestrenol

药物药理信息

【药理毒理】本品增强绒毛膜活性，促进内源性孕酮及 HCG 的分泌，促使胎盘功能正常化；升高催产素酶的浓度及活性，降催产素水平；提高子宫的兴奋阈值，拮抗前列腺素对子宫的刺激作用。本品无雌激素、雄激素活性。

【药代动力学】本品口服吸收完全，2 小时血药浓度达高峰，血浆清除半衰期 16～18 小时，70%在肝内代谢，30%以原型从肾排出，24～30 小时完全排出。

【药物相互作用】慎与酶诱导剂合用，因此类药物可能会降低本药的药效。

【不良反应】偶见体液潴留、恶心和头痛。由于本药可降低糖耐量，故糖尿病孕妇应定期测定血糖水平。严重肝功能障碍；Dubin－Johnson 、Rotor 综合征、妊高征或既往期孕期感染疱疹病毒者禁用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
烯丙雌醇片	化学药	HZ003646

HY002002 烯丙罗定

【外文名称】Allylprodine

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633 号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY002003　烯丙尼定

【其他名称】烯丙可乐宁

【外文名称】Alinidine

药物药理信息

【药理毒理】本品为唑啉类新型抗心律不齐药物，属Ⅴ类药物。直接作用于窦房结，抑制阴离子通道，减弱心率，降低肌耗氧量，并增加缺氧区血流量，且不影响心肌收缩力和房室传导，对于缺血性心脏病和心律失常，优于 β－受体阻滞剂。临床用于治疗心绞痛和心律失常、心肌梗死。用药后患者心绞痛发作次数显著减少，血压下降，心率减慢，预后良好。

【药代动力学】本品口服吸收迅速而完全，生物利用度近100%，1～2小时达 C_{max}，$t_{1/2}$为3～4小时，约0.1%代谢为可乐定，其余大部分以原药经肾脏排泄。

【不良反应】本品毒性小，不良反应轻微，常见的不良反应有嗜睡、乏力、口干及其他类似可乐定的不良反应。

HY002004　硒化钠

【外文名称】Sodium Selenide

药物理化信息

【分子式】Na_2Se

药物药理信息

【药理毒理】微量元素硒补充剂。

过去一直认为硒是一种有毒的元素，直到20世纪50～60年代才肯定硒是动物体必需的微量元素。1973年联合国卫生组织宣布硒是人体必需的微量元素，1988年中国营养学会将硒列入人们每日膳食营养素之一。

1．硒是谷胱甘肽过氧化物酶的组成部分。谷胱甘肽过氧化物酶具有抗氧化作用，能清除体内过氧化物，以保护生物膜免受过氧化物的损害，维持细胞的正常功能。硒有很强的抗氧化能力，其作用与维生素E相似，但效力更大，可调节体内氧化还原反应的速度，影响某些重要酶的代谢及活性，调节维生素A、C、E、K在体内的吸收及消耗，参与辅酶A、Q的合成，提高肌体的免疫力，抗衰老。

2．对某些致癌物有较强的拮抗作用，能抑制化学致癌物、分解致癌物质，如黄曲霉素、四乙铅基等，还能对长期积存在人体中的有害金属离子如铅、汞、砷、镍等排出体外，具有天然的解毒、排毒作用。

3．可维持心血管系统的正常结构和功能，预防心血管病。许多调查发现，血硒高的地区人群心血管发病率低。动物实验中硒对心肌纤维、小动脉及微血管的结构及功能有重要作用。在我国以心肌损害为特征的克山病，发现缺硒是一个重要因素。

4．保护视觉器官。硒是机体内谷胱甘肽过氧化酶的重要成分之一，而这种物质能清除人体内包括眼睛的过氧化物和自由基，使眼睛免受损害。若人眼长期缺乏硒的摄入，就会发生视力下降和许多眼疾如白内障、视网膜病、夜盲症等。白内障者及糖尿病性失明者补充硒后，发现视觉功能有改善。硒对视觉器官的功能是极为重要的，支配眼球活动的肌肉收缩，瞳孔的扩大和缩小，眼辨色力的正常均需要硒的参与。

5．硒是生育与繁殖所必需。已有实验表明我国孕妇血清硒的含量普遍偏低，妊娠晚期硒值低于标准的占95%以上。而妊高症主要发生在妊娠晚期，虽然妊高症发病有很多因素，但在妊娠中晚期补硒后发现血清硒水平明显高于对照组，而妊高症发病率明显低于对照组。低硒还可使自然流产率明显增加。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肠内营养粉剂（TP）	化学药	HZ000518

HY002005　硒酵母

【外文名称】Selenious Yeast

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第16册

【性状及组成】本品为酵母科啤酒酵母菌（*Saccharomyces Cerevisae* Hansen）在含有一定量亚硒酸盐中培养的，得到未经提取的干燥菌体，蛋白质不得少于40.0%，总硒含量为670～730ppm，无机硒含量不得超过总硒含量的15.0%。

本品为淡黄色或淡黄棕色的颗粒或粉末；有酵母的特殊臭，味微苦，不应有异臭。显微镜下检视，多数细胞呈圆形、卵圆柱形、圆柱形或集结成块。

药物药理信息

【药理毒理】硒是人体必需的微量元素，适量摄入硒能够提高体内硒水平，使体内谷胱甘肽过氧化酶（GSH－PX）活性增加，由于GSH－PX在体内有保护细胞膜完整性、消除自由基、增强体内免疫功能等作用，因而起到防病治病的作用。

本品口服给药的 LD_{50}大于5g/kg，毒性低，安全性高。

【药物过量】长期过量服用，可致肝损害、指甲变形和毛发脱落。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
硒酵母混悬液	化学药	HZ003647
硒酵母胶囊	化学药	HZ003648
硒酵母片	化学药	HZ003649

HY002006 硒元素

【外文名称】Selenium

药物药理信息

【药理毒理】硒是人体必需的一种微量元素，体内含量约 14～21mg，广泛分布于除脂肪组织以外的所有组织中。主要以含硒蛋白质形式存在。人体每日硒的需要量为 50～200μg。

硒是谷胱甘肽过氧化物酶及磷脂过氧化氢谷胱甘肽氧化酶的组成成分。

硒的生理功能和药理作用：

1．抗氧化作用。硒是谷胱甘肽过氧化酶（GSH－Px）的必需成分，硒代半胱氨酸为该酶提供其活性中心的必需基因，GSH－Px 利用谷胱甘肽（GSH）使有毒性的过氧化物还原为无害的羟基化合物，使过氧化物分解，清除自由基保护细胞膜结构和功能，修复分子损伤部位。研究表明，补充硒可以防止心肌病变发生。

（1）硒能加速动物心肌梗死区细胞的修复，对梗死心肌具保护作用。明显抑制心肌非酶促脂质过氧化，稳定梗死周围区域内心肌细胞和亚细胞膜，减轻心肌损伤，缩小梗死范围。

（2）硒可缓解心绞痛发作次数和疼痛程度。

（3）实验证明，硒具抗心律失常作用。

（4）硒使 GSH－Px 活性升高，通过脂氧合酶和环氧合酶途径致前列腺素 E_2 合成增加，前列腺素 E_2 扩张血管，从而防止血压升高。由于硒为 GSH－Px 的重要组分，GSH－Px 可清除自由基和过氧化脂质（LPO）。补充硒使 GSH－Px 活性增强，清除自由基和 LPO 能力加强，从而达到延缓衰老的目的。

2．硒促进体内多种代谢活动。对 α－酮戊二酸脱氢酶系有明显激活作用，参与辅酶 A、辅酶 Q 的生物合成，故与三羧酸循环和呼吸链的电子传递有关。三羧酸循环是物质代谢枢纽，是糖、脂肪、氨基酸三大营养物质分解的最后共同通路，是三大物质氧化分解获能量最多的阶段，具有很重要的生理意义。

3．硒是肌肉的正常成分。缺硒会使骨骼肌萎缩和呈灰白色条纹，发生白肌病，同时心肌受损，心肌细胞致密性变化，脂质增多，钙质沉积，导致克山病。故补充硒可防治克山病。

4．硒参与眼中光感受器使光子转换成电信号的能量转换过程。从而增强视力。

5．硒在体内有拮抗和降低多种重金属的毒性作用。可与银、汞、铅等重金属形成不溶性物质，对人畜抵御环境中重金属污染起一定作用。

6．硒能刺激免疫球蛋白和抗体的产生，提高机体免疫功能。

7．硒有抗癌作用。有文献报道，硒能抑制淋巴肉瘤的生长，使肿瘤缩小；硒胱氨酸对人的急性与慢性白血病有治疗作用。增加硒的摄取，可减少癌症尤其是乳腺癌和结肠癌的发生。

【药物过量】摄入过量的硒将引起硒中毒，其症状为：胃肠障碍、腹水、贫血、毛发脱落、指甲及皮肤变形、肝脏受损。正常人如摄入超过生理需要量 50 倍的硒有产生中毒的危险。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
多维元素片	化学药	HZ000804
多维元素片（25）	化学药	HZ000809
多维元素片（29）	化学药	HZ000810
多种维生素片	化学药	HZ000817
复方多维元素片（23）	化学药	HZ001152
复方营养混悬剂	化学药	HZ001478
善存银片	化学药	HZ003189

HY002007 锡元素

【外文名称】Stannum

药物药理信息

【药理毒理】锡 20 世纪 70 年代才被公认为人体的必需微量元素。

经研究证实，锡与黄色酶活性有关，并能促进蛋白质及核酸反应，有助于动物生长。人和动物的各器官中都含有锡，在骨和牙齿中的含量最高，人体约含锡 5～20mg，人体每日约需锡 3.5mg。

动物试验表明：当在纯氨基酸饲料中加入 1～2μg 硫酸锡，则动物生长率增加 60%。锡参与了蛋白质的代谢，有助于动物的生长发育。锡对蛋白质和其他大分子的三级结构起作用，它也可能起氧化还原催化剂的作用。锡含量不足影响发育，严重者发生侏儒症。

【药代动力学】锡的吸收率很低。主要由粪便排出。锡容易与蛋白质结合，从而抑制了蛋白质水解酶消化锡作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
多维元素片（29）	化学药	HZ000810

HY002008　喜树碱

【其他名称】CPT、喜树素

【外文名称】Camptothecine

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第1册

药物理化信息

【化学名】4－乙基－4,12－二氧－4－羟－1*H*－吡喃［3,4,6,7］吡吲哚［1,2－*b*］喹啉－3,14－二酮

【分子式】$C_{20}H_{16}N_2O_4$

【分子量】348.34

【性状及组成】本品为淡黄色针状结晶，难溶于水，遇光易变质，微有引湿性，微溶于二甲基亚砜。其注射液由喜树碱钠配制，为黄色澄明水溶液，具有紫色荧光，呈碱性。

熔点：本品的熔点为264～267℃（分解）。

比旋光度＋31.3°（三氯甲烷－甲醇，8:2）。

药物药理信息

【药理毒理】早期研究表明，本品在体外是一种强大的核酸合成抑制剂，不是通过抑制核苷酸合成，亦不是通过影响DNA、RNA聚合酶，它对RNA的合成抑制是可逆的，对DNA的合成抑制较持久，对rRNA生物合成的作用大于其他RNA的作用，对蛋白质的合成影响较小。

近年来的研究显示，哺乳动物DNA拓朴异构酶Ⅰ（TOPO Ⅰ）是喜树碱类药物的作用靶点，TOPOⅠ酶广泛存在于原核细胞及真核细胞中，主要引起DNA二维、三维结构改变，与DNA复制、修复细胞增殖及基因表达关系密切。喜树碱可抑制TOPOⅠ活性，导DNA单链断裂。

喜树碱是细胞周期特异性药物，主要作用于S期细胞，亦能延缓G_2/M转换期。与常用抗肿瘤药物无交叉耐药性。

另外，喜树碱尚有免疫抑制作用，但不持久，停药9日后免疫功能即可恢复。

【药代动力学】给小鼠腹腔注射本品15分钟后，血中浓度达高峰，并很快进入肝、肾及胃肠道，而在胃肠道停留时间最长，浓度最高；胆囊中药物浓度为血中的2倍。本品静脉注射后部分与血浆蛋白结合，半衰期相当长，血中可存留6日以上。体内很少代谢，主要以原形从尿中排出，48小时排出17%。

【药物相互作用】甘草酸单胺盐能能显著对抗CPT的副作用，并增强疗效。

【不良反应】

1．骨髓抑制：白细胞与血小板减少，多在总量达到100～140mg时出现，一般不严重。

2．胃肠道反应：恶心，呕吐，食欲减退；腹泻有时相当严重，可引起脱水、电解质紊乱及肠麻痹。

3．泌尿道反应：泌尿道刺激较明显，有尿频，尿急，尿前及血尿；个别病例可因血尿而死亡。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方喜树碱贴片	化学药	HZ001437
喜树碱软膏	化学药	HZ003655

HY002009　细胞色素C

【外文名称】Cytochrome C

药物药理信息

【药理毒理】本品是存在于细胞线粒体中的一种以铁卟啉为辅基的蛋白质，目前已能提纯分离。药用制剂是从动物心脏或酵母中分离出来的，细胞色素是呼吸链的一环。各种细胞色素按一定顺序排列组成细胞色素体系，其分子中的Fe^{3+}在有关酶的作用下，能进行可逆的氧化还原反应，担负传递电子的作用，是细胞呼吸所不可少的。

细胞色素C不能透过细胞膜，因此对正常人无作用，但当组织缺氧时，细胞膜通透性增高，外源性制剂即能进入细胞内，从而发挥其纠正细胞呼吸和物质代谢作用。

【药代动力学】动物试验表明，大鼠十二指肠给药后的达峰时间（t_{max}）约为0.4小时，清除半衰期（$t_{1/2\beta}$）约为1.7小时，生物利用度为46.8%。本品缺乏人体的药代动力学参数。

【不良反应】本品可引起过敏反应，也可因制剂不纯，混有热原而引起热原反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
细胞色素C肠溶片	化学药	HZ003656
细胞色素C注射液	化学药	HZ003657
注射用细胞色素C	化学药	HZ005006

HY002010 细胞色素 C 溶液

【外文名称】Cytochrome C Solution

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

【性状及组成】本品系自猪或牛心中提取的细胞色素 C 的水溶液，为深红色的澄清液体。每 1ml 中加含细胞色素 C 不得少于 15mg。

药物药理信息

【药理毒理】本品是存在于细胞线粒体中的一种以铁卟啉为辅基的蛋白质，目前已能提纯分离。药用制剂是从动物心脏或酵母中分离出来的，细胞色素是呼吸链的一环。各种细胞色素按一定顺序排列组成细胞色素体系，其分子中的 Fe^{3+} 在有关酶的作用下，能进行可逆的氧化还原反应，担负传递电子的作用，是细胞呼吸所不可少的。

细胞色素 C 不能透过细胞膜，因此对正常人无作用，但当组织缺氧时，细胞膜通透性增高，外源性制剂即能进入细胞内，从而发挥其纠正细胞呼吸和物质代谢作用。

用于各种组织缺氧急救的辅助治疗，如一氧化碳中毒、催眠药中毒、氰化物中毒、新生儿窒息、严重休克期缺氧、脑血管意外、脑震荡后遗症、麻醉及肺部疾病引起的呼吸困难和各种心脏疾患引起的心肌缺氧的治疗。

【不良反应】本品无毒性，但可引起过敏反应，也可因制剂不纯，混有热原而引起热原反应。

HY002011 细辛脑

【其他名称】α－细辛醚、α－细辛脑

【外文名称】Asarone

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 5 册

药物理化信息

【化学名】反式－2，4，5－三甲氧基－1－丙烯苯

【分子式】$C_{12}H_{16}O_3$

【分子量】208.26

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理

（1）平喘：能对抗组胺、乙酰胆碱，缓解支气管痉挛；止咳：对咳嗽中枢有较强的抑制作用。

（2）祛痰：引起分泌物增加，使浓痰变稀，降低痰液黏滞，易于咳出。

（3）镇静：有接近安定的镇静作用，显著降低自发活动而无抑制作用。

（4）解痉：类似氨茶碱，有松弛支气管平滑肌作用。

（5）抗惊厥：能提高大脑皮质的电刺激阈，抑制电刺激的突触传导及癫痫性电的扩散，因而可防止或减轻癫痫发作。

（6）具有扩张脑血管，降低脑血管阻力，增加脑血流量，改善脑循环的作用。还具有对抗血小板聚集的作用。

2．毒理 α－细辛脑小鼠口服及腹腔注射的 LD_{50} 分别为（680.5 ± 41.6）mg/kg 和（388.7 ± 28.5）mg/kg。家兔静脉注射最小致死量（MLD）为（66.3 ± 10.0）mg/kg。

【药代动力学】口服吸收迅速完全，在体内分布较广，主要随小便排泄，少量经肝脏代谢。半衰期（$t_{1/2}$）约 3～4 小时。

【不良反应】少数患者可见头昏、恶心、纳差、乏力，停药后可自行消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
细辛脑胶囊	化学药	HZ003658
细辛脑氯化钠注射液	化学药	HZ003659
细辛脑片	化学药	HZ003660
细辛脑注射液	化学药	HZ003661
注射用细辛脑	化学药	HZ005007

HY002012 纤溶酶

【其他名称】消栓灵

【外文名称】Fibrinogenase

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 9 册

【性状及组成】本品系长白山眉蝮蛇毒中提取的蛋白水解酶，每 1mg 蛋白中纤溶酶活力不得少于 800 单位。

本品为白色至类白色冻干块状物和粉末，有引湿性。本品易溶于水。

药物药理信息

【药理毒理】本品作用于纤维蛋白原及纤维蛋白，使其降解为小分子可溶片段，容易分解和从血循环中清除，从而产生去纤维蛋白效应；本品促使组织纤溶酶原激活物（t－PA）由内皮细胞释放，并增强其活性，故具抗血栓功能；本品可降低血小板聚集及血液黏度；本品还具有降低心肌耗氧量，改善微循环的功能。

【药代动力学】本品静脉注入人体内，3 小时后

血药浓度达到最高，药品本身及其降解产物均可通过血－脑脊液屏障，主要经肾脏、肝脏代谢后随尿液排出。

【药物过量】本品静脉给予药量一次不宜超过300单位。超量使用易引起凝血系统的代谢紊乱，而造成出血风险。

【不良反应】

1．可发生创面、注射部位、皮肤及黏膜出血。

2．可引起头痛、头晕或氨基转移酶升高。极少量病人可致过敏反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
纤溶酶注射液	化学药	HZ003662
注射用纤溶酶	化学药	HZ005008

HY002013　纤维醋法酯

【外文名称】Cellacefate

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

【性状及组成】本品为部分乙酰化的醋酸纤维与苯二甲酸酐缩合制得。

本品为白色或灰白色的无定形纤维状或细条状或粉末；略有醋酸味。

本品在二氧六环、丙酮中溶解，在水、乙醇中不溶。在pH6以上的水溶液中溶解。

药物药理信息

【药理毒理】药用辅料。

HY002014　纤维素酶

【外文名称】Cellulase

【性状及组成】纯品为白色，溶于水，高温下失去活性。

药物药理信息

【药理毒理】催化纤维素水解的酶。主要由内切葡聚糖酶、纤维二糖水解酶及β－葡萄糖苷酶三个部分组成，在各组中又可分离出各种分子量不同的亚组分。可催化纤维素水解，成为低聚合度纤维素和葡萄糖。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方阿嗪米特肠溶片	化学药	HZ001019
复方消化酶胶囊	化学药	HZ001438

HY002015　氙［^{133}Xe］

【外文名称】Xenon［^{133}xe］

药物药理信息

【药理毒理】^{133}Xe为惰性气体，无特殊的药理毒理作用。

本品主要用于脑局部血流量测定及肺通气显像等。①脑局部血流量测定：颈动脉内注入它能自由通过血脑屏障扩散至脑组织内，然后再通过血脑屏障自由返回至血液循环中；②肺通气显像：自肘静脉以弹丸式注入后，弹丸迅速由上腔静脉进入右心，继之进入肺，氙自毛细血管床逸出至肺泡内，并随呼气排出体外。

【药代动力学】^{133}Xe为惰性气体，化学性质不活泼，在血浆及水中溶解度很低。它不与血中蛋白等物质结合，不参与代谢。由于其脂溶性，细胞膜对^{133}Xe不起屏障作用，它可以自由穿过、扩散，均匀分布在肺、脑等组织中。静脉注射后迅速通过肺部，由肺泡中排出。颈动脉内注入后它能够自由通过血脑屏障扩散至脑组织内，然后再通过血脑屏障自由返回至血液循环中。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氙［^{133}Xe］气体	化学药	HZ003663
氙［^{133}Xe］注射液	化学药	HZ003664

HY002016　腺苷

【外文名称】Adenosine

药物理化信息

【化学名】6－氨基－9－β－D－呋喃核糖基－9－H－嘌呤

【分子式】$C_{10}H_{13}N_5O_4$

【分子量】267.24

药物药理信息

【药理毒理】本品是一种强血管扩张剂，通过激活嘌呤受体松弛平滑肌和调节交感神经减少血管张力而产生药理作用。腺苷明显增加正常冠状动脉血流，而对狭窄动脉血流增加很小或没有作用。造成心肌供血重新分布，与核素显像超声心动图等方法相结合，可用于冠心病诊断，具有较高的敏感性和特异性。

腺苷是一种存在于身体细胞中的内源性核苷，毒性较低，其注射液无过敏性，溶血性，血管刺激性等作用。

【药代动力学】本品注射给药后，很快进入血液循环中，并被清除细胞摄取，主要由红细胞和血管内皮细胞摄取。细胞内的腺苷很快被代谢掉。或以腺苷酶磷酸化而成单磷酸腺苷。或经细胞内的腺苷脱氨酶脱氨而成的肌苷：细胞外援腺苷半衰期小于10秒，主要由细胞摄取而清除，其余部分可通过腺苷脱氨的形式进行脱氨。由于腺苷的激活与灭活均不通过肝肾代谢，因此肝肾功能衰退不改变腺苷的药效和耐受性。

【药物相互作用】其他作用于心脏的药物（如β-肾上腺阻断剂、强心苷、钙通道阻滞剂、腺苷受体拮抗剂（如咖啡、茶碱）、腺苷作用增强剂（如潘生丁）可能对腺苷负荷造成影响，一般不宜在至少5个半衰期内使用。

【药物过量】本品在血液中的半衰期小于10秒，腺苷的不良反应（当其出现时）在停止输注时很快消除，但延迟的和持续的药效仍可观察到。腺苷受体拮抗剂，例如氨茶碱，可用于中止持续性的不良反应，5～15mg稀释成20ml于1～2分钟内注入，或250mg稀释成20ml于5分钟内注入。若氨茶碱不能消除缺血反应，应使用硝酸酯类药物。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
腺苷注射液	化学药	HZ003667
腺苷注射液（供诊断用）	化学药	HZ003668

HY002017 腺苷蛋氨酸

【外文名称】Ademetionine

药物理化信息

【化学名】*S*-腺苷-L-蛋氨酸-1，4-二硫酸丁烷

药物药理信息

【药理毒理】腺苷蛋氨酸是存在于人体所有组织和体液中的一种生理活性分子。它作为甲基供体（转甲基作用）和生理性巯基化合物（如半胱氨酸、牛磺酸、谷胱甘肽和辅酶A等）的前体（转巯基作用）参与体内重要的生化反应。在肝内，通过使质膜磷脂甲基化而调节肝脏细胞膜的流动性，而且通过转巯基反应可以促进解毒过程中硫化产物的合成。只要肝内腺苷蛋氨酸的生物利用度在正常范围内，这些反应就有助于防止肝内胆汁郁积。

现已发现，肝硬化时肝内腺苷蛋氨酸的合成明显下降，这是因为腺苷蛋氨酸合成酶（催化必需氨基酸蛋氨酸向腺苷蛋酸转化）的活性显著下降所致。这种代谢障碍使蛋氨酸向腺苷蛋氨酸转化减少，因而削弱了防止胆汁淤积的正常生理过程。结果使肝硬化病人饮食中的蛋氨酸血浆清除率降低，并造成其代谢产物，特别是半胱氨酸、谷胱甘肽和牛磺酸利用度的下降。而且这种代谢障碍还造成高蛋氨酸血症，使发生肝性脑病的危险性增加。有研究证明体内蛋氨酸累积可导致其降解产物（如硫醇，甲硫醇）在血中的浓度升高，而这些降解产物在肝性脑病的发病机制中起重要作用。

由于腺苷蛋氨酸可以克服腺苷蛋氨酸合成酶不足的障碍，故应用腺苷蛋氨酸可以使巯基化合物合成增加，但不增加血循环中蛋氨酸的浓度。给肝硬化病人补充腺苷蛋氨酸可以使一种在肝病时生物利用度降低的必需化合物恢复其内源性水平。

在各种试验模型中确已发现腺苷蛋氨酸的抗胆汁郁积作用与其下列作用有关：①促进腺苷蛋氨酸-依赖性质膜磷脂的合成（降低胆固醇/磷脂的比例）而恢复细胞质膜的流动性；②克服转巯基反应障碍，促进了内源性解毒过程中巯基的合成。

【药代动力学】以SD_4盐形式口服的腺苷蛋氨酸经胃肠道吸收，生物利用度仅为5%，首过代谢效应显著，肝脏代谢迅速。单剂口服400～1000mg，在3～5小时后血浆峰浓度为0.5～1mg/L。口服200mg，48小时后，15.5%经尿液排出，72小时后23.5%经粪便排出，其余部分可能结合于细胞内贮存。单剂静脉注射100和500 mg，分布容积分别为0.41和0.44 L/kg，血浆蛋白结合率小于5%，肌内注射的生物利用度为95%。健康志愿者静脉注100和500mg，24小时后34%和40%的原药经尿液排出。腺苷蛋氨酸$t_{1/2}$为20～80分钟，慢性肝病患者$t_{1/2}$为121分钟。

【不良反应】因为本品只有在酸性片剂中才能保持活性，故有些患者服本药后感烧心和上腹痛。在特别敏感的个体，偶可引起昼夜节律紊乱，睡前服用催眠药可减轻此症状。以上作用均表现轻微，不需中断治疗。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
腺苷蛋氨酸肠溶片	化学药	HZ003665
注射用腺苷蛋氨酸	化学药	HZ005009

HY002018 腺苷钴胺

【其他名称】辅酶B_{12}、辅酶维B_{12}、辅酶维生素B_{12}、脱氧腺苷钴胺、腺苷辅酶维生素B_{12}

【外文名称】Cobamamide

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】5,6－二甲基苯并咪唑基－5′－脱氧腺嘌呤核苷基钴胺

【分子式】$C_{72}H_{100}CoN_{18}O_{17}P$

【分子量】1579.60

【性状及组成】本品为暗红色结晶或非晶性粉末，引湿性强，遇光极易分解。本品在水中略溶，在乙醇中几乎不溶，在丙酮、乙醚、三氯甲烷中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：维生素类药。

本品是氰钴型维生素 B_{12}的同类物，即其 CN 基被腺嘌呤核苷取代成为 5′－脱氧腺苷钴胺，它是体内维生素 B_{12}的两种活性辅酶形式之一，是细胞生长增殖和维持神经髓鞘完整所必须的物质。为细胞合成核苷酸的重要辅酶，参与体内甲基转换及叶酸代谢，促进与甲基叶酸还原为四氢叶酸；也参与三羧酸循环，对神经髓鞘中脂蛋白的形成非常重要，可使巯基酶处于活性状态，从而参与广泛的蛋白质及脂肪代谢。本品能促进红细胞的发育与成熟，为完整形成神经鞘脊髓纤维和保持消化系统上皮细胞功能所必需的因素。

【药代动力学】本品肌内注射后吸收迅速而且完全，1 小时后血浆浓度达峰值，贮存于肝脏，主要从肾排出，大部分在最初 8 小时排出。

【药物相互作用】

1．不宜与氯丙嗪、维生素 C、维生素 K 等混合于同一容器中。

2．氯霉素减少其吸收。

3．消胆胺可结合维生素 B_{12}减少其吸收。

4．与葡萄糖液有配伍禁忌。

5．与对氨基水杨酸钠不能并用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
维铁缓释片	化学药	HZ003584
腺苷钴胺片	化学药	HZ003666
注射用腺苷钴胺	化学药	HZ005010

HY002019　腺嘌呤

【其他名称】6－氨基嘌呤

【外文名称】Adenine

药物理化信息

【化学名】6－氨基嘌呤

【分子式】$C_5H_5N_5$

【分子量】135.14

【性状及组成】本品的三水合物为白色斜方针状结晶。110℃失水，熔点 360～365℃，220℃升华。难溶于水，溶于沸水，微溶于乙醇，不溶于乙醚和三氯甲烷。

药物药理信息

【药理毒理】本品是脱氧核糖核酸（DNA）和核糖核酸（RNA）中的一种碱基，缩写为 A。在脱氧核糖核酸中，它与胸腺嘧啶（T）配对。在核糖核酸中，它与尿嘧啶（U）配对。

其磷酸盐有刺激白细胞增生的作用，用于防治各种原因引起的白细胞减少症，特别是由于肿瘤化疗、放射治疗及苯类等药物中毒所造成的白细胞减少症。白细胞增生一般见于用药后年 2～4 周左右。在肿瘤化疗前或同时使用本品，能防止白细胞减少症发生，因此可以延长化疗时间。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
输血用 1 号抗凝液	化学药	HZ003215
输血用 2 号抗凝液	化学药	HZ003216

HY002020　香草醛

【其他名称】抗癫香素、香荚兰醛、香兰素、香苹兰醇

【外文名称】Vanillin

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 6 册

药物理化信息

【化学名】4－羟基－3－甲氧基苯甲醛

【分子式】$C_8H_8O_3$

【分子量】152.15

【性状及组成】本品为白色至微黄色细结晶或结晶性粉末。有香子兰的香味。光对其有影响，在空气中加速分解。熔程 81～83℃。1 份可溶于 100 份水、大约 20 份甘油、20 份 80℃热水，易溶于乙醇、三氯甲烷、乙醚、植物油和热的挥发油。遇碱或碱性物质易变质。水溶液对石蕊显酸性。

药物药理信息

【药理毒理】本品能对抗戊四氮引起的惊厥，抑制由戊四氮诱发的癫痫样脑电，尚能抑制动物自发活动及延长环己烯巴比妥钠的睡眠时间，具有镇静及抗癫痫作用。可用于治疗各型癫痫，尤适用于小发作。

本品为食用香料，在药剂中用作矫味剂，多用

于液体制剂和半固体制剂；在香料工业中用作香料。在食品工业中用于制造巧克力、奶油、饼干、糕点等。在日化工业中用作赋香剂，用于制造化妆品等。一般用量为0.25%～1.0%。

小鼠腹腔注射给药 LD_{50}为（946.0±18.5）mg/kg；灌胃 LD_{50}为（1032.0±211.8）mg/kg。

【药代动力学】本品主要经肠道吸收，吸收率98%以上，血清蛋白结合率71%±1%，易通过血脑屏障，主要经肾排泄。

【药物相互作用】本品遇甘油生成不溶于乙醇的化合物，遇碱会分解，遇铁盐、氧化剂和空气中的氧被氧化而分解。

【不良反应】个别患者服药后出现头昏等反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
胆汁槟榔维 B_1 胶囊	化学药	HZ000650
香草醛片	化学药	HZ003669
复方草玉梅含片	民族药	MZ000155
咳康含片	民族药	MZ000284
复方冬凌草含片	中成药	ZC001339
四季消炎喉片	中成药	ZC005318
植麦健脾颗粒	中成药	ZC007203

HY002021 香豆素

【外文名称】Cumarin

【分子式】$C_9H_6O_2$

【分子量】146.15

【性状及组成】本品为白色晶体，熔点69℃，沸点：297～299℃，溶于乙醇、三氯甲烷、乙醚，不溶于水，较易溶于热水。

药物药理信息

【药理毒理】抗凝血剂。具有抗凝血及抗血小板聚集的作用。

【药物相互作用】

1．大量维生素A与香豆素同服，可导致凝血酶原降低。

2．水杨酸类药、奎尼丁、四环素类药，磺胺类药可增加香豆素的抗凝血作用

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
曲克芦丁羟丙茶碱胶囊	化学药	HZ003033
曲克芦丁香豆素片	化学药	HZ003035

HY002022 香菇多糖

【其他名称】香茹菌多糖

【外文名称】Lentinan

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第51册

药物理化信息

【化学名】β-（1→3）（1→6）-D-葡萄糖

【性状及组成】本品为类白色或浅黄色粉末；无味，有引湿性。

本品在水、甲醇、乙醇或丙酮中几乎不溶，在0.5mol/L氢氧化钠溶液中溶解。

比旋度：取本品，精密称定，加0.5mol/l氢氧化钠溶液研磨使溶解并定量稀释制成每1ml中含10mg的溶液，用滤膜（0.8μm）滤过，取滤液，依法测定，比旋度为0°至+17°。

药物药理信息

【药理毒理】益气健脾，补虚扶正。用于慢性乙型迁延性肝炎及消化道肿瘤的放、化疗辅助药。

香菇菌多糖通过降低谷丙转氨酶（ALT），增强肝糖原合成，减少其分解而起到保肝作用。

香菇菌多糖通过激活T细胞、NK、K细胞和巨噬细胞，诱导细胞因子白细胞介素的产生而提高机体免疫功能。

研究证明香菇多糖具有抗肿瘤作用，近年这方面临床试验得到更多证明，尤其外国报道较多，试验证明香菇多糖通过提高免疫功能抑瘤及其转移。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
香菇多糖片	化学药	HZ003670
香菇多糖注射液	化学药	HZ003671
注射用香菇多糖	化学药	HZ005011

HY002023 香精

【外文名称】Essence

【性状及组成】又称调和香精或调和香料。将天然香料和人造香料按照适当比例调和（配制）而成的具有一定香气类型的产品。调和比例一般以质量百分比表示。香气较原来香料更能符合要求。例如玫瑰型香精、茉莉型香精、橙花型香精等。

药物药理信息

【药理毒理】本品在制药工业中主要用作矫味剂。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
丁硼乳膏	化学药	HZ000741
多维铁口服溶液	化学药	HZ000800
复方薄荷柳酯搽剂	化学药	HZ001099
复方桔梗氯化胺糖浆	化学药	HZ001234
复方枇杷氯化铵口服溶液	化学药	HZ001336
复方枇杷氯化铵糖浆	化学药	HZ001337
复方珊瑚姜溶液尿素咪康唑软膏复合制剂	化学药	HZ001373
加香甲酚皂溶液	化学药	HZ001820
六合氨基酸颗粒	化学药	HZ002444
蒙脱石颗粒	化学药	HZ002679
葡萄糖酸钙含片	化学药	HZ002884
葡萄糖酸钙维 D_2 散	化学药	HZ002891
铁铵锌铜维 B_1 糖浆	化学药	HZ003402
小儿复方赖氨酸颗粒	化学药	HZ003757
小儿五维赖氨酸糖浆	化学药	HZ003781
盐酸氨溴索泡腾片	化学药	HZ003877
愈酚待因口服溶液	化学药	HZ004615
白沙糖浆	民族药	MZ000043
肺力咳合剂	民族药	MZ000140
肤舒止痒膏	民族药	MZ000148
感清糖浆	民族药	MZ000184
开喉剑喷雾剂	民族药	MZ000277
开喉剑喷雾剂（儿童型）	民族药	MZ000278
咳速停糖浆	民族药	MZ000288
苦豆子油搽剂	民族药	MZ000294
涩肠止泻散	民族药	MZ000482
小儿功劳止泻颗粒	民族药	MZ000673
小儿消食开胃颗粒	民族药	MZ000675
白芝颗粒	中成药	ZC000173
贝桔止咳糖浆	中成药	ZC000298
薄荷止痒酊	中成药	ZC000385
蚕蛾公补合剂	中成药	ZC000465
蚕蛾公补酒	中成药	ZC000466
川贝枇杷颗粒	中成药	ZC000592
川贝枇杷片	中成药	ZC000594
川贝枇杷糖浆	中成药	ZC000595
垂阴茶颗粒	中成药	ZC000646

续表

制剂名称	类别	序号
丹参颗粒	中成药	ZC000742
貂油治裂软膏	中成药	ZC000857
儿咳糖浆	中成药	ZC000990
风痛灵	中成药	ZC001123
复方枇杷喷托维林颗粒	中成药	ZC001465
甘桔止咳糖浆	中成药	ZC001665
感冒解毒灵颗粒	中成药	ZC001730
解痉镇痛酊	中成药	ZC002634
咳立停糖浆	中成药	ZC003037
咳痰清糖浆	中成药	ZC003046
龙血竭含片	中成药	ZC003367
龙血竭片	中成药	ZC003369
络通酊	中成药	ZC003452
浓缩水牛角颗粒	中成药	ZC003731
清凉止痒搽剂	中成药	ZC004115
清热解毒口服液	中成药	ZC004143
三七冠心宁合剂	中成药	ZC004472
烧烫伤膏	中成药	ZC004649
参芪鹿茸口服液	中成药	ZC004831
参茸口服液	中成药	ZC004877
参术儿康糖浆	中成药	ZC004928
十二味齿龈康散	中成药	ZC005065
苏菲咳糖浆	中成药	ZC005356
乌梅人丹	中成药	ZC005807
乌阳补心糖浆	中成药	ZC005813
小儿感冒退热糖浆	中成药	ZC006208
小儿清毒糖浆	中成药	ZC006287
小儿清凉止痒酊	中成药	ZC006297
新肤螨软膏	中成药	ZC006474
苑叶止咳糖浆	中成药	ZC007138
枣参合剂	中成药	ZC007190
止咳梨煎膏	中成药	ZC007334
治咳枇杷露	中成药	ZC007423

HY002024　香精油

【其他名称】芳香油、精油

【外文名称】Essential Oil

【性状及组成】从植物的花、果皮、根、茎、叶、皮或全株，采用水蒸气蒸馏、压榨或溶剂萃取等得到的芳香挥发性油状液体。大多不溶或微溶于水。本品为具有一定香气并有挥发性的植物性油状液体。主要成分是萜烯烃类、芳香烃类、醇类、醛类、酮类、醚类、酯类和酚类等。

药物药理信息

【药理毒理】本品可用于日化及食用药用香精或提取分离香料。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方薄樟桉油溶液	化学药	HZ001103
复方达克罗宁薄荷溶液	化学药	HZ001124
丁香风油精	中成药	ZC000892

HY002025 香茅油

【外文名称】Citionella Oil

药物药理信息

【药理毒理】本品又称香草油或雄刈萱油。主要成分是香茅醛、香叶醇和香茅醇。用于提取香茅醛，供合成羟基香茅醛、香叶醇和薄荷脑。也可用作杀虫剂、驱蚊药和皂用香料。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
斧标正红花油	中成药	ZC001175
岭南黑鬼油	中成药	ZC003275
岭南正红花油	中成药	ZC003277
强力狮子油	中成药	ZC003981
万应蔻术油	中成药	ZC005652
正红花油Ⅱ	中成药	ZC007282

HY002026 香叶醇

【外文名称】Geraniol

【分子式】$C_{10}H_{18}O$

【性状及组成】本品存在于香茅油、香叶油、香草油、玫瑰油等中。无色至淡黄色液体，有甜玫瑰香气。不溶于水，溶于乙醇、乙醚、矿物油和动植物油。

熔点：－15℃。

沸点：230℃。

折光率：1.4766（20℃）。

旋光度：－2°至＋2°。

药物药理信息

【药理毒理】本品为醇类合成香料。主要用作玫瑰型香精的主剂，也是各种花香型香精的调香原料，用于玫瑰、香豌豆、木兰等花精油的调合，广泛用于香水、香皂、室内芳香剂等化妆品。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
香叶醇软胶囊	中成药	ZC006028

HY002027 消旋啡烷

【外文名称】Racemorphan

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY002028 消旋甲啡烷

【外文名称】Racemethorphan

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY002029 消旋卡多曲

【外文名称】Racecadotril

药物理化信息

【化学名】（±）*N*－［［2－（乙酰巯基）甲基］－1－氧－3－苯基丙基］甘氨酸苄酯

【分子式】$C_{21}H_{23}NO_4S$

【分子量】385.48

【性状及组成】本品的相对密度1.206。熔点89℃。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理：消旋卡多曲是一个脑啡肽酶抑制剂。脑啡肽酶可降解脑啡肽，本品可选择性、可逆性的抑制脑啡肽酶，从而保护内源性脑啡肽免受降解，延长消化道内源性脑啡肽的生理活性，减少水和电

解质的过度分泌。

口服消旋卡多曲作用于外周脑啡肽酶，不影响中枢神经系统的脑啡肽酶活性，且对胃肠道蠕动和肠道基础分泌无明显影响。

2．毒理：有文献报道，灵长类动物服用治疗剂量100倍的消旋卡多曲12个月，未发现任何毒性反应。小鼠以50mg/kg（2次/天）的剂量腹腔注射消旋卡多曲10天，在用药期间及停药后，未发现有毒性反应。

【药代动力学】

1．吸收：本品口服后能迅速吸收，对血浆中内啡肽酶的抑制作用在30分钟时出现。对酶抑制作用的强度与用药剂量相关。当用药剂量为1.5mg/kg时，2.5小时后对酶的抑制作用达到峰值（对酶的抑制作用达到90%），对酶的抑制作用持续8小时左右，$t_{1/2}$约为3小时。

2．分布：本品组织分布较少，仅有1%的药物分布到组织中。血浆蛋白结合率达90%（主要与白蛋白结合）。

3．代谢：本品进入体内后，迅速转变为其活性代谢物Thiorphan，即（±）*N*－（1－氧－2－巯甲基－3－苯丙基）甘氨酸，然后转变为无活性代谢物二硫化物和巯甲醚，最后经尿、粪便及肺排泄。本品在成人体内对细胞色素P450酶系无诱导作用。

4．消除：放射标记法研究发现，本品主要通过粪便和尿排泄。重复给药不会改变本品的药代动力学特性。

饮食延长脑啡肽酶抑制作用的出现时间，但对峰高和药时曲线下面积（AUC）无影响。

【药物相互作用】

1．红霉素、酮康唑等细胞色素酶P450－3A4抑制剂可能减少消旋卡多曲的代谢，增加毒性；

2．利福平等细胞色素酶P450－3A4诱导剂可能降低消旋卡多曲的抗腹泻作用。

【药物过量】临床试验中，曾有患者单次服用本品2g（相当于成人常用治疗剂量的20倍）治疗急性腹泻未引起任何不良反应，无偶用大剂量发生不良反应的报道，本品尚无特异性的解毒剂。若发现用药过量，可按常规药物过量进行处理。

【不良反应】偶见嗜睡、皮疹、便秘、恶心和腹痛等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
消旋卡多曲胶囊	化学药	HZ003672
消旋卡多曲颗粒	化学药	HZ003673

续表

制剂名称	类别	序号
消旋卡多曲口腔崩解片	化学药	HZ003674
消旋卡多曲片	化学药	HZ003675
消旋卡多曲散	化学药	HZ003676

HY002030　消旋麻黄碱

【外文名称】Racephedrine

药物管理信息

【特殊管理分类】易制毒药

药物药理信息

【药理毒理】《易制毒化学品管理条例》（国务院令第445号）规定本品为易制毒化学药品。

HY002031　消旋吗拉胺

【外文名称】Racemoramide

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY002032　消旋山莨菪碱

【其他名称】654－2

【外文名称】Raceanisodamine

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】（±）－6β－羟基－1αH,5αH－托烷－3α－醇托品酸酯

【分子式】$C_{17}H_{23}NO_4$

【分子量】305.38

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末，无臭，味苦。

本品在乙醇或盐酸中易溶，在水中溶解。

熔点：本品的熔点为103～113 ℃，熔距应在6℃以内。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗胆碱药。

本品具有外周抗M胆碱受体作用，能解除乙酰胆碱所致平滑肌痉挛。对胃肠道平滑肌有松弛作用，并抑制其蠕动，作用较阿托品稍弱，其抑制消化道

腺体分泌作用为阿托品 1/10。抑制唾液腺分泌及扩瞳作用较弱，为阿托品的 1/20～1/10。能解除微血管痉挛，改善微循环。因不易通过血－脑脊液屏障，故中枢作用亦弱于阿托品。

【药代动力学】本品口服吸收较差，大鼠口服 24 小时后大部分留在胃肠道，尿中量少。人口服后尿中药量约为用药量的 2%，近 90% 的药出现于大便中。长期应用无蓄积作用。

【药物相互作用】

1. 与金刚烷胺、吩噻嗪类药、三环类抗抑郁药、扑米酮、普鲁卡因胺及其他抗胆碱药合用，可使不良反应增加。

2. 与单胺氧化酶制剂（包括呋喃唑酮和甲基苄肼）配伍用，可加强抗毒蕈碱作用的副作用。

3. 能减弱胃肠运动和延迟胃排空，对一些药物产生影响，如红霉素在胃内停留过久降低疗效，对乙酰氨基酚吸收延迟，地高辛、呋喃妥因等药物的吸收增加。

【药物过量】剂量过大可出现阿托品样中毒症状，可用 1% 毛果芸香碱解救，每次 0.25～0.5ml，皮下注射，每 15 分钟一次，直至症状缓解。

【不良反应】常见的有：口干、面红、视物模糊等。少见的有：心跳加快、排尿困难等。上述症状多在 1～3 小时内消失。用量过大时可出现阿托品样中毒症状。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方羟丙茶碱去氯羟嗪胶囊	化学药	HZ001342
复方山莨菪碱滴眼液	化学药	HZ001372
复方消旋山莨菪碱滴眼液	化学药	HZ001440
消旋山莨菪碱滴眼液	化学药	HZ003677
消旋山莨菪碱片	化学药	HZ003678

HY002033 硝苯地平

【其他名称】ADALAT、艾克地平（Ecodipine）、Corinfer、Nifelat、Oxcord、Procardia、硝苯吡啶、心痛定

【外文名称】Nifedipine

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】2，6－二甲基－4－（2－硝基苯基）－1，4－二氢－3，5－吡啶二甲酸二甲酯

【分子式】$C_{17}H_{18}N_2O_6$

【分子量】346.34

【性状及组成】本品为黄色结晶性粉末；无臭，无味；遇光不稳定。本品在丙酮或三氯甲烷中易溶，在乙醇中略溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 171～175℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：钙通道阻滞药。

硝苯地平为二氢吡啶类钙拮抗剂，可选择性抑制钙离子进入心肌细胞和平滑肌细胞的跨膜转运，并抑制钙离子从细胞内释放，而不改变血浆钙离子浓度。

1. 药理作用

（1）本品能同时舒张正常供血区和缺血区的冠状动脉，拮抗自发的或麦角新碱诱发的冠状动脉痉挛，增加冠状动脉痉挛病人心肌氧的递送，解除和预防冠状动脉痉挛。

（2）本品可抑制心肌收缩，降低心肌代谢，减少心肌耗氧量。

（3）本品能舒张外周阻力血管，降低外周阻力，可使收缩血压和舒张血压降低，减轻心脏后负荷。

（4）本品可延缓离体心脏的窦房结功能和房室传导；整体动物和人的电生理研究未发现本品有延缓房室传导、延长窦房结恢复时间和减慢窦房结率的作用。

2. 致癌、致突变及生殖毒性

无致癌作用。无致突变性。大剂量应用可降低雌性鼠生殖力；可致畸；可引起流产（胎鼠药物吸收率增加、胎鼠死亡率上升、新生鼠存活率下降）。孕猴服用 2/3～2 倍于人类最大剂量，可导致小胎盘和绒毛发育不全；给大鼠 3 倍于人类最大剂量，可引起妊娠延长。对人类的生殖力影响尚不明确。

【药代动力学】口服后吸收迅速、完全。口服后 10 分钟即可测出其血药浓度，约 30 分钟后达血药峰浓度，嚼碎服或舌下含服达峰时间提前。硝苯地平在 10～30mg 之间，生物利用度和半衰期无显著差别。吞服、嚼碎服或舌下含服硝苯地平片，相对生物利用度基本无差异。硝苯地平与血浆蛋白高度结合，约为 90%。口服 15 分钟起效，1～2 小时作用达高峰，作用持续 4～8 小时；舌下给药 2～3 分钟起效，20 分钟达高峰。$t_{1/2}$呈双相，$t_{1/2\alpha}$2.5～3 小时，$t_{1/2\beta}$为 5 小时。药物在肝脏内转换为无活性的代谢产物，约 80% 经肾排泄，20% 随粪便排出。肝肾功能不全的患者，硝苯地平代谢和排泄速率降低。

缓释胶囊口服后约 6 小时达平台，波动小，作用可持续 24 小时。在禁食情况下，缓释制剂可减少血药浓度的波动。口服 90mg，其平均血药浓度为 115ng/ml。高脂餐时其血药浓度可提高 60%，达峰

浓度时间延长，AUC 无明显变化。与普通制剂相比缓释制剂的相对生物利用度为 86%。剂量在 30～180mg 范围内，血药浓度与剂量成正比。

缓释片血浓峰时在 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。

【药物相互作用】

1. 与硝酸酯类合用，控制心绞痛发作，有较好的耐受性。

2. 与 β－受体阻滞剂合用，绝大多数患者对本品有较好的耐受性和疗效，但个别患者可能诱发和加重低血压、心力衰竭和心绞痛。

3. 与洋地黄合用，可能增加血地高辛浓度，提示在初次使用、调整剂量或停用本品时应监测地高辛的血药浓度。

4. 与蛋白结合率高的药物合用，如双香豆素类、苯妥英钠、奎尼丁、奎宁、华法林等，这些药的游离浓度常发生改变。

5. 与西咪替丁合用，本品的血浆峰浓度增加，注意调整剂量。

6. 葡萄柚汁与本品同服时，本品的 C_{max} 及 AUC 增加。

【药物过量】尚无足够的研究资料。现有文献表明，增加剂量可使外周血管过度扩张，导致或加重低血压状态。药物过量导致临床上出现低血压的患者，应及时给予心血管支持治疗，包括心肺监测、抬高下肢、注意循环血容量和尿量。若无禁忌症，可用血管收缩药（去甲肾上腺素）恢复血管张力和血压。肝功能损害的患者药物清除时间延长。血液透析不能清除硝苯地平。

【不良反应】

1. 常见服药后出现外周水肿（外周水肿与剂量相关，服用 60mg/d 时的发生率为 4%，服用 120mg/d 则为 12.5%）；头晕；头痛；恶心；乏力和面部潮红（10%）。一过性低血压（5%），多不需要停药（一过性低血压与剂量相关，在剂量＜60mg/d 时的发生率为 2%，而 120mg/d 的发生率为 5%）。个别患者发生心绞痛，可能与低血压反应有关。还可见心悸，鼻塞，胸闷，气短，便秘，腹泻，胃肠痉挛，腹胀，骨骼肌发炎，关节僵硬，肌肉痉挛，精神紧张，颤抖，神经过敏，睡眠紊乱，视力模糊，平衡失调等（2%），晕厥（0.5%）。减量或与其他抗心绞痛药合用则不再发生。

2. 少见贫血，白细胞减少，血小板减少，紫癜，过敏性肝炎，齿龈增生，抑郁，偏执，血药浓度峰值时瞬间失明，红斑性肢痛，抗核抗体阳性关节炎等（＜0.5%）。

3. 可能产生的严重不良反应：心肌梗死和充血性心力衰竭发生率 4%，肺水肿的发生率 2%，心律失常和传导阻滞的发生率各小于 0.5%。

4. 本品过敏者可出现过敏性肝炎、皮疹，甚至剥脱性皮炎等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
硝苯地平缓释胶囊	化学药	HZ003680
硝苯地平缓释片（Ⅰ）	化学药	HZ003681
硝苯地平缓释片（Ⅱ）	化学药	HZ003682
硝苯地平胶囊	化学药	HZ003683
硝苯地平胶丸	化学药	HZ003684
硝苯地平控释片	化学药	HZ003685
硝苯地平片	化学药	HZ003686
硝苯地平注射液	化学药	HZ003687

HY002034　硝苯洛尔

【外文名称】Nifenalolt

药物药理信息

【药理毒理】本品能阻断 β_1、β_2 受体，具有内在拟交感活性，但作用仅为普萘洛尔的 1/25。用于心绞痛、心律失常。

【不良反应】可见乏力、嗜睡、头晕、失眠、恶心、腹胀、皮疹、晕厥、低血压、心动过缓等。

HY002035　硝呋太尔

【外文名称】Nifuratel

药物理化信息

【化学名】5－［（甲硫基）甲基］－3－［［（5－硝基－2－呋喃）甲叉］氨基］－2－噁唑烷酮

药物药理信息

【药理毒理】硝呋太尔为硝基呋喃类衍生物，具有广谱抗微生物作用，对滴虫、细菌、白色念珠菌等均具有活性。

硝呋太尔对抑制阴道滴虫、大肠杆菌、念珠菌都有效，体外抗溶组织内阿米巴的疗效与盐酸依米丁、克痢酰胺和甲硝哒唑相比，最小有效剂量分别为：1.2，36.0，0.8 和 6.0μg/ml。

硝呋太尔在动物急性毒理实验中毒性反应甚微。兔子口服 LD_{50}（半数至死量）为其治疗剂量的 1500 倍，兔子按 450mg/（kg·d）的剂量（相当于 20 倍治疗剂量）口服 47 天后无任何毒性反应；在 6 个月的慢性毒理实验中，狗一日口服 10 倍于人类的治疗剂

量无毒性反应和血相变化；怀孕小鼠和兔子分别口服 100mg/（kg·d）和 200mg/（kg·d），没有发生致畸或生育的变化。

【药代动力学】本品口服后经胃肠道吸收，大部分通过肾脏排泄，在血、尿、生殖器组织浓度较高，故在泌尿系统中可产生强烈的抗菌作用，其代谢产物仍有抗菌活性，且自尿中排出。口服硝呋太尔吸收迅速，口服 200mg 后 2 小时即达血药峰浓度为 9.48μg/l。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
硝呋太尔片	化学药	HZ003688
硝呋太尔阴道片	化学药	HZ003689
硝呋太尔制霉素阴道软胶囊	化学药	HZ003690
硝呋太尔制霉素阴道栓	化学药	HZ003691

HY002036 硝卡芥

【其他名称】AT－1258、邻丙氨酸硝卡芥、消瘤芥

【外文名称】Nitrocaphane

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（二部）·第 4 册

药物理化信息

【化学名】2－［双（β－氯乙基）胺甲基］－5－硝基苯丙氨酸

【分子式】$C_{14}H_{19}Cl_2N_3O_4$

【分子量】364.23

【性状及组成】本品为淡棕黄色粉末。本品在水或乙醇中不溶，在盐酸或冰醋酸中溶解。

熔点：本品的熔点为 194～200℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】本品为溶肉瘤素脂肪族的异构体，为我国开发的烷化剂。为细胞周期非特异性药物，抑制 DNA 和 RNA 的合成，对 DNA 的合成更为显著。对癌细胞分裂各期均有影响，对增殖和非增殖细胞都有作用。对多种动物肿瘤有抑制作用。抗瘤谱广，毒性较低。静脉注射后，肾，肝和肺含量较高。能通过血脑屏障。肿瘤中含量高。口服吸收快，主要经尿和粪排泄。

【药代动力学】本品注射后在血中维持时间较长，24 小时后减少 54%。分布以胆囊和肾脏最多，肿瘤、肝、肺次之，脑中最少。能通过血脑屏障，肿瘤内含量高。静脉注射 1 小时后药物分布至全身各个组织，口服 24 小时后药物分布至全身。主要通过肾脏排泄，24 小时后排出 53%。

【不良反应】胃肠道反应：食欲下降，恶心，偶有呕吐。

骨髓抑制：一般较轻。脱发，乏力。

偶有血栓性静脉炎。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用硝卡芥	化学药	HZ005012

HY002037 硝普钠

【其他名称】Acetest、Nipride、Nipruss、Nipruton、Nitropress、Sodium Nitroferricyanide、亚硝基铁氰化钠

【外文名称】Sodium Nitroprusside

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】亚硝基铁氰化钠二水合物

【分子式】$Na_2Fe(CN)_5NO·H_2O$

【分子量】297.95

【性状及组成】本品为红棕色的结晶或粉末，无臭或几乎无臭。本品在水中易溶，在乙醇中微溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：血管扩张药。

本品为一种速效和短时作用的血管扩张药。通过血管内皮细胞产生 NO，对动脉和静脉平滑肌均有直接扩张作用，但不影响子宫、十二指肠或心肌的收缩。血管扩张使周围血管阻力减低，因而有降压作用。血管扩张使心脏前、后负荷均减低，心排血量改善，故对心力衰竭有益。后负荷减低可减少瓣膜关闭不全时主动脉和左心室的阻抗而减轻反流。

【药代动力学】静滴后立即达血药浓度峰值，其水平随剂量而定。本品由红细胞代谢为氰化物，在肝脏内氰化物代谢为硫氰酸盐，代谢物无扩张血管活性；氰化物也可参与维生素 B_{12} 的代谢。本品给药后几乎立即起作用并达作用高峰，静滴停止后维持 1～10 分钟。肾功能正常者半衰期为 7 天（由硫氰酸盐测定），肾功能不良或血钠过低时延长，经肾排泄。

【药物相互作用】

1．与其他降压药同用可使血压剧降。

2．与多巴酚丁胺同用，可使心排血量增多而肺毛细血管嵌压降低。

3．与拟交感胺类同用，本品降压作用减弱。

【药物过量】血压过低时减慢滴速或暂停本品即可纠正。如有氰化物中毒征象，吸入亚硝酸异戊酯或静滴亚硝酸钠或硫代硫酸钠均有助于将氰化物转为硫氰酸盐而降低氰化物血药浓度。

【不良反应】短期应用适量不致发生不良反应。

1．本品毒性反应来自其代谢产物氰化物和硫氰酸盐，氰化物是中间代谢物，硫氰酸盐为最终代谢产物，如氰化物不能正常转换为硫氰酸盐，则硫氰酸盐血浓度虽正常也可发生中毒。

2．麻醉中控制降压时突然停用本品，尤其血药浓度较高而突然停药时，可能发生反跳性血压升高。

3．以下三种情况出现不良反应。

（1）血压降低过快过剧，出现眩晕、大汗、头痛、肌肉颤搐、神经紧张或焦虑，烦躁、胃痛、反射性心动过速或心律失常，症状的发生与静脉给药速度有关，与总量关系不大。

（2）硫氰酸盐中毒或逾量时，可出现运动失调、视力模糊、谵妄、眩晕、头痛、意识丧失、恶心、呕吐、耳鸣、气短。

（3）皮肤：光敏感与疗程及剂量有关，皮肤石板蓝样色素沉着，停药后经较长时间（1～2年）才渐退。其他过敏性皮疹，停药后消退较快。

（4）氰化物中毒或超量时，可出现反射消失、昏迷、心音遥远、低血压、脉搏消失、皮肤粉红色、呼吸浅、瞳孔散大。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用硝普钠	化学药	HZ005013

HY002038　硝酸

【其他名称】发烟硝酸、硝强水

【外文名称】Nitric Acid

药物理化信息

【化学名】硝酸

【分子式】HNO_3

【分子量】63.01

【性状及组成】本品为澄明无色或几乎无色的发烟液体，具有特殊的刺激臭。

相对密度：1.14。

恒沸点：120.5℃。

熔点：本品的熔点为41.3℃。

含硝酸69%～71%。遇光和热不稳定，分解放出二氧化氮。本品为强酸和强氧化剂。

药物药理信息

【药理毒理】本品为强氧化剂，也是强酸，在药剂制造中用作氧化剂、酸化剂和成盐助溶剂，用于高氯化铁溶液、火棉胶、中草药制剂等的制备。

【药物相互作用】本品与还原物、碱类、有机物等均发生反应，有极强的腐蚀性。

【不良反应】液体对皮肤具有极强的腐蚀性，易引起灼伤，蒸汽对眼、鼻、黏膜有极强的刺激性。使用中应注意劳动保护。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
白降丹	中成药	ZC000152
红升丹	中成药	ZC002135

HY002039　硝酸甘油

【外文名称】Nitroglycerin

【分子式】$C_3H_5N_3O_9$

【分子量】227.09

药物药理信息

【药理毒理】本品主要药理作用是松弛血管平滑肌。硝酸甘油释放一氧化氮（NO），NO与内皮舒张因子相同，激活鸟苷酸环化酶，使平滑肌和其他组织内的环鸟苷酸（cGMP）增多，导致肌球蛋白轻链去磷酸化，调节平滑肌收缩状态，引起血管扩张。

硝酸甘油扩张动静脉血管床，以扩张静脉为主，其作用强度呈剂量相关性。外周静脉扩张，使血液潴留在外周，回心血量减少，左室舒张末压（前负荷）降低。扩张动脉使外周阻力（后负荷）降低。动静脉扩张使心肌耗氧量减少，缓解心绞痛。对心外膜冠状动脉分支也有扩张作用。

治疗剂量可降低收缩压、舒张压和平均动脉压，有效冠状动脉灌注压常能维持，但血压过度降低或心率增快使舒张期充盈时间缩短时，有效冠状动脉灌注压则降低。

使增高的中心静脉压与肺毛细血管楔嵌压、肺血管阻力与体循环血管阻力降低。心率通常稍增快，估计是血压下降的反射性作用。心脏指数可增加、降低或不变。左室充盈压和外周阻力增高伴心脏指数低的患者，心脏指数可能会有增高。相反，左室充盈压和心脏指数正常者，静脉注射用药可使心脏指数稍有降低。

致癌和致突变现象：动物实验未观察到。

【药代动力学】舌下含服立即吸收，生物利用度80%；而口服因肝脏首过效应，生物利用度仅为8%。舌下给药约2～3分钟起效、5分钟达到最大效应，血药浓度峰值为2～3 ng/ml，作用持续10～30分钟，半衰期约1～4分钟。血浆蛋白的结合率约为

60%。主要在肝脏代谢，中间产物为二硝酸盐和单硝酸盐，终产物为丙三醇。两种主要活性代谢产物1，2－和1，3－二硝酸甘油与母体药物相比，作用较弱，半衰期更长。代谢后经肾脏排出。气雾剂用药后30秒钟至1分钟起效者为39.3%，1分钟起效41.8%，起效时间明显快于硝酸甘油片，但持续时间也短。

【药物相互作用】

1．中度或过量饮酒时，使用本药可致低血压。

2．与降压药或血管扩张药合用可增强硝酸盐的致体位性低血压作用。

3．阿司匹林可减少舌下含服硝酸甘油的清除，并增强其血流动力学效应。

4．使用长效硝酸盐可降低舌下用药的治疗作用。

5．枸橼酸西地那非（万艾可）加强有机硝酸盐的降压作用。

6．与乙酰胆碱、组胺及拟交感胺类药合用时，疗效可能减弱。

【药物过量】过量可引起严重低血压、心动过速、心动过缓、传导阻滞、心悸、循环衰竭导致死亡、晕厥、持续搏动性头痛、眩晕、视力障碍、颅内压增高、瘫痪和昏迷并抽搐、脸红与出汗、恶心与和呕吐、腹部绞痛与腹泻、呼吸困难与高铁血红蛋白血症。

【不良反应】

1．头痛，可于用药后立即发生，可为剧痛和呈持续性。

2．偶可发生眩晕、虚弱、心悸和其他体位性低血压的表现，尤其在直立、制动的患者。

3．治疗剂量可发生明显的低血压反应，表现为恶心、呕吐、虚弱、出汗、苍白和虚脱。

4．晕厥、面红、药疹和剥脱性皮炎均有报道。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
硝酸甘油控释片	化学药	HZ003692
硝酸甘油片	化学药	HZ003693
硝酸甘油葡萄糖注射液	化学药	HZ003694
硝酸甘油气雾剂	化学药	HZ003695
硝酸甘油溶液	化学药	HZ003696
硝酸甘油贴片	化学药	HZ003697
硝酸甘油注射液	化学药	HZ003698

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】4－甲基－3－［（2－甲基－4－氨基－5－嘧啶基）甲基］－5－（2－羟基乙基）噻唑鎓硝酸盐

【分子式】$C_{12}H_{17}N_5O_4S$

【分子量】327.37

【性状及组成】本品为白色或类白色的粉末或结晶性粉末，微有特臭。本品在水中略溶，在乙醇或三氯甲烷中微溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：维生素类药。

在体内与焦磷酸结合成辅酸酶。参与糖代谢中丙酮酸和α－酮戊二酸的氧化脱羧反应，是糖类代谢所必需。缺乏时，氧化受阻形成丙酮酸，乳酸堆积，并影响机体能量供应。其症状主要表现在神经和心血管系统，出现感觉神经和运动神经均受影响的多发性周围神经炎，表现为感觉异常，神经痛，四肢无力，以及肌肉酸痛和萎缩等症状。心血管方面由于血中丙酮和乳酸增多，使小动脉扩张，舒张压下降，心肌代谢失调，故易出现心悸，急促，胸闷，心脏肥大，肝肺充血和周围水肿等心脏功能不全的症状。消化道方面表现为食欲下降导致衰弱和体重下降等。

【药物相互作用】

1．本品遇碱性药物如碳酸氢钠（小苏打）、枸橼酸钠等可发生变质。

2．本品不宜与含鞣质的中药和食物合用。

3．大剂量应用时，测定血清茶碱浓度可受到干扰，测定尿酸浓度可显假性增高，尿胆原可产生假阳性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
多维片（6）	化学药	HZ000798
多维元素片（14）	化学药	HZ000805
多维元素片（16）	化学药	HZ000806
复方果糖二磷酸钙片	化学药	HZ001200
复方小檗碱鞣酸蛋白胶囊	化学药	HZ001443
硝酸硫胺片	化学药	HZ003699
注射用复方三维B Ⅱ	化学药	HZ004764

HY002040 硝酸硫胺

【外文名称】Thiamine Nitrate

HY002041 硝酸毛果芸香碱

【其他名称】匹鲁卡品

【外文名称】Pilocarpine Nitrate

药物管理信息

【特殊管理分类】医疗用毒性药品

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】4－［（1－甲基－1*H*－咪唑－5－基）甲基］－3－乙基二氢－2（3*H*）－呋喃酮硝酸盐

【分子式】$C_{11}H_{16}N_2O_2 \cdot HNO_3$

【分子量】271.27

【性状及组成】本品为南美植物 *Pilocarpus Jaborandin* 和 *Pilocarpusmi Crophylus* 的叶子提取的植物碱。

本品为无色结晶或白色结晶性粉末，无臭，遇光易变质。

本品在水中易溶，在乙醇中微溶，在三氯甲烷或乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为 174～178℃，熔融时同时分解。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中含 0.10g 的溶液，依法测定，比旋度应为 +80°至 +83°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：缩瞳药。

毛果芸香碱是拟胆碱药物，口服吸收后通过直接激动汗腺、唾液腺、泪腺、消化道和呼吸道腺体细胞 M－胆碱受体引起分泌增多，以汗腺、唾液腺最明显。本品亦可激动消化道平滑肌 M－胆碱受体而使胃肠蠕动和张力增加，也可使输尿管、膀胱等平滑肌兴奋。及分泌腺上的毒蕈碱受体而起作用。

毛果芸香碱是一种具有直接作用的拟胆碱药物，通过直接刺激位于瞳孔括约肌、睫状体及分泌腺上的毒蕈碱受体而起作用。毛果芸香碱通过收缩瞳孔括约肌，使周边虹膜离开房角前壁，开放房角，增加房水排出。同时本品还通过收缩睫状肌的纵行纤维，增加巩膜突的张力，使小梁网间隙开放，房水引流阻力减小，增加房水排出，降低眼压。

【药代动力学】口服易吸收。

本品的角膜透性良好。动物实验显示，用 2% 本品对家兔单剂量滴眼，房水中的药物峰浓度出现在用药后的 30 分钟。用 1% 本品滴眼后，10～30 分钟开始缩瞳，降眼压作用达峰时间约为 75 分钟。缩瞳持续时间为 4～8 小时。维持降眼压作用时间（与药物浓度有关）为 4～14 小时。

【药物相互作用】

1．本品与 β 受体阻断剂、碳酸酐酶抑制剂、α 和 β 肾上腺能受体激动剂或高渗脱水剂联合使用有协同作用。

2．本品与拉坦前列素合用可降低葡萄膜巩膜途径房水流出的量，减低降眼压作用。

3．与局部抗胆碱药物合用将干扰本品的降眼压作用。与适量的全身抗胆碱药物合用，因全身用药到达眼部的浓度很低，通常不影响本品的降眼压作用。

4．与其他拟胆碱药或抗胆碱酯酶药（如新斯的明）合用，可增加本品作用，须调整本品剂量。局抗胆碱药物（如阿托品）可对抗本品药理作用。

【药物过量】药物过量可产生出汗、流涎、恶心、震颤、脉搏缓慢和血压下降。在哮喘患者可发生支气管缩窄。在中度药物过量时，可自行恢复，静脉补液可纠正脱水，有助于恢复。对严重的病例，阿托品是毛果芸香碱的拮抗药。

本品眼局部滴用过量时，可用温水将其从眼部冲洗掉。

【不良反应】口服可见流涎、出汗、胃肠道不适、腹痛等。

滴眼液可使眼刺痛，有烧灼感，结膜充血引起睫状体痉挛，浅表角膜炎，颞侧或眼周头痛，诱发近视。眼部反应通常发生在治疗初期，并在治疗过程中消失。老年人和晶状体混浊的病人在照明不足的情况下会有视力减退。有使用缩瞳剂后视网膜脱离的罕见报告。长期使用本品可出现晶状体混浊。

局部用药后出现全身不良反应的情况罕见，但偶见特别敏感的患者，局部常规用药后出现流涎、出汗、胃肠道反应和支气管痉挛。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
硝酸毛果芸香碱滴眼液	化学药	HZ003700
硝酸毛果芸香碱片	化学药	HZ003701
硝酸毛果芸香碱注射液	化学药	HZ003702

HY002042　硝酸咪康唑

【其他名称】达克宁、达可宁、二氯苯咪唑、霉可乃除、霉可唑、咪康唑、美康唑、双氯苯咪唑、硝酸氯苯咪唑

【外文名称】Miconazole Nitrate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】1－［2－（2,4－二氯苯基）－2－［（2,4－二氯苯基）甲氧基］乙基］－1*H*－咪唑的硝酸盐

【分子式】$C_{18}H_{14}Cl_4N_2O \cdot HNO_3$

【分子量】479.15

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶或结晶性粉末，无臭或几乎无臭。本品在甲醇中略溶，在三氯甲烷或乙醇中微溶，在水或乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点应为 178 ~ 184℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗真菌药。

本品在 4mg/L 浓度时可抑制大部分真菌生长，芽生菌属、组织浆胞菌属对其呈现高度敏感，隐球菌属、念珠菌属、球孢子菌属等亦对本品敏感。

本品通过干扰细胞色素 P450 的活性，从而抑制真菌细胞膜主要固醇类 - 麦角固醇的生物合成，损伤真菌细胞膜并改变其通透性，以致重要的细胞内物质外漏；本品也可抑制真菌的三酰甘油和磷脂的生物合成，抑制氧化酶和过氧化酶的活性，引起细胞内过氧化氢积聚导致细胞亚微结构变性和细胞坏死。对白念珠菌则可抑制其自芽孢转变为侵袭性菌丝的过程。

【药代动力学】本品口服吸收差，口服 1g 后血药峰浓度仅为 1mg/L。血分布半衰期（$t_{1/2\alpha}$）约为 0.4 小时，血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）约为 2.1 小时，终末半衰期（$t_{1/2}$）为 20 ~ 24 小时，血清蛋白结合率为 90%。在体内分布广泛，可渗入炎症的关节、眼球的玻璃体及腹腔中，但在脑脊液、痰液、房水中浓度均甚低，对血脑屏障的穿透性亦差。本品主要经肝脏代谢灭活为无活性的代谢物。口服量的 14% ~ 22% 自尿排出，主要为无活性的代谢物，其中不到 1% 为原形物。口服量的 50% 以原形自粪便排出。

散剂局部用药，自皮肤的吸收甚少，血液中未能检测出咪康唑。

【药物相互作用】

1. 本品与香豆素或茚满二酮衍生物等抗凝药合用时，可增强此类药物的作用，导致凝血酶原时间延长，对患者应严密观察，监测凝血酶原时间，调整抗凝药的剂量。

2. 本品可使环孢素的血药浓度增高，并可能使肾毒性发生的危险性增加，当两药合用时，应对环孢素的血药浓度进行监测。

3. 利福平可增强本品的代谢，增加肝脏毒性，合用时可降低本品的血药浓度，导致治疗失败。与异烟肼合用时亦可降低本品的血药浓度，故应谨慎合用上述药物。

4. 苯妥英钠与本品合用可引起两种药物代谢的改变，并使本品的达峰时间延迟，两药合用时应严密观察其反应。

5. 本品与降糖药合用时，可由于抑制后者的代谢而致严重低血糖症。

6. 本品与西沙必利合用属禁忌，因合用时抑制细胞色素 P450 代谢通道，可导致心律紊乱。本品若与阿司咪唑或特非那定合用也有发生心律失常的危险，故也应避免。

【不良反应】

1. 消化道反应如恶心、呕吐、腹泻和食欲减退。

2. 少数患者可发生皮肤瘙痒、皮疹、头晕、发冷、发热等，偶可发生过敏性休克。

3. 偶可发生正常红细胞性贫血、粒细胞和血小板减少、高脂血症（如胆固醇和三酰甘油升高）。偶可致血清氨基转移酶一过性轻度升高。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方硝酸咪康唑软膏	化学药	HZ001441
咪康唑氯倍他索乳膏	化学药	HZ002683
曲咪新乳膏	化学药	HZ003037
硝酸咪康唑搽剂	化学药	HZ003703
硝酸咪康唑胶囊	化学药	HZ003704
硝酸咪康唑凝胶剂	化学药	HZ003705
硝酸咪康唑乳膏	化学药	HZ003706
硝酸咪康唑散	化学药	HZ003707
硝酸咪康唑栓	化学药	HZ003708
硝酸咪康唑阴道片	化学药	HZ003709
硝酸咪康唑阴道软胶囊	化学药	HZ003710

HY002043 硝酸哌美立特

【其他名称】五甲哌丙胺

【外文名称】Pemeride Nitrate

药物药理信息

【药理毒理】本品系哌啶类衍生物，能抑制延脑咳嗽中枢，为非成瘾性中枢镇咳药。其镇咳作用较可待因强，且毒性低，不良反应少，无苦味，故尤其适用于小儿服用。

本品可与芳香矫味剂及其他药如祛痰药、抗菌药、解热药等配成可口的复方制剂应用。

HY002044 硝酸士的宁

【其他名称】蕃木鳖碱、士的年

【外文名称】Strychnine Nitrate

药物管理信息

【特殊管理分类】医疗用毒性药品

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】番木鳖碱 - 10 - 酮单硝酸盐

【分子式】$C_{21}H_{22}N_2O_2 \cdot HNO_3$

【分子量】397.44

【性状及组成】本品为无色针状结晶或白色结晶性粉末，无臭，味极苦。本品在沸水中易溶，在水中略溶，在乙醇或三氯甲烷中微溶，在乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：中枢兴奋药。

本品对脊髓有选择性兴奋作用，对大脑皮层也有一定兴奋作用，本品安全范围窄，过量易产生惊厥。

【药代动力学】起效快，迅速在肝内代谢，仅约 20% 的原型药从尿中排出。有蓄积作用。

【药物过量】中毒症状：初期表现烦躁不安、抽搐、呼吸加快、颈肌和面肌有僵硬感、瞳孔缩小。严重中毒时，延髓麻痹，心脏及呼吸抑制，甚至死亡。

处理：将中毒者置于安静而黑暗的房间，避免声音及光线刺激。如有抽搐发生，给予镇静剂。等患者安静后洗胃、输液并视病情给予相应的对症治疗和支持疗法。

【不良反应】可出现惊厥、呼吸肌痉挛和呼吸运动受限。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
硝酸士的宁注射液	化学药	HZ003713

HY002045　硝酸异山梨酯

【其他名称】Carvanil、硝酸脱水山梨醇酯、硝酸异山梨醇酯（Sorbide Dinitrate Nitrosorbide）、消心痛、硝异梨醇

【外文名称】Isosorbide Dinitrate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】1，4：3，6 - 二脱水 - D - 山梨醇二硝酸酯

【分子式】$C_6H_8N_2O_8$

【分子量】236.14

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭。本品在丙酮或三氯甲烷中易溶，在乙醇中略溶，在水中微溶。

熔点：本品的熔点为 68 ~ 72℃。

比旋度：取本品，精密称定，加无水乙醇溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为 + 135°至 + 140°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：血管扩张药。

硝酸异山梨酯（ISDN）主要药理作用是松弛血管平滑肌。ISDN 在体内代谢生成单硝酸异山梨酯（ISMN），后者释放氧化氮（NO），NO 与内皮舒张因子相同，激活鸟苷酸环化酶，使平滑肌细胞内的环鸟苷酸（cGMP）增多，从而松弛血管平滑肌，使外周动脉和静脉扩张，对静脉的扩张作用更强。静脉扩张使血液潴留在外周，回心血量减少，左室舒张末压和和肺毛细血管楔嵌压（前负荷）减低。动脉扩张使外周血管阻力、收缩期动脉压和平均动脉压（后负荷）减低。冠状动脉扩张，使冠脉灌注量增加。总的效应是使心肌耗氧量减少，供氧量增多，心绞痛得以缓解。

致癌、致突变及生殖力损害作用：动物（鼠）试验中，大剂量长期（2 年以上）应用硝酸异山梨酯可产生肝纤维化及间质细胞瘤。大剂量有微弱的致突变作用。无致畸性。给予大鼠一日 25 ~ 100mg/kg 最大推荐剂量 24 个月，生育力未见明显减退。

【药代动力学】口服吸收完全，平均生物利用度约 25%，肝脏首过代谢明显。血清浓度达峰时间在服药后 1 小时。吸收后的分布容积为 2 ~ 4 L/kg，清除率为 2 ~ 4 L/min，半衰期约 1 小时。脱硝基后生成 2 - 单硝酸酯（15% ~ 25%）和 5 - 单硝酸酯（75% ~ 85%），两者均有生物活性。5 - 单硝酸酯的活性更强，半衰期为 5 小时，在血清中脱硝后形成异山梨醇（大约 37%）和右旋山梨醇（大约 7%），由尿中排出，此外 25% 以葡糖醛酸形式排出，2% 以原形排出，粪便中排出 < 1%。5 - 单硝酸酯的代谢产物均无扩血管作用。与硝酸甘油比较，硝酸异山梨酯血浓度高的多且稳定。

本品气雾剂生物利用度 100%，起效快。

当喷雾剂进入口腔后，立即经黏膜吸收，5 ~ 7.5 分钟后，血药浓度达最大峰值。每次喷雾 1.25mg 时，最大血药浓度为 16.2ng/ml，两次连续喷入 2.5mg 时，则为 32.7ng/ml。用药后 2、4、6 和 10 分钟，血药浓度明显高于该药之吸入剂。2.5mg 喷雾后平均吸收半衰期为 1.1 分钟，当使用该药吸入剂时，其生物利用度仅为本剂型之 75%，喷雾剂在其应用 2 小时后仍可从血中测出。喷雾剂型生物利用度较舌下片和口服片分别高出 40% 和 66%。

本品可经皮肤吸收。贴膜产生稳定的血浓度

生物利用度约 30%，作用持续 16～24 小时。

经静脉给药，迅速分布至全身，在心脏、脑组织和胰腺中含量较高，脂肪组织、皮肤、大肠、肾上腺和肝脏含量较低，血浆蛋白结合率低。经至肝脏时，大部分药迅即被代谢成活性产物 2－单硝酸异山梨酯和 5－单硝酸异山梨酯，肾脏是其主要排泄途径，其次为胆汁排泄。

【药物相互作用】 与其他血管扩张剂、钙拮抗剂、β受体阻滞剂、降压药、三环抗抑郁药及酒精合用，可增强本类药物的降血压效应。可加强二氢麦角碱的升压作用。同时使用类固醇抗炎药可降低本药的疗效。消炎痛可抑制硝酸异山梨酯的扩张血管作用。

【药物过量】 与血管过度扩张有关的反应有颅内压增高、眩晕、心悸、视力模糊、恶心与呕吐、晕厥、呼吸困难、出汗伴皮肤潮红或湿冷、传导阻滞与心动过缓、瘫痪、昏迷、癫痫发作或死亡。无特异的拮抗剂可对抗 ISMN 的血管扩张作用，用肾上腺素和其他动脉收缩剂可能弊大于利，处理方法包括抬高患者的下肢以促进静脉回流以及静脉补液。也可能发生高铁血红蛋白血症，治疗方法是静注亚甲蓝 1～2 mg/kg。

【不良反应】 用药初期可能会出现硝酸酯引起的血管扩张性头痛，还可能出现面部潮红、眩晕、直立性低血压和反射性心动过速。偶见血压明显降低、心动过缓和心绞痛加重，罕见虚脱及晕厥。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
硝酸异山梨酯缓释胶囊	化学药	HZ0003715
硝酸异山梨酯缓释片	化学药	HZ0003716
硝酸异山梨酯喷雾剂	化学药	HZ0003717
硝酸异山梨酯片	化学药	HZ0003718
硝酸异山梨酯葡萄糖注射液	化学药	HZ0003719
硝酸异山梨酯气雾剂	化学药	HZ0003720
硝酸异山梨酯乳膏	化学药	HZ0003721
硝酸异山梨酯注射液	化学药	HZ0003722
注射用硝酸异山梨酯	化学药	HZ0005014

HY002046 硝酸益康唑

【外文名称】 Econazole Nitrate

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 1－［2,4－二氯－β（4－氯苄氧基）苯乙基］咪唑硝酸盐

【分子式】 $C_{18}H_{15}Cl_3N_2O \cdot HNO_3$

【分子量】 444.70

【性状及组成】 本品为白色或微黄色的结晶或结晶性粉末，无臭。本品在甲醇中易溶，在三氯甲烷中微溶，在水中极微溶解。

熔点：本品的熔点为 163～167℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：抗真菌药。

本品为吡咯类抗真菌药，为咪康唑的去氯衍生物。对念珠菌属、着色真菌属、球孢子菌属、组织浆胞菌属、孢子丝菌属等均具抗菌作用，对毛发癣菌等亦具抗菌活性。本品对曲霉、申克孢子丝菌、毛霉属某些暗色孢科等作用差。

本品通过干扰细胞色素 P450 的活性，从而抑制真菌细胞膜主要固醇类－麦角固醇的生物合成，损伤真菌细胞膜并改变其通透性，以致重要的细胞内物质外漏。本品可抑制真菌的三酰甘油和磷脂的生物合成，抑制氧化酶和过氧化酶的活性，引起细胞内过氧化氢积聚导致细胞亚微结构变性和细胞坏死。对白念珠菌则可抑制其自芽孢转变为侵袭性菌丝的过程。

【药代动力学】 本品外用后大部分进入表皮，亦可达到真皮，仅 1%吸收入血液，在尿和粪便中的重吸收量小于给药量的 1%。

【不良反应】 个别患者出现局部刺激，偶见过敏反应，表现为皮肤灼热感、瘙痒、针刺感、充血等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方莪术油栓	化学药	HZ001153
复方硝酸益康唑软膏	化学药	HZ001442
复方益康唑氧化锌撒粉	化学药	HZ001473
曲安奈德益康唑乳膏	化学药	HZ003020
曲安奈德益康唑乳膏（Ⅱ）	化学药	HZ003021
硝酸益康唑喷剂	化学药	HZ003723
硝酸益康唑气雾剂	化学药	HZ003724
硝酸益康唑溶液	化学药	HZ003725
硝酸益康唑乳膏	化学药	HZ003726
硝酸益康唑栓	化学药	HZ003727
硝酸益康唑癣药水	化学药	HZ003728

HY002047　硝酸银

【外文名称】Silver Nitrate

药物理化信息

【化学名】硝酸银

【分子式】$AgNO_3$

【分子量】169.89

药物药理信息

【药理毒理】本品为消毒防腐药。具有杀菌、收敛和促进创面愈合的作用，作用强度与浓度和作用时间成正比。本品对淋病奈瑟菌特别敏感，对化脓性肺炎球菌、金黄色葡萄球菌、铜绿假单胞杆菌、变形杆菌、感冒杆菌及沙眼衣原体具有较强的抗菌活性。

本品作用机制是银离子与蛋白质结合，抑制酶系统，破坏细胞核，使细菌蛋白质凝固而死亡。

【药代动力学】本品几乎不吸收入体循环。

【不良反应】外用可出现局部红斑、充血、烧灼感等皮肤刺激症状。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
硅炭银片	化学药	HZ001648
硝酸银软膏	化学药	HZ003729

HY002048　硝西泮

【其他名称】莫加顿、硝基安定、硝基二氮䓬、消虑苯、硝西潘、硝䓬酮、益脑静

【外文名称】Nitrazepam

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】5－苯基－7－硝基－1，3－二氢－2*H*－1，4－苯并二氮䓬－2－酮

【分子式】$C_{15}H_{11}N_3O_3$

【分子量】281.27

【性状及组成】本品为淡黄色结晶性粉末，无臭，无味。本品在三氯甲烷中略溶，在乙醇或乙醚中微溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 226～229℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗焦虑药、抗惊厥药

本品为苯二氮䓬类抗焦虑药，作用机制与其选择性作用于大脑边缘系统，与中枢苯二氮䓬受体结合，而促进 γ－氨基丁酸的释放，促进突触传导功能有关，具有安定、镇静及显著催眠作用。本品还具有中枢性肌松弛作用和抗惊厥作用。

【药代动力学】口服快速吸收，生物利用度为 78%，口服后 2 小时血药浓度达峰值，2～3 天血药浓度达稳态，蛋白结合率高达 85%，半衰期为 8～36 小时，在肝脏代谢，大部分以代谢产物随尿排出，20%随粪便排出。总清除率为 4L/h，表观分布容积 175L。本品可通过胎盘。

【药物相互作用】

1．本品与易成瘾的和其他可能成瘾药合用时，成瘾的危险性增加。

2．饮酒及与全麻药、可乐定、镇痛药、单胺氧化酶抑制药和三环类抗抑郁药合用时，可相互增效。

3．本品与抗酸药合用时可延迟本品的吸收。

4．本品与抗高血压药或与利尿降压药合用时，可使降压作用增强。

5．本品与钙离子通道拮抗药合用时，可使低血压加重。

6．本品与西咪替丁合用时可以抑制本品的肝脏代谢，从而使清除减慢，血药浓度升高。

7．本品与普萘洛尔合用时可导致癫痫发作的类型和（或）频率改变，应及时调整剂量。

8．本品与卡马西平合用时，由于肝微粒体酶的诱导可使两者的血药浓度下降，清除半衰期缩短。

9．本品与左旋多巴合用时，可降低后者的疗效。

10．本品与抗真菌药酮康唑、伊曲康唑合用，可提高本品疗效并增加其毒性。

【药物过量】中毒症状：大剂量中毒时，可出现昏迷、血压降低、呼吸抑制和心动缓慢等。

处理：立即催吐、洗胃、导泻以排除药物，并依病情给予对症治疗及支持疗法。

【不良反应】常见嗜睡，可见无力、头痛、晕眩、恶心、便秘等，偶见皮疹、肝损害、骨髓抑制。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方苯硝那敏片	化学药	HZ001088
硝西泮片	化学药	HZ003730

HY002049　硝乙醇胺

【外文名称】Itramine

药物药理信息

【药理毒理】本品为速效抗心绞痛药，舌下含服约2分钟奏效，口服持续时间为4小时，主要用于心绞痛发作时的缓解症状。

【不良反应】不良反应与硝酸甘油类似，急性心肌梗死期禁用。

HY002050 小茴香油

【外文名称】Fennel Oil

【性状及组成】小茴香油有甜和苦小茴香油之分，它们分别由伞形科植物甜小茴香（*Foeniculum vulgate* Mill. var. dulce D. C.）和苦小茴香（*F. Vulgate* Mill. var. amara）的种子经水蒸气蒸馏得到的浅黄色或黄绿色液体。

甜小茴香油具有茴香特征辛香气，带甜味。旋光度 + 12°至 + 24°（25℃），凝固点≥3℃。主成分为反式茴脑、d－水芹烯、α－水芹烯和d－苧烯等。

苦小茴香油具带樟脑和茴香辛香，味微苦而后甜。旋光度 + 20° ~ + 68°（20℃）。主成分为反式茴脑、α－蒎烯、茨烯、α－水芹烯等。

药物药理信息

【药理毒理】增香剂。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
胃痛宁片	中成药	ZC005737
乌金片	中成药	ZC005800

HY002051 缬氨酸

【外文名称】Valine

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】L－2－氨基－3－甲基丁酸

【分子式】$C_5H_{11}NO_2$

【分子量】117.15

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末，无臭，味微甜而后苦。

本品在水中溶解，在乙醇中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加6mol/L盐酸溶液溶解并释稀成每1ml中含80mg的溶液，依法测定，比旋度为 + 26.5°至 + 29.0°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：氨基酸类药。

本品属必需氨基酸。成人男子需要量为10mg/(kg·d)。L－型的生理效果为D－型的2倍。如缺乏可引起神经障碍、停止发育、体重下降、贫血等。作为营养增补剂，可与其他必需氨基酸共同配制氨基酸输液、综合氨基酸制剂。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
11氨基酸注射液－833	化学药	HZ000212
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
低分子右旋糖酐氨基酸注射液	化学药	HZ000673
复方氨基酸胶囊（8－11）	化学药	HZ001047
复方氨基酸颗粒（14AA）	化学药	HZ001049
复方氨基酸口服溶液（14AA）	化学药	HZ001050
复方氨基酸（15）双肽（2）注射液	化学药	HZ001051
复方氨基酸注射液（3AA）	化学药	HZ001052
复方氨基酸注射液（6AA）	化学药	HZ001053
复方氨基酸注射液（9AA）	化学药	HZ001054
复方氨基酸注射液（14AA）	化学药	HZ001055
复方氨基酸注射液（15AA）	化学药	HZ001056
复方氨基酸注射液（15－HBC）	化学药	HZ001057
复方氨基酸注射液（17AA）	化学药	HZ001058
复方氨基酸注射液（17AA－Ⅰ）	化学药	HZ001059
复方氨基酸注射液（17AA－H）	化学药	HZ001060
复方氨基酸注射液（17种氨基酸）	化学药	HZ001061
复方氨基酸注射液（18）	化学药	HZ001062
复方氨基酸注射液（18AA）	化学药	HZ001063
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅰ）	化学药	HZ001064
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅱ）	化学药	HZ001065
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅲ）	化学药	HZ001066
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅳ）	化学药	HZ001067
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅴ）	化学药	HZ001068
复方氨基酸注射液（18AA－N）	化学药	HZ001069
复方氨基酸注射液（18－B）	化学药	HZ001070
复方氨基酸注射液（20AA）	化学药	HZ001071
六合氨基酸颗粒	化学药	HZ002444
小儿复方氨基酸注射液（18AA－Ⅰ）	化学药	HZ003749
小儿复方氨基酸注射液（18AA－Ⅱ）	化学药	HZ003750
小儿复方氨基酸注射液（19AA－Ⅰ）	化学药	HZ003751
脂肪乳氨基酸葡萄糖注射液	化学药	HZ004653

HY002052　缬沙坦

【其他名称】Diovan

【外文名称】Valsartan

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第49册

药物理化信息

【化学名】（*S*）－*N*－戊酰基－*N*－［［2′－（1*H*－5－四氮唑－基）［1,1－联二苯］－4－基］甲基］－缬氨酸

【分子式】$C_{24}H_{29}N_5O_3$

【分子量】435.52

【性状及组成】本品为白色结晶或白色、类白色粉末，有引湿性。

本品在乙醇中极易溶解，在甲醇中易溶；在乙酸乙酯中略溶，在水中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加甲醇溶解并稀释成每1ml中含10mg的溶液、依法测定，比旋度为－64.0°至－69.0°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：血管紧张素Ⅱ－AT1受体拮抗剂。

缬沙坦也属于非肽类、口服有效的血管紧张素Ⅱ（AT）受体拮抗剂。它对Ⅰ型受体（AT_1）有高度选择性，可竞争性地拮抗而无任何流动作用。它还可抑制AT所致的肾上腺球细胞释放醛固酮，但对钾所致的释放，缬沙坦没有抑制作用，这也说明缬沙坦对AT受体的选择作用。经各种类型的高血压动物模型的体内试验均表明缬沙坦具有良好的降压作用，对心收缩功能及心率无明显影响。对血压正常的动物则不产生降压作用。突然停药，不会出现血压反跳或其他临床不良反应。高血压患者服药，在血压下降时，不影响心率。

【药代动力学】口服吸收快，2小时达峰值，血浆浓度以双指数方式下降，分布相和消除相的平均半衰期分别小于1小时和6～7小时，重复或每天给药动力学没有改变，药物在体内无蓄积。平均药物体内总量以曲线下面积AUC表示，其增加大小与测定范围内的剂量成正比。单剂量静注后，人的稳态分布容积约为17L，血浆清除率为2.2L/h。静注时30%，口服时10%的药物以原形从尿排出，其余从胆汁排出。同食物一起服用后，缬沙坦的吸收减少46%。低血药浓度阻碍了对外源性血管紧张素Ⅱ的反应。因此，进食并未显著影响这一药效学效应，缬沙坦的药代动力学不受年龄的影响。

【药物相互作用】临床试验未发现本药与下列药物间存在有临床意义的相互作用：西咪替丁、华法林、呋塞米（呋喃苯胺酸）、地高辛、阿替洛尔、吲哚美辛、氢氯噻嗪、氨氯地平、格列本脲。

由于缬沙坦基本不被代谢，所以它与细胞色素P450酶系统的诱导剂或抑制剂通常不会发生有临床意义的相互作用。尽管缬沙坦与血浆蛋白结合率高，但体外实验表明本药与其他血浆蛋白结合率高的药物，如双氯芬酸、呋塞米（呋喃苯胺酸）和华法林之间无血浆蛋白结合方面的相互作用。

与保钾利尿剂（如螺内酯、氨苯喋啶、阿米洛利）、钾制剂、或含钾的盐代用品合用时，可使血钾升高。如必须同时服用，应注意监测。

【药物过量】虽然无本药过量的经验，但其可能出现的主要症状是明显的低血压。如果是在服药后不久发生，可采用催吐治疗，否则可按常规采用静脉滴注生理盐水。本品与血浆蛋白结合率高，故不太可能经透析被清除。

【不良反应】本药的总体不良反应发生率与安慰剂组相似。临床应用中曾观察到的不良反应主要有：头痛、头晕、病毒感染、上呼吸道感染、咳嗽、腹泻、疲劳、鼻炎、背痛、恶心、咽炎及关节痛。不良反应的发生率与剂量和治疗时间长短无关，与性别、年龄或种族无关，尚未知此反应是否与本品治疗有因果关系。

化验指标：本药偶可引起血红蛋白和血球压积减少。在临床对照试验中，服用本药的患者出现血球压积和血红蛋白明显降低，分别为0.8%和0.4%，安慰剂组为0.1%。

服用本药与服用ACE抑制剂，出现中性粒细胞减少症的患者分别为1.9%和1.8%。

在临床对照试验中，服用本药的患者发生明显的血肌酐、血钾及总胆红素升高者分别为0.8%，4.4%和6%，而ACE抑制剂组分别为1.6%，6.4%和12.9%。

服用本药的患者偶有肝功能指标升高。

本药治疗原发性高血压患者时无需监测特殊的实验室指标。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
缬沙坦分散片	化学药	HZ003787
缬沙坦胶囊	化学药	HZ003788
缬沙坦片	化学药	HZ003789
缬沙坦氢氯噻嗪胶囊	化学药	HZ003790
缬沙坦氢氯噻嗪片	化学药	HZ003791

HY002053 辛伐他汀

【其他名称】斯伐他汀、舒降脂

【外文名称】Simvastatin

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第49册

药物理化信息

【化学名】2,2-二甲基丁酸-8-｛(4*R*, 6*R*)-6-(2-[(1*S*,2*S*,6*R*,8*S*,8a*R*)-1,2,6,7,8,8-*a*-六氢-8-羟基-2,6-二甲基-1-萘基]乙基)｝四氢-4-羟基-2*H*-吡喃-2-酮酯

【分子式】$C_{25}H_{38}O_5$

【分子量】418.57

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末或结晶性粉末。

本品在乙腈、乙醇、甲醇中易溶，在水中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加乙腈使溶解并制成每1ml中约含5mg的溶液，依法测定测定，25℃比旋度为+285°至+298°。

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理作用

本品为3-羟基-3-甲基-戊二酰-辅酶A（HMG-CoA）还原酶的抑制剂，抑制内源性胆固醇的合成，为降血脂药。辛伐他汀可降低正常的和升高的低密度脂蛋白胆固醇（LDL-C）水平。低密度脂蛋白（LDL）由极低密度脂蛋白（VLDL）生成，主要通过与LDL受体结合代谢。辛伐他汀降低LDL作用的机制在于降低VLDL胆固醇浓度和LDL受体的诱导作用，从而导致LDL-C的产生减少和（或）分解代谢增加。载脂蛋白B（Apo B）在辛伐他汀治疗期间也有下降。因为每个LDL微粒包含一分子Apo B，而且在主要以LDL-C升高的病人（不伴随VLDL升高）体内仅发现很少的Apo B，均提示辛伐他汀不仅通过降低LDL而降低胆固醇，而且减少外周的LDL微粒的浓度。另外，辛伐他汀可降低VLDL和甘油三酯（TG），并升高HDL-C。辛伐他汀对于脂蛋白、纤维蛋白原和冠心病的其他的生化指标的影响尚不明确。

2. 毒理研究

（1）遗传毒性：微生物致突变实验（Ames），体外大鼠肝细胞碱洗脱分析、哺乳动物V-79细胞正向致突变研究、体外CHO细胞染色体突变研究或体内小鼠骨髓细胞染色体突变分析实验，均未发现致突变作用。

（2）生殖毒性：辛伐他汀大鼠一日剂量25mg/kg或兔10mg/kg，未见致畸性。两剂量均达到人暴露体表面积（mg/m^2）的3倍。在另一个结构相关的HMG-CoA还原酶抑制剂的研究中，发现大鼠和小鼠的骨骼畸形。

给予辛伐他汀25mg/kg（以病人剂量的AUC计，为人最大暴露水平的4倍）共34周，雄性大鼠生育力降低。但在随后的一个雄性大鼠服用同样剂量的辛伐他汀共11周（精子发育的完整周期，包括附睾发育成熟）的生育力实验中，未观察到对生育力的影响。这两个实验显微镜下均未观察到大鼠睾丸的改变。180mg/（kg·d）时（这一剂量以体表面积计，比人用剂量80mg/（kg·d）的最大暴露水平高22倍）观察到输精管变性（生精上皮的坏死和损伤）。狗服用10mg/（kg·d）（以AUC计约为人类暴露剂量80mg/天的2倍），可见与药物相关的睾丸萎缩、精子产生减少、精母细胞变性和巨细胞形成。尚不明确以上发现的临床意义。

致癌性：小鼠给予辛伐他汀25、100和400mg/(kg·d)，时间为72周的致癌性实验表明，平均血药浓度分别高于人类口服80mg/（kg·d）平均血药浓度的约1、4和8倍（以AUC作为总抑制活性）。在高剂量雌性组和中、高剂量雄性组，肝癌发生率显著升高，雄性组最高发生率为90%。中和高剂量雌性组肝腺瘤的发生率显著升高。雌性和雄性中和高剂量组肺腺瘤的发生率也显著升高。高剂量雄性组与对照组相比，副泪腺（啮齿类动物眼睛的腺体）腺瘤显著增多。25mg/（kg·d）组未见对致癌性的影响。

小鼠给予剂量达25mg/（kg·d）的92周研究中，未见其致癌性作用（通过AUC计算，平均血浆药物浓度高于人口服80mg辛伐他汀血药浓度的1倍）。

大鼠给予辛伐他汀25mg/（kg·d）连续，雌性大鼠甲状腺滤泡腺瘤的发生率有统计学意义地显著升高，通过AUC计算，其暴露水平较人服用辛伐他汀80mg高11倍。

大鼠连续两年，剂量为50和100mg/（kg·d）的致癌性研究，发现肝细胞腺瘤和癌（在雌性的两个剂量组和雄性100mg/（kg·d）组）。在雄性和雌性的两个剂量组中甲状腺滤泡细胞腺瘤增多，雌性100mg/（kg·d）组甲状腺滤泡细胞癌增多。其他HMG-CoA还原酶抑制剂均出现甲状腺肿瘤发生率增高。其血药浓度相当于人类每日剂量80mg平均血浆药物暴露水平的7和15倍（雄性）和22和25倍（雌性）。

【药代动力学】辛伐他汀口服后对肝脏有高度的选择性，其在肝脏中的浓度明显高于其他非靶性组织，辛伐他汀的大部分经肝组织吸收，主要作用在

肝脏发挥，随后从胆汁中排泄。只有低于5%口服剂量活性结构的辛伐他汀在外围中发现，而其中95%可与血浆蛋白结合。

【药物相互作用】

1．当辛伐他汀与其他在治疗剂量下对细胞色素P450 3A4有明显抑制作用的药物（如：环孢霉素、米贝地尔、伊曲康唑、酮康唑、红霉素、克拉霉素和奈法唑酮）或纤维酸类衍生物或烟酸合用时，导致横纹肌溶解的危险性增高。

2．本品与甲基羟戊二酰辅酶A（HMG－COA）还原酶抑制剂合并用药会增加肌病的发生率和严重程度，这些药物包括吉非贝齐和其他贝特类，以及降脂剂量的烟酸（大于等于1g/d）。此外，血浆中高水平的甲基羟戊二酰辅酶A还原酶抑制剂的活性增高也会增加肌病的危险。辛伐他汀和其他甲基羟戊二酰辅酶A还原酶抑制剂由细胞色素P450的同工酶3A4所代谢。数种在治疗剂量对此代谢途径有明显抑制作用的药物能增高甲基羟戊二酰辅酶A还原酶抑制剂的血药水平，并因而增加肌病的危险。这些药物包括环孢菌素、Ⅵ四氢萘酚类、钙通道阻滞剂米贝地尔、伊曲康唑、酮康唑及其他抗真菌唑类、大环内酯类抗生素红霉素和克拉霉素，以及抗抑郁药奈法唑酮。

3．香豆类衍生物，临床研究曾发现辛伐他汀能中度提高香豆类抗凝剂的抗凝效果。故成人早期应用抗凝血治疗及并用辛伐他汀时应多次检查凝血酶原时间，籍此确定凝血酶原时间没有显著改变。当服用香豆类衍生物的病人，已有一个稳定的凝血酶原时间后，仍推荐在固定的期间内继续作凝血酶原时间的监察。如果辛伐他汀的剂量有变动，应同样执行以上的程序。在未服用抗凝血剂的病人中，辛伐他汀治疗从未有报道对出血或凝血酶原时间有影响。

【不良反应】辛伐他汀一般耐受性良好，大部分副作用轻微且为一过性。在临床对照实验中只有少于2%的病人因辛伐他汀的副作用而中途停药。

在已有对照组的临床实验中不良反应（分为可能、可疑或肯定）与药物有关的发生率大于或等于1%的有腹痛、便秘、胃肠胀气，发生率在0.5%～0.9%的不良反应有疲乏无力、头痛。发现肌病的报道很罕见。

下列不良反应的报道曾出现在无对照组临床试验或上市后的应用中：如恶心、腹泻、皮疹、消化不良、瘙痒、脱发、晕眩、肌肉痉挛、肌痛、胰腺炎、感觉异常、外周神经病变、呕吐和贫血、横纹肌溶解和肝炎/黄疸罕有发生，横纹肌溶解和肝炎有报道。

包括下列一项或多项特征的明显过敏反应综合征罕有报道：血管神经性水肿、狼疮样综合征、风湿性多发性肌痛、脉管炎、血小板减少症、嗜酸细胞减少症、关节炎、关节痛、荨麻疹、发烧、发热、潮红、呼吸困难，以及不适。

实验室检查发现，血清转氨酶显著和持续性升高的情况罕有报道。肝功能检查异常为轻微或一过性的。来源于骨骼肌部分的血清肌酸激酶（CK）升高的情况已有报道。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
辛伐他汀滴丸	化学药	HZ003792
辛伐他汀分散片	化学药	HZ003793
辛伐他汀胶囊	化学药	HZ003794
辛伐他汀片	化学药	HZ003795

HY002054　辛弗林

【其他名称】对羟福林、脱氧肾上腺素、辛内福林

【外文名称】Synephrine

药物理化信息

【化学名】4－hydroxy－α［（methylamino）methyl］benzenemethanol

【分子式】$C_9H_{13}NO_2$

【分子量】167.20

【性状及组成】本品为白色到类白色精细粉末，易溶于甲醇、乙醇。在强酸、强碱离子交换树脂层析分离中易发生消旋化作用。

熔点：本品的熔点为184～185℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为肾上腺素α受体兴奋剂，对心脏α受体有一定的兴奋作用。辛弗林有收缩血管、产生升高血压的作用。辛弗林有较强的扩张气管和支气管的作用。麻醉猫静脉注射可完全对抗组织胺所引起的支气管收缩，对豚鼠离体气管亦有同样作用。辛弗林临床用于治疗支气管哮喘及手术和麻醉时低血压、虚脱及休克、体位性低血压等。

国外研究发现辛弗林还具有以下作用：

提高新陈代谢、增加热量消耗、提高能量水平、氧化脂肪、减肥。因此，辛弗林常用为减肥药物中的有效成分。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
胃苏颗粒	中成药	ZO005731

HY002055 辛基甲氧基肉桂酸酯

药物药理信息

【药理毒理】药品标准类别：乳膏基质。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方二氧化钛乳膏	化学药	HZ001159

HY002056 锌元素

【外文名称】Zinc

药物药理信息

【药理毒理】锌是微量元素的一种，人体正常含锌量为2～3g。绝大部分组织中都有极微量的锌分布，其中肝脏、肌肉和骨骼中含量较高。锌是80多种酶的组成成分或激动剂。如DNA聚合酶、碱性磷酸酶、碳酸酐酶、乳酸脱氢酶、谷氨酸脱氢酶、超氧化物歧化酶等，参与体内多种物质的代谢。锌还参与胰岛素合成。成人一日需要量为15～200mg。

缺乏锌时，生长停滞、生殖无能、伤口不易愈合、机体衰弱，还可发生结膜炎、口腔炎、舌炎。食欲减退、慢性腹泻、味觉丧失以及神经症状等。锌对儿童生长发育尤为重要。

【药代动力学】锌主要在小肠中吸收。肠腔内有与锌特异结合的因子，能促进锌的吸收。肠黏膜细胞中的锌结合蛋白能与锌结合并将其转动到基度膜一侧，锌在血中与白蛋白结合而送输。锌主要随胰液、胆汁排泄入肠腔。由粪便排出，部分锌可从尿及汗排出。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
多维元素胶囊（13）	化学药	HZ000801
多维元素片	化学药	HZ000804
多维元素片（16）	化学药	HZ000806
多维元素片（16－Ⅱ）	化学药	HZ000807
多维元素片（21）	化学药	HZ000808
多维元素片（29）	化学药	HZ000810
多种维生素片	化学药	HZ000817
复方多维元素片（21）	化学药	HZ001151
复方多维元素片（23）	化学药	HZ001152
复方营养混悬剂	化学药	HZ001478
复合维生素片	化学药	HZ001497
善存银片	化学药	HZ003189

HY002057 新福菌素

【其他名称】放线菌素23－21、更生霉素、更新霉素

【外文名称】Actinomycin 23－21

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第5册

【性状及组成】本品主要成分为：放线菌素D和放线菌素S3。

放线菌素D：分子式，C62H86N12O16；分子量，1255.44。

放线菌素S3：分子式，C62H85N12O17；分子量，1270.44。

药物药理信息

【药理毒理】新福菌素由发色环和多肽两个部分组成，主要含有Actinomycin D和Actinomycin S_3，分别占总量的50%～70%和25%～40%，Act23－21的抗癌效应主要由这两个组分决定，药理与临床验证认为Actinomycin D和Actinomycin S_3构成的比例恰当时，其疗效有协同作用，且副反应较轻。

本品为细胞周期非特异性药物，对G_1期前半段最敏感，即相当mRNA合成时。其作用机制为与DNA结合，抑制以DNA为模板的RNA多聚酶，从而抑制RNA的合成。结合方式可能是通过其发色团嵌入DNA的碱基对之间，而其肽链则位于DNA双螺旋的小沟内，妨碍RNA多聚酶沿DNA分子前进，本品对RNA合成的抑制作用主要是RNA链的延伸而不是影响它的起始，本品选择性地与DNA中的鸟嘌呤结合，与缺乏鸟嘌呤碱基的RNA不发生结合作用。本品不能阻止DNA的复制，因DNA多聚酶能在其正前方引起DNA局部变性（如双螺旋的解开），可使本品较快地解离开。

【药代动力学】动物试验表明静脉注射后迅速分布至各组织，胆汁＞肾＞脾＞肝＞胰＞肺，其他如心、胃、大肠、小肠均含有微量本品，而雄性生殖系统测不到本品，雌性生殖系统中有微量存在，并与组织结合；静脉给药后不同时间取血，在血清中均未测得新福菌素。给药后25小时尿中自然排泄出新福菌素占给药量2.6%～8%。在体内代谢的量很小，缓慢自尿及粪排泄，原形药品10%由尿排出，50%由胆道排出。半衰期（$t_{1/2}$）为36小时。9日后仅能发现注射剂量的30%。

【不良反应】

1. 骨髓抑制：可出现白细胞、血小板明显下降，常在用药后7～14日出现。

2. 胃肠道反应：表现为食欲减退、恶心、呕

吐、腹泻，少数有口腔溃疡。

3. 局部反应：静注可引起静脉炎，漏到血管外可引起组织坏死。

4. 其他：少数患者出现头晕、乏力、骨关节酸痛、肝功能损害、心电图改变、脱发等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
新福菌素注射液	化学药	HZ003797

HY002058　新鱼腥草素钠

【外文名称】Sodium New - houttuyninum

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第5册

药物理化信息

【化学名】亚硫酸氢钠十二酰乙醛

【分子式】$C_{14}H_{27}NaO_5S$

【分子量】330.41

药物药理信息

【药理毒理】

药理作用：本品为三白草科植特蕺菜（*Houttuynia sulfite*）全草挥发油中一种醛类成分的化学合成物。对肺炎双球菌、伤寒杆菌、金黄色葡萄球菌、大肠杆菌及孢子丝菌等有明显抑制作用。可提高机体免疫力，增加患者白细胞的吞噬功能，提高血清白介素水平，提高机体非特异性免疫力。

毒理研究：（1）在20组18～20g的实验小白鼠中（每组5只），尾静脉注射本品0.3ml（2mg/ml），或腹腔注射1ml（2 mg/ml），24小时内，未见任何中毒症状与死亡现象。（2）豚鼠实验40只，20只作对照试验，按日用量8mg/kg，分2次腹腔注射，连续给药30天后处死。给药动物心、肝、肾、肺等组织，均未见有特异性病理病变。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
新鱼腥草素钠注射液	化学药	HZ003800
注射用新鱼腥草素钠	化学药	HZ005017

HY002059　胸腺蛋白

【外文名称】Thymus Protein

【性状及组成】本品主要组成成分为从健康乳猪新鲜胸腺中提取的蛋白质。

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理：体外细胞培养试验证明本品对内皮及成纤维细胞有促增殖作用；动物实验研究表明，本品能直接对不同因素所致的胃溃疡模型有明显的预防和治疗作用，其特点是通过增强胃黏膜 Na^+，K^+ - ATP酶活力和提高胃黏液细胞功能、增加胃黏膜前列腺素合成及降低血浆内皮素水平等机制，达到保护和营养胃黏膜、促进其损伤修复的作用。

2. 毒理：本品经口急性毒性最大耐受量为4000mg/kg（即 LD_{50} > 4000mg/kg），经口长期毒性试验，各项观察指标未见明显异常。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
胸腺蛋白口服溶液	化学药	HZ003802

HY002060　胸腺肽

【外文名称】Thymopeptidum

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第16册

【性状及组成】本品主要成分为：胸腺 α_1 及其他小分子多肽。

药物药理信息

【药理毒理】本品为免疫调节药。具有调节和增强人体细胞免疫功能的作用，能促使有丝分裂原激活后的外周血中的T淋巴细胞成熟，增加T细胞在各种抗原或致有丝分裂原激活后各种淋巴因子（如：α、γ干扰素、白介素2和白介素3）的分泌，增加T细胞上淋巴因子受体的水平。它同时通过对T4辅助细胞的激活作用来增强淋巴细胞反应。此外，本品可能影响NK前体细胞的趋化，该前体细胞在暴露于干扰素后变得更有细胞毒性。因此，本品具有调节和增强人体细胞免疫功能的作用。

【药物相互作用】

1. 本品与许多常用药物合并使用，其中包括干扰素、消炎药、抗菌素、激素、镇痛药、降压药、利尿药、治疗心血管疾病的药物、中枢神经系统药物、避孕药，没有任何干扰现象出现。

2. 本品与干扰素合用，对于改善免疫机能有协同作用。

3. 本品与抗生素合用，能增强抗菌作用。

4. 本品与化疗药合用，可降低化疗的不良反应。

【药物过量】目前尚无任何关于人体过量（治疗或意外）的报道。动物毒性试验显示在10mg/kg剂量以下（目前研究所用最高量）没有任何副反应发生。

【不良反应】

1. 耐受性良好、个别可见恶心、发热、头晕、

胸闷、无力等不良反应，少数患者偶有嗜睡感。

2. 慢性乙型肝炎患者使用时可能 ALT 水平短暂上升，如无肝衰竭预兆出现，仍可继续使用本品。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
胸腺肽肠溶胶囊	化学药	HZ003803
胸腺肽肠溶片	化学药	HZ003804
胸腺肽注射液	化学药	HZ003805
胸腺肽注射液	化学药	HZ003805
注射用胸腺肽	化学药	HZ005018

HY002061 胸腺肽 α_1

【外文名称】Thymosin α_1

【性状及组成】本品为白色粉末或片状物。

药物药理信息

【药理毒理】

药理作用：本品治疗慢性乙型肝炎和增强免疫系统反应性的作用机制尚未完全阐明。多项体外试验显示，本品通过刺激外周血液淋巴细胞丝裂原来促进 T 淋巴细胞的成熟，增加抗原或丝裂原激活后 T 细胞分泌的干扰素 α、干扰素 γ 以及白介素 2、白介素 3 等淋巴因子水平，同时增加 T 细胞表面淋巴因子受体水平。本品还可通过对 CD4 细胞的激活，增强异体和自体的人类混合淋巴细胞反应。本品可能增加前 NK 细胞的聚集，而干扰素可使其细胞毒性增强。体内试验显示，本品可以提高经刀豆蛋白 A 激活后小鼠淋巴细胞白介素 2 受体的表达水平，同时提高白介素 2 的分泌水平。

毒理研究

遗传毒性：本品遗传毒性试验结果阴性。

生殖毒性：本品对动物胎仔无明显致畸作用。目前尚不清楚妊娠妇女使用本品后，是否会影响其生殖力或对胎儿造成损害。只有在确实需要时，妊娠妇女才能使用本品。同样，目前也不清楚本品是否能够经人乳汁分泌，因此哺乳期妇女使用本品应慎重。

【药代动力学】健康人单次皮下注射胸腺肽 α_1 1.6mg，血药峰浓度为 37.51ng/ml，达峰时间约为 1.67 小时，$AUC_{0\to15}$ 约为 152.15ng/（ml·h），半衰期约为 1.65 小时。

【药物过量】目前未见任何有关人体用药过量（治疗或意外）的报道。

【不良反应】胸腺肽 α_1 的耐受性良好。部分患者可有注射部位不适。慢性乙肝患者接受本品治疗时，可能出现 ALT 水平暂时波动至基础值的 2 倍以上，此时通常应继续使用，除非有肝衰竭的症状和预兆出现。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用胸腺肽 α_1	化学药	HZ005019

HY002062 胸腺五肽

【其他名称】Thymopoietin Pentapeptide、胸腺喷丁

【外文名称】Thymopentin

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 50 册

药物理化信息

【化学名】*N* - ［*N* - ［*Nα* - ［*Nα* - L - 精氨酰 - L - 赖氨酰］ - L - α - 天门冬氨酰］ - L - 缬氨酰］ - L - 酪氨酸

【分子式】$C_{30}H_{49}N_9O_9$

【分子量】679.77

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末。

本品在水中极易溶，在乙醇中微溶，在乙酸乙酯、乙醚或石油醚中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水制成每 1ml 中含 20mg 的溶液，依法测定，比旋度应为 - 14.0°至 - 22.0°。

药物药理信息

【药理毒理】胸腺五肽的作用之一是诱导 T 细胞分化。它可选择性地诱导 Thy - 1 - 的前胸腺细胞转化为 Thy - 1 + 的 T 细胞。其 T 细胞分化作用由胞内 cAMP 水平升高介导。胸腺五肽的另一基本作用是对成熟外周血 T 细胞的特异受体结合，使胞内 cAMP 水平上升，从而诱发一系列胞内反应，这也是它免疫调节功能的基础。在正常机体状态下胸腺五肽显现免疫刺激作用，能显著增高脾淋巴细胞的 E 玫瑰花结形成率及转化率，对免疫应答的初次或再次反应的不同阶段都有增强作用，能增多 IgM 类型和 IgG 或 IgA 类型的抗体形成细胞。胸腺五肽还可增强巨噬细胞的吞噬功能，增加多形核嗜中性白细胞的酶和吞噬功能，升高循环抗体含量，增强红细胞免疫功能。胸腺五肽能活化 CD_4 和 CD_8 阳性细胞，使专一的 Tc 细胞寿命维持更长时间，同时也可活化 Th 细胞，诱导 Ts 细胞的功能。胸腺五肽的抗感染力和治疗作用与它增进 TC 细胞活性相关。在抗感染免疫中适量胸腺五肽可明显增加干扰素的产生。诱导和促进 T 细胞分化成熟，调节 T 淋巴细胞亚群比例使 CD_4/CD_8 趋于正常，增强巨噬细胞吞噬功能，增强红细胞免疫功能，提高自然杀伤细胞的活力，提高白介素 - 2

的产生水平与受体表达水平，增强外周血单核细胞γ干扰素的产生，增强血清中SOD活性。

本品为免疫双向调节药。具有诱导和促进T淋巴及其亚群分化、成熟和活化的功能，调节T淋巴细胞的比例，使CD_4^+/CD_8^+趋于正常；调节和增强人体细胞免疫功能的作用，能促使有丝分裂原激活后的外周血中的T淋巴细胞成熟，增加T细胞在各种抗原或致有丝分裂原激活后各种淋巴因子（如：α、γ干扰素，白介素2或白介素3）的分泌，增加T细胞上淋巴因子受体的水平。它同时通过对T辅助细胞的激活作用来增强淋巴细胞反应。此外，本品可能影响NK前体细胞的趋化，该前体细胞在暴露于干扰素后变得更有细胞毒性，有利于发挥其治疗作用。此外，本品能增强人体抗辐射的能力。因此，本品具有调节和增强人体细胞免疫功能的作用。

【药物相互作用】

1. 本品与许多常用药物合并使用，其中包括干扰素、消炎药、抗菌素、激素、镇痛药、降压药、利尿药，治疗心血管疾病的药物，中枢神经系统药物、避孕药，没有任何干扰现象出现。

2. 本品与干扰素合用，对于改善免疫机能有协同作用。

3. 本品与抗生素合用，能增强抗菌作用。

4. 本品与化疗药合用，可降低化疗的不良反应。

【药物过量】目前尚无任何关于人体过量（治疗或意外）的报道。动物毒性试验显示在10mg/kg剂量以下（目前研究所用最高量）没有任何副反应发生。

【不良反应】

1. 耐受性良好，个别可见恶心、发热、头晕、胸闷、无力等不良反应，少数患者偶有嗜睡感。

2. 慢性乙型肝炎患者使用时可能ALT水平短暂上升，如无肝衰竭预兆出现，仍可继续使用本品。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
胸腺五肽注射液	化学药	HZ0003806
注射用胸腺五肽	化学药	HZ0005020

HY002063　熊去氧胆酸

【其他名称】Arsacol 150、Chenodiol、Chenofalk、Cholit－Ursan、Delursan 250、Destolit、Deursil、Fluibil、UDCA

【外文名称】Ursodeoxycholic Acid

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】3α,7β－二羟基－5β－胆甾烷－24－酸

【分子式】$C_{24}H_{40}O_4$

【分子量】392.58

【性状及组成】本品为白色结晶粉末，无臭，味苦。几乎不溶于水，易溶于乙醇和冰醋酸，微溶于三氯甲烷，在氢氧化钠试液，乙醚中极微溶解。

熔点：本品的熔点为200～204℃。

比旋度：取本品，精密称定，加无水乙醇溶解并定量稀释制成每1ml中含40mg的溶液。依法测定，比旋度为+59.0°至+62.0°。

药物药理信息

【药理毒理】本品可增加胆汁酸的分泌，同时导致胆汁酸成分的变化，使本品在胆汁中的含量增加。本品还能显著降低人胆汁中胆固醇及胆固醇酯的摩尔浓度和胆固醇的饱和指数，从而有利于结石中胆固醇逐渐溶解。

【药代动力学】熊去氧胆酸系弱酸，当发生微胶粒聚集时，其pKa值约为6.0。口服后主要由回肠吸收。通过肝脏时被摄取5%～60%，明显低于鹅去氧胆酸（UDCA），仅少量药物进入体循环。口服后1小时和3小时分别出现两个血药浓度峰值。UDCA的作用不取决于血药浓度而与胆汁中的药物浓度有关。$t_{1/2}$为3.5～5.8天。UDCA在肝脏与甘氨酸或牛黄酸迅速结合，从胆汁排入小肠，参加肝循环。小肠内结合的UDCA一部分在水解回复为游离型，另一部分在细菌作用下转变为石胆酸，后者进而被硫酸盐化，从而降低其潜在的肝脏毒性。

【药物相互作用】

1. 避孕药可增加胆汁饱和度，用本品治疗时应尽量采取其他节育措施以免影响疗效。

2. 考来烯胺、考来替泊和含铝制酸剂都能与CDCA结合，减少其吸收，不宜同用。

【药物过量】若服用过量，立即以不少于1L的考来烯胺或活性炭（每100ml水中2g）洗胃，再口服氢氧化铝悬液50ml。

【不良反应】本品的毒性和不良反应比鹅去氧胆酸小，一般不引起腹泻，其他偶见的不良反应有便秘、过敏、头痛、头晕、胰腺炎和心动过速等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方消化酶胶囊	化学药	HZ0001438
熊去氧胆酸胶囊	化学药	HZ0003807
熊去氧胆酸片	化学药	HZ0003808

制剂名称	类别	序号
溴吡斯的明片	化学药	HZ003809
溴吡斯的明注射液	化学药	HZ003810

HY002064 溴吡斯的明

【其他名称】吡斯的明、Mestinon、美斯地浓、溴吡啶斯的明

【外文名称】Pyridostigmine Bromide

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】溴化 1 - 甲基 - 3 - 羟基吡啶镒二甲氨基甲酸酯

【分子式】$C_9H_{13}BrN_2O_2$

【分子量】261.12

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，味苦，有引湿性。

本品在水、乙醇或三氯甲烷中极易溶解，在石油醚或乙醚中极微溶解。

熔点：本品的熔点为 153 ~ 157℃。

吸收系数：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 25μg 的溶液，照紫外 - 可见分光光度法，在 269nm 的波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）应为 180 ~ 190 。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗胆碱酯酶药。

本品为可逆性的抗胆碱酯酶药，能抑制胆碱酯酶的活性，使胆碱能神经末梢释放的乙酰胆碱破坏减少，突触间隙中乙酰胆碱积聚，出现毒蕈碱样（M）和烟碱样（N）胆碱受体兴奋作用。此外，对运动终板上的烟碱样胆碱受体（N_2 受体）有直接兴奋作用，并能促进运动神经末梢释放乙酰胆碱，从而提高胃肠道、支气管平滑肌和全身骨骼肌的肌张力，作用虽较溴化新斯的明弱但维持时间较久。

【药代动力学】本品口服后胃肠道吸收差，生物利用度约为 11.5% ~ 18.9%。健康志愿者口服 60mg 后达峰时间为 1 ~ 5 小时，半衰期约为 3.3 小时，可被血浆胆碱酯酶水解，也在肝脏代谢，可进入胎盘，但不易进入中枢神经系统。本品主要以原形药物与代谢物经尿排泄，微量从乳汁排泄。

【不良反应】

1. 常见的有腹泻、恶心、呕吐、胃痉挛、汗及唾液增多等。较少见的有尿频、缩瞳等。

2. 接受大剂量治疗的重症肌无力病人，常出现精神异常。

药物制剂信息

HY002065 溴丙胺太林

【其他名称】Corrigast、Ercarol、Mephathelin、Pantheline、普鲁本辛、Probanthine

【外文名称】Propantheline Bromide

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】溴化 *N* - 甲基 - *N* - （1 - 甲基乙基）- *N* - ［2 - （9*H* - 呫吨 - 9 - 甲酰氧基）乙基］- 2 - 丙铵

【分子式】$C_{23}H_{30}BrNO_3$

【分子量】448.40

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶性粉末，无臭，味极苦，微有引湿性。本品在水、乙醇或三氯甲烷中极易溶解，在乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为 157 ~ 164℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗胆碱药。

本品用于胃及十二指肠溃疡、胃肠痉挛、妊娠呕吐及多汗症等。

【药物相互作用】

1. 本品与甲氧氯普胺、多潘立酮不能同用。

2. 由于本品可延长胃排空时间，会对一些药物的吸收产生影响。如红霉素可因在胃内停留过长而受到胃酸分解，降低疗效，对乙酰氨基酚的吸收可被延迟，血浆峰浓度降低；地高辛的血浆浓度可因同用本品而提高。

【不良反应】类似阿托品。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方溴丙胺太林铝镁片	化学药	HZ001448
复方溴丙胺太林片	化学药	HZ001449
溴丙胺太林片	化学药	HZ003811
海甘胃片	中成药	ZC002043

HY002066 溴凡克新

【其他名称】Bronquinucil、Brovan、Brovaxin、溴

环己酰胺、溴维来克星

【外文名称】Brovanexine

药物药理信息

【药理毒理】本品为溴环己胺的又一个有效代谢物，可使痰中酸性黏多糖纤维断裂，降低痰液黏度，使其液化，同时还能改善肺功能。适用于急、慢性支气管炎。

【药代动力学】本品口服或直肠给药吸收良好，服后3~4小时达血药浓度峰值。

【不良反应】有效剂量下，尚未见有不良反应。

HY002067　溴化铵

【外文名称】Ammonium Bromidum

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第1册

药物理化信息

【化学名】溴化铵

【分子式】NH_4Br

【分子量】97.94

【性状及组成】本品为无色结晶或白色结晶性粉末，无臭，味咸，水溶液显中性或弱酸性反应，微有引湿性。

本品在水中易溶，在乙醇中溶解。

药物药理信息

【药理毒理】本品为镇静药。溴离子可增强大脑皮层的抑制过程，产生镇静，使皮层兴奋与抑制过程恢复平衡状态。

【药代动力学】本品口服易吸收，其体内分布同氯离子，经肾排出，氯化钠可增加其排泄速度。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
三溴片	化学药	HZ003169

HY002068　溴化钙

【外文名称】Calcium Bromide

药物理化信息

【化学名】溴化钙

【分子式】$CaBr_2 \cdot 2H_2O$

【分子量】235.91

【性状及组成】本品为白色颗粒状结晶，无臭，味碱苦，有吸湿性，在空气中渐变黄色，易溶于水与乙醇。

药物药理信息

【药理毒理】本品为中枢抑制药，溴离子有抑制大脑皮层活动的作用，可用于一般镇静。钙离子也有镇静作用，两者联合可加强作用。

本品还可做抗过敏辅助治疗药。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
溴化钙注射液	化学药	HZ003812

HY002069　溴化钾

【外文名称】Potassium Bromide

药物理化信息

【化学名】溴化钾

【分子式】KBr

【分子量】119.00

【性状及组成】本品为无色或白色的立方形结晶或白色颗粒状粉末，无臭，味咸、微苦。

本品在水中易溶，在乙醇中微溶。

药物药理信息

【药理毒理】溴离子可增强大脑皮层的抑制过程，产生镇静，使皮层兴奋与抑制过程恢复平衡状态。常用于神经衰弱、癔病、神经性失眠、精神兴奋状态。

【药代动力学】口服易吸收，其体内分布同氯离子，经肾排出，氯化钠可增加其排泄速度。

【药物过量】长期服用，能蓄积中毒，早期症状为皮疹（溴痤疮，记忆减退，情绪抑郁，如出现早期症状应即中止服药，并在饮食中增加食盐量或服用氢氯噻嗪促进其排出。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方颠茄维 B_6 片	化学药	HZ001138
三溴片	化学药	HZ003169

HY002070　溴化钠

【其他名称】溴曹、溴钠

【外文名称】Sodium Bromide

药物理化信息

【化学名】溴化钠

【分子式】NaBr

【分子量】102.89

【性状及组成】本品为无色或白色细小的立方形结晶，或白色颗粒状粉末，无臭，味咸，微苦，有引湿性。

本品在水中易溶，在乙醇中溶解。

药物药理信息

【药理毒理】溴化物的作用主要取决于溴离子，溴离子能加强大脑皮层的抑制过程，并促进其集中。主要用于治疗神经衰弱、精神兴奋、焦虑不安。

【药代动力学】本品口服后易吸收，经肾脏缓慢排泄。

【药物过量】长期服用可引起蓄积中毒，使记忆力减退、情绪抑郁、乏力、嗜睡及皮疹（溴痤疮）等。

有中毒症状时应停药，并口服或静注大量灭菌生理盐水，增加溴的排出。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方苯巴比妥溴化钠片	化学药	HZ001082
复方溴咖片	化学药	HZ001450
氯化钙溴化钠注射液	化学药	HZ002480
三溴片	化学药	HZ003169

HY002071 溴米那

【其他名称】布洛母拉、布洛米那、Bromisovalerylurea、Bromural、Bromurea、Bromvalerylurea、Bromvaletone、Bromylum、Brovalurea、Isobromyl、Pivadorm、溴母拿、溴米索伐、溴异戊脲、溴异戊酰脲

【外文名称】Bromisovale

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第13册

药物药理信息

【药理毒理】本品为镇静催眠药。可用于禁忌巴比妥类或水合氯醛的患者。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
溴米那普鲁卡因注射液	化学药	HZ003813

HY002072 溴哌利多

【外文名称】Bromperidol

药物药理信息

【药理毒理】本品为丁酰苯类抗精神病药。可对抗阿扑吗啡、苯丙胺的作用，对条件回避反应有抑制作用；但对强直性昏厥作用弱。实验证明，本品具有促进脑内多巴胺代谢和阻断脑内多巴胺受体的作用，这与其抗精神病作用有关。

本品适用于治疗精神分裂症。

【药代动力学】本品口服可吸收，且吸收较迅速，4～6小时后达血药高峰浓度，血浆半衰期为20.2～30.0小时。经肝脏与葡萄糖醛酸结合，自肾脏排出。

【不良反应】本品主要副作用为帕金森氏综合征、静坐不能、睡眠障碍、困倦、便秘、乏力、倦怠，偶见ALT升高。

HY002073 溴噻乙啶

【外文名称】Panteldine Bromide

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第1册

药物理化信息

【化学名】反式1－［α－（α－噻吩基）乙烯基］吡啶溴化物

【分子式】$C_{11}H_{10}BrNS \cdot H_2O$

【分子量】286.19

【性状及组成】本品为黄色或桔黄色结晶或结晶性粉末，味苦。

本品在水中极易溶解，在乙醇中溶解，在三氯甲烷中极微溶解，在丙酮或乙醚中几乎不溶。

熔点：取本品研细后，于105℃干燥4小时，迅速装入毛细管中，立即熔封，依法测定，熔点为177～182℃（测定时，应在传温液温度上升至较规定的熔点低限约30℃时将毛细管浸入）。

药物药理信息

【药理毒理】本品为新合成的季铵盐类驱虫药，驱钩虫效果与噻嘧啶相当，驱蛔虫效果稍次，驱蛲虫效果较佳，驱鞭虫效果稍差。

【不良反应】服药后可引起神经系统和消化道反应，成人较儿童多见，其症状以头昏、恶心为主，次为呕吐、头痛、流涎等，其程度较轻，仅个别较重。反应出现在服药后1～4小时，持续约5小时，不经特殊处理可自行消失。个别有肝炎病史者用药后ALT升高。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
溴噻乙啶片	化学药	HZ003814

HY002074 溴替唑仑

【其他名称】Ladormin、Lendormin、溴噻二氮䓬

【外文名称】Brotizolam

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

【性状及组成】本品为白色至微黄色结晶性粉末，无味。易溶于二氯乙烷、冰醋酸，难溶于乙醇，极难溶于乙醚，几乎不溶于水。

药物药理信息

【药理毒理】本品具有催眠、抗激动、抗惊厥、肌肉松弛等作用。低剂量时具有良好的催眠效果，可缩短入睡时间，减少醒觉次数，延长总睡眠时间。本品0.25mg与硝西泮5mg的催眠作用相等。

动物试验表明，对小鼠戊四唑引起的癫痫发作的作用与氟西泮相似，而对抑制异烟肼引起的癫痫发作作用更强。本品可减少Ⅰ期睡眠的潜伏期和百分率，减少觉醒次数和觉醒时间，延长有效睡眠时间。Ⅱ期睡眠的百分率也增加，但快动眼（REM）百分率和慢波睡眠（Ⅲ和Ⅳ期）减少。

临床适用于治疗失眠症。尤其适用于入睡障碍和睡眠中觉醒后不易再入睡等类型失眠症的治疗。

【药代动力学】在胃肠道吸收迅速，片剂的绝对生物利用度约为70%。0.5～2小时血药浓度可达峰值。消除半衰期儿童为3.6～7.9小时，老人为6～9.3小时，血浆蛋白结合率为89%～95%。主要代谢产物为9－羟基溴替唑仑和6－羟基溴替唑仑。代谢物皆为结合型，而非结合型的代谢物具有药理活性。本品大部分经肾脏排泄，少量由粪便排泄。停药4天后全部药物从体内消除。

【药物相互作用】与中枢抑制药、抗组胺药、巴比妥类药同服时，可增加本品作用。

【不良反应】

1．不良反应偶见胃肠道不适、头痛、眩晕，高血压患者血压下降。大剂量用药时（尤其对本品敏感的患者），可见次晨乏力、注意力不集中。

2．本品可能产生耐药性或进展性健忘。

HY002075　溴西泮

【其他名称】Lectopam、Lexotanil、宁神定、溴安定、溴吡啶安定、溴吡二氮䓬

【外文名称】Bromazepam

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

药物药理信息

【药理毒理】本品作用与地西泮相似，属短至中等半衰期苯二氮䓬类药。适用于焦虑性神经症、抑郁性神经症。对改善焦虑抑郁症状具有良好效果。

【药代动力学】本品口服吸收完全，1－4小时血浆浓度达峰值，半衰期为8～28小时。主要是3－羟基溴安定和3－羟基苯酰吡啶衍生物与葡萄糖醛酸结合物，从尿排出。重复用药蓄积甚少，停药后很快消除。

【不良反应】嗜睡、眩晕、口干、食欲减退、共济失调。长期使用，可产生药物依赖。

HY002076　溴新斯的明

【外文名称】Neostigmine Bromide

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】溴化－*N*，*N*，*N*－三甲基－3－［（二甲氨基）甲酰氧基］苯铵

【分子式】$C_{12}H_{19}BrN_2O_2$

【分子量】303.20

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，味苦。

本品在水中极易溶解，在乙醇或三氯甲烷中易溶，在乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为171～176℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗胆碱酯酶药。

本品具有抗胆碱酯酶作用，且能直接激动骨骼肌运动终板上的N2胆碱受体，故对骨骼肌的作用较强。而对腺体、眼、心血管及支气管平滑肌作用较弱，对胃肠道平滑肌可促进胃收缩和增加胃酸分泌，在食管明显弛缓和扩张的病人，本品能有效地提高食管张力。本品可促进小肠、大肠，尤其是结肠的蠕动，促进内容物向下推进。

【药代动力学】口服吸收差且不规则。口服达峰时间为1～3小时，平均血浆半衰期为0.87小时，生物利用度为1%～2%。在婴儿和儿童中消除半衰期明显较成人为短，但其治疗作用持续时间未必明显缩短。肾功能衰竭病人其半衰期明显延长。本品既可被血浆中胆碱酯酶水解，亦可在肝脏中代谢。用药量的80%可在24小时内经尿排出。其中原形药物占给药量50%，15%以3－羟基苯－3－甲基铵的代谢物排出体外。本品血清蛋白结合率为15%～25%，但进入中枢神经系统的药物很少。

【药物相互作用】

1．本品不宜与去极化型肌松药合用。

2．本品不宜与β受体阻断剂合用。

3．某些能干扰肌肉传递的药物如奎尼丁，能使本品作用减弱，不宜合用。

【药物过量】过量时可导致胆碱能危象，表现为

大量出汗、大小便失禁、瞳孔缩小、睫状肌痉挛、前额疼痛、心动过缓和其他类型的心率失常，亦可见低血压、肌痉挛、肌无力、肌麻痹、胸腔紧缩感及支气管平滑肌痉挛。

【不良反应】本品可致药疹，大剂量时可引起恶心、呕吐、腹痛、腹泻、流泪、流涎等，严重时可出现共济失调、惊厥、昏迷、语言不清、焦虑不安、恐惧甚至心脏停搏等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
溴新斯的明片	化学药	HZ003815

HY002077 雪胆素

【外文名称】Hemsleyadin

【性状及组成】本品为葫芦科雪胆属植物中提取的雪胆素甲和雪胆素乙的混合物，含雪胆素甲 $C_{32}H_{50}O_8$ 应不得少于95.0%。

本品在乙醇、甲醇或三氯甲烷中易溶，在丙酮或乙酸乙酯中溶解，在乙醚中微溶，在水、石油醚或环己烷中不溶。

熔点：干品熔点为222～227℃。

旋光度：取本品，精密称定，加乙醇制成每1ml中含10mg的溶液，依法测定，按干品计算，应为+54°至+60°。

吸收系数：取本品，加无水乙醇制成每1ml中含1mg的溶液，照紫外－可见分光光度法在（286±1）nm的波长处测定吸光度，吸收系数为2.0～2.4。

药物药理信息

【药理毒理】

抑菌作用：雪胆素及雪胆皂苷在体外对福氏痢疾杆菌、伤寒杆菌、猪霍乱沙门菌等都有不同程度的抑制作用。

解热作用：静脉注射雪胆素甲40mg/kg（腹腔注射）对家兔注射伤寒副伤寒甲混合菌苗引起的发热有轻度退热作用，但对正常体温及非细菌性发热则无明显影响。

对心血管系统的作用：总皂苷能增加小鼠冠脉流量、降低心肌耗氧量。对麻醉犬有降压作用。剂量为20～40mg/kg时，即出现传导阻滞，最后心跳停止。

【不良反应】少数病人可出现腹痛、腹泻、停药后症状消失（恢复正常）。

药理试验证明，剂量过大时，可使猫心律减慢，呼吸减弱。心脏疾患者忌用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
雪胆素片	中成药	ZO006553

HY002078 雪胆素甲

【外文名称】Cucurbitacin

【分子式】$C_{32}H_{50}O_8$

【分子量】562.74

药物药理信息

【药理毒理】消热解毒，抗菌消炎。用于菌痢、肠炎、支气管炎、急性扁桃体炎。

HY002079 血卟啉

【外文名称】Hematoporphyrine

药物理化信息

【化学名】1，3，5，8－四甲基－2，4－二（α－羟乙基）卟酚－6，7－二丙酸

【分子式】$C_{34}H_{38}N_4O_6$

【分子量】598.70

药物药理信息

【药理毒理】本品和激光联合应用，能杀伤癌细胞。

【不良反应】个别患者可出现暴露部位红肿，严重恶心。部分病人可出现一过性肝、肾功能损伤。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
血卟啉注射液	化学药	HZ003816

HY002080 血管紧张素

【外文名称】Angiotensin

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第15册

【分子式】$C_{49}H_{70}N_{14}O_{11}$

【分子量】1031.20

【性状及组成】本品为白色冻干块状物或粉末。

药物药理信息

【药理毒理】血管紧张素来源于血管紧张素原，血管紧张素原是存在于人体血浆 α_2－球蛋白的一种十四肽，经肾素作用裂解为十肽和四肽，仅具有很小的生物活性，当被体内血浆中转换酶水解为八肽即血管紧张素后，才具有升压的生物活性。血管紧张素能特异地引起血压上升和周围血管阻力增加，它支配动物血管平滑肌感受器而致血管收缩，因此

它比一般的拟交感神经胺类药物（如去甲基肾上腺素、新福林、间羟胺、恢压敏等）升压效能强，且无组织坏死、影响肾功能之严重不良反应，是一种升压的急救药物。

【不良反应】快速注射血管紧张素时，可能立即产生非常严重高血压和心动徐缓，使用高剂量可能发生室性节律不齐。偶有眩晕，头痛及中度荨麻疹样反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用血管紧张素	化学药	HZ005021

HY002081　鸦胆子油

【外文名称】Brucea Javanic Oil

【性状及组成】本品为苦木科植物鸦胆子（*Brucea javanical*［L］Merr）的干燥成熟果实经石油醚提取后所得到的脂肪油。

本品为黄色的澄明液体，气特异，味苦。

本品能与乙醚、三氯甲烷、二硫化碳、四氯化碳任意混合。在甲醇、乙醇、戊醇中微溶，在水中不溶。

相对密度：应为0.900～0.920。

折光率：应为1.468～1.472。

碘值：应为80～95。

酸值：应不得大于6。

药物药理信息

【药理毒理】鸦胆子油的主要成分油酸，它能够抑制拓扑异构酶（TOPOII）活性，从而抑制细胞DNA的合成及生长，阻断癌细胞的增殖。

经动物和人体实验，对多种肿瘤有抑制作用，可见药液的小油滴与癌细胞有较好的亲合力，癌周黏附时间长，在体内有定向分步的作用，为其网状内皮系统的吞噬细胞所和潴留，使肿瘤药物在该处有较高的浓度。对体液免疫有促进作用，对癌细胞的G_1、S、G_2期均有一定的损伤或抑制作用，抑制癌细胞DNA合成，因而可能属于细胞周期非特异性药物。除直接杀伤癌细胞外，对维持人正常代谢功能的骨髓有保护和升高白细胞作用。主要用于治疗肺癌及肺癌脑转移、消化道肿瘤等。

【药代动力学】在体内分布比较广，主要从尿和粪便中排泄，24小时排出46%。油酸能通过血脑屏障，脑内药物浓度较高。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
鸦胆子油口服乳液	中成药	ZC006612
鸦胆子油乳注射液	中成药	ZC006613
鸦胆子油外用液体	中成药	ZC006614

HY002082　芽子碱

【外文名称】Ecgonine

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY002083　亚胺醌

【外文名称】Solazigune

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第1册

药物理化信息

【化学名】3,6－二（甲氧基代乙氧基）－2，5－二（吖丙啶基）苯醌

【分子式】$C_{16}H_{22}N_2O_6$

【分子量】338.36

【性状及组成】本品为赭红色片状结晶或颗粒状结晶。

本品在三氯甲烷中易溶，在水、乙醇或乙醚中略溶，在石油醚中极微溶解。

熔点：本品的熔点为77～80℃。

药物药理信息

【药理毒理】亚胺醌（diaziquone，azidinyl－benzoquinone，AZQ），为乙烯亚胺类化合物。实验证明，它对多种小鼠、大鼠移植性肿瘤有效，AZQ的脂溶性较大，可通过血－脑屏障进入中枢神经系统，它和其他烷化剂一样具烷化及DNA交叉连结作用。如醌核被还原，则可增强其烷化及交叉连结作用。在乏氧细胞中，AZQ在NADPH酶系统还原的速率较在富氧细胞中迅速，因此它和丝裂霉素一样具有生物还原性烷化作用。此外，AZQ在体外与星状细胞瘤细胞一起培养，则该细胞的线粒体受损。

【不良反应】为骨髓抑制，产生白细胞及血小板减少症，并可引起恶心、呕吐等胃肠道症状，少数病人可出现肝功能不良。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用亚胺醌	化学药	HZ005023

HY002084 亚胺培南

【外文名称】Imipenem

药物药理信息

【药理毒理】亚胺培南对革兰阳性、阴性的需氧和厌氧菌具有抗菌作用。本品对肺炎链球菌、化脓性链球菌、金黄色葡萄球菌（包括产酶株）、大肠杆菌、克雷伯杆菌、不动杆菌部分菌株、脆弱拟杆菌及其他拟杆菌、消化球菌和消化链球菌的部分菌株很敏感。本品对粪链球菌、表皮链球菌、流感嗜血杆菌、奇异变形杆菌、沙雷杆菌、产气肠杆菌、阴沟肠杆菌、铜绿假单胞菌、气性坏疽梭菌、难辨梭菌等也相当敏感。本品有较好的耐酶性能，与其他β－内酰胺类药物间较少出现交叉耐药性。

【药代动力学】静注亚胺培南250mg、500mg或1000mg后20分钟，血药峰浓度分别为20μg/ml、35μg/ml或66μg/ml，蛋白结合率约为20%。本品体内分布广泛，以细胞间液、肾脏、上颌窦、子宫颈、卵巢、盆腔、肺等部位浓度最高，在胆汁、前列腺、扁桃体、痰中浓度也较高，能通过胎盘而难以通过血－脑脊液屏障。半衰期约为1小时，主要经肾排泄。肾功能减退时，排泄量减少，血药浓度上升，半衰期延长。

亚胺培南单独应用，受肾肽酶的影响而分解，在尿液中只能回收少量的原形药物。西拉司丁是肾肽酶抑制剂，保护亚胺培南在肾脏中不受破坏，因此在尿液中回收的原形药物可达70%。且西拉司丁能抑制亚胺培南进入肾小管上皮组织，因而减少亚胺培南的排泄并减轻药物的肾毒性。

【不良反应】

1. 本品静脉使用时速度太快可引起血栓静脉炎，肌内注射时可引起局部疼痛、红斑、硬结等，宜注意改换注射部位。

2. 肝脏：可有氨基转移酶、血胆红素或碱性磷酸酶升高。

3. 肾脏：可有血肌酐和血尿素氮升高。但儿童用本药时常可发现红色尿，这是由于药物引起变色，并非血尿。

4. 可有神经系统方面的症状，如肌痉挛、精神障碍等。

5. 本品可引起恶心、呕吐、腹泻等胃肠道症状，偶可引起假膜性肠炎。

6. 可有嗜酸粒细胞增多、白细胞减少、中性粒细胞减少、血小板减少或增多、血红蛋白减少等，并可致抗人球蛋白Coombs试验阳性。

7. 本品也可致过敏反应，如皮肤瘙痒、皮疹、荨麻疹、药热等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用亚胺培南西司他丁钠	化学药	HZ005024

HY002085 亚甲基二膦酸

【外文名称】Methylenediphosphonate

【分子式】$CH_6O_6P_2$

【分子量】176.00

药物药理信息

【药理毒理】本品不直接使用，无单独的药理毒理作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用亚锡亚甲基二膦酸盐	化学药	HZ005038

HY002086 3,4－亚甲基二氧苯基－2－丙酮

药物管理信息

【特殊管理分类】易制毒药

药物药理信息

【药理毒理】

《易制毒化学品管理条例》（国务院令第445号）规定本品为易制毒化学药品。

HY002087 亚甲蓝

【其他名称】甲烯蓝、美蓝

【外文名称】Methylthioninium Chloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】氯化－3.7－双（二甲氨基）吩噻嗪－5－鎓三水化合物

【分子式】$C_{16}H_{18}ClN_3S\cdot 3H_2O$

【分子量】373.90

【性状及组成】本品为深绿色、有铜光的柱状结晶或结晶性粉末，无臭。本品在水或乙醇中易溶，在三氯甲烷中溶解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：解毒药。

亚甲蓝本身系氧化剂，根据其在体内的不同浓度，对血红蛋白有两种不同的作用。低浓度时6－磷酸－葡萄糖脱氢过程中的氢离子经还原型三磷酸吡啶核苷传递给亚甲蓝，使其转变为还原型的白色亚甲蓝；白色亚甲蓝又将氢离子传递给带三价铁的高铁血红蛋白，使其还原为带二价铁的正常血红蛋白，而白色亚甲蓝又被氧化为亚甲蓝。亚甲蓝的还原－氧化过程可反复进行。高浓度时，亚甲蓝不能被完全还原为白色亚甲蓝，因而起氧化作用，将正常血红蛋白氧化为高铁血红蛋白。由于高铁血红蛋白易与CN^-结合形成氰化高铁血红蛋白，但数分钟后二者又离解，故仅能暂时抑制CN^-对组织中毒的毒性。

【药代动力学】亚甲蓝静注后作用迅速，基本不经过代谢即随尿排出，口服在胃肠道的pH条件下可被吸收。并在组织内迅速还原为白色亚甲蓝。在6天内74%由尿排出，其中22%为原形，其余为白色亚甲蓝，且部分可能被甲基化。少量亚甲蓝通过胆汁，由粪便排出。

【药物过量】静脉注射量过大（500mg）时，可致头痛、头晕、心前区痛、出汗、神志不清、T波低平或倒置。

【不良反应】本品静脉注射过速，可引起头晕、恶心、呕吐、胸闷、腹痛、剂量过大，除上述症状加剧外，还出现头痛、血压降低、心率增快伴心率失常、大汗淋漓和意识障碍。用药后尿呈蓝色，排尿时可有尿道口刺痛。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
亚甲蓝注射液	化学药	HZ003819

HY002088　亚硫酸氢钠

【其他名称】酸式亚硫酸钠、重亚硫酸钠

【外文名称】Sodium Bisulfite

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】亚硫酸氢钠

【分子式】$NaHSO_3$

【分子量】104.06

【性状及组成】本品为亚硫酸氢钠与焦亚硫酸钠的混合物，为白色颗粒或结晶性粉末，有二氧化硫的微臭。

本品在水中易溶，在乙醇或乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料。

本品还原性强，在注射剂中作抗氧剂使用。

【药物相互作用】本品水溶液呈酸性，具还原性，更适用于偏酸性药物作抗氧剂，常用浓度为0.1%～0.2%。

【不良反应】在常用剂量下是安全的。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氨酚柴胡注射液	化学药	HZ000167
复方氨基酸注射液（14AA）	化学药	HZ001055
复方氨基酸注射液（15AA）	化学药	HZ001056
复方氨基酸注射液（17AA）	化学药	HZ001058
复方氨基酸注射液（18）	化学药	HZ001062
复方氨基酸注射液（18AA）	化学药	HZ001063
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅲ）	化学药	HZ001066
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅴ）	化学药	HZ001068
复方氨基酸注射液（18－B）	化学药	HZ001070
小儿复方氨基酸注射液（18AA－Ⅱ）	化学药	HZ003750
转化糖电解质注射液	化学药	HZ005138
清肝注射液	中成药	ZC004066
参皇软膏	中成药	ZC004765
消痔灵注射液	中成药	ZC006143

HY002089　亚硫酸氢钠穿心莲内酯

【外文名称】Sodium Sulfite Andrographolide

【分子式】$C_{20}H_{30}O_5 \cdot NaHSO_3$

【性状及组成】本品是从中药穿心莲中提取制成的有效单体，为穿心莲内酯的亚硫酸氢钠加成物。为白色或类白色的粉末，无臭，味苦，略具引湿性。

本品在水中易溶，在甲醇中溶解，在乙醇中略溶，在三氯甲烷中微溶。

药物药理信息

【药理毒理】清热解毒，抗菌消炎。用于细菌性痢疾，肺炎，急性扁桃体炎。

药理研究：本品具有增强机体免疫功能、抗菌消炎、抗病毒及解热作用。临床研究表明本品治疗肠道感染、小儿肺炎、上呼吸道感染及其所致的发热有效。

【药物相互作用】应尽可能避免本品与其他具有肾毒性药物，如氨基糖苷类等有肾损害药物的联合使用。

【不良反应】1988年至2005年3月，国家药品不

良反应监测中心病例报告数据库中有关莲必治注射液的病例报告50例，不良反应表现为急性肾功能损害、皮疹、头晕、胃肠道反应、过敏样反应等。其中急性肾功能损害17例，并有1例合并肝功能异常。

1978年至2005年2月，国内文献报道中检索到有关莲必治注射液引起急性肾功能损害的病例共26例。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
莲必治注射液	中成药	ZC003226

HY002090 亚硫酸氢钠甲萘醌

【其他名称】甲萘醌、Menadione、维凯素（Vicasol）、维生素K_3（Vitamin K_3）、维生素K_3亚硫酸氢钠

【外文名称】Menadione Sodium Bisulfite

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】亚硫酸氢钠甲醌与亚硫酸氢钠的混合物

【分子式】$C_{11}H_9NaO_5S\cdot 3H_2O$

【分子量】330.30

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭或微有特臭，有引湿性，遇光易分解。本品在水中易溶，在乙醇、乙醚或苯中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：维生素类药。

亚硫酸氢钠甲萘醌为人工合成的维生素K（K_3）。维生素K是肝脏合成因子Ⅱ、Ⅶ、Ⅸ、Ⅹ所必需的物质。维生素K缺乏可引起这些凝血因子合成障碍或异常，临床可见出血倾向和凝血酶原时间延长。

维生素K到达细胞后，在微粒体环氧化酶作用下，可转化为环氧叶绿醌，环氧叶绿醌有助于因子Ⅱ的前身（无功能前体蛋白）氨基末端γ-羧基谷氨酸的加羧基作用。

【药代动力学】肌注吸收后，随β脂蛋白转运，约8~24小时作用才开始明显，并在肝内被利用，需数日才能使凝血酶原恢复至正常水平。以葡萄糖醛酸和硫酸结合物形式经肾及胆道排泄。

【药物相互作用】

1. 口服抗凝剂如双香豆素类可干扰维生素K代谢，两药同用，作用相互抵消。

2. 较大剂量水杨酸类、磺胺药、奎宁、奎尼丁等也可影响维生素K效应。

【不良反应】

1. 局部可见红肿和疼痛。

2. 较大剂量可致新生儿、早产儿溶血性贫血、高胆红素血症及黄疸。在红细胞6-磷酸脱氢酶缺乏症患者可诱发急性溶血性贫血。

3. 大剂量使用可致肝损害。肝功不全患者可改用维生素K_1。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
亚硫酸氢钠甲萘醌片	化学药	HZ003820
亚硫酸氢钠甲萘醌注射液	化学药	HZ003821

HY002091 α-亚麻酸

【外文名称】α-linolenic Acid

药物药理信息

【药理毒理】α-亚麻酸作为n-3多不饱和脂肪酸的母体，在降血脂方面起重要作用。α-亚麻酸在人体内代谢生成二十碳五烯酸（EPA）、二十二碳六烯酸（DHA），可以调节血脂、抗血栓形成，并且无肝脏积累脂质症状；此外，对炎症介质、白细胞介素等具有调节作用，减少肝细胞损伤。

HY002092 亚硒酸钠

【外文名称】Sodium Selenite

【性状及组成】本品为白色结晶。在空气中稳定。溶于水，不溶于乙醇。

药物药理信息

【药理毒理】硒是人体生命活动中必需的微量元素之一，具有多种生物功能：

1. 硒是谷胱甘肽的重要组成成分，它的抗自由基作用是维生素E和维生素C的300~500倍。硒能清除人体内过多的氧自由基，防止细胞膜脂质过氧化的破坏，保护细胞膜、溶酶体结构，修复受损细胞。硒在人体生化代谢上起着重要作用。

2. 硒能促进T细胞和中性粒细胞的增殖和杀伤作用，促进免疫球蛋白的合成和抗体生成，增强人体抗病毒的能力，抑制补体活化，减轻免疫复合物造成的免疫损伤。还能抑制艾滋病病毒活化，防止细胞凋亡。

3. 硒除能防治克山病、大骨节病外，还能够抗病毒、抗过敏、抗衰老、抗重金属中毒（镉、汞等），抗黄曲霉毒素B_1和苯并蒽、亚硝胺等致癌作用，以及减轻放疗、化疗的不良反应。

4. 研究证明，硒能保护内皮细胞，减轻血管重构，改善血管功能，降低血压，降低全血黏度和血小板聚集引起的高凝状态，改善微循环，降低高血压、冠心病的发病率和死亡率。

5. 患全身炎症反应综合征（SIRS）和多脏器功能障碍综合征（MOFS）时，补硒可使 GSH－P 活性增高，抑制细胞因子和炎症介质对组织细胞的伤害作用，改善症状，降低病死率。

本品用于缺硒患者以及地方性疾病克山病的防治，以及长时间依靠静脉高营养维持的缺硒患者。

【药物过量】摄入量过多也会引起人体生化反应紊乱和中毒，症状为：恶心、呕吐、毛发脱落、精神疲乏和贫血等。增加蛋白质的摄入可降低硒的毒性，蛋氨酸、维生素 E 可促进硒的排泄，减轻硒的毒副作用。

一日最大安全量为 400μg。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
多种微量元素注射液（Ⅰ）	化学药	HZ000815
亚硒酸钠片	化学药	HZ003823

HY002093　亚硝酸钠

【外文名称】Sodium Nitrite

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】亚硝酸钠

【分子式】$NaNO_2$

【分子量】69.00

【性状及组成】本品为无色或白色至微黄色的结晶，无臭，味微咸，有引湿性，水溶液显碱性反应。本品在水中易溶，在乙醇中微溶。

药物药理信息

【药理毒理】氰化物与线粒体细胞色素氧化酶的三价铁（Fe^{3+}）有高亲和性，结合后使酶失去活力，抑制细胞呼吸，导致细胞乳酸酸中毒和缺氧。本品系氧化剂，能使血红蛋白中的二价铁（Fe^{2+}）氧化成三价铁（Fe^{3+}），形成高铁血红蛋白。高铁血红蛋白中的 Fe^{2+} 与氰化物（CN^-）结合力比细胞色素氧化酶的 Fe^{3+} 为强，即使已与细胞色素氧化酶结合的 CN^- 也可使其重新释放，恢复酶的活力。但高铁血红蛋白与 CN^- 结合后形成的氰化高铁血红蛋白在数分钟后又逐渐解离，释出 CN^-，又重现氰化物毒性。因此本品对氰化物中毒仅起暂时性的延迟其毒性。本品尚有扩张血管作用。

【不良反应】有恶心、呕吐、头昏、头痛、出冷汗、发绀、气急、昏厥、低血压、休克、抽搐。不良反应的程度除与剂量过大有关，还与注射本品速度有关。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
亚硝酸钠注射液	化学药	HZ003825

HY002094　亚硝酸辛酯

【外文名称】Octyl Nitrite

药物药理信息

【药理毒理】吸入剂，作用与用途类似于亚硝戊酯，但毒性较小。

HY002095　亚硝酸异戊酯

【外文名称】Amyl Nitrite

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第 1 册

药物理化信息

【化学名】亚硝酸－2－甲基丁酯与亚硝酸－3－甲基丁酯的混合物

【分子式】$C_5H_{11}NO_2$

【分子量】117.15

【性状及组成】本品为淡黄色的澄明液体，臭似乙醚带果香，味辛，在低温中即能挥发，并易燃烧。

本品与乙醇、乙醚、三氯甲烷或苯能任意混合，在水中几乎不溶。

相对密度：本品的相对密度，在 25℃时为 0.865～0.875。

沸程：取本品，照沸程测定法项下的方法测定，在 90～100℃馏出的数量不少于 85%（ml/ml）。

药物药理信息

【药理毒理】本品血管扩张作用与硝酸甘油类似，但作用更快。释放氧化氮（NO），NO 与内皮舒张因子相同，激活鸟苷酸环化酶，使平滑肌和其他组织内的环鸟苷酸（cGMP）增多，导致血管扩张；并能扩张周围静脉，使周围静脉贮血，左心室末压降低和舒张期对冠脉血流阻力降低，也可扩张周围小动脉而使周围阻力和血压下降，从而心肌耗氧量降低，缓解心绞痛。还具有解除氰化物毒性的作用，其机制与亚硝酸钠相同，使血红蛋白中的 Fe^{2+} 氧化

成 Fe^{3+}，Fe^{3+} 再与氰化物（CN^-）结合成高铁血红蛋白，暂时延缓氰化物的毒性。随即需注射亚硝酸钠和硫代硫酸钠。吸入后 30 秒钟起效，持续 3～5 分钟。用药后心率增快、血压降低，左室舒张末压降低。

【药物过量】过量可因血管扩张和高铁血红蛋白血症而引起发绀、晕厥、呼吸困难和肌软弱。如本品发生严重毒性反应，可将中毒者腿部抬高，保暖，活动四肢末端可有助于静脉回流，吸氧或人工通气，给予血浆扩容剂及适当的电解质溶液以维持循环功能，如发生高铁血红蛋白血症，应静脉注射亚甲蓝。如有较多的喷雾剂被吞咽下去，可采用洗胃方式治疗。

【不良反应】常引起面红、头痛与头晕、恶心与呕吐、低血压、不安和心动过速。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
亚硝酸异戊酯吸入剂	化学药	HZ003826

HY002096 亚叶酸钙

【其他名称】Folinic Acid、甲酰四氢叶酸钙、甲叶钙、甲叶酸钙、Leucovorin Calcium、醛氢叶酸钙、Wellcovrin、叶醛酸钙

【外文名称】Calcium Folinate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】*N*－［4－［（2－氨基－5－甲酰基－1,4,5,6,7,8,－六氢－4－氧代－6－蝶啶基）甲基］氨基］苯甲酰基－L－谷氨酸钙盐五水合物

【分子式】$C_{20}H_{21}CaN_7O_7 \cdot 5H_2O$

【分子量】601.61

【性状及组成】本品为类白色至微黄色结晶或无定形粉末，无臭。

本品在水中易溶，在乙醇或乙醚中几乎不溶；在 0.1mol/L 氢氧化钠溶液中易溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：解毒药、抗贫血药。

本品为四氢叶酸的甲酰衍生物。主要用于高剂量甲氨蝶呤等叶酸拮抗剂的解救。甲氨蝶呤的主要作用是与二氢叶酸还原酶结合，通过四氢叶酸还原酶转变为四氢叶酸，能有效地对抗甲氨蝶呤引起的毒性反应。

本品可限制甲氨蝶呤对正常细胞的损害程度，逆转甲氨蝶呤对骨髓和胃肠黏膜反应，但对已存在的甲氨蝶呤神经毒性则无明显作用。

【药代动力学】本品口服后易于吸收，（1.72 ± 0.8）小时后，血清还原叶酸达峰值，药物作用持续 3～6 小时；经肝和肠黏膜作用后本品代谢为 5－甲基四氢叶酸，口服后代谢较肌注快而充分，80%～90%经肾排出，5%～8%随粪便排泄。

本品肌注血清峰值需（0.71 ± 0.09）小时。血清还原叶酸 $t_{1/2}$ 在静注、肌注后为 3.5～6.2 小时。无论何种途径进入，药物作用持续 3～6 小时。经肝和肠黏膜作用后本品代谢为 5－甲基四氢叶酸，80%～90%经肾排出，小量 5%～8%随粪便排泄。

本品静注 10 分钟后血药浓度达峰值，消除半衰期为 32～35 分钟，80%～90%的药物通过尿排泄，5%～8%的药物通过大便排泄。

【药物相互作用】本品较大剂量与巴比妥、扑米酮或苯妥英钠同用，可影响抗癫痫作用。

【药物过量】未有过量使用本品的报道。然而，亚叶酸钙超量可减弱叶酸拮抗剂类抗癌药物的疗效。

【不良反应】很少见，偶见皮疹、荨麻疹或哮喘等过敏反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方亚油酸钙片	化学药	HZ001451
亚叶酸钙胶囊	化学药	HZ003827
亚叶酸钙氯化钠注射液	化学药	HZ003828
亚叶酸钙片	化学药	HZ003829
亚叶酸钙注射液	化学药	HZ003830
注射用亚叶酸钙	化学药	HZ005042

HY002097 亚油酸

【外文名称】Linoleic Acid

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 5 册

药物理化信息

【化学名】顺－9－顺－12－十八碳二烯酸

【分子式】$C_{18}H_{32}O_2$

【分子量】280.00

【性状及组成】本品系从豆油或红花子油中制得。

本品为黄色或淡棕黄色的澄清油状液体，有植物油的微臭，味辛辣。

相对密度：本品的相对密度为 0.895～0.905。

折光率：本品的折光率为 1.465～1.470。

碘值：取本品 0.12～0.14g，精密称定，照碘值

的测定法自“置 250ml 的干燥碘瓶中”起，依法测定，碘值应不少于 148。

药物药理信息

【药理毒理】亚油酸是一种必需脂肪酸。必需脂肪酸不能被机体合成，必须从食物中供给。必需脂肪酸关系到健康的许多方面，例如皮肤、体表状态、肾功能和生殖功能等方面。

亚油酸在人体内可被转化成 γ－亚麻酸，DH－γ－亚麻酸和花生四烯酸，也可作为能量使用或贮存。

亚油酸的主要生理功能是：作为某些生理调节物质（如前列腺素）的前体物质，亚油酸可使胆固醇脂化，从而降低血清和肝脏中的胆固醇水平；对糖尿病也有预防作用；亚油酸能抑制动脉血栓的形成，因而可预防心肌梗塞的发生；亚油酸对维持机体细胞膜功能也起着重要作用。

研究表明，以人体推荐量的（0.1g/kg）的 25～100 倍的亚油酸喂养试验小鼠、大鼠均无明显毒性作用。

【不良反应】不良反应有轻度胃肠道反应，连续服药可逐渐消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方三维亚油酸胶丸Ⅱ	化学药	HZ001368
亚油酸胶丸	化学药	HZ003831
亚油酸维生素 E 胶丸	化学药	HZ003832
舒络片	中成药	ZC005198

HY002098　亚油酸乙酯

【外文名称】Ethyl Linoleate

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 13 册

【性状及组成】本品为淡黄色的澄清油状液体，无酸败味。不溶于水，溶于乙醇、乙醚，与 *N*，*N*－二甲基甲酰胺、脂肪族溶剂和油类等混溶。

沸点 212℃（1.6kPa），175℃（0.33kPa），133℃（0.133kPa）。折射率 1.4675。

药物药理信息

【药理毒理】亚油酸乙酯和亚油酸一样都有降低胆固醇和血脂的作用，可预防或减轻脉粥样硬化症。亚油酸乙酯的副反应比亚油酸轻得多。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方三维亚油酸胶丸Ⅰ	化学药	HZ001367

HY002099　烟酸

【其他名称】抗癞皮病维生素、尼古丁酸、Niacin、Nicolar、Nicosode、尼克酸、维生素 B_5、维生素 PP、烟碱酸

【外文名称】Nicotinic Acid

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】吡啶－3－羧酸

【分子式】$C_6H_5NO_2$

【分子量】123.11

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末，无臭或有微臭，味微酸；水溶液显酸性反应。本品在沸水或沸乙醇中溶解，在水中略溶，在乙醇中微溶，在乙醚中几乎不溶；在碳酸钠溶液或氢氧化钠溶液中均易溶。

熔点：本品的熔点为 234～238℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：维生素类药。

烟酸在体内转化为烟酰胺，再与核糖腺嘌呤等组成烟酰胺腺嘌呤二核苷酸（辅酶Ⅰ）和烟酰胺腺嘌呤二核苷酸磷酸（辅酶Ⅱ），为脂质氨基酸、蛋白、嘌呤代谢，组织呼吸的氧化作用和糖原分解所必需。烟酸可减低辅酶 A 的利用；通过抑制极低密度脂蛋白（VLDL）的合成而影响血中胆固醇的运载，大剂量可降低血清胆固醇及甘油三酯浓度。烟酸有周围血管扩张作用。

【药代动力学】胃肠道吸收。口服后 30～60 分钟血药浓度达峰值，广泛分布到各组织。半衰期（$t_{1/2}$）约为 45 分钟。肝内代谢。治疗量的烟酸仅有小量以原形及代谢物由尿排出。食物中色氨酸通过肠道细菌作用转换为烟酸。吸收后在体内首先转化成辅酶Ⅰ及辅酶Ⅱ，主要代谢产物是 *N*－甲基烟酰胺，大剂量使用时可以原型排出体外。

【药物相互作用】

1．异烟肼可阻止烟酸与辅酶Ⅰ结合，而致烟酸缺少。

2．烟酸与胍乙啶等肾上腺素受体阻滞型抗高血压药合用，其血管扩张作用协同增强，并可产生直立性低血压。

3．可使降压药及吩噻嗪衍生物的作用加剧，并能使纤维蛋白酶失活。

【药物过量】用量超过需要时，绝大部分可经肾排出。

【不良反应】

1. 烟酸在肾功能正常时几乎不会发生毒性反应。

2. 烟酸的一般反应有：感觉温热、皮肤发红，特别在脸面和颈部，头痛。

3. 大量烟酸可导致腹泻、头晕、乏力、皮肤干燥、瘙痒、眼干燥、恶心、呕吐、胃痛等。

4. 偶尔大量应用烟酸可致高血糖、高尿酸、心律失常、肝毒性反应。

5. 一般服用烟酸2周后，血管扩张及胃肠道不适可渐适应，逐渐增加用量可避免上述反应。如有严重皮肤潮红、瘙痒、胃肠道不适，应减小剂量。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
多维铁口服溶液	化学药	HZ000800
复方儿茶胶囊	化学药	HZ001154
复方肝浸膏糖浆	化学药	HZ001190
复方毛冬青氯贝酸铝片	化学药	HZ001317
复方三维亚油酸胶丸Ⅰ	化学药	HZ001367
复方维生素 B_2 片	化学药	HZ001420
口服五维葡萄糖	化学药	HZ002143
浓维磷糖浆	化学药	HZ002824
七维牛磺酸口服溶液	化学药	HZ002926
小儿复方四维亚铁散	化学药	HZ003760
烟酸缓释胶囊	化学药	HZ003833
烟酸缓释片	化学药	HZ003834
烟酸片	化学药	HZ003835
烟酸注射液	化学药	HZ003840
注射用烟酸	化学药	HZ005043
决明降脂片	中成药	ZC002923

HY002100 烟酸肌醇酯

【其他名称】Hexanicit、Hexanicotol、Hexopal、肌醇烟酸酯、六烟酸肌醇酯、Meso－Inositol Hexanicotinate、Vasonicit、烟肌酯

【外文名称】Inositoli Nicotinas

药物理化信息

【化学名】1,2,3,5/4,6环己六醇尼古丁酸酯

【分子式】$C_{42}H_{30}N_6O_{12}$

【分子量】810.73

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭。

本品在三氯甲烷中极微溶解，在水，乙醇或乙醚中不溶，在稀酸中溶解。

药物药理信息

【药理毒理】本品为一温和的周围血管扩张剂，在体内逐渐水解为烟酸和肌醇，故具有烟酸和肌醇二者的药理作用，具降脂作用。其血管扩张作用较烟酸缓和而持久，没有服用烟酸后的潮红和胃部不适等副作用。本品可选择性的使病变部位和受寒冷刺激的敏感部位的血管扩张，而对正常血管的扩张作用则较弱。此外并有溶解血栓、抗凝、抗脂肪肝、降低毛细血管脆性等作用。

毒理：本品在体内水解为烟酸和肌醇，其中烟酸的 LD_{50} 为（口服）大鼠 7g/kg，（皮下）大鼠 5g/kg。

【药代动力学】本品烟酸成分经吸收后广泛分布到各组织。约45分钟肝内代谢。$t_{1/2}$大剂量治疗时，绝大部分经肾排出。

【药物过量】如发生药物过量，应针对中毒症状采取相应支持疗法。

【不良反应】服药后可有轻度恶心、发汗、瘙痒感等反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肌醇烟酸酯片	化学药	HZ001789
肌醇烟酸酯软膏	化学药	HZ001790

HY002101 烟酸占替诺

【其他名称】烟胺羟丙茶碱

【外文名称】Xantinol Nicotinate

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】7－［2－羟基－3－（2－羟乙基－甲胺基）－丙基］茶碱的烟酸盐

【分子式】$C_{19}H_{26}N_6O_6$

【分子量】434.45

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末，无臭，无味。

本品在水中或冰醋酸中易溶，在无水乙醇或三氯甲烷中极微溶解。

熔点：本品的熔点为180～184℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品是一种血管扩张剂，直接作用于小动脉平滑肌及毛细血管，使血管扩张，改善血液流变学，减少周围血管的阻力。本品能促进葡萄糖透过血脑屏障，增强脑细胞的葡萄糖和氧的利用，

改善大脑的糖代谢和大脑功能，还有促进脂肪代谢，降低高血脂、高胆固醇和高纤维蛋白原的作用。

【药代动力学】 文献报道用气相色谱法研究了静脉注射烟酸占替诺在 Beagle 狗体内的药代动力学结果表明，吸收半衰期为 0.4 小时，消除半衰期为 1.67 小时，分布容积为 0.93L/kg，体内总清除率为 0.63L/（h·kg）。

【药物相互作用】 不宜与神经节阻断剂及抗交感神经药同时应用。

【不良反应】 面部潮红、口干、胸闷、皮疹、四肢红斑及风团。极个别患者出现脑出血及脑疝。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
烟酸占替诺氯化钠注射液	化学药	HZ0003836
烟酸占替诺片	化学药	HZ0003837
烟酸占替诺葡萄糖注射液	化学药	HZ0003838
烟酸占替诺注射液	化学药	HZ0003839
注射用烟酸占替诺	化学药	HZ0050144

HY002102　烟酰胺

【其他名称】 尼克烟胺、维生素 B_5、维生素 PP、烟碱胺、烟碱酸胺

【外文名称】 Nicotinamide

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 3－吡啶甲酰胺

【分子式】 $C_6H_6N_2O$

【分子量】 122.13

【性状及组成】 本品为白色的结晶性粉末，无臭或几乎无臭，味苦。本品在水或乙醇中易溶，在甘油中溶解。

熔点：本品的熔点为 128～131℃

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：维生素类药

本品在体内与核糖、磷酸、腺嘌呤形成烟酰胺腺嘌呤二核苷酸（辅酶 I）和烟酰胺腺嘌呤二核苷酸磷酸（辅酶 II），为脂质代谢、组织呼吸的氧化作用和糖原分解所必需，缺乏时可影响细胞的正常呼吸和代谢而引起糙皮病。此外，本品尚有防治心脏传导阻滞和提高窦房结功能及抗快速型实验性心律失常的作用，能显著改善维拉帕米引起的心率减慢和房室传导阻滞。

【药代动力学】 胃肠道易吸收，吸收后分布到全身组织，半衰期（$t_{1/2}$）约为 45 分钟。经肝脏代谢，治疗量仅少量以原形自尿排出。肌注吸收更快，吸收后在体内转变成辅酶分布到全身组织，半衰期为 45 分钟。

【药物相互作用】 烟酰胺与异烟肼有拮抗作用，长期服用异烟肼时，应适当补充烟酰胺。

【药物过量】 用量超过需要暂时排泄增多。

【不良反应】 个别有头昏、恶心、上腹不适、食欲减退等，可自行消失。静滴给药后可出现皮肤潮红和瘙痒等。偶尔可发生高血糖、高尿酸、心律失常。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
八维钙锌片	化学药	HZ0000287
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ0000517
肠内营养粉剂（TP）	化学药	HZ0000518
多维氨基酸糖浆	化学药	HZ0000797
多维片（6）	化学药	HZ0000798
多维生素滴剂	化学药	HZ0000799
多维元素胶囊（13）	化学药	HZ0000801
多维元素胶囊（15）	化学药	HZ0000802
多维元素胶囊（16）	化学药	HZ0000803
多维元素片	化学药	HZ0000804
多维元素片（14）	化学药	HZ0000805
多维元素片（16）	化学药	HZ0000806
多维元素片（16－Ⅱ）	化学药	HZ0000807
多维元素片（21）	化学药	HZ0000808
多维元素片（25）	化学药	HZ0000809
多维元素片（29）	化学药	HZ0000810
多种维生素片	化学药	HZ0000817
复方氨基酸胶囊（8－11）	化学药	HZ0001047
复方八维甲睾酮胶囊	化学药	HZ0001076
复方淀粉酶口服溶液	化学药	HZ0001147
复方多维元素片（21）	化学药	HZ0001151
复方多维元素片（23）	化学药	HZ0001152
复方二维右旋泛酸钙糖浆	化学药	HZ0001369
复方营养混悬剂	化学药	HZ0001478
复合维生素 BC 片	化学药	HZ0001494
复合维生素 B 片	化学药	HZ0001495
复合维生素 B 注射液	化学药	HZ0001496
复合维生素片	化学药	HZ0001497

续表

制剂名称	类别	序号
九合维生素丸	化学药	HZ001965
九维片	化学药	HZ001966
九维鱼肝油乳	化学药	HZ001967
克补片	化学药	HZ002094
口服五维赖氨酸葡萄糖	化学药	HZ002142
六维胶丸	化学药	HZ002448
新富乐 T 片	化学药	HZ002937
善存液	化学药	HZ003188
善存银片	化学药	HZ003189
十维片	化学药	HZ003201
十维铁咀嚼片	化学药	HZ003202
四维他片	化学药	HZ003320
维胺颗粒	化学药	HZ003511
维铁缓释片	化学药	HZ003584
维铁片	化学药	HZ003585
五维 B 颗粒	化学药	HZ003604
五维甘草那敏胶囊	化学药	HZ003605
五维赖氨酸颗粒	化学药	HZ003606
五维赖氨酸口服溶液	化学药	HZ003607
五维赖氨酸片	化学药	HZ003608
五维牛磺酸口服液	化学药	HZ003609
五维葡钙口服溶液	化学药	HZ003610
五维他口服溶液	化学药	HZ003611
小儿善存片	化学药	HZ003769
小儿善存液	化学药	HZ003770
小儿维生素咀嚼片	化学药	HZ003778
小儿五维赖氨酸糖浆	化学药	HZ003781
烟酰胺片	化学药	HZ003841
烟酰胺葡萄糖注射液	化学药	HZ003842
烟酰胺注射液	化学药	HZ003843
注射用复合维生素 B	化学药	HZ004766
注射用水溶性维生素	化学药	HZ004960
注射用烟酰胺	化学药	HZ005045
注射用 12 种复合维生素	化学药	HZ005133
枯草杆菌/肠球菌二联活菌多维颗粒剂	生物制品	SW0000148

HY002103 烟酰酸镁

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方牛磺酸胶囊	化学药	HZ001330

HY002104 岩白菜素

【其他名称】 矮茶素、矮茶树 1 号、Ardisic acid B、Ardisic acid B、Bergenit、Corylopsin、Cuscutin、佛手配质、鬼灯聚素、虎耳草素、Peltaphorin、Vakerin、岩白菜宁、岩白菜内酯

【外文名称】 Bergeninum

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 1 部

【分子式】 $C_{14}H_{16}O_9$

【分子量】 328.27

【性状及组成】 本品为白色疏松的针状结晶或结晶性粉末，无臭，味苦，遇光或热渐变色。在甲醇中溶解，在水或乙醇中微溶。

熔点：取本品，在 130℃干燥后，依法测定，熔点为 232 ~ 240℃。

比旋度：取本品，精密称定，加甲醇制成每 1ml 含 20mg 的溶液，依法测定，按干燥品计算，比旋度为 - 38° 至 - 45°。

药物药理信息

【药理毒理】

1. 本品具有镇痛、镇静、催眠及安定作用。其镇痛作用弱于哌替啶，强于一般解热镇痛药。在治疗剂量下无呼吸抑制作用，亦不引起胃肠道平滑肌痉挛。对慢性持续性疼痛及内脏钝痛效果较好，对急性锐痛（如手术后疼痛、创伤性疼痛等）、晚期癌症痛效果较差。在产生镇痛作用的同时，可引起镇静及催眠。

本品的作用机制尚待阐明，可能与通过抑制脑干网状结构上行激活系统，阻滞脑内多巴胺受体的功能有关。治疗量无成瘾性。

2. 止咳及对气管及肺组织呼吸的影响：作用于含巯基必需基团的酶系统，能降低组织呼吸，但作用不强。

3. 抗炎症：临床主要用于治疗慢性气管炎和慢性胃炎。对胃和十二指肠溃疡等亦有效。

毒性：对大鼠生长发育和主要脏器都有毒性，小鼠腹腔注射 LD_{50} 为 10g/kg。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方岩白菜素片	化学药	HZ001453
矽肺宁片	中成药	ZC005920

HY002105　炎琥宁

【外文名称】Potassium Sodium Dehydroandrographolide Succinate

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第1册

药物理化信息

【化学名】14－脱羟－11,12－二脱氢穿心莲内酯－3,19－二琥珀酸半酯钾钠盐

【分子式】$C_{28}H_{34}KNaO_{10}\cdot H_2O$

【分子量】610.68

【性状及组成】本品为微黄色粉末，无臭，味苦，有引湿性。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理：本品系穿心莲提取物经酯化、脱水、成盐精制而成。能抑制早期毛细血管通透性增高与炎性渗出和水肿，能特异性地兴奋垂体－肾上腺皮质功能，促进ACTH释放，增加垂体前叶中ACTH的生物合成；体外具有灭活腺病毒、流感病毒、呼吸道病毒等多种病毒的作用。动物实验有抗早、中孕作用。

2．毒理：本品静注和腹腔注射LD_{50}分别为（600±20）mg/kg和（675±30）mg/kg。给大白鼠腹腔注射本品，剂量分别为36和84mg/kg，一日一次，连续10日，结果在上述剂量下本品对动物生长、食欲、毛色、活动、肝肾功及主要脏器病检等均无明显影响，是安全的。

【药代动力学】穿琥宁肌内或静脉给药后，在体内迅速吸收、分布，其吸收相半衰期为（18.90±12.12）分钟，分布相半衰期仅为（1.3±0.3）分钟。用药6小时后血药浓度明显下降，其消除相半衰期为（3.86±1.06）小时，用药2天后可排出给药量的85%以上。肌注的生物利用度达94.2%±32.9%，表明肌注后吸收利用较完全。

【药物相互作用】

1．本品忌与酸、碱性药物或含有亚硫酸氢钠、焦亚硫酸钠为抗氧剂的药物配伍。

2．本品不宜与氨基糖苷类、喹诺酮类药物配伍。

【不良反应】关于炎琥宁临床应用文献报道较少，偶见皮疹等过敏反应。动物试验中肌肉给药可见局部刺激反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
炎琥宁氯化钠注射液	化学药	HZ003844
炎琥宁注射液	化学药	HZ003845
注射用炎琥宁	化学药	HZ005046

HY002106　盐酸

【外文名称】Hydrochloric Acid

药物管理信息

【特殊管理分类】易制毒药

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】盐酸

【分子式】HCl

【分子量】36.46

【性状及组成】本品为无色发烟的澄清液体，有强烈的刺激臭，呈强酸性。

相对密度：本品的相对密度在25℃时约为1.18。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料、酸化剂。

盐酸作为一种酸化剂，广泛用于各种食品和药物制剂中。它也可被稀释成各种浓度的稀酸，稀盐酸除了作为药用辅料外还有治疗作用，静脉注射可治疗代谢性碱中毒，口服治疗胃酸缺乏。

【药物相互作用】盐酸可与碱剧烈反应并产生大量热量。盐酸也可与许多金属反应并放出氢。

【不良反应】使用稀的或低浓度的盐酸通常不会引起任何不良反应。但是高浓度溶液的腐蚀性很强，与眼睛和皮肤相接触或吞入都会引起严重损伤。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
稀盐酸	化学药	HZ003654
盐酸奈福泮氯化钠注射液	化学药	HZ004209
盐酸奈福泮葡萄糖注射液	化学药	HZ004211
白降丹	中成药	ZC000152

HY002107　盐酸阿比朵尔

【其他名称】阿比多尔

【外文名称】Arbidol Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】6－溴－4－（二甲氨基甲基）－5－羟基－1－甲基－2－（苯硫甲基）－1*H*－吲哚－3－羧酸乙酯盐酸盐－水合物

【分子式】$C_{22}H_{25}BrN_2O_3S \cdot HCl \cdot H_2O$

【分子量】531.89

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：本品为预防和治疗流行性感冒药，通过抑制流感病毒脂膜与宿主细胞的融合而阻断病毒的复制。体外细胞培养试验直接抑制A、B型流感病毒的复制，体内动物试验降低流感病毒感染小鼠的死亡率。

2．毒理研究

长期毒性：本品连续灌胃给药，大鼠100～125mg/kg 6个月、犬25mg/kg 6个月，未见明显毒性反应。

生殖毒性：本品对大鼠无致畸胎作用。

遗传毒性：本品经体内、外试验，未见致突变作用。

【药代动力学】在国内健康受试者（$n=12$）进行的药代研究表明：单次口服阿比多尔个体间吸收差异较大。单剂量口服盐酸阿比多尔200mg、400mg、600mg，达峰时间分别为（2.0±1.3）小时、（1.5±1.3）小时、（1.3±1.1）小时，达峰浓度分别为(614.1±342.5)、(904.2±355.6)、(975.1±661.0)，半衰期分别为（11.9±3.7）小时、(12.27±5.32）小时、(13.4±6.9）小时。同剂量组间的t_{max}、$t_{1/2}$、Ke和MRT均相近，无显著性差异；在200mg组与400mg组间的C_{max}、AUC呈剂量倍比性增加趋势；600mg组C_{max}、AUC虽高于400mg组，但无剂量倍比性增加趋势。

另据动物药代动力学，大鼠灌胃给予本药后吸收迅速，绝对生物利用度为35.6%。本药全身分布，肝脏中浓度最高，其次是胸腺、肾脏和脑。给药后48小时，40%药物以原形排出体外，其中粪便中排出38.9%。尿中排出不足0.12%。

【不良反应】不良事件发生率约为6.2%，主要表现为恶心、腹泻、头晕和血清转氨酶增高。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸阿比朵尔胶囊	化学药	HZ003846
盐酸阿比朵尔颗粒	化学药	HZ003847
盐酸阿比朵尔片	化学药	HZ003848

HY002108 盐酸阿芬太尼

【外文名称】Alfentanil Hydrochloride

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】本品为芬太尼的类似物，主要作用于μ阿片受体，为短效强镇痛药。对心血管系统影响小，一般不影响血压，用于心血管外科如冠状动脉搭桥术的静脉全麻药。

【药代动力学】起效快，静注后1.5～2分钟作用达峰，维持约10分钟。分布$t_{1/2}$为0.4～3.1分钟，再分布$t_{1/2}$为4.6～21.6分钟。消除$t_{1/2}$为64～129分钟。静注后血浆蛋白结合率90%，分布容积小，符合三室模型，经肝脏代谢失活后经尿排出。

HY002109 盐酸阿呋唑嗪

【外文名称】Alfuzosin Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第40册

药物理化信息

【化学名】*N*－［3－［(4－氨基－6,7－二甲氧基－2－喹唑啉）甲胺基］丙基］－四氢呋喃－2－酰胺盐酸盐

【分子式】$C_{19}H_{27}N_5O_4 \cdot HCl$

【分子量】425.92

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭。

本品在水中易溶，在乙醇或三氯甲烷中略溶，在乙酸乙酯或乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】盐酸阿呋唑嗪是一种喹唑啉类衍生物，可选择性地阻断分布于膀胱、尿道和前列腺三角区的突触后α肾上腺素受体，拮抗该受体介导的下泌尿道平滑肌收缩，从而改善良性前列腺增生患者排尿困难的相关症状。

【药代动力学】本品口服吸收迅速，口服生物利用率为64%，食物不影响本品的吸收。本品的药代动力学在治疗剂量范围内呈线性。18名年轻健康志愿者单次口服本品5mg，C_{max}为（18.40±5.94）ng/ml，t_{max}为（1.89±0.72）小时，AUC_{0-12}为（78.70±18.79）ng·（h/ml），血浆消除半衰期为3.19±0.60h。本品在肝脏广泛代谢，仅有11%以原形药物形式由肾排泄，其代谢物的15%～30%随尿液排出，75%～91%随粪便排出。本品的

血浆蛋白结合率为90%。

老年患者的血药浓度峰值和生物利用度增加，但 $t_{1/2}$不变。肝功能损失患者的 C_{max}生物利用度增加，$t_{1/2}$延长。肾功能损伤患者可能由于蛋白结合下降导致分布容积和清除率增加，但 $t_{1/2}$不变。

【药物相互作用】

1．本品应避免与其他 α 受体拮抗剂合用。

2．钙拮抗剂与本品对扩张血管有协同作用，与本品合用可能导致严重的低血压，故本品应避免与钙拮抗剂合用。

3．本品与抗高血压药、心绞痛治疗药合用时应慎重。

【药物过量】一旦发生药物过量，患者应取卧位，并在医院进行输液及给予血管升压治疗。可给予直接作用于血管平滑肌纤维的缩血管药解毒。由于本品蛋白结合率高，透析作用不大。

【不良反应】常见的不良反应为眩晕、虚弱、头痛、心跳加快，偶见体位性低血压、潮热、瞌睡、消化不良、恶心、呕吐、腹泻、晕厥、口干、皮疹。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸阿夫唑嗪缓释片	化学药	HZ003849
盐酸阿呋唑嗪片	化学药	HZ003850

HY002110　盐酸阿罗洛尔

【其他名称】阿尔马尔、ALMARL、ARO

【外文名称】Hydrochloride Arotinolol

【性状及组成】本品为白色至黄色结晶性粉末，无臭。有刺激味。略溶于水及甲醇，微溶于无水乙醇。熔点148～149℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为可阻断 α 及 β 受体，但阻断 α 受体的作用较弱，阻断 α 受体与 β 受体的比为1:8，故其体位性低血压作用甚弱。其阻断 β 受体的作用比普萘洛尔者强。无膜稳定作用，亦无内在活性。本品可使血压降低，使亢进的心功能降低，使心肌耗氧量减少。本品滴眼后可降低眼内压，其0.50%溶液的降眼内压强度与0.5%噻吗洛尔溶液者相当。滴眼后1小时见效。

【药物相互作用】与对交感神经系统有抑制作用的药物如利血平合用，可出现过度抑制症状。与降血糖药合用可增强降血糖作用。与钙拮抗剂合用可互相增强作用。可乐定可能增强停药后的反跳现象。与吡二丙胺、普鲁卡因酰胺、阿马林合用，可出现心功能过度抑制症状。

【不良反应】

1．心力衰竭，房室传导阻滞，心动过缓，胸痛，胸部不适感，眩晕，低血压，偶见心房颤动，末梢血循环障碍，心悸，气喘。乏力，头痛，嗜睡，偶见忧郁，失眠。

2．腹部不适感，腹泻，腹痛，恶心，呕吐，偶见食欲减退，消化不良，腹胀，便秘。

3．肝功能损害。

4．支气管痉挛，气喘，咳嗽。

5．眼泪减少，眼睛疲劳，偶见雾视。

6．皮疹，荨麻疹，瘙痒，灼热感。水肿，麻木，肌肉痛，口渴，脱发，白细胞增多。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸阿罗洛尔片	化学药	HZ003851

HY002111　盐酸阿米洛利

【外文名称】Amiloride Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】*N*－脒基－3,5－二氨基－6－氯吡嗪－2－酰胺盐酸盐二水合物

【分子式】$C_6H_8ClN_7O\cdot HCl\cdot 2H_2O$

【分子量】302.10

【性状及组成】本品为淡黄色或黄绿色粉末，无臭或几乎无臭，味苦。本品在水中微溶，在乙醇中极微溶解，在三氯甲烷或乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：利尿药。

本品系保钾利尿药，作用于肾脏远端小管，阻断钠－钾交换机制，促使钠、氯排泄而减少钾和氢离子分泌。作用不依赖于醛固酮。其本身促尿钠排泄和抗高血压活性减弱，但与噻嗪类或髓袢类利尿剂合用有协同作用。

【药代动力学】口服后经胃肠道吸收。作用半衰期6～9小时，单次口服起效时间为2小时，血清浓度达峰时间为3～4小时，有效持续时间为6～10小时，约50%以原形药从小便中排泄，40%在72小时内随粪便排出。

【药物相互作用】

1．肾上腺皮质激素尤其是具有较强盐皮质激素作用者，促肾上腺皮质激素能减弱本药的利尿作用，而拮抗本药的潴钾作用。

2. 雌激素能引起水钠潴留，从而减弱本药的利尿作用。

3. 非甾体类消炎镇痛药，尤其是吲哚美辛，能降低本药的利尿作用，且合用时肾毒性增加。

4. 拟交感神经药物降低本药的降压作用。

5. 多巴胺加强本药的利尿作用。

6. 与引起血压下降的药物合用，利尿和降压效果均加强。

7. 且不宜与其他保钾利尿药或钾盐合用。与下列药物合用时，发生高钾血症的机会增加，如含钾药物、库存血（含钾 20mmol/L，如库存 10 日以上含钾高达 65mmol/L）、血管紧张素转换酶抑制剂、血管紧张素Ⅱ受体拮抗剂和环孢素 A 等。

8. 与葡萄糖胰岛素液、碱剂、钠型降钾交换树脂合用，发生高钾血症的机会减少。

9. 本药使地高辛半衰期延长。

10. 与氯化铵合用易发生代谢性酸中毒。

11. 与肾毒性药物合用，肾毒性增加。

12. 甘珀酸钠、甘草类制剂具有醛固酮样作用，可降低本药的利尿作用。

【不良反应】

1. 单独使用时高钾血症较常见。

2. 本药偶可引起低钠血症，高钙血症，轻度代谢性酸中毒。

3. 胃肠道反应可有口干、恶心、呕吐、腹胀等不良反应。

4. 还可见到头痛、头晕、胸闷、性功能低下等不良反应。

5. 过敏反应主要表现为：皮疹甚至呼吸困难。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方呋塞米片	化学药	HZ001165
复方盐酸阿米洛利片	化学药	HZ001454
盐酸阿米洛利片	化学药	HZ003852

HY002112 盐酸阿米替林

【外文名称】 Amitriptyline Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 *N*，*N* - 二甲基 - 3 - ［10,11 - 二氢 - 5*H* - 二苯并［*a*，*d*］环庚三烯 - 5 - 亚基］ - 1 - 丙胺盐酸盐

【分子式】 $C_{20}H_{23}N \cdot HCl$

【分子量】 313.87

【性状及组成】 本品为无色结晶或白色、类白色粉末，无臭或几乎无臭，味苦，有灼热感，随后有麻木感。本品在水、甲醇、乙醇或三氯甲烷中易溶，在乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 195 ~ 199℃。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：抗抑郁药。

本品为三环类抗抑郁药，其作用在于抑制 5 - 羟色胺和去甲肾上腺素的再摄取，对 5 - 羟色胺再摄取的抑制更强，镇静和抗胆碱作用亦较强。

【药代动力学】 口服吸收好，生物利用度为 31% ~ 61%，蛋白结合率 82% ~ 96%，半衰期（$t_{1/2}$）为 31 ~ 46 小时，表观分布容积（V_d）5 ~ 10L/kg。主要在肝脏代谢，活性代谢产物为去甲替林，自肾脏排泄，可分泌入乳汁，老年病人由于代谢和排泄能力下降，对本品敏感性增强，应减少用量。肝硬化和门脉系外科手术患者、肾衰患者需减量。

肌内注射后吸收快而完全，广泛分布于体内，达峰时间（t_{max}）不到 6 小时。

【药物相互作用】

1. 本品与舒托必利合用，有增加室性心律失常的危险，严重可致尖端扭转心律失常。

2. 本品与乙醇或其他中枢神经系统抑制药合用，中枢神经抑制作用增强。

3. 本品与肾上腺素、去甲肾上腺素合用，易致高血压及心律紊乱失常。

4. 本品与可乐定合用，后者抗高血压作用减弱。

5. 本品与抗惊厥药合用，可降低抗惊厥药的作用。

6. 本品与氟西汀或氟伏沙明合用，可增加两者的血浆浓度、出现惊厥，不良反应增加。

7. 本品与阿托品类合用，不良反应增加。

8. 与单胺氧化酶合用，可发生高血压。

【药物过量】 中毒症状：烦躁不安、谵妄、昏迷、可出现严重的抗胆碱能反应或癫痫发作。心脏毒性可致传导障碍、心律失常、心力衰竭。

处理：洗胃、催吐，以排除毒物，采取增加排泄措施，并依病情进行相应对症治疗和支持疗法。

【不良反应】 治疗初期可能出现抗胆碱能反应，如多汗、口干、视物模糊、排尿困难、便秘等。中枢神经系统不良反应可出现嗜睡，震颤、眩晕。可发生体位性低血压。偶见癫痫发作、骨髓抑制及中毒性肝损害等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸阿米替林片	化学药	HZ003853
盐酸阿米替林注射液	化学药	HZ003854

HY002113　盐酸阿莫罗芬

【其他名称】罗噻尼尔

【外文名称】Amorolfine Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】顺式－4［3－［4－（1,1－二甲基－丙基）苯基］－2－甲基丙烷］－2,6－二甲基－吗啉盐酸盐

【分子式】$C_{21}H_{35}NO\cdot HCl$

【分子量】353.98

药物药理信息

【药理毒理】本品是局部外用抗真菌药。其活性成分为吗啉衍生物——阿莫罗芬。阿莫罗芬的抑菌作用主要是通过改变构成真菌细胞膜的脂类的生物合成来实现的。使麦角固醇含量减少，非典型脂类的累积导致真菌细胞膜和细胞器的形态改变，从而实现抑菌作用。

阿莫罗芬为广谱高效抗真菌药，它的抗菌谱如下。

酵母菌：白色念珠菌及其他念珠菌种。皮肤癣菌：红色毛癣菌、指（趾）间毛癣菌、须发毛癣菌及其他毛癣菌种，表皮癣菌，小孢子菌。霉菌：帚霉菌。暗色孢菌：Hendersonula、链格孢菌、分支孢子菌。低敏感性菌种：曲霉菌、镰孢菌、毛霉菌。

【药代动力学】盐酸阿莫罗芬搽剂可渗透甲板并在其中弥散，根除甲板内及甲板下的真菌。

盐酸阿莫罗芬搽剂局部外用所致的全身吸收很少，即便连续用药一年以上，血浆中的药物浓度仍然低于检测水平。

【不良反应】使用盐酸阿莫罗芬搽剂后会在局部甲床周围皮肤出现轻微的烧灼感、瘙痒、红斑、脱屑，无须停药即可消失。极少数情况下，会出现渗出、水疱、疼痛、炎症等。罕见荨麻疹发生。尚未见全身副作用报道。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸阿莫罗芬搽剂	化学药	HZ003855

HY002114　盐酸阿扑吗啡

【外文名称】Apomorphine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（*R*）－6－甲基－5,6,6a,7－四氢－4*H*－二苯并［*de*，*g*］喹啉－10,11－二酚盐酸盐半水合物

【分子式】$C_{17}H_{17}NO_2\cdot HCl\cdot 1/2H_2O$

【分子量】312.80

【性状及组成】本品为白色或灰白色有闪光的结晶或结晶性粉末，无臭，在空气或日光中渐变绿色。本品在热水中溶解，在水或乙醇中略溶，在三氯甲烷或乙醚中极微溶解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：催吐药。

本品由吗啡分子中去除一个水分子而得，其结构与多巴胺相近，具有激动多巴胺第 2 受体（D2）作用，国外有用于帕金森病的诊断和处理，认为有助于控制“开关”现象。在国内，本品主要用于催吐，它可直接兴奋催吐化学敏感区，前庭中枢亦受到刺激，运动可增加本品的催吐作用。此外，阿扑吗啡尚有镇定作用。

【药代动力学】口服作用弱而迟缓，皮下注射后成人在 5～10 分钟、小儿在 1～2 分钟开始催吐作用。在肝内代谢，由肾脏排泄，其中有极少量以原形排出。

【药物相互作用】

1．先期服用止吐药，可降低阿扑吗啡的催吐效应。

2．对中枢神经系统起抑制作用的吩噻嗪类镇吐药与本品合用，可导致严重的呼吸和循环抑制，产生不良反应或延长睡眠。

3．纳洛酮可以对抗本品的催吐作用对中枢神经与呼吸等的抑制。

4．在服用口服避孕药期间服用本品，可使本品镇静作用减弱。

【药物过量】用量过大可引起持续性呕吐和中枢抑制，纳洛酮能够对抗本品的催吐作用及对中枢神经与呼吸等的抑制，可用于解救过量中毒。

【不良反应】

1．中枢抑制的呼吸短促、呼吸困难或心动过缓；

2．用量过大可引起持续性呕吐；

3．昏睡、晕厥和直立性低血压等；

4. 快速或不规则的呼吸、疲倦无力、颤抖或心率加快，以及中枢神经刺激反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸阿扑吗啡舌下片	化学药	HZ003856
盐酸阿扑吗啡注射液	化学药	HZ003857

HY002115 盐酸阿普林定

【其他名称】安搏律定、Amidonal、安室律定、Fibocil、印丙胺、茚丙胺、印满丙二胺

【外文名称】Aprindine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第7册

药物理化信息

【化学名】*N*，*N*－二乙基－*N′*－2－茚满基－*N′*－苯基－1,3－丙二胺盐酸盐

【分子式】$C_{22}H_{30}N_2 \cdot HCl$

【分子量】358.95

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末，无臭，味苦，随后有麻痹感。

本品在三氯甲烷中极易溶解，在水或乙醇中易溶。

熔点：本品的熔点为126.5～130℃。

吸收系数：取本品，精密称定，加乙醇溶解并定量稀释制成每1ml中约15mg的溶液，照紫外－可见分光光度法，在258nm的波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为334～369。

药物药理信息

【药理毒理】本品是一种具有局部麻醉作用的抗快速心律失常药。其电生理效应类似利多卡因，主要降低0相最大上升速率，减慢传导速度。抑制4相舒张期自动除极，降低自律性。延长心房、心室与房室结的有效不应期，缩短浦氏纤维的动作电位时程，阻滞旁路传导，对前向阻滞较逆向阻滞更为显著。

【药代动力学】口服吸收良好，生物利用度80%～90%，2小时血浆浓度达峰值，85%～95%与血浆蛋白结合，95%在肝内代谢，65%由尿中排出，35%由粪便排出，有效血药浓度为1.0～2.0mg/L。$t_{1/2}$约30h。

【不良反应】产生毒性作用的剂量与治疗剂量相当接近，不良反应较多。主要引起神经症状，当血浆浓度在2mg/L时，出现头晕、神经过敏、记忆障碍等；血药浓度在3mg/L时，出现颤抖、复视、幻觉、癫痫发作、共济失调等。胃肠道症状有恶心、呕吐、腹泻等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸阿普林定片	化学药	HZ003858
盐酸阿普林定注射液	化学药	HZ003859

HY002116 盐酸阿齐利特

【外文名称】Azimilide Dihydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】阿齐利特是一种能同时阻断快速激活钾通道电流和慢速激活钾通道电流的新型Ⅲ类抗心律失常药物，其作用机制是延长心肌动作电位时程（APD）和有效不应期（ERP）而延长心肌复极。临床用于转复防止房扑、房颤、室上性心动过速的复发和减少近期心肌梗死患者发生心律失常性猝死的危险。

作用机制：

1. 对离子通道和心肌的作用：阿齐利特是第一个表现出具有慢速激活钾通道电流拮抗活性的Ⅲ类抗心律失常药，也是目前开发出的数种慢速激活钾通道电流拮抗剂中唯一可以同时阻滞快速激活钾通道电流和慢速激活钾通道电流的化合物。阿齐利特延长心肌复极，体外实验表现为动作电位时程（APD）和有效不应期（ERP）的延长，其作用呈浓度依赖性。动作电位90%复极时间可被延长5%～66%，EFP可被延长2%～25%，其作用与阻滞动物和人类心脏的延迟整流钾通道（包括快速激活钾通道电流和慢速激活钾通道电流）的外向钾电流有关。阿齐利特对快速激活钾通道电流的半减活剂量（IC_{50}）为0.1～0.3μmol/L，对慢速激活钾通道电流的IC_{50}为1～3μmol/L。阿齐利特降低动作电位（AP）平台期的电压，但静息电位、AP幅度和0期最大超射速度不变。

2. 对受体的作用：阿齐利特表现出β受体拮抗性。在豚鼠离体心脏上，阿齐利特可抑制异丙肾上腺素引起的心率加快，它还可抑制普萘洛尔与β受体结合。但阿齐利特缺乏可与β受体结合的结构，提示其作用机制不同于简单的受体结合。

3. 频率依赖性：大多数Ⅲ类抗心律失常药都是在较慢的刺激频率下使APD的延长较大幅度，被称为“反向频率依赖性”，使得Ⅲ类药物在心动过速时作用减弱或消失，并导致长Q－T综合征、尖端扭转型室性心动过速（TdP）和心动过缓引起的心律失常。研究认为这与Ⅲ类药只阻滞快速激活钾通道电

流，使慢速激活钾通道电流过度上调有关，而阿齐利特阻滞慢速激活钾通道电流使得在心动过速和刺激 β 受体的情况下仍保持效能。体内研究显示阿齐利特的作用不具有频率依赖性。

【药代动力学】正常志愿者口服阿齐利特可完全吸收，峰浓度发生在服药后约 7 小时，吸收程度不受食物影响，不需因年龄和性别调整剂量。与蛋白质的结合率约为 94%，终末半衰期为 4 天。大部分通过代谢清除，肾清除率约占总清除率的 10%。只有一种代谢物具Ⅲ类药物活性，但其血浆浓度不到母体化合物的 5%。

【药物相互作用】接受地高辛治疗的 18 名患者服用阿齐利特 5 天达稳态后，地高辛的肾清除率和吸收率有轻度升高，但无临床意义，不需调整地高辛剂量。34 名接受华法林治疗的患者服阿齐利特 5 天后未见药代动力学相互作用，合并用药未见严重副作用。因此，阿齐利特与地高辛和华法林合用无相关药物反应，不需调整剂量。

HY002117　盐酸阿奇霉素

【外文名称】Azithromycin Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】阿奇霉素为氮杂内酯类抗生素，其作用机制是通过与敏感微生物的 50s 核糖体的亚单位结合，从而干扰其蛋白质的合成（不影响核酸的合成）。体外试验和临床研究均表明，阿奇霉素对以下多种致病菌有效。①革兰阳性需氧微生物：金黄色葡萄球菌、酿脓链球菌、肺炎链球菌、溶血性链球菌。阿奇霉素对于耐红霉素的革兰阳性菌有交叉耐药性。大多数粪链球菌（肠球菌）以及耐甲氧西林的葡萄球菌对本品耐药。②革兰阴性需氧微生物：流感嗜血杆菌、卡他莫拉菌、沙眼支原体。体外试验和临床研究已证实，阿奇霉素可预防鸟胞内分枝杆菌复合体（由鸟胞内分枝杆菌和胞内分枝杆菌组成）引起的疾病。③阿奇霉素对产 β - 内酰胺酶的菌株无效。对以下微生物已有体外研究结果，但是其临床意义尚不清楚，包括链球菌属（C、F、G）、草绿色链球菌、百日咳杆菌、杜克嗜血杆菌、嗜肺性军团菌、类杆菌属、消化链球菌属、包柔螺旋体、肺炎衣原体、梅毒螺旋体、解脲脲原体等。

盐酸为小分子量无机酸，其形成的盐类具有水溶性好、组织渗透性好的优点，可以用注射水溶解后，静注或静滴。

【药物相互作用】使用含镁、铝的抗酸药，茶碱，苄丙酮时应谨慎合用本品；合用地高辛、麦角胺或二氢麦角胺、三唑仑、细胞色素 P450 系统代谢药时应密切观察患者。

【不良反应】常见的有：腹泻、恶心、腹痛、稀便、呕吐；注射部位疼痛、局部炎症；皮疹、瘙痒；畏食、头晕。较少发生的有：消化不良、胃肠胀气、黏膜炎；过敏反应等等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸阿奇霉素	化学药	HZ005047

HY002118　盐酸阿柔比星

【其他名称】Aclacinon、ACM - A、安乐霉素、盐酸阿克拉比星、盐酸阿克拉鲁比西、盐酸阿克拉霉素、盐酸阿克拉霉素 A、盐酸阿拉霉素

【外文名称】Aclarubicin Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 45 册

药物理化信息

【化学名】（1*R*，2*R*，4*S*）- 2 - 乙基 - 1,2,3,4,6,11 - 六氢 - 2,5,7 - 三羟基 - 6,11 - 二氧代 - 4 - ［［2,3,6 - 三脱氧 - 4 - *O* - ［2,6 - 二脱氧 - 4 - *O* - ((2*R*，6*S*) 四氢 - 6 - 甲基 - 5 - 氧代 - 2*H* - 吡喃 - 2 - 基）- α - L - 来苏 - 己吡喃糖基］ - 3 - 二甲胺基］ - 3 - 二甲胺基 - α - L - 来苏 - 己吡喃糖基］ - 氧代 - 1 - 并四苯基羧酸甲酯

【分子式】$C_{42}H_{53}NO_{15}$

【分子量】811.88

【性状及组成】本品为淡桔黄色粉末，无臭。极易溶于三氯甲烷和甲醇，易溶于丙酮和水，几乎不溶于乙醚和正己烷。

药物药理信息

【药理毒理】阿柔比星是一种新蒽环类抗肿瘤抗生素，对各种移植性动物肿瘤如 L310、P388、Ehlrich 腹水癌、Lewis 肺癌、S100 肉瘤、B16 黑色素瘤和 CDF8 及 C3H 乳癌等均有较强的抗瘤活性。本品能抑制癌细胞的生物大分子合成，特别对 RNA 合成的抑制作用强。

本品对实验动物有一定的心脏毒性和骨髓抑制作用，但作用是可逆的。本品有生殖毒性。

【药代动力学】本品静脉注射后，能很快分布到全身组织中，以肺浓度为最高、其次为脾、胸腺、小肠、心脏；在肝、肾中以配基类代谢物为主；瘤组织中也有一定分布。虽然本品在注射后，血药浓度迅速降低，但能较久地维持在一定浓度。原形药

和糖苷类代谢物在胆汁中排泄较多，在尿粪中排泄较少；配基类代谢物主要由尿、粪排泄。

【药物相互作用】与环磷酰胺、长春新碱、阿糖胞苷及依托泊苷等有联合协同等作用。与活疫苗合用，可增加活疫苗感染危险。与特拉珠玛合用增加心功能不全的发生率和严重性。

【不良反应】主要不良反应为消化道反应和骨髓抑制，少数患者出现轻度脱发，个别患者出现发热、静脉炎、心脏毒性及肝肾功能异常。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸阿柔比星	化学药	HZ005048

HY002119 盐酸阿糖胞苷

【外文名称】Cytarabine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】1 - β - D - 阿拉伯呋喃糖基 - 4 - 氨基 - 2（1H）- 嘧啶酮盐酸盐

【分子式】$C_9H_{13}N_3O_5 \cdot HCl$

【分子量】279.68

【性状及组成】本品为白色细小针状结晶或结晶性粉末。本品在水中极易溶解，在乙醇中略溶，在乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 189 ~ 195℃，熔融时同时分解。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度应为 + 127°至 + 133°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗肿瘤药。

本品为主要作用于细胞 S 增殖期的嘧啶类抗代谢药物，通过抑制细胞 DNA 的合成，干扰细胞的增殖。阿糖胞苷进入人体后经激酶磷酸化后转为阿糖胞苷三磷酸及阿糖胞苷二磷酸，前者能强有力地抑制 DNA 聚合酶的合成，后者能抑制二磷酸胞苷转变为二磷酸脱氧胞苷，从而抑制细胞 DNA 聚合及合成。本品为细胞周期特异性药物，对处于 S 增殖期细胞的作用最为敏感，对抑制 RNA 及蛋白质合成的作用较弱。

【药代动力学】可静脉、皮下、肌内或鞘内注射而吸收。静脉注射后能广泛分布于体液、组织及细胞内，静脉滴注后约有中等量的药物可透过血脑屏障，其浓度约为血浆中浓度的 40%。本品在肝、肾等组织内代谢，在血及组织中很容易被胞嘧啶脱氨酶迅速脱氨而形成无活性的尿嘧啶阿拉伯糖苷。在脑脊液内，由于脱氨酶含量较低，故其脱氨作用较缓慢。静脉给药时，$t_{1/2\alpha}$为 10 ~ 15 分钟。$t_{1/2\beta_2}$ ~ 2.5 小时；鞘内给药时，$t_{1/2}$可延至 11 小时。在 24 小时内约 10%以阿糖胞苷，70% ~ 90%以尿嘧啶阿糖胞苷为主的无活性物质形式从肾脏排泄。

【药物相互作用】四氢尿苷可抑制脱氨酶，延长阿糖胞苷血浆半衰期，提高血中浓度，起增效作用。本品可使细胞部分同步化，继续应用柔红霉素、阿霉素、环磷酰胺及亚硝脲类药物可以增效。本品不应与 5 - Fu 并用。

【药物过量】采用中剂量或大剂量的阿糖胞苷治疗时，部分患者可能发生严重的胃肠道及神经系统不良反应，如胃肠道溃疡、胃肠囊样积气、坏死性结肠炎、周围神经病变、大脑或小脑功能障碍如性格改变、肌张力减退、癫痫、嗜睡、昏迷、定向力障碍、眼球震颤、语音失调、步态不稳；其他尚可发生出血性结膜炎、皮疹、脱发、脱皮、严重心肌病、肺脓疡毒血症等。

如出现上述各项严重的不良反应，应立即停用阿糖胞苷，并立即采用各种有效措施治疗，给患者肾上腺皮质激素可能减轻中剂量或大剂量阿糖胞苷的不良反应。

【不良反应】

1. 造血系统：主要是骨髓抑制，白细胞及血小板减少，严重者可发生再生障碍性贫血或巨幼细胞性贫血。

2. 白血病、淋巴瘤患者治疗初期可发生高尿酸血症，严重者可发生尿酸性肾病。

3. 较少见的有口腔炎、食管炎、肝功能异常、发热反应及血栓性静脉炎。阿糖胞苷综合征多出现于用药后 6 ~ 12 小时，有骨痛或肌痛、咽痛、发热、全身不适、皮疹、眼睛发红等表现。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸阿糖胞苷	化学药	HZ005049

HY002120 盐酸阿替卡因

【外文名称】Articaine Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】本品为新型酰胺类口腔专用局麻剂，具有起效快、麻醉力强、持续时间长［局部麻木消失时间（3 ± 1.2 小时）］、过敏反应少、不良反应小的特点，是安全有效的局部麻醉药物。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方盐酸阿替卡因注射液	化学药	HZ001455

HY002121　盐酸阿扎司琼

【外文名称】Azasetron Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第58册

药物理化信息

【化学名】3,4－二氢－4－甲基－6－氯－3－氧代－*N*－3－奎宁环基－2*H*－1,4－苯并噁嗪－8－甲酰胺盐酸盐

【分子式】$C_{17}H_{20}ClN_3O_3 \cdot HCl$

【分子量】386.28

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，味苦。

本品在水中易溶，在乙醇中极微溶解，在三氯甲烷中几乎不溶。

吸收系数：取本品适量，精密称定，给水溶解并定量稀释制成每1ml中约含40μg的溶液，照分光光度法，在305nm波长处测定吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为101～108。

药物药理信息

【药理毒理】阿扎司琼是5－HT_3受体拮抗剂类止吐药，具有强效、高选择性地拮抗5－HT_3受体的作用，但没有多巴胺受体拮抗作用。本品对5－HT_3受体有高度的亲和力，作用强度比甲氧氯普胺强约410倍，是昂丹司琼的2倍，几乎和格拉司琼等同。本品静脉注射，能高度拮抗5－HT_3诱发的心动过缓，它的拮抗作用比甲氧氯普胺强约900倍，比昂丹司琼强约4倍，和格拉司琼等同。在感觉神经细胞、离体心脏或离体回肠的离体实验中，本品对5－HT_3受体的拮抗作用比甲氧氯普胺强约20～720倍，比格拉司琼强1/8～3倍。

体内或体外试验表明，本品对其他受体的亲和力很小或几乎没有。本品对5－HT_3受体的亲和力强而对H_1受体的亲和力小。本品静脉注射0.1mg/kg或0.3mg/kg，对顺铂或阿霉素、环磷酰胺所致犬的呕吐有止吐作用；0.3mg/kg几乎完全抑制放疗引起的犬呕吐。

本品雄性大鼠静脉注射的LD_{50}为135mg/kg，雌性大鼠的LD_{50}为132mg/kg，雄性狗的致死量为300mg/kg。以0.3、3、10、60mg/kg对大鼠静脉给药3个月的试验表明，剂量在10mg/kg以上时尾部注药部位变为暗红色。在食量及体重增加的同时，心脏、肝脏、脑及肾上腺重量均有增加。这些变化均为可逆性。以0.3、3、30mg/kg对狗静脉给药3个月的试验表明，30mg/kg剂量给药组出现呕吐及流涎等症状。用豚鼠做全身性过敏试验及皮肤反应试验，用小鼠血清做的大白鼠PCA反应试验均无抗原性。细菌突变试验阴性，培养细胞染色体异常试验中发现结构异常，但小鼠小核试验未发现异常。对兔所做的研究表明，肌肉局部损害程度相当于损害分级标准的2级。

【药代动力学】据文献报道，健康男性志愿者静脉注射本品10mg后，3分钟血浆中原形药的浓度为90.5μg/ml，其药动学呈线性。本品呈双向消除，α相和β相的半衰期分别为0.3小时和4.3小时。对接受顺铂治疗的肿瘤患者，静脉注射本品10mg后，终末半衰期为7.3±1.2小时，较健康人长；原形药24小时由尿排泄量为剂量的(64.3±15)%。

大鼠静脉注射^{14}C－盐酸阿扎司琼，测其给药后15分钟的组织放射性浓度，结果肝脏、肺及肾脏的值增高。各组织内的放射性迅速消失，给药后24小时的浓度为给药后15分钟时的1/10以下。

【药物相互作用】盐酸阿扎司琼注射液与碱性注射剂（呋喃苯胺酸、甲氨蝶呤、氟尿嘧啶、吡咯他尼等针剂）或鬼臼乙叉苷注射液配伍会发生浑浊或结晶析出，故本剂应先与生理盐水混合后，方可配伍。与鬼臼乙叉苷注射液或氟氧头孢钠注射液配伍使用时可能会使本剂含量降低，故应在配制后6小时内使用。与地西泮注射液配伍后会出现浑浊沉淀，应避免与之配伍。

【不良反应】

1．严重副作用：过敏性休克，曾有发生过敏性休克（心烦、胸闷、呼吸困难、喘鸣、面部潮红、发红、水肿、发绀、血压下降等）的报道，故应密切观察，发现异常应立即停止用药，并给予适当处置。

2．其他副作用：精神神经系统，有时出现头痛、头重、焦躁感。消化系统，有时出现口渴、稀便、便秘、腹痛。循环系统，有时出现面色苍白、厥冷、心悸。肝脏，有时出现GTO、ALT、总胆红素值以及γ－GPT、AlP、LDH的上升。肾脏，有时出现BUN上升。皮肤，有时出现皮疹、全身瘙痒感。其他，有时出现发热、寒战、倦怠感、双下肢痉挛、颜面潮红、血管痛、呃逆。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸阿扎司琼氯化钠注射液	化学药	HZ003860
盐酸阿扎司琼片	化学药	HZ003861
盐酸阿扎司琼注射液	化学药	HZ003862

HY002122 盐酸艾司洛尔

【外文名称】Esmolol Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第41册

药物理化信息

【化学名】4－（3－异丙氨基－2－羟基丙氧基）苯丙酸甲酯盐酸盐

【分子式】$C_{16}H_{25}NO_4 \cdot HCl$

【分子量】331.84

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，味微苦。

本品在水中极易溶解，在乙醇或三氯甲烷中易溶，在乙酸乙酯中极微溶解。

熔点：本品的熔点应为85～92℃（测定时，每分钟上升的温度为0.5℃）。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：盐酸艾司洛尔注射液是一快速起效的作用时间短的选择性的β_1肾上腺素受体阻滞剂。其主要作用于心肌的β_1肾上腺素受体，大剂量时对气管和血管平滑肌的β_2肾上腺素受体也有阻滞作用。在治疗剂量无内在拟交感作用或膜稳定作用。它可降低正常人运动及静息时的心率，对抗异丙肾上腺素引起的心率增快。其降血压作用与β－肾上腺素受体阻滞程度呈相关性。静脉注射停止后10～20分钟β－肾上腺素受体阻滞作用即基本消失。

电生理研究提示盐酸艾司洛尔注射液具有典型的β－肾上腺素受体阻滞剂作用：降低心率，降低窦房结自律性，延长窦房结恢复时间，延长窦性心律及房性心律时的AH间期，延长前向的文式传导周期。

放射性核素心血池造影提示：在0.2mg/（kg·min）的剂量下，本品可降低静息态心率、收缩压、心率血压乘积、左右心室射血分数和心脏指数，其效果与静脉注射4mg普萘洛尔（心得安）相似。运动状态下，盐酸艾司洛尔注射液与心得安相似，均可减慢心率，降低心率血压乘积和心脏指数，但对收缩压的降低作用更明显。心血管造影提示：在0.3mg/（kg·min）的剂量下，本品除引起上述作用，还可引起左室舒张末压和肺动脉楔压的轻度升高，停药30分钟后血流动力学参数即完全恢复。

2．致癌、致突变和生殖毒性：由于盐酸艾司洛尔注射液的超短期使用方法，尚无其致癌、致突变和影响生殖的研究结果。

【药代动力学】本品在体内代谢迅速，主要受红细胞胞浆中的酯酶作用，使其酯键水解而代谢。其在人体的总清除率约20L/（kg·h），大于心输出量，所以本品的代谢不受代谢组织（如肝、肾）的血流量影响。本品的分布半衰期（$t_{1/2\alpha}$）约2分钟，消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）约9分钟。经适当的负荷量，继以0.05～0.3mg/（kg·min）的剂量静点滴，本品于5分钟内即可达到稳态血药浓度（如不用负荷量，则需30分钟达稳态血药浓度）。超过上述剂量，稳态血药水平呈线性增长，但清除与剂量无关。本品半衰期短，通过持续静脉点滴可维持稳态血药浓度，改变静脉点滴速度可很快改变血药浓度。

本品在体内代谢为酸性代谢产物和甲醇，其酸性代谢产物在动物体内的活性仅为原形药物的1/1500，所以在正常人体内无β－肾上腺素受体阻滞作用。在用药后24小时内，约73%～88%的药物以酸性代谢产物形式由尿排出，仅2%以原形由尿排出。酸性代谢产物消除半衰期约3.7小时，肾病患者则约为正常的10倍。本品约55%与血浆蛋白结合，其酸性代谢产物10%血浆蛋白结合。

【药物相互作用】

1．与交感神经节阻断剂合用，会有协同作用，应防止发生低血压、心动过缓、晕厥。

2．与华法林合用，本品的血药浓度似会升高，但临床意义不大。

3．与地高辛合用时，地高辛血药浓度可升高10%～20%。

4．与吗啡合用时，本品的稳态血药浓度会升高46%。

5．与琥珀胆碱合用可延长琥珀胆碱的神经肌肉阻滞作用5～8分钟。

6．本品会降低肾上腺素的药效。

7．本品与异搏定合用于心功能不良患者会导致心脏停搏。

【药物过量】一次用量达12～50mg/kg即可致命。药物过量时会出现心脏停搏、心动过缓、低血压、电机械分离、意识丧失。本品半衰期短，故首先应立即停药，观察临床效果。心动过缓可给予阿

托品静推；哮喘可予 β_2 受体激动剂或茶碱类治疗；心功能不全患者可予利尿剂及洋地黄类治疗；休克者可予多巴胺、多巴酚丁胺、异丙肾上腺素、氨力农等治疗。

【不良反应】大多数不良反应为轻度、一过性。最重要的不良反应是低血压。有报道使用艾司洛尔单纯控制心室率发生死亡。

1. 发生率 > 1% 的不良反应：注射时低血压（63%），停止用药后持续低血压（80%），无症状性低血压（25%），症状性低血压（出汗、眩晕）（12%），出汗伴低血压（10%），注射部位反应包括炎症和不耐受（8%），恶心（7%），眩晕（3%），嗜睡（3%）。

2. 发生率为 1% 的不良反应：外周缺血、神志不清、头痛、易激惹、乏力、呕吐。

3. 发生率 < 1% 的不良反应：偏瘫、无力、抑郁、思维异常、焦虑、食欲减退、轻度头痛、癫痫发作、气管痉挛、打鼾、呼吸困难、鼻充血、干啰音、湿啰音、消化不良、便秘、口干、腹部不适、味觉倒错，注射部位水肿、红斑、皮肤褪色、烧灼感，血栓性静脉炎和外渗性皮肤坏死，尿潴留，语言障碍，视觉异常，肩胛中部疼痛，寒战，发热。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸艾司洛尔注射液	化学药	HZ003863
注射用盐酸艾司洛尔	化学药	HZ005050

HY002123　盐酸安非拉酮

【外文名称】Amfepramone Hydrochloride

【分子式】$C_{13}H_{20}NO$

【分子量】206.31

药物药理信息

【药理毒理】本品为非苯丙胺类食欲抑制剂，其中枢兴奋作用比苯丙胺小。通过兴奋下丘脑腹内侧的饱食中枢，促进 5－羟色胺的释放；抑制下丘脑摄食中枢，阻止 5－羟色胺的再摄取，从而产生饱食感，达到控制食欲、降低食量的作用。本品的急性毒性试验，小白鼠静脉 LD_{50} 为 60.11mg/kg，灌胃给药 4.33～13mg/kg。

【药代动力学】口服容易吸收，$t_{1/2}$ 2 小时。主要代谢产物为马尿酸，从尿中排泄。

【药物相互作用】不可与单胺氧化酶抑制剂合用或接续使用。

【不良反应】常见不良反应有：激动、失眠、口干、恶心、便秘或腹泻等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸安非拉酮片	化学药	HZ003864

HY002124　盐酸安非他酮

【外文名称】Bupropion Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】安非他酮是去甲肾上腺素、5－羟色胺、多巴胺再摄取的弱抑制剂，对单胺氧化酶没有抑制作用。

本品抗抑郁作用机制尚不清楚，可能与其抑制去甲肾上腺素和（或）多巴胺的作用有关。

本品的戒烟机制尚不明确，可能与去甲肾上腺素能和（或）多巴胺能作用相关。

【药代动力学】安非他酮是一种消旋混合物。尚未研究单个对映体的药理活性和药代动力学。安非他酮的药代动力学曲线呈二室模型。终末相平均半衰期为 21 小时（20%），分布相平均半衰期为 3～4 小时。

【药物相互作用】

1. 细胞色素 P450IID6 代谢的药物：体外试验表明安非他酮和羟安非他酮是 CYPIID6 酶的抑制剂，因此正在使用 CYPIID6 酶代谢药物治疗的患者服用安非他酮时，应当考虑减少原来药物的剂量，特别是那些治疗指数窄的药物。这些药物包括某些抗抑郁药物（如，去甲替林、米帕明、地昔帕明、帕罗西汀、氟西汀、舍曲林），抗精神病药（如，氟哌啶醇、利培酮、甲硫达嗪），b－阻断剂（如，美托洛尔），抗心律失常药物（如，普罗帕酮、哌氟酰胺），同时在合并治疗开始时应当使用最小剂量。

2. MAO 抑制剂：动物研究显单胺氧化酶抑制剂（MAOI）苯乙肼可以增加安非他酮的急性毒性。

3. 左旋多巴：临床资料表明同时使用安非他酮和左旋多巴后，副作用发生率可能升高。服用左旋多巴的患者同时服用本品时应谨慎，从最小剂量开始使用，然后逐渐加量。

4. 降低癫痫发作阈值的药物：本品与降低癫痫发作阈值的药物（如，抗精神病药物、抗抑郁药物、茶碱、类固醇化合物等）合用或突然中断苯二氮䓬类药物治疗后使用本品时应减少剂量，剂量的增加应缓慢。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸安非他酮缓释片	化学药	HZ003865
盐酸安非他酮片	化学药	HZ003866

HY002125 盐酸安他唑啉

【外文名称】Antazoline Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】4,5－二氢－*N*－苯基－*N*－（苯甲基）－1H－咪唑－2－甲胺盐酸盐

【分子式】$C_{17}H_{19}N_3 \cdot HCl$

【分子量】301.80

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭或几乎无臭，味苦。

本品在乙醇中溶解，在水中略溶，在三氯甲烷中微溶，在乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 238～243℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗组胺药。

本品具有抗心律失常作用，其作用机制是干扰心肌细胞膜对钠、钾离子的渗透，减慢了心肌的传导；同时有轻度的交感神经阻滞作用，从而增加周围血管的阻力及降低心排血量，对血压和心率无影响，作用时间可维持 4～6 小时。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸安他唑啉片	化学药	HZ003868

HY002126 盐酸氨基葡萄糖

【外文名称】Glucosamine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 16 册

药物药理信息

【药理毒理】骨关节软骨磨损、退化所引起关节疼痛，部分原因是因为关节软骨蛋白多糖合成异常而引起。氨基葡萄糖是一种天然的氨基单糖，可以刺激软骨细胞产生有正常多聚体结构的蛋白多糖，抑制损伤软骨的酶如胶原酶和磷酯酶 A2，并可防止损伤细胞的超氧化自由基的产生，从而可延缓骨关节疼痛的病理过程和疾病的进程，改善关节活动，缓解疼痛。

通过刺激黏多糖的生化合成及增加骨骼钙质的摄取，提高骨与软骨组织的代谢功能与营养，亦能改善及增强滑膜液的黏稠度，增加滑膜液合成，提供关节润滑功能。本品可阻断骨关节炎的病理过程，防止疾病进展，改善关节活动功能，缓解关节疼痛，抑制及消退关节变性形成。

【药物相互作用】

1．本品可增加四环素类药物在胃肠道的吸收，减少口服青霉素或氯霉素的吸收。

2．同时服用非甾体抗炎药的患者可能需降低本品的服用剂量，或降低非甾体抗炎药的服用剂量。

3．本品与利尿药可能存在相互作用，两药同时服用时可能需增加利尿药的服用剂量。

【不良反应】此药耐受性良好，偶尔会发生轻微的胃肠不适，如恶心、胃灼热、腹泻，以及头晕、过敏等症状。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氨糖美辛肠溶片	化学药	HZ000249
盐酸氨基葡萄糖胶囊	化学药	HZ003869
盐酸氨基葡萄糖片	化学药	HZ003870

HY002127 盐酸氨溴索

【其他名称】Lanbroxol、兰索力素、美斯可、美舒咳、沐舒痰、Mucosolva Transbrocho、Musco、痰之保克、溴环己铵醇

【外文名称】Ambroxol Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】反式－4－［（2－氨基－3,5－二溴苄基）氨基］环己醇盐酸盐。

【分子式】$C_{13}H_{18}Br_2N_2O \cdot HCl$

【分子量】414.57

【性状及组成】本品为白色至微黄色结晶性粉末，几乎无臭。

本品在甲醇中溶解，在水中略溶，在乙醇中微溶。

吸收系数：精密称取本品适量，加 0.01mol/L 盐酸溶液溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 25μg 的溶液，照紫外－可见分光光度法在 244nm 的波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为 233～247。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：祛痰药。

本品具有促进黏液排除的作用及溶解分泌物的特性。可促进呼吸道内黏稠分泌物的排出及减少黏液的滞留，因而显著促进排痰，改善呼吸状况。应用氨溴索治疗时，病人黏液的分泌可恢复至正常状态。咳嗽及痰量通常显著减少，呼吸道黏膜上的表面活性物质因而能发挥其正常的保护功能。

急性毒性试验中 LD_{50}：小鼠，口服 300mg/kg；静注 140 mg/kg。氨溴索的毒性指数非常低。氨溴索无致突变性（Ames 和微核试验）。对于小鼠及大鼠的致癌性研究显示，氨溴索无致癌性。

【药代动力学】氨溴索从血液至组织的分布快而显著，肺为主要靶器官。

文献资料表明：盐酸氨溴索经口服后迅速被吸收，约 1 小时血药浓度达峰值，并从血液向组织迅速分布，以肺、肝、肾分布较多，主要经过肝代谢，血清半衰期（$t_{1/2}$）约 7 小时，主要从尿中排泄，血浆蛋白结合率 90%。

口服缓释胶囊 75mg 后，约 4 小时血药浓度达峰值，（C_{max}）为 163.1（16.6ng/ml）。

【药物相互作用】本品可增加阿莫西林及阿莫西林/克拉维酸等药物在肺部的分布浓度。故本品同上述任何一个药物联合用于治疗肺部感染时，均可提高其抗菌疗效。

【药物过量】迄今无有关过量症状的报道，如发生，则应对症处理。

【不良反应】可有上腹部不适、纳差、腹泻、偶见皮疹。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氨溴特罗口服液	化学药	HZ000250
盐酸氨溴索分散片	化学药	HZ003871
盐酸氨溴索缓释胶囊	化学药	HZ003872
盐酸氨溴索胶囊	化学药	HZ003873
盐酸氨溴索口服液	化学药	HZ003874
盐酸氨溴索口腔崩解片	化学药	HZ003875
盐酸氨溴索氯化钠注射液	化学药	HZ003876
盐酸氨溴索泡腾片	化学药	HZ003877
盐酸氨溴索片	化学药	HZ003878
盐酸氨溴索葡萄糖注射液	化学药	HZ003879
盐酸氨溴索糖浆	化学药	HZ003880
盐酸氨溴索注射液	化学药	HZ003881
注射用盐酸氨溴索	化学药	HZ00505i

HY002128　盐酸胺碘酮

【外文名称】Amiodarone Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（2－丁基－3－苯并呋喃基）［4－［2－（二乙氨基）乙氧基］－3,5－二碘苯基］甲酮盐酸盐

【分子式】$C_{25}H_{29}I_2NO_3 \cdot HCl$

【分子量】681.78

【性状及组成】本品为白色至微带黄白色结晶性粉末，无臭，无味。本品在三氯甲烷中易溶，在乙醇中溶解，在丙酮中微溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 158～162℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗心律失常药。

本品属Ⅲ类抗心律失常药。主要电生理效应是延长各部心肌组织的动作电位及有效不应期，有利于消除折返激动。同时具有轻度非竞争性的 α 及 β 肾上腺素受体阻滞和轻度Ⅰ及Ⅳ类抗心律失常药性质。减低窦房结自律性。对静息膜电位及动作电位高度无影响。对房室旁路前向传导的抑制大于逆向。由于复极过度延长，口服后心电图有 Q－T 间期延长及 T 波改变，可以减慢心率 15%～20%，使 PR 和 Q－T 间期延长 10%左右。对冠状动脉及周围血管有直接扩张作用。可影响甲状腺素代谢。本品特点为半衰期长，故服药次数少，治疗指数大，抗心律失常谱广。

【药代动力学】口服吸收迟缓且不规则。生物利用度约为 50%，表观分布容积大约 60L/kg，主要分布于脂肪组织及含脂肪丰富的器官。其次为心、肾、肺、肝及淋巴结。最低的是脑、甲状腺及肌肉。在血浆中 62.1%与白蛋白结合，33.5%可能与 β 脂蛋白结合。主要在肝内代谢消除，代谢产物为去乙基胺碘酮。单次口服 800mg 时半衰期为 4.6 小时（组织中摄取），长期服药半衰期（$t_{1/2}$）为 13～30 天。终末血浆清除半衰期可达 40～55 天。停药后半年仍可测出血药浓度。口服后 3～7 小时血药浓度达峰值。约 1 个月可达稳态血药浓度，稳态血药浓度为 0.92～3.75μg/ml。4～5 天作用开始，5～7 天达最大作用，有时可在 1～3 周才出现。停药后作用可持续 8～10 天，偶可持续 45 天。原药在尿中未能测到，尿中排碘量占总含碘量的 5%，其余的碘经肝肠循环从粪便中排出。血液透析不能清除本品。

静注后5分钟起效，停药可持续20分钟～4小时。有效血药浓度为1～2.5μg/ml，中毒血药浓度1.8～3.7μg/ml以上。

【药物相互作用】

1. 增加华法林的抗凝作用，该作用可自加用本品后4～6天，持续至停药后数周或数月。合用时应密切监测凝血酶原时间，调整抗凝药的剂量。

2. 增强其他抗心律失常药对心脏的作用。本品可增高血浆中奎尼丁、普鲁卡因胺、氟卡尼及苯妥英的浓度。与Ia类药合用可加重Q－T间期延长，极少数可致扭转型室速，故应特别小心。从加用本品起，原抗心律失常药应减少30%～50%剂量，并逐渐停药，如必须合用则通常推荐剂量减少一半。

3. 与β受体阻滞剂或钙通道阻滞剂合用可加重窦性心动过缓、窦性停搏及房室传导阻滞。如果发生则本品或前两类药应减量。

4. 增加血清地高辛浓度，亦可能增高其他洋地黄制剂的浓度达中毒水平，当开始用本品时洋地黄类药应停药或减少50%，如合用应仔细监测其血清中药浓度。本品有加强洋地黄类药对窦房结及房室结的抑制作用。

5. 与排钾利尿药合用，可增加低血钾所致的心律失常。

6. 增加日光敏感性药物作用。

7. 可抑制甲状腺摄取［^{123}I］、［^{131}I］及［^{99m}Tc］。

【药物过量】有报道服用3～8g胺碘酮致过量中毒的，但没有死亡和后遗症报道。动物实验证实胺碘酮的LD_{50}较高（＞3000mg/kg）。发生药物过量中毒时，需立即监测心电图和血压，严重心动过缓者可用β－受体激动剂或临时起搏器。低血压状态引起机体灌注不良者应用正性肌力药和/或升压药。

【不良反应】

1. 心血管：较其他抗心律失常药对心血管的不良反应要少。

（1）窦性心动过缓、窦性停搏或窦房阻滞，阿托品不能对抗此反应；

（2）房室传导阻滞；

（3）偶有Q－T间期延长伴扭转性室性心动过速，主要见于低血钾和并用其他延长Q－T的药物时；

（4）以上不良反应主要见于长期大剂量和伴有低血钾时，以上情况均应停药，可用升压药、异丙肾上腺素、碳酸氢钠（或乳酸钠）或起搏器治疗；注意纠正电解质紊乱；扭转性室性心动过速发展成室颤时可用直流电转复。由于本品半衰期长，故治疗不良反应需持续5～10天。

2. 甲状腺

（1）甲状腺功能亢进，可发生在用药期间或停药后，除突眼征以外可出现典型的甲亢征象，也可出现新的心律失常，化验T3、T4均增高，TSH下降。发病率约2%，停药数周至数月可完全消失，少数需用抗甲状腺药、普萘洛尔或肾上腺皮质激素治疗；

（2）甲状腺功能低下，发生率1%～4%，老年人较多见，可出现典型的甲状腺功能低下征象，化验TSH增高，停药后数月可消退，但黏液性水肿可遗留不消，必要时可用甲状腺素治疗。

3. 胃肠道：便秘，少数人有恶心、呕吐、食欲下降，负荷量时明显。

4. 眼部：服药3个月以上者在角膜中基底层下1/3有黄棕色色素沉着，与疗程及剂量有关，儿童发生较少。这种沉着物偶可影响视力，但无永久性损害。少数人可有光晕，极少因眼部副作用停药。

5. 神经系统：不多见，与剂量及疗程有关，可出现震颤、共济失调、近端肌无力、锥体外体征，服药1年以上者可有周围神经病，经减药或停药后渐消退。

6. 皮肤：光敏感与疗程及剂量有关，皮肤石板蓝样色素沉着，停药后经较长时间（1～2年）才渐退。其他过敏性皮疹，停药后消退较快。

7. 肝脏：肝炎或脂肪浸润，氨基转移酶增高，与疗程及剂量有关。

8. 肺脏：肺部不良反应多发生在长期大量服药者（一日0.8～1.2g）。主要产生过敏性肺炎，肺间质或肺泡纤维性肺炎，肺泡及间质有泡沫样巨噬细胞及2型肺细胞增生，并有纤维化，小支气管腔闭塞。临床表现有气短、干咳及胸痛等，限制性肺功能改变，血沉增快及血液白细胞增高，严重者可致死。需停药并用肾上腺皮质激素治疗。

9. 其他：偶可发生低血钙及血清肌酐升高。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸胺碘酮胶囊	化学药	HZ003882
盐酸胺碘酮片	化学药	HZ003883
盐酸胺碘酮注射液	化学药	HZ003884
注射用盐酸胺碘酮	化学药	HZ005052

HY002129 盐酸昂丹司琼

【其他名称】奥丹西龙、恩丹西酮、枢复宁、盐

酸恩丹西酮

【外文名称】 Ondansetron Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 2,3－二氢－9－甲基－3－［(2－甲基咪唑－1－基）甲基］－4（1*H*）－咔唑酮盐酸盐二水合物

【分子式】 $C_{18}H_{19}N_3O \cdot HCl \cdot 2H_2O$

【分子量】 365.86

【性状及组成】 本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，味苦。

本品在甲醇中易溶，在水中略溶，在丙酮中微溶，在 0.1mol/L 盐酸溶液中略溶。

熔点：取本品，以五氧化二磷为干燥剂干燥 30 分钟后，依法测定，熔点为 175～180℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】 本品是一强效、高选择性的 5－HT_3 受体拮抗剂，有强止吐作用。化疗药物和放射治疗可造成小肠释放 5－HT，经由 5－HT_3 受体激活迷走神经的传入支，触发呕吐反射。本品能阻断这一反射的触发。迷走神经传入支的激动也可引起位于第四脑室底部 Postrema 区的 5－HT 释放，从而经过中枢机制而加强。本品对化疗、放疗引起的恶心、呕吐系通过拮抗位于周围和中枢神经局部的神经原的 5－HT 受体而发挥止吐作用。手术后恶心、呕吐的作用机制未明，但可能具类似细胞毒类致恶心、呕吐的共同途径而诱发。本品尚能抑制因阿片诱导的恶心，其作用机制尚不清楚。由于本品的高选择性作用，因而不具有其他止吐药的副作用，如锥体外系反应、过度镇静等。

【药代动力学】 口服本品约 2 小时左右达血浆峰浓度，其生物利用度大约为 60%（老年人则更高）。口服或静脉给药时，本品的体内情况大致相同，其消除半衰期约 3 小时。老年人可能延长至 5 小时。药物彻底代谢，代谢物经肾脏（75%）与肝脏（25%）排泄。血浆蛋白结合率为 75%。

口服或静脉给药时，本品的体内情况大致相同。

【药物相互作用】

1．没有证据表明本品会诱导或抑制其他同时服用药物的代谢。有专门研究表明，本品与酒精、替马西泮、呋塞米、曲马多及丙泊酚无相互作用。

2．对司巴丁及异喹胍代谢差的患者，对本品消除的半衰期无影响。对这类患者重复给药后，药物的暴露水平与正常人体无差异，故用药剂量和用药次数不需改变。

3．与地塞米松合用可加强止吐效果。

4．它与下列静脉注射液相容：0.9% *W/V* 氯化钠静脉输注液《英国药典》；5% *W/V* 葡萄糖静脉输注液《英国药典》；10% *W/V* 甘露糖静脉输注液《英国药典》；林格氏静脉输注液；0.3% *W/V* 氯化钾与 0.9% *W/V* 葡萄糖静脉输注液《美国药典》；03% *W/V* 氯化钾与 5% *W/V* 葡萄糖输注液《英国药典》。

本品只能与推荐的静脉输注液混合使用，作静脉输入的溶液应现用现配。不过，在室温（25℃以下）荧光照射下或在冰箱中，本品与上述静脉输注液混合后仍能保持稳定 7 天。

5．可用输液袋或注射泵静脉输注本品，每小时 1mg。如果本品浓度为 16～160μg/ml（即分别为 8mg/500ml 和 8mg/50ml）时，下列药物可通过枢复宁给药装置的 Y 形管来给药：顺铂，5－Fu，卡铂，依托泊苷，环磷酸胺，多柔比星及头孢噻甲羧肟等。

6．对司巴丁及异喹胍代谢差的患者，对本品消除的半衰期无影响。对这类患者重复给药后，药物的暴露水平与正常人体无差异，故用药剂量和用药次数不需改变。

【药物过量】 虽有少数病人发生用药过量，但对于这方面的资料所知较少。曾有两位病人分别接受了静脉输入本品 84mg 和 145mg，得知用药过量后会出现下列现象：视觉障碍、严重便秘、低血压及迷走神经节短暂二级 AV 阻滞。这些现象可得到完全纠正。视觉障碍、严重便秘、低血压及迷走神经节短暂二级 AV 阻滞。这些现象可得到完全纠正。对本品无特异的解毒药，当怀疑用药过量时，应适当地采取对症疗法和支持疗法。不推荐用吐根治疗本品用药过量，因为患者会因本品自身具有的止吐作用，而不反应。

【不良反应】 可有头痛、腹部不适、便秘、口干、皮疹、偶见支气管哮喘或过敏反应、短暂性无症状转氨酶增加。上述反应轻微，无须特殊处理。个别患者有癫痫发作。并有胸痛、心律不齐、低血压及心动过缓的罕见报道。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸昂丹司琼胶囊	化学药	HZ003885
盐酸昂丹司琼氯化钠注射液	化学药	HZ003886
盐酸昂丹司琼片	化学药	HZ003887
盐酸昂丹司琼葡萄糖注射液	化学药	HZ003888
盐酸昂丹司琼注射液	化学药	HZ003889
注射用盐酸昂丹司琼	化学药	HZ005053

HY002130 盐酸奥布卡因

【其他名称】Benoxinate Hydrochloride、Novesin、盐酸丁氧普鲁卡因

【外文名称】Oxybuprocaine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第5册

【分子式】$C_{17}H_{28}N_2O_3 \cdot HCl$

药物药理信息

【药理毒理】本品为酯类局麻药，对黏膜刺激性小于丁卡因。

奥布卡因为眼科最好的表浅麻醉剂，滴眼后，60秒内产生足够深度的麻醉，维持约半小时。适用于眼前部的各种检查和小手术。不影响瞳孔，眼压无改变。

1%水溶液可用于鼻部及喉部表面麻醉。

【不良反应】有一过性刺激、疼痛、烧灼感、结膜发红等一过性过敏反应。严重者可出现弥漫性上皮角膜炎、虹膜炎。过敏体质应慎用。偶有发生角膜表层水肿者。有3例由于滥用本药而致失明。

本药在用于眼压计测量眼压时，可致有小的点状上皮细胞染色。

本药喷雾可引起咳嗽、腹部不适及腹痛。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸奥布卡因滴眼液	化学药	HZ003890
盐酸奥布卡因凝胶	化学药	HZ003891

HY002131 盐酸奥洛他定

【外文名称】Olopatadine Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】11-［（Z）-3-（二钾胺）丙烷］-6-11-二氢二苯［b，e］庚英-2-乙酸盐。

【分子式】$C_{21}H_{21}O_3N \cdot HCl$

【分子量】373.88

【性状及组成】本品为白色粉末。

药物药理信息

【药理毒理】奥洛他定是肥大细胞稳定剂及相对选择性组胺 H_1-受体拮抗剂。活体和体外实验中均能抑制Ⅰ型速发型过敏反应。奥洛他定对 α-肾上腺素能受体，多巴胺受体，毒蕈碱Ⅰ型和Ⅱ型受体及5-羟色胺受体没有作用。

药理实验表明，盐酸奥洛他定能够有效阻断组胺 H_1 受体，抑制血管扩张和局部水肿。

在过敏反应中，盐酸奥洛他定能够稳定细胞膜，非选择性地抑制肥大细胞释放炎性细胞因子和化学介质，减少组胺、白三烯、血烷素、血小板激活因子、前列腺素以及血管活性肽的释放量。同时通过减少花生四烯酸的释放，干扰磷脂酶A2活性，减轻变态反应引起的血管通透性增加，炎性渗出，水肿等症状。

本药具有药效作用起效快，作用时间久，特异性强，副作用小的临床特点。

毒理研究：以500mg/（kg·d）和200mg/（kg·d）的剂量分别给小鼠和大鼠口服奥洛他定，未引起癌变。按每滴40μl算，这些剂量比最大的人眼推荐用量大78125和31250倍。

在体外进行的细菌逆转突变试验，体外哺乳动物染色体畸变测试或小鼠微核试验等未观察到诱发突变的可能性。

给雄和雌的大鼠口服最大人眼推荐用量的62500倍剂量的奥洛他定后，生育指数稍有下降且受孕率下降；口服最大人眼推荐用量的7800倍时未发现影响生育功能。

【药代动力学】在人类局部滴眼后，只有极少量奥洛他定进入全身循环。在2次有关健康志愿者（共24人）的研究中，双眼滴用0.15%的奥洛他定滴眼液，每12小时1次，共用2周，血浆浓度普遍低于可检测值（<0.5ng/ml）。仅在用药后2小时内有些血浆样本中可检测到奥洛他定，浓度为0.5~1.3ng/ml。血浆半衰期约为3小时，主要由肾脏排出约60%~70%的原药。在尿中发现2种代谢产物单—去甲和 N-氧化物，浓度很低。

【不良反应】回顾观察进行短期临床研究的患者，发现奥洛他定具有较好的临床耐受性。主要不良反应为嗜睡、倦怠、口渴、腹痛等。个别患者临床检查值肝脏谷丙转氨酶，谷草转氨酶，乳酸脱氢酶，谷氨酰转移酶上升。当出现上述症状时，应减量或者停药处理。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸奥洛他定滴眼液	化学药	HZ003892

HY002132 盐酸奥索马嗪

【其他名称】二氧异丁嗪

【外文名称】Oxomemazine Hydrochloride

【性状及组成】本品为结晶形，易溶于水。

本品11.1mg相当于奥索马嗪10mg。

药物药理信息

【药理毒理】本品为吩噻嗪衍生物，能抑制咳嗽中枢，是非成瘾性中枢镇咳药，同时兼有局麻、抗组胺、抗炎和一定的平喘作用。其镇咳效果比可待因强，作用维持时间2~8h。适用于急慢性支气管炎引起的咳嗽和轻症哮喘。

【不良反应】主要为中枢抑制，可引起嗜睡、轻度头晕等。偶见咽干。

HY002133　盐酸奥昔布宁

【外文名称】Oxybutynin Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第30册

药物理化信息

【化学名】α－环己基－α－羟基－苯乙酸－4－二乙氨基－2－丁炔酯盐酸盐

【分子式】$C_{22}H_{31}NO_3 \cdot HCl$

【分子量】393.95

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末，无臭。

本品在甲醇或三氯甲烷中易溶，在水中溶解，在正乙烷中几乎不溶，在冰醋酸中溶解。

熔点：本品的熔点为124~129℃。

药物药理信息

【药理毒理】盐酸奥昔布宁对平滑肌具有直接解痉作用，并能抑制乙酰胆碱对平滑肌的毒蕈碱作用。可选择性作用于膀胱逼尿肌，降低膀胱内压，增加膀胱容量，减少不自主性的膀胱收缩而缓解尿急、尿频和尿失禁。本品对家兔逼尿肌的抗胆碱能活性仅为阿托品的1/5，但解痉作用是阿托品的4~10倍。对骨骼肌神经节和自主神经节无阻断作用。遗传毒性：人体酵母菌、酿酒酵母菌和鼠伤寒沙门氏菌试验体系致突变试验结果均为阴性。

生殖毒性：小鼠、大鼠、仓鼠和家兔的生殖毒性试验均未见本品对动物的生育力或胚胎有损伤作用。但本品对孕妇或可能怀孕妇女的安全性尚不确定，因此，孕妇不应使用本品，除非医师认为使用本品的潜在临床益处超过其潜在危险性。尚不清楚奥昔布宁是否从人乳中排泄。由于许多药物能从人乳中排泄，哺乳妇女应慎用本品。致癌性：在大鼠连续给药2年的长期致癌性试验中，给药剂量分别为20、80和160mg/（kg·d）（按体表面积折算，分别相当于临床推荐最大剂量的6、25和50倍），结果未表现出致癌性。

【药代动力学】

1．据国外文献资料

①吸收　奥昔布宁缓释片首剂口服后，4~6小时内血药浓度持续上升，维持稳定的血药浓度将近24小时。与奥昔布宁普通制剂相比，奥昔布宁缓释片中*R*－奥昔布宁和*S*－奥昔布宁的相对生物利用度分别为156%和187%。*R*－奥昔布宁和*S*－奥昔布宁的血药浓度－时间曲线形状大致相同。奥昔布宁缓释片多剂量服用后，3天后血浆达稳态浓度，未观察到有药物蓄积以及奥昔布宁和去乙基奥昔布宁的药动学参数变化。食物不影响奥昔布宁缓释片的吸收和代谢。②分布　奥昔布宁静脉给药或口服，血浆浓度呈二相的方式下降，静脉注射5mg盐酸奥昔布宁，其分布容积为193L。单剂口服奥昔布宁缓释片10mg后，t_{max}在*R*－奥昔布宁为12.7小时，在*S*－奥昔布宁为11.8小时，其消除半衰期分别为13.2小时和12.4小时。③代谢　奥昔布宁主要经细胞色素P450酶系统代谢（尤其是肝脏和肠壁的CYP3A4），其主要代谢物为无活性的苯基环己基羟基乙酸和有活性的去乙基奥昔布宁。服用奥昔布宁缓释片后，*R*－奥昔布宁和*S*－奥昔布宁的血药浓度分别为奥昔布宁的72%和93%。④排泄　奥昔布宁绝大多数在肝脏代谢，仅有不到0.1%的药物以原形药物从尿排泄，不到0.1%的药物以代谢物去乙基奥昔布宁形式从尿中排泄。在5~20mg的剂量范围内，奥昔布宁及其代谢产物去乙基奥昔布宁的药动学参数呈剂量相关性。

2．特殊人群的药代动力学

①老年人：78岁以下人群奥昔布宁缓释片的药代动力学特征相同。②儿童：18岁以下儿童的药代动力学未进行评价。③性别：奥昔布宁缓释片的药代动力学特征在男、女健康受试者间无显著差别。④种族：奥昔布宁缓释片的药代动力学特征在不同种族的健康受试者间无显著差别。⑤肾功能不全：没有肾功能不全的用药经验。⑥肝功能不全：没有肝功能不全的用药经验。

【药物相互作用】

1．奥昔布宁与其他解痉药物、其他产生口干、便秘、嗜睡药物或其他抗胆碱能样药物合用会增加上述症状的频度和严重程度；

2．抗胆碱药由于其对胃肠道能动性的作用而影响与之同时服用药物的吸收；

3．奥昔布宁与P450细胞色素酶抑制剂如抗真菌药物（如酮康唑、伊曲康唑和咪康唑）、大环类抗生素（如红霉素、克拉霉素）等相互作用的资料还没建立。

【药物过量】本品过量治疗期间，应考虑奥昔布宁的持续释放特征。病人至少应监测24小时，并采用对症及支持治疗，可能需服用活性炭和泻药。

【不良反应】少数患者可出现口干、少汗、视力模糊、心悸、嗜睡、头晕、恶心、呕吐、便秘、阳痿、抑制泌乳等抗胆碱能药物所产生的类似症状，个别患者可见过敏反应或药物特异反应，如荨麻疹和其他皮肤症状。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸奥昔布宁缓释片	化学药	HZ003893
盐酸奥昔布宁胶囊	化学药	HZ003894
盐酸奥昔布宁片	化学药	HZ003895

HY002134 盐酸奥昔非君

【其他名称】安心酮、盐酸奥西麻黄碱、盐酸麻黄苯丙酮

【外文名称】Oxyfedrine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第10册

药物理化信息

【化学名】L-3-甲氧基-ω（1-羟基-1-苯基异丙胺基）苯丙酮盐酸盐

【分子式】$C_{19}H_{23}NO_3 \cdot HCl$

药物药理信息

【药理毒理】本品为去甲麻黄碱衍生物，有选择性激动β受体及直接扩张冠状动脉血管作用，能降低冠脉阻力，增加冠脉流量，减少心室容积，降低心室壁张力，改善心肌氧平衡以及增强心肌收缩力，加快心率等作用。对血压影响不大。

【药代动力学】由胃肠道吸收。口服给药4～8分钟心绞痛即可缓解，维持作用时间4～6小时，经8小时有50%在肝内还原为去甲麻黄碱从尿中排出。

【不良反应】少数患者服用期间可能出现暂时的味觉障碍。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸奥昔非君片	化学药	HZ003896

HY002135 盐酸八角枫碱

【其他名称】消旋苷藜碱

【外文名称】Anabasine Hydrochloride

【性状及组成】本品为白色或微黄色针状结晶，无臭，味咸苦，有引湿性。易溶于水、乙醇、三氯甲烷，微溶于丙酮。

熔点：本品的熔点为187～191℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品系双相型肌肉松弛剂，作用与肌安松相似，并有一定的镇痛作用。后期作用可为新斯的明拮抗。静脉滴注后，起效温和，维持时间与肌安松相似。临床主要用作较长时间手术全麻时产生肌肉松弛，亦用于中药麻醉及针麻，目前临床罕用。

【不良反应】本品呼吸抑制作用较强，时间较长、剂量过大，给药过快可致血压骤升和心律失常。

HY002136 盐酸巴氨西林

【其他名称】巴坎西林、盐酸巴坎西林

【外文名称】Bacampicillin Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】1-乙氧甲酰乙氧6-〔D（-）-2-氨基-2-苯乙酰氨基〕青霉烷酸盐酸盐

【分子式】$C_{21}H_{27}N_3O_7S \cdot HCl$

【分子量】501.98

药物药理信息

【药理毒理】巴氨西林系氨苄西林甲戊酯，在体外无抗菌活性，在体内吸收过程中被肠壁的非特异性酯酶水解为氨苄西林而发挥其抗菌作用。氨苄西林为广谱半合成青霉素。本品对多种革兰阳性菌和革兰阴性菌有效。对溶血性链球菌、肺炎链球菌和不产青霉素酶葡萄球菌具较强抗菌活性，但稍逊于青霉素。氨苄西林对草绿色链球菌亦有良好抗菌作用，对肠球菌属和李斯德菌属的作用优于青霉素。本品对白喉棒状杆菌、炭疽芽孢杆菌、放线菌属、流感嗜血杆菌、百日咳鲍特杆菌、奈瑟菌属以及除脆弱拟杆菌外的厌氧菌均具抗菌活性，部分奇异变形杆菌、大肠埃希菌、沙门菌属和志贺菌属细菌对本品敏感。

氨苄西林通过抑制细菌细胞壁合成发挥杀菌作用。

【药代动力学】本品口服吸收迅速且完全。吸收后前期药物迅速水解，释放出氨苄西林。口服本品0.4g后血药浓度的达峰时间（t_{max}）约0.5～1小时。血药峰浓度（C_{max}）为7mg/L，与口服1g氨苄西林相似。

氨苄西林对胃酸稳定，吸收后分布良好，胆汁及尿中药物浓度较高，在有炎症的脑脊液、胸腹水、关节腔积液和支气管分泌液中均可达到有效治疗浓度。血浆蛋白结合率为20%。

本品血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）约为1小时。口服3小时后，约70%～75%以氨苄西林原形经肾排泄。

【药物相互作用】

1. 丙磺舒、阿司匹林、吲哚美辛、保泰松、磺胺药可减少本品在肾小管的排泄，因而使本品的血药浓度升高，血消除半衰期延长，毒性也可能增加。

2. 本品与别嘌醇合用时，皮疹发生率显著增高，故应避免合用。

3. 本品不宜与双硫仑等乙醛脱氢酶抑制药合用。

4. 本品与氯霉素合用于细菌性脑膜炎时，远期后遗症的发生率较两者单用时高。

5. 本品可刺激雌激素代谢或减少其肠肝循环，因此可降低口服避孕药的效果。

6. 氯霉素、红霉素、四环素类、磺胺药等抑菌药可干扰本品的杀菌活性，因此不宜与本品合用，尤其在治疗脑膜炎或急需杀菌药的严重感染时。

7. 本品可加强华法林的作用。

【不良反应】

1. 过敏反应：斑丘疹、荨麻疹、皮肤瘙痒、偶可发生剥脱性皮炎及严重过敏反应（过敏性休克）等。

2. 消化道反应：腹泻、稀便、恶心、腹痛、痉挛、上腹痛及呕吐等。

3. 贫血、血小板减少、嗜酸粒细胞增多等血液系统异常。

4. 肝功能异常：如血清氨基转移酶和血清胆红素增高。

5. 偶见间质性肾炎。

6. 二重感染：长期或大量应用本品可致耐青霉素酶金黄色葡萄球菌、革兰阴性杆菌或白色念珠菌感染。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸巴氨西林片	化学药	HZ003897

HY002137　盐酸巴尼地平

【其他名称】Hypoca、Mepirodipine

【外文名称】Barnidipine Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】本品为二氢吡啶类钙拮抗药。可舒张血管，增加冠脉流量，使血压下降，作用强而持久，可持续24小时。主要用于高血压。

【药代动力学】口服后吸收良好，1～6小时后达血药浓度峰值。$t_{1/2}$约10小时。

5例健康志愿者，经口给药0.5～30mg，观察到在给药1.5小时后，血浆峰浓度为3.0～4.4ng/ml，并伴有最大的药效作用，持续到6小时。

另在4例健康志愿者，经口服用碳－14标记的本品15mg，放射活性和药物原形的血浆峰值分别为330ng/ml和3ng/ml，平均半衰期分别为24小时和2小时。

在另一项25例健康志愿者的观察中，经口单次服5、10或20mg后，血浆达峰时间为1.0～1.6小时，口服20mg的消除半衰期为7.5小时。在反复给予持续释放的制剂后，观察到吸收同样迅速且无蓄积。

【药物过量】本品与其他抗高血压药物并用可使药效增强。已有报道，其他钙拮抗剂如硝苯吡啶（nifedipine）可使地高辛的血浆浓度升高。还有报道，这类药物与西咪替丁伍用可导致药效增强。

【不良反应】转氨酶、尿酸、尿素氮和肌酸酐可能升高，发生这类情况应停止用药。若出现过敏反应（红斑、皮疹或黄疸）应停药。其他可能发生的不良反应，包括恶心、呕吐、便秘、发热、颜面潮红、心悸、水肿、无力、不适、头痛、胸部压迫感、眩晕、耳鸣和血清肌酸磷酸激酶（CRK）升高。

HY002138　盐酸班布特罗

【外文名称】Bambuterol Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】1－［双－（3′,5′－*N*,*N*－二甲氨甲酰氧基）苯基］－2－*N*－叔丁基氨基乙醇盐酸盐

【分子式】$C_{18}H_{29}N_3O_5 \cdot HCl$

【分子量】403.91

药物药理信息

【药理毒理】本品是肾上腺素β_2－受体激动剂特布他林的前药．口服吸收后在酶的作用下，代谢为特布他林。特布他林主要是激活β_2受体，从而对支气管平滑肌产生松弛作用，抑制内源性致痉物的释放和由内源介质引起的水肿，增加黏膜纤毛的清除能力。致突变试验表明：班布特罗Ames试验对鼠伤寒沙门菌TA97、TA98、TA100和TA102无致突变现；啮齿类动物微核试验，ICR小鼠口服给药，结果为阴性；哺乳动物培养细胞染色体畸变试验，不论S9存在与否，其结果均为阴性。生殖毒性实验文献资料表明：未见有对生育影响的报道。

【药代动力学】文献报道，口服盐酸班布特罗片后，大约口服剂量的20%被吸收。吸收后被缓慢代谢成有活性的特布他林。盐酸班布特罗和中间代谢物对肺组织显示有亲和力，在肺组织内也进行盐酸班布特罗→特布他林的代谢。因此在肺中活性药物

可以达到较高浓度。口服本药后，约 7 小时可以达到活性代谢物特布他林的最大血浆浓度，半衰期为 17 小时左右。盐酸班布特罗及它的代谢物，主要由肾脏排出。

【药物相互作用】

1. 与其他拟交感胺类药合用作用加强，毒性增加。

2. 不宜与肾上腺素能受体阻滞剂（如心得安）合用。

3. 可能延长琥珀碱的肌肉松弛效果，这是由于盐酸班布特罗可部分抑制胆碱酯酶产生，此抑制作用依赖于剂量并可以完全恢复。

【药物过量】目前尚未有服用过量的病例报道，从理论上讲，过量有可能导致血中特布他林的浓度升高，可产生头痛、焦虑、强直性肌肉痉挛、心悸、心律不齐等症状，甚至发生血压下降的现象。实验室报道：有时可发生高血糖及乳酸中毒，高剂量的 β_2 - 激动剂可能会导致体内钾重新分布而引发低血钾，这种情况一般不需特殊处理。过量的治疗：轻微或中度过量，需减量或停药。严重病例，需洗胃，服用活性炭，测定酸碱平衡、血糖及电解质，监测心率及血压，推荐选用对心脏有选择性的 β_2 - 受体阻滞剂（如美托洛尔）治疗心律不齐。要注意使用 β_2 - 受体阻滞剂须非常谨慎，因其可能诱发支气管痉挛，如果因 β_2 受体介导的外周血管阻力下降而导致血压下降，可给予血容量扩增剂。

【不良反应】有震颤、头痛、强直性肌肉痉挛和心悸等，但本药较其他同类药物不良反应为轻。其强度与剂量正相关，在治疗最初 1～2 周内大多数不良反应自行消失。极少数人可能会出现转氨酶轻度升高及口干、头晕、胃部不适等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸班布特罗胶囊	化学药	HZ003898
盐酸班布特罗口服液	化学药	HZ003899
盐酸班布特罗片	化学药	HZ003900

HY002139 盐酸半胱氨酸

【其他名称】L - 半胱氨酸盐酸盐、L - Cysteine Hydrochloride

【外文名称】Cysteine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】L - 2 - 氨基 - 3 - 巯基丙酸盐酸盐一水合物

【分子式】$C_3H_7NO_2S \cdot HCl \cdot H_2O$

【分子量】175.64

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末，有臭，味酸。本品在水中易溶，在乙醇中略溶，在丙酮中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加 1mol/L 盐酸溶液溶解并稀释成每 1ml 中约含 80mg 的溶液，依法测定，比旋度为 + 5.5°至 7.0°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：氨基酸类药。

本品为一种含巯基的氨基酸，参与细胞的还原过程和肝脏内的磷脂代谢，它有保护肝细胞不受损害、促使肝脏功能旺盛的作用。还可与有毒的芳香族化合物缩合成硫醚氨酸而起解毒作用。

【药代动力学】半胱氨酸的分解是在厌氧条件下通过脱硫氢酶的作用分解成丙酮酸和硫化氢和氨，或是通过转氨基作用，经由中间产物 β - 巯基丙酮酸分解成为丙酮酸和硫黄，在氧化条化下，氧化成半胱氨酸亚硫酸后，可经转氨基作用分解成为丙酮酸与亚硫酸，以及由脱羧基作用分解成为亚牛磺酸、牛磺酸等。此外，半胱氨酸是不稳定的化合物，容易氧化还原，与胱氨酸相互转换。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
复方氨基酸注射液（9AA）	化学药	HZ001054
复方氨基酸注射液（15AA）	化学药	HZ001056
复方氨基酸注射液（15 - HBC）	化学药	HZ001057
复方氨基酸注射液（17AA）	化学药	HZ001058
复方氨基酸注射液（17AA - H）	化学药	HZ001060
复方氨基酸注射液（18AA - Ⅰ）	化学药	HZ001064
复方氨基酸注射液（18AA - Ⅲ）	化学药	HZ001066
复方氨基酸注射液（18AA - Ⅳ）	化学药	HZ001067
复方氨基酸注射液（18AA - Ⅴ）	化学药	HZ001068
复方氨基酸注射液（18AA - N）	化学药	HZ001069
复方氨基酸注射液（18 - B）	化学药	HZ001070
复方氨基酸注射液（20AA）	化学药	HZ001071
复方甘草酸铵注射液	化学药	HZ001178
复方甘草酸单铵 S 氯化钠注射液	化学药	HZ001179

续表

制剂名称	类别	序号
复方甘草酸单铵S葡萄糖注射液	化学药	HZ001180
复方甘草酸单胺注射液	化学药	HZ001181
复方甘草酸苷注射液	化学药	HZ001182
复方甘草甜素氯化钠注射液	化学药	HZ001183
小儿复方氨基酸注射液（18AA－Ⅰ）	化学药	HZ003749
小儿复方氨基酸注射液（18AA－Ⅱ）	化学药	HZ003750
小儿复方氨基酸注射液（19AA－Ⅰ）	化学药	HZ003751
注射用半胱氨酸	化学药	HZ004693
注射用复方甘草酸单铵S	化学药	HZ004760
注射用复方甘草酸苷	化学药	HZ004761

HY002140　盐酸贝那普利

【外文名称】Benazepril Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】3－［（1－乙氧羰基－3－苯基－（1*S*）－丙基）氨基］2,3,4,5－四氢－2－氧代－1*H*－1－（3*S*）苯并氮杂䓬－1－乙酸盐酸盐

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理

（1）降压：本品在肝内水解为贝那普利拉，成为一种竞争性的血管紧张素转换酶抑制剂，阻止血管紧张素Ⅰ转换为血管紧张素Ⅱ、使血管阻力降低，醛固酮分泌减少，血浆肾素活性增高。贝那普利拉还抑制缓激肽的降解，也使血管阻力降低，产生降压作用。

（2）减低心脏负荷：本品扩张动脉与静脉，降低周围血管阻力或心脏后负荷，降低肺毛细血管嵌压或心脏前负荷，也降低肺血管阻力，从而改善心排血量，使运动耐量和时间延长。

2．毒理：大鼠和小鼠持续口服贝那普利2年，剂量为每天150mg/kg，未发现本品有致癌性。（该剂量按mg/kg计算，为人类最大用量的110倍；按mg/m^{2}计算，为人类最大用量的18倍和9倍）不论在细菌试验中，还是在体外培养的哺乳动物细胞试验中均未发现本品有致突变性。雌、雄大鼠口服贝那普利，剂量为每天50～150mg/kg，未发现本品影响生殖能力。（该剂量按mg/kg计算，为人类最大用量的37～375倍；按mg/m^{2}计算，为人类最大用量的6～60倍）

【药代动力学】本品口服吸收迅速，达峰时间为0.5～1小时，贝那普利为1～1.5小时。口服吸收至少37%，进食不影响吸收。本品的蛋白结合率高达96.7%，贝那普利为95.3%。本品吸收后在肝内水解生成贝那普利，其抑制血管紧张素转换酶的作用比本品强。本品的半衰期为0.6小时，贝那普利为10～11小时，2～3天后达稳态。本品主要经肾清除，不到1%的贝那普利以原形排出，20%以贝那普利排出，另外则以贝那普利和贝那普利的乙酰－葡萄苷酸的结合物排出；11%～12%从胆道排泄。轻中度肾功能障碍（肌酐清除率＞30ml/min）、肝硬化所致肝功能障碍及年龄不影响药代动力学。血液透析时，本品少量可被透析清除。

【药物相互作用】

1．与利尿药合用降压作用增强，可能引起严重低血压。故原用利尿药应停药或减量，本品开始用小剂量，逐渐调整剂量。

2．与其他扩血管药合用可能导致低血压。如合用，应从小剂量开始。

3．与潴钾利尿药（如螺内酯、氨苯蝶啶、阿米洛利）合用可引起血钾过高。

4．与非甾体类抗炎止痛药合用可通过抑制前列腺素合成及水钠潴留，使本品降压作用减弱。

5．与其他降压药合用，降压作用加强。其中与引起肾素释出或影响交感活性的药物呈较大的相加作用，与β受体阻滞剂合用呈小于相加的作用。

【药物过量】首先应纠正低血压，通过静脉输注生理盐水扩充血容量是恢复血压的一个有效措施。贝那普利拉可部分经透析除去。

【不良反应】

1．常见的有：头痛、头晕、疲乏、嗜睡、恶心、咳嗽。最常见的为头痛和咳嗽。

2．少见的有：症状性低血压、体位性低血压、晕厥、心悸、周围性水肿、皮疹、皮炎、便秘、胃炎、焦虑、失眠、感觉异常、关节痛、肌痛、哮喘等。血管神经性水肿罕见。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸贝那普利片	化学药	HZ003901

HY002141　盐酸贝那替秦

【其他名称】苯纳嗪、苯那辛、羟基解痉素、罂

复康、胃乐康、盐酸苯乃嗪、盐酸倍那替净、盐酸苯羟乙胺、盐酸乙胺苄静

【外文名称】Benactyzine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第11册

【分子式】$C_{20}H_{25}NO_3 \cdot HCl$

【分子量】363.88

【性状及组成】本品为白色或几乎白色结晶性粉末。25℃时100ml水中可溶解该品14.9g，几乎不溶于乙醚。无臭，味微苦。

熔点：本品的熔点为177～181℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为抗胆碱药，有缓解内脏痉挛、减少胃酸分泌及中枢安定作用，用于焦虑患者并有胃及十二指肠溃疡、胃炎、胃痉挛、胆石症等。

【不良反应】本品可能产生四肢麻木感、恶心、感觉迟钝、口渴、嗜睡、头晕、运动失调等副作用，一般能自行消失。如发现四肢麻痹、恶心、眩晕等时应减量或停药。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸贝那替秦片	化学药	HZ0003902

HY002142 盐酸贝尼地平

【其他名称】苄尼地平、苯尼地平、Coniel、Cooid、KW－3049

【外文名称】Benidipine Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】（±）（R^*）－3－［（R^*）－1－苄基－3－哌啶基］－5－甲基－2,6－二甲基－4－（3－硝基苯基）－1,4－二氢－3,5－吡啶二羧酸酯盐酸盐

【分子式】$C_{28}H_{31}N_3O_6 \cdot HCl$

【分子量】542.03

药物药理信息

【药理毒理】本品是一种二氢吡啶类钙拮抗剂，与细胞膜电位依赖性钙通道的DHP结合部位相结合，抑制钙离子内流，从而扩张冠状动脉和外周血管。

另外，本品在细胞膜的分布较多，主要是进入细胞内与DHP结合部位相结合。此外，通过研究离体血管收缩抑制作用和DHP结合部位亲和性等，证明本品与DHP结合部位的结合性强且解离速度非常缓慢，所以显示持续药理作用，而与血药浓度无相关性。

1．降压作用：对自发性高血压大鼠、DOCA－食盐高血压大鼠、肾性高血压犬经口给予本品，显示缓慢而持续的降压作用。长期给药不产生耐受性。原发性高血压患者口服本品1日1次时，不影响血压的日内变动，在24小时内显示稳定的降压效果。

2．抗心绞痛作用：本品对实验性心绞痛模型（大鼠）及狗冠状动脉结扎再灌流引起的心功能低下、缺血性心电图变化有显著的改善作用。在给劳累性心绞痛患者口服本品时，显示本品对运动负荷所引起的缺血性变化（心电图ST段降低）具有改善作用。

3．保护肾功能作用：对肾功能不全模型（肾切除5/6）自发性高血压大鼠连续经口给予本品时，在显示降压作用的同时改善肾功能。原发性高血压患者口服本品时，可见到肾血流量显著增加。高血压合并慢性肾功能不全的患者口服本品后，肌酐清除率及尿素氮清除率显著增加，显示肾功能保护作用。

4．抑制血管重塑，对血管内皮的保护作用：本品通过激活内皮NO合成酶（eNOS）和增强eNOS基因表达来增加NO生成，并通过其抗氧化作用抑制NO灭活，最终扩大NO生物活性，从而抑制血管重塑，对血管内皮起保护性作用。

急性毒性LD_{50}（mg/kg）：小鼠口服为321.6～384.5，大鼠口服为87.6～197.9，狗口服为29.3～62.8。未见致畸、致癌变作用，也未见抗原性、变异原性等。

【药代动力学】

1．吸收：本品口服后吸收较快，健康成人口服给药（2，4，8mg）后约1小时血药浓度达峰值，半衰期为1～2小时。

2．分布：体内组织的分布：大鼠经口给予^{14}C－盐酸贝尼地平1mg/kg后，贝尼地平主要分布于肝脏、肾脏、肾上腺、颌下腺、肺、垂体、胰腺中，而脑、脊髓、睾丸中的分布较少。

妊娠大鼠经口给予^{14}C－盐酸贝尼地平1mg/kg，在胎仔中可见药物的分布，其总量为母体血浆中的1/3以下。哺乳大鼠经口给予^{14}C－盐酸贝尼地平1mg/kg，其乳汁中的药物浓度与血浆中药物浓度变化情况基本一致。

蛋白结合率：75.0%（口服^{14}C－盐酸贝尼地平8mg，1小时后采血）。

3．代谢：通过对人的血浆、尿中的检出代谢物以及对动物的代谢研究认为：人的代谢反应主要为脱去3位侧链的苄基（N－脱烷化），水解3位的1－苄基－3－哌啶酯及5位的甲酯，氧化二氢吡啶环，氧化2位的甲基。

4．排泄（参考英国的试验结果）：西欧健康成年男子5名，单次口服^{14}C－盐酸贝尼地平8mg时，

累积放射能排泄率。在给药后48小时内尿中排泄量约为总给药量的35%，粪中排泄约为36%，给药后120小时内尿中排泄约为36%，粪中排泄约为59%。

【药物相互作用】

1．其他降压药：降压作用增强，可能引起血压过度降低。

2．地高辛：抑制肾小管的地高辛分泌，使血中地高辛浓度上升。有可能引起洋地黄中毒。

3．西咪替丁：西咪替丁抑制肝微粒体的钙拮抗剂代谢酶，同时降低胃酸，增加药物吸收。有可能使血压过度降低。

4．利福平：利福平诱导肝脏的药物代谢酶，促进钙拮抗剂代谢，可降低贝尼地平的血药浓度，使降压作用减弱。

5．柚子汁：柚子汁抑制本品在肝脏的代谢，使本品的血药浓度升高。有可能使血压过度降低。

【药物过量】过量用药有可能引起血压过度降低。若出现严重血压降低，应抬高下肢，进行输液或给升压药等适当处置。另外，因本品的蛋白结合率高，故采取透析除去的方法是无效的。

【不良反应】偶见AST和ALT升高、BVN和肌酸酐升高，白细胞减少，嗜酸细胞增加；心悸、颜面潮红、发烧、胸闷、头痛、头重、眩晕、蹒跚、嗜睡、便秘、恶心、腹部不适；发疹、瘙痒、水肿、倦怠、耳鸣、手指发红、尿频等不良反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸贝尼地平片	化学药	HZ003903

HY002143　盐酸倍他洛尔

【其他名称】倍他索洛尔、倍他心安、卡尔仑

【外文名称】Betaxolol Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】1－［4－［2－（环丙基甲氧基）乙基］苯氧基］－3－［（1－甲基乙基）氨基］－2－丙醇盐酸盐

【分子式】$C_{18}H_{29}NO_3 \cdot HCl$

【分子量】343.89

药物药理信息

【药理毒理】本品为选择性β_1受体阻断剂，无内在拟交感活性及膜稳定作用。对β_1受体的选择性比阿替洛尔和美托尔略高。对心脏的作用与其他β受体阻断剂一样。对血管和支气管平滑肌的作用较弱。亦能降低血浆肾素活性。

本品滴眼作用机制是减少房水生成、不影响瞳孔大小及调节功能，作用时间长，降压作用可维持12小时。本品是钙离子拮抗作用，可直接扩张血管，改善眼的血液供应，从而对视神经起保护作用。

【药代动力学】本品口服吸收率在90%以上，首过效应小于20%，生物利用度为76.5%～88%。口服后血浆药物浓度在2～6小时达高峰。$t_{1/2}$为16.8小时。血浆蛋白结合率为50%。可通过胎盘，也可透过血脑屏障，亦能分泌于乳汁中。主要在肝中代谢，有15%以原形经肾排出。

本品降眼压的作用始于用药后30分钟内，2小时可达最大降眼压效果。每次点药后可使降眼压效果持续12小时之久。

【药物相互作用】勿与氟喹胺苯酯、乙胺碘呋酮合用。与挥发性卤化麻醉药、钙离子拮抗剂、抗心律失常药、氯苯氨丁酸、奎尼丁、胰岛素和磺酰胺类降血糖药、利多卡因、非类固醇类抗炎药、丙咪嗪类抗抑制药、肾上腺皮质激素、合成促皮质素、甲氟喹合用时应小心。

【不良反应】不良反应与普萘洛尔相似但较弱、较少。

口服会有易疲劳、四肢冷、心跳减慢、胃功能紊乱、性欲降低。罕见心功能不全、血压突然降低、支气管痉挛、低血糖、雷诺氏综合征、皮疹。

滴眼可能会有暂时性的不适感。偶有视物模糊、点状角膜炎、异物感、畏光、流泪、痒、干燥、红斑、发炎、分泌物增多、视力敏锐度降低、过敏反应、水肿、角膜敏感性降低及瞳孔大小不一；心动过缓、心脏传导阻滞及充血性心力衰竭；可能会有因呼吸困难、支气管痉挛、气管分泌物浓稠、气喘或呼吸衰竭而产生肺压迫感、失眠、眩晕、头昏、头痛、忧郁、嗜睡、荨麻疹、中毒性表皮坏死、脱毛、舌炎等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸倍他洛尔滴眼液	化学药	HZ003904

HY002144　盐酸倍他司汀

【其他名称】倍他胺、倍他啶、倍他组啶、百西斯汀、甲胺乙比啶、抗眩啶、Microser、培他啶、培他定、培他司汀、培他组啶

【外文名称】Betahistine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】*N*－甲基－2－吡啶乙胺二盐酸盐

【分子式】$C_8H_{12}N_2 \cdot 2HCl$

【分子量】209.12

【性状及组成】常用其二盐酸盐，为白色或类白色结晶或结晶性粉末，无臭，味微苦，易潮解。本品在水中极易溶解，在乙醇中微溶，在丙酮中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：血管扩张药。

本品为一种类组胺药物，对脑血管、心血管，特别是对椎底动脉系统有较明显的扩张作用，显著增加心、脑及周围循环血流量，改善血循环，并降低全身血压，此外能增加耳蜗和前底血流量，从而消除内耳性眩晕，耳鸣和耳闭感，还能增加毛细血管通透性，促进细胞外液的吸收，消除淋巴内水肿；能对抗儿茶酚胺的缩血管作用及降低动脉压，并有抑制血浆凝固及 ADP 诱导的血小板凝集作用，能延长大白鼠体外血栓形成时间，还有轻微的利尿作用。

LD_{50}大鼠（口服）3.04g/kg。

【药代动力学】本品为口服易吸收，在体内转化为活性代谢产物，代谢物 t_{max}为 1 小时，$t_{1/2}$为 3.4～5.6 小时。

本品口服后约 3～5 小时血药浓度达峰值。倍他司汀是一种组胺的类似物，口服后很快吸收。放射性同位素标记的倍他司汀研究表明，倍他司汀的吸收完全。而组胺口服无效，因为口服后被肠道细菌、胃肠黏膜和肝脏降解。在肝脏广泛代谢，倍他司汀在肝脏至少转化为 2 种代谢产物。代谢产物 2－吡啶乙酸无活性。目前还不清楚是否其他的代谢产物具有药理活性。本品在肾脏清除，口服给药后绝大多数的倍他司汀在 3 天内以代谢物的形式从尿液中排出体外。本品是否可经乳汁排泄尚不清楚。母体药物清除半衰期为 3.5 小时。

犬口饲后尿中曾检出代谢物（2－吡啶基）乙酸。

【药物相互作用】不宜同用抗组织胺药。

【不良反应】用本品偶有口干、胃部不适、心悸、皮肤瘙痒等，个别病例偶有恶心、头晕、头胀、出汗等，一般不影响继续服药。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸倍他司汀口服液	化学药	HZ0003905
盐酸倍他司汀氯化钠注射液	化学药	HZ0003906
盐酸倍他司汀片	化学药	HZ0003907
盐酸倍他司汀注射液	化学药	HZ0003908
注射用盐酸倍他司汀	化学药	HZ0005054

HY002145 盐酸苯丙醇胺

【其他名称】PPA

【外文名称】Phenylpropanolamine Hydrochlordie

药物药理信息

【药理毒理】苯丙醇胺是一种人工合成的拟交感神经兴奋性胺类的物质，用作鼻腔和鼻窦减充血剂，有缓解鼻黏膜充血、肿胀的作用，可使鼻塞症状减轻。

2002 年 11 月 15 日原国家药品监督管理局（国药管办［2000］523 号文件）《关于暂停使用和销售含苯丙醇胺的药品制剂的通告》规定禁止使用和销售所有含本品的药品制剂。

【药代动力学】口服后迅速完全吸收，血浆达峰时间约 1～2 小时，主要由尿液排泄。

【不良反应】研究结果表明，服用含有本品的制剂容易引起过敏、心律失常、高血压、急性肾衰、失眠等严重的不良反应，甚至可能引发心脏病和脑出血。

美国耶鲁大学医学院的拉尔夫·霍尔维兹博士及同事通过对 2000 个年龄介于 18～49 岁的成年人，包括 702 个因脑中风而住院的病人，进行了长达 5 年的跟踪研究，结果发现，在研究期内，服用含有本品药品的病人比不服用本品的病人患脑中风的机会高出 50%，而服用含有本品的感冒、咳嗽类药物的病人比服用其他药物的病人患脑中风的机会高出 23%。更可怕的是，服用含有本品的控制食欲类药物（即某些减肥药）的妇女患脑中风的机会增加了 16 倍。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方氨酚美沙芬片（Ⅰ）	化学药	HZ0001032

HY002146 盐酸苯呋洛尔

【其他名称】Benfuran、Bentos、Betaclar、Glauconex、青妥治、氧茚心安

【外文名称】Befunolol Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】本品为阻断 β_1、β_2 受体，无内在拟交感活性，作用与普萘洛尔相似。

用于青光眼、眼内压增高。

【不良反应】滴眼有短暂疼痛和眼刺激症状，偶有视力模糊、结膜充血、瘙痒感、异物感、眼睑炎、结膜炎、眼干燥、表层角膜炎、眼分泌增多等。偶见心动过速、头痛、胸部不适。

HY002147　盐酸苯海拉明

【外文名称】Diphenhydramine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】*N*，*N*－二甲基－2－（二苯基甲氧基）乙胺盐酸盐

【分子式】$C_{17}H_{21}NO \cdot HCl$

【分子量】291.82

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，味苦、随后有麻痹感。本品在水中极易溶解，在乙醇或三氯甲烷中易溶，在丙酮中略溶，在乙醚中极微溶解。

熔点：本品的熔点为 167～171℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗组胺药。

本品为乙醇胺的衍生物，抗组胺效应不及异丙嗪，作用持续时间也较短，镇静作用两药一致，有局麻、镇吐和抗 M 胆碱样作用。①抗组胺作用，可与组织中释放出来的组胺竞争效应细胞上的 H_1 受体，从而制止过敏反应；②对中枢神经活动的抑制引起镇静催眠作用；③加强镇咳药的作用；④也有抗眩晕、抗震颤麻痹作用。

【药代动力学】本品口服吸收快而完全，血浆蛋白结合率为 98%，1～4 小时血药浓度达峰值，$t_{1/2}$为 4～7 小时，本药可透过血脑屏障进入中枢。口服后 15～60 分钟起效，一次给药后可维持 3～6 小时。

【药物相互作用】

1．本品可短暂影响巴比妥类药和磺胺醋酰钠等的吸收。

2．和对氨基水杨酸钠同用可降低后者血药浓度。

3．可增强中枢神经抑制药的作用。

【药物过量】过量可能引起精神错乱、抽搐、震颤、呼吸困难、低血压。婴儿与儿童用药过量可致激动、幻觉、抽搐，甚至死亡。如服用中毒量，可用生理盐水洗胃和导泻。解救时务必使病人保持安静，特别是小儿应防止躁动，必要时可静注地西泮（安定）控制抽搐。低血压时可使用血管收缩药，其他治疗包括给氧和静脉输液等支持疗法。

【不良反应】

1．常见的有：中枢神经抑制作用、共济失调、恶心、呕吐、食欲减退等。

2．少见的有：气急、胸闷、咳嗽、肌张力障碍等。有报道给药后可发生牙关紧闭并伴喉痉挛。

3．偶可引起皮疹、粒细胞减少，贫血及心律紊乱。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氨苯伪麻片（夜片）	化学药	HZ000147
氨酚美伪麻片/苯酚伪麻片	化学药	HZ000175
氨麻苯美片	化学药	HZ000240
苯海拉明薄荷脑糖浆	化学药	HZ000339
苯海拉明伪麻黄碱胶囊	化学药	HZ000340
酚明伪麻片	化学药	HZ000932
复方氨酚苯海拉明片	化学药	HZ001029
复方倍氯米松新霉素贴膏	化学药	HZ001080
复方苯海拉明搽剂	化学药	HZ001083
复方苯海拉明克罗米通酊	化学药	HZ001084
复方苯海拉明克罗米通乳膏	化学药	HZ001085
复方苯海拉明麻黄碱糖浆	化学药	HZ001086
复方磷酸可待因片	化学药	HZ001268
复方水杨酸甲酯苯海拉明喷雾剂	化学药	HZ001389
复方紫荆皮水杨酸溶液	化学药	HZ001488
美息伪麻拉明分散片	化学药	HZ002654
盐酸苯海拉明片	化学药	HZ003909
盐酸苯海拉明注射液	化学药	HZ003910
蟾酥镇痛膏	中成药	ZC000501
复方鼻炎膏	中成药	ZC001286
狗皮膏［改进型］	中成药	ZC001830
关节解痛膏	中成药	ZC001913
关节止痛膏	中成药	ZC001918
冠心膏	中成药	ZC001933
红药贴膏	中成药	ZC002139
肩痹膏	中成药	ZC002440
筋骨宁膏	中成药	ZC002793
咳喘清片	中成药	ZC003031
扭伤膏	中成药	ZC003730
伤湿解痛膏	中成药	ZC004626
麝香拔湿膏	中成药	ZC004689
麝香关节止痛膏	中成药	ZC004697
麝香活血化瘀膏	中成药	ZC004700
麝香祛风湿膏	中成药	ZC004707

续表

制剂名称	类别	序号
麝香伤湿解痛膏	中成药	ZC004712
麝香心痛膏	中成药	ZC004718
麝香壮骨膏	中成药	ZC004725
特制狗皮膏	中成药	ZC005422
脱苦膏	中成药	ZC005616
蜈蚣追风膏	中成药	ZC005823
消炎镇痛膏	中成药	ZC006128
新型狗皮膏	中成药	ZC006483
腰肾膏	中成药	ZC006735

HY002148 盐酸苯海索

【其他名称】 Artane

【外文名称】 Benzhexol Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 α－环己基－α－苯基－1－哌啶丙醇盐酸盐

【分子式】 $C_{20}H_{31}NO \cdot HCl$

【分子量】 337.93

【性状及组成】 本品为白色轻质结晶性粉末，无臭，味微苦，后有刺痛麻痹感。本品在甲醇、乙醇或三氯甲烷中溶解，在水中微溶。

熔点：本品的熔点为 250～256℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：抗帕金森病药。

本品为中枢抗胆碱抗帕金森病药，作用在于选择性阻断纹状体的胆碱能神经通路，而对外周作用较小，从而有利于恢复帕金森病患者脑内多巴胺和乙酰胆碱的平衡，改善患者的帕金森病症状。

【药代动力学】 本品口服后吸收快而完全，可透过血脑屏障，口服 1 小时起效，作用持续 6～12 小时。服用量的 56%随尿排出，肾功能不全时排泄减慢，有蓄积作用，并可从乳汁分泌。

【药物相互作用】

1．本品与乙醇或其他中枢神经系统抑制药合用时，可使中枢抑制作用加强。

2．本品与金刚烷胺、抗胆碱药、单胺氧化酶抑制药帕吉林及丙卡巴肼合用时，可加强抗胆碱作用，并可发生麻痹性肠梗阻。

3．本品与单胺氧化酶抑制剂合用，可导致高血压。

4．本品与制酸药或吸附性止泻剂合用时，可减弱本品的效应。

5．本品与氯丙嗪合用时，后者代谢加快，可使其血药浓度降低。

6．本品与强心苷类合用可使后者在胃肠道停留时间延长，吸收增加，易于中毒。

【药物过量】 中毒症状：超剂量时，可见瞳孔散大、眼压增高、心悸、心动过速、排尿困难、无力、头痛、面红、发热或腹胀。有时伴有精神错乱、谵妄、妄想、幻觉等中毒性精神病症状。严重者可出现昏迷、惊厥、循环衰竭。

处理：催吐或洗胃，采取增加排泄措施，并依病情进行相应对症治疗和支持疗法。

【不良反应】 常见口干、视物模糊等，偶见心动过速、恶心、呕吐、尿潴留、便秘等。长期应用可出现嗜睡、抑郁、记忆力下降、幻觉、意识混浊。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸苯海索片	化学药	HZ003911

HY002149 盐酸苯环壬酯

【外文名称】 Phencynonate Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 国家药品标准新药转正标准·第 38 册

药物理化信息

【化学名】 苯基环戊基羟基乙酸－*N*－甲基－3－氮杂双环［3.3.1］壬－9α 酯盐酸盐

【分子式】 $C_{22}H_{31}NO_3 \cdot HCl$

【分子量】 393.95

【性状及组成】 本品为白色或类白色粉末，无臭，味微苦，有引湿性。

本品在甲醇、三氯甲烷中溶解，水或丙酮中微溶，在乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】 本品系中枢抗胆碱药，能通过血脑屏障进入脑内。在可逆性胆碱酯酶抑制剂引起的兔逆向转圈综合征和猫运动病样综合征两种动物运动病模型，显示有预防晕动病作用。它阻断乙酰胆碱对脑内毒蕈碱受体（M 受体）和烟碱受体（N 受体）的激动作用。在小鼠上它能拮抗胆碱酯酶抑制剂产生的内源性乙酰胆碱引起的惊厥，能拮抗 M 受体激动剂引起的震颤和 N 受体激动剂引起的惊厥。还能加强戊巴比妥钠的催眠作用。本品有外周阻断乙酰

胆碱对 M 受体的激动作用，如抑制回肠收缩，扩大瞳孔，抑制唾液腺分泌。

本品大剂量还能增快心率及呼吸率。对呼吸深度和血压无明显影响，对外周 N 受体无明显拮抗作用。

【药物相互作用】与单胺氧化酶抑制剂（如呋喃唑酮）合用时可加强抗 M 胆碱作用所致的不良反应。

【不良反应】偶见轻微口干。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸苯环壬酯片	化学药	HZ003912

HY002150　盐酸苯那辛

【外文名称】Benactyzini Hydrochloridum

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方氯解磷定注射液	化学药	HZ001305

HY002151　盐酸苯乙双胍

【外文名称】Phenformin Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】1－（2－苯乙基）双胍盐酸盐

【分子式】$C_{10}H_{15}N_5 \cdot HCl$

【分子量】241.72

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末，无臭，味苦。本品在水中易溶，在乙醇中溶解，在三氯甲烷或乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 174～178℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：降血糖药。

盐酸苯乙双胍为双胍类口服降血糖药，本品不刺激 β 细胞分泌胰岛素，用药后血中胰岛素浓度无明显变化。本品降血糖的作用机制可能是：

1．增加周围组织对胰岛素的敏感性，增加胰岛素介导的葡萄糖利用；

2．增加非胰岛素依赖的组织对葡萄糖的利用，如脑、血细胞、肾髓质、肠道、皮肤等；

3．抑制肝糖原异生作用，降低肝糖输出；

4．抑制肠壁细胞摄取葡萄糖；

5．抑制胆固醇的生物合成和贮存，降低血甘油三酯、总胆固醇水平。与胰岛素作用不同，本品无促进脂肪合成的作用，对正常人无明显降血糖作用，对Ⅱ型糖尿病单独应用时一般不引起低血糖。

【药代动力学】本品口服后迅速从胃肠吸收，生物利用度 60%，血浆蛋白结合率为 20%，作用持续 6～8 小时。本品半衰期为 3～5 小时，主要在肝内代谢，经肾排泄，约 1/3 以羟基苯乙双胍的代谢产物形式从尿中排出。

【药物相互作用】与胰岛素合用，降血糖作用加强，应减少胰岛素剂量；本品可加强抗凝药（如华法林等）的抗凝血作用，可致出血倾向。

【药物过量】如果患者过量服用本品（一日口服大于 75mg），可能引起低血糖和乳酸酸中毒。乳酸酸中毒是一种高死亡率的不良反应，应引起医师和患者高度重视。

【不良反应】

1．常见的有：恶心、呕吐、腹泻、口有金属味。

2．可有乏力、疲倦、体重减轻、头晕、皮疹。

3．亦可发生乳酸性酸中毒，临床表现为呕吐、腹痛、过度换气、神志障碍，血液中乳酸浓度增加而不能用于尿毒症、酮症酸中毒或水杨酸中毒等。

4．可减少肠道吸收维生素 B_{12}，使血红蛋白减少，产生巨幼细胞性贫血，也可引起吸收不良。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸苯乙双胍片	化学药	HZ003913

HY002152　盐酸吡多胺

【其他名称】二盐酸吡多胺

【外文名称】Pyridoxamine Dihydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 10 册

【性状及组成】本品为白色至微黄色的结晶或结晶性粉末，无臭，味酸苦，遇光变质，具引湿性。

本品在水中易溶，在乙醇中微溶，在乙醚或三氯甲烷中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】维生素 B_6 的组成之一，药理及应用同维生素 B_6。

HY002153　盐酸吡格列酮

【其他名称】Actos、艾汀

【外文名称】Pioglitazone Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】（±）-5[[4-[2-（5-乙基-2-吡啶基）二氧基]苄基]-2,4]噻唑烷二酮盐酸盐。

药物药理信息

【药理毒理】本品为噻唑烷二酮类抗糖尿病药物，属胰岛素增敏剂，作用机制与胰岛素的存在有关，可减少外周组织和肝脏的胰岛素抵抗，增加依赖胰岛素的葡萄糖的处理，并减少肝糖的输出。与磺酰脲类不同，本品不是一个胰岛素促分泌药。其作用机制是高选择性的激动过氧化物酶小体生长因子活化受体-γ［PPAR-γ］，PPAR-γ的活化可调节许多控制葡萄糖及脂类代谢的胰岛素相关基因的转录。

动物实验表明，本品可减少胰岛素抵抗的高血糖、高胰岛素及高三酰甘油。本品引起的代谢变化导致了依赖胰岛素的组织应答的增加。

由于本品提高了循环胰岛素的作用（即降低胰岛素抵抗），因此它不能降低缺乏内源性胰岛素的动物模型的血糖。

【药代动力学】本品每天给予家兔10次后，吡格列酮及其活性代谢物的血清浓度持续升高，7天内达到稳态浓度。在稳定状态下，吡格列酮的2个活性代谢物Ⅲ（M-Ⅲ）及Ⅳ（M-Ⅳ）的血浆浓度≥吡格列酮的血浆浓度，吡格列酮约占30%～50%，其AUC占总AUC的20%～25%。

【药物相互作用】

1. 与含乙炔雌二醇及炔诺酮合用，可使2种激素的血浆浓度降低约30%。

2. 本品对格列吡嗪、地高辛、华法林和二甲双胍无影响。

3. CYP3A4对本品的代谢有一定作用。

4. 酮康唑在体外可明显抑制本品的代谢。

5. 除膀胱外未发现其他器官有药物诱导型肿瘤。

【不良反应】经3000多例（其中1100例疗程为半年，450例为1年）临床试验显示，不良反应主要有：

1. 低血糖。

2. 吡格列酮组贫血症发生率为1.0%，安慰剂组为0。与胰岛素联合用药，吡格列酮组与安慰剂组贫血症发生率均为1.6%。与磺酰脲类联合治疗，吡格列酮组贫血症发生率为0.3%，安慰剂组为1.6%。与二甲双胍联合治疗，吡格列酮组贫血症发生率为1.2%，安慰剂组为0。血红蛋白平均降低2%～4%。

3. 水肿。

4. 可能引起血浆容积增加，终致前负荷诱导型心脏肥大。

5. ALT升高，吡格列酮组有0.26%（4/1526）的患者、安慰剂组有0.25（2/793）的患者ALT水平≥正常上限的3倍。偶尔出现肌酸激酶水平短暂升高。

6. 未见致畸作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸吡格列酮胶囊	化学药	HZ003914
盐酸吡格列酮口腔崩解片	化学药	HZ003915
盐酸吡格列酮片	化学药	HZ003916

HY002154 盐酸吡硫醇

【外文名称】Pyritinol Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】3,3-（二硫代亚甲基）双（5-羟基-6-甲基-吡啶甲烷）二盐酸盐一水合物

【分子式】$C_{16}H_{20}N_2O_4S_2 \cdot 2HCl \cdot H_2O$

【分子量】459.40

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，味苦涩。本品在水中易溶，在乙醇中略溶，在丙酮、三氯甲烷或乙醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：脑代谢改善药。

本品为脑代谢改善药，系维生素B_6的衍生物，能促进脑内葡萄糖及氨基酸代谢，改善全身同化作用，增加颈动脉血流量，增强脑功能。对边缘系统和网状结构亦有一定作用。

【药代动力学】本品口服2～4小时，血中浓度达高峰，在中枢神经系统内维持1～6小时，并在体内完全代谢吸收。静脉注射8～40分钟，血中浓度达高峰，在中枢神经系统内维持1～6小时，并在体内完全代谢吸收。

【不良反应】偶可引起恶心、皮疹等，停药后即可恢复。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸吡硫醇胶囊	化学药	HZ003917
盐酸吡硫醇氯化钠注射液	化学药	HZ003918
盐酸吡硫醇片	化学药	HZ003919
盐酸吡硫醇葡萄糖注射液	化学药	HZ003920

续表

制剂名称	类别	序号
盐酸吡硫醇注射液	化学药	HZ003921
注射用盐酸吡硫醇	化学药	HZ005055

HY002155　盐酸吡柔比星

【外文名称】Pirarubicin Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】（8*S*，10*S*）－10－［（3′－氨基－2′,3′,6′－三脱氧－α－L－阿拉伯吡喃糖基）－氧］－6,8,11－三羟基－8－羟乙酰基－1－甲氧基－7,8,9,10－四氢并四苯－5,12－二酮盐酸盐

【分子式】$C_{32}H_{37}NO_{12}\cdot HCl$

【分子量】664.10

药物药理信息

【药理毒理】本品为半合成的蒽环类抗癌药，进入细胞核内迅速嵌入 DNA 核酸碱基对间，干扰转录过程，阻止 mRNA 合成，抑制 DNA 聚合酶及 DNA 拓扑异构酶Ⅱ活性，干扰 DNA 合成。因本品同时干扰 DNA、mRNA 合成，在细胞分裂的 G_2 期阻断细胞周期而干扰瘤细胞分裂、抑制肿瘤生长，故具有较强的抗癌活性。

【药代动力学】本品静注后迅速吸收，组织分布广，以脾、肺及肾组织浓度高，心脏内较低，有选择性作用于瘤细胞的作用。其半衰期明显低于阿霉素（ADM）。人静注本品 30mg/m^3 后血浆浓度迅速减少，6～8 小时后为 11ng/ml 左右，$t_{1/2\alpha}$、$t_{1/2\beta}$、$t_{1/2\gamma}$ 各为 0.89 分钟、0.46 小时及 14.2 小时。

【不良反应】

1．骨髓抑制为剂量限制性毒性，主要为粒细胞减少，平均最低值在 14 天，第 21 天恢复，贫血及血小板减少少见。

2．心脏毒性低于 ADM，急性心脏毒性主要为可逆性心电图变化，如心律失常或非特异性 ST－T 异常，慢性心脏毒性呈剂量累积性。

3．胃肠道反应：恶心、呕吐、食欲减退、口腔黏膜炎，有时出现腹泻。

4．其他：肝肾功能异常、脱发、皮肤色素沉着等，偶有皮疹。膀胱内注入可出现尿频、排尿痛、血尿等膀胱刺激症状，甚至膀胱萎缩。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸吡柔比星	化学药	HZ005056

HY002156　盐酸吡西卡尼

【其他名称】匹西卡因胺、Sunrbythm

【外文名称】Pilsicainide Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】*N*－2,6 二甲基苯基－8－双稠吡咯－乙酰胺盐酸盐

【分子式】$C_{17}H_{24}N_2O\cdot HCl\cdot 2H_2O$

【分子量】317.86

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末。

药物药理信息

【药理毒理】吡西卡尼为一口服有效的通过阻滞 Na^+ 通道而起作用的 IC 类抗心律失常药。本品对多种心律失常显示良好的疗效，包括冠脉结扎诱导的心律失常、肾上腺素及畦巴因诱导的心律失常。本品显示微弱的心脏抑制作用、抗胆碱能作用及中枢神经系统作用。适用于室性或室上性心律失常，特别用于其他抗心律失常药无效或不能耐受的室性心动过速的治疗。

【药代动力学】健康成人和患者口服本品单剂量后，吸收良好，于 1～2 小时后血药浓度达到峰值，$t_{1/2}$为 3～5 小时。主要由肾脏排泄。

【药物相互作用】维拉帕米、心得安、地高辛及硝酸甘油可增强本品的作用，故与它们合用应加以注意。

【不良反应】

1．可能出现心室纤颤、室性心动过速、心房纤颤、期外收缩、ARS 或 Q－T 间期延长、房室或窦房阻滞、心悸和胸部不适等，此时须减量或停止给药并采取适当措施。

2．其他有胃疼、腹部不适、恶心、呕吐、腹泻、口干、眩晕、头痛、淋巴细胞减少、嗜酸粒细胞增多、白细胞计数异常及 AST、ALT 或 LDH 升高、CPK 增高和呆滞。

3．如果出现皮疹等过敏反应，须停止治疗。

HY002157　盐酸苄达明

【其他名称】盐酸炎痛静、炎痛静

【外文名称】Benzydamine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁标准（二部）·第 5 册

药物理化信息

【化学名】1－苄基－3－（3－二甲胺基丙氧基）－1H－吲唑盐酸盐

【分子式】$C_{19}N_{23}N_3O \cdot HCl$

【分子量】345.87

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，味辛辣。

本品在水中极易溶解，在乙醇或三氯甲烷中易溶，在乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 157～161℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为非甾体抗炎药，具有抗炎、解热、镇痛作用，对炎症性疼痛有效，本品尚有罂粟碱样解痉作用。

【不良反应】服用本品后有时有头晕、失眠、轻度食欲减退、腹泻、胃酸过多等症状，并可能引起白细胞减少。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸苄达明片	化学药	HZ003922
脱苦膏	中成药	ZC005616

HY002158 盐酸苄普地尔

【外文名称】Bepridil Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 60 册

药物理化信息

【化学名】β－［（2－甲丙氧基）甲基］－*N*－苯基－1－吡咯烷乙胺盐酸盐。

【分子式】$C_{24}H_{34}N_2O \cdot HCl$

【分子量】421.02

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末，微臭、味苦。

本品在乙醇中易溶，在乙酸乙酯中微溶，在水中极微溶解。

吸收系数：取本品，精密称定，加 90% 乙醇溶液使溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 10μg 的溶液，照紫外－可见分光光度法，在 249nm 的波长处测定吸光度，吸收系数 $E_{1cm}^{1\%}$ 应为 351～373。

药物药理信息

【药理毒理】本品为钙离子拮抗剂。本品为钙通道阻滞剂，抑制心肌和血管平滑肌细胞的钙离子缓慢内流和钠离子快速内流，具有良好的抗心绞痛作用。

【药代动力学】在健康志愿者的研究中，盐酸苄普地尔片口服后吸收迅速、完全。吸收后 99% 在肝脏经 P450 酶代谢。8 名健康男性志愿者口服本品 200mg 后，血浆浓度于平均 3 小时达到高峰（454.0 ± 79.03）ng/ml，平均消除半衰期为（16.5 ± 6.5）小时。平均相对生物利用度为 105.3%。盐酸苄普地尔剂量在每天 200～400mg 的范围内与稳态血浓度呈线性关系。盐酸苄普地尔的消除呈双相性，单剂量口服盐酸苄普地尔片 400mg 后，其消除半衰期为（39.54 ± 5.4）小时。

一次口服后 10 天内，其代谢产物 67% 经尿排出，23% 经粪便排出。心绞痛患者对盐酸苄普地尔的清除能力减退，因此平均血浆浓度高于健康人。盐酸苄普地尔 98% 以上与血浆蛋白相结合，餐后服药使血药浓度达峰时间稍推迟，盐酸苄普地尔可引起子宫张力减退，并能通过胎盘屏障。

【药物相互作用】

1. 硝酸酯：稳定型心绞痛患者对同时服用盐酸苄普地尔和长效或短效的硝酸酯类药物具有良好的耐受性。在服用盐酸苄普地尔期间，为控制急性心绞痛发作，必要时仍可含服硝酸甘油片。

2. β 阻滞剂：稳定型心绞痛病人能良好地耐受盐酸苄普地尔和 β 阻滞剂合用。但是，现有资料不足以确认这种合并用药对心室功能障碍或心脏传导异常患者的作用。

3. 口服降糖药：盐酸苄普地尔已被安全地用于糖尿病患者而并不显著地降低其血糖水平，或改变糖尿病患者对胰岛素或口服降糖药的需要量。

4. 有些药物能增加盐酸苄普地尔潜在的严重不良反应的可能性，包括：抗心律失常药物（如奎尼丁和普鲁卡因酰胺）、强心苷和三环类抗抑郁药。抗心律失常药和抗抑郁药可以增加盐酸苄普地尔延长 QT 间期的作用。强心苷可以加重盐酸苄普地尔对房室结传导的抑制作用。

【药物过量】一旦发生服用过量的情况，建议密切心脏监护至少 48 小时，采取洗胃及其他适当的支持措施。β 肾上腺素能刺激或胃肠道外给予含钙溶液可增加跨膜钙离子内流；出现有临床意义的低血压反应或高度房室阻滞时可给予血管加压药或人工心脏起博；对室性心动过速应予复律，如持续存在，可予超速起博。

【不良反应】

1. 在临床对照试验中发现的发生率在 2% 以上的不良反应有以下内容。

全身系统：无力、头痛、流感样症状。

心血管/呼吸系统：心悸、呼吸困难、呼吸系统感染。

胃肠道系统：胃肠道不适、消化不良、恶心、畏食、口干、腹泻、腹痛、便秘。

一般神经系统：嗜睡、头昏、失眠、震颤、手

抖、感觉异常。

心理方面：紧张。

特殊感觉：耳鸣。

2. 不良反应较常见，大多可耐受，有15%患者因胃肠道反应、眩晕、室性心律失常和晕厥而停药，临床研究和药品上市后报道的发生率在2%以下的可能不良反应有以下内容。

全身性：发热、疼痛、肌痛性无力、双重感染和流感综合征。

心血管/呼吸系统：窦性心动过速、窦性心动过缓、高血压血管控制、水肿、室性早博、室性心动过速、Q－T间期延长、鼻炎、咳嗽、咽炎。

胃肠系统：胃肠胀气、胃炎、食欲亢进、口干、便秘。

肌肉骨骼系统：关节炎。

中枢神经系统：头晕、眩晕、不能静坐、嗜睡、失眠、震颤。

精神系统：忧郁、焦虑、不良行为。

皮肤：皮疹、出汗、皮肤刺激反应。

特殊感觉：视力模糊、耳鸣、味觉变化。

泌尿生殖系统：性欲丧失、阳痿。

实验室检查异常：肝功能异常、ALT升高。

粒细胞缺乏症：根据美国的临床试验结果，800多例病人服用盐酸苄普地尔长达5年，2例老年糖尿病患者发生明显的白细胞减少和中性粒细胞减少。

充血性心力衰竭：在美国的临床对照试验中，少数病例（约1%）发生心力衰竭。

肝酶升高：在美国1000多例病人服用盐酸苄普地尔的临床研究中，1%左右的患者发生具有意义的转氨酶升高（至少达正常上限的2倍），停药后恢复正常。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸苄普地尔片	化学药	HZ003923

HY002159　盐酸苄丝肼

【其他名称】苄丝拉肼、Laevodopaet、Madopa－125、马多巴、美道普－125、羟苯丝肼、Serazide Hydrochloride、色拉肼、丝氯酰肼、三羟苄酰肼

【外文名称】Benserazide Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】2－〔(2,3,4－三羟基苯基）甲基〕酰肼－DL丝氨酸盐酸盐

【分子式】$C_{10}H_{15}N_3O_5 \cdot HCl$

【分子量】293.71

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，有吸湿性，遇光色变深。本品在水中易溶，在甲醇中略溶，在乙醇或丙酮中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：脱羧酶抑制药。

苄丝肼为外周脱羧酶抑制剂，不易进入中枢，仅抑制外周左旋多巴转化为多巴胺、使循环中左旋多巴含量增加5～10倍，因而进入中枢的左旋多巴的量也增多，左旋多巴在脑内经多巴脱羧酶作用转化为多巴胺而发挥药理作用，改善帕金森病症状。苄丝肼与左旋多巴合用既可降低左旋多巴的外周性心血管系统的不良反应，又可减少左旋多巴的用量。

一般苄丝肼与左旋多巴按1:4配伍应用。

【药代动力学】口服吸收快，吸收率约58%，在肠内代谢，由尿排泄，12小时排泄约90%。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
多巴丝肼胶囊	化学药	HZ000780
多巴丝肼片	化学药	HZ000781

HY002160　盐酸表柔比星

【其他名称】表阿霉素

【外文名称】Epirubicin Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第32册

药物理化信息

【化学名】(8*S*, 10*S*)－10－〔3　－氨基－2,3′, 6.－三脱氧－α－L－阿拉伯吡喃糖基〕－*O*－〕－6.8.11－三羟基－8－羟乙酰基－1－甲氧基－7,8,9,10－四氢并四苯－5、12－二酮盐酸盐

【分子式】$C_{27}H_{29}NO_{11} \cdot HCl$

【分子量】579.98

【性状及组成】本品为鲜红色或橙红色粉末，有引湿性。

本品在水或甲醇中溶解，在乙醇中中微溶，在乙醚中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加甲醇溶解并定量稀释制成每1ml中约含0.5mg的溶液，依法测定，按无溶剂的无水物计算，比旋度为+310°至+340°。

吸收系数：取本品，精密称定，加甲醇溶解并定量稀释制成每1ml中约含15μg的溶液，照紫外－可见分光光度法，在495nm的波长处测定吸光度，

按无溶剂的无水物计算，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为 200～230。

药物药理信息

【药理毒理】本品为多柔比星的同分异构体，4′位置上的羟基由顺位变为反位。为一细胞周期非特异性药物，其主要作用部位是细胞核。本品的作用机制与其能与 DNA 结合有关。体外培养的细胞加入本品可迅速透入胞内，进入细胞核与 DNA 结合，从而抑制核酸的合成和有丝分裂。已证实表阿霉素具有广谱的抗实验性肿瘤的作用，对拓扑异构酶也有抑制作用。疗效与阿霉素相等或略高，而毒性尤其是心脏毒性低于阿霉素。

【药代动力学】体内代谢和排泄较阿霉素快，平均血浆半衰期约 40 小时，主要在肝脏代谢，经胆汁排泄。48 小时内，9%～10%的给药量由尿排出，4 天内，40%的给药量由胆汁排出，该药不通过血脑屏障。对有肝转移和肝功能受损的病人，该药在血浆中的浓度维持时间较长，故应适当减小剂量。肾功能正常与否对本品的药代动力学特性影响不大。

【药物相互作用】

1. 表阿霉素可与其他抗肿瘤药物合用，但表阿霉素用量应减低。联合用药时，不得在同一注射器内使用。

2. 表阿霉素不可与肝素混合注射，因为二者化学性质不配伍，在一定浓度时会发生沉淀反应。

【药物过量】本品总限量为按体表面积 550～800mg/m^2。

【不良反应】

1. 与阿霉素相似，但程度较低，尤其是心脏毒性和骨髓抑制毒性；

2. 其他不良反应有：脱发，60%～90%的病例可发生，一般可逆，男性有胡须生长受抑；黏膜炎，用药的第 5～10 天出现，通常发生在舌侧及舌下黏膜；胃肠功能紊乱，如恶心、呕吐、腹泻；曾有报道偶有发热、寒战、荨麻疹、色素沉着、关节疼痛。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸表柔比星	化学药	HZ005057

HY002161 盐酸丙胺卡因

【外文名称】Prilocaine Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】本品为酰胺类局麻药，作用与利多卡因相仿，但时间较长，无血管扩张作用，毒性较小，蓄积性也较小。毒性低于利多卡因。目前临床上已不常用，主要局限用于局部浸润麻醉及局部静脉麻醉。

【药代动力学】有相当一部分在肺内代谢或分离，在体内被肝脏快速降解代谢。

【药物相互作用】对正在接受能引起高铁血红蛋白血症的其他药物治疗（如磺胺类药）的患者，本药可加重高铁血红蛋白的形成。

【药物过量】当剂量超过 600mg 时，代谢产生的邻甲苯胺，还原血红蛋白为正铁血红蛋白，且血中正铁血红蛋白超过 1.5g/dl 时，临床上可出现青紫、血红蛋白尿等并发症。一旦发生，予以 1mg/kg 美蓝可有效治疗正铁血红蛋白血症。

HY002162 盐酸丙卡巴肼

【其他名称】盐酸甲基苄肼

【外文名称】Procarbazine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】*N*－（1－甲基乙基）－4－［（2－甲基肼基）甲基］苯甲酰胺盐酸盐

【分子式】$C_{12}H_{19}N_3O \cdot HCl$

【分子量】257.76

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末。本品在水中易溶，在乙醇中略溶，在乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 218～226℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】本品为肼的衍生物，本身无抗癌作用，体内代谢物具烷化作用，属非典型烷化剂，本品经肝微粒体酶的氧化作用放出甲基正离子（CH_3^+）与 DNA 结合使之解聚，并使 DNA 前体物胸腺苷酸及鸟嘌呤甲基化，进而抑制 RNA 及蛋白质合成，干扰肿瘤细胞增殖，在细胞周期中阻碍 S 期细胞进入 G_2 期。

【药代动力学】本品口服吸收快而完全，易透过血脑屏障，以肝肾组织中浓度最高，血浆 $t_{1/2}$为 7～10 分钟，主要从尿中排泄。

【药物相互作用】不宜与丙咪嗪、胍乙啶、利血平等并用，以免增加其降压作用；本品有增加巴比妥、麻醉剂如硫喷妥钠及抗组胺类药的作用；与箭毒并用，增加肌肉松弛作用，可致呼吸困难；可增强降血糖药作用，故用本品时应尽量避免与其并用。

【不良反应】

1. 骨髓抑制为剂量限制性毒性，可致白细胞及血小板减少，出现较迟，一般发生于用药后 4～6 周，2～3 周后可恢复；

2. 恶心、呕吐、食欲减退常见，偶有口腔炎、口干、腹泻、便秘、眩晕、嗜睡、精神错乱、脑电图异常等，肝损害、皮炎、皮肤色素沉着、脱发、外周神经炎等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸丙卡巴肼肠溶片	化学药	HZ003924

HY002163　盐酸丙卡特罗

【外文名称】Procaterol Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】5－（1－羟基－2－异丙胺基丁基）－8－羧基喹诺酮盐酸盐半水合物

【分子式】$C_{16}H_{22}N_2O_3 \cdot HCl \cdot 1/2H_2O$

【分子量】335.83

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，味涩。

本品在水或甲醇中溶解，在乙醇中微溶，在乙醚中几乎不溶，在甲酸中溶解。

熔点：本品的熔点为 193～198℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：β_2 肾上腺素受体激动药。

本品为 β_2 受体激动剂，对支气管平滑肌的 β_2 肾上腺素受体有较高的选择性，从而起到舒张支气管平滑肌的作用；还具有一定的抗过敏作用和促进呼吸道纤毛运动。

【药代动力学】本品口服 5 分钟内开始起效，1.5 小时左右作用最强，可持续 6～8 小时，消除半衰期为 8.4 小时。本品经 8 名健康成人口服 100mg 后，血药浓度达峰值时间（t_{max}）约 2 小时左右，峰浓度为（2070 ± 325）pg/ml，半衰期为（5.2 ± 1.7）小时。总尿中排泄量为 10.3% ± 2.4%。

【药物相互作用】

1. 本药与肾上腺素及异丙肾上腺素等儿茶酚胺类并用时会引起心律失常、心率增加，故应避免与上述药物并用。

2. 并用茶碱类药时，可增加舒张支气管平滑肌作用，但不良反应也增加。

3. 避免与单胺氧化酶抑制剂及三环类抗抑郁药同时应用。

【不良反应】偶有口干、鼻塞、倦怠、恶心、胃部不适、肌颤、头痛、眩晕或耳鸣。亦可发生皮疹、心律失常、心悸、面部潮红等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸丙卡特罗胶囊	化学药	HZ003925
盐酸丙卡特罗口服液	化学药	HZ003926
盐酸丙卡特罗片	化学药	HZ003927

HY002164　盐酸丙美卡因

【其他名称】丙氧苯卡因、Placaine、Proparacaine Hydrochloirde、盐酸丙对卡因

【外文名称】Proxymetacaine Hydrochloride

【性状及组成】白色或类白色结晶粉末，无臭或几无臭。溶于 30 份水及 50 份乙醇，不溶于乙醚。遇热或霸置空气会变色，溶液露置空气将由黄变深棕而功效降低。

药物药理信息

【药理毒理】本品为酯类表面麻醉剂。麻醉强度略大于相同浓度的丁卡因，作用快。由于其结构不同于普鲁卡因和丁卡因，因而与其他局麻药之间无交叉过敏性，很少引起初期的刺激作用。

因毒性太大，不用于注射。

1%水溶液 pH 约 5.7～6.4，适用于眼科表面麻醉。

【药代动力学】眼科表面麻醉 20 秒起效，持续时间约 15 分钟或更长。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸丙美卡因滴眼液	化学药	HZ003928

HY002165　盐酸丙咪嗪

【外文名称】Imipramine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】*N*，*N*－二甲基－10,11－二氢－5*H*－二苯并［*b*，*f*］氮杂䓬－5－丙胺盐酸盐

【分子式】$C_{19}H_{24}N_2 \cdot HCl$

【分子量】316.88

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶性粉末，无臭或几乎无臭，遇光渐变色。本品在水、乙醇或三氯甲烷中易溶，在乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 170～175℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为三环类抗抑郁药，主要作用在于阻断中枢神经系统对去甲肾上腺素和 5－羟色胺这两种神经递质的再摄取，从而使突触间隙中这两种神经递质浓度增高，发挥抗抑郁作用。本品还有抗胆碱，抗 α_1 肾上腺素受体及抗 H_1 组胺受体作用，但对多巴胺受体影响甚小。

【药代动力学】本品口服吸收好，生物利用度 29%～77%，蛋白结合率 76%～95%，半衰期为 9～24 小时，分布容积 15～30L/kg。主要在肝脏代谢，活性代谢产物为去甲丙咪嗪。自肾脏排泄，可分泌入乳汁，老年病人对本品的代谢与排泄能力下降，敏感性增强，应减少用量。

【药物相互作用】

1．本品与乙醇合用，可使中枢神经的抑制作用增强。

2．本品与抗惊厥药合用，可降低抗惊厥药的作用。

3．本品与抗组胺药或抗胆碱药合用，药效相互加强。

4．本品与雌激素或含雌激素的避孕药合用，可增加本品的不良反应。

5．本品与肾上腺素受体激动药合用，可引起严重高血压与高热。

6．本品与甲状腺制剂合用，可互相增效，导致心律失常。

7．与单胺氧化酶合用，有发生高血压的危险。

【药物过量】

1．中毒症状

（1）超剂量服用可致谵妄、幻觉、昏迷、痉挛、血压下降、呼吸抑制、瞳孔散大。

（2）循环系统可见窦性心动过速、心肌缺血、多灶性期外收缩及房室或室内传导阻滞、室性纤颤。

2．处理：洗胃、催吐，以排除毒物，并依病情进行相应对症治疗及支持疗法。

【不良反应】治疗初期可能出现失眠与抗胆碱能反应，如多汗、口干、震颤、眩晕、心动过速、视物模糊、排尿困难、便秘或麻痹性肠梗阻等。大剂量可发生心脏传导阻滞、心律失常、焦虑等。其他有皮疹，体位性低血压、偶见癫痫发作和骨髓抑制或中毒性肝损害。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸丙咪嗪片	化学药	HZ003929

HY002166 盐酸丙帕他莫

【外文名称】Propacetamol Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】二乙胺基乙酸－4－乙酰氨基苯酯盐酸盐

【分子式】$C_{14}H_{20}N_2O_3 \cdot HCl$

【分子量】300.78

药物药理信息

【药理毒理】盐酸丙帕他莫是对乙酰氨基酚的前体药物，具有对乙酰氨基酚的镇痛、解热、镇静作用。其水溶性好，进入体内经血浆酯酶转化成对乙酰氨基酚而发挥解热镇痛作用。

在术后镇痛方面，盐酸丙帕他莫注射剂 2g 静脉滴注，与度冷丁 50mg 肌内注射同样安全有效。丙帕他莫用于术后短期镇痛具有较高的安全性，且无吗啡类药物的副作用，是较好的吗啡类药的替代物。

【药代动力学】丙帕他莫在血浆中 99%迅速水解而成（水解半衰期约 11 分钟）对乙酰氨基酚及 *N*，*N*－二乙基甘氨酸。本品 15 分钟静脉输注后，于 15 分钟开始起效，1～2 小时达药效峰值，镇痛作用达 4～6 小时，解热作用维持约 4 小时。

本品产物对乙酰氨基酚主要在肝脏代谢，约 60%～80%与葡萄糖醛酸结合后随尿排泄，约 20%～30%与硫酸结合后排泄。有 5%以上以原形排出。还有 4%被细胞色素 P450 转化为一种与谷胱甘肽结合的代谢物，主要通过尿液排泄。二乙基甘氨酸部分在尿中以原形分泌。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸丙帕他莫	化学药	HZ005058

HY002167 盐酸丙哌维林

【外文名称】Propiverine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 53 册

药物理化信息

【化学名】1－甲基－4－哌啶基二苯基丙氧乙酸酯盐酸盐

【分子式】$C_{23}H_{29}NO_3 \cdot HCl$

【分子量】403.95

【性状及组成】本品为白色针状结晶或结晶性粉末，无臭，无味。

本品在甲醇或三氯甲烷中易溶，在水或乙醇中溶解，在丙酮中略溶，在冰醋酸中易溶。

熔点：本品的熔点为212～216℃。

药物药理信息

【药理毒理】

1．对在体膀胱排尿运动的抑制作用

（1）增加膀胱容量：膀胱内压测定表明，本药可增加麻醉的大鼠和狗的最大膀胱容量，以及除脑狗的最大膀胱容量和有效膀胱容量，但未观察到残留尿量的显著性增加。

（2）抑制排尿运动：本药可减少麻醉的大鼠和狗膀胱充盈时的节律性收缩（排尿运动）次数。

（3）抑制电刺激引起的膀胱收缩。不论是否切断盆神经，本药均可降低电刺激狗盆神经引起的膀胱的收缩力。

2．对离体膀胱的作用：可剂量相关性的抑制膀胱平滑肌因乙酰胆碱、氯化钙（大鼠、狗、豚鼠）、电刺激（大鼠、狗、家兔）引起的收缩。

3．作用机制：可抑制乙酰胆碱、氯化钙对离体膀胱的收缩作用，对肌蛋白受体有亲和性，可抑制阿托品无法抑制的因电刺激引起的收缩。而且可抑制刺激切断的盆神经末梢引起的膀胱收缩，表明本药可直接作用于膀胱平滑肌。

另外，本药主要代谢产物1－甲基－4－哌啶基－二苯基丙氧基乙酸－*N*－氧化物（本药的*N*－氧化物，以下简称为M－1）直接作用于平滑肌，1－甲基－4－哌啶基－苯甲酸－*N*－氧化物（M－1的脱丙基诱导体，以下简称为M－2）有抗胆碱作用。

由此，本药可直接作用于平滑肌，并有抗胆碱作用，但主要是因为其直接抑制平滑肌而抑制排尿运动。

4．毒理研究：大鼠50mg/（kg·d）连续给药52周，出现体重增加抑制，血液尿素氮氮水平增加，血脂下降，肝脏重量增加，组织学检查见肝脏脂肪沉着、滑面内织网增加。犬口服本药3mg/kg以上剂量，出现肝脏重量增加。

【药代动力学】健康成年男子经口给以本药20mg，测定血浆及尿中药物原形和代谢物。

1．单次给药：药物原形、M－1、M－2和2－苯基－1－（2－羟基）丙氧基乙酸（脱哌啶基，氢氧化诱导体，以下简称为M－3）的t_{max}分别为0.8（0.6）小时、0.6（0.2）小时、2.3（1.5）小时、3.0（1.1）小时，C_{max}分别为104.0（20.2）ng/ml、576.3（157.0）ng/ml、20.5（9.3）ng/ml、3.7（0.4）ng/ml。

另外，0～48小时尿中排泄主要代谢物为M－1、M－2和2，2－二苯基－5－甲基－1，4－二氧六烷－3酮（M－3的脱水诱导体），它们的总排泄量约为给药量的16%。

2．连续给药：1日1次，连续给药7天，测血浆中药物原形的浓度（C_{max}、C_{min}），第1～3日其值逐渐上升，第4～7日其值达稳态，给药结束后半衰期约为25小时。

此外，主要代谢物M－1的血药浓度（C_{min}）呈现同样变化，给药结束后半衰期约为14小时。

【药物相互作用】与抗胆碱药、三环类抑郁药、吩噻嗪类药、单胺氧化酶抑制剂合用，可能增强抗胆碱作用。

【不良反应】

1．严重的不良反应

（1）本药的不良反应

①急性青光眼发作：偶见眼内压增高，引起青光眼急性发作，眼痛、视力低下并伴有恶心、头痛，应注意观察。出现以上症状要及时停药，给以适当处置。

②尿闭：有时可引起尿闭，应注意观察，及时停药并给以适当处置。

③麻痹性肠梗阻：偶见麻痹性肠梗阻，注意观察，出现明显便秘、腹部胀满应停药，进行适当处置。

④幻觉、谵妄：偶引起幻觉、谵妄，注意观察，并及时停药。

（2）类似药的不良反应：房室传导阻滞、室性心动过速：服用类似药盐酸双苯丁胺，有引起心动过缓、Q－T间期延长、房室传导阻滞的报导。

2．其他不良反应

（1）过敏反应：偶有瘙痒，荨麻疹、药疹发生，注意及时停药。

（2）循环系统：有时可引起心悸、偶见心动过缓、心律不齐、胸部不适，应注意观察，若发现异常，及时停药，并进行适当处理。

（3）神经系统：有时可引起眩晕、头痛、困倦、麻木等症状。此外，偶见帕金森症的下肢僵直，小碎步行走，以及振颤等症状，若发现，应停药，进行适当处理。

（4）泌尿系统：有时可引起排尿困难、无尿意、尿液残留等现象。

（5）眼：有时可引起眼调节障碍。

（6）消化系统：口渴，有时可引起便秘、腹痛、恶心、腹泻、消化不良、呕吐、食欲减退。

（7）肝脏：有时可引起GOT、GPT、Al－P值升高。

（8）肾脏：有时可引起BUN、肌酸值升高。

（9）血液：有时可引起白细胞减少。

（10）其他：有时可引起浮肿、倦怠、无力、腰痛、声音嘶哑、痰液黏稠。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸丙哌维林片	化学药	HZ003930

HY002168 盐酸博安霉素

【其他名称】盐酸博莱霉酰精胺

【外文名称】Boanmycin Hydrochloride

【分子式】$C_{60}H_{96}N_{20}O_{21}S_2 \cdot nHCl$

【分子量】1497.66

药物药理信息

【药理毒理】博安霉素对多种小鼠移植性肿瘤包括肉瘤180、肝癌、艾氏癌（实体型），食管癌SGA－73和黑色素瘤HP，均有非常显著的抑制作用，抑瘤率达85%～90%。体外试验对数种人癌细胞株有明显杀伤作用，其中尤其以对肝癌BEL－7402细胞的杀伤作用最强。博安霉素对在裸鼠移植的人体肝癌、胃癌和结肠癌均有显著的抑制作用，肿瘤抑制率为74%～90%。本品对小鼠一次静脉和肌肉给药的LD_{50}分别为97.8mg/kg和70.5mg/kg。狗和大鼠长期给药后，主要引起肾功能损害。本品对兔一次肌注，未见局部刺激性。

【药代动力学】本品肌注吸收迅速，血药浓度达峰的平均时间为18.6分钟，平均峰浓度为0.20μg/ml，240分钟后降至0.01μg/ml。

【不良反应】本品可引起发热、寒战、肌肉疼痛、消化道反应，皮肤色素沉着。个别病人有过敏反应。肺毒性较同类药物轻，不排除长期用药导致肺纤维化的可能。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸博安霉素	化学药	HZ005059

HY002169 盐酸博莱霉素

【其他名称】Blenox－ane、Bleo、Bleomycin、BLM、急光霉素

【外文名称】Bleomycin Hydrochloride

【分子式】$C_{55}H_{84}ClH_{17}O_{21}S_3$

【性状及组成】本品系日本梅泽滨夫自轮状链丝菌培养液中提取的一种碱性水溶性糖肽类抗肿瘤抗生素，含有13种组分的复合物，日本的博莱霉素制品的主要成分为A2（占55%～77%）。

本品为白色或黄白色粉末，易溶于水，微溶于乙醇，几乎不溶于丙酮、乙酸乙酯及乙醚。

药物药理信息

【药理毒理】本品具有广谱抗癌作用，能与DNA结合，这种结合一部分系通过嵌合机制，但并不影响核酸的二级结构，可使DNA分子发生单链或双链断裂。研究表明，在DNA结构的破坏上，博莱霉素需要有O_2和Fe^{2+}的存在。DLM被认为是一种金属螯合物，能与Fe^{2+}形成Bleomycin Fe^{2+}复合物，这一复合物能为氧分子（O_2）提供电子，形成过氧化物和羟基，正是这些高度活性的中间产物最后破坏DNA，引起DNA分子断裂。在正常细胞和肿瘤细胞内BLM的钝化酶、酶活性低的正常组织，如肺、皮肤和某些肿瘤组织对BLM特别敏感。

本品为细胞周期非特异性药物，即能杀伤增殖细胞，又能杀伤非增殖细胞，M期细胞对之最敏感，其次为G2期细胞，它可命名细胞阻断在G2期，G1期细胞对之耐药力最强。

另外，本品可增强放谢性杀伤肿瘤细胞的作用。

【药代动力学】本品口服吸收不佳，需通过胃肠外给药，如静脉、肌肉、皮下或动脉注射。

药物生物活性分布研究表明，在皮肤、肺、膀胱、肾分布最多。而肝、脾内是以不活化形式存在，证明不影响造血功能。成人静脉注射15mg后。血浓度立即达3μg/ml，1小时后＜0.5μg/ml。肌内注射的血中最大浓度是静脉注射时的1/3。24小时内，静脉注射量38.3%、肌内注射的19.2%从尿中排泄，静脉注射15mg1小时后，尿中浓度达到峰值30.7μg/ml，然后下降，半衰期58.6分钟，48小时后，约80%以原形从尿中排出。

只要肌酐清除率超过35ml/min，其排泄基本上不受肾脏疾病的影响。然而因肾脏是药物主要排泄器官，所以肾功能衰竭的患者应避免使用本药或减量。

因代谢药物的酶在肝肾中丰富而在肺和皮肤中则缺乏，故毒性易出现在肺和皮肤，其毒性大小取决于肺和皮肤中的药量。

【药物相互作用】

1．抗肿瘤药物：合并使用时应注意有诱发间质肺炎、肺纤维化可能。

2．放射线照射：有诱发间质肺炎、肺纤维化可能。头颈部放疗可加重口内炎、口角炎、喉头黏膜炎，诱发黏膜炎症。

【不良反应】

1．肺毒性：潜在的致死性肺毒性可见于接受该药患者的10%～20%。年龄超过70岁，化疗前曾接受胸部放疗以及总量超过400U者更易发生。临床表

现初发症状为干咳、低热、呼吸困难等；病理征象包括肺泡内皮细胞坏死，Ⅱ型细胞的不典型增生，透明膜形成，肺泡巨噬细胞增多，以及最后阶段的肺间质纤维化。

2. 皮肤反应：色素沉着，脱发，手足以及身体受压处皮肤脱屑，手指手背肥厚，足部肿大，四肢末端变硬、变黑或硬结，手足指胀痛。

3. 全身反应：部分患者于给药3~6小时后出现发冷、发热，部分患者在第1~2次给药时可出现高热、低血压、过敏性休克、瘙痒性红斑。

4. 胃肠道反应：恶心，呕吐，口炎等均较少见。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸博莱霉素	化学药	HZ005060

HY002170　盐酸布比卡因

【外文名称】Bupivacaine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】1-丁基-*N*-（2,6-二甲苯基）-2-哌啶甲酰胺盐酸盐一水合物

【分子式】$C_{18}H_{28}N_2O\cdot HCl\cdot H_2O$

【分子量】342.91

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，味苦。本品在乙醇中易溶，在水中溶解，在三氯甲烷中微溶，在乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：局麻药。

本品为酰胺类长效局部麻醉药，其麻醉时间比盐酸利多卡因长2~3倍，弥散度与盐酸利多卡因相仿．对循环和呼吸的影响较小，对组织无刺激性，不产生高铁血红蛋白，常用量对心血管功能无影响，用量大时可致血压下降，心率减慢。对β-受体有明显的阻断作用，无明显的快速耐受性。母体的药物血浓度为胎儿药物血浓度的4倍。

【药代动力学】本品一般在给药5~10分钟作用开始，15~20分钟达高峰，维持3~6小时或更长时间。本品血浆蛋白结合率约95%，大部分经肝脏代谢后经肾脏排泄，仅约5%以原形随尿排出。

【药物相互作用】与碱性药物配伍会产生沉淀失去作用。

【药物过量】使用时不得过量，过量可致高血压、抽搐、心搏骤停、呼吸抑制及惊厥。

【不良反应】

1. 少数患者可出现头痛、恶心、呕吐、尿潴留及心率减慢等。如果出现严重副反应，可静脉注射麻黄碱或阿托品。

2. 过量或误入血管可产生严重的毒性反应，一旦发生心肌毒性几无复苏希望。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方明矾布比卡因注射液	化学药	HZ001321
盐酸布比卡因注射液	化学药	HZ003931

HY002171　盐酸布桂嗪

【外文名称】Bucinnazine Hydrochloride

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】1-正丁酰基-4-肉桂基哌嗪盐酸盐

【分子式】$C_{17}H_{24}N_2O\cdot HCl$

【分子量】308.85

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，有异臭，味苦。本品在水或三氯甲烷中易溶，在乙醇中溶解，在苯中不溶。

熔点：本品的熔点为204~208℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：镇痛药。

本品为速效镇痛药，镇痛作用为吗啡的1/3，但比解热镇痛药强，为氨基比林的4~20倍。对皮肤、黏膜、运动器官（包括关节、肌肉、肌腱等）的疼痛有明显的抑制作用，对内脏器官疼痛的镇痛效果较差。无抑制肠蠕动作用，对平滑肌痉挛的镇痛效果差。与吗啡相比，本品不易成瘾，但有不同程度的耐受性。

【药代动力学】本品口服后，易由胃肠道吸收，口服后10~30分钟起效，镇痛效果维持3~6小时。本品主要以代谢形式从尿与粪便中排出。皮下注射10分钟起效，镇痛效果维持3~6小时。皮下注射后20分钟血药浓度达峰值。本品主要以代谢形式从尿与粪便中排出。

【不良反应】

1. 少数病人可见有恶心、眩晕或困倦、黄视、全身发麻感等，停药后可消失。

2. 本品引起依赖性的倾向与吗啡类药相比为低，据临床报道，连续使用本品，可耐受和成瘾，

故不可滥用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸布桂嗪片	化学药	HZ003932
盐酸布桂嗪注射液	化学药	HZ003933

HY002172 盐酸布库洛尔

【其他名称】Cscumarol、香豆心安

【外文名称】Bucumolol Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】本品具有 β_1 和 β_2 受体阻滞作用，其强度为普萘洛尔的 2 倍，亦具有奎尼丁样作用和局麻作用，但较普萘洛尔低；无内源性拟交感神经作用，对中枢神经系统、平滑肌及消化系统均无明显影响。临床用于治疗心绞痛和心律失常，对窦性心动过速、室上性期外收缩、室性期外收缩较为有效。

本品毒性较普萘洛尔小，小鼠和大鼠口服的 LD_{50}分别为 1259～1318mg/kg 和 676～692mg/kg。无慢性毒性，无致畸作用，亦未见致突变和抗原性。

【药代动力学】本品口服易吸收，大约 2h 血药和组织浓度达峰值。体内部分被代谢成 5－羧酸。由尿和粪便排泄。$t_{1/2}$为 2.4～4.6h。连续给药无蓄积作用。

【药物相互作用】与拟交感神经系统的药物如利血平合用时，会发生过度抑制，应慎用或减量；与口服降血糖药物合用，本品可增强降血糖作用，应慎用或间隔一定时间使用。

【不良反应】服用本品有时出现食欲减退、恶心、腹胀、口干、便秘、腹泻、头晕、头痛、困倦、咳嗽、气喘、乏力等不良反应，偶可引起充血性心力衰竭或恶化、低血压、心动过缓性水肿、窦房结传导阻滞、皮疹等不良反应，此时应停止用药。

HY002173 盐酸布尼洛尔

【其他名称】丁苄腈心安、Stresson

【外文名称】Bunitrolol Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】本品非选择性 β 受体阻断剂。β 受体阻断作用是普萘洛尔的 3 倍，具有轻度内在活性和弱的膜稳定作用。能降低血浆肾素活性。临床用于治疗高血压及心绞痛。

【药代动力学】口服吸收率为 85%～100%，血药浓度达到高峰时间为 1～2 小时，半衰期约 2 小时。

【不良反应】可见乏力、嗜睡、头晕、失眠、恶心、腹胀、皮疹、晕厥、低血压、心动过缓等。

HY002174 盐酸布替萘芬

【外文名称】Butenafine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 60 册

药物理化信息

【化学名】*N*－［4－（1,1－二甲基乙基）苄基］－*N*－甲基－1－萘甲胺盐酸盐

【分子式】$C_{23}H_{27}N \cdot HCl$

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，微有异臭，味微苦。

本品在甲醇或三氯甲烷中易溶，在乙醇中溶解，在丙酮中微溶，在水、乙醚及盐酸溶液（9→10）中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为苯甲胺衍生物，其作用机制与烯丙胺类抗真菌药相似，可能是通过抑制角鲨烯的环氧化而阻断真菌细胞膜的必需成分——麦角甾醇的生物合成。体外试验和感染临床研究（在适应症范围内）结果均表明本品对以下微生物的多数菌株均表现出抗真菌活性：絮状表皮癣菌、石膏样癣菌、红色癣菌和断发癣菌。

遗传毒性：细菌回复突变试验、中国仓鼠淋巴细胞染色体畸变试验、大鼠微核试验结果均未表现出潜在的致突变作用。

生殖毒性：本品皮下给药剂量达每日 150mg/m^2（为临床推荐治疗脚癣最大剂量每日 30mg/m^2 的 5 倍和临床推荐治疗体癣最大剂量每日 24mg/m^2 的 6 倍）时对雌雄动物的生育力无影响。怀孕大鼠或家兔在致畸敏感期经皮下或皮肤局部给药，剂量达每日 150～300mg/m^2 时，未见致畸作用，但是，目前尚无充分和严格控制的孕妇临床研究资料。因为动物生殖研究并不总能预测药物对人的影响，所以只有当确实需要时才可以在怀孕期间使用本品。

【药代动力学】国内目前尚缺乏本品详细的药代动力学研究资料。

据 Physician's Desk Reference（54 版）介绍，在一项对健康受试者进行的为期 14 天的对比研究中，将 6g 1%盐酸布替萘芬乳膏涂抹于 7 名受试者的背部皮肤（3000m^2），一天 1 次；同时，将 20g 1%盐酸布替萘芬乳膏该药涂抹于另 12 名受试者的手臂、躯干、腹股沟（10000cm^2），一天 1 次。研究结果表明，用

药 14 天后，6g 剂量组盐酸布替萘芬平均血药峰浓度（C_{max}）为（1.4 ± 0.8）ng/ml，相应的血药浓度达峰时间（t_{max}）为（15 ± 8）小时，平均 $AUC_{0\to 24h}$ 为（23.9 ± 11.3）ng·h/ml；对 20g 剂量组，盐酸布替萘芬平均血药峰浓度为（5.0 ± 2.0）ng/ml，相应的血药浓度达峰时间为（6 ± 6）小时，平均 $AUC_{0\to 24h}$ 为（87.8 ± 45.3）ng·h/ml；血浆盐酸布替萘芬消除相呈双相型，估算的计其半衰期约为 35 小时到大于 150 小时；最后一次给药后 72 小时，6g 剂量组血药浓度降为（0.3 ± 0.2）ng/ml；12g 剂量组血药浓度降为（1.1 ± 0.9）ng/ml；最后一次给药后 7 天后，盐酸布替萘芬血药浓度降到很低，6g 剂量组的维持浓度为（0.1 ± 0.2）ng/ml，12g 剂量组的维持浓度为（0.7 ± 0.5）ng/ml；由皮肤吸收进入循环系统的盐酸布替萘芬总量目前还未测定，尿中代谢物为叔丁基侧链羟化产物。

11 名足癣患者将 1% 盐酸布替萘芬乳膏涂于患处，每天 1 次，连用 4 周，在 1，2，4 周给药后 10 ~ 20 小时内采血，盐酸布替萘芬血药浓度低于 0.3ng/ml。

24 名体癣患者将 1% 盐酸布替萘芬乳膏涂于患处，每天 1 次，平均用药剂量为（1.3 ± 0.2g），连用 4 周，在最后一次给药后 0.5 ~ 65 小时内采血，盐酸布替萘芬血药浓度为低于检测限 - 2.52ng/ml，平均值为（0.91 ± 0.15）ng/ml。停药后 4 周，盐酸布替萘芬血药浓度为低于检测限 - 2.8ng/ml。

【药物相互作用】 布替萘芬不抑制细胞色素 P450 酶，不影响肾上腺及性腺激素合成。

【药物过量】 目前尚未见有过量使用的报道。

【不良反应】 皮肤局部的不良反应包括烧灼感、螫刺感、红斑、瘙痒、局部刺激等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸布替萘芬搽剂	化学药	HZ003934
盐酸布替萘芬喷剂	化学药	HZ003935
盐酸布替萘芬乳膏	化学药	HZ003936

HY002175　盐酸川芎嗪

【外文名称】 Ligustrazine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 化学药品地标升国标·第 5 册

药物理化信息

【化学名】 2,3,5,6 - 四甲基吡嗪盐酸盐二水化合物

【分子式】 $C_8H_{12}N_2 \cdot HCl \cdot 2H_2O$

【分子量】 208.69

药物药理信息

【药理毒理】 本品具有抗血小板聚集，并对已聚集的血小板有解聚作用。此外，本品尚有扩张小动脉、改善微循环和增加脑血流量，从而产生抗血栓和溶血栓的作用。

1. 钙拮抗作用：川芎嗪明显拮抗钙调素激活的核苷酸磷酸二酯酶活性，对电位依赖性钙通道的阻滞作用明显强于受体操纵性钙通道。

2. 抗氧化作用：川芎嗪抑制自由基的生成，有效清除氧自由基，其脑保护作用优于超氧化物歧化酶。

3. 改善血液流变学：川芎嗪有提高红细胞和血小板表面电荷，抑制血小板聚集及血栓形成，缩短血栓长度，改善血液流变学特性等作用。动脉狭窄等病理改变可造成某些血管段异常高的剪切条件，体内、体外实验均证实川芎嗪有抑制 SIPA（剪切诱导血小板聚集）的作用。而 Aspirin 不能抑制剪切应力诱导的聚集。

4. 阻断缺血再灌注损伤（I/R）、抑制细胞凋亡：川芎嗪通过抗氧化、抑制炎性、保护内皮细胞、抑制钙超载等作用对心、脑、肝、肾、脊髓等多个组织脏器 I/R 的发生途径有明确的阻断作用，抑制细胞凋亡，充分发挥组织保护作用。

5. 抗纤维化作用：许多细胞的增殖与细胞内的 Ca^{2+} 和钙调素有关，已经发现钙通道和钙调素阻滞剂可显著地抑制培养的人胚肺成纤维细胞的增殖。研究证实，川芎嗪可降低博莱霉素所致鼠肺纤维化组织钙含量及钙调素活性，防治鼠肺纤维化。

【药物相互作用】 不宜与碱性注射剂一起配伍。

【不良反应】 偶有口干，嗜睡等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
丹参川芎嗪注射液	化学药	HZ000627
参芎葡萄糖注射液	化学药	HZ003194
盐酸川芎嗪氯化钠注射液	化学药	HZ003937
盐酸川芎嗪葡萄糖注射液	化学药	HZ003938
盐酸川芎嗪注射液	化学药	HZ003939
注射用盐酸川芎嗪	化学药	HZ005061

HY002176　盐酸春雷霉素

【外文名称】 Kasugamycin Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第8册

药物理化信息

【化学名】[5－氨基－2－甲基－6－（2,3,4,5,6－五羟基环己基氧代）四氢吡喃－3－基]氨基－α－亚氨醋酸盐酸盐一水化合物

【分子式】$C_{14}H_{25}N_3O_9 \cdot HCl \cdot H_2O$

【分子量】433.84

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末，无臭。

本品在水中易溶，在乙醇、三氯甲烷、丙酮中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗生素类药。

注射用盐酸春雷霉素曾用于临床，但因本品毒性大，2003年5月7日国家食品药品监督管理局公布第二批停止使用药品名单时撤销该药品的批准文号。

HY002177 盐酸达克罗宁

【外文名称】Dyclonine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第1册

药物理化信息

【化学名】4－丁氧基－β－哌啶基苯丙酮的盐酸盐

【分子式】$C_{18}H_{27}NO_2 \cdot HCl$

【分子量】325.88

【性状及组成】本品为白色或几乎白色的结晶或结晶性粉末，无臭，味微苦，随后有麻痹感。

本品在乙醇中溶解，在水中略溶，在丙酮中微溶，在乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为172～176℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为既非酯族又非酰胺族局麻药，能溶于水。能阻断各种神经冲动或刺激的传导，抑制触觉，压觉和痛觉。适用于黏膜麻醉，但不宜作注射麻醉或浸润麻醉。可用于烧伤、皮肤擦伤、痒疹、溃疡、褥疮等。

本品对皮肤有优异的止痛、止痒功效，并有相当强的杀菌消炎作用。

本品穿透力强，可通过皮肤及黏膜吸收，作用迅速而持久，强度和维持时间与普鲁卡因近似，毒性小，滴入结膜不致引起瞳孔缩小或扩大。

【不良反应】可能有轻度刺激或刺痛。敏感者罕见，低毒，变态反应亦少见，可见有荨麻疹、肿胀和水肿等不良反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
达克罗宁氯己定硫软膏	化学药	HZ000615
复方苯海拉明克罗米通酊	化学药	HZ001084
复方苯海拉明克罗米通乳膏	化学药	HZ001085
复方达克罗宁薄荷溶液	化学药	HZ001124
复方氯己定达克罗宁乳膏	化学药	HZ001300
复方氯己定地塞米松膜	化学药	HZ001301
盐酸达克罗宁胶浆	化学药	HZ003940

HY002178 盐酸大观霉素

【外文名称】Spectinomycin Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】[2*R*－（2α，4aβ，5aβ，6β，7β，8β，9α,9α,3α,10aβ)]十氢－4α,7,9－三羟基－2－甲基－6,8－双甲氨基－4*H*－吡喃并[2，3－*b*][1,4]苯并二氧六环－4－酮二盐酸盐五水合物

【分子式】$C_{14}H_{24}N_2O_7 \cdot 2HCl \cdot 5H_2O$

【分子量】495.35

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末。

本品在水中易溶，在乙醇、三氯甲烷或乙醚中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并稀释制成每1ml中含100mg的溶液。依法测定，比旋度为+15°至+21°。

按无水物计算，每1mg的效价不得少于779大观霉素单位。

药物药理信息

【药理毒理】本品为链霉菌 *Streptomyces spectabilis* 产生的氨基糖苷类抗生素。主要对淋病奈瑟菌有高度抗菌活性，对产生β内酰胺酶的淋病奈瑟菌也有良好的抗菌活性；对许多肠杆菌科细菌具中度抗菌活性。普罗菲登菌和铜绿假单胞菌通常对本品耐药；对本品耐药的菌株往往对链霉素、庆大霉素、妥布霉素等仍敏感。本品对溶脲支原体有良好作用，对沙眼衣原体和梅毒螺旋体无活性。

本品的作用机制是与细菌核糖体30S亚单位结合，抑制细菌蛋白质的合成。

【药代动力学】本品肌内注射吸收良好。一次肌内注射本品2g后，1小时达血药峰浓度（C_{max}），约

为100mg/L，8小时血药浓度为15mg/L，剂量加倍则血药浓度亦约增加1倍。与血清蛋白不结合。血浆消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为1～3小时，肾功能减退者（肌酐清除率<20ml/min）可延长至10～30小时。本品主要以原形经肾排出，一次给药后48小时内尿中以原形排出约100%。

血液透析可使本品的血药浓度降低约50%

【药物相互作用】据文献资料报道，本品与碳酸锂合用，可使碳酸锂在个别患者身上出现毒性作用。

【不良反应】个别患者偶可出现注射部位疼痛、短暂眩晕、恶心、呕吐及失眠等；偶见发热、皮疹等过敏反应和血红蛋白、红细胞压积减少、肌酐清除率降低，以及碱性磷酸酶、尿素氮和血清氨基转移酶等升高。也有尿量减少的病例发生。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸大观霉素	化学药	HZ0005062

HY002179　盐酸氮芥

【外文名称】Chlormethine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】*N*－甲基－*N*－（2－氯乙基）－2－氯乙胺盐酸盐

【分子式】$C_5H_{11}Cl_2N\cdot HCl$

【分子量】192.52

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，有引湿性与腐蚀性。本品在水中极易溶解，在乙醇中易溶。

熔点：本品的熔点为108－111℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗肿瘤药。

本品为双功能烷化剂，主要抑制DNA合成，同时对RNA和蛋白质合成也有抑制作用。其作用机制是氮芥可与鸟嘌呤第7位氮呈共价结合，产生DNA的双链内交叉联结或DNA的同链内不同碱基的交叉联结，阻止DNA复制，造成细胞损伤或死亡。对肿瘤细胞的G_1期和M期杀伤作用最强，大剂量时对各期细胞均有杀伤作用，属细胞周期非特异性药物。动物实验证实氮芥对大鼠金生肉瘤、瓦克癌肉瘤256、吉田肉瘤腹水型和小鼠淋巴瘤等有明显抑制作用。对动物毒性主要表现为明显的胃肠道反应和骨髓抑制。

【药代动力学】氮芥进入血中后迅速与水或细胞的某些成分结合，在血中停留时间只有0.5～1分钟，即有90%以上从血中消除，迅速分布于肺、小肠、脾脏、肾脏、肝脏及肌肉等组织中，脑中含量最少。氮芥的半衰期很短，从狗的实验中证明，血药浓度在48分钟内减低65%～90%，在小鼠10分钟内减低95%。由于药物变化较快，原形物从尿中排出不到0.01%。给药后6小时与24小时血中及组织中含量很低，20%的药物以二氧化碳形式经呼吸道排出，有多种代谢产物从尿中排除。

【药物过量】剂量按体重超过0.6mg/kg可导致中枢神经系统毒性，严重骨髓抑制及心脏毒性。

【不良反应】骨髓抑制：主要表现为白细胞和血小板减少，严重时可导致全血细胞减少。白细胞下降最低值在注射本品后第7～10天，停药1～2周后多可恢复。胃肠道反应：恶心、呕吐常出现于注射后3～6小时，可持续24小时。生殖功能影响：包括睾丸萎缩、精子减少、精子活动能力降低和不育，妇女可致月经紊乱、闭经。其他不良反应还包括脱发、乏力、头晕、注射于血管外时可引起溃疡。局部涂抹可产生迟发性皮肤过敏反应。常规剂量氮芥对肝肾功能无明显影响。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸氮芥搽剂	化学药	HZ003941
盐酸氮芥酊	化学药	HZ003942
盐酸氮芥注射液	化学药	HZ003943

HY002180　盐酸氮革斯汀

【外文名称】Azelastine Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】盐酸氮革斯汀（简称AZT）是一强力、可口服的长效抗哮喘非类固醇类药物，结构独特。

1．盐酸氮革斯汀及其主要代谢产物是组胺H_1受体拮抗剂，具有抗炎、抗变态反应、平喘等多种作用：

2．抑制白三烯的合成与释放。

3．对多种化学介质（组胺、白三烯、5－羟色胺、乙酰胆碱、缓激肽和血小板和血小板激活因子等）具有拮抗作用。

4．抑制组胺的释放，但对自发性组胺的释放过程几乎无影响。

5．抑制Ⅰ型变态反应和Ⅲ型变态反应。

6．此外，已证明本品还能增加β－受体的数目，防止由叔丁喘宁引起的β－受体下降调节，并加速

已减敏的 β－受体恢复。减缓 β－受体激动剂耐药性的发生。更为重要的是，该药还可以减少激素依赖性病人口服维持激素的用量，大大减轻激素引起的医源性副作用。

盐酸氮䓬斯汀已在支气管哮喘、变应性鼻炎（季节性和长年性）患者进行评价。其中 51 例轻中度支气管哮喘患者，每日口服该药 4mg，2 周后，52%的患者症状获得明显改善，第 4 周和第 6 周末，各自有 74%和 81%的患者有显著改善。盐酸氮䓬斯汀对支气管哮喘患者产生显著和持久的支气管扩张作用。每天口服本品 4mg 与每天口服酮替酚 2mg 或每日口服茶碱缓释剂 700mg 的效果相当。

2．遗传毒性：Ames 实验、DNA 损伤修复试验、小鼠淋巴细胞正向突变试验、小鼠微核试验及大鼠骨髓染色体畸变试验均未发现遗传毒性。

3．生殖毒性：大鼠口服盐酸䓬斯汀 30mg/（kg·d）（以 mg/m² 计，为人鼻腔内给药临床最大推荐剂量的 240 倍）时，对雌雄大鼠的生育力未见影响。口服 68.6mg/（kg·d）（以 mg/m² 计，为人鼻腔内给药临床最大推荐剂量的 550 倍），大鼠的动情同期延长，交配活动及怀孕数量减少。黄体数及植入数降低，但植入率不受影响。小鼠口服 68.6mg/（kg·d），显示有胚胎毒性、胎儿毒性和致畸性（外观及骨骼异常）。大鼠口服 30mg/（kg·d），发现骨化延迟（掌骨未发育），第 14 肋骨的发生率增加。大鼠口服 68.6mg/（kg·d），造成流产和胎儿毒性。这些在高暴露量下观察到的骨骼异常与人类的相关性尚不清楚。本品是否在人乳中分泌尚不清楚。

致癌试验：大鼠和小鼠口服盐酸氮䓬斯汀 30mg/（kg·d）和 25mg/（kg·d）（mg/m² 计，为人鼻腔内给药临床最大推荐剂量的 240 和 100 倍），连续 24 个月，未发现致癌性。

【药代动力学】 本品口服后 4～5 小时血药浓度达高峰，半衰期为 16 小时。

盐酸氮䓬斯汀鼻腔用药的药代动力学研究较少。有文献报道 0.56mg 鼻腔给药后平均稳态血浆浓度正常人为 0.26μg/L，鼻炎患者为 0.65μg/L，这可能是由于鼻炎患者的鼻黏膜通透性增加的结果。鼻腔给药约 10 分钟起效，药效可持续 10～12 小时，2～3 小时后达到稳态血药峰浓度，生物利用度可达到 40%。

代谢与消除：盐酸氮䓬斯汀在细胞色素酶 P450 作用下经过氧化代谢生成主要活性成分脱甲基氮䓬斯汀，鼻喷雾剂给药由于主要代谢产物脱甲基氮䓬斯汀浓度低于分析检测限，因此未能检测。鼻喷雾剂给药后，当盐酸氮䓬斯汀达到稳态时，脱甲基氮䓬斯汀的血药浓度是氮䓬斯汀的 20%～50%。

体外实验表明血浆蛋白与盐酸氮䓬斯汀和脱甲基氮䓬斯汀结合率分别为 88%和 97%。

鼻腔用药后，盐酸氮䓬斯汀的消除仍然是通过粪便和尿排出。

【药物相互作用】 在饮酒或使用中枢神经系统抑制剂时，禁用本品，否则会加重中枢神经系统抑制。口服盐酸氮䓬斯汀（4mg，2 次/天），同时口服西咪替丁（150mg，2 次/天）可使盐酸氮䓬斯汀的生物利用度提高 65%。口服盐酸氮䓬斯汀同时分别口服红霉素（500mg，3 次/天，连续 7 天）和酮康唑（200mg，2 次/天，连续 7 天），红霉素对盐酸氮䓬斯汀的药代动力学和 Q－T 间期无影响。酮康唑对 Q－T 间期无影响，但对盐酸氮䓬斯汀的血药浓度测定有干扰。

【药物过量】 临床研究表明，成人一次口服 16mg 不会增加不良反应。到目前为止尚不知道盐酸氮䓬斯汀的解药，如使用药物过量应立即采取相应的措施。

【不良反应】 盐酸氮䓬斯汀通常具有很好的耐受性，不良反应轻微、短暂。最常见的不良反应是味觉异常和嗜睡，但中止治疗者不到 2%。每日口服本品 2～4mg 不比每天服用特非那丁（非嗜睡作用的抗组胺药）120mg 产生更大的镇静作用。本品作用机制与 H_1 受体阻断剂不同，对心脏副作用小，使用安全、可靠。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸氮䓬斯汀鼻喷雾剂	化学药	HZ003944
盐酸氮䓬斯汀片	化学药	HZ003945

HY002181 盐酸地尔硫䓬

【外文名称】 Diltiazem Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 顺－（＋）－5－［（2－二甲氨基）乙基］－2－（4－甲氧基苯基）－3－乙酰氧基－2,3－二氢－1,5－苯并硫氮杂䓬－4（5H）－酮盐酸盐

【分子式】 $C_{22}H_{26}N_2O_4S\cdot HCl$

【分子量】 450.99

【性状及组成】 本品为白色或类白色的结晶或结晶性粉末，无臭，味苦。本品在水、甲醇或三氯甲烷中易溶，在乙醚或苯中不溶。

熔点：本品的熔点为 210～215℃，熔融时同时分解。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为 + 115°至 + 120°。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：钙通道阻滞药。

本品为钙离子通道阻滞药，作用与心肌或血管平滑肌膜除极时抑制钙离子内流有关。

抗心绞痛的作用和机制：本品可使心外膜、心内膜的冠状动脉扩张，缓解自发性或由麦角新碱诱发冠状动脉痉挛所致心绞痛；在劳力性心绞痛，本品扩张周围血管，降低血压和减慢心率，减轻心脏工作负荷，从而减少氧的需要量，增加运动耐量并缓解劳力性心绞痛。用于治疗高血压，本品使血管平滑肌松弛，周围血管阻力降低，血压下降，同时并不伴有反射性心动过速。

本品对心肌细胞慢钙通道的抑制使窦房结和房室结的自律性和传导性降低，故用于治疗室上性快速心律失常。由于本品能改善左室舒张功能，可用于治疗肥厚性心肌病。

致癌、致突变和生殖毒性作用：有报道大鼠服用本品 24 个月，小鼠服用本品 21 个月未发现致癌作用。体外细菌实验未发现致突变作用。动物实验证实本品对生育力无明显作用。

【药代动力学】 本品片剂口服后通过胃肠道吸收较完全（达 80%），有较强的首过效应，生物利用度为 40%。在体内代谢完全，仅 2% ~ 4% 原药由尿液排除。血浆蛋白结合率 70% ~ 80%。单次口服本品 30 ~ 120mg，30 ~ 60 分钟后可在血浆中测出，2 ~ 3 小时血药浓度达峰值，单次或多次给药血浆消除半衰期 3.5 小时。最小有效血药浓度 50 ~ 200ng/ml。

单剂口服本品缓释胶囊 120mg 后 2 ~ 3 小时可测到血浆药物浓度，6 ~ 11 小时达到血浆药物浓度高峰。单剂或多剂口服本品后的表观消除半衰期为 5 ~ 7 小时。当一日剂量由 120mg 增至 240mg，其 AUC 增加 2.6 倍。当每日剂量由 240mg 增至 360mg，其 AUC 增加 1.8 倍。仅 2% ~ 4% 原药由尿液排除。血浆蛋白结合率 70% ~ 80%。最小有效血药浓度 50 ~ 200ng/ml。

静脉注射分布相半衰期（$t_{1/2\beta}$）为 1.9 小时。

【药物相互作用】 同时用对心脏收缩和（或）传导有影响的药物，由于可能有协同作用，应用本品须谨慎和仔细滴定所用剂量。在体内由 P450 细胞色素氧化酶生物转化，同时用本品和经同一生物转化途径的其他药物可导致代谢的竞争抑制，故多种药物治疗时应谨慎。在开始或停止同时使用时，对相同代谢药物剂量特别是治疗指数低的药或有肝肾功能受损患者，须加以调整以维持合理的血药浓度。

1. β 阻滞药可能影响心脏传导，尤其在病窦综合征或有房室传导阻滞者，在左室功能受损者可影响心室功能，与本品同用均有协同作用，并且对心脏负性肌力作用也相加。例如普萘洛尔可增加本品生物利用度近 50%，因而须调整普萘洛尔剂量。

2. 西咪替丁由于抑制 P450 细胞色素而使本品血药浓度药时曲线下面积增加，因而需调整本品的剂量。雷尼替丁虽可使本品血药浓度升高，但不明显。

3. 与洋地黄同用时，对心脏传导阻滞有协同作用，因此联合应用时应谨慎。例如本品可使地高辛血药浓度增加 20%，但也有并不影响的报道，虽然结果矛盾，但在开始调整和停止本品治疗时，应监测地高辛血药浓度，以免洋地黄过量或不足。

4. 麻醉药对心肌收缩、传导、自律性都有抑制并有血管扩张作用，且与钙通道阻滞剂有协同作用，因此，此两种药同时应用时，须仔细滴定剂量。

5. 苯二氮䓬：本品可明显增加三唑仑和咪达唑仑血浆峰浓度及延长其消除半衰期。

6. 卡马西平：本品与卡马西平合用后，一些病例中可使卡马西平的血药浓度增高 40% ~ 72% 而导致毒性。

7. 环孢菌素：在心、肾移植患者中发现，本品与环孢菌素合用时，环孢菌素的剂量应降低 15% ~ 48% 以保证环孢菌素的药物浓度与合用本品前相同。二者合用时应监测环孢菌素血浆药物浓度，特别在开始、调整剂量、或停止使用本品时。环孢菌素对本品血浆药物浓度的影响尚未知。

8. 利福平：本品与利福平合用后可以明显降低本品血浆药物浓度及疗效。

【药物过量】 已报道的有关本品过量的剂量范围为小于 1g 至 10.8g。本品过量反应有：心动过缓、低血压、心脏传导阻滞和心力衰竭。过量反应可考虑应用以下方法：

1. 心动过缓，给予阿托品 0.6 ~ 1mg，如无迷走阻滞反应，谨慎应用异丙肾上腺素。

2. 高度房室传导阻滞，治疗同上，如出现持续的高度房室传导阻滞则应用起搏器治疗。

3. 心力衰竭，给予正性肌力药物（多巴胺或多巴酚丁胺）和利尿药。

4. 低血压，给予升压药（多巴胺或去甲肾上腺素）。

【不良反应】

1. 国外治疗心绞痛时以安慰剂对照试验，结果表明，本品不良反应并不比安慰剂多。

2. 临床治疗心绞痛病人观察到最常见的不良反

应和发生率为：水肿（2.4%）、头痛（2.1%）、恶心（1.9%）、眩晕（1.5%）、皮疹（1.3%）、无力（1.2%）。

3. 不常有的（小于1%）有以下情况：

（1）心血管系统：心绞痛、心律失常、房室传导阻滞（Ⅰ°、Ⅱ°、Ⅲ°），心动过缓、束支传导阻滞，充血性心力衰竭、心电图异常、低血压、心悸、晕厥、心动过速、室性期前收缩。本品延长房室交界不应期，除病窦综合征外并不明显延长窦房结恢复时间，罕见情况下此作用可异常减慢心率（特别在病窦综合征患者）或致Ⅱ°或Ⅲ°房室传导阻滞。本品与β阻滞剂或洋地黄同用可导致对心脏传导的协同作用。虽本品有负性肌力作用，但在心室功能正常的人血流动力学研究无心脏指数降低或对收缩性（dp/dt）持续负性作用。在心室功能受损的患者单用本品或与β阻滞剂同用的经验有限，因而这些患者应用本品须谨慎。低血压者用本品治疗偶可致症状性低血压。

（2）神经系统：多梦、遗忘、抑郁、步态异常、幻觉、失眠、神经质、感觉异常、性格改变、嗜睡、震颤。

（3）消化系统：畏食、便秘、腹泻、味觉障碍、消化不良、口渴、呕吐、体重增加。应用本品时急性肝损害为罕见情况，有碱性磷酸酶、乳酸脱氢酶、天门冬氨酸氨基转移酶、丙氨酸氨基转移酶明显增高和其他伴有急性肝损害现象，停药可以恢复。

（4）皮肤：瘀点、光敏感性、瘙痒、荨麻疹，注射局部发红。

（5）其他：弱视、呼吸困难、鼻衄、易激惹、高血糖、高尿酸血症、阳痿、肌痉挛、鼻充血、耳鸣、夜尿、多尿、骨关节痛。

（6）不常有的：脱发、多形性红斑、锥体外系综合征、齿龈增生、溶血性贫血、出血时间延长、白细胞减少、紫癜、视网膜病和血小板减少，亦有报道发生剥脱性皮炎。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸地尔硫䓬缓释胶囊	化学药	HZ003946
盐酸地尔硫䓬缓释片	化学药	HZ003947
盐酸地尔硫䓬缓释微丸	化学药	HZ003948
盐酸地尔硫䓬控释胶囊	化学药	HZ003949
盐酸地尔硫䓬片	化学药	HZ003950
盐酸地尔硫䓬注射液	化学药	HZ003951
注射用盐酸地尔硫䓬	化学药	HZ005063

HY002182 盐酸地芬尼多

【其他名称】戴芬逸多、二苯哌丁醇、眩晕停

【外文名称】Difenidol Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】α，α－二苯基－1－哌啶丁醇盐酸盐

【分子式】$C_{21}H_{27}NO \cdot HCl$

【分子量】345.91

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，味涩。本品在甲醇中易溶，在乙醇中溶解，在水或三氯甲烷中略溶。

熔点：本品的熔点为217～222℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：镇吐药。

本品可改善椎底动脉供血，调节前庭系统功能，抑制呕吐中枢，有抗眩晕及镇吐作用。

本品对中枢性、末梢性眩晕有治疗作用，有较强的抗眩晕及止吐作用，用于防治乘车、飞机、船引起的眩晕、恶心和呕吐，也可用于多种疾病引起的眩晕、恶心与呕吐。

【不良反应】有幻听、幻视、定向障碍、嗜睡、烦躁、抑郁等反应。极罕见的不良反应有低血压、头痛、眩晕、皮疹。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸地芬尼多片	化学药	HZ003952

HY002183 盐酸地芬诺酯

【其他名称】苯乙哌啶、氰苯哌酯

【外文名称】Diphenoxylate Hydrochloride

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】1－（3,3－二苯基－3－氰基丙基）－4－苯基－4－哌啶甲酸乙酯盐酸盐。

【分子式】$C_{30}H_{32}N_2O_2 \cdot HCl$

【分子量】489.06

【性状及组成】本品为白色或几乎白色的粉末或结晶性粉末，无臭。本品在三氯甲烷中易溶，在甲醇中溶解，在乙醇或丙酮中略溶，在水或乙醚中几

乎不溶。

熔点：本品的熔点应为 221～226℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：止泻药。

地芬诺酯是哌替啶的衍生物。对肠道作用类似吗啡，可直接作用于肠平滑肌，通过抑制肠黏膜感受器，消除局部黏膜的蠕动反射而减弱肠蠕动，同时可增加肠的节段性收缩，使肠内容物通过延迟，有利于肠内水分的吸收。适用于急、慢性功能性腹泻及慢性肠炎等。

大剂量（1 次 40～60mg）可产生欣快感，长期服用可致依赖性（但用常量与阿托品合用进行短期治疗，则产生依赖性的可能性很小）。

【药代动力学】本品口服吸收迅速，2 小时达血药高峰。在人体内主要代谢物为地芬诺辛，其止泻作用比母体强 5 倍。$t_{1/2}$为 2.5 小时，地芬诺辛为 12～24 小时。

【药物相互作用】本品可增强巴比妥类、阿片类及其他中枢抑制药的作用，不宜合用。

【不良反应】服药后偶见口干、腹部不适、恶心、呕吐、嗜睡、烦躁、失眠等，减量或停药后即消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方地芬诺酯片	化学药	HZ001130

HY002184　盐酸地拉草

【其他名称】Coratoline、Cornelian、地拉齐普、克冠二氮䓬、扩冠嗪、克冠草、双酯嗪

【外文名称】Dilazep Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 8 册

药物理化信息

【化学名】$N-N'-$双［3－（3′,4′,5′－三甲氧基苯酰氧基）丙基］全氢－1,4－二氮杂䓬二盐酸盐的一水合物

【分子式】$C_{31}H_{44}N_2O_{10}\cdot 2HCl\cdot H_2O$

【分子量】695.63

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，味苦，有引湿性。

本品在水中易溶，在甲醇或乙醇中略溶，在冰醋酸中易溶。

吸收系数：取本品，精密称定，加水制成每 1ml 中含 15μg 的溶液，照分光光度法在 265nm 的波长处测定吸光度，按干燥品计算，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为 277～294。

药物药理信息

【药理毒理】本品为抗缺血性心脏病药物，具有明显、持久的选择性扩张冠脉作用，能降低冠脉阻力，从而增加冠脉血流量。尚能促进冠脉的侧支循环，并具有抑制血小板聚集的作用。其作用机制是抑制体内腺苷分解酶，阻止腺苷的分解代谢，从而发挥腺苷的扩张冠脉作用。

【药代动力学】本品口服吸收良好，经 2～6 小时达最高血浓度，$t_{1/2}$约 24 小时。其在心肌的浓度比在脑或其他组织高 2～6 倍。

【不良反应】偶有头晕、胃肠道不适等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸地拉草胶囊	化学药	HZ003953
盐酸地拉草片	化学药	HZ003954

HY002185　盐酸地来洛尔

【外文名称】Dilevalol Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】本品是柳氨苄心定的 *RR*－立体异构体，为非心脏选择性 β 肾上腺素受体阻滞药。类似于普萘洛尔的效率，强于亲代消旋体柳氨苄心定的 3～6 倍，兼有部分 β_2 兴奋和轻度 α_1 阻滞作用。降压作用主要与外周血管扩张、体循环阻力降低有关，但心率基本保持不变，且可改善左室功能。此外，还有降低肾素、增加高密度脂蛋白和降低低密度脂蛋白、保护肾小球滤过率和有效肾血流量的作用。

【药代动力学】本品口服吸收完全，但有广泛的首过代谢，与葡糖醛酸结合。生物利用度＜30%，尿中仅有 1.25% 的原形药物。本品口服 400mg 后，50 分钟内达到血药峰浓度（220～485μg/L），血浆蛋白结合率为 75%，消除半衰期为 8～12 小时，严重肾功能不全者延至 19 小时，血透患者为 29 小时。静脉注射 50mg 后，表观分布容积约为 25L/kg，总清除率为 23ml/（kg·min）。血浆清除部位在肝脏，清除时间达 48 小时。本品主要由肾排出。

【药物相互作用】本品与氢氯噻嗪合用，可增强其降压作用。

【不良反应】机体对本品的耐受性（一日 100～1600mg）良好。常见的不良反应：

1. 眩晕，头痛和腹泻各约占 7%。
2. 肢端发冷和呼吸困难的发生率＜4%。
3. 心动过缓和心脏传导阻滞的发生率明显低于

美托洛尔或普萘洛尔。

4. 血清转氨酶升高占 2%。

5. 抗核抗体阳性占 3%。

HY002186 盐酸地美索酯

【其他名称】咳散

【外文名称】Dimethoxanate Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 4 册

【分子式】$C_{19}H_{22}N_2O_3S \cdot HCl$

药物药理信息

【药理毒理】本品为吩噻嗪类化合物，属抗组胺药，对平滑肌有微弱的解痉和轻度麻醉作用，但无中枢镇静和呼吸抑制作用。对上呼吸道感染支气管炎，尤其是对病程较短的干咳疗效明显。

本品镇咳作用比可待因弱，但没有可待因的成瘾性、依赖性。

【药代动力学】本品口服吸收快而安全，约 5～10 分钟起效，维持 4～6 小时。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸地美索酯片	化学药	HZ003955

HY002187 盐酸地匹福林

【外文名称】Dipivefrine

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（±）3,4－二羟基－α－［（甲氨基）甲基］－苯甲醇－3,4－二新戊酸酯盐酸盐

【分子式】$C_{19}H_{29}NO_5 \cdot HCl$

【分子量】387.90

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，味苦，有引湿性；与日光或空气接触易变质。

本品在水中极易溶解，在乙醇中易溶，在乙酸乙酯中极微溶解，在石油醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 161～166℃，熔距在 2℃以内。

药物药理信息

【药理毒理】地匹福林是肾上腺素的前药，本身无生物活性，进入眼组织后在催化酶的作用下，迅速水解成肾上腺素而发挥生物效应，引起散瞳、降眼压。

本品具有高度脂溶性，滴眼液滴眼后极易透过角膜屏障进入眼内。研究证明地匹福林的眼内通透性比肾上腺素强 10～17 倍。0.1%地匹福林的降眼压作用与 1%肾上腺素相当、比 2%肾上腺素略低，但散瞳作用与 2%肾上腺素相当。降眼压作用与肾上腺素一样系通过减少房水分泌和改善房水流畅系数奏效。

0.1%地匹福林溶液一滴滴眼后，30 分钟开始降眼压，1～2 小时获最大作用，维持约 10～12 小时。

与毛果芸香碱或 β－肾上腺素受体阻滞剂联合应用有相加作用。

【药物相互作用】与毛果芸香碱或 β－肾上腺素受体阻滞剂联合应用有相加作用。

【不良反应】地匹福林浓度仅为肾上腺素的 1/10～1/20，因此不良反应的发生率要比肾上腺素低得多。溶液滴眼对血压和心率影响较小。但能引起散瞳（未经手术的闭角型青光眼禁用）和无晶体性黄斑病变。局部滴眼后有轻度烧灼和刺痛感，其他有滤泡性结膜炎、结膜血管收缩后反跳性充血、视物模糊、额痛及畏光和角结膜色素沉着等，停药后消失。

全身不良反应一般不发生，偶有枕部疼痛、心律失常、心率增快、血压增高、脸色苍白、发抖和出汗等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸地匹福林滴眼液	化学药	HZ003956

HY002188 盐酸丁丙诺啡

【外文名称】Buprenorphine Hydrochloride

药物管理信息

【特殊管理分类】一类精神药

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】21－环丙基－7α［（S）－1－羟基－1,2,2－三甲基丙基］－6,14－桥亚乙基－6,7,8,14－四氢东罂粟碱盐酸盐

【分子式】$C_{29}H_{41}NO_4 \cdot HCl$

【分子量】504.11

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭。本品在乙醇中溶解，在三氯甲烷中略溶，在水中极微溶解。

比旋度：取本品，精密称定，加乙醇制成每 1ml 中含 5mg 的溶液，依法测定，比旋度应为－95°至－101°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：镇痛药。

本品为部分 μ 受体激动药，属激动－拮抗药。镇痛作用强于哌替啶、吗啡。与 μ 受体亲合力强，故可置换出结合于 μ 受体的其他麻醉性镇痛药，从而产生拮抗作用。其起效慢，持续时间长。对呼吸有抑制作用，但临床未见严重呼吸抑制发生。也能减慢心率、使血压轻度下降，对心排血量无明显影响，药物依赖性近似吗啡。可通过胎盘和血－脑脊液屏障。

对大鼠的慢性毒性研究表明，本品对重要器官未发现明显的毒性作用，无致突变作用和生殖毒性。

【药代动力学】本品舌下含片主要经颊部黏膜吸收。血浆蛋白结合率为 96%，消除 $t_{1/2}$ 为 1.2～7.2 小时不等。血药浓度与镇痛效果无明显相关性。本品在肝脏部分代谢为 *N*－脱烷基丁丙诺啡（*N*－dealkylbuprenorphine）及共轭化合物。大部分（2/3）经粪便以原形排泄，有迹象表明其中部分进入肠肝循环。经尿液排出的原形物较少，主要为代谢产物。口服有显著的首过效应。

本品注射液能迅速地被吸收，几分钟内达到血药浓度高峰，主要在肝中代谢，从胆汁排泄，粪便中排出，本品可透过血脑和胎盘屏障。临床的药代动力学报道本品的血浓度变化符合三次幂指数消除曲线，起始相快（$t_{1/2}$ 为 2 分钟），终末相慢（$t_{1/2}$ 约为 3 小时），峰值为 5 分钟，清醒时血药浓度比麻醉时低，生物利用度接近 100%，在体内几乎完全被代谢，经胆汁排泄，随粪便排出。

【药物相互作用】与单胺氧化酶抑制剂有协同作用。

【药物过量】过量引起呼吸抑制，用纳洛酮常不易拮抗，多沙普仑可能有效。

【不良反应】不良反应类似吗啡。常见不良反应有头晕、嗜睡、恶心、呕吐等。在使用其他阿片类药物的基础上使用可能有戒断症状。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸丁丙诺啡舌下片	化学药	HZ003957
盐酸丁丙诺啡注射液	化学药	HZ003958

HY002189　盐酸丁卡因

【其他名称】阿尼辛、本多卡因、地卡因、狄卡因、潘托卡因、四卡因

【外文名称】Tetracaine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】4－（丁氨基）－苯甲酸－2－（二甲氨基）乙酯盐酸盐

【分子式】$C_{15}H_{24}N_2O_2 \cdot HCl$

【分子量】300.83

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，味微苦，有麻舌感。本品在水中易溶，在乙醇中溶解，在乙醚或苯中不溶。

熔点：本品的熔点为 147～150℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：局麻药。

本品能穿透神经细胞膜，改变细胞膜对钠离子的通透性，阻止钠离子内流，从而使动作电位上升减慢，直至停止产生动作电位，神经兴奋和传导功能丧失，无法传递信息。

麻醉效力比普鲁卡因大 10～15 倍，毒性亦大 10～20 倍。用于黏膜表面麻醉、传导阻滞麻醉、硬膜外麻醉和蛛网膜下腔麻醉；也用于眼科表面麻醉，优点是不损伤角膜上皮，不升高眼内压。

开始作用慢，潜伏期为 10～15 分钟，但作用时效可长达 2～3 小时。硬膜外阻滞时起效慢，与利多卡因合用具有作用快、时效长的优点。蛛网膜下腔阻滞时，与神经组织结合快而牢固，1.5～2 分钟起效。黏膜表面麻醉时作用迅速，1～3 分钟生效，维持时间 20～40 分钟，而且无血管收缩，瞳孔扩大和腭部刺激作用，适用于眼、耳、鼻、喉科等手术。

【药代动力学】本品进入血液后，大部分和血浆蛋白结合，蓄积于组织中，骨骼肌内蓄积量最大，当血浆内的浓度下降时又释放出来。本品大部分由血浆胆碱酯酶水解转化，经肝代谢为对氨基苯甲酸与二甲氨基乙醇，然后再降解或结合随尿排出。

【药物相互作用】

1．不得与碱性药液合用。

2．如合用某些酸性药液，由于 pH 不同，也可影响本品的离解值，以致局麻减效或起效时间延迟。

3．不宜同时服用磺胺类药物。

【药物过量】大剂量可致心脏传导系统和中枢神经系统抑制。

【不良反应】

1．毒性反应：本品药效强度为普鲁卡因的 10 倍，毒性也比普鲁卡因高 10 倍，毒性反应发生率也比普鲁卡因高，常由于剂量大、吸收快或操作不当引起，如误注入血管使血药浓度过高等。用药过量的中毒症状表现为：头昏、目眩、继之寒战、震颤、恐慌、最后可致惊厥和昏迷，并出现呼吸衰竭和血压下降，需及时抢救。

2. 变态反应：对过敏患者可引起猝死，即使表面麻醉时也需注意。

3. 可产生皮疹或荨麻疹，颜面、口或（和）舌咽区水肿等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方庆大霉素膜	化学药	HZ001352
复方四环素泼尼松膜	化学药	HZ001397
复方西吡氯铵含片	化学药	HZ001436
盐酸丁卡因片	化学药	HZ003961
盐酸丁卡因溶液	化学药	HZ003962
注射用盐酸丁卡因	化学药	HZ005064

HY002190 盐酸丁咯地尔

【外文名称】Buflomedil Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第49册

药物理化信息

【化学名】4－（1－吡咯烷基）－1－（2,4,6－三甲氧基苯基）－1－丁酮盐酸盐

【分子式】$C_{17}H_{25}NO_4 \cdot HCl$

【分子量】343.85

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，味略苦。

本品在水、甲醇或三氯甲烷中易溶，在乙醇中溶解，在乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点应为194～198℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】本品为α－肾上腺素能受体抑制剂，并具有较弱的非特异性钙离子拮抗作用。通过抑制毛细血管前括约肌痉挛而改善大脑及四肢微循环血流。本品还具有抑制血小板聚集和改善红细胞变形性的功能。

【药代动力学】盐酸丁咯地尔经静脉输注后，广泛分布于组织和体液，经肝脏代谢，消除半衰期约3小时，盐酸丁咯地尔主要以原形和芳香环去甲基代谢物由尿排出。盐酸丁咯地尔的血清蛋白结合率与血药浓度有关：血药浓度为0.5mg/L时，血清蛋白结合率为81%；血药浓度为5mg/L时，血清蛋白结合率为25%。

【药物相互作用】正在服用抗高血压药物患者慎用。

【药物过量】在有意或意外过量用药的情况下，迅速（约15分钟）出现神经系统症状（癫痫发作/癫痫持续状态），随后可能会出现心血管症状（窦性心动过速，低血压，严重室性心律失常，传导阻滞，尤其是室性传导阻滞），患者可能迅速发展成昏迷甚至血液循环停止。这些与抗抑郁药丙咪嗪用药过量的临床表现非常相似。

患者应紧急送医院急救，按药物过量进行对症抢救治疗，应立刻给予辅助呼吸，并进行神经和心电图监护。

【不良反应】偶有胃肠不适（胃灼热感、胃痛、恶心）、头痛、头晕、嗜睡、失眠、四肢灼热感、皮肤潮红或瘙痒。罕有心悸、房颤、血清肌酐水平升高，尿量增加、月经量改变、动脉高血压（arterial hypertension）、鼻出血和银屑病的报道。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸丁咯地尔缓释片	化学药	HZ003963
盐酸丁咯地尔胶囊	化学药	HZ003964
盐酸丁咯地尔氯化钠注射液	化学药	HZ003966
盐酸丁咯地尔片	化学药	HZ003967
盐酸丁咯地尔葡萄糖注射液	化学药	HZ003968
盐酸丁咯地尔注射液	化学药	HZ003969
注射用盐酸丁咯地尔	化学药	HZ005065

HY002191 盐酸丁螺环酮

【外文名称】Buspirone Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】8－氮杂螺［4，5］癸烷－7,9－二酮，8－［4－［4－（2－嘧啶基）－1－哌嗪基］丁基－盐酸盐

【分子式】$C_{21}H_{31}N_5O_2 \cdot HCl$

【分子量】421.97

药物药理信息

【药理毒理】动物实验模型表明本品主要作用于脑内5－HT1A受体的激动，降低焦虑症过高的活动，产生焦虑作用。本品无镇静、肌松弛和抗惊厥作用。

【药代动力学】本品口服吸收快而完全，0.5～1小时达血药浓度峰值。存在肝脏首过效应，$t_{1/2}$为1～14小时，血浆蛋白结合率为95%。大部分在肝内代谢，其代谢产物为5－羟基丁螺环酮和1－（2－嘧啶基）－哌嗪，仍有一定生物活性。口服后，约60%由肾脏排泄，40%由粪便排出。肝硬化时，由于首过效应降低，可使血药浓度增高，药物清除率

明显降低，肾功能障碍时清除率轻度减低。在老年病人中动力学无特殊变化。

【药物相互作用】本品与单胺氧化酶抑制剂合用可致血压增高。

【不良反应】有头晕、头痛、恶心、呕吐及胃肠功能紊乱。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸丁螺环酮片	化学药	HZ003970

HY002192　盐酸度硫平

【其他名称】Altapin、Depresym、Dothiepin、二苯噻庚英、Prothiaden

【外文名称】Dosulepin Hydrochloride

【性状及组成】为白色或淡黄色结晶粉末，无臭或几乎无臭，熔点 218 - 221℃；易溶于水（1:2）、乙醇（1:8）和三氯甲烷（1:2），几乎不溶于乙醇。

药物药理信息

【药理毒理】本品为三环类抗抑郁药，类似阿米替林，除有抗抑郁作用外，也有镇静作用。除供治疗抑郁症外，对多种疼痛如纤维肌痛或纤维组织炎、非典型性面部疼痛与癌症疼痛，当传统的镇痛药无效时可试用。

【药代动力学】本品口服易吸收，因可减慢胃肠转动，尤其当过量摄入时，吸收可能延迟；在肝内经首过代谢去甲基成为其主要的活性代谢产物去甲度硫平，代谢途径尚有 S - 氧化；主要在其代谢产物经尿排泄，小量也从粪便排出，乳汁中也含有之；$t_{1/2}$为 14 ~ 46 小时。

【不良反应】抗毒蕈碱副反应少见，偶见皮肤光敏反应。

HY002193　盐酸度洛西汀

【外文名称】Duloxetine Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】度洛西汀是一种选择性的 5 - 羟色胺与去甲肾上腺素再摄取抑制剂（SSNRI）。度洛西汀抗抑郁与中枢镇痛作用的确切机制尚未明确，但认为与其增强中枢神经系统 5 - 羟色胺能与去甲肾上腺素能功能有关。临床前研究结果显示，度洛西汀是神经元 5 - 羟色胺与去甲肾上腺素再摄取的强抑制剂，对多巴胺再摄取的抑制作用相对较弱。体外研究结果显示，度洛西汀与多巴胺能受体、肾上腺素能受体、胆碱能受体、组胺能受体、阿片受体、谷氨酸受体、GABA 受体无明显亲和力。度洛西汀不抑制单胺氧化酶。

【药代动力学】度洛西汀肠溶胶囊消除半衰期大约为 12 小时（变化范围为 8 ~ 17 小时），在治疗范围之内其药代动力学参数与剂量成正比。一般于服药 3 天后达到稳态血药浓度。度洛西汀主要经肝脏代谢，涉及两种 P450 酶：CYP2D6 和 CYP1A2。

1. 吸收与分布：口服盐酸度洛西汀肠溶胶囊吸收完全。平均滞后 2 小时药物开始被吸收，口服 6 小时后度洛西汀达到最大血浆浓度（C_{max}）。进食不影响 C_{max}，但是将延迟达峰时间 6 ~ 10 小时，略微降低吸收程度，约 10%。晚间一次服药与晨间一次服药相比，度洛西汀的吸收滞后 3 小时，表观清除增加 1/3。表观分布容积平均为 1640L。度洛西汀与人体血浆蛋白有高度亲和性（> 90%），主要与白蛋白和 α_1 - 酸性糖蛋白结合。目前还未评价度洛西汀和其他高蛋白结合药物之间是否有药物相互作用，肝或肾功能不全不影响度洛西汀的血浆蛋白结合。

2. 代谢和排泄：口服 ^{14}C 标记的度洛西汀以确定其人体内生物转化和降解。血浆中的度洛西汀仅占总放射标记物 3%，提示度洛西汀代谢广泛，代谢产物多。度洛西汀主要的生物转化途径包括结合后萘基环氧化以及进一步氧化。体外试验中 CYP2D6 和 CYP1A2 都可催化萘基环氧化，血浆中的代谢产物包括葡萄糖醛酸结合的 4 - 羟基度洛西汀、硫酸结合的 5 - 羟基 6 - 甲氧基度洛西汀。尿中分离出多种其他代谢产物，有些仅出现在小的消除代谢旁路中。尿液中仅有少量未经代谢的盐酸度洛西汀原形（约占口服剂量的 1%），大部分（约占口服剂量的 70%）以盐酸度洛西汀代谢产物形式经尿液排出，大约 20%经粪便排出。

3. 特殊人群

（1）性别：度洛西汀在男性、女性中的半衰期相似，不同性别无需调整剂量。

（2）年龄：比较健康老年女性（65 ~ 77 岁）与健康中年女性（32 ~ 50 岁）单次口服 40mg 度洛西汀后的药代动力学，其 C_{max}无差异，但老年女性的血药浓度—时间曲线下面积（AUC）稍高（约 25%），并且半衰期延长 4 小时。人群药代动力学分析提示：从 25 至 75 岁中，年龄每增加 1 岁，药物清除率下降约 1%。但是年龄作为一个预测因素，仅能解释患者间个体变异的很小部分。无须根据年龄调整剂量。

（3）吸烟：吸烟者盐酸度洛西汀的生物利用度（AUC）减少约 1/3。不推荐吸烟者调整剂量。

（4）种族：尚未进行专门的药代动力学研究，探讨不同种族的药代动力学特征。

（5）肾功能不全：关于度洛西汀对终末期肾脏

疾病（ESRD）患者影响的数据非常有限。单次口服60mg度洛西汀后，接受长期间歇性血液透析的终末期肾病患者，其 C_{max}和 AUC 值比肾功能正常的人群增加约 100%，然而两者消除半衰期近似。大部分经尿液排出的主要循环代谢产为葡萄糖醛酸结合的 4－羟基度洛西汀、硫酸结合的 5－羟基 6－甲氧基度洛西汀，其 AUC 大约升高 7～9 倍，预计多次口服药物后增加会更明显。因此，不推荐终末期肾病的患者（需要透析者），或严重肾功能损害（估计肌酐清除率≤30ml/min）者使用度洛西汀肠溶胶囊。人群药代动力学分析显示，轻度到中度肾功能障碍（肌酐清除率 30～80ml/min）者对度洛西汀的表观清除无显著影响。

（6）肝功能不全：临床上明显的肝功能不全患者，度洛西汀的代谢和清除均下降。单次口服 20mg 度洛西汀后，6 名中度肝功能不全肝硬化的患者与年龄、性别相当的健康人群相比，平均血浆清除率为后者的 15%，平均 AUC 较后者增加 5 倍。虽然肝硬化患者的 C_{max}与肝功能正常者近似，但是，前者半衰期延长 3 倍。不推荐度洛西汀用于治疗有任何肝功能不全的患者。

【不良反应】 MDD 急性期治疗的安慰剂对照研究中，接受度洛西汀治疗的患者中，发生率≥2%以及高于安慰剂组的不良反应。其中最常见的不良反应（发生率≥5%，且至少是安慰剂组发生率的两倍）包括恶心、口干、便秘、食欲下降、疲乏、嗜睡、出汗增多。

尿急：度洛西汀属于已知的影响尿道阻力的药物。如果应用度洛西汀治疗的过程中出现尿急，应当考虑药物导致的可能性。

实验室变化：9 周 MDD 或 13 周 DPNP 安慰剂对照研究中，与基线比较，度洛西汀治疗结束后，ALT、AST、CPK 和碱性磷酸酯酶均值出现轻度增高。与安慰剂组比较，度洛西汀治疗的患者中出现这些异常值表现为偶发、中度、一过性的异常。

生命体征改变：在为期 9 周的 MDD 安慰剂对照研究中，度洛西汀的剂量为 40～120mg/d，导致血压升高，与安慰剂比较，收缩压平均升高 2mmHg，舒张压平均升高 0.5mmHg，收缩压超过 140mmHg 的发生率增加。9 周的 MDD 和 13 周 DPN 安慰剂对照研究中，度洛西汀治疗导致心率轻度增加，与安慰剂比较约增加 2 次/分钟。

体重变化：在 MDD 安慰剂对照研究中，应用度洛西汀治疗 9 周的患者体重平均下降约 0.5kg，而安慰剂治疗的患者体重平均增加约 0.2kg。在糖尿病周围神经痛的安慰剂对照临床试验中，接受度洛西汀治疗 13 周的患者平均体重降低约 1.1kg，安慰剂治疗的患者体重平均增加约 0.2kg。

心电图的改变：持续 8 周的 MDD 安慰剂对照研究中，321 例度洛西汀治疗和 169 例安慰剂治疗的患者进行了心电图检查。心率校正后的 Q－T（QTc）间期在度洛西汀和安慰剂治疗的患者之间没有差异。两者之间在 Q－T、PR、QRS 间期之间无显著差异。在为期 13 周的 DPNP 安慰剂对照研究中，528 例接受度洛西汀治疗和 205 例安慰剂治疗的患者进行了心电图检查。接受度洛西汀治疗的患者，其心率校正后的 QT 间期改变与安慰剂治疗者无差异。度洛西汀治疗组和安慰剂治疗组的 Q－T、PR、QRS 或 QTc 间期检查均未发现有临床意义的显著差异。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸度洛西汀肠溶胶囊	化学药	HZ003971

HY002194 盐酸多巴胺

【外文名称】 Dopamine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 4－（2－氨基乙基）－1,2－苯二酚盐酸盐

【分子式】 $C_8H_{11}NO_2 \cdot HCl$

【分子量】 189.64

【性状及组成】 本品为白色或类白色有光泽的结晶，无臭，味微苦，露置空气中及遇光色渐变深。

本品在水中易溶，在无水乙醇中微溶，在三氯甲烷或乙醚中极微溶解。

熔点：本品的熔点为 243～249℃。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：多巴胺受体激动药。

激动交感神经系统肾上腺素受体和位于肾、肠系膜、冠状动脉、脑动脉的多巴胺受体其效应为剂量依赖性。

1．小剂量时（每分钟按体重 0.5～2μg/kg），主要作用于多巴胺受体，使肾及肠系膜血管扩张，肾血流量及肾小球滤过率增加，尿量及钠排泄量增加。

2．小到中等剂量（每分钟按体重 2～10μg/kg），能直接激动 β_1 受体及间接促使去甲肾上腺素自储藏部位释放，对心肌产生正性肌力作用，使心肌收缩力及心搏量增加，最终使心排血量增加、收缩压升高、脉压可能增大，舒张压无变化或有轻度升高，外周总阻力常无改变，冠脉血流及耗氧改善。

3. 大剂量时（每分钟按体重大于 10μg/kg），激动 α 受体，导致周围血管阻力增加，肾血管收缩，肾血流量及尿量反而减少。由于心排血量及周围血管阻力增加，致使收缩压及舒张压均增高。

（1）对心脏 β_1 受体激动，增加心肌收缩力作用强的多；

（2）由于增加肾和肠系膜的血流量，可防止由这些器官缺血所致的休克恶性发展。在相同的增加心肌收缩力情况下，致心律失常和增加心肌耗氧的作用较弱。总之，多巴胺对于伴有心肌收缩力减弱、尿量减少而血容量已为补足的休克患者尤为适用。

【药代动力学】 口服无效，静脉滴入后在体内分布广泛，不易通过血－脑脊液屏障。静注 5 分钟内起效，持续 5～10 分钟，作用时间的长短与用量不相关。在体内很快通过单胺氧化酶及儿茶酚－氧位－甲基转移酶（COMT）的作用，在肝、肾及血浆中降解成无活性的化合物。一次用量的 25% 左右，在肾上腺神经末梢代谢成去甲基肾上腺素。半衰期约为 2 分钟左右。经肾排泄，约 80% 在 24 小时内排出，尿液内以代谢物为主，极小部分为原形。

【药物相互作用】

1. 与硝普钠、异丙肾上腺素、多巴酚丁胺合用，注意心排血量的改变，比单用本品时反应不同。

2. 大剂量多巴胺与 α 受体阻滞剂如酚苄明、酚妥拉明、妥拉唑林等同用，后者的扩血管效应可被本品的外周血管的收缩作用拮抗。

3. 与全麻药（尤其是环丙烷或卤代碳氢化合物）合用由于后者可使心肌对多巴胺异常敏感，引起室性心律失常。

4. 与 β 受体阻滞剂同用，可拮抗多巴胺对心脏的 β_1 受体作用。

5. 与硝酸酯类同用，可减弱硝酸酯的抗心绞痛及多巴胺的升压效应。

6. 与利尿药同用，一方面由于本品作用于多巴胺受体扩张肾血管，使肾血流量增加，可增加利尿作用；另一方面本品自身还有直接的利尿作用。

7. 与胍乙啶同用时，可加强多巴胺的加压效应，使胍乙啶的降压作用减弱，导致高血压及心律失常。

8. 与三环类抗抑郁药同时应用，可能增加多巴胺的心血管作用，引起心律失常、心动过速、高血压。

9. 与单胺氧化酶抑制剂同用，可延长及加强多巴胺的效应；已知本品是通过单胺氧化酶代谢，在给多巴胺前 2～3 周曾接受单胺氧化酶抑制剂的病人，初量至少减到常用剂量的 1/10。

10. 与苯妥英钠同时静注可产生低血压与心动过缓。在用多巴胺时，如必须用苯妥英钠抗惊厥治疗时，则须考虑两药交替使用。

【不良反应】 常见的有胸痛、呼吸困难、心悸、心律失常（尤其用大剂量）、全身软弱无力感；心跳缓慢、头痛、恶心呕吐者少见。长期应用大剂量或小剂量用于外周血管病患者，出现的反应有手足疼痛或手足发凉；外周血管长时期收缩，可能导致局部坏死或坏疽；过量时可出现血压升高，此时应停药，必要时给予 α 受体阻滞剂。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸多巴胺注射液	化学药	HZ003972
注射用盐酸多巴胺	化学药	HZ005066

HY002195　盐酸多巴酚丁胺

【外文名称】 Dobutamine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 4－［2－［［1－甲基－3－（4－羟苯基）丙基］氨基］乙基］－1,2－苯二酚盐酸盐

【分子式】 $C_{18}H_{23}NO_3 \cdot HCl$

【分子量】 337.85

【性状及组成】 本品为白色或类白色结晶性粉末，几乎无臭，味微苦，露置空气中及遇光色渐变深。

本品在水、无水乙醇中略溶，在三氯甲烷中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 188～193 ℃。

药物药理信息

【药理毒理】 盐酸多巴酚丁胺（dobutamine hydrochloride）是一种直接影响肌肉收缩力的药物，它的主要活性来自于刺激心脏的肾上腺素能受体；它有轻度变时性、升高血压、致心律失常及扩张血管作用。与多巴胺比较，它并不释放去甲肾上腺素，而且它的作用也不依赖于蓄积在心脏内的去甲肾上腺素。动物研究表明，在获得强心作用时，盐酸多巴酚丁胺引发心率加快和外周血管阻力下降的作用均比异丙肾上腺素小。

在人体内，盐酸多巴酚丁胺能增加每搏射血量和心输出量，并能降低心室充盈压、体循环和肺循环的阻力。作为对心肌收缩力增强的一种反映，心室功能曲线向左上方发生位移。

当使用常用的盐酸多巴酚丁胺剂量时，心率不会明显的加快；然而，当使用高剂量时，可能会发

生明显的心动过速（剂量通常大于 10μg/（kg·min））。

由于增加心输出量的作用受到同时发生的外周血管阻力下降的平衡，使用盐酸多巴酚丁胺通常不会导致动脉血压发生明显的改变。动脉血压升高和降低的情况都已有报道。以前患有动脉性高血压的病人，即使当时他们的血压是正常的，似乎对血压升高的反应也更为敏感。动物实验表明，盐酸多巴酚丁胺具有降低由于肺部缺氧时血管收缩的作用。这可能会导致通气不良区域的灌注增加。这一作用可能会使某些病人的动脉氧饱和度降低，但降低的程度较使用多巴胺或异丙肾上腺素小。由于在这样的病人中心输出量有所增加，使用盐酸多巴酚丁胺时氧的转运一般会升高。在采用呼吸机呼气末正压通气（positive end – expiratory pressure，PEEP）的病人中，盐酸多巴酚丁胺可预防或部分恢复心输出量的降低。盐酸多巴酚丁胺对多巴胺受体无作用，因此，它不会对肾或内脏的血管产生选择性的扩张作用。通过提高心输出量和非选择性的血管扩张，盐酸多巴酚丁胺也许能改善肾脏的血流、肾小球的滤过率、尿量以及尿钠排泄。盐酸多巴酚丁胺在儿童中也显示出影响肌肉收缩力的作用，但与成人相比，其血流动力学的反应多少有些不同。虽然在儿童中心输出量升高，但体循环血管阻力和心室充盈压下降较少，心率加快和动脉血压升高比较明显。在年龄为12个月或更小的儿童中，在输注盐酸多巴酚丁胺期间肺楔压可能升高。

在对人进行电生理研究时以及在伴有心房颤动的病人中，盐酸多巴酚丁胺可改善房室传导。

与所有强心药物一样，盐酸多巴酚丁胺可增加心肌耗氧量。

盐酸多巴酚丁胺还会增加冠脉血流量和心肌需氧量。对氧需求的改变与下列几个因素有关：①心室直径的改变，它决定收缩期产生心室内压所需心室壁张力的水平；②改变后负荷，通常成比例地改变收缩压；③改变心率。当在患有心力衰竭、心脏扩大的病人中使用一种影响肌肉收缩力的药物时会引发心室直径变小，而后负荷和心率无明显升高，需氧量可能仅有轻微的升高或并未升高。一般而言，在患有心脏病的动物或人中，盐酸多巴酚丁胺没有引起耗氧与供氧之间出现失衡。输注盐酸多巴酚丁胺期间供氧量的增加常常超过了摄氧量的增加，因此，冠状窦中血液的氧饱和度有所增加。动静脉血的乳酸分配率为一种间接的无氧代谢的证据，在输注盐酸多巴酚丁胺期间一般能够维持。在某些情况下，心肌的乳酸浸出有所下降。在少数病人中报道了乳酸的净产出，输注盐酸多巴酚丁胺可显著增加心率和升高动脉血压。在给予盐酸多巴酚丁胺之前已存在心室功能障碍时，心率、血压无明显变化。

在患有心绞痛而无心力衰竭的病人中，输注盐酸多巴酚丁胺能产生类似于体育锻炼一样的作用，心肌的需氧量超过了冠状动脉的供氧量，因而产生可逆性心肌局部缺血的临床体征。这些体征包括心绞痛、心电图的 ST 段压低、铊闪烁成像的灌注缺失以及新的室壁运动异常。与未接受盐酸多巴酚丁胺治疗的相同病人相比，患有急性心肌梗死的病人使用盐酸多巴酚丁胺治疗 24 小时，其心肌梗死的面积和发生率以及心室节律的严重程度均未加剧。在动物中，与接受生理盐水相比，结扎冠状动脉后给予盐酸多巴酚丁胺能减小梗死的面积。在其他伴有实验性梗死的动物中，在给予能够加快心率和增强心肌收缩力的盐酸多巴酚丁胺剂量下，出现了局部缺血加重的心电图体征。最近的动物实验结果表明，在给予包括盐酸多巴酚丁胺在内的强心药物时，动物功能性衰退和可能出现的实验性心肌损伤的扩大与它们的变时性作用有关，而与正性肌收缩力变化无关。当输注的剂量能产生明显的强心作用而心率无明显加快时，未发现加重心肌损伤的证据。

给患有充血性心力衰竭的病人输注盐酸多巴酚丁胺不超过 1 小时会使心输出量增加并使肺楔压降低，然而，血流动力学并未伴随着运动耐受力的提高而得到改善。与之相对应，输注时间较长（直至 72 小时）或以固定的间隔重复输注达数周或数月能够增强运动的耐受力且能改善临床状况。这一情况确实存在，即使静息的心室功能并不总能得到增强。

尚不了解延长输注时间或间歇性地输注盐酸多巴酚丁胺能持续性地改善心室功能的机制。然而，在人中进行的涉及延长盐酸多巴酚丁胺输注时间的研究中报道了在线粒体超微结构及生物化学方面发生了改变，提示了改善得以延长的基础。

盐酸多巴酚丁胺益与多巴胺联合使用。一般而言，与单独给予相等剂量的盐酸多巴酚丁胺相比，联合用药并不能使心输出量增加得更多。可是，联合使用盐酸多巴酚丁胺和多巴胺会导致：①全身动脉血压升高（这对低血压患者而言将是有益的）；②肾脏的血流量、尿量以及钠的分泌增加；③预防单独使用多巴胺时发生的心室充盈压升高的倾向，这样，就能减少发生肺充血和肺水肿的危险，在伴有左心室功能受损的病人中更是如此。

盐酸多巴酚丁胺还可与其他血管扩张药联合使用，例如硝酸甘油或硝普盐，这对治疗患有局部缺血性心脏病的病人有利。这种联合用药的好处在于：既增加了心脏输出量，又降低了外周血管阻力和心室充盈压力。这是任何药物在单独使用时都无法达

到的。在联合给予盐酸多巴酚丁胺和其他血管扩张剂时，患者心率和血压稍有增加或没有变化。

盐酸多巴酚丁胺是一种 β 肾上腺素能的激动剂。因此，它的作用可能会受到 β 肾上腺素能受体拮抗剂的抵消。在使用 β 受体拮抗剂治疗期间，低剂量的盐酸多巴酚丁胺将显示出不同程度的 α 肾上腺素能活性，例如血管收缩。由于盐酸多巴酚丁胺与拮抗剂之间对 β 受体的相互作用是可逆的，这两类药物间将产生竞争。因此，较高剂量的盐酸多巴酚丁胺将会逐渐抵消 β 肾上腺素能受体拮抗剂的作用。

致癌、致突变、胎儿受损：尚未在动物中进行终身研究以评估药物潜在的致癌作用。在一项细菌的突变分析中未观察到致突变的潜在可能。尚未在动物中进行过研究以评估药物对胎仔的影响。

【药代动力学】口服无效，静脉注入 1～2 分钟内起效，如缓慢滴注可延长到 10 分钟，一般静注后 10 分钟作用达高峰，持续数分钟。表观分布容积为 0.2L/kg，清除率为 244L/h，半衰期约为 2 分钟，在肝脏代谢成无活性的化合物。代谢物主要经肾脏排出。

虽然盐酸多巴酚丁胺在静脉给药 1 至 2 分钟之内开始发挥作用，但对于任何一种输注速度而言，达到稳态血浆浓度以及最大作用也许需要大约 10 分钟时间。稳态血浆浓度与输注速度之间呈线性关系。当输注速度为 5μg/（kg·min）时，充血性心力衰竭患者的平均血浆浓度大约是 100ng/ml。

盐酸多巴酚丁胺在人体内的血浆清除率为 2.4L/（min·m^3），分布容积大约为体重的 20%，而血浆消除半衰期则小于 3 分钟。药物处置的主要途径主要为甲基化，其次为结合。代谢产物通过肾和胆汁消除。在人的尿液中，主要的排泄物包括共轭结合的多巴胺和 3－*O*－甲基多巴酚丁胺。3－*O*－甲基衍生物没有活性。

在连续输注时间延长时会发生对盐酸多巴酚丁胺的部分耐受，并且在 72 小时达到有统计学显著性差异的水平。在患有充血性心力衰竭的病人中，连续输注盐酸多巴酚丁胺 72 小时心输出量的反应相当于输注 2 小时末的 70%。这一现象可能是由于 β 肾上腺素能受体数量减少（下调）造成的。

在动物中，利用利舍平或三环类抗抑郁药改变儿茶酚胺类的突触浓度并不能改变盐酸多巴酚丁胺的作用；盐酸多巴酚丁胺的作用是直接的，它的作用并不依赖于突触前的机制。

【药物相互作用】

1．与全麻药尤其环丙烷、氟烷等同用，室性心律失常发生的可能性增加。

2．与 β 受体阻滞剂同用，可拮抗本品对 β_1 受体的作用，导致 α 受体作用占优势，外周血管的总阻力加大。

3．与硝普钠同用，可导致心排血量微增，肺楔压略降。

4．本品不得与碳酸氢钠等碱性药物混合使用。

假如给病人使用了 β 肾上腺素能受体拮抗剂，盐酸多巴酚丁胺的效能就可能减弱。在这种情况下，未受到抵消的盐酸多巴酚丁胺的 α 激动剂作用可能就会变得明显，包括外周血管的收缩以及高血压。相反地，α 肾上腺素能的阻断可能会使 β_1 和 β_2 的作用明显，从而导致心悸和血管舒张。

临床研究表明：盐酸多巴酚丁胺与下列药物间无明显的相互作用，这些药物包括洋地黄制剂、速尿、安体舒通、利多卡因、硝酸甘油、硝普钠、硝酸异山梨醇、吗啡、阿托品、肝素、鱼精蛋白、氯化钾、叶酸及对乙酰氨基酚。

【药物过量】有关多巴酚丁胺过量的报道极少。如果出现使用过量的情况时，可按下列方法进行处理。

1．体征和症状：盐酸多巴酚丁胺的毒性通常是由于对心脏的 β 受体过度刺激引起的。盐酸多巴酚丁胺作用的持续时间一般比较短（$t_{1/2}$为 2 分钟），因为它被儿茶酚－*O*－甲基转移酶迅速地代谢。毒性症状包括食欲减退、恶心、呕吐、震颤、焦虑、心悸、头痛、呼吸短促以及心绞痛和不明确的胸痛。多巴酚丁胺对心脏的正性肌力及正性变时性作用可能会导致高血压、快速型心律紊乱、心肌局部缺血和心室颤动。血管扩张可能会导致低血压、

如果将本品口服，在口腔和胃肠道内的吸收量不可预测。

2．治疗：在处置过量时，须考虑您的病人发生多种药物过量、药物间的相互反应以及异常药物动力学的可能性。

发生盐酸多巴酚丁胺过量时首先应采取的步骤是停止给药，气管插管，以确保供氧和通气。必须迅速地开始采用复苏的措施。使用普萘洛尔或利多卡因也许能有效地治疗严重的室性快速型心律失常。高血压通常对减小剂量或停止治疗有反应。

保证患者的气道通畅并给予通气和输液支持。假如需要，可以在能够接受的范围内，对病人的生命体征、血气、血清电解质等进行精确的监测并予以维持。药物通过胃肠道吸收时，可给予活性炭减少药物吸收，在许多情况下，给予活性炭比呕吐或洗胃更加有效；应考虑使用活性炭代替将胃排空或两者共用。在一定时间内重复给予活性炭可能会促使已经吸收的一些药物得到消除。当采用将胃排空或活性炭时，注意保护病人气道。

尚未证实加强利尿、腹膜透析、血液透析或活性炭血液灌注对盐酸多巴酚丁胺过量有帮助。

【不良反应】

1. 心率加快、血压升高以及心室异位搏动：在许多病人，收缩压升高 10 至 20mmHg，心率加快 5～15 次/分钟。在输注盐酸多巴酚丁胺期间，大约有 5%的病人出现了室性早搏的情况。这些作用通常都与剂量有关。

2. 低血压：偶有报道指出血压急剧下降与使用多巴酚丁胺治疗有关。减低剂量或停止输注一般能使血压迅速地回复到基线水平。在极少数情况下，可能需要进行处置，而且可能无法立即得到逆转。

3. 静脉输注部位的反应：静脉炎偶有报道。不小心发生渗漏后出现了局部炎性改变。已经报道了有关皮肤坏死的零星病例（皮肤组织破坏）。

4. 各种不常见的作用：在 1% 至 3% 的病人中报道了下列不良反应：恶心、头痛、心绞痛、不明确的胸痛、心悸以及呼吸短促。已经报道了有关血小板减少症的零星病例。

如同其他儿茶酚胺类一样，给予盐酸多巴酚丁胺能导致血清钾浓度的轻度降低，但达到低钾血症水平的极少。

5. 长期安全性：除了在较短的输注内见到的那些不良反应以外，输注直至 72 小时未见其他不良反应。有证据显示连续输注盐酸多巴酚丁胺 72 小时或更长时会发生部分耐受，因此，可能需要更高的剂量以维持相同的作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸多巴酚丁胺葡萄糖注射液	化学药	HZ003973
盐酸多巴酚丁胺注射液	化学药	HZ003974
注射用盐酸多巴酚丁胺	化学药	HZ005067

HY002196 盐酸多奈哌齐

【外文名称】 Donepezil Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 国家药品标准新药转正标准·第 55 册

药物理化信息

【化学名】 1－苄基－4－［（5,6－二甲氧基茚满酮－2－基）甲基］哌啶盐酸盐

【分子式】 $C_{24}H_{29}NO_3 \cdot HCl$

【分子量】 415.96

【性状及组成】 本品为白色或类白色粉末，无臭，有吸湿性。

本品在水或三氯甲烷中易溶，在乙醇中微溶，在乙酸乙酯中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】 盐酸多奈哌齐为特异的可逆性乙酰胆碱酯酶抑制剂，此酶主要存在于脑部。盐酸多奈哌齐在活体外实验对乙酰胆碱酯酶的抑制作用比对丁酰胆碱酯酶的抑制作用强 1252 倍，后者主要存在于中枢神经系统以外。临床试验中，阿尔茨海默型痴呆病人一日 1 次口服本药 5mg 或 10mg，服药后稳态时乙酰胆碱酶活性测定（红细胞膜）分别被抑制 63.6% 和 77.3%。

盐酸多奈哌齐抑制红细胞乙酰胆碱酯酶活性（AChE）的作用与其 ADAS－cog 量表的变化有关，这个量表是一个检查认知功能某些方面的敏感量表。尚没有对盐酸多奈哌齐改变疾病的原发神经病理过程的潜力进行过研究。

临床前安全资料：广泛的动物实验表明，该药除了有胆碱能神经兴奋的药理作用以外，其他作用很少。在细菌 Ames 回复突变实验或小鼠体外淋巴瘤正向突变实验中，未发现盐酸多奈哌齐有致畸作用。体外实验中观察到药物有某些致畸作用，但仅在对细胞有明显毒性的浓度，及在临床试验病人稳态浓度 3000 倍以上的浓度时才有此作用。在小鼠体内微核模型中，盐酸多奈哌齐无致畸作用。在对大鼠和家兔的长期致癌研究中，没有证据表明有致癌的可能。盐酸多奈哌齐对大鼠生殖功能无影响，在大鼠和家兔中无致畸性，但当给妊娠大鼠 50 倍人用剂量时，对死胎和仔鼠的早期存活有轻微影响。

【药代动力学】 吸收：口服本药后 3～4 小时达血浆峰浓度，血浆浓度和药时曲线下面积与剂量成正比。消除半衰期约 70 小时，所以，多次一日单剂量给药将缓慢达到稳态。治疗开始后 3 周内达稳态，稳态后，血浆盐酸多奈哌齐浓度和相应的药效学活性在一日中变化很小。饮食对盐酸多奈哌齐的吸收无影响。

分布：约 95% 的盐酸多奈哌齐与人血浆蛋白结合。有活性的代谢产物 6－*O*－desmethyl donepezil 的血浆蛋白结合情况尚不清楚。盐酸多奈哌齐在不同组织中的分布尚未明确研究。但是，在健康成年男性志愿者做的放射性质量平衡研究中，给予单剂 ^{14}C－标记的盐酸多奈哌齐 240 小时后，仍有 28% 的标记物未被吸收，表明盐酸多奈哌齐和（或）其代谢物在体内存在 10 天以上。

代谢/排泄：盐酸多奈哌齐以原形由尿排泄，或由细胞色素 P450 系统代谢为多种代谢产物，其中某些尚未确定。服用单剂 ^{14}C－标记的盐酸多奈哌齐 5

mg后，血浆放射性（以服用剂量的百分比表示），主要为盐酸多奈哌齐原形（30%），6 - O - desmethyl donepezil（11%，唯一具有盐酸多奈哌齐相似活性的代谢物），denepezil - *cis* - *N* - oxide（9%），5 - O - desmethyl donepezil（7%）和5 - O - desmethyl donepezi的葡萄糖醛酸结合物（3%）。约见57%的总放射物从尿中回收（有17%是没有转化的多奈哌齐），14.5%从粪便中回收，提示生物转化和尿排泄为消除的主要途径。尚无证据表明盐酸多奈哌齐和（或）其代谢产物有肝肠循环。血浆中多奈哌齐浓度以生物半衰期70小时下降。

性别、种族和吸烟史对血浆盐酸多奈哌齐浓度的影响在临床上无显著差异。

多奈哌齐的药代动力学还没有在健康的老年人或阿尔茨海默病病人中进行过正式的研究，但是，病人的平均血浆浓度与年轻的健康志愿者的数值相近。

【药物相互作用】应用多奈哌齐的临床经验目前有限，因为这个原因，可能还没有记录到所有可能出现的相互作用，所以可能会发生新的、未知的与多奈哌齐的相互作用。

盐酸多奈哌齐和（或）其任一代谢产物都不抑制茶碱、华法令、西咪替丁或地高辛在人体内的代谢。盐酸多奈哌齐的代谢不被同时服用地高辛或西咪替丁所影响。

活体外试验显示，细胞色素酶P450系统的同工酶3A4和很小限度参与的同功酶2D6与多奈哌齐的代谢有关。活体外的药物间相互作用研究显示，酮康唑和奎宁丁，分别是CYP3A4和2D6的抑制剂，抑制多奈哌齐的代谢。因此，这些药物和其他CYP3A4的抑制剂，如伊曲康唑和红霉素，以及CYP2D6的抑制剂，如氟西汀能够抑制多奈哌齐的代谢。在对健康志愿者进行的研究中，酮康唑增加多奈哌齐的平均浓度大约30%。酶的诱导剂，如利福平、苯妥英钠、卡马西平和酒精可能降低多奈哌齐的浓度。因为抑制或者诱导作用的程度还不知道，类似药物的联合应用应当非常谨慎。

盐酸多奈哌齐有与抗胆碱能药物相互作用的可能，也有与共同治疗的药物，如琥珀酰胆碱、其他神经 - 肌肉阻滞剂、胆碱能激动剂或 β - 受体阻滞剂（其影响心肌的传导）等有协同作用的可能。

【药物过量】小鼠及大鼠一次口服单剂盐酸多奈哌齐的半数致死量分别为45和32mg/kg，或分别为推荐的人用最大剂量10mg/天的225和160倍。在动物中观察到的与剂量相关的胆碱能兴奋症状包括：自发运动减弱、俯卧位、蹒跚步态、流泪、阵挛状惊厥、呼吸抑制、流涎、缩瞳、肌束震颤及体表温度降低。

过量使用胆碱酯酶抑制剂会引起胆碱能危象，表现为严重的恶心、呕吐、流涎、出汗、心动过缓、低血压、呼吸抑制、虚脱和惊厥，可能会有进行性肌无力，如累及呼吸肌可致死。

治疗用药过量的病人，应使用一般支持疗法，给予叔胺型抗胆碱药如阿托品作解毒剂。建议根据反应使用静脉给予的硫酸阿托品，首剂静脉给1mg和2mg，然后根据临床表现给药。有报道合用其他拟胆碱药，如与季胺型抗胆碱药格隆溴胺合用时，血压和心率反应不典型，尚不清楚盐酸多奈哌齐和（或）其代谢物能否由透析清除（血液透析、腹膜透析或血液过滤）。

【不良反应】最常见的不良反应为腹泻、肌肉痉挛、乏力、恶心、呕吐和失眠。其他常见的不良反应为头痛、疼痛、意外伤害、普通感冒、腹部器官功能紊乱和头晕。晕厥、心动过缓和少见的窦房传导阻滞、房室传导阻滞和癫痫也有报道。

几乎没有报道过包括肝炎的肝功能退化。如果出现不能解释的肝功能退化，应当考虑停用本品。有包括幻觉、易激怒和攻击行为的精神紊乱的报道。解决的办法是减量或停止治疗。也有一些关于畏食，胃、十二指肠溃疡和胃肠道出血的报道。可见血肌酸激酶浓度的轻微增高。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸多奈哌齐滴丸	化学药	HZ003975
盐酸多奈哌齐胶囊	化学药	HZ003976
盐酸多奈哌齐片	化学药	HZ003977

HY002197　盐酸多柔比星

【其他名称】14 - 羟基柔红霉素、14 - 羟基正定霉素、ADM、ADR、Adriamycin、阿霉素、NSC - 123127、羟基红比霉素、羟基柔红霉素、羟基正定霉素、亚得利亚霉素、盐酸阿霉素、盐酸多柔米星

【外文名称】Doxorubicin Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】10 - ［（3 - 氨基 - 2、3、6 - 三去氧 - α - L - 来苏己吡喃基）- 氧］- 7、8、9、10 - 四氢 - 6,8,11 - 三羟基 - 8 - （羟乙酰基）- 1 - 甲氧基 - 5,12 萘二酮的盐酸盐

【分子式】$C_{27}H_{29}NO_{11}\cdot HCl$

【分子量】579.99

【性状及组成】本品应为橙红色结晶性粉末，有引湿性。本品在水中溶解，在甲醇中微溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗肿瘤药。

药物可穿透进入细胞核，与染色体结合。实验显示多柔比星的平面环插入碱基对之间从而与 DNA 结合形成复合物，严重干扰 DNA 合成、DNA 依赖性 RNA 合成和蛋白质合成。但通过该机制产生抗增生作用所需的多柔比星浓度比临床治疗中肿瘤部位的药物浓度要高。近期的实验显示药物插入 DNA 引发拓扑异构酶Ⅱ裂解 DNA，从而破坏 DNA 三级结构。这一作用在临床治疗的药物浓度即可见。多柔比星还与氧化/还原作用有关：一系列 NADPH 依赖性的细胞还原酶可还原多柔比星为半醌自由基，再与分子氧反应产生高反应活性的细胞毒化合物如过氧化物、活性的氢氧基和过氧化氢，自由基形成与多柔比星的细胞毒作用有关。多柔比星的更进一步作用部位可能在细胞膜：与细胞膜上的脂结合影响各种不同的功能。多柔比星的细胞毒作用和（或）抗增生作用可以是上述任何一种机制的结果，也可能还有其他作用机制存在。

研究显示多柔比星在整个细胞周期均有活性作用，包括在细胞间期。故快速增生组织如肿瘤组织（但也包括骨髓、胃肠道和黏膜、毛囊）是对多柔比星抗增生作用最敏感的。

【药代动力学】吸收：多柔比星不能通过胃肠道吸收。由于对组织具有强烈刺激性，故药物必须通过血管给药（静脉内或动脉内）。已证明膀胱内给药也是可行的，这一给药途径药物很少进入体循环。

分布：多柔比星迅速而广泛地分布入周边室，初始血浆半衰期很短（5～10 分钟），稳态分布容积超过 20～30L/kg，但多柔比星不通过血－脑屏障。血浆蛋白结合率约为 75%，并且血药浓度低于 2mol/L 时药物血浆蛋白结合率与血药浓度无关。

代谢：主要由肝脏代谢。主要代谢产物是由醛酮还原酶作用产生的 13－羟－多柔比星酮，该代谢物也有一定抗肿瘤活性。尿液和胆汁中多柔比星和 13－羟－多柔比星酮占被排泄药物的大多数。血浆中可检测到的其他代谢产物还有多柔比星糖苷配基和 13－羟－多柔比星酮糖苷配基。

排泄：静脉给药后，多柔比星血浆浓度呈多相衰减，终末相半衰期为 20～48 小时。代谢物 13－羟－多柔比星酮的终末相半衰期与原形药物相似。血浆清除率为 8～20ml/（min·kg），血浆清除是由于代谢和胆汁分泌。在肝功能受损患者，这一较慢的血浆消除可能更慢。多柔比星的消除很大程度是药物代谢转化为一系列无活性或活性较低的产物。胆汁和粪便中七天内可排出用药量的 40%～50%。肾脏分泌较少，五天内只有 5%～10%的用药量从尿中排出。

【药物相互作用】

1．多柔比星通常与其他细胞毒药物联合治疗，所以可能出现毒性作用特别是骨髓、血液学和胃肠道毒性作用的叠加。另外，如多柔比星与其他已报道有潜在心脏毒性作用的抗肿瘤药物伴随使用（如 5－Fu，环磷酰胺，顺铂等）或与其他具有心脏活性作用的药物伴随使用（如钙通道拮抗剂），需在整个治疗期间密切监测心脏功能。

2．多柔比星主要在肝脏代谢，其他的伴随治疗所引起的肝功能改变可影响多柔比星的代谢、药代动力学、疗效和/或毒性。

3．本品应避免与碱性溶液长期接触。

4．因会产生沉淀，速溶型阿霉素不可与肝素混用，亦不建议速溶型阿霉素与其他药物混合。

【药物过量】单次 250mg 和 500mg 的多柔比星剂量已证实是致命的。这些剂量可导致 24 小时内急性心肌衰竭和严重的骨髓抑制，且用药后 10～15 天效应最大，在此期间应加强支持疗法，并采取输血、无菌隔离护理等措施。延迟性心力衰竭可于过量用药半年后出现，病人应密切观察，一旦出现心力衰竭征象时应予以常规治疗。

【不良反应】

1．骨髓抑制和口腔溃疡。存在骨髓抑制和口腔溃疡时不可重复使用本品，后者可能存在口腔烧灼感的先兆症状，出现症状时应不再使用。多柔比星使用后 10 天左右可出现明显的骨髓抑制，故不管是血液疾病或非血液疾病患者都应常规监测血常规。

2．心脏毒性。心脏毒性可表现为心动过缓，包括室上性心动过缓和心电图改变，建议常规监测心电图，对已有心功能损害的患者需格外小心，累积剂量超过 450～500mg/m^2 时须特别小心，超过该剂量水平时，发生不可逆性充血性心力衰竭的危险性大大增加。当考虑多柔比星的用药总量时，应对患者以往或同时使用其他有明显心脏毒性药物，如高剂量静脉给药的环磷酰胺，纵隔放疗或相关的蒽环类化合物如柔红霉素的使用情况进行综合评定。已证实每周给予多柔比星比每 3 周给予多柔比星的心脏毒性要低，这样可允许患者得到较高的累积剂量的治疗。必须注意心力衰竭可在用药后几周出现，且可能对治疗无反应。建议监测基础心电图，并在用药期间和用药后即刻做心电图随访。一过性心电图改变，如 T 波低平，S－T 段下降和心律失常，并

不认为是停止使用药物的指征。现在认为 QRS 波降低是心脏毒性较为特异的表现。如果出现这个变化，须慎重权衡继续用药治疗的益处及发生不可逆性心脏损害的危险两者间的关系。严重的心力衰竭可突然发生，而预先无心电图改变。

3．速溶型注射用盐酸多柔比星可使尿液呈红色，尤其是在注射后第一次排的尿，应告知患者无须惊慌。

4．胃肠道反应：呕吐、恶心和腹泻也可发生。

5．其他：肝肾功能异常，脱发也是常见现象，包括干扰胡子的生长，不过停药后所有的毛发可恢复正常生长。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸多柔比星	化学药	HZ005068

HY002198　盐酸多塞平

【其他名称】多虑平

【外文名称】Doxepin Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】N，N－二甲基－3－二苯并［b，e］－噁庚英－11（6H）亚基－1－丙胺盐酸盐顺反异构体混合物

【分子式】$C_{19}H_{21}NO\cdot HCl$

【分子量】315.84

【性状及组成】本品为白色粉末，味略甜，随后有麻痹感。本品在水中易溶，在乙醇或三氯甲烷中溶解，在苯中不溶。

本品的熔点为 185～191℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗抑郁药。

1．药理学

（1）本品为三环类抗抑郁药，其作用在于抑制中枢神经系统对 5－羟色胺及去甲肾上腺素的再摄取，从而使突触间隙中这二种神经递质浓度增高而发挥抗抑郁作用，也具有抗焦虑和镇静作用。

（2）本品具有阻断 H_1 和 H_2 受体的作用，同时也是胆碱能受体和肾上腺素受体拮抗剂，其阻断 H_1 受体效价比苯海拉明强 775 倍，比安太乐强 56 倍，比赛庚啶强 11 倍。用本品 117mg/kg、83mg/kg、50mg/kg 皮肤给药，对右旋糖酐引起的小鼠全身性瘙痒有明显的抑制作用，对小鼠的皮肤血管通透性有明显的降低作用，而且比苯海拉明强，并抑制磷酸组织胺引起的豚鼠过敏反应，对三种过敏模型的抗过敏作用均呈现较好的量效关系。

2．毒理学：本品对完整的以及破损的皮肤产生中度刺激性，但停药一周可完全恢复。小鼠（口服）LD_{50}148～178mg/kg，大鼠 346～460mg/kg。

【药代动力学】口服吸收好，生物利用度为 13%～45%，生物半衰期（$t_{1/2}$）为 8～12 小时，表观分布容积（V_d）9～33L/kg。主要在肝脏代谢，活性代谢产物为去甲基化物。代谢物自肾脏排泄，老年病人对本品的代谢和排泄能力下降。

局部外用本品后，可在血中检测到有意义的药物浓度。本品代谢迅速，它在肝脏中进行去甲基反应，生成最初活性代谢物去甲基多塞平。多塞平和去甲基多塞平两者代谢途径包括羟基化反应、N－氧化反应、与葡糖醛酸的结合反应，主要以游离和结合方式的代谢物从尿液排泄。本品在体内分布广泛，并与血浆蛋白结合，血浆半衰期 8～24 小时，本品可越过血脑屏障和胎盘屏障。

【药物相互作用】

1．本品与舒托必利合用，有增加室性心律失常的危险，严重者可致尖端扭转心律失常。

2．本品与乙醇或其他中枢神经系统抑制药合用，中枢神经抑制作用增强。

3．本品与肾上腺素、去甲肾上腺素合用，易致高血压及心律失常。

4．本品与可乐定合用，后者抗高血压作用减弱。

5．本品与抗惊厥药合用，可降低抗惊厥药的作用。

6．本品与氟西汀或氟伏沙明合用，可增加两者的血浆浓度，出现惊厥，不良反应增加。

7．本品与阿托品类合用，不良反应增加。

8．与单胺氧化酶合用，可发生高血压。

【药物过量】

1．轻度过量可有嗜睡、幻视、口干；

2．重度过度可有呼吸抑制、低血压、昏迷、惊厥、心律不齐、心动过速、尿潴留、胃肠运动减慢、高血压、反射亢进等。

3．对此应进行及时对症处理，但由于本品组织及蛋白结合能力较高，未用透析和利尿剂处理作用不大。

【不良反应】

1．全身的不良反应一般为嗜睡，还可有口干、头痛、眩晕、疲倦、情绪改变、味觉改变、恶心、焦虑和发热等。

2．局部的不良反应有一过性刺痛感和（或）烧灼感、瘙痒、红斑、皮肤发干等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸多塞平片	化学药	HZ003978
盐酸多塞平乳膏	化学药	HZ003979
盐酸多塞平注射液	化学药	HZ003980

HY002199 盐酸多沙普仑

【其他名称】Dopram、Doxapril、多普兰、二苯吗啉吡酮、二苯吗啉乙吡酮、吗啉吡咯酮、吗乙苯吡酮、吗乙苯咯

【外文名称】Doxapram Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】1－乙基－3,3－二苯基－4－（2－吗啉乙基）－2－吡咯烷酮盐酸盐一水合物

【分子式】$C_{24}H_{30}N_2O_2 \cdot HCl \cdot H_2O$

【分子量】432.99

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭。本品在水、三氯甲烷或乙醇中略溶，在乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为 217～221℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：中枢兴奋药。

本品为呼吸兴奋剂，小量时通过颈动脉体化学感受器反射性兴奋呼吸中枢，大量时直接兴奋延髓呼吸中枢，使潮气量加大，呼吸频率增快有限。大剂量兴奋脊髓及脑干，但对大脑皮层似无影响，在阻塞性肺疾病患者发生急性通气不全时，应用此药后，潮气量、血二氧化碳分压、氧饱和度均有改善。

【药代动力学】静脉注射起效只需 20～40 秒，1～2 分钟效应最显著，持续时间仅 5～12 分钟。静脉注射后迅速代谢，代谢产物经肾排泄。半衰期（$t_{1/2}$）为 3 小时。

【药物相互作用】

1．本品能促进儿茶酚胺的释放增多，在全麻药如氟烷、异氟烷等停用 10～20 分钟后，才能使用。

2．本品与咖啡因、哌醋甲酯、匹莫林、肾上腺素受体激动药等合用，可能出现紧张、激动、失眠甚至惊厥或心律失常。

3．本品与单胺氧化酶抑制药丙卡巴肼以及升压药合用时，可使血压明显升高。

【药物过量】中毒症状：心动过速、心律失常、高血压、焦虑不安、震颤、谵妄、惊厥、反射亢进。处理：视病情给予相应的对症治疗和支持疗法。

【不良反应】头痛、无力、恶心、呕吐、出汗、感觉奇热、腹泻及尿潴留。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸多沙普仑注射液	化学药	HZ003981
注射用盐酸多沙普仑	化学药	HZ005069

HY002200 盐酸多西环素

【外文名称】Doxycycline Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】6－甲基－4－（二甲氨基）－3,5,10,12,12*a*,－五羟基－1，11－二氧代－1,4,4*a*,5,5*a*,6,11,12*a*－八氢－2－并四苯甲酰胺盐酸盐半乙醇半水合物

【分子式】$C_{22}H_{24}N_2O_8 \cdot HCl$，$1/2C_2H_5OH$，$1/2H_2O$

【分子量】512.93

【性状及组成】本品为淡黄色或黄色结晶性粉末，无臭，味苦。本品在水或甲醇中易溶，在乙醇或丙酮中微溶，在三氯甲烷中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加盐酸溶液（9→100）的甲醇溶液（1→100）溶解并稀释制成每 1ml 中含 10mg 的溶液，在 25℃时，依法测定，按无水无醇物计算，比旋度为－105°至－120°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：四环素类抗生素。

本品为广谱抑菌剂，高浓度时具杀菌作用。许多立克次体属、支原体属、衣原体属、非典型分枝杆菌属、螺旋体也对本品敏感。本品对革兰阳性菌作用优于革兰阴性菌，但肠球菌属对其耐药。其他如放线菌属、炭疽杆菌、单核细胞增多性李斯特菌、梭状芽孢杆菌、奴卡菌属、弧菌、布鲁菌属、弯曲杆菌、耶尔森菌对本品敏感。本品对淋病奈瑟菌具一定抗菌活性，但耐青霉素的淋病奈瑟菌对多西环素也耐药。多年来由于四环素类的广泛应用，临床常见病原菌对本品耐药现象严重，包括葡萄球菌等革兰阳性菌及多数革兰阴性杆菌。本品与四环素类抗生素不同品种之间存在交叉耐药。本品作用机制为药物能特异性与细菌核糖体 30S 亚基的 A 位置结合，抑制肽链的增长和影响细菌蛋白质的合成。

动物试验证实本品有致畸性。体外试验表明本品在一定浓度时有致突变的可能。

【药代动力学】本品口服吸收完全，约可吸收给

药量的90%以上，进食对本品吸收的影响小。单剂口服本品100mg后，血药高峰浓度为1.8～2.9mg/L。吸收后广泛分布于体内组织和体液，多西环素有较高的脂溶性，对组织穿透力较强，在胸导管淋巴液、腹水、肠组织、眼和前列腺组织中均有较高浓度，约为血药浓度的60%～75%，在胆汁中浓度可达同期血药浓度的10～20倍，表观分布容积为0.7L/kg。蛋白结合率为80%～93%，血浆消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为12～22小时，肾功能减退者$t_{1/2\beta}$延长不明显。本品部分在肝内代谢灭活，主要自肾小球滤过排泄，给药后24小时内可排出约35%～40%。肾功能损害患者应用本品时，药物自胃肠道的排泄量增加，成为主要排泄途径，因此本品是四环素类中可安全用于肾功能损害患者的药物。血液或腹膜透析不能清除本品。

【药物相互作用】

1．本品可抑制血浆凝血酶原的活性，所以接受抗凝治疗的患者需要调整抗凝药的剂量。

2．巴比妥类、苯妥英或卡马西平与本品同用时，上述药物可由于诱导微粒体酶的活性致多西环素血药浓度降低，因此须调整多西环素的剂量。

3．可干扰青霉素的杀菌作用，应避免与青霉素合用。

4．注射本品时不能联合用铝，钙，镁，铁等金属离子药物。

【药物过量】本品无特异性拮抗药，药物过量时应给予催吐、洗胃及大量饮水及补液等对症治疗及支持治疗。需要注意的是血液透析并不能改变本品的半衰期，并且不能给患者带来益处。

【不良反应】

1．消化系统：本品口服可引起恶心、呕吐、腹痛、腹泻等胃肠道反应。偶有食管炎和食管溃疡的报道，多发生于服药后立即卧床的患者。

2．肝毒性：脂肪肝变性患者和妊娠期妇女容易发生，亦可发生于并无上述情况的患者。偶可发生胰腺炎，本品所致胰腺炎也可与肝毒性同时发生，患者并不伴有原发肝病。

3．过敏反应：多为斑丘疹和红斑，少数病人可有荨麻疹、血管神经性水肿、过敏性紫癜、心包炎以及系统性红斑狼疮皮损加重，表皮剥脱性皮炎并不常见。偶有过敏性休克和哮喘发生。某些用本品的患者日晒可有光敏现象。所以，建议患者服用本品期间不要直接暴露于阳光或紫外线下，一旦皮肤有红斑应立即停药。

4．血液系统：偶可引起溶血性贫血、血小板减少、中性粒细胞减少和嗜酸粒细胞减少。

5．中枢神经系统：偶可致良性颅内压增高，可表现为头痛、呕吐、视神经乳头水肿等，停药后可缓解。

6．二重感染：长期应用本品可发生耐药金黄色葡萄球菌、革兰阴性菌和真菌等引起的消化道、呼吸道和尿路感染，严重者可致败血症。

7．四环素类的应用可使人体内正常菌群减少，并致维生素缺乏、真菌繁殖，出现口干、咽炎、口角炎和舌炎等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸多西环素肠溶胶囊	化学药	HZ003982
盐酸多西环素胶囊	化学药	HZ003983
盐酸多西环素胶丸	化学药	HZ003984
盐酸多西环素片	化学药	HZ003985
注射用盐酸多西环素	化学药	HZ005070

HY002201　盐酸厄洛替尼

【外文名称】Erlotinib Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗肿瘤药。

厄洛替尼的抗肿瘤作用机制主要为抑制表皮生长因子（EGFR）酪氨酸激酶胞内磷酸化。

【药代动力学】厄洛替尼口服后60%吸收，半衰期约36小时，主要由CYP3A4代谢清除。口服厄洛替尼150mg的生物利用度约60%，4小时后达血浆峰浓度。对591例接受单药厄洛替尼治疗的药代动力学分析显示，达到稳定血药浓度需7～8天，患者的年龄、体重、性别与药物的清除速率无显著关系，吸烟可使药物清除率增加24%。

【不良反应】最常见的不良反应是皮疹和腹泻，皮疹和腹泻的发生率分别为9%和6%，皮疹的中位出现时间是8天，腹泻中位出现时间为12天。

发生率大于10%的不良反应有：皮疹、腹泻、食欲减低、疲劳、呼吸困难、咳嗽、恶心、感染、呕吐、口腔炎、瘙痒、皮肤干燥、结膜炎、角膜结膜炎、腹痛。

肺毒性：有较少的报道提示在接受厄洛替尼治疗的NSCLC患者或其他实体瘤患者中可出现严重的间质性肺病（ILD），甚至导致死亡。在随机对照研究中，ILD的发生率是0.8%，并且这一发生率在厄洛替尼治疗组和安慰剂组是相同的。报道的ILD包括：肺炎、间质性肺炎、间质性肺病、闭塞性细支气管炎、肺纤维化、急性呼吸应激综合征和肺渗出。症状发生于治疗后5天到超过9个月，中位发生时

间为47天。多数患者常有混杂因素导致ILD发生，如：之前有化疗/放疗、原有实质性肺疾病、肺转移或肺部感染。当有新出现的、难以解释的肺部症状，例如：呼吸困难、咳嗽、发热等，需进行检查评价，一旦诊断ILD，应停止继续使用厄洛替尼，并采取适当治疗。

肝毒性：厄洛替尼治疗可引起无症状的肝转氨酶升高，因此，治疗期间应定期复查肝功能，包括：转氨酶、胆红素、碱性磷酸酶等，如果肝功能损害严重应减量或停药。肝功能损害常为暂时性的或伴有肝转移。

较少报道有胃肠道出血，常发生于同时应用华法林的患者，所以，同时服用华法林或其他抗凝剂的患者应监测凝血酶原时间。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸厄洛替尼片	化学药	HZ0003986

HY002202 盐酸恩卡尼

【其他名称】恩卡胺、Enkaide、哌茴苯胺、英卡胺

【外文名称】Encainide Hydrochloride

【性状及组成】本品为白色固体，溶于水，微溶于乙醇。1%水溶液的pH为5.8。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗心律失常药。

本品为苯甲酸基苯胺衍中物，属Ⅰc类抗心律失常药。其化学结构较特殊，与普鲁卡因相似。其电生理效应能降低心肌传导纤维的动作电位0相最大上升速率和幅度，轻至中度延长动作电位时程和有效不应期，提高致室颤阈值，延长房室结及旁路传导速度。此外，尚有轻度负性肌力、增加周围血管阻力、抗胆碱及β受体阻滞作用。适用于室性早搏、室性心动过速及心室颤动。也可用于室上性心动过速；对折返性心动过速，尤其是预激综合征有效。

本品对原有心肌梗死伴持续性室性心动过速者疗效不佳。

【药代动力学】口服吸收良好，1～2h达血药浓度峰值。生物利用度为42%±24%，表观分布容积为4.4～5.3L/kg，主要经肝脏代谢为*O*-去甲恩卡尼（MODE）、*N*-去甲恩卡尼（ODE）及3-甲氧-*O*-去甲恩卡尼（NDE），均有较强的药理活性。$t_{1/2}$为3～4h。有效血药浓度为2～96μg/ml。37%～78%经尿排出，5%～35%经粪便排出。本品及ODE的血浆蛋白结合率为75%～85%，而MODE的结合率为92%。

【药物相互作用】

1. 与奎尼丁合用，可明显延长HV间期和QRS间期。因此，两者合用有一定危险，特别对有希氏束-心肌传导纤维障碍患者更应注意。

2. 与西咪替丁合用，可增加血清中恩卡尼浓度。

3. 与胺碘酮合用，可加强抗心律失常作用。

4. 与β受体阻滞药合用，可增加头晕、感觉异常发生率。

5. 与维拉帕米合用，偶可致心脏传导阻滞或心搏骤停的危险。

【不良反应】口服的不良反应有头晕、头痛、恶心、呕吐、皮疹、震颤、视力障碍、共济失调、小腿痉挛、金属味等。静注可致室内传导阻滞、窦性心动过缓、室性心动过速、甚至室颤、暂时性低血压等。约使10%患者的室性心律失常加重。

HY002203 盐酸二甲弗林

【外文名称】Dimefline Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（二部）·第4册

药物理化信息

【化学名】3-甲基-7-甲氧基-2-苯基-8[（二甲氨基）甲基]-4*H*-1-苯并吡喃-4-酮盐酸盐

【分子式】$C_{20}H_{21}NO_3 \cdot HCl$

【分子量】359.85

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，几乎无臭，味极苦。

本品在水中易溶，在乙醇中溶解，在乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点应为212～217℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】本品对呼吸中枢有较强兴奋作用，用药后可见肺换气量明显增加，二氧化碳分压下降。

【药代动力学】口服吸收快而完全，作用快，维持时间2～3小时。

【药物过量】过量时可引起抽搐、惊厥。

处理：1. 惊厥时可用短效巴比妥类药（如异戊巴比妥）治疗。

2. 静脉滴注10%葡萄糖注射液，促进排泄。

3. 对症治疗。

【不良反应】恶心、呕吐及皮肤烧灼感等。用量

较大易引起抽搐或惊厥，尤见于小儿。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸二甲弗林片	化学药	HZ003987
盐酸二甲弗林注射液	化学药	HZ003988
注射用盐酸二甲弗林	化学药	HZ005071

HY002204　盐酸二甲双胍

【外文名称】Metformin Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】1,1－二甲基双胍盐酸盐

【分子式】$C_4H_{11}N_5 \cdot HCl$

【分子量】165.63

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭。本品在水中易溶，在甲醇中溶解，在乙醇中微溶，在三氯甲烷或乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为 220～225℃。

吸收系数：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中含 5μg 的溶液。照紫外－可见分光光度法，在 233nm 的波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为 778～818。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：降血糖药。

本品可降低Ⅱ型糖尿病患者空腹及餐后高血糖，HbAlc 可下降 1%～2%，本品降血糖的机制可能是：

1．增加周围组织对胰岛素的敏感性，增加胰岛素介导的葡萄糖利用。

2．增加非胰岛素依赖的组织对葡萄糖的利用，如脑、血细胞、肾髓质、肠道、皮肤等。

3．抑制肝糖原异生作用，降低肝糖输出。

4．抑制肠壁细胞摄取葡萄糖。

5．抑制胆固醇的生物合成和贮存，降低血甘油三酯、总胆固醇水平。

与胰岛素作用不同，本品无促进脂肪合成作用、对正常人无明显降血糖作用，对Ⅱ型糖尿病单独应用时一般不引起低血糖。

【药代动力学】二甲双胍主要由小肠吸收，吸收半衰期为 0.9～2.6 小时，生物利用度为 50%～60%。口服二甲双胍 0.5g 后 2 小时，其血浆浓度达峰值，近 2μg/ml。胃肠道壁内集聚较高水平二甲双胍，为血浆浓度的 10～100 倍。肾、肝的唾液内含量约为血浆浓度的 2 倍多，二甲双胍结构稳定，不与血浆蛋白结合，以原形随尿液排出，清除迅速，血浆半衰期为 1.7～4.5 小时，12 小时内 90%被清除。本品一部分可由肾小管分泌，故肾清除率大于肾小球滤过率，由于本品主要以原形由肾脏排泄，故在肾功能减退时用本品可在体内大量积聚，引起高乳酸血症或乳酸性酸中毒。

肠溶胶囊口服后由肠道吸收，与口服片剂相比，达峰时间推迟 1～2 小时，峰浓度与片剂相近，服用 1g 后，峰浓度为 1.44±0.39μg/ml，主要以原形经肾排泄。

【药物相互作用】

1．本药与胰岛素合用会加强降血糖作用，应减少胰岛素剂量。

2．可加强抗凝药（如华法林等）的抗凝血作用，导致出血倾向。

3．本品如与含醇饮料同服可发生腹痛、酸血症及体温过低。

4．本品与磺酰脲类并用时，可引起低血糖。

5．西咪替丁可增加本品的生物利用度，减少肾脏清除率，故应减少本品剂量。

【药物过量】当口服盐酸二甲双胍 85g 时尚未发生过低血糖症，但会产生乳酸性酸中毒，二甲双胍在透析条件下，透析率 170ml/min，因此透析可以有助于消除蓄积在体内的过量二甲双胍。

【不良反应】

1．常见的有：恶心、呕吐、腹泻、口中有金属味。

2．有时有乏力、疲倦、头晕、皮疹。

3．乳酸性酸中毒虽然发生率很低，但应予注意。临床表现为呕吐、腹痛、过度换气、神志障碍，血液中乳酸浓度增加而不能用尿毒症、酮症酸中毒或水杨酸中毒解释。

4．可减少肠道吸收维生素 B_{12}，使血红蛋白减少，产生巨幼红细胞性贫血，也可引起吸收不良。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
二甲双胍格列本脲胶囊（Ⅰ）	化学药	HZ000840
二甲双胍格列本脲胶囊（Ⅱ）	化学药	HZ000841
二甲双胍格列本脲片（Ⅰ）	化学药	HZ000842
二甲双胍格列本脲片（Ⅱ）	化学药	HZ000843
二甲双胍格列齐特片	化学药	HZ000844
复方二甲双脲格列吡嗪胶囊	化学药	HZ001155
格列本脲二甲双胍片（1.25/250）	化学药	HZ001590

续表

制剂名称	类别	序号
盐酸二甲双胍肠溶胶囊	化学药	HZ003989
盐酸二甲双胍肠溶片	化学药	HZ003990
盐酸二甲双胍缓释胶囊	化学药	HZ003991
盐酸二甲双胍缓释片	化学药	HZ003992
盐酸二甲双胍胶囊	化学药	HZ003993
盐酸二甲双胍片	化学药	HZ003994

HY002205 盐酸二氢埃托啡

【外文名称】Dihydroetorphine Hydrochloride

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第52册

药物理化信息

【化学名】7α－［1－（*R*）－羟基－1－甲基丁基］6,14－内乙桥四氢东罂粟碱的盐酸盐

【分子式】$C_{25}H_{35}NO_4 \cdot HCl$

【分子量】450.02

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末。

本品在甲醇中溶解，在水或乙醇中微溶，在三氯甲烷中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加甲醇溶解并定量稀释制成每1ml中含10mg的溶液，依法测定，比旋度为－64.5°至－69.0°。

药物药理信息

【药理毒理】本品为高效镇痛药，是阿片受体的纯激动剂，与μ、δ、κ受体的亲和力都远远大于吗啡，特别对μ受体的亲和力大于δ和κ上千倍。其镇痛作用的量效关系与吗啡一样呈直线型，药理活性强度比吗啡强6000～10000多倍。故安全系数（即治疗指数）比吗啡大，身体依赖性潜力比吗啡明显为轻。慢性给予二氢埃托啡的猴，不论是突然停药还是皮下注射拮抗剂烯丙吗啡催瘾，产生的戒断症状都较吗啡明显为轻。用大鼠自动注射给药法研究其精神依赖性潜力，结果同样表明比吗啡为轻。Ⅰ期临床试验表明，受试者中没有反映有欣快感，相反当剂量较大时，却有头晕、恶心、呕吐、乏力等不良反应。以往对阿片受体激动剂的传统观念认为，镇痛作用越强，欣快感越明显，成瘾性也越大。而二氢埃托啡的镇痛剂量最小，止痛作用最强，却无欣快感反应，故其成瘾潜在性小。Ⅱ期临床试验及推广试用的3000多人次结果表明，本品镇痛作用的总有效率高达99.6%。二氢埃托啡还具有镇静和解痉的中枢作用。对呼吸的抑制作用相对比吗啡轻，在规定的镇痛剂量下很少发生呼吸抑制（0.83%），当超剂量使用时可明显抑制呼吸。若由静脉给药，剂量大于0.4μg/kg时，抑制呼吸明显，需进行呼吸管理。长期应用同样有耐受性的产生，也有依赖现象。本品的主要不足为镇痛有效时间较短。

毒理：急性毒性 LD_{50}（mg/kg）：皮下，小鼠82±17。兔，0.047±0.016（吗啡436±70.533）。

【药代动力学】本品口服吸收差，ED_{50}高达123（98～153）μg/kg，舌下吸收快，经10～15分钟疼痛可获明显减轻，剂量仅相当于口服的1/30。由于用量极小，目前尚无用于人体药动学研究的药物检测方法。

【药物过量】在规定剂量内使用时未发生过中毒反应，但在非医嘱或用法不当的超量用药时，可发生急性中毒，主要表现为呼吸近乎停止，昏迷等，用烯丙吗啡或纳洛酮可迅速解救。

【不良反应】本品用于各种疼痛病例时，在治疗剂量下一般无明显不良反应，少数病人可出现头晕、恶心、呕吐、乏力、出汗，卧床病人比活动病人反应轻。这些反应可不经任何处理而自愈。偶见呼吸抑制。未见吗啡样致便秘作用。偶见呼吸减慢至每分钟10次左右，用呼吸兴奋药尼可刹米可纠正，也可用吸氧纠正。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸二氢埃托啡舌下片	化学药	HZ003995
盐酸二氢埃托啡注射液	化学药	HZ003996

HY002206 盐酸二氧丙嗪

【其他名称】克咳敏、盐酸二氧异丙嗪

【外文名称】Dioxopromethazine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】10－（2－二甲氨基－异丙基）吩噻嗪－5,5－二氧化物的盐酸盐

【分子式】$C_{17}H_{20}N_2O_2S \cdot HCl$

【分子量】352.88

【性状及组成】本品为白色或微黄色的粉末或结晶性粉末，无臭，味苦。本品在水中溶解，在乙醇中极微溶解。

吸收系数：取本品，精密称定，加0.1mol/L盐酸溶液溶解并定量稀释制成每1ml中含10μg的溶液，

照紫外－可见分光光度法，在264nm的波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为350～370。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：镇咳药。

1．药理：本品具有较强的镇咳作用。并有抗组胺、解除平滑肌痉挛、抗炎和局部麻醉作用。镇咳作用出现于服药后的30～60分钟，持续4～6小时或更长。

2．毒理：本品无肝肾等脏器的毒性。经过致畸研究，对胎儿无伤害。未发现其成癌性。

【药代动力学】镇咳作用出现于服药后的30～60分钟，持续4～6小时或更长。

【不良反应】常见的不良反应为困倦、乏力等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
二氧丙嗪苯丙哌林片	化学药	HZ000864
复方氨酚葡锌片（1）	化学药	HZ001035
复方氨酚葡锌片（2）	化学药	HZ001036
复方二氧丙嗪茶碱片	化学药	HZ001158
盐酸二氧丙嗪颗粒	化学药	HZ003997
盐酸二氧丙嗪片	化学药	HZ003998

HY002207　盐酸伐地那非

【外文名称】Vardenafil Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】伐地那非（Vardenafil）为第2个磷酸二脂酶5抑制剂（PDE－5 inhibitor）。阴茎的勃起是在外周和中枢神经系统联合作用下以阴茎海绵体平滑肌松弛和血管舒张为目的的血流动力学过程。在性和观感的刺激下，海绵窦神经和内皮细胞释放一氧化氮（NO），促进环磷酸腺苷（cGMP）增多，导致细胞内Ca^{2+}水平下降，从而导致海绵体平滑肌细胞舒张，流入阴茎的血流增多，海绵窦扩张，静脉回流减少，阴茎勃起。PDE－5主要存在于阴茎血管平滑肌细胞中，使cGMP降解为失活的GMP。PDE－5抑制剂选择性地阻断cGMP的降解过程，促使cGMP水平升高，平滑肌松弛，阴茎勃起。目前，高选择性磷酸二酯酶5型（PDE5）抑制剂只选择性抑制PDE5，而不对其他PDE作用，特别是不抑制PDE6。其目的以减少西地那非治疗勃起功能障碍后的不良反应，如头痛、肌肉痛、骨骼痛、头晕、面颊部潮红、焦虑、消化不良、血尿、心肌梗死、高血压、脑血管出血等。

伐地那非可使人体内cGMP水平升高，导致NO介导的刺激作用增强，阴茎海绵体内平滑肌松弛，血液充盈，有利于引发和维持阴茎勃起，用后10分钟起效，在性生活前60分钟服用，一般剂量为10mg。

【药代动力学】口服在胃肠道吸收迅速，生物利用度为60%，单剂量10mg或20mg顿服，血浆药物浓度达峰时间分别为0.7～0.9小时，血浆峰浓度为9.05μg/ml和20.9μg/ml。药动学显示其吸收并呈量效的线性关系。血浆半衰期为3.9～4.2小时，血浆蛋白结合率为95%，主要在肝脏代谢，经肝酶CYP450 3A4酶代谢，95%由粪便中排出，5%由尿液中排出。

【药物相互作用】

1．对由肝酶CYP40酶系统抑制药物合用，可能影响本品的消除。与红霉素联用时剂量不宜超过5mg。

2．与α受体阻断剂合用时可引起低血压，因此正在服用α受体阻断剂者禁用本品。

3．正在服用硝酸酯类药或一氧化氮供体类药物者不宜同时服用本品。

4．建议患者在服用本品期间不宜饮用葡萄柚汁，以免影响本品的血浆浓度。

【不良反应】常见有头痛、面颊潮红、焦虑、消化不良、腹部不适、肌肉疼痛、骨骼疼痛、血尿；循环系统表现为心律失常、心肌梗死、心脏猝死、脑血管出血、高血压、Q－T间期延长；视觉系统表现为对光敏感、视力模糊、鼻炎、复视、眼部肿胀、眼内压升高、视物蓝绿模糊；但副作用多轻微且为一过性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸伐地那非片	化学药	HZ003999

HY002208　盐酸伐昔洛韦

【其他名称】万乃洛韦、盐酸万乃洛韦

【外文名称】Valaciclovir Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】L－缬氨酸－2－［（6－氧代－2－氨基－1,6－二氢－9*H*－嘌呤－9－基）甲氧基］乙基酯盐酸盐

【分子式】$C_{13}H_{20}N_6O_4 \cdot HCl$

【分子量】360.80

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉

末，无臭，味微苦，有引湿性。

本品在水中易溶，在甲醇中微溶，在乙醇中极微溶解，在三氯甲烷中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 含 40mg 的溶液，依法测定，比旋度为 -8.5°至 -11.5°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗病毒药。

本品是阿昔洛韦的前体药物，口服后吸收迅速并在体内很快转化为阿昔洛韦，其抗病毒作用为阿昔洛韦所发挥，阿昔洛韦进入疱疹病毒感染的细胞之后，与脱氧核苷竞争病毒胸腺嘧啶激酶或细胞激酶，药物被磷酸化成活化型无环鸟苷三磷酸酯，作为病毒复制的底物与脱氧鸟嘌呤三磷酸酯竞争病毒 DNA 多聚酶，从而抑制了病毒 DNA 合成，显示抗病毒作用。

盐酸伐昔洛韦口服生物利用度高，故体内抗病毒活性优于阿昔洛韦，对单纯疱疹病毒Ⅰ型和Ⅱ型的治疗指数分别比阿昔洛韦高 42.91% 和 30.13%。对水痘带状疱疹病毒也有很高的疗效，对哺乳动物宿主细胞的毒性很低。

盐酸伐昔洛韦大、小鼠灌胃给药的半数致死量（LD_{50}）分别为 4.4g/kg 和 1.51g/kg，高于临床给药剂量数百倍。由于盐酸伐昔洛韦在体内很快转化为阿昔洛韦，其代谢产物在体内没有蓄积现象，因此，当调整与阿昔洛韦相同血药浓度水平时，在不同阶段的慢性和亚慢性试验中，盐酸伐昔洛韦与阿昔洛韦具有相同的安全性。在临床剂量范围内，盐酸伐昔洛韦是很安全的。

【药代动力学】本品口服后迅速吸收转化为阿昔洛韦，阿昔洛韦血药峰浓度约为（2.59 ± 0.82）μg/ml，血中阿昔洛韦达峰时间为 0.88 ~ 1.75 小时。口服生物利用度为 67% ± 13%，是阿昔洛韦的 3 ~ 5 倍。本品进入体内后广泛分布，可分布至多种组织中，其中胃、小肠、肾、肝、淋巴结和皮肤组织中浓度最高，脑组织中的浓度最低。本品在体内全部转化为阿昔洛韦，代谢物主要从尿中排除，其中阿昔洛韦占 46% ~ 59%，8 - 羟基 - 9 - 鸟嘌呤占 25% ~ 30%，9 - 羟基甲氧基鸟嘌呤占 11% ~ 12%。阿昔洛韦原形为单相消除，血浆消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为 2.86 ± 0.39 小时。

【药物相互作用】

1. 与齐多夫定合用可引起肾毒性，表现为深度昏睡和疲劳。

2. 与丙磺舒竞争性抑制有机酸分泌，合用丙磺舒可使阿昔洛韦的排泄减慢，半衰期延长，体内药物蓄积。

【不良反应】偶有头晕、头痛、关节痛、恶心、呕吐、腹泻、胃部不适、食欲减退、口渴、白细胞下降、蛋白尿及尿素氮轻度升高、皮肤瘙痒等，长程给药偶见痤疮、失眠、月经紊乱。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸伐昔洛韦胶囊	化学药	HZ004000
盐酸伐昔洛韦颗粒	化学药	HZ004001
盐酸伐昔洛韦片	化学药	HZ004002

HY002209 盐酸法舒地尔

【外文名称】Fasudil Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】六氢 - 1 - （5 - 磺酰基异喹啉）- 1（*H*）- 1,4 - 二氮杂䓬盐酸盐。

【分子式】$C_{14}H_{17}N_3O_2S \cdot HCl \cdot 1/2H_2O$

【分子量】336.84

药物药理信息

【药理毒理】法舒地尔可抑制平滑肌收缩最终阶段的肌球蛋白轻链磷酸化，使血管扩张而显示以下作用。

1. 脑血管痉挛的缓解及预防作用：向狗颅内两次注入自身血引起的狗迟发性脑血管痉挛模型，静脉内给本剂可缓解其痉挛。早期连续给药可预防脑血管痉挛的发生。

2. 脑血流改善作用：改善狗迟发性脑血管痉挛模型的大脑皮质血流。对两侧颈总动脉闭塞引起的大鼠脑缺血模型，可增加缺血部位的脑局部血流量。用正电子发射 CT（PAT）定量性测定脑缺血部位的脑血流量，结果脑血流量增加 5 倍。

3. 脑葡萄糖利用率的改善作用：对两侧颈总动脉闭塞引起的大鼠脑缺血模型，可部分增加脑局部葡萄糖利用率。

4. 脑神经细胞变性的抑制作用：可抑制一过性两侧颈总动脉闭塞引起的沙鼠脑缺血模型的迟发性神经细胞变性。

5. 体外实验：可使离体的脑血管松弛。可抑制因钙离子引起的离体血管的收缩。可抑制各种不同机制脑血管收缩药物的收缩作用。抑制细胞内钙离子致血管收缩。此时，不会降低细胞内钙浓度。抑制血管收缩时肌球蛋白轻链磷酸化物的生成。在试管内构成与体内相似条件时，同样出现抑制肌球蛋白轻链磷酸化酶的效果。

毒理：未见性别差异。另外，猴静脉内给药的

致死量约为 20～28mg/kg。

亚急性及慢性毒性试验：用大鼠和猴静脉内给药试验，探讨了亚急性及慢性毒性。两种动物均在给大剂量（大鼠 > 25mg/kg、猴 > 6.25mg/kg）时，见到自主运动减少、伏卧位、蹲位等症状。对大鼠和猴进行的临床及病理学检查，发现药物毒性作用的靶位脏器为肾脏。两者均未见性别差异。所出现的临床症状及病理学变化均于停药后恢复。

生殖及发育毒性试验：用大鼠及家兔进行妊娠前及妊娠初期给药试验，发现大剂量给药会引起排卵数轻度减少。胎仔器官形成期给药试验以及围产期和哺乳期给药试验，见到轻度抑制子代体重增加等。但未见致畸性。另外，对其他生殖能力及子代进行观察也未见影响。

抗原性试验：家兔被动红细胞凝集（PHA）反应出现弱阳性。豚鼠被动皮肤过敏（PCA）反应未检出特异性抗体，用小鼠进行的试验也呈阴性，因此认为抗原性极弱。

致突变性试验：染色体畸变试验发现高浓度会引起细胞核内双倍体增加，为此进行了各种补充试验，但未发现染色体不分离及疑在体内诱发细胞核内双倍体在内的四倍体现象。而且一般毒性试验以及生殖和发育毒性试验，也未见增殖性细胞由来的组织和器官异常，因此认为无致突变性。

局部刺激性试验：家兔耳廓静脉 3 分钟贮留法，未见刺激性。

【药代动力学】健康成人单次用 30 分钟静脉内持续给盐酸法舒地尔 0.4mg/kg 时，血浆中原形药物浓度在给药结束时达最高值，其后迅速衰减。消除半衰期为约 16 分钟。另外，盐酸法舒地尔的主要代谢产物为异喹啉骨架 1 位的羟化体及其络合体。给药后 24 小时以内的原形及代谢物合计尿中累积排泄率为给药量的 67%。

蛛网膜下腔出血术后患者，反复静脉滴注盐酸法舒地尔 30 mg，1 日 3 次，共 14 日的血浆中浓度变化，与健康成人类似。

动物试验资料：大鼠及猴静脉内给 ^{14}C 标记的盐酸法舒地尔时，血液中放射能浓度自给药结束后迅速减少，消除半衰期为大鼠约 1 小时，猴 1.4 小时。放射能在给药后迅速移行于各组织。尤其高浓度分布于肾脏及肝脏，其消除速度比血浆中浓度缓慢。另也移行于脑内。猴还分布于皮肤，其消除缓慢。大鼠及猴均迅速排泄，大鼠以同程度排泄于尿及胆汁中，猴主要向尿中排泄。也向乳汁及胎仔移行，但迅速消除。主要代谢产物有异喹啉骨架 1 位的羟化体及其络合体，主要代谢组织为肝脏。大鼠一日 1 次反复静脉内给药，估计在给药 21 次时血浆中浓度接近稳态。反复给药不影响粪尿中排泄。反复给药时的组织内浓度随给药次数的增加而升高，但估计给药 21 次时接近稳态。另外，反复给药后从组织中的消除速度比血浆中浓度缓慢，与单次给药相比可见延迟倾向。

【不良反应】本药在总病例 4907 例中，571 例（11.64%）出现不良反应。其主要不良反应有 AST（GOT）、ALT（GPT）、ALP、LDH 升高等肝功能异常 375 例（7.64%），颅内出血 80 例（1.63%），低血压 29 例（0.59%）。（1999 年 6 月安全性定期报告）。

重大不良反应：颅内出血（1.63%），有时会出现颅内出血。消化道出血、肺出血、鼻出血、皮下出血（0.29%），有时会出现消化道出血、肺出血、鼻出血、皮下出血等出血，故注意观察，若出现异常，应停药并予以适当处置。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸法舒地尔注射液	化学药	HZ004003

HY002210　盐酸非那吡啶

【外文名称】Phenazopyridine Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】盐酸非那吡啶为偶氮化合物，口服后以原型从尿液排出，尿液中的药物可直接作用于泌尿道黏膜并发挥止痛作用，阻断感觉传导，消除膀胱感觉超敏状态。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸非那吡啶胶囊	化学药	HZ004004

HY002211　盐酸非索非那定

【外文名称】Fexofenadine

药物理化信息

【化学名】（±）－4－［1－羟基－4－［4－（羟基二苯基甲基）－1－哌啶］－丁基］－α，α－二甲基苯乙酸盐酸盐

【分子式】$C_{32}H_{39}NO_4 \cdot HCl$

【分子量】538.13

药物药理信息

【药理毒理】盐酸非索非那定可选择性作用于外周 H_1 受体，发挥抗组胺作用，是第二代非镇静性抗组胺药，为特非那定的活性代谢物；其作用具有高效、长效、低毒的特点。

小鼠、大鼠、狗单次口服盐酸非索非那定的大约致死量分别为 > 5146 > 5146 > 450mg/kg。

大鼠静脉注射的大约致死量分别为 > 25，< 50mg/kg。狗口服 1 和 6 个月的无毒性量为 900mg/kg。小鼠口服 3 个月的无毒性量：雌、雄性分别为 10324 和 8722mg/（kg·d）。在以上长毒实验中可见轻度抑制体重增加、摄食量减少；呕吐、唾液分泌增加、黄白色大便；AST 和 ALT 上升，肝小叶中心性肥大等。无致畸、致癌及突变作用。

【药代动力学】 单次口服盐酸非索非那定 20～180mg 后，药动学参数与剂量呈线性关系，口服消除半衰期为 9.6 小时。盐酸非索非那定每次 60mg 和 120mg，2 次/日，7 日内反复给药，结果显示，服药后第 2 天，血药浓度达到稳定，无蓄积性。单次口服盐酸非索非那定 120mg 于 48 小时内，盐酸非索非那定在尿中的排泄率约为 12.4%，*N* - 脱烷集体（M5）代谢物在尿中的排泄率为 0.71%。口服盐酸非索非那定 60mg 后第 11 天，80%经粪便排泄，尿中排泄约 11.5%。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸非索非那定片	化学药	HZ004005

HY002212 盐酸芬地林

【其他名称】 苯乙二苯丙胺、Cordan、Difmecor、Fendilar、Sensit

【外文名称】 Fendiline Hydrochloride

【性状及组成】 本品为白色或淡粉红色粉末，微溶于水，易溶于甲醇、乙醇、三氯甲烷。

药物药理信息

【药理毒理】 本品为普尼拉明类钙拮抗药，化学结构及作用与普尼拉明极相似，用于劳力型心绞痛。

HY002213 盐酸芬氟拉明

【外文名称】 Fenfluramine Hydrochlordie

药物管理信息

【依据标准】 卫生部颁药品标准（二部）·第 3 册

药物理化信息

【化学名】 *N* - 乙基 - α - 甲基 - 3 - 氟甲基苯乙基胺盐酸盐

【分子式】 $C_{12}H_{16}F_3N \cdot HCl$

【分子量】 267.72

【性状及组成】 本品为白色结晶性粉末，无臭。

本品在三氯甲烷或乙醇中易溶，在水中溶解，在乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为 169～173℃。

药物药理信息

【药理毒理】 本品为苯丙胺类食欲抑制剂。具有中枢兴奋作用，但强度较弱。可使血压下降，亦能增加周围组织对葡萄糖的利用而降低血糖，还有降低甘油三酯、胆固醇、总血浆脂质的作用。

【药代动力学】 口服吸收良好，经 2～4 小时达最高血药浓度，作用维持 6～8 小时，其半衰期为 18～30 小时，3～4 天后血药水平可达稳态，产生疗效。大部分以代谢物形式从尿中缓慢排出。

【药物相互作用】

1. 忌与单胺氧化酶制剂合用。

2. 对肥胖伴有高血压和糖尿病患者，在与降血压或降血糖药合用时，可产生协同作用，应适当减少剂量。

【不良反应】 常见有非腹泻性大便次数增多、头晕、嗜睡、口干、腹部不适、恶心、夜尿增多及抑郁等症状，但一般均可耐受，且能在持续用药中逐渐消除，不能耐受者减量则上述症状即可消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸芬氟拉明片	化学药	HZ004006

HY002214 盐酸酚苄明

【外文名称】 Phenoxybenzamine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 *N* -（1 - 甲基 - 2 - 苯氧乙基）- *N* -（2 - 氯乙基）苯甲胺盐酸盐

【分子式】 $C_{18}H_{22}ClNO \cdot HCl$

【分子量】 340.29

【性状及组成】 本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，几乎无味。

本品在乙醇或三氯甲烷中易溶，在水中极微溶解。

熔点：本品的熔点为 137～140℃。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：α 肾上腺素受体阻滞药。

药理作用：盐酸酚苄明胶囊是作用时间长的 α

-受体阻滞剂（α_1、α_2）。作用于节后 α 肾上腺素受体，防止或逆转内源性或外源性儿茶酚胺作用。使周围血管扩张，血流量增加，卧位时血压稍下降，直立时可显著下降。血压下降可反射性引起心率增快。可使前列腺、膀胱颈平滑肌松弛。

致癌、致突变和生殖毒性：小鼠淋巴瘤实验及艾姆斯（Ames，检查致癌物质）实验表明，盐酸酚苄明有体外致突变活性；小鼠微核实验（micronucleus test）则没有显示本品有致突变活性。大鼠或小鼠腹腔内连续注射盐酸酚苄明，能引起腹膜肉瘤。大鼠长期口服给药能引起胃肠道恶性肿瘤，绝大多数是胃非腺性恶性肿瘤。在长期口服实验中，大鼠溃疡性或糜烂性胃炎发生率高，可能亦与药物作用有关。尚无盐酸酚苄明影响生殖的研究结果。

【药代动力学】口服后约 20%～30% 的盐酸酚苄明在胃肠道以活性形式吸收，口服用药的半衰期（$t_{1/2}$）尚不清楚，口服后数小时开始作用，持续 3～4 天。本品在肝内代谢，多数药物 24 小时内从肾及胆汁排出，少量在体内保留数天。

静脉注射本品后 1 小时作用达高峰，消除半衰期（$t_{1/2}$）约为 24 小时。由于本品与 α 受体结合牢固，排泄缓慢，故静脉用药作用可持续 3～4 天。一日给药一次，其效应累计可长达一周。静脉输注 12 小时后约排出 50%。

【药物相互作用】

1. 与拟交感胺类合用，升压效应减弱或消失；

2. 与胍乙啶合用，易发生体位性低血压；

3. 与二氮嗪合用时拮抗后者抑制胰岛素释放的作用；

4. 本品可阻断左旋去甲肾上腺素引起的体温过高，亦可阻断利血平引起的体温过低症。

5. 本品与 α、β 受体激动剂（如肾上腺素）合用可导致严重低血压。

【药物过量】药物过量时出现体位性低血压、头晕、疲劳、心动过速、呕吐、嗜睡或休克，应立即停药，同时给予抗休克治疗。轻者置患者于头低脚高卧位，恢复脑供氧，绑腿和腹带加压有助于减轻患者的低血压反应和缩短药物反应时间；严重的低血压反应，需静脉输注去甲肾上腺素重酒石酸盐，拮抗盐酸酚苄明的 α 受体阻滞作用。酚苄明过量时，不能使用肾上腺素。

【不良反应】常见体位性低血压、鼻塞、口干、瞳孔缩小、反射性心跳加快和胃肠刺激。少见神志模糊、倦怠、头痛、阳痿、嗜睡，偶可引起心绞痛和心肌梗死。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方酚苄明片	化学药	HZ001162
盐酸酚苄明胶囊	化学药	HZ004007
盐酸酚苄明片	化学药	HZ004008
盐酸酚苄明注射液	化学药	HZ004009

HY002215　盐酸呋喃硫胺

【外文名称】Fursultimine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 10 册

【分子式】$C_{17}H_{26}N_4O_3S_2 \cdot HCl$

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭或略有类似蒜臭。

本品在水中易溶，在乙醇中微溶，在苯或乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：维生素类药。

呋喃硫胺是维生素 B_1 的新型衍生物，在体内迅速转化为活性硫胺，不为体内硫胺酶分解，对组织亲和力强，脏器浓度高，血中浓度高，维持时间长，具有高效、长效、低毒的特性。与维生素 B_1 一样，活性硫胺在体内与焦磷酸结合成辅酸酶。参与糖代谢中丙酮酸和 α-酮戊二酸的氧化脱羧反应，是糖类代谢所必需。缺乏时，氧化受阻形成丙酮酸，乳酸堆积，并影响机体能量供应。其症状主要表现在神经和心血管系统，出现感觉神经和运动神经均受影响的多发性周围神经炎，表现为感觉异常，神经痛，四肢无力，以及肌肉酸痛和萎缩等症状。心血管方面由于血中丙酮和乳酸增多，使小动脉扩张，舒张压下降，心肌代谢失调，故易出现心悸，急促，胸闷，心脏肥大，肝肺充血和周围水肿等心脏功能不全的症状。消化道方面表现为食欲下降导致衰弱和体重下降等。

【药代动力学】呋喃硫胺是维生素 B_1 的衍生物，在体内迅速转化为活性硫胺，不为体内硫胺酶分解，对组织亲和力强，脏器与血中浓度高，维持时间长，具有高效、长效、低毒的特性。

【不良反应】偶见头昏、乏力、恶心、呕吐，停药后即消失，偶见过敏反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用复方三维 B	化学药	HZ004763
乙诺奇片	中成药	ZC006803

HY002216 盐酸氟奋乃静

【其他名称】Anatensol、Dapotum、氟非纳静、氟奋乃静、Prolixin、羟哌氟丙嗪

【外文名称】Fluphenazine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】4 - ［3 - ［2 - （三氟甲基） - 10*H* - 吩噻嗪 - 10 - 基］丙基］ - 1 - 哌嗪乙醇二盐酸盐

【分子式】$C_{22}H_{26}F_3N_3OS \cdot 2HCl$

【分子量】510.44

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶性粉末，无臭，味微苦，遇光易变色。本品在水中易溶，在乙醇中略溶，在丙酮中极微溶，在苯或乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为 226 ~ 233℃，熔融时同时分解。

吸收系数：取本品，精密称定，加盐酸溶液（9→1000）溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 10μg 的溶液，照紫外 - 可见分光光度法，在 255nm 的波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为 553 ~ 593。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗精神病药。

本品属哌嗪类吩噻嗪，抗精神病作用主要与其阻断脑内的多巴胺受体（DA_2）有关，抑制网状结构上行激活系统而有镇静作用，止吐和降低血压作用较弱。

【药代动力学】口服吸收好，在肝脏代谢，活性代谢产物为亚砜基、*N* - 羟基衍生物，半衰期为 13 ~ 24 小时。本品具有高度亲脂性与高度的蛋白结合率，并可通过胎盘屏障进入胎血循环，亦可分泌入乳汁，小儿、老龄者对本品的代谢与排泄均降低。

【药物相互作用】

1. 本品与乙醇或其他中枢神经系统抑制药合用，中枢抑制作用加强。

2. 本品与抗高血压药合用易致体位性低血压的危险。

3. 本品与舒托必利合用，有发生室性心律紊乱的危险，严重者可致尖端扭转心律失常。

4. 本品与阿托品类药物合用，不良反应加重。

5. 本品与锂盐合用，可引起意识丧失。

【药物过量】中毒症状：超剂量可致严重的锥体外系反应，主要表现为角弓反张，扭转痉挛、粗大震颤，运动不能，吞咽困难等。

处理：立即停药，吞服大量药物者应及时洗胃，并依病情给予对症治疗及支持疗法。

【不良反应】锥体外系反应多见，如静坐不能、急性肌张力障碍和类帕金森病。长期大量使用可发生迟发性运动障碍。可发生心悸、失眠、乏力、口干、视物模糊、排尿困难、便秘、溢乳、男子女性化乳房、月经失调、闭经等。少见思睡、躁动、眩晕、尿潴留。偶见过敏性皮疹、白细胞减少及恶性综合征。偶可引起体位性低血压、心悸或心电图改变、中毒性肝损害或阻塞性黄疸、骨髓抑制、癫痫。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸氟奋乃静片	化学药	HZ004010
盐酸氟奋乃静注射液	化学药	HZ004011

HY002217 盐酸氟桂利嗪

【外文名称】Flunarizine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（*E*） - 1 - ［双（4 - 氟苯基）甲基］ - 4 - （2 - 丙烯基 - 3 - 苯基） - 哌嗪二盐酸盐

【分子式】$C_{26}H_{26}F_2N_2 \cdot 2HCl$

【分子量】477.42

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶或结晶性粉末，无臭，无味。本品在甲醇或乙醇中略溶，在三氯甲烷中微溶，在水中极微溶解，在苯中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 204 ~ 210℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：血管扩张药。

本品能防止因缺血等原因导致的细胞内病理性钙超载而造成的细胞损害。本品具有：

1. 缓解血管痉挛，对血管收缩物质引起的持续性血管痉挛有持久的抑制作用，尤其对基底动脉和颈内动脉明显，其作用比脑益嗪强 15 倍；

2. 前庭抑制作用，能增加耳蜗小动脉血流量，改善前庭器官循环；

3. 抗癫痫作用，本品可阻断神经细胞的病理性钙超载而防止阵发性去极化，细胞放电，从而避免癫痫发作；

4. 保护心肌，明显减轻缺血性心肌损害；

5. 氟桂利嗪尚有改善肾功能之作用，可用于慢性肾功能衰竭；

6. 另外本品还有抗组织胺作用。

【药代动力学】本品口服 2～4 小时达血浆峰值，$t_{1/2}$为 2.4～5.5 小时，体内主要分布于肝、肺、胰、并在骨髓、脂肪中积蓄。连服 5～6 周达稳态血药浓度，90%与血浆蛋白结合，可通过血脑屏障，并可随乳汁分泌。绝大部分经肝脏代谢，并由消化道排泄。经胆汁进入肠道，经大便排泄。

【药物相互作用】

1．与酒精、催眠药或镇静药合用时，加重镇静作用。

2．与苯妥英钠，卡马西平联合应用时，可以降低氟桂利嗪的血药浓度。

3．放射治疗病人合用氟桂利嗪，可提高对肿瘤细胞的杀伤力。

4．在应用抗癫痫药物治疗的基础上加用氟桂利嗪可以提高抗癫痫效果。

【不良反应】

1．中枢神经系统的不良反应有：

（1）嗜睡和疲惫感为最常见。

（2）长期服用者可以出现抑郁症，以女性病人较常见。

（3）锥体外系症状，表现为不自主运动、下颌运动障碍、强直等。多数用药 3 周后出现，停药后消失。老年人中容易发生。

（4）少数病人可出现失眠，焦虑等症状。

2．消化道症状表现为：胃部烧灼感，胃纳亢进，进食量增加，体重增加。

3．其他：少数病人可出现皮疹，口干，溢乳，肌肉酸痛等症状。但多为短暂性，停药可以缓解。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸氟桂利嗪胶囊	化学药	HZ004012
盐酸氟桂利嗪片	化学药	HZ004013

HY002218　盐酸氟西泮

【外文名称】Flurazepam Hydrochloride

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】1－［α－（二乙氨基）乙基］－5－（α－氟苯基－7－氯－1,3－二氢－2*H*－1,4－苯并二氮杂䓬－α－酮二盐酸盐

【分子式】$C_{21}H_{23}ClFN_3O\cdot 2HCl$

【分子量】460.81

【性状及组成】本品为类白色或微黄色结晶性粉末，几乎无臭，味苦，有强引湿性，遇光变质。本品在水中极易溶解，在甲醇中易溶，在乙醇或三氯甲烷中溶解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗焦虑药。

本品为苯二氮䓬类镇静催眠药，作用于中枢苯二氮䓬受体，促进中枢抑制性神经递质 γ－氨基丁酸（GABA）与其受体结合，增强 GABA 的活性。具有镇静、催眠、抗焦虑及骨骼肌松弛的作用。

【药代动力学】口服后由胃肠道充分吸收，经肝脏代谢。代谢物去羟氟西泮，半衰期（$t_{1/2}$）为 30～100 小时，属长效药。口服后 15～45 分钟作用开始，0.5～1 小时血药浓度达峰值。7～10 天血药浓度达稳态。经肾排泄，代谢物可滞留在血液中数天。

【药物相互作用】

1．本品与易成瘾的和其他可能成瘾药合用时，成瘾的危险性增加。

2．饮酒及与全麻药、可乐定、镇痛药、单胺氧化酶抑制药和三环类抗抑郁药合用时，可相互增效。

3．与抗酸药合用时可延迟本品的吸收。

4．本品与抗高血压药或与利尿降压药合用时，可使降压作用增强。

5．本品与钙离子通道阻断剂及其他降血压药物合用时，可使其降压作用增强。

6．本品与西咪替丁合用时可以抑制本品的肝脏代谢，从而使清除减慢，血药浓度升高。

7．本品与普萘洛尔合用时可导致癫痫发作的类型和（或）频率改变，应及时调整剂量。

8．本品与卡马西平合用时，由于肝微粒体酶的诱导可使两者的血药浓度下降，消除半衰期缩短。

9．本品与左旋多巴合用时，可降低后者的疗效。

10．本品与抗真菌药酮康唑、伊曲康唑合用，可提高本品疗效并增加其毒性。

11．与利福平合用时，可增加本品的消除，使血药浓度降低。

12．与异烟肼合用时，可抑制本品的消除，使血药浓度增高。

【药物过量】中毒症状：大剂量中毒时，可出现昏迷、血压降低、呼吸抑制和心动缓慢等。

处理：立即催吐、洗胃、导泻以排除药物，并依病情给予对症治疗及支持疗法。

【不良反应】常见嗜睡，可见无力、头痛、晕眩、恶心、便秘等。偶见皮疹，罕见中毒性肝损害、骨髓抑制。男性偶见阳痿。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸氟西泮胶囊	化学药	HZ004014

HY002219 盐酸氟西汀

【外文名称】Fluoxetine Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】（±）－*N*－甲基－γ－［4－（三氟甲基）－苯氧基］－苯丙胺盐酸盐

【分子式】$C_{17}H_{18}F_3NO \cdot HCl$

【分子量】345.79

药物药理信息

【药理毒理】盐酸氟西汀是一种选择性的5－羟色胺再摄取抑制剂（SSRI），其能有效地抑制神经元从突触间隙中摄取5－羟色胺，增加间隙中可供实际利用的这种神经递质，从而改善情感状态，治疗抑郁性精神障碍。

【药代动力学】本品口服后吸收很快，血浆氟西汀浓度约在6～8小时达峰。大约95%与血浆蛋白结合。主要在肝脏中代谢成活性代谢产物去甲氟西汀及其他代谢物，从肾脏由尿排出。据文献报道，不论氟西汀还是其代谢产物去甲氟西汀排泄均很慢。其半衰期：氟西汀短期给药为1～3天，长期给药为4～6天；去甲氟西汀短期、长期给药均为4～16天。每天服药20mg，4周后稳态血药浓度为：氟西汀（540±282）nmol/L，去甲氟西汀（640±332）nmol/L。

【不良反应】常见不良反应为口干、食欲减退、恶心、失眠、乏力，少数病例可见焦虑、头痛。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸氟西汀肠溶片	化学药	HZ004015
盐酸氟西汀分散片	化学药	HZ004016
盐酸氟西汀胶囊	化学药	HZ004017
盐酸氟西汀片	化学药	HZ004018

HY002220 盐酸福米诺苯

【其他名称】胺酰苯吗啉、Oleptan

【外文名称】Fominoben Hydrochloride

【性状及组成】白色或类白色粉末，无臭，味苦，具强烈刺激味。在酸中易溶，在乙醇中略溶，在三氯甲烷中微溶，在水中极微溶解。

熔点：206～208℃（熔融时分解）。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：镇咳药。

本品的特点是抑制咳嗽中枢的同时，具有呼吸中枢兴奋的作用。其镇咳作用与可待因接近。呼吸道阻塞和呼吸功能不全者使用本品后，可改善换气功能，使动脉氧分压升高，二氧化碳分压降低。

适用于各种原因引起的慢性咳嗽和呼吸困难，用于小儿顽固性百日咳。本品也能降低痰液的黏滞性，有利于咳痰。

【不良反应】本品无成瘾性，毒性小，大剂量时可致血压降低。

HY002221 盐酸高血糖素

【外文名称】Glucagon Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】L－组氨酰－L－丝氨酰－L－谷氨酰胺酰－L－甘氨酰－L－苏氨酰－L－苯丙氨酰－L－苏氨酰－L－丝氨酰－L－天冬氨酰－L－酪氨酰－L－丝氨酰－L－赖氨酰－L－酪氨酰－L－亮氨酰－L－天冬氨酰－L－丝氨酰－L－精氨酰－L－精氨酰－L－丙氨酰－L－谷氨酰胺酰－L－天冬氨酰－L－苯丙氨酰－L－缬氨酰－L－谷氨酰胺酰－L－色氨酰－L－氧氨酰－L－甲硫氨酰－L－天冬酰氨酰－L－苏氨酸盐酸盐

【分子式】$C_{153}H_{225}N_{43}O_{49}S$

【分子量】3482.82

药物药理信息

【药理毒理】本品的主要生理作用是调控肝脏糖原的降解和葡萄糖异生作用，具有明显的升血糖作用，此外还可以促进脂肪组织中脂肪的水解作用和生酮作用，遏制氨基酸参与蛋白质的合成作用和增加尿素的排泄。临床上可应用于急性的或顽固性低血糖症的治疗。

本品对胃肠道的蠕动及分泌有较强的抑制效应，它减弱食道下部括约肌、胃肠道的收缩，抑制胃酸、消化酶及消化液的分泌，增加胆汁流量。因此，可作为内窥镜检查与动脉X光摄影时的松弛剂。另一方面，本品能增加肠中水及盐分的消失，可能引起水泻，尤其是当胃泌素与VIP一起过量分泌的情况下。

【药代动力学】肌内注射盐酸高血糖素后，平均C_{max}（CV%）为1686pg/ml（43%），浓度达峰时间为12.5分钟，平均半衰期为4分钟。盐酸高血糖素主要分布在肝、肾、血浆中。

【药物相互作用】除与胰岛素有相互拮抗作用

外，未发现与其他药物发生作用。

【药物过量】药物过量可能引起恶心和呕吐。一般无需特殊治疗。血清钾可能降低，必要时应密切监察并补充。

【不良反应】罕见严重的不良反应。偶有发生恶心和呕吐，特别是剂量超过1mg或注射太快（少于1分钟）时。可能会出现暂时心跳加速。无毒性反应的报道。少数患者可能会有过敏反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸高血糖素	化学药	HZ005072

HY002222　盐酸格拉司琼

【外文名称】Granisetron Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】1-甲基-*N*-［桥-9-甲基-9-氮杂双环［3.3.1］壬烷-3-基］-1*H*-吲唑-3-甲酰胺盐酸盐

【分子式】$C_{18}H_{34}N_4O \cdot HCl$

【分子量】348.88

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，味苦。

本品在水中易溶，在甲醇中略溶，在乙醇中微溶；在0.1mol/L盐酸溶液中略溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗肿瘤辅助药。

本品是一强效、高选择性的外周神经元和中枢神经系统内5-HT_3受体拮抗剂。对因化疗、放疗及手术引起的恶心和呕吐具有良好的预防和治疗作用。化疗、放疗及外科手术等因素可引起肠嗜铬细胞释放5-HT，5-HT可激活中枢或迷走神经的5-HT_3受体，触发呕吐反射。本品可选择性地阻断这一反射的触发。由于本品的高选择性作用，因而不具有其他止吐药的副作用，如锥体外系反应、过度镇静等。

毒理研究：生殖毒性本品皮下给药剂量达6mg/（kg·d）（以体表面积算，为临床静脉给药推荐剂量的97倍）时，未表现出对雌、雄大鼠生育力和生殖行为的影响。妊娠的大鼠和家兔静脉给予本品剂量分别为9mg/（kg·d）［54mg/（m^2·d）按体表面积算，相当于临床静脉给药推荐剂量的146倍］及3mg/（kg·d）［35.4mg/（m^2·d），按体表面积算，相当于临床静脉给药推荐剂量的96倍］的生殖毒性研究中，均未表现出对动物生育力和胎仔发育的影响。但尚无充分和严格对照的本品妊娠妇女给药的临床研究。因为动物试验并不总能预测药品对人体的影响，故只有在确实必需时，才能在妊娠期间服用本品。

目前尚不清楚本品是否通过乳汁分泌。因为许多药物可以经乳汁分泌，故哺乳妇女服用本品时应慎重考虑其对后代的影响。

遗传毒性：本品Ames试验、小鼠淋巴瘤细胞正向突变试验、小鼠微核试验及体内、外大鼠肝细胞UDS试验结果均未表现出致突变作用。但在细胞体外试验中出现UDS明显增加，体外人淋巴细胞染色体畸变试验中，多倍体细胞的数量明显增加。

致癌性：在给药两年的致癌性试验中，大鼠经口给予本品的剂量分别为1、5、50mg/kg［6、30、300/（m^2·d)］，其中高剂量组在第59周时因毒性反映而将剂量降至25mg/kg。结果显示，5mg/（kg·d）以上组（包括该剂量组）雄性大鼠和25mg/（kg·d）组雌性大鼠（以体表面积算，其剂量分别相当于临床静脉给药推荐剂量的81倍以上和405倍）的肝细胞癌和腺瘤的发生率显著增加，而1mg/kg组雄性大鼠和5mg/kg组雌性大鼠（以体表面积计算，分别为临床静脉给药推荐剂量的16倍和81倍）的肝肿瘤分发生率未见增加。在12个月的试验中，经口给予本品100mg/（kg·d）组（600mg/m^2以体表面积计算，相当于临床静脉给药推荐剂量的1622倍）的雌、雄大鼠均发生肝细胞腺瘤，而空白对照组未出现。本品给药24个月的小鼠致癌性试验结果显示，肿瘤的发生率未见有统计学意义的明显增加，但该试验尚未得出最后结论。因为在大鼠致癌性研究中出现肿瘤，故本品只应在说明书中推荐的剂量下和适应症范围内应用。

【药代动力学】本品口服吸收迅速且完全。血药浓度达峰时间为3小时。在体内分布广泛，血清蛋白结合率为65%。主要代谢途径为*N*-去烷基化及芳香环氧化后再被共轭化。消除半衰期在代谢正常者为8小时，代谢不良者为42小时。剂量的8%～9%以原形、70%以代谢物的形式从尿中排出；15%从粪便中排出，几乎全部为代谢物。老年人用药后药动学参数与年轻人无异。健康受试者静注本品20μg/kg或40μg/kg后，平均血浆峰浓度分别为13.7μg/L和42.8μg/L，血浆消除半衰期约3.1～5.9小时。

【药物相互作用】与利福平或其他肝酶诱导药物同时使用，本品血药浓度减低，应适当增加剂量。

【药物过量】症状：患者服用建议剂量的10倍后，只出现轻微头痛而无其他后遗症。

治疗：现仍无特异性解毒剂，若过量时，应予

对症治疗。

【不良反应】常见的副作用为头痛、倦怠、发热、便秘及胃肠道功能紊乱，偶有短暂性无症状肝转氨酶增高。上述反应轻微，无须特殊处理。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸格拉司琼分散片	化学药	HZ004019
盐酸格拉司琼胶囊	化学药	HZ004020
盐酸格拉司琼氯化钠注射液	化学药	HZ004021
盐酸格拉司琼片	化学药	HZ004022
盐酸格拉司琼葡萄糖注射液	化学药	HZ004023
盐酸格拉司琼注射液	化学药	HZ004024
注射用盐酸格拉司琼	化学药	HZ005073

HY002223 盐酸胍甲环素

【其他名称】胍哌甲基四环素

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第7册

药物药理信息

【药理毒理】本品的抗菌谱与四环素相同，但对支气管、肺组织亲和力强，血药浓度比四环素高而持久。主要用于治疗呼吸与泌尿系统感染。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸胍甲环素胶囊	化学药	HZ004025

HY002224 盐酸海索那林

【其他名称】Etoscol、Ipradol、己双肾上腺素、Leanol、六甲双喘定、息喘酚、哮平灵

【外文名称】Hexoprenaline Hydrochloride

【分子式】$C_{22}H_{32}N_2O_6 \cdot 2HCl$

药物药理信息

【药理毒理】本品为选择性 β_2 受体激动药，其扩张支气管平滑肌、抑制过敏物质释放、升高血糖等 β_2 受体激动效应与异丙肾上腺素相仿，而比沙丁胺醇强。但其对心脏的 β 受体的激动作用仅为异丙肾上腺素的1/10，故对心率、血压等心血管系统影响较小。由于本品在体内不被儿茶酚氧位甲基转移酶破坏，因而作用维持时间较长。此外，本品对哮喘患者的动脉血氧分压无不良影响，对子宫平滑肌的 β_2 受体亦有较高的选择性激动作用，可松弛妊娠期子宫平滑肌。

【药代动力学】本品口服、静注、吸入均有效，气雾吸入2~3分钟即见效，作用可维持3~5小时。支气管哮喘患者气雾吸入本品0.1mg后，平均第1s最大呼气量（FEV1）增加44%。口服一般对血压等无明显影响，没有蓄积性毒性。

【不良反应】少数患者用药后有心慌、肌肉震颤、食欲减退、口干、恶心及头晕等不良反应，但一般不影响继续治疗，必要时可酌情减量或停药。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸海索那林片	化学药	HZ004027

HY002225 盐酸环丙沙星

【外文名称】Ciprofloxacin Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】1-环丙基-6-氟-1，4-二氢-4-氧代-7-（1-哌嗪基）-3-喹啉羧酸盐酸盐一水合物

【分子式】$C_{17}H_{18}FN_3O_3 \cdot HCl \cdot H_2O$

【分子量】385.82

【性状及组成】本品为白色或微黄色结晶性粉末，几乎无臭，味苦。

本品在水中溶解，在甲醇中微溶，在乙醇中极微溶解，在0.1mol/L盐酸溶液中略溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：喹诺酮类抗菌药。

本品具广谱抗菌作用，尤其对需氧革兰阴性杆菌的抗菌活性高，对下列细菌在体外具良好抗菌作用：肠杆菌科的大部分细菌，包括枸橼酸杆菌属、阴沟、产气肠杆菌等肠杆菌属、大肠埃希菌、克雷伯菌属、变形杆菌属、沙门菌属、志贺菌属、弧菌属、耶尔森菌等。常对多重耐药菌也具有抗菌活性。对青霉素耐药的淋病奈瑟菌、产酶流感嗜血杆菌和莫拉菌属均具有高度抗菌活性。对铜绿假单胞菌等假单胞菌属的大多数菌株具抗菌作用。本品对甲氧西林敏感葡萄球菌具抗菌活性，对肺炎链球菌、溶血性链球菌和粪肠球菌仅具中等抗菌活性。对沙眼衣原体、支原体、军团菌具良好抗微生物作用，对结核杆菌和非典型分枝杆菌也有抗菌活性。对厌氧菌的抗菌活性差。

环丙沙星为杀菌剂，通过作用于细菌DNA螺旋酶的A亚单位，抑制DNA的合成和复制而导致细菌

死亡。

【药代动力学】健康人口服盐酸环丙沙星0.2g或0.5g后，其血药峰浓度（C_{max}）分别为1.21μg/ml和2.5μg/ml，达峰时间（t_{max}）为1～2小时。广泛分布至各组织、体液（包括脑脊液），组织中的浓度常超过血药浓度，蛋白结合率约为20%～40%。血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为4小时。可在肝脏部分代谢，代谢物仍具较弱的活性。口服给药后24小时以原形经肾排出给药量的40%～50%。以代谢物形式排出约15%。同时亦有一部分药物经胆汁和粪便排泄。

【药物相互作用】

1．尿碱化药可减低本品在尿中的溶解度，导致结晶尿和肾毒性。

2．含铝或镁的制酸药可减少本品口服的吸收，建议避免合用。不能避免时应在服本品前2小时，或服药后6小时服用。

3．本品与茶碱类合用时可能由于与细胞色素P450结合部位的竞争性抑制，导致茶碱类的肝消除明显减少，血消除半衰期延长，血药浓度升高，出现茶碱中毒症状，如恶心、呕吐、震颤、不安、激动、抽搐、心悸等，故合用时应测定茶碱类血药浓度和调整剂量。

4．环孢素与本品合用时，其血药浓度升高，必须监测环孢素血药浓度，并调整剂量。

5．本品与抗凝药华法林同用时可增强后者的抗凝作用，合用时应严密监测患者的凝血酶原时间。

6．丙磺舒可减少本品自肾小管分泌约50%，合用时可因本品血药浓度增高而产生毒性。

7．本品干扰咖啡因的代谢，从而导致咖啡因消除减少，血消除半衰期延长，并可能产生中枢神经系统毒性。

8．去羟肌苷（DDI），该药可减少本品的口服吸收，因其制剂中所含的铝及镁可与本品螯合，故不宜合用。

9．长期大量局部用药，经局部吸收后，可产生与全身用药相同的药物相互作用，如可使茶碱类、环孢素、丙磺舒等药物的血药浓度升高，增强抗凝药华法林的抗凝作用，干扰咖啡因的代谢等。

【不良反应】

1．胃肠道反应较为常见，可表现为腹部不适或疼痛、腹泻、恶心或呕吐。

2．中枢神经系统反应可有头昏、头痛、嗜睡或失眠。

3．过敏反应：皮疹、皮肤瘙痒，偶可发生渗出性多形性红斑及血管神经性水肿。少数患者有光敏反应。

4．偶可发生：①癫痫发作、精神异常、烦躁不安、意识混乱、幻觉、震颤；②血尿、发热、皮疹等间质性肾炎表现；③结晶尿，多见于高剂量应用时；④关节疼痛。

5．少数患者可发生血清氨基转移酶升高、血尿素氮增高及周围血常规白细胞降低，多属轻度，并呈一过性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸环丙沙星滴耳液	化学药	HZ004028
盐酸环丙沙星滴眼液	化学药	HZ004029
盐酸环丙沙星胶囊	化学药	HZ004030
盐酸环丙沙星凝胶	化学药	HZ004031
盐酸环丙沙星片	化学药	HZ004032
盐酸环丙沙星葡萄糖注射液	化学药	HZ004033
盐酸环丙沙星乳膏	化学药	HZ004034
盐酸环丙沙星栓	化学药	HZ004035
盐酸环丙沙星眼膏	化学药	HZ004036
盐酸环丙沙星阴道泡腾片	化学药	HZ004037
注射用盐酸环丙沙星	化学药	HZ005074

HY002226　盐酸环仑特罗

【其他名称】喘敌素、盐酸双氯氨苯恶唑

【外文名称】Cycloclenbuterol Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第6册

药物理化信息

【化学名】5－（4－氨基－3,5－二氯苯基）－3－叔丁基恶唑烷盐酸盐

【分子式】$C_{13}H_{18}Cl_2N_2O\cdot HCl$

【分子量】325.66

【性状及组成】本品为白色或几乎白色的结晶性粉末，无臭，味略苦。

本品在水或乙醇中溶解，在三氯甲烷或丙酮中微溶，在乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为182～185℃，熔距不超过1.5℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】本品为强效选择性β_2受体激动剂，其松弛支气管平滑肌作用强而持久，但对心血管系统影响较小。其支气管扩张作用约为沙丁胺醇的100倍，故用药量极小，哮喘患者每次口服本品30μg，

可明显增加每秒肺活量（FEV1）和最大呼气流速（FEF），降低气道阻力，其平喘疗效与间羟叔丁肾上腺素（每次 5mg，一日 3 次）相近，即较后者强 165 倍。本品尚能增强纤毛运动和促进痰液排除，这也有助于提高平喘疗效。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸环仑特罗片	化学药	HZ004038

HY002227 盐酸黄酮哌酯

【外文名称】Flavoxate Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 57 册

药物理化信息

【化学名】3－甲基黄酮－8－羧酸－2－哌啶乙酯盐酸盐

【分子式】$C_{24}H_{25}NO_4 \cdot HCl$

【分子量】427.93

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，无味。

本品在三氯甲烷或冰醋酸中溶解，在水或甲醇中略溶，在丙酮或乙醚中几乎不溶。

吸收系数：取本品，精密称定，加 0.01mol/L 盐酸溶液溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 20μg 的溶液，照紫外可见分光光度法，在 293nm 波长测定吸光度，吸收系数 $E_{1cm}^{1\%}$为 300～330。

药物药理信息

【药理毒理】本品为平滑肌松弛药。具有抑制腺苷酸环化酶、磷酸二酯酶的作用以及拮抗钙离子作用，并有弱的抗毒蕈碱作用，对泌尿生殖系统的平滑肌具有选择性解痉作用，因而能直接解除泌尿生殖系统平滑肌的痉挛，使肌肉松弛，消除尿频、尿急、尿失禁及尿道膀胱平滑肌痉挛引起的下腹部疼痛。

【药代动力学】据文献报道，本品脂溶性较高，口服吸收很快，一次口服 0.2g，2 小时左右血药浓度即达高峰，它与血浆蛋白结合很少，其水溶性代谢产物 3－甲基黄酮－8－羧酸与血浆蛋白结合率高，一次口服后血中 $t_{1/2}$为 50 分钟，其主要经尿排泄，$t_{1/2}$约为 24 小时。代谢产物有 3－甲基黄酮－8－羧酸、哌啶醇及羟化产物，原形药很少，还有少量药物从胆汁排泄。

【不良反应】个别患者可出现胃部不适、恶心、呕吐、口渴、嗜睡、视力模糊、心悸及皮疹等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸黄酮哌酯胶囊	化学药	HZ004039
盐酸黄酮哌酯片	化学药	HZ004040

HY002228 盐酸吉西他滨

【其他名称】Gemzer、双氟脱氧胞苷

【外文名称】Gemcitabine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 47 册

药物理化信息

【化学名】（＋）2－脱氧－2，2－二氟胞嘧啶盐酸盐

【分子式】$C_9H_{11}F_2N_3O_4 \cdot HCl$

【分子量】299.70

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭。

本品在水中溶解，在乙醇中极微溶解，在三氯甲烷或丙酮中几乎不溶。

比旋度：取本品适量，精密称定，加水溶解并稀释制成每 1ml 中含 5mg 的溶液，依法测定比旋度＋46°至＋50°。

药物药理信息

【药理毒理】本品是细胞周期特异性抗代谢类药物，主要作用于 DNA 合成期的肿瘤细胞，即 S 期细胞，在一定条件下，可以阻止 G1 期向 S 期的进展；它对各种培养的人及鼠肿瘤有明显的细胞毒活性，其抗癌活性与抗药的方式有关，如每天给药会导致动物死亡，而抗癌活性很少，当每 3～4 天给 1 次药，在非致死量时，对鼠的多种肿瘤均有很好的抗癌活性。吉西他滨作为一种前药在细胞内是脱氧胸苷激酶磷酸化的良好底物，在酶的作用下转化成下列代谢物：吉西他滨一磷酸盐（dFdCMP）、吉西他滨二磷酸盐（dFdCDP）和吉西他滨三磷酸盐（dFdCTP）其中 dFdCDP 和 dFdCTP 为活性产物。dFdCDP 抑制核糖核苷酸还原酶，从而减少了 DNA 合成的修复所需的脱氧核苷酸的量（尤其是 dCTP），低水平的 dCTP 逆转了脱氧苷激酶正常的负反馈抑制，导致 dFdCTP 更多的积聚。同时 dFdCDP 抑制了 dCTP 诱导的脱氧胞氨酶对 dFdCMP 的脱氨作用，且 dFdCTP 直接抑制脱氧胞苷脱酶，从而使更多的 dFdCMP 转化成活性代谢物 dFdCMP 的脱氨作用，且 dFdCTP 直接抑制脱氧胞苷脱氨酶，从而使更多的 dFdCMP 转化成活性代谢物 dFdCDP，dFdCTP 而 dFdCTP 则与 dCTP 竞争结合进入 DNA 链，插入至 DNA 链中脱氧胞苷的位点，并允许

鸟苷与其配对，吉西他滨分子就被此鸟苷“掩蔽”使其免受核糖核酸外切酶的移除修复，然后 DNA 链合成停止，进而 DNA 断裂、细胞死亡。

【药代动力学】本品在静注后，很快分布到体内各组织，输注时间越长，分布体积就越广、越深入，半衰期也就越长。在短时间的输注下，本品的 $t_{1/2}$ 约为 32～94 分钟；在结束输注 5 分钟内，本品的血浆峰浓度为 3.2～45.5μg/ml；本品仅有少数与蛋白质结合，能被胞苷脱氨酸在肝脏、肾、血液和其他组织中快速、完全的代谢，只有不到 10% 的原药与代谢物从尿中排泄；它的总清除率为 29.2～92.2L/（h·m^2）与性别、年龄有关（个体差异为 52.2%）。

【不良反应】

1. 血液系统：有骨髓抑制作用，可出现贫血、白细胞降低和血小板减少。

2. 胃肠道：约 2/3 的患者出现肝脏转氨酶异常，多为轻度、非进行性损害；约 1/3 的患者出现恶心和呕吐反应，20% 的患者需要药物治疗。

3. 肾脏：约 1/2 的患者出现轻度蛋白尿和血尿，有部分病例出现不明原因的肾衰。

4. 过敏：约 25% 的患者出现皮诊，10% 的患者出现瘙痒，少于 1% 患者可发生支气管痉挛。

5. 其他：约 20% 的患者有类似于流感的表现；水肿/周围性水肿的发生率约 30%；脱发、嗜睡、腹泻、口腔毒性及便秘发生率则分别为 13%，10%，8%，7% 和 6%。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸吉西他滨	化学药	HZ005075

HY002229　盐酸加替沙星

【外文名称】Gatifloxacin Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】1－环丙基－6－氟－7－（3－甲基－1－哌嗪基）－8－甲氧基－1，4－二氢－4－氧代喹啉－3－羧酸盐酸盐

【分子式】$C_{19}H_{22}FN_3O_4 \cdot HCl$

【分子量】411.80

药物药理信息

【药理毒理】加替沙星为 8－甲氧基氟喹诺酮类外消旋化合物，体外具有广谱的抗革兰阴性和阳性微生物的活性，其 *R*－和 *S*－对映体抗菌活性相同。本品抗菌作用是通过抑制细菌的 DNA 旋转酶和拓扑异构酶 IV，从而抑制细菌 DNA 复制、转录和修复过程。

体外试验和临床使用结果均表明，本品对以下微生物的大多数菌株具有抗菌活性：

1. 革兰阳性菌：金黄色葡萄球菌（仅限于对甲氧西林敏感的菌株）、肺炎链球菌（对青霉素敏感的菌株）。

2. 革兰阴性菌：大肠杆菌、流感和副流感嗜血杆菌、肺炎克雷伯杆菌、卡他莫拉菌、淋病奈瑟菌、奇异变形杆菌。

3. 其他微生物：肺炎衣原体、嗜肺性军团杆菌、肺炎支原体。

【药代动力学】从动物（狗）药代动力学实验结果看，该药口服吸收迅速，各剂量组的吸收半衰期在 0.2～0.5 小时，在 2 小时内血药浓度即达峰值，符合无滞后时间的一级吸收和一级消除的一室模型。消除半衰期在 6 小时左右，与剂量无关。5，10 和 20mg/kg 剂量组 AUC 分别为 19.32，36.22 和 105.45μg·（h/ml）；C_{max} 分别为 2.01，3.18 和 8.67μg/ml，与剂量平行；t_{max} 分别为 1.27，1.78 和 1.63h，与剂量无关。

大鼠口服 20mg/kg 盐酸加替沙星后 5 分钟，15 分钟和 4 小时，除 5 分钟睾丸、脑和 4 小时脑以外，在各组织中均有分布，其中肝、肾、胃和肠中分布最多，心、肺和脾次之。大鼠口服 20mg/kg 盐酸加替沙星后 48 小时，尿和胆汁药物累积排泄率分别为 53.24% 和 7.38%。血浆蛋白结合率较低。

【药物相互作用】

1. 本品与丙磺舒合用，可减缓加替沙星经肾排除。

2. 西咪替丁、茶碱、华法林、优降糖或咪达唑仑与本品同时服用未见发生药代动力学的相互作用，也不影响华法林对凝血时间和优降糖对血糖水平的作用。

3. 本品与地高辛同时服用，未见加替沙星药代动力学发生明显改变，单在部分受者发现地高辛血药浓度升高，故应监测服用地高辛患者的地高辛毒性反应的症状和体征。对表现出毒性症状和体征的患者，应测定地高辛的血药浓度，并适当调整地高辛剂量。但不推荐事先调整两药剂量。

【不良反应】临床试验中所见不良反应多属轻度，主要见于静脉给药局部和胃肠道及神经系统，包括静脉炎、恶心、呕吐、腹泻、头痛及眩晕等。其他少见的临床相关不良事件包括：

全身反应：变态反应，寒战，发热，背痛，胸痛，虚弱及面部水肿。

心血管系统：高血压，心悸。

消化系统：腹痛，便秘，消化不良，舌炎，念珠菌性口腔炎，口腔炎，口腔溃疡，呕吐，食欲减

退，胃炎及胃肠胀气。

代谢与营养系统：外周水肿，高血糖及口渴。

骨骼肌肉系统：关节痛，下肢痛性痉挛。

神经系统：多梦，失眠，感觉异常，震颤，血管扩张，眩晕，激动，焦虑，混乱及紧张。

呼吸系统：呼吸困难，咽炎。

皮肤及皮肤软组织：皮疹，出汗，皮肤干燥及瘙痒。

特殊感官：视觉异常，味觉异常，耳鸣。

泌尿生殖系统：排尿困难。

而罕见的相关不良反应有：思维异常。不能耐受酒精，关节炎，虚弱，哮喘（支气管痉挛），共济失调，骨痛，心动过缓，胸痛，唇炎，结肠炎，意识模糊，惊厥，发绀，人格解体，抑郁，糖尿病，吞咽困难，耳病，瘀斑，水肿，鼻衄，欣快感，眼痛，光敏感性，全身水肿，胃肠出血。牙龈炎，口臭，幻觉，呕血，血尿，敌意，感觉过敏，高血糖，肌张力增加，过度敢，低血糖，淋巴结病，斑丘疹，子宫出血，偏头痛，口腔水肿，肌痛，肌无力，颈痛，惊慌，妄想狂，嗅觉倒错，畏光，伪膜性肠炎，精神病，上脸下垂，直肠出血，紧张，胸骨下胸痛，心动过速，味觉丧失，口干，舌肿，疱疹等。

实验室检查异常改变发生率低，包括：白细胞减少，血小板减少，血红蛋白下降，ALT 或 AST 增高以及碱性磷酸酶，总胆红素，血清淀粉酶，电解质异常等。

已有报道加替沙星引起的血糖异常，包括症状性低血糖症和高糖血症。这些通常在糖尿病患者中发生。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸加替沙星胶囊	化学药	HZ004041
盐酸加替沙星氯化钠注射液	化学药	HZ004042
盐酸加替沙星片	化学药	HZ004043
盐酸加替沙星注射液	化学药	HZ004044

HY002230 盐酸甲基丙炔苄胺

【其他名称】巴吉林、Eutonyl、Pargylinum、优降灵、优降宁、盐酸帕吉林

【外文名称】Pargyline Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 11 册

药物理化信息

【化学名】*N* - 甲基 - *N* - 丙炔 - 苄胺盐酸盐

【分子式】$C_{11}H_{13}N \cdot HCl$

【分子量】159.22

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末，有特臭。

本品在水中极易溶解，在乙醇中易溶，在丙酮中微溶。

熔点：本品的熔点为 156 ~ 161℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品具有明显的降压作用，属单胺氧化酶抑制剂。其降压机制尚未完全阐明，可能由于对单胺氧化酶的抑制，使肾上腺素能神经末梢的酪胺的正常代谢发生变化，产生卜羟酪胺，后者是一种“假介质”，与去甲肾上腺素一样能被贮存、释放并与受体结合，但因引起的反应较弱，不能起到节后交感神经冲动的传导作用，以致血管舒张，血压下降。其他单胺氧化酶抑制剂如苯乙肼等，亦有降压作用，但作为降压药则因副作用多而无实际价值。

本品降压作用较强，作用出现较慢，一般在用药 1 ~ 2 周后出现作用，作用维持时间较久，每天服药 1 ~ 2 次即可。临床上主要用于重度高血压，尤其是在其他降压药疗效不满意者，自觉症状较多，特别是精神及情绪均较差者以及对利血平有较严重副作用者。轻度高血压不宜用本品，中等度高血压可单用本品或与口服利尿药合用。

【药物相互作用】本品不宜与麻黄碱、苯丙胺、丙米嗪、乙醇、甲基多巴、利血平、降压灵、胍乙啶等合用。

【不良反应】服用量过大时，可引起体位性低血压，有时有口干、胃口不适、失眠、多梦等症状。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
降压避风片	中成药	ZC002564
舒络片	中成药	ZC005198

HY002231 盐酸甲氯芬酯

【其他名称】氯酯醒

【外文名称】Meclofenoxate Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】2 - （二甲基氨基）乙基对氯苯氧基乙酸酯盐酸盐

【分子式】$C_{12}H_{16}ClNO_3 \cdot HCl$

【分子量】294.18

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，略有特异臭，味酸苦。本品在水中极易溶解，在乙醚中易溶，在三氯甲烷中溶解。

熔点：本品的熔点为137～142℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品能促进脑细胞的氧化还原代谢，增加对糖类的利用，对中枢抑制患者有兴奋作用。

【药物过量】中毒症状：焦虑不安、活动增多、共济失调、惊厥，可引起心悸、心率加快、血压升高。

处理：洗胃、5%葡萄糖氯化钠注射液静脉滴注，并给予相应的对症治疗及支持疗法。

【不良反应】胃部不适、兴奋、失眠、倦怠、头痛。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸甲氯芬酯胶囊	化学药	HZ004045
注射用盐酸甲氯芬酯	化学药	HZ005076

HY002232　盐酸甲麻黄碱

【其他名称】盐酸甲基麻黄碱

【外文名称】Methylephedrine Hydrochloride

药物管理信息

【特殊管理分类】易制毒药

【依据标准】化学药品地标升国标·第5册

【分子式】$C_{11}H_{17}NO \cdot HCl$

【分子量】215.72

药物药理信息

【药理毒理】盐酸甲麻黄碱可直接激动肾上腺素受体，也可以通过促使肾上腺素能神经末梢释放去甲肾上腺素而间接激动肾上腺素受体，对α和β受体均有激动作用。可舒张支气管并收缩局部血管消除鼻咽部黏膜充血、肿胀、减轻鼻塞症状，起作用时间较长；加强心肌收缩力，增强心输出量，使静脉回心血量充分；有较肾上腺素更强的兴奋中枢神经作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氨茶碱暴马子胶囊	化学药	HZ000155
复方氨酚甲麻口服液	化学药	HZ001031
复方茶碱甲麻黄碱片	化学药	HZ001106
复方甲麻黄碱口服溶液	化学药	HZ001222

续表

制剂名称	类别	序号
甲麻芩苷那敏片	化学药	HZ001891
盐酸甲麻黄碱颗粒	化学药	HZ004046
盐酸甲麻黄碱片	化学药	HZ004047
愈酚甲麻那敏分散片	化学药	HZ004616
愈酚甲麻那敏糖浆	化学药	HZ004617
愈美甲麻敏糖浆	化学药	HZ004625

HY002233　盐酸甲哌卡因

【其他名称】Carbocaine、卡波卡因

【外文名称】Mepivacaine Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】局部麻醉效能强，作用较迅速、持久，毒性及副作用较小。且不扩张血管，使用时可不加肾上腺素。适用于腹部手术、四肢及会阴部手术等。

【不良反应】因能通过胎盘影响胎儿，故孕妇忌用。

HY002234　盐酸甲氧氯普胺

【其他名称】灭吐灵、呕感平、扑息吐、胃复安

【外文名称】Metoclopramide Dihydrochloride

药物理化信息

【化学名】*N*－［（2－二乙氨基）乙基］－4－氨基－2－甲氧基－5－氯－苯甲酰胺盐酸盐一水合物

【分子式】$C_{14}H_{22}ClN_3O_2 \cdot 2HCl \cdot H_2O$

【分子量】390.72

药物药理信息

【药理毒理】本品为多巴胺第2（D_2）受体拮抗剂，同时还具有5－羟色胺第4（5－HT_4）受体激动效应，对5－HT_3受体有轻度抑制作用。可作用于延髓催吐化学感受区（CTZ）中多巴胺受体而提高CTZ的阈值，具有强大的中枢性镇吐作用。本品亦能阻断下丘脑多巴胺受体，抑制催乳素抑制因子，促进泌乳素的分泌，故有一定的催乳作用。对中枢其他部位的抑制作用较微，有较弱的安定作用，较少引起催眠作用。对于胃肠道的作用主要在上消化道，促进胃及上部肠段的运动；提高静息状态胃肠道括约肌的张力增加下食管括约肌的张力和收缩的幅度，使食管下端压力增加，阻滞胃食管反流，加强胃和食管蠕动，并增强对食管内容物的廓清能力，促进胃的排空；促进幽门、十二指肠及上部空肠的松弛、

形成胃窦、胃体与上部小肠间的功能协调。这些作用也可增强本品的镇吐效应。本品对小肠和结肠的传送作用尚不确定。

【药代动力学】进入血液循环后，13%～22%迅速与血浆蛋白（主要为白蛋白）结合。经肝脏代谢。$t_{1/2}$一般为4～6小时，根据用量大小有别。作用开始时间：肌注10～15分钟，静注1～3分钟。持续时间一般为1～2小时。主要以游离型、结合型或代谢产物经肾脏排泄，也可自乳汁排出。

【药物相互作用】

1. 与对乙酰氨基酚、左旋多巴、锂化物、四环素、氨苄青霉素、乙醇和安定等同用时，胃内排空增快，使后者在小肠内吸收增加。

2. 与乙醇或中枢抑制药等同时并用，镇静作用均增强。

3. 与抗胆碱能药物和麻醉止痛药物合用有拮抗作用。

4. 与抗毒蕈碱麻醉性镇静药并用，甲氧氯普胺对胃肠道的能动性效能可被抵消。

5. 由于其可释放儿茶酚胺，正在使用单胺氧化酶抑制剂的高血压病人，使用时应注意监控。

6. 与阿扑吗啡并用，后者的中枢性与周围性效应均可被抑制。

7. 与西咪替丁、慢溶型剂型地高辛同用，后者的胃肠道吸收减少，如间隔2小时服用可以减少这种影响；本品还可增加地高辛的胆汁排出，从而改变其血浓度。

8. 与能导致锥体外系反应的药物，如吩噻嗪类药等合用，锥体外系反应发生率与严重性均可有所增加。

【药物过量】

1. 用药过量症状：深昏睡状态，神志不清；肌肉痉挛，如颈部及背部肌肉痉挛、拖曳步态、头部及面部抽搐样动作，以及双手颤抖摆动等锥体外系症状。

2. 药物过量时，使用抗胆碱药物、治疗帕金森病药物或抗组胺药，可有助于锥体外系反应的制止。

【不良反应】

1. 较常见的不良反应为：昏睡、烦躁不安、疲怠无力。

2. 少见的反应有：乳腺肿痛、恶心、便秘、皮疹、腹泻、睡眠障碍、眩晕、严重口渴、头痛、容易激动。

3. 用药期间出现乳汁增多，由于催乳素的刺激所致。

4. 注射给药可引起直立性低血压。

5. 大剂量长期应用可能因阻断多巴胺受体，使胆碱能受体相对亢进而导致锥体外系反应（特别是年轻人），可出现肌震颤、发音困难、共济失调等，可用苯海索等抗胆碱药物治疗。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸甲氧氯普胺注射液	化学药	HZ004048

HY002235 盐酸甲氧明

【其他名称】凡索昔、甲氧胺、美速胺、美速克新命、Vasoxine、Vasoxyl

【外文名称】Methoxamine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】α－（1－氨基乙基）－2,5－二甲氧基苯甲醇盐酸盐

【分子式】$C_{11}H_{17}NO_3 \cdot HCl$

【分子量】247.72

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末，无臭或几乎无臭，味苦。

本品在水中易溶，在乙醇中溶解，在三氯甲烷或乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为214～219℃，熔融时同时分解。

吸收系数：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每1ml中约含30μg的溶液，照分光光度法，在290nm的波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为133～141。

药物药理信息

【药理毒理】

1. 本品为α受体激动剂，有明显的血管收缩作用，它能通过提高外周阻力，使收缩压和舒张压均升高，而对心脏无兴奋作用。另适用于大出血、创伤、外科手术所引起的低血压及脊髓麻醉前预防低血压症、室上性阵发性心动过速。也可用于手术后的循环衰竭和因周围循环衰竭所引起的低血压休克。

2. 本品为一能兴奋α肾上腺素受体的外周升压药。有着较强的收缩周围血管、升高血压，反射性地引起心率减慢等作用。临床用于周围循环功能不全时低血压状态的急救，手术时维持血压及腰椎麻醉所致的低血压等。

【药代动力学】静脉滴注后1～2分钟，肌注后15～20分钟起效，可分别维持1小时和1.5小时。本品不被单胺氧化酶破坏。

【药物相互作用】α－受体阻滞剂可拮抗本品的

作用。与降压药合用两者作用均减弱，但与利血平或胍乙啶合用可增强本品的升压作用。与洋地黄合用可产生心律失常，与麦角胺合用可引起周围血管严重缺血。

【不良反应】

1. 大剂量可发生头痛、恶心、呕吐、心动过速、血压过高等不良反应。

2. 可发生肾血管痉挛。偶可引起少尿或无尿。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸甲氧明注射液	化学药	HZ004049

HY002236　盐酸甲氧那明

【其他名称】奥所克新、喘咳平、甲氧苯丙甲胺、Methoxiphenadrin、Orthoxine、Oxynarin

【外文名称】Methoxyphenamine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第5册

【分子式】$C_{11}H_{17}NO\cdot HCl$

【分子量】215.72

【性状及组成】本品为白色或灰白色结晶性粉末，有轻微特殊臭、味苦。易溶于水及乙醇。其5%水溶液pH为5.3～5.7。

药物药理信息

【药理毒理】本品为β肾上腺素受体激动药。

本品作用类似麻黄碱，但主要激动β受体，对α受体作用极弱，能显著舒张支气管平滑肌，平喘作用较麻黄碱强，而对心血管系统和中枢神经系统影响较弱。此外尚具有轻度抗组胺，镇静和抑制咳嗽中枢的作用。

【药代动力学】口服易吸收，作用维持时间约3小时。

【不良反应】偶有失眠、心悸、眩晕、头痛、口干、恶心等反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方甲氧那明胶囊	化学药	HZ001226
盐酸甲氧那明片	化学药	HZ004050

HY002237　盐酸金刚烷胺

【外文名称】Amantadine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】三环[3.3.1.1<3,7>]癸烷-1-胺盐酸盐

【分子式】$C_{10}H_{17}N\cdot HCl$

【分子量】187.71

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末；无臭，味苦。本品在水或乙醇中易溶，在三氯甲烷中溶解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗帕金森病药、抗病毒药。

本品原为抗病毒药，其抗帕金森病机制主要是促进纹状体多巴胺的合成和释放，减少神经细胞对多巴胺的再摄取，并有抗乙酰胆碱作用，从而改善帕金森病患者的症状。

【药代动力学】本品口服吸收快而完全，2～4小时血药浓度达峰值，每日服药者在2～3日内可达稳态浓度。本品可通过胎盘及血脑屏障。半衰期为11～15小时。口服后主要由肾脏排泄，90%以上以原形经肾随尿排出，部分可被动重吸收，在酸性尿中排泄率增加，少量由乳汁排泄。总清除率16.5L/h。老年人肾清除率下降。

【药物相互作用】

1. 服药期间不宜饮用含酒精饮料，因可增加神经系统不良反应，如眩晕、头重脚轻、直立性低血压等。

2. 抗胆碱药、抗抑郁药、抗运动障碍药、抗组胺药、止泻药、含阿片类或吩噻嗪等药物与本品联合应用时可能增强抗胆碱样不良反应，如意识障碍、幻觉、恶梦等。因此上述药物或本品的剂量宜酌减；同时应注意可能出现麻痹性回肠。

3. 本品不宜与中枢神经兴奋剂合用，以免引起中枢神经兴奋症状，如不安、易激惹、失眠、抽搐或心律紊乱等。

4. 氢氯噻嗪和氨苯蝶啶等利尿剂与本品同用时，可能减少本品经肾清除量，导致血药浓度增高和毒性反应。

【药物过量】中毒症状：超剂量时，可见排尿困难、心律失常、低血压、躁动，精神错乱、谵妄、幻觉等，严重者可出现昏迷与惊厥、甚至死亡。

处理：视病情给予相应的对症治疗与支持疗法。

支持疗法：根据病情分别给予镇静剂、抗惊厥剂、抗心律失常药，必要时可加用其他药物。控制中枢神经系统中毒的症状：可缓慢静注毒扁豆碱，患儿每间隔5～10分钟给0.5mg，最大用量每小时甚至可达2mg。

【不良反应】眩晕、失眠和神经质，恶心、呕

吐、畏食、口干、便秘。偶见抑郁、焦虑、幻觉、精神错乱、共济失调、头痛，罕见惊厥。少见白细胞减少、中性粒细胞减少。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氨酚咖黄烷胺片	化学药	HZ000170
氨酚烷胺咖敏胶囊	化学药	HZ000181
氨酚烷胺那敏胶囊	化学药	HZ000182
氨金黄敏颗粒	化学药	HZ000223
复方氨酚烷胺分散片	化学药	HZ001038
复方氨酚烷胺胶囊	化学药	HZ001039
复方氨酚烷胺颗粒	化学药	HZ001040
复方氨酚烷胺片	化学药	HZ001041
小儿胺酚烷胺颗粒	化学药	HZ003740
小儿复方氨酚烷胺片	化学药	HZ003748
盐酸金刚烷胺胶囊	化学药	HZ004051
盐酸金刚烷胺颗粒	化学药	HZ004052
盐酸金刚烷胺片	化学药	HZ004053
盐酸金刚烷胺糖浆	化学药	HZ004054
感愈胶囊	中成药	ZC001764
金感康胶囊	中成药	ZC002661
金感欣片	中成药	ZC002662

HY002238 盐酸金刚乙胺

【其他名称】甲金胺、甲基金刚烷甲胺

【外文名称】Rimantadine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 57 册

药物理化信息

【化学名】α－甲基－1－金刚烷甲基胺盐酸盐

【分子式】$C_{12}H_{21}N$，HCl

【分子量】215.76

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，味苦，含辛辣味。

本品在甲醇中易溶，在水或乙醇中溶解。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：盐酸金刚乙胺为合成的抗病毒药，主要对 A 型流感病毒具有活性。本品的作用机制尚不完全清楚，可能是通过抑制病毒脱壳，从而在病毒复制的早期环节起作用。遗传学研究提示，由病毒颗粒 M2 基因编码的一种蛋白，在金刚乙胺抑制敏感 A 型流感病毒中起重要作用。本品不影响灭活的 A 型流感病毒疫苗的免疫原性。

2．毒理研究

（1）遗传毒性：在进行的数项标准致突变试验中，未见本品有致突变作用。

（2）生殖毒性：雌、雄大鼠在给予剂量达 60mg/（kg·d）（根据体表面积推算，相当于人最大用药剂量的 3 倍），未发现其生育能力降低。有报道，本品能通过小鼠的胎盘，并已证实，当给予大鼠剂量达 200mg/（kg·d）（根据体表面积推算，相当于人最大用药剂量的 11 倍）时，本品具有胚胎毒性。该剂量产生的胚胎毒性被认为是由于增加了胚胎的吸收所致，而且此剂量对母体也产生了以下影响，如运动失调、震颤、惊厥和明显的体重下降。兔子给予剂量为 16mg/（kg·d）（根据体表面积推算，相当于人最大用药剂量的 5 倍）时，未发现有胚胎毒性，但已有证据表明：动物出现 12 或 13 根肋骨的胚胎比率的改变，同窝仔的正常比率约为 50:50，而用本品处理后的比率为 80:20。在产前和产后的生殖毒性研究中，孕鼠给予本品剂量分别为 30、60 和 200mg/（kg·d）（根据体表面积推算，分别相当于人最大用药剂量的 1.7、3.4 和 11 倍），在受孕期，两个高剂量组已发现母体毒性。在产后第 2～4 天期间，幼仔死亡率增加。另外在两个较高剂量组，还发现 F1 代动物生育力降低，所以在妊娠期，应权衡对母体和胚胎的利大于弊时，才可使用本品。

（3）致癌性：尚未进行动物致癌性的研究。

【药代动力学】

1．我国目前尚缺乏盐酸金刚乙胺片剂和口服溶液剂的详细的药代动力学研究资料。但是，国内 18 名健康受试者的人体生物等效性研究资料表明，单次口服金刚乙胺片或口服溶液 200mg，片剂的 C_{max}（实测值）、t_{max}（实测值）、AUC（梯形法计算）分别为（207.85 ± 49.67）ng/ml、4.9 ± 2.1 小时、（11262 ± 4773）ng·h/ml，口服溶液剂的 C_{max}（实测值）、t_{max}（实测值）、AUC（梯形法计算）分别为（205.82 ± 52.99）ng/ml、4.9 ± 3.1 小时、（10204 ± 3603）ng·h/ml。国产品的药代动力学主要参数与国外产品基本一致。

2．据 Physician's Desk Reference（54 版介绍），虽然盐酸金刚乙胺的药代动力学已经非常清楚，但尚没有有效的药效学数据来建立一个血浆浓度与它的抗病毒效果之间的关系。

片剂和糖浆剂口服后吸收是相同的，即单一剂量 100mg 盐酸金刚乙胺口服吸收后血药浓度峰值为（74 ± 22）ng/ml（范围 45～138ng/ml）。对于 20～40

岁之间的健康成年人，在（6±1）小时后可达到高峰。这种剂量在上述群体的体内半衰期是（25.4±6.3）小时（范围13~65小时），同一剂量在71~79岁的健康人实验中，体内清除半衰期是（32±6）小时（范围20~65小时）。在18~70岁的健康志愿者一日服用2次100mg的金刚乙胺，10天后，时量曲线下面积AUC值比服用单一剂量100mg预计的高出近30%。在稳定状态下，最低血药浓度范围在118~468ng/ml。研究发现在药代动力学方面，这些患者并没有年龄之间的差异。然而，在对50~60岁组，61~70岁组，71~79岁组健康的老年受试者进行对比研究中发现，71~79岁组的在稳定状态下的平均AUC值、峰值浓度和消除半衰期值比其他二组高出20%~30%。对60~102岁需要家庭护理的患者，在稳定状态下浓度比健康的青年人和中老年人组高出2~4倍。

金刚乙胺对儿童全面的药物动力学还没有被建立。给一组（10个人）4~8岁的儿童6.6mg/kg剂量的盐酸金刚乙胺糖浆剂，5至6小时后，金刚乙胺的血浆浓度范围在446~988ng/ml，24小时后，范围在170~424ng/ml，在某些儿童中最后一次服药后72小时血浆中仍能测到该药物浓度。

口服后，金刚乙胺在肝脏中被广泛的代谢，尿中排泄的原形仅占剂量的25%。在血浆中发现三种羟基代谢物。在服用单一剂量的金刚乙胺200mg后，经72小时尿中排出的羟基代谢物及一种相关的结合代谢物和原形物约占剂量的74%±10%（$n=4$）。

在一组（14人）主要为稳定期肝硬化的慢性肝病患者中，组成6位肝病患者和6位性别、年龄及体重相仿的健康受试者，口服单一200mg剂量的金刚乙胺后作比较，其药物动力学没有明显差异。患严重肝功能不良的病人（10人）在服用单一剂量200mg后，与从健康受试者得到的原始数据作对照。AUC值增加了近3倍，消除半衰期约长2倍，表观清除率大约降低50%。

肾功能不全者对金刚乙胺的药物动力学影响的研究中得到的结论是不一致的。在肌酐清除率（Clcr）为31~50ml/min的8位患者和肌酐清除率（Clcr）为11~30ml/min的6位患者，与体重、年龄和性别相仿的健康受试者（9人Clcr>50ml/min）进行对照，在口服单一剂量200mg金刚乙胺后，表观消除率分别降低37%和16%，血浆代谢物浓度较高。8位血液渗析病人（Clcr 0~10ml/min）在口服单一剂量200mg金刚乙胺后，与年龄相仿的健康组对比，清除半衰期增加了1.6倍，表观清除率下降40%，血液渗析无助于金刚乙胺的清除。

与金刚乙胺结合的体外人血浆蛋白的浓度超过通常的血浆浓度大约40%，白蛋白是主要的结合蛋白。

【药物相互作用】西米替丁：其慢性的作用在金刚乙胺的代谢是未知的。当正常的健康成人服用单一剂量100mg的本品，1小时后开始服用西米替丁（每次0.3g，每日4次），总体的单一剂量的金刚乙胺表观清除率减少了18%（与没有服用西米替丁的相同条件的受试者总体金刚乙胺表观清除率作对照）。

扑热息痛：给几位健康志愿者服用本品（每次0.1g，每日2次），持续13天，在第11天服用扑热息痛（每次0.65g，每日4次），持续8天。在第11天与第13天评价金刚乙胺的药物动力学，发现和扑热息痛一同服用后，金刚乙胺的血药峰值浓度和AUC值降低了约11%。

阿司匹林：12位健康志愿者服本品（每次0.1g，每日2次），持续13天，在第11天，开始服用阿司匹林（每次0.65g，每日4次），持续8天，在第11天和13天评价金刚乙胺的药物动力学，发现和阿司匹林一同服用后，金刚乙胺的血浆峰值浓度和AUC值降低了约10%。

【不良反应】毒性不良反应较小，仅少数患者出现呕吐、梦魇、幻觉、焦虑、肢端感觉异常等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸金刚乙胺颗粒	化学药	HZ004055
盐酸金刚乙胺口服液	化学药	HZ004056
盐酸金刚乙胺片	化学药	HZ004057

HY002239　盐酸金霉素

【外文名称】Chlortetracycline Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】6-甲基-4-（二甲氨基）-3,6,10,12,12*a*-五羟基-1,11-二氧代-7-氯-1,4,4*a*,5,5*a*,6,11,12*a*-八氢-2-并四苯甲酰胺盐酸盐

【分子式】$C_{22}H_{23}ClN_2O_8\cdot HCl$

【分子量】515.35

【性状及组成】本品为金黄色或黄色结晶，无臭，味苦，遇光色渐变暗。本品在水或乙醇中微溶，在丙酮、乙醚或三氯甲烷中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并稀释

成每 1ml 中含 5mg 的溶液，避光放置 30 分钟，在 25℃时，依法测定，比旋度为 -235°至 -250°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：四环素类抗生素。

本品为四环素类抗生素，许多立克次体属、支原体属、衣原体属、非典型分枝杆菌属、螺旋体对本品敏感。肠球菌属对其耐药。多年来由于四环素类的广泛应用，临床常见病原菌对金霉素耐药现象严重，葡萄球菌等革兰阳性菌及多数肠杆菌科细菌耐药。本品与四环素类不同品种之间存在交叉耐药性。本品作用机制为药物能特异性与细菌核糖体 30S 亚基的 A 位置结合，抑制肽链的增长和影响细菌蛋白质的合成。

【药代动力学】本品局部用药，很少吸收。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸金霉素软膏	化学药	HZ004058
盐酸金霉素眼膏	化学药	HZ004059

HY002240 盐酸精氨酸

【其他名称】Acdril、Anetil、Argiceto、Arginil、Arginine Hydrochloridum、Arginin - oxo - glurate、Argivene、L - 盐酸精氨酸

【外文名称】Arginine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】L - 2 - 氨基 - 5 - 胍基戊酸盐酸盐

【分子式】$C_6H_{14}N_4O_2 \cdot HCl$

【分子量】210.66

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，水溶液显酸性反应。本品在水中易溶，在乙醇中极微溶解。

比旋度：取本品，精密称定，加 6mol/L 盐酸溶液溶解并稀释成每 1ml 中含 80mg 的溶液，依法测定，比旋度为 +21.5°至 +23.5°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：氨基酸类药。

本品在人体内参与鸟氨酸循环，促进尿素的形成，使人体内产生的氨，经鸟氨酸循环转变成无毒的尿素，由尿中排出，从而降低血氨浓度。

【药代动力学】本品口服经肠道吸收较好，绝对生物利用度约为 70%，静脉给药后 22～30 分钟，口服给药 90 分钟达血药峰值浓度。本品在肝脏代谢，经肾小球滤过后几乎被肾小管完全重吸收，其清除半衰期为 1.2～2 小时。

【药物相互作用】

1. 本品与谷氨酸钠、谷氨酸钾合用，可增加疗效；

2. 本品与螺内酯合用可引起高钾血症，特别是合并严重肝脏疾病的患者；

3. 本品禁忌与强心苷类联合应用；

4. 用于抢救肝昏迷有缺钙者，可与麸氨酸合用。

【药物过量】尚无本品药物过量的系统的研究资料。静脉大剂量给予精氨酸可引起低血压。一旦发生药物过量，应立即停药，给予支持和对症治疗。

【不良反应】

1. 可引起高氯性酸中毒，以及血中尿素、肌酸、肌酐浓度升高。

2. 少数患者可出现过敏反应。

3. 静滴过快，可引起流涎、面部潮红及呕吐等。

4. 有报道肝肾功能不良或糖尿病患者使用本品可引起高钾血症。

5. 静脉滴注本品可引起肢体麻木和头痛、恶心、呕吐及局部静脉炎。静脉给予大剂量精氨酸可使外周血管扩张而引起低血压。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方氨基酸注射液（17AA - Ⅰ）	化学药	HZ001059
复方氨基酸注射液（18AA - Ⅴ）	化学药	HZ001068
核酪口服溶液	化学药	HZ001690
核酪注射液	化学药	HZ001691
盐酸精氨酸片	化学药	HZ004060
盐酸精氨酸葡萄糖注射液	化学药	HZ004061
盐酸精氨酸注射液	化学药	HZ004062

HY002241 盐酸肼屈嗪

【其他名称】肼苯达嗪、肼苯太素、肼太嗪

【外文名称】Hydralazine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】1 - 肼基 - 2,3 - 二氮杂萘的盐酸盐

【分子式】$C_8H_8N_4 \cdot HCl$

【分子量】196.64

【性状及组成】本品为白色或淡黄色结晶性粉末，无臭。本品在水中溶解，在乙醇中微溶，在乙醚中极微溶解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗高血压药。

1．降压：降压作用的确切机制未明。主要扩张小动脉，对静脉作用小，使周围血管阻力降低，心率增快，心搏量和心排血量增加。长期应用可致肾素分泌增加，醛固酮增加，水钠潴留而降低效果。

2．心力衰竭：本品增加心排出量，降低血管阻力与后负荷。

【药代动力学】本品口服吸收良好，达90%，1~2小时达血浆高峰浓度，但生物利用度较低为30%~50%。血浆蛋白的结合率为87%。在肝内经乙酰化产生有活性的代谢产物。半衰期为3~7小时，肾功能衰竭时延长，但不必调整剂量。由于本品持久存在于血管壁内，故其降压作用半衰期比血药浓度半衰期为长。口服后45分钟起作用，持续3~8小时。经肾排出，2%~4%为原形。

【药物相互作用】

1．与非甾体类抗炎止痛药同用可使降压作用减弱。

2．拟交感胺类与本品同用可使本品的降压作用降低。

3．与二氮嗪或其他降压药同用可使降压作用加强。

【药物过量】如有过量，应停药，将胃排空，给活性炭。若有休克，应予扩容治疗。

【不良反应】

1．常见：头痛、恶心、呕吐、腹泻、心悸、心动过速等。

2．少见：便秘、低血压、脸潮红、流泪、鼻塞。

3．罕见：免疫变态反应所致，长期大量应用(400mg/d以上)，可引起皮疹、瘙痒、胸痛、淋巴结肿大、周围神经炎、水肿、红斑性狼疮综合征。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方四嗪利血平片	化学药	HZ001398
盐酸肼屈嗪片	化学药	HZ004063
盐酸肼屈嗪注射液	化学药	HZ004064

HY002242　盐酸卡波罗孟

【其他名称】盐酸乙氧香豆素

【外文名称】Carbocromen Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第5册

药物理化信息

【化学名】3-（β-二乙胺乙基）-4-甲基7-乙氧-羰基甲氧基香豆素盐酸盐

【分子式】$C_{20}H_{27}NO_5 \cdot HCl$

【分子量】397.90

药物药理信息

【药理毒理】本品可扩张冠状血管。其扩张冠状血管起效较慢，但作用时间较长。能解除心绞痛及急性心肌梗死时的疼痛，增加冠脉血流量，改善心肌氧供应。本品在扩张冠状血管的同时，降低冠状循环阻力，显著增加冠脉血流。

本品能显著抑制ADP和去甲肾上腺素等导致的血小板聚集作用，并能直接阻止血小板聚集，从而防止血栓形成。

【药代动力学】本品口服吸收很快，口服300mg，15分钟后血中出现其羧甲基衍生物，60分钟达峰值，从血中清除的半衰期为70分钟。口服本品后48小时内以羧甲基衍生物的形式排泄。70.8%由粪便排出，22.7%由尿排出。

【不良反应】少数患者在治疗期间内可能出现头晕、头痛、失眠、轻度恶心、关节痛。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸卡波罗孟片	化学药	HZ004065

HY002243　盐酸卡替洛尔

【外文名称】Carteolol Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】5-［3-［(1,1-二甲基乙基）氨基］-2-羟丙氧基］-3,4-二氢-2（1*H*）-喹诺酮盐酸盐

【分子式】$C_{16}H_{24}N_2O_3 \cdot HCl$

【分子量】328.84

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末。本品在水中溶解，在甲醇中略溶，在乙醇中极微溶解，在乙醚中几乎不溶，在冰醋酸中极微溶解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：β肾上腺素受体阻滞剂。

1．药理作用

（1）盐酸卡替洛尔为非选择性β-肾上腺受体阻断剂，对β_1和β_2受体均有阻断作用。盐酸卡替洛尔具有极小或不具有局麻作用。

（2）卡替洛尔与其他 β 受体阻断剂的主要区别在于它具有内在拟交感活性。

（3）本品为盐酸卡替洛尔滴眼液，对高眼压和正常眼压患者均有降眼压作用，可使眼压下降 22%～25%。

（4）卡替洛尔的主要代谢产物 8－羟基－卡替洛尔是一种眼部 β 受体阻断剂，也有降眼压作用，它可能与卡替洛尔降眼压作用持续时间较长有关。

（5）本品的降眼压机制主要是减少房水生成，本品对房水经葡萄膜巩膜外流、房水流出易度及巩膜上静脉压无影响。

2. 非临床毒理研究

（1）致癌性：动物实验显示对大鼠和小鼠大量口服盐酸卡替洛尔连续 2 年不产生致癌毒性。

（2）致突变性：体内外动物实验未显示盐酸卡替洛尔有致突变活性。

（3）生殖毒性：动物实验显示大剂量口服盐酸卡替洛尔，对雄、雌性大鼠及小鼠的生殖功能均无影响。

【药代动力学】对家兔单眼滴 2% ^{14}C 盐酸卡替洛尔 0.01ml，滴药眼房水中的放射活性在滴药后 1 小时达峰值，其大部分为原形。滴药后 0.5～1 小时，药物向其他眼组织中的转移达峰值，此后迅速消失，未发现在眼组织内的蓄积性。滴药后 1 小时，滴药眼房水、血浆及对侧眼房水中的放射活性比值为 200:5:1。

对健康人双眼各滴 2% 本品 1 滴，滴药后 24 小时，滴入量的 16% 经尿排出，该时的尿中排泄半衰期为 5 小时，此外，滴眼后爆破的血药浓度在定量界限（5ng/ml）以下。

【药物相互作用】

1. 与肾上腺素合用可引起瞳孔扩大。

2. 正在服用儿茶酚胺耗竭药（如利血平）者，使用本品时应严密观察，因可引起低血压和明显的心动过缓。

3. 不主张两种局部 β 受体阻断剂同时应用，对正在应用 β 受体阻断剂口服治疗的患者应慎用本品。

4. 本品与钙通道拮抗剂合用应慎重，因可引起房室传导阻滞，左心室衰竭及低血压。对心功能受损的患者，应避免两种药合并使用。

5. 本品与洋地黄类和钙通道拮抗剂合用可进一步延长房室传导时间。

6. 吩噻嗪类药物可增加 β 受体阻断剂的降血压作用，因可使相互的代谢途径受到抑制。

【不良反应】

1.1/4 的患者出现暂时性眼烧灼、眼刺痛及流泪、结膜充血水肿。

2. 一些患者出现下列不良反应：视物模糊、畏光、上睑下垂、结膜炎、角膜着色及中度角膜麻醉。

3. 长期连续用于无晶体眼或有眼底疾病患者时，偶在眼底黄斑部出现水肿、混浊，故需定期测定视力，进行眼底检查。

4. 一些患者出现心率减慢及血压下降。

5. 偶见下列不良反应：心律失常、心悸、呼吸困难、无力、头痛、头晕、失眠、鼻窦炎。

6. 应用本品还有以下非常罕见不良反应。全身症状：头痛。心血管系统：心律失常，晕厥，心传导阻滞，脑血管意外，脑缺血，心衰，心悸。消化系统：恶心。神经系统：抑郁。皮肤：过敏反应，包括局部和全身疹，脱发。呼吸系统：支气管痉挛，呼吸衰竭。内分泌系统：掩盖糖尿病患者应用胰岛素或降糖药后的低血糖症状。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸卡替洛尔滴眼液	化学药	HZ004066

HY002244 盐酸可卡因

【外文名称】Cocaine Hydrochloride

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】8－甲基－3－（苯甲酰氧基）－8－氮杂双环［3.2.1］辛烷－2－甲酸甲酯盐酸盐

【分子式】$C_{17}H_{21}NO_4 \cdot HCl$

【分子量】339.82

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末，无臭。

本品在水中极易溶解，在乙醇中易溶，在三氯甲烷中溶解，在乙醚中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中含 20mg 的溶液，依法测定，比旋度为－71°至－73°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：局麻药。

HY002245 盐酸可乐定

【外文名称】Clonidine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】2-［（2,6-二氯苯基）亚氨基］咪唑烷盐酸盐

【分子式】$C_9H_9Cl_2N_3 \cdot HCl$

【分子量】266.56

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末；无臭。本品在水或乙醇中溶解，在三氯甲烷中极微溶解，在乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗高血压药。

1. 药理作用

（1）可乐定是α受体激动剂。

（2）可乐定直接激动下丘脑及延脑的中枢突触后膜α_2受体，使抑制性神经元激动，减少中枢交感神经冲动传出，从而抑制外周交感神经活动。可乐定还激动外周交感神经突触前膜α_2受体，增强其负反馈作用，减少末梢神经释放去甲肾上腺素，降低外周血管和肾血管阻力，减慢心率，降低血压。肾血流和肾小球滤过率基本保持不变。直立性症状较轻或较少见，很少发生体位性低血压。

（3）盐酸可乐定使卧位心输出量中度（15%～20%）减少，而不改变周围血管阻力；45°倾斜时轻度减少心输出量和周围血管阻力。长期治疗后心输出量趋于正常，但周围血管阻力持续降低。使用可乐定的患者大部分有心率减慢，但药物对血流动力学无影响。

（4）临床研究证实可乐定降低血浆肾素活性、减少醛固酮及儿茶酚胺分泌，但这些药理作用与抗高血压作用的确切关系并不完全清楚。

（5）急性使用盐酸可乐定刺激儿童和成人的生长激素释放，但长期使用不引起生长激素水平持续增高。

（6）可乐定可以治疗偏头疼、痛经及绝经期潮热，但其治疗机制不明，可能通过稳定周围血管发挥作用。可能通过抑制脑内α受体活性戒阿片瘾。

（7）通过激动外周交感神经α_2受体，负反馈抑制其活性，减少房水生成，降低眼压。对瞳孔大小、对光反应及调节功能无影响。

2. 致癌、致突变及生殖毒性　小鼠服用32～46倍人体最大推荐剂量的盐酸可乐定132周，无致癌事件。3倍于人体最大推荐剂量的盐酸可乐定对兔子无致畸作用，无红细胞毒性不良反应。

盐酸可乐定150mg/kg或约3倍于人体最大推荐剂量时不影响雄性或雌性小鼠的繁殖能力；但500～2000mg/kg或10～40倍人体最大推荐剂量，影响雌性小鼠繁殖能力。

【药代动力学】本品口服后70%～80%吸收，并很快分布到各器官，组织内药物浓度比血浆中高，能通过血脑屏障蓄积于脑组织。蛋白结合率为20%～40%。口服本品后半小时到1小时发挥降压作用，3～5小时血药浓度达峰值，一般为1.35ng/ml，作用持续时间6～8小时。消除半衰期为12.7（6～23）小时，肾功能不全时延长。表观分布容积为2.1±0.4L/kg。肌酐清除率3.1±1.2ml/（min·kg）。在肝脏代谢，约50%吸收的剂量经肝内转化。40%～60%以原形于24小时内经肾排泄，20%经肝肠循环由胆汁排出。

滴眼后可被全部吸收，故也可使对侧眼的眼压下降，滴眼后30分钟眼压下降，1～2小时达高峰，持续4～8小时。缓慢静脉注射后可在10分钟内产生降压作用，最大作用约在注射完后30～60分钟，持续约3～7小时，产生降压作用前可出现短暂高血压现象。本品很快分布到各器官，组织内药物浓度比血浆中高，能通过血脑屏障蓄积于脑组织。蛋白结合率为20%～40%。消除半衰期为12.7（6～23）小时，肾功能不全时延长。表观分布容积为（2.1±0.4）L/kg。肌酐清除率（3.1±1.2）ml/（min·kg）。在肝脏代谢，约50%吸收的剂量经肝内转化，大多以原形经肾排泄。

【药物相互作用】

1. 与乙醇、巴比妥类或镇静药等中枢神经抑制药合用，可加强中枢抑制作用。

2. 与其他降压药合用可加强降压作用。

3. 与β受体阻滞剂合用后停药，可增加可乐定的撤药综合征危象，故宜先停用β受体阻滞剂，再停可乐定。

4. 与三环类抗抑郁药合用，减弱可乐定的降压作用。可乐定须加量。

5. 与非甾体类抗炎药合用，减弱可乐定的降压作用。

【药物过量】过量的症状和体征包括低血压、心动过缓、嗜睡、烦躁、乏力、困倦、反射减低或丧失、恶心、呕吐和通气不足。过大剂量可有可逆性心脏传导障碍或心律失常，短暂高血压。低血压时应平卧，抬高床脚，必要时静脉输液，给多巴胺升血压。高血压时静脉给呋噻米、二氮嗪、酚妥拉明或硝普钠对症治疗。

【不良反应】大部分不良反应轻微，并随用药过程而减轻。

1. 常见：最常见口干（与剂量有关），昏睡，头晕，精神抑郁，便秘和镇静，性功能降低和夜尿多，瘙痒，恶心、呕吐，失眠，荨麻疹、血管神经性水肿和风疹，疲劳，直立性症状，紧张和焦躁，脱发，皮疹，畏食和全身不适，体重增加，头痛，乏力，戒断综合征，短暂肝功能异常。

2. 少见：肌肉关节痛，心悸、心动过速、心动过缓，下肢痉挛，排尿困难，男性乳房发育，尿潴留，更少见有多梦、夜游症、烦躁不安、兴奋、幻视幻听、谵妄、雷诺现象、心力衰竭，心电图异常如传导紊乱、心律失常、乙醇过敏、发烧、短暂血糖升高、血清肌酸磷酸激酶升高、肝炎和腮腺炎等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸可乐定滴眼液	化学药	HZ004067
盐酸可乐定膜	化学药	HZ004068
盐酸可乐定片	化学药	HZ004069
盐酸可乐定注射液	化学药	HZ004070
珍菊降压片	中成药	ZC007227

HY002246 盐酸克林霉素

【外文名称】Clindamycin Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】6-（1-甲基-反-4-丙基-L-2-吡咯烷甲酰氨基）-1-硫代-7（S）-氯-6,7,8-三脱氧-L-苏式-α-D-半乳辛吡喃糖苷盐酸盐

【分子式】$C_{18}H_{33}ClN_2O_5S \cdot HCl$

【分子量】461.44

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭。

本品在水中极易溶解，在甲醇或吡啶中易溶，在乙醇中微溶，在丙酮或三氯甲烷中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并稀释成每 1ml 中含 40mg 的溶液，依法测定，比旋度为 +135°至 +150°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗菌药。

本品属林可霉素类抗生素，为林可霉素的衍生物，抗菌谱与林可霉素相同，抗菌活性较林可霉素强 4~8 倍。对革兰阳性菌如葡萄球菌属（包括耐青霉素株）、链球菌属、白喉杆菌、炭疽杆菌等有较高抗菌活性。对革兰阴性厌氧菌也有良好抗菌活性，拟杆菌属包括脆弱拟杆菌、梭杆菌属、消化球菌、消化链球菌、产气荚膜杆菌等大多对本品高度敏感。革兰阴性需氧菌包括流感嗜血杆菌、奈瑟菌属及支原体属均对本品耐药。本品与青霉素、氯霉素、头孢菌素类和四环素类之间无交叉耐药，与大环内酯类有部分交叉耐药，与林可霉素有完全交叉耐药性。

本品的作用机制是与细菌核糖体 50S 亚基结合，阻止肽链的延长，从而抑制细菌细胞的蛋白质合成。本品系抑菌药，但在高浓度时，对某些细菌也具有杀菌作用。

【药代动力学】本品口服后不被胃酸破坏，在胃肠道内迅速吸收，空腹口服的生物利用度为 90%，进食不影响其吸收。口服克林霉素 150mg、300mg 及 600mg 后的血药峰浓度（C_{max}）分别约为 2.5mg/L、4mg/L 及 8mg/L，达峰时间为 0.75~2 小时。本品的蛋白结合率高，为 92%~94%。除脑脊液外，本品广泛分布于体液及组织中，在骨组织中亦可达较高浓度，在胆汁及尿液中可达高浓度，也能透过胎盘，进入胎儿循环。本品在肝脏代谢，部分代谢物具抗菌活性。约 10%给药量以活性成分由尿排出，3.6%以活性成分由粪便排出。血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）成人为 2.4~3.0 小时，儿童为 2.5~3.4 小时。肾衰竭及严重肝脏损害者 $t_{1/2\beta}$略有延长（3~5 小时）。多次给药未见药物蓄积现象。血透及腹透不能清除克林霉素。

本品肌内注射后血药浓度达峰时间（t_{max}），成人约为 3 小时，儿童约为 1 小时。静脉注射本品 300mg，10 分钟血药浓度为 7mg/L。表观分布容积（V_d）约为 94L。在骨组织、胆汁及尿液中可达高浓度。

【药物相互作用】

1. 可增强吸入性麻醉药的神经肌肉阻断现象，导致骨骼肌软弱和呼吸抑制或麻痹（呼吸暂停），在手术中或术后同用时应注意。以抗胆碱酯酶药物或钙盐治疗可望有效。

2. 与抗蠕动止泻药、含白陶土止泻药同用：克林霉素在疗程中，甚至在疗程后数周有引起伴严重水样腹泻的伪膜性肠炎可能。因可使结肠内毒素延迟排出，从而导致腹泻延长和加剧，故抗蠕动止泻药不宜同用。含白陶土止泻药和克林霉素同时口服，后者的吸收将显著减少，故两者不宜同时服用，须间隔一定时间（至少 2 小时）

3. 本品具神经肌肉阻断作用，与抗肌无力药合用时将导致后者对骨骼肌的效果减弱。为控制重症肌无力的症状，在合用的疗程中抗肌无力药的剂量应予调整。

4. 氯霉素或红霉素在靶位上均可置换本品，或阻止后者与细菌核糖体 50S 亚基的结合，体外试验显示本品与红霉素具拮抗作用，故本品不宜与氯霉素或红霉素合用。

5. 与阿片类镇痛药合用，本品的呼吸抑制作用与阿片类的中枢呼吸抑制作用可因累加现象而有导

致呼吸抑制延长或引起呼吸麻痹（呼吸暂停）的可能，故必须对病人进行密切观察或监护。

6. 本品可增强神经肌肉阻断药的作用，两者应避免合用。

7. 本品不宜加入组分复杂的输液中，以免发生配伍禁忌。

【药物过量】本品无特异性拮抗药，药物过量时主要是对症疗法和支持疗法。

【不良反应】

1. 胃肠道反应：常见恶心、呕吐、腹痛、腹泻等；严重者有腹绞痛、腹部压痛、严重腹泻（水样或脓血样），伴发热、异常口渴和疲乏（伪膜性肠炎）。腹泻、肠炎和假膜性肠炎可发生在用药初期，也可发生在停药后数周。

2. 血液系统：偶可发生白细胞减少、中性粒细胞减少、嗜酸粒细胞增多和血小板减少等，罕见再生障碍性贫血。

3. 过敏反应：可见皮疹、瘙痒等，偶见荨麻疹、血管神经性水肿和血清病反应等，罕见剥脱性皮炎、大疱性皮炎、多形性红斑和 Steven – Johnson 综合征。

4. 肝、肾功能异常，如血清氨基转移酶升高、黄疸等。

5. 静脉滴注可能引起静脉炎，肌内注射局部可能出现疼痛、硬结和无菌性脓肿。

6. 其他：耳鸣、眩晕、念珠菌感染等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
克林霉素甲硝唑搽剂	化学药	HZ002103
克林霉素软膏	化学药	HZ002113
盐酸克林霉素胶囊	化学药	HZ004071
盐酸克林霉素氯化钠注射液	化学药	HZ004072
盐酸克林霉素凝胶	化学药	HZ004073
盐酸克林霉素葡萄糖注射液	化学药	HZ004074
盐酸克林霉素溶液	化学药	HZ004075
盐酸克林霉素阴道泡腾片	化学药	HZ004076
盐酸克林霉素注射液	化学药	HZ004077
注射用盐酸克林霉素	化学药	HZ005077

HY002247　盐酸克林霉素棕榈酸酯

【外文名称】Clindamycin Palmitate Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 44 册

药物理化信息

【化学名】6 –（1 – 甲基 – 反 – 4 – 丙基 – L – 2 – 吡咯烷甲酰氨基）– 1 – 硫代 – 7（*S*）– 氯 – 6,7,8 – 三脱氧 – L – 苏式 – α – D – 半乳辛吡喃糖苷 – 2 – 棕榈酸酯盐酸盐

【分子式】$C_{34}H_{63}ClN_2O_6S \cdot HCl$

【分子量】699.85

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末，有特殊异臭，无味。

本品在乙醇、乙醚或三氯甲烷中易溶，在水中溶解。

药物药理信息

【药理毒理】本品系克林霉素的衍生物，体外无抗菌活性，在体内经酯酶水解形成克林霉素而发挥抗菌活性。克林霉素作用机制为抑制细菌蛋白质的合成，主要作用于革兰阳性球菌和厌氧菌感染。本品对金黄葡萄球菌和表皮葡萄球菌、肺炎链球菌、化脓性链球菌等均有较好的抗菌作用，对流感嗜血杆菌及淋病奈瑟氏球菌中度敏感。部分耐红霉素的金黄葡萄球菌、表皮葡萄球菌对本品仍敏感。本品对革兰阴性和革兰阳性厌氧菌均有较好的抗菌作用，其中对脆弱拟杆菌的 MIC_{50} 和 MIC_{90} 分别为 0.062 和 0.5mg/ml，对消化链球菌 MIC_{50} 和 MIC_{90} 分别为 0.125 和 4mg/ml。

【药代动力学】本品口服后药物自胃肠道迅速吸收水解为克林霉素，吸收率约为 90%，吸收不受食物影响。约 1 小时达血药峰浓度（按克林霉素计，儿童每次口服 2 ~ 4mg/kg，每 6 小时 1 次，血药浓度约可达 2 ~ 4μg/ml；成人每次 150 ~ 300mg，血药浓度约可达 2.5 ~ 4μg/ml）。药物与血浆蛋白的结合率极高，达 90% 以上，半衰期（$t_{1/2}$）儿童约为 2 小时，成人约为 2.5 小时，肝肾功能损害时半衰期（$t_{1/2}$）可延长。药物吸收后迅速广泛分布于除脑脊液外的全身各组织和体液中，在肝、肾、脾、骨、胆汁和尿液中浓度较高（母体内达血药浓度 46% 的药物可透过胎盘进入胎儿血循环，并在胎儿肝中形成较高浓度）。克林霉素经肝内代谢产生 *N* – 去甲克林霉素和克林霉素亚砜两个有抗菌活性的代谢产物。药物和其代谢产物经肾、胆汁、肠液及乳汁排泄，尿中 24 小时排泄率达 10%，大便中约 4%。多次用药未见药物蓄积或代谢改变。

【药物相互作用】

1. 本品与神经肌肉阻断剂、中枢性麻醉剂、阿片类具呼吸抑制作用的镇痛药合用，可使神经肌肉阻断现象和呼吸抑制现象加强；而与抗肌松药合用可使抗肌松作用减弱。

2. 氯霉素和红霉素均可置换或阻止克林霉素与细菌核糖体 50S 亚基的结合，故不宜与本品合用。

3. 本品与庆大霉素、黏菌素合用，可能使抗菌作用增强。

【不良反应】

1. 胃肠道反应：偶见恶心、呕吐、腹痛及腹泻。

2. 过敏反应：少数病人可出现药物性皮疹。

3. 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。

4. 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。

5. 极少数病人可产生假膜性结膜炎。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸克林霉素棕榈酸酯分散片	化学药	HZ004078
盐酸克林霉素棕榈酸酯干混悬剂	化学药	HZ004079
盐酸克林霉素棕榈酸酯颗粒	化学药	HZ004080

HY002248 盐酸克仑特罗

【其他名称】氨必妥、胺双氯喘通、氨双氯喘通、氨哮素、Clenbuterolum、克喘素、NAB－365、双氯醇胺、Spiropent、瘦肉精、盐酸双氯醇胺

【外文名称】Clenbuterol Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】α－［（叔丁氨基）甲基］－4－氨基－3,5－二氯苯甲醇盐酸盐

【分子式】$C_{12}H_{18}Cl_2N_2O \cdot HCl$

【分子量】313.65

【性状及组成】本品为白色或几乎白色的结晶性粉末，无臭，味略苦。本品在水或乙醇中溶解，在三氯甲烷或丙酮中微溶，在乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为 172～176℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：β_2 肾上腺素受体激动药。

为选择性 β_2 受体激动剂，其松弛支气管平滑肌作用强而持久。有增强纤毛运动，溶解黏液的作用。但对心血管系统影响较少。

【药代动力学】有效剂量低，生物半衰期长，口服吸收快而完全。吸收半衰期为 1 小时。药物的分布符合带有周边室的二室开放模型。自血浆中的消除可分两相，α 相的半衰期为 1 小时，β 相为 34 小时。主要通过肾脏排泄，168 小时后排泄 87%。给药间隔 12 小时足以维持血药浓度。在人体中已发现 5 种代谢物。

直肠给药后 10～30 分钟起效，作用持续 8～24 小时。

【药物相互作用】本品与 β－受体阻滞药互相拮抗。

【药物过量】如本品服用过量，给予 β－受体阻滞药症状可立即消失。如服用本品 0.6mg（0.02mg 30 片）后 90 分钟，给予 β－受体阻滞药，则仍可耐受而无并发症。应根据临床表现，间隔短时间累积给药。本品的作用可能长于阻滞药的作用，故可能需重复给予拮抗药。

【不良反应】和所有拟 β－肾上腺素能药一样，本品可能引起震颤，特别在治疗开始阶段。在治疗剂量时偶可出现不安、期外收缩和心动过速。过量可引起不安、焦急、面部潮红、心动过速、明显震颤或血压升高。震颤时在血清中肌肉细胞的特异性酶增高。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氨溴特罗口服液	化学药	HZ000250
复方二氧丙嗪茶碱片	化学药	HZ001158
复方羟丙茶碱去氯羟嗪胶囊	化学药	HZ001342
复方盐酸克仑特罗胶丸	化学药	HZ001456
复方盐酸克仑特罗栓	化学药	HZ001457
盐酸克仑特罗膜	化学药	HZ004081
盐酸克仑特罗片	化学药	HZ004082
盐酸克仑特罗气雾剂	化学药	HZ004083
盐酸克仑特罗栓	化学药	HZ004084
安喘片	中成药	ZC000007
喘舒片	中成药	ZC000637
喘息灵胶囊	中成药	ZC000639
肺气肿片	中成药	ZC001067
情安喘定片	中成药	ZC004222
止喘灵气雾剂	中成药	ZC007320

HY002249　盐酸喹那普利

【其他名称】ACCllpllil、Accuprin、Accupro

【外文名称】Quinapril Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第33册

药物理化信息

【化学名】*S*-2-［*S*-*N*-［(*S*)-1-乙氧羰基-3-苯丙基］-L-丙氨酰］-1,2,3,4-四氢-3-异喹啉酸盐酸盐

【分子式】$C_{25}H_{30}N_2O_5 \cdot HCl$

【分子量】474.98

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，味苦，有吸湿性。

本品在甲醇中极易溶解，在三氯甲烷中易溶，在水中溶解，在醋酸乙酯或乙醚中几乎不溶；在0.1mol/L盐酸溶液中易溶。

比旋度：取本品，精密称定，加甲醇制成每1ml中约含20mg的溶液，依法测定，比旋度为+13.0°至+17.0°。

药物药理信息

【药理毒理】本品为无巯基、长效、口服血管紧张素转换酶（ACE）抑制剂前体药。口服后在肝脏水解成具有活性的二酸型化合物，即喹那普利拉，可抑制ACE，阻止血管紧张素Ⅰ转换为血管紧张素Ⅱ，从而使血管紧张素Ⅱ所介导的血管收缩作用明显减弱，降低动脉的血管阻力；同时还抑制醛固酮的合成，减少醛固酮所产生的水和钠的潴留，使血压进一步下降。因而是一种安全、高效的降压药物。

【药代动力学】本品口服约有60%被迅速吸收。在肠和肝中转变成有活性的喹那普利拉。口服后在1.4~1.5小时血药浓度达峰值。终末半衰期为25h（因与组织内的转换酶亲和力高）。由肾清除约61%、粪中排出约37%。蛋白结合率约为35%。本品作用开始较快，最大降压作用出现在口服后2~6小时。

【不良反应】临床试验表明，绝大多数患者都可服用本品。偶见不良反应，如干咳、头痛、眩晕、疲劳等，大多症状轻微，可以耐受。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸喹那普利片	化学药	HZ004085

HY002250　盐酸拉贝洛尔

【其他名称】AH5158、Enduronyl、格尔、Ibidomide、降压乐、柳胺苄心定、柳安羟胺、拉平他乐、Presdate、Sch15719、TRANDATE、湍泰低

【外文名称】Labetalol Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第7册

药物理化信息

【化学名】5-〔1-羟基-2（1-甲基-3苯丙胺基）-乙基〕水杨酰胺盐酸盐

【分子式】$C_{19}H_{24}N_2O_3 \cdot HCl$

【分子量】364.87

【性状及组成】本品为白色粉末或颗粒，溶于水及醇，几不溶于乙醚和三氯甲烷。

药物药理信息

【药理毒理】拉贝洛尔在化学结构上有两个光学中心，有4种立体异构物，即*R*，*R*-，*R*，*S*-，*S*，*R*-及*S*，*S*-拉贝洛尔。各异构物的阻断受体的选择性各不同：*R*，*R*-型者主要阻断β受体；*S*，*R*-型的阻断α受体的作用最强；*S*，*S*-型具有较弱的阻断α受体的作用；*R*，*S*-型不具任何阻断作用。临床应用的拉贝洛尔为上述4种异构体的消旋混合物。故兼有α受体及β受体阻断作用。其β受体阻滞作用约为普萘洛尔的1/2.5，但无心肌抑制作用，α受体阻滞作用为酚妥拉明的1/6~10。对β受体的作用比α受体强，口服时为3:1，静注时则为6.9:1。它与单纯β阻滞剂不同，能降低卧位血压和周围血管阻力，一般不降低心排血量或每次心搏量。对卧位病人心率无明显变化，立位或运动时心率则减慢。对高血压的疗效比单纯β阻滞剂为优。本品亦可引起体位性低血压。*R*，*R*-拉贝洛尔，又名地来洛尔（dilevalol）曾作为降压药应用，后因其肝毒性较大而停止使用。本品使支气管平滑肌收缩的作用虽不强，但对哮喘患者仍可致支气管痉挛。本品属α、β受体阻断药，通过对α及β受体竞争性拮抗而产生降压作用，其中阻断β_1和β_2，受体程度相似，对α_1受体作用较弱，对α_2受体则无作用。

1. 药理：本品为具有选择性α_1和非选择性β受体拮抗作用，两种作用均有降压效应，静注时两种作用之比约为1:6.9。大剂量时具有膜稳定作用，内源性拟交感活性甚微。本品降压强度与剂量有关，不伴反射性心动过速和心动过缓，立位血压下降较卧位明显。

2. 毒理：本品小白鼠静注的半数致死量（LD_{50}）为51.8±1.9mg/kg。兔每天1~10mg/kg静注，长期

观察均未见有明显毒性反应。

【药代动力学】口服后可吸收，生物利用度约70%；吸收迅速，血浆药物浓度达峰时间1～2小时。在血浆中与蛋白的结合率约50%。大多数药物在肝中被代谢。半衰期（$t_{1/2}$）为6～8小时，其原形药物和代谢产物由尿排出。血液透析和腹膜透析均不易清除。V_d为11.2L/kg。

【药物相互作用】

1. 本药与三环抗抑郁药同时应用可产生震颤。

2. 本品可减弱硝酸甘油的反射性心动过速，但降压作用可协同。

3. 与维拉帕米类钙拮抗剂联用时需十分谨慎。

4. 本品可增强氟烷对血压的作用。

【药物过量】剂量过大，还可发生心动过速、急性肾衰竭。

【不良反应】

1. 常见有眩晕、乏力、幻觉、胃肠道障碍（恶心、消化不良、腹痛、腹泻）、口干、头皮麻刺感。

2. 剂量过大，还可发生心动过速、急性肾衰竭。

3. 儿童、孕妇及哮喘、脑溢血病人忌用静注。

4. 心绞痛病人不能突然停药。

5. 头晕、瘙痒、乏力、恶心、胸闷，少数患者可发生体位性低血压。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸拉贝洛尔片	化学药	HZ004086
盐酸拉贝洛尔注射液	化学药	HZ004087
注射用盐酸拉贝洛尔	化学药	HZ005078

HY002251 盐酸赖氨酸

【其他名称】赖氨酸盐酸盐

【外文名称】Lysine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】L－2,6－二氨基己酸盐酸盐

【分子式】$C_6H_{14}N_2O_2 \cdot HCl$

【分子量】182.65

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末，无臭。

本品在水中易溶，在乙醇中极微溶解，在乙醚中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加6mol/L盐酸溶液溶解并稀释成每1ml中含80mg的溶液，依法测定，比旋度为+20.0°至+21.5°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：氨基酸类药。

赖氨酸属碱性氨基酸，分子中含两个氨基，为人体必需氨基酸之一，在维持人体氮平衡的八种必需氨基酸中特别重要，是衡量食物营养价值的重要指标之一，特别是在儿童发育期、病后恢复期、妊娠授乳期，对赖氨酸的需要量更高。由于其在大米、玉米等食物中含量较低，容易造成人体缺乏，被称为“第一缺乏氨基酸”。赖氨酸缺乏会引起发育不良、食欲减退、体重减轻、负氮平衡、低蛋白血症、牙齿发育不良、贫血、酶活性下降及其他生理功能障碍。赖氨酸广泛存在于各种蛋白质中，肉、蛋、乳等蛋白中含量较高，约为7%～9%，鸡卵蛋白中高达13%。

【药物过量】过量使用可能出现严重的新陈代谢中毒危险。一旦过量，应给予支持和对症治疗。

【不良反应】偶见轻度恶心、呕吐及过敏反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
11氨基酸注射液－833	化学药	HZ000212
低分子右旋糖酐氨基酸注射液	化学药	HZ000673
多维赖氨酸糖浆	化学药	HZ000797
多维铁口服溶液	化学药	HZ000800
多维元素片（21）	化学药	HZ000808
二维钙赖氨酸片	化学药	HZ000854
复方氨基酸胶囊（8－11）	化学药	HZ001047
复方氨基酸颗粒（14AA）	化学药	HZ001049
复方氨基酸口服溶液（14AA）	化学药	HZ001050
复方氨基酸注射液（17AA－Ⅰ）	化学药	HZ001059
复方氨基酸注射液（17AA－H）	化学药	HZ001060
复方氨基酸注射液（18）	化学药	HZ001062
复方氨基酸注射液（18AA）	化学药	HZ001063
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅰ）	化学药	HZ001064
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅴ）	化学药	HZ001068
复方氨基酸注射液（18AA－N）	化学药	HZ001069
复方氨基酸注射液（20AA）	化学药	HZ001071
复方八维甲睾酮胶囊	化学药	HZ001076
复方赖氨酸颗粒	化学药	HZ001257
复方氯化钾颗粒	化学药	HZ001296
复方三维亚铁口服液	化学药	HZ001366

续表

制剂名称	类别	序号
口服五维赖氨酸葡萄糖	化学药	HZ002142
赖氨肌醇维 B_{12}口服溶液	化学药	HZ002168
赖氨葡锌颗粒	化学药	HZ002171
赖氨葡锌片	化学药	HZ002172
赖氨酸磷酸氢钙颗粒	化学药	HZ002174
赖氨酸磷酸氢钙片	化学药	HZ002175
赖氨酸维 B_{12}颗粒	化学药	HZ002176
赖氨酸盐酸盐颗粒	化学药	HZ002177
葡萄糖酸钙锌口服液	化学药	HZ002892
五维赖氨酸颗粒	化学药	HZ003606
五维赖氨酸口服溶液	化学药	HZ003607
五维赖氨酸片	化学药	HZ003608
小儿复方赖氨酸颗粒	化学药	HZ003757
小儿复方四维亚铁散	化学药	HZ003760
小儿五维赖氨酸糖浆	化学药	HZ003781
盐酸赖氨酸氯化钠注射液	化学药	HZ004088
盐酸赖氨酸片	化学药	HZ004089
盐酸赖氨酸葡萄糖注射液	化学药	HZ004090
盐酸赖氨酸散	化学药	HZ004091
盐酸赖氨酸注射液	化学药	HZ004092
脂肪乳氨基酸葡萄糖注射液	化学药	HZ004653
注射用盐酸赖氨酸	化学药	HZ005079
健宝灵片	中成药	ZC002447

HY002252　盐酸乐卡地平

【外文名称】Lercanidipine Hydrochloride

【性状及组成】结晶，本品的熔点为 186 ~ 188℃。

药物药理信息

【药理毒理】乐卡地平为亲脂性的二氢吡啶类钙拮抗剂，口服具有降低全身动脉血压的活性，作用发生缓慢而持久。对豚鼠心室肌细胞的电生理学研究显示，该药及其镜像（对映）异构体对去极化细胞上的钙通道有起效缓慢而持久的阻滞作用，对正常极化细胞的作用甚微，对心肌收缩力无影响，表明该化合物可以产生选择性的血管扩张作用，而无降低血压不需要的心脏作用。体外研究中，本品对被氯化钾收缩的小鼠主动脉段的扩张作用起效缓慢，但持续时间较长。血管扩张作用：本品可引起直接的冠状血管和外周血管扩张，作用强度与药物浓度关系密切。高血压病人常有某种程度的动脉粥样硬化，血管壁内沉积的胆固醇能阻止亲脂性差的钙拮抗剂进入血管的细胞膜，使药物效果减弱。乐卡地平“独特的亲脂性”克服了现有二氢吡啶类药物的不足（这些药物的结合部位是细胞膜类脂双层周围的蛋白质间隙），使其能够集中于该类脂双层上，维持治疗有效时间达 24 小时。由于其分子的亲脂性，可以透过血管内壁的脂肪空斑，即使胆固醇较高时也能进入细胞膜，因而适用于动脉粥样硬化病人的降压治疗。血管保护作用：乐卡地平长期使用能保护血管不受胆固醇的侵害，延缓动脉粥样硬化速度，最终降低中风发生率。研究发现乐卡地平能抑制人动脉肌细胞的迁移和增生，还能抑制 3H 标记的胸苷掺入这些细胞的 DNA，其中（*R*）-异构体的这种作用最强。大鼠和人主动脉肌细胞增生明显受到乐卡地平的抑制，抑制程度与药物浓度呈正相关性。本品还可阻滞低密度脂蛋白（LDL）的氧化作用，作用机制有两个：一方面直接防止血管受到 LDL 的氧化，另一方面是干扰细胞调节的 LDL 氧化作用。本品为外消旋的分子，两个对映体在试管内及动物和人体内减慢粥样硬化进程的效果相同。左旋异构体引起钙阻断活性，右旋异构体似能减慢粥样硬化的进展而不引起血压下降，故后者对动脉粥样硬化而不是对高血压有潜在的治疗功效。保护心肌作用：用离体家兔心脏做成急性心肌缺血模型，研究乐卡地平的心脏作用，结果显示由于本品抑制了细胞外钙离子的流入，而对缺血的心肌具有保护作用，这种活性作用主要靠乐卡地平的（*S*）-镜像异构体。对用 Langendorff 灌注的兔缺血/再灌注心脏的保护作用，乐卡地平给药时间的选择尤为重要。在缺血之前使用，心脏保护作用与给药浓度呈正相关性。而缺血发生时给药，只有高浓度才有效。乐卡地平的两种镜像异构体都有依赖浓度对抗缺血性重灌注危害的心脏保护作用，其中（*S*）-镜像异构体作用更强。对灌注兔心脏的线粒体的研究表明，乐卡地平对脂质过氧化引起的兔心脏损害有保护作用。体外和体内研究均显示，本品对血管的选择性明显高于心肌，在扩张冠脉和外周血管时对心室功能无影响，提示其对治疗充血性心力衰竭具有潜在的价值，特别适用于伴有左心室功能不全或充血性心力衰竭的高血压病人。本品缓慢穿透并进入细胞壁，作用持久，因而耐受性好。综合使用本品治疗高血压的 1016 名病人的资料提示，每次给药 10mg 或 20mg，1 次/天，具有良好的安全性，无肌力作用，不导致心率的反射性加快，不会引起踝部水肿，副作用发生率低。本品为第三代二氢吡啶类钙通道阻滞剂，作

用机制与同类药物相似，即可逆地阻滞血管平滑肌细胞膜L型钙通道的Ca^{2+}内流，扩张外周血管而降低血压。本品亲脂性较高，因此起效时间较慢，而作用持续时间较长。体内外试验表明，本品选择性血管扩张作用所致的负性肌力作用较硝苯地平、尼群地平和非洛地平弱；而血管选择性强于氨氯地平、非洛地平、尼群地平及拉西地平。此外，本品还具有抗动脉粥样硬化和保护终末器官作用。本品在治疗剂量时不干扰高血压患者的正常心脏兴奋性和传导性。动物实验表明，本品对肾脏有保护作用，其机制可能与血流动力学无关。

【药代动力学】本品为消旋体，有效部分为*S*型异构体。轻中度高血压患者口服10或20mg后，其t_{max}为2～3小时，C_{max}分别为1.75和4.09μg·L^{-1}，其AUC与剂量呈现非线性相关，表明此药具有首过代谢的饱和性。食物可增加本品的吸收，12例健康受试者单剂量口服20mg，其C_{max}由禁食的3.20μg·L^{-1}增至高脂肪餐后的10.21μg·L^{-1}，故推荐饭后服用，本品吸收后迅速分布、积聚在细胞膜脂质双层，蛋白结合率高于98%。本品口服后，主要由CYP3A4代谢而具有广泛首过效应，无活性代谢产物约50%由粪便排出。

【不良反应】主要不良反应为头痛、视神经乳头水肿。本品耐受性良好，据20个临床试验中心、共约1800例患者参与的试验结果表明，不良反应发生率为11.8%，安慰剂组为7%。最常见不良反应是头痛、面红、无力、疲劳、心悸及踝关节水肿，约3%～5%患者因此而停药。对9605例临床观察表明，本品耐受性良好，其中7469例轻中度高血压患者口服10或20mg·d^{-1}，疗程3个月，不良反应发生率7.6%，最常见头痛（2.7%）和踝关节水肿(2.1%)。本品不良反应多属于轻中度，且与血管扩张作用相关。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸乐卡地平片	化学药	HZ004093

HY002253 盐酸雷洛昔芬

【外文名称】Raloxifene Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】［6－羟基－2－（4－羟苯基）苯并［*b*］噻酚－3－基］－［4－［2－（1－哌啶基）乙氧基］－苯基］－甲酮盐酸盐

【分子式】$C_{28}H_{27}NO_4S·HCl$

【分子量】510.05

药物药理信息

【药理毒理】药理治疗组：本品为选择性雌激素受体调节剂（SERM）.ATC码：G03XC01作为一种选择性雌激素受体调节剂（SERM），雷洛昔芬对雌激素作用的组织有选择性的激动或拮抗活性。它是一种对骨骼和部分对胆固醇代谢（降低总胆固醇和LDL－胆固醇）的激动剂，但对下丘脑、子宫和乳腺组织无此激动作用。

雷洛昔芬的生物学作用，如同雌激素一样是通过与高亲和力的雌激素受体结合和基因表达的调节为介导的。这种结合引起不同组织的多种雌激素调节基因的不同表达。最近的资料表明雌激素受体至少可以通过两种有配体、组织和/或基因特异性的旁路调节基因表达。

1．骨骼的作用：绝经后体内可利用的雌激素减少，导致骨吸收明显增强，骨量丢失和骨折的危险性显著增加。绝经后的前10年内骨丢失明显加快，尽管骨形成也代偿性加快，但不足以补偿骨吸收增强所致的骨丢失。其他可能引起骨质疏松症的危险因素包括绝经早，骨量减少（至少低于峰值骨量的1SD以下），体形瘦，白人和亚洲人种以及骨质疏松症家族史者。替代治疗通常可以逆转骨吸收过快。在绝经后骨质疏松妇女中，雷洛昔芬可以降低椎体骨折的发生率，保持骨量和增加骨矿盐密度（BMD）。

基于这些危险因素，雷洛昔芬预防骨质疏松症适用于绝经10年以内的妇女，和腰椎BMD在正常青年人均值的1.0至2.5SD之间者，主要考虑到高龄时会发生骨质疏松性骨折的危险。雷洛昔芬治疗骨质疏松症适用于脊柱BMD在正常青年人均值2.5SD以下的骨质疏松症或严重的骨质疏松症者和（或）伴有椎体骨折，无论其骨密度如何。

（1）骨折的发生率：在一项平均年龄为66岁，患有骨质疏松症或伴有已存在骨折的骨质疏松症的7705名绝经后妇女参加的研究，雷洛昔芬治疗3年椎体骨折的发生率分别降低47%（RR0.53，CI0.35，0.79；$p<0.001$）和31%（RR 0.69，CI0.56，0.86；$p<0.001$）。45名骨质疏松症妇女和15名骨质疏松症伴发骨折的严重骨质疏松症妇女需要雷洛昔芬治疗3年预防一处或多处的椎体骨折。对椎体外骨折的作用尚未证实。该研究中的所有病人均补充钙剂和维生素D。

（2）骨矿盐密度（BMD）：雷洛昔芬一日1次的效果对年龄达60岁的有或没有子宫的绝经后妇女中进行了为期2年的观察，妇女的绝经年限为2至8年。三项研究包括1764名绝经后妇女使用雷洛昔芬加钙或安慰剂加钙治疗。这些研究中有一项研究中

受试妇女以前进行过子宫切除术。与安慰剂相比，雷洛昔芬使髋部和脊柱骨密度和全身骨量显著增加。与安慰剂比较骨密度一般增加2%。同样，在治疗研究人群中骨密度也有类似增加。在预防研究人群中，雷洛昔芬治疗BMD增加和降低个体的百分比分别为：脊柱减低和增加分别为37%和63%，全髋部降低和增加分别为29%和71%。

（3）钙动力：雷洛昔芬与雌激素对骨重建和钙代谢的作用相似。雷洛昔芬每日60mg使骨吸收降低的同时使钙平衡正向转移，这一作用主要是通过使尿钙的丢失减少所致。

（4）组织计量学（骨质量）：一项雷洛昔芬与雌激素的对比研究发现经两种药物治疗的骨组织学正常，未出现矿化缺陷，编织骨和骨髓纤维化。雷洛昔芬降低骨吸收；对骨的作用表现为血清和尿的骨转换标志物水平下降，放射性钙动力研究提示骨吸收降低，BMD增加和骨折发生率降低。

2．对脂代谢和心血管危险因素的影响：临床研究表明雷洛昔芬每日60mg能显著降低总胆固醇（3%～6%）和LDL胆固醇（4%～10%）。妇女的基础胆固醇水平最高者降低的幅度也最大。HDL胆固醇和甘油三酯水平无明显变化。经过3年雷洛昔芬治疗使纤维蛋白原降低（6.71%）。

在骨质疏松症的治疗研究中，与安慰剂比较需要开始降血脂的患者较少。没有资料能证明雷洛昔芬对心血管疾病有益处。

雷洛昔芬治疗静脉血栓栓塞事件的相对危险度与安慰剂比较为2.32（CI1.26，4.26）与雌激素或性激素替代治疗比较相对危险度为1.0（CI0.3，6.2）。治疗的最初4个月血栓栓塞性疾病的危险性最大。

3．对子宫内膜的影响：临床研究中，雷洛昔芬对绝经后子宫内膜无刺激作用，与安慰剂比较，雷洛昔芬与点状出血或经血或内膜增生无相关性。所有的剂量组约对831名妇女进行了3000次经阴道超声检查。雷洛昔芬治疗妇女子宫内膜厚度保持不变，与安慰剂组无区别。治疗3年后经阴道超声判断子宫内膜厚度增加至少5mm，在221名雷洛昔芬60mg/d治疗妇女的发生率为1.9%，在219名安慰剂治疗组为1.8%。雷洛昔芬和安慰剂治疗组报道子宫出血的发生率无差异。

使用雷洛昔芬60mg/d治疗6个月所有病人的子宫内膜活检未见增生。此外一项使用日推荐剂量2.5倍的研究中也未见到内膜增生和子宫体积增大。

骨质疏松症治疗研究的3年中对受试者（1781名病人）每年进行子宫内膜厚度评价，经过3年的治疗，雷洛昔芬治疗组子宫内膜的厚度与基线时比较无改变。

雷洛昔芬和安慰剂组比较妇女发生阴道出血和阴道分泌的发生率无差别。

雷洛昔芬治疗妇女因子宫脱垂需要外科干预者不比安慰剂组多。

雷洛昔芬治疗3年，子宫内膜和卵巢癌的危险性未见增加。绝经后妇女经雷洛昔芬治疗3年良性子宫内膜息肉的发生率为0.7%，而安慰剂治疗组为0.2%。

4．对乳腺组织的作用：雷洛昔芬对乳腺组织无刺激作用。所有安慰剂对照研究，雷洛昔芬发生乳腺症状的频率和严重程度均与安慰剂组无差别（无肿胀、压痛和乳腺疼痛）。

在雷洛昔芬的临床研究中有12000名病人参加，多数患者治疗至少42个月，发生新诊断乳腺癌的相对危险性明显减低，对几项研究合并分析表明雷洛昔芬治疗的绝经后妇女比安慰剂下降64%（RR0.36，CI0.20，0.65）。浸润性雌激素受体（ER）阳性的乳腺癌的发生的总体危险性降低80%（RR0.20，CI 0.09，0.41）。雷洛昔芬对ER阴性的乳腺癌的危险性无影响。这些观察支持雷洛昔芬对乳腺组无内在的雌激素刺激活性。雷洛昔芬对乳腺癌的长期作用不详。

5．对认知功能的影响：未发现对认知功能的不良影响。

临床前安全性资料：在一项2年的大鼠诱癌研究中表明，在大剂量雌性组［279mg/（kg·d）］卵巢颗粒和鞘细胞肿瘤增加。该组雷洛昔芬的全身量（AUC）相当于绝经后妇女摄入每日60mg剂量的400倍。21个月的小鼠诱癌研究表明雄性予以41或210mg/kg剂量，睾丸间质细胞肿瘤、前列腺腺瘤和前列腺腺癌增加，雄性210mg/kg剂量组的前列腺平滑肌瘤增加。雌性小鼠9～242mg/kg剂量（人体AUC的0.3到32倍）卵巢上皮样肿瘤的发生率增加，包括来源于颗粒和鞘细胞的良性和恶性肿瘤和良性的上皮细胞肿瘤。这些研究中的雌性啮齿类动物治疗均处在生育期，此时卵巢有功能并对激素刺激呈高反应。与这些啮齿类动物不同的是绝经后妇女卵巢功能对生殖类激素的刺激相对无反应。

在所有的实验系统组合中均未发现雷洛昔芬的生殖毒性。

观察雷洛昔芬药理作用的同时观察了其对生殖和发育的影响。雷洛昔芬在每天每千克0.1mg到10mg的剂量范围内能破坏雌性大鼠的发情周期但在治疗结束后不延缓受孕，仅空白期稍降低，孕期延长和改变胎鼠发育的时间。在着床前给药，雷洛昔芬可以延缓和破坏着床导致孕期延长和仔鼠外形变小，但子代的发育到断奶不受影响，家兔和大鼠中

进行了致畸研究，家兔出现了流产和极少的室间隔缺损（≥0.1mg/kg）和脑积水（≥10mg/kg）。大鼠的胚胎发育延迟，肋骨变形和肾脏空洞形成（≥1mg/kg）。

雷洛昔芬在大鼠子宫中有抗雌激素作用并可预防大鼠和小鼠的雌激素依赖性乳房肿瘤的生长。

【药代动力学】吸收：雷洛昔芬在口服后迅速吸收，口服剂量的大约60%被吸收。进入循环前被大量葡萄糖醛化。绝对生物利用度为2%。达到平均最大血浆浓度的时间取决于雷洛昔芬和其葡萄糖醛化代谢物全身内转换和肠肝循环。

分布：雷洛昔芬在全身广泛分布。分布容积不依赖与剂量。雷洛昔芬与血浆蛋白紧密结合（98%~99%）。

代谢：雷洛昔芬大量参与首过代谢为葡萄糖醛基结合物，雷洛昔芬-4-葡萄糖苷酸，雷洛昔芬-6-葡萄糖苷酸和雷洛昔芬-4，6-葡萄糖苷酸。未检出其他代谢物。雷洛昔芬包含低于其结合浓度的1%和葡萄糖苷酸代谢物。通过肠肝循环维持雷洛昔芬的水平，血浆半衰期为27.7小时。通过单次用药的结果推测多次用药的药代动力学。增加雷洛昔芬的剂量导致血浆时间浓度曲线下面积增加的比例轻度下降。

排泄：服入体内的雷洛昔芬及其葡萄糖苷酸代谢物的绝大部分在5日内排泄，主要通过粪便，经尿排出的部分少于6%。

特殊人群：肾功能不全，少于总剂量的6%经尿中排出，一项人群的药代动力学研究表明，经净体质量校正的肌酐清除率降低47%会导致雷洛昔芬的清除降低17%和雷洛昔芬结合物的清除降低15%。肝功能不全，肝硬化和轻度肝功能不全（Child-Pμgh A级）单次使用雷洛昔芬的药代动力学与健康者比较，血浆雷洛昔芬的浓度比对照者约高2.5倍并与胆红素水平相关。

【药物相互作用】

1．同时摄入碳酸钙或含铝和氢氧化镁的抗酸剂对全身使用雷洛昔芬不影响。

2．同时服用雷洛昔芬和华法林不改变两种化合物的药代动力学。但发现能轻度减少凝血酶原时间，所以当雷洛昔芬与华法林或其他香豆素类衍生物合用时需要监测凝血酶原时间。对已经接受香豆素抗凝的药物的病人雷洛昔芬对凝血酶原时间的作用可能出现。

3．雷洛昔芬不影响对单次使用甲基强的松龙的药代动力学。

4．雷洛昔芬不影响地高辛曲线下面积的稳定状态，地高辛的药物最大浓度的增加少于5%。

5．在雷洛昔芬预防和治疗的临床研究中评价了同时服药物对雷洛昔芬血浆浓度的影响。经常同服的药物包括：对乙酰氨基酚，非甾体类抗炎药（如乙酰水杨酸、布洛芬和萘普生。口服抗生素，H_1拮抗剂，H_2拮抗剂，和苯二氮䓬类。未发现同服药物对雷洛昔芬血浆浓度的临床影响。

若需要治疗阴道萎缩的症状，可以在临床治疗方案中同时经阴道使用雌激素制剂，与安慰剂比较使用雷洛昔芬的病人中局部雌激素的使用例数未见增加。雷洛昔芬在体外与华法林，苯妥英钠和三苯氧胺之间无相互作用。

6．雷洛昔芬不宜与消胆胺（或其他阴离子交换树脂）同时服用，它可显著减低雷洛昔芬的吸收和肠肝循环。

7．与氨苄青霉素同服会减低雷洛昔芬的峰浓度，但由于不影响整体的吸收量和清除率，雷洛昔芬可以与氨苄青霉素同服。

8．雷洛昔芬可轻度增加激素结合球蛋白的浓度，包括性激素结合球蛋白（SHBG），甲状腺素结合球蛋白（TBG）和皮质激素结合球蛋白（CBG），使相应的总的激素浓度增高，但并不影响自由激素的浓度。

【药物过量】还没有人体用药过量的报道。一项每日摄入600mg共8周的研究和120mg超过2500名绝经后妇女参加疗程3年的研究，均具有良好的耐受性。没有针对盐酸雷洛昔芬的特殊解毒剂。

【不良反应】

1．无论其原因，参加研究的12000名妇女在治疗期间为2至36个月中出现的不良反应均做记录。绝大多数的不良反应通常无需停止治疗。在预防研究人群中出现因任何不良反应而中断治疗者：其中在581名使用雷洛昔芬的个体中为10.7%，而在584名使用安慰剂治疗的个体中为11.1%。在治疗研究人群中由于任何不良事件而中断治疗者2557名雷洛昔芬治疗病人为10.9%，而在2567名安慰剂治疗病人为8.8%。与使用雷洛昔芬有关的不良反应在雷洛昔芬治疗组和安慰剂组之间有显著差异的（$P<0.05$），叙述如下：所有安慰剂对照的临床研究中静脉血栓栓塞事件，包括深静脉血栓，肺栓塞和视网膜静脉血栓发生的频率约0.7%或3.25例/每1000例病人中。与安慰剂比较雷洛昔芬治疗的相对危险性为2.32（CI1.26，4.26）。开始治疗的4个月静脉血栓栓塞事件的危险性最大。浅静脉血栓性静脉炎的发生频率少于1%。与安慰剂比较使用雷洛昔芬的病人血管扩张（潮热）的发生轻度增加（骨质疏松症的预防研究，绝经后2至8年的妇女中，雷洛昔芬和安慰剂分别为24.3%和18.2%；骨质疏松症的治

疗研究，在平均年龄66岁的妇女中，雷洛昔芬和安慰剂的血管扩张发生率分别为9.7%和6.4%），这项不良反应多数出现在开始治疗的6个月，在以后则极少出现。

观察到的另一个不良反应为小腿痛性痉挛（在预防研究人群中雷洛昔芬和安慰剂分别为5.5%和1.9%，在治疗研究人群中雷洛昔芬和安慰剂的发生率分别为7.0%和3.7%）还观察到的一个不具统计意义的改变（$P > 0.05$），但有明显的剂量趋势。即外周水肿在预防研究人群雷洛昔芬组和安慰剂组分别为3.1%和1.9%，在治疗研究人群中的发生率分别为5.2%和4.4%。

有报道在雷洛昔芬治疗期间血小板数目轻度减少（6%～10%）。

上市后随访中有极少（<1/10000）胃肠症状的报道如恶心、呕吐、腹痛和消化不良，皮疹，血压升高及包括偏头痛在内的头痛。

有13.5%的雷洛昔芬和11.4%的安慰剂治疗的病人出现流感综合征。

极少病例出现AST和/或ALT轻度增加，不能排除是雷洛昔芬所致，在安慰剂人群中发生的频率相似。

雷洛昔芬（$n = 317$）与持续的联合（$n = 110$）激素替代治疗（HRT）或周期（$n = 205$）

HRT的几个临床研究相比，雷洛昔芬治疗时乳腺症状和子宫出血的发生率显著低于任何一种HRT治疗方案。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸雷洛昔芬片	化学药	HZ004094

HY002254　盐酸雷莫司琼

【外文名称】 Ramosetron Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】（－）－5－*R*－［（1－甲基－1*H*－吲哚－3－基）羰基］－4,5,6,7－四氢－1*H*－苯并咪唑盐酸盐

【分子式】 $C_{17}H_{17}N_3O \cdot HCl$

【分子量】 315.80

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用

5－HT_3受体拮抗作用：在5－羟色胺引起的豚鼠离体结肠收缩实验和大鼠，雪貂心率减慢反射（Bezold－Jarisch反射）实验中，本药显示了对5－HT_3受体的拮抗作用。

抗恶性肿瘤药物诱发呕吐抑制作用：对使用顺铂诱发的雪貂的呕吐，在出现呕吐之前或在初次呕吐之后给予本药，显示了抑制作用。

顺铂等抗恶性肿瘤药物可使5－羟色胺从消化道的肠嗜铬细胞中游离出来。5－羟色胺与存在于消化道黏膜内传入迷走神经末梢的5－HT_3受体结合，进而刺激呕吐中枢诱发呕吐。盐酸雷莫司琼是通过阻断这一5－HT_3受体而发挥止吐作用的。

2．毒理研究

急性毒性：对小鼠、大鼠和狗进行了静脉给药的动物试验。小鼠和大鼠在给药后可见一过性的自发运动的减少，在出现震颤和痉挛后死亡。LD_{50}分别是：雄性小鼠90～108mg/kg，雌性小鼠108～130mg/kg，雄性大鼠172mg/kg，雌性大鼠151mg/kg。对狗给药30mg/kg后可见呕吐，呼吸急促，心率加快，体重减少等，未出现死亡。无论哪种动物都没有明显的性别差异。

亚急性毒性：对大鼠和狗进行了为期一个月的静脉给药动物试验。大鼠［给药量：0.1，1.0，10mg/（kg·d）］在给药1mg/kg以上时出现ALT的轻度升高（大约是对照组的1.2倍），在给药10mg/kg时体重增加受到抑制（大约4%）。但是，无论是哪一种动物，脏器组织都未出现病理组织学的异常。大鼠的最大无毒剂量推定为0.1mg/（kg·d）。对狗的最高给药量达3mg/kg，也未出现毒性影响。

生殖毒性和致癌性：对大鼠和家兔静脉给药，剂量达10mg/kg时，大鼠未出现妊娠毒性，未出现致畸，致死胎作用，仅出生鼠体重增加受到抑制。剂量达20mg/kg时家兔出现胎儿体重减少，骨化延迟，但未出现致畸作用。对大鼠和小鼠的24周口服给药表明，未见肿瘤发生。

【药代动力学】 健康成人静脉给药0.1～0.8mg时，血浆中原形药物浓度呈双相性降低，$t_{1/2}\beta$约为5小时。AUC与给药量成正比，体内药物动态呈线性变化。雷莫司琼血浆蛋白结合率（在恶性肿瘤患者）为85.9%～91.0%，肿瘤病人消除半衰期为9.02±4.17小时，给药后24小时内尿中原形药物排泄率为给药量的16%～22%。药物经尿及粪便中排泄，作用维持在24h以上，一日给药1次即可。健康成人连续用药时，体内药物动态没有变化，未见蓄积性。

【药物相互作用】 本药与甘露醇注射液、布美他尼注射液、呋塞米注射液等可发生配伍反应，所以不要混合使用。但向含有呋喃苯胺酸20mg的呋塞米注射液中加200ml生理盐水与本药1个安瓿混合时可以使用。

【不良反应】 在上市前进行安全性评价的352病

例中有 7 例（2.0%）出现了不良反应。主要的不良反应是体热、头痛、头重等。严重不良反应：对本品过敏者可能出现过敏样症状，如胸闷、呼吸困难、喘鸣、颜面潮红、发红、瘙痒、发绀、血压降低甚至休克等。发生率尚不明确。此外，在国外有使用其他 5 - HT_3 受体拮抗型止吐药出现癫痫样发作的报道。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸雷莫司琼口内崩解片	化学药	HZ004095
盐酸雷莫司琼注射液	化学药	HZ004096
注射用盐酸雷莫司琼	化学药	HZ005080

HY002255 盐酸雷尼替丁

【其他名称】 呋喃硝胺、甲硝呋胍、善胃得（Zantac）、西斯塔（Histac）

【外文名称】 Ranitidine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 *N'* - 甲基 - *N* - ［2 - ［［［5 - ［（二甲氨基）甲基］ - 2 - 呋喃基］ - 甲基］硫代］乙基］ - 2 - 硝基 - 1,1 - 乙烯二胺盐酸盐

【分子式】 $C_{13}H_{22}N_4O_3S \cdot HCl$

【分子量】 350.87

【性状及组成】 本品为类白色或淡黄色结晶性粉末，有异臭，味微苦带涩，极易潮解，吸潮后颜色变深。本品在水或甲醇中易溶，在乙醇中略溶，在丙酮中几乎不溶。

熔点：取本品，不经研磨，依法测定，熔点为 137 ~ 143℃，熔融并同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：H_2 受体阻滞药。

1. 药理：本品为 H_2 受体拮抗剂，以呋喃环取代了西咪替丁的咪唑环，对 H_2 受体具有更高的选择性，能显著抑制正常人和溃疡病人的基础和夜间胃酸分泌，以及五肽胃泌素、组胺和进餐引起的胃酸分泌，其抑制胃酸作用较西咪替丁强 5 ~ 12 倍。静注本品可使胃酸分泌降低 90%；对胃蛋白酶原的分泌有一定的抑制作用。对实验性胃黏膜损伤和急性溃疡有保护作用。对胃泌素和性激素的分泌无影响。

2. 毒理：小鼠口服的 LD_{50} 为 1440 ~ 1750mg/kg。连续口服 5 周的每天最大无毒剂量，大鼠（雄）为 500mg/kg，大鼠（雌）为 250mg/kg，犬为 40mg/kg。连续 26 周的每天最大无毒剂量，大鼠为 100mg/kg，犬为 40mg/kg。小鼠口服 100 ~ 200mg/kg 达 114 周，大鼠口服 100 ~ 2000mg/Kg 达 129 周，均未见致癌作用。

【药代动力学】 口服后自胃肠道吸收迅速，生物利用度（*F*）约为 50%，血药浓度达峰时间（t_{max}）1 ~ 2 小时，血浆蛋白结合率为 15% ± 3%，有效血浓度为 100ng/ml，在体内分布广泛，表观分布容积（V_d）为 1.1 ~ 1.9L/kg，且可通过血 - 脑脊液屏障，脑脊液药物浓度为血浓度的 1/30 ~ 1/20。30% 经肝脏代谢，其代谢产物有 *N* - 氧化物、*S* - 氧化物和去甲基代谢物，50% 以原形自肾随尿排出。半衰期（$t_{1/2}$）为 2 ~ 3 小时，与西咪替丁相似，肾功能不全时，半衰期相应延长。本品可经胎盘转运，乳汁内药物浓度高于血浆。

本品注射液一次给药后作用时间可持续 12 小时。在体内分布广泛，且可通过血脑屏障。30% 经肝代谢，50% 以原形随尿排出，$t_{1/2}$ 为 2 ~ 3 小时。肾清除率为 489 ~ 512ml/min，肾功能不全时降低，$t_{1/2}$ 延长，剂量应减半。对肝脏微粒体药酶抑制作用不明显，很少影响其他药物代谢。

【药物相互作用】

1. 本品能减少肝血流量，当与某些经肝代谢、受肝血流影响较大的药物伍用时，如华法林、利多卡因、环孢素、地西泮、普萘洛尔（心得安）等，可增加上述药物的血浓度，延长其作用时间和强度，有可能增加某些药物的毒性，值得注意。

2. 与抗凝血药、抗癫痫药合用时，要比西咪替丁安全。

3. 与华法林合用可以降低或增加凝血酶原时间。

4. 可降低维生素 B_{12} 的吸收，长期使用可致维生素 B_{12} 缺乏。

5. 与华法林、利多卡因、地西泮、普萘洛尔等经肝代谢的药物伍用时，雷尼替丁的血药浓度不会升高而出现不良反应。

6. 与普鲁卡因胺并用，可使普鲁卡因胺的清除率降低。

7. 有报道与细胞色素 P450 有微弱的结合作用，但推荐剂量并不会抑制肝脏中细胞色素 P450 与药酶的作用。然而有独立的药物相互作用报道指出，本品通过某些作用不明的机制可能会影响一些药物的生物利用度。

8. 在三唑仑与雷尼替丁的药物相互作用研究中，同时口服雷尼替丁时三唑仑的血浆浓度要高于三唑仑单独给药。试验对象为 18 ~ 60 岁的患者，同时口服雷尼替丁片剂 75mg 和 150mg，与单用三唑仑

相比，三唑仑的平均浓度－时间曲线面积分别高出10%和28%。在60岁以上年龄组中，给予雷尼替丁片剂75mg和150mg，其平均AUC则高出约30%。三唑仑以及主要代谢产物α－羟基三唑仑的药动学指标及其消除均无改变。雷尼替丁减少胃酸分泌可能导致三唑仑的生物利用度增加，二者之间这种药物相互作用的临床意义不明。

【药物过量】在口服制剂方面曾有部分过量使用的报道。有报道口服剂量达到18g时会产生类似于一般临床应用时的短暂不良反应。另外，有步态异常与低血压的报道。

药物过量时，应从胃肠道清除尚未吸收的药物，并进行临床监控与支持疗法。

【不良反应】

1．常见的有恶心、皮疹、便秘、腹泻、乏力、头痛、眩晕等，一般较轻微，继续用药过程中可缓解。

2．部分病人于静脉注射后出现面热感、胃刺痛等，十余分钟后自行消失；静注局部可有瘙痒，发红，1小时后可消失。

3．偶见静脉注射后出现心动过缓。

4．与西咪替丁相比，损伤肾功能、性腺功能和中枢神经的不良作用较轻。

5．少数患者用药后引起白细胞或血小板减少，停药后症状可自行消失。

6．本品可引起轻度肝功能损伤，ALT可逆性升高，停药后症状即消失，肝功能也恢复正常。可能系药物过敏反应，与药物的用量无关。

7．偶有发热、男性乳房发育、肾炎等。

8．长期服用因可持续降低胃液酸度，而利于细菌在胃内繁殖，从而使食物内硝酸盐还原为亚硝酸盐，形成*N*－亚硝基化合物。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方枸橼酸铋钾甲硝唑胶囊	化学药	HZ001241
复方雷尼替丁胶囊	化学药	HZ001258
复方雷尼替丁颗粒	化学药	HZ001259
复方雷尼替丁片	化学药	HZ001260
盐酸雷尼替丁胶囊	化学药	HZ004097
盐酸雷尼替丁口服液	化学药	HZ004098
盐酸雷尼替丁氯化钠注射液	化学药	HZ004099
盐酸雷尼替丁泡腾颗粒	化学药	HZ004100
盐酸雷尼替丁泡腾片	化学药	HZ004101
盐酸雷尼替丁片	化学药	HZ004102

续表

制剂名称	类别	序号
盐酸雷尼替丁糖浆	化学药	HZ004103
盐酸雷尼替丁注射液	化学药	HZ004104
注射用盐酸雷尼替丁	化学药	HZ005081

HY002256　盐酸利多卡因

【其他名称】Lignocaine、赛罗卡因（Xylocaine）、Xylotox

【外文名称】Lidocaine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】*N*－（2,6－二甲苯基）－2－（二乙氨基）乙酰胺盐酸盐一水合物

【分子式】$C_{14}H_{22}N_{20}\cdot HCl\cdot H_2O$

【分子量】288.82

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，味苦，继有麻木感。本品在水或乙醇中易溶，在三氯甲烷中溶解，在乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为75～79℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：局麻药、抗心律失常药。

盐酸利多卡因为酰胺类局麻药，血液吸收后对中枢神经系统有明显的兴奋和抑制双相作用，且可无先驱的兴奋，血药浓度较低时，出现镇痛和思睡、痛阈提高；随着剂量加大，作用或毒性增强，亚中毒血药浓度时有抗惊厥作用；当血药浓度超过5mg/ml可发生惊厥。

本品在低剂量时，可促进心肌细胞内K^+外流，降低4相斜率，减慢舒张期自动去极化，降低心肌的自律性，而具有抗室性心率失常作用；在治疗剂量时，对心肌细胞的电活动、房室传导和心肌的收缩无明显影响；血药浓度进一步升高，可引起心脏传导速度减慢，房室传导阻滞，抑制心肌收缩力和使心排血量下降。

本品为膜稳定剂，对浦肯野纤维细胞膜具有抑制Na^+内流而降低心肌自律性，促进心肌细胞内K^+外流而引起超极化，消除折返激动，抑制心室应激性，提高室颤阈值，但对心房及窦房结作用很轻、降低心肌的自律性，在治疗剂量时，对心肌细胞的电活动、而具有抗室性心率失常作用，但对房室传导和心肌的收缩无明显影响，本品的抑制房室旁路传导的作用，对经旁路折返的室上性心动过速可能

有效。

【药代动力学】本品吸收、注射后，组织分布快而广，能透过血－脑屏障和胎盘。本品麻醉强度大、起效快、弥散力强，药物从局部消除约需 2 小时，加肾上腺素可延长其作用时间。大部分先经肝微粒酶降解为仍有局麻作用的脱乙基中间代谢物单乙基甘氨酰胺二甲苯，毒性增高，再经酰胺酶水解，经尿排出，约用量的 10% 以原形排出，少量出现在胆汁中。

【药物相互作用】

1. 与西咪替丁以及 β－受体阻断剂如普萘洛尔、美托洛尔、纳多洛尔合用，利多卡因经肝脏代谢受抑制，利多卡因血浓度增加，可发生心脏和神经系统不良反应，应调整利多卡因剂量，并应心电图监护及监测利多卡因血药浓度。

2. 巴比妥类药物可促进利多卡因代谢，两药合用可引起心动过缓，窦性停搏。

3. 与普鲁卡因胺合用，可产生一过性谵妄及幻觉，但不影响本品血药浓度。

4. 异丙基肾上腺素因增加肝血流量，可使本品的总清除率升高；去甲肾上腺素因减少肝血流量，可使本品总清除率下降。

5. 与下列药品有配伍禁忌：苯巴比妥，氨苄西林，美索比妥，硫喷妥钠，硝普钠，甘露醇，两性霉素 B，氨苄西林，磺胺嘧啶。

【药物过量】超量可引起惊厥和心脏骤停。

【不良反应】

1. 本品偶可引起高敏反应和过敏反应；

2. 对呼吸道高敏病人，可引起支气管痉挛；

3. 本品剂量过大、吸收太快可导致中毒反应，表现为耳鸣、激动、烦燥等中枢神经兴奋症状，并可迅速发展为抽搐、昏迷、血压下降等；

4. 血药浓度过高，可引起心房传导速度减慢、房室传导阻滞、室颤和心搏骤停。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
成膜型利多卡因氯己定气雾剂	化学药	HZ000528
复方甘菊利多卡因凝胶	化学药	HZ001186
复方角菜酸酯乳膏	化学药	HZ001230
复方羟乙桂胺乳膏	化学药	HZ001344
复方盐酸利多卡因注射液	化学药	HZ001458
利多卡因氯己定气雾剂	化学药	HZ002208
利多卡因气雾剂	化学药	HZ002209
林可霉素利多卡因凝胶	化学药	HZ002260

续表

制剂名称	类别	序号
三维 B 注射液	化学药	HZ003160
双氯芬酸钠利多卡因注射液	化学药	HZ003247
碳酸利多卡因注射液	化学药	HZ003363
盐酸利多卡因缓释滴丸	化学药	HZ004105
盐酸利多卡因胶浆	化学药	HZ004106
盐酸利多卡因氯化钠注射液	化学药	HZ004107
盐酸利多卡因凝胶	化学药	HZ004108
盐酸利多卡因葡萄糖注射液	化学药	HZ004109
盐酸利多卡因注射液	化学药	HZ004110
盐酸利多卡因注射液（溶剂用）	化学药	HZ004111
注射用双氯芬酸钠盐酸利多卡因	化学药	HZ004958

HY002257 盐酸利托君

【其他名称】雷托君、利妥特灵、羟苄麻黄碱、柔托扒、幼托、YUTOPAR

【外文名称】Ritodrine Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】本品为 β_2 肾上腺素受体激动剂，可激动子宫平滑肌中的 β_2 受体抑制子宫平滑肌的收缩，减少子宫的活动而延长妊娠期。

【不良反应】本品对 β_2 受体的激动作用选择性不强，它同时也作用于 β_1 受体，故可发生心悸、胸闷、胸疼和心律失常等反应，反应严重者应中断治疗。

本品可以升高血糖及降低血钾，故糖尿病患者及使用排钾利尿剂的病人慎用。

本品能通过胎盘屏障使新生儿心率改变和出现低血糖，应密切注意。

静脉注射时还可有震颤、恶心、呕吐、头痛和红斑以及神经过敏、心烦意乱、焦虑不适等反应。

口服还可有心率增加、心悸和震颤、恶心和颤抖、皮疹和心律失常等反应。

与糖皮质激素合用可出现肺水肿，极严重者可导致死亡。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸利托君片	化学药	HZ004112
盐酸利托君注射液	化学药	HZ004113

HY002258　盐酸林可霉素

【其他名称】Cillimycin、洁霉素、Lincocin、Lincomix、林肯霉素、Mycivin

【外文名称】Lincomycin Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】6 - （1 - 甲基 - 反 - 4 - 丙基 - L - 2 - 吡咯烷甲酰氨基） - 1 - 硫代 - 6,8 - 二脱氧 - D - 赤式 - α - D - 半乳辛吡喃糖苷盐酸盐一水合物

【分子式】$C_{18}H_{34}N_2O_6S \cdot HCl \cdot H_2O$

【分子量】461.02

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，有微臭或特殊臭，味苦。本品在水中极易溶解，在甲醇或吡啶中易溶，在乙醇中微溶，在丙酮或三氯甲烷中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并稀释成每 1ml 中含 40mg 的溶液，依法测定，比旋度为 + 138°至 + 150°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗菌药。

本品对常见的需氧革兰阳性菌有较高抗菌活性，如金黄色葡萄球菌（包括耐青霉素 G 者）、表皮葡萄球菌、β 溶血性链球菌、草绿色链球菌和肺炎链球菌等。对厌氧菌有良好的抗菌作用包括破伤风杆菌、白喉棒状杆菌和产气荚膜杆菌等。对肠球菌、脑膜炎双球菌、淋病奈瑟菌和流感嗜血杆菌等革兰阴性菌以及真菌无活性。本品与青霉素、氯霉素、头孢菌素类和四环素类之间无交叉耐药，与大环内酯类有部分交叉耐药。

本品作用于敏感菌核糖体的 50S 亚基，阻止肽链的延长，从而抑制细菌细胞的蛋白质合成，一般系抑菌剂，但在高浓度时，对某些细菌也具有杀菌作用。

本品的半数致死量（LD_{50}）小鼠静注为 214mg/kg，口服为 4000mg/kg；大鼠口服为 4000mg/kg。

【药代动力学】本品口服不为胃酸灭活，可自胃肠道吸收，空腹口服仅 20% ~ 30% 被吸收，进食后服用则吸收更少。成人空腹或进食后服 0.5g，分别在 2 小时和 4 小时达血药峰浓度（C_{max}）2.6mg/L 和 1.0mg/L，12 小时后在血清中仍有微量。吸收后除脑脊液外，广泛及迅速分布于各体液和组织中，包括骨组织。可迅速经胎盘进入胎儿循环，在胎血中的浓度可达母血药浓度的 25%。蛋白结合率为 77% ~ 82%。本品在肝脏代谢，部分代谢物具抗菌活性。儿童的代谢率较成人为高。血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为 4 ~ 6 小时，肝、肾功能减退时，$t_{1/2\beta}$可延长至 10 ~ 20 小时。本品可经胆道、肾和肠道排泄，口服后 40%以原形随粪便排出，9% ~ 13%以原形自尿中排出。也可分泌入乳汁中。血透及腹透不能清除林可霉素。

成人肌内注射 600mg，30 分钟达血药峰浓度（C_{max}）。本品可经胆道、肾和肠道排泄，肌内注射后 1.8% ~ 24.8%药物经尿排出，静脉滴注后 4.9% ~ 30.3%经尿排出。

【药物相互作用】

1. 可增强吸入性麻醉药的神经肌肉阻断现象，导致骨骼肌软弱和呼吸抑制或麻痹（呼吸暂停），在手术中或术后合用时应注意。以抗胆碱酯酶药物或钙盐治疗可望有效。

2. 与抗蠕动止泻药、含白陶土止泻药合用，本品在疗程中甚至在疗程后数周有引起伴严重水样腹泻的伪膜性肠炎可能。因可使结肠内毒素延迟排出，从而导致腹泻延长和加剧，故抗蠕动止泻药不宜合用。本品与含白陶土止泻药合用时，前者的吸收将显著减少，故两者不宜同时服用，需间隔一定时间（至少 2 小时）。

3. 本品具神经肌肉阻断作用，与抗肌无力药合用时将导致后者对骨骼肌的效果减弱。为控制重症肌无力的症状，在合用时抗肌无力药的剂量应予调整。

4. 氯霉素或红霉素在靶位上均可置换本品，或阻抑后者与细菌核糖体 50S 亚基的结合，体外试验显示本品与红霉素具拮抗作用，故本品不宜与氯霉素或红霉素合用。

5. 与阿片类镇痛药合用，本品的呼吸抑制作用与阿片类的中枢呼吸抑制作用可因累加现象而有导致呼吸抑制延长或引起呼吸麻痹（呼吸暂停）的可能，故必须对病人进行密切观察或监护。

6. 本品可增强神经肌肉阻断药的作用，两者应避免合用。

7. 与新生霉素、卡那霉素在同瓶静滴时有配伍禁忌。

【药物过量】药物过量时主要是对症疗法和支持疗法，如洗胃、用催吐药及补液等。

【不良反应】

1. 胃肠道反应：恶心、呕吐、腹痛、腹泻等症状；严重者有腹绞痛、腹部压痛、严重腹泻（水样或脓血样），伴发热、异常口渴和疲乏（假膜性肠炎）；腹泻、肠炎和假膜性肠炎可发生在用药初期，也可发生在停药后数周。

2. 血液系统：偶可发生白细胞减少、中性粒细

胞减少、中性粒细胞缺乏和血小板减少，再生障碍性贫血罕见。

3. 过敏反应：可见皮疹、瘙痒等，偶见荨麻疹、血管神经性水肿和血清病反应等，罕有表皮脱落、大疱性皮炎、多形红斑和 S－J 综合征的报道。

4. 偶有口服本品引起黄疸的报道。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
林可霉素利多卡因凝胶	化学药	HZ002260
林可霉素维 B_6 软膏	化学药	HZ002261
盐酸林可霉素滴耳液	化学药	HZ004114
盐酸林可霉素滴眼液	化学药	HZ004115
盐酸林可霉素胶囊	化学药	HZ004116
盐酸林可霉素口服溶液	化学药	HZ004117
盐酸林可霉素片	化学药	HZ004118
盐酸林可霉素葡萄糖注射液	化学药	HZ004119
盐酸林可霉素溶液	化学药	HZ004120
盐酸林可霉素软膏	化学药	HZ004121
盐酸林可霉素栓	化学药	HZ004122
盐酸林可霉素注射液	化学药	HZ004123
注射用盐酸林可霉素	化学药	HZ005082

HY002259 盐酸硫必利

【其他名称】 胺甲磺回胺、泰必乐、泰必利、Tiapredex、Ttapridal

【外文名称】 Tiapride Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 化学药品地标升国标·第 5 册

药物理化信息

【化学名】 *N*－［2－（二乙氨基）乙基］－5－（甲磺酰）－邻－甲氧苯酰胺盐酸盐

【分子式】 $C_{15}H_{24}N_2O_4S \cdot HCl$

【分子量】 364.97

【性状及组成】 本品为白色针状结晶性粉末，无臭，味微苦。本品在水中极易溶解，在三氯甲烷中略溶，在乙醇中微溶，在乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 198～202℃，熔融时同时分解。

吸收系数：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释成每 1ml 中约含 60μg 的溶液，照紫外－可见分光光度法，在 287nm 的波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为 62～65。

药物药理信息

【药理毒理】 本品为神经精神安定药，对中脑边缘系统多巴胺能 D2 受体亢进有阻滞作用，实验表明，本品有对抗运动障碍、镇痛、抗焦虑作用和对抗酒精中毒所致神经精神症状的作用。

本药结构与舒必利相似，为抗精神失常药，其特点为对感觉运动方面神经系统疾病及精神运动行为障碍具有良效。①抗精神病、镇静作用：临床观察表明，本品可纠正精神运动障碍，此与本品抗中脑边缘系统多巴胺能活动有关，因此治疗舞蹈病及抽动－秽语多动症的疗效最好。②镇痛作用：对顽固性头痛、痛性痉挛、关节疼痛及肩关节周围炎的疼痛均有明显疗效。动物实验证实，本品可阻滞疼痛冲动经脊髓丘脑束向网状结构的传导。有人认为本药的镇痛作用可能与丘脑的中枢整合作用有关。③其他作用：尚有镇吐、兴奋胃肠平滑肌等作用。

本品对小鼠肌注 LD_{50} 为 891mg/kg，静注 LD_{50} 为 179mg/kg。

【药代动力学】 本品口服吸收迅速，用药 1 小时后血药浓度达高峰。口服半衰期为 4 小时。主要以原形随尿排出，约有给药量的 31%（男性）或 18%（女性）以代谢物排出。

肌内注射 1 小时后血药浓度即达峰值。在体内分布迅速，符合药代动力学的线性二室模型，一日 3 次给药后 24～48 小时血药浓度即达稳态，与血浆蛋白结合率很低，平均清除半衰期为 3 小时，主要以原形随尿排出。

【药物相互作用】 能增强中枢抑制药的作用，可与镇痛药、催眠药、安定药、抗忧郁药、抗震颤麻痹药及抗癫痫药合用，但在治疗开始时，应减少合用的中枢抑制药剂量。

【药物过量】 药物过量时，会出现神经抑制的副作用，可使用抗胆碱能类的抗帕金森病药予以拮抗。

【不良反应】 治疗量不良反应轻微，可有嗜睡、口干、头昏、乏力、便秘等，偶见锥体外系不良反应如震颤、静坐不能等，罕见暂时性闭经、溢乳。一般停药或减量均可自行消失。个别对本品高度敏感的患者，可能发生重度锥体外系不良反应，必要时可用抗胆碱能药物如东莨菪碱治疗即可迅速缓解。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸硫必利片	化学药	HZ004124
盐酸硫必利注射液	化学药	HZ004125
注射用盐酸硫必利	化学药	HZ005083

HY002260　盐酸硫利达嗪

【其他名称】甲硫哌啶、利达新、硫醚嗪、Mellavil、Melleretten、美立康、Ridazine、Sonapax Melleril、盐酸甲硫达嗪

【外文名称】Thioridazine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】10－［2－（1－甲基－2－哌啶基）乙基］－2－甲基硫代吩噻嗪盐酸盐

【分子式】$C_{21}H_{26}N_2S_2 \cdot HCl$

【分子量】407.04

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶性粉末，微臭。本品在三氯甲烷中易溶，在乙醇或水中溶解，在乙醚中几乎不溶。

本品的熔点为 159～165℃，熔距不得超过 2℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗精神病药。

本品为吩噻嗪类抗精神病药，抗精神病作用主要由于阻断脑内多巴胺受体，对锥体外系统多巴胺受体作用及体温中枢影响较弱，镇静作用也较弱。

【药代动力学】本品口服生物利用度约 40%，血药浓度达峰时间为 1～4 小时，$t_{1/2}$为 21 小时，血浆蛋白结合率达 99%，主要在肝脏代谢，从尿及粪便中排出。

【药物相互作用】

1．本品可增强镇痛药、催眠药、抗组胺药、麻醉药及乙醇的中枢抑制作用。

2．不宜与奎尼丁合用。

【药物过量】长期服用大剂量后，可有色视改变如蓝绿色盲或发生黄视。急性中毒者可发生震颤、嗜睡、血压降低，脉搏减慢及体位性舒张压升高。也可发生心电图 T 波变化，少数引起癫痫发作。主要采取对症治疗及支持疗法。

【不良反应】常见不良反应有口干、心动过速、视物模糊等。也可见嗜睡、头晕、鼻塞、体位性低血压，偶有腹泻、腹胀、心电图异常中毒性肝损害，长期用药可引起色素性视网膜病变，大多停药后消失。较少引起震颤、流涎、运动迟缓、静坐不能和急性肌张力障碍等锥体外系不良反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸硫利达嗪片	化学药	HZ004126

HY002261　盐酸芦氟沙星

【外文名称】Rufloxacin Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 60 册

药物理化信息

【化学名】9－氟－10－（4－甲基－1－哌嗪基）－7－氧－2,3－二氢－7*H*－吡啶并［1,2,3－*de*］［1,4］苯并噻嗪－6－羧酸盐酸盐

【分子式】$C_{17}H_{18}FN_3O_3S \cdot HCl$

【分子量】399.57

【性状及组成】本品为淡黄绿色针状结晶或结晶性粉末，无臭，味苦，有引湿性，遇光色渐变深。

本品在水中略溶，在甲醇中微溶，在三氯甲烷或冰醋酸中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品具广谱抗菌作用，对革兰阴性菌具良好抗菌作用，包括大肠埃希菌、伤寒沙门菌、志贺菌属、流感嗜血杆菌、淋病奈瑟菌等均具有较强的抗菌活性。对葡萄球菌属、溶血性链球菌等革兰阳性球菌也有一定的抗菌作用。对铜绿假单胞菌无效。

本品为杀菌剂，通过作用于细菌 DNA 螺旋酶的 A 亚单位，抑制 DNA 的合成和复制而导致细菌死亡。

【药代动力学】口服吸收迅速而完全，健康志愿者单剂量口服 0.2g 后，血药峰浓度（C_{max}）约为 2.3mg/L，达峰时间约为 3 小时。血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）长，约为 35 小时。本品吸收后广泛分布至各组织、体液中。体内代谢产物为 *N*－去甲基芦氟沙星及硫－氧芦氟沙星，前者含量约为 2%，后者含量极少，两种代谢产物均有一定的抗菌活性。

本品主要以原形自肾排泄，约为 50%，胆汁排泄占 1%，以代谢物排出量约占 2%，另有部分经肠管壁的跨上皮分泌液进肠道，再经粪便排泄。

【药物相互作用】

1．尿碱化剂可减低本品在尿中的溶解度，导致结晶尿和肾毒性。

2．本品与茶碱类合用时可能由于与细胞色素 P450 结合部位的竞争性抑制，导致茶碱类的肝消除明显减少，血消除半衰期延长，血药浓度升高，出现茶碱中毒症状，如恶心、呕吐、震颤、不安、激动、抽搐、心悸等，应避免合用，不能避免时应测定茶碱类血药浓度并调整剂量。

3．环孢素与本品合用时，其血药浓度升高，必须监测环孢素血浓度，并调整剂量。

4. 本品与抗凝药华法林同用时可增强后者的抗凝作用，合用时应严密监测患者的凝血酶原时间，并调整剂量。

5. 丙磺舒可减少本品自肾小管分泌约50%，合用时可因本品血浓度增高而产生毒性。

6. 本品干扰咖啡因的代谢，从而导致咖啡因消除减少，血消除半衰期延长，并可能产生中枢神经系统毒性，合用时应严密监测患者咖啡因的血药浓度并调整剂量。

7. 含铝、镁的制酸药可减少本品的口服吸收，不宜合用。

【不良反应】

1. 胃肠道反应较为常见，可表现为腹部不适或疼痛、腹泻、恶心或呕吐。

2. 中枢神经系统反应可有头昏、头痛、嗜睡或失眠。

3. 过敏反应：皮疹、皮肤瘙痒，偶可发生渗出性多性红斑及血管神经性水肿。严重者可见舌肿大、声带水肿、呼吸困难、休克等。少数患者有光敏反应。

4. 偶可发生：①癫痫发作、精神异常、烦躁不安、意识混乱、幻觉、震颤；②血尿、发热、皮疹等间质性肾炎表现；③静脉炎；④结晶尿，多见于高剂量应用时；⑤关节疼痛。

5. 少数患者可发生血清氨基转移酶升高、血尿素氮增高及周围血常规白细胞降低，多属轻度，并呈一过性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸芦氟沙星胶囊	化学药	HZ004127
盐酸芦氟沙星片	化学药	HZ004128

HY002262 盐酸氯胺酮

【外文名称】Ketamine Hydrochloride

药物管理信息

【特殊管理分类】一类精神药

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】2-（2-氯苯基）-2-（甲氨基）环己酮盐酸盐

【分子式】$C_{13}H_{16}ClNO \cdot HCl$

【分子量】274.19

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭。本品在水中易溶，在热乙醇中溶解，在乙醚或苯中不溶。

本品的熔点为259~263℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：静脉全麻药。

本品主要是选择性的抑制丘脑的内侧核，阻滞脊髓至网状结构的上行传导，兴奋边缘系统，并对中枢神经和脊髓中的阿片受体有亲和力。产生麻醉作用，主要是抑制兴奋性神经递质（乙酰胆碱、L-谷氨酸）及*N*-甲基-D-天门冬酸受体的结果；镇痛作用主要由于阻滞脊髓至网状结构对痛觉传入的信号及与阿片受体的结合，而对脊髓丘脑传导无影响，故对内脏疼痛改善有限。静脉注射1~2mg/kg或肌注4~6mg/kg，分别于30秒钟及3~5分钟意识消失。麻醉后出现睁眼凝视及眼球震颤，肢体肌力增强，呈木僵状态；眼泪、唾液分泌增多，术前用抗胆碱药可避免或减少发生。对交感神经和循环有兴奋作用，表现在血压升高、心率加快、眼内压和颅内压均升高、肺动脉压及心排出量皆高。但它对心肌有直接抑制作用，在循环衰竭病人更为突出。大剂量应用时，可出现呼吸抑制和呼吸暂停，对肝肾功能无明显影响。在麻醉恢复期常有恶心、呕吐发生。可使儿茶酚胺增高、血糖上升、内分泌亢进。不影响子宫收缩，但在剖宫产时，应用本品，因血压升高而致出血量较多。

【药代动力学】本品进入血循环后大部分进入脑组织，然后再分布于全身组织中，肝、肺和脂肪内的药物浓度也高。本品$t_{1/2\alpha}$为2~11分钟，$t_{1/2\beta}$为2~3小时。主要在肝内进行生物转化成去甲氯胺酮，再逐步代谢成无活性的化合物经肾排出，仅有2.5%以原形随尿排出。

【药物相互作用】

1. 氯胺酮与苯二氮䓬类及阿片类药物并用时，可延长作用时间并减少不良反应的发生。剂量应酌情减少。

2. 与氟烷等含卤全麻药同用时，氯胺酮的作用延长，苏醒迟延。

3. 与抗高血压药或中枢神经抑制药合用时，尤其是氯胺酮用量偏大，静注过快，可导致血压剧降或（和）呼吸抑制。

4. 服用甲状腺素的病人，氯胺酮有可能引起血压过高和心动过速。

【不良反应】

1. 麻醉恢复期可出现幻觉、躁动不安、恶梦及谵语等，且青壮年多且严重。

2. 术中常有泪液、唾液分泌增多，血压、颅压及眼压升高。不能自控的肌肉收缩偶见。

3. 偶有呼吸抑制或暂停、喉痉挛及气管痉挛，多半是在用量较大、分泌物增多时发生。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸氯胺酮注射液	化学药	HZ004129
注射用盐酸氯胺酮	化学药	HZ005084

HY002263　盐酸氯苯达诺

【其他名称】 Detigon、敌退咳、氯苯胺丙醇

【外文名称】 Clofedanol Hydrochloride

【性状及组成】 本品为无色结晶或白色结晶性粉末。能溶于水和乙醇，略溶于乙醚。

药物药理信息

【药理毒理】 本品抑制延脑咳嗽中枢，为非成瘾性镇咳药，同时兼有微弱的局麻作用、抗组胺作用和阿托品样解痉作用，本品可使支气管黏膜充血，水肿减轻，分泌物轻度减少，与祛痰药合用可增加疗效，其镇咳作用比可待因稍弱，但有作用持久、不抑制呼吸和不引起便秘等优点。适用于各种原因引起的干咳，对上呼吸道感染和急性支气管炎引起的干咳或阵咳疗效更好，常与祛痰药合用。

【药代动力学】 口服后 30 分钟生效，2 小时达最大效应，镇咳作用持续 3～8 小时。

【不良反应】 偶有荨麻疹、头晕、恶心等反应。不宜单独用于多痰的病人。

HY002264　盐酸氯丙那林

【其他名称】 Asthone、Isoprophenamine、氯喘、氯喘能、邻氯喘息定、盐酸氯喘

【外文名称】 Clorprenaline Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 α［［（1－甲基乙基）氨基］甲基］－2－氯－苯甲醇盐酸盐

【分子式】 $C_{11}H_{16}ClNO \cdot HCl$

【分子量】 250.17

【性状及组成】 本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，味苦。本品在水或乙醇中易溶，在三氯甲烷中溶解，在丙酮中微溶，在乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为 165～169℃。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：β 肾上腺素受体激动药。

本品为 β_2 受体激动剂，对支气管有明显的扩张作用，平喘效果比异丙肾上腺素略弱，但对心脏毒性明显降低，对心脏的兴奋作用仅为异丙肾上腺素的 1/3～1/10。

【药代动力学】 本品口服后 15～30 分钟生效，约 1 小时达最大效应，作用维持 4～6 小时。

【药物相互作用】

1．本药与肾上腺素及异丙肾上腺素等儿茶酚胺类并用时会引起心律失常、心率增加，故应避免与上述药物并用。

2．本品有抑制过敏引起的皮肤反应作用，故评估皮肤试验反应时，应考虑到本药对反应的影响。

3．并用茶碱类药时，可增加舒张支气管平滑肌作用，但不良反应也增加。

4．避免与单胺氧化酶抑制剂及三环类抗抑郁药同时应用。

5．与其他扩张支气管的 β_2 受体激动同用时有相加作用，但也增加不良反应。

【不良反应】 少数患者可见口干、轻度心悸、手指震颤、头晕等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方氯丙那林溴己新胶囊	化学药	HZ001293
复方氯丙那林溴己新片	化学药	HZ001294
复方氯丙那林鱼腥草素钠片	化学药	HZ001295
磺啶新林胶囊	化学药	HZ001776
盐酸氯丙那林片	化学药	HZ004130
海珠喘息定片	中成药	ZC002068

HY002265　盐酸氯丙嗪

【其他名称】 Aminazine、阿密那嗪、Ampliactil、Amplictil、Contomin、冬眠灵、可乐静、Largactil、氯苯骈噻嗪、氯硫二苯胺、氯普马嗪、Megaphen Promacid、Protran、Prozil、Thorazine、Torazine

【外文名称】 Chlorpromazine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 *N*，*N*－二甲基－2－氯－10*H*－吩噻嗪－10－丙胺盐酸盐

【分子式】 $C_{17}H_{19}ClN_2S \cdot HCl$

【分子量】 355.33

【性状及组成】 本品为白色或乳白色结晶性粉末，有微臭，味极苦，有引湿性，遇光渐变色，水

溶液显酸性反应。本品在水、乙醇或三氯甲烷中易溶，在乙醚或苯中不溶。

熔点：本品的熔点为 194～198℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗精神病药。

本品为抗精神病药，其作用机制主要与其阻断中脑边缘系统及中脑皮层通路的多巴胺受体（DA_2）有关。对多巴胺（DA_1）受体、5－羟色胺受体、M 型乙酰胆碱受体、α 肾上腺素受体均有阻断作用，作用广泛。此外，本品小剂量时可抑制延脑催吐化学感受区的多巴胺受体，大剂量时直接抑制呕吐中枢，产生强大的镇吐作用。抑制体温调节中枢，使体温降低，体温可随外环境变化而改变，其阻断外周 α 肾上腺素受体作用，使血管扩张，引起血压下降，对内分泌系统也有一定影响。本品的止吐作用可能与抑制延髓的催吐化学感受区有关；抗晕作用可能通过中枢性抗胆碱性能，作用于前庭和呕吐中枢及中脑髓质感受器，阻断前庭核区胆碱能突触迷路冲动的兴奋。本品由于间接降低了脑干网状上行激活系统的应激性起到镇静催眠作用。

【药代动力学】本品口服吸收好，1～3 小时达血药浓度峰值。本品有“首过效应”。血浆蛋白结合率 90%以上。易透过血－脑屏障，颅内药物浓度高 4～5 倍。在肝脏代谢，主要以代谢物形式从尿和粪便中排出。半衰期（$t_{1/2}$）为 12～36 小时。

注射给药生物利用度比口服高 3～4 倍，血浆蛋白结合率在 90%以上，易于透过血－脑屏障，颅内药物浓度高 4～5 倍。在肝脏代谢，主要以代谢物形式从尿和粪便中排出。

【药物相互作用】

1．本品与乙醇或其他中枢神经系统性抑制药合用时中枢抑制作用加强。

2．本品与抗高血压药合用易致体位性低血压。

3．本品与舒托必利合用，有发生室性心律紊乱的危险，严重者可致尖端扭转心律失常。

4．本品与阿托品类药物合用，不良反应加强。

5．本品与碳酸锂合用，可引起血锂浓度增高。

6．抗酸剂可以降低本品的吸收，苯巴比妥可加快其排泄，因而减弱其抗精神病作用。

7．本品与单胺氧化酶抑制剂及三环类抗抑郁药合用时，两者的抗胆碱作用加强，不良反应加重。

【药物过量】

1．中毒症状

（1）表情淡漠、烦躁不安、吵闹不停、昏睡，严重时可出现昏迷。

（2）严重锥体外系反应。

（3）心血管系统：心悸，四肢发冷，血压下降，直立性低血压，持续性低血压休克，并可导致房室传导阻滞及室性早搏甚至心跳骤停。

2．处理

（1）超剂量时，立即刺激咽部，催吐。在 6 小时内须用 1:5000 高锰酸钾液或温开水洗胃，本品易溶于水，而且能抑制胃肠蠕动，故必须反复用温水洗胃，直至胃内回流液澄清为止。因本品镇吐作用强，故用催吐药效果不好。

（2）注射高渗葡萄糖注射液，促进利尿，排泄毒物，但输液不宜过多，以防心力衰竭和肺水肿。

（3）依病情给予对症治疗及支持疗法。

【不良反应】

1．常见口干、上腹不适、食欲减退、乏力及嗜睡。

2．可引起体位性低血压、心悸或心电图改变。

3．可出现锥体外系反应，如震颤、僵直、流涎、运动迟缓、静坐不能、急性肌张力障碍。

4．长期大量服药可引起迟发性运动障碍。

5．可引起血浆中泌乳素浓度增加，可能有关的症状为溢乳、男子女性化乳房、月经失调、闭经。

6．可引起中毒性肝损害或阻塞性黄疸。

7．少见骨髓抑制。

8．偶可引起癫痫、过敏性皮疹或剥脱性皮炎及恶性综合征。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
安乃近氯丙嗪注射液	化学药	HZ000136
氯丙嗪异丙嗪注射液	化学药	HZ002470
盐酸氯丙嗪片	化学药	HZ004131
盐酸氯丙嗪注射液	化学药	HZ004132

HY002266 盐酸氯环利嗪

【外文名称】Chlorcyclizine Hydrochloride

【分子式】$C_{18}H_{21}ClN_2 \cdot HCl$

【分子量】337.30

药物药理信息

【药理毒理】本品为一抗组胺药，其作用持续时间一般为 12～18 小时。能拮抗组胺所致动物的毛细血管扩张作用和支气管平滑肌的痉挛作用。并经离体组织证明本品具有抗胆碱作用。

【不良反应】同一般抗组胺药。嗜睡，服用大剂

量可出现口干、眩晕等症状。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸氯环利嗪片	化学药	HZ004133
盐酸氯环利嗪乳膏	化学药	HZ004134

HY002267　盐酸氯己定

【其他名称】洗必泰、盐酸洗必泰

【外文名称】Chlorhexidine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第8册

药物理化信息

【化学名】1,6－双（*N*－氯苯基－N^5－双胍基）己烷二盐酸盐

【分子式】$C_{22}H_{30}Cl_2N_{10}\cdot 2HCl$

【分子量】578.37

【性状及组成】本品为白色或几乎白色的结晶性粉末，无臭，味苦。

本品在水或乙醇中极微溶解。

熔点：本品的熔点为255～259℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】盐酸氯己定为广谱杀菌剂，对金黄色葡萄球菌、变异链球菌、大肠杆菌有迅速的杀灭能力，对嗜血链球菌中度敏感，可吸附在细菌胞浆膜的渗透屏障使细菌内容物漏出；低浓度抑菌，高浓度杀菌。对革兰阳性和阴性菌有效，即使在有血液血清存在环境中仍有效。对皮肤真菌也有一定的抑菌作用。

【药物相互作用】本品与肥皂、碱、高锰酸钾及碘制剂不应同用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方氯己定达克罗宁乳膏	化学药	HZ001300
复方氯己定地塞米松膜	化学药	HZ001301
复方氯己定撒粉	化学药	HZ001304
氯己定苯佐卡因含片	化学药	HZ002498

HY002268　盐酸氯雷他定

【外文名称】Loratadine Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】4－（8－氯－5,6－二氢－11*H*－苯并[5,6]环庚基[1,2－b]吡啶－11－烯）－1－哌啶羧酸乙酯盐酸盐

【分子式】$C_{22}H_{23}ClN_2O_2\cdot HCl$

【分子量】419.35

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：本品为长效三环类抗组胺药，可通过选择性地拮抗外周H_1受体，缓解季节性过敏性鼻炎的鼻部或非鼻部症状。

2．毒理研究

（1）遗传毒性：在Ames试验、正向点突变试验、DNA损伤试验、染色体畸变试验中，均未见氯雷他定有致突变作用。在小鼠淋巴瘤试验中，在非活化状态时，出现阳性结果，活化状态时为阴性。

（2）生殖毒性：雄性大鼠经口给予氯雷他定，剂量达64mg/kg（按体表面积折算，约相当于临床推荐最大日口服剂量的50倍）时，可致生育力下降，表现为雌鼠受孕率降低。经口给予氯雷他定剂量达24mg/kg（按体表面积折算，约相当于临床推荐最大日口服剂量的20倍）时，对雌雄大鼠生育力无影响。大鼠和家兔经口给予氯雷他定剂量达96mg/kg（按体表面积折算，分别约相当于临床推荐最大日口服剂量的75和150倍）时，未见致畸作用。

（3）致癌性：小鼠连续18个月经口给予氯雷他定，剂量达40mg/kg时，雄性小鼠肝细胞瘤（包括腺瘤和癌）的发生率明显增加；大鼠连续2年经口给予氯雷他定，剂量为10mg/kg组雄鼠和25mg/kg组雌雄大鼠肝细胞瘤（包括腺瘤和癌）的发生率明显增加。人长期服用氯雷他定时，上述发现的临床意义尚不明确。

【药代动力学】本品口服迅速吸收。健康成年人每天一次10mg，连续服药10天，本品与其主要代谢物脱羧乙氧氯雷他定的达峰时间（t_{max}）分别为1.3小时和2.5小时。单次用药，食物分别使氯雷他定和脱羧乙氧氯雷他定的AUC增加40%和15%，t_{max}延迟1小时，峰浓度不受食物的影响。用药10天内，大约80%的药物以其代谢物的形式等比例分布于尿液和粪便中，几乎所有患者，其代谢物的AUC高于原形药物的AUC，对于健康成年人（$n=54$），氯雷他定及脱羧乙氧氯雷他定的平均清除半衰期（$t_{1/2}$）分别为8.4小时（3～20小时）和28小时（8.8～92小时），一般第5天血药浓度达稳态，由于本品具有首过效应，因此，药代动力学参数的个体差异较大。

人肝脏微粒体酶的离体试验表明，本品主要通过细胞色素P450 3A4（CYP3A4）代谢为脱羧乙氧氯雷他定，少部分由细胞色素P450 2D6（CYP2D6）代谢，当与CPY3A4抑制剂酮康唑同服时，本品主要通

过 CYP2D6 代谢成脱羧氯雷他定，本品与酮康唑、红霉素（两者均为 CYP3A4 抑制剂）或西米替丁（CYP2D6 和 CYP3A4 抑制剂）同时服用，血浆氯雷他定浓度增加。

6～12 岁儿童口服氯雷他定糖浆的药代动力学与成年人类似，13 名儿童志愿者（8～12 岁）口服 10mg/10ml 氯雷他定糖浆的药代动力学指数（AUC 和 C_{max}）与成年人口服等量糖浆的药代动力学指数无显著差异。

12 位健康老年人（66～78 岁）口服本品，血浆氯雷他定和脱羧氯雷他定的 AUC 和 C_{max}均比健康成年人高出 50%，氯雷他定和脱羧氯雷他定的半衰期分别位 18.2 小时（6.7～37 小时）和 17.5 小时（11～38 小时）。

与 6 名肾功正常（肌酐清除率≥80ml/min）的受试者比，12 位慢性肾功不全患者（肌酐清除率≤30ml/min）口服本品后，氯雷他定的 AUC 和 C_{max}增加约 73%，脱羧乙氧氯雷他定的 AUC 和 Cmax 增加约 120%，血浆氯雷他定和脱羧乙氧氯雷他定的 t_{max}分别位 7.6 小时和 23.9 小时。血透并不影响本品在慢性肾功不全患者体内的药代动力学过程。

与健康受试者相比，7 名慢性酒精性肝病患者服用本品，血浆氯雷他定的 AUC 和 C_{max}增加 1 倍，而脱羧乙氧氯雷他定无明显改变，氯雷他定和脱羧乙氧氯雷他定的血浆 $t_{1/2}$分别为 24 小时和 37 小时，而且 $t_{1/2}$随着肝脏损伤程度的加重而延长。

【药物相互作用】临床试验中，24 名健康成年人，在口服氯雷他定的同时，分别服用治疗剂量下的红霉素、西米替丁和酮康唑，尽管上述药物增加氯雷他定和脱羧乙氧氯雷他定的血药浓度，但对心电图指数（QTc）、临床实验室检查、生命体症和副作用发生率无明显影响，也不导致镇静或晕厥。西米替丁和酮康唑的血药浓度不受氯雷他定的影响。氯雷他定使红霉素的血药浓度（AUC_{0-24}）增加 15%，但并不确定这种差异的临床意义。

【药物过量】成年人过量服用本品（40～180mg）可发生嗜睡，心率失常，头痛。一旦发生以上症状，立即给予对症和支持疗法。治疗措施包括催吐，随后给予活性炭吸附未被吸收的药物，如果催吐不成功，则用生理盐水洗胃，进行导泻以稀释肠道内的药物浓度，血透不能清除氯雷他定，还未确定腹膜透析能否清除本品。

【不良反应】大约 90000 名 12 岁以上过敏性鼻炎患者参加的随机对照临床试验中，口服氯雷他定 10mg，每天 1 次，连续用药 2 周至 6 个月，用药组和安慰剂组因不良反应停药者发生率 2%。

慢性特发性荨麻疹患者服用本品的副作用与过敏性鼻炎者的类似。

本品的副作用不随年龄、性别、种族的不同而不同。除了上述发生率大于 2%的副作用以外，还发现以下副作用（发生率小于 2%）。

自主神经系统：流泪，流涎，潮红，感觉迟钝，阳痿，多汗。

一般状况：血管神经性水肿，虚弱，背痛，视物模糊，胸痛，耳痛，眼痛，腿部抽筋，抑郁，寒战，耳鸣，病毒感染，体重增加。

心血管系统：高血压，低血压，心悸，室上性快速性心律失常，晕厥，心动过速。

中枢和外周神经系统：眼睑痉挛，眩晕，感觉异常，震颤。

胃肠道系统：消化不良，胃胀，味觉改变，食欲下降，便秘，腹泻，呃逆，食欲增加，恶心，胃炎，牙痛，呕吐。

肌肉骨骼系统：关节痛，肌痛。

精神神经系统：激动，健忘，焦虑，精神错乱，性欲下降，抑郁，注意力不集中，失眠，易怒。

生殖系统：乳房痛，痛经，月经过多，阴道炎。

呼吸系统：支气管炎，支气管痉挛，咳嗽，呼吸困难，鼻衄，咯血，喉炎，鼻干，咽炎，鼻窦炎，喷嚏。

皮肤及附属器：真皮炎，毛发干燥，皮肤干燥，光敏反应，瘙痒症，紫癜，皮疹，风疹。

泌尿系统：尿频，尿液外观颜色改变，尿失禁，尿潴留。

另外，服用本品还可偶发肝功能异常（包括黄疸，肝炎和肝坏死），秃发，过敏反应，乳腺增生，多形红斑，周围性水肿，癫痫。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸氯雷他定胶囊	化学药	HZ004135
盐酸氯雷他定片	化学药	HZ004136

HY002269 盐酸氯米帕明

【其他名称】Anafranil、安拿芬尼、氯丙咪嗪、盐酸氯丙咪嗪

【外文名称】Clomipramine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】*N*，*N*－二甲基－10，11－二氢－3－氯－5*H*－二苯并［*b*，*f*］氮杂䓬－5－丙胺盐酸盐

【分子式】$C_{19}N_{23}ClN_2 \cdot HCl$

【分子量】351.32

【性状及组成】本品为白色或微黄色结晶性粉末，无臭，味苦；遇光色渐变黄。

本品在冰醋酸或三氯甲烷中极易溶解，在水或乙醇中易溶，在丙酮中微溶，在乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为190～196℃，熔距不得超过2℃。

吸收系数：取本品，精密称定，加盐酸溶液（9→1000）溶解并定量稀释制成每1ml中约含20μg的溶液，照紫外－可见分光光度法，在252nm的波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为220～233。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗抑郁药。

本品为三环类抗抑郁药，主要作用在于阻断中枢神经系统去甲肾上腺素和5－羟色胺的再摄取，对5－羟色胺的再摄取的阻断作用更强，而发挥抗抑郁及抗焦虑作用，亦有镇静和抗胆碱能作用。

【药代动力学】本品口服吸收快而完全，生物利用度为30%～40%，蛋白结合率为96%～97%，半衰期为22～84小时，表观分布容积7～20L/kg，在肝脏代谢，活性代谢物为去甲氯米帕明，由尿排出。本品可分泌入乳汁。

【药物相互作用】

1．本品与舒托必利合用，有增加室性心律失常的危险，严重者可至尖端扭转心律失常。

2．本品与乙醇或其他中枢神经系统抑制药合用，中枢神经抑制作用增强。

3．本品与肾上腺素、去甲肾上腺素合用，易致阵发性高血压及心律失常。

4．本品与可乐定合用，后者抗高血压作用减弱。

5．本品与抗惊厥药合用，可降低抗惊厥药的作用。

6．本品与氟西汀或氟伏沙明合用，可增加两者的血浆浓度，出现惊厥，不良反应增加。

7．本品与阿托品类合用，不良反应增加。

【药物过量】

1．中毒症状：首发症状一般是严重的抗胆碱能反应，中枢症状有嗜睡、木僵、昏迷、躁动不安、震颤、谵妄、大量出汗、反射亢进、肌肉强直、惊厥等，心血管系统可出现心律失常、心动过缓，传导阻滞，充血性心衰甚至心脏骤停。也可发生呼吸抑制、发绀、低血压、休克、呕吐、高热、瞳孔散大、少尿或无尿等。

2．处理：洗胃，保持呼吸道通畅，采取增加排泄措施，并依病情进行相应对症治疗和支持疗法。

【不良反应】治疗初期可能出现抗胆碱能反应，如多汗、口干、视物模糊、排尿困难、便秘等。中枢神经系统不良反应可出现嗜睡，震颤、眩晕。可发生体位性低血压。偶见癫痫发作、心电图异常、骨髓抑制或中毒性肝损害等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸氯米帕明片	化学药	HZ004137
盐酸氯米帕明注射液	化学药	HZ004138

HY002270　盐酸氯哌丁

【其他名称】咳平、氯苯息定、氯哌斯汀

【外文名称】Cloperastini Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第1册

药物理化信息

【化学名】1－［2－［（4－氯－α－苯基苄基）氧］乙基］哌啶的盐酸盐

【分子式】$C_{20}H_{24}ClNO\cdot HCl$

【分子量】366.33

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，味辛、苦、有麻木感。

本品在水、乙醇或三氯甲烷中易溶，在丙酮中微溶。

熔点：本品的熔点为146～153℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为苯海拉明的类似物，为非成瘾性中枢性镇咳药，主要抑制咳嗽中枢，还具有H_1受体阻断作用，能轻度缓解支气管平滑肌痉挛及支气管黏膜充血、水肿，这亦有助于其镇咳作用。

本品镇咳作用较可待因弱，但无耐受性及成瘾性。

【药代动力学】服药后20～30分钟生效，作用可维持3～4小时。

【药物相互作用】与中枢镇静药合用，可增强嗜睡作用。

【不良反应】偶有轻度口干、嗜睡等副作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方酚咖伪麻胶囊	化学药	HZ001163
盐酸氯哌丁片	化学药	HZ004139

HY002271　盐酸氯普鲁卡因

【其他名称】Nesacaine、纳塞卡因

【外文名称】Chloroprocaine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第59册

药物理化信息

【化学名】4－氨基－2－氯苯甲酸－2－（二乙氨基）乙酯盐酸盐

【分子式】$C_{13}H_{19}ClN_2O_2 \cdot HCl$

【分子量】307.22

【性状及组成】本品为白色或类白色针状结晶，无臭，味苦，有麻痹感。

本品在水中溶解，在甲醇中略溶，在醋酸乙酯中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】氯普鲁卡因是酯类局麻药。为盐酸普鲁卡因的氯化同类局部麻醉药。

氯普鲁卡因主要通过封闭钠通道的内口产生神经阻滞作用。目前认为钠通道上存在一个以上的特殊结合点。由于－Cl基团与苯环共轭，使孤对电子与钠通道上的受体产生快速有效结合，导致Na^+离子内流终止，神经传导逐渐停止。

氯普鲁卡因是在普鲁卡因的结构基础上引入－Cl基团，脂溶性增加，在化学结构上形成了麻醉效应强，麻醉后恢复快的优点。起效快（6～12分钟），麻醉作用平稳（持续60分钟），镇痛和肌松完全；停药后运动和感觉同步恢复快。

急性毒性试验表明：盐酸氯普鲁卡因注射液的LD_{50}为305.1mg/kg，95%可信限为261.3～356.3mg/kg，皮下注射的LD_{50}为720mg/kg，95%可信限为605.1～856.6mg/kg。

局部用药毒性试验表明该药无致敏反应。

【药物相互作用】避免与单胺氧化酶抑剂、三环类抗抑郁药或吩噻嗪类的药物同时使用。如必须同时使用时则需要密切观察患者。

避免与磺胺药同时使用。

禁与苛性碱及其碳酸盐、肥皂、银盐、碘和碘化物合用。

【不良反应】不良反应少于利多卡因、普鲁卡因、丁卡因等局麻药。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸氯普鲁卡因注射液	化学药	HZ0004140
注射用盐酸氯普鲁卡因	化学药	HZ0005085

HY002272 盐酸氯普噻吨

【其他名称】泰尔登

【外文名称】Chlorprothixene Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】（*Z*）*N*，*N*－二甲基－3－（2－氯9H－亚噻吨基）－1－丙胺盐酸盐

【分子式】$C_{18}H_{18}ClNS \cdot HCl$

【分子量】352.32

药物药理信息

【药理毒理】本品为硫杂蒽类抗精神病药，可通过阻断脑内神经突触后多巴胺受体而改善精神障碍，也可抑制脑干网状结构上行激活系统，引起镇静作用，还可抑制延脑化学感受区而发挥止吐作用。本品抗肾上腺素作用及抗胆碱作用较弱，并有抗抑郁及抗焦虑作用。

【药代动力学】主要在肝内代谢，大部分经肾脏排泄。

【药物相互作用】

1．本品能促使中枢神经抑制药如吸入全麻药或巴比妥类等静脉全麻药增效，合用时应将中枢神经抑制药的用量减少到常用量的1/4～1/2。

2．本品与苯丙胺合用，可降低后者的效应。

3．合用制胃酸药或泻药时，可减少本品的吸收。

4．本品可降低惊厥阈值，使抗惊厥药作用减弱，不宜用于癫痫病人。

5．本品与抗胆碱药物合用时药效可互相加强。

6．本品与肾上腺素合用，由于α受体活动受阻，β受体活动占优势，可出现血压下降。

7．本品与左旋多巴合用时，可抑制后者的抗震颤麻痹作用。

8．三环类或单胺氧化酶抑制药与本品合用，镇静及抗胆碱效能可更显著。

9．可掩盖某些抗生素（如氨基苷类）的耳部毒性。

【药物过量】

1．中毒症状：过量时的症状为昏迷、昏睡、呼吸抑制、低血压（在服药几小时后出现），并能维持2～3日，心跳加速、发热和瞳孔缩小、躁狂，在恢复期可出现血尿。

2．处理：维持呼吸道通畅，并依病情给予对症治疗及支持疗法。

【不良反应】有头晕、嗜睡、无力、体位性低血压和心悸、口干、便秘、视力模糊、排尿困难等抗胆碱能症状。剂量大时可出现锥体外系反应，如震

颤、僵直、流涎、运动迟缓、静坐不能、急性肌张力障碍。长期大量使用可引起迟发性运动障碍。可引起血浆中泌乳素浓度增加，可能有关的症状为：溢乳、男子女性化乳房、月经失调、闭经。可能引起肝功能损害、粒细胞减少。偶可引起癫痫。偶见过敏性皮疹及恶性综合征。可引起注射局部红肿、疼痛、硬结。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸氯普噻吨注射液	化学药	HZ0004141

HY002273　盐酸仑氨西林

【其他名称】盐酸仑氨苄西林

【外文名称】Lenampicillin Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】本品为半合成青霉素类广谱抗生素，为氨苄西林酯，在体内水解成氨苄西林而显效。抗菌谱与氨苄西林相同，对革兰阳性菌如金葡菌、链球菌、肺炎球菌、肠球菌等和革兰阴性菌，如大肠杆菌、奇异变形杆菌、流感杆菌等均有较好疗效。

【不良反应】

1. 过敏反应：用药后偶见发热、皮疹、荨麻疹等症状，出现时应中止给药；罕见休克症状，应严密观察，遇有不适感、口内异常感、哮喘、眩晕、耳鸣等症状时应中止给药。

2. 胃肠道反应：偶见恶心、食欲减退、腹泻等，罕见伪膜性肠炎。

3. 肝脏毒性：少数患者用药后出现转氨酶升高等肝功能检查异常。

4. 肾毒性：少数患者用药后可出现间质性肾炎。

5. 血液系统：罕见嗜酸粒细胞增多、粒细胞减少、血小板减少、溶血性贫血等。

6. 其他：长期大剂量服用偶可见菌群失调，二重感染等。偶见维生素 K、维生素 B 族缺乏症、低钠血症、低氯血症和低钾血症，突然停药可引起钠、氯及水的潴留。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸仑氨西林片	化学药	HZ0004142

HY002274　盐酸罗格列酮

【外文名称】Rosiglitazone Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】5－［4－［2－（甲基－2－吡啶氨基）乙氧基］苄基］－2，4－噻唑烷二酮盐酸盐二水合物

【分子式】$C_{18}H_{19}N_3O_3S\cdot HCl\cdot 2H_2O$

【分子量】429.92

药物药理信息

【药理毒理】本品属噻唑烷二酮类抗糖尿病药，通过提高胰岛素的敏感性而有效地控制血糖。本品为过氧化物酶体增殖激活受体 γ（PPAR－γ）的高选择性、强效激动剂。人类的 PPAR 受体存在于胰岛素的主要靶组织如肝脏、脂肪和肌肉组织中。本品激活 PPAR－γ 核受体，可对参与葡萄糖生成、转运和利用的胰岛素反应基因的转录进行调控。此外，PPAR－γ 反应基因也参与脂肪酸代谢的调节。在本品临床研究中，空腹血糖（FPG）和 HbA1c 的检测结果表明，本品可改善血糖控制情况，同时伴有血胰岛素和 C 肽水平降低，也可使餐后血糖和胰岛素水平下降。本品对血糖控制的改善作用较持久，可维持达 52 周。Ⅱ型糖尿病的主要病理生理学特征为胰岛素抵抗。本品的抗糖尿病作用已在Ⅱ型糖尿病的动物模型（由于靶组织的胰岛素抵抗而出现高血糖症和/或糖耐量下降）中得到显示。可有效地降低 ob/ob 肥胖小鼠、db/db 糖尿病小鼠和 fa/fa Zucker 肥胖大鼠的血糖，减轻其高胰岛素血症，并可延缓 db/db 小鼠和 Zucker 肥胖大鼠模型的糖尿病发展。动物研究提示，本品的抗糖尿病作用是通过提高肝脏、肌肉和脂肪组织对胰岛素的敏感性而实现，并且在脂肪组织中使胰岛素调控的葡萄糖转运因子 GLUT－4 的基因表达增加。本品单独使用不会使Ⅱ型糖尿病和/或糖耐量减低的模型动物出现低血糖。

1. 动物毒性：本品小鼠、大鼠、犬给药剂量分别为 3mg/（kg·d）、4mg/（kg·d）和 2mg/（kg·d）（相当于人日服最大推荐剂量下 AUC 的 5，22 和 2 倍）时，均发现心脏重量增大，形态学检查可见心室肥大，这可能与血容量增加导致心脏负荷加大有关。

2. 遗传毒性：体外细菌基因致突变试验、体外人淋巴细胞染色体畸变试验、小鼠体内微核试验、体内、外大鼠程序外 DNA 合成试验（UDS）结果均为阴性。小鼠淋巴瘤体外试验中，在代谢活化条件下可见突变率有轻度增加（约 2 倍）。

3. 生殖毒性：本品剂量达 40mg/（kg·d）（相当于人日服最大推荐剂量下 AUC 的 116 倍），对雄性大鼠交配和生育力无影响。本品可改变雌性大鼠的动情周期［剂量 2mg/（kg·d），相当于人日服最大推荐剂量下 AUC 的 20 倍］，降低雌性大鼠的生育力

[40mg/（kg·d），相当于人日服最大推荐剂量下 AUC 的 200 倍]，并伴血中的孕激素和雌激素降低。在 0.2mg/（kg·d）（相当于人日服最大推荐剂量下 AUC 的 3 倍）剂量下，未见到上述改变。本品剂量为 0.6 和 4.6mg/（kg·d）（相当于人日服最大推荐剂量下 AUC 的 3 和 15 倍），可降低猴子卵泡期血清雌二醇水平，继而使黄体激素水平和黄体期孕酮水平下降，并出现闭经，这可能与本品直接抑制卵巢甾体激素的生成有关。大鼠怀孕早期给予本品，对着床或胚胎无影响；但在妊娠中、晚期给予本品，可引起大鼠和家兔胚胎死亡和生长延滞。大鼠和家兔给药剂量分别达 3mg/（kg·d）和 100mg/（kg·d）（分别相当于人日服最大推荐剂量下 AUC 的 20 和 75 倍）时，未见致畸作用。大鼠给药 3mg/（kg·d）时可使胎盘出现病理改变。大鼠妊娠和哺乳期连续给药可引起窝仔数减少，新生鼠生存能力下降和出生后生长迟缓，但生长迟缓可于青春期后恢复。本品对大鼠、家兔胎盘、胚胎/胎仔和仔代的无影响剂量分别为 0.2mg/（kg·d）、15mg/（kg·d），约为人日服最大推荐剂量下 AUC 的 4 倍。尚无充分和严格控制的孕妇临床研究资料。只有当其潜在利益大于对胎儿的潜在危险性时，孕妇才可以服用本品。大鼠乳汁中检测到了本品的相关物质，但本品是否经人乳汁分泌尚不清楚。由于许多药物可经人乳汁分泌，故哺乳妇女不宜使用本品。现有资料明显提示，妊娠期间血糖水平异常可增加新生儿先天性畸形的发生率、新生儿的发病率和死亡率，为此大多数专家建议在妊娠期单用胰岛素，以尽可能维持正常的血糖水平。

4. 致癌性：小鼠掺食给予本品 2 年，剂量为 0.4、1.5 和 6mg/（kg·d）（高剂量相当于人日服最大推荐剂量下 AUC 的 12 倍），未见致癌作用，但在 1.5mg/（kg·d）以上剂量，可引起脂肪组织增生。大鼠经口给予本品 2 年，剂量为 0.05、0.3 和 2mg/（kg·d）[高剂量分别相当于人日服最大推荐剂量下 AUC 的 10（雄性）倍和 20 倍（雌性）]，在 0.3mg/（kg·d）和更高剂量下，可明显增加大鼠良性脂肪组织瘤的发生率。上述两种动物上发现的增生反应与本品对脂肪组织过度而持久的药理作用有关。

【药代动力学】罗格列酮的绝对生物利用度为 99%，健康成人一次口服罗格列酮片 4mg，1 小时后血药浓度达最高，C_{max}约为 319ng/ml（一次口服罗格列酮片 2mg，C_{max}为 156ng/ml）$t_{1/2}$为 3～4 小时，该品 99.8%分布在血清蛋白（主要是白蛋白）中，该品大部分以代谢物的形式由尿排出，小部分由粪便排出。

【药物相互作用】

1. 经细胞色素 P450 代谢的药物：体外药物代谢试验表明，在临床使用剂量下，罗格列酮不抑制主要的 P450 酶。体外试验资料证实，罗格列酮主要通过 CYP2C8 代谢，极少部分经 CYP2C9 代谢。

2. 尼莫地平和口服避孕药（炔雌醇和炔诺酮）主要经 CYP3A4 途径代谢，因此与本品（4mg，每日 2 次）合用，不会对上述二药物产生具有临床意义的药代动力学影响。

3. 格列本脲：对于服用格列本脲后病情稳定的糖尿病患者，本品（2mg/次，每日 2 次）与格列本脲（3.75mg/d 至 10mg/d）合用 7 天，不会改变其 24 小时的平均稳态血糖水平。

4. 二甲双胍：对于健康受试者，本品（2mg/次，每日 2 次）与二甲双胍（500mg/次，每日 2 次）合用 4 天，不会改变本品及二甲双胍的稳态药代动力学参数。

5. 阿卡波糖：健康受试者服用阿卡波糖（100mg/次，每日 3 次）7 天，对单剂口服本品的药代动力学参数无影响。

6. 地高辛：健康受试者连服本品（8mg/次，每日 1 次）14 天，对地高辛（0.375mg/次，每日 1 次）的稳态药代动力学参数无影响。

7. 华法林：连续服用本品对华法林对映体的稳态药代动力学参数无影响。

8. 乙醇：服用本品的 2 型糖尿病患者单次饮用中等量的乙醇，不会增加其急性低血糖发生的危险性。

9. 雷尼替丁：健康受试者服用雷尼替丁（150mg/次，每日 2 次）4 天，不会改变罗格列酮单剂口服或静脉给药的药代动力学参数。该结果表明胃肠道 pH 升高不影响本品的口服吸收。

【药物过量】根据志愿者临床研究显示：给予单剂量口服本品不超过 20mg 者，耐受性良好。一旦出现药物过量，可根据患者临床主诉给予适当的对症支持治疗，一般均可缓解。

【不良反应】

1. 轻中度水肿，文献报道本品单药治疗时水肿发生率为 4.8%。

2. 贫血，发生率约为 1%。本品可能会使血红蛋白和红细胞压积下降，可能与盐酸罗格列酮造成血浆容量增加有关。

3. 低血糖反应，合并使用其他降糖药物时，有发生低血糖的风险。

4. 肝功能异常，均为轻中度转氨酶升高，并且可逆。

5. 血脂增高。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸罗格列酮胶囊	化学药	HZ004143
盐酸罗格列酮片	化学药	HZ004144

HY002275　盐酸罗哌卡因

【外文名称】Ropivacaine

药物理化信息

【化学名】*S*－（－）－1－丙基－2′,6′－二甲苯胺甲酰基哌啶盐酸盐

【分子式】$C_{17}H_{26}N_2O \cdot HCl$

【分子量】310.87

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：罗哌卡因是一个纯左旋体长效酰胺类局麻药，有麻醉和镇痛双重效应，大剂量可产生外科麻醉，小剂量时则产生感觉阻滞（镇痛），仅伴有局限的非进行性运动神经阻滞。

加用肾上腺素不改变罗哌卡因的阻滞强度和持续时间。

罗哌卡因通过阻断钠离子流入神经纤维细胞膜内对沿神经纤维的冲动传导产生可逆性的阻滞。

局麻药也可能对如脑细胞和心肌细胞等易兴奋的细胞膜产生类似作用。如果过量的药物快速地进入体循环，中枢神经系统和心血管系统将产生中毒症状和体征。

怀孕母羊和未怀孕的母羊相比，并不显示对罗哌卡因有更强的敏感性。

健康志愿者静脉注射罗哌卡因后耐受良好，此药临床经验提示一个良好的安全范围。根据副交感神经阻滞程度，硬膜外使用此药可出现间接的心血管效应（低血压、心动过缓）。

2．毒性研究：据文献报道，只有在高剂量或意外将药物注入血管内而使药物血浆浓度骤然上升或者在药物过量的情况下，盐酸罗哌卡因才会造成急性毒性反应。

曾有一例患者因作臂丛神经阻断时，无意中将200mg药物注入血管内后，发生惊厥。

3．生殖毒性：接受试验的两代大鼠未见生育力及一般生殖行为受药物的影响。施用最高剂量的盐酸罗哌卡因后，因其对孕母的毒性不良反应，产后3天内幼仔的死亡数增多，列于新生仔死亡的第二位原因。

对大鼠和兔所进行的致畸试验未见罗哌卡因对器官发生以及胎儿早期发育有任何不利影响，以最大可耐受剂量对围产期及产后的大鼠进行研究，未见其对胎儿后期发育、分娩、哺乳、新生儿生存力及子代的生长有任何影响。

另一大鼠围产期及产后的研究，将罗哌卡因与布比卡因作比较，发现在用药剂量低得多与游离血浆浓度也低的布比卡因即可观察到对孕母的毒性不良反应。

【药代动力学】本品的pKa为8.1。其血浆浓度取决于剂量、用药途径和注射部位的血管分布，并且呈线性药代动力学特征，血浆最高浓度与剂量成正比。本品从硬膜外吸收为完全的双相吸收，半衰期分别为14分钟和4小时。比静脉注射半衰期（1.8小时）长，提示硬膜外吸收相对缓慢。本品血浆蛋白结合率高，约为95%。本品血浆清除率为（0.82±0.16）L/min。足月妊娠患者清除率有一定的下降，硬膜外注射后血浆未结合清除率为妊娠患者的一半。分娩时脐带血与母体血药浓度相同，但新生儿的神经适应能力（NAC）评分与血药浓度之间无明显的相关性。本品主要由肝脏清除，少部分由肠道及肾脏清除。本品在体内广泛代谢，静注后约86%经尿液排泄。

【药物相互作用】接受其他局麻药或酰胺类结构相关的药物治疗的患者，如同时用本品应谨慎，因为毒性作用是可以累加的。

【药物过量】

1．急性全身性毒性：将局麻药误注入血管，可能立即产生毒性不良反应。当给药过量时需要1～2小时才达到血浆峰浓度，达峰时间取决于注射部位。因此中毒症状会延迟出现。全身性中毒不良反应可能包括中枢神经系统和心血管系统毒性反应。

中枢神经系统中毒可以表现为逐渐加重的相应症状和体征。最先出现的症状是视觉和听觉障碍，口周麻木、头昏、轻微头痛，麻刺感和感觉异常。语言障碍、肌肉僵直和肌肉震颤是非常严重的症状，可能是惊厥急性发作的先兆。不要将这些症状和神经官能症的行为相混淆。这些症状出现后，会出现意识丧失和癫痫大发作的惊厥，时间持续几秒钟至几分钟。由于突然惊厥引起的肌肉活动增加和对呼吸的影响，会立即产生缺氧和碳酸过多的症状，在有些情况下甚至会出现窒息。呼吸和代谢性酸中毒会增加局麻药的不良反应。

局麻药通过中枢神经系统和代谢途径的重新分布，使机体得到恢复。一般来说，只要未注射大量的药物，机体就可以很快得到恢复。

发生心血管系统中毒情况更为严重，全身高浓度局麻药会引起低血压，心动过缓，心律失常甚至心跳停止。在志愿者静脉注射罗哌卡因会引起心脏

传导和心肌收缩抑制的症状。除非病人处于麻醉状态或使用了大量的镇静剂如安定、巴比妥钠，中枢神经系统中毒的现象一般出现于在心血管不良反应产生之前。

2. 急性中毒的治疗：如果出现急性全身中毒的现象必须立即停止注射局麻药。

如果发生惊厥，必须治疗。治疗目的是供氧、中止惊厥和维持体循环。必要时可给予面罩供氧来辅助通气。如果在 15～20 秒内惊厥没有自动停止，必须静脉给予抗惊厥药。静脉注射 100～150mg 硫喷妥钠可快速中止惊厥发作，也可选择起效缓慢的地西泮 5～10mg 静脉注射。琥珀酰胆碱能很快地中止肌肉抽搐，但病人需要气管插管和控制通气。

如果确实出现心血管系统抑制症状（如低血压、心动过缓），可静注 5～10mg 麻黄素，必要时 2～3 分钟后重复推注。

如果出现循环衰竭，必须立即进行心肺复苏，适当的供氧、通气和维持循环以及治疗酸中毒，对抢救生命尤为重要。

【不良反应】 在临床研究治疗中病人低血压发生率为 39%，恶心的发生率为 25%。临床报道常见不良反应事件（>1%）是低血压、恶心、心动过缓、呕吐、感觉异常、体温升高、头痛、尿潴留、头晕、高血压、寒战、心动过速、焦虑、感觉减退。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸罗哌卡因注射液	化学药	HZ004145
注射用盐酸罗哌卡因	化学药	HZ005086

HY002276 盐酸罗匹尼罗

【外文名称】 Ropinirole Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】 4－［2－（二丙胺基）乙基］－1,3－二氢吲哚－2－酮

【性状及组成】 为白色或浅黄色粉末，可溶于水（133mg/ml）。

熔点：241～243℃。

药物药理信息

【药理毒理】 本品是一种选择性多巴胺 D_2 受体激动剂，用于治疗帕金森病（尤其是早期帕金森病）。在应用左旋多巴治疗时，有时会出现疗效减弱及波动现象，主要是由于纹状体内多巴胺能神经元进行性变性或受体的敏感性降低所致。因此，在左旋多巴疗效不佳时，加用多巴胺激动剂常可奏效，因这类药物具有直接激发纹状体多巴胺受体的作用。还可作用于下丘脑和垂体来抑制泌乳素的分泌。本品适用于治疗帕金森病，对年轻患者的早期疗效与左旋多巴相似，耐受性良好。本品也适用于左旋多巴治疗患者出现“开－关”波动，可减少左旋多巴日总剂量的 20%。

【药物过量】 过量的症状包括恶心、呕吐、嗜睡、意识混乱、面部肌肉痉挛。

【不良反应】 本品不良反应与外周多巴胺能活性有关。最常见的不良反应是恶心、嗜睡、下肢水肿、腹痛、呕吐和惊厥。偶见症状性低血压。

以下不良反应很少发生：意识混乱、不安、晕厥、下肢肿胀、痉挛、胸痛、心跳异常加快或减慢。

以下不良反应极少发生：肌肉疼痛、视力障碍、发热、严重的肌肉僵直、突然的难以抗拒的睡意。

HY002277 盐酸罗通定

【外文名称】 Rotundine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 2,3,9,10－四甲氧基－5,8,13,13*a*－四氢－6*H*－二苯并［*a*，*g*］喹嗪的盐酸盐

【分子式】 $C_{21}H_{25}NO_4 \cdot HCl$

【分子量】 391.89

【性状及组成】 本品为白色或微黄色的结晶，无臭，味苦，遇光受热易变黄。本品在三氯甲烷甲醇或沸水，在水中略溶，在无水乙醇中微溶，在己醚或丙酮中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中含 10mg 的溶液，在 25℃时依法测定，比旋度为－232°以上。

吸收系数：取本品，精密称定，加 0.01mol/L 盐酸溶液溶解，并定量稀释制成每 1ml 中约含 30μg 的溶液，照紫外－可见分光光度法，在 281nm 波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为 135～146。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：镇痛药。

本品具有镇痛、镇静、催眠及安定作用。其镇痛作用弱于哌替啶，强于一般解热镇痛药。在治疗剂量下无呼吸抑制作用，亦不引起胃肠道平滑肌痉挛。对慢性持续性疼痛及内脏钝痛效果较好，对急性锐痛（如手术后疼痛，创伤性疼痛等）、晚期癌症痛效果较差。在产生镇痛作用的同时，可引起镇静及催眠。本品的作用机制尚待阐明，可能与通过抑制脑干网状结构上行激活系统、阻滞脑内多巴胺受体的功能有关。治疗量无成瘾性。

本品为非麻醉性镇痛药，具有镇痛、镇静、催眠及安定作用，镇痛作用较一般解热镇痛药强，服药后10分钟出现镇痛作用，可维持2～5小时，对胃肠道系统引起的钝痛有良好的止痛效果，对外伤等剧痛效果差。对于月经痛有效，对于失眠尤其是因疼痛引起的失眠更为适宜，醒后无后遗效应。

【药代动力学】本品在体内以脂肪组织中分布最多，肺、肝、肾次之。主要经肾排泄。此后内脏含量下降，脂肪中含量却增加，显然与本品脂溶性有关。从鼠与兔试验表明，本品极易透过血脑屏障而进入脑组织，几分钟内即出现较高浓度，但30分钟后即降低，2小时后低于血中含量。

【药物相互作用】与其他中枢抑制剂（如一些镇静安眠药）同服，可引起嗜睡及呼吸抑制现象。

【药物过量】大剂量应用本品，对呼吸中枢有抑制作用，并可引起锥体外系反应。逾量中毒者可立即催吐或洗胃排除胃中药物。吸氧、人工呼吸解除呼吸抑制，输液、扩容改善微循环，对症处理锥体外系症状。

【不良反应】常用剂量下不良反应较轻，较长期应用也不致成瘾。偶有眩晕、乏力、恶心等反应。用于镇痛时，约有76.9%的病人出现嗜睡。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸罗通定片	化学药	HZ004146

HY002278　盐酸洛贝林

【外文名称】Lobeline Hydrochloreide

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】2－［1－甲基－6－（β－羟基苯乙基）－2－哌啶基］苯乙酮盐酸盐

【分子式】$C_{22}H_{27}NO_2 \cdot HCl$

【分子量】373.92

【性状及组成】本品为白色结晶或颗粒状粉末，无臭，味苦，水溶液显弱酸性反应。本品在乙醇或三氯甲烷中易溶，在水中溶解。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每1ml中约含20mg的溶液，依法测定，比旋度为－56°至－58°。

吸收系数：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每1ml中约含10μg的溶液，照紫外－可见分光光度法测定，在249nm的波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为360～390。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：呼吸兴奋药。

本品可刺激颈动脉窦和主动脉体化学感受器（均为N1受体），反射性地兴奋呼吸中枢而使呼吸加快，但对呼吸中枢并无直接兴奋作用。对迷走神经中枢和血管运动中枢也同时有反射性的兴奋作用；对自主神经节先兴奋而后阻断。

【药物过量】剂量较大时能引起心动过速、传导阻滞、呼吸抑制甚至惊厥。

【不良反应】可有恶心、呕吐、呛咳、头痛、心悸等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸洛贝林注射液	化学药	HZ004147

HY002279　盐酸洛非西定

【外文名称】Lofexidine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】2－［1－（2，6－二氯苯氧基）－乙基］－2－咪唑啉盐酸盐

【分子式】$C_{11}H_{12}Cl_2N_2O \cdot HCl$

【分子量】295.60

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶性粉末，无臭。

本品在水或乙醇中易溶，在三氯甲烷中微溶，在丙酮中极微溶解，在乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为224～229℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗高血压药。

药理学：本品为咪唑啉类衍生物。与可乐定的结构和作用相似。选择性激动中枢α_2受体，降低外周交感神经活性，抑制去甲肾上腺素释放，松弛血管平滑肌，产生血压下降作用。阿片类药物能抑制中枢去甲肾上腺素能神经原的活性，当戒除阿片药品或毒品时，因突然除去对该神经原的抑制而使其活动亢进，产生阿片类戒断综合征。本品能对抗这种作用，所以使用本品可使海洛因戒断综合征的强度与持续时间。本品无成瘾性。

毒理学：在大鼠和犬12月的口服毒性研究证明，洛非西定的用量在1mg/kg以下时没发现任何不良反应；3mg/kg是临界毒性剂量，这个剂量相当人治疗剂量的300倍；5.0～25.0mg/kg，相当于人治疗剂量的500～2500倍，出现中度到重度反应。可见这

个药物的毒性不大，是比较安全的。

【药代动力学】用^{14}C盐酸洛非西定在人的研究证明，洛非西定口服后吸收完全，t_{max}约在2～5小时，C_{max}相当于2.6～4.0mg/ml的游离盐基。达到峰浓度后血药浓度呈双相性下降。吸收相$t_{1/2\alpha}$为1.3～3.7小时，消除相$t_{1/2\beta}$为9～18.3小时。吸收后的药物，原形由尿中排出的平均为12%（5%～20%），12小时内可排出48%，48小时内能排出80%，由粪便约排出4%。大部分被肝脏代谢，其中主要代谢产物为2，6－二氯酚，并以葡萄糖醛酸的形式排出。约有80%～90%的药物与血浆蛋白结合。

【药物相互作用】因为本品为α_2受体激动剂，所以不能与α受体阻断同时使用，以免发生药理学的拮抗作用。

【药物过量】洛非西定过量产生血压下降、心动过缓。动物试验证明，急性中毒表现瞌睡、共济失调、过度兴奋、甚致晕厥。对药物过量的解毒剂可用α受体阻断药，如酚妥拉明或妥拉唑林。

【不良反应】洛非西定口服后主要的不良反应有瞌睡和口、咽及鼻腔干燥，困倦、乏力，此外还可能出现体位性低血压或短暂昏厥，这些反应在减少服药量后可自行消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸洛非西定片	化学药	HZ004148

HY002280 盐酸洛美利嗪

【外文名称】Lomerizine Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】1－［双（4－氟苯基）甲基］－4－（2,3,4－三甲氧基苄基）哌嗪二盐酸盐。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：本品为二苯哌嗪类钙通道阻滞剂，具有选择性的脑血管舒张作用。

盐酸洛美利嗪为一种新型的二苯哌嗪类钙通道阻滞剂，能增加椎动脉、颈总动脉、冠状动脉和股动脉的血流量，但其扩张椎动脉血管的作用为最大。冠脉血流量增加30%的剂量（ED_{30}）为椎动脉血流增加30%剂量的20倍。该药还能抑制大脑皮层扩散抑制和神经炎，保护人和动物免遭脑缺血和缺氧的损害。因而，盐酸洛美利嗪可用于偏头痛、丛集性头痛和脑血管等疾病的治疗。

2．毒理研究

（1）遗传毒性：微生物回复突变试验、染色体畸变试验和小鼠微核试验结果均为阴性。

（2）生殖毒性：对雄性大鼠生育力的无毒性剂量为100mg/（kg·d），雌性大鼠的为30mg/（kg·d）。大鼠胎仔器官形成期毒性试验显示，雌性大鼠10mg/（kg·d）以上的剂量组，可见分娩异常、幼鼠出生率下降；30mg/（kg·d）剂量组可见母体阴道出血、体重增加抑制和摄食量减少，胎仔死亡数增加、体重减低及以手指缺失为主要表现的外形异常。对母鼠、胎鼠和出生后幼鼠的无毒性剂量为3mg/（kg·d）。家兔胎仔器官形成期毒性试验结果显示，5、15、45mg/（kg·d）三个剂量组给药对母体动物未见明显影响。45mg/（kg·d）组可见胎仔死亡率上升，存活率下降，未见致畸作用。孕兔的安全剂量为45mg/（kg·d），家兔胎仔的为15mg/（kg·d）。大鼠围产期及哺乳期的毒性试验结果显示，30mg/（kg·d）剂量组可见母体体重增加抑制、分娩障碍，同时可见同组幼鼠出现因哺乳不良而出现的一般状况恶化、体重下降、生存率降低。哺乳期间，给药10mg/（kg·d）以上剂量组可见幼鼠有低体重倾向及耳廓分离完成率低下。围产期和哺乳期母鼠的安全剂量为10mg/（kg·d），幼鼠的为3mg/（kg·d）。

【药代动力学】洛美利嗪在血浆中被快速吸收，但消除缓慢。主要通过肝代谢，少量通过尿排泄。

雌雄大鼠、雄性狗（分别为20，20和10mg/kg）口服给药后，未转变药物的血浆浓度在2小时内达到C_{max}，最终的半衰期分别为4，9，14小时，生物利用度分别为10%，30%，70%。

【不良反应】主要为困倦、眩晕、蹒跚（摇晃）、恶心、发热感0.3%，另外还可出现实验室检查值的变化，ALT上升2.2%、AST上升。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸洛美利嗪胶囊	化学药	HZ004149
盐酸洛美利嗪片	化学药	HZ004150

HY002281 盐酸洛美沙星

【外文名称】Lomefloxacin Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第49册

药物理化信息

【化学名】（±）－乙基－6,8－二氟－1,4－二氢－7－（3－甲基－1－哌嗪基）－4－氧代－3喹啉羧酸盐酸盐

【分子式】$C_{17}H_{19}F_2N_3O_3 \cdot HCl$

【分子量】387.81

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，几乎无臭、味苦。

本品在水中微溶，在甲醇和乙醇中几乎不溶，在稀盐酸中极微溶解，在氢氧化钠中易溶。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理：本品为喹诺酮类抗菌药。对肠杆菌科细菌如大肠埃希菌、志贺菌属、克雷伯菌属、变形杆菌属、肠杆菌属等具有高度的抗菌活性；流感嗜血杆菌、淋病奈瑟菌等对本品亦呈现高度敏感；对不动杆菌、铜绿假单胞菌等假单胞菌属、葡萄球菌属和肺炎球菌、溶血性链球菌等亦有一定的抗菌作用。

本品通过作用于细菌细胞 DNA 螺旋酶的 A 亚单位，抑制 DNA 的合成和复制而起杀菌作用。

2．毒理：本品仅在用 CHO/HGPRT 方法进行的体外致突变试验中，浓度≥226μg/ml 时有微弱的阳性反应。小鼠口服人用推荐剂量 34 倍的本品时不影响其生育力。

【药代动力学】本品口服后吸收完全，生物利用度为 90%～98%。单次空腹口服 400mg，1.5 小时后达血药峰浓度（C_{max}）3.0～5.2mg/L。本品在体内分布广，组织穿透性好，在皮肤、痰液、扁桃体、前列腺、胆囊、泪液、唾液和齿龈等组织中的药物浓度均达到或高于血药浓度，血消除半衰期约为 7～8 小时。本品主要通过肾脏排泄，给药后 48 小时约可自尿中以药物原形排出给药量的 60%～80%，仅少量（5%）在体内代谢，胆汁排泄约 10%。

本品静脉滴注后血药峰浓度为 9.00±2.72mg/L。本品体内分布广，组织穿透性好，在皮肤、痰液、扁桃体、前列腺、胆囊、泪液、唾液和齿龈等组织中的药物浓度均达到或高于血药浓度，血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）约为 7～8 小时。

0.3%洛美沙星滴耳液滴入豚鼠中耳腔后，在 1 小时达血药峰浓度 0.16μg/ml，24 小时仍有 0.047μg/ml；在脑组织和内耳外淋巴液中药物浓度 2 小时达峰浓度分别为 0.07μg/ml 和 57.62μg/ml，24 小时后分别为 0.004μg/ml 和 1.77μg/ml；在中耳黏膜中的药物浓度 1 小时达峰浓度 1955.72μg/ml，24 小时仍有 6.25μg/ml。

【药物相互作用】

1．本品对茶碱类药物和咖啡因的肝内代谢、体内清除过程影响小。

2．硫糖铝和制酸药可使本品吸收速率减慢 25%，曲线下面积（AUC）降低约 30%，如在本品服用前 4 小时或服用后 6 小时服硫糖铝和制酸药则影响甚微。

3．与芬布芬合用可致中枢兴奋、癫痫发作。

4．丙磺舒可延迟本品的排泄，使平均曲线下面积（AUC）增大 63%，平均达峰时间延长 50%，平均峰浓度增高 4%；故合用时可因本品血浓度增高而产生毒性。

5．可加强口服抗凝药如华法林等的作用，应监测凝血酶原时间及其他项目。

6．尿碱化剂可减低本品在尿中的溶解度，导致结晶尿和肾毒性。

7．去羟肌苷（DDI）制剂中含铝及镁可与喹诺酮类螯合，不宜合用。

8．与环孢素合用，可使环孢素血药浓度升高，必须监测环孢素血浓度，并调整剂量。

9．服用本品前后 2 小时内不宜服用含金属离子的营养剂和维生素。

【药物过量】

1．过量的处理

（1）催吐、洗胃。

（2）支持疗法和对症处理。

2．大鼠和小鼠大剂量服用本品时，会出现流涎、震颤、活动度降低、呼吸困难、阵挛性惊厥直至死亡。

【不良反应】

1．胃肠道反应较为常见，可表现为腹部不适或疼痛、腹泻、恶心或呕吐。

2．中枢神经系统反应：可有头昏、头痛、嗜睡或失眠。

3．过敏反应：皮疹、皮肤瘙痒，偶可发生渗出性多形性红斑及血管神经性水肿。其中光敏反应较其他常用喹诺酮类多见。

4．少数患者可发生血清氨基转移酶、BUN 值升高及周围血常规白细胞降低，多属轻度，并呈一过性。

5．偶可发生：①癫痫发作、精神异常、烦躁不安、意识混乱、幻觉、震颤；②血尿、发热、皮疹等间质性肾炎表现；③结晶尿，多见于高剂量应用时；④关节疼痛。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
门冬氨酸洛美沙星氯化钠注射液	化学药	HZ002672
盐酸洛美沙星滴耳液	化学药	HZ004151
盐酸洛美沙星滴眼液	化学药	HZ004152
盐酸洛美沙星分散片	化学药	HZ004153

续表

制剂名称	类别	序号
盐酸洛美沙星胶囊	化学药	HZ004154
盐酸洛美沙星颗粒	化学药	HZ004155
盐酸洛美沙星氯化钠注射液	化学药	HZ004156
盐酸洛美沙星片	化学药	HZ004157
盐酸洛美沙星葡萄糖注射液	化学药	HZ004158
盐酸洛美沙星乳膏	化学药	HZ004159
盐酸洛美沙星软膏	化学药	HZ004160
盐酸洛美沙星眼用凝胶	化学药	HZ004161
盐酸洛美沙星注射液	化学药	HZ004162
注射用盐酸洛美沙星	化学药	HZ005087

HY002282 盐酸洛哌丁胺

【外文名称】Loperamide Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】*N*，*N*－二甲基－α，α－二苯基－4－（对氯苯基）－4－羟基－1－哌啶丁酰胺盐酸盐

【分子式】$C_{29}H_{33}ClN_2O_2 \cdot HCl$

【分子量】513.51

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶性粉末，几乎无臭，味苦。

本品在乙醇或冰醋酸中易溶，在水中微溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：止泻药。

本品化学结构类似氟哌啶醇和哌替啶，但治疗量对中枢神经系统无任何作用。对肠道平滑肌的作用与阿片类相似。可抑制肠道平滑肌的收缩，减少肠蠕动。还可减少肠壁神经末梢释放乙酰胆碱，通过胆碱能和非胆碱能神经元局部的相互作用，直接抑制蠕动反射。本品可延长食物在小肠的停留时间，促进水、电解质及葡萄糖的吸收，抑制前列腺素、霍乱毒素和其他肠毒素引起的肠过度分泌。此外，本品还可增加肛门括约肌的张力，可抑制大便失禁或便急。LD_{50}为 105mg/kg（小鼠口服）、185mg（大鼠口服）。

【药代动力学】本品与肠壁的高亲和力和明显的首过代谢，使其几乎不进入全身血液循环。本品口服吸收约 40%，几乎全部进入肝脏代谢，原形药的血药浓度很低。t_{max}为 4～6 小时，$t_{1/2}$约为 7～15 小时，蛋白结合率 97%。大部分经胆汁由肠道排泄，尿中排泄约占 5%～10%。

【药物相互作用】尚未发现本品与其他药物同时服用时有相互作用。

【药物过量】服用过量，可能出现嗜睡、便秘、肌肉紧张、瞳孔缩小、呼吸徐缓等中毒症状，可用纳洛酮解毒，并对患者进行至少 48 小时的观察，以便及时发现中枢神经系统的抑制作用。

【不良反应】不良反应轻，可出现过敏如皮疹等，消化道症状如口干、腹胀、食欲减退、胃肠痉挛、恶心、呕吐、便秘，以及头晕、头痛、乏力等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸洛哌丁胺胶囊	化学药	HZ004163
盐酸洛哌丁胺颗粒	化学药	HZ004164

HY002283 盐酸麻黄碱

【外文名称】Ephedrine Hydrochloride

药物管理信息

【特殊管理分类】易制毒药

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（1*R*，2*S*）－2－甲氨基－苯丙烷－1－醇盐酸盐

【分子式】$C_{10}H_{15}NO \cdot HCl$

【分子量】201.70

【性状及组成】本品为白色针状结晶或结晶性粉末，无臭，味苦。

本品在水中易溶，在乙醇中溶解，在三氯甲烷或乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为 217～220 ℃。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 50mg 的溶液，依法测定比旋度为 －33°至 －35.5°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：β_2 肾上腺素受体激动药。

本品可直接激动肾上腺素受体，也可通过促使肾上腺素能神经末梢释放去甲肾上腺素而间接激动肾上腺素受体，对 α 和 β 受体均有激动作用。可舒张支气管并收缩局部血管，其作用时间较长；加强心肌收缩力，增加心输出量，使静脉回心血量充分；有较肾上腺素更强的兴奋中枢神经作用。

【药代动力学】本品口服很快被吸收，可通过血脑屏障进入脑脊液。口服 15～60 分钟起效，持续作用 3～5 小时。$t_{1/2}$当尿 pH 为 5 时约 3 小时，尿 pH 为

6.3时约6小时。吸收后仅有少量经脱胺氧化，大部分以原形自尿排出。

肌注或皮下注射很快被吸收，可通过血脑屏障进入脑脊液。肌注10～20分钟起效，持续作用肌注或皮下注射25～50mg/小时。

【药物相互作用】

1．与肾上腺皮质激素合用，本品可增加它们的代谢清除率，须调整皮质激素的剂量。

2．尿碱化剂，如制酸药、钙或镁的碳酸盐、枸橼酸盐、碳酸氢钠等，影响本品在尿中的排泄，增加本品的半衰期，延长作用时间，特别是如尿保持碱性几日或更长，患者大多致麻黄碱中毒，本品用量应调整。

3．与α受体阻滞药如酚妥拉明、哌唑嗪、妥拉唑啉以及吩噻嗪类药合用时，可对抗本品的加压作用。

4．与全麻药如三氯甲烷、氟烷、异氟烷等同用，可使心肌对拟交感胺类药反应更敏感，有发生室性心律失常危险，必须同用时，本品用量应减小。

5．与三环类抗抑郁药如马普替林同用时，降低本品的加压作用

6．与洋地黄苷类合用，可致心律失常。

7．与麦角新碱、麦角胺或缩宫素同用，可加剧血管收缩，导致严重高血压或外围组织缺血。

8．与多沙普仑同用，两者的加压作用均可增强。

【不良反应】

1．对前列腺肥大者可引起排尿困难；

2．大剂量或长期使用可引起精神兴奋、震颤、焦虑、失眠、心痛、心悸、心动过速等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
茶碱麻黄碱胶囊	化学药	HZ000504
茶碱麻黄碱片	化学药	HZ000505
呋麻滴鼻液	化学药	HZ000940
复方阿托品麻黄碱栓	化学药	HZ001023
复方氨酚苯海拉明片	化学药	HZ001029
复方氨酚美沙糖浆	化学药	HZ001033
复方苯海拉明麻黄碱糖浆	化学药	HZ001086
复方茶碱麻黄碱片	化学药	HZ001107
复方茶碱片	化学药	HZ001108
复方福尔可定糖浆	化学药	HZ001171
复方甘草氯化铵糖浆	化学药	HZ001175

续表

制剂名称	类别	序号
复方甘草麻黄碱片	化学药	HZ001176
复方桔梗麻黄碱糖浆	化学药	HZ001235
复方桔梗麻黄碱糖浆Ⅱ	化学药	HZ001236
复方桔梗远志麻黄碱片Ⅰ	化学药	HZ001238
复方桔梗远志麻黄碱片Ⅱ	化学药	HZ001239
复方枸橼酸喷托维林颗粒	化学药	HZ001243
复方可待因口服溶液	化学药	HZ001252
复方磷酸可待因口服溶液	化学药	HZ001267
复方麻黄碱色甘酸钠贴膜	化学药	HZ001313
复方麻黄碱糖浆	化学药	HZ001314
复方枇杷氯化铵糖浆	化学药	HZ001337
复方盐酸麻黄碱软膏	化学药	HZ001459
复方愈酚麻黄糖浆	化学药	HZ001482
甘草麻黄碱片	化学药	HZ001541
黄麻嗪胶丸	化学药	HZ001739
小儿复方麻黄碱桔梗糖浆	化学药	HZ003758
盐酸麻黄碱滴鼻液	化学药	HZ004165
盐酸麻黄碱片	化学药	HZ004166
盐酸麻黄碱糖浆	化学药	HZ004167
盐酸麻黄碱注射液	化学药	HZ004168
愈酚待因口服溶液	化学药	HZ004615
安嗽糖浆	中成药	ZC000061
白纸扇感冒颗粒	中成药	ZC000174
贝桔止咳糖浆	中成药	ZC000298
鼻炎滴剂	中成药	ZC000320
复方鼻炎膏	中成药	ZC001286
复方川贝精胶囊	中成药	ZC001297
复方川贝精片	中成药	ZC001298
甘桔止咳糖浆	中成药	ZC001665
桔远止咳片	中成药	ZC002649
咳立停糖浆	中成药	ZC003037
咳痰清糖浆	中成药	ZC003046
良园枇杷叶膏	中成药	ZC003237
芦根枇杷叶颗粒	中成药	ZC003384
祛痰平喘片	中成药	ZC004261
散痰宁糖浆	中成药	ZC004527
舒肺糖浆	中成药	ZC005148

续表

制剂名称	类别	序号
苏菲咳糖浆	中成药	ZC005356
痰咳清片	中成药	ZC005403
天一止咳糖浆	中成药	ZC005465
息喘丸	中成药	ZC005921
消咳宁片	中成药	ZC006067
小儿化痰止咳颗粒	中成药	ZC006219
小儿化痰止咳糖浆	中成药	ZC006220
苑叶止咳糖浆	中成药	ZC007138
镇咳宁胶囊	中成药	ZC007263
镇咳宁颗粒	中成药	ZC007264
镇咳宁口服液	中成药	ZC007265
镇咳宁糖浆	中成药	ZC007266
支气管炎片	中成药	ZC007301
止咳祛痰颗粒	中成药	ZC007343
止咳祛痰糖浆	中成药	ZC007344

HY002284 盐酸马尼地平

【其他名称】Calslot

【外文名称】Manidipine Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】本品对于动脉平滑肌细胞钙通道具有选择性阻滞作用，能扩张血管，降低外周血管阻力和动脉压，具有比尼卡地平、硝苯地平选择性高、降压作用强而持久，对心脏影响小等优点。本品在有效控制血压的同时对肾脏功能具有明显的保护作用。因此临床上可用于治疗各种高血压，尤其是伴有肾病的患者。

【药代动力学】口服易吸收，血药浓度峰时间 1～2 小时。在血浆中与蛋白结率为 97%。$t_{1/2}$约 5 小时。

【不良反应】偶见有肝功能或肾功能异常、白细胞减少等。

HY002285 盐酸马普替林

【其他名称】Aneural、路滴美、Ludiomil、吗丙啶、麦普替林

【外文名称】Maprotiline Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】*N* - 甲基 - 9,10 - 桥亚乙基蒽 - 9(10*H*) - 丙胺盐酸盐

【分子式】$C_{20}H_{23}N \cdot HCl$

【分子量】313.87

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，味苦。本品在甲醇或三氯甲烷中易溶，在水中微溶，在正庚烷中不溶。

熔点：本品的熔点为 238～242℃，熔距不得超过 2.5℃。熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】本品为四环类抗抑郁药。主要作用在于选择性抑制外周和中枢神经去甲肾上腺素再摄取，而对 5 - 羟色胺再摄取无影响。由于去甲肾上腺素再摄取减少，突触间隙中去甲肾上腺素浓度增高，使突触前膜 α_2 受体下调，后膜 α_1 受体作用加强，产生抗抑郁作用。本品兼有抗焦虑作用，镇静、抗胆碱、降低血压作用较轻。

【药代动力学】口服吸收缓慢。生物利用度为 65%，体内广泛分布，总清除率为 63.5L/h，蛋白结合率为 88%。口服后 8～16 小时血药浓度达峰值。半衰期为 27～58 小时，活性代谢产物半衰期为 60～90 小时。主要经肝脏代谢，大部分自尿中排出，其中原形物约 2%～4%，少部分由粪便排出。动物实验表明本品可泌入乳汁，其浓度与血液中浓度相当。

【药物相互作用】

1. 本品与抗组胺药合用，可加强抗胆碱能作用。

2. 西咪替丁可使本品的血药浓度增加。

3. 本品减弱或消除肾上腺素能抑制剂的降压作用，与可乐定、胍乙啶合用，可使后者的降压作用减弱。

4. 本品与甲状腺激素合用，可增加心律失常。

5. 本品与氟西汀合用，两者血药浓度均增高，不宜合用。

6. 加强利血平或甲基多巴的中枢镇静作用。

7. 勿与单胺氧化酶抑制剂同时使用。

8. 可加强某些拟交感神经药物如去甲肾上腺素、肾上腺素、苯丙胺、哌醋甲酯对心血管的作用。

9. 可加强酒精、中枢神经系统抑制剂、抗胆碱能神经药物和左旋多巴的作用。与苯二氮䓬类合用可加强其镇静作用。

10. 对肝脏单氧合酶系统有激活作用的药物如

巴比妥酸盐、苯妥英、卡马西平有加速本药代谢的作用。可导致苯妥英的血清浓度升高。与强的松、心得安合用可引起本药的血清浓度升高。

【药物过量】

1. 中毒症状：窒息、心跳加快、共济失调、呕吐、发绀、低血压、休克、不安、激动、高热、肌肉僵直、手足徐动、瞳孔散大、心律失常。严重者可见神志模糊，并有躁狂、心衰等。

2. 处理：洗胃，保持呼吸道通畅，采取增加排泄措施，并依病情进行相应对症治疗和支持疗法。

【不良反应】以口干、便秘、排尿困难、眩晕、视力模糊与心动过速等抗胆碱能症状为常见，程度较轻，多发生于服药的早期。中枢神经系统不良反应可出现嗜睡、失眠或激动，用药早期可能增加患者自杀的危险性。其他有皮疹，体位性低血压及心电图异常改变，以传导阻滞为主。偶见癫痫发作及中毒性肝损害。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸马普替林口服液	化学药	HZ004169
盐酸马普替林片	化学药	HZ004170
盐酸马普替林注射液	化学药	HZ004171

HY002286　盐酸吗啡

【外文名称】Morphine Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】17－甲基－3－羟基－4,5α－环氧－7，8－二脱氢吗啡喃－6α－醇盐酸盐三水合物

【分子式】$C_{17}H_{19}NO_3 \cdot HCl \cdot 3H_2O$

【分子量】375.85

【性状及组成】本品为白色、有丝光的针状结晶或结晶性粉末，无臭，遇光易变质。

本品在水中溶解，在乙醇中略溶，在三氯甲烷或乙醚中几乎不溶。

比旋度：取本品约1g，精密称定，置50ml量瓶中，加水适量使溶解后，用水稀释至刻度，依法测定，比旋度为－110.0°至－115.0°。

药物药理信息

【药理毒理】本品为纯粹的阿片受体激动剂，有强大的镇痛作用，同时也有明显的镇静作用，并有镇咳作用（因其可致成瘾而不用于临床）。对呼吸中枢有抑制作用，使其对二氧化碳张力的反应性降低，过量可致呼吸衰竭而死亡。本品兴奋平滑肌，增加肠道平滑肌张力引起便秘，并使胆道、输尿管、支气管平滑肌张力增加。可使外周血管扩张，尚有缩瞳、镇吐等作用（因其可致成瘾而不用于临床）。

阿片类药物的镇痛机制尚不完全清楚，实验证明采用离子导入吗啡于脊髓胶质区，可抑制伤害性刺激引起的背角神经元放电，但不影响其他感觉神经传递。按阿片受体激动后产生的不同效应分型，吗啡可激动μ、κ及δ型受体，故产生镇痛、呼吸抑制、欣快成瘾。阿片类药物可使神经末梢对乙酰胆碱、去甲肾上腺素、多巴胺及P物质等神经递质的释放减少，并可抑制腺苷酸环化酶，使神经细胞内的cAMP浓度减少，提示阿片类药物的作用与cAMP有一定关系。

急性毒性 LD_{50}（mg/kg）：大鼠口服905，皮下700，腹腔920，静脉237。

【药代动力学】本品口服后自胃肠道吸收，但经过肝脏时可迅速为肝微粒体酶代谢，故血药浓度不高。吸收后可分布至肺、肝、脾、肾等各组织。成人中仅有少量吗啡透过血、脑脊液屏障，但已能产生高效的镇痛作用。可通过胎盘到达胎儿体内。消除$t_{1/2}$为1.7～3小时，蛋白结合率26%～36%。一次给药镇痛作用维持4～6小时。本品主要在肝脏代谢，60%～70%在肝内与葡萄糖醛酸结合，10%脱甲基成去甲基吗啡，20%为游离型。主要经肾脏排出，少量经胆汁和乳汁排出。盐酸吗啡缓释片口服后由胃肠道黏膜吸收，与普通片剂相比，口服缓释片、控释片血药浓度达峰时间较长，一般为服后2～3小时，峰浓度也稍低，消除半衰期为3.5～5小时，在达稳态时血药浓度的波动较小，主要用于晚期癌症病人镇痛。

本品皮下和肌内注射吸收迅速，皮下注射30分钟后即可吸收60%，吸收后迅速分布至肺、肝、脾、肾等各组织。

【药物相互作用】

1. 与吩噻嗪类、镇静催眠药、单胺氧化酶抑制剂、三环抗抑郁药、抗组织胺药等合用，可加剧及延长吗啡的抑制作用。

2. 本品可增强香豆素类药物的抗凝血作用。

3. 与西咪替丁合用，可能引起呼吸暂停、精神错乱、肌肉抽搐等。

【药物过量】吗啡过量可致急性中毒，成人中毒量为60mg，致死量为250mg。对于重度癌痛病人，吗啡使用量可超过上述剂量（既不受药典中关于吗啡极量的限制）。

中毒解救：距口服4～6小时内应立即洗胃以排出胃中药物。采用人工呼吸、给氧、对症治疗、补

充液体促进排泄。静脉注射拮抗剂纳洛酮 0.005～0.01mg/kg，成人 0.4mg。亦可用烯丙吗啡作为拮抗药。

【不良反应】

1. 连用 3～5 天即产生耐药性，1 周以上可成瘾，但对于晚期中重度癌痛病人，如果治疗适当，少见依赖及成瘾现象。

2. 恶心、呕吐、呼吸抑制、嗜睡、眩晕、便秘、排尿困难、胆绞痛等。偶见瘙痒、荨麻疹、皮肤水肿等过敏反应。

3. 本品急性中毒的主要症状为昏迷，呼吸深度抑制、瞳孔极度缩小、两侧对称，或呈针尖样大，血压下降、发绀，尿少，体温下降，皮肤湿冷，肌无力，由于严重缺氧致休克、循环衰竭、瞳孔散大、死亡。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
吗啡阿托品注射液	化学药	HZ002613
盐酸吗啡缓释片	化学药	HZ004172
盐酸吗啡控释片	化学药	HZ004173
盐酸吗啡片	化学药	HZ004174
盐酸吗啡注射液	化学药	HZ004175

HY002287 盐酸吗啉胍

【其他名称】 ABOB、病毒灵、吗啉咪胍、Morpholinebiguanide、盐酸吗啉双胍

【外文名称】 Moroxydine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 化学药品地标升国标·第 7 册

药物理化信息

【化学名】 *N*－（胍基－亚氨代甲基）－吗啉的盐酸盐

【分子式】 $C_6H_{13}NO_5 \cdot HCl$

【分子量】 207.66

【性状及组成】 本品为白色结晶性粉末，无臭。

本品在水中易溶，在乙醚中微溶，在三氯甲烷中几乎不溶。

吸收系数：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中含盐酸吗啉胍 5μg 的溶液，照分光光度法测定，在 237nm 的波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为 773～821。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：抗病毒药。

本品是第一个用于抑制疱疹病毒 DNAP，为 DNA 链伸长终止剂。因其只中止病毒 HAV－DNA 链的延伸，阻断病毒复制，正常细胞不能使其转化为单磷酸化合物，故有选择性，毒性小。

对多种病毒（包括流感病毒、副流感病毒、鼻病毒、冠状病毒、腺病毒等）有抑制作用。用于流感、流行性腮腺炎、水痘、疱疹、滤泡性结膜炎等的防治，但疗效难予评价，故已少用。

【药物相互作用】

1. 抗组胺药，维生素 B_1、维生素 C 可增强本品的疗效，减轻不良反应。

2. 板蓝根与本品联用可提高疗效，两药联用有协同作用。

【不良反应】 可引起出汗及食欲减退等反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方吗啉胍片	化学药	HZ001316
盐酸吗啉胍滴眼液	化学药	HZ004176
盐酸吗啉胍片	化学药	HZ004177
盐酸吗啉胍注射液	化学药	HZ004178
感冒清胶囊	中成药	ZC001739
感冒清片	中成药	ZC001740
治感佳胶囊	中成药	ZC007417
治感佳片	中成药	ZC007418

HY002288 盐酸毛果芸香碱

【外文名称】 Pilocarpine Hydrochloride

药物管理信息

【特殊管理分类】 医疗用毒性药品

【分子式】 $C_{11}H_{16}N_2O_2 \cdot HCl$

【分子量】 244.72

药物药理信息

【药理毒理】 毛果芸香碱是拟胆碱药物，口服吸收后通过直接激动汗腺、唾液腺、泪腺、消化道和呼吸道腺体细胞 M－胆碱受体引起分泌增多，以汗腺、唾液腺最明显。本品亦可激动消化道平滑肌 M－胆碱受体而使胃肠蠕动和张力增加。也可使输尿管、膀胱等平滑肌兴奋。及分泌腺上的毒蕈碱受体而起作用。

毛果芸香碱是一种具有直接作用的拟胆碱药物，通过直接刺激位于瞳孔括约肌、睫状体及分泌腺上的毒蕈碱受体而起作用。毛果芸香碱通过收缩瞳孔括约肌，使周边虹膜离开房角前壁，开放房角，增加房水排出。同时本品还通过收缩睫状肌的纵行纤

维，增加巩膜突的张力，使小梁网间隙开放、房水引流阻力减小，增加房水排出，降低眼压。

【药代动力学】本品的角膜透性良好。动物实验显示，用2%本品对家兔单剂量滴眼，房水中的药物峰浓度出现在用药后的30分钟。用1%本品滴眼后，10～30分钟开始缩瞳，降眼压作用达峰时间约为75分钟。缩瞳持续时间为4～8小时。维持降眼压作用时间（与药物浓度有关）为4～14小时。

【药物相互作用】

1. 本品与β受体阻断剂、碳酸酐酶抑制剂、α和β肾上腺能受体激动剂或高渗脱水剂联合使用有协同作用。

2. 本品与拉坦前列素合用可降低葡萄膜巩膜途径房水流出的量，减低降眼压作用。

3. 与局部抗胆碱药物合用将干扰本品的降眼压作用。与适量的全身抗胆碱药物合用，因全身用药到达眼部的浓度很低，通常不影响本品的降眼压作用。

4. 与其他拟胆碱药或抗胆碱酯酶药（如新斯的明）合用，可增加本品作用，须调整本品剂量。局抗胆碱药物（如阿托品）可对抗本品药理作用。

【药物过量】药物过量可产生出汗、流涎、恶心、震颤、脉搏缓慢和血压下降。在哮喘患者可发生支气管缩窄。在中度药物过量时，可自行恢复，静脉补液可纠正脱水，有助于恢复。对严重的病例，阿托品是毛果芸香碱的拮抗药。

本品眼局部滴用过量时，可用温水将其从眼部冲洗掉。

【不良反应】口服可见流涎、出汗、胃肠道不适、腹痛等。

滴眼液眼刺痛，烧灼感，结膜充血引起睫状体痉挛，浅表角膜炎，颞侧或眼周头痛，诱发近视。眼部反应通常发生在治疗初期，并在治疗过程中消失。老年人和晶状体混浊的病人在照明不足的情况下会有视力减退。有使用缩瞳剂后视网膜脱离的罕见报道。长期使用本品可出现晶状体混浊。

局部用药后出现全身副性反应的情况罕见，但偶见特别敏感的患者，局部常规用药后出现流涎、出汗、胃肠道反应和支气管痉挛。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
马来酸噻吗洛尔毛果芸香碱滴眼液	化学药	HZ002595

HY002289　盐酸美加明

【外文名称】Mecamylamine Hydrochloride

【性状及组成】本品为结晶性粉末，无臭、微苦。溶于水或乙醇，几不溶于乙醚。

熔点：246℃（分解）。

药物药理信息

【药理毒理】阻断神经节N_1受体，从而阻断交感神经节的神经冲动传递，产生血管扩张、血压下降。用于重症高血压。

【药代动力学】本品口服吸收完全，分布于各组织，肝、肾中浓度高。药物能通过胎盘和血脑屏障。以原形在尿中缓慢排出，碱性尿时排出减少。

【不良反应】可有口干、便秘、尿贮留、直立性低血压、恶心、性功能障碍、眩晕、肌震颤、运动失调等。

HY002290　盐酸美金刚

【外文名称】Memantine Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】1－氨基－3,5－二甲基金刚烷胺盐酸盐

【分子式】$C_{12}H_{21}N\cdot HCl$

【分子量】215.77

药物药理信息

【药理毒理】越来越多的证据显示谷氨酸能神经递质功能障碍（尤其是NMDA受体功能损害时）会表现出神经退行性痴呆的临床症状和疾病进展。

美金刚是一种电压依赖性、中等程度亲和力的非竞争性NMDA受体拮抗剂。它可以阻断谷氨酸浓度病理性升高导致的神经元损伤。

在啮齿类动物和狗中进行的重复剂量的毒性试验中可观察到眼部的改变，但未得出一致的结论，对猴子进行的试验中未观察到上述结果。在美金刚的临床试验中进行的特定眼科检查未发现任何眼科病变。

标准剂量的美金刚试验中未观察到遗传毒性。在大鼠和小鼠中进行的终生研究未发现任何致癌的证据。在大鼠和家兔中，美金刚即使是在母体毒性剂量下也无致畸性，对生育能力也没有副作用。在大鼠中，当美金刚剂量相当于或略高于人体剂量时，可观察到胚胎发育的迟缓。

【药代动力学】美金刚的绝对生物利用度约为100%，t_{max}为3～8小时，食物不影响美金刚的吸收。在10～40mg剂量范围内的药代动力学呈线性。血浆

蛋白结合率为45%。

在人体内，约80%以原形存在。在人体内的主要代谢产物为 *N*－3，5－二甲基－葡萄糖醛酸苷、4－羟基美金刚和6－羟基美金刚的同分异构体混合物以及1－亚硝基－3，5－二甲基－金刚烷胺。这些代谢产物都不具有NMDA拮抗活性。在离体实验中未发现本品经细胞色素P450酶系统代谢。

在一项口服^{14}C－美金刚的研究中，平均84%的本品在20天内排出体外，99%以上经肾脏排泄。

本品的消除半衰期 $t_{1/2}$ 为60～100小时。在肾功能正常的志愿者中，总体清除率为170ml/min/1.73m^2，其中部分总体肾脏清除率是通过肾小管分泌来实现的。

肾小管还可重吸收美金刚，可能与阳离子转运蛋白的参与有关。在尿液呈碱性条件时，本品的肾脏清除率下降到1/7～1/9。而碱性尿液可见于饮食习惯骤然改变（如从肉食转为素食时）或摄入大量呈碱性的胃酸缓冲液时。

特殊患者人群：在肾功能正常或减退［肌酐清除率50～100ml/（min·1.73m^2）］的老年志愿者中，肌酐清除率与美金刚的总肾脏清除率显著相关。

还未研究肝脏疾病对美金刚药代动力学的影响。由于美金刚只有很小部分被代谢，且代谢产物不具有NMDA拮抗剂活性，因此当存在轻中度肝功能障碍时，美金刚的药代动力学特性不会发生具有临床意义的改变。

药代动力学/药效学关系：美金刚剂量为每日20mg时，脑脊液（CSF）中的美金刚浓度达到其ki值（ki为抑制常数），即在人体的额叶皮层为0.5mmol。

【药物相互作用】根据本品的药理作用和作用机制，可能有下列相互作用：

1．在合并使用NMDA拮抗剂时，左旋多巴，多巴胺受体激动剂和抗胆碱能药物的作用可能会增强，巴比妥类和神经阻滞剂的作用有可能减弱。美金刚与抗痉挛药物（如丹曲洛林或巴氯芬）合用时可以改变这些药物的作用效果，因此需要进行剂量调整。

2．因为美金刚与金刚烷胺在化学结构上都是NMDA拮抗剂，因此应避免合用，以免发生药物中毒性精神病。同样道理，也不应将美金刚与氯胺酮或右美沙芬合用。在已发表的一个报道中，美金刚与苯妥英合用可能风险增加。

3．由于其他药物（如西咪替丁、雷尼替丁、普鲁卡因酰胺、奎尼丁、奎宁以及尼古丁）与金刚烷胺共用相同的肾脏阳离子转运系统，因此也有可能与美金刚产生相互作用，导致血浆水平升高的潜在风险。

4．美金刚与氢氯噻嗪或任何一个含氢氯噻嗪的复方制剂合并应用时有可能使氢氯噻嗪的血清水平降低。

5．美金刚在离体条件下不抑制细胞色素酶（CYP1A2、2A6、2C9、2D6、2E1、3A）、环氧化物水解酶和硫酸化以及含单氧化酶的黄素的活性。

【药物过量】对症治疗。

【不良反应】本品的不良事件总发生率与安慰剂水平相当，且所发生的不良事件通常为轻中度。

本品的常见不良反应（发生率低于2%）有幻觉、意识混沌、头晕、头痛和疲倦。少见的不良反应（发生率为0.1～1%）有焦虑、肌张力增高、呕吐、膀胱炎和性欲增加。

根据自发报告，有癫痫发作的报告，多发生在有惊厥病史的患者。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸美金刚片	化学药	HZ004179

HY002291 盐酸美克洛嗪

【外文名称】Meclozine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】1－〔（4－氯苯基）苯甲基〕－4－〔（3－甲苯基）甲基〕－哌嗪二盐酸盐

【分子式】$C_{25}H_{27}ClN_2 \cdot 2HCl$

【分子量】463.88

【性状及组成】本品为淡黄色或黄色结晶性粉末，微臭，无味。本品在三氯甲烷中易溶，在乙醇中溶解，在水中极微溶，在乙醚中几乎不溶。

吸收系数：取本品，精密称定，加0.1mol/L盐酸溶液溶解并定量稀释制成每1ml中约含15μg的溶液，照紫外－可见分光光度法，在232nm的波长处测定吸光度，吸收系数为345～380。

药物药理信息

【药理毒理】本品为组胺受体的拮抗剂，可对抗组胺引起的降压效应、并对致死量组胺引起的动物死亡起保护作用。并有中枢抑制和局麻作用。抗晕动症和眩晕效应与其抗胆碱作用有关。

【药代动力学】口服后1小时起效，$t_{1/2}$为6小时，用药一次可维持药效8～24小时。

【药物相互作用】

1．本品可使乙醇、中枢抑制药和抗胆碱药的作用加强。

2．本品可拮抗阿朴吗啡的催吐作用。

【药物过量】过量可能引起精神错乱、抽搐、震颤、呼吸困难、低血压。如服用中毒量，可用生理盐水洗胃和导泻。抽搐时可静注地西泮控制。低血压者可使用血管收缩药对症治疗，其他包括给氧和静脉输液等支持疗法。

【不良反应】常见困倦，其他尚有视力模糊、乏力、口干等反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸美克洛嗪片	化学药	HZ004180

HY002292　盐酸美普他酚

【其他名称】甲氮草酚、Meptid、消痛定

【外文名称】Meptazinol Hydrochloride

药物理化信息

【分子式】$C_{15}H_{23}NO\cdot HCl$

【分子量】269.82

药物药理信息

【药理毒理】本品化学结构与吗啡相似，是阿片μ受体的激动剂，亦是μ受体的拮抗剂。为强效镇痛剂，对呼吸抑制作用较弱，产生抑制呼吸剂量为哌替啶的1.8倍。口服本品100mg对中、重度疼痛有良好镇痛作用，效果相当喷他佐辛25mg。

肌注本品100mg镇痛效果相当哌替啶100mg，喷他佐辛60mg。本品作用不易被纳洛酮拮抗。主要用于中等度疼痛，外伤、术后、产科疼痛及肾绞痛。

【药代动力学】口服、肌注及直肠给药吸收迅速、安全。口服有首过效应，95%经肝脏代谢。$t_{1/2}$为3.5～5小时，血浆蛋白结合率27%。可通过胎盘，并能迅速从新生儿体内消除。

注射后30～60分钟显效，持续约2小时。

【不良反应】

1．可产生较轻恶心、呕吐，呼吸抑制及精神紊乱等不良反应。

2．一般呼吸抑制发生率较低，但剂量过大可致呼吸抑制。

HY002293　盐酸美沙酮

【外文名称】Methadone Hydrochloride

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】4,4－二苯基－6－（二甲氨基）－3－庚酮盐酸盐

【分子式】$C_{21}H_{27}NO\cdot HCl$

【分子量】345.91

【性状及组成】本品为无色结晶或白色结晶性粉末，无臭。本品在乙醇或三氯甲烷中易溶，在水中溶解，在乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为230～234℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为阿片受体激动剂。主要作用于μ受体。其药理作用与吗啡相似，镇痛效能和持续时间也与吗啡相当。本品也能产生呼吸抑制、镇咳、降温、缩瞳的作用，镇静作用较弱，但重复给药仍可引起明显的镇静作用。其特点为口服有效，抑制吗啡成瘾者的戒断症状的作用期长，重复给药仍有效。耐受性及成瘾发生较慢，戒断症状略轻，但脱瘾较难。

急性毒性LD_{50}（mg/kg）：小鼠口服93.7，腹腔31～38.2，静脉17.3～20.9。大鼠口服95，腹腔24～40。

【药代动力学】本品口服吸收迅速，30分钟后即可在血中找到，约4小时内达高峰。血浆蛋白结合率87%～90%。主要分布在肝、肺、肾和脾脏。只有小部分进入脑组织。其生物利用度为90%，血浆$t_{1/2}$约为7.6小时，治疗血浓度为0.48～0.85mg/L，致死血浓度为74mg/L。主要在肝脏代谢，由尿排泄，少量原形从胆汁排泄。酸性尿液可增加其排泄。

本品皮下注射10分钟后即可出现在血浆中。血浆蛋白结合率87%～90%。主要分布在肝、肺、肾和脾脏。只有小部分进入脑组织。皮下或肌注后约1小时脑中达最高浓度。其生物利用度为90%，血浆$t_{1/2}$约为7.6小时，治疗血浓度为0.48～0.85mg/L，致死血浓度为74mg/L。主要在肝脏代谢，由尿排泄，少量原形从胆汁排泄。酸性尿液可增加其排泄。

【药物相互作用】

1．与碱性液、氧化剂、糖精钠以及苋菜红等接触，药液显混浊。

2．苯妥英钠和利福平等能促进肝细胞微粒体酶的活动增强，因而本品在体内的降解代谢加快，用量应相应增加。

【药物过量】用药过量时，可逐渐进入昏迷，并出现右束支传导阻滞，心动过速或（和）低血压。

【不良反应】

1．不良反应主要有性功能减退，男性服用后精液少，且可有乳腺增生。女性与避孕药同用，可终日迷倦乏力，逾量可逐渐进入昏迷，并出现右束支传导阻滞、心动过速或（和）低血压。

2. 亦有眩晕、恶心、呕吐、出汗、嗜睡等，也可引起便秘及药物依赖。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸美沙酮口服液	化学药	HZ004181
盐酸美沙酮片	化学药	HZ004182
盐酸美沙酮注射液	化学药	HZ004183

HY002294 盐酸美司坦

【其他名称】半胱氨酸甲酯、半胱甲酯、麦塞莱茵、盐酸半胱氨酸甲酯

【外文名称】Mecysteine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第16册

药物药理信息

【药理毒理】本品为黏液溶解性祛痰剂，有溶解痰液的作用，因其分子中的巯基（—SH）能使黏液中黏蛋白的—S—S－键断裂，使黏滞度迅速下降，从而使痰液易于咯出。

【药物相互作用】

1. 应避免同时服用强镇咳药，以免痰液堵塞气道。

2. 本品不宜与糜蛋白酶及酸性药物配合使用。

【不良反应】偶见轻度头晕、恶心、胃部不适。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸美司坦片	化学药	HZ004184

HY002295 盐酸美他环素

【外文名称】Metacycline Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】[4*S*－（4*α*，4a*α*，5*α*，5a*α*，12a*α*）]－6－亚甲基－4－（二甲氨基）－3,5,10,12,12*a*－五羟基－1,11－二氧代－2－并四苯甲酰胺盐酸盐

【分子式】$C_{22}H_{22}N_2O_8 \cdot HCl$

【分子量】478.89

【性状及组成】本品为黄色结晶性粉末，无臭，味苦。本品在水或甲醇中略溶，在三氯甲烷中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品属于四环素类抗生素。某些四环素或土霉素耐药的菌株对本品仍可敏感。许多立克次体属、支原体属、衣原体属、某些非典型分枝杆菌属、螺旋体对本品敏感，但肠球菌属对其耐药。其他如放线菌属、炭疽杆菌、单核细胞增多性李斯特菌、梭状芽孢杆菌、奴卡菌属、弧菌、布鲁菌属、弯曲杆菌、耶尔森菌等对本品敏感。本品对淋病奈瑟菌具一定抗菌活性，但耐青霉素的淋球菌对美他环素也耐药。多年来由于四环素类的广泛应用，临床常见病原菌对美他环素耐药现象严重，包括葡萄球菌等革兰阳性菌及多数肠杆菌科细菌耐药。本品与四环素类不同品种之间存在交叉耐药。本品作用机制为药物能与细菌核糖体30S亚基的A位置结合，抑制肽链的增长和影响细菌蛋白质的合成。

【药代动力学】口服可吸收，单剂口服500mg后血药峰浓度约为2mg/L，血消除半衰期16小时，蛋白结合率为80%，在体内分布较广。以原型自尿排泄约占给药量的50%，72小时内经粪便排泄者仅占5%。

【药物相互作用】

1. 与制酸药如碳酸氢钠同用时，由于胃内pH增高，可使本品吸收减少，活性减低，故服用本品后1～3小时内不应服用制酸药。

2. 含钙、镁、铁等金属离子的药物，可与本品形成不溶性络合物，使本品口服后吸收减少。

3. 与全麻药甲氧氟烷合用时，可增强其肾毒性。

4. 与强利尿药如呋塞米等药物合用时可加重肾功能损害。

5. 与其他肝毒性药物（如抗肿瘤化疗药物）合用时可加重肝损害。

6. 降血脂药考来烯胺或考来替泊可影响本品的吸收，必须间隔数小时分开服用。

7. 本品可降低避孕药效果，增加经期外出血的可能。

8. 本品可抑制血浆凝血酶原的活性，所以接受抗凝治疗的患者需要调整抗凝药的剂量。

【药物过量】本品无特异性拮抗药，药物过量时应予以催吐、洗胃及大量饮水、补液等对症治疗和支持治疗。

【不良反应】

1. 消化系统：胃肠道症状如恶心、呕吐、上腹不适、腹胀、腹泻，偶有胰腺炎等。偶有食管炎和食管溃疡的报道，多发生于服药后立即上床的患者。

2. 肝毒性：通常为脂肪肝变性，妊娠期妇女、原有肾功能损害的患者易发生，亦可发生于并无上述情况的患者。本品所致胰腺炎也可与肝毒性同时发生，患者并不伴有原发性肝病。

3．变态反应：多为斑丘疹和红斑，此外可见荨麻疹、血管神经性水肿、过敏性紫癜、心包炎以及系统性红斑狼疮皮损加重，表皮剥脱性皮炎并不常见。偶有过敏性休克和哮喘发生。某些用本品的患者日晒时可能有光敏现象。所以，建议患者不要直接暴露于阳光或紫外线下，一旦皮肤有红斑应立即停药。

4．血液系统：偶可引起溶血性贫血、血小板减少、中性粒细胞减少和嗜酸粒细胞减少。

5．中枢神经系统：偶可致良性颅内压增高，可表现为头痛、呕吐、视神经乳头水肿等。

6．肾毒性：原有显著肾功能损害的患者可能发生氮质血症、高磷酸血症和酸中毒。

7．二重感染：长期应用本品可诱发耐药金葡菌、革兰阴性杆菌和真菌等引起的二重感染，严重者可致败血症。

8．本品的应用可使人体内正常菌群减少，导致维生素缺乏，真菌繁殖，出现口干、咽炎、口角炎、舌炎等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸美他环素胶囊	化学药	HZ004185
盐酸美他环素片	化学药	HZ004186

HY002296　盐酸美西律

【其他名称】慢心律

【外文名称】Mexiletine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】1－（2,6－二甲基苯氧基）－2－丙胺盐酸盐

【分子式】$C_{11}H_{17}NO \cdot HCl$

【分子量】215.72

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，几乎无臭，味苦。

本品在水或乙醇中易溶，在乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 200～204 ℃。

药物药理信息

【药理毒理】属 Ib 类抗心律失常药，可以抑制心肌细胞钠内流，降低动作电位 0 相除极速度，缩短浦氏纤维的有效不应期。在心脏传导系统正常的病人中，美西律对心脏冲动的产生和传导作用不大，临床试验中未发现美西律引起Ⅱ°或Ⅲ°房室传导阻滞。美西律不延长心室除极和复极时程，因此可用于 Q－T 间期延长的室性心律失常。该药具有抗心律失常、抗惊厥及局部麻醉作用。对心肌的抑制作用较小。美西律的有效血药浓度 0.5～2μg/ml，中毒血药浓度与有效血药浓度相近，为 2μg/ml 以上。少数患者在有效血药浓度时即可出现严重不良反应。

【药代动力学】美西律口服后在胃肠道吸收良好。生物利用度为 80%～90%，急性心肌梗死者吸收较低。口服后 30 分钟作用开始，约持续 8 小时，2～3 小时达到血药峰浓度。口服 200mg 的血药峰值为 0.3μg/ml，口服 400mg 时约为 1.0μg/ml。2～3 小时达到血药峰浓度。在体内分布广泛，表观分布容积为 5～7L/kg，有或无心力衰竭者相似。血液红细胞内的浓度比血浆中高 15%。正常人血浆清除半衰期为 10～12 小时。长期服药者为 13 小时，急性心肌梗死者为 17 小时。肝功能受损者半衰期也可延长。血浆蛋白结合率为 50%～60%。美西律在肝脏代谢成多种产物，药理活性很小。约 10%经肾排出。尿 pH 不影响药物清除，尿 pH 显著异常可以减慢药物清除速度：酸性尿加快其清除速度，碱性尿减慢其清除速度。

【药物相互作用】

1．有临床试验报道美西律与常用的抗心绞痛、抗高血压和抗纤溶药物合用未见相互影响。

2．美西律与奎尼丁、普萘洛尔或胺碘酮合用治疗效果更好。可用于单用一种药物无效的顽固室性心律失常。但不宜与 Ib 类药物合用。

3．如果苯妥英钠或其他肝酶诱导剂如利福平和苯巴比妥等与美西律合用，可以降低美西律的血药浓度。

4．有报道苯二氮䓬类药物不影响美西律的血药浓度。

5．美西律和地高辛、利尿剂和普萘洛尔合用不影响心电图 PR、QRS 和 QT 间期。

6．在急性心肌梗死早期，吗啡使本品吸收延迟并减少，可能与胃排空延迟有关。

7．制酸药可减低口服本品时的血药浓度，但也可因尿 pH 增高，血药浓度升高。

【药物过量】过量时心电图可产生 P－R 间期延长及 QRS 波增宽，门冬氨酸氨基转移酶增高，偶有抗核抗体阳性。有报道服 4400mg 美西律可导致死亡。药物应用过量的表现包括恶心、低血压、窦性心动过缓、感觉异常、癫痫发作、间歇性左束支传导阻滞和心跳骤停。

【不良反应】约 20%～30%患者口服发生不良反应。

1．胃肠反应：最常见。包括恶心、呕吐等，有肝功能异常的报道，包括 AST 增高。

2. 神经：为第二位常见不良反应。包括头晕、震颤（最先出现手细颤）、共济失调、眼球震颤、嗜睡、昏迷及惊厥、复视、视物模糊、精神失常、失眠。

3. 心血管：窦性心动过缓及窦性停博一般较少发生。偶见胸痛，促心律失常作用如室性心动过速，低血压及心力衰竭加剧。治疗包括停药、用阿托品、升压药、起搏器等。

4. 过敏反应：皮疹。

5. 极个别有白细胞及血小板减少。

静注可有恶心、呕吐、嗜睡。心动过缓、低血压、震颤、头痛、眩晕等，大剂量可引起低血压、心动过缓、传导阻滞等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸美西律胶囊	化学药	HZ004187
盐酸美西律片	化学药	HZ004188
盐酸美西律注射液	化学药	HZ004189

HY002297 盐酸咪达普利

【其他名称】依米普利

【外文名称】Imidapril Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理：本品为血管紧张素转换酶（ACE）抑制剂。口服后，在体内转换成活性代谢物咪达普利拉，后者可抑制 ACE 的活性，阻止血管紧张素Ⅰ转换成血管紧张素Ⅱ，使外周血管舒张，降低血管阻力，产生降压作用。

2. 毒理（致癌、致突变和生殖毒性）：大鼠和小鼠分别长期口服本品（一日 10mg/kg 和每日 30mg/kg）18 个月和 4 个月，均未发现有致癌作用。

细菌的逆转变异试验、小鼠微核试验、染色体畸变和基因突变试验均未见致突变作用。

大鼠和家兔的生殖毒性研究未见致畸和致死作用。

【药代动力学】健康成年男子口服 10mg，约 6～8 小时血浆中活性代谢物咪达普利拉的浓度达峰值（15ng/ml），消除半衰期为 8 小时，24 小时尿中总排泄率为服用剂量的 25.5%。健康成人每次口服 10mg，连续服用 7 天，血浆中咪达普利拉的浓度在 3～5 天后达稳态，未见有体内蓄积；但肾功能障碍患者的血浆浓度与健康成年人比较，可见半衰期延长和血药峰浓度增大。

【药物相互作用】

1. 本品与保钾利尿剂（螺内酯、氨苯蝶啶等）或补钾制剂（氯化钾等）合用可使血清钾浓度升高。

2. 本品与锂制剂（碳酸锂）合用可能引起锂中毒。

3. 使用利尿剂（三氯甲噻嗪、双氢氯噻嗪等）治疗的患者，初次服用本品会使降压效果增强。

4. 与非甾体抗炎药物（吲哚美辛）合用则使本品降压作用减弱

5. 其他有降压作用的药物（降压药、硝酸类制剂等）也可增强本品的降压作用。

【药物过量】现有的文献表明，药物过量能够导致过度的外周血管扩张，继发或延长体循环低血压状态，表现为低血压、头晕、头痛、疲劳、嗜睡，严重者出现休克或死亡。轻者置患者于卧位，血压低者给予补液、升压治疗；显著的低血压反应的患者，应及时在心肺监测的同时，给予积极的心血管支持治疗。

【不良反应】本品不良反应大多轻微，主要有咳嗽（4.5%）、咽部不适（0.5%）、头晕（0.2%）、体位性低血压（0.2%）、皮疹（0.1%）等。偶有伴呼吸困难的面、舌、咽喉部血管神经性水肿、严重血小板减少、肾功能不全恶化、或肝氨基转移酶升高。有报道血管紧张素转换酶抑制剂可引起各种血细胞减少。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸咪达普利片	化学药	HZ004190

HY002298 盐酸米安色林

【外文名称】Mianserin Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 57 册

药物理化信息

【化学名】1,2,3,4,10,14*b*－六氢－2－甲基二苯并［*c*，*f*］吡嗪［1,2－*a*］氮杂盐酸盐

【分子式】$C_{18}H_2ON_2 \cdot HCl$

【分子量】300.83

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭或几乎无臭，味微苦。

本品在三氯甲烷中溶解，在水中略溶，在乙醇中微溶，在 0.1mol/L 氢氧化钠溶液中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗抑郁药。

盐酸米安色林在化学结构上是一个非三环类抗抑郁药，它的活性成分属于哌嗪－氮䓬化合物。由于其化学结构中没有三环类抗抑郁药的基本侧链，这一侧链被认为是与三环类抗抑郁药的抗胆碱能作用有关。因此，盐酸米安色林没有抗胆碱能的不良反应。盐酸米安色林抗抑郁效果与当前所使用的其他抗抑郁药相似，但它兼有抗焦虑的作用。

【药物相互作用】

1．盐酸米安色林能加剧乙醇对中枢的抑制作用，故应劝说病人在治疗期间禁酒。

2．盐酸米安色林不应与单胺氧化酶抑制剂同时服用，停用单胺氧化酶抑制剂两周之内也不应服用本药。

3．盐酸米安色林与苄二甲哌、氯压定、甲基多巴、哌乙啶或心得安（单独使用或与肼苯吡嗪合用）均无相互作用，但是建议监测同时服用降压药病人的血压。

盐酸米安色林不拮抗拟交感神经药物，不拮抗高血压药物（苄二甲哌）或 α－受体阻滞剂（如氯压定、甲基多巴），也不影响香豆素抗凝剂，如苯丙香豆素的作用。

【药物过量】急性超剂量症状仅限于过度镇静。不太可能发生心律不齐，癫痫发作，严重低血压和呼吸抑制。迄今无特效解救药。可采用洗胃及适当的对症和支持疗法，以维持生命功能。

【不良反应】盐酸米安色林具有良好的耐受性，特别是对老年患者和心血管病患者。

盐酸米安色林在治疗剂量时，没有抗胆碱能作用，也不产生明显的心血管系统反应。与三环类抗抑郁药相比较，即使服用超剂量盐酸米安色林，也甚少有对心脏有毒性不良反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸米安色林片	化学药	HZ004192

HY002299　盐酸米多君

【其他名称】管通、甲氧胺福林

【外文名称】Midodrine Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】本品的药物原形无活性。口服给药后，在血液中经氨基乙酸酶水解后转化为活性代谢物脱甘氨酸米多君。脱甘氨酸米多君为选择性外周交感神经 α_1 受体激动剂，直接作用于突触后，释放肾上腺素兴奋剂。本品具有血管张力调节功能，对直立性血压调节异常的患者可增加外周动、静脉阻力，还能防止下肢大量血液淤积，促进血液回流，使血容量保持稳定，从而提高患者直立位血压，改善循环容量不足而引起的症状（如晨起精神不振、乏力、头晕、眼花等），本品不会引起中枢神经系统兴奋性增高；对心脏也无直接作用，但用药后由于反馈作用，心率可能下降。

【临床评价】国外资料报道，米多君能增加立位血压，改善其伴随的诸如乏力、晕用、视力模糊和疲劳症状。①临床对照研究：2项双盲对照研究应用随机交叉设计，研究比较了米多君与安慰剂、米多君与对照药物（麻黄碱或氟氢化可的松）的疗效。研究中主要疗效评价标准为立位血压的增加和无晕厥或晕厥前症状以及血压的增加和同氟氢化可的松相比较的综合临床疗效，安慰剂对照研究显示，米多君明显改善了患者的直立能力以及立位血压，治疗前不能站立的患者为10.7%，米多君治疗后不能站立的仅为5.3%，症状改善具有统计学意义。

【药代动力学】口服生物利用度为93%，米多君 C_{max} 为 10～50μg/L，t_{max} 为 20～40 分钟。脱甘氨酸米多君 Cmax 为 4.7～27μg/L，t_{max} 为 60 分钟。米多君的 $t_{1/2}$ 为 30 分钟，脱甘氨酸米多君的 $t_{1/2}$ 为 3 小时。本品的代谢发生在小肠壁，代谢相当完全，仅有 2%～4%以原形排泄，主要经尿排泄（米多君 82%，脱甘氨酸米多君 77%）。

【不良反应】个别病例在服药后可出现心跳异常、心区疼痛和皮肤反应。大剂量用药后皮肤可能出现竖毛反应（即起鸡皮疙瘩，尤其在头、颈部），自觉寒冷及尿潴留，脉搏可能降到 60 次/分钟以下。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸米多君片	化学药	HZ004193

HY002300　盐酸米诺环素

【其他名称】二甲胺四环素、Minomycin、美满霉素、米诺四环素、Ultramycin

【外文名称】Minocycline Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】［4*S*－（4*a*，4a*a*，5a*a*，12a*a*）］－4,7－双－（二甲氨基）－1,4,4*a*，5,5*a*,6,11,12*a*－八氢－3,10,12,12*a*－四羟基－1,11－二氧代－2－并四苯甲酰胺盐酸盐

【分子式】$C_{23}H_{27}N_3O_7 \cdot HCl$

【分子量】493.94

【性状及组成】本品为黄色结晶性粉末，无臭，味苦，有引湿性。

本品在甲醇中溶解，在水中略溶，在乙醇中微溶，在乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理：本品为半合成四环素类广谱抗生素，具高效和长效性，在四环素类抗生素中，本品的抗菌作用最强。抗菌谱与四环素相近。对革兰阳性菌包括耐四环素的金黄色葡萄球菌、链球菌等和革兰阴性菌中的淋病耐瑟菌均有很强的作用；对革兰阴性杆菌的作用一般较弱；本品对沙眼衣原体和溶脲支原体亦有较好的抑制作用。近年来由于滥用四环素类抗生素，现大多数常见革兰阳性和阴性菌均对本品耐药。

本品的作用机制是与核糖体 30S 亚基的 A 位置结合，阻止肽链的延长，从而抑制细菌或其他病原微生物的蛋白质合成。本品系抑菌药，但在高浓度时，也具有杀菌作用。

2. 毒理：本品能导致实验动物（大鼠、狗和猴）的甲状腺变为黑色。大鼠给予本品进行慢性治疗，结果导致甲状腺肿，甚至甲状腺瘤。本品亦能导致大鼠和狗的甲状腺增生。

【药代动力学】本品口服后迅速被吸收，食物对本品的吸收无明显影响。口服本品 0.2g，1～4 小时内（平均 2.1 小时）达血药峰浓度（C_{max}），为 2.1～5.1mg/L。本品脂溶性较高，易渗透入许多组织和体液中，如甲状腺、肺、脑和前列腺等，本品在胆汁和尿中的浓度比血药浓度高 10～30 倍，在唾液和泪液中的浓度比其他四环素类抗生素高。血清蛋白结合率为 76%～83%。在体内代谢较多，在尿中排泄的原形药物远低于其他四环素类。本品排泄缓慢，大部分由肾和胆汁排出。血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为 11.1～22.1 小时（平均 15.5 小时）。

【药物相互作用】

1. 由于本品能降低凝血酶原的活性，故本品与抗凝血药合用时，应降低抗凝血药的剂量。

2. 由于制酸药（如碳酸氢钠）可使本品的吸收减少、活性降低，故本品与制酸药应避免同时服用。

3. 本品与含铝、钙、镁、铁离子的药物合用时，可形成不溶性络合物，使本品的吸收减少。

4. 降血脂药物考来烯胺或考来替泊与本品合用时，可能影响本品的吸收。

5. 由于巴比妥类、苯妥英或卡马西平可诱导微粒体酶的活性致使本品血药浓度降低，故合用时须调整本品的剂量。

6. 全麻药甲氧氟烷和本品合用可导致致命性的肾毒性。

7. 由于本品能干扰青霉素的杀菌活性，所以应避免本品与青霉素类合用。

8. 本品与强利尿药（如呋塞米等）合用可加重肾损害。

9. 本品与其他肝毒性药物（如抗肿瘤化疗药物）合用可加重肝损害。

10. 本品和口服避孕药合用，能降低口服避孕药的效果。

【不良反应】

1. 菌群失调：本品引起菌群失调较为多见。轻者引起维生素缺乏，也常可见到由于白色念珠菌和其他耐药菌所引起的二重感染。亦可发生难辨梭菌性假膜性肠炎。

2. 消化道反应：食欲减退、恶心、呕吐、腹痛、腹泻、口腔炎、舌炎、肛门周围炎等，偶可发生食管溃疡。

3. 肝损害：偶见恶心、呕吐、黄疸、脂肪肝、血清氨基转移酶升高、呕血和便血等，严重者可昏迷而死亡。

4. 肾损害：可加重肾功能不全者的肾损害，导致血尿素氮和肌酐值升高。

5. 影响牙齿和骨发育：本品可沉积于牙齿和骨中，造成牙齿黄染，并影响胎儿、新生儿和婴幼儿骨骼的正常发育。

6. 过敏反应：主要表现为皮疹、荨麻疹、药物热、光敏性皮炎和哮喘等。罕见全身性红斑狼疮，若出现，应立即停药并作适当处理。

7. 可见眩晕、耳鸣、共济失调伴恶心、呕吐等前庭功能紊乱（呈剂量依耐性，女性比男性多见），常发生于最初几次剂量时，一般停药 24～48 小时后可恢复。

8. 血液系统：偶有溶血性贫血、血小板减少、中性粒细胞减少、嗜酸性粒细胞增多等。

9. 维生素缺乏症：偶有维生素 K 缺乏症状（低凝血酶原症、出血倾向等）、维生素 B 族缺乏症状（舌炎、口腔炎、食欲减退、神经炎等）等。

10. 颅内压升高：偶见呕吐、头痛、复视、视神经乳头水肿、前囟膨隆等颅内压升高症状，应立即停药。

11. 休克：偶有休克现象发生，须注意观察，如发现有不适感、口内异常感、哮喘、便意、耳鸣等症状时，应立即停药，并作适当处理。

12. 皮肤：斑丘疹、红斑样皮疹等；偶见剥脱性皮炎、混合性药疹、多形性红斑和 Steven－Johnson 综合征。长期服用本品，偶有指甲、皮肤、黏膜处色素沉着现象发生。

13. 其他：偶有头晕、倦怠感等。长期服用本品，可使甲状腺变为棕黑色，甲状腺功能异常少见。罕见听力受损。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸米诺环素胶囊	化学药	HZ004194
盐酸米诺环素片	化学药	HZ004196

HY002301　盐酸米托蒽醌

【外文名称】Mitoxantrone Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】1,4－二羟基－5,8－双［［2－［（2－羟乙基）氨基］乙基］氨基］－9,10－蒽醌二盐酸盐

【分子式】$C_{22}H_{28}N_4O_6 \cdot 2HCl$

【分子量】517.41

【性状及组成】本品为蓝黑色结晶性粉末，无臭，有引湿性。本品在水中溶解，在乙醇中微溶，在三氯甲烷中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】通过和 DNA 分子结合，抑制核酸合成而导致细胞死亡。本品为细胞周期非特异性药物。本品与蒽环类药物没有完全交叉耐药性。

【药代动力学】本品静脉滴注后，血药浓度下降很快，并迅速分布于各组织中，消除缓慢，主要通过胆汁由粪便排泄。用药后 5 天中，由粪便排出约 21%，尿排出约 6.5%。排出物主要为原形药，亦有代谢产物。

【不良反应】

1. 骨髓抑制，引起白细胞和血小板减少，为剂量限制性毒性；

2. 少数患者可能有心悸、早搏及心电图异常；

3. 可有恶心、呕吐、食欲减退、腹泻等消化道反应；

4. 偶见乏力、脱发、皮疹、口腔炎等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸米托蒽醌氯化钠注射液	化学药	HZ004197
盐酸米托蒽醌葡萄糖注射液	化学药	HZ004198
盐酸米托蒽醌注射液	化学药	HZ004199
注射用盐酸米托蒽醌	化学药	HZ005088

HY002302　盐酸嘧啶亚硝脲

【其他名称】尼莫司汀

【外文名称】Nimustine HCl

药物药理信息

【药理毒理】本品为亚硝脲类药物，具有烷化作用，能抑制 DNA 和 RNA 的合成。可通过血脑屏障。动物实验表明，静注后迅速分布全身，有 7%～16% 进入脑脊液，最高可达 30%。

急性 LD_{50}：雄性小鼠、大鼠（口服）105.5 和 145.2mg/kg，皮下 81.7 和 66.1mg/kg，腹腔 53.7 和 65.0mg/kg，静脉 65.0 和 47.8mg/kg。

抗肿瘤作用：①对小鼠白血病 L1210 显示抗肿瘤活性很高；②对小鼠移植肿瘤抗肿瘤谱很广。对淋巴细胞白血病 L1210、粒细胞白血病 C－1498、浆细胞瘤 X－5563（腹水型）、欧利希腹水癌、腹水型乳癌 MM－102、腹水型乳癌 FM3A43、浆细胞瘤 X－5563（实体）、欧利希实体癌、硬膜肉瘤 MS－147 显示显著效果；③本品对淋巴细胞白血病 L1210 及甲基胆蒽诱发恶性神经胶质瘤细胞的脑内移植小鼠，有延长寿命效果。

主要作用机制是使细胞内 DNA 烷化而使 DNA 低分子化，抑制 DNA 合成。

【药代动力学】给 14 例脑肿瘤病人静注本剂 1.72～2.50mg/kg，用药 5 分钟后始分布于脑脊液（脑室），用药 30 分钟后脑脊液中浓度达高峰（平均 0.59mg/L），半衰期 0.49 小时，其后渐减。给本品 5 分钟后血中浓度平均值为 3.86mg/L，其后急速下降，但 60 分钟后依然保持 1.0mg/L 浓度（$t_{1/2\alpha}$ = 1.3 分钟，$t_{1/2\beta}$ = 35 分钟）。另外，从分布容量的探讨判明高浓度分布于组织内。

【不良反应】在 286 个医院应用本品总病例 1970 例中，不良反应为 1208 例（61.3%）。本品不良反应与其他亚硝脲类抗恶性肿瘤药相同，其中白细胞减少（31.5%）、血小板减少（30.0%）等造血系统障碍最多，其次为食欲减退（12.5%）、恶心（8.9%）、欲吐（7.9%）、呕吐（13.4%）等消化道症状。另外，可有乏力、发热、皮疹、脱发，AST 及 ALT 上升分别为 3.55% 和 3.50%。造血系统障碍的恢复，随用药次数的增加而有迟缓倾向。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸尼莫司汀	化学药	HZ005093

HY002303 盐酸莫雷西嗪

【其他名称】乙吗噻嗪

【外文名称】Moricizine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】10 - （3 - 吗啉丙酰基）- 吩噻嗪 - 2 - 氨基甲酸乙酯盐酸盐

【分子式】$C_{22}H_{25}N_3O_4S \cdot HCl$

【分子量】463.98

【性状及组成】本品为白色或类白色的粉末。

本品在甲醇中易溶，在水或乙醇中溶解，在丙酮中微溶，在乙酸乙酯中不溶，在冰醋酸中易溶。

吸收系数：取本品适量，精密称定，加乙醇 - 水（1:1）溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 0.1mg 的溶液；精密量取适量，加水稀释成每 1ml 中约含 10μg 的溶液，照紫外 - 可见分光光度法（附录ⅣA），在 268nm 处测定吸光度，按干燥品计算，吸收系数（$E^{1\%}_{1cm}$）为 360 ~ 375。

药物药理信息

【药理毒理】本品对大鼠、狗等动物多种心律失常模型具有显著的抗快速性心律失常作用，其作用与奎尼丁相似，对呼吸、血压、心率及心肌收缩力无明显影响。本品还具有扩张冠状血管，解痉和抗 M - 胆碱能作用。

本品属 1 类抗心律失常药，具体分类尚有不同意见。它可抑制快 Na^+ 内流，具有膜稳定作用，缩短 2 相和 3 相复极及动作电位时间，缩短有效不应期。对窦房结自律性影响很小，但可延长房室及希浦系统的传导。本品血流动力学作用轻微，在严重器质性心脏病患者可使心衰加重。

本品对小鼠灌胃给药 LD_{50} 为 282mg/kg，对大鼠和狗的长期（3 ~ 6 个月）毒性试验表明，本品毒性低，对主要脏器无明显损伤，无致畸，致突变作用。

【药代动力学】本品对大鼠灌胃给经吸收较快，一小时后血药浓度达高峰，吸收达 75%，半衰期为 1 ~ 1.7 小时，分布于肝、肾、脑等部位。人口服本品经胃肠道吸收，给药 1 ~ 3 小时后血药浓度达高峰。

口服生物利用度 38%，饭后 30 分钟服用影响吸收速度，使峰浓度下降，但不影响吸收量。表观分布容积 > 300L/kg。蛋白结合率约 95%，约 60% 经肝脏生物转化，至少有 2 种代谢产物具药理活性，半衰期为 1.5 ~ 3.5 小时。口服后 0.5 ~ 2 小时血药浓度达峰值，抗心律失常作用与血药浓度的高低和时程无关。服用剂量的 56% 从粪便排出。

【药物相互作用】

1. 西咪替丁可使本品血药浓度增加 1.4 倍，同时应用时本品应减少剂量。

2. 本品可使茶碱类药物清除增加，半衰期缩短。

3. 其与华法林共用时可改变后者对凝血酶原时间的作用。在华法林稳定抗凝的病人开始用本品或停用本品时应进行监测。

【药物过量】恶心、嗜睡、昏迷、晕厥、低血压状态、心衰恶化、心肌梗死、窦性停博、心律失常（包括结性心动过缓、室性心律失常、室颤、心脏停博）和呼吸衰竭。莫雷西嗪用量超过 2250 和 10000mg 有致死报道。

【不良反应】有头晕、恶心、头痛、乏力、嗜睡、腹痛、消化不良、呕吐、出汗、感觉异常、口干、复视等。致心律失常作用的发生率约 3.7%。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸莫雷西嗪片	化学药	HZ004200

HY002304 盐酸莫普洛尔

【其他名称】甲氧苯心安、Levotensin、Omeral、心乐宁、愈酸心安

【外文名称】Moprolol Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】本品含左旋体和右旋体各半，仅前者具有 β 受体阻断作用，无内在拟交感活性。β 受体阻断作用似普萘洛尔但略强，膜稳定作用为普萘尔的三分之一。用于高血压。

【不良反应】可见乏力、嗜睡、头晕、失眠、恶心、腹胀、皮疹、晕厥、低血压、心动过缓等。

HY002305 盐酸莫索尼定

【外文名称】Moxonidine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 34 册

药物理化信息

【化学名】4 - 氯 - 5 - （2 - 咪唑啉 - 2 - 氨基）- 6 - 甲氧基 - 2 - 甲基嘧啶盐酸盐

【分子式】$C_9H_{12}N_5OCl \cdot HCl \cdot H_2O$

【分子量】296.16

药物药理信息

【药理毒理】莫索尼定是新型的中枢降压药，它是一种对咪唑啉 I_1 受体具有高度亲和力的选择性激动剂。根据不同的种属、组织和所用的配体，本品对咪唑啉 I_1 受体的选择性比对 α_2 肾上腺素受体的选择性可高达 600 倍，在体内与中枢咪唑啉 I_1 受体的结合明显与血压下降程度有关。动物实验时用一种对咪唑啉受体位点有亲和力的 α_2 肾上腺素受体拮抗剂预处理后，可抵消本品引起的血压下降。

体外本品是一种 α_2 肾上腺素受体选择性激动剂，比对 α_1 肾上腺素受体结合强达 288 倍。本品的降压作用与 α_2 肾上腺素受体结合无明显关系。

小鼠药理实验显示：本品可减少自主活动次数，协同戊巴比妥促进小鼠睡眠，抑制中枢神经系统活动；它在降压同时减慢心率，但对心电和呼吸频率及深度无明显影响。

大鼠的毒性实验显示：随所用剂量的增加，会出现松毛、少动和体重增长缓慢等一般药物反应；尿液检查异常；肝酶的升高；病理组织学异常主要见于肾脏和心脏。停药 4 周以后大部分异常指标可恢复。

小鼠的毒性实验显示：一次灌胃 LD_{50}（半数致死量）为 190mg/kg；一次静脉注射 LD_{50} 为 37mg/kg；对死亡小鼠组织学检查发现除左心室扩张和肺血管扩张充血外，其余脏器无明显变化。

【药代动力学】本品口服吸收较快，0.3～1 小时血药浓度达峰值，生物利用度约为 88%。本品没有首过效应，58%～60% 的原形化合物经肾脏排泄，只有小于 2% 的药物经粪便排泄。小于 15% 的药物在体内代谢，主要产物为 4，5－脱氧莫索尼定和胍基衍生物，口服 $t_{1/2}$（消除半衰期）为 2 小时左右。食物摄入不影响本品的药代动力学。

【药物相互作用】

1．与 β 阻断剂合用时，开始时即产生降压，然后有较强的反跳现象出现。

2．与其他降压药合用可增强本品的降压效果。

3．与苄唑啉合用时，能削弱本品的降压作用。

4．与酒精、镇静药或麻醉药合用时，能增强其降压效果。

【药物过量】发生严重低血压可抬高下肢，补充血容量，如果无效，可缓慢静脉注射缩血管药物，不断监测血压变化。

【不良反应】治疗开始时可出现口干、疲乏和头痛等症状；偶见头晕、失眠和下肢无力感等。极少产生胃肠道不适，个别有皮肤过敏反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸莫索尼定胶囊	化学药	HZ004201
盐酸莫索尼定片	化学药	HZ004202

HY002306　盐酸莫西赛利

【其他名称】百里胺、百利胺、Moxyl、Opilon、Thymoxamine、Vasoklin

【外文名称】Moxisylyte Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】本品能选择性地作用于椎动脉、颈内动脉及脑皮质的微小血管，阻滞突触后 α_1 肾上腺素受体，扩张脑血管，增加脑血流量。促进脑组织代谢，特别对脑组织缺血区具有保护作用，其机制与促进脑缺血灶线粒体呼吸功能有关。此外，本品具有抗血栓形成作用，能抑制血小板聚集并生成前列腺素。

本品对血压影响很小。

临床用于脑血管及外周血管痉挛性疾病，改善脑梗死或脑出血后遗症的各种症状。

【药代动力学】健康受试者口服本品后，血药浓度约 1 小时达峰值，消除半减期为 67 分钟。本品口服后在肝脏分布最高，其次为心、脾、脑及肌肉。大部分经尿排泄，其余从粪排泄，连续用药未发现有体内蓄积。

【药物相互作用】本品与 β 肾上腺素能药物如异丙肾上腺素、奥西那林、沙丁胺醇合用，能增强这些药物的药效，引起支气管扩张。与抗高血压药合用，可增强降压药的药效。

用药期间应避免用镇静药、乙醇或抗抑郁药。

【不良反应】少数患者用药后出现血清转氨酶升高，偶见胃部不适、食欲减退、恶心、腹痛、便秘或腹泻，另外如头痛、头重、困倦思睡、眩晕、心悸、四肢发麻、皮肤瘙痒及血压下降等也偶可发生。上述不良反应停药后即可自行消失。

HY002307　盐酸莫西沙星

【外文名称】Moxifloxacin Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】1－环丙基－7－（*S*，*S*－2，8－重氮－二环［4.3.0］壬烷－8－基）－6－氟－8－甲氧－1,4－二氢－4－氧－3－喹啉羧酸氢氯化物

【分子式】$C_{21}H_{24}FN_3O_4 \cdot HCl$

【分子量】437.90

药物药理信息

【药理毒理】作用机制：莫西沙星是广谱和具有抗菌活性的8－甲氧基氟喹诺酮类抗菌药。莫西沙星在体外显示出对革兰阳性细菌，革兰阴性菌，厌氧菌、抗酸菌和非典型微生物如支原体、衣原体和军团菌有广谱抗菌活性。

抗菌作用机制为干扰Ⅱ、Ⅳ拓扑异构酶。拓扑异构酶是控制DNA拓扑和在DNA复制、修复和转录中关键的酶。

其杀菌曲线表明，莫西沙星是具有浓度依赖性的杀菌活性。最低杀菌浓度和最低抑菌浓度基本一致。莫西沙星对β－内酰胺类和大环内酯类抗生素耐药的细菌亦有效。通过感染的实验动物模型证实，莫西沙星体内活性高。

耐药：导致对青霉素类、头孢菌素类、糖肽类、大环内酯类和四环素类耐药的耐药机制不影响莫西沙星的抗菌活性。莫西沙星和这些抗菌药无交叉耐药性。至今未发现质粒介导的耐药性的出现。

莫西沙星的8－甲氧基部分与8－氢部分相比具有对革兰阳性菌高活性和耐药突变的低选择性。7位的二氮杂环取代能阻止活性流出，该活性流出为氟喹诺酮耐药机制。体外试验显示经过多步变异才能缓慢的出现对莫西沙星的耐药性。总之其耐药率很低。序列地将细菌暴露在低于莫西沙星MIC浓度时只能使MIC值有少量的增加。其他喹诺酮类之间存在交叉耐药。但是，一些对其他喹诺酮类耐药的革兰阳性菌和厌氧菌对莫西沙星敏感。

对人类肠道菌群的作用：通过对两名志愿者服用莫西沙星后的研究观察到下列的变化，大肠杆菌、芽孢杆菌、普通拟杆菌、肠球菌、克雷伯杆菌和厌氧菌，如双歧杆菌、真杆菌和消化链球菌等的减少。这些变化在2周内可以恢复正常，未发现艰难梭菌毒素。体外试验敏感数据，敏感－革兰阳性菌：肺炎球菌（包括青霉素和大环内酯类耐药菌株）、A组化脓链球菌、米氏链球菌、轻型链球菌、无乳链球菌、停乳链球菌、金黄色葡萄球菌（包括甲氧西林敏感菌）、科氏葡萄球菌、表皮葡萄球菌（包括甲氧西林敏感菌）、溶血葡萄球菌、人葡萄球菌、腐生葡萄球菌、模仿葡萄球菌、白喉棒状杆菌；革兰阴性菌：流感嗜血杆菌（包括产生和不产生β－内酰胺酶的菌株）、副流感嗜血杆菌、卡他莫拉菌（包括产生和不产生β－内酰胺酶的菌株）、百日咳博德特菌、大肠埃希杆菌、肺炎克雷伯菌、产酸克雷伯杆菌、产气肠杆菌、聚团肠杆菌、阴沟肠杆菌、中间肠杆菌、阪崎肠杆菌、奇异变形菌、普通变形菌、摩氏摩根菌、雷氏普罗威登斯菌、斯氏普罗威登斯菌。厌氧菌：吉氏拟杆菌、埃氏拟杆菌、脆弱拟杆菌、卵形拟杆菌、多形拟杆菌、单形拟杆菌、梭形杆菌属、卟啉单胞菌属、厌氧卟啉单胞菌、不解糖卟啉单胞菌、卟啉单胞菌、普雷沃菌属、疮疱丙酸杆菌、产气荚膜梭菌、多枝梭菌。其他：肺炎衣原体、肺炎支原体、嗜肺军团菌、伯氏柯克斯体。对于任何细菌的获得性耐药可能随地理和时间而改变，但目前莫西沙星尚无这方面的资料。局部耐药是可能出现的，特别是治疗严重感染时。上述体外敏感试验结果可用来指导判断微生物是否对莫西沙星敏感。

【药代动力学】单剂量静脉和口服给予400mg莫西沙星的PK/PD比较。需住院病人的AUC/MIC_{90}值大于125并C_{max}/MIC_{90}为8～10为临床有效治疗期望值。门诊病人的参数值通常要低，AUC/MIC_{90}大于30～40。

【药物相互作用】慎与下列药物合用：1a类（如奎宁丁、普鲁卡因）或Ⅲ类（如胺碘酮、索托落尔）抗心律失常药、西沙必利、红霉素、抗精神病药物和三环类抗抑郁药。

食物和乳制品：食物的摄入不影响莫西沙星的吸收。因此，莫西沙星的服用时间不受进食的影响。

抗酸药、矿物质和多种维生素：莫西沙星与抗酸药、矿物质和多种维生素同时服用会因为与这些物质形成多价螯合物而减少药物的吸收。这将导致血浆中的药物浓度比预定值低，因此，抗酸药、抗逆转录病毒、和其他含有镁、铝和其他矿物质如铁等的制剂需要在口服莫西沙星4小时前或2小时后服用。

雷尼替丁：与雷尼替丁同时服用不会影响莫西沙星的吸收特性，其吸收参数（C_{max}，t_{max}，AUC）均提示莫西沙星不受胃酸缺乏的影响。

钙补充剂：当给予高剂量补充剂时，仅观察到吸收率稍有减少，而吸收范围保持不变。高剂量钙补充剂对莫西沙星的吸收不具有临床意义。

茶碱：莫西沙星对稳态时茶碱的药代动力学无影响，提示莫西沙星对P450酶的1A2亚型无影响。当服用莫西沙星治疗时，达到稳态的茶碱浓度未升高。因此，服用莫西沙星时不必调整茶碱的用量。

华法林：据观察，莫西沙星与华法林同时服用未发现对凝血酶原时间和凝血的其他参数有影响。

口服避孕药：莫西沙星与口服避孕药同时服用未发现有相互作用。

抗糖尿病药：优降糖和莫西沙星同时服用未发现有相互作用。

伊曲康唑：莫西沙星与伊曲康唑同时服用时伊曲康唑的药时曲线下面积仅少量改变。伊曲康唑对莫西沙星的药代动力学无显著性影响。当服用伊曲康唑时给予莫西沙星不需要调整剂量，反之亦然。

地高辛：莫西沙星对地高辛的药代动力学没有严重影响。反之亦然。

吗啡：肠外给予吗啡同时服用莫西沙星，并不减少口服莫西沙星的生物利用度，且 C_{max}（17%）仅稍有下降。

普鲁苯辛：在一项观察普鲁苯辛对肾脏排泄功能影响的研究中未发现对莫西沙星的全身清除和肾脏清除有明显影响。因此，当这两种药同时服用时不必调整剂量。

炭：同时口服炭及 400 mg 莫西沙星能减少药物的全身利用、在体内能阻止 80% 药物吸收。药物过量时，利用活性炭能在吸收早期阻止药物的进一步进入全身系统。

【药物过量】关于过量的研究资料非常有限，单次最大剂量 800 mg 和每日 600 mg 多次口服，连用 10 天在健康志愿者身上未发现有任何明确不良反应。一但服用过量莫西沙星时，应根据患者状况采取适当支持措施。

【不良反应】在莫西沙星的临床试验中，绝大多数的不良反应为轻中度（大于 90%），由于不良反应导致不能使用莫西沙星治疗的病人为 3.6%。根据莫西沙星的临床试验总结出的常见不良反应（其相关程度分为很可能、可能和无法评估）列表如下：

发生率≥1%且＜10%：

全身症状：腹痛、头痛。

消化系统：恶心、腹泻、呕吐、消化不良、肝功能化验异常。

特殊感官：味觉倒错。

神经系统：眩晕。

心血管系统：合并低钾血症的患者 Q－T 间期延长。

发生率≥0.1%且＜1%：

全身症状：乏力、念珠菌病、疼痛、不适、胸痛。

心血管系统：心动过速、高血压、心悸、QT 延长。

消化系统：口干、恶心和呕吐、腹胀、便秘、口腔念珠菌病、食欲下降、胃炎、胃肠失调、舌炎、γ－谷氨酰胺转肽酶增高。

血液和淋巴系统：白细胞减少、凝血酶原减少、嗜酸粒细胞增多。

代谢和营养：淀粉酶增加。

骨骼肌肉系统：关节痛、肌肉痛。

神经系统：失眠、眩晕、神经质、嗜睡、焦虑、颤抖、感觉异常。

呼吸系统：呼吸困难。

皮肤和附件：皮疹、瘙痒、多汗。

泌尿生殖系统：阴道念珠菌病、阴道炎。

发生率≥0.01%且＜0.1%：

全身症状：骨盆痛、面部水肿、背痛、实验室检查异常、过敏反应、下肢痛。

心血管系统：低血压、血管舒张、外周水肿。

消化系统：胃炎、舌苔异常、咽下困难、黄疸、腹泻（难辨梭状芽孢杆菌）。

血液和淋巴系统：凝血活酶减少、凝血酶原增加、血小板减少、贫血。

代谢和营养：高血糖、高血脂、高尿酸血症、LDH 升高（伴异常肝功能）。

骨骼肌肉：关节炎、肌腱异常。

神经系统：幻觉、人格解体、紧张、运动失调、焦虑、健忘症、失语症、情绪不稳定、睡眠失调、语言障碍、思维异常、感觉减退、多梦、惊厥、精神错乱、抑郁。

呼吸系统：哮喘。

皮肤和附件：皮疹（斑丘疹、紫癜、脓泡）。

特殊感官：耳鸣、视觉异常、失味、嗅觉倒错减弱及嗅觉失去、弱视。

泌尿生殖系统：肾功能异常。

未在上述不良反应中列出的与药物无关的最常见的试验室参数异常为：红细胞压积增加或减少、白细胞增加、红细胞增加或减少、血糖下降、血红蛋白减少、碱性磷酸酶升高、SGOT/AST 升高、SGPT/ALT 升高、胆红素升高、尿素升高、肌酐升高、尿素氮升高，上述异常是否由该药或治疗时患者状况导致尚属未知。

上市后报告的不良反应：（发生率＜0.01%）过敏反应：过敏性的反应、过敏性休克（可能威胁生命）。

消化系统：伪膜性肠炎，

肌肉骨骼系统：肌腱断裂。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸莫西沙星片	化学药	HZ0004203
盐酸莫西沙星注射液	化学药	HZ0004204

HY002308 盐酸纳洛酮

【其他名称】 丙烯吗啡酮、Narcan、烯丙羟吗啡酮

【外文名称】 Naloxone Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 17－烯丙基－4,5α 环氧基－3,14－羟基吗啡喃－6－酮盐酸盐二水合物

【分子式】 $C_{19}H_{21}NO_4 \cdot HCl \cdot 2H_2O$

【分子量】 399.87

【性状及组成】 本品为白色结晶或结晶性粉末，无臭。

本品水中易溶，在甲醇中溶解，在三氯甲烷或乙醚中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中含 25mg 的溶液，依法测定，比旋度为－170°至－181°。

药物药理信息

【药理毒理】 本品为纯粹的阿片受体拮抗药，本身无内在活性。但能竞争性拮抗各类阿片受体，对四种阿片受体亚型（μ－受体、δ－受体、κ－受体、6－受体）均有拮抗作用。对吗啡中毒者，小剂量（0.4～0.8mg）肌内或静脉注射、可迅速翻转吗啡的作用，1～3 分钟就可消除吗啡中毒引起的呼吸抑制、镇静、瞳孔缩小以及严重中毒引起的血压降低、昏迷等作用。对吗啡成瘾者可迅速诱发戒断综合征。纳洛酮还有抗休克作用，对抗休克时内啡肽的作用。对动物酒精中毒有促醒作用。

纳洛酮同时逆转阿片激动剂所有作用，包括镇痛。另外其还具有与拮抗阿片受体不相关的回苏作用。可迅速逆转阿片镇痛药引起的呼吸抑制，可引起高度兴奋，使心血管功能亢进。本品尚有抗休克作用。不产生吗啡样的依赖性、戒断症状和呼吸抑制。

急性毒性 LD_{50}：小鼠，口服 565（mg/kg）。

【药代动力学】 本品含服吸收速度较快，易透过血－脑脊液屏障，10 分钟即可产生作用，吸收半衰期为 11 分钟，消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为 164 分钟。口服吸收效果差，主要在肝内代谢，代谢物与葡萄糖醛酸结合后由尿中排出。

本品静注后 1～3 分钟即产生最大效应，持续 45 分钟；肌注后 5～10 分钟产生最大效应，持续 2.5～3 小时。本品吸收迅速，易透过血脑屏障，代谢很快，人血浆 $t_{1/2}$ 为 30～78 分钟，主要在肝内生物转化，产物随尿排出。

【药物相互作用】 纳洛酮促进乙醇从胃肠道吸收，所以口服本品后不得再用乙醇。

【不良反应】 本品有轻度嗜睡，偶见恶心、呕吐、心动过速、高血压及烦躁不安。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸纳洛酮舌下片	化学药	HZ004205
盐酸纳洛酮注射液	化学药	HZ004206
注射用盐酸纳洛酮	化学药	HZ005089

HY002309 盐酸纳曲酮

【外文名称】 Naltrexone Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 国家药品标准新药转正标准·第 57 册

药物理化信息

【化学名】 17－环丙甲基－4,5α－环氧－3,14－二羟基吗啡喃－6－酮盐酸盐

【分子式】 $C_{20}H_{23}NO_4 \cdot HCl$

【分子量】 377.87

【性状及组成】 本品为白色至类白色结晶性粉末，无臭、无味，有引湿性。

本品在水中易溶，在甲醇中溶解，在三氯甲烷或乙醚中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，用水溶解并稀释制成每 1ml 中含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为－182℃至－192℃。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理学：纳曲酮是阿片受体拮抗剂，药效学与纳洛酮的作用相似，能明显的减弱或完全阻断阿片受体，甚至反转由静脉注射阿片类药物所产生的作用。能解除其对阿片的身体依赖性，使已戒断阿片瘾者保持正常生活。本品口服有效，而且作用维持时间较长。本品不产生躯体或精神依赖性。

2．毒理学：本品对大鼠 2 年的致癌研究证明，在雄鼠间皮瘤和两性中血管源性肿瘤的数目稍有增加。但除雌性血管瘤稍有增加外，肿瘤的发生都在对照组的范围内。

【药代动力学】 纳曲酮口服后主要消除途径是大量被肝脏代谢，约占有吸收量的 95% 变为几种代谢产物，其中主要的活性代谢产物是 6－β

纳曲醇，其药理作用也是阻断阿片受体。一个次要的代谢物是2－羟基－3－甲氧基－6－β纳曲醇。纳曲酮及其代谢物主要经肾脏排出，原形由尿中排出的不到口服剂量的1%，由尿中排出的原形药物和结合的6－β纳曲醇约为口服剂量的38%。从药代动力学来看，本品及其代谢物能发生肝肠循环。

给24名男性志愿者服用50mg纳曲酮后，纳曲酮及其主要代谢产物6－β纳曲醇的C_{max}分别为8.6和99.3mg/ml。在50～200mg用量之间纳曲酮和6－β纳曲醇的C_{max}和AUC呈比例的增加。t_{max}约1小时。纳曲酮和6－β纳曲醇的消除$t_{1/2}$分别为3.9和12.9小时。其平均消除$t_{1/2}$和t_{max}与用量无关。纳曲酮不在体内蓄积。由于$t_{1/2}$长，6－β纳曲醇的血浓度在长期给药时可增加40%。体内纳曲酮的总清除率为1.5L/min（相当肝血流）。其肾清除率为127ml/min，完全由肾小球滤过。6－β纳曲醇的肾清除率为283ml/min，推测有肾小管分泌机制。纳曲酮静注后的分布容积为1350L。纳曲酮在治疗剂量范围内约有21%与血浆蛋白结合。

【药物相互作用】本品可能干扰含有阿片类药物的治疗作用，凡使用阿片类镇痛药应避免与这类药物同时使用。

【药物过量】目前尚无人用过量的经验。只有1次研究说明，一日用纳曲酮800mg，连用1周而未发现毒性。在小鼠、大鼠和豚鼠口服本品的LD_{50}分别为：（1.100±96）mg/kg，（1.450±265）mg/kg和（1.490±102）mg/kg。小鼠、大鼠和犬急性致死的原因是阵挛性强直性惊厥和呼吸衰竭。因为缺乏治疗纳曲酮过量的经验，故应做好对症治疗。

【不良反应】

1．纳曲酮的一日用量达到300mg时可引起肝细胞损害。

2．除肝损害外，不良反应发生率在10%以上的反应有：睡眠困难、焦虑、易激动、腹痛/痉挛、恶心和/或呕吐、关节肌肉痛、头痛。

3．不良反应发生率在10%以下的反应有：食欲减退、腹泻、便秘、口渴、头晕。

4．在1%以下的不良反应有以下内容。呼吸系统：鼻充血、发痒、流鼻涕、咽痛、黏液过多、声音嘶哑、咳嗽、呼吸短促。心血管系统：鼻出血、静脉炎、水肿、血压升高、非特异性心电改变、心悸、心动过速。胃肠道：产气过多、便血、腹泻、溃疡。肌肉骨路：肩、下肢和膝关节疼痛、震颤。皮肤：油皮肤、瘙痒、痤疮、唇疱疹。泌尿生殖系：排尿不适增多、性欲降低。精神方面：抑郁、忘想狂、疲倦、不安、精神错乱、幻觉、恶梦。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸纳曲酮片	化学药	HZ004207

HY002310　盐酸奈福泮

【其他名称】平痛新

【外文名称】Nefopam Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】5－甲基－1－苯基－3,4,5,6－四氢－1H－2,5－氧氮苯并辛因盐酸盐

【分子式】$C_{17}H_{19}NO\cdot HCl$

【分子量】289.80

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，味微苦。本品在水中略溶，在乙醇中微溶，在苯中不溶。

熔点：本品的熔点为248～253℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】本品为一种新型的非麻醉性镇痛药，兼有轻度的解热和肌松作用。化学结构属于环化邻甲基苯海拉明。所以不具有非甾体抗炎药的特性，亦非阿片受体激动剂。对中、重度疼痛有效，肌注本品20mg相当12mg吗啡效应。对呼吸抑制作用较轻。对循环系统无抑制作用。无耐受和依赖性。

急性毒性LD_{50}：小鼠，口服66.6mg/kg，腹腔28.7mg/kg，静脉21.9mg/kg。大鼠，口服178mg/kg，肌注56.9mg/kg。

【药代动力学】本品口服吸收迅速，t_{max}为1～3小时，首过效应明显。本品肌注5～10分钟生效，t_{max} 1.5小时，作用持续2～8小时。$t_{1/2}$ 4～8小时，血浆蛋白结合率71%～76%。由肝代谢而失去药理活性，大部分经肾脏排泄，原形药不足5%，少量随粪便排出。

【药物过量】本品过量可引起兴奋，宜用安定解救。

【不良反应】产生作用时常有嗑睡、恶心、出汗、头晕、头痛等。但一般持续时间不长。偶见口干、眩晕、皮疹。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸奈福泮胶囊	化学药	HZ004208
盐酸奈福泮氯化钠注射液	化学药	HZ004209
盐酸奈福泮片	化学药	HZ004210
盐酸奈福泮葡萄糖注射液	化学药	HZ004211
盐酸奈福泮注射液	化学药	HZ004212
注射用盐酸奈福泮	化学药	HZ005090

HY002311 盐酸萘法唑酮

【其他名称】 Dutonin、尼法唑酮、盐酸非那唑酮

【外文名称】 Nefazodone Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】 2－［3－［4－（3－氯苯基）－1－哌嗪］丙基］－5－乙基－2,4－二氢－4－（2－苯氧乙基）－3H－1,2,4－三氮－3－酮盐酸盐

【分子式】 $C_{17}H_{14}O_4S$

【分子量】 506.00

药物药理信息

【药理毒理】 本品是苯基哌嗪衍生物，在生物化学和药理学方面明显不同于其他抗抑郁药。

本品具有双重作用模式，能阻滞 5－羟色胺再吸收及突触后 5－HT_2 受体。故可使 5－羟色胺水平提高并通过 5－HT_1A 受体有利于神经传递。因此，本品既为 5－HT_2Z 受体拮抗剂，也阻断 5－HT 重摄入，以及通过抑制突触前的去甲肾上腺素自体受体（Autoreceptors）抑制去甲肾上腺素摄入。一般认为本品是治疗抑郁症的一种新的和有效的途径，它同时作用于 5－羟色胺和去甲肾上腺素递质。

临床前的研究显示：本品虽抑制去甲肾上腺素再吸收和拮抗 α_1－肾上腺素能受体，但这些作用较轻。最强的药理作用是阻断 5－HT_2 受体。而这种受体兴奋则会产生睡眠紊乱、激动和自杀念头。阻断 5－HT_2 受体是本品耐受性改善的原因，其耐受性与 SSRI 典型的不良反应有关。

【药代动力学】 本品口服后，吸收迅速、完全，但在肝内经历广泛的首过代谢，绝对生物利用度约 20%。食物延迟本品吸收，并减少生物利用度约 20%，但临床意义不大。其最重要的代谢物是羟基萘法唑酮，也发挥着在质和量上都类似于萘法唑酮的药理作用。

【药物相互作用】 本品体外已显示可抑制细胞色素 P450 3A4 同工酶，因此禁与代谢过程中包含有此酶参与的特非那丁和阿司咪唑并用。

阿普唑仑和三唑仑也被 CYP3A4 同工酶代谢，与本品并用时可使它们的血药浓度及活性明显增强，因此阿普唑仑和三唑仑的初剂量应分别减少 50% 和 75%。

本品慎与单胺氧化酶抑制剂并用，也慎用于中断单胺氧化酶抑制剂治疗 14 日内，中断本品治疗至少 7 日以上才可开始单胺氧化酶抑制剂的治疗。

本品亦可减少氟哌啶醇的清除率，增加地高辛的血浓度，因此本品与它们并用时应密切观察。

用药期间也不应饮酒。

【不良反应】 包括神经系统作用（例如：思睡 25%，头晕 17%，头昏 10%，精神错乱 7%），胃肠道症状（例如：恶心 22%，便秘 14%，口干 25%，虚弱 11%），视力模糊 9%，视觉异常 7% 等。

治疗期间有发热及喉痛、长时间阴茎异常勃起，应停药。

HY002312 盐酸萘甲唑林

【其他名称】 盐酸萘唑林

【外文名称】 Naphazoline Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 4,5－二氢－2－（1－萘甲基）－1*H*－咪唑盐酸盐

【分子式】 $C_{14}H_{14}N_2 \cdot HCl$

【分子量】 246.74

【性状及组成】 本品为白色结晶性粉末，无臭，味苦。

本品在水中易溶，在乙醇中溶解，在三氯甲烷中极微溶解，在乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为 254～260 ℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】 为肾上腺素受体激动药，有较强的收缩血管作用。

【药物相互作用】 单胺氧化酶抑制剂或拟交感药物不能与本品同用。

当马普替林或三环类抗抑郁药与本品合用时可加强萘唑林的升高血压作用。使用 MAO 抑制剂治疗的病人如果再用拟肾上腺素药物可能会发生严重的高血压危象。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方醋酸曲安西龙搽剂	化学药	HZ001123
复方门冬维甘滴眼液	化学药	HZ001318
复方萘甲唑啉喷剂	化学药	HZ001324
复方盐酸萘甲唑林滴眼液	化学药	HZ001460
马来酸非尼拉敏/盐酸萘甲唑啉滴眼液	化学药	HZ002579
萘林那敏溴铵喷雾剂	化学药	HZ002740
萘敏维滴眼液	化学药	HZ002741
萘扑维滴眼液	化学药	HZ002745
盐酸萘甲唑林滴鼻液	化学药	HZ004213
盐酸萘甲唑林滴眼液	化学药	HZ004214

HY002313　盐酸萘替芬

【外文名称】Naftifine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第56册

药物理化信息

【化学名】（*E*）－*N*－甲基－*N*－（3－苯基－2－丙烯基）－1－萘甲胺盐酸盐

【分子式】$C_{21}H_{21}N\cdot HCl$

【分子量】323.88

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭。本品在甲醇、三氯甲烷中易溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为175～180℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为一新型丙烯胺类局部抗真菌药。对皮肤真菌（毛癣菌属、小孢子菌属、表皮癣菌属）有杀菌作用，对马拉色菌属、念珠菌属及其他酵母菌具有抑菌作用。对革兰阳性及阴性细菌也具有局部杀菌作用。其作用机制为抑制真菌角鲨烯、环氧化酶，干扰真菌细胞麦角固醇的生物合成，影响真菌的脂质代谢，使真菌细胞损伤和死亡而起到杀菌和抑菌作用。

【药代动力学】健康人皮肤外用1%盐酸萘替芬软膏，约有3%～6%的剂量被吸收。单剂量给药24小时内在皮肤表层的萘替芬浓度足以抑制皮肤癣菌的生长。萘替芬在体内通过苯环和萘环氧化以及*N*－去烷基化，至少可转化成三种代谢物。体内药物约有40%～60%以原形和代谢物形式排泄到尿中，其余部分经胆汁排泄到粪便中。皮肤外用萘替芬的半衰期约为2～3天。

【不良反应】不良反应罕见，少数患者有局部刺激，如红斑、烧灼及干燥、瘙痒感觉等，个别患者可发生接触性皮炎，无全身不良反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
萘替芬酮康唑乳膏	化学药	HZ002763
盐酸萘替芬溶液	化学药	HZ004215
盐酸萘替芬乳膏	化学药	HZ004216

HY002314　盐酸尼非卡兰

【外文名称】Nifekalant Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】[1,3－二甲基－6－（2－[*N*－（2－羟乙基）－3－（4－硝苯基）丙胺基]乙氨基）－2,4（1*H*，3*H*）－盐酸嘧啶二酮]

【分子式】$C_{19}H_{27}N_5O_5\cdot HCl$

【分子量】441.91

药物药理信息

【药理毒理】本品是一种钾通道拮抗剂，新的Ⅲ类抗心律失常药，与索他洛尔有相似的电生理特性，但它避免了β肾上腺素能阻断效应。用微电极技术研究本品对不同心肌组织电生理效应并与索他洛尔比较，本品诱导产生浓度依赖性的动作电位时程（APD）延长，对浦肯野纤维有效的浓度比索他洛尔低至少10倍以上，在浓度10μmol/L以上作用即很显著，对静止膜电位、动作电位振幅或最大上行电压无明显作用，相似的浓度，本品也选择性延长犬的心室肌动作电位，与索他洛尔相似。在荷兰猪心房肌，同索他洛尔相比，本品仅很小程度诱导动作电位时限延长，两种化合物均诱导兔窦结细胞的动作时限随剂量增加，并且在高浓度（100～1000μmol/L）降低自发频率。在麻醉的动物体内，本品诱导剂量依赖的房室不应期延长，轻微降低心率，静注0.1～10mg/kg，观察到QTc间期的延长依赖于药物浓度，但对其他参数无影响。当以恒速2mg/（kg·min）静滴50分钟，引起QTc间期增加不超过30%，未见心律失常。

为了考察本品的临床疗效，对11例病人进行了电生理研究。所有病人分别给予初始剂量0.2或0.3mg/kg，5分钟内静脉注射，接着以0.2或0.3mg/kg剂量连续滴注30分钟，QT间期在开始输注本品3分钟后明显增加，心率在给药后10分钟明显降低

8%以上，平均 PR 和 QRS 间期及血压受本品影响不明显，心房和心室的有效不应期分别从（202 ± 24）ms 延长到（231 ± 26）ms 和从（238 ± 11）ms 到（257 ± 13）ms，分别延长达 13%和 7%以上。

【药代动力学】狗口服或静脉注射本品后，主要生物转化途径为脱烃基作用，犬浦肯野纤维的研究表明，代谢物中至少有一种与母体药物对动作电位时限有相似作用。

对健康男子单次静脉注射盐酸尼非卡兰 0.1 ~ 0.4mg/kg，注射后血浆药物浓度立刻达到峰值，然后呈三相消除。剂量 0.3mg/kg 时 β 相半衰期为 1.53 小时。曲线下面积（AUC）与剂量呈正相关。其他参数维持一相对恒定的水平。健康成年男子以 0.4mg/kg 的负荷剂量静脉注射盐酸尼非卡兰后，连续静脉滴注 0.4mg/（kg·h）的盐酸尼非卡兰，4 小时后达到稳态浓度，稳态血药浓度为 543ng/ml，然后也呈三相从体内消除。盐酸尼非卡兰体内血清结合率为 86.4% ~ 96.4%，主要以原形（46.9% ~ 55.5%）和 M - GC（27.8% ~ 31.7%）形式排泄，静注 24 ~ 48 小时后排泄完全。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸尼非卡兰	化学药	HZ005091

HY002315 盐酸尼卡地平

【其他名称】佩尔地平

【外文名称】Nicardipine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】2，6 - 二甲基 - 4 - （3 - 硝基苯基）- 1,4 - 二氢吡啶 - 3,5 - 二羧酸，3 - ［β - （*N* - 苄基 - *N* - 甲氨基）］乙酯 - 5 - 甲酯盐酸盐

【分子式】$C_{26}H_{29}N_3O_6 \cdot HCl$

【分子量】515.99

【性状及组成】本品为淡黄色粉末或黄色结晶性粉末，无臭，几乎无味。本品在甲醇中溶解，在乙醇、三氯甲烷中略溶，在水或乙醚中几乎不溶，在冰醋酸中溶解。

熔点：本品的熔点为 179 ~ 185℃，熔融时同时分解。

吸收系数：取本品，精密称定，加甲醇溶解并定量稀释成每 1ml 中约含 8μg 的溶液，照紫外 - 可见分光光度法，在 236nm 的波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为 507 ~ 539 即得。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用

（1）本品为钙通道阻滞剂（慢通道阻滞剂或钙离子拮抗剂），可抑制心肌与血管平滑肌的跨膜钙离子内流而不改变血钙浓度。本品具有高度的血管选择性，对血管平滑肌的钙离子拮抗作用强于对心肌的作用。

（2）动物实验中本品扩张冠状血管平滑肌。本品可增加慢性稳定型心绞痛患者的运动耐受量，减少心绞痛发作频率。

（3）本品降低人体外周血管阻力，使血压下降，可降低轻、中度高血压患者的收缩压与舒张压，但是不改变血压的昼夜节律变化。此作用在高血压患者大于正常血压者，降压时有反射性心率加快和心肌收缩性增强。

（4）本品增加心脏射血分数及心排血量，左室舒张末压改变不多。

（5）可短暂增加尿钠排泄。

（6）本品阻滞慢钙通道而不影响快钠通道。麻醉狗实验表明本品扩张冠状动脉并增加局部心肌血流量，但不影响房室传导。

2．致癌、致突变和生殖毒性：大鼠分别每日给尼卡地平 5、15 或 45mg/kg，两年后的结果表明，甲状腺增生和瘤形成（滤泡状腺瘤/肿瘤）随剂量的增加而增加。对大鼠的研究显示这些结果与尼卡地平诱导的血浆甲状腺素（T_4）水平降低有关，伴随血浆促甲状腺素（TSH）水平的升高。TSH 的缓慢增加可引起甲状腺高度兴奋。饮食缺碘的大鼠给尼卡地平一个月，出现甲状腺增生，可通过补充 T_4 防止该现象。小鼠每日给尼卡地平 100mg/kg，18 个月后未发现任何组织的瘤形成和甲状腺改变。狗每日给尼卡地平 25mg/kg，1 年后未见甲状腺病理改变；未发现尼卡地平影响人的甲状腺功能（血浆 T_4 和 TSH）。

盐酸尼卡地平注射液以高达 5mg/（kg·d）的剂量给予怀孕大鼠，以高达 0.5mg/（kg·d）的剂量给予怀孕兔时，未见产生胚胎毒性或致畸性。大鼠在 10mg/（kg·d）的剂量下，兔子在 1mg/（kg·d）的剂量下可见胚胎毒性，但在这些剂量下未见致畸性。

当在器官形成期间，以高达 100mg 尼卡地平/（kg·d）的剂量（在该治疗剂量下死亡率明显增加）治疗新西兰大白兔时，未见对胎儿的不良作用。口服给予怀孕的大鼠高达 100mg/（kg·d）（50 倍于人最大推荐剂量）的尼卡地平，没有胚胎致死性和致畸性的迹象。然而，注意到难产、出生时体重减轻、

新生鼠存活率下降和体重增长减少。

在对微生物指示菌进行的生殖毒性试验、小鼠和仓鼠的微核试验或仓鼠的姐妹染色单体交换试验中均未发现尼卡地平有致突变作用。雄性大鼠和雌性大鼠口服尼卡地平 100mg/kg 未见生殖能力损伤。

3. 血流动力学：盐酸尼卡地平注射液明显降低全身的血管阻力。在动脉内给药研究中，与血压正常的健康志愿者相比，高血压病人的血管扩张和血压降低程度更显著。血压正常的志愿者以 0.25～3.0mg/h 的剂量给药 8 小时，收缩压改变 < 5mmHg，舒张压改变 < 3mmHg。

盐酸尼卡地平诱导的冠状动脉扩张改善了慢性缺血区的灌注和需氧代谢，从而导致乳酸盐产生减少，氧消耗增加。在左室功能损伤的充血性心衰病人中，盐酸尼卡地平增加静息期和运动期心排出量。也观察到左室舒张期末压降低。然而，在某些患有严重左室功能不全的病人中，该药可能具有负性肌力作用并可能导致心衰恶化。

在用盐酸尼卡地平注射剂治疗过程中观察到“冠状动脉窃流”现象。盐酸尼卡地平注射液也显示改善正常的和运动功能减退部位的心肌收缩期缩短。

当给予患有中度肾损伤的轻度至中度高血压病人盐酸尼卡地平注射液时，肾小球滤过率（GRF）明显降低，有效肾血浆流量（RPF）明显减少。

【药代动力学】本品口服吸收完全，20 分钟后血中可测得本品，血药浓度峰值出现于服药后 0.5～2 小时（平均 1 小时）。餐后服用本品血药浓度降低。由于饱和肝脏首过代谢，呈非线性动力学特征。口服 20、30 和 40mg 本品（一日 3 次）稳态时的达峰浓度分别为 36、88 和 133ng/ml，且个体差异较大。每日给药 3 次，2 至 3 天后血药浓度达稳态，稳态时的血药浓度比单剂量给药时高 2 倍，平均消除半衰期 8.6小时。口服 30mg 本品稳态时的生物利用度为 35%。本品的血浆蛋白结合率高（> 95%），在不同种属动物间相近。本品在肝脏广泛代谢，60% 从尿中排出，35% 从粪便排出，尿中检测到的原形药物小于 1%。给药后 48 小时内回收的药物总量为 90%。本品不诱导自身代谢，也不诱导肝微粒体代谢酶。由于本品在肝脏广泛代谢，血药浓度水平受肝功能变化的影响。严重肝功能失常患者的体内药物浓度高于正常受试者，半衰期明显延长。

本品在肾功能不全患者（基线血肌酐浓度 1.2～5.5mg/dL）体内的血药浓度高于健康受试者。口服 30mg（一日 3 次）本品达稳态时，肾功能不全患者的 C_{max} 和 AUC 比健康受试者高 2 倍。

12 名健康成人受试者单次服用本品缓释胶囊 40mg 后测定血药浓度呈双峰态，第一峰时为（0.79 ± 0.45）小时，达峰浓度为（14.2 ± 8.2）ng/ml，第二峰时为（5.08 ± 0.79）小时，达峰浓度为（16.3 ± 5.8）ng/ml（血药浓度呈双峰曲线与本制剂由速释和缓释两种成分构成的药剂学特点相符）；每天口服两次，每次 40mg，连服 7 天后测血药浓度，峰浓度为（36.9 ± 6.1）ng/ml，在 7 天之内达到恒定状态。连续口服给药的半衰期约为 7.6 小时。本品主要通过肝脏广泛代谢，仅 21% 的代谢物由尿液排出，尿中未检出尼卡地平原形物。

停止输注后，尼卡地平浓度迅速降低，停药后的最初 2 小时至少降低 50%。只有长期输注后才能检测到早期快速分布相（$t_{1/2\alpha}$ = 2.7 分钟），中间相（$t_{1/2\beta}$ = 44.8 分钟，和缓慢的末端相 $t_{1/2\gamma}$ = 14.4 小时）。总血浆清除率为 0.4L/（h·kg），当使用非房室模型时，表观分布容积为 8.3l/kg。在 0.5～40.0mg/h 的剂量范围内，盐酸尼卡地平注射液的药动学是线性的。在开始输注尼卡地平后的最初 2 小时可见与剂量有关的尼卡地平血浆浓度迅速增加。在最初几小时后，血浆浓度以缓慢的速度增加，并在 24～48 小时达稳态。尼卡地平血浆蛋白结合率高（> 95%）。盐酸尼卡地平注射液迅速并且广泛地通过肝脏代谢。静脉内给予具有放射性的盐酸尼卡地平注射液，在 96 小时内，未回收到原形尼卡地平。尼卡地平在老年高血压病人（> 65 岁）和年轻的健康成年人中的稳态药动学是类似的。

【药物相互作用】

1. 本品与 β 阻滞剂同用，耐受良好。

2. 本品与西咪替丁合用，本品血药浓度增高。

3. 本品与其他降压药联合用药时，有可能产生相加作用，使用时应多加注意。

4. 本品与地高辛联合用药时，测定地高辛血药浓度。

5. 本品与环孢素合用时环孢素血浓度增高。

6. 在体外，治疗浓度的呋塞米、普萘洛尔、双嘧达莫、华法林、奎尼丁等加于人体血浆中不改变本品的蛋白结合率。

【药物过量】对大鼠进行了 24 个月的给药实验，与对照组相比，45mg/（kg·d）给药组（大约是临床用量的 40 倍）的雄性动物中甲状腺滤泡的肿瘤显著增加。过量时引起显著低血压、心率变化、嗜睡、意识模糊，可采用对症治疗如排空胃内容物、抬高四肢、注意循环血量和尿排出量、心脏和呼吸功能的监测血管、静脉补液，对严重低血压患者给予血管升压药，静脉内给葡萄糖酸钙以纠正症状。

【不良反应】

1. 较常见者有足踝部水肿、头晕、头痛、面部潮红等。

2. 有时出现谷丙转氨酶（ALT）、谷草转氨酶（AST）升高。

3. 较少见者有心悸、心动过速、心绞痛加重，减少剂量或加 β－受体阻滞剂可以纠正。

4. 少有恶心、口干、便秘、乏力、皮疹等。

5. 偶有胆红素、乳酸脱氢酶、胆固醇、尿素氮、肌酐升高，偶见粒细胞减少。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸尼卡地平缓释胶囊	化学药	HZ004217
盐酸尼卡地平缓释片	化学药	HZ004218
盐酸尼卡地平氯化钠注射液	化学药	HZ004219
盐酸尼卡地平片	化学药	HZ004220
盐酸尼卡地平葡萄糖注射液	化学药	HZ004221
盐酸尼卡地平注射液	化学药	HZ004222
注射用盐酸尼卡地平	化学药	HZ005092

HY002316 盐酸诺氟沙星

【外文名称】 Norfloxacin Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】 1－乙基－6－氟－1,4－二氢－4－氧代－7－（1－哌嗪基）－喹啉－3－羧酸盐酸盐

【分子式】 $C_{16}H_{18}FN_3O_3 \cdot HCl$

【分子量】 355.80

【性状及组成】 本品为白色或类白色结晶性粉末。

药物药理信息

【药理毒理】 本品为氟喹诺酮类抗菌药，具广谱抗菌作用，尤其对需氧革兰阴性杆菌的抗菌活性高，对下列细菌在体外具良好抗菌作用：肠杆菌科的大部分细菌，包括枸橼酸杆菌属、阴沟肠杆菌、产气肠杆菌等肠杆菌属、大肠埃希菌、克雷伯菌属、变形菌属、沙门菌属、志贺菌属、弧菌属、耶尔森菌等。诺氟沙星在体外对多重耐药菌亦具抗菌活性。对青霉素耐药的淋病奈瑟菌、流感嗜血杆菌和卡他莫拉菌亦有良好抗菌作用。

诺氟沙星为杀菌剂，通过作用于细菌 DNA 螺旋酶的 A 亚单位，抑制 DNA 的合成和复制而导致细菌死亡。

【药代动力学】

本品 250ml：0.4g 静脉滴注，经 0.5 小时后达血药峰浓度（C_{max}）约为 5μg/ml。广泛分布于各组织、体液中，如肝、肾、肺、前列腺、睾丸、子宫及胆汁、痰液、水疱液、血、尿液等，但未见于中枢神经系统。血清蛋白结合率为 10% ~ 15%，血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为（0.245 ± 0.93）小时，肾功能减退时可延长。肾脏（肾小球滤过和肾小管分泌）和肝胆系统为主要排泄途径，26% ~ 32% 以原形和小于 10% 以代谢物形式自尿中排出，自胆汁和（或）粪便中的排出量占 28% ~ 30%。尿液 pH 影响本品的溶解度。尿液 pH7.5 时溶解最少，其他 pH 时溶解增多。

【药物相互作用】

1. 尿碱化剂可减低本品在尿中的溶解度，导致结晶尿和肾毒性。

2. 与茶碱类合用时可能由于与细胞色素 P450 结合部位的竞争性抑制，导致茶碱类的肝清除明显减少，血消除半衰期延长，血药浓度升高，出现茶碱中毒症状，如恶心、呕吐、震颤、不安、激动、抽搐、心悸等，故合用时应测定茶碱类血药浓度和调整剂量。

3. 与环孢素合用，可使其的血药浓度升高，必须监测环孢素血浓度，并调整剂量。

4. 与抗凝药华法林合用时可增强后者的抗凝作用，合用时应严密监测患者的凝血酶原时间。

5. 丙磺舒可减少本品自肾小管分泌约 50%，合用时可因本品血浓度增高而产生毒性。

6. 本品与呋喃妥因具拮抗作用，不推荐联合应用。

7. 本品干扰咖啡因的代谢，从而导致咖啡因清除减少，血消除半衰期延长，并可能产生中枢神经系统毒性。

【药物过量】 急性药物过量时，应仔细观察病情变化，予以对症处理及支持疗法。并须维持适当的补液量。

【不良反应】

1. 胃肠道反应　较为常见，可表现为腹部不适或疼痛、腹泻、恶心或呕吐。

2. 中枢神经系统反应　可有头昏、头痛、嗜睡或失眠。

3. 过敏反应　皮疹、皮肤瘙痒，偶可发生渗出性多形性红斑及血管神经性水肿。少数患者有光敏反应。

4. 偶可发生：①癫痫发作、精神异常、烦躁不安、意识混乱、幻觉、震颤；②血尿、发热、皮疹等间质性肾炎表现；③静脉炎；④结晶尿，多见于高剂量应用时；⑤关节疼痛。

5. 少数患者可发生血清氨基转移酶升高、血尿素氮增高及周围血常规白细胞降低，多属轻度，并呈一过性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸诺氟沙星	化学药	HZ0005094

HY002317　盐酸帕罗西汀

【外文名称】Paroxetine Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】4*R*－（4－氟苯基）－3S－［3′,4′－（亚甲二氧基）苯氧基甲基］－哌啶盐酸盐半水物

【分子式】$C_{19}H_{20}FNO_3 \cdot HCl \cdot 1/2H_2O$

【分子量】374.84

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：本品属抗抑郁症药，为强效、高选择性5－羟色胺再摄取抑制剂，可使突触间隙中5－羟色胺浓度升高，增强中枢5－羟色胺神经功能。仅微弱抑制去甲肾上腺素和多巴胺的再摄取，与毒蕈碱1、2受体或肾上腺素受体，多巴胺2受体，5－羟色胺1、2受体和组胺H_1受体几乎没有亲和力。对单胺氧化酶也没有抑制作用。

2．毒理研究

（1）遗传毒性：帕罗西汀细菌突变试验、小鼠淋巴瘤突变试验、程序外DNA合成试验、人淋巴细胞染色体畸变试验、小鼠骨髓微核试验及大鼠显性致死试验结果均为阴性。

（2）生殖毒性：给帕罗西汀15mg/（kg·d）（以mg/m^2计算，是治疗抑郁症临床推荐剂量的2.9倍），大鼠的受孕率下降。在2到52周的毒性研究中，发现雄性大鼠生殖道不可逆损伤［50mg/（kg·d）时可见附睾管上皮空泡，25mg/（kg·d）时伴随精子生成抑制的睾丸输精管萎缩］。器官形成期大鼠和家兔分别给予帕罗西汀50mg/（kg·d）和6mg/（kg·d）（以mg/m^2计算，分别相当于治疗抑郁症临床推荐剂量的9.7和2.2倍），未显示出致畸毒性。但是在大鼠妊娠后三个月及整个哺乳期连续给药，哺乳期的前4天，幼鼠死亡增加，该作用发生在1mg/（kg·d），死亡原因尚不清楚。未能确定造成大鼠幼鼠死亡的无影响剂量。

（3）致癌性：在啮齿类动物给药（饲料掺入法）两年的致癌性研究中，小鼠和大鼠给药剂量分别达25mg/（kg·d）和20mg/（kg·d）（以mg/m^2计算，分别相当于治疗抑郁症临床推荐剂量的2.4和3.9倍），结果高剂量组雄性大鼠网状细胞瘤显著增加（对照、低、中和高剂量组分别为1/100，0/50，0/50，和4/50），淋巴网状内皮细胞瘤随剂量递增。雌性大鼠不受影响。尽管在小鼠中肿瘤数呈现剂量相关性增加，但没有药物相关的肿瘤小鼠数量的增加。这些发现与人类的相关性尚不清楚。

（4）依赖性：目前没有有关帕罗西汀动物或人的滥用、耐受或躯体依赖的系统研究资料。

【药代动力学】本品口服后易吸收，不受抗酸药物和食物的影响。中国健康男性志愿者口服40mg盐酸帕罗西汀，$t_{1/2}$为19.74小时，血药浓度达峰时间为5.30小时，峰浓度为31.01ng/ml，AUC_{0-Tn}为727.93ng/（ml·h），AUC_{0-inf}873.17ng/（ml·h）。据文献报道口服盐酸帕罗西汀30mg，大都10天能达到稳态，血药浓度达峰时间为5.2小时，峰浓度为61.7ng/ml，血浆蛋白结合率为95%，分布到各组织器官，包括中枢神经系统。本品清除半衰期通常为24小时。在肝脏代谢，约2%以原形由尿排出，其余以代谢产物形式从尿中排出，少量由粪便排泄。

【药物相互作用】

1．本品与色氨酸合用，可造成高血清素综合征，表现为躁动、不安及胃肠道症状。再者可出现肌张力增高、高热或意识障碍，故本品不宜与色氨酸合用。

2．肝脏药物代谢酶的诱导剂或抑制剂，可影响本品的代谢和药代动力学性质，当本品与已知的药物代谢抑制剂合用时，应使用剂量范围的低限，而与已知的酶诱导剂合用时，无须考虑调整初始剂量。

3．服用本品的患者应避免饮酒。

4．服用本品前后2周内不能使用单胺氧化酶抑制剂，在停用单胺氧化酶抑制剂2周后，开始服用本药应慎重，剂量应逐渐增加。

5．本品和锂盐合用时应慎重，注意监测血锂浓度。

6．与苯妥英钠及其他抗惊厥药合用时，会降低本药的血药浓度，并可增加不良反应的发生。

7．本品与华法林合用，可导致出血增加。

8．本品与三环类抗抑郁药阿米替林、丙咪嗪合用，可使后者的血浓度增高。

9．本品可明显增加丙环定的血浆水平，若出现抗胆碱作用时应减少丙环定的剂量。

【药物过量】药物过量时可引起P－Q间期延长，恶心、呕吐、瞳孔散大、口干、烦躁、头痛、眩晕、肌震颤或抽搐。应对症治疗及支持疗法。

【不良反应】可有胃肠道不适，如恶心、畏食、腹泻等。亦可出现头痛、不安、无力、嗜睡、失眠、头晕等。少见不良反应有过敏性皮疹及性功能减退。突然停药可见撤药综合征，如失眠、焦虑、恶心、出汗、眩晕或感觉异常等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸帕罗西汀片	化学药	HZ004223

HY002318 盐酸哌甲酯

【其他名称】哌醋甲酯、盐酸哌醋甲酯

【外文名称】Methylphenidate Hydrochloride

药物管理信息

【特殊管理分类】一类精神药

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】α－苯基－2－哌啶乙酸甲酯盐酸盐

【分子式】$C_{14}H_{19}NO_2 \cdot HCl$

【分子量】269.77

【性状及组成】本品为白色的结晶性粉末，无臭。本品在水或甲醇中易溶，在乙醇中溶解，在三氯甲烷中微溶，在丙酮中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为呼吸兴奋剂，小剂量时通过颈动脉体化学感受器反射性兴奋呼吸中枢，大量时直接兴奋延髓呼吸中枢。

【药代动力学】口服易吸收。一次给药作用可维持 4 小时左右。在体内迅速代谢，经肾排泄。

【药物相互作用】

1．本品与抗癫痫药、抗凝药，以及保泰松合用可使血药浓度升高，出现毒性反应。

2．本品与抗高血压药以及利尿性抗高血压药合用，效应减弱。

3．本品与抗 M－胆碱药合用可增效。

4．本品与中枢兴奋药、肾上腺素受体激动药合用，作用相加，可诱发紧张、激动、失眠、甚至惊厥或心律失常。

【药物过量】

1．中毒症状：超剂量时，有焦虑、紧张、精神错乱、谵妄、幻觉等精神病样症状，严重者可出现昏迷、惊厥甚至死亡。

2．处理：洗胃，促进排泄，并视病情给予相应的对症治疗和支持疗法。

【不良反应】失眠、眩晕、头昏、头痛、恶心、畏食、心悸等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸哌甲酯片	化学药	HZ004224

HY002319 盐酸哌仑西平

【外文名称】Pirenzepine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 46 册

药物理化信息

【化学名】5，11－二氢－11－［（4－甲基－1－哌嗪基）乙酰基］－6*H*－吡啶并［2,3－b］［1,4］苯并二氮杂䓬－6－酮二盐酸盐水合物

【分子式】$C_{19}H_{21}N_5O_2 \cdot 2HCl \cdot H_2O$

【分子量】442.35

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，味苦，有引湿性。

本品在热水中易溶，在水中溶解，在乙醇中极微溶解，在无水乙醇、三氯甲烷或乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为一种具有选择性的抗胆碱能药物，对胃壁细胞的毒蕈碱受体有高度亲和力，而对平滑肌、心肌和唾液腺等的毒蕈碱受体的亲和力低，故应用一般治疗剂量时，仅能抑制胃酸分泌，而很少有其他抗胆碱药物对瞳孔、胃肠平滑肌、心脏、唾液腺和膀胱肌等的副作用。剂量增大则可抑制唾液分泌，只有大剂量才能抑制胃肠平滑肌和引起心动过速。本品不能透过血脑屏障，故不影响中枢神经系统。人口服、肌注或静注本品后，无论是基础胃酸分泌，还是由外源性五肽胃泌素、胰岛素引起的胃酸分泌均受到抑制。本品对胃液的 pH 影响不大，主要是使胃液（包括胃蛋白酶原和胃蛋白酶）分泌量减少，从而使胃最大酸分泌和最高酸分泌下降。

【药代动力学】本品口服吸收不完全，t_{max}为 2～3 小时，绝对生物利用度约为 26% ± 4.6%，与进食同时服用时可减少吸收，降至 10%～20%。除了脑及胚胎组织外，本品在其他脏器和骨骼肌均有分布，其中以肝、肾浓度为最高，脾、肺次之，心脏、皮肤、肌肉中和血浓度较低。血浆蛋白结合率约为 10%，血浆 $t_{1/2}$为 10～12 小时。在体内很少被代谢，口服后 24 小时内约 90% 以原形化合物通过肾脏（12%～50%）和胆道（40%～48%）排泄。虽给药后 3～4 日，始能全部排泄，但未见有蓄积性。

【药物相互作用】

1．乙醇和咖啡等可减弱本品的作用；

2．H_2 受体拮抗剂可增强本品的作用。

【药物过量】对超剂量而引起中毒者，作对症处理，无特殊解毒药。

【不良反应】与剂量有关。常见不良反应有：轻度口干、眼睛干燥及视力调节障碍等轻微副作用，停药后症状即消失。偶有便秘、腹泻、头痛、精神错乱，一般较轻，有2%需停药。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸哌仑西平片	化学药	HZ004225

HY002320　盐酸哌替啶

【其他名称】DEMEROL、度冷丁、地美霜、Dolantin、唛啶、Meperidine

【外文名称】Pethidine Hydrochloride

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】1－甲基－4－苯基－4－哌啶甲酸乙酯盐酸盐

【分子式】$C_{15}H_{21}NO_2 \cdot HCl$

【分子量】283.80

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭或几乎无臭。本品在水或乙醇中易溶，在三氯甲烷中溶解，在乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为186～190℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为阿片受体激动剂，是目前最常用的人工合成强效镇痛药。其作用类似吗啡，效力约为吗啡的1/10～1/8，与吗啡在等效剂量下可产生同样的镇痛、镇静及呼吸抑制作用，但后者维持时间较短，无吗啡的镇咳作用。与吗啡相似，本品为中枢神经系统的μ及κ受体激动剂而产生镇痛、镇静作用。本品有轻微的阿托品样作用，可引起心搏增快。

【药代动力学】本品口服或注射给药均可吸收，口服时约有50%首先经肝脏代谢，故血药浓度较低。一次口服后，血药浓度达峰时间1～2小时，可出现两个峰值。蛋白结合率40%～60%。主要经肝脏代谢成哌替啶酸、去甲哌替啶和去甲哌替啶酸水解物，然后与葡萄糖醛酸形成结合型或游离型经肾脏排出，尿液pH酸度大时，随尿排出的原形药和去甲基衍生物有明显增加。消除$t_{1/2}$约3～4小时，肝功能不全时增至7小时以上。本品可通过胎盘屏障，少量经乳汁排出。代谢物去甲哌替啶有中枢兴奋作用，因此根据给药途径的不同及药物代谢的快慢情况，中毒病人可出现抑制或兴奋现象。

【药物相互作用】

1．本品与芬太尼因化学结构有相似之处，两药可有交叉敏感。

2．本品能促进双香豆素、茚满二酮等抗凝药物增效，并用时后者应按凝血酶原时间而酌减用量。

3．注射液不能与氨茶碱、巴比妥类药钠盐、肝素钠、碘化物、碳酸氢钠、苯妥英钠、磺胺嘧啶、磺胺甲噁唑、甲氧西林配伍，否则发生浑浊。

【药物过量】

1．本品逾量中毒时可出现呼吸减慢、浅表而不规则，发绀，嗜睡，进而昏迷，皮肤潮湿冰冷，肌无力，脉缓及血压下降，偶尔可先出现阿托品样中毒症状，瞳孔扩大、心动过速、兴奋、谵妄，甚至惊厥，然后转入抑制。

2．中毒解救口服者应尽早洗胃以排出胃中毒物。人工呼吸、吸氧、给予升压药提高血压，β－肾上腺素受体阻滞药减慢心率、补充液体维持循环功能。静脉注射纳洛酮0.005～0.01mg/kg，成人0.4mg，亦可用烯丙吗啡作为拮抗剂。但本品中毒出现的兴奋惊厥等症状，拮抗剂可使其症状加重，此时只能用地西泮或巴比妥类药物解除。当血内本品及其代谢产物浓度过高时，血液透析能促进排泄毒物。

【不良反应】

1．本品的耐受性和成瘾性程度介于吗啡与可待因之间，一般不应连续使用。

2．治疗剂量时可出现轻度的眩晕、出汗、口干、恶心、呕吐、心动过速及直立性低血压等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸哌替啶片	化学药	HZ004226
盐酸哌替啶注射液	化学药	HZ004227

HY002321　盐酸哌唑嗪

【外文名称】Prazosin Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】1－（4－氨基－6,7－二甲氧基－2－喹唑啉基）－4－（2－呋喃甲酰）哌嗪盐酸盐

【分子式】$C_{19}H_{21}N_5O_4 \cdot HCl$

【分子量】419.87

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，无味。本品在乙醇中微溶，在水中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理作用

(1) 盐酸哌唑嗪为选择性突触后 α_1 受体阻滞剂，是喹唑啉衍生物，本品可松弛血管平滑肌，扩张周围血管，降低周围血管阻力，降低血压。

(2) 本品扩张动脉和静脉，降低心脏前负荷与后负荷，使左心室舒张末压下降，改善心功能，治疗心力衰竭起效快，1 小时达高峰，持续 6 小时。

(3) 本品对肾血流量与肾小球滤过率影响小，可通过阻滞膀胱颈、前列腺包膜和腺体、尿道的 α_1 受体减轻前列腺增生病人排尿困难。

(4) 动物实验显示，大部分药物与 α_1 酸性糖蛋白相结合，仅 5% 药物以游离型存在于血液中，肺、心脏、血管等部位的浓度较高，而在脑中较低。

(5) 本品不影响 α_2 受体，降压时很少发生反射性心动过速，对心排出量影响较小，也不增加肾素分泌。长期应用对脂质代谢无影响。

2. 致癌、致突变及生殖毒性

(1) 大鼠使用人体最高推荐剂量（一日 20mg）225 倍的盐酸哌唑嗪 18 个月，未发现致癌作用；在基因毒理学研究中，亦未发现盐酸哌唑嗪有致基因突变的作用。

(2) 大鼠给以人体最高推荐剂量的 225 倍（75mg/kg）盐酸哌唑嗪，生殖能力下降；而以人体最大推荐剂量的 75 倍（25mg/kg）给药，对生殖没有影响。犬与大鼠以每日 25mg/kg 的剂量给药，为期 1 年，睾丸出现萎缩及坏死；而以一日 10mg/kg（人体最高推荐剂量的 30 倍）给药，未发现上述变化。105 例长期服用盐酸哌唑嗪的患者监测 17 - 酮类固醇的分泌，未发现有异常变化；27 例服药长达 51 个月的患者亦未发现药物引起精子形态学改变。

(3) 对妊娠大鼠、兔及猴子分别以人体最高推荐剂量的 225 倍或 12 倍给药时，未发现胎儿出现外观、内脏及骨骼异常。

【药代动力学】本品口服吸收完全，生物利用度 50%～85%，血浆蛋白结合率高达 97%。本品口服后 2 小时起降压作用，血药浓度达峰时间为 1～3 小时，$t_{1/2}$为 2～3 小时，心力衰竭时 $t_{1/2}$延长达 6～8 小时。持续作用 10 小时。本品主要通过去甲基化和共价键结合形式在肝内代谢，随胆汁与粪便排泄，尿中仅占 6%～10%、5%～11% 以原形排出，其余以代谢物排出。心力衰竭时，清除率比正常为慢，不能被透析清除。

【药物相互作用】

1. 与钙拮抗药同用，降压作用加强，剂量须适当调整。与其他降压药或利尿药同用，也须同样注意。

2. 与噻嗪类利尿药或 β 受体阻滞药合用，使降压作用加强而水钠潴留可能减轻，合用时应调节剂量以求每一种药物的最小有效剂量。

3. 与非甾体类抗炎镇痛药同用，尤其与吲哚美辛同用，可使本品的降压作用减弱。

4. 与拟交感类药物同用，本品的降压作用减弱。

5. 本药与以下药物合用时无不良反应发生：地高辛、胰岛素；磺脲类降糖药，包括降糖灵、甲磺丁脲、氯磺丙脲、妥拉磺脲；镇静剂，包括利眠宁、安定，丙磺舒；抗心律失常药，包括普鲁卡因胺、氨酰心安、奎尼丁；止痛、退热及抗炎药，包括丙氧芬、阿司匹林、消炎痛、保泰松。

【药物过量】本品过量发生低血压，甚至循环衰竭时，可让病人保持卧位促使血压和心率恢复正常。若无效则须补充血容量，必要时给予血管收缩药。治疗中应注意肾功能变化。本品不易经透析排出。

【不良反应】

1. 本品可引起晕厥，大多数由体位性低血压引起，偶发生在心室率为 100～160 次/分的情况下，通常在首次给药后 30～90 分钟或与其他降压药合用时出现。低钠饮食与合用 β 受体阻滞剂的患者较易发生。如果将首次剂量改为 0.5mg，临睡前服用，可防止或减轻这种不良反应；在给本药前一天停止使用利尿药，也可减轻“首次现象”。这种副作用有自限性，多数情况下不会再发生。

2. 眩晕和嗜睡可发生在首次服药后，在首次服药或加量后第一日应避免驾车和危险的工作。目眩可发生于体位由卧位变为立位时，缓慢起床可避免。此外，目眩在饮酒、长时间站立、运动或天气较热时也可出现，故在上述情况下应慎用本品。

3. 发生率为 5% 的不良反应依次为眩晕（10.3%）、头痛（7.8%）、嗜睡（7.6%）、精神差（6.9%）、心悸（5.3%）、恶心（4.9%）。不良反应多发生在服药初期，可以耐受。

其他不良反应发生率为 1%～4% 的如下：呕吐、腹泻、便秘、水肿、体位性低血压、晕厥、头晕、抑郁、易激动、皮疹、瘙痒、尿频、视物模糊、巩膜充血、鼻塞、鼻出血。

发生率低于 1% 的不良反应有：腹部不适、腹痛、肝功能异常、胰腺炎、心动过速、感觉异常、幻觉、脱发、扁平苔藓、大小便失禁、阳痿、阴茎持续勃起。其他偶见不良反应：耳鸣、发热、出汗、关节炎和抗核抗体阳性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸哌唑嗪膜	化学药	HZ0004228
盐酸哌唑嗪片	化学药	HZ0004229

HY002322　盐酸匹哌氮酯

【其他名称】哌哌氮嗪酯、咳塞坦、Pipazetate、Selvigon

【外文名称】Pipazethate Hydrochloride

【性状及组成】为白色结晶粉末，极易溶于水，能溶于乙醇、甲醇，难溶于丙酮和苯。

药物药理信息

【药理毒理】本品抑制咳嗽中枢，为非成瘾性中枢镇咳药，兼有局麻呼吸道黏膜、解除呼吸道平滑肌痉挛、镇静和镇痛作用。可用于治疗百日咳，麻疹等引起的剧烈无痰咳嗽。

【药代动力学】口服 10～30 分钟起效，作用持续 4～6h。

【不良反应】偶见恶心、呕吐、不安、失眠，心动过速和药疹等反应。有 4 岁健康儿童误服本品产生嗜睡，激动，惊厥，继而昏迷伴心律不齐的报道。

HY002323　盐酸平阳霉素

【外文名称】Bleomycin A5 Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】*N*－［3－［（4－氨基丁基）氨基］丙基］博莱霉素酰胺盐酸盐

【分子式】$C_{57}H_{83}N_{19}O_{21}S_2 \cdot NHCl$

【性状及组成】本品为白色疏松块状物或粉末，无臭或几乎无臭，引湿性较强。

本品在水中或甲醇中易溶、在乙醇中微溶，在丙酮、三氯甲烷或乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理：平阳霉素是由平阳链霉菌（*Stieplomyces Pingyangensisn* S.P.）产生的博莱霉素类抗肿瘤抗生素，能抑制癌细胞 DNA 的合成和切断 DNA 链，影响癌细胞代谢功能，促进癌细胞变性，坏死。

体外实验证明：平阳霉素对培养的多种癌细胞如肝癌 BEL7402，胃癌 MGC803，鼻咽癌 CNB－2，结肠癌 HT－29 和口腔鳞癌 KB 均有较强的杀灭作用。

在体内：平阳霉素对大鼠皮下接种的瓦克瘤 256，小鼠肉瘤 180，肉瘤 37，肝癌和黑色素瘤都有明显的抑制作用，对小鼠皮下接种的结肠癌 C_{20}；食管癌 SGA73 和 Lewis 肺癌的抗肿瘤作用强于丝裂霉素和 Bleomycin A2。平阳霉素为细胞周期非特异性药物，对机体的免疫功能和造血功能无明显影响。

2．毒理：用 18～20 克体重的小白鼠，雄雌各半，随机分组，每组 10 只动物，分别由静脉或腹腔内注射平阳云霉素，观察 14 天，记录死亡动物数，用机率对数绘图法测定 LD_{50}和 LD_{10}。结果：平阳霉素静脉注射的 LD_{50}为 165ml/kg，LD_{10}为 100ml/kg；腹腔内注射的 LD_{50}为 188ml/kg，LD_{10}为 125ml/kg。

【药代动力学】给接种艾氏腹水癌的荷瘤小白鼠注射平阳霉素，测定了肾、胃、肺、肝、肌、血、肿瘤、脾、心和骨中的药物浓度，发现除肾脏外，肿瘤中药物浓度最高，瘤血比达到 4:1。

【不良反应】平阳霉素的不良反应主要有发热、胃肠道反应（恶心、呕吐、食欲减退等）、皮肤反应（色素沉着、角化增厚、皮炎、皮疹等）、脱发，肢端麻病和口腔炎症等，肺部症状（肺炎样病变或肺纤维化）出现率低于博莱霉素。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸平阳霉素	化学药	HZ0005095

HY002324　盐酸普拉克索

【外文名称】Pramipexole Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】（*S*）－2－氨基－4,5,6,7－四氢－6－丙胺－苯并噻唑二盐酸盐。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：普拉克索是一种非麦角类多巴胺激动剂。体外研究显示，普拉克索对 D_2 受体的特异性较高并具有完全的内在活性，对 D_3 受体的亲和力高于 D_2 和 D_4 受体。普拉克索与 D_3 受体的这种结合作用与帕金森氏病的相关性不明确。普拉克索治疗帕金森氏病的确切机制尚不清楚，目前认为与激活纹状体的多巴胺受体有关。动物电生理试验显示，普拉克索可通过激活纹状体与黑质的多巴胺受体而影响纹状体神经元放电频率。

2．毒理研究

（1）遗传毒性：普拉克索 Ames 实验、HGRRT V79 基因突变试验、CHO 细胞染色体畸变试验、小鼠微核试验结果均为阴性。

（2）生殖毒性：生育力实验中，大鼠给予普拉克索 2.5mg/（kg·d）［按 mg/m^2 推算，相当于人最大

推荐剂量（1.5mg，每天3次）的5.4倍]，可见动情周期延长，着床率降低，这可能与普拉克索导致的血清催乳素水平降低有关（在大鼠早期妊娠中，胚胎的着床和维持需要催乳素，而家兔和人则不需要）。妊娠大鼠于致畸敏感期给予普拉克索1.5mg/(kg·d)（按血浆AUC推算，相当于人最大推荐剂量时AUC的4.3倍），可总吸收胎发生率增加，这可能与普拉克索导致的血清催乳素水平降低有关。妊娠家兔于致畸敏感期给予普拉克索10mg/（kg·d）（血浆AUC为人给予最大推荐剂量时AUC的71倍），未见异常。妊娠大鼠围产期给予普拉克索0.5mg/（kg·d）（按mg/m^{2}推算相当于人的最高临床推荐剂量）或更高剂量，子代大鼠出生后生长未受不良影响。

（3）致癌性：小鼠与大鼠掺食法分别给予普拉克索0.3、2、10mg/（kg·d）（按mg/m^{2}推算，分别相当于人最大推荐剂量的0.3、2.2和11倍）或0.3、2、8mg/（kg·d）（按血浆AUC推算，分别相当于人最大推荐剂时AUC的0.3、2.5和12.5倍），未见肿瘤发生率增加。

【药代动力学】普拉克索口服吸收迅速完全。绝对生物利用度高于90%，最大血浆浓度在服药后1~3小时之间出现。与食物一起服用不会降低普拉克索吸收的程度，但会降低其吸收速率。普拉克索显示出线性动力学特点，患者间血浆水平差异很小。

在人体内，普拉克索的血浆蛋白结合度很低（小于20%），分布容积很大。普拉克索在男性体内的代谢程度很低。

以原形从肾脏排泄是普拉克索的主要清除途径。^{14}C标记的药物大约有90%是通过肾排泄的，粪便中的药物少于2%。普拉克索的总清除率大约为500ml/min，肾脏清除率大约为400ml/min。年轻人和老年人的普拉克索清除半衰期（$t_{1/2}$）从8~12小时不等。

【药物相互作用】普拉克索与血浆蛋白的结合程度很低（低于20%），在男性体内几乎不发生生物转化。因此，普拉克索不可能与影响血浆蛋白结合的其他药物相互作用，也不可能通过生物转化清除。由于抗胆碱能药物主要通过生物转化清除，所以尽管普拉克索与抗胆碱能药物的相互作用还未被研究，但可推测这种相互作用的可能性非常有限。普拉克索与司来吉兰和左旋多巴没有药代动力学的相互作用。

西咪替丁可以使普拉克索的肾脏清除率降低大约34%，可能是通过对肾小管阳离子分泌转运系统的抑制实现的。因此，抑制这种主动的肾脏清除途径或通过这种途径清除的药物，例如西咪替丁和金刚烷胺，可能与普拉克索发生相互作用并导致任何一种或两种药物的清除率降低。

当这些药物与本品同时应用时，应考虑降低普拉克索剂量。

当本品与左旋多巴联用时，建议在增加本品的剂量时降低左旋多巴的剂量，而其他抗帕金森病治疗药物的剂量保持不变。

由于可能的累加效应，患者在服用普拉克索的同时要慎用其他镇静药物或酒精。

普拉克索应避免与抗精神病药物同时应用。

【药物过量】没有关于药物过量的临床经验。预期的不良事件可能是与多巴胺能受体激动剂药效学特点相关的事件，包括恶心、呕吐、运动功能亢进、幻觉、激动和低血压。多巴胺能受体激动剂用药过量没有明确的解毒剂。如果存在中枢神经系统兴奋症状，可能需要神经抑制类药物进行治疗。用药过量可能需要一般的支持性处理措施，以及胃灌洗、静脉输液和心电监护等措施。

【不良反应】基于汇总的安慰剂对照试验，其中包括1351名服用本品的患者和1131名服用安慰剂的患者，分析显示两组都经常发生不良事件。88%服用本品的患者和83.6%服用安慰剂的患者至少报道过一起不良事件。当本品日剂量高于1.5mg时嗜睡的发生率增加。与左旋多巴联用时最常见的不良反应是运动障碍。便秘、恶心和运动障碍往往随治疗进行逐渐消失。治疗初期可能发生低血压，尤其本品药量增加过快时。下面是安慰剂对照试验中服用本品所发生的药物不良反应（数字为高于安慰剂的发生率）。

精神障碍：常见（1%~10%），失眠、幻觉、精神错乱。

神经系统异常：常见（1%~10%），眩晕、运动障碍、嗜睡。

血管异常：不常见（0.1%~1%），低血压。

胃肠道异常：常见（1%~10%），恶心、便秘。

全身异常：常见（1%~10%），外周水肿。

本品与嗜睡有关，与偶发的白天过度嗜睡及突然睡眠发作也有关。

本品可能与性欲异常有关（增加或降低）。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸普拉克索片	化学药	HZ004230

HY002325 盐酸普鲁卡因

【外文名称】Procaine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】4－氨基苯甲酸－2－（二乙氨基）乙酯盐酸盐

【分子式】$C_{13}H_{20}N_2O_2 \cdot HCl$

【分子量】272.77

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末，无臭，味微苦，随后有麻痹感。本品在水中易溶，在乙醇中略溶，在三氯甲烷中微溶，在乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为154～157℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为酯类局麻药，能暂时阻断神经纤维的传导而具有麻醉作用，本品对皮肤、黏膜穿透力弱，不适于表面麻醉。本品弥散性和通透性差，其盐酸盐的结合形式在组织中释放出游离碱而发挥局部麻醉作用。本品对中枢神经系统常量抑制，过量兴奋。首先引起镇静、头昏，痛阈提高，继而引起眩晕、定向障碍、共济失调，中枢抑制继续加深，出现知觉迟钝、意识模糊、进而进入昏迷状态。剂量继续加大，可出现肌肉震颤、烦躁不安和惊厥等中枢兴奋的中毒症状。本品小剂量有兴奋交感神经的作用，使心率加快、血压上升，剂量加大，由于心肌抑制，外周血管扩张、神经节轻度阻断而血压下降，心率增快。本品抑制突触前膜乙酰胆碱释放，产生一定的神经肌肉阻断，可增强非去极化肌松药的作用，并直接抑制平滑肌，可解除平滑肌痉挛。

【药代动力学】本品进入体内吸收迅速，很快分布，维持药效约30～60分钟，大部分与血浆蛋白结合，并蓄积在骨骼肌、红细胞等组织内，当血浆浓度降低时再分布到全身。在血循环中大部分迅速被血浆中假性胆碱酯酶水解，生成对氨基苯甲酸和二乙氨基乙醇，前者80%以原形和结合型，后者仅有30%经肾脏排出，其余经肝酯酶水解，进一步降解后随尿排出。本品易通过血－脑屏障和胎盘。

【药物相互作用】

1．可加强肌松药的作用，使肌松药作用时间延长，与肌松药合用宜减少肌松药的用量。

2．与其他局部麻醉药合用时应减量。

3．本品可削减磺胺类药物的药效，不宜同时应用磺胺类药物。

4．本品可增强洋地黄类药物的作用，合用可导致其毒性反应。

5．新斯的明等抗胆碱酯酶药物可干扰本品代谢，使本品毒性增强，忌联合应用。

6．本品可加深麻醉性镇痛药对呼吸的抑制及致低血压的作用。

7．本品忌与下列药品配伍：碳酸氢钠、巴比妥类、氨茶碱、硫酸镁、肝素钠、硝普钠、甘露醇、甲基硫酸新斯的明、氢化考的松、地塞米松等。

【药物过量】过量中毒的症状如头昏、目眩，继之寒战、震颤、恐慌、多言，最后可致惊厥和昏迷，为了防止过量中毒，最大剂量不要超过1.0g，宜用最低有效浓度，应严格控制单位时间内的用量，按20分钟计，局部注射每千克体重不宜超过20mg；气管系黏膜表面麻醉时，每千克体重5～10mg；脊椎麻醉时，每千克体重3～4mg。

【不良反应】本品可有高敏反应和过敏反应，个别病人可出现高铁血红蛋白症；剂量过大，吸收速度过快或误入血管可致中毒反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方普鲁卡因片	化学药	HZ001339
复方盐酸普鲁卡因胶囊	化学药	HZ001461
复方樟柳碱注射液	化学药	HZ001485
普鲁卡因泛酸钙胶囊	化学药	HZ002918
普鲁卡因肾上腺素注射液	化学药	HZ002919
庆大霉素普鲁卡因胶囊	化学药	HZ003011
庆大霉素普鲁卡因维 B_{12} 胶囊	化学药	HZ003012
庆大霉素普鲁卡因维 B_{12} 颗粒	化学药	HZ003013
溴米那普鲁卡因注射液	化学药	HZ003813
盐酸普鲁卡因片	化学药	HZ004233
盐酸普鲁卡因注射液	化学药	HZ004234
注射用盐酸普鲁卡因	化学药	HZ005096
海贝胃痛胶囊	中成药	ZC002041
溃疡宁片	中成药	ZC003120
麝香活血化瘀膏	中成药	ZC004700
玉金方胶囊	中成药	ZC007071
玉金方片	中成药	ZC007072

HY002326　盐酸普鲁卡因胺

【外文名称】Procainamide Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】*N*－［（2－二乙氨基）乙基］－4－氨基苯甲酰胺盐酸盐

【分子式】$C_{13}H_{21}N_3O \cdot HCl$

【分子量】271.79

【性状及组成】本品为白色或淡黄色结晶性粉末，无臭，有引湿性。本品在水中易溶，在乙醇中溶解，在三氯甲烷中微溶，在乙醚中极微溶解。

熔点：本品的熔点为 165～169℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品属 Ia 类抗心律失常药。该药可增加心房的有效不应期，降低心房、浦肯野纤维和心室肌的传导速度，通过升高阈值而降低心房、普肯野纤维、乳头肌和心室的兴奋性，延长不应期及抑制舒张期除极，降低自律性。对心肌收缩性的抑制作用较弱，可轻度减低心输出量。间接抗胆碱作用弱于奎尼丁，小量即可使房室传导加速、用量偏大则直接抑制房室传导。本品有直接扩血管作用，但不阻断 α 受体。其代谢产物 *N*－乙酰普鲁卡因胺具有药理活性。用量 > 12μg/ml 时产生毒性反应。

【药代动力学】本品吸收较快而完全，广泛分布于全身，75%集中在血液丰富的组织内。表观分布容积约 1．75～2.5L/kg。蛋白结合率为 15%～20%。半衰期约为 2～3 小时，因乙酰化速度而异，心、肾功能衰竭者可延长。约 25%经肝脏代谢成 *N*－乙酰普鲁卡因胺。乙酰化速度受遗传因素影响，中国大多数人为快乙酰化型，乙酰化快者血中乙酰化代谢物可较原形药的浓度高 2～3 倍。饮酒可增加原形药的乙酰化，因此原药总的清除增加，血及尿中 *N*－乙酰普鲁卡因胺与原药比值也增加。*N*－乙酰普鲁卡因胺的半衰期约为 6 小时。

静注后即刻起效。有效血药浓度 2～10μg/ml，中毒血药浓度 12μg/ml 以上。该 30%～60%以原形经肾排出，*N*－乙酰普鲁卡因胺主要经肾清除，原药的 6%～52%以乙酰化形从肾清除，肾功能障碍者体内蓄积量可超过原药；血液透析可清除原药及 *N*－乙酰普鲁卡因胺。

【药物相互作用】

1．与其他抗心律失常药物、抗毒蕈碱药物合用时，效应相加。

2．口服胺碘酮可以改变静脉普鲁卡因的药代动力学特性，降低其清除率，延长其半衰期，因此静脉应用时剂量应减少 20%～30%。

3．与降压药合用，尤其静注本品时，降压作用可增强。

4．与拟胆碱药合用时，本品可抑制这类药对横纹肌的效应。

5．与神经肌肉阻滞剂（包括去极化型和非去极化型阻滞剂）合用时，神经肌肉接头的阻滞作用增强，时效延长。

6．酒精可以增加该药的清除率，缩短其半衰期。

7．抗酸药物可以降低其生物利用度，因此不建议两者合用。

8．西咪替丁可以降低普鲁卡因胺和 *N*－乙酰普鲁卡因胺的肾清除率，因此两药合用时需减低普鲁卡因胺的用量。

9．雷尼替丁可影响该药在肾脏的代谢，合用时注意调整用量。

10．甲氧苄啶可以降低普鲁卡因胺和 *N*－乙酰普鲁卡因胺的肾清除率，合用时需减低普鲁卡因胺的用量。

【药物过量】药物过量急性期可出现高铁血红蛋白血症；还可以引起溶血性贫血，红细胞 G－6－PD 缺乏症，肾功能和肝功能损害。

【不良反应】

1．心血管：产生心脏停搏、传导阻滞及室性心律失常。心电图出现 QRS 波增宽、P－R 及 Q－T 间期延长，R 波在 T 波上诱发多型性室性心动过速（扭转型室性心动过速）或室颤，但较奎尼丁少见。快速静注可使血管扩张产生严重低血压、室颤、心脏停博。血药浓度过高可引起心脏传导异常。

2．胃肠道：大剂量较易引起畏食、恶心、呕吐、腹泻、口苦、肝肿大、氨基转移酶升高等。

3．过敏反应：少数人可有荨麻疹、瘙痒、血管神经性水肿及斑丘疹。

4．红斑狼疮样综合征：发热、寒战、关节痛、皮肤损害、腹痛等。长期服药者较易发生，但也有仅服数次药即出现者。

5．神经：少数人可有头晕、精神抑郁及伴幻觉的精神失常。

6．血液：溶血性或再生不良性贫血、粒细胞减少、嗜酸性细胞增多、血小板减少及骨髓肉芽肿，血浆凝血酶原时间及部分凝血活酶时间延长。

7．肝肾：偶可产生肉芽肿性肝炎及肾病综合征。

8．肌肉：偶可出现进行性肌病及 Sjogren 综合征。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸普鲁卡因胺片	化学药	HZ004231
盐酸普鲁卡因胺注射液	化学药	HZ004232

HY002327 盐酸普罗吗酯

【其他名称】咳必定、咳吗宁

【外文名称】Promolate Hydrochloride

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，易溶于

水。

药物药理信息

【药理毒理】本品为非成瘾性中枢性镇咳药，其镇咳作用强度较可待因弱，等效镇咳剂量约为可待因的10倍。本品尚能缓解组胺、乙酰胆碱和氯化钡引起的气管平滑肌痉挛，并有一定的镇静作用。临床用于治疗各种原因引起的咳嗽，对轻、中度咳嗽的疗效较重度者为好；对急性支气管炎、上呼吸道感染的镇咳疗效较慢性支气管炎为佳。由于它有镇静作用，尤适用于因咳嗽而影响睡眠的病例。

【药代动力学】本品口服后30～60分钟出现明显镇咳效果，作用可持续4～6小时。

【不良反应】偶有口干、恶心、胃部不适等副作用。

HY002328　盐酸普罗帕酮

【其他名称】心律平

【外文名称】Propafenone Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】3－苯基－1－［2－［3－（丙氨基）－2－羟基丙氧基］－苯基］－1－丙酮盐酸盐

【分子式】$C_{21}H_{27}NO_3 \cdot HCl$

【分子量】377.91

【性状及组成】本品为白色的结晶性粉末，无臭，味苦。本品在乙醇、三氯甲烷或冰醋酸中微溶，在水中极微溶解。

熔点：本品的熔点为171～174℃。

药物药理信息

【药理毒理】

1．本品属于Ic类（即直接作用于细胞膜）的抗心律失常药。在离体动物心肌的实验结果指出，0.5～1μg/min时可降低收缩期的去极化作用，因而延长传导，动作电位的持续时间及有效不应期也稍有延长，并可提高心肌细胞阈电位，明显减少心肌的自发兴奋性。它既作用于心房、心室（主要影响浦金野纤维，对心肌的影响较小），也作用于兴奋的形成及传导。临床资料表明，治疗剂量（口服300mg及静注30mg）时可降低心肌的应激性，作用持久，PQ及QRS均增加，延长心房及房室结的有效不应期，它对各种类型的实验性心律失常均有对抗作用。

抗心律失常作用与其膜稳定作用及竞争性β阻断作用有关。它尚有微弱的钙拮抗作用（比维拉帕米弱100倍），尚有轻度的抑制心肌作用，增加末期舒张压，减少博出量，其作用均与用药的剂量成正比。它还有轻度的降压和减慢心率作用。

2．离体实验表明普罗帕酮能松弛冠状动脉及支气管平滑肌。

3．它具有与普鲁卡因相似的局部麻醉作用。

4．大鼠口服180～360mg/（kg·d）（成人推荐用药最大剂量的12～24倍）六个月后发生肾功能异常，肾小管和间质可见炎症和非炎症性反应。长期给予大鼠19倍成人推荐最大用量时可发现肝脂肪变性。

【药代动力学】口服后自胃肠道吸收良好，服后2～3小时抗心律失常作用达峰效，作用可持续8小时以上，其生物利用度呈剂量依赖性，如100mg普罗帕酮3.4%，而300mg的生物利用度为10.6%。本品与血浆蛋白结合率高达93%，剂量增加，生物利用度还会提高。肝功能下降也会增加药物的生物利用度，严重肝功能损害时普罗帕酮的清除减慢。普罗帕酮的药代动力学曲线为非线性。该药半衰期为3.5～4小时。本品经肾脏排泄，主要为代谢产物，小部分（<1%）为原形物。不能经过透析排出。

【药物相互作用】与奎尼丁合用可以减慢代谢过程。与局麻药合用增加中枢神经系统副作用的发生。普罗帕酮可以增加血清地高辛浓度，并呈剂量依赖型。与普萘洛尔、美托洛尔合用可以显著增加其血浆浓度和清除半衰期，而对普罗帕酮没有影响。与华法林合用时可增加华法令血药浓度和凝血酶原时间。与西咪替丁合用可使普罗帕酮血药稳态水平提高，但对其电生理参数没有影响。

【药物过量】药物过量摄入后3小时症状最明显，包括低血压，嗜睡，心动过缓，房内和室内传导阻滞，偶尔发生抽搐或严重室性心律失常。

【不良反应】

1．不良反应较少，主要者为口干，舌唇麻木，可能是由于其局部麻醉作用所致。此外，早期的不良反应还有头痛，头晕、闪耀，其后可出现胃肠道障碍如恶心、呕吐、便秘等。也有出现房室阻断症状。有两例在连续服用两周后出现胆汁郁积性肝损伤的报道，停药后2～4周各酶的活性均恢复正常。据认为这一病理变化属于过敏反应及个体因素性。

2．在试用过程中未见肺、肝及造血系统的损害，有少数病人出现上述口干、头痛、眩晕、胃肠道不适等轻微反应，一般都在停药后或减量后症状消失。有报道个别病人出现房室传导阻滞，Q－T间期延长，P－R间期轻度延长，QRS时间延长等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸普罗帕酮胶囊	化学药	HZ004235
盐酸普罗帕酮片	化学药	HZ004236
盐酸普罗帕酮注射液	化学药	HZ004237

HY002329 盐酸普萘洛尔

【其他名称】恩特来、奈心安、心得安

【外文名称】Propranolol Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】1－异丙氨基－3－（1－萘氧基）－2－丙醇盐酸盐

【分子式】$C_{16}H_{21}NO_2 \cdot HCl$

【分子量】295.81

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶性粉末，无臭，味微甜后苦。本品在水或乙醇中溶解，在三氯甲烷中微溶。

熔点：本品的熔点为 162～165℃。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用

（1）普萘洛尔为非选择性竞争抑制肾上腺素 β 受体阻滞剂。阻断心脏上的 β_1、β_2 受体，拮抗交感神经兴奋和儿茶酚胺作用，降低心脏的收缩力与收缩速度，同时抑制血管平滑肌收缩，降低心肌耗氧量，使缺血心肌的氧供需关系在低水平上恢复平衡，可用于治疗心绞痛。

（2）抑制心脏起搏点电位的肾上腺素能兴奋，用于治疗心律失常。本品亦可通过中枢、肾上腺素能神经元阻滞，抑制肾素释放以及心排出量降低等作用，用于治疗高血压。

（3）竞争性拮抗异丙肾上腺素和去甲肾上腺素的作用，阻断 β_2 受体，降低血浆肾素活性。可致支气管痉挛。抑制胰岛素分泌，使血糖升高，掩盖低血糖症状，延迟低血糖的恢复。

（4）有明显的抗血小板聚集作用，这主要与药物的膜稳定作用及抑制血小板膜 Ca^{2+} 转运有关。

2．致癌、致突变和生殖毒性：在 18 个月内，大鼠或小鼠一日给药 150mg/kg，为期 18 个月，无明显毒性反应，无与药物相关的致癌作用。生殖实验未见与普萘洛尔作用有关的生殖能力损伤。当给与动物 10 倍于人用剂量时，显示本品有胚胎毒性。

【药代动力学】本品口服后胃肠道吸收较完全，广泛地在肝内代谢，生物利用度约 30%。药后 1～1.5 小时达血药浓度峰值，消除半衰期为 2～3 小时，血浆蛋白结合率 90%～95%。个体血药浓度存在明显差异，表观分布容积（3.9±6.0）L/kg。经肾脏排泄，主要为代谢产物，小部分（<1%）为母药。不能经透析排出。

缓释胶囊每日口服一次，在胃肠道内缓慢释放，吸收完全，稳态时的血药浓度达峰时间 6.6 小时，血药峰浓度 21.5ng/ml（剂量为每次 60mg），半衰期（$t_{1/2}$）为 7.0 小时。药物在肝脏有很强首过效应，能透过血－脑脊液化屏障和胎盘，蛋白结合率大于 90%。药物在肝脏中代谢，代谢产物从肾脏排泄。

【药物相互作用】

1．与抗高血压药物相互作用：本品与利血平合用，可导致体位性低血压、心动过缓、头晕、晕厥。与单胺氧化酶抑制剂合用，可致极度低血压。

2．与洋地黄合用，可发生房室传导阻滞而使心率减慢，需严密观察。

3．与钙拮抗剂合用，特别是静脉注射维拉帕米，要十分警惕本品对心肌和传导系统的抑制。

4．与肾上腺素、苯福林或拟交感胺类合用，可引起显著高血压、心率过慢，也可出现房室传导阻滞。

5．与异丙肾上腺素或黄嘌呤合用，可使后者疗效减弱。

6．与氟哌啶醇合用，可导致低血压及心脏停博。

7．与氢氧化铝凝胶合用可降低普萘洛尔的肠吸收。

8．酒精可减缓本品吸收速率。

9．与苯妥英、苯巴比妥和利福平合用可加速本品清除。

10．与氯丙嗪合用可增加两者的血药浓度。

11．与安替比林、茶碱类和利多卡因合用可降低本品清除率。

12．与甲状腺素合用导致 T3 浓度的降低。

13．与西咪替丁合用可降低本品肝代谢，延缓消除，增加普萘洛尔血药浓度。

14．可影响血糖水平，故与降糖药同用时，需调整后者的剂量。

15．麻醉：对大多数病人来说，在外科手术前停用 β 肾上腺素受体拮抗药物是不妥当的，然而在使用乙醚、环丙烷和三氯乙烷之类的麻醉药时须十分小心。如果出现迷走神经兴奋，可以用阿托品（1～2mg 静脉给药）来纠正。

16．对于心室功能较弱的病人，β 肾上腺素拮抗

药与维拉帕米尔同时使用时要加以小心，对于传导异常的病人，不能同时使用这两类药物，在其中一种药物停用后 48 小时内不得静脉注射另一种药物。

17. β 肾上腺素拮抗药与一线抗心律失常药（例如丙吡胺）同时使用时必须十分小心。

【药物过量】一般情况下，如药物过量应尽快排空胃内容物、预防吸入性肺炎。心动过缓时给予阿托品，慎用异丙肾上腺素；必要时安装心脏起搏器。室性早博给予利多卡因或苯妥因钠。心力衰竭时服用洋地黄或利尿剂。低血压时给予升压药，例如去甲肾上腺素或肾上腺素。支气管哮喘给予肾上腺素或氨茶碱。透析无法排出本药。

【不良反应】应用本品可出现眩晕、神志模糊（尤见于老年人）、精神抑郁、反应迟钝等中枢神经系统不良反应；头昏（低血压所致）；心率过慢（<50 次/分钟）；较少见的有支气管痉挛及呼吸困难、充血性心力衰竭；更少见的有发热和咽痛（粒细胞缺乏）、皮疹（过敏反应）、出血倾向（血小板减小）；不良反应持续存在时，须格外警惕雷诺氏征样四肢冰冷、腹泻、倦怠、眼口或皮肤干燥、恶心、指趾麻木、异常疲乏等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方普萘洛尔咖啡因片	化学药	HZ001340
盐酸普萘洛尔缓释胶囊	化学药	HZ004238
盐酸普萘洛尔缓释片	化学药	HZ004239
盐酸普萘洛尔片	化学药	HZ004240
盐酸普萘洛尔注射液	化学药	HZ004241

HY002330　盐酸齐拉西酮

【外文名称】Ziprasidone Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】5－［2－［4－（1,2－苯并异噻唑－3－基）－1－哌嗪基］乙基］－6－氯－1,3－二氢－2（1*H*）－吲哚－2－酮盐酸盐半水合物

【分子式】$C_{21}H_{21}ClN_4OS\cdot HCl\cdot 1/2H_2O$

【分子量】458.41

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理作用：齐拉西酮是一种非典型抗精神病药，其结构与吩噻嗪类或丁酰苯类抗精神病药物不同。体外研究显示，齐拉西酮对多巴胺 D2、D3、5－羟色胺 5－HT_2A、5－HT_2C、5－HT_1A、5－HT_1D 和 α_1－肾上腺素能受体具有较高的亲和力，对组胺 H_1 受体具有中等亲和力，对包括 M 胆碱能受体在内的其他受试受体/结合位点未见亲和力。齐拉西酮对 D2、5－HT_2A、5－HT_1D 受体具有拮抗作用，对 5－HT_1A 受体具有激动作用。齐拉西酮能抑制突触对 5－羟色胺和去甲肾上腺素的再摄取。

与其他抗精神分裂症药物一致，齐拉西酮的作用机制不明确。研究认为其抗精神分裂症作用可能是通过对 D2 和 5－HT_2 受体的拮抗作用来发挥的，对其他相似亲和力受体的拮抗作用可能是导致其他治疗作用和副作用的原因。对 H_1 受体的拮抗作用可能是齐拉西酮产生嗜睡的原因，对 α_1－肾上腺素能受体的拮抗作用可能是产生体位性低血压的原因。

2. 毒理研究

（1）遗传毒性　Ames 试验中，在无代谢活化时齐拉西酮可使一株鼠伤寒沙门氏菌回复突变率升高。小鼠淋巴瘤细胞基因突变试验、人淋巴细胞染色体畸变试验结果均为阳性，小鼠微核试验结果为阴性。

（2）生殖毒性　SD 大鼠在齐拉西酮剂量为 10～160mg/（kg·d）（按 mg/m^2 推算，相当于人最大推荐剂量 200mg/d 的 0.5～8 倍）时可见交配时间延长，在剂量为 160mg/（kg·d）时生育力降低，在剂量为 40mg/（kg·d）时对生育力未见影响。雄性大鼠在剂量为 160mg/（kg·d）时与未给药雌性大鼠交配后，未见生育力降低，因此齐拉西酮可能仅对雌性大鼠的生育力有影响。在一项周期为 6 个月的大鼠试验中，给药剂量为 200mg/kg（按 mg/m^2 推算，相当于人最大推荐剂量 200mg/d 的 10 倍），未见对睾丸的影响。

大鼠致畸敏感期给予齐拉西酮 10～160mg/（kg·d），可见胎仔体重降低、骨骼骨化延迟，但未见畸形，对发育无影响剂量为 5mg/（kg·d）。在剂量为 40 和 160mg/kg 时可见母体毒性。家兔致畸敏感期给予齐拉西酮 30mg/（kg·d）（按 mg/m^2 推算，相当于人最大推荐剂量 200mg/d 的 3 倍）可见胎仔结构畸形发生率增加，对发育无影响剂量为 10 mg/（kg·d）。

大鼠围产期给予齐拉西酮 10mg/（kg·d）（按 mg/m^2 推算，相当于人最大推荐剂量 200mg/d 的 0.5 倍）或更高剂量，死产数增加，哺乳前 4 天存活动物数减少。在剂量为 5 mg/（kg·d）（按 mg/m^2 推算，相当于人最大推荐剂量 200mg/d 的 0.2 倍）时，可见子代动物发育延迟和神经行为功能受损。

（3）致癌性　Long Evans 大鼠和 CD－1 小鼠掺食法分别给予齐拉西酮 2、6、12mg/（kg·d）或 50、100、200mg/（kg·d）（按 mg/m^2 推算，分别相当于人最大剂量 200mg/d 的 0.1～0.6 倍和 1～5 倍），连续 24 个月。与对照组比较，大鼠和雄性小鼠中未见肿瘤发生率增加。在雌性小鼠中，可见垂体腺瘤和垂

体癌、乳腺癌发生率呈剂量依赖性增加。啮齿类动物长期给予其他抗精神病药物可见垂体和乳腺增生，认为是催乳素介导的。小鼠掺食法给予齐拉西酮100、200mg/（kg·d），连续1个月，可见雌性小鼠血清催乳素水平升高，雄性小鼠无影响。大鼠掺食法给予齐拉西酮也未见催乳素改变。啮齿类动物中催乳素介导的内分泌肿瘤对人体用药风险的相关性尚不明确。

【药代动力学】 齐拉西酮的药理活性主要来自原形药物。口服盐酸齐拉西酮后经胃肠道吸收良好，分布广泛，6～8小时达血浆峰浓度，1～3天达到稳态血浓度，血浆蛋白结合率大于99%，齐拉西酮的平均表观分布容积为1.5L/kg，餐时服用20mg药物的绝对生物利用度约为60%，食物能增加本品的吸收约2倍。在推荐的临床剂量范围内，齐拉西酮的平均终末半衰期（$t_{1/2}$）约为7小时，平均表观系统清除率为7.5ml/min/kg。血浆蛋白结合率大于99%。口服齐拉西酮后主要经肝脏充分代谢，仅少量原形药经尿液（<1%）和粪便（<4%）排泄。齐拉西酮主要经三种代谢途径消除、生成四种主要的循环代谢产物：苯并异噻唑（BITP）亚砜、BITP－砜、齐拉西酮亚砜和S－甲基－二氢齐拉西酮。经尿液和粪便排泄的药物分别约为20%和66%，血清中原形齐拉西酮约为44%。体外人肝细胞组分研究表明，经两步生成S－甲基－二氢齐拉西酮。体外人肝微粒体和重组酶研究表明，氧化代谢齐拉西酮的CYP酶主要是CYP3A4，CYP1A2的作用较弱。在体分泌和代谢资料表明，不足1/3的齐拉西酮经细胞色素P450氧化代谢消除，约2/3齐拉西酮经醛氧化酶代谢清除。对醛氧化酶有临床意义的抑制剂或激动剂情况尚不清楚。

年龄、性别和种族对齐拉西酮药代动力学无影响。不需要调整剂量。

吸烟：体外人肝细胞酶进行的研究表明，齐拉西酮不是CYP1A2酶的底物，吸烟应该对齐拉西酮的药代动力学无影响。群体药代动力学研究结果与体外研究结果一致，群体药代动力学研究表明，吸烟和不吸烟对齐拉西酮的药代动力学无影响

肾损伤：齐拉西酮代谢率高，经肾分泌的原形药物低于1%，单独肾损伤对齐拉西酮的药代动力学无明显影响，不需根据肾功能损伤程度调整用药剂量。

肝损伤：齐拉西酮主要经肝脏清除，肝损伤会导致齐拉西酮AUC增加。对13例Childs－PughA型和B型坏死性肝炎受试者进行的多剂量（20mg，一日两次，连续5天）研究结果显示，Childs－PughA型和B型受试者与相匹配的对照者（$n=14$）比较，AUC_{0-12}分别增加13%和34%。肝损害者的半衰期为7.1小时，而对照者为4.8小时。在狗体进行的毒理研究，当给予口服药物，药物暴露（血浆AUC）是最大临床暴露量2倍的剂量时，出现肝内胆汁淤积和血清ALT升高、碱性磷酸酶升高。在严重肝脏功能损害患者中使用齐拉西酮的经验还不足，因此，在这组患者中，应谨慎使用齐拉西酮。

【药物相互作用】

1．齐拉西酮不应与延长Q－T间期的药物合用。

2．齐拉西酮主要作用于中枢神经系统，与其他作用于中枢的药物合用时应十分谨慎。

3．齐拉西酮可能诱发低血压，因此可能会增强某些抗高血压药物的疗效。

4．齐拉西酮可能拮抗左旋多巴胺和多巴胺激动剂的作用。

5．其他药物对齐拉西酮的影响

卡马西平：卡马西平为CYP3A4诱导剂，每天2次连续21天服用200mg卡马西平，患者齐拉西酮的AUC降低约35%。卡马西平剂量越高，齐拉西酮的AUC降得越多。

酮康唑：酮康唑为强效CYP3A4抑制剂，患者每天服用400mg酮康唑，连续5天，齐拉西酮的AUC和C_{max}增加约35%～40%。其他CYP3A4抑制剂有相似的作用。

西咪替丁：800mg西咪替丁，每日1次，服用2天，对齐拉西酮药代动力学无影响。

制酸剂：合用30ml抗酸剂（Maalox），对齐拉西酮药代动力学无影响。

此外，在对照临床试验中，对入组的精神分裂症患者进行的群体药代动力学分析表明，与苯扎托品、普萘洛尔和劳拉西泮合用，齐拉西酮的药代动力学无显著性改变。

6．齐拉西酮对其他药物的影响

体外试验表明，与主要经CYP1A2、CYP2C9、CYP2C19、CYP2D6和CYP3A4清除的药物合用，齐拉西酮不会干扰其代谢。几乎没有因为置换作用而造成齐拉西酮与其他药物间的相互作用。

锂：齐拉西酮（40mg，每日2次）、与锂（450mg，每日2次）合用7天，不会影响锂的稳态血药浓度或肾清除率。

口服避孕药：齐拉西酮（20mg，每日2次）与口服避孕药炔雌醇（0.03mg）和左炔诺孕酮（0.15mg）合用，不会影响这两种口服避孕药的药代动力学。

右美沙芬：与体外试验结果一致，一项在健康志愿者中进行的研究结果显示，齐拉西酮不会改变CYP2D6的底物－右美沙芬代谢生成其主要代谢产物

右啡烷的过程。尿中右美沙芬/右啡烷的比值无显著性改变。

【药物过量】人体药物过量经验：在5400例患者或正常受试者参加的上市前的临床试验中，偶然或有意过量使用齐拉西酮共10人，所有这些患者均完全恢复正常，未出现后遗症。服最大剂量3240mg的患者仅出现如下不良反应：轻度镇静、言语不清和一过性高血压（200/95）。

上市后的使用中，报道的与齐拉西酮过量相关的不良反应主要包括：锥体外系症状、嗜睡、震颤和焦虑，经证实上市后服用最大剂量的过量患者有一例病例报道，剂量达12800mg，出现了锥体外系症状和QTc间期延长达446毫秒，但未发生心脏方面后遗症。

过量处理：一旦出现急性过量，建立并保持通风，确保氧气充足。可以静脉输液或洗胃（如果患者不清醒，可插管，插管后洗胃），考虑泻药与活性炭一起使用。过量用药后可能出现头颈部感觉迟钝、癫痫发作或张力障碍反应，这可能导致吸入风险，诱发呕吐。

立即监测心血管功能并持续监测心电图，以发现可能出现的心律失常。如果服药治疗心律失常，需谨慎应用丙吡胺、盐酸普鲁卡因胺和奎尼丁，因为理论上这些药物可能增加齐拉西酮致Q-T间期延长的风险。

采取适当的措施，如静脉输液的方式处理低血压和循环衰竭，如果使用拟交感神经药物改善血管功能，就不能使用肾上腺素和多巴胺，因为β_1激动作用加上齐拉西酮的α_1拮抗作用可能加剧低血压。同样地，溴苄胺（抗心律失常药）的α肾上腺素阻断特性可能会协同齐拉西酮的这方面作用，也可能加重低血压，使问题复杂化。

对严重的锥体外系症状，可用抗胆碱能药物处理。齐拉西酮过量时，无特殊的解毒药，也不能透析。可以考虑使用多种药物进行对症处理。应密切进行医学观察和监测，直到患者康复。

【不良反应】

1. 国外上市前临床试验报道了以下不良反应

精神分裂症患者：齐拉西酮组和安慰剂组不良反应所致停药率分别为4.1%（29/702）和2.2%（6/273）。主要不良反应为皮疹，齐拉西酮组有7例患者因皮疹停药（1%），安慰剂组为0。

短期、固定剂量、安慰剂对照试验中，剂量依赖性不良反应

集合分析4个研究中剂量-反应关系表明，下列不良反应发生率与剂量明显相关：乏力、体位低血压、畏食、口干、流涎增加，关节痛、焦虑、头晕、肌张力障碍、肌张力亢进、嗜睡、震颤、鼻炎、皮疹和视觉异常。

锥体外系综合征（EPS）：短期，安慰剂对照试验中，治疗组和安慰剂组EPS的发生率分别为14%和8%。经Simpson-Angus测量表（主要评价EPS）和Barnes Akathisia表（主要评价静坐不能）评估，治疗组和安慰剂组间无差异。

生命体征变化：齐拉西酮与体位性低血压有关。

体重增加：集合分析4周和6周安慰剂对照临床试验，结果显示齐拉西酮治疗组和安慰剂组体重超过初始体重7%的患者比例分别为10%和4%，两组比较差异有统计学意义。与安慰剂组相比，治疗组体重平均增加0.5kg。在这些临床试验中，齐拉西酮治疗组和安慰剂组出现体重增加的不良反应率分别为0.4%和0.4%。长期用齐拉西酮治疗期间，根据基线体重指数（BMI，body mass index）对患者进行分组，结果显示与体重正常（体重指数BMI=23~27）或体重过重（BMI>27）的患者相比，BMI较低（BMI<23）的患者平均体重增加最大、具有临床意义的体重增加（体重的7%）的发生率也最高。基线BMI低的患者体重平均增加1.4kg，基线BMI正常的患者体重无变化，基线BMI高的患者体重平均降低1.3kg。

心电图（ECG）变化：齐拉西酮与QTc间期增加有关，在治疗精神分裂症的临床试验中，患者用齐拉西酮后心率平均增加1.4次/分，患者服安慰剂心率平均降低0.2次/分。

2. 上市前口服齐拉西酮的其他不良反应

下面按身体系统对不良事件再次进行分类，并且按照下列定义的发生频率进行排序：常见不良反应，发生率至少为1%；不常见不良反应，1/1000<发生率<1/100；罕见不良反应，发生率<1/1000。

全身：常见不良反应，腹痛、感冒样症状、发热、意外跌倒、面部水肿、寒战、光敏反应、肋痛、体温过低、驾驶机动车意外。

心血管系统：常见，心动过速、高血压、体位性低血压；不常见：心动过缓、心绞痛、心房颤动；罕见，1级AV传导阻滞、束支传导阻滞、静脉炎、肺栓塞、心肌肥大、脑梗死、脑血管意外、深度血栓性静脉炎、心肌炎、血栓性静脉炎。

消化系统：常见，畏食、呕吐；不常见，直肠出血、吞咽困难、舌水肿；罕见，牙龈出血、黄疸、粪便嵌塞、γ-谷氨酰转氨酶升高、呕血、胆汁阻塞性黄疸、肝炎、肝肿大、口黏膜白斑病、脂肪肝、黑吐症。

内分泌系统：罕见，甲状腺功能减退，甲状腺功能亢进，甲状腺炎。

血液淋巴系统：不常见，贫血、淤血、白细胞增多、白细胞减少、嗜曙红细胞增多、淋巴结病；罕见，血小板减少、低色素性贫血、淋巴细胞增多、单核细胞增多、嗜碱粒细胞增多、淋巴水肿、红细胞增多症、血小板增多症。

代谢和营养性疾病：不常见，渴、转氨酶升高、周围性水肿、高血糖、肌酸磷酸激酶升高、碱性磷酸酶升高、高胆固醇血症、脱水、乳酸脱氢酶升高、蛋白尿、低血钾；罕见，BUN 升高、肌酐升高、高血脂、血浆胆固醇降低、高血钾、低血氯、低血糖、低血钠、低蛋白血症、糖耐量异常、痛风、高氯血症、高尿酸血症、低钙血症、低血糖性反应、低镁血症、酮病、呼吸性碱中毒。

肌肉骨骼系统：常见，肌痛；不常见，腱鞘炎；罕见，肌病。

神经系统：常见，激越、锥体外系症状、震颤、肌张力障碍、肌张力亢进、运动障碍、敌意、颤搐、感觉异常、意识混乱、眩晕、运动功能减退、运动功能增加、步态异常、动眼神经危象、感觉迟钝、共济失调、健忘症、齿轮样强直、谵妄、肌张力减退、运动不能、发音困难、戒断综合征、舞蹈症、复视、运动失调、神经病变；不常见，麻痹；罕见，肌阵挛、眼球震颤症、斜颈、口周感觉异常、角弓反张、反射增强、牙关紧闭症。

呼吸系统：常见，呼吸困难；不常见，肺炎，鼻衄；罕见，咯血、喉痉挛。

皮肤及附属器官：不常见，斑丘疹、荨麻疹、秃顶、湿疹、表皮脱落性皮炎、接触性皮炎、水泡大疱疹。

特殊感觉：常见，真菌性皮炎；不常见，结膜炎、干眼、耳鸣、睑炎、白内障、畏光；罕见，眼出血、视野缺损、角膜炎、结膜炎。

泌尿生殖系统：不常见，阳痿、异常射精、闭经、血尿、月经过多、女性泌乳、多尿症、尿潴留、子宫不规则出血、男性性功能障碍、性快感缺失、糖尿；罕见，男子女性型乳房、阴道出血、夜尿症、少尿、女性性功能障碍、子宫出血。

3. 上市后的使用中观察到的其他不良反应

上市后报道的、未在上面介绍的不良反应包括下面这些不良反应，根据发生率的定义，属于罕见不良反应（并且尚未确定与齐拉西酮治疗的因果关系）。心脏疾病：心动过速、尖端扭转型室性心律失常（同时有很多混杂因素，参见注意事项）。生殖系统和乳腺疾病：溢乳。神经系统疾病：精神抑制药恶性综合征。精神疾病：失眠。皮肤及皮下组织疾病：过敏性反应、皮疹。血管疾病：体位性低血压。

在中国进行的验证性临床研究中，经判断与盐酸齐拉西酮相关的不良事件共 75 例（62.5%），主要为锥体外系症状、上呼吸道感染、便秘、失眠、心电图异常、呕吐、嗜睡、头晕等。多为轻中度，仅 1 例出现严重锥体外系症状。心电图异常改变出现 9 例（7.5%），为 T 波异常、心肌供血不足、心肌损害和不完全性右束支传导阻滞、窦性心动过速、窦性心动过缓；未发现 Q－T 间期延长病例。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸齐拉西酮胶囊	化学药	HZ004242
盐酸齐拉西酮片	化学药	HZ004243

HY002331 盐酸齐培丙醇

【其他名称】 双苯哌丙醇、镇咳嗪

【外文名称】 Zipeprol Hydrochloride

【性状及组成】 本品为白色结晶或结晶性粉末，无臭，味苦。易溶于水及甲醇。

熔点：231℃。

药物药理信息

【药理毒理】 本品为非麻醉性中枢性镇咳药。其镇咳作用不及可待因。

本品尚具有局麻作用和松弛支气管平滑肌作用，并有较弱的抗胆碱、抗组胺作用。体外试验还证明，本品具有黏痰溶解作用，使痰液的黏滞性降低。与可待因不同，本品不抑制呼吸，亦无成瘾性。用于各种原因引起的咳嗽。

HY002332 盐酸羟苄唑

【其他名称】 α－Hydrozybenzylbenzimidazole、HBB、Hydroxybenzyl Benzimidazole、羟苄苯并咪唑

【外文名称】 Hydrobenzole Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 化学药品地标升国标·第 15 册

药物理化信息

【化学名】 2－（α－羟基苄苯）苯并咪唑盐酸盐

【分子式】 $C_{14}H_{12}H_2O \cdot HCl$

【分子量】 260.71

【性状及组成】 本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭、味微苦，水溶液显酸味性反应。

药物药理信息

【药理毒理】 抗微小 RNA 病毒药。抑制人类肠道病毒、柯萨奇病毒、脊髓灰质炎病毒和“红眼病毒”。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸羟苄唑滴眼液	化学药	HZ004244

HY002333　盐酸羟甲唑啉

【外文名称】Oxymetazoline Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第56册

药物理化信息

【化学名】3－［（4,5－二氢－1*H*－2－咪唑基）甲基］－6－（1,1－二甲基乙基）－2,4－二甲基苯酚盐酸盐

【分子式】$C_{16}H_{24}N_2O \cdot HCl$

【分子量】296.84

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶性粉末，无臭，味苦。

本品在水或乙醇中易溶，在乙醚或三氯甲烷中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为一唑啉类衍生物，是具有收缩血管作用的拟交感神经药物，为减充血剂。其作用是直接刺激血管平滑肌上的 α_1 受体，为 α－肾上腺素受体激动药，具有迅速收缩血管的作用，从而改善鼻塞、眼部充血症状。

【药代动力学】局部使用后的吸收量少。

【药物过量】滴眼液过量应用本品可导致眼红加重；过量应用本品可能在儿童或部分过敏的成人引起外周血管的收缩，心率减慢及血压升高。儿童大剂量意外使用本品后可出现严重的中枢神经系统抑制。

【不良反应】鼻用个别患者可能有轻微的烧灼感、针刺感、鼻黏膜干燥等。滴眼液对某些过敏的病人可能引起瞳孔散大而导致眼内压升高。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方羟甲唑啉喷雾剂	化学药	HZ001343
盐酸羟甲唑啉滴鼻液	化学药	HZ004245
盐酸羟甲唑啉滴眼液	化学药	HZ004246
盐酸羟甲唑啉喷雾剂	化学药	HZ004247

HY002334　盐酸羟考酮

【外文名称】Oxycodone Hydrochloride

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物理化信息

【化学名】4，5－环氧基－14－羟基－3－甲氧基－17－甲基吗啡烷－6－酮盐酸盐

【分子式】$C_{18}H_{21}NO_4 \cdot HCl$

【分子量】351.83

药物药理信息

【药理毒理】羟考酮为阿片受体纯激动剂。对脑和脊髓的阿片受体具有亲和力，羟考酮的作用类似吗啡。主要药理作用是镇痛，其他药理作用包括抗焦虑、止咳和镇静。无极量限制，镇痛作用无封顶效应，只受限于不能耐受的副作用。

从几项研究资料可以认为，羟考酮对人产生基因毒性的危险性较低。下述试验表明羟考酮不致突变：在艾姆斯氏沙门菌和大肠杆菌试验中不论存在代谢活性状态与否，剂量直到 5000μg 时；在人体淋巴细胞染色体畸变试验中（不存在代谢激活状态下）剂量直到 1500μg/ml 时，以及在代谢激活状态剂量直到 500μg/ml 作用 48 小时情况下；在小鼠体内骨髓微核试验中（血浆药物浓度直到 48μg/ml 时）。

羟考酮在下述情况产生致突变效果：在人体染色体突变试验中存在代谢激活状态下剂量大于或等于 1250μg/ml，作用 24 小时而非 48 小时情况下；在小鼠淋巴瘤试验中存在代谢激活状态下剂量等于或大于 50μg/ml。以及不存在代谢激活状态剂量等于或大于 40μg/ml 时。

【药代动力学】本品的活性成分是羟考酮。口服后，会出现两释放相，即提供快速镇痛的早期快释放相和随后的持续释放相，药物持续作用 12 小时。羟考酮吸收良好，口服生物利用度为 60% ~ 87%。健康志愿者多次服用药后，24 ~ 36 小时内达稳态血药浓度。用药剂量与血药峰值浓度（C_{max}），以及用药剂量与药时曲线下面积（AUC）成比例变化。其平均表现消除半衰期为 4.5 小时，约 1 天内达稳态。羟考酮的主要代谢物是去甲羟考酮和羟氢吗啡酮，代谢物主要经肾脏排泄。口服本品后约 3 小时达血药峰值浓度。本品 10mg 每 12 小时服用一次与羟考酮普通制剂 5mg 每 6 小时服用一次相比较，峰谷血药浓度相同。

本品的羟考酮释放不受 pH 影响。摄入高脂食不影响该药物吸收用峰值浓度。

年龄：老年人的 AUC 较青年人增加 15%。

性别：在调整体重的基础上，女性血浆羟考酮平均浓度比男性高 25%。

肾功能障碍：与正常人相比较，轻中度肾功能障碍患者的血浆羟考酮和去甲羟考酮峰值浓度分别

增高约 50% 和 20%；羟考酮、去甲羟考酮和羟氢吗啡酮的 AUC 分别增高约 60%、60% 和 40%。羟考酮的清除半衰期仅延长 1 小时。

轻中度肝功能障碍：与正常人相比较，轻、中度肝功能障碍患者的血浆羟考酮和去甲羟考酮峰值浓度分别增高约 50% 和 20%；AUC 分别增高约 95% 和 75%。血浆羟氢吗啡酮峰浓度和 AUC 降低 15% ~ 50%。羟考酮的清除半衰期延长 2.3 小时。

【药物相互作用】 类似其他阿片类药物，本品可以与下列药物有叠加作用：镇定剂、麻醉剂、催醉剂、催眠剂、酒精、抗精神病药、肌肉驰缓剂、抗抑郁药、吩噻嗪类和降压药。尽管未观察到羟考酮与单胺氧化酶抑制剂发生相互作用，但是服用任何阿片类药物都应避免同时使用胺氧化酶抑制剂。部分羟考酮经细胞色素 P450 – 2D6 酶作用，代谢成为羟氢吗啡酮。羟氢吗啡酮的浓度不足给药总量的 15%。某些药物（如抗抑郁剂，胺碘酮和奎尼丁等心血管药物）可能阻断该代谢途经。然而，合用具有抑制细胞色素 P450 – 2D6 酶作用的奎尼丁，并未影响羟考酮的药效。可能抑制羟考酮的代谢的其他药物包括：甲氰咪胍。酮康唑和红毒素等细胞色素 P450 – 3A 酶抑制剂。

【药物过量】 羟考酮过量及中毒症状表现为针尖样瞳孔、呼吸抑制和低血压症。严重者可能发生嗜睡、发展至昏迷、循环衰竭及深度昏迷、骨髓肌松弛、心动过缓和死亡。

羟考酮过量的解救治疗：首先保持呼吸道通畅。然后给予相应的支持疗法（改善通气、给氧、升压药），纠正休克及肺水肿，心跳骤停或心律不齐可能需要心脏按摩或除颤。必要时洗胃，清除胃内容物可除去未吸收的药物，尤其对于服用持续释放药物制剂。

解救用药：纳洛酮 0.4 ~ 0.8mg，静脉注射。必要时，间隔 2 ~ 3 分钟重复给药，或将纳络酮 2mg 溶于 500ml 生理盐水或 5% 葡萄糖（0.004mg/ml），静脉滴注。根据情况和以往服药的剂量决定药物的输注速率。由于纳络酮的作用持续时间相对较短，而本品释放羟考酮持续 12 小时，因此必须严密观察病情，直至患者重新恢复稳定的自主呼吸。

对于少数服药严重过量的患者，静脉注射纳洛酮 0.2mg，继之每 2 分钟增加用药 0.1mg。过量服用羟考酮的患者，如果临床上未出现明显呼吸抑制或循环障碍，不必使用纳洛酮。对羟考酮产生身体依赖性或可疑产生身体依赖性的患者，慎用纳洛酮。因为在此情况下使用纳络酮，可能突然完全阻断阿片类药物的作用，导致急性疼痛发作及急性戒断综合征。

【不良反应】 可能出现阿片受体激动剂的不良反应。可能产生耐受性和依赖性。

常见不良反应：便秘（缓泻药可预防便秘）、恶心、呕吐、头晕、瘙痒、头痛、口干、多汗、思睡和乏力。如果出现事恶心和呕吐反应，可用止吐药治疗。

偶见不良反应：畏食、紧张、失眠、发热、精神错乱、腹泻、腹痛、血管舒张、消化不良、感觉异常、皮疹、焦虑、欣快、抑郁、呼吸困难、体位低血压、寒战、恶梦、思维异常、呃逆。

罕见不良反应：眩晕、抽搐、胃炎、定向障碍、面红、情绪改变、心悸（在戒断综合征的情况下）、幻觉、支气管痉挛、吞咽困难、嗳气、气胀、肠梗阻、味觉反常、激动、遗忘、张力过高、感觉过敏、张力过低、不适、肌肉不自主收缩、言语障碍、震颤、视觉异常、戒断综合征、闭经、性欲减退、阳痿、低血压、室上性心动过速、晕厥、脱水、水肿、外周性水肿、口渴、皮肤干燥、荨麻疹、变态反应、过敏性反应、类过敏性反应、瞳孔缩小和绞痛。可能发生排尿困难、胆道痉挛或输尿管痉挛。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
对乙酰氨基酚羟考酮片	化学药	HZ000772
盐酸羟考酮控释片	化学药	HZ004248

HY002335 盐酸羟嗪

【外文名称】 Hydroxyzine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 卫生部颁药品标准（二部）·第 4 册

药物理化信息

【化学名】 2 – ［2 – ［4 – （4 – 氯苯基）苯基甲基 – 1 – 哌嗪基］乙氧基］ – 乙醇二盐酸盐

【分子式】 $C_{21}H_{27}ClN_2O_2 \cdot 2HCl$

【分子量】 447.83

【性状及组成】 本品为白色或类白色粉末，无臭，有引湿性。

本品在水或丙酮中易溶，在三氯甲烷中溶解，在乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为 202 ~ 207℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】 具有中枢镇静，弱抗焦虑及肌肉松弛作用，并有抗组胺作用。

【药物相互作用】

1. 与巴比妥类、阿片类或其他中枢抑制药合用，能增强其他中枢抑制药的作用，增强阿片类的镇痛和镇静作用，但不增加呼吸抑制作用。

2. 术前使用本品可延长麻醉药氯胺酮的麻醉恢复时间（延长约30%～40%）。

【不良反应】常见嗜睡，可见无力、头痛、晕眩、低血压与心悸。偶见皮疹、骨髓抑制，可能诱发癫痫。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方盐酸克仑特罗栓	化学药	HZ001457
盐酸羟嗪片	化学药	HZ004249

HY002336　盐酸青藤碱

【其他名称】毛防己碱、青风碱、清风藤碱

【外文名称】Sinomenine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第8册

【分子式】$C_{19}H_{23}NO_4$

【分子量】329.38

药物药理信息

【药理毒理】药理作用有以下几项内容。

1. 抗免疫作用：本品对体液免疫、细胞免疫均有不同程度的抑制作用，其中对细胞免疫功能的抑制程度更为显著，在时间上亦先于体液免疫。大剂量时能抑制单核吞噬细胞功能。对膜性肾小球肾炎（C-BSA）模型有降低尿蛋白、减少血中循环免疫复合物（CIC）及尿中β2微球蛋白（β_2-MG）含量的作用。明显抑制视网膜抗原诱发大鼠自身免疫视网膜色素膜炎（EAU）发生，同时也抑制了EAU大鼠对S抗原的体液免疫及细胞免疫反应，还能有效抑制脂质过氧化并保护抗氧酶活性。

2. 抗炎作用：明显减轻多种急、慢性炎症。对大鼠甲醛性、蛋清性、细菌性炎症均有抗炎作用，能抑制肉芽组织的增生，使肾炎模型的肾小球肿胀直径缩小，肾小球内细胞增殖与浸润减轻。

3. 抗凝作用：使全血黏度和血浆黏度及红细胞压积下降，能拮抗花生四烯酸引起的血小板聚集，延缓凝血形成，提高红细胞变形能力。

4. 视网膜保护作用：有清除超氧阴离子及自由基的作用，可明显抑制脂质过氧化产物（MKA）生成。可抑制EAU大鼠视网膜共轭双烯的形成，降低丙二醛、视网膜萤光色脂类、视网膜脂类氢过氧化物酶水平，从而对视网膜具有保护作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
正清风痛宁缓释片	中成药	ZC007287
正清风痛宁胶囊	中成药	ZC007288
正清风痛宁片	中成药	ZC007289
正清风痛宁注射液	中成药	ZC007290

HY002337　盐酸巯乙胺

【其他名称】Becaptan、Beta-mercaptoethylamine、半胱胺、半胱胺盐酸盐、Cysteamine、Lambratene、Mercamine Cysteamine

【外文名称】Mercaptamine Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】β-巯基乙胺盐酸盐

【性状及组成】本品为无色结晶或白色结晶性粉末，具有硫醇的特殊臭，味咸，有较强的引湿性。极易溶于水，溶于乙醇。对光敏感，其水溶液与金属接触即变暗色。

药物药理信息

【药理毒理】本品为解毒药。有络合金属的作用，能解除金属对细胞中酶系统活动的抑制，故有对抗金属的中毒作用；又有抗氧化作用，亦能与体内某些酶相互作用，因而使其对放射能稳定。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸巯乙胺注射液	化学药	HZ004250

HY002338　盐酸曲吡那敏

【外文名称】Tripelennamine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第2册

药物理化信息

【化学名】*N*-苄基-*N*′，*N*′-二甲基-*N*-吡啶-2-基乙胺

【分子式】$C_{16}H_{21}N_3 \cdot HCl$

【分子量】291.83

【性状及组成】常用其盐酸盐，为白色结晶性粉末，有苦味，极易溶于水。白色结晶，无臭，味苦，

溶于水（1:1）、乙醇（1:6）。

药物药理信息

【药理毒理】本品为为乙二胺类 H_1 受体阻断药，能竞争性阻断 H_1 受体而产生抗组胺作用。抗组胺作用比苯海拉明略强而持久，嗜睡等副作用较少。本品除具有抗组胺药的作用外，还具有抗胆碱作用与较强的局麻作用，可用于过敏患者需麻醉时。

【药代动力学】本品在肝脏中代谢，24 小时内用量的 20%从尿中排出。一次服用 400mg 以后，2 小时之内药物在血液中出现。

【药物相互作用】与中枢神经抑制药合用可加强中枢抑制作用。

【不良反应】本品可引起眩晕、嗜睡、口干、头痛、恶心、肌肉震颤、感觉异常、瞳孔放大、皮疹，气喘及咳嗽等反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸曲吡那敏片	化学药	HZ004251

HY002339 盐酸曲马多

【外文名称】Tramadol Hydrochloride

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（±）-*E*-2-［（二甲氨基）甲基］-1-（3-甲氧基苯基）环己醇盐酸盐

【分子式】$C_{16}H_{25}NO_2 \cdot HCl$

【分子量】299.84

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末，无臭，味苦，有引湿性。本品在水中极易溶，在乙醇或三氯甲烷中易溶，在丙酮中微溶，在乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为 179～182℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为非阿片类中枢性镇痛药，虽也可与阿片受体结合，但其亲和力很弱．对 μ 受体的亲和力相当于吗啡的 1/6000，对 κ 和 δ 受体的亲和力仅为 μ 受体的 1/25。曲马多系消旋体，其（+）对映体作用于阿片受体，而（-）对映体则抑制神经元突触对去甲肾上腺素的再摄取，并增加神经元外 5-羟色胺浓度。从而影响痛觉传递而产生镇痛作用，其作用强度为吗啡的 1/8～1/10。本品无抑制呼吸作用，依赖性小。有镇咳作用，强度为可待因 50%。不影响组胺释放。口服、注射吸收均好，镇痛功效相同。

【药代动力学】本品口服或注射给药均可吸收。用于中重度急慢性疼痛，服后 0.5 小时生效，持续 6 小时。口服后几乎完全吸收，于 10～20 分钟内起效，25～35 分钟达到峰值，维持时间约 4～8 小时，长期应用不易成瘾。口服给药后。肺、脾、肝和肾含量最高，在肝内代谢。24 小时约有 80%的本品原形及代谢产物从肾排出。缓释制剂可以延长体内盐酸曲马多治疗浓度的维持时间，减少血药浓度的波动。

【药物相互作用】

1．与中枢神经抑制药物或酒精合用时有强化本品的镇静作用，特别是呼吸抑制作用。与神经阻滞剂合用，个别病例有惊厥的报道。

2．接受单胺氧化酶（MAO）抑制剂治疗者，再服用本品可能会出现对中枢神经、循环、呼吸系统的严重影响。

3．西咪替丁对本品的影响非常小。

4．注意耐药性或药物依赖性形成。

【药物过量】过量的典型症状：意识紊乱、昏迷、全身性癫痫发作、低血压、心动过速、瞳孔扩大或缩小、呼吸抑制甚至呼吸骤停。

上述症状可以通过使用阿片受体拮抗剂（如：纳洛酮）对抗，因其作用时间较盐酸曲马多短，应注意小量多次给药。另外，可酌情采取，气管插管、人工呼吸等。发生惊厥时，可考虑给苯二氮䓬类药。

【不良反应】用药后可能出现恶心、呕吐、出汗、口干、眩晕、嗜睡等症状。昏迷可偶尔发生。少数病例也可发现对心血管系统有影响（如：心悸、心动过速、体位性低血压和循环性虚脱），尤其在病人直立、疲劳情况下较易出现。此外，头痛、便秘、胃肠功能紊乱、皮肤瘙痒、皮疹较少见。运动无力、食欲减退、排尿紊乱极少发生。精神方面不良反应极少见，也因人而异，包括情绪的改变（多数是情绪高昂，但有时也表现为心境恶劣）、活动的改变（多数是活动减少，有时是增加）、认知和感觉能力的改变（判断和理解障碍）。个别病例报道过惊厥，但这种情况一般出现于注射高剂量的盐酸曲马多或神经阻滞剂合用时。过敏性休克，亦不能完全排除。

在医师推荐剂量下，通常不会发生呼吸抑制和昏迷。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氨酚曲马多片	化学药	HZ000180
复方盐酸曲马多片（Ⅰ）	化学药	HZ001462
复方盐酸曲马多片（Ⅱ）	化学药	HZ001463
科洛曲片	化学药	HZ002087
盐酸曲马多滴剂	化学药	HZ004252
盐酸曲马多分散片	化学药	HZ004253
盐酸曲马多缓释胶囊	化学药	HZ004254
盐酸曲马多缓释片	化学药	HZ004255
盐酸曲马多胶囊	化学药	HZ004256
盐酸曲马多氯化钠注射液	化学药	HZ004257
盐酸曲马多片	化学药	HZ004258
盐酸曲马多葡萄糖注射液	化学药	HZ004259
盐酸曲马多栓	化学药	HZ004260
盐酸曲马多注射液	化学药	HZ004261
注射用盐酸曲马多	化学药	HZ005097

HY002340　盐酸曲美他嗪

【其他名称】三甲氧苄嗪、Vasorel、心康宁

【外文名称】Trimetazidine Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】1－（2,3,4－三甲氧基苯基）哌嗪二盐酸

【分子式】$C_{14}H_{24}Cl_2N_2O_3$

【分子量】339.30

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末，味苦，熔点235～238℃，极易溶于水，稍难溶于乙醇，几不溶于乙醚、苯、丙酮。

药物药理信息

【药理毒理】本品为抗心绞痛药。具有对抗肾上腺素、去甲肾上腺素及加压素的作用，能降低血管阻力，增加冠脉及循环血流量，促进心肌代谢及心肌能量的产生。同时能降低心肌耗氧量，从而改善心肌氧的供需平衡。亦能增加对强心苷的耐受性。心绞痛患者的对照试验显示：①本药可增加心绞痛患者的运动试验耐量，从治疗第15天起延缓运动诱发的心肌缺血，减少缺血，但不引起血流动力学的变化。②限制快速血压波动并不引起心率显著变化，显著减少心绞痛发作频率。③使硝酸甘油的用量明显减少。曲美他嗪作用机制：对缺血心肌的作用可能是直接细胞保护作用。通过保存缺血细胞内的能量代谢，防止细胞内ATP水平下降，在维持细胞内环境稳定的同时确保离子泵的功能完善和跨膜钠－钾泵正常转运，减少细胞内酸中毒以及阻止心肌细胞内钠和钙的聚集，保护细胞收缩功能和限制氧自由基造成的细胞溶解和内膜损伤。

曲美他嗪通过保护细胞在缺氧或缺血情况下的能量代谢，阻止细胞内ATP水平的下降，从而保证了离子泵的正常功能和透膜钠－钾流的正常运转，维持细胞内环境的稳定。

动物研究：曲美他嗪帮助维持心脏和神经感觉器官在缺血和缺氧情况下的能量代谢。降低细胞内的酸中毒和由缺血引起透膜离子流的变化。减少缺血时和心肌再灌注时出现的多核中性粒细胞的转移和浸润。它也能减少实验性梗塞的范围。在缺乏直接的血流动力学作用时产生这种作用。

人体研究：对心绞痛患者的对照实验显示曲美他嗪可以增加冠脉血流储备，因此在开始治疗的第15天起，延迟运动诱发缺血的发生。限制血压的快速波动而心率没有明显的改变。明显的降低心绞痛发作的频率。明显降低三硝酸甘油脂的使用。

【药代动力学】口服给药后，曲美他嗪吸收迅速，不到2小时即达到血浆峰值。单剂曲美他嗪20mg口服后，血浆峰值浓度大约是55mg/ml。重复给药后，24～36小时后达到稳定的状态并且在整个治疗中保持非常稳定。表面分布体积是4.8L/kg，这提示它具有良好的组织弥散性。蛋白结合率低，离体测定为16%。曲美他嗪主要通过尿液清除，主要以原形清除。清除半衰期大约是6小时。

【不良反应】个别可有头晕、食欲减退、皮疹等。极少数患者有胃肠不适（恶心、呕吐）。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸曲美他嗪片	化学药	HZ004262
盐酸曲美他嗪注射液	化学药	HZ004263

HY002341　盐酸曲普利啶

【其他名称】Actidil、Actidilon、苯丙烯啶、吡啶吡胺、吡咯吡胺、吡咯烷甲苯基丙烯、克敏、Triprolidinum、盐酸苯丙烯啶、盐酸吡咯胺、盐酸吡咯吡胺

【外文名称】Triprolidine Hydrochloride

药物理化信息

【分子式】$C_{19}H_{22}N_2 \cdot HCl \cdot H_2O$

【分子量】332.88

【性状及组成】本品溶于水、甲醇、乙醇。

熔点：116～118℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品是一种具有中枢镇定及抗毒蕈作用的强效 H 受体拮抗剂，通过竞争性、可逆性阻断组织上的组胺受体而消除组胺导致的过敏性反应。

本药为抗组胺药，在体内与组胺竞争结合靶细胞上的 H_1 受体，使组胺不能与 H_1 受体结合，从而抑制机体过敏反应的发生。本药抗组胺作用具有长效、低毒、对中枢抑制作用弱等特点。

【药代动力学】本药口服吸收迅速、完全，10～15 分钟起效，1～3 小时即可达血药峰浓度，维持作用可长达 8～12 小时。本药体内分布广泛，局部浓度以肺、脾、肾较高。可通过血－脑脊液屏障。半衰期为 3～5 小时。本药部分经肝代谢，降解物以甲苯甲基化合物为主。由肾排泄，也可随乳汁分泌，24 小时可自乳汁排出用药量的 0.06%～0.2%。

【药物相互作用】

1. 颠茄及颠茄生物碱可增加本药的抗胆碱能作用。

2. 与丙卡巴肼（抗肿瘤药）联用可导致中枢抑制。

3. 乙醇可加强本药的镇静作用。

【药物过量】药物过量表现为中枢抑制或中枢刺激兴奋、抗胆碱作用（口干、皮肤潮红）。应立即洗胃、催吐、大量口服活性炭。如有低血压表现，应给予升压药。控制癫痫须用地西泮或苯妥英，忌用中枢兴奋药。

【不良反应】本药不良反应少，偶有口干、畏食、恶心、呕吐、便秘、腹痛、腹泻、倦乏、轻微嗜睡等，减量或停药后可自行消失。

国外不良反应参考以下内容。

1. 心血管系统：可出现低血压或高血压、心动过速和期外收缩，可能与本药的抗胆碱能作用有关。

2. 中枢神经系统：最常见的反应是镇静作用，但不同患者个体差异很大，重者可致深睡眠。多数患者继续用药后对镇静可耐受。另可有头晕、动作失调、倦怠、疲劳。个别患者（特别是儿童）使用本药后可出现反常的中枢神经系统兴奋、刺激症状，表现为坐立不安、失眠、欣快、谵妄、易怒、心悸、梦魇或癫痫发作等。

3. 胃肠道：可有口干、咽干，偶有畏食、恶心、呕吐、便秘、腹泻、腹痛，为本药的抗胆碱能作用所致。

4. 呼吸系统：可有鼻腔干燥、胸闷、气急和支气管分泌物黏稠，为本药抗胆碱能作用所致。

5. 泌尿生殖系统：使用本药后，有出现尿潴留、排尿困难和阳痿的报道。

6. 眼：可出现视物模糊、复视等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氨酚曲麻片	化学药	HZ000179
复方福尔可定口服溶液	化学药	HZ001170
复方可待因口服溶液	化学药	HZ001252
盐酸曲普利啶胶囊	化学药	HZ004264
盐酸曲普利啶片	化学药	HZ004265

HY002342 盐酸曲唑酮

【外文名称】Trazodone Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】曲唑酮是三唑吡啶类抗抑郁药，其抗抑郁作用相似于三环类和 MAOI，但对心血管系统毒性小，无抗胆碱副作用，较适用于老年或伴有心血管疾病的抑郁症病人。抗抑郁作用机制是选择性地阻断 5－HT 的再吸收，并可有微弱的阻止去甲肾上腺素重吸收的作用，但对多巴胺、组胺和乙酰胆碱无作用，亦不抑制脑内 MAO 的活性。本品还具有中枢镇静作用和轻微的肌肉松弛作用，但无抗痉挛和中枢兴奋作用。本品对心脏无影响，但能引起血压下降，此作用与剂量有关。

【药代动力学】口服吸收良好，2 小时达高峰浓度。与食物同服可推迟其吸收，并使其吸收量降低。吸收后较多分布于肝、肾中，经肝脏代谢，其代谢产物仍有明显的活性。本品与其代谢产物均易透过血脑屏障，但少进入胎儿体内。代谢产物最后经肾脏排出，很少原形排出（只有 1%），肾功能损伤不影响其排泄。$t_{1/2}$平均为 4.1 小时。

【不良反应】不良反应较少而轻微。最常见的不良反应是嗜睡，偶见皮肤过敏、视力模糊、便秘、口干、高血压或低血压、心动过速、头晕、头痛、腹痛、恶心、呕吐、肌肉痛、震颤、协同动作障碍。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸曲唑酮片	化学药	HZ004266

HY002343 盐酸屈他维林

【其他名称】Deprolen、Dihydroethaverine、定痉灵、Drotaverinum、No－Spa、Nospasin、诺仕帕、诺在帕、氢喹维林、羟戊丁氨酯、氢乙罂粟碱

【外文名称】Drotaverine Hydrochloride

【分子式】$C_{24}H_{31}NO_4 \cdot HCl$

药物药理信息

【药理毒理】本药为一种特异性平滑肌解痉药，对血管、胃肠道及胆道等平滑肌均有松弛作用，用于解除或预防功能性或神经性的平滑肌痉挛。对心脏 β 受体有选择性阻断作用。本药只作用于平滑肌而不影响自主神经系统，故可用于抗胆碱类解痉药禁忌的青光眼和前列腺肥大的患者。

【药代动力学】口服吸收迅速、完全。健康志愿者单次口服本药 80mg，1～3 小时可达血药浓度峰值（约 6.12ng/ml）。本药与人体血浆蛋白高度结合（95%～98%）。药物吸收后分布迅速，主要分布于中枢神经系统、心肌、肾上腺、肾和肺。主要排泄途径为尿与粪便。

【药物相互作用】本药可使左旋多巴的抗帕金森病作用减弱。

【不良反应】

1. 本药一般耐受良好，偶见恶心、头晕、头痛、过敏性皮炎、心悸、多汗。

2. 本药静脉注射过快时可出现低血压。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸屈他维林片	化学药	HZ0004267
盐酸屈他维林注射液	化学药	HZ0004268

HY002344　盐酸去甲替林

【其他名称】Acetexa、Allegron、Motipress、Motival、Nortrllen、Pamelor、去甲阿米替林、Sensival

【外文名称】Nortriptyline Hydrochloride

【性状及组成】本品为白色或灰白色粉末，稍有特臭，熔点为 213～215℃；可溶于水（1∶90）、乙醇（1∶30）、三氯甲烷（1∶20）和甲醇（1∶10），几乎不溶于乙醚和其他大多数有机溶剂；1% 水溶液的 pH 约为 5。

盐酸去甲替林 22.8mg 约相当去甲替林 20mg。

药物药理信息

【药理毒理】为阿米替林的代谢产物，具有抗抑郁作用，起效快。适用于伴有紧张、焦虑的抑郁症患者。亦可用于焦虑状态。尤其对伴有睡眠障碍的抑郁症效果良好。

【药代动力学】本品为阿米替林的主要活性代谢产物，在肝内大量被首过代谢为 10－羟去甲替林，仍具活性；生物利用度为 32%～79%，蛋白结合率为 93%～95%，血浆 $t_{1/2}$ 为 18～93 小时，分布容积为 21～57L/kg。治疗抑郁症的有效血浆浓度为 50～150ng/ml。

【不良反应】本品不良反应比丙米嗪少而且轻。常见有口干、嗜睡、便秘、视力模糊、排尿困难、心悸，偶见心律失常、眩晕、运动失调、癫痫样发作、体位性低血压、肝损伤及迟发性运动障碍。

HY002345　盐酸去甲万古霉素

【外文名称】Norvancomycin Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（*Sa*）－（3*S*，6*R*，7*R*，22*R*，23*S*，26*S*，36*R*，38*aR*）－44－［［2－*O*－（3－氨基－2,3,6－三脱氧－3－C－甲基－*a*－L－来苏－己吡喃糖基）－β－D－葡吡喃糖基］氧］－3－（氨基甲酰基甲基）－10，19－二氯－2,3,4,5,6,7,23,24,25,26,36,37,38,38*a*－十四氢－7,22,28,30,32－五羟基－6－［（2*R*）－4－甲基－2－（氨基）戊酰氨基］－2,5,24,38,39－五氧代－22*H*－8,11：18,21－二亚乙烯基－23,36－（亚氨基亚甲基）－13,16：31,35－二亚甲基－1*H*，16*H*－［1,6,9］噁二氮杂环十六基［4,5－*m*］［10,2,16］－苯并氧杂二氮杂环二十四素－26－羧酸盐酸盐

【分子式】$C_{65}H_{73}Cl_2N_9O_{24}\cdot HCl$

【分子量】1471.71

【性状及组成】本品为白色至淡棕色粉末，无臭，味苦。

本品在水中易溶，在甲醇中微溶，在丙酮、丁醇或乙醚中不溶；在溶液中能被多种重金属盐类沉淀。

药物药理信息

【药理毒理】本品对葡萄球菌属包括金黄色葡萄球菌和凝固酶阴性葡萄球菌中甲氧西林敏感及耐药株、各种链球菌、肺炎链球菌及肠球菌属等多数革兰阳性菌均有良好抗菌作用。

【药代动力学】本品口服不吸收，单剂静脉滴注 400mg，滴注完毕即达到血药峰浓度 25.18mg/L，8 小时血浓度平均为 1.90mg/L，有效血浓度可维持 6～8 小时。单剂静脉滴注 800mg，高峰血浓度平均为 50.07mg/L。本品可广泛分布于身体各种组织体液，但不易进入脑组织中，在胆汁中的量亦甚微。静脉滴注后主要经肾脏排泄，单次静脉滴注 400mg，24 小时尿中平均总排泄率为 81.1%；单次静脉滴注 800mg，24 小时尿中平均总排泄率为 85.9%。

【适应症】本品静脉滴注适用于葡萄球菌属（包括甲氧西林耐药菌株对本品敏感者）所致心内膜炎、骨髓炎、肺炎、败血症或软组织感染等。

青霉素过敏者不能采用青霉素类或头孢菌素类，或经上述抗生素治疗无效的严重葡萄球菌感染患者，可选用万古霉素。本品也用于对青霉素过敏者的肠球菌心内膜炎、棒状杆菌属（类白喉杆菌属）心内膜炎的治疗。对青霉素过敏与青霉素不过敏的血液透析患者发生葡萄球菌属所致动、静脉分流感染的治疗。

【不良反应】少数患者可出现皮疹、恶心、静脉炎等。本品也可引致耳鸣、听力减退，肾功能损害。个别患者尚可发生一过性周围血常规白细胞降低、血清氨基转移酶升高等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸去甲万古霉素	化学药	HZ005098

HY002346 盐酸去氯羟嗪

【其他名称】克喘嗪、克敏嗪

【外文名称】Decloxizine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】2－［2－［4－（二苯基甲基）－1－哌嗪基］乙氧基］乙醇二盐酸盐

【分子式】$C_{21}H_{28}N_2O_2 \cdot 2HCl$

【分子量】413.39

【性状及组成】本品为白色或微黄白色粉末、无臭，味苦，具有引湿性。本品在水中极易溶解，在乙醇中易溶，在三氯甲烷中略溶，在丙酮中极微溶解，在乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为 201～207℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】本品为第一代抗组胺药羟嗪的衍生物，有较强的 H_1 受体选择性阻断作用，本品除有拮抗 H_1 受体作用外，对白三烯等过敏介质亦有一定的抑制作用。有抗组胺作用，并有平喘和镇静效果。本品具有较强的抗组胺、抗 5－羟色胺、抗过敏、扩张支气管作用和轻度的镇静作用。与 β－受体兴奋剂、麻黄碱或氨茶碱等合用能增强平喘作用。

【药代动力学】作用时间长，可维持疗效 6～12 小时。

【药物相互作用】本品与酒精和其他中枢抑制药有相加作用，不应同服。

【不良反应】偶有嗜睡、口干、失眠等反应，停药后可消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方氯丙那林溴己新胶囊	化学药	HZ001293
复方氯丙那林溴己新片	化学药	HZ001294
复方羟丙茶碱去氯羟嗪胶囊	化学药	HZ001342
盐酸去氯羟嗪片	化学药	HZ004269
盐酸去氯羟嗪注射液	化学药	HZ004270
海珠喘息定片	中成药	ZC002068

HY002347 盐酸去氧肾上腺素

【外文名称】Phenylephrine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（*R*）－（－）－α－［（甲氨基）甲基］－3－羟基苯甲醇盐酸盐

【分子式】$C_9H_{13}NO_2 \cdot HCl$

【分子量】203.67

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶性粉末，无臭，味苦。本品在水或乙醇中易溶，在三氯甲烷或乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为 140～145℃。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中含 20mg 的溶液，依法测定，比旋度应为－42°至－47°。

药物药理信息

【药理毒理】本品为 α 肾上腺素受体激动药。本品为直接作用于受体的拟交感胺类药，但同时也间接通过促进去甲肾上腺素自贮存部位释放而生效。作用于 α 受体（尤其皮肤、黏膜、内脏等处），引起血管收缩，外周阻力增加，使收缩压及舒张压均升高。随血压升高可激发迷走神经反射，使心率减慢，由此可治疗室上性心动过速。本品收缩血管的作用比肾上腺激素或麻黄碱为长，在治疗剂量，很少引起中枢神经系统兴奋作用；本品可使肾、内脏、皮肤及肢体血流减少，但冠状动脉血流增加。作为血管收缩剂加入局麻药液可减慢后者的吸收，从而局限局麻的范围并延长其时效。

【药代动力学】在胃肠道和肝脏内被单胺氧化酶降解，不宜口服。皮下注射，升压作用 10～15 分钟起效，持续 50～60 分钟；肌注一般也是 10～15 分钟起效，持续 30～120 分钟；静注立即起效，持续 15～20 分钟。

【药物相互作用】

1．先用α受体阻滞药如酚妥拉明、酚苄明、妥拉唑林、吩噻嗪类等后再给药时，可减弱本品的升压作用。

2．与全麻药（尤其环丙烷或卤代碳氢化合物）同用，易引起室性心律失常；也不宜将本品加入局麻药液中用于指趾末端，以避免末梢血管极度收缩，引起组织坏死溃疡。

3．与降压药同用，可使降压作用减弱。

4．与胍乙啶同用，可降低胍乙啶的作用，并使本品的升压作用增效。

5．与催产药同用，可引起严重的高血压。

6．与单胺氧化酶（MAO）抑制剂同用，可使本品的升压作用增强，在使用 MAO 抑制剂后 14 天内禁用本品。

7．与拟交感神经药同用，可使这类药潜在的不良反应容易显现。

8．与甲状腺激素同用，使二者的作用均加强。

9．同用三环类抗抑郁药本品升压作用增强。

10．与硝酸盐类同用，可使本品的升压作用与硝酸盐类的抗心绞痛作用均减弱。

【药物过量】出现血压过度上升，反射性心动过缓可用阿托品纠正，其他逾量表现可用α受体阻滞剂如酚妥拉明治疗。

【不良反应】

1．胸部不适或疼痛、眩晕、易激怒、震颤、呼吸困难、虚弱等，一般少见，但持续存在时需注意。

2．持续头痛以及异常心率缓慢，呕吐，头胀或手足麻刺痛感，提示血压过高而愈量应立即重视，调整用药量；反射性心动过缓可用阿托品纠正，其他愈量表现可用α受体阻滞剂如酚妥拉明治疗。

3．静注给药治疗阵发性心动过速时常出现心率加快或不规则，提示过量。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
儿童复方氨酚肾素片	化学药	HZ000833
复方氨酚肾素片	化学药	HZ001037
复方托吡卡胺滴眼液	化学药	HZ001414
柳酚咖敏片	化学药	HZ002443
去氧肾上腺素溴苯那敏胶囊	化学药	HZ003064
盐酸去氧肾上腺素注射液	化学药	HZ004271

HY002348　盐酸柔红霉素

【其他名称】DNR、DRB、Fl6339、红保霉素、红比霉素、红变霉素、红比脲、红卫霉素、柔毛霉素、正定霉素

【外文名称】Daunorubicin Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】10－［（3－氨基－2,3,6－三去氧基－α－L－来苏已吡喃基）－氧］－7,8,9,10－四氢－6,8,11－三羟基－8－乙酰基－1－甲氧基－5,12 萘二酮的盐酸盐

【分子式】$C_{27}H_{29}NO_{10}\cdot HCl$

【分子量】563.98

【性状及组成】本品为橙红色结晶性粉末，有引湿性。

本品在水或甲醇中易溶，在乙醇中微溶，在丙酮中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品是由 streptolnyces peucetins 培养液中提得的蒽环类化合物，我国河北省正定县土壤中获得的同类放线菌菌株培养液中亦可提得此物质，故又名正定霉素。本品能以其分子结构中的平面部分，嵌入到 DNA 的双链中形成稳定复合物，影响 DNA 的许多功能，阻止 DNA 复制和 RNA 的转录，抑制 TopoⅡ功能，抑制肿瘤细胞的分裂繁殖。本品为细胞周期非特异性药物，对 S 期细胞比较敏感。还有免疫抑制和抗菌作用。

柔红霉素为周期非特异性抗肿瘤药，动物试验表明它对小鼠 L1210 白血病有延长生命的作用，并且对氨基甲叶酸、6－巯基嘌呤及 5－氟尿嘧啶耐药的细胞株也显示出一定的疗效。另外，它对吉田肉瘤大鼠有延长生命的疗效，并且对环磷酰胺、三乙烯硫代磷酰胺、6－巯基嘌呤、5－氟尿嘧啶、丝裂霉素 C 及色霉素 A3 耐药的细胞株也显示出一定的疗效。

柔红霉素作用机制在于细胞的核酸合成过程，能直接与 DNA 结合，阻碍 DNA 合成和依赖 DNA 的 RNA 合成反应。

【药代动力学】通常静脉给药，给药后迅速分布到全身，心、肾、肺、肝和脾分布较多，本品不易透过血脑屏障，可通过胎盘，主要在肝代谢，其代谢物柔红霉素醇仍有抗癌活性，本品在血浆中迅速消除。消除曲线呈双相。半衰期分别为 45 分钟和 55 小时。代谢产物与原形药物缓慢由胆汁及尿中排出，尿液可呈红色。

给 10 例白血病成人患者静脉注射（将本药 40mg 溶解于 40ml 生理盐水中）3 分钟时的血中和红细胞中的浓度分别为（228 ± 204）μg/ml 和 237μg/g。它在人体的主要代谢产物是柔红霉素醇。在 24 小时的总排泄率为（11.8 ± 5.1）%，其中柔红霉素（6.33 ±

2.93)%，道诺红菌素醇（5.3 ± 2.48)%。其分布半衰期（$t_{1/2\alpha}$）为 0.07 小时，消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为 2.86 小时，半衰期（$t_{1/2\gamma}$）为 97.3 小时。

【药物相互作用】可与泼尼松、阿糖胞苷或长春碱等合用，以增加其疗效。

【不良反应】本品毒性较大，限制剂量的不良反应为骨髓抑制，发生率达 90%，白细胞减少较血小板减少严重。其他不良反应有畏食、恶心、呕吐、口炎、胃炎和脱发等。注入太快或总量超过 550mg/m^2 可引起心脏毒性，有的为进行性、隐伏性、致死性心肌损害。出现心动过速或心力衰竭，这是一种延迟毒性，有时在停药后 1～6 个月才出现。累积量超过 25mg/kg 者，心肌毒性致死率为 10%。对小儿、老人、有心脏病史及肝肾功能不全者尤应注意。本品有刺激性，应避免与皮肤、黏膜接触，静注时外漏可致局部组织坏死。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸柔红霉素	化学药	HZ0005099

HY002349 盐酸瑞芬太尼

【外文名称】Remifentanil Hydrochloride

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物理化信息

【化学名】3－［4－（甲氧羰基）－4－［(1－氧丙基）苯胺基］－1－哌啶］丙酸甲酯单盐酸盐

【分子式】$C_{20}H_{28}N_2O_5 \cdot HCl$

【分子量】412.91

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：瑞芬太尼为芬太尼类 μ 型阿片受体激动剂，在人体内 1 分钟左右迅速达到血－脑平衡，在组织和血液中被迅速水解，故起效快，维持时间短，与其他芬太尼类似物明显不同。瑞芬太尼的镇痛作用及其副作用呈剂量依赖性，与催眠药、吸入性麻醉药和苯二氮䓬类药物合用有协同作用。瑞芬太尼的 μ 型阿片受体激动作用可被纳洛酮所拮抗。另外瑞芬太尼也可引起呼吸抑制、骨骼肌（如胸壁肌）强直、恶心呕吐、低血压和心动过缓等，在一定剂量范围内，随剂量增加而作用加强。盐酸瑞芬太尼剂量高达 30μg/kg 静脉注射（1 分钟内注射完毕）不会引起血浆组胺浓度的升高。

2．毒理研究

（1）遗传毒性：瑞芬太尼的原核细胞基因突变试验、大鼠肝细胞程序外 DNA 合成试验（UDS）、基因断裂试验（CHO 细胞）和小鼠微核试验的结果均为阴性；但有代谢活化剂存在，体外小鼠淋巴细胞试验出现致突变作用。

（2）生殖毒性：①一般生殖毒性，瑞芬太尼 0.5mg/kg（按体表面积 mg/m^2 计算，相当于临床最大推荐人用剂量的 40 倍）连续静脉注射 70 多天，雄性大鼠的生育力降低；雌性大鼠交配前静脉注射瑞芬太尼 1mg/kg 15 天，其生育力未受影响。②致畸敏感期毒性，大鼠和家兔分别静脉注射瑞芬太尼 5mg/kg 和 0.8mg/kg（按体表面积 mg/m^2 计算，相当于临床最大推荐人用剂量的 400 倍和 125 倍）未见致畸作用。怀孕兔和大鼠注射放射性标记的瑞芬太尼后，发现其通过胎盘并进入胎仔体内。③围产期毒性，大鼠围产期静脉注射瑞芬太尼 5mg/kg（按体表面积 mg/m^2 计算，相当于临床最大推荐人用剂量的 400 倍），对 F_1 代大鼠的存活、发育和生殖能力未见明显影响。

【药代动力学】瑞芬太尼是哌啶的衍生物，因含有一个酯的结构，极易被体内酯酶迅速水解。若血浆胆碱酯酶受到抑制或功能不良时，瑞芬太尼的分解并不受到影响。它也不干扰酯酶对其他药物，如琥珀胆碱或艾司洛尔的分解。瑞芬太尼起效快，分布容积小，再分布快，廓清终末 $t_{1/2}$ 为 8.8～40 分钟；血浆和作用点之间的药浓度半时值为 1.0～1.5 分钟；单次注射后的峰浓度时间为 1.5 分钟。

研究结果表明，在应用大剂量的瑞芬太尼后，所测的廓清终末 $t_{1/2}$ 的结果有差异，但其血浆浓度连贯敏感半时值是相当恒定的，此时间极短，不论滴注时间多长均为 3～5 分钟。瑞芬太尼在滴注 3 小时后，呼吸恢复短于 15 分钟；终止滴注 5 分钟，后者需纳洛酮对抗者为 50%，而前者为 17%。肝功能衰竭时，较小剂量的瑞芬太尼就能抑制每分钟通气量 50%，止痛作用相似，苏醒同样快速。肾功能衰竭时，药物的敏感性并不升高，剂量应用如常，苏醒也无变化。瑞芬太尼初级代谢产物不能经肾排出而在体内蓄积，但是由于代谢产物的作用微乎其微，即使连续滴注 24 小时，代谢产物也不会达到产生临床症状的有效浓度。在 2～12 岁儿童中，其代谢和成人无异。在老年人中，此药的起效较缓，但老年人对药物较敏感。老年人的分布容积较小，廓清率也低，年龄 > 65 岁者，初剂量应减 50%。此外，瑞芬太尼易通过胎盘，但是在胎儿体内快速代谢，不引起胎儿的呼吸抑制。

【药物相互作用】瑞芬太尼必须以氧化亚氮、丙泊酚或异氟烷作补充。计算机模拟证明丙泊酚的最佳血浆浓度为 2.55μg/kg［以 80μg/（kg·min）滴注］，瑞芬太尼为 4.08μg/L［以 0.2μg/（kg·min）滴注］，当用于 3 小时的滴注时，苏醒最快，7 分钟时神智恢复。此模拟指出增加丙泊酚的剂量而不是增加瑞芬太尼剂量，则苏醒期相对延长。为保证神智消失，瑞芬太尼的应用必须联用丙泊酚的滴注或吸入一定浓度的麻醉药。

【药物过量】药物过量症状包括窒息、胸壁肌强直、癫痫、缺氧、低血压和心动过缓等。

如果出现药物过量或怀疑药物过量，立即中断给药，维持开放气道，吸氧并维持正常的心血管功能。如呼吸抑制与肌肉强直有关，需给予神经肌肉阻断剂或 μ 阿片拮抗剂，并辅助呼吸。输液和增压药及其他辅助方法可用来处置低血压。葡萄糖吡咯或阿托品用于处置心动过缓或低血压。阿片拮抗剂（如纳络酮）作为特异性解毒剂，用于处置严重呼吸抑制或肌肉强直。

【药物的滥用与依赖】本品能产生吗啡类药物的依赖性，因此有存在滥用的潜力。但在正常临床指导应用剂量下未发现病人有药物依赖。

【不良反应】瑞芬太尼麻醉剂量较大并与其他麻醉药共同应用时可引起血压降低、心动过缓和肌僵，还可引起恶心、呕吐。小剂量的咪达唑仑（2mg）可以减少瑞芬太尼恶心、呕吐的发生率。瑞芬太尼麻醉的颅脑手术后收缩压较高，71%病人需要柳胺苄心啶或 32%病人需要肼屈嗪治疗。另外，该药可引起瘙痒及焦虑。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸瑞芬太尼	化学药	HZ005100

HY002350　盐酸塞利洛尔

【外文名称】Celiprolol Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 45 册

药物理化信息

【化学名】3－〔3－乙酰基－4－（3－特丁氨基－2 羟基－丙氧基）－苯基〕－1,1－二乙基脲盐酸盐

【分子式】$C_{20}H_{33}N_3O_4 \cdot HCl$

【分子量】416.96

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶或结晶性粉末，无臭，味苦。

本品在水或甲醇中易溶，在无水乙醇中略溶，在丙酮中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 198～204℃。熔融时同时分解。

吸收系数：取本品，精密称定，加 0.1mol/L 盐酸溶液溶解并定量稀释制成 1ml 中含 10μg 的溶液，照分光光度法，在 232nm 波长处测定吸光度，吸收系数为 640～686。

药物药理信息

【药理毒理】本品是一种高选择性 β－受体阻滞剂，通过阻滞 β_1 受体，扩张血管，降低血压。本品高选择性地和心肌细胞膜上 β_1 受体结合，其亲和力比支气管和血管平滑肌 β_2 受体强 20～30 倍。能降低休息和运动时的心率与心输出量，降低运动时的收缩压，抑制异丙肾上腺素诱导的心动过速。对健康人，本品不能逆转 β_2 受体介导的异丙肾上腺素的血管舒张效应。本品有内在拟交感活性，不增加呼吸道阻力，扩张外周血管，改善血液循环。本品无膜稳定化作用也不抑制心肌收缩力，比其他无内源拟交感活性的 β 受体阻滞剂引起窦性心动过缓的可能性要小。本品能通过胎盘屏障。

【药代动力学】本品口服后大约有 30%能被吸收，服药后 2～4 小时血药浓度达峰值。约 30%的本品以可逆方式和血浆蛋白结合，消除半衰期为 2～3 小时。本品能通过胎盘屏障，在体内不被代谢，以原形排出，其中 10%从尿中、85%从粪便中排出。

【药物相互作用】

1．与肾上腺素能神经元阻断药如利血平合用时其作用相加，有时会发生体位性低血压和心动过缓甚至出现眩晕和晕厥。

2．维拉帕米和 β－受体阻滞剂都能减慢房－室传导，抑制心肌收缩力，但作用机制不同，当从维拉帕米换服本品或从本品换服维拉帕米时，应有停药期。如果需要连续给药，开始时应使用心电图监护。已有传导异常的患者不应两药合用。

【不良反应】可有头痛、头晕、乏力、困倦、嗜睡及恶心，一般反应轻微，偶见心悸、震颤，通常无需停药，罕见抑郁症及过敏反应。如果出现支气管痉挛、皮疹等与 β－受体阻滞剂有关的副反应时应停药。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸塞利洛尔胶囊	化学药	HZ004272
盐酸塞利洛尔片	化学药	HZ004273

HY002351 盐酸塞洛唑啉

【外文名称】Xylometazoline Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】2－（4－特丁基－2,6－二甲苄基）－2－咪唑啉盐酸盐

【分子式】$C_{16}H_{24}N_2 \cdot HCl$

【分子量】280.84

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，味苦。

本品在乙醇中易溶，在水中或三氯甲烷中溶解，在乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品属肾上腺素受体激动药，对肾上腺素α受体有特殊的兴奋作用。本品直接作用于拟交感神经胺和鼻黏膜小血管上的肾上腺素α受体，产生血管收缩作用，从而减少血流量，以解除鼻黏膜的充血肿胀。

【药物相互作用】本品和单胺氧化酶抑制药（如异卡波肼、丙卡巴肼）合用，可引起严重的头痛、高血压危象。其他潜在的反应还包括恶心、呕吐、心律不齐、胸痛、颅内出血、循环衰竭、高烧和死亡。

使用本品时不能同时使用其他收缩血管类滴鼻剂。

【不良反应】偶见鼻腔内有一过性的轻微烧灼感、干燥感、头痛、头晕和心率加快等反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸赛洛唑啉滴鼻液	化学药	HZ004278
盐酸赛洛唑啉喷鼻剂	化学药	HZ004279

HY002352 盐酸噻氯匹定

【外文名称】Ticlopidine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】5－（2－氯苯基）－4,5,6,7－四氢噻吩并［3,2－*c*］吡啶盐酸盐

【分子式】$C_{14}H_{14}ClNS \cdot HCl$

【分子量】300.25

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，味微咸。

本品在水、甲醇或三氯甲烷中溶解，在丙酮中极微溶解，在冰醋酸中易溶。

药物药理信息

【药理毒理】噻氯匹定为血小板聚集抑制剂。血小板的活化受多种因素的影响，其中二磷酸腺苷（ADP）起关键作用。当二磷酸腺苷与其特异性受体结合后，可活化血小板膜表面的纤维蛋白原受体（糖蛋白Ⅱb－Ⅲa复合物），并使其结合纤维蛋白原进而引起血小板聚集（Ⅰ期聚集）。另外，血小板活化后又可释放二磷酸腺苷，导致血小板进一步聚集（Ⅱ期聚集）。噻氯匹定对 ADP 诱导的血小板聚集（包括Ⅰ期及Ⅱ期聚集）有强力的抑制作用，且作用持久。此外，噻氯匹定可降低纤维蛋白原浓度与血液黏滞性，并提高全血及红细胞的滤过率。

【药代动力学】口服后易吸收，在服用后 1～2 小时达到血药峰浓度，其血浆半衰期为 6 小时左右。服用后较快速地产生显著的抑制血小板聚集作用。第 4 至 6 天达最大作用。血药峰值与其最大效应间有 24～48 小时延迟。其药效作用应不与血药浓度相关，其作用时间与血小板存活半衰期（7 日）相关，故停药之后，抑制血小板聚集作用尚持续数日。在血浆中迅速清除，仅一小部分以原形药随尿液排出。活性成分的 60%转化为代谢物随粪便排泄。代谢物可能具有活性作用。

本品蛋白结合率甚高，为 98%，主要与血中清蛋白及脂蛋白结合。本品由肝脏代谢。其代谢产物主要由肾脏（60%）及粪便（25%）排出。

【药物相互作用】

1．本品与任何血小板聚集抑制剂、溶栓剂及导致低凝血酶原血症或血小板减少的药物合用均可加重出血的危险。若临床确有必要联合用药，应密切观察并进行实验室监测。

2．本品与茶碱合用时，因其降低了后者的清除率，会使茶碱血药浓度升高并有过量的危险。故用本品期间及之后应调整茶碱用量，必要时进行茶碱血药浓度监测。

3．本品与地高辛合用时可使后者血药浓度轻度下降（约 15%），但一般不会影响地高辛的临床疗效。

4．偶见本品降低环孢素血药浓度的报道，故二者合用时应定期进行环孢素血药浓度监测。

【不良反应】本品最常见的不良反应为粒细胞减少或粒细胞缺乏（2.4%）、血小板减少（0.4%）、胃肠功能紊乱及皮疹。上述不良反应多出现于用药后 3 个月之内。偶见用药数年后发生粒细胞减少、血小板减少及血栓形成性血小板减少性紫癜（Thrombotic thrombocytopenic purpura，TTP）的报道。严重的粒细胞缺乏或 TTP 甚至有致命的危险。胃肠反应多表现

为恶心、呕吐及腹泻，一般为轻度，无须停药，1～2周后常可恢复。此外，罕见肝炎和胆汁淤积性黄疸、血管神经性水肿、脉管炎、狼疮综合征及过敏性肾病等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸噻氯匹定缓释片	化学药	HZ004274
盐酸噻氯匹定胶囊	化学药	HZ004275
盐酸噻氯匹定片	化学药	HZ004276

HY002353　盐酸赛庚啶

【其他名称】安替根、乙苯环庚啶

【外文名称】Cyproheptadine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】1－甲基－4－（5H－二苯并［a，d］环庚三烯－5－亚基）哌啶盐酸盐倍半水合物

【分子式】$C_{21}H_{21}N\cdot HCl\cdot 3/2H_2O$

【分子量】350.89

【性状及组成】本品为白色或微黄色的结晶性粉末，几乎无臭，味微苦。本品在甲醇中易溶，在三氯甲烷中溶解，在乙醇中略溶，在水中微溶，在乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】其H_1受体拮抗作用较氯苯那敏、异丙嗪强，并具有轻中度的抗5－羟色胺作用以及抗胆碱作用。此外尚有刺激食欲的作用，服用一定时间后可见体重增加。其食欲增进作用可能是由于抑制下丘脑饱觉中枢所致。据报道本品有阻断钙通道作用，并可抑制醛固酮和促肾上腺皮质素分泌。

【药代动力学】胃肠吸收后完全代谢，代谢物主要从尿中排泄。

【药物相互作用】

1．不宜与乙醇合用，可增加其镇静作用。

2．不宜与中枢神经系统抑制药合用。

3．与吩噻嗪药物（如氯丙嗪等）合用可增加室性心律失常的危险性，严重者可致尖端扭转型心律失常。

【不良反应】嗜睡、口干、乏力、头晕、恶心等。机动车驾驶员，高空作业者慎用。消化性溃疡、幽门梗阻、尿潴留、青光眼患者忌用。长期服用可增进食欲，使体重增加。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸赛庚啶片	化学药	HZ004277

HY002354　盐酸赛克力嗪

【外文名称】Cyclizine Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】本品用于晕动症引起的恶心、呕吐等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方盐酸赛克力嗪片	化学药	HZ001464

HY002355　盐酸三氟拉嗪

【其他名称】Amylozine、Calmazine、甲哌氟丙嗪、三氟吡拉嗪、三氟拉嗪、Stelazine、Terflazine、Terfluzine、Triphthazinum

【外文名称】Trifluoperazine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】10－［3－（4－甲基－1－哌嗪基）丙基］－2－（三氟甲基）－吩噻嗪二盐酸盐

【分子式】$C_{21}H_{24}F_3N_3S\cdot 2HCl$

【分子量】480.42

【性状及组成】本品为白色或微黄色的结晶性粉末，无臭或几乎无臭，味苦，微有引湿性，遇光渐变色。本品在水中易溶，在乙醇中溶解，在三氯甲烷中微溶，在乙醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为吩噻嗪类抗精神病药，抗精神病作用与其阻断脑内多巴胺受体有关，抑制延脑催吐化学感受区的多巴胺受体及直接抑制呕吐中枢，产生强大镇吐作用，镇静作用和抗胆碱作用较弱。

【药代动力学】口服吸收好，在肝脏代谢，主要活性代谢产物为硫氧化物，*N*－去甲基和7－羟基代谢物，半衰期约为13小时。

【药物相互作用】

1．与乙醇或其他中枢神经系统抑制药合用，可增强中枢抑制作用。

2．与抗高血压药合用，易致体位性低血压。

3．本品与舒托必利合用有增加室性心律紊乱危险，严重者可致尖端扭转心律失常。

4．本品与其他阿托品类药物合用，不良反应

相加。

【药物过量】

1. 中毒症状：

(1) 中枢神经系统：可出现严重的锥体外系症状，并有意识障碍，从嗜睡、注意力不集中到昏睡，最后进入昏迷。检查时可发现瞳孔缩小，对光反射迟钝，同时伴有中枢性体温过低。

(2) 心血管系统：体位性低血压、心率加快、脉细数、偶见心律不齐，严重时导致低血容量性休克。

(3) 血液系统：中性粒细胞减少、过敏性紫癜。

2. 处理：洗胃，导泻，输液，并依病情给予对症治疗及支持疗法。

【不良反应】锥体外系反应多见，如静坐不能、急性肌张力障碍和类帕金森病。长期大量使用可发生迟发性运动障碍。可发生心悸、失眠、乏力、口干、视物模糊、排尿困难、便秘、溢乳、男子女性化乳房、月经失调、闭经等。少见思睡、躁动、眩晕、尿潴留。偶见过敏性皮疹、白细胞减少及恶性综合征。偶可引起体位性低血压、心悸或心电图改变、肝酶水平升高或阻塞性黄疸、癫痫。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸三氟拉嗪片	化学药	HZ0004280

HY002356 盐酸三氟哌多

【其他名称】盐酸三氟哌丁苯

【外文名称】Trifluperidol Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第5册

药物理化信息

【化学名】4′-氟-4-[4-羟基-4-（间三氟甲苯基）哌啶-1]苯丁酮-1的盐酸盐

【分子式】$C_{22}H_{23}F_4NO_2 \cdot HCl$

【性状及组成】本品为白色或微黄色无定形结晶性粉末，无臭，味苦。

本品在甲醇中易溶，在乙醇中溶解，在水或丙酮中微溶，在乙醚中几乎不溶。

溶点：本品的熔点为206～211℃。

药物药理信息

【药理毒理】强安定药。

HY002357 盐酸三甲卡因

【其他名称】Mesocaine、美索卡因

【外文名称】Trimecaine Hydrochloride

【分子式】$C_{15}H_{25}ClN_2O$

【分子量】284.83

【性状及组成】本品是白色针状结晶或结晶性粉末，无臭，味苦而麻。易溶于水及热乙醇，微溶于醇，难溶于三氯甲烷等。

药物药理信息

【药理毒理】本品为酰胺类局麻药，作用出现快，持续时间长，毒性比利多卡因低，局麻效能比利多卡因强。适用于浸润、传导、硬膜外麻醉。

HY002358 盐酸沙格雷酯

【外文名称】Sarpogrelate Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】

1. 本品对于血小板以及血管平滑肌的5-HT_2受体具有特异性拮抗作用。因而显示抗血小板以及抑制血管收缩的作用。

2. 抑制血小板凝聚作用。

(1) 对于健康成人以及慢性动脉闭塞症患者，本品可抑制由于同时添加5-羟色胺和胶原蛋白所导致的血小板的凝聚（exovivo试验）。

(2) 在invitro试验中，发现本品可抑制胶原蛋白所导致的血小板凝聚以及ADP或肾上腺素所导致的继发性凝聚。另外，由胶原蛋白所导致的血小板凝聚会由5-羟色胺所增强，本品可抑制这一现象。

3. 抗血栓作用。

(1) 在使用周围动脉闭塞症模型（通过输注月桂酸导致大白鼠周围动脉闭塞）的试验中，本品可抑制其病症的发作。

(2) 在使用动脉血栓模型（血管内皮损伤导致的小白鼠动脉血栓、聚乙烯管置换大白鼠动脉血栓）的试验中，本品可抑制其血栓的形成。

4. 抑制血管收缩作用：在使用大白鼠血管平滑肌进行的invitro试验中，发现本品可抑制5-羟色胺导致的血管平滑肌收缩。另外，血管平滑肌会伴随血小板凝聚而发生收缩，使用本品可抑制这种收缩。

5. 微循环改善作用：本品可使慢性动脉闭塞症患者的透皮性组织氧分压以及皮肤表面温度升高。在使用侧支血行循环障碍模型（大白鼠）的试验中，本品可改善其循环障碍。

【药代动力学】

1. 吸收：健康成人一次服用本品100mg时的血药浓度变化以及药代动力学参数如下所示：健康成人（$n=6$）C_{max}（μg/ml）0.54±0.10，t_{max}（h）0.92±0.59，$t_{1/2}$（h）0.69±0.14，$AUC_{0\to\infty}$（μg·h/ml）

0.58 ± 0.19。

2. 排泄：健康成人一次服用本品 100mg 时，服用后 24 小时内在尿与粪便中未发现药物原形。另外，从尿中以及粪便中的排泄总计分别为 44.5% 及 4.2%。

3. 有关动物的吸收、分布、代谢、排泄：给大白鼠口服^{14}C - 盐酸沙格雷酯时，大部分组织内放射性浓度在 15 ~ 30 分钟达到最高值，而且肝脏、肾脏以及肺中的放射性浓度分布要高于血液中。^{14}C - 盐酸沙格雷酯从各组织内的消失也很迅速。用药后 96 小时之内从尿中排泄 30 ~ 40%、从便中排泄 60 ~ 70%。

【药物相互作用】 抗凝血剂、华法林以及具有抑制血小板凝聚作用的药物阿司匹林、盐酸噻氯匹定、西洛他唑等有加剧出血的可能。

【不良反应】 在 4807 总病例中，发现有不良反应的为 107 例（2.23%）（包括临床检验值异常在内）。主要的不良反应有：恶心 12 例（0.25%）、反酸 10 例（0.21%）。腹痛 9 例（0.19%）。

严重不良反应有以下内容。

1. 脑出血（0.1%以下）、消化道出血（0.1%以下）：曾发现有脑出血、吐血和便血等消化道出血的不良反应，因此在使用本品时需要进行充分观察，当发现有异常情况时，应停止用药并进行适当处理。

2. 血小板减少：曾发现有血小板减少的不良反应，因此在使用本品时需要进行充分观察，当发现有异常情况时，应停止用药并进行适当处理。

3. 肝功能障碍、黄疸：曾发现有伴随 AST、ALT、γ - GTP、LDH 升高的肝功能障碍、黄疸等不良反应，因此在使用本品时需要进行充分观察，当发现有异常情况时，应停止用药并进行适当处理。

4. 严重不良反应：同类药物（盐酸噻氯匹定）发现有粒细胞缺乏症等不良反应，因此需要注意。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸沙格雷酯片	化学药	HZ004281

HY002359　盐酸舍曲林

【外文名称】 Sertraline Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】（1*S* - 顺式）- 4 -（3,4 - 二氯苯基）- 1,2,3,4 - 四氢 - *N* - 甲基 - 1 - 萘胺盐酸盐

【分子式】 $C_{17}H_{17}NCl_2 \cdot HCl$

【分子量】 342.70

药物药理信息

【药理毒理】 本品可选择性抑制中枢神经系统对 5 - 羟色胺的再摄取，从而使突触间隙中 5 - 羟色胺浓度增高，发挥抗抑郁作用。

【药代动力学】 口服易吸收，血药浓度达峰时间为 6 ~ 10 小时，$t_{1/2}$约 26 小时，服药 4 ~ 7 日可达稳态血浓度。血浆蛋白结合率为 97%。在肝脏代谢，代谢产物为 *N* - 去甲舍曲林，活性为母药的 1/10。主要由尿排出。

【药物相互作用】

1. 本品与单胺氧化酶抑制剂合用，可出现严重反应，在停用单胺氧化酶抑制剂 14 天内，不能服用本药；停用本品后也需 14 天以上才能开始单胺氧化酶抑制剂的治疗。

2. 本品与色氨酸或芬氟拉明合用时，可使中枢神经系统对 5 - 羟色胺的再摄取增加，出现药效学相互作用。

3. 在舍曲林治疗期间不宜饮酒。

4. 本品与西咪替丁合用，可降低舍曲林的清除。

5. 本品与华法林合用，可延长凝血酶原时间。

6. 本品与锂盐合用时，可能存在药效学相互作用，应慎用。

【药物过量】 药物过量可出现嗜睡、恶心、呕吐、心动过速、ECG 改变、焦虑不安和瞳孔散大等症状。应对症治疗及支持疗法。

【不良反应】 可有胃肠道不适，如恶心、畏食、腹泻等。亦可出现头痛、不安、无力、嗜睡、失眠、头晕或震颤等。少见不良反应有过敏性皮疹及性功能减退。大剂量时可能诱发癫痫。突然停药可有撤药综合征，如失眠、焦虑、恶心、出汗、震颤、眩晕或感觉异常等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸舍曲林胶囊	化学药	HZ004282
盐酸舍曲林片	化学药	HZ004283

HY002360　盐酸肾上腺素

【外文名称】 Adrenaline Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】（*R*）- 4 [2 -（甲氨基）- 1 - 羟基乙基] - 1，2 - 苯二酚盐酸盐

【分子式】 $C_9H_{13}NO_3$

【分子量】 219.67

药物药理信息

【药理毒理】 本品兼有 α 受体和 β 受体激动作

用。α受体激动引起皮肤、黏膜、内脏血管收缩。β受体激动引起冠状血管扩张、骨骼肌、心肌兴奋、心率增快、支气管平滑肌、胃肠道平滑肌松弛。对血压的影响与剂量有关，常用剂量使收缩压上升而舒张压不升或略降，大剂量使收缩压、舒张压均升高。

【药代动力学】肾上腺素在体内的代谢途径与异丙肾上腺素相同。口服后有明显的首过效应，在血中被肾上腺素神经末梢摄取，另一部分迅速在肠黏膜及肝中被儿茶酚－氧位－甲基转移酶（COMT）和单胺氧化酶（MAO）灭活，转化为无效代谢物，不能达到有效血浓度。皮下注射由于局部血管收缩使之吸收缓慢，肌内注射吸收较皮下注射为快。皮下注射约6～15分钟起效，作用维持1～2小时，肌注作用维持80分钟左右。仅少量原形药物由尿排出。本药可通过胎盘，不易透过血－脑脊液屏障。

【药物相互作用】

1．α受体阻滞剂以及各种血管扩张药可对抗本品的加压作用。

2．与全麻药合用，易产生心律失常，直至室颤。用于指、趾部局麻时，药液中不宜加用本品，以免肢端供血不足而坏死。

3．与洋地黄、三环类抗抑郁药合用，可致心律失常。

4．与麦角制剂合用，可致严重高血压和组织缺血。

5．与利血平、胍乙啶合用，可致高血压和心动过速。

6．与β受体阻滞剂合用，两者的β受体效应互相抵消，可出现血压异常升高、心动过缓和支气管收缩。

7．与其他拟交感胺类药物合用，心血管作用加剧，易出现副作用。

8．与硝酸酯类合用，本品的升压作用被抵消，硝酸酯类的抗心绞痛作用减弱。

【不良反应】1．心悸、头痛、血压升高、震颤、无力、眩晕、呕吐、四肢发凉。

2．有时有心律失常，严重者可由于心室颤动而致死。

3．用药局部有水肿、充血、炎症。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方盐酸阿替卡因注射液	化学药	HZ001455
盐酸肾上腺素注射液	化学药	HZ004284

HY002361 盐酸士的宁

【外文名称】Strychnine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（二部）·第5册

药物理化信息

【化学名】士的宁定－10－酮盐酸盐二水合物

【分子式】$C_{21}H_{22}N_2O_2 \cdot HCl \cdot 2H_2O$

【分子量】406.92

【性状及组成】本品为无色棱柱状的结晶或白色粉末，无臭，味极苦。

本品在水或乙醇中略溶，在乙醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品对脊髓有选择性兴奋作用，对大脑皮层也有一定兴奋作用，本品安全范围窄，过量易产生惊厥。

【药代动力学】起效快，迅速在肝内代谢，仅约20%的原型药从尿中排出。有蓄积作用。

【药物过量】

1．中毒症状：初期表现烦躁不安、抽搐、呼吸加快、颈肌和面肌有僵硬感、瞳孔缩小，严重中毒时，延髓麻痹，心脏及呼吸抑制，甚至死亡。

2．处理：将中毒者置于安静而黑暗的房间，避免声音及光线刺激。如有抽搐发生，给予镇静剂。等患者安静后洗胃、输液并视病情给予相应的对症治疗和支持疗法。

【不良反应】可出现惊厥、呼吸肌痉挛和呼吸运动受限。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸士的宁注射液	化学药	HZ004285

HY002362 盐酸舒托必利

【外文名称】Sultopride Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第47册

药物理化信息

【化学名】本品为*N*－〔（1－乙基－2－吡咯烷基）甲基〕－5－（乙基磺酰基）－2－甲氧基－苯甲酰胺盐酸盐

【分子式】$C_{17}H_{26}N_2O_4S \cdot HCl$

【分子量】390.93

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，味微苦。

本品在水中易溶，在乙醇或丙酮中微溶，在乙醚中极微溶解，在氢氧化钠溶液中易溶。

熔点：本品的熔点为 183 ~ 188℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】抗精神病药。

HY002363　盐酸双环胺

【其他名称】Bentyl01、Procyclomine

【外文名称】Dicyclomini Hydrochloride

【分子式】$C_{19}H_{35}O_2N \cdot HCl$

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，几乎无臭，味苦后有麻木感。溶于水，易溶于乙醇和三氯甲烷，不溶于乙醚。

药物药理信息

【药理毒理】为抗胆碱药，其作用与阿托品相似而较弱，并有局部麻醉作用。用于胃及十二指肠溃疡，胃酸过多及胆胃肠道、尿道痉挛等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方氢氧化铝镁片	化学药	HZ001350

HY002364　盐酸司来吉兰

【其他名称】丙炔苯并胺、克金平

【外文名称】Selegiline Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】（*R*）－*N*－α－二甲基－*N*－（2－丙炔基）苯乙胺盐酸盐

【分子式】$C_{13}H_{17}N \cdot HCl$

【分子量】223.75

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理学研究

盐酸司来吉兰是苯乙胺的左旋炔类衍生物，为B型单胺氧化酶（MAO－B）不可逆性抑制剂，在临床推荐剂量时（如每天 10mg）可选择性地抑制 MAO－B。司来吉兰经 MAO 转化后，其活性部分与 MAO 的活性中心和（或）其辅酶异咯嗪黄素腺嘌呤二核苷酸（FAD）不可逆性结合，“自杀性”抑制 MAO 活性。MAO 可分为 A 型和 B 型，人类脑中主要是 MAO－B，而肠中 MAO－A 占优势。MAO 可使多种儿茶酚胺类化合物和 5－羟色胺氧化脱胺而降解。司来吉兰作为左旋多巴/卡比多巴的辅助用药，通过抑制脑内 MAO－B，阻断多巴胺的降解，相对增加多巴胺含量，补充神经元合成多巴胺能力的不足。

通常认为司来吉兰的作用主要是通过抑制 MAO－B 的活性而产生，但另外有证据表明司来吉兰可通过其他机制增强多巴胺能神经的功能。如干扰突触对多巴胺的再摄取，或通过其代谢产物（安非他敏和甲基苯丙胺）干扰神经元对多种神经递质的摄取，增强递质（去甲肾上腺素、多巴胺、5－HT）的释放来加强多巴胺能神经的功能。

MAO 对食物和药物中的多种外源性胺类物质也有降解作用，肠道和肝脏中的 MAO（主要是 MAO－B）对于防止外源性胺类物质吸收引发高血压危象（称为“干酪反应”）具有重要作用。如果发酵的干酪、红葡萄酒、鲱以及治疗咳嗽/感冒药等所含的胺类物质大量进入血液循环，被肾上腺素能神经元吸收后，置换囊胞储存位点中的去甲肾上腺素，后者释放入血，可引起血压升高等反应。司来吉兰对 MAO－B 活性中心的亲和力大于 MAO－A，因此理论上讲，在临床推荐剂量下可选择性地抑制 MAO－B 而不会明显抑制肠道中的 MAO－A。

2．毒理学研究

（1）遗传毒性：鼠伤寒沙门菌基因突变试验和体内染色体畸变试验，未见基因突变或染色体损伤。但尚不能确定司来吉兰无致突变或致染色体裂变的作用。

（2）生殖毒性：致畸敏感期试验中，SD 大鼠经口给予司来吉兰 4、12 和 36mg/kg（按 mg/m^2 计算，分别相当于人用剂量的 4、12、35 倍）未观察到致畸作用，但 36mg/kg 组的胎仔体重降低；新西兰兔经口给药 5、25、50mg/kg（按 mg/m^2 计算，分别相当于人用剂量的 10、48、95 倍）未见致畸作用，但 25 和 50mg/kg 组的胎仔数少于致畸作用评价所推荐的胎仔数，50mg/kg 组的总吸收胎数和着床后丢失率增加，平均存活胎仔数减少。围产期试验中，SD 大鼠经口给予司来吉兰 4、16 和 64mg/kg（按 mg/m^2 计算，分别相当于人用剂量的 4、15、62 倍），发现 16 和 64mg/kg 组死胎数增加，平均产仔数、存活胎仔数减少，胎仔体重减轻（出生时以及整个哺乳期间），64mg/kg 组出生时的活仔产后 4 天内就全部死亡，故无法判断此剂量对出生后发育的影响。

【药代动力学】盐酸司来吉兰迅速被肠胃道吸收，口服半小时后达峰值。生物利用度低，仅平均 10%的未变化的盐酸司来吉兰在循环系统内（个体差异大）。盐酸司来吉兰是亲脂性，略带碱性，迅速渗入各组织，包括脑，并迅速分布于人身体各部分，静注 10mg 后，其分布体积约 500L。

盐酸司来吉兰在治疗剂量下，约 75% ~ 85% 盐酸司来吉兰与血浆蛋白结合。主要通过肝代谢为去甲基盐酸司来吉兰，左旋甲基苯丙胺及左旋苯丙胺。这三种代谢物人类一次或多次用药后可在血浆及尿液探测到。

平均清除半衰期为 1.6 小时。代谢物主要通过尿液排泄，15% 由粪便排泄。临床作用时间不取决于本品清除率，因本品不可逆转地抑制 MAO - B 受体，所以一日 1 次剂量已足够。

【药物相互作用】 本品治疗中与间接的拟交感神经药相互作用所引起的高血压反应要留意。治疗帕金森所用的盐酸司来吉兰片剂量与含酪食品同时服用未发现有高血压反应。本品与非选择性单胺氧化酶抑制剂合用可能引起严重低血压。同时与单胺氧化酶 A 抑制剂吗氯贝胺服用并无耐药问题的报道。但同期用此类药品（MAOA 及 MAOB 抑制剂）及酪胺类物质（例如含酪食品如发酵食品及饮料、芝士、香肠、腌肉类、野味、肝脏、牛肉汤、咸鱼、豆类及豌豆、德国腌菜及酵母制品）会轻度增加高血压反应。但由于本品与吗氯贝胺同时服用文献报道不详，这两种药不能同时服用。

有报道盐酸司来吉兰片与哌替啶有相互作用，由于有些相互作用可致命并且机理未被确定，所以应避免同时服用。

盐酸司来吉兰片与氟西汀同时服用有报道产生严重反应，例如共济失调、震颤、高热、高/低血压、惊厥、心悸、流汗、脸红、眩晕及精神变化（激越、错乱、及幻觉）演变至谵妄及昏迷。盐酸司来吉兰片与其他两种 5 - 羟色胺重摄取抑制剂舍曲林及帕罗西汀同时服用也有类似报导，并且相互作用机制并不清楚了解，这些药物与盐酸司来吉兰片应避免同时服用。

由于氟西汀及其代谢产物的半衰期较长，氟西汀停药最少 5 星期后才开始服用盐酸司来吉兰片。另盐酸司来吉兰片及其代谢产物半衰期短，盐酸司来吉兰片停药两星期后即可开始服用氟西汀。在健康志愿者中同时服用盐酸司来吉兰片及西酞普兰无任何临床、药效学或药物动力学的相互作用。不过，同时服用盐酸司来吉兰片及所有选择性 5 - 羟色胺重摄取抑制剂万拉法辛及氟优沙明都要注意。盐酸司来吉兰片及三环类抗抑郁药同用时要小心，曾报道有严重中枢神经症状，有几例出现高热、震颤及激越的死亡报告。其他报道同时服用盐酸司来吉兰片及三环类抗抑郁药的不良反应有高/低血压、眩晕、出汗增加、震颤、抽搐、行为及精神改变。由于相互作用机理尚未清楚，加进这些药物于正服用盐酸司来吉兰片的病人要谨慎。

【药物过量】 无过量报道。在开发研究盐酸司来吉兰时，每日 600mg 剂量被发现引起严重低血压及精神运动性激越。盐酸司来吉兰过量理论上抑制 MAO - A 及 MAO - B 酶。所以症状类似非选择性单胺氧化酶（MAO）抑制剂过量（例如：嗜睡、眩晕、激惹、活动过多、不安、严重头痛、幻觉、高血压、低血压、胸痛、心跳增加或不规则血管委陷、呼吸抑制、出汗增加及发烧）。无解毒剂，以症状性治疗为主。

【不良反应】

1. 单独服用盐酸司来吉兰耐受性好。

2. 有报道服用盐酸司来吉兰后病人口干，短暂血清转氨酶值上升及睡眠障碍（例如失眠）的发生率比用安慰剂病人增加。由于盐酸司来吉兰能增加左旋多巴效果，故左旋多巴副反应也可能增加。

3. 加入盐酸司来吉兰给已服最大耐受剂量左旋多巴患者，可能出现不随意运动、恶心、激惹、错乱、幻觉、头痛、位置性低血压及眩晕；排尿困难、出现皮疹也曾有报道。应监测潜在的副反应。所以，当加入盐酸司来吉兰治疗时，左旋多巴剂量应降低平均 30%。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸司来吉兰胶囊	化学药	HZ0004286
盐酸司来吉兰片	化学药	HZ0004287

HY002365 盐酸司他斯汀

【外文名称】 Setastine Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】 1 - ［2 - ［1 - （4 - 氯苯基） - 1 - 苯乙氧基］乙基］六氢 - 1H - 吖庚因盐酸盐。

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理学研究

本品为镇静作用及对其他中枢神经系统影响较小的 H_1 受体拮抗剂。

本品对组胺引起的豚鼠死亡有保护作用，能抑制组胺引起的豚鼠支气管痉挛，抑制组胺引起的大鼠血管通透性的增加。

2. 毒理研究

（1）重复给药毒性：大鼠给药超过 2 年的最大无毒性剂量为 15mg/kg，犬给药超过毒性剂量为 1mg/kg。

（2）遗传毒性：本品体内、体外实验中未观察

到基因突变或 DNA 和染色体的损害。

（3）生殖毒性：本品剂量高于临床治疗剂量的 350 倍时，在大鼠和家兔上未观察到致畸胎作用。

（4）致癌性：大鼠 24 个月和小鼠 1 个月的致癌性试验中未观察到肿瘤发生率的增加。

【药代动力学】本品口服吸收快，30 分钟内起效，口服 2mg 后血浆峰浓度在 10～13ng/ml 之间，两次服用无蓄积倾向，生物半衰期为 14.54 小时。本品组织分布广，在肺、脂肪、胃和肝中含量较高，在脑、心、睾丸中含量较低。本品代谢物通过尿和粪便排出。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸司他斯汀片	化学药	HZ0004288

HY002366　盐酸四环素

【外文名称】Tetracycline Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】6－甲基－4－（二甲氨基）－3,6,10,12,12*a*－五羟基－1,11－二氧代－1,4,4*a*,5,5*a*,6,11,12*a*－八氢－2－并四苯甲酰胺盐酸盐

【分子式】$C_{22}H_{24}N_2O_8 \cdot HCl$

【分子量】480.90

【性状及组成】本品为黄色结晶性粉末，无臭，味苦，有引湿性，遇光色渐变深，在碱性溶液中易破坏失效。本品在水中溶解，在乙醇中略溶，在三氯甲烷或乙醚中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加 0.01mol/L 盐酸溶液溶解并稀释成每 1ml 中含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为－240°至－258°。

药物药理信息

【药理毒理】本品为广谱抑菌剂，高浓度时具杀菌作用。本品对肺炎链球菌、溶血性链球菌、草绿链球菌及部分葡萄球菌、产气荚膜杆菌、炭疽杆菌、鼠疫杆菌、白喉杆菌、破伤风杆菌、布鲁菌属、流感嗜血杆菌、弯曲杆菌属、霍乱弧菌均有一定抗菌作用，对立克次体、支原体属、衣原体属、螺旋体、某些原虫也有抑制作用。肠杆菌科细菌如大肠杆菌、克雷伯菌属、沙门菌属、志贺菌属等对本品多数耐药。

本品对革兰阳性菌的作用优于革兰阴性菌，但肠球菌属对其耐药。其他如放线菌属、炭疽杆菌、单核细胞增多性李斯特菌、梭状芽孢杆菌、奴卡菌属等亦对本品敏感。本品对淋病奈瑟菌和脑膜炎奈瑟菌具一定抗菌活性，但耐青霉素的淋球菌对四环素也耐药。本品对铜绿假单胞菌无抗菌活性。对部分厌氧菌属细菌具一定抗菌作用，但远不如甲硝唑、克林霉素和氯霉素，因此临床上并不选用。多年来由于四环素类的广泛应用，临床常见病原菌包括葡萄球菌等革兰阳性菌及肠杆菌属等革兰阴性杆菌对四环素耐药现象严重，并且同类品种之间存在交叉耐药。

本品作用机制在于药物能特异性地与细菌核糖体 30S 亚基的 A 位置结合，阻止氨基酰－tRNA 在该位上的连结，从而抑制肽链的增长和影响细菌蛋白质的合成。

【药代动力学】本品口服可吸收但不完全，约有 60%～70%的给药量可从胃肠道吸收。口服吸收受食物和金属离子的影响，后者与药物形成络合物使吸收减少。单剂口服本品 250mg 后，血药峰浓度（C_{max}）为 2～4mg/L。多剂口服该药 250mg 或 500mg（每 6 小时服药 1 次后），稳态血药浓度分别可达 1～3mg/L 和 1.5～5mg/L。吸收后广泛分布于体内组织和体液，易渗入胸水、腹水、胎儿循环，但不易透过血－脑脊液屏障。本品易与骨和牙齿等组织结合，在胎儿循环中浓度可达母体的 20%～75%，本品可分泌至乳汁，乳汁中浓度可达母血浓度的 60%～80%。蛋白结合率为 55%～70%，本品主要自肾小球滤过排出体外，肾功能正常者血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为 6～11 小时，无尿患者可达 57～108 小时，其未吸收部分自粪便以原形排出，少量药物自胆汁分泌至肠道排出，故肾功能减退时可明显影响药物的清除。本品可自血液透析缓慢清除，约可清除给药量的 10%～15%。

单次静脉给药 500mg 后，血药峰浓度为 15～20mg/L，1～2 小时后降至 4～10mg/L，12 小时后尚有 1～3mg/L。

【药物相互作用】

1．与制酸药如碳酸氢钠同用时，由于胃内 pH 增高，可使本品吸收减少，活性减低，故服用本品后 1～3 小时内不应服用制酸药。

2．含钙、镁、铁等金属离子的药物，可与本品形成不溶性络合物，使本品吸收减少。

3．与全身麻醉药甲氧氟烷合用时，可增强其肾毒性。

4．与强利尿药如呋塞米等药物合用时可加重肾功能损害。

5．与其他肝毒性药物（如抗肿瘤化疗药物）合用时可加重肝损害。

6．降血脂药考来烯胺或考来替泊可影响本品的吸收，必须间隔数小时分开服用。

7．本品可降低避孕药效果，增加经期外出血的

可能。

8. 本品可抑制血浆凝血酶原的活性，所以接受抗凝治疗的患者需要调整抗凝药的剂量。

【药物过量】应用本品超过每日 2g 可能引起致命的肝毒性。本品无特异性拮抗剂，药物过量时主要是对症疗法和补液等支持疗法，如洗胃、用催吐剂及补液等。

【不良反应】

1. 胃肠道症状如恶心、呕吐、上腹不适、腹胀、腹泻等，偶尔引起胰腺炎，偶有食管炎和食管溃疡的报道，多发生于服药后立即卧床的患者。

2. 本品可致肝毒性，通常为脂肪肝变性，妊娠期妇女、原有肾功能损害的患者易发生肝毒性，但肝毒性亦可发生于并无上述情况的患者。

3. 变态反应：多为斑丘疹和红斑，少数患者可见荨麻疹、血管神经性水肿、过敏性紫癜、心包炎以及系统性红斑狼疮加重，表皮剥脱性皮炎并不常见。偶有过敏性休克和哮喘发生。某些用四环素的患者日晒时会有光敏现象。所以，应建议患者服用本品期间不要直接暴露于阳光或紫外线下，一旦皮肤有红斑则立即停药。

4. 血液系统：偶可引起溶血性贫血、血小板减少、中性粒细胞减少和嗜酸性粒细胞减少。

5. 中枢神经系统：偶可致良性颅内压增高，可表现为头痛、呕吐、视神经乳头水肿等。

6. 肾毒性：原有显著肾功能损害的患者可能发生氮质血症加重、高磷酸血症和酸中毒。

7. 二重感染：长期应用本品可发生耐药金黄色葡萄球菌、革兰阴性杆菌和真菌等引起的消化道、呼吸道和尿路感染，严重者可致败血症。

8. 四环素类的应用可使人体内正常菌群减少，导致维生素缺乏、真菌繁殖，出现口干、咽炎、口角炎、舌炎、舌苔色暗或变色等。

9. 四环素静脉应用时，局部可产生疼痛等刺激症状，严重者发生血栓性静脉炎。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方枸橼酸铋钾甲硝唑胶囊	化学药	HZ001241
复方四环素片	化学药	HZ001396
复方四环素泼尼松膜	化学药	HZ001397
盐酸四环素醋酸可的松眼膏	化学药	HZ004289
盐酸四环素胶囊	化学药	HZ004290
盐酸四环素片	化学药	HZ004291
注射用盐酸四环素	化学药	HZ005101

HY002367 盐酸索他洛尔

【其他名称】甲磺胺心安、Sotacor、Sotalex、Sotapor、施太可、心得怡

【外文名称】Sotalol Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 55 册

药物理化信息

【化学名】（*RS*）－4′－（1－羟基－2－异丙胺基乙基）－甲磺酰苯胺盐酸盐

【分子式】$C_{12}H_{20}N_2O_3S \cdot HCl$

【分子量】308.82

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，味苦。

本品在水或甲醇中易溶，在乙醇中溶解，在三氯甲烷中几乎不溶。

吸收系数：取本品，紧密称定，加 0.1mol/L 氢氧化钠溶液制成每 1ml 中约含 10μg 的溶液，照分光光度法，在 249nm 的波长处测定吸光度，吸收系数为 456～504。

药物药理信息

【药理毒理】本药兼有第Ⅱ类及第Ⅲ类抗心律失常药物特性，是非心脏选择性、无内在的拟交感活性类 β 受体阻滞剂，有 β_1、β_2 受体阻滞作用。并能延长心肌动作电位、有效不应期及 QT 新时期，抑制窦房结、房室结传导时间，并延长房室旁路的传导。心电图表现为 P－R 间期延长，QRS 时限轻度增宽，Q－T 间期显著延长。

本药有轻度正性肌力作用，可能由于动作电位延长，钙内流时间增加，胞浆内钙增高所致。

本药列入Ⅲ类抗心律失常药物的范围内。

【药代动力学】人体静注或口服索他洛尔后，血药浓度－时间曲线符合二室模型，索他洛尔不与血浆蛋白结合，其表现分布容积 1.6～2.4L/kg，该药在肾脏、肝脏及心脏组织中浓度较高。索他洛尔是一种亲水性化合物，因此，透过血脑屏障较差，在中枢系统中浓度极低，不在脂肪组织中累积，故在肥胖与标准体重的健康志愿者的表观分布容积相近。

索他洛尔在人体内无明显生物转化，其血浆清除率与肝脏药物代谢能力无关。主要消除途径是以原形经肾脏排泄，小量从粪便、胆汁或其他肠道分泌液中排泄。终末消除半衰期 10～20 小时，血浆药物浓度与剂量呈线性相关。

【药物相互作用】

1. 与其他Ⅰa、Ⅱ、Ⅲ类抗心律失常药同用时

有协同作用。

2．与钙拮抗剂同用时可加重传导障碍，进一步抑制心室功能，降低血压。

3．与儿茶酚胺类药（如利血平、胍乙啶）同用产生低血压和严重心动过缓。

4．有血糖增高，需增加胰岛素和降糖药的报道。

【药物过量】血压下降，心动过慢、Q－T延长，并可出现严重致命性心律失常。

【不良反应】与β阻滞剂作用相关的有心动过缓、低血压、支气管痉挛。本品高可有乏力、气短眩晕、恶心、呕吐皮疹等。

本品严重的不良反应是致心律失常作用，可表现为原有心律失常加重或出现新的心律失常，严重时可出现扭转性室性心动过速，多源性室性心动过速，心室颤动，多与剂量大，低钾，Q－T延长，严重心脏病变等有关。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸索他洛尔片	化学药	HZ004292
盐酸索他洛尔注射液	化学药	HZ004293
注射用盐酸索他洛尔	化学药	HZ005102

HY002368　盐酸酞氨西林

【其他名称】Fisiopen、Talpen、盐酸氨苄青霉素酞酯

【外文名称】Talampicillin Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第5册

药物理化信息

【化学名】酞基（2*S*,5*R*,6*R*）－6－［（2*R*）－2（氨基）乙酰氨基］－3,3－二甲基－7－氧－4－硫－1氮杂双环［3.2.0］庚烷－2－羧酸盐酸盐

【分子式】$C_{24}H_{23}N_3O_6S\cdot HCl$

【分子量】517.98

【性状及组成】本品为白色或淡黄色结晶性粉末，味苦，无臭，有引湿性。

本品在丙酮、甲醇、二氯甲烷中极易溶解；在乙醇、水中略溶；在异丙醇、乙酸乙酯中微溶；在苯、乙醚、石油醚中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定。加无水乙醇制成每1ml中含10mg的溶液，依法测定比旋度为＋153°至＋168°。

药物药理信息

【药理毒理】本品吸收后在体内迅速水解为氨苄西林而发挥抗菌功效。

本品对革兰阳性或阴性菌如金黄色葡萄球菌、化脓性链球菌、白喉杆菌、伤寒杆菌、肺炎杆菌、志贺氏痢疾杆菌以及沙门氏杆菌有较强的抑菌作用。

【不良反应】

1．偶有不适、喘鸣、眩晕、耳鸣等症状，应停止用药，以免发生休克。

2．偶有发热、皮疹、荨麻疹等过敏反应，应停止继续服药。

3．有恶心、食欲减退、白细胞减少、血小板减少等症。

HY002369　盐酸坦洛新

【其他名称】盐酸坦索罗辛

【外文名称】Tamsulosin Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】（*R*）（－）5－［2－［［2－（2－乙氧苯基）乙醚基］胺基］－2－甲基］－乙基－2－甲氧基苯磺酰胺盐酸盐

【分子式】$C_{20}H_{28}N_2O_5S\cdot HCl$

【分子量】444.98

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：本品为坦洛新盐酸盐，属肾上腺素α_1受体亚型α_1A的阻断剂，其对α_1受体的亲和力较α_2受体强5400～24000倍。由于尿道、膀胱颈部及前列腺存在的α_1受体主要为α_1A受体，故本品对尿道、膀胱颈及前列腺平滑肌就具有高选择性阻断作用。本品抑制尿道内压上升的能力是抑制血管舒张压上升能力的13倍，因此本品可减少服药后发生直立性低血压的机率。本品可改善排尿障碍，实践证明本品可降低尿道内压曲线中的前列腺部压力，而对节律性膀胱收缩和膀胱内压曲线则无影响。

2．毒理研究

（1）致癌性：雄性大鼠以43mg/（kg·d）的剂量给药，雌性大鼠以52mg/（kg·d）的剂量给药，肿瘤的发生没有增加。当雌鼠受试剂量≥5.4mg/kg，乳腺纤维瘤有所增加（$P<0.015$）。在大鼠致癌试验中最高剂量盐酸坦洛新产生的系统指征（AUC）3倍于人体最大给药剂量（每天0.8mg）。

给雄小鼠127mg/（kg·d），雌小鼠1.58mg/（kg·d）的剂量，雄小鼠没有明显的肿瘤发生，雌鼠给予两个最高剂量45和158mg/（kg·d）2年乳房纤维瘤（$P<0.0001$），和乳腺癌（$P<0.0075$）的发生明显增加。在小鼠致癌试验中盐酸坦洛新最大剂量产生

系统指征（AUC）是人体接受最大治疗剂量 0.8mg/d 的 8 倍。

小鼠和大鼠乳腺增生的发生率增加，对于盐酸坦洛新引起的血浆催乳素过多来说是次要的。盐酸坦洛新是否提高人的催乳素尚不清楚。在啮齿目中发现的调节催乳内分泌腺瘤在人体的情况尚不清楚。

（2）致突变：盐酸坦洛新致突变性在体外爱默氏相反变化试验中还没有被证实，小鼠淋巴瘤胸腺嘧啶核苷激酶分析，非列表 DNA 修复接合分析，大鼠卵巢细胞和人体淋巴细胞染色体异常分析，在体内姐妹染色体分析交换和小鼠微核分析并未发现突变作用。

（3）生殖毒性：以单剂量或 300mg/（kg·d）多剂量的方式给雄性大鼠盐酸坦洛新胶囊，明显降低生育能力的作用。雄性大鼠生育能力下降的机制，可能是滞留在阴道内的精液组成发生变化以及对射精的损害。对生育能力的影响在单剂量给后 3 天或多剂量给药后 4 周将翻转而改善。多剂量给药停药后 9 周内将完全恢复。10 和 100mg/（kg·d）盐酸坦洛新胶囊多剂量给药改变雄小鼠生育能力的作用不明显。盐酸坦洛新胶囊对精液的组成和功能的影响没有被证实。对雌性大鼠的研究显示，单剂量或 300mg/（kg·d）ay 多剂量右旋体或消旋体的盐酸坦洛新胶囊明显降低生育能力。在雌性大鼠中单剂量给药后生育能力下降与对受精作用的损害有关。10 或 100mg/（kg·d）多剂量消旋体给药没有明显损害雌性大鼠的生育能力。

【药代动力学】单剂量口服本品 0.2mg 后，表观消除半衰期为（7.68 ± 1.40）小时，达峰时间（5.2 ± 1.0）小时，峰浓度（7.37 ± 1.12）ng/ml，平均驻留时间 MRT 为（12.31 ± 1.70）小时。

【药物相互作用】

1. 硝苯地平、阿替洛尔、苯丙脯酯：患者合用硝苯地平、阿替洛尔、苯丙脯酯，无需调整盐酸坦洛新的剂量。

2. 华法林：盐酸坦洛新和华法林合用尚无试验结果，因此与华法林合用需谨慎。

3. 地高辛和茶碱：盐酸坦洛新与地高辛或茶碱同时使用不必调整剂量。

4. 速尿：与速尿合用不必调整剂量。

5. 西咪替丁：西咪替丁使盐酸坦洛新清除率显著降低，AUC 显著增加，所以与西咪替丁合用应慎重，尤其当剂量大于 0.4mg 时。

【药物过量】盐酸坦洛新过量服用可能引起低血压，所以首要进行心血管支持疗法。让病人仰卧，采取措施使血压及心率正常。如果这些措施作用不够明显，应考虑静滴液体。如果必要，可进行血管加压及肾功能监测和肾功能支持疗法。实验室数据表明盐酸坦洛新蛋白结合率为 94% ~ 99%，所以透析不起作用。

【不良反应】一般无严重不良反应，偶可出现头晕及蹒跚感，多可自愈。极少数人偶可出现皮疹，需停药。少数人有胃肠道不适，饭后服药多可避免。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸坦洛新缓释胶囊	化学药	HZ004294
盐酸坦洛新缓释片	化学药	HZ004295

HY002370 盐酸特比萘芬

【其他名称】兰美抒

【外文名称】Terbinafine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 56 册

药物理化信息

【化学名】（*E*）－*N*－（6,6－二甲基－4－炔－2－庚烯）－*N*－甲基－1－萘甲胺盐酸盐

【分子式】$C_{21}H_{25}N \cdot HCl$

【分子量】327.90

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，微有特臭。

本品在乙醇中易溶，在水中微溶，在乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为广谱抗真菌活性的丙烯胺类药物。能特异地干扰真菌细胞壁固醇的早期生物合成，导致麦角固醇合成减少，并高选择性抑制真菌的角鲨烯环氧化酶，使真菌细胞膜的角鲨烯环氧化反应受阻，角鲨烯在细胞中堆积，细胞膜破坏和死亡，从而达到杀灭或抑制真菌的作用。

【药代动力学】据文献报道单次口服特比萘芬 250mg。用药后 2 小时内，血浆浓度峰值达 0.97μg/ml。本品的吸收半衰期为 0.8 小时，分布半衰期为 4.6 小时，其生物利用度略受进食影响，但不必作剂量调整。药物与血浆蛋白的结合率为 99%，并能迅速经真皮层弥散并集中在亲脂的角质层。特比萘芬也可分布在皮肤中。因此，在毛囊，头发与多皮脂的皮肤中可达相当高的浓度。在治疗的最初几周，特比萘芬即可进入甲板中。本品生物转化后的代谢物无抗真菌活性，它们主要从尿中排出，其清除半衰期为 17 小时，在体内无蓄积作用。特比萘芬的稳态血药浓度不受年龄影响。但肝、肾功能不全者的

特比萘芬清除率可能降低，从而导致血药浓度升高。

局部涂抹后，被吸收的药量不超过用药量的5%，故全身血药浓度极低。本品生物转化后的代谢物无抗真菌作用，主要随尿液和粪便排出体外，清除半衰期为17小时，无体内蓄积现象。

【不良反应】本品耐受性好，副作用轻至中度，且常为一过性的。最常见的有胃肠道症状（胀满感、食欲减退、恶心、轻度腹痛及腹泻）或轻型的皮肤反应（皮疹、荨麻疹等）。个别严重的皮肤反应病例（如Stevens－Johnson综合征、中毒性表皮坏死松解症）曾见报道，若发生进行性皮疹，则应停药。罕见味觉改变，包括味觉缺失，后者于停药后几周内可恢复。极个别病例发生肝胆功能不全。虽然，是否由本品引起的尚未肯定，不过若发生上述情况，则应停用本品。曾报道，极个别患者发生尿中红细胞增多。

偶在用药部位出现发红、发痒或蛰刺感，但很少因此停药。注意：这些症状必须要与那些极少发生但必须停药的过敏反应相区别。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸特比萘芬搽剂	化学药	HZ004296
盐酸特比萘芬凝胶	化学药	HZ004297
盐酸特比萘芬泡腾片	化学药	HZ004298
盐酸特比萘芬喷雾剂	化学药	HZ004299
盐酸特比萘芬片	化学药	HZ004300
盐酸特比萘芬溶液	化学药	HZ004301
盐酸特比萘芬乳膏	化学药	HZ004302
盐酸特比萘芬散剂	化学药	HZ004303

HY002371　盐酸特拉唑嗪

【外文名称】Terazosin Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第49册

药物理化信息

【化学名】1－（4－氨基－6,7－二甲氧基－2－喹唑啉基）－4－（四氢呋喃－2－甲酰）哌嗪盐酸盐二水合物

【分子式】$C_{19}H_{25}N_5O_4 \cdot HCl \cdot 2H_2O$

【分子量】459.93

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，味微苦，几乎无臭。

本品在甲醇中溶解，在水中略溶，在乙醇中微溶。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药效学

（1）良性前列腺增生（BPH）：与BPH有关的症状涉及膀胱出口阻塞，它包括两个基本组成部分：静态部分和动态部分。静态部分是前列腺增大的结果。一段时间内，前列腺会不断扩大。然而，临床研究表明，前列腺的大小与BPH症状的严重性或尿道阻塞的程度无关。动态部分是前列腺和膀胱颈平滑肌紧张增加的功能，导致膀胱出口的狭窄。平滑肌紧张是由α_1－肾上腺素能受体的交感神经刺激作用介导的，该受体在前列腺、前列腺囊和膀胱颈中是丰富的。给予特拉唑嗪后症状减轻和尿流速改善与膀胱颈和前列腺中的α_1－肾上腺素能受体阻断所引起的平滑肌松弛有关。因为在膀胱体中有相对少的α_1－肾上腺素能受体，因此特拉唑嗪能够减轻膀胱出口的阻塞而不影响膀胱的收缩。

特拉唑嗪在1222例具有BPH症状的男性患者中进行研究。在三个空白对照研究中，给药后大约24小时进行症状评价和尿流计测量。采用Boyarsky Index对症状进行定量。调查表形式评价阻塞（排尿犹豫、不连续、排尿结束后滴尿、尿流的大小和压力损伤、膀胱未完全排空的感受）和刺激（夜尿、白天的尿频、尿急、排尿困难）症状，9个症状各自按0～3打分，总分数为27。特拉唑嗪对个体排尿症状影响的分析表明，与空白相比，特拉唑嗪明显改善排尿犹豫、不连续、尿流的大小和压力损伤、膀胱未完全排空的感受、排尿结束后滴尿、白天的尿频和夜尿。

对排尿的总体功能和症状进行了综合评价，与空白治疗的病人相比，用特拉唑嗪治疗的病人有明显（$P \leqslant 0.001$）大的总体改善。

长期试验中，特拉唑嗪使症状和尿流速最大值分数都有明显改善，提示特拉唑嗪使平滑肌细胞松弛。尽管阻断α_1－肾上腺素能受体也降低因外周血管阻力增加而引起的高血压病人的血压，但血压正常的BPH男性病人用特拉唑嗪治疗时未引起临床上明显的血压降低作用。

（2）高血压：在动物中，特拉唑嗪通过减少总外周血管阻力从而使血压降低。特拉唑嗪的血管舒张、血压降低作用似乎主要是由α_1－肾上腺素能受体阻断所引起的。在给药后15分钟内，特拉唑嗪使血压逐渐降低。

患有轻度（大约77%，舒张压95～105mmHg）或中度（大约23%，舒张压105～115mmHg）高血压的病人，按照5～20mg/天的总剂量，一日1次或2次给予特拉唑嗪进行临床试验。同所有α拮抗剂一

样，因为特拉唑嗪在首次或前几次给药后可使血压急速下降，因此起始剂量为 1mg，然后调整到某一固定剂量或调整到某一特定血压终点（通常仰卧位的舒张压为 90mmHg）。

在给药间期末（通常 24 小时）测量血压，结果显示，降压作用持续整个间期，通常，仰卧位的收缩压降低比空白大 5 ~ 10mmHg，舒张压的降低大 3.5 ~ 8mmHg。给药后 24 小时测量，心率未改变。

引起血压反应的量与哌唑嗪类似，但低于氢氯噻嗪。

特拉唑嗪小剂量组在统计学上明显地减少病人的总胆固醇、低密度和极低密度脂蛋白，但对高密度脂蛋白和甘油三酯没有明显改变。

2. 毒理

（1）致癌、致突变和生殖毒性：特拉唑嗪没有致突变作用。也无证据支持特拉唑嗪有致癌作用。治疗对睾丸的重量和形态不产生影响。以 30 和 120mg/（kg·d）剂量给药，子宫涂片与对照涂片相比精子含量减少并且精子的数量与随后的受孕有比较好的相关性。当以 40 和 250mg/（kg·d）（29 和 175 倍于人推荐最大剂量）的剂量口服给予大鼠一年或两年时，睾丸萎缩的发生率明显增加，但在 8mg/(kg·d)（＞人推荐最大剂量的 6 倍）剂量时没有增加。在狗的实验中，300mg/（kg·d）（＞人推荐最大剂量的 500 倍）给药 3 个月时也观察到了睾丸萎缩，但剂量为 20mg/（kg·d）（＞人推荐最大剂量的 38 倍）时没有观察到睾丸萎缩。

（2）致畸作用：尚未在怀孕妇女中进行足够的和很好的对照性研究并且特拉唑嗪在怀孕期的安全性尚未确定。不推荐在怀孕期使用特拉唑嗪，除非证明有益性高于对产妇和胎儿的危险性。

【药代动力学】男性患者服药后基本上完全吸收。饭后立即服药对吸收程度的影响极小，但使血浆浓度达峰时间延迟大约 40 分钟。特拉唑嗪的肝首过代谢很小。服药后约 1 小时达到峰值，半衰期约为 12 小时。在年龄对特拉唑嗪药代动力学影响的研究中发现，70 岁和 20 ~ 39 岁年龄的病人，其血浆半衰期分别为 14.0 和 11.4 小时。血浆蛋白结合率为 90% ~ 94%。约 40%经尿排泄，约 60%随粪便排出。

【药物相互作用】在对照性试验中，将特拉唑嗪加到利尿剂和某些 β - 肾上腺素能阻滞剂中，未观察到意想不到的相互作用。特拉唑嗪已与下列种类的药物联合给药：镇痛/抗炎药物、抗生素、抗胆碱能/拟交感神经药物、抗痛风药物、心血管药物、皮质类固醇药物、胃肠药物、降血糖药物、镇静和安定药物。

与其他药物合用：特拉唑嗪和维拉帕米同时给药时，特拉唑嗪的平均 AUC_{0-24}在首次给予维拉帕米时增加 11%，在用维拉帕米治疗 3 周后增加 24%，并且此时特拉唑嗪的平均 t_{max}从 1.3 小时减小到 0.8 小时。未发现对维拉帕米有明显影响。特拉唑嗪与卡托普利合用达稳态时，特拉唑嗪的最大血浆浓度随剂量成线性增加。

【药物过量】盐酸特拉唑嗪过量可导致低血压。可以让病人保持仰卧位，以恢复血压和正常的心率。如果该方法无效，应采取补充体液的方法扩容。必要时，使用升压药并监测和维持肾功能。实验室数据表明，特拉唑嗪的血浆结合率为 90% ~ 94%；因此，透析治疗对药物过量可能是无益的。

【不良反应】

1. 前列腺增生：6 项良性前列腺增生的特拉唑嗪和空白对照临床试验表明特拉唑嗪 1 ~ 20mg，一日 1 次，不良反应发生率至少为 1%，并高于空白对照组，或具有临床意义的不良反应，包括无力、体位性低血压、头晕、瞌睡、鼻充血/鼻炎和阳痿。特拉唑嗪组尿道感染的发生率明显降低。在治疗的最初 7 天并且包括各给药间期，发生低血压不良反应事件的危险最大。不良反应事件通常是短暂的和轻度或中度的，发生严重不良反应时，必须中断治疗。在空白 - 对照试验中，由于不良反应过早中断治疗的比例在空白和特拉唑嗪组之间无显著性差异。

2. 高血压：4 项特拉唑嗪空白对照治疗高血压的临床试验表明，特拉唑嗪 1 ~ 40mg，每日一次，单方或与其他降压药的合用，特拉唑嗪比空白对照组显著增多的不良反应有无力、视觉模糊、头晕、鼻充血、恶心、外周水肿、心悸和嗜眠。

在对照或公开的短期或长期临床试验中，1987 例服药病人中至少有 1%病人发生的或者在上市后有报道的不良反应包括：全身反应，胸痛、面部水肿、发热、腹痛、颈痛、肩痛；心血管系统，心律失常、血管舒张；消化系统，便秘、腹泻、口干、消化不良、肠胃气胀、呕吐；代谢/营养障碍，痛风；肌肉与骨骼系统，关节痛、关节炎、关节病、肌痛；神经系统，焦虑、失眠；呼吸系统，支气管炎、感冒症状、鼻出血、流感症状、咳嗽加重、咽炎、鼻炎；皮肤及其附件，瘙痒、皮疹、出汗；特殊感觉，视觉异常、结膜炎、耳鸣；泌尿生殖系统，尿频、尿失禁（主要是绝经后妇女）、尿道感染。

上市后显示，偶有病人过敏，也有阴茎异常勃起的报道。

不良反应通常是轻度或中度的，但有时是严重的，必须中断治疗。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸特拉唑嗪滴丸	化学药	HZ004304
盐酸特拉唑嗪胶囊	化学药	HZ004305
盐酸特拉唑嗪片	化学药	HZ004306

HY002372　盐酸特洛特罗

【其他名称】Berachin、Chlobamol、Chlobamolie Hydro Chloride、喘舒、丁氯喘、HOKUNALIN、氯丁喘安、Lobuterol、叔丁氯喘通、妥布特罗、Tulobuterol、盐酸丁氯喘、盐酸氯丁喘氨、盐酸妥洛特罗

【外文名称】Tulobuterol Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第6册

药物理化信息

【化学名】1－（邻氯苯基）－2－叔丁胺基乙醇的盐酸盐

【分子式】$C_{12}H_{18}ClNO \cdot HCl$

【分子量】264.29

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，味苦。

本品在水、乙醇中易溶，在丙酮中溶解，在乙酸乙脂中略溶，在乙醚中几乎不溶。

熔点：本品熔点为159～163℃。

药物药理信息

【药理毒理】为选择性β_2受体激动剂，对支气管平滑肌具有较强而持久的扩张作用，对心脏的兴奋作用较弱，离体动物实验证明，本品松弛支气管平滑肌是氯喘通的2～10倍，而对心脏的兴奋作用是异丙肾上腺素的1/1000，作用维持时间较异丙肾上腺素长10倍多。临床试用表明，本品除有明显的平喘作用外，还有一定的止咳、平喘作用，而对心脏的兴奋作用极微。一般口服5～10分钟起效，作用可维持4～6小时。

【药物相互作用】与肾上腺素、异丙肾上腺素合用易致心律失常，故应避免合用。

【不良反应】

1. 偶有心悸、手指震颤、心动过速、头晕、恶心、胃部不适等不良反应，一般停药后即消失。

2. 偶有过敏反应，此时应立即停药。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方妥洛特罗糖浆	化学药	HZ001417
小儿复方盐酸妥洛特罗片	化学药	HZ003761
盐酸特洛特罗片	化学药	HZ004307

HY002373　盐酸替罗非班

【外文名称】Tirofiban Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】*N*－（丁基磺酰基）－*O*－［4－（4－哌啶基）丁基］－L－酪氨酸盐酸盐一水合物

【分子式】$C_{22}H_{36}N_2O_5S \cdot HCl \cdot H_2O$

【分子量】95.08

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理作用

（1）抗血小板聚集作用：体外研究表明，本品可剂量依赖性地抑制ADP、胶原、花生四烯酸、血栓烷类似物U46619和凝血酶引起的人体外血小板聚集，而对瑞斯托菌素引起的血小板聚集无影响。其中对2μg/ml胶原或3.4μmol/L ADP引起血小板聚集的半数抑制浓度（IC_{50}）分别为（66±8）和（39±4）nmol/L。此外，本品可竞争性抑制125I－人体纤维蛋白原与ADP活化血小板的结合，IC_{50}为（10.0±4.2）nmol/L，抑制常数K_i为（2.1±1.0）nmol/L。

体内研究表明，狗快速静脉推注10～500μg/kg或在360分钟内连续静脉输注1～10μg/（kg·min）盐酸替罗非班，对ADP和胶原诱导的血小板聚集有抑制作用，停止输注后30～90分钟内血小板止血功能恢复正常，表明盐酸替罗非班对血小板无直接的长期作用。快速静脉推注盐酸替罗非班后ADP引起的血小板聚集作用消失，出血时间无明显延长。

（2）抗血栓形成作用：Joseph等研究表明，快速推注300和1000μg/kg盐酸替罗非班，可使狗冠状动脉左旋支狭窄引起血小板依赖性循环血流减少（CFRs）模型全部消除的作用时间分别达（18±1）和（37±5）分钟。在电损伤引起的冠状动脉左旋支闭塞性血栓模型中，静注10.0μg/（kg·min）盐酸替罗非班即可防止3只狗形成闭塞性血栓，使血栓形成时间延长，血栓重量减少，于对照组相比有显著差异。当与肝素（HEP）合用作为溶栓辅助药治疗电损伤引起冠状动脉左旋支闭塞性血栓时，在给予组织型纤维蛋白溶解酶原激活物（t－PA）或链激酶（STK）前15分钟静注盐酸替罗非班可增加再灌注的发生率，减少连续用药期间急性血栓再闭塞的发生率。

2. 毒理学：经一系列体内外试验证实，盐酸替罗非班无致突变作用和生殖毒性作用。

【药代动力学】健康志愿者在常规推荐剂量下，血药浓度峰值与静脉输注期间稳态血药浓度相近。半衰期约为2小时，主要经肾脏排泄，分别为给药

剂量的65%和25%经尿、粪排泄，而且多以原形排泄。在0.01～25μg/ml剂量范围内，本品的血浆蛋白结合率为65%，与浓度无关，游离型药物占血浆的35%，稳态分布容积为22～42L。在健康志愿者中，本品血浆清除率为213～314ml/min，肾清除率占血浆清除率的39%～69%，冠状动脉疾病患者服用本品后血浆清除率为152～267ml/min，肾清除率占血浆清除率的39%。本品在男性和女性冠状动脉疾病患者中的血浆清除率相近，在65岁以上老年患者中的血浆清除率与65岁以下患者相比约下降19%～26%。本品在轻至中度肝功能不全患者中的血浆清除率与健康志愿者相比无明显差异；本品在严重肾功能不全患者（肌酐清除率＜30ml/min，包括需血液透析的患者）中的血浆清除率下降约50%以上。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸替罗非班氯化钠注射液	化学药	HZ0004308

HY002374 盐酸替扎尼定

【外文名称】Tizanidine Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】5－氯－4－（2－咪唑啉－2氨基）－2,1,3－苄硫噻嗪盐酸盐

【分子式】$C_9H_8ClN_5S \cdot HCl$

【分子量】290.17

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：替扎尼定为中枢性α_2肾上腺素受体激动剂，可能是通过增强运动神经元的突触前抑制作用而降低强直性痉挛状态。动物实验显示，替扎尼定对骨骼肌纤维和神经肌肉接头没有直接作用，对单突触脊髓反射的作用弱。替扎尼定对多突触通路的作用最强，这些作用被认为与脊髓运动神经元的易化性降低有关。

2．毒理研究

（1）遗传毒性：替扎尼定Ames试验、哺乳动物基因突变试验、中国仓鼠细胞染色体畸变试验、小鼠骨髓微核试验、中国仓鼠骨髓微核试验和细胞遗传学试验、小鼠显性致死诱变试验和小鼠程序外DNA合成试验结果均为阴性。

（2）生殖毒性：雄性大鼠给予替扎尼定10mg/kg，雌性大鼠3mg/kg（以mg/m²计算，分别相当于人最大推荐剂量的2.7倍和1倍），未见对生育力的影响。雄性大鼠给予替扎尼定30mg/kg、雌性大鼠10mg/kg时，生育力下降，母体出现镇静、体重减轻和运动失调等症状。大鼠给予替扎尼定3mg/kg、家兔30mg/kg（以mg/m²计算，分别相等于人最大推荐量的1倍和16倍），未见致畸作用。给予1～8倍于人最大推荐剂量的替扎尼定可延长大鼠的妊娠期，导致围生期幼鼠丢失增加、发育迟缓。家兔给予替扎尼定1mg/kg及更高剂量下，胚胎着床后丢失增加。

（3）致癌性：小鼠经口给予替扎尼定剂量达16mg/kg，连续78周，大鼠经口给予替扎尼定剂量达9mg/kg，连续104周（按mg/m²计算，分别相当于人最大推荐量的2倍和2.5倍），肿瘤发生率均未见显著增加。

【药代动力学】盐酸替扎尼定口服吸收良好，其绝对口服生物利用度为40%（变异系数24%）。口服后达峰浓度的时间为1.5小时（变异系数40%）；食物可使口服该药后的血药浓度峰值增加近1/3，使达峰时间缩短近40分钟，但是并不影响胃肠道对该药的总吸收。盐酸替扎尼定在体内分布广泛，健康志愿者静脉给药达稳定时的V_d为2.4L/kg（变异系数21%）。该药与血浆蛋白结合率约为30%，且在治疗剂量范围内无明显浓度依赖性。肝脏对该药的首过消除作用较大，给药后约95%的药物经肝脏代谢，代谢产物无明显活性。盐酸替扎尼定血浆消除半衰期约为2.5小时（变异系数33%），其代谢产物的$t_{1/2}$为20～40小时。约20%的盐酸替扎尼定经肠道排出，60%以上的药物经肾脏排泄，其中原形排泄物仅为3%，肾功能不良明显影响该药的排泄；当肌酐清除率小于1.5L/h时，肾脏对该药的排泄速度降低50%以上，使该药的血浆消除半衰期平均延长达13.6小时。

【药物相互作用】用人肝微粒体细胞色素P450同功酶体外实验研究表明，盐酸替扎尼定及其代谢产物不影响该酶对其他药物的代谢。

盐酸替扎尼定使扑热息痛的达峰时间推迟16分钟，而扑热息痛对盐酸替扎尼定的药动学参数没有影响。

乙醇使盐酸替扎尼定的曲线下面积增加约20%，使最大峰浓度增加15%，同时盐酸替扎尼定的不良反应增加，乙醇和盐酸替扎尼定的中枢神经系统抑制作用有相加作用。

4mg盐酸替扎尼定单次或多次给予的回顾性研究表明，与没有同时服用口服避孕药的病人相比，同时服用口服避孕药使盐酸替扎尼定的清除率下降50%。

【药物过量】已有报道1例46岁患有硬化症的男性病人，1次服用100片（4mg/片）替扎尼定后迅速出现昏迷，体检没有发现瞳孔扩大的眼球震颤，

病人出现 Cheyne – Stokes 样呼吸的明显呼吸抑制，通过洗胃和呋塞咪和甘露醇强迫利尿，病人在几小时后苏醒，没有后遗症，实验室检查正常。

有鉴于此，如果发生过量，首先应确保气道的通畅，其次进行呼吸和循环系统的监测。

【不良反应】据文献报道有以下内容。

1．导致治疗终止的一般性的不良事件：在多剂量、安慰剂对照的临床研究中，264 名病人给予替扎尼定，261 名给予安慰剂，药物处理组中包括几种严重的不良事件在内的不良反应的发生比安慰剂对照组频率更高。

多剂量安慰剂对照研究中，由于不良反应的发生而中途停止给药的患者在接受替扎尼定的 264 名病人中有 45 名（17%），给予安慰剂的 261 名患者中有 13 名（5%）。当退出治疗后，他们常常叙述有 2 个或以上的停止服药的理由。导致停药的最常出现的不良事件有：疲乏（3%），嗜睡（3%），口干（3%），痉挛程度或张力增加（2%）和头昏（2%）。其中，乏力，嗜睡/镇静，口干和头昏为最常发生的与替扎尼定相关的不良事件，有 3/4 的病人认为这些不良事件是轻度 – 中度，1/4 的病人认为很严重；这些不良事件有剂量依赖性。

2．单剂量给予安慰剂对照的 142 名受试者参与的研究中，除了上述最常见的不良事件之外，还有低血压和心动过缓（发生率 > 2%）。

3．研究中观察到的其他不良反应：在另外的 1187 例病人临床研究中观察替扎尼定的不良事件。这些研究，有的是随机双盲，有的是开放研究；有的为安慰剂对照研究，有的则未设立对照组；有的为门诊病人，有的为住院病人；有的采用逐渐增量的给药方案。最后的统计结果，以 COSTART 原则为标准，分为全身不良事件和各系统的不良事件。常见不良事件发生指发生率超过 1/100，少见不良事件发生率在 1/100 ~ 1/1000 之间，罕见的不良事件指发生率在 1/1000。应该指出的是，尽管这些不良事件发生于替扎尼定治疗过程中，但是不一定是由该药引起。

（1）全身的不良事件：常见的，发热；少见的，变态反应，念珠菌病，不适，脓肿，颈痛，败血症，死亡；罕见的，癌症，先天性畸形，自杀倾向。

（2）心血管系统：少见的，血管扩张，体位性低血压，晕厥，偏头痛，心律失常；罕见的，心绞痛，冠状动脉疾患，心衰，心肌梗死，静脉炎，肺栓塞，室早和室速。

（3）消化系统：常见的，腹痛，腹泻，消化不良；少见的，吞咽困难，胆结石，粪便嵌塞，胃肠胀气，黑便，肝炎；罕见的，呕血，胃肠炎，肝癌，小肠梗阻，肝损害。

（4）血液淋巴系统：少见的，淤斑，高胆固醇血症，贫血，高脂血症，白细胞减少症，白细胞增多症，败血症；罕见的，瘀点，紫癜，血小板减少症，血小板增多症。

（5）营养和代谢系统：少见的，水肿，甲状腺功能低下，体重减轻；罕见的，肾上腺皮质功能不全，高血糖症，高钾血症，低钠血症，低蛋白血症和呼吸性酸中毒。

（6）骨骼肌系统：常见的，肌无力，背痛；少见的，病理性骨折，关节痛，关节炎和滑囊炎。

（7）神经系统：常见的，抑郁，焦虑，感觉异常；少见的，震颤，情绪不稳定，惊厥，麻痹，思维异常，眩晕，怪梦，激动不安，丧失自我感，欣快感，偏头痛，感觉丧失，自主神经功能失调，神经痛；极少见的，痴呆，神经病。

（8）呼吸系统：少见的，鼻窦炎，肺炎，支气管炎；罕见的，哮喘。

（9）皮肤及附属器官：常见的，皮疹，出汗，皮肤溃疡；少见的，瘙痒，皮肤干燥，痔疮，秃头，荨麻疹；罕见的，表皮剥脱，皮炎，单纯疱疹，带状疱疹，皮肤癌。

（10）特殊感觉：少见的，耳痛，耳鸣，耳聋，青光眼，结合膜炎，眼痛，视神经炎，中耳炎，视网膜出血，视野缺损；罕见的，虹膜炎，眼萎缩。

（11）泌尿生殖系统：少见的，尿急，膀胱炎，尿潴留，月经过多，肾盂肾炎，肾结石，子宫纤维化扩大，阴道念珠菌感染，阴道炎；罕见的，蛋白尿，糖尿，血尿，宫血。

4．药物成瘾与依赖性：还没进行该药滥用成瘾的人体研究。猴以剂量依赖性的方式给药时，在超过人最大推荐用量（mg/m^2）的 35 倍时，突然停药，可生产短暂的戒断症状，此短暂的戒断症状（活动增加，躯体震颤，对人敌对情绪）不能被纳洛酮逆转。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸替扎尼定片	化学药	HZ004309

HY002375　盐酸头孢吡肟

【其他名称】头孢吡肟、头孢匹美

【外文名称】Cefepime Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】1 – [[(6*R*, 7*R*) – 7 – [2 – (2 – 氨基 – 4 – 噻唑基) – 乙醛酰氨基] – 2 – 羧基 – 8 – 氧

代－5－硫杂－1－氮杂双环［4.2.0］辛－2－烯－3－基］甲基］－1－甲基吡咯烷氯，72－（Z）－（O－甲基肟），盐酸，一水化合物

【分子式】 $C_{19}H_{25}ClN_6O_5S_2 \cdot HCl \cdot H_2O$

【分子量】 571.50

【性状及组成】 本品为白色或微黄色粉末，为盐酸头孢吡肟和L－精氨酸的无菌混合物，配制后的注射液的pH维持于4.0～6.0。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：头孢吡肟为广谱第四代头孢菌素，通过抑制细菌细胞壁的生物合成而达到杀菌作用。体外试验表明，本品对革兰阳性菌和阴性菌均有作用。本品对细菌染色体编码的β－内酰胺酶的亲和力低，可高度耐受多数β－内酰胺酶的水解，并可迅速渗入革兰阴性菌的细胞内。在菌体细胞内，其靶分子为青霉素结合蛋白（PBP）。

体外和临床感染研究证实本品对以下大多数微生物有活性。

革兰阴性需氧微生物：肠杆菌属、肺炎克雷伯杆菌、大肠杆菌、奇异变形杆菌、绿脓杆菌。

革兰阳性需氧微生物：金黄色葡萄菌（仅对甲氧西林敏感的菌株）、化脓性链球菌（A族链球菌）、肺炎链球菌。

本品体外对以下大多微生物有活性，但是尚无充分和严格的临床感染性疾病治疗支持。

革兰阴性需氧微生物：醋酸钙不动杆菌、弗氏枸橼酸菌、异型枸橼酸菌、聚团肠杆菌属、流感嗜血杆菌（包括产β－内酰胺酶菌株）、蜂房哈夫尼菌、奥克西托克雷伯杆菌、莫拉卡他菌（包括产β－内酰胺酶菌株）、普通变形杆菌、雷氏变形杆菌、斯氏普罗维登斯菌、黏质沙雷菌。

本品对多数寡养单胞菌株无活性。

革兰阳性需氧微生物：表皮葡萄球菌（仅针对甲氧西林敏感的菌株），腐生性葡萄球菌、无乳链球菌（B组链球菌）。

多数肠球菌，如粪肠球菌和耐甲氧西林葡萄球菌对本品耐药。

厌氧微生物：革兰阴性杆菌（包括脆弱拟杆菌、其他拟杆菌属和梭杆菌属）、革兰阳性和革兰阴性球菌（包括消化球菌、消化链球菌和韦荣氏球菌属）、革兰阳性杆菌（包括梭状芽孢杆菌、真杆菌和乳杆菌属）。

2．毒理研究

（1）遗传毒性：体内、外的研究结果均未发现本品有遗传毒性。

（2）生殖毒性：小鼠、大鼠和兔分别给予本品剂量为1200、1000、100mg/kg（以体外表面积计，分别相当于临床推荐人用最大剂量的1～4倍），均未见本品对动物生育力和生殖有明显影响。但是尚无充分和严格的孕妇研究资料，动物与人的相关性尚不清楚。

【药代动力学】 据文献资料：

本药0.25～2g静脉单剂量输注，显线性药代动力学，头孢吡肟的平均血浆消除半衰期为2.0±0.3小时，机体总消除率为（120.0±8.0）ml/min。肌肉给药，头孢吡肟可完全被吸收，血药浓度达峰时间（t_{max}）约为1.5小时，在0.5～2.0g剂量范围内，药代动力学呈线性。健康成年男性志愿者接受临床剂量的头孢吡肟连续9天未见蓄积。

头孢吡肟与血清蛋白的结合率约为20%，且与药物血浓度无关。头孢吡肟平均稳态分布容积为（18.0±2.0）L，在尿液、胆汁、腹膜液、水泡液，气管黏膜、痰液、前列腺液、阑尾、胆囊中均能达到治疗浓度，并可通过炎性血脑屏障。

头孢吡肟主要经肾分泌排出。在体内有少量亦可经转化为N－甲基吡咯烷（NMP）最后代谢为N－甲基吡咯烷氧化物（NMP－N氧化物）。头孢吡肟和其代谢产物主要经肾排泄，尿液中头孢吡肟原形为摄入量的85%，NMP不足1%，NMP氧化物约为6.8%，头孢吡肟异构体约为2.5%。

亦有少量头孢吡肟可自人体乳腺分泌排出。

2月龄至11岁单剂量静脉注射头孢吡肟，机体总消除率和稳态分布容积分别为（3.3±1.0）ml/min/kg体重和（0.3±0.1）L/kg体重，尿液中头孢吡肟原形为给药量的60.4%±30.4%，平均肾消除率为（2.0±1.1）ml/（min·kg）体重。按体重校正，药物消除率和分布容积在儿童性别和年龄间无差异。50mg/kg体重，12小时一次给药，未见药物蓄积，而每8小时一次给药，稳态时的C_{max}、AUC和半衰期约增加15%。儿童50mg/kg体重静脉注射的AUC与成人2g静脉给药的暴露量相当。肌内注射的绝对生物利用度为82.3%±15%。

65岁和65岁以上的老年人给予头孢吡肟，药物总消除率下降。

肾功能不全患者中头孢吡肟的总清除率与肾肌酐消除率相关。需接受血透的患者中，头孢吡肟的平均消除半衰期为（13.5±2.7）小时，需持续腹膜透析的患者中，半衰期为（19.0±2.0）小时。因此肾功能不全患者使用本品应注意调整剂量或（和）给药间期。

肝功能不全头孢吡肟药代动力学无改变，这些病人无需调整剂量。

【药物相互作用】 和多数β－内酰胺类抗生素一

样，由于药物的相互作用，头孢吡肟溶液不可加至甲硝唑，万古霉素，庆大霉素，妥布霉素或硫酸奈替米星，氨茶碱溶液中。头孢吡肟浓度超过40mg/ml时，不可加至氨苄青霉素溶液中。如有与头孢吡肟合用的指征，这些抗菌素应与头孢吡肟分开使用。

头孢吡肟可引起尿糖试验假阳性反应。建议使用本品治疗期间，使用葡萄糖氧化酶反应检测方法。

【药物过量】用药过量患者，应仔细观察并使用支持疗法，并用血液透析治疗促进药物的排除，而不宜采用腹膜透析。在血透开始的3个小时内，体内68%的头孢吡肟可排出。

【不良反应】通常本品耐受性良好，不良反应轻微且多短暂，终止治疗少见。常见的与本品可能有关的不良反应主要是腹泻，皮疹和注射局部反应，如静脉炎，注射部位疼痛和炎症。其他不良反应包括恶心，呕吐，过敏，瘙痒，发热，感觉异常和头痛。肾功能不全患者而未相应调整头孢吡肟剂量时，可引起脑病，肌痉挛，癫痫。如发生与治疗有关的癫痫，应停止用药，必要时，应进行抗惊厥治疗。本品治疗儿童脑膜炎患者，偶有惊厥、嗜睡、神经紧张和头痛，主要是脑膜炎引起，与本品无明显关系。

偶有肠炎（包括伪膜性肠炎）、口腔念珠菌感染报道。

与本品有关的实验室检查异常多为一过性，停药即可恢复，包括血清磷升高或减少，转氨酶（ALT和AST）升高，嗜酸粒细胞增多，部分凝血酶原时间和凝血酶原时间延长。碱性磷酸酶、血尿素氮、肌酐、血钾、总胆红素升高，血钙降低，红细胞压积减少。与其他头孢菌素类抗生素类似，也有白细胞减少，粒细胞减少，血小板减少的报道。

头孢菌素类抗生素还可引起Stevens－Johnson综合征，多形性红斑，毒性表皮坏死，肾功能紊乱，毒性肾病，再生障碍性贫血，溶血性贫血，出血，肝功能紊乱（胆汁淤积）和血细胞减少。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸头孢吡肟	化学药	HZ005103

HY002376　盐酸头孢甲肟

【其他名称】氨噻肟唑头孢菌素、Bestcall、倍司特克、CMX、噻肟唑头孢、头孢氨噻肟唑、头孢噻肟四唑

【外文名称】Cefmenoxime Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】（6*R*，7*R*）－7－［2－（2－氨基－4－噻唑基）（甲氧亚氨基）乙酰氨基］－3－［［（1－甲基－1H－四唑－5－基）－硫］甲基］－8－氧代－5－硫杂－1－氮杂双环［4.2.0］辛－2－烯－2－甲酸盐酸盐（2:1）

【分子式】$(C_{16}H_{17}N_9O_5S_3)_2 \cdot HCl$

【分子量】1059.58

【性状及组成】本品为类白色至淡黄色结晶或结晶性粉末，无臭。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：头孢甲肟为第三代半合成的头孢菌素类广谱抗生素，通过抑制细菌细胞壁的生物合成而达到杀菌作用。体外试验表明，本品对革兰阳性菌和阴性菌均有作用。本品对革兰阴性菌具有强抗菌作用是由于其对细胞外膜的通透性良好和对β－内酰胺酶稳定，且对青霉素结合蛋白（PBPs）1A、1B和3的亲和力强，从而对细胞壁黏肽交联形成具有较强的阻碍作用。

2．生殖毒性：在大鼠、兔及猴的器官形成期给药（大鼠肌内注射本品30、100和300mg/（kg·d）、家兔肌内注射10、30和90mg/（kg·d）、猴静脉注射100、300mg/（kg·d））试验结果显示，家兔各给药组均出现雌兔死亡或流产，但各种动物均未见致畸作用。大鼠一般生殖毒性试验、围产期生殖毒性试验均未见明显异常。

【药代动力学】肾功能正常成人单次静脉滴注本药0.5g和1g后，血药峰浓度分别可达50.9mg/L和135.7mg/L，单次静脉注射头孢甲肟0.5g和1g后，血药峰浓度分别可为75mg/L和125mg/L。本品的血清消除半衰期约为1小时。给药后在多种组织和体液中分布良好。也可透过血脑屏障。本药主要经肾脏排泄，成年人（肾功能正常者）一次静脉注射或静脉滴注本药0.5g、1g、2g后，6小时内尿中排泄率为60%～82%。此外，静脉滴注1g后的尿药浓度为0～2小时约4400μg/L，2～4小时约750μg/L，4～6小时约120μg/L。小儿（肾功能正常者）一次静脉注射或静脉滴注10、20、40mg/kg后，6小时的尿排泄率与成年人相同。

【药物相互作用】

1．呋喃苯胺酸利尿剂：有报道与其他头孢类抗生素并用可使肾功能障碍加重，故并用时应注意肾功能。

2．乙醇（饮酒）：由饮酒而摄取乙醇，有时出现潮红恶心、心动过速、多汗、头痛等，故在用药期间及用药后至少一周内应避免饮酒而摄取乙醇。

【不良反应】

1. 消化系统：恶心、呕吐、食欲减退、腹痛、腹泻、伪膜性肠炎、口腔炎、鹅口疮、维生素 K 缺乏症及维生素 B 缺乏症、肝功能损害。

2. 肾功能损害：偶有急性肾功能不全。

3. 过敏反应：过敏性休克。

4. 血液系统：中性粒细胞减少、嗜酸粒细胞、血小板减少及肝功能异常。

5. 肾功能不全者应用大剂量可能引起痉挛，长期应用可致霉菌感染和维生素缺乏。

6. 呼吸系统：咳嗽，呼吸困难，胸部 X 线异常。

7. 神经系统：肾功能不全的患者大量用药时可能引起痉挛。引起眩晕。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸头孢甲肟	化学药	HZ005104

HY002377 盐酸头孢他美酯

【外文名称】Cefetamet Pivoxil Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】(6*R*，7*R*) -3-甲基-7-[(*Z*) -2-(2-氨基-4-噻唑基) -2-(甲氧亚氨基) -乙酰氨基] -8-氧代-5-硫杂-1-氮杂双环[4.2.0] 辛-2-烯-2-甲酸新戊酰氧甲酯盐酸盐

药物药理信息

【药理毒理】本品为口服的第三代广谱头孢菌素类抗生素。本品对链球菌属（粪链球菌除外）、肺炎链球菌等革兰阳性菌，对大肠埃希菌、流感嗜血杆菌、克雷伯菌属、沙门菌属、志贺菌属、淋病奈瑟氏球菌等革兰阴性菌都有很强的抗菌活性，尤其对头孢菌素敏感性低的沙雷菌属、吲哚阳性变形杆菌、肠杆菌属及柠檬酸菌属的抗菌活性明显。对细菌产生的 β-内酰胺酶稳定。但本品对假单孢杆菌、支原体、衣原体、肠球菌等耐药性微生物无效。

【药代动力学】本品单一剂量和多剂量的药代动力学参数基本一致。本品口服后，经过肠黏膜或首次经过肝脏时盐酸头孢他美酯被迅速代谢，在体内转变为头孢他美而发挥作用。本品随食物口服后，平均约 55% 的剂量转变为头孢他美。口服本品 500mg 后 3～4 小时，血药浓度达峰值 (4.1 ± 0.7) mg/L，分布容积为 0.29L/kg，与细胞外水平一致。约 22% 头孢他美与血清蛋白结合。年龄、肾脏及肝脏疾病对盐酸头孢他美酯的生物利用度无影响。抗酸剂（镁、铝、氢氧化物等）或雷尼替丁不改变本品生物利用度。本品 90% 以头孢他美形式随尿液排出，清除半衰期为 2～3 小时。肾衰竭患者，头孢他美的清除情况同肾功能成正比。

【药物相互作用】抗酸剂，H_2 受体拮抗剂对本品的药代动力学无影响。目前尚未见到本品对实验室检测值或方法有影响的报道，也未观察到伴随利尿药治疗的患者在使用本品时对肾功能的损伤。

【药物过量】若过量服用，发生严重反应，应洗胃，并采取对应治疗。

【不良反应】

1. 消化系统：常见腹泻、恶心、呕吐。偶有伪膜性肠炎、腹胀、胃灼热、腹部不适、血中胆红素升高、氨基转移酶一过性升高等。

2. 皮肤：偶有出现瘙痒、局部水肿、紫癜、皮疹等。

3. 中枢神经系统：偶有出现头痛、眩晕、衰弱、疲劳感等。

4. 血液系统：偶有白细胞减少、嗜酸粒细胞增多、血小板增多等，均为一过性反应。

5. 其他罕见的反应有：齿龈炎、直肠炎、结膜炎、药物热等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸头孢他美酯干混悬剂	化学药	HZ004310
盐酸头孢他美酯胶囊	化学药	HZ004311
盐酸头孢他美酯片	化学药	HZ004312

HY002378 盐酸头孢替安

【外文名称】Cefotiam Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】(6*R*,7*R*) -7-[[(2-氨基-4-噻唑基) 乙酰基] 氨基] -3-[[1-[2-(二甲氨基) 乙基] -1*H*-四唑-5-基] 硫代甲基] -8-氧代-5-硫杂-1-氮杂双环[4.2.0] 辛-2-烯-2-羧酸二盐酸盐

【分子式】$C_{18}H_{23}N_9O_4S_3 \cdot 2HCl$

【分子量】598.54

【性状及组成】本品为白色至淡黄色结晶性粉末。

药物药理信息

【药理毒理】

1. 抗菌作用

(1) 对革兰阴性菌和阳性菌都有广泛的抗菌作用。尤其对大肠杆菌、克雷伯杆菌属、奇异变形杆菌，流感杆菌等，显示了更强的抗菌活性。对肠道

菌属、枸橼酸杆菌属、吲哚阳性的普通变形杆菌、雷特格变形杆菌、摩根变形杆菌也显示了良好的抗菌活性。

（2）本品的抗菌作用为杀菌性的。

2. 作用机制：本品的抗菌作用机制是阻碍细菌细胞壁的合成。本品对革兰阴性菌有较强的抗菌活性是因为它对细菌细胞外膜有良好的通透性和对β-内酰胺酶比较稳定以及对青霉素结合蛋白 1B 和 3 亲和性高，从而增强了对细胞壁黏肽交叉联结的抑制作用所致。

3. 毒理研究

（1）亚急性及慢性毒性实验：将本品分别按 0.1，0.3，1，3g/（kg·d）给大鼠肌注 1 个月和按 0.03，0.1，0.3，1g/（kg·d）肌注 6 个月；给狗按 0.1，0.3，1g/（kg·d）静注及肌注 1 个月和按 0.03，0.1，0.3g/（kg·d）静注 6 个月；给猴按 0.1，0.3，1g/（kg·d）静注或肌注 1 个月的实验中可认为是由本品引致的主要所见如下：

①对肾脏的影响：在猴的 1g/kg 的给药组除见到近端肾小管上皮坏死和肾小管腔内细胞性或玻璃样圆柱体增加以外无其他异常所见；在对大鼠 1g/（kg·d）肌注 1 个月和对猴 1g/（kg·d）肌注 1 个月的实验中还和先锋霉素Ⅰ的 1g/（kg·d）给药组做了对照比较研究，其结果是本品对肾脏的影响与先锋霉素Ⅰ大致相同。

②对肝脏的影响：除猴的 1g/kg 和大鼠 3g/kg 给药组出现了肝细胞脂肪化和 AST，ALT 增高外，未见其他异常变化。

③其他：各种动物的大剂量肌注组在注射部位出现了局部刺激作用及其伴随的局部血管收缩，对狗除见到特异的皮肤潮红和肿胀以外别无其他异常所见。

（2）生殖实验：在大鼠和家兔的器官形成期各给肌注噻乙胺唑头孢菌素 0.03，0.1，0.3g/（kg·d）和 0.01，0.03，0.09g/（kg·d）的实验中除看到家兔 0.09g/（kg·d）给药组母动物出现体重抑制与死亡外，未见有致畸作用和对胎仔的影响等。

在对大鼠的妊娠前及妊娠期给药实验以及围产期及授乳期给药实验中皆未见到异常变化。

【药代动力学】 30 分钟静脉滴注本品 1g 和 2g，血药峰浓度分别为 75 和 148mg/L；静脉推注本品 0.5g 后，5 分钟的血药浓度为 51mg/L，本品的血清半衰期为 0.6～1.1 小时。

静脉注射给药后，本品可广泛分布于体内各组织，血液、肾组织及胆汁中浓度较高。静脉滴注 2g 后，2 小时平均胆汁中药物浓度为 702mg/L，静脉推注 0.5g 后，肾组织中浓度超过 100mg/kg。药物在体内可分布至扁桃体、痰液、肺组织、胸水、胆囊壁、腹水、肾组织、膀胱壁、前列腺、盆腔渗出液、羊水等，乳汁中有微量分布，但本品难以透过血脑屏障。

本品在体内无积蓄作用，主要以原形经肾排泄，其次为胆汁排泄，血清蛋白结合率约为 8%。1 次静脉滴注或静注 0.5g、1g 和 2g 后，至 6 小时后，尿中排出给药量的 60%～75%。静脉推注 0.5g 后，尿药浓度在给药后 0～2 小时、2～4 小时和 4～6 小时，分别达到 2000mg/L、350mg/L 和 66mg/L。小儿 1 次静脉给药 10、20 或 40mg/kg 后，6 小时内尿中排泄情况与成人大致相仿。

【药物相互作用】 与本品类似的化合物（别种头孢类抗生素）与速尿等利尿药并用可增强肾毒性，因而本品与速尿等利尿药并用时应注意肾功能。

【药物过量】 如发生药物过量，应立即停用本品，必要时可进行血液透析或腹膜透析。

【不良反应】

1. 休克：偶有发生休克症状，因而给药后应注意观察，若发生感觉不适，口内感觉异常、喘鸣、眩晕、排便感、耳鸣、出汗等症状，应停止给药。

2. 过敏性反应：若出现皮疹、荨麻疹、红斑、瘙痒、发热、淋巴腺肿大、关节痛等过敏性反应时应停止给药并做适当处置。

3. 肾脏：偶尔出现急性肾功能衰竭等严重肾障碍，因而应定期实行检查，充分观察，出现异常情况时，应中止给药，并做适当处置。

4. 血液：有时出现红细胞减少，粒细胞减少，嗜酸性白细胞增高，血小板减少，偶尔出现溶血性贫血。

5. 肝脏：有时出现 S-GOT，S-GPT，碱性磷酸酶增高，偶尔出现胆红素、乳酸脱氢酶、γ-谷氨酰转肽酶增高。

6. 消化系统：偶尔出现伪膜性结肠炎等伴随带血便症状的严重结肠炎，若因应用本品而出现腹痛或多次腹泻时应立即停药并做适当处置。本品有时可引起恶心、腹泻，偶也出现呕吐、食欲减退、腹痛等症状。

7. 呼吸系统：偶尔发生伴随发烧、咳嗽、呼吸困难、胸部 X 线异常、嗜酸性白细胞增高等症状的间质性肺炎，若出现上述症状，应停药并采取注射肾上腺皮质荷尔蒙等适当处置。

8. 中枢神经系统：对肾功能衰竭患者大剂量给药时有时可出现痉挛等神经症状。

9. 菌群交替现象：偶有出现口腔炎、念珠菌症。

10. 维生素缺乏症：偶有出现维生素 K 缺乏症

(低凝血酶原血症、出血倾向等)，维生素 B 族缺乏症（舌炎、口腔炎、食欲减退、神经炎等)。

11. 其他：偶有引起头晕、头痛、倦怠感、麻木感等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸头孢替安	化学药	HZ005105

HY002379 盐酸土霉素

【外文名称】Oxytetracycline Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】6 - 甲基 - 4 - (二甲氨基) - 3,5,6,10,12,12*a* - 六羟基 - 1,11 - 二氧代 - 1,4,4*a*,5,5*a*,6,11,12*a* - 八氢 - 2 - 并四苯甲酰胺盐酸盐

【分子式】$C_{22}H_{24}N_2O_9 \cdot HCl$

【分子量】496.90

【性状及组成】本品为黄色结晶性粉末，无臭，味微苦，微有引湿性，在日光下颜色变暗，在碱溶解中易破坏失效。本品在水中易溶，在乙醇中略溶，在三氯甲烷或乙醚中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加盐酸溶解（9→1000）溶解并稀释成每 1ml 中含 10mg 的溶液，避光放置 1 小时，依法测定，比旋度为 - 188°至 - 200°。

药物药理信息

【药理毒理】本品为四环素类抗生素，为广谱抑菌剂，许多立克次体属、支原体属、衣原体属、螺旋体、阿米巴原虫和某些疟原虫也对本品敏感。肠球菌属对其耐药。其他如放线菌属、炭疽杆菌、单核细胞增多性李斯特菌、梭状芽孢杆菌、奴卡菌属、弧菌、布鲁菌属、弯曲杆菌、耶尔森菌等对本品敏感。本品对淋球菌和脑膜炎球菌具一定抗菌活性，但耐青霉素的淋球菌对土霉素也耐药。多年来由于四环素类的广泛应用，临床常见病原菌对土霉素耐药现象严重，包括葡萄球菌等革兰阳性菌及多数革兰阴性杆菌。四环素类抗生素的不同品种之间存在交叉耐药。

本品作用机制为药物能特异性地与细菌核糖体 30S 亚基的 A 位置结合，抑制肽链的增长和影响细菌蛋白质的合成。

【药代动力学】本品口服后约可吸收口服量的 30% ~ 58%，单剂口服本品 1g 后，血药峰浓度（C_{max}）为 3.9mg/L，6 小时尚有 2.1mg/L，进食后土霉素的吸收比空腹服用时约降低一半。本品吸收后广泛分布于肝、肾、肺等组织和体液，易渗入胸水、腹水，不易透过血 - 脊液、脑屏障。本品表观分布容积（V_d）为 0.9 ~ 1.9L/kg，蛋白结合率为 20% ~ 35%，肾功能正常者血消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）为 6 ~ 10 小时，无尿患者可达 47 ~ 66 小时。本品主要自肾小球滤过排出，给药后 24 小时内排出给药量的 70%，其不吸收部分以原形药随粪便排泄。血液透析约可清除给药量的 10% ~ 15%。

【药物相互作用】

1. 与制酸药如碳酸氢钠同用时，由于胃内 pH 增高，可使本品吸收减少，活性减低，故服用本品后 1 ~ 3 小时内不应服用制酸药。

2. 含钙、镁、铁等金属离子的药物，可与本品形成不溶性络合物，使本品吸收减少。

3. 与全麻药甲氧氟烷同用时，可增强其肾毒性。

4. 与强利尿药如呋塞米等药物同用时可加重肾功能损害。

5. 与其他肝毒性药物（如抗肿瘤化疗药物）同用时可加重肝损害。

6. 降血脂药考来烯胺或考来替泊可影响本品的吸收，必须间隔数小时分开服用。

7. 本品可降低避孕药效果，增加经期外出血的可能。

8. 本品可抑制血浆凝血酶原的活性，所以接受抗凝治疗的患者需要调整抗凝药的剂量。

【药物过量】本品无特异性拮抗药，药物过量时应给予催吐、洗胃及大量饮水及补液等对症治疗及支持治疗。

【不良反应】

1. 消化系统：胃肠道症状如恶心、呕吐、上腹不适、腹胀、腹泻以及胰腺炎等，偶有食管炎和食管溃疡的报道，多发生于服药后立即上床的患者。

2. 肝毒性：通常为脂肪肝变性，妊娠期妇女、原有肾功能损害的患者易发生肝毒性，但肝毒性亦可发生于并无上述情况的患者。四环素所致胰腺炎也可与肝毒性同时发生，患者并不伴有原发肝病。

3. 过敏反应：多为斑丘疹和红斑，此外可见荨麻疹、血管神经性水肿、过敏性紫癜、心包炎以及系统性红斑狼疮加重，表皮剥脱性皮炎并不常见。偶有过敏性休克和哮喘发生。某些用四环素的患者日晒时有光敏现象。所以，应建议患者不要直接暴露于阳光或紫外线下，一旦皮肤有红斑则立即停药。

4. 血液系统：可引起溶血性贫血、血小板减少、中性粒细胞减少和嗜酸粒细胞减少。

5. 中枢神经系统：偶可致良性颅内压增高，可

表现为头痛、呕吐、视神经乳头水肿等。

6. 肾毒性：原有显著肾功能损害的患者可能发生氮质血症、高磷酸血症和酸中毒。

7. 二重感染：长期应用本品可诱发耐药金黄色葡萄球菌、革兰阴性杆菌和真菌等的消化道、呼吸道和尿路感染，严重者可致败血症。

8. 本品可沉积在牙齿和骨骼中，致牙齿产生不同程度的变色黄染，牙釉质发育不良及龋齿，并可致骨发育不良。

9. 应用本品可使人体内正常菌群减少，导致维生素缺乏，真菌繁殖，出现口干、咽痛、口角炎和舌炎等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸土霉素胶囊	化学药	HZ004313
盐酸土霉素片	化学药	HZ004314

HY002380　盐酸托泊替康

【其他名称】盐酸拓扑替康

【外文名称】Topotecan Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第59册

药物理化信息

【化学名】（*S*）－10－［（二甲氨基）甲基］－4－乙基－4,9－二羟基－1*H*－吡喃［3′,4′,6,7,］－中氮茚并［1,2－*b*］－喹啉－3－14（4*H*，12*H*）－二酮盐酸盐

【分子式】$C_{23}H_{23}N_3O_5 \cdot HCl$

【分子量】457.91

【性状及组成】本品为淡黄色至黄色或黄绿色结晶性粉末，无臭，有引湿性。

本品在水中溶解，在甲醇中微溶，在乙醇中极微溶解，在三氯甲烷中几乎不溶；在0.1mol/L的盐酸溶液中溶解。

比旋度：取本品，精密称定，加0.1mol/L盐酸溶液溶解并制成每1ml中含5mg的溶液，依法测定，比旋度为+90.0°至+100.0°。

药物药理信息

【药理毒理】

1. 抗肿瘤活性：本药显示了很强的抗肿瘤活性和广泛的抗癌谱，临床前的体内抑瘤试验中对P388及L121白血病、B16黑色素瘤、B16/F10黑色素瘤亚株、Lewis肺癌、ADJ－PC6浆细胞瘤、M5076卵巢肉瘤、乳腺癌16/c、结肠腺癌38及51、Wadison肺癌等动物移植性肿瘤疗效显著。

2. 作用方式：本药为拓扑异构酶Ⅰ的抑制剂。拓扑异构酶Ⅰ可诱导DNA单链可逆性断裂，使DNA螺旋链松解，本药可与拓扑异构酶Ⅰ－DNA复合物结合并阻止这些单股断链的重新连接，其细胞毒作用是在DNA的合成中，是S期细胞周期特异性药物。本药与拓扑异构酶Ⅰ和DNA形成的三元复合物与复制酶相互作用时产生双股DNA的损伤，而哺乳动物的细胞不能有效地修复这些双股DNA链的中断。

【药代动力学】对癌症患者以1.5 mg/kg的剂量30分钟静脉滴注，在体内呈二室模型，分布非常快，很容易分布到肝、肾等血流灌注好的组织，其$t_{1/2\alpha}$为4.1～8.1分钟，代谢产物内酯式拓扑替康的$t_{1/2\beta}$为1.7～8.4小时，总拓扑替康$t_{1/2\beta}$为2.3～4.3小时，与血浆蛋白结合率为6.6%～21.3%，药物可进入脑脊液中，在脑脊液中有蓄积，大部分（26%～80%）经肾脏排泄，其中90%在用药后12小时排泄，小部分经胆汁排泄，肾功能不全的病人对本药清除率降低，其MTD亦降低，肝功能不全病人对本药的代谢和毒性与正常人无明显差异。

【药物相互作用】盐酸拓扑替康与G－CSF同时使用可延长中性粒细胞减少的持续时间，所以应在治疗的第6天，即在完成盐酸拓扑替康治疗后24小时才可使用G－CSF。

【药物过量】目前尚不清楚本品过量的解毒方法，过量的主要并发症是骨髓抑制。

【不良反应】

1. 血液系统：有白细胞减少、血小板减少、贫血等反应。骨髓抑制（主要是中性粒细胞）是本品的剂量限制性毒性，治疗期间要监测外周血常规，在治疗中中性粒细胞恢复至＞1500个/mm^3，血小板恢复至100000个/mm^3，血红蛋白恢复至9.0g/dl方可继续使用（必要时可使用G－CSF或辅助成分血）。与其他细胞毒药物联合应用时可加重骨髓抑制。

2. 消化系统：恶心、呕吐、腹泻、便秘、肠梗阻、腹痛、口腔炎、畏食。

3. 皮肤及附件：脱发、偶见严重的皮炎及瘙痒。

4. 神经肌肉：头痛、关节痛、肌肉痛、全身痛、感觉异常。

5. 呼吸系统：可致呼吸困难。虽然尚不能肯定是否会因此而造成死亡，但应引起医生的重视。

6. 肝脏：有时出现肝功能异常，转氨酶升高。

7. 全身：乏力、不适、发热。

8. 局部：静脉注射时，若药液漏在血管外局部可产生局部刺激、红肿。

9. 过敏反应：罕见过敏反应及血管神经性水肿。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸托泊替康	化学药	HZ0005106

HY002381 盐酸托哌酮

【其他名称】甲苯哌丙酮

【外文名称】Tolperisone Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第11册

药物理化信息

【化学名】2,4－二甲基－3－哌啶基苯丙酮盐酸盐

药物药理信息

【药理毒理】本品具有血管扩张作用及中枢性肌肉松弛作用。可直接扩张血管平滑肌和抑制多突触反射，能降低骨骼肌张力，缓解因脑、脊髓受损而出现的肌肉强直、阵挛等。

【药代动力学】口服吸收迅速，1～2小时达血药浓度峰值。

【药物相互作用】不宜与神经节阻断剂及抗交感神经药物同时使用。

【不良反应】少数患者服后有食欲减退、腹痛、头晕、嗜睡、面部潮红、患肢肿痛、下肢无力、乏力等症状，但不严重，多为一过性，一般停药1～2天即消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸托哌酮胶囊	化学药	HZ004315
盐酸托哌酮片	化学药	HZ004316
脑络通胶囊	中成药	ZC003631

HY002382 盐酸托烷司琼

【其他名称】Navoban、呕必停、托普西龙

【外文名称】Tropisetron Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】内－1H－吲哚－3－羧酸－8－甲基－8－氮杂双环［3.2.1］辛－3－基酯盐酸盐

【分子式】$C_{17}H_{20}N_2O_2 \cdot HCl$

【分子量】320.81

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶状粉末、熔点为201～202℃。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理研究

本品为外周神经元和中枢神经系统内5－HT_3受体的高选择性抑制剂。抗癌药物或放疗可激发小肠黏膜的嗜铬细胞释放5－HT_3，诱导呕吐反射，造成恶心和呕吐。本品选择性抑制这一反射中外周神经系统的突触前5－HT_3受体的兴奋，并可能对中枢神系统5－HT_3受体传递的迷走神经传入后区有直接影响，这种双重作用阻断了呕吐反射过程中神经介质的化学传递，从而对化疗及放疗引起的呕吐有治疗作用。

托烷司琼一日一次，其疗效可与其他5－HT_3拮抗剂相媲美，甚至在其他5－HT_3拮抗剂增大剂量或增加给药次数的情况下也是如此。对以前采用5－HT_3拮抗剂治疗失败的患者，托烷司琼仍有较好的治疗效果。托烷司琼对以前采用常规止吐药物无效者也有非常满意的效果。

托烷司琼与地塞米松合用，能使疗效更进一步提高。

托烷司琼对麻醉药物所致的恶心呕吐亦有良好的疗效，所用剂量为2mg/d。疗效优于常规的止吐药物，在某些方面甚至优于其他5－HT_3拮抗剂。

2．毒性研究

（1）遗传毒性：文献报道盐酸托烷司琼对小鼠骨髓微核无明显影响，体外高浓度也未见染色体畸变和致突变作用。

（2）生殖毒性：动物生殖毒性试验提示有潜在胚胎毒性。尚不清楚本品是否可进入乳汁，因此哺乳期妇女不应使用本品。

【药代动力学】健康志愿者的药代动力学结果表明本品口服吸收迅速、完全，2.2小时内吸收口服100mg剂量的95%以上，t_{max}为2～3.5小时 C_{max}为21.7～29.0μg/L，静注 C_{max}为82～84μg/L，口服 $t_{1/2}$为8.6～41.9小时，静注 $t_{1/2}$为7.3～30.2小时；V_d为554.1L；约71%的本品以非特异的方式与血浆蛋白结合；代谢正常者，约8%的本品以原形从尿中排出，70%以代谢物从尿中排出，粪中排出约占15%，几乎均为代谢物；在非正常代谢人中，尿中原形排出比例大于正常代谢者。

健康志愿者静脉注射盐酸托烷司琼，消除半衰期（$t_{1/2\beta}$）约为7.3～30.3小时，表观分布容积约为400～600L，蛋白结合率约为59%～71%。

托烷司琼的代谢主要是吲哚环上5、6和7位的羟化，再进一步形成葡萄糖醛酸和硫酸的结合产物，然后经尿或胆汁排泄（代谢物经尿和粪排出的比例为5:1）。代谢物对5－HT_3受体的作用极弱，故不呈现药理作用。代谢正常者的消除半衰期（β相）约

7～10小时，在代谢不良者中，该值可能延长至45小时。本品的总体清除率约为1L/min，其中经肾清除的约为10%。在代谢不良的患者中，尽管经肾清除的比例不变，但总体清除率降为0.1～0.2L/min。这种降低可导致消除半衰期延长约4～5倍、AUC值提高5～7倍，而C_{max}和分布容积与正常代谢者无显著差别。在代谢不良者中，经尿液排出的药物原形比例较代谢正常者大。

在剂量超过10mg、每天二次的多天用药期间，参与本品代谢的肝酶系统的代谢能力可达饱和，并可造成本品血浓度的剂量依赖性增高。然而，即使在代谢不良者中，这类剂量所产生的血药暴露仍属可较好耐受的水平。因此，如果采用5mg/d、共六天的给药方案，不必担心药物的蓄积作用。

【药物相互作用】

1．盐酸托烷司琼若与利福平或其他肝酶诱导药物（如苯巴比妥）同时使用，则可导致盐酸托烷司琼的血浆浓度降低，因此代谢正常者需增加剂量（代谢不良者不需增加）。

2．细胞色素P450酶抑制剂如西米替丁对盐酸托烷司琼的血浆浓度的影响极微，在正常使用的情况下无需调整剂量。

【药物过量】

1．症状：多数大剂量使用时可有幻视。高血压患者的血压可升高。

2．处理：对症治疗，应对患者的重要生命体征做严密观察。

【不良反应】托烷司琼的耐受性明显好于常规止吐药。甚至可能说，托烷司琼不会引起患者化验指标的改变，也不会加重化疗引起的副作用。

盐酸托烷司琼通常耐受性良好，推荐剂量下的不良反应为一过性，常见的不良反应有头痛、头昏、便秘、眩晕、疲劳、胃肠功能紊乱如腹痛和腹泻等。极少数病人可能出现一过性血压改变或过敏反应，前者无需特殊治疗，后者经抗过敏治疗后可好转。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸托烷司琼胶囊	化学药	HZ004317
盐酸托烷司琼氯化钠注射液	化学药	HZ004318
盐酸托烷司琼片	化学药	HZ004319
盐酸托烷司琼葡萄糖注射液	化学药	HZ004320
盐酸托烷司琼注射液	化学药	HZ004321
注射用盐酸托烷司琼	化学药	HZ005107

HY002383　盐酸妥卡尼

【其他名称】室安卡因、妥卡胺、盐酸妥卡胺

【外文名称】Tocainide Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】*N*－（2，6－二甲苯基）－2－氨基丙酰胺盐酸盐

【分子式】$C_{11}H_{16}N_2O\cdot HCl$

【分子量】228.72

【性状及组成】本品为粒状结晶，无臭。

本品在水中易溶，在乙醇中溶解，在乙醚中微溶，在三氯甲烷中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为245～251℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】本品属Ib类抗心律失常药，为利多卡因同系物，主要作用于浦氏纤维和心室肌，抑制Na^+内流，促进K^+外流；降低4相除极坡度，从而降低自律性；明显缩短动作电位时程，相对延长有效不应期及相对不应期；降低心肌兴奋性；减慢传导速度；提高室颤阈。不影响窦房结功能，不影响心室除极和复极时间。小鼠中口服妥卡尼的LD_{50}为800mg/kg，大鼠中为1000mg/kg，豚鼠中为230mg/kg。

【药代动力学】口服吸收迅速，经0.5～1.5小时达最高血浓度，半衰期为15小时，治疗量血浓度为4～10mg/ml（18～45mmol/l）。血浆蛋白结合率约为10%。生物利用度接近100%。

【药物相互作用】妥卡尼和利多卡因药理作用相似，因此这两种药合用时可增加副作用的发生。妥卡尼与西咪替丁、地高辛和华法林合用不发生严重临床效果，在地高辛化和非地高辛化病人中妥卡尼均有效。但妥卡尼与美托洛尔合用对肺锲压和心脏指数都有影响。

【药物过量】药物过量多影响神经系统。其他如胃肠功能紊乱等副作用也可发生。一旦发生抽搐、心肺抑制或骤停，应尽快开通气道。如果开通气道并给氧气后抽搐仍持续，可静脉给小剂量抗抽搐药物，包括苯并二氮䓬类、超短波巴比妥盐或短波巴比妥盐等。

【不良反应】不良反应多轻微、短暂，一般不影响治疗。常见者胃肠道系统有畏食、恶心、呕吐、便秘等；神经系统有眩晕、头痛、嗜睡、出汗、耳鸣、震颤等。偶见皮疹。上述反应在停药后均可自

行消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸妥卡尼胶囊	化学药	HZ004322
盐酸妥卡尼片	化学药	HZ004323

HY002384 盐酸妥拉唑林

【其他名称】Benzazoline Hydrochloride、苯甲唑啉、苄唑啉、Priscoline、妥拉苏林、Tolazol Hydrochlor

【外文名称】Tolazoline Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】4,5－二氢－2－苯甲基－1*H*－咪唑盐酸盐

【分子式】$C_{10}H_{12}N_2 \cdot HCl$

【分子量】193.67

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，味苦。本品的水溶液对石蕊试纸显微酸性反应。

本品在水中易溶，在乙醇及三氯甲烷中溶解，在乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为 172～176℃。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：本品为短效 α 受体阻制剂。对 α 受体的阻断作用比酚妥拉明弱，通过扩张外周血管而降压，但降压作用不稳定。本品通常降低肺动脉压及血管阻力。本品具有拟交感活性（心脏兴奋，变力与变时作用），也有罂粟碱样直接松弛血管平滑肌的作用，还有胆碱能样作用，能增强消化器官的蠕动、增进唾液和胆汁分泌，及组胺样促进胃液分泌作用。

2．致癌、致突变及生殖毒性：尚未见致癌、致畸、致突变的动物和人体研究资料。

【药代动力学】本品在胃肠道吸收，经 40～100 分钟达最大作用；从肾脏消除较快，不易达到有效浓度。肌内注射吸收更快，可于 30～60 分钟达最大作用，持续数小时。在新生儿体内的半衰期为 3 至 10 小时，也有报道长达 40 小时，并与尿量成反比。用药后 30 分钟内起效。本品主要以原形经肾脏排出。

【药物相互作用】

1．本品可拮抗大剂量多巴胺所致的外周血管收缩作用。

2．本品可降低麻黄碱的升压作用。

3．大剂量的本品与肾上腺素或去甲肾上腺素合用可导致反常性的血压下降，发生反跳性的剧烈升高。

4．与间羟胺合用，降低其升压作用。

5．应用本品后，再应用甲氧明或去甲肾上腺素将阻滞后者的升压作用，可能出现严重的低血压。

【药物过量】给药过量会发生低血压。应让患者取头低位平躺休息，必要时输注电解质溶液，并用其他升压药对症治疗。

【不良反应】

1．常见的不良反应

（1）胃肠道出血 该反应可能致命。可通过对胃内容物化验得到证实。

（2）低氯性碱中毒。

（3）体循环低血压 新生儿中常见，可突然发生，此时患儿应取头低位及静脉补液。不宜用肾上腺素或去甲肾上腺素，以免血压过度下降引起随后血压过度反跳。如果扩容不能维持血压，给予多巴胺（可能需要大剂量）与本品同时静脉滴注。

（4）急性肾功能不全 少尿、血尿。

（5）血小板减少。

2．较少见的不良反应

（1）恶心、呕吐、腹泻和上腹痛。

（2）麻刺感、寒冷、发抖、出汗，竖毛活动增加，引起鸡皮现象。

（3）周围血管扩张，皮肤潮红。

（4）反射性心动过速，曾有发生心律失常和心肌梗死的报道。

3．罕见的不良反应：瞳孔扩大。动脉内注射时，注射肢体有烧灼感。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸妥拉唑啉片	化学药	HZ004324
盐酸妥拉唑啉注射液	化学药	HZ004325

HY002385 盐酸万古霉素

【其他名称】凡古霉素、凡可霉素

【外文名称】Vancomycin

【分子式】$C_{66}H_{75}Cl_2N_9O_{24}$

药物药理信息

【药理毒理】本品静脉注射主要用于治疗对甲氧西林耐药的葡萄球菌引起的感染，对青霉素过敏的患者及不能使用其他抗生素包括青霉素、头孢菌素类、或使用后治疗无效的葡萄球菌、肠球菌和棒状杆菌、类白喉杆菌属等感染患者，如心内膜炎、骨

髓炎、败血症或软组织感染等。也可用于防治血液透析患者发生的葡萄球菌属所致的动、静脉血分流感染。本品口服用于治疗由于长期服用广谱抗生素所致难辨梭状杆菌引起的伪膜性结肠炎或葡萄球菌性肠炎。

【药物相互作用】

1．要注意与各种药物的相互作用。与氨基糖苷类、两性霉素 B、阿司匹林及其他水杨酸盐类、注射用杆菌肽及布美他尼、卷曲霉素、卡氮芥、顺铂、环孢素、依他尼酸、巴龙霉素及多黏菌素类药物等合用或先后应用，可增加耳毒性及肾毒性。如必须合用，应监测听力及肾功能并给予剂量调整。抗组胺药、布克利嗪、赛克利嗪、吩噻嗪类、噻吨类及曲美苄胺等于本品合用时，可能掩盖耳鸣、头昏、眩晕等耳毒性症状。

2．有报道称同时使用万古霉素和麻醉药可能出现红斑、类组织胺样潮红及过敏反应。

3．本品与碱性溶液有配伍禁忌，遇重金属可发生沉淀。

【药物过量】多次给药，药物间互相作用和罕见药物动力学可导致用药过量，可引起不良反应增加，特别是耳毒性和肾毒性。万古霉素不易用透析法除去，采用聚砜树脂离子交换可提高万古霉素的清除率。

【不良反应】

1．静滴引起的副作用：快速静滴万古霉素时或之后，可能发生类过敏性反应，包括低血压、喘息、呼吸困难、荨麻疹或瘙痒。快速静滴亦可能引起身体上部潮红（“红颈”）或疼痛及胸部和背部的肌肉抽筋。这些反应通常在 20 分钟内即可解除，但亦可能持续数小时。若万古霉素采用 60 分钟以上的缓慢静滴，此类情况罕见发生。在健康受试者中，若以 10mg/min 或更低速度滴注，很少会发生不良反应。

2．肾毒性：在使用本品病人中，很少有血清肌酐或 BUN 浓度增加的情况或间质肾炎发生。此等情况，通常发生在病人合并使用氨基糖苷药物，或原本患者有肾功能不全者，当停用万古霉素，大部分病人的氮质血症恢复正常。

3．耳毒性：有报道使用万古霉素伴有听觉丧失的情况，这类病人大部分为肾功能失调、预先已有听觉丧失者，或同时与其他耳毒性药品并用。头晕、目眩、耳鸣则罕有报道。

4．造血功能：经万古霉素治疗 1 周后或数周，或总剂量多于 25g 后，有发生可逆性中性粒细胞减少的报道，当停用本品，中心粒细胞减少症多可迅速恢复正常。可逆性粒细胞缺乏症（粒细胞 < 500/mm^3）则罕有报道。

5．静脉炎：曾有报道在注射部位发生。

6．其他：使用万古霉素，偶有过敏反应，药物热、寒战、恶心、嗜酸粒细胞增多、皮疹、帝文斯－约翰逊综合征、性表皮坏死松解，并罕有脉管炎。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用盐酸万古霉素	化学药	HZ005108

HY002386　盐酸维拉帕米

【其他名称】异博定

【外文名称】Verapamil Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】α－［3－［［2－（3,4－二甲氧苯基）乙基］甲氨基］丙基］－3,4－二甲氧基－α－异丙基苯乙腈盐酸盐

【分子式】$C_{27}H_{38}N_2O_4 \cdot HCl$

【分子量】491.07

【性状及组成】本品为白色粉末，无臭。本品在甲醇、乙醇或三氯甲烷中易溶，在水中溶解。

熔点：本品的熔点为 141～145℃。

药物药理信息

【药理毒理】

1．盐酸维拉帕米为钙离子拮抗剂。通过调节心肌传导细胞、心肌收缩细胞以及动脉血管平滑肌细胞细胞膜上的钙离子内流，发挥其药理学作用，但不改变血清钙浓度。

2．盐酸维拉帕米扩张心脏正常部位和缺血部位的冠状动脉主干和小动脉，拮抗自发的或麦角新碱诱发的冠状动脉痉挛，增加了冠状动脉痉挛病人心肌氧的递送，解除和预防冠状动脉痉挛；维拉帕米减少总外周阻力，降低心肌耗氧量。可用于治疗变异型心绞痛和不稳定型心绞痛。

3．维拉帕米减少钙离子内流，延长房室结的有效不应期，减慢传导，可降低慢性心房颤动和心房扑动病人的心室率；减少阵发性室上性心动过速发作的频率。通常维拉帕米不影响正常的窦性心率，但可导致病窦综合征病人窦性停搏或窦房阻滞；维拉帕米不改变正常心房的动作电位或室内传导时间，但它降低被抑制的心房纤维去极化的振幅、速度以及传导的速度，可能缩短附加旁路通道的前向有效不应期，加速房室旁路合并心房扑动或心房颤动病人的心室率，甚至会诱发心室颤动。

4．维拉帕米通过降低体循环的血管阻力产生降

低血压作用，一般不引起体位性低血压或反射性心动过速。

5. 维拉帕米减轻后负荷，抑制心肌收缩，可改善左室舒张功能。在心肌等长或动力性运动中，维拉帕米不改变心室功能正常病人的心脏收缩功能。器质性心脏疾病的病人，维拉帕米的负性肌力作用可被降低后负荷的作用抵消，心脏指数无下降。但在严重左室功能不全的病人（例如肺楔压大于20mmHg或射血分数小于30%），或服用β受体阻滞剂或其他心肌抑制药物的病人，可能出现心功能恶化。

6. 动物试验提示维拉帕米的局部麻醉作用，是普鲁卡因等摩尔的1.6倍。在人体该作用及剂量尚不清楚。

7. 致癌、致突变和生殖毒性：维拉帕米无致癌性。艾姆斯试验证实维拉帕米无致突变性。Beagle狗长期服用维拉帕米≥30mg/（kg·d），导致透镜状和（或）缝线状改变，≥62.5mg/（kg·d）时引起症状明显的白内障。人类尚未有因服用维拉帕米而促使白内障形成的报道。雌性鼠未见损害生殖力。对人类的生殖力影响尚不明确。

【药代动力学】维拉帕米口服后90%以上被吸收。经门静脉有首过效应。生物利用度仅有20%～35%。血浆蛋白结合率约为90%。单剂口服后1～2小时内达峰浓度，作用持续6～8小时。平均半衰期为2.8～7.4小时，在增量期可能延长。长期口服（间隔6小时给药至少10次）半衰期增加至4.5～12.0小时。老年病人的清除半衰期可能延长。

健康人口服维拉帕米后大部分在肝脏代谢。尿中可检测到13种代谢产物；除去甲维拉帕米外，所有代谢产物都是微量的。去甲维拉帕米的心血管活性是维拉帕米的20%，可达到与维拉帕米基本相同的稳态血药浓度。口服维拉帕米后5天内大约70%以代谢物由尿中排泄，16%或更多由粪便清除，约3%～4%以原形由尿排出。维拉帕米在肝功能不全的病人代谢延迟，清除半衰期延长至14～16小时，表观分布容积增加，血浆清除率降低至肝功能正常人的30%。

禁食状态下口服维拉帕米缓释片，生物利用度与维拉帕米普通片剂相似。经门静脉有首过效应，生物利用度仅有20%～35%。禁食状态下单剂口服维拉帕米缓释片240mg后5.21小时内达峰浓度，血浆峰浓度为164ng/ml，AUC_{0-24}为1478ng·h/ml；餐后用药，达峰时间为7.71小时，血浆峰浓度为79ng/ml，AUC_{0-24}为841ng·h/ml。血浆蛋白结合率约为90%。

维拉帕米静脉注射后2分钟（1～5分钟）开始发挥抗心律失常作用，2～5分钟达最大作用，作用持续约2小时。血流动力学作用3～5分钟开始，约持续10～20分钟。维拉帕米静脉注射后代谢迅速，大部分在肝脏代谢。清除呈双指数型，分为早期快速分布相（半衰期约为4分钟）和终末缓慢清除相（半衰期为2～5小时）。年龄可能影响维拉帕米的药代动力学，老年病人的清除半衰期可能延长。5天内大约70%以代谢物由尿中排泄，16%或更多由粪便清除，约3%～4%以原形由尿排出。肝功能不全时半衰期延长，血浆清除率降低。

【药物相互作用】

1. 环磷酰胺、长春新碱、甲基苄肼、强的松、长春碱酰胺、阿霉素、顺铂等细胞毒性药物减少维拉帕米的吸收。

2. 苯巴比妥、乙内酰脲、维生素D、苯磺唑酮和雷米封通过增加肝脏代谢降低维拉帕米的血浆浓度。

3. 西咪替丁可能提高维拉帕米的生物利用度。

4. 维拉帕米抑制乙醇的消除，导致血中乙醇浓度增加，可能延长酒精的毒性不良反应。

5. 少数病例报道维拉帕米和阿司匹林合用，出血时间较单独使用阿司匹林时延长。

6. 与β受体阻滞剂联合使用，可增强对房室传导的抑制作用。

7. 长期服用维拉帕米，使地高辛血药浓度增加50%～75%。维拉帕米明显影响肝硬化病人地高辛的药代动力学，使地高辛的总清除率和肾外清除率分别减少27%和29%。因此服用维拉帕米时，须减少地高辛和洋地黄的剂量。

8. 与血管扩张剂、血管紧张素转换酶抑制剂、利尿剂等抗高血压药合用时，降压作用叠加，应适当监测联合降压治疗的病人。

9. 与胺碘酮合用可能增加心脏毒性。

10. 肥厚性心肌病主动脉瓣下狭窄的病人，最好避免联合用药。

11. 维拉帕米与氟卡胺合用，可使负性肌力作用叠加，房室传导延长。

12. 维拉帕米可增加卡马西平、环胞素、阿霉素、茶碱的血药浓度。

13. 有报道维拉帕米增加病人对锂的敏感性（神经毒性）。

14. 动物实验提示吸入性麻醉剂与维拉帕米同时使用时，需仔细调整两药剂量，避免过度抑制心脏。

15. 避免维拉帕米与丙吡胺同时使用。

【药物过量】服用维拉帕米过量的主要表现为低血压和心动过缓（如房室分离、高度房室传导阻滞、

心脏停搏）、精神错乱、昏迷、恶心、呕吐、肾功能不全、代谢性酸中毒和高血糖等。

对症治疗包括应用阿托品、异丙肾上腺素和心脏起搏治疗及静脉输液、血管收缩剂、钙溶液（如10%的氯化钙溶液）、正性肌力药等。血液透析不能清除维拉帕米。

【不良反应】以推荐的单剂量和一日总量为起始剂量并逐渐向上调整剂量用药，严重不良反应少见。

发生率在1%～10%的不良反应：便秘（7.3%），眩晕、轻度头痛（3.5%），恶心（2.7%），低血压（2.5%），头痛（2.2%）。外周水肿（2.1%），充血性心力衰竭（1.8%），窦性心动过缓，Ⅰ°、Ⅱ°或Ⅲ°房室阻滞，皮疹（1.2%），乏力，心悸；转氨酶升高，伴或不伴碱性磷酸酶和胆红素的升高，这种升高有时是一过性的，甚至继续使用维拉帕米仍可消失。

发生率<1%的不良反应：低血压，心动过速，潮红，溢乳，牙龈增生，非梗阻性麻痹性肠梗阻等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸维拉帕米缓释胶囊	化学药	HZ004326
盐酸维拉帕米缓释片	化学药	HZ004327
盐酸维拉帕米片	化学药	HZ004328
盐酸维拉帕米注射液	化学药	HZ004329
注射用盐酸维拉帕米	化学药	HZ005109

HY002387　盐酸伪麻黄碱

【外文名称】Pseudoephedrine Hydrochloride

药物管理信息

【特殊管理分类】易制毒药

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】［*S*－（*R**,*R**）］－α－1［1－（甲氨基）乙基］－苯甲醇盐酸盐

【分子式】$C_{10}H_{15}NO \cdot HCl$

【分子量】201.70

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，味苦。

本品在水中极易溶解，在乙醇中易溶，在三氯甲烷中微溶。

熔点：本品的熔点为183－186℃。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每1ml中约含50mg的溶液，依法测定，比旋度为+61.0°至+62.5°。

药物药理信息

【药理毒理】本品主要通过促进去甲肾上腺素的释放，间接发挥拟交感神经作用；具有选择性的收缩上呼吸道毛细血管，消除鼻咽部黏膜充血、肿胀、减轻鼻塞症状，对全身其他脏器的血管无明显收缩作用，对心率、心律、血压和中枢神经无明显影响。

【药代动力学】服药后2～3小时，血药浓度达高峰。据文献报道伪麻黄碱部分代谢为无活性代谢产物，55%～75%以原形从尿中排泄。其半衰期随尿pH改变而异。

本品缓释片口服后能缓慢释放而被吸收，健康成人一次服用本品120mg，达峰时间为（5.5±0.9）小时，峰浓度为（387.4±39.4）ng/ml。

【不良反应】有较轻的兴奋作用、失眠、头痛。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氨苯伪麻片（日片）	化学药	HZ000146
氨苯伪麻片（夜片）	化学药	HZ000147
氨酚氯汀伪麻片	化学药	HZ000173
氨酚麻美糖浆	化学药	HZ000174
氨酚美伪麻片/苯酚伪麻片	化学药	HZ000175
氨酚曲麻片	化学药	HZ000179
氨酚伪麻滴剂	化学药	HZ000183
氨酚伪麻胶囊（Ⅱ）	化学药	HZ000184
氨酚伪麻咀嚼片	化学药	HZ000185
氨酚伪麻颗粒剂	化学药	HZ000186
氨酚伪麻美芬氨麻美敏Ⅱ片	化学药	HZ000188
氨酚伪麻美芬片	化学药	HZ000189
氨酚伪麻美芬片（Ⅱ）	化学药	HZ000190
氨酚伪麻美芬片（Ⅲ）	化学药	HZ000191
氨酚伪麻美芬片Ⅲ/氨麻美敏片Ⅲ	化学药	HZ000192
氨酚伪麻那敏分散片	化学药	HZ000193
氨酚伪麻那敏分散片（儿童）	化学药	HZ000194
氨酚伪麻那敏胶囊	化学药	HZ000195
氨酚伪麻那敏咀嚼片	化学药	HZ000197
氨酚伪麻那敏泡腾颗粒	化学药	HZ000198
氨酚伪麻那敏片	化学药	HZ000199
氨酚伪麻那敏片（Ⅰ）	化学药	HZ000200
氨酚伪麻那敏片（Ⅱ）	化学药	HZ000201
氨酚伪麻那敏片（Ⅲ）	化学药	HZ000202
氨酚伪麻那敏溶液	化学药	HZ000203

续表

制剂名称	类别	序号
氨酚伪麻片（Ⅰ）	化学药	HZ000204
氨酚伪麻片（Ⅱ）	化学药	HZ000205
氨咖麻敏胶囊	化学药	HZ000230
氨麻苯美片	化学药	HZ000240
氨麻美敏胶囊Ⅱ	化学药	HZ000241
氨麻美敏口服溶液	化学药	HZ000242
氨麻美敏片	化学药	HZ000243
氨麻美敏片（Ⅱ）	化学药	HZ000244
氨麻美敏片Ⅲ	化学药	HZ000245
氨愈美麻片	化学药	HZ000251
贝敏伪麻片	化学药	HZ000317
苯海拉明伪麻黄碱胶囊	化学药	HZ000340
布洛伪麻分散片	化学药	HZ000482
布洛伪麻干混悬剂	化学药	HZ000483
布洛伪麻缓释胶囊	化学药	HZ000484
布洛伪麻缓释片	化学药	HZ000485
布洛伪麻混悬液	化学药	HZ000486
布洛伪麻胶囊	化学药	HZ000487
布洛伪麻颗粒	化学药	HZ000488
布洛伪麻片	化学药	HZ000489
布洛伪麻软胶囊	化学药	HZ000490
酚咖麻敏胶囊	化学药	HZ000920
酚麻美敏混悬液	化学药	HZ000922
酚麻美敏胶囊［夜用］	化学药	HZ000923
酚麻美敏咀嚼片	化学药	HZ000924
酚麻美敏颗粒	化学药	HZ000925
酚麻美敏口服溶液（成人用）	化学药	HZ000926
酚麻美敏口服溶液（小儿用）	化学药	HZ000927
酚麻美软胶囊	化学药	HZ000928
酚美愈伪麻分散片	化学药	HZ000929
酚美愈伪麻口服溶液	化学药	HZ000930
酚明伪麻片	化学药	HZ000932
复方布洛芬片	化学药	HZ001105
复方酚咖伪麻胶囊	化学药	HZ001163
复方福尔可定口服溶液	化学药	HZ001170
复方盐酸伪麻黄碱缓释胶囊	化学药	HZ001465
咖酚伪麻片	化学药	HZ002043

续表

制剂名称	类别	序号
洛芬伪麻片	化学药	HZ002569
美芬伪麻咀嚼片	化学药	HZ002629
美酚伪麻胶囊	化学药	HZ002630
美酚伪麻片	化学药	HZ002631
美敏伪麻咀嚼片	化学药	HZ002636
美敏伪麻口服液（1）	化学药	HZ002637
美敏伪麻口服液（2）	化学药	HZ002638
美扑伪麻咀嚼片	化学药	HZ002640
美羧伪麻颗粒	化学药	HZ002647
美息伪麻拉明分散片	化学药	HZ002654
美息伪麻软胶囊	化学药	HZ002655
美愈伪麻胶囊	化学药	HZ002659
美愈伪麻颗粒	化学药	HZ002660
美愈伪麻口服溶液	化学药	HZ002661
那敏伪麻胶囊	化学药	HZ002725
那敏伪麻片	化学药	HZ002726
萘普生钠伪麻黄碱缓释片	化学药	HZ002757
扑尔伪麻片	化学药	HZ002872
双分伪麻/酚麻美敏胶囊	化学药	HZ003222
双分伪麻胶囊	化学药	HZ003223
双酚伪麻糖浆	化学药	HZ003224
双扑伪麻颗粒	化学药	HZ003261
双扑伪麻口服溶液	化学药	HZ003262
双扑伪麻片（2）	化学药	HZ003263
特酚伪麻片	化学药	HZ003372
特洛伪麻胶囊	化学药	HZ003373
伪麻那敏胶囊	化学药	HZ003592
伪麻那敏片	化学药	HZ003593
西替伪麻缓释片	化学药	HZ003638
小儿氨酚伪麻分散片	化学药	HZ003738
小儿美敏伪麻口服液	化学药	HZ003764
小儿伪麻滴剂	化学药	HZ003779
小儿伪麻美芬滴剂	化学药	HZ003780
盐酸伪麻黄碱缓释片	化学药	HZ004330
盐酸伪麻黄碱片	化学药	HZ004331
愈酚伪麻待因口服溶液	化学药	HZ004620
愈酚伪麻颗粒	化学药	HZ004621

续表

制剂名称	类别	序号
愈酚伪麻片	化学药	HZ004622
蒿蓝感冒颗粒	中成药	ZC002082
镇咳宁含片	中成药	ZC007262

HY002388　盐酸文拉法辛

【其他名称】凡拉克辛、万拉法新

【外文名称】Venlafaxine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第28册

药物理化信息

【化学名】（±）－1－［2－（二甲氨基）－1－（4－甲氧苯基）乙基］－环己醇盐酸盐

【分子式】$C_{17}H_{27}NO_2 \cdot HCl$

【分子量】313.87

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，味略苦。

本品在水、稀盐酸中易溶解，在乙醇、三氯甲烷中溶解，在乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为215～220℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品主要通过抑制中枢神经系统对5－羟色胺和去甲肾上腺素的再摄取，使突触间隙中这两种单胺递质浓度增高，发挥抗抑郁作用。

【药代动力学】口服吸收迅速，单剂给药时，仅有12.6%进入循环，食物对本品及其代谢物的吸收无影响。$t_{1/2}$平均为4小时，表观分布容积为6L/kg，主要在肝代谢，原药及其代谢物大部分由肾脏排泄。肾功能受损使万拉法辛与其代谢物大约降低55%，消除半衰期明显延长，因此，在肌酐清除率＜30ml/min的肾病病人中，使用本品时应注意调整剂量。对肝功能损害者必须减少剂量。

据文献报道，文拉法辛在肝脏广泛的代谢，*O*－去甲基文拉法辛（ODV）是主要的活性代谢物。食物对盐酸文拉法辛的吸收和*O*－去甲基文拉法辛的形成没有明显的影响。文拉法辛与人血浆蛋白结合率为27%±2%，*O*－去甲基文拉法辛与人血浆蛋白的结合率为30%±12%。文拉法辛和*O*－去甲基文拉法辛稳态血药浓度在多剂治疗的3天达到。文拉法辛和*O*－去甲基文拉法辛的血浆清除率分别为（1.3±0.6）和（0.4±0.2）l/（h·kg）；消除半衰期分别为（5±2）和（11±2）小时；稳态分布容积分别为（7.5±3.7）和（5.7±1.8）l/kg。本品及其代谢物主要经肾脏排泄，48小时内给药剂量的87%由尿排出。

【药物相互作用】

1．与选择性5－羟色胺再摄取抑制剂或与单胺氧化酶抑制剂合用时，可引起高血压、僵硬、肌阵挛、不自主运动、焦虑不安、意识障碍乃至昏迷和死亡。因此，在由一种药物转换为另一种药物治疗时，需7～14日的洗净期（停用单胺氧化酶抑制剂至少14天后，才可换用本品）。

2．与奎尼丁合用时，可使本品血药浓度升高。

3．与β－受体阻滞剂普萘洛尔、美多洛尔、噻吗洛尔或与三环类抗抑郁药阿米替林、氯米帕明、丙咪嗪或与抗心律失常药普鲁帕酮，可待因和美沙芬等合用，可竞争性地抑制本品的代谢。

4．与西米替丁合用时，可使本品清除率降低。

5．本品对细胞色素P450－IID6、P450－3A4二酶的药物同时使用时，应慎用。

6．本品与丙咪嗪合用可使去甲丙咪嗪的血药峰浓度和血药谷浓度增加35%。

7．有报道与氯氮平合用出现氯氮平血药浓度升高的短暂性不良反应，如癫痫。

8．本品与中枢神经系统活性药物联合应用时，应慎用。

9．据报道，接受华法林治疗的病人服用文拉法辛后出现凝血酶原时间、部分促凝血酶原激酶时间或INR增大。

【药物过量】过量服用文拉法辛的病人主要为同时饮酒和（或）服用其他药物的病人。曾报道发生心电图改变（如Q－T间期延长、束支传导阻滞、QRS延长）、窦性和室性心动过速、心动过缓、低血压、眩晕、嗜睡、昏迷、癫痫甚至死亡。

文拉法辛的安全范围较大。曾报道有文拉法辛过量服药高达6.75g的病人经治疗后得到康复，未留下后遗症。

过量后的治疗应保持呼吸道通畅、吸氧以及换气。密切监视心率和生命体征，并进行洗胃、服用活性炭等各种支持疗法和对症治疗。

强制性利尿、透析、血液灌注以及换血疗法疗效不大。目前尚无文拉法辛的特殊解毒剂。

【不良反应】可有胃肠道不适如恶心、畏食、腹泻等。亦可出现头痛、不安、无力、嗜睡、失眠、头晕或震颤等。少见不良反应有过敏性皮疹及性功能减退。可引起血压升高，且与剂量呈正相关。大剂量时可诱发癫痫。突然停药可见撤药综合征如失眠、焦虑、恶心、出汗、震颤、眩晕或感觉异常等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸文拉法辛缓释胶囊	化学药	HZ004332
盐酸文拉法辛胶囊	化学药	HZ004333

HY002389 盐酸乌拉地尔

【其他名称】 Ebrantil、压宁定、优匹敌

【外文名称】 Urapidil Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 国家药品标准新药转正标准·第36册

药物理化信息

【化学名】 6－［［3－［4－（2－甲氧基苯基）－1－哌嗪基］丙基］氨基］－1，3－二甲基－2，4（1*H*，3*H*）嘧啶二酮盐酸盐

【分子式】 $C_{20}H_{29}N_5O_3 \cdot HCl$

【分子量】 423.94

【性状及组成】 本品为白色或类白色的结晶性粉末，醇香，味苦。

本品在水中易溶，在乙醇或三氯甲烷中微溶，在乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】 乌拉地尔为苯唑嗪取代的尿嘧啶，本品具有外周和中枢双重降压作用。外周主要阻断突触后 α_1 受体，使血管扩张显著降低外周阻力。同时也有较弱的突触前 α_2 阻滞作用，阻断儿茶酚胺的收缩血管作用（不同于哌唑嗪的外周作用）；中枢作用主要通过激动5羟色胺－1A（5－HT_1A）受体，降低延髓心血管中枢的交感反馈调节而降压（不同于可乐定的中枢作用）。在降血压同时，本品一般不会引起反射性心动过速。

在临床开放性研究中，单项麻醉时可分别降低收缩压和舒张压3.1%和2.1%，对高血压病人分别降低为12%和6.7%。本药对高血压病效果显著。而对血压正常者没有降压效果。脊髓麻醉时，可明显地降低收缩压约32%、舒张压27%。

在心功能不全的病人中应用乌拉地尔可降低心肌氧耗量、降低肺楔嵌压及外周阻力，改善左心室功能，增加心排血量。

乌拉地尔不影响糖及脂肪代谢，亦不损害肾功能。

动物实验研究表明，给猫脊椎动脉注射乌拉地尔可引起显著的中枢性降压效应，其中枢性降压效应不受中枢 α_2 肾上腺素能受体介导，α_2 受体阻滞剂不能阻断乌拉地尔的中枢性降压效应。乌拉地尔对大鼠具有中度的镇静作用，这一作用亦不受 α_2 受体阻滞剂的影响。有研究发现，当给麻醉后高血压犬的脑池内注射1mg乌拉地尔后，高血压犬的血压开始下降，但心率仍保持在对照前水平。当注射剂量达2～4mg时，心率开始下降，但血压恢复至对照前水平，未见反射性心动过速。

大鼠动物实验研究未发现乌拉地尔有致癌、致突变、致生殖能力下降的作用。动物试验未发现此药有致畸作用。

【药代动力学】 本品口服吸收较快4～6小时血药浓度达峰值，在肝内广泛代谢，主要为羟化，产生的对羟基化合物（M_1）占50%，无生物活性，芳环邻脱甲基化合物（M_2）和尿嘧啶环 *N*－去甲基化合物（M_3）为微量，有生物活性如原药。本品口服吸收后80%与蛋白结合，大部分代谢产物和10%～20%原药通过肾脏排泄，余下的通过粪便排出。口服 $t_{1/2}$ 为4.7小时，静脉 $t_{1/2}$ 为2.7小时。

【药物相互作用】

1．乌拉地尔针剂不能与酸性液体混合，因其酸性性质可能引起溶液混浊或絮状物形成。

2．与降压药同用或饮酒可增强本品降压作用。

3．与西咪替丁同用可增加本品血药浓度15%。

4．目前无足够资料说明本品可与血管紧张素转换酶抑制剂同用，故暂不提倡与血管转换酶抑制剂合用。若同时使用其他抗高血压药物、饮酒或病人存在血容量不足的情况，如腹泻、呕吐，可增强乌拉地尔针剂的降压作用。

【药物过量】 发生严重低血压可抬高下肢，补充血容量，如果无效，可缓慢静脉注射缩血管药物，不断监测血压变化，个别病例需使用肾上腺素。

【不良反应】

1．使用乌拉地尔后，个别病例可能出现头痛、头晕、恶心、呕吐、出汗、烦躁、乏力、心悸、心律失常、上脸部压迫感或呼吸困难等症状，其原因多为血压降得太快所致，通常在数分钟内即可消失，病人无需停药。血压过度降低，可抬高下肢，补充血容量即可改善。

2．过敏反应少见（如瘙痒，皮肤发红，皮疹等）。

3．极个别病例在口服本药时出现血小板计数减少，但血清免疫学研究尚未证实其因果关系。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸乌拉地尔缓释胶囊	化学药	HZ004334
盐酸乌拉地尔缓释片	化学药	HZ004335
盐酸乌拉地尔注射液	化学药	HZ004336
注射用盐酸乌拉地尔	化学药	HZ005110

HY002390　盐酸戊乙奎醚

【外文名称】Penehyclidine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第50册

药物理化信息

【化学名】3-（2-环戊基-2-羟基-2-苯基乙氧基）奎宁环烷盐酸盐

【分子式】$C_{20}H_{29}NO_2 \cdot HCl$

【分子量】351.92

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末，无臭，味苦。

本品在水、甲醇或三氯甲烷中易溶，在丙酮中微溶，在乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品系新型选择性胆碱药，能通过血脑屏障进入脑内。它能阻断乙酰胆碱对脑内毒蕈碱受体（M受体）和烟碱受体（N受体）的激动作用；因此，能较好地拮抗有机磷毒物（农药）中毒引起的中枢中毒症状，如惊厥、中枢呼吸循环衰竭和烦躁不安等。同时，在外周也有较强的阻断乙酰胆碱对M受体的激动作用；因而，能较好地拮抗有机磷毒物（农药）中毒引起的毒蕈碱样中毒症状，如支气管平滑肌痉挛和分泌物增多、出汗、流涎、缩瞳和胃肠道平滑肌痉挛或收缩等。它还能增加呼吸频率和呼吸流量，但由于本品对M_2受体无明显作用，故对心率无明显影响；对外周N受体无明显拮抗作用。

本品毒性较小，小鼠LD_{50}为261.7mg/kg（肌内注射），71.2mg/kg（静脉注射）；大鼠LD_{50}450.7mg/kg（肌内注射），71.2mg/kg（静脉注射）；大鼠和狗的长期毒性试验，除出现一些常见抗胆碱反应外，未见其他异常，肌注局部刺激试验符合规定。致突变试验为阴性；在相当于人用量75倍内剂量无明显一般生殖毒性；在相当于人用量300倍内未见致畸胎作用和胚胎毒性，亦未见行为致畸胎作用。

【药代动力学】健康成人肌内注射1mg盐酸戊乙奎醚后，2分钟可在血中检测出盐酸戊乙奎醚，约0.56小时血药浓度达峰值，峰浓度约为13.20μg/L，消除半衰期约为10.35小时。动物实验表明本品分布到全身各组织，以颌下腺、肺、脾、肠较多。本品主要由尿和粪便排泄，24小时总排泄为给药量的94.17%。

【药物相互作用】当本品与其他抗胆碱药（阿托品、东莨菪碱和山莨菪碱等）伍用时有协同作用，应酌情减量。

【药物过量】用药过量时，可出现眩晕、口干、视力模糊、谵妄、尿潴留、体温升高、幻觉、定向障碍和昏迷等；一般不须特殊处理，停药后可自行缓解；必要时，对症治疗或给予镇静药物。

【不良反应】用量适当时常常伴有口干、面红和皮肤干燥等。如用量过大，可出现头晕、尿潴留、谵妄和体温升高等。一般不须特殊处理，停药后可自行缓解。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸戊乙奎醚注射液	化学药	HZ004337

HY002391　盐酸西布曲明

【外文名称】Sibutramine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第59册

药物理化信息

【化学名】（±）1-（4-氯苯基）-*N*，*N*-二甲基-α-异丁基-环丁甲胺盐酸盐一水合物

【分子式】$C_{17}H_{26}ClN \cdot HCl \cdot H_2O$

【分子量】334.33

【性状及组成】本品为白色至类白色结晶性粉末，无臭。

本品在甲醇、乙醇或三氯甲烷中溶解，在水中微溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：减肥药。

本品为作用于中枢的肥胖症治疗药。主要通过其胺类（仲胺和伯胺类）代谢产物而产生作用，其主要机制为抑制去甲肾上腺素、5-羟色胺和多巴胺的再摄取而增强饱食感，而对去甲肾上腺素、5-羟色胺和多巴胺的释放无明显影响。研究还表明，本品及其胺类活性代谢产物无明显抗胆碱、抗组胺和单胺氧化酶抑制作用。

【药代动力学】口服吸收迅速，单次服药平均最少可吸收77%，血药浓度达峰值时间为1.2小时，口服清除率为1750L/h，半衰期为11小时。经肝脏首过效应，被肝脏的细胞色素P450（3A4）同工酶代谢为具有药理活性的代谢物单和双去甲基的M_1和M_2，这些活性代谢物进一步羟基化和结合代谢为非药理活性代谢物M_5和M_6。血浆中药物原形及其代谢产物的浓度分别为原形（3%）、M（16%）、M（212）%、M（552%）、M（627%）。M_1和M_2的血浆

浓度在服药后 3～4 小时内可达峰值，服药 4 天内 M_1 和 M_2 的血浆浓度达到稳态，浓度是单次服药的 2 倍。M_1 和 M_2 的半衰期分别为 14 和 16 小时，多次给药后半衰期无变化。在治疗剂量下，药物原形、M_1、M_2 的人血浆蛋白结合率分别为血药浓度的 97%、94%、94%。口服药物经肠道吸收后，可迅速、广泛地分布到组织中，肝脏和肾脏中浓度最高。单次服药后大约 85%（68%～95%）由尿和粪便排泄。M_1 和 M_2 主要经肝脏排泄；M_5 和 M_6 主要经肾脏排泄，尿中没有原形成分。

【药物相互作用】

1. 本品不能与单胺氧化酶抑制剂（MAOI）同时使用。在开始使用本品治疗前应至少停用 MAOI2 周，而在使用 MAOI 前应至少停用本品 2 周。

2. 由于本品抑制 5－羟色胺再摄取，因此不宜与其他 5－羟色胺能药物合用。

3. 正在服用含去甲麻黄碱、麻黄碱和伪麻黄碱等影响血压和心率药物的患者，慎用本品。

4. 本品与抑制细胞色素 P450（3A4）代谢的药物如酮康唑、红霉素等有潜在的相互作用，但影响幅度不大。

【药物过量】现无本品过量的特效解毒药，治疗方法包括处理药物过量的一般方法，如保证呼吸畅通、监测心脏和重要生命体征，采取对症和支持疗法；可谨慎应用 β－受体阻滞剂来控制升高的血压和心动过速。还未证实利尿和血液透析的效果。

【不良反应】常见不良反应有：口干、畏食、失眠、便秘等。其他发生率≥1%的不良反应有：发热、心率增快、血压升高、呼吸困难以及腹泻、胃肠炎等。本品可以引起肝功能异常，常随进一步的治疗而消失，有明确的剂量－反应关系。另外还可见肢体痉挛、张力增加、思维异常、癫痫发作、间质性肾炎、月经紊乱、外周性水肿、关节炎、皮肤瘙痒、感觉异常、弱视等反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸西布曲明胶囊	化学药	HZ004338
盐酸西布曲明片	化学药	HZ004339

HY002392 盐酸西替利嗪

【其他名称】Cetrizet、塞特赞、仙特敏、Zyrtec

【外文名称】Cetirizine Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】（±）－2－［2－［4－［（4－氯苯基）甲苯基］－1－哌嗪基］乙氧基］乙酸二盐酸盐

【分子式】$C_{21}H_{25}ClN_2O_3 \cdot 2HCl$

【分子量】461.80

药物药理信息

【药理毒理】本品为选择性组胺 H_1 受体拮抗剂，无明显抗胆碱或抗 5－羟色胺作用，中枢抑制作用较轻。

【药代动力学】据资料报道，盐酸西替利嗪口服后由胃肠道迅速吸收。健康成人口服 10mg，血药浓度达峰时间（t_{max}）为 30～60 分钟，血药浓度峰值（C_{max}）为 300ng/ml，血浆半衰期约 10 小时，约 70%以原形药物从尿中排泄，少量从粪便排泄。西替利嗪与蛋白结合率高。

【药物相互作用】未发现与其他药物相互作用的报道，但同时服用镇静剂时应慎重。

【药物过量】本药无特效拮抗剂，严重超量患者应立即洗胃，采用支持疗法，并长期严密观察病情变化。

【不良反应】不良反应轻微且为一过性，可能有困倦、思睡、头痛、眩晕、激动、口干、鼻干及胃肠道不适等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
西替伪麻缓释片	化学药	HZ003638
盐酸西替利嗪滴剂	化学药	HZ004340
盐酸西替利嗪分散片	化学药	HZ004341
盐酸西替利嗪胶囊	化学药	HZ004342
盐酸西替利嗪口服液	化学药	HZ004343
盐酸西替利嗪片	化学药	HZ004344
盐酸西替利嗪糖浆	化学药	HZ004345

HY002393 盐酸消旋山莨菪碱

【外文名称】Raceanisodamine Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】（±）－6β－羟基－1αH，5αH－托烷－3α－醇托品酸酯的盐酸盐

【分子式】$C_{17}H_{23}NO_4 \cdot HCl$

【分子量】341.84

药物药理信息

【药理毒理】具有外周抗 M 胆碱受体作用，能解除乙酰胆碱所致平滑肌痉挛，也能解除微血管痉挛，改善微循环。对胃肠道平滑肌有松弛作用，并抑制其蠕动，作用较阿托品稍弱，其抑制消化道腺体分泌作用为阿托品的 1/10。抑制唾液腺分泌及扩瞳作用较弱，为阿托品的 1/20～1/10。因不易通过血－

脑脊液屏障，故中枢作用弱于阿托品。

【药代动力学】大鼠静脉注射后15分钟，肾中浓度最高，30分钟胰中浓度高，肾、心、肺、脾、肝次之，脑、血浆中浓度低。静脉注射后1～2分钟起效，很快自肾排出，$t_{1/2}$约40分钟。长期应用无蓄积作用。

【药物相互作用】

1．与金刚烷胺、吩噻嗪类药、三环类抗抑郁药、扑米酮、普鲁卡因胺及其他抗胆碱药合用，可使不良反应增加。

2．与单胺氧化酶制剂（包括呋喃唑酮和甲基苄肼）伍用，可加强抗毒蕈碱作用的副作用。

3．能减弱胃肠运动和延迟胃排空，对一些药物产生影响，如红霉素在胃内停留过久降低疗效，对乙酰氨基酚吸收延迟，对地高辛、呋喃妥因等药物的吸收增加。

【药物过量】剂量过大可出现阿托品样中毒症状，可用1%毛果芸香碱注射液解救，每次0.25～0.5ml，皮下注射，每15分钟一次，直至症状缓解。

【不良反应】常见的有：口干、面红、视物模糊等；少见的有：心跳加快、排尿困难等；上述症状多在1～3小时内消失。用量过大时可出现阿托品样中毒症状。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸消旋山莨菪碱氯化钠注射液	化学药	HZ004346
盐酸消旋山莨菪碱注射液	化学药	HZ004347

HY002394　盐酸小檗胺

【其他名称】升白安、升血胺、小檗胺

【外文名称】Berbamine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第13册

【分子式】$C_{37}H_{40}N_2O_6 \cdot 2HCl$

【分子量】608.71

【性状及组成】从小檗属植物根中分离得到的一种双苄基异喹啉类生物碱。

本品为类白色或微黄色结晶性粉末，无臭，味苦。

本品在水中易溶，在甲醇、乙醇、冰醋酸中溶解，在石油醚、苯、乙醚、三氯甲烷中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理研究：本品为促进白细胞增生药。具有刺激骨髓细胞增殖作用，能提高造血干细胞集落因子的含量，促进骨髓造血干细胞和粒细胞的增殖，并向粒细胞分化。此外，本品还具有增强机体免疫力、抗结核、扩张血管、抗心肌缺氧、缺血、抗心律失常等作用。

2．毒理研究：盐酸小檗胺片小鼠口服给药的LD_{50}为1500mg/kg。狗亚急性毒性实验，口服盐酸小檗胺30～120mg/（kg·d），共实验用药30天，开始时口服30mg/（kg·d），15天后改120mg/（kg·d）。仅在大剂量时60mg/（kg·d）出现食欲减退，但不影响继续给药，停药后可行恢复。血常规、BSP排泄和血清尿素氮未见异常。在大鼠的实验中，每周给药3次，每次250mg/kg，持续灌药5个月，动物体重与对照组相同，病理检查肝、肾、脾等未见异常改变，证明盐酸小檗胺的长期毒性很低。

【药代动力学】本品口服组织分布以肝脏最高，依次是肾、肺、脾、心和脑，以粪便排泄为主。

【药物相互作用】与氨硫脲并用能增强氨硫脲的抗结核疗效，对环磷酰胺的抗癌疗效有相加作用。

【不良反应】少数患者服药后出现头痛、无力、便秘、口干并伴有阵发性腹痛、腹胀等症状，但继续服药均能耐受，服药1周后不适症状可自行减轻可消失。偶见心慌，咳喘。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸小檗胺片	化学药	HZ004348

HY002395　盐酸小檗碱

【其他名称】黄连素

【外文名称】Berberine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】5，6－二氢－9，10－二甲氧苯并［*g*］－1，3－苯并二氧戊环［5，6－*a*］喹嗪盐酸盐二水合物

【分子式】$C_{20}H_{18}ClNO_4 \cdot 2H_2O$

【分子量】407.85

【性状及组成】本品为黄色结晶性粉末，无臭，味极苦。本品在热水中溶解，在水或乙醇中微溶，在三氯甲烷中极微溶解，在乙醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为抗菌药，抗菌谱广，体外对多种革兰阳性及阴性菌均具抑制作用，其中对溶血性链球菌、金黄色葡萄球菌、霍乱弧菌、脑膜炎奈瑟菌、志贺菌属、伤寒杆菌、白喉杆菌等具有较强

抑制作用。对阿米巴原虫也有一定作用。

【药代动力学】口服吸收差。

【药物相互作用】含鞣质的中药与黄连素合用后，由于鞣质是生物碱沉淀剂，二者结合，生成难溶性鞣酸盐沉淀，降低药效。

【不良反应】不良反应较少，偶有恶心、呕吐、皮疹和药热，停药后即消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方硫酸锌滴眼液	化学药	HZ001278
复方灭活白葡萄球菌片	化学药	HZ001320
复方木香小檗碱片	化学药	HZ001323
复方石榴皮小檗碱胶囊	化学药	HZ001378
复方小檗碱鞣酸蛋白胶囊	化学药	HZ001443
硫糖铝小檗碱片	化学药	HZ002435
小檗碱甲氧苄啶胶囊	化学药	HZ003731
盐酸小檗碱胶囊	化学药	HZ004349
盐酸小檗碱片	化学药	HZ004350
白连止痢胶囊	中成药	ZC000157
肠康胶囊	中成药	ZC000528
肠康片	中成药	ZC000529
胆宁片（1）	中成药	ZC000772
儿泻止颗粒	中成药	ZC001005
耳炎药膏	中成药	ZC001012
妇炎平胶囊	中成药	ZC001251
妇炎平泡腾片	中成药	ZC001252
妇炎平散	中成药	ZC001253
复方白头翁胶囊	中成药	ZC001272
复方白头翁片	中成药	ZC001273
复方黄连素片	中成药	ZC001397
肛泰	中成药	ZC001767
肛泰软膏	中成药	ZC001768
肛泰栓	中成药	ZC001769
谷海生片	中成药	ZC001842
连蒲双清胶囊	中成药	ZC003219
连蒲双清片	中成药	ZC003220
六味香连胶囊	中成药	ZC003331
牛黄消炎灵胶囊	中成药	ZC003716
牛黄消炎灵丸	中成药	ZC003717
青龙蛇药片	中成药	ZC004033

续表

制剂名称	类别	序号
三黄胶囊	中成药	ZC004450
三黄片	中成药	ZC004451
四黄泻火片	中成药	ZC005307
速效止泻胶囊	中成药	ZC005373
苋菜黄连素胶囊	中成药	ZC005977
香连素片	中成药	ZC005997
小儿肠胃康颗粒	中成药	ZC006180
雪胆解毒丸	中成药	ZC006551
障翳散	中成药	ZC007212
治痢片	中成药	ZC007425

HY002396 盐酸辛可卡因

【其他名称】地布卡因、Dibucaine、纽白卡因、Nupercaine、Percaine、沙夫卡因、Sovcaine

【外文名称】Cinchocaine Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】本品局麻效能较普鲁卡因大 22～25 倍，持续时间长，但毒性比普鲁卡因大 15～20 倍，一旦出现中毒，抢救需 4～8 小时，才能逆转。

本品在组织中远较普鲁卡因稳定，因此麻醉作用持续时间较久（约为普鲁卡因的 3 倍）。

本品适用于硬膜外麻醉以及腰麻。

本品容易通过黏膜，也用于表面麻醉，但因其毒性过大（约比普鲁卡因高 15 倍），较少用于浸润麻醉。

【不良反应】毒性较大，可有恶心，出汗，呼吸困难、谵妄或谵语。大剂量使用时，有惊厥，颜面或皮肤潮红。个别病例有过敏反应。

HY002397 盐酸溴己新

【其他名称】Bisolvon、Bromhexini Hydrochloridum、Broncokin、必嗽平、必消痰、环丙溴己胺、溴苄环己胺、溴环己胺、溴己铵、溴己新

【外文名称】Bromhexine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】*N* – 甲基 – *N* – 环己基 – 2 – 氨基 – 3,5 – 二溴苯甲胺盐酸盐

【分子式】$C_{14}H_{20}Br_2N_2 \cdot HCl$

【分子量】412.60

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶性粉末，无臭，无味。本品在乙醇或三氯甲烷中略溶，在水中极微溶解。

熔点：本品的熔点为 239～243℃，熔融时同时分解。

吸收系数：取本品，精密称定，加乙醇溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 20μg 的溶液，照紫外－可见分光光度法，在 249nm 的波长处测定吸光度，吸收系数为 262～278。

药物药理信息

【药理毒理】本品为印度民间祛痰止咳药鸭嘴花有效成分鸭嘴花碱的人工合成类似物，有较强的溶解黏痰作用，可使痰中的黏多糖纤维素或黏蛋白裂解，降低痰液黏度；还作用于气管、支气管腺体细胞分泌黏滞性较低的小分子黏蛋白，改善分泌的流变学特性和抑制黏多糖合成，使黏痰减少，从而稀释痰液，易于咳出。本品还可促进呼吸道黏膜的纤毛运动，并刺激胃黏膜，引起反射性的恶心祛痰作用。口服 1 小时生效，维持 6～8 小时，连服 3～5 天才达到本品的最佳效应。绝大部分的代谢物随尿液排出，粪便仅排除极少部分。

本品为祛痰药。用于急性及慢性支气管炎、哮喘、支气管扩张、肺气肿，尤适用于白色黏痰咳出困难者及因痰液广泛阻塞小支气管引起的危重急症等。

【药代动力学】口服后 1 小时见效，而 3～5 小时作用最强，作用可维持 6～8 小时。

【药物相互作用】与四环素合用，能增加支气管分泌液中四环素的浓度。

本品可增加阿莫西林的疗效。

【不良反应】偶有恶心、胃部不适、减量或停药后可消失，少数病人血清转氨酶短暂升高。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
茶新那敏片	化学药	HZ000509
复方氯丙那林溴己新胶囊	化学药	HZ001293
复方氯丙那林溴己新片	化学药	HZ001294
复方氯丙那林鱼腥草素钠片	化学药	HZ001295
复方羟丙茶碱去氯羟嗪胶囊	化学药	HZ001342
复方头孢克洛干混悬剂	化学药	HZ001410
复方头孢克洛胶囊	化学药	HZ001411
复方头孢克洛片	化学药	HZ001412
复方妥洛特罗糖浆	化学药	HZ001417

续表

制剂名称	类别	序号
磺啶新林胶囊	化学药	HZ001776
克洛己新干混悬剂	化学药	HZ002115
克洛己新片	化学药	HZ002116
小儿复方盐酸妥洛特罗片	化学药	HZ003761
盐酸溴己新片	化学药	HZ004352
盐酸溴己新葡萄糖注射液	化学药	HZ004353
盐酸溴己新注射液	化学药	HZ004354
注射用盐酸溴己新	化学药	HZ005111
复方咳喘胶囊	中成药	ZC001420
清咳散	中成药	ZC004104

HY002398　盐酸伊达比星

【其他名称】4－Demethoxy Dazcnorubicin、去甲氧柔红霉素、盐酸去甲氧基柔红霉素、ZAVEDOS

【外文名称】Idarubicin Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】（1c.3c）－3－乙酰－1,2,3,4,6,11－六氢－3,15,12－三羟基－6,11－二氧代－丁炔基－3氨基－2,3,6－三脱氧基－α－*l*－来苏糖－吡喃己糖苷。

或：4－去甲氧基柔红霉素盐酸盐

【分子式】$C_{26}H_{27}NO_9 \cdot HCl$

【分子量】533.97

【性状及组成】本品的盐酸盐为鲜橙色结晶。

熔点：本品的熔点为 172～174℃。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理学研究

本药为蒽环类抗生素，有抗有丝分裂和细胞毒作用。盐酸伊达比星为柔红霉素类似物，因蒽环第 4 位缺少一个甲氧基，故比柔红霉素的脂溶性高，更易透过细胞膜。

其作用机制为作用于拓扑异构酶Ⅱ，抑制核酸合成。蒽环结构 4 位的改变使该化合物具有新脂性，提高了细胞对经物的摄入。

2．毒理学研究

（1）遗传毒性：Ames 试验和哺乳动物细胞试验结果显示盐酸伊达比星有致突变性。

（2）生殖毒性：雄性犬连续 18 周给予盐酸伊达比星 1.8mg/kg/次，每周 3 次，（按体表面积折算，相当于临床用药量的 1/7），或给予临床用药量的 3

倍，动物出现睾丸萎缩，精子生成或成熟受到抑制，停药 8 周后毒性反应无明显恢复。

（3）致癌性：尚无规范的盐酸伊达比星动物长期用药致癌性研究资料，但盐酸伊达比星及其相关药物已表现出了致癌特性。

【药代动力学】肝肾功能正常的病人静脉给药后盐酸伊达比星从体循环中清除，其终末血浆半衰期在 11～25 小时之间，大部分药物经代谢生成活性代谢产物伊达比星醇，而该代谢产物的清除更慢，血浆半衰期在 41～69 小时，绝大部分药物是以伊达比星醇的形式经胆汁和尿液排出体外。

在白血病人体内进行的细胞内药物浓度（有核细胞核骨髓细胞）的研究表明，注射本品几分钟后，伊达比星即达到细胞浓度峰值，伊达比星和伊达比星醇在有核细胞和骨髓细胞中的浓度比在血浆中的浓度高 1000 倍以上。

伊达比星和伊达比星醇在血浆和细胞中的清除速率相当，其终末半衰期约 15 小时，伊达比星醇的终末半衰期大约是 72 小时。

【药物相互作用】

1．食物似乎并不减少去甲氧基柔红霉素的吸收，因此盐酸伊达比星胶囊可随清淡饮食一起服用。

2．与其他有骨髓抑制作用的药物合用可加重骨髓抑制。

3．与碱性溶液将降解。

4．与肝素合用会产生沉淀，故不要与其他药物使用。

【药物过量】过大剂量的本品可能在 24 小时内引起急性心肌中毒，一至二周内产生严重的骨髓抑制，此期间应加强支持疗法和应用输血，无菌隔离护理等措施也有报道，蒽环类药物过量后引起的心力衰竭可于数月后出现，病人应密切观察，一旦出现心力衰竭的症状和体症时应予以常规治疗。

【不良反应】主要的严重不良反应为严重的骨髓抑制和心脏毒性，骨髓抑制主要表现为白细胞，红细胞，血小板减少，心脏毒性表现为致命性充血性心力衰竭，急性心律失常及心肌病。

其他不良反应有：脱发，绝大多数病人为可逆性，急性恶心和呕吐，黏膜炎，通常主要是口腔黏膜炎，出现于开始治疗后 3～10 天，食管炎和腹泻，发热，寒战，皮疹，肝脏酶类和胆红素增高的发生率为 20%～30%，单独使用本品或与阿糖胞苷合用会产生严重的有时甚至是致命的感染。

使用本品 1～2 天后，尿出现红染，应告知患者无需惊慌。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸伊达比星胶囊	化学药	HZ004355
注射用盐酸伊达比星	化学药	HZ005112

HY002399 盐酸伊立替康

【外文名称】Irinotecan Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 45 册

药物理化信息

【化学名】（+）-（4*S*）-4，11-二乙基-4-羟基-9［（4-哌啶基哌啶）羰基］-1*H* 吡喃并［3，4，6，7］吲哚嗪［1，2-*b*］喹啉-3，14-（4*H*，12*H*）-二酮盐酸盐三水合物

【分子式】$C_{33}H_{38}N_4O_6 \cdot HCl \cdot 3H_2O$

【分子量】677.19

【性状及组成】本品为淡黄色或黄色结晶性粉末，无臭。

本品在水、乙醇或三氯甲烷中微溶，在丙酮中几乎不溶。

比旋度：取本品适量，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中含 5mg 的溶液，依法测定比旋度为 +63.0°至 +69.0°。

药物药理信息

【药理毒理】本品为抑制细胞生长的拓扑异构酶Ⅰ抑制剂（L-抗肿瘤和免疫抑制剂）。伊立替康是半合成喜树碱的衍生物，是能特异性抑制 DNA 拓扑异构酶Ⅰ的抗肿瘤药。它在大多数组织中被羧酸酯酶代谢为 SN-38，而后者作用于提纯的拓扑异构酶Ⅰ的活性比伊立替康更强，且对几种鼠和人肿瘤细胞系的细胞毒性也强于伊立替康。SN-38 或伊立替康可诱导单链 DNA 损伤，从而阻断 DNA 复制叉，由此产生细胞毒性。这种细胞毒性是时间依赖性的，并特异性作用于 S 期。

在体外实验中，并未发现伊立替康和 SN-38 可被 P-糖蛋白 MDR 有效识别，且显示出对阿霉素和长春花碱耐药的细胞系仍有细胞毒作用。另外，在体内实验中，伊立替康对鼠肿瘤模型显示了广谱的抗瘤活性（PPO3 胰导管腺癌，MA-16/C 乳腺癌，C38 和 C51 结肠腺癌）并有抗人异种移植肿瘤的活性（CO03 胰导管腺癌，MA-16/C 乳腺癌，C38 和 C51 结肠腺癌）并有抗人异种移植肿瘤的活性（Co-4 结肠腺癌，MX-1 乳腺癌，St-15 和 SC-6 胃腺癌），伊立替康对表达 P-糖蛋白 MDR 的肿瘤（长春新碱和阿霉素耐药的 P388 白血病）也有抗瘤活性。伊立

替康除具有抗肿瘤活性外，最相关的药理学作用为抑制乙酰胆碱酯酶。

【药代动力学】文献报导，人体静脉注射本品后，伊立替康的血浆浓度呈常指数消除。平均消除半衰期为6～12小时，活性代谢产物SN－38的消除半衰期为10～20小时。因为其内酯和羟基酸是化学平衡的，故活性内酯和SN－38的半衰期与完整的伊立替康和SN－38的半衰期相近。

在50～350mg/m^{2}的剂量范围内，伊立替康吸收面积（AUC）与剂量呈线性递增关系：SN－38的AUC增加要小于剂量的增加。在90分钟内静脉滴注本品后1小时内，活性代谢产物SN－38达到最大浓度。伊立替康与血浆蛋白的结合率为30%～68%，明显低于SN－38与血浆蛋白的结合率（大约95%）。伊立替康主要在肝内由羧酸酯酶转化为活性代谢产物SN－38，后者代谢为葡萄糖苷酸，活性为SN－38的1/50～1/100（由体内细胞毒性检测）。体内分布不明；药物及代谢产物经尿排泄：伊立替康为11%～20%，SN－38＜1%，SN－38糖苷约3%。给药48小时后胆汁蓄积和经尿排泄的药25%～50%。

【药物相互作用】目前无药物相互作用的报道，但伊立替康与神经肌肉阻滞剂之间的相互作用不可忽视，具有抗胆碱酯酶活性的药物可延长琥珀胆碱的神经肌肉阻滞作用，非去极化神经肌肉阻滞剂可能被拮抗。

【药物过量】目前尚无过量报道。Ⅱ期研究中，在严密观察下剂量曾高达750mg/kg。最显著的不良反应是严重中性粒细胞减少症和腹泻。因而，为防使用过量，应在专科医院使用；目前尚无已知解毒剂。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸伊立替康注射液	化学药	HZ0004356
注射用盐酸伊立替康	化学药	HZ0005113

HY002400　盐酸伊托必利

【其他名称】盐酸依托必利

【外文名称】Itopride Hydrchloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第53册

药物理化信息

【化学名】*N*－［4－［2－（二甲氨基）乙氧基］苄基］－3,4－二甲氧基苯甲酰胺盐酸盐

【分子式】$C_{20}H_{26}N_2O_4 \cdot HCl$

【分子量】349.90

【性状及组成】本品为白色或微黄色结晶性粉末，无臭，味苦。

本品在水中极易溶解，在乙醇中略溶，在三氯甲烷中极微溶解。

熔点：本品的熔点为193～198℃。

吸收系数：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每1ml中含15μg的溶液，照分光光度法，在258nm波长处测定吸光度，吸收系数为337～357。

药物药理信息

【药理毒理】本品具多巴胺D2受体阻滞和乙酰胆碱酯酶抑制的双重作用，通过刺激内源性乙酰胆碱释放并抑制其水解而增强胃和十二指肠运动，促进胃排，并具有中度催吐作用。

【药代动力学】本品口服吸收迅速给药30分钟血药达峰，半衰期约为6小时，多次给药血清药物浓度与单次给药相同，本品原形药物4%～5%代谢物75%通过尿液排泄，动物试验体内主要分布于肝胆肾脑和消化系统，中枢系统分布很少。

【药物相互作用】本品与抗胆碱药，具有肌肉松弛作用的药物（安定类，氯唑沙宗等）联合应用，可相互抵消作用。

【药物过量】出现乙酰胆碱作用样症状，视觉模糊，恶心，呕吐，腹泻，严重的可出现低血钾，呼吸短促，喘鸣，胸闷，唾液和支气管分泌增多等可用适量阿托品解救。

【不良反应】消化系统：偶尔出现腹泻，腹痛，便秘，唾液分泌增加。神经精神系统：偶见头痛，睡眠障碍等。血液系统：偶见白细胞减少（确认应停药）。过敏症状：皮疹发热，瘙痒等。偶出现血DUN，肌酐值升高。也可见背部疼痛，疲乏，手指发麻，手抖等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸伊托必利分散片	化学药	HZ0004357
盐酸伊托必利胶囊	化学药	HZ0004358
盐酸伊托必利颗粒	化学药	HZ0004359
盐酸伊托必利片	化学药	HZ0004360

HY002401　盐酸依米丁

【外文名称】Emetine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】6′,7′,10,11 - 四甲氧基吐根烷二盐酸盐七水合物

【分子式】$C_{29}H_{40}N_2O_4 \cdot 2HCl \cdot 7H_2O$

【分子量】679.68

【性状及组成】本品为白色或淡黄色结晶性粉末，无臭；味苦；遇光易变质。本品在水、乙醇或三氯甲烷中易溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 50mg 的溶液，依法测定比旋度为 + 16°至 + 19°。

药物药理信息

【药理毒理】依米丁对阿米巴原虫滋养体有直接杀灭作用，但对其包囊则无效。其作用是通过抑制肽链的延长，而使寄生虫和哺乳动物细胞中的蛋白质合成受阻。依米丁只能杀死肠壁及组织中的滋养体，而不能消灭肠腔中的滋养体。

【药代动力学】依米丁注射后药物分布在肝、肺、肾及脾，而以肝内为最高。主要由肾脏排泄，自肠黏膜随粪便排出的量极少。由于此药的排泄很慢，停药后 40～60 天仍继续排泄药物，所以易发生蓄积作用。

【药物相互作用】本药的心脏毒性反应可为其他易引起心律异常的药物所加强，用药时必须注意。

【药物过量】可引起低血压、心律不齐，严重时可出现阿斯综合征而死亡。

【不良反应】

1. 局部反应：注射的部位可有疼痛，有时出现坏死及蜂窝织炎，甚至脓肿。

2. 胃肠道反应：恶心、呕吐、腹泻等。

3. 神经肌肉反应：常见的有肌肉疼痛和无力，特别是四肢和颈部；有时可因全身无力而出现呼吸困难。

4. 心脏反应：低血压、心前区疼痛、心动过速和心律不齐，常是心脏受损的征象。心电图改变尤其是 T 波低平或倒置、Q - T 间期延长，这些变化提示心肌早期中毒的征象。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸依米丁注射液	化学药	HZ004361

HY002402 盐酸依匹斯汀

【外文名称】Epinastine Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】3 - 氨基 - 9,13*b* - 二氢 - 1*H* - 二苯[*c*,*f*]咪唑并[1,5 - *a*]氮杂䓬盐酸盐

【分子式】$C_{16}H_{15}N_3 \cdot HCl$

【分子量】285.82

【性状及组成】本品为白色粉末。熔点：270～273℃

药物药理信息

【药理毒理】本品对 H_1 受体具有高度选择性的亲和力，对组胺及白三烯 C4、PAF、5 - 羟色胺等有强烈的拮抗作用并能抑制组胺、SRS - A（慢反应物质 A）等化学介质的释放。

用^{3}H - mepyramine 取代实验观察发现，依匹斯汀对 H_1 受体有很强的亲和力（*Ki* 和 IC_{50}分别为 7.8、9.8nM），而与 H_2 受体的亲和力很低（*Ki* 和 IC_{50}分别为 2897、4030nM）。对 H_1 受体的亲和力与阿司咪唑相似，而是特非拉定的 9 倍。依匹斯汀对 α 和 5 - HT_2 受体也有弱的亲和力，而阿斯咪唑对 α、M 和 5 - HT_2 受体都有作用。

依匹斯汀能以剂量依赖性的方式拮抗组胺诱导的离体豚鼠回肠肌的收缩，明显强于阿司咪唑和特非拉定；依匹斯汀预处理能明显抑制组胺引起的大鼠皮肤风团，作用强度比阿司咪唑和特非拉定强 100 倍以上。依匹斯汀口服也能对因吸入引起的豚鼠支气管痉挛有明显的保护作用，其作用与酮替酚相当，而比异丙嗪强 20 倍。

依匹斯汀能明显对抗 5 - HT 诱导的支气管收缩，该作用也明显强于阿司咪唑和异丙嗪。依匹斯汀还能以浓度依赖性的方式抑制 LTB4（白三烯 B4）诱导的粒细胞聚集，其作用明显小于倍他米松而与 LTB4 受体拮抗剂 ADCA 的作用相似。PAF 能明显引起气道张力增加，而依匹斯汀明显抑制 PAF 诱导的支气管收缩，其作用明显优于酮替酚，但在抑制 PAF 引起的血小板聚集的作用方面与酮替酚相当。依匹斯汀、酮替酚、氮䓬斯汀均能明显对抗缓激肽引起的支气管痉挛，而三个药物中以依匹斯汀作用最强。

【药代动力学】健康成人口服盐酸依匹斯汀 20mg，1.9 小时达血药峰值浓度，血浆浓度消除半衰期为 9.2 小时。健康成人口服给药吸收率约为 40%，生物利用度约为 39%；健康成人口服或静脉给药，尿或粪便提取物中的放射性均为原形物，代谢物的总量很少。健康成人口服给药尿中及粪便中排泄率分别为 25.4%、70.4%。

【不良反应】尽管依匹斯汀属于非镇静性的抗组胺药物，但是其仍然具有中枢神经系统（CNS）抑制作用，具体症状表现为眩晕、耳鸣、视物模糊、复视、疲倦、疲劳、陶醉感、神经质、失眠、震颤、协调差等。这些症状可能在合用乙醇或其他 CNS 药物时表现更严重。

1. 眼科应用依匹斯汀时可能出现的不良反应：

眼科使用依匹斯汀发生频率最高的眼部不良反应包括眼烧灼感、毛囊病、充血和瘙痒等，发生率约为1%～10%。发生率较高的眼外不良反应包括感染（感冒症状、上呼吸道感染）约占10%，头疼、鼻炎、鼻窦炎、咳嗽和咽炎等约占1%～3%。抗组胺药物的阿托品样不良反应可引起瞳孔改变，如眼调节下降、视力模糊、黏液分泌减少；剂量增大还可以引起单侧或双侧面部肌肉的麻痹。

2. 依匹斯汀全身给药可能出现的不良反应：全身给药的依匹斯汀主要在日本和南美上市，因此关于依匹斯汀全身给药可能出现的不良反应的有关报道主要来源于这些地区。已报道86例病人出现107种可能与依匹斯汀使用相关的不良反应。报道最多的不良反应是中枢抑制，嗜睡、头晕、头疼等；其次为胃肠道反应，包括胃炎、消化不良、胃食管反流、恶心、呕吐等。抗胆碱样作用包括心动过速、便秘、口干、尿潴留和尿频等。也有报道出现过敏反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸依匹斯汀胶囊	化学药	HZ004362
盐酸依匹斯汀片	化学药	HZ004363

HY002403　盐酸依普拉酮

【其他名称】盐酸苯丙哌酮

【外文名称】Eprazinone Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第2册

药物理化信息

【化学名】1－（2苯基－2－乙氧基）乙基－4－（2－苯甲酰基）丙基哌嗪的二盐酸盐

【分子式】$C_{24}H_{32}N_2O_2 \cdot 2HCl$

【分子量】453.52

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，味苦。

本品在水中略溶，在乙醇或三氯甲烷中微溶，在丙酮或乙醚几乎不溶。

熔点：本品的熔点应为210～214℃，熔融时同时分解。

吸收系数：取本品，精密称定，加0.05mol/L硫酸溶液溶解并定量稀释制成每1ml中约含0.02mg的溶液，照紫外－可见分光光度法，在250nm的波长处测定吸光度，吸收系数（$E_{1cm}^{1\%}$）为279～297。

药物药理信息

【药理毒理】盐酸依普拉酮为兼具中枢性与末梢性镇咳作用的非成瘾性镇咳药，主要作用于咳嗽中枢。动物试验显示，选择性抑制脑干网状体，包括延髓的咳嗽中枢，其作用强度与可待因相近或为其1/3，为美沙芬的2倍，那可丁的3倍。本品的临床镇咳效果与可待因相近或稍逊，但无可待因的抑制肠蠕动作用。本品兼具祛痰作用，能使痰中酸性糖蛋白的多糖纤维性状改变，黏多糖纤维膨胀断裂，具有较强的黏液溶解作用。此外，实验结果还表明，本品还具有镇静作用、局麻作用和抗5－羟色胺引起的支气管平滑肌痉挛作用。

【药代动力学】同位素示踪研究表明，本品口服后在胃肠道很快吸收，约2小时达血药浓度高峰，主要分布于肺、肝、肾等器官。药物经代谢后，大约14%经尿、36%经粪便、23%由胆汁排泄。

【不良反应】少数患者可有头昏、口干、胃部不适及恶心等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸依普拉酮片	化学药	HZ004364
消痰咳片	中成药	ZC006112

HY002404　盐酸依替福辛

【外文名称】Etifoxine Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】本品具有焦虑作用。本品给药后不影响机体的主要功能，亦不引起不良反应，但它对自主神经系统具有调节作用。特别是本品不仅对焦虑引起的行为反常有拮抗作用，对生理和生化方面的异常现象也有作用。对易激动的动物进行的试验表明，本品的作用具有很强的选择性。

临床药理学研究表明，在应激的情况下（表现为易兴奋，突发性高血压，血清游离脂肪酸增加，氢化可的松增加等），本品能减弱各种反应。对猴的实验表明，本品不会引起依赖性。

【药代动力学】本品口服后吸收良好，不与血液成分结合，主要随尿排泄。本品能穿过胎盘。

【药物相互作用】与中枢抑制药和酒合用需慎重。不宜同时饮用含酒精的饮料，以免增加药物的吸收量。

【不良反应】

1. 有轻度嗜眠，继续使用时会自行消失。驾驶员和机械操作人员，使用本品应谨慎，40名病人临床连用6～12个月的追踪治疗，表明本品无须增大剂量，停药后也没有观察到戒断症状出现。

2. 虽然在动物试验中本品未观察到致畸作用，

但怀孕期和哺乳期妇女不宜服用。

3. 对肌无力的病人，本品可加剧肌肉疲劳，应进行监护。

HY002405 盐酸依替卡因

【外文名称】Etidocaine Hydrochloride

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末。易溶于水。其 PKa 为 7.74。

药物药理信息

【药理毒理】本品局麻作用与丁比卡因相似，作用开始于 2～4 分钟，持续时间较丁比卡因稍长。作用强度为利多卡因的 4 倍，毒性与利多卡因相似。对运动神经的作用强，且先于对感觉神经的作用。

【药物相互作用】与肾上腺素伍用，其局部麻醉作用既可加强又可延长。

HY002406 盐酸乙胺丁醇

【外文名称】Ethambutol Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】［2*R*,2［*S*－（*R**，*R**）］－*R*］－（＋）2,2′－（1,2－乙二基二亚氨基）－双－1－丁醇二盐酸盐

【分子式】$C_{10}H_{24}N_2O_2 \cdot 2HCl$

【分子量】277.23

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭或几乎无臭；略有引湿性。本品在水中极易溶解，在乙醇中略溶，在三氯甲烷中极微溶解，在乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 199～204℃，熔融时同时分解。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中含 0.10g 的溶液。在 25℃时，依法测定，比旋度为＋6.0°至＋7.0°。

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理：本品为人工合成抑菌性抗结核药。对生长繁殖期细菌具较强活性，对静止期细菌几无作用。对各型分枝杆菌具高度抗菌活性。结核杆菌对本品与其他药物之间无交叉耐药现象。

本品的作用机制尚未完全阐明，可能与抑制敏感细菌的代谢，抑制 RNA 的合成，干扰结核杆菌蛋白代谢，从而导致细菌死亡。

2. 毒理：本品大剂量时在小鼠试验中可引致腭裂、脑外露和脊柱畸形等；在大鼠试验中可引致轻度颈椎畸形；在家兔试验中可引致独眼、短肢和腭裂等。

【药代动力学】本品口服后经胃肠道吸收 75%～80%，达峰时间 2～4 小时。在体内各组织中分布广泛，可浓集在红细胞（红细胞内浓度可达血药浓度的 2～3 倍）、肾、肺、唾液和尿液中，在胸水、腹水浓度极低。脑脊液中药物浓度约为血药浓度 20%～80%，表观分布容积为 1.6～3.9L/kg，蛋白结合率约 10%～30%。血消除半衰期为 2.5～4 小时，肾功能减退者可延长至 7～15 小时，故应进行剂量调整。约 10%～20% 的本品在肝脏代谢，本品经肾小球滤过和肾小管分泌排出，给药后约 50%～90% 药物以原形在 24 小时内经肾排出，约 15% 为无活性代谢物，肾清除率为 5.93～8.45ml/（min·kg）。在粪便中以原形排出约 20%。乳汁中的药物浓度约相当于母体血药浓度。血液透析和腹膜透析可清除本品。

【药物相互作用】

1. 铝盐，包括 DDI 缓冲液可减少本品的吸收。

2. 本品与维拉帕米合用可减少后者的吸收。

3. 与神经毒性药物合用可增加本品的神经毒性，如视神经炎或周围神经炎。

4. 与乙硫异烟胺合用可增加黄疸性肝炎、视神经炎等不良反应。

【药物过量】

1. 药物过量主要表现为视神经损害，如球后视神经炎、视神经中心纤维损害，重症者可发生永久性视神经萎缩。

2. 药物过量的处理。

（1）停药。

（2）对症处理：①球后视神经炎者可用维生素 B_6、复合维生素及锌铜制剂等。②恢复视力，可选用地塞米松 5mg，每日静滴或球后注射；妥拉苏林 12.5mg，每日球后注射；氢化可的松 200mg，每日静滴。也可口服强的松 20mg，一日 2～3 次。同时给予维生素等。恢复期可予针刺治疗，口服地巴唑、烟酸等，或每日肌内注射。③必要时进行血液透析和腹膜透析。

【不良反应】

1. 常见视神经损害，如球后视神经炎、视神经中心纤维损害。可能与本品同铜、锌等金属元素螯合后引起这些金属元素含量下降有关。球后视神经炎发生率约 0.8%，与剂量、疗程有关，长期服药、一日剂量大于 25mg/kg 时易于发生，每日剂量 15mg/kg 发生率为 1%，25mg/kg 为 6%，35mg/kg 增至 15%。表现为视力模糊、眼痛、红绿色盲或视力减退、视野缩小。上述反应早期发现和及时停药则可

于数周或数月内自行消失，永久性视觉功能丧失极少发生。

2. 少见畏寒、关节肿痛（尤其大趾、髁、膝关节）和病变关节表面皮肤发热拉紧感（急性痛风、高尿酸血症）。

3. 偶见胃肠道不适、恶心、呕吐、腹泻、肝功能损害、周围神经炎（常表现为麻木、针刺感、烧灼痛或手足软弱无力）和过敏反应（常表现为皮疹、瘙痒、头痛、发热、关节痛）等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸乙胺丁醇胶囊	化学药	HZ004365
盐酸乙胺丁醇片	化学药	HZ004366
乙胺吡嗪利福异烟片Ⅱ	化学药	HZ004492

HY002407　盐酸乙基吗啡

【外文名称】Ethylmorphine Hydrochloride

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】17 - 甲基 - 3 - 乙氧基 - 4,5α - 环氧 - 7,8 - 二脱氢吗啡喃 - 6α - 醇盐酸盐二水合物

【分子式】$C_{19}H_{23}NO_3 \cdot HCl \cdot 2H_2O$

【分子量】385.89

【性状及组成】本品为白色或淡黄色结晶性粉末，无臭。

本品在水或乙醇中溶解，在三氯甲烷或乙醚中微溶。

熔点：本品的熔点为 120 ~ 123 ℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】局部刺激药。

HY002408　盐酸乙哌立松

【其他名称】盐酸乙苯哌丙酮

【外文名称】Eperisone Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 60 册

药物理化信息

【化学名】4′ - 乙基 - 2 - 甲基 - 3 - 哌啶基苯丙酮盐酸盐

【分子式】$C_{17}H_{25}NO \cdot HCl$

【分子量】295.85

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，有特异的气味，味苦。

本品在水中或甲醇中易溶，在丙酮中极微溶解，在盐酸溶液（9→10）易溶。

熔点：本品的熔点为 168 ~ 174℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】盐酸乙苯哌丙酮是一种能同时作用于中枢神经系统和血管平滑肌，缓和骨骼肌肉紧张并改善血流，从多方面阻断骨骼肌和恶性循环，改善各式各种肌紧张症状的新型药物。

盐酸乙苯哌丙酮主要作用于脊髓，抑制脊髓反射，并作用于中枢神经系统和血管平滑肌，减轻肌梭的灵敏度，从而缓解骨骼肌的紧张。并且，通过扩张血管而显示改善血流的作用，从多方面阻断肌紧张亢进→循环障碍→肌疼痛→肌紧张亢进这种骨骼肌的恶性循环。

通过这些作用，本剂对近年来逐渐增加的各种脑脊髓疾病、颈肩臂综合征、肩周炎、腰痛症等引起的肩酸、颈部疼痛、头痛、眩晕、腰痛、手腿僵直和僵硬等肌紧张症状具有改善作用。

1. 缓解骨骼肌紧张亢进。

（1）抑制实验性强直：可剂量依赖性抑制猫、大白鼠的间切断去丘脑强直（γ - 强直）以及缺血性大脑强直（α - 强直）。

（2）抑制脊髓反射：可剂量依赖性抑制猫脊髓后根的刺激引起的单突触性以及多突触性反射电位。

（3）通过 γ - 系减轻肌梭的灵敏度：可在投药 20 分钟后，抑制从人的肌梭中产生的传入神经（Ⅰa 纤维）的活动。本剂抑制动物的 γ - 运动神经元自发发射，但不直接作用于肌梭。因此，可以认为，本剂借助于 γ - 系减轻肌梭的灵敏度。

2. 改善血流。

（1）血管扩张作用：通过对血管平滑肌的钙离子拮抗作用和肌交感神经抑制作用，可扩张血管。

（2）增加血流作用：增加皮肤、肌肉以及外颈动脉、内颈动脉、椎骨动脉的血流。

3. 具有镇痛以及疼痛反射抑制作用：对大白鼠脊髓痛觉传递物之一的物质 P 具有拮抗作用，以及抑制尾部夹痛（Tail pinch）的疼痛反射。

4. 抗眩晕作用：人体发生肌紧张异常时，会感染眩晕。由于上述作用，本品制剂可使肌紧张异常恢复正常，改善眩晕现象。

5. 对动物不起镇静、催眠作用：对动物未发现有抑制自发作用以及增强戊巴比妥麻醉作用。

6. 使随意运动自如：用于中风患者等痉挛性麻痹病例中，可改善 Cybex 的转矩曲线以及肌电图。在不降低痉挛肌肌力的情况下，使上下肢的伸展、曲折动作轻快顺利，随意运动自如。

本品 LD_{50}（口服）：小鼠 1024mg/kg，SD 大鼠 1300mg/kg；Wistar 大鼠 1850mg/kg。

【药代动力学】 健康成人 1 次/日口服本剂 150mg，连续服 14 天，第 1、第 8 以及第 14 天血浆中浓度的变化（平均）如下：服药后 1.6～1.9 小时达最高浓度（7.5～7.9ng/ml），半衰期为 1.6～1.8 小时，血浆中浓度曲线下面积为 19.7～21.1ng·h/ml。与初次投药时相比较，第 8 天以及第 14 天均未发现显著性变化。

【药物相互作用】 类似药物盐酸甲苯哌丙酮在与甲氧卡巴莫合用时，曾有眼调节障碍出现的报告。

【不良反应】

1. 休克：偶有休克现象，故应注意观察，当出现异常症状时，应停止用药，并采取适当措施。

2. 肝脏：偶有出现肝功能异常，故应对肝功能进行检查等，注意观察，当出现肝功能异常时，应停止用药。

3. 肾脏：偶有出现肾功能异常，故应对肾功能进行检查等，注意观察，当出现肾功能异常时，应停止用药。

4. 血液系统：偶有出现红细胞数、血红蛋白值异常，故应对血液进行检查等，注意观察，当出现异常时，应停止用药。

5. 皮肤：有时会出现发疹、瘙痒等症状。

6. 精神神经系统：有时会出现失眠、头痛、困倦、身体僵硬、四肢麻木、四肢发颤等症状。

7. 消化器官：有时会出现恶心、呕吐、食欲减退、胃部不适、口渴、便秘、腹泻、腹痛、腹部膨胀感、软便、偶会出现口腔炎等症状。

8. 泌尿系统：偶有出现尿闭、尿失禁、残余尿感等症状。

9. 全身症状：有时会出现四肢无力、站立不稳、全身怠倦感。偶有出现头晕、肌紧张减退等症状。

10. 其他：有时会出现颜面发烧、偶有出汗等症状。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸乙哌立松胶囊	化学药	HZ004367
盐酸乙哌立松颗粒	化学药	HZ004368
盐酸乙哌立松片	化学药	HZ004369

HY002409 盐酸异丙嗪

【其他名称】 非那根

【外文名称】 Promethazine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 *N*，*N*，α－三甲基－10*H*－吩噻嗪－10－乙胺盐酸盐

【分子式】 $C_{17}H_{20}N_2S \cdot HCl$

【分子量】 320.89

【性状及组成】 本品为白色或几乎白色的粉末或颗粒；几乎无臭，味苦；在空气中日久变为蓝色。本品在水中极易溶解，在乙醇或三氯甲烷中易溶，在丙酮或乙醚中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 217～223℃，熔融时同时分解。

吸收系数：取本品，精密称定，加 0.01mol/L 盐酸溶液溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 6μg 的溶液，照分光光度法，在 249nm 的波长处测定吸光度，吸收系数为 883～937。

药物药理信息

【药理毒理】 异丙嗪是吩噻嗪类衍生物，属抗组胺药。

1. 抗组胺作用：与组织释放的组胺竞争 H_1 受体，能拮抗组胺对胃肠道、气管、支气管或细支气管平滑肌的收缩或挛缩，能解除组胺对支气管平滑肌的致痉和充血作用。

2. 止呕作用：可能与抑制了延髓的催吐化学感受区有关。

3. 抗晕动症作用：可能通过中枢性抗胆碱性能，作用于前庭和呕吐中枢及中脑髓质感受器，主要是阻断了前庭核区胆碱能突触迷路冲动的兴奋。

4. 镇静催眠作用：有关抑制中枢神经系统的机制尚未确切阐明，可能由于间接降低了脑干网状结构激活系统的应激性。

【药代动力学】 口服或注射给药后吸收快而完全，蛋白结合率高。本品经口服或直肠给药后起效时间为 20 分钟，抗组胺作用一般持续时间为 6～12 小时，镇静作用可持续 2～8 小时。主要在肝内代谢，无活性的代谢物可经尿排出，经粪便排出量少。

注射给药后吸收快而完全，血浆蛋白质结合率高。肌注给药后起效时间为 20 分钟，静注后为 3～5 分钟，抗组胺作用一般持续时间为 6 ～ 12 小时，镇静作用可持续 2 ～ 8 小时。

【药物相互作用】

1．对诊断的干扰：葡萄糖耐量试验中可显示葡萄糖耐量增加。可干扰尿妊娠免疫试验，结果呈假阳性或假阴性。

2．乙醇或其他中枢神经抑制剂，特别是麻醉药、巴比妥类、单胺氧化酶抑制剂或三环类抗抑郁药与本品同用时，可增加异丙嗪或（和）这些药物的效应，用量要另行调整。

3．抗胆碱类药物，尤其是阿托品类和异丙嗪同用时，后者的抗毒蕈碱样效应增加。

4．溴苄铵、胍乙啶等降压药与异丙嗪同时用时，前者的降压效应增强。肾上腺素与异丙嗪同用时肾上腺素的 α 作用可被阻断，使 β 作用占优势。

5．顺铂、巴龙霉素及其他氨基糖苷类抗生素、水杨酸制剂和万古霉素等耳毒性药与异丙嗪同用时，其耳毒性症状可被掩盖。

6．不宜与氨茶碱混合注射。

【药物过量】用量过大的症状和体征有：手脚动作笨拙或行动古怪，严重时倦睡或面色潮红、发热，气急或呼吸困难，心率加快（抗毒蕈碱 M 受体效应），肌肉痉挛，尤其好发于颈部和背部的肌肉。坐卧不宁，步履艰难，头面部肌肉痉挛性抽动或双手震颤（后者属锥体外系的效应）。解救时可对症注射地西泮和毒扁豆碱。必要时给予吸氧和静脉输液。

【不良反应】异丙嗪属吩噻嗪类衍生物，小剂量时无明显不良反应，但大量和长时间应用时可出现吩噻嗪类常见的不良反应。

1．增加皮肤对光的敏感性，多恶梦，易兴奋，易激动，幻觉、中毒性谵妄，儿童易发生锥体外系反应。上述反应发生率不高。

2．下列情况持续存在时应予注意：较常见的有嗜睡；较少见的有视力模糊或色盲（轻度）、头晕目眩、口鼻咽干燥、耳鸣、皮疹、胃痛或胃部不适感、反应迟钝（儿童多见）、恶心或呕吐［进行外科手术和（或）并用其他药物时］，甚至出现黄疸。使用栓剂时可发生直肠烧灼感或刺痛。

3．心血管的不良反应很少见，可见血压增高，偶见血压轻度降低。白细胞减少、粒细胞减少症及再生不良性贫血则属少见。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
阿托品异丙嗪注射液	化学药	HZ000095
氨酚异丙嗪注射液	化学药	HZ000206
对乙酰氨基酚异丙嗪注射液	化学药	HZ000778
复方地巴唑氢氯噻嗪胶囊	化学药	HZ001128
复方桔梗枇杷糖浆	化学药	HZ001237

续表

制剂名称	类别	序号
复方罗布麻片Ⅰ	化学药	HZ001311
复方罗布麻片Ⅱ	化学药	HZ001312
复方三嗪芦丁片	化学药	HZ001365
复方四嗪利血平片	化学药	HZ001398
复方妥洛特罗糖浆	化学药	HZ001417
复方愈创木酚磺酸钾口服溶液	化学药	HZ001481
黄麻嗪胶丸	化学药	HZ001739
氯丙嗪异丙嗪注射液	化学药	HZ002470
小儿复方盐酸妥洛特罗片	化学药	HZ003761
盐酸异丙嗪片	化学药	HZ004370
盐酸异丙嗪注射液	化学药	HZ004371
异丙嗪胆汁片	化学药	HZ004527
愈酚待因口服溶液	化学药	HZ004615
愈酚喷托异丙嗪颗粒	化学药	HZ004618
胆龙止喘片	中成药	ZC000768
复方气管炎胶囊	中成药	ZC001473
复方气管炎片	中成药	ZC001474
化痰平喘片	中成药	ZC002226
咳喘膏	中成药	ZC003025
罗己降压片	中成药	ZC003443
珠贝定喘丸	中成药	ZC007490

HY002410　盐酸异丙肾上腺素

【外文名称】Isoprenaline Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】4－［（2－异丙氨基－1－羟基）乙基］－1，2－苯二酚盐酸盐

【分子式】$C_{11}H_{17}NO_3 \cdot HCl$

【分子量】247.72

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶性粉末，无臭，味微苦；遇光和空气渐变色，在碱性溶液中更易变色。本品在水中易溶，在乙醇中略溶，在三氯甲烷或乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为 165.5～170℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】本品为 β－受体激动剂，对 β_1 和

β_2－受体均有强大的激动作用，对 α－受体几乎无作用。主要作用：①作用于心脏 β_1－受体，使心收缩力增强，心率加快，传导加速，心输出量和心肌耗氧量增加。②作用于血管平滑肌 β_2－受体，使骨骼肌血管明显舒张，肾、肠系膜血管及冠脉亦不同程度舒张，血管总外周阻力降低。其心血管作用导致收缩压升高，舒张压降低，脉压差变大。③作用于支气管平滑肌 β_2－受体，使支气管平滑肌松弛。④促进糖原和脂肪分解，增加组织耗氧量。

【药代动力学】静注后，作用维持不到 1 小时。$t_{1/2}$根据注射的快慢为 1 分钟至数分钟。静注后约 40%～50%以原形排出。

【药物相互作用】

1．与其他拟肾上腺素药物合用可增效，但不良反应也增多。

2．并用普萘洛尔时本品的作用受到拮抗。

【不良反应】常见的不良反应有：口咽发干、心悸不安；少见的不良反应有：头晕、目眩、面潮红、恶心、心率增速、震颤、多汗、乏力等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方盐酸异丙肾上腺素气雾剂	化学药	HZ001466
盐酸异丙肾上腺素片	化学药	HZ004372
盐酸异丙肾上腺素气雾剂	化学药	HZ004373
盐酸异丙肾上腺素注射液	化学药	HZ004374

HY002411 盐酸英地卡尼

【其他名称】DECABID、Ricainide

【外文名称】Indecainide Hydrocholride

药物药理信息

【药理毒理】本品是阿普林定衍生物，能减慢房室结、希－浦系统和心室肌传导，对心房或心室肌不应期影响不明显。有效血药浓度为 300～900mg/L。临床用于室性早搏和潜在恶性心律失常患者。

【不良反应】长期口服有头昏、唇舌麻木、视力模糊、复视、腹泻、头痛和神经错乱等。

HY002412 盐酸罂粟碱

【其他名称】帕帕非林

【外文名称】Papaverine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】1－［（3,4－二甲氧基苯基）甲基］－6,7－二甲氧基异喹啉盐酸盐

【分子式】$C_{20}H_{21}NO_4 \cdot HCl$

【分子量】375.85

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭。本品在三氯甲烷中溶解，在水中略溶，在乙醇中微溶，在乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】罂粟碱对血管、心脏或其他平滑肌有直接的非特异性松弛作用，其作用可能是抑制环核苷酸磷酸二酯酶所致。

【药代动力学】口服易吸收，但差异大，生物利用度约 54%。蛋白结合率近 90%。$t_{1/2}$为 0.5～2 小时，但有时也长达 24 小时。主要在肝内代谢为 4－羟基罂粟碱葡萄糖醛酸盐。一般以代谢产物形式由肾排泄。可经透析被清除。

【药物相互作用】

1．与左旋多巴同用时可减弱后者的疗效，本品能阻滞多巴胺受体。

2．吸烟时因烟碱作用，本品的疗效降低。

【不良反应】

1．用药后出现黄疸，眼及皮肤明显黄染，提示肝功能受损。

2．过量时有视力模糊、复视、嗜睡或（和）软弱。

3．胃肠道外给药可引起注射部位发红、肿胀或疼痛。快速胃肠道外给药可使呼吸加深、面色潮红、心跳加速、低血压伴眩晕。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸罂粟碱氯化钠注射液	化学药	HZ004375
盐酸罂粟碱片	化学药	HZ004376
盐酸罂粟碱注射液	化学药	HZ004377
注射用盐酸罂粟碱	化学药	HZ005114
肛泰	中成药	ZC001767

HY002413 盐酸组氨酸

【其他名称】L－Histidine Hydrochloride、L－组氨酸盐酸盐

【外文名称】Histidine Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】2－氨基－3－（1*H*－咪唑－4）－丙

酸盐酸盐一水合物

【分子式】$C_6H_9N_3O_2 \cdot HCl \cdot H_2O$

【分子量】209.63

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，味微酸苦。

本品在水中易溶，在乙醇、三氯甲烷或乙醚中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加 6mol/L 盐酸溶液溶解并稀释成每 1ml 中约含 0.11g 的溶液，依法测定，比旋度为 +8.5°至 +10.5°。

药物药理信息

【药理毒理】氨基酸类药。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方氨基酸注射液（17AA－Ⅰ）	化学药	HZ001059

HY002414　盐酸左布比卡因

【外文名称】Levobupivacaine Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】（*S*）－1－丁基－*N*－（2,6－二甲苯基）－2－哌啶甲酰胺盐酸盐一水合物

【分子式】$C_{18}H_{28}N_2O \cdot HCl \cdot H_2O$

【分子量】342.91

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：左布比卡因为酰胺类局麻药，可以升高神经动作电位的阈值，延缓神经冲动的扩散，降低动作电位升高的速度，从而阻断神经冲动的产生和传导。麻醉作用的产生与神经纤维的轴径、髓鞘形成和传导速度有关。

2．毒理作用

（1）遗传毒性：细菌突变试验、小鼠淋巴瘤突变试验、人淋巴细胞染色体畸变试验和小鼠骨髓微核试验均未发现左布比卡因具有致突变作用。

（2）生殖毒性：给予大鼠左布比卡因 18mg/（kg·d）（按体表面积折算，剂量约为最大临床剂量的一半），未见亲代和子代动物的生育力受到影响。给予哺乳期大鼠左布比卡因，幼仔体内可检测到少量药物。

【药代动力学】硬膜外给药后约 30 分钟血药浓度达峰值，剂量为 150mg 时平均 C_{max} 达到 1.2μg/ml，本品在血药浓度为 0.1～1μg/ml 时，约有 97% 与血浆蛋白结合，在 0.01～0.1μg/ml 与人的血细胞结合为 0～2%，在血药浓度为 10μg/ml 时与血细胞结合增加到 32%。静脉给药后，左布比卡因分布容积为 67L。左布比卡因在肝脏代谢降解，在尿、便中难以查到原形药物。在体内生物半衰期为 3.3 小时，血浆清除率为 39L/h，血浆消除半衰期为 1.3 小时。

【药物相互作用】体外试验表明吗啡、芬太尼、可乐定、舒芬太尼对左布比卡因的氧化代谢无抑制作用。然而，这些药物中没有一个是 CYP3A4 或 CYP1A2 同型物的抑制剂，虽然还未进行临床研究，但有可能左布比卡因的代谢机制受已知的 CYP3A4 诱导剂（如苯妥英钠、苯巴比妥、利福平等）、CYP3A4 抑制剂，CYP1A2 诱导剂（奥美拉唑等）和 CYP1A2 抑制剂的影响。

【药物过量】重在预防，最好分次注射左布比卡因的剂量，每注射后或滴注过程中，密切观察病人的生命指针和意识状态，一但有变化，应及时给予氧气吸入。

一但发生肺通气不足或鞘内误注射药物导致的呼吸停止，应立即建立人工气道或使呼吸道保持通畅，以 100% 氧气控制通气或辅助通气。

如发生惊厥，须静脉注射盐酸巴比妥、抗惊厥药或肌肉松弛药止惊，但须在有经验的医师指导下用这些药物。在保证有效肺通气的同时，迅速估计循环功能，循环衰竭时，要静注补液，如有必要，使用升血压药。

抢救局部麻醉药中毒的足月孕妇有特殊困难，增大的子宫会压迫下腔静脉，加重循环衰竭。这时应使孕妇采取左侧卧位，或将子宫向左侧推移，解除对腔静脉的压迫。产妇的复苏要比其他病人困难，心脏按压往往效果不佳，应尽快分娩或取出胎儿，以使复苏容易成功。

【不良反应】低血压、恶心、发热、呕吐、贫血、瘙痒、疼痛、头痛、便秘、眩晕、胎儿窘迫等，偶见哮喘、水肿、少动症、不随意肌收缩、痉挛、震颤、晕厥、心律失常、期外收缩、房颤、心搏停止、肠梗阻、胆红素升高、意识模糊、窒息、支气管痉挛、呼吸困难、肺水肿、呼吸功能不全、多汗、皮肤变色等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸左布比卡因注射液	化学药	HZ004380

HY002415　盐酸左布诺洛尔

【外文名称】Levobunolol Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】（－）－5－［3－叔丁氨基－2－羟丙氧基］－3，4－二氢－1－（2*H*）萘酮盐酸盐

【分子式】$C_{17}H_{25}NO_3 \cdot HCl$

【分子量】327.85

药物药理信息

【药理毒理】1. 药理作用

（1）左布诺洛尔为非选择性 β－肾上腺受体阻断剂，对 β_1 和 β_2－受体均有阻断作用。左布诺洛尔的阻断受体作用比它的右旋异构体强 60 倍，但直接心肌抑制作用相同，因此左旋异构体－左布诺洛尔被采用。左布诺洛尔无明显局麻作用及内在拟交感作用。

（2）盐酸左布诺洛尔滴眼液，对高眼压及正常眼压患者均有降眼压作用，降眼压效果与 timolol 相同，最大降眼压幅度为 7mmHg。

（3）本品的降眼压机制主要是减少房水生成，本品对房水经葡萄膜巩膜外流、房水流出易度及巩膜上静脉压无影响。

2. 非临床毒理研究

（1）致癌性：动物实验显示长期大量口服盐酸左布诺洛尔可使雌性小鼠良性平滑肌瘤、雄性大鼠良性肝部肿瘤发生率明显增高。

（2）致突变性：体内外动物实验未显示盐酸左布诺洛尔有致突变活性。

（3）生殖毒性：动物实验显示大剂量口服盐酸左布诺洛尔，对雄、雌性小鼠的生殖功能均无影响。

【药代动力学】滴用本品 1 小时内可检测到其药物作用，2～6 小时作用达高峰，一次用药后药物作用可维持 24 小时。药理作用维持时间长是本品最大优点，其机制为主药左旋丁萘酮洛尔的血浆半衰期较长，为 6 小时，而其主要代谢产物二氢丁萘酮洛尔与主药有相同的降眼压效应，且半衰期更长，达 7 小时。

【药物相互作用】

1. 与肾上腺素合用可引起瞳孔扩大。

2. 正在服用儿茶酚胺耗竭药（如利血平）者，使用本品时应严密观察，因可引起低血压和明显的心动过缓，后者可引起头晕，晕厥或直立性低血压。

3. 不主张两种局部 β－受体阻断剂同时应用。

4. 本品与钙通道拮抗剂合用应慎重，因可引起房室传导阻滞，左心室衰竭及低血压。对心功能受损的患者，应避免两种药合并使用。

5. 本品与洋地黄类和钙通道拮抗剂合用可进一步延长房室传导时间。

6. 吩噻嗪类药物可增加 β－受体阻断剂的降血压作用，因可使相互的代谢途径受到抑制。

【药物过量】尚未见过量应用本品的报道。

【不良反应】1/3 的患者出现暂时性眼灼烧感及眼刺痛。5%的患者出现结膜炎。一些患者出现心率减慢及血压下降。

1. 其他少见不良反应有：心率变化，呼吸困难，虹膜睫状体炎，头痛，头晕，一过性共济失调，嗜睡，瘙痒及荨麻疹。

2. 应用本品还有以下非常罕见不良反应。全身症状：无力，胸痛。心血管系统：心动过缓，心律失常，低血压，晕厥，心传导阻滞，脑血管意外，脑缺血，心衰，心绞痛，心悸，心搏停止。消化系统：恶心，腹泻。神经系统：抑郁，精神错乱，加重重症肌无力的症状，感觉异常。皮肤：过敏反应，包括局部和全身疹，脱发，Stevens－Johnson 综合征。呼吸系统：支气管痉挛，呼吸衰竭，呼吸困难，鼻腔充血。内分泌系统：掩盖糖尿病患者应用胰岛素或降糖药后的低血糖症状。泌尿生殖器系统：阳痿。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸左布诺洛尔滴眼液	化学药	HZ004381

HY002416 盐酸左卡巴斯汀

【外文名称】Levocabastine Hydrochloride

药物药理信息

【药理毒理】本品为强效、速效和具有高度选择性的组胺 H_1 受体拮抗剂。与 H_1 受体的亲和力大于组胺，可消除组胺与 H_1 受体而产生的过敏症状。局部用于鼻部，几乎立即起效，消除过敏性鼻炎打喷嚏、鼻痒、流鼻涕等症状，可持续数小时。本品无中枢镇静作用，对精神运动活动无影响，不影响用药者驾驶和操作机器的能力。

【药代动力学】本品鼻喷雾剂鼻内每喷 1 次，约有 30～40μg 的左卡巴斯汀被吸收，主要以原形药由尿排出（70%），血浆 $t_{1/2}$ 约 35～40 小时。

【不良反应】本品鼻喷雾剂偶有暂时而轻微的局部刺激（鼻刺痛和烧灼感），罕见变态反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸左卡巴斯汀鼻喷剂	化学药	HZ004382

HY002417 盐酸左西替利嗪

【外文名称】Levocetirizine Hydrochloride

药物理化信息

【化学名】*R*－（－）2－［2－［4－［4－（氯苯基）苯甲基］－1－哌嗪基］乙氧基］乙酸二盐酸盐

【分子式】$C_{21}H_{25}ClN_2O_3 \cdot 2HCl$

【分子量】461.80

药物药理信息

【药理毒理】本品为口服选择性组胺 H_1 受体拮抗剂。无明显抗胆碱和抗 5－羟色胺作用，中枢抑制作用较小。

毒理研究遗传毒性：本品 Ames 试验、人淋巴细胞染色体畸变试验、小鼠淋巴瘤试验和大鼠微核试验结果均为阴性。

生殖毒性：小鼠生育力和一般生殖毒性试验结果提示，西替利嗪经口给药剂量达 64mg/kg（按体表面积折算，约相当于成人临床推荐最大日口服剂量的 25 倍）时，对生育力无损伤。小鼠、大鼠和兔经口给药剂量分别达 96、225 和 135mg/kg（按体表面积折算，分别约相当于成人临床推荐最大日口服剂量的 40、180 和 220 倍）时，均未见致畸作用。但目前尚无充分和严格控制的孕妇临床研究资料。由于动物生殖研究并不总能预测药物对人的影响，所以只有当确实需要时，才可以在怀孕期间服用本品。哺乳期小鼠（母鼠）经口给药剂量达 96mg/kg（按体表面积折算，约相当于成人临床推荐剂量大日口服剂量的 40 倍）时，可引起仔鼠体重增长延迟。Beagie 犬的研究表明，给药量的大约 3%经乳汁排泄。

致癌性：大鼠连续 2 年经口给药的致癌性试验中，剂量达 20mg/kg（按体表面积折算，约相当于成人临床推荐最大日口服剂量的 15 倍，或儿童临床推荐最大日剂量的 10 倍）时，未见致癌性。小鼠连续 2 年经口给药的致癌性试验中，剂量达 16mg/kg（按体表面积折算，约相当于成人临床推荐最大日口服剂量的 6 倍，或儿童临床推荐最大日剂量的 4 倍）时，可引起雄性动物良性肝肿瘤的发生率增加；剂量为 4mg/kg（按体表面积折算，约相当于成人临床推荐最大日口服剂量的 2 倍，或儿童临床推荐最大日剂量）时，未见肝肿瘤发生率的增加。上述发现的临床意义尚不清楚。

【药代动力学】口服吸收迅速，达峰时间 0.7～1 小时，生物利用度 > 96%，与食物同服可使本品的达峰时间轻度延长，峰浓度降低（约 20%）。1 小时起效，疗效可持续 24 小时。本品的蛋白结合率为 96%，平均表观分布容积 26.9L，在脑中的浓度低于血浆浓度的 1/10，本品不经过肝脏代谢，消除半衰期 7～8 小时，绝大多数以原形药物形式经肾脏排泄，尿中排泄量占 85%，粪便中占 13%。

【药物相互作用】尚无使用本品进行药物相互作用的研究。消旋西替利嗪与伪麻黄碱、西咪替丁、酮康唑、红霉素、阿奇霉素、格列吡嗪和地西泮间无相互作用。

【药物过量】本品无特效拮抗剂，严重超量服用本品应立即洗胃。

【不良反应】本品耐受性良好，不良反应轻微且多可自愈，常见不良反应有嗜睡、口干、头痛、乏力等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸左西替利嗪分散片	化学药	HZ004383
盐酸左西替利嗪胶囊	化学药	HZ004384
盐酸左西替利嗪片	化学药	HZ004385

HY002418　盐酸左旋咪唑

【外文名称】Levamisole Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（*S*）－（－）－6－苯基－2，3，5，6－四氢咪唑并［2，1－b］噻唑盐酸盐

【分子式】$C_{11}H_{12}N_2S \cdot HCl$

【分子量】240.76

【性状及组成】本品为白色或类白色的针状结晶或结晶性粉末，无臭，味苦。本品在水中极易溶解，在乙醇中易溶，在三氯甲烷中微溶，在丙酮中极微溶解。

熔点：本品的熔点为 225～230℃。

比旋度：取本品适量，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 5mg 的溶液。依法测定，比旋度为不低于 －121.5°。

药物药理信息

【药理毒理】本品为四咪唑的左旋体，可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，减少能量产生。当虫体与之接触时，能使神经肌肉去极化，肌肉发生持续收缩而致麻痹；药物的拟胆碱作用有利于虫体的排出。其活性约为四咪唑（消旋体）的 1～2 倍，但毒性及不良反应则较低。另外，药物对虫体的微管结构可能有抑制作用。左旋咪唑还有免疫调节和免疫兴奋功能。

【药代动力学】口服后迅速吸收，服用 150mg 后 2 小时内，血药浓度达峰值（500mg/ml），$t_{1/2}$ 为 4 小时。在肝内代谢，本品及其代谢产物可自尿（大部分）、粪和呼吸道排出，乳汁中亦可测得。

【药物相互作用】

1．与噻嘧啶合用可治疗严重的钩虫感染，并可提高驱除美洲钩虫的效果。

2．与噻苯哒唑合用可治疗肠道线虫混合感染。

3．与枸橼酸乙胺嗪先后顺序应用可治疗丝虫感染。

4．不宜与四氯乙烯合用，以免增加其毒性。

【不良反应】一般轻微。有恶心、呕吐、腹痛等，少数可出现味觉障碍、疲惫、头晕、头痛、关节酸痛、神志混乱、失眠、发热、流感样症群、血压降低、脉管炎、皮疹、光敏性皮炎等，偶见蛋白尿，个别可见粒细胞减少、血小板减少，少数甚至发生粒细胞缺乏症（常为可逆性），常发生于风湿病或肿瘤患者。另尚可引起即发型和 Arthus 过敏反应，可能系通过刺激 T 细胞而引起的特应性反应。个体病例可出现共济失调，感觉异常或视力模糊。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方甲苯咪唑片	化学药	HZ001220
复方甲苯咪唑乳膏	化学药	HZ001221
盐酸左旋咪唑宝塔糖	化学药	HZ004386
盐酸左旋咪唑搽剂	化学药	HZ004387
盐酸左旋咪唑肠溶片	化学药	HZ004388
盐酸左旋咪唑颗粒	化学药	HZ004389
盐酸左旋咪唑片	化学药	HZ004390
盐酸左旋咪唑栓	化学药	HZ004391
盐酸左旋咪唑糖浆	化学药	HZ004392
盐酸左旋咪唑丸	化学药	HZ004393
复方鹤鸽菜散	中成药	ZC001622

HY002419 盐酸左氧氟沙星

【外文名称】Levofloxacin Hydrochloride

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2000 年版·2004 年增补本

药物理化信息

【化学名】（*S*）－9－氟－2，3－二氢－3－甲基－10－（4－甲基－1－哌嗪基）－7－氧代－7*H*－吡啶并［1,2,3－*de*］－［1，4］苯并噁嗪－6－羧酸盐酸盐的水合物

【分子式】$C_{18}H_{20}FN_3O_4 \cdot HCl \cdot H_2O$

【分子量】415.85

药物药理信息

【药理毒理】本品具有广谱抗菌作用，抗菌作用强，对多数肠杆菌科细菌，如大肠埃希菌、克雷伯菌属、变形杆菌属、沙门菌属、志贺菌属和流感嗜血杆菌、嗜肺军团菌、淋病奈瑟菌等革兰阴性菌有较强的抗菌活性。对金黄色葡萄球菌、肺炎链球菌、化脓性链球菌等革兰阳性菌和肺炎支原体、肺炎衣原体也有抗菌作用，但对厌氧菌和肠球菌的作用较差。

本品为氧氟沙星的左旋体，其体外抗菌活性约为氧氟沙星的 2 倍。其作用机制是通过抑制细菌 DNA 旋转酶的活性，阻止细菌 DNA 的合成和复制而导致细菌死亡。

【药代动力学】口服后吸收完全，单剂量口服 0.2g 后，血药峰浓度约为 1.6mg/L，达峰时间约为 1 小时。血消除半衰期约为 6 小时。蛋白结合率约为 30%～40%。

本品吸收后广泛分布至各组织、体液，在扁桃体、前列腺组织、痰液、泪液、妇女生殖道组织、皮肤和唾液等组织和体液中的浓度与血药浓度之比约在 1.1～2.1 之间。

本品主要以原形自肾排泄，在体内代谢甚少。48 小时内尿中排出量约为给药量的 80%～90%。本品以原形自粪便中排出少量，给药后 72 小时内累积排出量少于给药量的 4%。

国外资料单次静注左氧氟沙星 0.3g 和相同剂量口服给药的药代动力参数相似，多剂量静注研究中（0.3g 每日 2 次静脉滴注，共 6 天），其血药浓度于 24～48 小时达稳态，首次及末次剂量后的血药峰浓度分别为 5.35 和 6.12μg/ml，表明无明显蓄积。肾功能减退的患者左氧氟沙星清除率下降，清除半衰期延长，为避免药物蓄积，应进行剂量调整。血液透析和连续腹膜透析不影响左氧氟沙星从体内排除。

【药物相互作用】

1．尿碱化剂可减低本品在尿中的溶解度，导致结晶尿和肾毒性。

2．喹诺酮类抗菌药与茶碱类合用时可能由于与细胞色素 P450 结合部位的竞争性抑制，导致茶碱类的肝消除明显减少，血消除半衰期延长，血药浓度升高，出现茶碱中毒症状，如恶心、呕吐、震颤、不安、激动、抽搐、心悸等。本品对茶碱的代谢虽影响较小，但合用时仍应测定茶碱类血药浓度和调整剂量。

3．本品与环孢素合用，可使环孢素的血药浓度升高，必须监测环孢素血浓度，并调整剂量。

4．本品与抗凝药华法林合用时虽对后者的抗凝作用增强较小，但合用时也应严密监测患者的凝血

酶原时间。

5. 丙磺舒可减少本品自肾小管分泌约50%，合用时可因本品血浓度增高而产生毒性。

6. 本品可干扰咖啡因的代谢，从而导致咖啡因消除减少，血消除半衰期延长，并可能产生中枢神经系统毒性。

7. 含铝、镁的制酸药、铁剂均可减少本品的口服吸收，不宜合用。

8. 本品与非甾体类抗炎药芬布芬合用时，偶有抽搐发生，因此不宜与芬布芬合用。

9. 与口服降血糖药同时使用时可能引起血糖失调，包括高血糖及低血糖，因此用药过程中应注意监测血糖浓度，一旦发生低血糖时应立即停用本品，并给予适当处理。

【药物过量】左氧氟沙星无法通过血液透析或腹膜透析被有效地排除。

【不良反应】

1. 胃肠道反应：腹部不适或疼痛、腹泻、恶心或呕吐。

2. 中枢神经系统反应可有头昏、头痛、嗜睡或失眠。

3. 过敏反应：皮疹、皮肤瘙痒，偶可发生渗出性多形性红斑及血管神经性水肿。光敏反应较少见。

4. 偶可发生：①癫痫发作、精神异常、烦躁不安、意识混乱、幻觉、震颤；②血尿、发热、皮疹等间质性肾炎表现；③静脉炎；④结晶尿，多见于高剂量应用时；⑤关节疼痛。

5. 少数患者可发生血清氨基转移酶升高、血尿素氮增高及血常规白细胞降低，多属轻度，并呈一过性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸左氧氟沙星滴眼液	化学药	HZ004394
盐酸左氧氟沙星分散片	化学药	HZ004395
盐酸左氧氟沙星胶囊	化学药	HZ004396
盐酸左氧氟沙星氯化钠注射液	化学药	HZ004397
盐酸左氧氟沙星片	化学药	HZ004398
盐酸左氧氟沙星葡萄糖注射液	化学药	HZ004399
盐酸左氧氟沙星软膏	化学药	HZ004400
盐酸左氧氟沙星眼用凝胶	化学药	HZ004401
盐酸左氧氟沙星注射液	化学药	HZ004402
注射用盐酸左氧氟沙星	化学药	HZ005115

HY002420　眼镜蛇毒神经毒素

【其他名称】科博肽、克痛宁、眼镜蛇神经毒蛋白

【外文名称】Cobratoxin

【分子量】7000.00

【性状及组成】眼镜蛇毒神经毒素由68个氨基组成的单链多肽，四个二硫键维系其空间结构。

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理：眼镜蛇毒神经毒素与N型乙酰胆碱受体有高度的亲和力，能阻止神经肌肉接头神经冲动信号的传递。影响试验动物脑内乙酰胆碱的代谢，并能提高人、鼠脑内脑啡肽的含量，其镇痛作用可能与此有关。本品长期应用无依赖性和耐受性；动物实验结果显示：本品与吗啡、度冷丁等阿片类药物无交叉耐受现象。可完全替代吗啡等阿片类药物用于晚期癌痛等重度疼痛的治疗。

2. 毒理：由于本品能阻断神经肌肉信号冲动的传递，超大剂量时有箭毒样作用，可使呼吸肌麻痹。胆碱酯酶抑制剂等可迅速逆转此作用。

【药物相互作用】本品与吗啡、度冷丁等阿片药物及布洛芬、双氯芬酸等非甾体类解热镇痛药物有协同增效作用；但毒性并无增加。

阿托品等M型受体阻断药、抗胆碱酯酶药物能完全拮抗其镇痛作用；骨骼肌松弛药可增强其呼吸肌麻痹作用，这几类药物不能与本品同时使用。

【药物过量】连续超量用药可能引起呼吸抑制，此时应停药并用胆碱酯酶抑制剂（如新斯的明）缓解。

【不良反应】

1. 个别人有口干、头晕、恶心症状，一般不需特殊处理。

2. 个别人初用时疼痛可能短时加重，继续用药即可显效。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
科博肽注射液	化学药	HZ002086
科洛曲片	化学药	HZ002087
注射用科博肽	化学药	HZ004837

HY002421　羊角拗苷

【其他名称】地伐西、Divaricoside

【外文名称】Divaside

【性状及组成】本品是从国产植物产羊角拗种子中提出的混合强心苷，主要成分为羊角拗苷甲、乙。

药物药理信息

【药理毒理】本品强心效价 1mg 相当哇巴因 0.4mg。作用及用途同毒毛花苷 K。由于易为肠道破坏，故给药以静注为宜。其作用既快又强，不易产生蓄积作用。

HY002422 羊毛脂

【外文名称】Lanolin

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】无水羊毛脂

【性状及组成】本品为淡黄色或棕黄色的软膏状物；有黏性而滑腻；臭微弱而特异。

本品在三氯甲烷或乙醚中易溶，在热乙醇中溶解，在乙醇中极微溶解，在水中不溶；但能与约 2 倍量的水均匀混合。

熔点：本品的熔点为 36～42℃。

酸值：本品的酸值不大于 1.5。

皂化值：本品的皂化值为 92～106（测定时加热回流时间为 2 小时）。

碘值：本品的碘值为 18～35（测定时在暗处放置时间为 4 小时）。

由于羊毛脂是从不同地域的来源中获得的天然产品，其物理特征，如颜色、稠度、碘值、皂化值和羟基值等，可能会由于不同来源而不同。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料，软膏基质。

羊毛脂可作为疏水性载体，用于油包水乳膏及软膏剂的制备。当与适宜的植物油或凡士林混合时，通过延迟、而不是完全阻止水分透过表皮层来维持皮肤通常的含水量（10%～30%），产生润肤作用，并能穿透皮肤，从而促进药物的吸收。羊毛脂与其约 2 倍量的水混合不分离，所形成的乳剂在贮藏时不宜酸败。

羊毛脂广泛应用于外用药物制剂和化妆品。

【药物相互作用】羊毛脂可能含助氧化剂，因而可能会影响某些活性药物的稳定性。

【不良反应】通常认为羊毛脂是无毒和无刺激性材料，但羊毛脂及其衍生物有时对皮肤有致敏反应。对羊毛脂敏感的个体应避免使用。本品因具有令人不愉快的羊膻气味，用量不宜过多。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
醋酸氯己定软膏	化学药	HZ000587
貂胰防裂软膏	民族药	MZ000093
肤舒止痒膏	民族药	MZ000148
复方木芙蓉涂鼻膏	民族药	MZ000164
日晒防治膏	民族药	MZ000451
丹芎跌打膏	中成药	ZC000755
风寒止痛膏	中成药	ZC001079
复方双金痔疮膏	中成药	ZC001524
骨健灵膏	中成药	ZC001856
苦参栓	中成药	ZC003102
扭伤膏	中成药	ZC003730
伤疖膏	中成药	ZC004612
烧烫伤膏	中成药	ZC004649
田七镇痛膏	中成药	ZC005479
小儿止泻贴	中成药	ZC006369
熊胆跌打膏	中成药	ZC006519
愈伤膏	中成药	ZC007116
晕宁软膏	中成药	ZC007175
治伤软膏	中成药	ZC007431

HY002423 洋地黄毒苷

【外文名称】Digitoxin

药物管理信息

【特殊管理分类】医疗用毒性药品

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】3β－［（*O*－2，6－二脱氧－β－D－核－己吡喃糖基－（1→4）－*O*－2,6－二脱氧－β－D－核－己吡喃糖基－（1→4）－2,6－二脱氧－β－D－核－己吡喃糖基）氧代］－14β－羟基－5β－心甾－20（22）烯内酯

【分子式】$C_{41}H_{64}O_{13}$

【分子量】764.95

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶性粉末，无臭。

本品在三氯甲烷中略溶，在乙醇或乙醚中微溶，在水中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】

1．正性肌力作用：本品选择性地与心肌细胞膜

$Na^+ - K^+ + ATP$ 酶结合而抑制该酶活性，使心肌细胞膜内外 $Na^+ - K^+$ 主动偶联转运受损，心肌细胞内 Na^+ 浓度升高，从而使肌膜上 $Na^+ - Ca^{2+}$ 交换趋于活跃，使细胞浆内 Ca^{2+} 增多，肌浆网内 Ca^{2+} 储量亦增多，心肌兴奋时，有较多的 Ca^{2+} 释放；心肌细胞内 Ca^{2+} 浓度增高，激动心肌收缩蛋白从而增加心肌收缩力。

2. 负性频率作用：由于其正性肌力作用，使衰竭心脏心排出量增加，血流动力学状态改善，消除交感神经张力的反射性增高，并增强迷走神经张力，因而减慢心率、延缓房室传导。此外，小剂量时提高窦房结对迷走神经冲动的敏感性，可增强其减慢心率作用。由于其负性频率作用，使舒张期相对延长，有利于增加心肌供血；大剂量（通常接近中毒量）则可直接抑制窦房结、房室结和希氏束而呈现窦性心动过缓和不同程度的房室传导阻滞。

3. 心脏电生理作用：通过对心肌电活动的直接作用和对迷走神经的间接作用，降低窦房结自律性；提高普肯野纤维自律性；减慢房室结传导速度，延长其有效不应期，导致房室结隐匿性传导增加，可减慢心房纤颤或心房扑动的心室率；由于本药缩短心房有效不应期，当用于房性心动过速和房扑时，可能导致心房率的加速和心房扑动转为心房纤颤；缩短普肯野纤维有效不应期。

【药代动力学】 口服几乎能完全吸收（96%以上）。生物利用度高达 90%以上，口服后 1～4 小时起效，8～14 小时作用达峰，持续约 14 天。静注后 0.5 小时起效，4～8 小时达最大效应。由于有较大蓄积作用，可能引起洋地黄中毒。治疗血药浓度为 13～25mg/ml，半衰期为 120～216 小时。

本品向组织分布慢而广泛，以肾、心肌浓度最高，骨骼肌内浓度虽低于心肌浓度，但因骨骼肌占身体重量 40%，故骨骼肌内含药量最多。本品血浆蛋白结合率达 97%。表观分布容积为 0.5L/kg。

本品主要经肝微粒体酶代谢清除，故肝微粒体酶诱导剂可促进其代谢。代谢速率存在个体差异，清除半衰期长短有差异，一般为 4～7 天，经肾排泄量 20%～30%。本品吸收后部分进入肝肠循环经胆道排泄入肠，再由肠道吸收，故其原形随粪排出量仅 10%～20%。肝功不良时，其肝外消除途径增强，故清除半衰期稍延长。洋地黄毒苷中毒浓度为 > 35ng/ml。

【药物相互作用】

1. 与两性霉素 B、皮质激素或失钾利尿剂如布美他尼、依他尼酸等同用时，可引起低血钾而致洋地黄中毒。

2. 与制酸药（尤其三硅酸镁）或止泻吸附药如白陶土、果胶、考来烯胺和其他阴离子交换树脂、柳氮磺吡啶或新霉素、对氨基水杨酸同用时，可抑制洋地黄强心苷吸收而导致强心苷作用减弱。

3. 与抗心律失常药、钙盐注射剂、可卡因、泮库溴胺、萝芙木碱、琥珀胆碱或拟肾上腺素类药同用时，可因作用相加而导致心律失常。

4. 有严重或完全性房室传导阻滞且伴正常血钾者的洋地黄化患者不应同时应用钾盐，但噻嗪类利尿剂与本品同用时，常须给予钾盐，以防止低钾血症。

5. β－受体阻滞剂与本品同用，有导致房室传导阻滞发生严重心动过缓的可能，应重视。但并不排除 β－受体阻滞剂用于洋地黄不能控制心室率的室上性快速心律失常。

6. 与奎尼丁同用，可使本品血药浓度提高约 1 倍，提高程度与奎尼丁用量相关，甚至可达到中毒浓度，即使停用洋地黄，其血药浓度仍继续上升，这是奎尼丁从组织结合处置换出洋地黄，减少其分布容积之故。两药合用时应酌减洋地黄用量 1/2～1/3。

7. 与维拉帕米、地尔硫䓬、胺碘酮合用，由于降低肾及全身对洋地黄的清除率而提高其血药浓度，可引起严重心动过缓。

8. 螺内酯可延长本品半衰期，需调整剂量或给药间期，随访监测本品的血药浓度。

9. 血管紧张素转换酶抑制剂及其受体拮抗剂可使本品血药浓度增高。

10. 依酚氯胺与本品合用可致明显心动过缓。

11. 吲哚美辛可减少本品的肾清除，使本品半衰期延长，有中毒危险，需监测血药浓度及心电图。

12. 与肝素同用，由于本品可能部分抵消肝素的抗凝作用，需调整肝素用量。

13. 洋地黄化时静脉用硫酸镁应十分谨慎，尤同时静注钙盐时，可发生心脏传导阻滞。

14. 红霉素由于改变胃肠道菌群，可增加本品在胃肠道的吸收。

15. 甲氧氯普胺因促进肠道运动而减少洋地黄的生物利用度约 25%。普鲁本辛因抑制肠道蠕动而提高洋地黄生物利用度约 25%。

16. 应用强心苷期间，或停用后 7 天以内，忌用肾上腺素、麻黄碱及其类似药物，因为这些药物可能增加强心苷的毒性。

17. 利血平可增加洋地黄对心脏的毒性反应，引起心律失常，对洋地黄毒苷则使其排泄增加，故二者与利血平合用时须加警惕。

【药物过量】

1. 若地高辛血药浓度 > 2.0～2.5ng/ml，应警惕地高辛药物过量或毒性反应。

2. 患者在2~3周之前服用过任何洋地黄制剂，宜予小剂量给药，以免中毒。

3. 强心苷剂量计算应按标准体重，因脂肪组织不摄取强心苷。

4. 推荐剂量只是平均剂量，必须按照患者需要调整每次剂量。

5. 肝功能不全者，应选用不以肝脏代谢为主的洋地黄制剂。

6. 肾功能不全者，应选用主要经肾脏排泄的洋地黄制剂。

7. 应用洋地黄患者对电复律极为敏感，应高度警惕。

8. 透析不能从体内迅速去除本品。

9. 在本品引起严重或完全性房室传导阻滞时，不宜补钾。

10. 肾功能不全、老年及虚弱者在常用剂量及血药浓度时就可有中毒反应。婴幼儿尤其是早产儿和发育不全儿，要在血药浓度及心电监测下调整剂量。

11. 当患者由强心苷注射液改为本品时，为补偿药物间药动学差别，需要调整剂量。

12. 应静脉给药，因为肌内注射有明显局部反应，且作用慢、生物利用度差。

13. 本品过量及毒性反应的处理：轻度中毒者，停用本品及利尿治疗，如有低钾血症而肾功能尚好，可给以钾盐。发生促心律失常者可用：①氯化钾静脉滴注，对消除异位心律往往有效。②苯妥英钠，该药能与强心苷竞争性争夺 $Na^+ - K^+ - ATP$ 酶，因而有解毒效应。成人用100~200mg加注射用水20ml缓慢静注，如情况不紧急，亦可口服，每次0.1mg，一日3~4次。③利多卡因，对消除室性心律失常有效，成人用50~100mg加入葡萄糖注射液中静脉注射，必要时可重复。④阿托品，对缓慢性心律失常者可用。成人用0.5~2mg皮下或静脉注射。⑤心动过缓或完全房室传导阻滞有发生阿斯综合征的可能时，可植入临时起搏器。应用异丙肾上腺素，可以提高缓慢的心率。⑥依地酸钙钠，以其与钙螯合的作用，也可用于治疗洋地黄所致的心律失常。⑦对可能有生命危险的洋地黄中毒可经膜滤器静脉给与地高辛免疫Fab片段，每40mg地高辛免疫Fab片段，大约结合0.6mg地高辛或洋地黄毒苷。

【不良反应】

1. 常见的不良反应包括：新出现的心律失常、胃纳不佳或恶心、呕吐（刺激延髓中枢）、下腹痛、无力等。

2. 少见的反应包括：视力模糊或“黄视”（中毒症状）、腹泻、中枢神经系统反应如精神抑郁或错乱。

3. 罕见的反应包括：嗜睡、头痛及皮疹、荨麻疹（过敏反应）。

4. 在洋地黄的中毒表现中，心律失常最重要，最常见者为室性早搏，约占心脏反应的33%。其次为房室传导阻滞，阵发性或加速性交界性心动过速，阵发性房性心动过速伴房室传导阻滞，室性心动过速、窦性停搏、心室颤动等。儿童中心律失常比其他反应多见，但室性心律失常比成人少见。新生儿可有P-R间期延长。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
洋地黄毒苷片	化学药	HZ004405
洋地黄毒苷注射液	化学药	HZ004406

HY002424 氧氟沙星

【外文名称】 Ofloxacin

药物管理信息

【依据标准】 中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】 （±）-9-氟-2，3-二氢-3-甲基-10-（4-甲基-1-哌嗪基）-7-氧代-7*H*-吡啶并［1，2，3-*de*］-［1，4］苯并噁嗪-6-羧酸

【分子式】 $C_{18}H_{20}FN_3O_4$

【分子量】 361.38

【性状及组成】 本品为白色或微黄色结晶性粉末，无臭、味苦；遇光渐变色。本品在三氯甲烷中略溶，在甲醇中微溶，在冰醋酸中易溶，在稀酸及0.1mol/L氢氧化钠溶液中略溶。

药物药理信息

【药理毒理】 本品具广谱抗菌作用，尤其对需氧革兰阴性杆菌抗菌活性高，对下列细菌在体外具良好抗菌作用：肠杆菌科的大部分细菌，包括枸橼酸杆菌属、阴沟杆菌、产气肠杆菌等肠杆菌属，大肠埃希菌，克雷伯菌属，变形杆菌属，沙门菌属，志贺菌属，弧菌属，耶尔森菌等。常对多重耐药菌也具有抗菌活性。对青霉素耐药的淋病奈瑟菌、产酶流感嗜血杆菌和莫拉菌属均具有高度抗菌活性。对铜绿假单胞菌等假单胞菌属的大多数菌株具抗菌作用。本品对甲氧西林敏感葡萄球菌具抗菌活性，对肺炎链球菌、溶血性链球菌和粪肠球菌仅具中等抗菌活性。对沙眼衣原体、支原体、军团菌具良好抗微生物作用，对结核杆菌和非典型分枝杆菌也有抗菌活性。对厌氧菌的抗菌活性差。

氧氟沙星为杀菌剂，通过作用于细菌 DNA 螺旋酶的 A 亚单位，抑制 DNA 的合成和复制而导致细菌死亡。

【药代动力学】口服后吸收完全，相对生物利用度达 95%～100%。血药达峰时间约为 1 小时。食物对本品的吸收影响很少。多次给药后稳态血药浓度约给药后第 3 天达到。血消除半衰期约为 4.7～7.0 小时，蛋白结合率为 20%～25%。

本品吸收后广泛分布至各组织、体液，组织中的浓度常超过血药浓度而达有效水平。本品尚可通过胎盘屏障。

本品主要以原形自肾排泄，少量（3%）在肝内代谢。口服 24 小时内尿中排出给药量的 75%～90%，尿中代谢物很少。本品以原形自粪便中排出少量，给药后 24 小时和 48 小时内累积排出量分别为给药量的 1.6%和 3.9%。本品也可通过乳汁分泌。

据文献报道，成人患者在中耳腔内点滴 0.3%的氧氟沙星溶液，一次 10 滴，一日 2 次，总计 14 次。耳浴 30 分钟后的血药浓度很低，为 0.009～0.012μg/ml。小儿患者在中耳腔内一次滴耳，耳浴 0.3%的氧氟沙星水溶液 5 滴，120 分钟后血清中浓度较低，不超过 0.013μg/ml。

滴眼液 1 滴点眼后，1 小时角膜浓度达最大值 3.22μg/g，房水浓度 30 分钟达峰值 0.71μg/ml。局部点眼后的眼内通透性良好。

【药物相互作用】

1．尿碱化剂可减低本品在尿中的溶解度，导致结晶尿和肾毒性。

2．喹诺酮类抗菌药与茶碱类合用时可能由于与细胞色素 P450 结合部位的竞争性抑制，导致茶碱类的肝消除明显减少，血消除半衰期延长，血药浓度升高，出现茶碱中毒症状，如恶心、呕吐、震颤、不安、激动、抽搐、心悸等。本品对茶碱的代谢影响虽较小，但合用时仍应测定茶碱类血药浓度和调整剂量。

3．本品与环孢素合用，可使环孢素的血药浓度升高，必须监测环孢素血浓度，并调整剂量。

4．本品与抗凝药华法林合用时虽对后者的抗凝作用增强较小，但合用时也应严密监测患者的凝血酶原时间。

5．丙磺舒可减少本品自肾小管分泌约 50%，合用时可因本品血浓度增高而产生毒性。

6．本品可干扰咖啡因的代谢，从而导致咖啡因消除减少，血消除半衰期延长，并可能产生中枢神经系统毒性。

7．含铝、镁的制酸药可减少本品口服吸收，不宜合用。

【不良反应】

1．胃肠道反应：腹部不适或疼痛、腹泻、恶心或呕吐。

2．中枢神经系统反应可有头昏、头痛、嗜睡或失眠。

3．过敏反应：皮疹、皮肤瘙痒，偶可发生渗出性多形性红斑及血管神经性水肿。光敏反应较少见。

4．偶可发生：①癫痫发作、精神异常、烦躁不安、意识混乱、幻觉、震颤；②血尿、发热、皮疹等间质性肾炎表现；③静脉炎；④结晶尿，多见于高剂量应用时；⑤关节疼痛。

5．少数患者可发生血清氨基转移酶升高、血尿素氮增高及周围血常规白细胞降低，多属轻度，并呈一过性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氧氟沙星滴耳液	化学药	HZ004408
氧氟沙星滴眼液	化学药	HZ004409
氧氟沙星甘露醇注射液	化学药	HZ004410
氧氟沙星胶囊	化学药	HZ004411
氧氟沙星颗粒	化学药	HZ004412
氧氟沙星氯化钠注射液	化学药	HZ004413
氧氟沙星凝胶	化学药	HZ004414
氧氟沙星片	化学药	HZ004415
氧氟沙星葡萄糖注射液	化学药	HZ004416
氧氟沙星软膏	化学药	HZ004417
氧氟沙星栓	化学药	HZ004418
氧氟沙星眼膏	化学药	HZ004419
氧氟沙星阴道泡腾片	化学药	HZ004420
氧氟沙星注射液	化学药	HZ004421
注射用氧氟沙星	化学药	HZ005116

HY002425　氧化淀粉

【外文名称】Oxystarch

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

【性状及组成】本品为玉米淀粉经高碘酸钠氧化后的在每个单体上生成两个醛基的产物。

本品为白色或淡黄色粉末，无臭，无味，有较强的引湿性。

本品在水或乙醇中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药用辅料，尿素氮吸附剂。

HY002426 氧化钙

【其他名称】石灰、生石灰

【外文名称】Calcium Oxide

药物理化信息

【化学名】氧化钙

【分子式】CaO

【分子量】56.08

【性状及组成】本品为白色粉末。

密度：3.25～3.38g/cm^3。熔点：2614℃。沸点：2850℃。

碱性氧化物。

与水反应剧烈，放出大量热，生成氢氧化钙。易溶于酸。在空气中渐渐吸收二氧化碳而成碳酸钙。

药物药理信息

【药理毒理】本品在药剂中用作干燥剂和碱化剂。本品也是食品添加剂，在食品工业中用作碱化剂、营养增补剂、面团调节剂、酵母食料等。

【药物相互作用】本品为碱性氧化物，遇水生成氢氧化钙，遇酸生成盐。

【不良反应】本品无毒，一日摄入量不作限制性规定（FAO/WHO，1985），一般公认是安全的。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
伤可贴	中成药	ZC004622

HY002427 氧化苦参碱

【外文名称】Oxymatrine

【分子式】$C_{15}H_{24}N_2O_2 \cdot H_2O$

【分子量】282.38

药物药理信息

【药理毒理】本品具有抗癌及抗心律失常作用。体外抗癌试验证实，在7mg/ml浓度下，对小鼠艾氏腹水癌细胞的赤染率为85%，证明体外有抗癌作用。体内抗癌试验表明，对小鼠S180实体瘤，EAC实体瘤，Lewis肺癌均有明显抑制作用，抑制率分别为47.83%，44.83%，45.35%（$P<0.01$），证明体内有抗癌作用。巨噬细胞的吞噬功能，实验证明有明显增强巨噬细胞的吞噬功能，吞噬指数为117.63（$P<0.01$），故对非特异性免疫功能有极明显的促进作用。

【药代动力学】氧化苦参碱在体内的代谢证明，静脉注射氧化苦参碱后，大鼠血浆中的药物浓度呈双相指数下降，符合开放式二室模型，说明药物在体内分布广，消除快。氧化苦参碱不同途径给药，药物在体内的转化有较大差异，肌内注射氧化苦参碱后，药物在大鼠组织中的分布以氧化苦参碱为主，尿中排出大量原形药，24小时内排出氧化苦参碱占给药量的88.3%。口服后，氧化苦参碱在大鼠或小鼠胃肠道中逐渐转化成苦参碱被吸收，药物在大鼠组织中的分布，苦参碱的含量比氧化苦参碱高，尿排泄也以苦参碱为主，24小时内占排出总量的80.1%。人口服氧化苦参碱后，尿排泄苦参碱比氧化苦参碱高。口服后效应与浓度之间的关系符合S型Emax模型，为非剂量依赖性。

【药物过量】目前尚未见药物过量特殊体征和症状。若发生药物过量，要对患者进行监护，给予常规支持疗法。

【不良反应】偶有轻度恶心、腹胀、头痛、眩晕等不良反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
苦参素胶囊	化学药	HZ002149
苦参总碱注射液	化学药	HZ002155
妇得康泡沫剂	中成药	ZC001181

HY002428 氧化镁

【外文名称】Magnesium Oxide

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】氧化镁

【分子式】MgO

【分子量】40.30

【性状及组成】本品为白色粉末，无臭，无味；在空气中能缓缓吸收二氧化碳。本品在水中几乎不溶，在乙醇中不溶；在稀酸中溶解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：抗酸药。

本品作为碱性稀释剂用于固体制剂中；作为抗酸剂，用于胃酸过多、胃和十二指肠溃疡病；也作为食品添加剂和抗酸剂，单独或与氢氧化铝联合应用；还可作为渗透性轻泻剂和镁补充剂应用于缺镁症。

【药物相互作用】氧化镁是碱性氧化物，在固态下可与酸性化合物反应生成盐，如二布洛芬镁，或使碱不稳定药物降解。文献报道了各种药物吸附于

氧化镁的现象，如抗组胺药，抗生素（尤指四环素），水杨酸盐，盐酸阿托品，氢溴酸东莨菪碱和邻氨苯甲酸衍生物。氧化镁可与聚合物，如渗透性丙烯酸树脂复合从而延长药物的释放并且在固态下能与苯巴比妥钠发生反应。氧化镁对地西泮的稳定性具有不良影响。氧化镁可影响三氯噻嗪和抗心律不齐药物的生物利用度。

【不良反应】氧化镁作为赋形剂和治疗剂广泛用于固体制剂中。在治疗学上，作为抗酸剂需口服250～500mg，作为渗透性轻泻剂需口服2～5g。氧化镁作为赋形剂应用时（因其有轻泻作用）如果大剂量口服，仍会产生此不良反应，但通常被认为是无毒物质。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方木香铝镁片	化学药	HZ001322
复方氢氧化铝镁片	化学药	HZ001350
复方溴丙胺太林铝镁片	化学药	HZ001448
铝镁颠茄片	化学药	HZ002459
祈富乐T片	化学药	HZ002937
陈香露白露片	中成药	ZC000560
复方田七胃痛胶囊	中成药	ZC001541
复方田七胃痛片	中成药	ZC001542
龙七胃康片	中成药	ZC003358
胃乐胶囊	中成药	ZC005709
益肺健脾颗粒	中成药	ZC006813
正胃片	中成药	ZC007295

HY002429　氧化铜

【其他名称】黑色氧化铜、一氧化铜

【外文名称】Copper Oxide

药物理化信息

【化学名】氧化铜

【分子式】CuO

【分子量】79.54

【性状及组成】本品为黑色或棕黑色粉末，稍有吸湿性。

本品不溶于水和乙醇，溶于酸、氯化铵及氰化钾溶液，氨溶液中缓慢溶解。

熔点：1326℃。

药物药理信息

【药理毒理】微量元素铜补充剂。

铜是必需微量元素之一，在人体中的含量仅为100～200mg。其主要功能为辅助造血，即催化血红蛋白的合成。铜不足可影响铁的吸收，从而导致血红蛋白合成减少。铜还是碳水化合物代谢中的催化剂，也是多种酶的活性组成部分。因此，缺铜将使体内重要的酶活性降低，并可导致骨骼生成障碍，造成骨质疏松。缺铜还可发生脱发症以及白化病等，如常见的白癜风就跟血清中缺少铜离子有关系。铜还以脑铜蛋白的形式存在于中枢神经系统，所以缺铜会影响脑发育。

人和动物的血液中有铜蓝蛋白，这种多功能的氧化酶，其重要作用之一是催化Fe^{2+}氧化为Fe^{3+}，从而有利于体内贮备铁的动用和食物中铁的吸收。

铜过氧化物歧化酶（SOD）的组分，它具有抗脂质过氧化作用。

缺乏铜会影响结缔组织和弹性组织的结构。赖氨酸氧化酶也是一种铜酶，是胶原交联时不可缺少的物质，而胶原与结缔组织的形成以及弹性组织有密切的关系。

大量研究已经明确表明氧化铜中铜对任何动物的利用率均极低，没有理由再用作动物的补铜添加剂。但是，由于在人的铜补充通常是制成药片，含铜量高的氧化铜在药片中占的空间比五水硫酸铜（25%Cu）少得多，所以氧化铜仍作为主要铜源继续应用于人的维生素－矿物质补剂中。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
祈富乐T片	化学药	HZ002937

HY002430　氧化锌

【其他名称】Flores Zinci、锌白、锌氧粉、亚铅华、Zinc White

【外文名称】Zine Oxide

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】氧化锌

【分子式】ZnO

【分子量】81.38

【性状及组成】本品为白色或极微黄白色的无砂性细微粉末，无臭；在空气中能缓缓吸收二氧化碳。本品在水或乙醇中不溶；在稀酸或氢氧化钠溶液中溶解。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：收敛药。

本品具轻度吸附、收敛和保护皮肤作用，还有

一定抗菌作用。常与硼酸、滑石粉配成粉剂或制成软膏、糊剂、洗剂外用治疗皮肤炎症和慢性溃疡等。

本品除在临床上用作收敛剂、保护剂外，在药剂制造中用作防腐剂、填充剂和稀释剂，用于硬膏剂、贴布剂，与氯化锌、磷酸等混合可作为牙科填充剂。本品也用于香粉、唇膏等化妆品的制造。

【药物相互作用】本品遇油脂，可以和油脂中的油酸、硬脂酸等脂肪缓慢反应生成团块物，遇其他酸、碱可生成盐。

【不良反应】本品无毒，对皮肤和黏膜无刺激性，一般认为是安全的。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
充填用复方麝香草酚散甲酚甲醛溶液复合制剂	化学药	HZ000529
复方八维甲睾酮胶囊	化学药	HZ001076
复方倍氯米松新霉素贴膏	化学药	HZ001080
复方苯佐卡因软膏	化学药	HZ001090
复方磺胺氧化锌软膏	化学药	HZ001218
复方角菜酸酯乳膏	化学药	HZ001230
复方角菜酸酯栓剂	化学药	HZ001231
复方硫酸氢黄连素软膏	化学药	HZ001272
复方炉甘石外用散	化学药	HZ001288
复方氯己定撒粉	化学药	HZ001304
复方麝香草酚撒粉	化学药	HZ001374
复方氧化锌软膏	化学药	HZ001467
复方氧化锌水杨酸散	化学药	HZ001468
复方益康唑氧化锌撒粉	化学药	HZ001473
复方鱼肝油氧化锌软膏	化学药	HZ001480
磺胺氧化锌软膏	化学药	HZ001773
炉甘石洗剂	化学药	HZ002455
硼酸氧化锌冰片软膏	化学药	HZ002859
硼酸氧化锌软膏	化学药	HZ002860
祈富乐T片	化学药	HZ002937
水杨酸氧化锌软膏	化学药	HZ003302
小儿复方麝香草酚撒粉	化学药	HZ003759
氧化锌硫软膏	化学药	HZ004423
氧化锌软膏	化学药	HZ004424
氧化锌升华硫软膏	化学药	HZ004425
氧化锌贴膏	化学药	HZ004426
氧化锌油	化学药	HZ004427

续表

制剂名称	类别	序号
枯草杆菌/肠球菌二联活菌多维颗粒剂	生物制品	SW000148
骨健灵膏	中成药	ZC001856
骨质增生一贴灵	中成药	ZC001886
黑豆馏油软膏	中成药	ZC002110
烂耳散	中成药	ZC003151
热痱搽剂	中成药	ZC004287
伤疖膏	中成药	ZC004612
田七镇痛膏	中成药	ZC005479
小儿止泻贴	中成药	ZC006369
辛夷鼻炎丸	中成药	ZC006471
熊胆跌打膏	中成药	ZC006519
愈伤膏	中成药	ZC007116

HY002431 氧化亚氮

【外文名称】Nitrous Oxide

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】氧化亚氮

【分子式】N_2O

【分子量】44.01

【性状及组成】本品为无色气体；无显著臭，味微甜；较空气为重。

本品在 20℃与气压 101.3kPa（760mmHg）下，在水或乙醇中易溶，在乙醚中溶解。

在高压下可压缩成无色液体，贮存于耐高压的钢筒内，性能稳定。使用时需时专用减压装置和流量计。

分配系数：油/气 1.4，橡胶/气 1.2，油/水 3.2。

药物药理信息

【药理毒理】本品 MAC 为 10.5%，血/气分配系数为 0.47，因此麻醉作用弱，诱导迅速平稳，吸入后病人有愉快感，无兴奋期，肌肉松弛不完全，全麻的深度最深为三期一级。但镇痛作用强，20% 浓度所产生的镇痛作用与吗啡 15mg 相当，其作用与内源性阿片样肽（一阿片受体系统）有关。本品作用于中枢神经系统后，大脑皮层迅速受到抑制，意识丧失，丘脑和小脑功能受抑制，下丘脑不受抑制，在不缺氧情况下延髓不受抑制，运动神经亦不受抑制，各种深浅反射存在，对心肌的直接抑制作用与

浓度有关，低浓度不引起明显的血流动力学变化，高浓度时则兴奋交感神经系统而掩盖了本品对心肌的直接抑制作用。对呼吸道黏膜无刺激性，对呼吸抑制轻微。可迅速透过胎盘，但不抑制胎儿呼吸。

【药代动力学】吸入本品后，迅速通过肺泡进入血循环。在体内不与任何组织结合。在各组织分布的浓度，首先是供血丰富的脑、心、肝和肾，其次是肌肉、脂肪或其他供血少的组织。在体内检少转化，绝大部分随呼吸排出体外。10 分钟后血内已测不到，极少量从皮肤排出，微量排至汗、尿和肠道中。

【药物相互作用】与其他吸入全麻药合用，全麻药最小肺泡浓度（MAC）下降。与丁酰苯类药、中枢神经抑制药并用时应减少本品麻醉剂量。

【不良反应】

1．连续吸入本品 3～4 天以上，可出现白细胞减少，骨髓涂片显示渐进行性红细胞再生不良，这是由于本品氧化维生素 B_{12}中的钴从而影响甲硫氨基酸的合成。吸入本品 50%限于 48 小时内为安全期。

2．当麻醉结束时，血中溶解的本品迅速弥散至肺泡内，冲淡肺泡内的氧浓度而导致缺氧。因此，在麻醉结束后，必须以纯氧通气 5～10 分钟洗出氧化亚氮后方可考虑拔管。

3．吸入气中氧化亚氮浓度过高也可致缺氧，因此应加强吸入气中氧气和氧化亚氮浓度监测，保持氧化亚氮浓度于 65%以下，并具备准备可靠的氧化亚氮和氧的流量表。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氧化亚氮	化学药	HZ004428

HY002432　氧化樟脑

【外文名称】Vitacamphorae

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 11 册

药物理化信息

【化学名】Ⅱ－氧化樟脑

【分子式】$C_{10}H_{14}O_2$

【分子量】163.20

药物药理信息

【药理毒理】动物试验表明：本品可使家兔呼吸兴奋，使正常下降的血压及对水合氯醛诱致的血压下降均能使其逐渐得到恢复，对麻醉家兔在体心脏亦有兴奋作用，使心跳幅度加宽，收缩加强。

【药物过量】用药过量时可出现头痛、失眠、兴奋、颜面潮红和发汗等症状。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氧化樟脑注射液	化学药	HZ004429

HY002433　氧聚维啶

【其他名称】克矽平

【外文名称】Oxy Povidine

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（二部）·第 5 册

药物理化信息

【化学名】聚－2－乙烯吡啶－N－氧化物。

【性状及组成】本品为类白色或微黄色粉末，无味。

本品在水、乙醇或三氯甲烷中易熔，在丙酮中不溶；水溶液具微弱的乳光。

吸收系数：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释使成每 1ml 中约含 7.5μg 的溶液，照分光光度法，在 260.5nm 的波长处测定吸光度，吸收系数为 540～580。

药物药理信息

【药理毒理】抗矽肺药。用于防治矽肺。

HY002434　氧烯洛尔

【其他名称】Tracosal、Trasacor、Trasicor、烯丙氧心胺、心得平

【外文名称】Oxprenolol

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】1－邻烯丙氧基苯氧基－3－异丙氨基－2－丙醇

【分子式】$C_{15}H_{23}NO_3$

【分子量】265.21

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，味苦。本品在乙醇或丙酮中易溶，在乙醚或三氯甲烷中略溶，在水中微溶。

熔点：本品的熔点为 77～80℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为 β－肾上腺素受体阻滞药。用于治疗冠心病心绞痛、高血压和心律失常。

【不良反应】本品约 8%～10%的患者可出现不良反应。包括多梦、失眠、头痛、头晕等中枢神经

系统症状，恶心、上腹不适等消化道症状，以及末梢循环障碍、阳痿等不良反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氧烯洛尔片	化学药	HZ004430

HY002435 药用炭

【其他名称】活性炭、脱色碳

【外文名称】Medicinal Charcoal

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

【性状及组成】本品为黑色、无臭、无味、无砂的粉末。粉末状粒径在 200 目以下的粒状炭，粒径一般为 1～4mm。不溶于水和有机溶剂。填装密度约为 0.3～0.6g/ml，微孔容积约为 0.6～0.8ml/g，比表面积约为 500～1500m^2/g。最佳适用 pH4.0～4.8，最佳温度 60～70℃。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：吸附药。

本品具有丰富的孔隙，能吸附导致腹泻及腹部不适的多种有毒或无毒的刺激性物质，及肠内异常发酵产生的气体，减轻对肠壁的刺激，减少肠蠕动，从而起止泻的作用：本品还可以在胃肠道内迅速吸附肌酐，尿酸等有毒物质，容纳于其孔隙之中，顺肠道排出体外，代替肾脏的解毒功能，降低毒性物质在血液中的浓度，保护健存的肾单位，并延长透析间期，减少透析次数。

【药物相互作用】本品不宜与维生素、抗生素、洋地黄、生物碱类、乳酶生及其他消化酶类等药物合用，以免被吸附而影响疗效。

【不良反应】可出现恶心。长期服用可出现便秘。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
硅炭银片	化学药	HZ001648
热敷袋	化学药	HZ003074
药用炭胶囊	化学药	HZ004431
药用炭片	化学药	HZ004432
药用炭散剂	化学药	HZ004433
肠舒片	民族药	MZ000068
雪胆胃肠丸	民族药	MZ000690
板蓝解毒注射液	中成药	ZC000230

续表

制剂名称	类别	序号
风寒感冒颗粒	中成药	ZC001077
女金丹丸	中成药	ZC003733
生三七丸	中成药	ZC005035
小儿清毒糖浆	中成药	ZC006287

HY002436 叶绿素

【其他名称】Chlorophyl、Chromule、Leaf green

【外文名称】Chlorophyll

【性状及组成】本品为蜡状蓝黑色细结晶。常呈剑状或叶片状。易溶于醚、醇、丙酮、三氯甲烷、二硫化碳和苯，难溶于冷甲醇，几乎不溶于石油醚。其醇溶液为蓝绿色并显深红色荧光。

熔点：117～120℃（150～153℃，分解）。

旋光度：－262℃（三氯甲烷）。

最大吸收波长（乙醚）为 660，613，557，531，498，429，409nm。

药物药理信息

【药理毒理】叶绿素用于肥皂、矿油、蜡和精油的着色。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方薄樟桉油溶液	化学药	HZ001103
复方达克罗宁薄荷溶液	化学药	HZ001124
丁香风油精	中成药	ZC000892

HY002437 叶绿素铜钠

【外文名称】Sodium Copper Chlorophyllin

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 5 册

【分子式】$C_{34}H_{31}O_6N_4CuNa_3$

【分子量】724.16

【性状及组成】本品为自蚕沙提取的叶绿素，经皂化、铜化得到的叶绿素铜钠以及叶绿素衍生物的混合物。

本品为墨绿色颗粒或粉末；有类似胺类化合物的特殊臭味，有吸湿性。水溶液显碱性。

本品在水中易溶，在乙醇或三氯甲烷中微溶，在乙醚中不溶。

吸收系数：取本品 0.1g，精密称定，置 500ml 量瓶中，加水适量使溶解并稀释至刻度，摇匀，精密

量取5ml，置100ml量瓶中，加磷酸盐缓冲溶液（pH 7.5）稀释至刻度，摇匀，立即照分光光度法，在405nm的波长处测定吸光度。按干燥品计算，吸收系数应不小于565。

药物药理信息

【药理毒理】叶绿素铜钠为造血细胞复合剂。叶绿素升高白细胞的机制，有研究认为主要是通过提高交感神经的兴奋性，并在肝脏、在肾上腺功能的参与下使中性粒细胞从骨髓释放。亦有报道认为叶绿素的生血作用是因为叶绿素的基本结构系由四个吡咯环组成的卟啉环与血红蛋白的结构极其相似，故能促使生血作用。

动物实验证实叶绿素不但能提升因照射引起再生障碍性贫血小鼠血常规中红细胞，血红蛋白，血细胞，血小板等项目指标，且对小鼠骨髓中多能干细胞（CFU－S），粒－单组细胞（CFU－GU），红系组细胞（CFU－E）及骨髓基质细胞的恢复有明显促进作用，对骨髓基质细胞的恢复也有一定调节作用。故认为本品对造血的作用是通过对造血多能干细胞，粒－单组细胞，红系组细胞及骨髓基质细胞增殖发育的调节，促进骨髓造血功能的恢复。

临床研究表明本品对肝脏网状内皮细胞具有激活作用，使肝功能得到恢复，增强肝细胞抵抗力，加速修复与再生，使肿大肝脏明显缩小或消失。

【不良反应】个别患者服药后有口干，轻度腹部不适等不良反应，在医师指导下，可继续服药；也有荨麻疹样过敏反应发生。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
大黄叶绿素铜钠胶囊	化学药	HZ0000619
复方氢氧化铝镁片	化学药	HZ0001350
复方维U颠茄铋片	化学药	HZ0001426
复方溴丙胺太林铝镁片	化学药	HZ0001448
叶绿素铜钠胶囊	化学药	HZ0004434
叶绿素铜钠片	化学药	HZ0004435
叶绿素铜钠乳膏	化学药	HZ0004436
复方两面针含片	中成药	ZC0001432
海甘胃片	中成药	ZC0002043

HY002438　叶酸

【外文名称】Folic Acid

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】*N*－［4－［（2－氨基－4－氧代－1，4－二氢－6－蝶啶）甲氨基］苯甲酰基］－L－谷氨酸

【分子式】$C_{19}H_{19}N_7O_6$

【分子量】441.40

【性状及组成】本品为黄色或橙黄色结晶性粉末，无臭，无味。在水、乙醇、丙酮、三氯甲烷或乙醚中不溶，在氢氧化钠或碳酸钠稀溶液中易溶。

药物药理信息

【药理毒理】叶酸系由蝶啶、对氨基苯甲酸及谷氨酸的残基组成的水溶性B族维生素，为机体细胞生长和繁殖必须物质。存在于肝、肾、酵母及绿叶菜蔬如豆类、菠菜、番茄、胡萝卜等内，现已能人工合成。叶酸经二氢叶酸还原酶及维生素B_{12}的作用，形成四氢叶酸（THFA），后者与多种一碳单位（包括CH_3、CH_2、CHO等）结合成四氢叶酸类辅酶，传递一碳单位，参与体内很多重要反应及核酸和氨基酸的合成。THFA在丝氨酸转羟基酶的作用下，形成N－5,10－甲烯基四氢叶酸，能促使尿嘧啶核苷酸形成胸腺嘧啶核苷酸，后者可参与细胞的DNA合成，促进细胞的分裂与成熟。在DNA合成过程中，脱氧尿苷酸转变为脱氧胸苷酸，其间所需的甲基由亚甲基四氢叶酸提供。叶酸缺乏时，DNA合成减慢，但RNA合成不受影响，结果在骨髓中生成细胞体积较大而细胞核发育较幼稚的血细胞，尤以红细胞最为明显，及时补充可有治疗效应。

【药代动力学】口服后主要以还原形式在空肠近端吸收，5～20分钟即出现于血中，1小时后达高峰，其$t_{1/2}$约为0.7小时。贫血患者吸收速度较正常人快。叶酸由门静脉进入肝脏，以N_5－甲基四氢叶酸的形式储存于肝脏中和分布到其他组织器官，在肝脏中储存量约为全身总量的1/3～1/2。治疗量的叶酸约90%自尿中排泄，大剂量注射后2小时，即有20%～30%出现于尿中。

【药物相互作用】

1．大剂量叶酸能拮抗苯巴比妥、苯妥英钠和扑米酮的抗癫痫作用，可使癫痫发作的临界值明显降低，并使敏感患者的发作次数增多。

2．口服大剂量叶酸，可以影响微量元素锌的吸收。

【药物过量】因大剂量叶酸能拮抗苯巴比妥、苯妥英钠和扑米酮的抗癫痫作用，可使癫痫发作的临界值明显降低，并使敏感患者的发作次数增多。因此，这些病人应用的叶酸剂量不应当超过1mg，主张不超过400μg为宜，以免影响病情。

【不良反应】不良反应较少，罕见过敏反应。长

期用药可以出现畏食、恶心、腹胀等胃肠症状。大量服用叶酸时，可使尿呈黄色。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
肠内营养粉剂（TP）	化学药	HZ000518
多维铁口服溶液	化学药	HZ000800
多维元素胶囊（13）	化学药	HZ000801
多维元素片	化学药	HZ000804
多维元素片（14）	化学药	HZ000805
多维元素片（25）	化学药	HZ000809
多维元素片（29）	化学药	HZ000810
多种维生素片	化学药	HZ000817
复方氨基酸胶囊（8－11）	化学药	HZ001047
复方多维元素片（21）	化学药	HZ001151
复方多维元素片（23）	化学药	HZ001152
复方硫酸亚铁叶酸片	化学药	HZ001282
复方营养混悬剂	化学药	HZ001478
复合维生素片	化学药	HZ001497
克补片	化学药	HZ002094
祈富乐 T 片	化学药	HZ002937
三维亚铁咀嚼片	化学药	HZ003163
善存银片	化学药	HZ003189
十维片	化学药	HZ003201
十维铁咀嚼片	化学药	HZ003202
维胺颗粒	化学药	HZ003511
小儿善存片	化学药	HZ003769
小儿维生素咀嚼片	化学药	HZ003778
叶酸片	化学药	HZ004438
叶酸注射液	化学药	HZ004439
注射用水溶性维生素	化学药	HZ004960
注射用叶酸	化学药	HZ005117
注射用 12 种复合维生素	化学药	HZ005133
乙诺奇片	中成药	ZC0006803

HY002439 液化苯酚

【外文名称】Liquefied Phenol

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（二部）·第 5 册

【性状及组成】本品为无色或淡红色的澄明液体；有特臭；遇光或在空气中渐变色；能腐蚀皮肤与黏膜使颜色变白。

本品与乙醇、乙醚或甘油均能任意混合，加等量的甘油混合后，能与水任意混合。

相对密度：约为 1.065。

馏程：本品的馏程不高于 182℃。

药物药理信息

【药理毒理】消毒防腐药。

HY002440 液状甘油磷酸钾

【外文名称】Potassium Glycerophosphate Liquidus

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第 5 册

药物药理信息

【药理毒理】本品为中枢神经营养剂，主要用于神经衰弱。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方五味子糖浆	化学药	HZ001434

HY002441 液状甘油磷酸钠

【外文名称】Natrii Glycerophosphas Liquidus

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第 1 册

【性状及组成】本品为无色或微黄色黏稠液体；无臭、味咸。

相对密度：1.28～1.41。

药物药理信息

【药理毒理】本品为中枢神经营养剂，主要用于神经衰弱。用于配制复方制剂。药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方五味子糖浆	化学药	HZ001434
浓维磷糖浆	化学药	HZ002824

HY002442 液状石蜡

【其他名称】Mineral Oil、石蜡油

【外文名称】Liquid Paraffin

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

【性状及组成】本品系自石油中制得的多种液状

烃的混合物。

本品为无色透明的油状液体；无臭，无味；在日光下不显荧光。本品在三氯甲烷、乙醚或挥发油中溶解，在水或乙醇中均不溶。

相对密度：0.845～0.890。

黏度：本品的运动黏度，在40℃时，不得小于36mm^2/s。

药物药理信息

【药理毒理】泻药。

【不良反应】长期服用可干扰脂溶性维生素的吸收。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方薄荷桉油溶液	化学药	HZ001103
复方新霉素软膏	化学药	HZ001446
肝素钠乳膏	化学药	HZ001578
液状石蜡	化学药	HZ004440
大发表胶囊	民族药	MZ000080
丹参益心胶囊	民族药	MZ000085
貂胰防裂软膏	民族药	MZ000093
七味解毒活血膏	民族药	MZ000390
消痔洁肤软膏	民族药	MZ000669
大蒜油软胶囊	中成药	ZC000709
貂油治裂软膏	中成药	ZC000857
风寒止痛膏	中成药	ZC001079
肤螨灵软膏	中成药	ZC001149
复方南星止痛膏	中成药	ZC001463
乳香风湿气雾剂	中成药	ZC004398
麝香祛风湿油	中成药	ZC004708
参棘软膏	中成药	ZC004767
外伤止痛膏	中成药	ZC005630
小儿止泻贴	中成药	ZC006369
新肤螨软膏	中成药	ZC006474
熊胆跌打膏	中成药	ZC006519
液体清凉油	中成药	ZC006769
治伤软膏	中成药	ZC007431

HY002443　一叶秋碱

【外文名称】Securinine

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第1册

药物理化信息

【化学名】（6*S*,11a*R*,11b*S*）－9,10,11,11*a*－四氢－8*H*－6,11*β*－亚甲呋喃并［2,3－*c*］吡啶并［1,2－*a*］氮杂䓬－2（6*H*）－酮

【分子式】$C_{13}H_{15}NO_2$

【分子量】217.27

【性状及组成】本品为从大戟科植物一叶秋叶中提出的一种生物碱，按干燥品计算，含$C_{13}H_{15}NO_2$不得少于98.0%。

本品为黄色针状结晶或结晶性粉末；无臭，味微苦。

本品在无水乙醇或三氯甲烷中溶解，在水中不溶。

熔点：140～144℃。

比旋度：取本品，精密称定，加乙醇制成每1ml中含10mg的溶液，在25℃时，依法测定，按干燥品计算，比旋度为－1012°至－1042°。

药物药理信息

【药理毒理】本品对脊髓有选择性兴奋作用，增强反射及肌肉紧张度。

【药代动力学】体内代谢较快，无蓄积作用，未被代谢的少量药物经尿排出。

【药物过量】

1．中毒症状：血压升高，面、颈肌抽动、痉挛。强直发作时因膈肌和肋间肌痉挛而致呼吸停止。

2．处理：维持呼吸，并依病情给予相应对症治疗和支持疗法。

【不良反应】注射部位疼痛、肿胀，部分病人有心悸、头痛。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
硝酸一叶秋碱注射液	化学药	HZ003714

HY002444　伊班膦酸钠

【外文名称】Ibandronate Monosodium

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第41册

药物理化信息

【化学名】1－羟基－3－（*N*－甲基－戊胺基）－亚丙基二膦酸一钠盐一水合物

【分子式】$C_9H_{22}NNaO_7P_2$

【分子量】359.24

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，

无味。

本品在水中易溶，在甲醇、乙醇或丙酮中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为双膦盐酸类骨吸收抑制剂，可能主要通过与骨内羟磷灰石结合，抑制羟磷灰石的溶解和形成，从而产生抗骨吸收的作用。其作用机制可能还与本品直接改变破骨细胞形态学或直接抑制成骨细胞介导的细胞因子等有关。

【药代动力学】据文献报道，健康志愿者和绝经期妇女的 AUC（药时曲线下面积）和 C_{max} 在剂量 2、4 和 6mg 时与剂量呈线性相关，单次静脉给药 4mg 时，AUC 为 577ng·h/ml，C_{max} 为 159ng/ml，$t_{1/2}$ 为 1.56 小时，药物清除率为 130ml/min。本品主要经肾脏排泄，大部分药物以原形自尿排泄。

【不良反应】少数病人可出现体温升高，有时也会出现类似流感的症状，如发热、寒战、类似骨骼和肌肉疼痛的情况。多数情况不需专门治疗，个别病例还会出现胃肠道不适。

由于肾脏钙的排泄减少，常伴有血清磷酸盐水平降低（通常不需治疗）。血清钙的水平可能会降至正常以下。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
伊班膦酸钠注射液	化学药	HZ004441

HY002445 伊莫拉明

【外文名称】Imolamine

药物药理信息

【药理毒理】本品可扩张冠脉、增加冠脉血流量，促进侧支循环。用于治疗心绞痛。

【不良反应】本品可有恶心、皮疹、面部潮红。

HY002446 伊曲康唑

【其他名称】斯皮仁诺

【外文名称】Itraconazole

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 35 册

药物理化信息

【化学名】顺－4－（4－（4－（4－（（2－（2,4－二氯苯基）－2－（1H－1,2,4－三氮唑基－1－甲基）－1,3－二氧环戊基－4）－甲氧基）苯基）－1－哌嗪基）苯基）－2,4－二氢－2－（1－甲基丙基）－3H－1,2,4－三氮唑－3－酮

【分子式】$C_{35}H_{38}Cl_2N_8O_4$

【分子量】705.64

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末，无臭，无味。

本品在二氯甲烷或三氯甲烷中易溶，在热甲醇中微溶，在水、甲醇或乙醇中不溶。

熔点：165～169℃。

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理学

（1）药物治疗学分类：J02AC02（系统性抗真菌药，三唑类衍生物）。

伊曲康唑是三唑类衍生物，对念珠菌属及其他酵母菌、霉菌、皮肤癣菌和其他致病真菌具有广谱抗真菌活性。

（2）体外实验研究结果表明伊曲康唑可以破坏真菌细胞膜中麦角甾醇的合成。麦角甾醇是真菌细胞膜的重要组成部分。干扰它的合成将最终产生抗真菌活性。

2. 毒理学：药理安全性、长期毒性、致突变性、致癌和生殖毒性等临床前研究显示：羟丙基－β－环糊精（HP－β－CD）对人体无特殊毒性。大剂量给药时，HP－β－CD 的主要靶器官是泌尿道，伊曲康唑的主要靶器官是肾上腺。HP－β－CD 和伊曲康唑均有的靶器官为肝脏和单核巨噬细胞系统。当给啮齿类动物有母体毒性剂量的伊曲康唑时，显示有胚胎毒性和致畸作用。

【药代动力学】餐后立即服用本品，生物利用度最高。口服本品 200mg 后 4.6±1.3 小时血药浓度达峰值，其血药浓度为 0.32±0.16μg/ml。本品血浆蛋白结合率为 99.8%，全血浓度为血浆浓度的 60%，在肺、肾脏、肝脏、骨骼、胃、脾脏和肌肉中的药物浓度比相应的血浆浓度高 2～3 倍。在富含角蛋白的组织中，尤其是皮肤中的浓度比血浆浓度高 4 倍，而药物清除与表皮再生过程有关。连续用药 4 周后停药，7 日后已测不到药物的血药浓度，但皮肤中药物仍可保持治疗浓度达 2～4 周。开始治疗 1 周后，在甲角质中就可以测到伊曲康唑，3 个月疗程结束后，其药物浓度仍至少存在 6 个月时间。本品存在于皮脂中，汗液中也少量存在。伊曲康唑同时也集中的分布在易于受到真菌感染的部位。在阴道组织中治疗浓度持续的时间是：200mg，一日 1 次治疗 3 日，可持续 2 天；200mg，一日 2 次治疗 1 日，则可持续 3 天。本品主要在肝脏中代谢，产生大量代谢产物。其中之一是羟基化伊曲康唑，体外研究发现其抗真菌活性与本品相似，生物分析法测得抗真菌药物水平约为高压液相色谱分析本品水平的 3 倍。

本品血浆中清除呈双相性，终末半衰期为（23.8±4.7）小时。经粪排泄的原型药约为所用剂量的3%～18%，经肾排泄的原型药则低于所用药剂量的0.03%，大约35%以代谢物形式在1周内随尿液排泄。

静脉注射型伊曲康唑是伊曲康唑和环糊精的复合物。

生物利用度：给健康志愿者1小时静脉输入伊曲康唑注射液200mg，一日2次，连续2天，足以使伊曲康唑浓度超过MIC_{90}［(250～500) μg/L］。从第3天开始，同样剂量每日给药1次，可维持血浆浓度在同样的稳态水平。侵入性肺曲霉病患者，91%经过2天（200mg，一日2次）静脉给药后可达到血浆抑菌浓度。

排除：伊曲康唑静脉给药后，环糊精迅速被肾小球滤过排除，体内几乎没有蓄积。有肾功能损害或接受透析治疗的患者不宜静脉输入高剂量伊曲康唑。

【药物相互作用】

1．诱酶药物：如利福平和苯妥英钠可明显降低本品的口服生物利用度，因此，当与诱酶药物共同服用时应监测本品的血浆浓度。

2．体外研究表明，在血浆蛋白结合方面，本品与丙咪嗪、普萘洛尔、地西泮、西咪替丁、吲哚美辛、甲苯磺丁脲和磺胺二甲基嘧啶之间无相互作用。

3．已报道当使用本品超过推荐剂量时，与环孢菌素A、阿司咪唑和特非那丁有相互作用。这些药物若与本品同服时，应减少剂量。

4．已报道本品与华法林和地高辛有相互作用。因此这些药物若与本品同服时，应减少剂量。

5．尚未观察到本品与AZT（齐多夫定）间的相互作用。

6．尚未观察到本品对炔雌醇和炔诺酮代谢的诱导效应。

【药物过量】当发生药物过量时，应采取支持疗法。伊曲康唑不能通过血液透析清除。也没有特效解毒药。

【不良反应】常见胃肠道不适，如畏食、恶心、腹痛和便秘。较少见的不良反应包括头痛、可逆性氨基转移酶升高、月经紊乱、头晕和过敏反应（如瘙痒、红斑、风团和血管性水肿）。有个例报告出现了Stevens－Johnson综合征（重症多形型红斑）。

已有潜在病理改变并同时接受多种药物治疗的大多数患者，在接受伊曲康唑长疗程治疗时可见低血钾症、水肿、肝炎和脱发等症状。有个例报告出现了外周神经病变，但是否与服用伊曲康唑有关还不能肯定。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
伊曲康唑胶囊	化学药	HZ004442
伊曲康唑口服溶液	化学药	HZ004443
伊曲康唑注射液	化学药	HZ004444

HY002447　伊维菌素

【其他名称】麦克丁、依弗米丁

【外文名称】Ivermectin

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第59册

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭、无味；微有引湿性。

本品在甲醇与二甲基甲酰胺中易溶，在乙醇中略溶，在水中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加甲醇溶解并定量稀释使成每1ml中约含25mg的溶液，依法测定，按无水无溶剂物计算，比旋度为－17°至－20°。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：本品为阿维菌素的衍生物，属口服半合成的广谱抗寄生虫药。本品对各种生命周期的大部分线虫（但非所有线虫）均有作用；对盘尾丝虫的微丝蚴有效、但对成虫无效；对仅处于肠道的类圆线虫也有效。

本品具有选择性的抑制作用，通过与无脊柱动物神经细胞与肌肉细胞中谷氨酸为阀门的氯离子通道的高亲和力结合，从而导致细胞膜对氯离子通透性的增加，引起神经细胞或肌肉细胞超极化，使寄生虫麻痹或死亡。本品亦可与其他配体阀门（如神经递质γ－氨基丁酸）的氯离子通道相互作用。

本品的选择性是因为一些哺乳动物体内没有谷氨酸－氯离子通道，且阿维菌素对哺乳动物配体－氯离子通道仅有低亲和力。本品不能穿透人的血脑屏障。

2．毒理研究

（1）遗传毒性：仅进行了体外的致突变试验，结果均未发现本品有遗传毒性。

（2）生殖毒性：在大鼠重复给药剂量达人临床最大推荐剂量的3倍时（以体表面积计），未见对动物生育力有影响。小鼠、大鼠和兔重复给药剂量分别达人临床最大推荐剂量的0.2、8.1和4.5倍时（以体表面积计），显示本品有致畸作用。两种动物

均出现腭裂，兔子还出现杵状前爪。这些作用是在接近于母体毒性剂量时发生。因此，本品显然不是选择性的胎儿毒性，然而尚无充分和严格的孕妇研究资料以确认在妊娠中使用本品的安全性，所以妊娠期间不应使用。

【药代动力学】我国目前尚缺乏伊维菌素胶囊的详细药代动力学研究资料。国内24名健康受试者（16男8女）随机分为3组，每组8人，分别服用口服伊维菌素片6、12、18mg。其中12mg组的8名受试者同时采用随机交叉设计，以MECTIZAN为对照，所进行的生物等效性研究数据表明，国产品6、12、18mg组的 C_{max}、t_{max}、Ka、Ke等药代动力学参数分别为20.18 ±9.99mg/L、4.70 ±1.92小时、0.61 ±0.37小时$^{-1}$、0.08 ±0.04小时$^{-1}$；23.48 ±6.35mg/L、5.26 ±2.29小时、0.73 ±0.40小时$^{-1}$、0.04 ±0.02小时$^{-1}$；31.21 ±10.88mg/L、5.11 ±2.31小时、0.77 ±0.66小时$^{-1}$、0.05 ±0.04小时$^{-1}$，与对照品基本一致。

据PDR－54版介绍，伊维菌素口服给药后，血药浓度大致与剂量成比例。在两组研究中，健康、空腹的志愿受试者服用12 mg伊维菌素（26mg）后（平均剂量为165mg/kg），大约4小时，主要成分（H2B1a）血药峰浓度分别为（46.6 ± 21.9）ng/ml（范围为16.4～101.1 ng/ml）及（30.6 ± 15.6）ng/ml（范围为13.9～68.4ng/ml）。伊维菌素及（或）其代谢物在服药后12天内几乎全随粪便排出体外，只有小于1%的服用剂量随尿排出。口服给药后，伊维菌素的血浆半衰期约为至少给药后16小时。国内外尚未研究进食对伊维菌素全身药效的影响。

【药物过量】超剂量可引起中毒，无特效解毒药。

【不良反应】肌内注射会产生严重的局部反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
伊维菌素片	化学药	HZ004445

HY002448 依巴斯汀

【其他名称】Kestine

【外文名称】Ebastine

药物理化信息

【化学名】4－二苯基甲氧基－1－［3－（对－叔丁基苯甲酰基）丙基］哌啶

【分子式】$C_{32}H_{39}NO_2$

【分子量】469.62

【性状及组成】本品为一非吸湿性、白色结晶粉末。

药物药理信息

【药理毒理】依巴斯汀是一种新型无中枢镇静作用的氧哌啶类第二代强效抗组胺 H_1 受体拮抗剂，其活性代谢产物卡瑞斯汀均为外周选择性组胺 H_1 受体拮抗型，无明显中枢神经系统作用和抗胆碱作用。本药及其代谢产物均不能穿过血脑屏障。

【药物相互作用】已确定当依巴斯汀与酮康唑或红霉素（已知这两种药物均可延长Q－T间期）联合应用时，有药物代谢动力学及药效动力学方面的相互作用，使QTc增加18～19毫秒（4.7%～5%）。与茶碱、华法林、西咪替丁、地西泮或乙醇无相互作用。

【药物过量】用药过量没有特殊的解救方法。可给予洗胃并监测心电图等生命指征，及时给予对症治疗。

【不良反应】最常见的不良反应为头疼、口干和倦睡。少见的不良反应有腹痛、消化不良、乏力、咽炎、鼻出血、鼻炎、鼻窦炎、恶心和失眠。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
依巴斯汀片	化学药	HZ004447

HY002449 依达拉奉

【其他名称】Radicut

【外文名称】Edaravone

药物理化信息

【化学名】3－甲基－1－苯基－2－吡唑啉－5－酮

【分子式】$C_{10}H_{10}N_2O$

【分子量】174.20

药物药理信息

【药理毒理】依达拉奉是一种脑保护剂（自由基清除剂）。临床研究提示N－乙酰门冬氨酸（NAA）是特异性的存活神经细胞的标志，脑梗死发病初期含量急剧减少。脑梗死急性期患者给予依达拉奉，可抑制梗死周围局部脑血流量的减少，使发病后第28天脑中NAA含量较甘油对照组明显升高。临床前研究提示，大鼠在缺血/缺血再灌注后静脉给予依达拉奉，可阻止脑水肿和脑梗塞的进展，并缓解所伴随的神经症状，抑制迟发性神经元死亡。机制研究提示，依达拉奉可清除自由基，抑制脂质过氧化，从而抑制脑细胞、血管内皮细胞、神经细胞的氧化损伤。

遗传毒性：依达拉奉Ames试验，CHL染色体畸

变试验及小鼠微核试验结果均为阴性。

生殖毒性：一般生殖毒性试验中，大鼠给予依达拉奉3、20、200mg/kg，20mg/kg和200mg/kg组的动物出现尿色橙褐、流泪、流涎和自主活动减少，体重和食量轻微下降；200mg/kg组雌鼠平均性周期延长，雌鼠、雄鼠生育力降低，胎仔胸腺残留率升高。致畸敏感期毒性试验中，妊娠大鼠静脉给予依达拉奉3、30、300mg/kg，300mg/kg组母鼠摄食量下降，体重增加减缓，给药后出现伏卧、步态不稳、自发运动减少、流泪等；各剂量组雄性胎仔体重及30mg/kg组雌性胎仔体重均低于对照组；各剂量组胎仔内脏畸形率升高，幼鼠耳廓展开、眼睑开裂、睾丸下垂、阴道开口有延迟倾向。妊娠新西兰白兔静脉注射给予依达拉奉3、20、100mg/kg，100mg/kg组动物出现尿液橙褐色，步态失调，流泪，瞳孔缩小，呼吸异常，后肢麻痹，给药部位充血、水肿，坏死及炎症；3、100mg/kg组动物胎盘重量显著增加。围产期毒性试验中，妊娠Wistar大鼠静脉注射给予依达拉奉3、20、200mg/kg，200mg/kg组动物给药期间摄食量下降，体重增加量降低，出现摇头、眨眼、流泪、自发运动减少等症状。幼鼠出生后28天旷场实验结果显示20、200mg/kg组幼鼠移动次数增高。

【药代动力学】

1. 血药浓度：健康成年男性受试者（5例）和65岁以上健康老年受试者（5例），以0.5mg/kg体重剂量，一日2次，每次30分钟内静脉滴注，连续给药2天后，血浆中药物浓度的变化和以起始给药时的血浆药物浓度变化所求得参数。

2. 药代参数

	健康成年男性受试者（5例）	健康老年受试者（5例）
C_{max}（ng/ml）	888 ± 171	1041 ± 106
$t_{1/2\alpha}$（小时）	0.27 ± 0.11	0.17 ± 0.03
$t_{1/2\beta}$（小时）	2.27 ± 0.80	1.84 ± 0.17

（平均值 ± 标准差）

健康成年男性受试者和健康老年受试者两者血浆中药物浓度几乎都同样消失，没有蓄积性。

3. 血清蛋白结合率：体外试验结果表明：依达拉奉的人血清蛋白和人血清白蛋白结合率分别为92%和89%～91%。

4. 代谢：在健康成年男性受试者和健康老年受试者中的研究结果表明，依达拉奉在血浆中的代谢物为硫酸络合物、葡萄糖醛酸络合物。在尿中主要代谢物为葡萄糖醛酸络合物、硫酸络合物。

5. 排泄：健康成年男性受试者和健康老年受试者使用本品1日2次，每次0.5mg/kg，30分钟内静滴，连续2天给药，每次给药至12小时排泄尿液中含0.7%～0.9%原药，71.0%～79.9%代谢物。

【药物相互作用】

1. 与先锋唑啉钠、盐酸哌拉西林钠、头孢替安钠等抗生素合用时，有致肾功能衰竭加重的可能，因此合并用药时需进行多次肾功能检测等观察。

2. 本品原则上必须用生理盐水稀释（与各种含有糖分的输液混合时，可使依达拉奉的浓度降低）。

3. 不可和高能量输液、氨基酸制剂混合或由同一通道静滴（混合后可致依达拉奉的浓度降低）。

4. 勿与抗癫痫药（地西泮、苯妥英钠等）混合（产生混浊）。

5. 勿与坎利酸钾混合（产生混浊）。

【不良反应】据日本临床病例569例观察，26例（4.57%）出现不良反应。主要表现为肝功能异常16次（2.81%），皮疹4次（0.70%）。569例中临床检测值异常变化的有122例（21.4%），主要是AST上升7.71%（43/558）、ALT上升8.23%（46/559）等肝功能检测值异常。

1. 严重不良反应有：①急性肾功能衰竭（程度不明）。用药过程中进行多次肾功能检测并密切观察，出现肾功能低下表现或少尿等症状时，停止用药并正确处理。②肝功能异常。黄疸（均程度不明）伴有AST、ALT、ALP、γ－GT、LDH上升等肝功能异常和黄疸，用药过程中需检测肝功能并密切观察，出现异常情况，停止用药并正确处理。③血小板减少（程度不明）。有血小板减少表现，用药过程中需密切观察，出现异常情况，停止给药并正确处理。④弥漫性血管内凝血（DIC）（程度不明）。可出现弥漫性血管内凝血的表现，用药过程中定期检测。出现疑为弥漫性血管内凝血的实验室表现和临床症状时，停止给药并进行正确处理。

2. 其他不良反应（发生率）及主要表现为：①过敏症（0.1%～5%）。主要表现为皮疹、潮红、肿胀、疱疹、瘙痒感；②血细胞系统（0.1%～5%）。主要表现为红细胞减少，白细胞增多，白细胞减少，红细胞压积减少，血红蛋白减少，血小板增多，血小板减少；③注射部位（0.1%～5%）。主要表现为注射部位皮疹、红肿等；④肝脏（发生率＞5%）。主要表现为AST升高、ALT升高、LDH升高、ALP升高，γ－GT升高。（发生率为0.1%～5%）：总胆红素升高，尿胆原阳性，胆红素尿；⑤肾脏（0.1%～5%）。主要表现为BUN升高，血清尿酸升高，血清尿酸下降，蛋白尿、血尿、肌酐升高（程度不明）；⑥消化系统（0.1%～5%）：嗳气；⑦其

他（0.1%～5%）：发热，热感，血压升高，血清胆固醇升高，血清胆固醇降低，甘油三酯升高，血清总蛋白减少，CK（CPK）升高，CK（CPK）降低，血清钾下降，血清钙下降。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
依达拉奉注射液	化学药	HZ004448

HY002450 依地酸钙钠

【其他名称】 Calcium Disodium、EDTA Ca－Na_2、EDTA Na－Ca、Versenate、依地钙、依地钙钠、依地酸钠钙、乙二胺四乙酸二钠钙

【外文名称】 Calcium Disodium Edetate

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 乙二胺四醋酸钙二钠六水合物

【分子式】 $C_{10}H_{12}CaN_2Na_2O_8 \cdot 6H_2O$

【分子量】 482.38

【性状及组成】 本品为白色结晶性或颗粒性粉末，无臭，无味；易潮解。本品在水中易溶，在乙醇或乙醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】 本品能与多种二价和三价重金属离子络合形成可溶性复合物，由组织释放到细胞外液，通过肾小球滤过，由尿排出；金属络合物在尿中排泄的高峰为用药后 24～48 小时。本品和各种金属离子的络合能力不同，其中以铅为最有效，其他金属效果较差，而对汞和砷则无效。这可能系汞和砷在体内与酶牢固结合，或本品不易与组织内的金、汞和砷络合。

【药代动力学】 静脉注射在血循环消失很快，$t_{1/2}$为 20～60 分钟；肌内注射，$t_{1/2}$为 90 分钟。存在于血浆，主要在细胞外液；脑脊液中甚微，仅占血浆的 5%。本品在体内几乎不进行代谢，1 小时内从尿排出 50%，24 小时内排出 95%。静脉注射本品 1g，24 小时可从尿中排出，血浆和肝、脾、肌肉等软组织中可络合铅的 14%，最多可排出铅 3～5mg。

【药物相互作用】 本品能络合锌，干扰精蛋白锌胰岛素的作用时间。

【药物过量】 剂量过大和疗程过长不一定成比例地增加尿中金属的排泄量，相反可以引起急性肾小管坏死。严重中毒患者不宜应用较大剂量，否则使血浆中金属－本品复合物增加量来不及从尿排除，反而增加铅对人体的毒性。

【不良反应】

1. 头昏、前额痛、食欲减退、恶心、畏寒、发热，组胺样反应有鼻黏膜充血、喷嚏、流涕和流泪。

2. 少数有尿频、尿急、蛋白尿、低血压和心电图 T 波倒置。

3. 过大剂量可引起肾小管上皮细胞损害，导致急性肾功能衰竭。肾脏病变主要在近曲小管，亦可累及远曲小管和肾小球。

4. 有患者应用本品出现高血钙症，应予以注意。

5. 不良反应和肾脏损害一般在停药后恢复。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
依地酸钙钠片	化学药	HZ004449
依地酸钙钠注射液	化学药	HZ004450

HY002451 依地酸钠

【其他名称】 EDTA－Na、Ethylenedlam inete4ro tetraacetic

【外文名称】 Disodium Edentate

药物管理信息

【依据标准】 化学药品地标升国标·第 11 册

【分子式】 $C_{10}H_{14}N_2Na_2O_8$

【分子量】 336.21

【性状及组成】 本品为无色结晶性粉末，无臭无味。

熔点：本品的熔点为 240℃（分解）。

本品不溶于冷水、醇及一般有机溶剂，微溶于热水，溶于氢氧化钠，碳酸钠及氨的溶液中，能溶于 160 份 100℃沸水。其碱金属盐能溶于水。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：螯合剂。

本品为稳定剂，是一种重要的络合剂，能和碱金属、稀土元素和过渡金属等形成稳定的水溶性络合物。屏蔽金属离子对药物稳定性的影响。

【药物相互作用】 依地酸盐与强氧化剂、强碱和高价金属离子如铜、镍和铜合金配伍禁忌。依地酸二钠盐显弱酸性，能与碳酸盐反应放出二氧化碳和与金属反应生成氢气。

其他配伍禁忌如依地酸二钠与锌的螯合可使胰岛素失效；当用依地酸二钠作为稳定剂的葡萄糖酸钙注射剂与肠道外营养液混合时，肠道外营养液中的微量金属将被螯合；在输液中依地酸二钠与两性霉素和盐酸肼苯达嗪有配伍禁忌。

【药物过量】 依地酸二钠、三钠盐和依地酸易与

钙螯合，长期大剂量服用或静脉输注速度过快可引起低血钙症。若用于口腔，可溶去牙齿中的钙。而依地酸二钠不再与钙螯合。

【不良反应】二钠盐和钙二钠盐胃肠道吸收差，作为药剂辅料二钠盐和钙二钠盐几乎无不良反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方桔油乳	化学药	HZ001240
萘敏维滴眼液	化学药	HZ002741
注射用水溶性维生素	化学药	HZ004960

HY002452　依非韦伦

【其他名称】Efavirenz

【外文名称】Efavirdine

药物理化信息

【化学名】（*S*）－6－氯－4－（环丙基乙炔基）－1，4－二氢－4－（三氟甲基）－2*H*－3，1－氧氮杂萘－2－酮

【分子式】$C_{14}H_9ClF_3NO_2$

【分子量】315.68

药物药理信息

【药理毒理】依非韦伦是人免疫缺陷病毒－1型（HIV－1）的选择性非核苷逆转录酶抑制剂。依非韦伦是HIV－1逆转录酶（RT）非竞争性的抑制剂，作用于模版、引物或三磷酸核苷，兼有小部分竞争性的抑制作用。远远超过临床治疗剂量的依非韦伦对HIV－2RT和人细胞DNA多聚酶α、β、γ和δ无抑制作用。

慢性毒性：猕猴服用依非韦伦2年，服用的剂量要使血浆平均AUC超过患者日服600mg的AUC的2～9倍。①观察到轻到中度的肝脏胆管增生。一只猕猴除中度胆管增生外还有轻度的胆汁淤积。停止用药后，胆管增生是可逆的。2年治疗期末，9/10接受最大剂量依非韦伦治疗的猕猴有轻到中度的胆管增生。随访26周停止治疗的恢复期，接受最大剂量依非韦伦治疗的猴子中有3/5胆管增生消失。其余2只猕猴是轻度的胆管增生。②观察到轻微的甲状腺滤泡细胞肥大，这一改变是由于继发诱导肝酶后甲状腺素清除率的增加。这一病理改变并不增加病人服用依非韦伦的危险性，因为与其他已知的酶诱导剂联用依非韦伦作长期治疗并不与临床甲状腺功能减退、甲状腺肿或甲状腺瘤有相关性。

在连续1年以上服用依非韦伦的猕猴中观察到非持续性的惊厥发作，血浆依非韦伦的浓度超过人日服600mg的4～13倍。但是这些猕猴的中枢神经系统未发现与依非韦伦相关的显微镜下改变。

致癌性：致癌性的研究显示，在雌性小鼠中观察到肝肿瘤和肺肿瘤的发生率是增加的，而雄性小鼠无此发现。肿瘤的发生率在服用依非韦伦的雄性小鼠、雄性或雌性大鼠中没有增加。肝肿瘤可能是因为依非韦伦的酶诱导效应；但是，肺肿瘤发生率上升的原因及其在人体内相应的效应仍未明了。

致突变性：体内和体外的遗传毒性分析研究显示，依非韦伦无致突变性和遗传毒性，研究包括在S. typhimurium和大肠杆菌中进行的细菌突变分析，在中国仓鼠卵巢细胞中进行的哺乳动物突变分析，在人周围血单核细胞或中国仓鼠卵巢细胞中进行的染色体畸变分析，以及小鼠体内骨髓微核分析。

生殖：依非韦伦不影响雌性或雄性小鼠的交配或生殖，并不影响经治疗的雄性小鼠的精子和后代。依非韦伦不影响雌性大鼠的生殖功能。由于在大鼠体内依非韦伦的快速清除，这些研究中，大鼠各个系统的血药浓度等于或低于依非韦伦在人体内的治疗剂量浓度。

发育研究：一项正在进行的后续毒性研究中发现，接受依非韦伦治疗的猕猴，20个胎儿/新生儿中有3个出现畸形。怀孕的猕猴服用依非韦伦的日剂量是60mg/kg，在一个胎儿中出现无脑畸形和单侧无眼畸形伴舌肥大，另一胎儿中出现小眼畸形，第三例出现上颚裂。依非韦伦治疗的大鼠中没有发现胎儿畸形，但是，200mg/kg的日剂量组发现有胎儿的再吸收。孕兔日服用75mg/kg的依非韦伦没有发现致畸性和胚胎毒性。

已证实依非韦伦可通过大鼠、兔和猕猴的胎盘屏障。在这些动物中，胎儿血中依非韦伦的浓度近似于母体内的血浓度。

【药代动力学】

1. 吸收：未感染HIV志愿者单剂量（100～1600mg）口服给药5小时后，依非韦伦血浆浓度达峰值（1.6～9.1μmol/L）。剂量至1600mg，观察到C_{max}及AUC呈剂量依赖关系；C_{max}及AUC的增加不与剂量成比例，而是小于相应的理论值，随着剂量的增加，吸收减少。多次给药并不改变达到峰药浓度所需的时间（3～5小时），6～7天后达血浆稳态浓度。

HIV感染者在血药稳态浓度时，平均C_{max}、平均C_{min}和平均AUC与每日口服剂量200，400，600mg呈线性关系。35位接受600mg/d本品治疗的患者，稳态C_{max}是12.9μmol/L，稳态Cmin是5.6μmol/L，AUC是184μmol/L/h。

食物对口服吸收的影响：未感染HIV志愿者中，

高脂或正常进餐后单剂服用 600mg 本品的生物利用度较空腹服用时分别增加 22% 和 17%。本品的服用不受食物影响。

2. 分布：依非韦伦与人血浆蛋白，尤其是白蛋白高度结合（结合率大约是 99.5% ~ 99.75%）。HIV - 1 感染者（n = 9）一日服用 200 ~ 600mg 本品至少 1 个月，脑脊液的药物浓度是对应血浆浓度的 0.26% ~ 1.19%（平均 0.69%）。这一比例超出血浆中非蛋白结合（游离）的依非韦伦的 3 倍以上。

3. 代谢：人体研究及用人肝微粒体进行的体外研究表明，依非韦伦主要经细胞色素 P450 系统代谢为含羟基的代谢物及其进一步的代谢产物 - 葡萄糖醛酸。这些代谢产物无抗 HIV - 1 的活性。体外研究证实 CYP3A4 及 CYP2B6 是依非韦伦代谢过程中主要的同工酶。同时体外研究显示了依非韦伦抑制 P450 的同工酶 2C9，$2C_{19}$及 3A4，在所观察的依非韦伦的血浆浓度范围内，Ki 值是 8.5 ~ 17μmol/L。体外研究中，依非韦伦不抑制 CYP2E1，仅在大大超出临床治疗剂量时才抑制 CYP2D6 和 CYP1A2（Ki 值是 82 ~ 160μmol/L）。

已证实依非韦伦诱导 P450 酶，导致自身代谢。每日 200 ~ 400mg 的剂量治疗 10 天，药物累积浓度低于预期值（低 22% ~ 42%），终点半衰期为 40 ~ 55 小时，亦低于单剂量用药的半衰期（52 ~ 76 小时）。药代动力学相互作用研究发现，400mg 或 600mg 依非韦伦与茚地那韦联用，与 200mg 剂量的依非韦伦组比较，不会造成茚地那韦 AUC 的下降。此发现说明，400mg 或 600mg 依非韦伦对 CYP3A4 的诱导程度是相似的。

4. 清除：依非韦伦单剂量给药的终点半衰期相对较长，为 52 ~ 76 小时，而多次给药后的半衰期为 40 ~ 55 小时。放射性标记依非韦伦，尿中发现的大约占 14% ~ 34%，以原形排泄至尿中的依非韦伦小于 1%。

5. 患者特异性：尚未在肝功能受损患者中进行适当的依非韦伦的药代动力学研究。未研究依非韦伦在肾功能不全患者中的药代动力学，但是，以原形排泄至尿中的依非韦伦小于 1%，因此肾功能受损对依非韦伦的清除影响应该是较小的。

6. 性别和种族差异：在男性和女性患者之间以及不同种族之间，依非韦伦的药代动力学没有区别。

7. 老年患者：本品的临床研究中 65 岁及以上患者的人数较少，因此无法判定是否与年轻人的反应不同。

8. 儿童患者：3 岁以下及体重小于 13kg 的儿童中未进行本品的研究。接受依非韦伦治疗的 57 名儿童中，除新发皮疹在儿童中的发生率较高外（46%），其余不良反应的类型和发生率大致与成人类似。儿童体内依非韦伦的代谢与成人类似。49 名患儿服用了等量于 600mg 本品的硬胶囊（根据体重计算体表面积来调整剂量），稳态 C_{max}是 14.2μmol/L，稳态 C_{min}是 5.6μmol/L，AUC 是 218μmol/L/h。

【药物相互作用】本药不得与特非那丁、阿司咪唑、西沙必利、咪唑唑仑、三唑仑或麦角衍生物合用，因为依非韦伦竞争 CYP3A4 可能抑制这些药物的代谢，并可能造成严重的和（或）危及生命的不良事件，如心律失常、持续的镇静作用或呼吸抑制。

依非韦伦是 CYP3A4 的诱导剂。与本品合并用药时，可能降低底物是 CYP3A4 的其他化合物的血浆浓度。

阿普那韦：感染 HIV 的患者联合使用阿普那韦（每 12 小时 1200mg）和依非韦伦（每天 600mg）时，阿普那韦的 C_{max}（33%）、AUC（24%）和 C_{min}（43%）均有下降。虽然并未明确阿普那韦血药浓度显著下降的临床意义，当选择的治疗方案中包括阿普那韦和依非韦伦时需考虑到药代动力学相互影响的程度。

茚地那韦：茚地那韦（每 8 小时 800mg）与本品同时服用时，由于酶诱导的结果，茚地那韦的 AUC 和 C_{max}分别降低约 31% 和 16%。因而，本品与茚地那韦合用时，茚地那韦的剂量应从每 8 小时 800mg 增加到 1000mg。与茚地那韦同时用药时，本品的剂量勿需调整。

利托那韦：在未受感染的志愿者中进行了本品 600mg（每天睡前服药 1 次）和利托那韦 500mg（每 12 小时用药）联合用药研究，结果显示这种联合用药的耐受性不好并且临床不良反应（如眩晕、恶心、感觉异常）和实验室化验值异常（如肝酶升高）的发生率较高。本品与利托那韦联合用药时，建议监测肝脏酶类。

沙奎那韦：沙奎那韦（软胶囊剂型，每天用药 3 次，共 1200mg）与本品合用时，沙奎那韦的 AUC 和 C_{max}分别降低 62% 和 45% ~ 50%。建议不要将本品与单独用作蛋白酶抑制剂的沙奎那韦合用。

利福霉素类：在 12 名未感染 HIV 的志愿者中，利福平可减少依非韦伦的 AUC26% 和 C_{max}20%。当与利福平同服时，本品的剂量应当提高到一日 800mg。与本品同服时利福平的剂量不需调整。一项在未感染 HIV 的志愿者中进行的研究表明，依非韦伦可分别减少利福布丁的 C_{max}32% 和 AUC38%，并增加利福布丁的清除率。利福布丁对依非韦伦的药代动力学没有显著影响。以上资料表明与依非韦伦联合服用时，利福布丁每天的用量应增加 50%，若每周 2 ~ 3 次服用利福布丁，则利福布丁的剂量应

加倍。

克拉霉素：将本品每天1次400mg与克拉霉素每12小时500mg合用7天，依非韦伦对克拉霉素的药代动力学将产生明显影响。与本品联合用药时，克拉霉素的AUC和C_{max}分别降低约39%和26%，而克拉霉素羟基代谢物的AUC和C_{max}分别增高约34%和49%。克拉霉素血浆水平的这些改变的临床意义还不清楚。服用本品和克拉霉素时，46%的未受感染的志愿者出现皮疹。与克拉霉素联合用药时，建议不必调整本品的剂量。而应考虑调整克拉霉素的剂量。

口服避孕药：仅对口服避孕药的炔雌醇成分进行了研究。炔雌醇单剂用药后的AUC因依非韦伦而增加（37%）。炔雌醇的C_{max}未见明显变化。这些影响的临床意义尚不清楚。炔雌醇单剂用药未见对依非韦伦的C_{max}和AUC有何影响。因为依非韦伦与口服避孕药的潜在相互作用尚未完全阐明，所以除口服避孕药外还应该使用可靠的屏障避孕方法。

抗惊厥药物：尚未进行依非韦伦和抗惊厥药物相互作用的研究。当依非韦伦与抗惊厥药物如卡巴咪嗪、苯妥英钠和苯巴比妥联合用药时，可能减少抗惊厥药物的血浆浓度，因此需定期监测血浆药物浓度。

美沙酮：一项在感染了HIV的静脉药物使用者中进行的研究发现，同时应用依非韦伦和美沙酮可减少美沙酮的血浆药物浓度并可产生鸦片样的戒断症状。美沙酮的剂量需平均增加22%以减轻戒断症状。应监控患者的戒断症状，必要时可增加美沙酮的剂量以减轻戒断症状。

小连翘属植物（金丝桃属）：服用依非韦伦的患者应避免服用含有小连翘属植物（金丝桃属）的制剂，因为可导致依非韦伦血药浓度的下降。这一效应是由于诱导CYP3A4活性导致疗效的丧失并产生耐药。

抗抑郁药：联合服用帕罗西汀和依非韦伦时，药代动力学参数没有临床显著变化，因此两药联用时都不需要调整剂量。舍曲林对依非韦伦的药代动力学没有显著影响，但依非韦伦可分别减少舍曲林C_{max}和AUC28.6%～46.3%。当联合服用舍曲林和依非韦伦时，应增加舍曲林的剂量以补偿依非韦伦诱导的舍曲林的代谢异常。舍曲林剂量的调整应在临床疗效的指导下进行。西替利嗪对依非韦伦的药代动力学参数的影响无明显的临床意义。依非韦伦可减少西替利嗪的C_{max}24%但不改变西替利嗪的AUC。这些改变不产生显著的临床效应。因此，西替利嗪和依非韦伦联合用药时不需调整两药的剂量。

氯羟去甲安定：依非韦伦可分别增加氯羟去甲安定C_{max}16.3%和AUC7.3%。依非韦伦对氯羟去甲安定药代动力学的影响在临床上没有显著性。因此两药联用时无需调整各自的剂量。

大麻酚类试验相互作用：依非韦伦不与大麻酚类受体结合。在服用本品的未受感染的志愿者中报告有尿液大麻酚试验假阳性。仅在用于筛选的CEDI-ADAU多水平THC测定中观察到假阳性结果，而在其他的大麻酚试验（包括用于确认阳性结果的试验）均未观察到假阳性试验结果。

【药物过量】已有某些偶然服用每天2次600mg的患者出现神经系统症状增多的报告，一名患者出现不自主肌肉收缩。本品过量用药的治疗需采取一般支持性措施，包括监测生命体征并观察患者的临床状况。可给予活性炭以帮助去除未吸收的药物。尚无本品过量用药的特异解毒剂。由于依非韦伦与蛋白高度结合，透析不可能有效地从血液中清除该药物。

已有某些偶然服用每天2次600mg的患者出现神经系统症状增多的报告，一名患者出现不自主肌肉收缩。

本品过量用药的治疗需采取一般支持性措施，包括监测生命体征并观察患者的临床状况。可给予活性炭以帮助去除未吸收的药物。尚无本品过量用药的特异解毒剂。由于依非韦伦与蛋白高度结合，透析不可能有效地从血液中清除该药物。

【不良反应】临床试验中依非韦伦有良好的耐受性。依非韦伦已在超过9000名患者中得到验证。在与蛋白酶抑制剂和（或）核苷类逆转录酶抑制剂联合用药的临床对照试验中，1008名患者每天服用600mg本品，在至少5%的患者中最常报道的与治疗有关的，至少为中重度不良事件的是皮疹（11.6%）、头晕眼花（8.5%）、恶心（8.0%）、头痛（5.7%）和乏力（5.5%）。对照组中恶心的发生率更高。与本品有关的最值得注意的不良事件为皮疹和神经系统症状。

临床试验中其他一些较少发生的与治疗相关的不良事件包括：过敏反应、协调异常、共济失调、混乱、昏迷、眩晕、呕吐、腹泻、肝炎、注意力不集中、失眠、焦虑、多梦、困倦、抑郁、思维异常、兴奋、健忘、精神错乱、情绪不稳定、欣快、幻觉和精神症状。

另外一些上市后监测报道的不良事件包括：神经衰弱、妄想症、惊厥、瘙痒症、腹痛、视力模糊、男子乳房发育和肝功能衰竭。

除了皮疹的发生率较高及程度较为严重外，儿童中其余不良反应的类型和发生率基本上与成人相似。

皮疹：临床试验中，接受600mg本品治疗的患者有26%发生皮疹（其中18%被认为与治疗有关），而对照组中患者皮疹的发生率为17%。接受本品治疗的患者发生严重的皮疹不超过1%，同时1.7%的患者因皮疹而中断治疗。多形性红斑或Stevens－Johnson综合征的发生率为0.14%。接受依非韦伦治疗的57名儿童中有26名儿童（46%）出现皮疹，其中3名儿童（5%）出现严重的皮疹。可考虑儿童开始依非韦伦治疗前可适当预防性应用抗组胺药。皮疹通常是轻至中度的斑丘疹性皮疹，发生于开始本品治疗的头2周。大多数患者的皮疹随着本品的继续治疗会在1个月内消退。对于因皮疹而中断治疗的患者可重新开始服用本品。重新服用本品时，建议使用适当的抗组胺药和（或）皮质激素类药物。本品用于中断了NNRTI类其他抗逆转录病毒药治疗患者的临床经验很有限。19名因皮疹而中断奈韦拉平治疗的患者已接受本品治疗。这些患者中9人在服用本品时发生轻至中度皮疹，2人因皮疹而停药。

精神症状：接受依非韦伦治疗的患者中有严重的精神不良事件的报道。在一项对照研究中，1008名患者接受了平均1.6年包含依非韦伦方案的治疗，而对照组635人接受了平均1.3年的对照剂治疗。依非韦伦组和对照组明确的严重精神事件的发生率分别为：严重抑郁（1.6%，0.6%）、自杀倾向（0.6%，0.3%）、非致命的自杀企图（0.4%，0%）、攻击性行为（0.4%，0.3%）、偏执状态（0.4%，0.3%）和躁狂（0.1%，0%）。既往有精神疾患的患者似乎有更高的危险性产生上述精神症状，躁狂的发生率升高到0.3%，严重抑郁和自杀倾向的发生率升高到2.0%。个别上市后报道有自杀身亡、错觉和神经质行为，但是尚不能肯定这些报道与依非韦伦相关。

神经系统症状：临床试验中，每天服用600mg本品的患者，常报道的神经系统症状包括但不仅限于眩晕、失眠、困倦、注意力降低及多梦。在600mg本品与其他抗逆转录病毒药合用的对照临床试验中，19.4%的患者出现中度至重度神经系统症状（其中2.0%为重度症状），相比之下，服用对照药物的患者有9%出现神经系统症状（其中1.3%为重度症状）。

临床试验中，2.1%用600mg本品治疗的患者由于神经系统症状而中止治疗。神经系统症状通常开始于治疗的头1或2天并且在头2～4周后基本消除。在一项临床研究中，发生至少中度以上神经系统症状的时间一般在4～48周，发生在5%～9%的接受依非韦伦治疗的患者及3%～5%的对照组中。在一项未受感染志愿者的研究中，代表性神经系统症状发作的中位时间为服药后1小时而中位持续期为3小时。临睡时服药可改善这些症状的耐受性，并且建议在治疗的第1周以及持续出现这些症状的患者临睡时服药。降低剂量或分次服用每天剂量并未能带来益处，因此不建议这样用药。

实验室化验指标异常：①肝酶：1008名接受600mg依非韦伦治疗的患者中有3% AST和ALT升高到正常上限的5倍以上。对照组中也有类似的肝酶升高。接受600mg依非韦伦治疗的患者中有156名乙型肝炎和（或）丙型肝炎的血清标志阳性，7%患者的AST以及8%患者的ALT升高到正常上限的5倍以上。对照组的患者中有91名乙型肝炎和（或）丙型肝炎的血清标志阳性，5%患者的AST以及4%患者的ALT升高到上述水平。所有接受600 mg依非韦伦治疗的患者中有4% GGT升高到正常上限的5倍以上，其中乙肝和丙肝患者的发生率是10%。对照组中，无论有无感染乙肝或丙肝，GGT类似升高的发生率是1.5%～2%。依非韦伦治疗的患者中单独的GGT升高反映的是酶的诱导而非肝毒性。②血脂：某些服用依非韦伦的未感染HIV者总胆固醇可升高10%～20%。依非韦伦＋ZDV＋3TC方案治疗的患者非空腹总胆固醇和HDL分别可升高大约20%和25%，依非韦伦＋IDV方案治疗的患者大约可升高40%和35%。依非韦伦对甘油三酯和LDL的作用无详细报道。目前尚不明确这些血脂改变的临床意义。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
依非韦伦片	化学药	HZ004451

HY002453 依降钙素

【外文名称】Elcatonin

【性状及组成】依降钙素是人工合成的鳗鱼降钙素衍生物，因为结构式中乙烯键替代鳗鱼降钙素S－S键，在保证鱼类降钙素高效特点的同时，使多肽分子更稳定。

药物药理信息

【药理毒理】本品为人工合成的鳗鱼降钙素多肽衍生物的无菌水溶液，其主要作用是抑制破骨细胞活性，减少骨的吸收，防止骨钙丢失，同时可降低正常动物和高钙血症动物血清钙，对实验性骨质疏松有改善骨强度、骨皮质厚度、骨钙质含量、骨密度等作用。

【药代动力学】据国外文献资料报道，健康成人肌内注射依降钙素0.5μg/kg时，30分钟后血药浓度

达峰值，持续时间 120 分钟，肌内注射的消除半衰期 $t_{1/2}$为 4.8 小时。

【不良反应】

1. 休克：偶见休克，故应密切观察，若有症状出现，应立即停药并及时治疗。

2. 过敏症：若出现皮疹、荨麻疹等时，应停药。

3. 循环系统：偶见颜面潮红、热感、胸部压迫感、心悸。

4. 消化系统：恶心、呕吐、食欲减退、偶见腹痛、腹泻、口渴、胃灼热等。

5. 神经系统：偶见眩晕、步态不稳，偶见头痛、耳鸣、手足抽搐。

6. 肝脏：少见 AST、ALT 上升。

7. 电解质代谢：偶见低钠血症。

8. 注射部位：偶见疼痛。

9. 其他：瘙痒，偶见哮喘、出汗、指端麻木、尿频、水肿、视力模糊、咽喉部有含薄荷类物质后感觉、发热、寒战、无力感、全身乏力等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
依降钙素注射液	化学药	HZ004453

HY002454　依卡倍特钠

【外文名称】Ecabet Sodium

药物药理信息

【药理毒理】本品是一抗溃疡药物，其并无抗革兰阳性或阴性菌的抗微生物活性，但却能抑制 H pylori 感染的胃上皮细胞 NF－kB 的激活和 IkB－a 的降解及 IL－8 基因的转录和 IL－8 的分泌，这种对炎症的抑制作用可能是其发挥抗溃疡活性的机制之一。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
依卡倍特钠颗粒	化学药	HZ004454

HY002455　依可碘酯

【其他名称】碘化胆碱硫磷酯、碘化二乙氧磷酰硫胆碱、碘化磷、碘磷定

【外文名称】Ecothiopate Iodide

药物药理信息

【药理毒理】本品为难逆性胆碱酯酶抑制剂。主要用于原发性青光眼、慢性单纯性（开角）青光眼、调节性内斜视。

【药物过量】本品过量时，由于强烈的缩瞳和调节痉挛，可致前额头痛、眼睑抽搐。

【不良反应】本品可有虹膜及结合膜血管扩张、充血。长期应用可引起白内障，过量吸收可出现急性痉挛性腹痛，甚至支气管痉挛等。

HY002456　依拉地平

【其他名称】Comir、导脉顺、Dynacirc、Prescal、Vascal、易拉地平、伊拉地平

【外文名称】Isradipine

药物药理信息

【药理毒理】本品为二氢吡啶类钙拮抗药，对血管的选择性高、能舒张外周血管、冠状血管和脑血管，对心脏的作用较小，仅抑制窦房结的自发活动。可使血压下降，生效较慢（2～4 周），持续时间较久。用于高血压、冠心病和心绞痛，也可用于充血性心力衰竭。

【药代动力学】本品口服后吸收良好，由于首过效应明显，生物利用率仅 17%。口服后血药浓度峰时间为 2 小时，在血浆中与蛋白的结合率为 95%。在肝中代谢。$t_{1/2}$约 9 小时。

【不良反应】本品不良反应主要是由于血管舒张所致的头痛、眩晕、心悸、面部潮红等。偶见肝功异常，且为时短暂。有时出现胃肠道不适等。

HY002457　依那普利拉

【其他名称】苯丁酯脯酸、苯酯丙脯氨酸、苯酯丙脯酸

【外文名称】Enalapril

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 55 册

药物理化信息

【化学名】*N*－〔（*S*）－1－羧基－3－苯丙基〕－L－丙氨酰－L－脯氨酸二水合物

【分子式】$C_{18}H_{24}N_2O_5 \cdot 2H_2O$

【分子量】384.43

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭。

本品在甲醇中略溶，在水中微溶，在乙醇中极微溶解，在三氯甲烷中几乎不溶；在稀盐酸中易溶。

比旋度：取本品适量，精密称定，加甲醇溶解并稀释制成每 1ml 中含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为－53°至－56°。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
依那普利拉注射液	化学药	HZ004455

HY002458 依诺肝素钠

【外文名称】Enoxaparin Sodium

药物药理信息

【药理毒理】为低分子肝素之一种，低分子肝素为经解聚的肝素分子片断，具有极强的抗凝因子Ⅹa功能及弱的抗凝血酶、与血小板结合及影响血小板功能的作用。与肝素比较，其优点为以低剂量能发挥更大生物效应，半衰期长，有更好的预测剂量效应，低分子肝素分子量一般在3500～7000D之间，化学、生物学及药理学也有差异。

【药代动力学】皮下注射后，血浆中抗Ⅹa活力可持续24小时。

【药物相互作用】与口服抗凝剂、抗血小板聚集药、乙酰水杨酸、非类固醇抗炎药及右旋糖酐等合用时，可发生凝血方面的相互作用。

【药物过量】过量引起出血时可用鱼精蛋白缓慢静注，1mg可中和本品1mg抗Ⅱa因子作用，但不能全部中和抗Ⅹa因子活力，仍可保持本品抗血栓形成作用。

【不良反应】血小板减少症，注射部位出血、瘀斑或坏死、全身或局部变态反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
依诺肝素钠注射液	化学药	HZ004458

HY002459 依诺沙星

【其他名称】Comprecin、ENX、氟啶酸、Flumark、Gyramid

【外文名称】Enoxacin

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】1－乙基－6－氟－1，4－二氢－4－氧代－7－（1－哌嗪基）－1，8－萘啶－3－羧酸倍半水合物

【分子式】$C_{15}H_{17}FN_4O_3 \cdot 1.5 * H_2O$

【分子量】347.35

【性状及组成】本品为类白色至微黄色结晶性粉末，无臭，味苦。本品在甲醇中微溶，在乙醇中极微溶解，在水中不溶；在冰醋酸或氢氧化钠试液中易溶。

熔点：本品的熔点为222～227℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】本品具广谱抗菌作用，尤其对需氧革兰阴性杆菌抗菌活性高，对下列细菌在体外具良好抗菌作用：肠杆菌科的大部分细菌，包括枸橼酸杆菌属，阴沟杆菌，产气肠杆菌等肠杆菌属，大肠埃希菌，克雷伯菌属，变形杆菌属，沙门菌属，志贺菌属，弧菌属，耶尔森菌等。常对多重耐药菌也具有抗菌活性。对青霉素耐药的淋病奈瑟菌、产酶流感嗜血杆菌和莫拉菌属均具有高度抗菌活性。对铜绿假单胞菌等假单胞菌属的大多数菌株具抗菌作用。本品对甲氧西林敏感葡萄球菌具抗菌活性，对肺炎链球菌、溶血性链球菌和粪肠球菌仅具中等抗菌活性。对沙眼衣原体、支原体、军团菌具良好抗微生物作用，对结核杆菌和非典型分枝杆菌也有抗菌活性。对厌氧菌的抗菌活性差。

依诺沙星为杀菌剂，通过作用于细菌DNA螺旋酶的A亚单位，抑制DNA的合成和复制而导致细菌死亡。

【药代动力学】口服后吸收完全，相对生物利用度约为90%。单剂量给药后血药达峰时间约为1～3小时。血消除半衰期约为3.3～5.8小时，蛋白结合率为18%～57%。

本品吸收后广泛分布至各组织、体液，组织中的浓度常超过血药浓度而达有效水平。

本品主要自肾排泄，48小时内给药量的52%～60%以原形自尿中排出，一部分（20%）在体内代谢。胆汁排泄越18%。

滴眼液，软膏为局部用药，只有少量吸收。

【药物相互作用】

1．尿碱化剂可减低本品在尿中的溶解度，导致结晶尿和肾毒性。

2．本品与茶碱类合用时可能由于与细胞色素P450结合部位的竞争性抑制，导致茶碱类的肝消除明显减少，血消除半衰期延长，血药浓度升高，出现茶碱中毒症状，如恶心、呕吐、震颤、不安、激动、抽搐、心悸等，应避免合用，不能避免时应测定茶碱类血药浓度并调整剂量。

3．环孢素与本品合用时，其血药浓度升高，必须监测环孢素血浓度，并调整剂量。

4．本品与抗凝药华法林合用时可增强后者的抗凝作用，故应避免二者合用。不能避免时应严密监测患者的凝血酶原时间、并调整剂量。

5．丙磺舒可减少本品自肾小管分泌约50%，合用时可因本品血浓度增高而产生毒性。

6. 本品干扰咖啡因的代谢，从而导致咖啡因消除减少，血消除半衰期延长，并可能产生中枢神经系统毒性，故应避免二者合用。不能避免时应严密监测患者咖啡因的血药浓度并调整剂量。

7. 含铝、镁的制酸药可减少本品的口服吸收，不宜合用。

8. 本品与非甾体类抗炎药芬布芬合用时，偶有抽搐发生，因此不宜与芬布芬合用。

9. 滴眼液，软膏长期大量使用经局部吸收后，可产生与全身用药相同的药物相互作用，如可使茶碱类、环孢素、丙磺舒等药物血药浓度升高，增强抗凝药华法林的抗凝作用，干扰咖啡因的代谢等。

【不良反应】

1. 胃肠道反应较为常见，可表现为腹部不适或疼痛、腹泻、恶心或呕吐。

2. 中枢神经系统反应可有头昏、头痛、嗜睡或失眠。

3. 过敏反应：皮疹、皮肤瘙痒，偶可发生渗出性多形性红斑及血管神经性水肿。少数患者有光敏反应。

4. 偶可发生：①癫痫发作、精神异常、烦躁不安、意识混乱、幻觉、震颤；②血尿、发热、皮疹等间质性肾炎表现；③静脉炎；④结晶尿，多见于高剂量应用时；⑤关节疼痛。

5. 少数患者可发生血清氨基转移酶升高、血尿素氮增高及周围血常规白细胞降低，多属轻度，并呈一过性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
依诺沙星滴眼液	化学药	HZ004459
依诺沙星胶囊	化学药	HZ004460
依诺沙星片	化学药	HZ004461
依诺沙星乳膏	化学药	HZ004462
依诺沙星注射液	化学药	HZ004463

HY002460　依帕司他

【其他名称】Kinedak、依帕他特

【外文名称】Epalrestat

药物药理信息

【药理毒理】本品为醛糖还原酶抑制药，以可逆地抑制与糖尿病性并发症的发病机制相关的多元醇代谢中葡萄糖转化为山梨醇的醛糖还原酶而发挥作用，已知山梨醇能影响神经细胞功能，它在神经元内蓄积会引起糖尿病性支配感觉运动的外周神经病症状。

【不良反应】

1. 偶见肌酐、胆红素及氨基转移酶升高等，此外尚可出现红斑、水疱等症状，应停药并适当处置。

2. 妊娠及哺乳妇女忌用。

3. 服用本品后尿液呈黄褐色，会影响胆红素及酮体尿定性试验。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
依帕司他胶囊	化学药	HZ004464
依帕司他片	化学药	HZ004465

HY002461　依泮洛尔

【其他名称】Visacor

【外文名称】Epanolol

药物药理信息

【药理毒理】本品为选择性 β_1 - 受体阻断药，有内在拟交感活性，无膜稳定作用。内在拟交感活性强度介于吲哚洛尔和醋丁洛尔之间。对静息心率无明显影响，对外周阻力有一定上升作用。临床对高血压治疗的效果不及阿替洛尔。也可用于心绞痛。

【不良反应】可见乏力、嗜睡、头晕、失眠、恶心、腹胀、皮疹、晕厥、低血压、心动过缓等。

HY002462　依普黄酮

【其他名称】7 - 异丙氧基异黄酮

【外文名称】Ipriflavone

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 54 册

药物理化信息

【化学名】7 - 异丙氧基 - 3 - 苯基 - 4*H* - 1 - 苯并吡喃 - 4 - 酮

【分子式】$C_{18}H_{16}O_3$

【分子量】280.32

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶及结晶性粉末，无臭，无味。

本品在三氯甲烷或二甲基甲酰胺中易溶，在丙酮或乙酸乙酯中溶解，在无水乙醇或乙醚中微溶，在水中几乎不溶。

熔点：本片的熔点为 116 ~ 120℃。

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理作用：本品是用于改善骨质疏松症所致

的骨量减少的药物，对卵巢切除和泼尼松龙造成的实验性骨质疏松模型大鼠均有抑制骨量减少的作用。其作用机制包括：直接抑制骨吸收；通过雌激素样作用增加降钙素的分泌，间接产生抗骨吸收作用；促进骨的形成。

2．毒理研究

（1）安全性药理：小鼠经口给予本品 1000mg/kg（按体表面积折算，约相当于临床日推荐剂量的 8.1 倍）以上时，有镇静作用。大鼠经口给予本品 300mg/kg（按体表面积折算，约相当于临床日推荐剂量的 4.9 倍）时，有降低体温及降低胃液酸度的作用，但均为轻度。

（2）重复给药毒性：大鼠和犬连续 1 年经口给药，未见明显毒性反应，无影响日剂量分别为 3000mg/kg（按体表面积折算，分别相当于临床日推荐剂量的 49 倍和 81 倍）。

（3）遗传毒性：本品 Ames 试验，CHL 细胞染色体畸变试验和小鼠微核试验结果均为阴性。

（4）生殖毒性：①一般生殖毒性：妊娠前及妊娠初期的大鼠经口给予本品，日剂量达 3000mg/kg 时，对亲代动物的一般状态、繁殖功能和胎仔均无异常影响。②致畸敏感期毒性：大鼠及家兔在胎仔器官形成期经口给予本品，日剂量达到 3000mg/kg 时，可见有抑制雌性大鼠体重增长的倾向，此外未见其他异常。③围产期毒性：围产期大鼠经口给予本品日剂量 300、1000 和 3000mg/kg，各给药组仔鼠的体重增长均有被抑制的倾向。在 1000mg/kg（按体表面积折算，约相当于临床日推荐剂量的 16 倍）以上剂量，可见仔鼠外耳道开通或全身发育迟缓。

由于本品对妊娠中用药的安全性尚未确立，除非其预期治疗益处大于潜在危险性时，才可用于孕妇或可能怀孕的妇女。动物试验表明，本品可进入大鼠乳汁中，因此，哺乳妇女应慎用本品。

【药代动力学】本品经口服在小肠形成 7 种代谢物与原形一起吸收，约 1.3 小时后原形的血药浓度达到峰值，其中 4 种代谢物具有生物效能。主要分布在胃、肠、肝和骨中，经门静脉入肝脏代谢，单剂量 200mg 口服，半衰期 9.8 小时，药时曲线下面积 632ng·h/ml；48 小时内尿总排泄率为 42.9%，均为代谢产物形式；一日 600mg，连续服药 6 天，血药浓度达稳态，半衰期 23.6 小时，药时曲线下面积为 1455ng·h/ml。继续服药后原药及代谢物无体内蓄积，血药浓度不再升高。

【药物相互作用】

1．对摘除卵巢的动物，并用雌酮，可增强激素的作用，故在并用本药与雌激素制剂时应慎重用药。

2．并用茶碱时，可使茶碱的血浓度上升，故在并用本药与茶碱时应减少茶碱用量并慎重用药。

3．并用香豆素类抗凝血剂，可增强香豆素类抗凝血剂的作用，故在并用本药与抗凝血剂的作用时应减少香豆素类抗凝血剂的用量，并慎重用药。

【不良反应】罕见：不良反应发生率少于 0.1%；偶见：少于 0.1%～5%；常见：5%以上。

1．消化性溃疡、胃肠道出血：罕见出现消化性溃疡、胃肠道出血或恶化症状。当出现这种情况时，应立即停药，并给予适当的处理。故有消化道溃疡以及有消化道溃疡病史者慎用。

2．黄疸：罕见出现黄疸，故应密切观察，如有异常状况，立即停用该药，并进行适当处理。

3．其他不良反应。

（1）过敏反应：出疹、瘙痒等症状偶见，此时应停止用药。

（2）消化器官：偶见恶心、呕吐、食欲减退、胃部不适、烧心、腹痛、腹部胀满、腹泻、便秘、口腔炎、口干、舌炎、味觉异常等。

（3）神经系统：偶见眩晕、轻微头晕、罕见头痛等。

（4）血液：罕见粒细胞减少，偶见贫血等。

（5）肝脏：偶见胆红素、AST、ALT、AlP、LDH 上升，罕见 γ－GTP 上升。

（6）肾脏：罕见尿素氮、肌酐上升。

（7）其他：罕见男子女性型乳房，若此情况出现，应停止用药，罕见舌唇麻木，偶见水肿、不适。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
依普黄酮胶囊	化学药	HZ004466
依普黄酮片	化学药	HZ004467

HY002463 依前列醇

【其他名称】Cycloprostin、Flolan、环前列烯醇钠、环依前列烯醇、PGI2、Prostacyclin、Prostacyclin Sodium、前列环素、前列腺素 I2

【外文名称】Epoprostenol

药物药理信息

【药理毒理】本品广泛存在于哺乳动物体内，它在血管壁中形成，也从肺作为循环激素释出。在正常生理条件下，它能阻止血小板粘连于正常血管壁，保证血流通畅。

本品可防止血小板凝固，甚至能使血小板凝块解聚。

本品能够直接防止血小板接触非血管表面时发生的活化与聚集。因此，它可在体外循环时防止血

栓形成。同时，它还有血管扩张活性，可产生降压作用。

本品为抗血小板凝集药物，可用于心肺分流手术，活性炭血液灌注时保护血小板功能，肾透析时代替肝素，也用于心血管疾病的研究（包括心绞痛及外周血管疾患）。

【药代动力学】本品性质不稳定，在体内迅速分解为6－酮－PGF1αt为2～3分钟，其代谢物较稳定，但生物活性极弱。

【不良反应】静滴速度超过每分钟10μg/kg时，可出现头痛、腹部不适、高血糖等，超过20μg/kg时，可出现血压下降、心率减慢，甚至昏厥。

HY002464　依他苯酮

【其他名称】BAXACOR、DIALICOR、PAGANO－COR、乙胺苯乙酮

【外文名称】Etafenone

药物药理信息

【药理毒理】本品用于治疗心绞痛及冠脉功能不全。

【不良反应】可有胃肠道反应、下肢水肿、面部潮红等。

HY002465　依他尼酸

【外文名称】Etacrynic Acid

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】［2，3－二氯－4－（2－亚甲基丁酰基）苯氧基］乙酸

【分子式】$C_{13}H_{12}Cl_2O_4$

【分子量】303.14

【性状及组成】本品为白色结晶粉末，无臭，味微苦涩。本品在乙醇或乙醚中易溶，在水中几乎不溶；在冰醋酸中易溶。

熔点：121～125℃。

药物药理信息

【药理毒理】同呋噻米。

1．对水和电解质排泄的作用。能增加水、钠、氯、钾、钙、镁、磷等的排泄。与依他尼酸等袢利尿药不同，呋塞米等袢利尿药存在明显的剂量－效应关系。随着剂量加大，利尿效果明显增强，且药物剂量范围较大。本类药物主要通过抑制肾小管髓袢厚壁段对NaCl的主动重吸收，结果管腔液Na^+、Cl^-浓度升高，而髓质间液Na^+、Cl^-浓度降低，使渗透压梯度差降低，肾小管浓缩功能下降，从而导致水、Na^+、Cl^-排泄增多。由于Na^+重吸收减少，远端小管Na^+浓度升高，促进Na^+-K^+和Na^+-H^+交换增加，K^+和H^+排出增多。至于依他尼酸抑制肾小管髓袢升支厚壁段重吸收Cl^-的机制，过去曾认为该部位存在氯泵，目前研究表明该部位基底膜外侧存在与Na^+-K^+ ATP酶有关的Na^+、Cl^-配对转运系统，依他尼酸通过抑制该系统功能而减少Na^+、Cl^-的重吸收。另外，依他尼酸可能尚能抑制近端小管和远端小管对Na^+、Cl^-的重吸收，促进远端小管分泌K^+。依他尼酸通过抑制亨氏袢对Ca^{2+}、Mg^{2+}的重吸收而增加Ca^{2+}、Mg^{2+}排泄。短期用药能增加尿酸排泄，而长期用药则可引起高尿酸血症。

2．对血流动力学的影响。依他尼酸能抑制前列腺素分解酶的活性，使前列腺素E_2含量升高，从而具有扩张血管作用。扩张肾血管，降低肾血管阻力，使肾血流量尤其是肾皮质深部血流量增加，在依他尼酸的利尿作用中具有重要意义，也是其用于预防急性肾功能衰竭的理论基础。另外，与其他利尿药不同，袢类利尿药在肾小管液流量增加的同时肾小球滤过率不下降，可能与流经致密斑的氯减少，从而减弱或阻断了球－管平衡有关。依他尼酸能扩张肺部容量静脉，降低肺毛细血管通透性，加上其利尿作用，使回心血量减少，左心室舒张末期压力降低，有助于急性左心衰竭的治疗。由于依他尼酸可降低肺毛细血管通透性，为其治疗成人呼吸窘迫综合征提供了理论依据。

【药代动力学】口服吸收迅速完全。血浆蛋白结合率高。口服和静脉注射作用开始时间分别约30分钟和5分钟，作用达峰时间分别为2小时和15～30分钟，作用持续时间分别为6～8小时和2小时，67%经肾脏排泄，33%经胆汁和粪便排泄，其中20%为原形排泄。

【药物相互作用】

1．肾上腺糖、盐皮质激素，促肾上腺皮质激素及雌激素能降低本药的利尿作用，并增加电解质紊乱尤其是低钾血症的发生机会。

2．非甾体类消炎镇痛药能降低本药的利尿作用，肾损害机会也增加，与前者抑制前列腺素合成、减少肾血流量有关。

3．与拟交感神经药物及抗惊厥药物合用，利尿作用减弱。

4．与氯贝丁酯合用，两药的作用均增强，并可出现肌肉酸痛、强直。

5．与多巴胺合用，利尿作用加强。

6．饮酒及含酒精制剂和可引起血压下降的药物能增强本药的利尿和降压作用；与巴比妥类药物、

麻醉药合用，易引起体位性低血压。

7. 本药可使尿酸排泄减少，血尿酸升高，故与治疗痛风的药物合用时，后者的剂量应作适当调整。

8. 降低降血糖药的疗效。

9. 降低抗凝药物和抗纤溶药物的作用，主要是利尿后血容量下降，致血中凝血因子浓度升高，以及利尿使肝血液供应改善、肝脏合成凝血因子增多有关。

10. 本药加强非去极化肌松药的作用，与血钾下降有关。

11. 与两性霉素、头孢霉素、氨基糖苷类等抗生素合用，肾毒性和耳毒性增加，尤其是原有肾损害时。

12. 与抗组胺药物合用时耳毒性增加，易出现耳鸣、头晕、眩晕。

13. 与锂合用肾毒性明显增加，应尽量避免。

14. 服用水合氯醛后静注本药可致出汗、面色潮红和血压升高，此与甲状腺素由结合状态转为游离状态增多，导致分解代谢加强有关。

15. 与碳酸氢钠合用发生低氯性碱中毒机会增加。

【不良反应】常见者与水、电解质紊乱有关、尤其是大剂量或长期应用时，如体位性低血压、休克、低钾血症、低氯血症、低氯性碱中毒、低钠血症、低钙血症以及与此有关的口渴、乏力、肌肉酸痛、心律失常等。

少见者有过敏反应（包括皮疹、间质性肾炎、甚至心脏骤停）、视觉模糊、黄视症、光敏感、头晕、头痛、纳差、恶心、呕吐、腹痛、腹泻、胰腺炎、肌肉强直等，骨髓抑制导致粒细胞减少，血小板减少性紫癜和再生障碍性贫血，肝功能损害，指、趾感觉异常，高糖血症，尿糖阳性，原有糖尿病加重，高尿酸血症。但胃肠道反应、水样腹泻和耳毒性较呋噻米多见。尚可引起血尿和消化道出血。对糖代谢的影响较呋塞米轻。有较强的耳源性毒性，目前临床上较少用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
依他尼酸片	化学药	HZ004468

HY002466 依他尼酸钠

【外文名称】Sodium Etacrynate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】［2，3－二氯－4－（2－亚甲基丁酰基）苯氧基］乙酸钠

【分子式】$C_{13}H_{11}Cl_2NaO_4$

【分子量】325.12

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，味苦涩。本品在水中溶解，在乙醇中微溶。

药物药理信息

【药理毒理】

1. 对水和电解质排泄的作用。能增加水、钠、氯、钾、钙、镁、磷等的排泄。与噻嗪类利尿药不同，依他尼酸等袢利尿药存在明显的剂量－效应关系。随着剂量加大，利尿效果明显增强，且药物剂量范围较大。本类药物主要通过抑制肾小管髓袢厚壁段对 NaCl 的主动重吸收，结果管腔液 Na^+、Cl^- 浓度升高，而髓质间液 Na^+、Cl^- 浓度降低，使渗透压梯度差降低，肾小管浓缩功能下降，从而导致水、Na^+、Cl^- 排泄增多。由于 Na^+ 重吸收减少，远端小管 Na^+ 浓度升高，促进 Na^+-K^+ 和 Na^+-H^+ 交换增加，K^+ 和 H^+ 排出增多。至于依他尼酸抑制肾小管髓袢升支厚壁段重吸收 Cl^- 的机制，过去曾认为该部位存在氯泵，目前研究表明该部位基底膜外侧存在与 Na^+，K^+-ATP 酶有关的 Na^+、Cl^- 配对转运系统，依他尼酸通过抑制该系统功能而减少 Na^+、Cl^- 的重吸收。另外，依他尼酸可能尚能抑制近端小管和远端小管对 Na^+、Cl^- 的重吸收，促进远端小管分泌 K^+。依他尼酸通过抑制亨氏袢对 Ca^{2+}、Mg^{2+} 的重吸收而增加 Ca^{2+}、Mg^{2+} 排泄。短期用药能增加尿酸排泄，而长期用药则可引起高尿酸血症。

2. 对血流动力学的影响。依他尼酸能抑制前列腺素分解酶的活性，使前列腺素 E_2 含量升高，从而具有扩张血管作用。扩张肾血管，降低肾血管阻力，使肾血流量尤其是肾皮质深部血流量增加，在依他尼酸的利尿作用中具有重要意义，也是其用于预防急性肾功能衰竭的理论基础。另外，与其他利尿药不同，袢利尿药在肾小管液流量增加的同时肾小球滤过率不下降，可能与流经致密斑的氯减少，从而减弱或阻断了球－管平衡有关。依他尼酸能扩张肺部容量静脉，降低肺毛细血管通透性，加上其利尿作用，使回心血量减少，左心室舒张末期压力降低，有助于急性左心衰竭的治疗。由于依他尼酸可降低肺毛细血管通透性，为其治疗成人呼吸窘迫综合征提供了理论依据。

【药代动力学】主要分布于细胞外液，分布容积平均为体重的 11.4%，血浆蛋白结合率为 91%～97%，几乎均与白蛋白结合，本药能通过胎盘屏障，并可泌入乳汁中。静脉用药后作用开始时间为 5 分

钟，达峰时间为 0.33～1 小时。作用持续时间为 2 小时，$t_{1/2\beta}$存在较大的个体差异，正常人为 30～60 分钟，无尿患者延长至 75～155 分钟，肝肾功能同时严重受损者延长至 11～20 小时。新生儿由于肝肾廓清能力较差，延长至 4～8 小时。88%以原形经肾脏排泄，12%经肝脏代谢由胆汁排泄。肾功能受损者经肝脏代谢增多。本药不被透析清除。

【不良反应】胃肠道反应、水样腹泻和耳毒性较呋噻米多见。尚可引起血尿和消化道出血。对糖代谢多影响较呋噻米轻。

常见者与水、电解质紊乱有关，尤其是大剂量或长期应用时，如体位性低血压、休克、低钾血症、低氯血症、低氯性碱中毒、低钠血症、低钙血症以及与此有关的口渴、乏力、肌肉酸痛、心律失常等。

少见者有过敏反应（包括皮疹、间质性肾炎、甚至心脏骤停）、视觉模糊、黄视症、光敏感、头晕、头痛、纳差、恶心、呕吐、腹痛、腹泻、胰腺炎、肌肉强直等，骨髓抑制导致粒细胞减少，血小板减少性紫癜和再生障碍性贫血，肝功能损害，指、趾感觉异常，高糖血症，尿糖阳性，原有糖尿病加重，高尿酸血症。耳鸣、听力障碍多见于大剂量静脉快速注射时（每分钟剂量大于 4～15mg），多为暂时性，少数为不可逆性，尤其当与其他有耳毒性的药物同时应用时。在高钙血症时，可引起肾结石。尚有报道本药可加重特发性水肿。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用依他尼酸钠	化学药	HZ0005118

HY002467　依替菲宁

【外文名称】Etifenin

【分子式】$C_{16}H_{22}N_2O_5$

【分子量】322.36

药物药理信息

【药理毒理】本品不直接使用，无单独的药理作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用亚锡依替菲宁	化学药	HZ0005040

HY002468　依替膦酸二钠

【外文名称】Etidronate Disodium

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 54 册

药物理化信息

【化学名】（1－羟基亚乙基）二膦酸二钠盐

【分子式】$C_2H_6Na_2O_7P_2$

【分子量】249.99

【性状及组成】本品为白色粉末，无臭，味微咸；具引湿性。

本品在水中易溶，在甲醇、无水乙醇或乙醚或三氯甲烷中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为骨代谢调节药。对体内磷酸钙有较强的亲和力，能抑制人体异常钙化和过量骨吸收，减轻骨痛；降低血清碱性磷酸酶和尿羟脯氨酸的浓度；在低剂量时可直接抑制破骨细胞形成及防止骨吸收、降低骨转换率，增加骨密度等达到骨钙调节作用。

【药代动力学】据报道正常成人一次口服 20mg/kg，1 小时后血清中浓度达到最高，半衰期为 2 小时，24 小时后为 0.03μg/ml，连续服药 7 天未见蓄积倾向。吸收率约 6%，进入体内后在骨及肾脏中浓度最高，随尿液排出 8%～16%，随粪便排出 82%～94%。

【不良反应】腹部不适、腹泻、便软、呕吐、口炎、咽喉灼热感、头痛、皮肤瘙痒、皮疹等症状。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
依替膦酸二钠胶囊	化学药	HZ0004469
依替膦酸二钠片	化学药	HZ0004470

HY002469　依替唑仑

【其他名称】Depas、乙噻二氮、乙替唑仑

【外文名称】Etizolam

【性状及组成】本品为白色或微黄白色结晶性粉末，无臭、无味。可溶于甲醇、三氯甲烷、0.1mol/L 盐酸试溶液，易溶于乙醇，略溶于乙酸乙酯、乙醚，几乎不溶于水。

药物药理信息

【药理毒理】本品属苯二氮䓬类抗焦虑药，其抗焦虑作用比地西泮强 3～5 倍，但其作用又与地西泮不完全相同。本品可抑制脑内去甲肾上腺素的周转率和肌挛缩（2 型），其作用机制主要是通过对大脑边缘系统尤其是扁桃核，抑制网状结构激活系统而产生镇静和催眠作用。常用的苯二氮䓬类药物抗肌挛缩而致的惊厥，对 γ 型肌挛缩强而对 α 型肌挛缩

弱，本品则对 γ 型和 α 型肌挛缩均有较强的抑制作用，因而具有很强的中枢性肌松作用。

【药代动力学】口服可迅速自胃肠道吸收，最后自粪便及尿排出体外。经肝脏代谢，原形药的血浆 $t_{1/2}$约为 3 小时，代谢物的 $t_{1/2}$为 8～16 小时。长期服用无蓄积作用。急性毒性较小。药物依赖性几乎与现有的苯二氮䓬类相同。

【药物相互作用】不能与单胺氧化酶抑制剂合用。

【不良反应】本品不良反应发生率较低，长期大量应用可出现依赖性。偶见谵妄、震颤、失眠、不安、兴奋、头昏、妄想、焦躁、视力模糊、ALT 及 AST 升高、呼吸困难、心悸、直立时眩晕、恶心、呕吐、便秘、乏力、出汗、排尿困难等。罕见过敏反应。

HY002470 依托泊苷

【其他名称】表鬼臼毒比喃葡萄糖甙、泛必治、鬼臼乙叉甙、VP－16、VP－16－213、依托泊甙、依托扑沙、足叶乙叉苷、足叶乙甙

【外文名称】Etopside

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】9－（4，6－*O*－亚乙基－β－D－吡喃葡萄糖苷）－4′－去甲基表鬼臼毒素

【分子式】$C_{29}H_{32}O_{13}$

【分子量】588.56

【性状及组成】本品为灰白色结晶性粉末，微溶于水，可溶于有机溶剂。pH5 时最稳定。在碱性溶液中，异构变为顺式内酯。

药物药理信息

【药理毒理】本品为半合成鬼臼脂素衍生物，有抗有丝分裂和抗肿瘤作用，高浓度（＞10μg/ml）能使进入分裂周期的细胞溶解；低浓度（0.3～1μg/ml）可抑制细胞进入分裂前期。实验证明 DNA 拓扑异构酶正是本品作用的靶点。本品与 Topo Ⅱ 和 DNA 可形成一种药物－酶－DNA 可裂性三元复合物，结果引起细胞剂量依赖性的单股和双股 DNA 断裂，细胞死亡。亦有认为，本品在肝线粒体酶和过氧化酶作用下发生去甲基化，产生中间产物，形成自由基，破坏单股及双股 DNA，发挥细胞毒作用。S 期和 G_2 期细胞对其最为敏感，因此是细胞周期特异性药物。本品对多种肿瘤细胞具有明显的细胞毒作用，抗癌谱较广。抗药性的细胞则靠放大编码 P－糖蛋白（使药物流出的载体）的 mdr－1 基因，或者靠突变或减少表达 Topo Ⅱ，或者靠突变细胞调亡所需的 P53 肿瘤抑制基因，达到抗药作用的。

【药代动力学】本品口服吸收后，在 0.5～4 小时达到血药浓度峰值，生物利用度为 50%，主要分布于胆汁，腹水，尿液，胸水和肺组织中，很少进入脑脊液。静注给药血浆浓度峰值可达 30μg/ml，血浆蛋白结合率达 40%，血浓度的降低呈双时相，肾功能正常者的终末相半衰期为 6～8 小时，约为给药量的 40%由尿以原形排泄，肾功不良者应按肌酐清除率的降低比率减少本品剂量。本品在脑脊液中的浓度平均为血浆浓度的 1%～10%。

人体血药浓度的半衰期为 7 小时（3 至 12 小时）。97%与血浆蛋白结合。由于本品与拓扑异构酶 Ⅱ 的结合是可逆的，并作用于细胞周期中持续时间较长的 S 期及 G_2 期，因此血药浓度持续时间长短比峰浓度高低更重要，一般采用静脉滴注，而不用静脉推注。44%至 60%由肾排泄（其中 67%以原形排泄）。粪便排泄仅占 16%。脑脊液中的浓度（给药 2 至 20 小时后）为血药浓度的 1%至 10%。

【药物相互作用】

1．由于本品有明显骨髓抑制作用，与其他抗肿瘤药物联合应用时应注意。

2．本品可抑制机体免疫防御机制，使疫苗接种不能激发人体抗体产生。

3．化疗结束后 3 个月以内，不宜接种病毒疫苗。

4．本品与血浆蛋白结合率高，因此，与其他血浆蛋白结合的药物合用可影响本品排泄。

【不良反应】常见的不良反应为骨髓抑制、胃肠道反应和脱发，表现为白细胞减少、血小板减少、恶心、呕吐、腹泻等症状。肾功能不全者慎用。静脉滴注速度过快会导致血压下降。极少数可发生严重过敏反应，应重视。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
依托泊苷胶囊	化学药	HZ004471
依托泊苷软胶囊	化学药	HZ004472
依托泊苷注射液	化学药	HZ004473

HY002471 依托度酸

【外文名称】Etodolac

药物理化信息

【化学名】（±）－1,8－二乙基－1,3,4,9－四氢吡喃［3,4－*b*］吲哚－1－乙酸

【分子式】$C_{17}H_{21}NO_3$

【分子量】287.37

药物药理信息

【药理毒理】本品为非甾体抗炎药。具有抗炎、解热和镇痛作用。其作用机制可能是通过阻断环氧合酶的活性，从而抑制了前列腺素（PG）的合成。

【药代动力学】据国外文献报道，口服给药吸收良好，没有明显的首过效应，全身生物利用度达80%或以上。每12小时给药在600mg以内时，血药浓度－时间曲线下面积与给药剂量成正比关系。99%以上的依托度酸与血浆蛋白结合，游离部分少于1%。单剂给药200～600mg，在（80±30）分钟内其平均血浆峰值浓度介于（14±4）～（37±9）mg/ml范围内。其平均血浆清除率为（47±16）ml/小时/kg，消除半衰期为（7.3± 4.0）小时。依托度酸经肝脏代谢，16%的给药剂量经粪便排泄。通常不根据体重决定给药剂量，但在推荐剂量下个体间血药浓度的差异显著，尤其在有胃肠道病变或服用影响GI吸收、蛋白结合率、损害肝肾功能的药物者。

【药物相互作用】

1．抗酸剂：同时服用抗酸剂对依托度酸的吸收没有明显的影响，然而抗酸剂可使依托度酸的峰值浓度下降15%～20%，但不影响达峰时间。

2．阿司匹林：依托度酸与阿司匹林合用时，尽管对游离依托度酸的清除不发生改变，但其蛋白结合率下降。此种药物相互作用的临床意义尚不清楚，然而由于两者同用时潜在的不良反应增加，因此临床不推荐此用法。

3．华法林：依托度酸与华法林同时应用可以使华法林的蛋白结合率下降，但不影响游离华法林的清除及凝血酶原时间，因此两药合用无需调整任何一种药物的剂量。然而上市后的一些报道显示两药合用使凝血酶原时间延长，因此应当慎用。

4．苯妥英钠：依托度酸与苯妥英钠之间无明显的药代动力学相互作用。

5．格列本脲：依托度酸与格列本脲合用时，药代动力学与药效学均无明显改变。

6．利尿剂：在健康志愿者中，依托度酸与速尿、双氢克尿噻之间无明显的药代动力学相互作用，依托度酸也不会减弱利尿剂的利尿效果。然而在已服用利尿剂或患有心、肾、肝功能衰竭的患者，两药同用应当小心。

7．甲氨蝶呤：依托度酸与甲氨蝶呤之间无明显的药代动力学相互作用。

8．环孢素、地高辛和锂：依托度酸因抑制前列腺素的合成，使肾脏对这些药物的清除发生改变，药物浓度增高，毒性增加。与环孢素相关的肾毒性也会增加。因此已服用这些药物的病人再接受依托度酸或其他NSAIDs治疗时，应当密切监测药物可能出现的毒性，尤其是已有肾功能损害者。

9．蛋白结合：体外研究资料表明，布洛芬、醋氨芬、苯妥英、丙磺舒、吲哚美辛、氯磺丙脲、优降糖、萘普生、格列吡嗪、炎痛喜康均对游离依托度酸的比例无明显影响。相反，保泰松使游离态浓度增加（约80%），尽管未经体内试验证实是否保泰松改变依托度酸的清除，但临床不推荐合用。

10．实验室检测的相互作用：服用依托度酸的患者尿中会出现其酚类代谢产物，因此测定尿胆红素可以出现假阳性反应。用快速诊断学方法在一部分服用依托度酸的病人中发现其尿酮体出现假阳性反应。这一现象与其他临床情况无相关性，也与给药剂量无关。

【不良反应】据国外资料报道，2629例关节炎病人在开放、双盲的临床验证中观察4～320周的结果以及世界范围内的大约6万病人在依托度酸上市后的监测结果，上市后的自发性报道也包含在其中。

临床研究显示，依托度酸总的耐受性较好，大多数不良反应轻微而且短暂，以下所列的发生率>1%的，可能与药物相关。

发生率>1%。全身症状：腹痛、乏力、不适、寒战、发热。消化系统：便秘、腹泻、消化不良、腹胀、胃炎、黑便、恶心、呕吐。神经系统：焦虑、抑郁、头晕。皮肤及附属器：瘙痒、皮疹。特殊感觉：视物模糊，耳鸣。泌尿生殖系统：排泄困难、尿频。

发生率<1%。全身症状：过敏反应、类过敏反应、胸痛、胸闷。心血管系统：充血性心力衰竭、面色潮红、高血压、心悸、晕厥、血管炎（包括坏死性和过敏性）。消化系统：畏食、口干、十二指肠炎、肝酶升高、结肠炎、嗳气、肝功能衰竭、肝炎（包括瘀胆性肝炎）、肠溃疡、黄疸（包括瘀胆）、胰腺炎、伴或不伴出血穿孔的消化性溃疡、口炎（包括溃疡性口炎）、口渴。血液及淋巴系统：粒细胞缺乏、贫血、出血时间延长、瘀斑、溶血性贫血、中性粒细胞缺乏、全血细胞减少、血小板减少。代谢和营养：水肿、尿素氮增高、既往已控制很好的糖尿病病人中血糖升高、血肌酐增高。神经系统：失眠、嗜睡。呼吸系统：哮喘。皮肤及附属器：血管性水肿、皮肤血管炎所致紫癜、多形红斑、Stevens－Johnson综合征、多汗、荨麻疹、水疱样皮疹。特殊感觉：畏光、短暂性视觉障碍。泌尿生殖系统：肾小球肾炎、肾盂肾炎、肾功能衰竭、肾乳头状坏死。

据报道以下症状与服用依托度酸同时出现，其发生率小于1%，但两者是否存在必然的联系尚不清

楚，仅用于提醒医生注意。其中包括两者之间因果关系不明确者以及经因果关系分析后确定其与依托度酸无关，但由于情况严重，且发生率较偶然事件发生率为高者。

全身性表现：感染、非自主性肌肉运动、肌肉痉挛、肌无力、肌肉疼痛、直肠－耻骨疼痛、皮下结节，第一掌指关节压痛。

心血管系统：心律失常（包括心动过速）、心血管意外、心肌梗死。

消化系统：食欲改变、结肠炎（包括缺血性结肠炎）、伴或不伴贲门痉挛或狭窄的食管炎、呕血、便血。

血液及淋巴系统：不典型淋巴细胞、红细胞压积下降、血色素下降、嗜酸粒细胞增多、白细胞减少。

代谢与营养：体重改变。

神经系统：意识混乱、手抖、头疼、注意力不能集中、多梦、感觉异常、烦躁。

呼吸系统：支气管炎、支气管痉挛、气短、过度通气、咽炎、鼻炎、鼻窦炎、打喷嚏。

皮肤及附属器：脱发、脆甲、毛细血管脆性增加、斑丘疹、过敏、皮肤脱屑。

特殊感觉：眼/鼻烧灼感、结膜炎、耳聋、耳痛、鼻衄、异食癖、眼后刺痛。

泌尿生殖系统：乳房压痛、膀胱炎、阳痿、血尿、间质性肾炎、白带增多、夜尿多、肾结石、子宫不规则出血、阴道出血。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
依托度酸缓释片	化学药	HZ004474
依托度酸胶囊	化学药	HZ004475
依托度酸片	化学药	HZ004476

HY002472 依托芬那酯

【其他名称】伏迈

【外文名称】Etofenamate

药物理化信息

【化学名】2－（2－羟基乙氧基）乙基－*N*－（α，α，α－三氟－间－甲苯基）邻氨基苯甲酸酯

【分子式】$C_{18}H_{18}F_3NO_4$

【分子量】369.35

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：本品为皮肤外用的非甾体类抗炎药，属邻氨基苯甲酸的衍生物。它主要作用于炎症过程的各个阶段，除了抑制前列腺素合成外，还抑制组胺的释放，对缓激肽和5－羟色胺具有中和作用，抑制补体活动和透明质酸酶的释放。

2．毒理作用：在慢性毒性研究中，给大鼠（7.0，27.0，100.0mg/kg）和猴（7.0；26.0，100.0mg/kg）每日口服给予依托芬那酯（时间为1年）。其无效剂量（大鼠27.0mg/kg和猴26.0mg/kg）远远高于人类日常治疗量。进一步研究表明，本药没有致畸、致突变及致癌作用的证据。

生殖毒性：依托芬那酯乳膏可以通过胎盘屏障。

哺乳妇女口服依托芬那酯后，乳汁中未测到有依托芬那酯，但有其主要代谢产物氟灭酸。但其浓度远远低于治疗量，因此没有重要的实际意义。

【药代动力学】在使用含有依托芬那酯300mg后12～14小时，可测得其血浆浓度最高峰值。在肾功能不全病人血浆中依托芬那酯的水平与正常志愿者相同（药物主要靠胆道排出）。蛋白结合率为98%～99%。依托芬那酯通过肾、胆汁和粪便以下述代谢产物：氢氧化物、醚裂解物、酯裂解物等和它们的结合物形式排除。

【药物相互作用】正确使用时尚未发现与其他药物有相互作用。

【药物过量】如果未正确使用，则可能发生以下情况。

1．在短时间内全身皮肤使用一支或更多的依托芬那酯乳膏，可引起头痛、眩晕或上腹不适。治疗方法：用水洗去皮肤上的优迈霜。

2．由于药物的味道，口服通常不会达到中毒剂量，否则应予洗胃、催吐或给予药用活性炭治疗。

【不良反应】

1．少数情况会出现皮肤发红。

2．极少数情况下出现皮肤过敏反应（例如：剧烈瘙痒、皮疹、红斑、肿胀、水疱等）。

上述症状停药后通常迅速减退。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
依托芬那酯乳膏	化学药	HZ004477

HY002473 依托红霉素

【其他名称】Erythromycin Propionate Laury Sulfate、红霉素丙酸酯十二烷基硫酸盐、红霉素硫酸月桂酸酯、Laurylin、Ritromin、无味红霉素

【外文名称】Erythromycin Estolate

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】红霉素丙酸酯的十二烷基硫酸盐

【分子式】$C_{40}H_{71}NO_{14}\cdot C_{12}H_{26}O_4S$

【分子量】1056.40

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，无味或几乎无味。

本品在乙醇或三氯甲烷中易溶，在水中几乎不溶。

熔点：取本品，置五氧化二磷干燥器中干燥后，依法测定，熔点为132～138℃（每分钟升温2.5～3℃）。

本品按无水物计算，每1mg的效价不得少于610红霉素单位。

药物药理信息

【药理毒理】本品属大环内酯类抗生素，为红霉素丙酸酯的十二烷基硫酸盐，对葡萄球菌属、各组链球菌和革兰阳性杆菌均具抗菌活性。奈瑟菌属、流感嗜血杆菌、百日咳鲍特菌等也可对本品呈现敏感。本品对除脆弱拟杆菌和梭杆菌属以外的各种厌氧菌亦具抗菌活性；对军团菌属、胎儿弯曲菌、某些螺旋体、肺炎支原体、立克次体属和衣原体属也有抑制作用。本品系抑菌剂，但在高浓度时对某些细菌也具杀菌作用。本品可透过细菌细胞膜，在接近供位（“P”位）处与细菌核糖体的50S亚基成可逆性结合，阻断了转移核糖核酸（t－RNA）结合至“P”位上，同时也阻断了多肽链自受位（“A”位）至“P”位的位移，因而细菌蛋白质合成受抑制。本品仅对分裂活跃的细菌有效。

【药代动力学】空腹或饭后口服都很快吸收，在胃酸中较稳定。蛋白结合率为90%～99%。口服后在胃肠道中分解为红霉素丙酸酯，部分在血液中水解成游离的红霉素而起抗菌作用。口服0.25g和0.5g的血药峰浓度于2小时到达，分别为1.4mg/L和4.2mg/L。吸收后除脑脊液和脑组织外，广泛分布于各组织和体液中，尤以肝、胆汁和脾中的浓度为最高，在肾、肺等组织中的浓度可高出血药浓度数倍，在胆汁中的浓度可达血药浓度的10%～40%倍以上。在皮下组织、痰及支气管分泌物中的浓度也较高，痰中浓度与血药浓度相仿；在胸、腹水、脓液等中的浓度可达有效水平。本品有一定量（约为血药浓度的33%）进入前列腺及精囊中，但不易透过血－脑脊液屏障，脑膜有炎症时脑脊液中浓度仅为血药浓度的10%左右。可进入胎血和排入母乳中，胎儿血药浓度为母体血药浓度的5%～20%，母乳中药物浓度可达血药浓度的50%以上。表观分布容积为0.9L/kg。游离红霉素在肝内代谢，血消除半衰期为1.4～2小时，无尿患者的血半衰期可延长至4.8～6小时。红霉素主要在肝中浓缩和从胆汁排出，并进行肠肝循环，约2%～5%的口服量和10%～15%的注入量自肾小球滤过排除，尿中浓度可达10～100mg/L。粪便中也含有一定量。血或腹膜透析后极少被清除，故透析后无需加用。

【药物相互作用】

1．本品可抑制卡马西平和丙戊酸等抗癫痫药的代谢，导致后者血药浓度增高而发生毒性反应。本品与阿芬太尼合用可抑制后者的代谢，延长其作用时间。本品与阿司咪唑或特非那定等抗组胺药合用可增加心脏毒性，与环孢素合用可使后者血药浓度增加而产生肾毒性。

2．与氯霉素和林可酰胺类有拮抗作用，不推荐同用。

3．本品为抑菌剂，可干扰青霉素的杀菌效能，故当需要快速杀菌作用如治疗脑膜炎时，两者不宜联合用药。

4．长期服用华法林的患者应用本品时可导致凝血酶原时间延长，从而增加出血的危险性，老年病人尤应注意。两者必须同用时，华法林的剂量宜适当调整，并严密观察凝血酶原时间。

5．除二羟丙茶碱外，本品与黄嘌呤类合用可使氨茶碱的肝清除减少，导致血清氨茶碱浓度升高和（或）毒性反应增加。这一现象在合用6日后较易发生，氨茶碱清除的减少幅度与本品血清峰值成正比。因此在两者合用疗程中和疗程后，黄嘌呤类的剂量应予调整。

6．与其他肝毒性药物合用可能增强肝毒性。

7．大剂量本品与耳毒性药物合用，尤其肾功能减退患者可能增加耳毒性。

8．与洛伐他丁合用时可抑制其代谢而使血浓度上升，可能引起横纹肌溶解，与咪达唑仑或三唑仑合用时可减少二者的清除而增强其作用。

【药物过量】应及时停药给予对症和支持治疗。血或腹膜透析后极少被消除。

【不良反应】

1．服用本品后发生肝毒性反应者较服用其他红霉素制剂为多见，服药数日或1～2周后患者可出现乏力、恶心、呕吐、腹痛、皮疹、发热等。有时可出现黄疸，肝功能试验显示淤胆，停药后常可恢复。

2．胃肠道反应有腹泻、恶心、呕吐、中上腹痛、口舌疼痛、胃纳减退等，其发生率与剂量大小有关。

3．大剂量（≥一日4g）应用时，尤其肝、肾疾病患者或老年患者，可能引起听力减退，主要与血药浓度过高（>12mg/L）有关，停药后大多可恢复。

4. 过敏反应表现为药物热、皮疹、嗜酸粒细胞增多等，发生率约 0.5% ~ 1%。

5. 其他：偶有心律失常、口腔或阴道念珠菌感染。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
依托红霉素混悬液	化学药	HZ004478
依托红霉素胶囊	化学药	HZ004479
依托红霉素颗粒	化学药	HZ004480
依托红霉素片	化学药	HZ004481

HY002474 依托利定

【外文名称】Etoxeridine

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633 号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY002475 依托咪酯

【其他名称】甲苄咪唑（Hypnomidate）、乙咪酯（Amidate）、宜妥利

【外文名称】Etomidate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（+）-1-（α-甲基苯甲基）咪唑-5-甲酸乙酯

【分子式】$C_{14}H_{16}N_2O_2$

【分子量】244.29

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末。本品在乙醇或三氯甲烷中极易溶解，在水中不溶；在稀盐酸中易溶。

熔点：本品的熔点为 66 ~ 70℃。

比旋度：取本品，精密称定，加乙醇制成每 1ml 中含 10mg 的溶液，依法测定，比旋度为 +67°至 +72°。

药物药理信息

【药理毒理】本品为快速催眠性静脉全身麻醉药，其催眠效应较硫喷妥钠强 12 倍，具有类似 GABA 样作用，与巴比妥类药不同，本品在催眠作用开始时导致新皮层睡眠，降低皮质下抑制。动物研究证明，依托咪酯的作用有部分可通过对脑干网状系统的抑制和激活作用。本品对心血管和呼吸系统影响较小，可用于休克或创伤患者的全麻诱导，单次静脉注射量大可引起短期呼吸暂停，不增加组胺释放，可降低脑内压、脑血流和眼内压。诱导剂量静脉注射按体重 0.3mg/kg，依托咪酯可降低血浆皮质激素浓度，且可持续 6 ~ 8 小时，使肾上腺皮质对促肾上腺皮质激素（ACTH）失去正常反应。

【药代动力学】静脉注射后，迅速分布至脑和其他组织，通常在 1 分钟以内起效。保持催眠最低血药浓度一般应在 0.2μg/ml 以上，单次注药，血药浓度在 30 分钟内迅速降低。本品呈三室分布，血浆蛋白结合率较高，78% 与白蛋白结合，白蛋白减少，则游离部分增多，3% 与球蛋白结合。V_d 高达（24.2 ± 4.2）L/kg。分布半衰期（2.81 ± 1.4）分钟，再分布半衰期（32.1 ± 16.5）分钟，作用时效 30 ~ 75 分钟，消除半衰期（28.7 ± 14）分钟，本品在肝和血浆中主要被酯酶迅速水解，初 30 分钟内水解最快，但 6 小时仍未完全，代谢物 80% 为混旋 -1-（α-甲苄基）-咪唑-5 羧酸酯，有 64.3% 与血浆蛋白结合，药理上无效。排泄的第一天为用量的 75% 经肾由尿排出，13% 从胆汁排出。其中 85% 为代谢物 3% 为原药。

【药物相互作用】

1. 与任何降压药合用，如与中枢性抗高血压药可乐定、甲基多巴、萝芙木碱、利血平等，利尿性抗高血压药，钙通道阻滞剂等均可导致血压剧降，应避免伍用。

2. 当与芬太尼合用时，可出现不能自制的肌肉强直或阵挛，安定可减少其发生。

3. 长期大剂量静脉滴注依托咪酯可抑制肾上腺皮质对促肾上腺素的应激，导致血浆皮质激素低于正常，如遇中毒性休克，多发性创伤或肾上腺皮质功能低下的病人，可同时给适当氢化考的松。

【不良反应】

1. 本品可阻碍肾上腺皮质产生可的松和其他皮质激素，引起暂时的肾上腺功能不全而呈现水盐失衡、低血压甚至休克。术后或危重病人由于应用此药已有需要补充肾皮质激素的报道。

2. 本品用后常见恶心呕吐，呃逆。

3. 本品可使肌肉发生阵挛，肌颤发生率约为 6% 左右，不自主的肌肉活动发生率可达 32%（22.7% ~ 63%）。

4. 注射部位疼痛可达 20%（1.2% ~ 42%），但若在肘部较大静脉内注射或用乳剂则发生率较低。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
依托咪酯脂肪乳注射液	化学药	HZ004482
依托咪酯注射液	化学药	HZ004483

HY002476　依托尼秦

【外文名称】Etonitazene

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY002477　依西美坦

【外文名称】Exemestane

药物药理信息

【药理毒理】依西美坦为甾体芳构化酶抑制剂，与其他的芳构化酶抑制剂相比，依西美坦具有以下特点。

1．不可逆地抑制芳构化酶的活性本品与来屈唑、阿那曲唑等可逆性芳构化酶抑制不同，它和芳构化酶的结合是不可逆的，实属芳构化酶蛋白水平的性质有益于减少复发率。

2．对芳构化酶的选择性高，抑制作用强依西美坦是特异性芳构化酶抑制剂、它竞争性且时间依赖性地抑制此酶的活性，且不抑制 5α－还原酶的活性，也不与性激素受体结合。

【药代动力学】其抑制人胎盘芳构化酶的 IC_{50}为42.5nmol/l，为氨鲁米特（TC_{50}为1754nmol/l）的1/40倍。酶失少曲线显示其灭活芳构酶的 $t_{1/2}$为13.9分钟，Ki为26.3）疗效肯定，临床应用潜力大动物试验表明，依西美坦下注射和经口给药均抑制绝经腺癌模型中肿瘤的生长和新生瘤的产生。769例经他莫西芬治疗失败的绝经后妇女转移性乳腺癌患者进行的Ⅲ期临床试验证实依西美坦的作用优于醋酸甲地孕酮；欧洲进行了一项比较依西美坦（一日25mg）和他莫昔芬（一日20mg）用作绝经后妇女乳腺癌一线疗法的Ⅱ期随机试验，结果依西美坦的总有效率明显高于他莫昔芬，而副作用明显低于他莫昔芬；另外，依西美坦还可用于早期乳腺癌辅助疗法，欧美目前都在进行他莫西芬5年辅助疗法后继续用依西美坦进行辅助治疗的临床试验。本品服用方便，口服吸收迅速。依西美坦是第一个口服有效的甾体类芳构化酶抑制剂，口服吸收迅速，达峰时间为1～2小时，峰浓度为17.7μg/l，药时曲线下面积为41μg/L·h，食物不影响其药效，依西美坦的消除半衰期为24小时。本品不良反应少，患者易于耐受本品可长期用药，每日只需服用25mg，因此用药方便，患者易于接受。用药理12周的临床试验表明，本品对精皮质激素、酮固酮、黄体生成素、雄激素等均无明显影响，也未发现其他严重的毒性及不良反应。

【药物相互作用】本品不可与雌激素类合用，以免拮抗本品的药效作用。

【药物过量】在健康女性患者中进行了高达800mg单剂量的临床试验；在绝经后晚期乳腺癌妇女中进行高至一日600mg共12周的临床试验，这些剂量下受试者耐受性良好。药物过量时无特殊解毒剂，应当进行一般的支持护理，如经常检查生命体征以及密切观察病人等。

【不良反应】恶心、口干、便秘、腹泻、头晕、呕吐、腹痛、食欲增加、体重增加等。其次文献报道还有高血压、抑郁、焦虑、呼吸困难、咳嗽。其他还有淋巴细胞计数下降，肝功能指标（如丙氨酸转移酶等）异常等。在临床试验中，只有3%的病人由于不良反应终止治疗，主要在依西美坦治疗的前10周内，由于不良反应后期终止治疗者不常见（0.3%）。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
依西美坦胶囊	化学药	HZ004484
依西美坦片	化学药	HZ004485

HY002478　依西酸喷他脒

【其他名称】Lomidine、Pentacarinat、Pentam、羟乙磺酸戊烷脒、戊双氧苯脒、戊烷脒

【外文名称】Pentamidine Isethionate

【性状及组成】本品为无色结晶性粉末，无臭、味苦。可溶于水或甘油，微溶于乙醇，几乎不溶于三氯甲烷、丙酮、乙醚。

药物药理信息

【药理毒理】本品为芳香双脒类药物。在体外能直接杀死利什曼原虫。治黑热病的效果不及葡萄糖酸锑钠。

本品作用机制尚不够清楚，可能干扰核苷酸生物合成和DNA的复制，也可干扰叶酸盐的转换。仅用于对锑剂有耐药性或不能用锑剂的黑热病（利什曼原虫病）和卡氏肺孢子虫病（首选药为复方磺胺甲噁唑）。也可用于治疗早期非洲锥虫病，但对晚期伴中枢神经系统感染的锥虫病患者的疗效差。

【药代动力学】肌注吸收良好，t_{max}约 0.5～1 小时，肾功能减弱时，血药浓度可升高。

【不良反应】

1. 肌内注射后局部可发生硬结和疼痛，偶见形成脓肿。静脉注射易引起低血压及其他严重的即刻反应。

2. 偶引起肝肾功能损害（均为可逆性）、低血糖或高血糖、焦虑、头晕、头痛、嗜睡等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
喷他脒片	化学药	HZ002848
注射用喷他脒	化学药	HZ004922

HY002479 胰蛋白酶

【其他名称】结晶胰蛋白酶（Crystalline Trypsin）

【外文名称】Trypsin

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

【性状及组成】本品系自牛、羊或猪胰中提取的蛋白水解酶。按干燥品计算，每 1mg 的效价不得少于 2500 单位。

本品为白色或类白色结晶性粉末。

药物药理信息

【药理毒理】本品具肽链内切酶的作用，选择地作用于变性蛋白使之水解成多肽或氨基酸，提高组织通透性、抑制水肿和血栓周围的炎症反应；溶解血凝块、渗出液、坏死组织；分解痰液、脓液等黏性分泌物；促使局部药液迅速扩散吸收。

【不良反应】注射给药不良反应。

1. 注射局部疼痛、硬结。

2. 本品可引起组胺释放，产生全身反应，有寒战、发热、头痛、头晕、胸痛、腹痛、皮疹、血管神经性水肿、呼吸困难、眼压升高、白细胞减少等。症状轻时不影响继续治疗，给予抗组胺药和对症药物即可控制，严重时应即停药。

3. 本品偶可致过敏性休克。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
多酶片	化学药	HZ000784
复方消化酶胶囊（Ⅱ）	化学药	HZ001439
口服胰糜酶	化学药	HZ002144
注射用糜胰蛋白酶	化学药	HZ004902
注射用胰蛋白酶	化学药	HZ005119

HY002480 胰岛素

【外文名称】Insulin

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

【性状及组成】本品系自猪或牛胰中提取制得的具有降血糖作用的物质。按干燥品计算，每 1mg 的效价不得少于 26 单位。

本品为白色或类白色的结晶性粉末。

本品在水、乙醇、三氯甲烷或乙醚中几乎不溶；在无机酸或氢氧化钠溶液中易溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为降血糖药。胰岛素的主要药效为降血糖，同时影响蛋白质和脂肪代谢，包括以下多方面的作用。

1. 抑制肝糖原分解及糖原异生作用，减少肝输出葡萄糖。

2. 促使肝摄取葡萄糖及肝糖原的合成。

3. 促使肌肉和脂肪组织摄取葡萄糖和氨基酸，促使蛋白质和脂肪的合成和贮存。

4. 促使肝生成极低密度脂蛋白并激活脂蛋白脂酶，促使极低密度脂蛋白的分解。

5. 抑制脂肪及肌肉中脂肪和蛋白质的分解，抑制酮体的生成并促进周围组织对酮体的利用。

【药代动力学】口服易被胃肠道消化酶破坏。皮下给药吸收迅速，皮下注射后 0.5～1 小时开始生效，2～4 小时作用达高峰，维持时间 5～7 小时；静脉注射 10～30 分钟起效，15～30 分钟达高峰，持续时间 0.5～1 小时。静注的胰岛素在血液循环中半衰期为 5～10 分钟，皮下注射后半衰期为 2 小时。皮下注射后吸收很不规则，不同注射部位胰岛素的吸收可有差别，腹壁吸收最快，上臂外侧比股前外侧吸收快；不同病人吸收差异很大，即使同一病人，不同时间也可能不同。胰岛素吸收到血液循环后，只有 5%与血浆蛋白结合，但可与胰岛素抗体相结合，后者使胰岛素作用时间延长。吸收进入血浆的胰岛素主要分布于细胞外液，主要在肝、肾和骨骼肌中降解。其中，肝脏代谢 50%左右。胰岛素极其降解产物主要经肾小球滤过而排泄。肾小管对胰岛素的重吸收功能及肾功能严重受损明显影响胰岛素的消除。

【药物相互作用】

1. 糖皮质类固醇、促肾上腺皮质激素、胰高血糖素、雌激素、口服避孕药、肾上腺素、苯妥英钠、噻嗪类利尿剂、甲状腺素等可不同程度地升高血糖浓度，同用时应调整这些药或胰岛素的剂量。

2. 口服降糖药与胰岛素有协同降血糖作用。

3. 抗凝血药、水杨酸盐、磺胺类药及抗肿瘤药甲氨蝶呤等可与胰岛素竞争和血浆蛋白结合，从而使血液中游离胰岛素水平增高。非甾体消炎镇痛药可增强胰岛素降血糖作用。

4. β-受体阻滞剂如普萘洛尔可阻止肾上腺素升高血糖的反应，干扰机体调节血糖功能，与胰岛素同用可增加低血糖的危险，而且可掩盖低血糖的症状，延长低血糖时间。合用时应注意调整胰岛素剂量。

5. 中等量至大量的酒精可增强胰岛素引起的低血糖的作用，可引起严重、持续的低血糖，在空腹或肝糖原贮备较少的情况下更易发生。

6. 氯喹、奎尼丁、奎宁等可延缓胰岛素的降解，在血中胰岛素浓度升高从而加强其降血糖作用。

7. 升血糖药物如某些钙通道阻滞剂、可乐定、丹那唑、二氮嗪、生长激素、肝素、H_2受体拮抗剂、大麻、吗啡、尼古丁、磺吡酮等可改变糖代谢，使血糖升高，因此胰岛素同上述药物合用时应适当加量。

8. 血管紧张素转化酶抑制剂、溴隐亭、氯贝特、酮康唑、锂、甲苯咪唑、吡多辛、茶碱等可通过不同方式直接或间接致血糖降低，胰岛素与上述药物合用时应适当减量。

9. 奥曲肽可抑制生长激素、胰高血糖素及胰岛素的分泌，并使胃排空延迟及胃肠道蠕动减缓，引起食物吸收延迟，从而降低餐后高血糖，在开始用奥曲肽时，胰岛素应适当减量，以后再根据血糖调整。

10. 吸烟：可通过释放儿茶酚胺而拮抗胰岛素的降血糖作用，吸烟还能减少皮肤对胰岛素的吸收，所以正在使用胰岛素治疗的吸烟患者突然戒烟时，应观察血糖变化，考虑是否需适当减少胰岛素用量。

【药物过量】对糖尿病患者，如用量过大或未按规定进食，均可引起血糖过低甚至产生低血糖性昏迷，有先兆症状时应口服葡萄糖、进食糕饼或糖水，如病人失去知觉，应肌肉、皮下或静脉注射胰高血糖素，神志清醒后，口服糖类物质。对胰高血糖素无反应者，须静注葡萄糖溶液。

【不良反应】

1. 低血糖反应：为胰岛素使用不当所致、胰岛素过量、注射胰岛素后未及时进餐或进行较剧烈的体力活动（肌肉摄取葡萄糖增加）时，易发生低血糖反应。低血糖反应的早期症状为无力、饥饿、眼花、出冷汗、皮肤苍白、心悸、兴奋、手抖、神经过敏、头痛、颤抖等类似交感神经兴奋的症状；进一步发展为抑郁、注意力不集中、嗜睡、缺乏判断和自制力、健忘，也可有偏瘫、共济失调、心动过速、复视、感觉异常，严重者可惊厥和昏迷。

2. 过敏反应：过敏反应可为全身性及局部性的过敏，局部性过敏表现为注射部位出现红斑、丘疹、硬结，一般发生在注射胰岛素后几小时或数天。全身性过敏反应在注射胰岛素后立即发生，全身出现荨麻疹，可伴有或不伴有血管神经性水肿、呼吸道症状（如哮喘、呼吸困难）以及极为少见的低血压、休克甚至死亡。因而，首次注射本品时，应密切注意病人对本品的敏感程度，防止过敏反应。

3. 注射部位脂肪萎缩：多见于年轻妇女，多为胰岛素制剂不纯所引起的脂肪溶解反应。

4. 注射部位的脂肪增生：为胰岛素所致的脂肪生成反应，于不同部位轮流注射可减少此种反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
低精蛋白锌胰岛素注射液	化学药	HZ000674
精蛋白锌胰岛素注射液	化学药	HZ001964
胰岛素注射液	化学药	HZ004486
注射用三磷酸腺苷辅酶胰岛素	化学药	HZ004953

HY002481　胰淀粉酶

【外文名称】Pancreatic Amylase

药物药理信息

【药理毒理】胰淀粉酶可将淀粉分解为糊精和糖，它和胰脏中其他酶一起完成胰脏生理功能。用于治疗消化系统障碍。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
多酶片	化学药	HZ000784
复方消化酶胶囊（Ⅱ）	化学药	HZ001439

HY002482　胰激肽原酶

【其他名称】保妥丁、Kallidinogenase、Pancreatic Kallikrein、血管舒缓素、胰激肽释放酶

【外文名称】Pancreatic Kininogenase

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（二部）·第6册

【性状及组成】本品为白色或浅黄色粉末，略有异嗅，无味。本品为内切蛋白水解酶类，是一种含有唾液酸的糖蛋白，分子量26800，28600；pI 4.11

易溶于水和低浓度醇溶液中，不溶于乙醇和乙醚，水溶液的 pH 值为 5.5～7.5。

药物药理信息

【药理毒理】本品在体内作用激肽原释放出激肽，从而发挥一系列的药理效应。可舒张毛细血管，扩张小动脉，促进前列腺素分泌，改善各器官血流，降低血黏度，防止血栓形成等。有扩张血管改善微循环作用；激活纤溶酶，降低血黏度；抑制磷脂酶 A2，防止血小板聚集，防止血栓形成等作用。

【药代动力学】口服 4 小时血浆浓度达峰值，$t_{1/2}$为 7 小时，主要经肾脏排泄。

【药物相互作用】

1. 本品与蛋白酶抑制剂不能同时使用。

2. 本品与血管紧张素转化酶抑制剂（ACEI）有协同作用。

【不良反应】偶有皮疹，皮肤瘙痒等过敏现象及胃部不适和倦怠等感觉，停药后消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
胰激肽原酶肠溶片	化学药	HZ004487
注射用胰激肽原酶	化学药	HZ005120

HY002483 胰酶

【外文名称】Pancreatin

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

【性状及组成】本品系自猪、羊或牛胰中提取的多种酶的混合物，主要为胰蛋白酶、胰淀粉酶与胰脂肪酶。按干燥品计算，每 1g 中含胰蛋白酶不得少于 600 活力单位，胰淀粉酶不得少于 7000 活力单位，胰脂肪酶不得少于 4000 活力单位。必要时可用乳糖、蔗糖或低倍胰酶稀释。

本品为类白色或微带黄色的粉末；微臭，但无霉败的臭气；有引湿性；水溶液煮沸或遇酸即失去酶活力。

药物药理信息

【药理毒理】本品为多种酶的混合物，主要含胰蛋白酶、胰淀粉酶和胰脂肪酶等，在中性或弱碱性条件下活性较强。在肠液中消化淀粉、蛋白质及脂肪，起促进食欲的作用。

【药物相互作用】

1. 在酸性条件下易破坏，服时不可咀嚼，不宜与酸性药物同服。

2. 与等量碳酸氢钠同时服用，可增加疗效。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方阿嗪米特肠溶片	化学药	HZ001019
复方酵母碳酸铋片	化学药	HZ001232
复方消化酶胶囊	化学药	HZ001438
复方胰酶散	化学药	HZ001471
胰酶肠溶胶囊	化学药	HZ004488
胰酶肠溶片	化学药	HZ004489
胰酶胶囊	化学药	HZ004490
胰酶片	化学药	HZ004491

HY002484 胰脂肪酶

药物药理信息

【药理毒理】胰脂肪酶可分解甘油三酯为脂肪酸、甘油一酯和甘油。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
多酶片	化学药	HZ000784

HY002485 胰脂酶

【外文名称】Pancrelipase

【性状及组成】由胰脏提取而得的消化酶混合物。主要成分是胰脂肪酶，还含有胰蛋白酶和胰淀粉酶。

药物药理信息

【药理毒理】作用、性质与胰酶相似，但含有较高的脂肪酶活性。胰脏的脂肪酶有三种：①脂酰甘油脂肪酶，可水解甘油三酯的 C1，C3 酯键，而产生两个游离脂肪酸和 2－单酯酰甘油；②胆固醇酯酶，水解胆固醇酯产生胆固醇和脂肪酸；③磷脂酶 A2，可水解磷脂产生溶血磷脂和脂肪酸。用于口服控制脂肪泻。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方消化酶胶囊	化学药	HZ001438
复方消化酶胶囊（Ⅱ）	化学药	HZ001439

HY002486 乙胺嘧啶

【其他名称】达拉匹林（Daraprim）、Malocide、Maloprim、息疟定

【外文名称】Pyrimethamine

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】2,4－二氨基－5－（对氯苯基）－6－乙基嘧啶

【分子式】$C_{12}H_{13}ClN_4$

【分子量】248.71

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，无味。本品在乙醇或三氯甲烷中微溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 239～242℃。

吸收系数：取本品，精密称定，加 0.1mol/L 盐酸溶液溶解，并定量稀释制成每 1ml 中约含 13μg 的溶液，照紫外－可见分光光度法，在 272nm 的波长处测定吸光度，吸收系数为 309～329。

药物药理信息

【药理毒理】乙胺嘧啶对某些恶性疟及间日疟原虫的红外期有抑制作用，对红内期的抑制作用仅限于未成熟的裂殖体阶段，能抑制滋养体的分裂。疟原虫红内期不能利用环境中出现的叶酸，而必须自行合成，乙胺嘧啶是二氢叶酸还原酶的抑制剂，使二氢叶酸不能还原为四氢叶酸，进而影响嘌呤及嘧啶核苷酸的生物合成，最后使核酸合成减少，使细胞核的分裂和疟原虫的繁殖受到抑制。疟原虫的 DNA 合成主要发生在滋养体阶段，在裂殖体期合成甚少，故乙胺嘧啶主要作用于进行裂体增殖的疟原虫，对已发育完成的裂殖体则无效。

【药代动力学】口服后在肠道吸收较慢但完全，6 小时内血浆浓度达高峰，它的抗叶酸作用可持续 48 小时以上。主要分布于红、白细胞及肺、肝、肾、脾等器官中。本品能通过胎盘，经肾脏缓慢排出。服药后 5～7 日内约有 10%～20%的原形物自尿中排出，可持续 30 日以上。本品也可由乳汁排出，从粪便仅排出少量。$t_{1/2}$为 80～100 小时。血浆浓度为 10～100mg/L 时，能抑制恶性疟原虫敏感株的血内裂殖体。

【药物过量】乙胺嘧啶过量时可引起急性中毒症状，儿童更易发生，本药具香味，儿童可误作糖果而造成中毒事故，误服过量后 1～2 小时内可出现恶心呕吐、胃部烧灼感、口渴心悸、烦躁不安等，重者出现眩晕、视力模糊、阵发性抽搐、惊厥昏迷，可引起死亡，此乃药物对中枢神经系统的直接毒性作用所致。

【不良反应】口服一般抗疟治疗量时，毒性很低，较为安全。大剂量应用时，如一日用 25 mg，连服 1 个月以上，就会出现叶酸缺乏现象。主要影响生长繁殖特别迅速的组织，如骨髓、消化道黏膜，引起造血功能及消化道症状，如味觉的改变或丧失，舌头疼痛、红肿、烧灼感及针刺感，口腔溃疡、白斑等，食管炎所致的吞咽困难、恶心、呕吐、腹痛、腹泻等。较严重的是巨细胞性贫血、白细胞减少症等，如及早停药，能自行恢复。甲酰四氢叶酸可改善骨髓功能。由于过敏所致的皮肤红斑则较少见。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乙胺嘧啶片	化学药	HZ004493
乙胺嘧啶贴剂	化学药	HZ004494

HY002487　乙醇

【其他名称】酒精、Spirtus Vini

【外文名称】Ethanol

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】乙醇

【分子式】C_2H_6O

【分子量】46.07

【性状及组成】本品为无色澄明液体；微有特臭，味灼烈；易挥发，易燃烧，燃烧时显淡蓝色火焰；热至约 78℃即沸腾。

本品与水、甘油、三氯甲烷或乙醚能任意混溶。

相对密度：本品的相对密度不大于 0.8129，相当于乙醇 2H6O 不少于 95.0%（ml/ml）。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：消毒防腐药、溶剂。

本品可渗入细菌体内，在一定浓度下能使蛋白质凝固变性而杀灭细菌。最适宜的杀菌浓度为 75%。因不能杀灭芽孢和病毒，故不能直接用于手术器械的消毒。50%稀醇可用于预防褥疮，25%～30%稀醇可擦浴，用于高热病人，使体温下降。

本品在药剂制造中用作溶剂、防腐剂和消毒杀菌剂。使用时应根据需要选择合适的浓度。

【药物相互作用】酒精不可与镇静药、催眠药及安定药等同服，以防中枢神经系统过度抑制。

在酸性溶液中，本品与氧化剂可能起剧烈反应。与碱混和，可使色泽变深。能使有机盐或阿拉伯胶、蛋白质等从水溶液或分散液中沉淀。

【药物过量】大量误服酒精可引起中枢神经系统抑制，麻痹呼吸中枢及心脏，使血管扩张，最后引起呼吸衰竭和循环衰竭。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
桉氨溶液	化学药	HZ000139
苯扎溴铵酊	化学药	HZ000368
薄荷麝香草酚搽剂	化学药	HZ000456
醋酸氯己定栓	化学药	HZ000589
碘酊	化学药	HZ000706
酚酞栓	化学药	HZ000935
复方安息香酊	化学药	HZ001026
复方苯海拉明克罗米通酊	化学药	HZ001084
复方苯甲酸酊	化学药	HZ001087
复方薄荷酊	化学药	HZ001098
复方薄荷柳酯搽剂	化学药	HZ001099
复方醋酸曲安奈德溶液	化学药	HZ001122
复方甘草口服溶液	化学药	HZ001173
复方肝浸膏糖浆	化学药	HZ001190
复方桔梗氯化铵口服溶液	化学药	HZ001233
复方桔梗枇杷糖浆	化学药	HZ001237
复方克霉唑溶液	化学药	HZ001253
复方氯己定含漱液	化学药	HZ001302
复方氯乙烷气雾剂	化学药	HZ001307
复方枇杷氯化铵糖浆	化学药	HZ001337
复方水杨酸溶液	化学药	HZ001392
复方水杨酸土槿皮酊	化学药	HZ001393
复方盐酸利多卡因注射液	化学药	HZ001458
甘油醇溶液	化学药	HZ001566
核酪口服溶液	化学药	HZ001690
甲硝唑氯己定洗剂	化学药	HZ001911
酒花素搽剂	化学药	HZ001968
硼酸冰片滴耳液	化学药	HZ002856
葡萄糖酸氯己定含漱剂	化学药	HZ002894
升华硫氯化氨基汞洗剂	化学药	HZ003198
舒肤特	化学药	HZ003212
维生素 E 搽剂	化学药	HZ003575
五维葡钙口服溶液	化学药	HZ003610
五维他口服溶液	化学药	HZ003611
硝酸甘油气雾剂	化学药	HZ003695
小儿复方麻黄碱桔梗糖浆	化学药	HZ003758
乙醇	化学药	HZ004495
樟脑苯酚溶液	化学药	HZ004643

续表

制剂名称	类别	序号
肤舒止痒膏	民族药	MZ000148
复方青蒿搽剂	民族药	MZ000166
复方青蒿喷雾剂	民族药	MZ000167
金喉健喷雾剂	民族药	MZ000257
开喉剑喷雾剂	民族药	MZ000277
苦豆子油搽剂	民族药	MZ000294
安络痛片	中成药	ZC000031
八角茴香水	中成药	ZC000093
冰黄软膏	中成药	ZC000358
橙皮酊	中成药	ZC000561
虫草双参酒	中成药	ZC000576
蜂胶牙泰	中成药	ZC001140
妇洁搽剂	中成药	ZC001182
复方熊胆通鼻喷雾剂	中成药	ZC001577
骨泰酊	中成药	ZC001869
姜红祛痛搽剂	中成药	ZC002547
热痱搽剂	中成药	ZC004287
参茸酒	中成药	ZC004875
湿痒洗液	中成药	ZC005056
酸痛喷雾剂	中成药	ZC005375
仙鹿补酒	中成药	ZC005968
小儿止泻贴	中成药	ZC006369
熊胆酒	中成药	ZC006523
益气养血补酒	中成药	ZC006880
茵陈酒	中成药	ZC006943

HY002488 乙二醇苯醚

【外文名称】Ethylene Glycol Monephenyl Ether, 2 - phenoxyethanol

【性状及组成】本品它是一种略带玫瑰香味，低挥发，高沸点的无色透明液体。

药物药理信息

【药理毒理】乙二醇苯醚（HJ - EPH）是一种典型的高沸点有机溶剂，能和许多有机溶剂混溶，渗透性强，与异佛尔酮、DBE、苯甲醇比综合性能突出，可全性能替代使用。HJ - EPH 对丙烯酸树脂、硝基纤维素、乙基纤维素、环氧树脂、醇酸树脂、苯氧基树脂等各种树脂具有极好的溶解性，能与醇、醚混溶，俗称“万能溶液”。在医药工业中是一种理

想的防腐剂，是制作杀菌剂的原料，也用于麻醉剂。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肤螨灵软膏	中成药	ZC0001149

HY002489　乙非他明

【外文名称】Etilamfetamine

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为精神药品，但我国未生产或使用。

HY002490　乙芬胺

【其他名称】MDA

【外文名称】N－ethyl

药物管理信息

【特殊管理分类】一类精神药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为精神药品，但我国未生产或使用。

HY002491　乙琥胺

【其他名称】柴浪丁、Emeside、Suxinultin

【外文名称】Ethosuximide

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】3－甲基－3－乙基－2，5－吡咯烷二酮

【分子式】$C_7H_{11}NO_2$

【分子量】141.17

【性状及组成】本品为白色或微黄色蜡状固体；几乎无臭，味微苦；有引湿性。本品在乙醇或三氯甲烷中极易溶解，在水中易溶。

熔点：本品的熔点为43～47℃（以液状石蜡为传温液）。

药物药理信息

【药理毒理】本品为抗癫痫药。毒性低，出现严重不良反应的危险性很少，癫痫小发作的首选药物之一。对肌阵挛性发作有较好的疗效。本品常与其他抗癫痫药物合用治疗大发作或其他发作合并小发作。

动物实验证明，本药对戊四氮引起之惊厥有明显对抗作用。作用机制不详，有人提出乙琥胺可能是通过增强中枢抑制性递质（GABA）作用直接或间接地增加脑内氯化物电导，从而增加细胞抑制，而抗癫痫。

【药代动力学】

1次给药后1～4小时可达血高峰值。连续用药7日可达稳态血浓度。很少与血浆蛋白结合，可迅速通过血脑屏障。长期用药时，在脑脊液中的浓度与血浆中相似。在体内部分经肝代谢，以原形及肝脏代谢物共同自尿排出体外。成年人的$t_{1/2}$约为60小时；儿童者约为30小时。

【不良反应】本品比较安全，不良反应发生率低，仅10%因不良反应而停药。常见的不良反应有：胃部不适、恶心、呕吐、食欲减退、疲乏、嗜睡、头晕、头痛、运动失调。这些不良反应与剂量有关，且随服药时间延长而减少。偶见皮疹、畏光、激动、欣快、震颤麻痹症状。罕见全身性红斑狼疮、斯－约综合征、白细胞减少、血小板较少、再生障碍性贫血。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乙琥胺胶囊	化学药	HZ0004496

HY002492　乙环利定

【外文名称】Eticyclidine

药物管理信息

【特殊管理分类】一类精神药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为精神药品，但我国未生产或使用。

HY002493　乙基纤维素

【其他名称】EC

【外文名称】Ethylcellulose

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】纤维素乙基醚

【分子式】$[C_6H_7O_2(OC_2H_5)X(OH)_3-X]_n$

【性状及组成】本品为乙基醚纤维素。按干燥品

计算，含乙氧基应为44.0%～51.0%。

本品为白色颗粒或粉末，无臭，无味。本品5%悬浮液对石蕊试纸呈中性。本品在甲苯或乙醚中易溶，在水中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料。

本品具有黏合、填充、成膜等作用，广泛应用于口服和外用制剂中。

口服制剂中乙基纤维素主要作为片剂和颗粒的疏水性包衣材料。用乙基纤维素包衣主要是为了调整药物的释放速度，掩盖不良气味，增加制剂的稳定性；例如，颗粒用乙基纤维素包衣可防止氧化，缓释片可用乙基纤维素作为骨架材料。

乙基纤维素，溶于有机溶剂或其混合物，其自身可制成水不溶性膜。越高黏度的乙基纤维素制成的膜越牢固持久。加入羟丙甲纤维素或增塑剂后可调整乙基纤维膜的溶解性。例如商品Aquacoat ECD（FMC生物聚合物公司）或Surelease（Colorcon公司）等乙基纤维素水分散体中没有有机溶剂，也可用以包乙基纤维素薄膜。

通过薄膜衣扩散可以控制乙基纤维素包衣制剂的药物释放。除非制剂的表面积（例如，小丸或颗粒，与片剂相比）很大，一般释放过程缓慢。在某些情况下，乙基纤维素水分散体一般用于颗粒或小丸的包衣，乙基纤维素水分散体一般用于颗粒或小丸的包衣。乙基纤维素包衣的小丸和颗粒能承受压力，因此可以保护包衣层在压片过程中免于破裂。

高黏度的乙基纤维素可用于药物微囊化。

药物从乙基纤维素包衣微囊的释放过程与微囊壁厚度和表面积有关。

在片剂中，乙基纤维素经干法或以95%的乙醇为溶液的湿法混合后还可用作黏合剂。用乙基纤维素制得的片子硬，脆性低，但是其溶出度差。

乙基纤维素还可用在口腔中（例如牙科），作为传递治疗药物的装置。

外用制剂中，选用合适的溶剂，乙基纤维素还可在软膏，洗剂或凝剂中作为增稠剂。

此外，乙基纤维素还可用在化妆品和食品中。

【药物相互作用】禁止与石蜡，微晶石蜡合用。

【不良反应】乙基纤维素广泛应用于口服和外用制剂中，也可应用于食品。口服乙基纤维素后人体不代谢因此为无热量物质。人体不能代谢乙基纤维素所以其不能应用于注射制剂中。注射剂使用乙基纤维素可能对肾有毒害。

普遍认为乙基纤维素是无毒，无致敏性，无刺激性的物质。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
冰栀伤痛气雾剂	中成药	ZC000371
维C银翘颗粒	中成药	ZC005668
维C银翘片	中成药	ZC005669

HY002494 乙甲噻丁

【外文名称】Ethylmethylthiambutene

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY002495 乙硫异烟胺

【外文名称】Ethionamide

药物药理信息

【药理毒理】对结核杆菌有抑菌作用，抗菌活性仅为异烟肼的十分之一。对渗出性及浸润性干酪病变疗效较好。单独应用少，常与其他抗结核病药联合应用以增强疗效和避免病菌产生耐药性。

【药代动力学】本品口服易吸收，体内分布广，可渗入全身体液（包括脑脊液），在体内全部代谢为无效物。

【药物过量】大剂量可引起体位性低血压。

【不良反应】

1．服药后有恶心、呕吐、腹痛、腹泻、畏食、胃部不适等症状，多于服药2～3周后发生，如不能耐受，可酌减剂量或暂停服药，俟症状消失后继续服用。如合用碳酸氢钠，或服肠溶片，可减轻反应。在发生呕吐时，可同时使用止吐药物。

2．少数患者有糙皮病症状、精神抑郁、视力紊乱和头痛、末梢神经炎、经期紊乱、男子乳房女性化、脱发、关节痛、皮疹、痤疮等。

3．20%～30%病人可对肝功能有影响，引起氨基转移酶升高，并可发生黄疸，故每月应测肝功能1次。

HY002496 乙氯维诺

【外文名称】Ethchlorvynol

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件

《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为精神药品，但我国未生产或使用。

HY002497　乙醚

【外文名称】Aether

药物管理信息

【特殊管理分类】易制毒药

药物药理信息

【药理毒理】本品在医药工业用作药物生产的萃取剂和医疗上的麻醉剂。《易制毒化学品管理条例》（国务院令第445号）规定本品为易制毒化学药品。

HY002498　乙色胺

【外文名称】Etryptamine

药物管理信息

【特殊管理分类】一类精神药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安〔2007〕633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为精神药品，但我国未生产或使用。

HY002499　乙水杨胺

【其他名称】邻乙氧基苯甲酰胺、乙水酰胺、止痛灵

【外文名称】Ethenzamide

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第2册

药物药理信息

【药理毒理】本品可抑制前列腺素合成，具有解热、镇痛和抗炎作用。

【药物相互作用】

1. 不应与含有本品的同类制剂及其他解热镇痛药同用。

2. 本品不宜与抗凝血药（如双香豆素、肝素）及溶栓药（链激酶）同用。

3. 抗酸药如碳酸氢钠等可增加本品自尿中的排泄，使血药浓度下降，不宜同用。

4. 本品与糖皮质激素（如地塞米松等）同用，可增加胃肠道不良反应。

5. 本品可加强口服降糖药及甲氨蝶呤的作用，故不应同用。

6. 与锂制剂同用可使其血药浓度上升，出现锂中毒症状。

7. 可减弱噻嗪类利尿药的作用。

8. 如正在服用其他药品，在服用本品前请咨询医师或药师。

【不良反应】

1. 较常见的有恶心、呕吐、上腹部不适或疼痛等胃肠道反应。

2. 较少见或罕见的有①胃肠道出血或溃疡，表现为血性或柏油样便，胃部剧痛或呕吐血性或咖啡样物，多见于大剂量服药患者；②支气管痉挛性过敏反应，表现为呼吸困难或哮喘；③皮肤过敏反应，表现为皮疹、荨麻疹、皮肤瘙痒等；④血尿、眩晕和肝脏损害。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乙水杨胺片	化学药	HZ004497

HY002500　乙酸乙酯

【其他名称】醋酸乙酯

【外文名称】Ethyl Acetate

药物理化信息

【化学名】乙酸乙酯

【分子式】$C_4H_8O_2$

【分子量】88.10

【性状及组成】本品为澄明、无色、带有宜人的水果香气并略带酸臭的挥发性液体，稀释后味适口，乙酸乙酯可燃。微溶于水，溶于醇、酮、醚、三氯甲烷等多数有机溶剂。

药物药理信息

【药理毒理】药品标准类别：香料、溶剂。

在药物制剂中，乙酸乙酯主要是作为溶剂使用，也可用作香料、调料。作为溶剂，它用于外用溶液剂和凝胶剂中，并且可用于片剂的可食性印字墨水。

乙酸乙酯可以增加氯喹酮的溶解度，制备新戊酸吡罗昔康及甲芬那酸的多晶型，并可用于微球的制备。

【药物相互作用】乙酸乙酯与强氧化剂、强碱、强酸和硝酸盐产生剧烈反应，可导致火灾或爆炸。本品与氯磺酸、氢化锂铝、2-氯甲基呋喃及四丁基氢氧化钾也起剧烈反应。

【不良反应】乙酸乙酯可用于食品和口服及外用药物制剂中，作为赋形剂一般认为本品相对无毒、无刺激性。

然而，乙酸乙酯可刺激黏膜并且高浓度可导致中央神经系统抑制。过度的暴露可能产生的症状包括眼、鼻、喉的刺激，麻痹和皮炎。

没有资料显示乙酸乙酯是人类致癌原，也未表

明其具有生殖和发育毒性。

WHO规定乙酸乙酯的一日允许摄入量最大为25mg/kg。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
聚甲基丙烯酸乙氧乙酯气雾剂	化学药	HZ002028

HY002501 乙烯比妥

【外文名称】Vinylbital

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安〔2007〕633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为精神药品，但我国未生产或使用。

HY002502 乙酰阿法甲基芬太尼

【外文名称】Acetylalphamethylfentanyl

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安〔2007〕633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY002503 乙酰胺

【外文名称】Acetamide

【分子式】C_2H_5NO

【分子量】59.07

【性状及组成】本品为白色透明结晶，易潮解。在水中极易溶解，在乙醇中易溶，在甘油、三氯甲烷中溶解。

药物药理信息

【药理毒理】为灭鼠药氟乙酰胺中毒的解毒剂，具有延长中毒潜伏期，减轻发病症状或制止发病的作用。

乙酰胺化学结构与氟乙酰胺相似，可能因为本品在体内与氟乙酰胺争夺酰胺酶，使后者不能转化为氟乙酸，从而消除其对机体的毒性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乙酰胺注射液	化学药	HZ004498

HY002504 乙酰半胱氨酸

【其他名称】AHR－3053、LJ－206、Mucocis、Mucolex、Mucopront、Reomucil、Rhinathiol、Thiodril、痰易净、易咳净

【外文名称】Acetylcysteine

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】*N*－乙酰基－L－半胱氨酸

【分子式】$C_5H_9NO_3S$

【分子量】163.20

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，有类似蒜的臭气，味酸；有引湿性。本品在水或乙醇中易溶。

熔点：本品的熔点为101～107℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品的活性成分为*N*－乙酰－L－半胱氨酸，它通过分解黏蛋白复合物、核酸，将痰中的脓性成分及其他黏液和黏液分泌物从黏稠变为稀薄而发挥强烈黏液溶解作用。

此外，本品通过一个能与亲电子的氧化基团直接发生作用的自由巯基（亲核的－SH）而发挥直接抗氧化作用。本品能保护α－1抗胰蛋白酶（弹性蛋白酶的抑制剂）免受次氯酸的作用而失活。次氯酸是活化吞噬细胞中髓过氧化物酶产生的一种强氧化剂。

这些特性使得本品特别适用于治疗以浓稠的黏液及黏液分泌物为特征的急性和慢性的呼吸系统感染。此外，本品的分子结构使它易于透过细胞膜。在细胞内，本品脱去乙酰基，形成L－半胱氨酸，这是一种合成谷胱甘肽（GSH）的必需氨基酸。

GSH是一种广泛存在于各种动物组织的高活性的三肽。谷胱甘肽是细胞内最重要的保护剂，对保持细胞功能和细胞形态的完整性是必需的。它可防止细胞免受自然界氧自由基和各种细胞毒素物质的损害。

本品在保持适当的GSH水平方面起着重要的作用。从而有助于保护细胞不因体内GSH水平过低而导致的细胞毒素损害，如对乙酰氨基酚中毒的情况。

由于具有这种作用的机制，在对乙酰氨基酚中毒时和在环磷酰胺治疗情况下及在出血性膀胱炎时，本品也可以作为一种特殊的解毒剂（在后一种情况中，本品提供使丙烯醛失活必需的巯基而不干扰化学治疗，丙烯醛是一种影响尿路黏膜的毒性代谢产物）。

急性毒性：NAC口服、腹腔内注射、静脉注射的急性毒性低，在正常喂养的大鼠和小鼠单次口服给药的LD_{50}值分别＞10kg和＞8g/kg，静脉注射给药大鼠2.8g/kg，小鼠为4.6g。

长期毒性：在重复给药研究中，大鼠日口服给药1g/kg共12周和6个月，耐受良好。狗日口服给药300mg/kg共1年，尚未见毒性反应。

生殖毒性研究：观察大鼠和兔在妊娠期用大剂量乙酰半胱氨酸后对后代器官发育期无致畸作用。

致突变研究：乙酰半胱氨酸无致突变作用（Ames试验）。

致癌研究：本品对动物和人的毒性研究试验显示无致突变作用，故未进行致癌试验。

【药代动力学】通过放射性标记口服给药，已证明本品在人体吸收良好，在2～3小时内血药浓度达到峰值，服药后肺组织中存在本品有效浓度。大约70%的药物以硫酸盐的形式排泄，服后4小时可见明显疗效。

【药物相互作用】

1．本品能增加金制剂的排泄。

2．可减弱青霉素类，四环素类，头孢菌素类的抗菌活性。故本品不可与这些药物并用，必要时可间隔4小时交替使用。但对强力霉素、红霉素、羟氨苄青霉素的吸收无影响。

3．本品不得与糜蛋白酶配伍用药。

4．本品不可与酸性药物同用，否则可降低本品作用。

5．本品可与支气管扩张剂和血管收缩剂等药物合用。

6．应避免同服强力镇咳药。

7．不宜与一些金属如铁、铜和橡胶接触。

【药物过量】未观察到特殊中毒症状和体征。

【不良反应】偶有轻度头晕、恶心、胃部不适、腹泻、胃肠道出血、皮疹等不良反应。极少出现皮疹和支气管痉挛等过敏反应。药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方氨基酸注射液（17AA－Ⅰ）	化学药	HZ001059
喷雾用乙酰半胱氨酸	化学药	HZ002853
乙酰半胱氨酸滴眼液	化学药	HZ004499
乙酰半胱氨酸胶囊	化学药	HZ004500
乙酰半胱氨酸颗粒	化学药	HZ004501
乙酰半胱氨酸泡腾片	化学药	HZ004502
乙酰半胱氨酸注射液	化学药	HZ004503

HY002505　乙酰谷酰胺

【其他名称】醋谷胺

【外文名称】Aceglutamide

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第9册

药物理化信息

【化学名】N_2－乙酰－L－谷氨酰胺

【分子式】$C_7H_{12}N_2O_4$

【分子量】188.18

药物药理信息

【药理毒理】乙酰谷酰胺为谷胺酰胺的乙酰化合物，通过血－脑脊液屏障后分解为谷氨酸和γ－氨基丁酸（GABA）。谷氨酸参与中枢神经系统的信息传递。γ－氨基丁酸能拮抗谷氨酸的兴奋性，改善神经细胞代谢，维持神经应激能力及降低血氨的作用，改善脑功能。用于肝昏迷，脑外伤性昏迷；酒药依赖；器质性精神障碍，智力、记忆力减退；瘫痪；小儿麻痹后遗症。

【药代动力学】本品在体内分布广泛，脑、肝、肾浓度较高，在肾小管细胞内经谷氨酰分解，分解出氨而变成乙酰谷氨酸，氨从肾小管分泌排出，乙酰谷氨酸被吸收，参与体内代谢。能通过血脑屏障。

【药物过量】尚无本品药物过量的研究资料和文献报道。一旦发生过量，应予以对症和支持治疗。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
谷红注射液	化学药	HZ001636
乙酰谷酰胺氯化钠注射液	化学药	HZ004504
乙酰谷酰胺氯化钠注射液	化学药	HZ004504
乙酰谷酰胺葡萄糖注射液	化学药	HZ004505
乙酰谷酰胺注射液	化学药	HZ004506
注射用乙酰谷酰胺	化学药	HZ005121

HY002506　乙酰吉它霉素

【外文名称】Acetylkitasamycin

药物理化信息

【化学名】（3*R*，4*R*，5*S*，6*R*，8*R*，9*R*，10*E*，12*E*，15*R*）－3,9二乙酰氧基－5－［*O*－（4－*O*－酰基－2,6－二脱氧－3－*C*－甲基－α－L－核糖－己吡喃糖基）－（1－4）－2－*O*－乙酰基－3,6－二脱氧－3－二甲氨基－β－D－吡喃葡萄糖基］－6－乙酰醛基－4－甲氧基－8,15－二甲基－10,12－十五烷

二烯－15－内酯

药物药理信息

【药理毒理】本品为大环内酯类抗生素。作用机制同红霉素，抗菌谱与红霉素也相似，但对大多数革兰阳性菌的抗菌活性略差，部分耐红霉素的金黄色葡萄球菌仍对吉他霉素敏感。本品对白喉杆菌、破伤风杆菌、淋病奈瑟菌、百日咳杆菌、立克次体属和沙眼衣原体也有相当活性。

【药代动力学】本品口服吸收良好。在脏器内分布广泛，肝和胆汁中浓度尤高，在肺、肾、肌肉等组织中浓度也较血药浓度为高。本品主要经肝胆系统排泄。

成人口服乙酰吉他霉素片800mg后的血药浓度为：90分钟为（2.86±0.98）μg/ml，3小时后为（1.11±0.27）μg/ml，4小时后为（0.72±0.21）μg/ml；达峰时间为（1.28±0.3）小时，达峰浓度为（3.89±0.50）μg/ml；曲线下面积（AUC）$_{0\sim8}$小时为（7.54±0.73）mg·h/L，曲线下面积（AUC）$_{0\sim\infty}$为（7.90±0.69）mg·h/L。

据文献资料报道：乙酰吉他霉素小儿口服0.1～0.2g后，血药浓度：30分钟后为4.3～6.8μg/ml，3小时后为2.7～5.8μg/ml，4小时后为0.4～2.8μg/ml。

【不良反应】偶有胃部不适、皮疹等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乙酰吉他霉素干混悬剂	化学药	HZ004507
乙酰吉他霉素胶囊	化学药	HZ004508
乙酰吉他霉素颗粒	化学药	HZ004509
乙酰吉他霉素口含片	化学药	HZ004510
乙酰吉他霉素片	化学药	HZ004511

HY002507 乙酰卡尼

【其他名称】乙酰卡因胺、乙酰普鲁卡因胺

【外文名称】Acecainide

药物药理信息

【药理毒理】本品为普鲁卡因胺的主要代谢产物，其对心肌的电生理作用与普鲁卡因胺相似。其与母核的药理学差异为：安全范围较窄；具有正性肌力作用；偶有引起类红斑狼疮综合征；长期用药可产生耐药性，增加剂量亦无效。可用于房性及室性早搏，心动过速。

【药代动力学】$t_{1/2}$较长，约6～22小时。

【不良反应】有恶心、腹泻、头晕、神经过敏、视力模糊等。

HY002508 N－乙酰邻氨基苯酸

【外文名称】N－Acetylanthranilic Acid

药物管理信息

【特殊管理分类】易制毒药

药物药理信息

【药理毒理】《易制毒化学品管理条例》（国务院令第445号）规定本品为易制毒化学药品。

HY002509 乙酰螺旋霉素

【其他名称】醋酸螺旋霉素

【外文名称】Acetylspiramycin

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】乙酰螺旋霉素

【性状及组成】本品为单乙酰螺旋霉素Ⅱ、单乙酰螺旋霉素Ⅲ、双乙酰螺旋霉素Ⅱ和双乙酰螺旋霉素Ⅲ四个组分为主的混合物。按干燥品计算，每1mg的效价不得少于1200个乙酰螺旋霉素单位。

本品为白色或微黄色粉末；味苦。

本品在甲醇、乙醇、丙酮或乙醚中溶解，在水中几乎不溶，在石油醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】乙酰螺旋霉素为螺旋霉素的乙酰化衍生物，属16元环大环内酯类。本品对金黄色葡萄球菌、肺炎链球菌、化脓性链球菌、粪肠球菌等革兰阳性球菌具良好抗菌作用。对李斯特菌属、卡他莫拉菌、淋病奈瑟菌、胎儿弯曲菌、流感嗜血杆菌、嗜肺军团菌、百日咳杆菌、拟杆菌属、产气荚膜杆菌、痤疮丙酸杆菌、消化球菌和消化链球菌以及衣原体属、支原体属、弓形虫、隐孢子虫等亦具抑制作用。肠道革兰阴性杆菌通常耐药。

作用机制为乙酰螺旋霉素与敏感微生物的核糖体50S亚单位结合，抑制依赖于RNA的蛋白质合成而发挥抑菌作用。

【药代动力学】本品耐酸，口服吸收好，经胃肠道吸收后脱乙酰基转变为螺旋霉素而起抗菌作用。单剂口服0.2g后2小时达血药峰浓度1mg/L。本品在体内分布广泛，在胆汁、尿液、脓液、支气管分泌物、肺组织及前列腺中的浓度一般较血浓度高，本品不能透过血－脑脊液屏障。平均血消除半衰期约为4～8小时。多次给药后体内有蓄积作用。本品主要经粪便排泄，12小时经尿排泄量约为给药量的5%～15%，其中大部分为代谢产物，胆汁中浓度可

达血浓度的15～40倍。

【药物相互作用】

1．本品不影响氨茶碱等药物的体内代谢。

2．在接受麦角衍生物类药物的患者中，同时使用某些大环内酯类曾出现麦角中毒，目前尚无麦角与乙酰螺旋霉素相互作用的报道，但理论上仍存在这一可能性，因此乙酰螺旋霉素与麦角不宜同时服用。

【不良反应】病人对本品耐受性良好，不良反应主要为腹痛、恶心、呕吐等胃肠道反应，常发生于大剂量用药时，程度大多轻微，停药后可自行消失。变态反应极少，主要为药疹。未发现肝、肾功能损害及血、尿常规异常。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乙酰螺旋霉素胶囊	化学药	HZ004512
乙酰螺旋霉素片	化学药	HZ004513

HY002510　乙酰麦迪霉素

【其他名称】醋酸麦迪霉素、美欧卡霉素

【外文名称】Acetylmidecamycin

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第45册

药物理化信息

【化学名】（3*R*，4*S*，5*S*，6*R*，7*R*，8*R*，9*R*，10*E*，12*E*，15*R*）－9－乙酰氧基－5－［［3，6－二脱氧－4－*O*－（3－*O*－乙酰基－2，6－二脱氧－3－*C*－甲基－4－*O*－丙酰基－α－L－核型－己吡喃葡糖基）－3－（二甲氨基）－β－D－吡喃葡糖基］－氧基］－4－甲氧基－8，15－二甲基－3－丙酰氧基－1－氧代－氧杂环十六碳－10，12－二烯－6－乙醛

【分子式】$C_{45}H_{71}NO_{17}$

【分子量】898.10

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末，无臭、无味。

本品在乙酸乙酯或丁酮中易溶，在甲醇中略溶，在乙醇中难溶，在水或乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品属大环内酯类抗生素。抗菌谱与红霉素相似，但抗菌作用略弱，对革兰阳性菌和奈瑟菌属具较好活性。本品不易诱导细菌产生耐药性，部分耐红霉素的金黄色葡萄球对本品仍可敏感。

本品通过作用于细菌核糖体的50S亚基，阻碍细菌蛋白质的合成而发挥作用，为生长期抑菌药。

【药代动力学】本品为麦迪霉素的二醋酸酯，较麦迪霉素吸收好，血药浓度高。本品口服后吸收迅速，约1小时后血药浓度达峰值。广泛分布于腮腺、咽部、扁桃体、皮肤软组织及肺、肝、肾等脏器，组织中药物浓度均较同时期血药浓度高，持续时间也较长。在痰及支气管分泌液中的分布也较多。本品主要在肝脏代谢，经胆汁排出，故在胆汁中的浓度可高达血药浓度的10倍以上。血消除半衰期为1.3～1.5小时。成人口服本品600mg后，24小时内尿中排泄率为4%～5%。本品难以透入脑脊液中。

【药物相互作用】本品可抑制茶碱的正常代谢，与茶碱合用时可致茶碱的血药浓度异常升高而致中毒，甚至死亡，故两药合用时应监测茶碱的血药浓度。

【不良反应】

1．肝毒性：在正常剂量下本品的肝毒性较小，主要表现为胆汁淤积和暂时性血清氨基转移酶升高等，一般停药后可恢复。

2．过敏反应：主要表现为药物热、药疹和荨麻疹等。

3．偶见恶心、呕吐、上腹不适、食欲减退等胃肠道反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乙酰麦迪霉素干混悬剂	化学药	HZ004514
乙酰麦迪霉素胶囊	化学药	HZ004515
乙酰麦迪霉素颗粒	化学药	HZ004516
乙酰麦迪霉素片	化学药	HZ004517

HY002511　乙酰葡醛酯

【其他名称】醋葡醛内酯、Glucaron、SLA、乙酰葡醛内酯

【外文名称】Aceglatone

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末。无臭、无味。

熔点：185～186℃、192℃（分解）。

在二甲基甲酰胺中溶解，在二氧六环、乙烷、甲醇和乙醇中微溶，在丙酮中难溶，在水中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】为葡萄糖醛酸苷酶的抑制剂，可抑制膀胱及血中β－葡萄糖醛酸苷酶的活力，使体内外因性或内因性的致癌物质失活而起抗癌作用。

芳香胺类是职业性膀胱癌的致癌原，它在肝脏

中代谢成为致癌原近似物后，与葡萄糖醛酸化合成为不活化型复合物，经肾排泄至膀胱，此时有部分可积蓄于膀胱，受到 β－葡萄糖醛酸苷酶的作用释放出芳香胺而恢复它的活性，因而可在膀胱黏膜中发生致癌作用。本品可抑制膀胱及血中的 β－葡萄糖醛酸苷酶的活性而发挥抗致癌作用。

【不良反应】 有轻度胃肠道反应，皮肤色素沉着等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乙酰葡醛酯片	化学药	HZ004518

HY002512 乙酰水杨酸铝

【其他名称】 阿司匹林铝

【外文名称】 Alumini Acidi Acetylsalicylicum

药物管理信息

【依据标准】 卫生部颁药品标准（二部）·第3册

【分子式】 $C_{18}H_{15}AlO_5$

【分子量】 402.29

【性状及组成】 本品为白色结晶性粉末，无臭或微带醋酸臭。

本品在水、乙醇、苯或已烷中几乎不溶；在氢氧化钠试液或碳酸钠试液中溶解但同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】 解热、消炎镇痛药。用于发热、疼痛、风湿及类风湿性关节炎等。

HY002513 乙酰天麻素

【外文名称】 Acetagastrodin

药物管理信息

【依据标准】 化学药品地标升国标·第16册

药物药理信息

【药理毒理】 本品具有增加脑血流量并缓解脑血管痉挛的作用；本品可恢复大脑皮层兴奋与抑制过程间的平衡失调，具有镇静、安眠和镇痛等中枢抑制作用。本品具有吸收快，体内不易蓄积，服用后不影响第二天工作及生活的特点。

【不良反应】 个别病人出现恶心、口干、胃部不适等症状，减药或停药后恢复正常。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乙酰天麻素片	化学药	HZ004520

HY002514 乙酰乌头碱

【其他名称】 3－乙酰乌头碱

【外文名称】 Acetylaconitine

药物管理信息

【依据标准】 化学药品地标升国标·第4册

【分子式】 $C_{36}H_{49}NO_{12}$

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乙酰乌头碱片	化学药	HZ004521

HY002515 乙酰唑胺

【其他名称】 Albox、醋氮酰胺、醋唑磺胺、带阿莫斯（Diamox）、DIAMOX、Didoc、Diluran、Diuramid、Diuriwas、Diurramide、代马克司、代冒克斯、丹木斯、Edemox、Glampax

【外文名称】 Acetazolamide

药物管理信息

【依据标准】 中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】 *N*－［5－（氨磺酰基）－1,3,4－噻二唑－2－基］乙酰胺

【分子式】 $C_4H_6N_4O_3S_2$

【分子量】 222.25

【性状及组成】 本品为白色针状结晶或结晶性粉末，无臭，味微苦。本品在沸水中略溶，在水或乙醇中极微溶解，在三氯甲烷或乙醚中几乎不溶；在氨溶液中易溶。

熔点：本品的熔点为256～261℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】 本品为碳酸酐酶抑制剂，能抑制房水生成，降低眼压。房水流出易度则不改变。乙酰唑胺能抑制睫状体上皮碳酸酐酶的活性，从而减少房水生成（50%～60%），使眼压下降。

【药代动力学】 口服容易吸收。与蛋白结合率高。口服乙酰唑胺500mg后1～1.5小时降低眼压作用开始；2～4小时血药浓度达峰值；可维持4～6小时，血清最高浓度为12～27mg/ml，$t_{1/2}$为2.4～5.8小时。乙酰唑胺口服，在24小时内给药量的90%～100%以原形由肾脏排泄。

【药物相互作用】

1．与促肾上腺皮质激素、糖皮质激素尤其与盐皮质激素联合使用，可以导致严重的低血钾，在联

合用药时应注意监护血清钾的浓度及心脏功能。亦应估计到长期同时使用有增加低血钙的危险，可以造成骨质疏松，因为这些药都能增加钙的排泄。

2. 与苯丙胺、抗M胆碱药、尤其是和阿托品、奎尼丁联合应用时，由于形成碱性尿，本品排泄减少，会使不良反应加重或延长。

3. 与抗糖尿病药（如胰岛素）联合应用时，可以减少低血糖反应，因为本品可以造成高血糖和尿糖，故应调整剂量。

4. 与苯巴比妥、卡马西平或苯妥英钠等联合应用，可引起骨软化发病率上升。

5. 洋地黄苷类与本品合用，可提高洋地黄的毒性，并可发生低钾血症。

6. 与甘露醇或尿素联合应用，在增强降低眼内压作用的同时，可增加尿量。

【药物过量】尚未有患者服用过量致急性毒性反应的报道。

【不良反应】一般用药后常见的不良反应有：①四肢麻木及刺痛感；②全身不适：疲劳、体重减轻、困倦抑郁、嗜睡、性欲减低等；③胃肠道反应：金属样味觉、恶心、食欲减退、消化不良、腹泻；④肾脏反应：多尿、夜尿、肾及泌尿道结石等。⑤可出现暂时性近视，也可发生磺胺样皮疹，剥脱性皮炎。

少见的不良反应：①电解质紊乱：代谢性酸中毒、低钾血症，补充碳酸氢钠及钾盐有可能减轻症状；②听力减退；③最严重的不良反应是造血系统障碍：急性溶血性贫血、粒细胞减少症、血小板减少症、嗜伊红细胞增多症、再生障碍性贫血，和肾功能衰竭。

长期用药可加重低钾血症、低钠血症、电解质紊乱及代谢性酸中毒等症状。由于血钾下降可减弱本品的降眼压作用。对肾结石病人，本品可诱发或加重病情，如出现肾绞痛和血尿应立即停药。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乙酰唑胺片	化学药	HZ004522
乙酰唑胺注射液	化学药	HZ004523

HY002516　乙氧苯柳胺

【外文名称】Etofesalamide

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第56册

药物理化信息

【化学名】N－（4－乙氧苯基）－2－羟基苯甲酰胺

【分子式】$C_{15}H_{15}NO_3$

【分子量】257.29

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，无味。

本品在丙酮中易溶，在三氯甲烷或乙酸乙酯中溶解，在甲醇、乙醇或乙醚中略溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为140～144℃。

药物药理信息

【药理毒理】

1. 药理学：本品为非甾体抗炎、抗过敏药物，外涂能抑制炎症介质（如组胺、5－羟色胺、前列腺素E1）引起的皮肤毛细血管通透性增加；抑制炎性肿胀和炎性增殖过程中的肉芽组织增生，对Ⅰ型、Ⅳ型变态反应具有抑制作用，此外，体外试验表明本品也有抗痤疮杆菌作用。其MIC为62.5μg/ml。

2. 毒理学：急性毒理试验：灌胃给药的LD_{50}＞5000mg/kg。腹腔注射途径给药的LD_{50}＞2750mg/kg。

【不良反应】个别患者局部痒、红、灼热、脱屑以及接触性皮炎等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乙氧苯柳胺软膏	化学药	HZ004524

HY002517　乙氧黄酮

【外文名称】Efloxate

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第1册

药物理化信息

【化学名】黄酮－7－氧醋酸乙酯

【分子式】$C_{19}H_{16}O_5$

【分子量】324.33

【性状及组成】本品为白色或类白色针状结晶或结晶性粉末，无臭，无味。

本品在三氯甲烷中易溶，在丙酮中溶解，在乙醇中微溶，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为123～126℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为冠脉扩张剂，能选择性的扩张冠状动脉增加冠脉血流量，但不增加心肌耗氧量。可促进冠脉侧支循环形成、对周围血管、呼吸、血压、心率、心输出量、心功能无影响。此外本品尚

有降低血胆固醇的作用。

【不良反应】偶有恶心、呕吐、面色潮红，失眠等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乙氧黄酮片	化学药	HZ0004525

HY002518 异丙安替比林

【其他名称】丙非那宗、苯甲丙吡唑酮、Degripol、Isopropytan、Lipyrine、Propipenazone

【外文名称】Propyphenazone

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第38册

药物理化信息

【化学名】4－异丙基－1，5－二甲基－3－氧代－2－苯基吡唑啉

【分子式】$C_{14}H_{18}N_2O$

【分子量】230.31

【性状及组成】本品为白色至微黄色结晶性粉末，无臭，味微苦。

本品在二氯甲烷或冰醋酸中极易溶解，在乙醇中易溶，在乙醚中溶解，在水中微溶。

熔点：本品的熔点为102～106℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品主要具有解热镇痛作用，抗炎抗风湿作用弱。

本品作用机制属中枢性，解热作用大体与安替比林、氨基比林相同，镇痛、抗炎作用则略低。对肠道平滑肌有松弛作用，其效力较罂粟减弱，而为氨基比林的4倍。

本品很少单用，多与其他解热、镇痛、消炎药组成复方。

【药物相互作用】与巴比妥并用时可增强，作用时间延长，而毒性亦增加。与麻黄碱、咖啡因配合也有协同作用。

【不良反应】可见皮疹、消化不良、虚脱等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方对乙酰氨基酚片Ⅱ	化学药	HZ0001150

HY002519 异丙醇

【外文名称】Isopropyl Alcohol

药物理化信息

【化学名】丙烷－2－醇

【分子式】C_3H_8O

【分子量】60.10

【性状及组成】异丙醇为无色、透明、易流动、易挥发、可燃的液体，有类酒精异臭，此臭气与乙醇和丙酮混合物相似；微有苦味。

药物药理信息

【药理毒理】异丙醇在化妆品和药物制剂中都有应用，在局部用制剂中主要作为溶剂使用。因其有毒性，不宜用于口服制剂。

虽然异丙醇可用于洗剂中，但其有强脱脂作用限制了含异丙醇制剂的多次反复使用。异丙醇也可用于片剂薄膜包衣或作片剂制粒的溶剂，并可通过蒸发法将其除去。

异丙醇具有一些抗菌活性，70%（*V*/*V*）的水溶液可作为局部用消毒剂。异丙醇用于手术后恶心或呕吐的治疗一直在研究中。

【药物相互作用】异丙醇和氧化剂，例如过氧化氢、硝酸有配伍禁忌，产生分解。异丙醇可由氯化钠、硫酸钠和其他盐类以及氢氧化钠的混合液中析出。

【不良反应】异丙醇在化妆品和局部用制剂中的应用广泛。其在胃肠道极易吸收，并通过完整皮肤缓慢吸收。长时间将皮肤暴露于异丙醇中可导致心脏和神经系统功能不全。婴儿局部应用异丙醇可致皮肤化学灼伤。

异丙醇比乙醇的代谢慢很多，主要生成丙醇。代谢产物和异丙醇主要通过尿排泄。

异丙醇的毒性大约是乙醇的2倍，因此不宜口服；异丙醇的口服不佳，其毒性反应的症状大体与乙醇相似，但异丙醇没有初始的欣快行为，而以胃肠炎和恶心为主要症状；另见乙醇品目。用δ－渗量测试技术作为快速筛选的方法，对由异丙醇摄入造成的合并症可快速确诊。虽然口服20ml后就出现中毒症状，但其口服致死剂量大约为120～250ml。注射20ml以水稀释的异丙醇，不良反应包括发热，血压稍有下降。通常在注射用制剂中不宜使用异丙醇。

虽然吸入异丙醇往往可引起刺激和昏迷，但是有关其吸入剂的治疗应用一直在研究中。异丙醇在局部给药制剂中的应用较常见，有致局部刺激作用。应用于眼部可导致角膜灼伤和眼损伤。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
克林霉素磷酸酯外用溶液	化学药	HZ0002108

HY002520　异丙托溴铵

【其他名称】溴化异丙基阿托品、异丙基阿托品

【外文名称】Ipratropium Bromide

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第5册

【分子式】$C_{20}H_{30}BrNO_3 \cdot H_2O$

【分子量】430.40

药物药理信息

【药理毒理】本品是一对支气管平滑肌有较高选择性的强效抗胆碱药，松弛支气管平滑肌作用较强，对呼吸道腺体和心血管系统的作用不明显。其扩张支气管的剂量仅及抑制腺体分泌和加快心率剂量的1/20～1/10。气雾吸入本品40或80μg对哮喘患者的疗效相当于气雾吸入2mg阿托品、70～200μg异丙肾上腺素或200μg沙丁胺醇的疗效。用药后痰量和痰液的黏滞性均无明显改变。本品为强效抗胆碱平喘药物，抗胆碱和松弛支气管平滑肌作用比阿托品强，且对支气管平滑肌具有较高选择性，吸入小剂量即可产生显著的支气管扩张作用，其扩张支气管的剂量仅为抑制腺体分泌和加快心率剂量的1/20～1/10。对呼吸道腺体和心血管系统的作用不明显，故不增加痰的黏稠度，不引起心率和其压的改变。其平喘效能优于异丙肾上腺素，以0.025%的气雾剂吸入，平喘强度与2%的奥西那林相当，而且未发现有全身性副作用。

【药代动力学】本品为季铵盐，口服不易吸收。气雾吸入后5分钟左右起效，约30～60分钟作用达峰值，维持4～6小时。

异丙托溴铵吸入后可很快吸收。估计吸入后的全身生物利用度低于用药量的10%。静脉给药后异丙托溴铵的肾脏排泄为46%，静脉用药终末清除期的半衰期为1.6小时。由放射标记法测得的清除药物及代谢产物的半衰期是3.6小时。异丙托溴铵不通过血脑屏障。

【药物相互作用】本品与β-受体激动剂合用可相互增强疗效，如与非诺特罗配伍制成气雾剂用于哮喘、慢性支气管炎和肺气肿。

【不良反应】类似阿托品，可引起心悸、头痛、头晕、神经质、恶心、呕吐、消化道疼痛、震颤、视物模糊、口干、咳嗽，排尿困难、呼吸道症状加重以及皮疹等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方异丙托溴铵气雾剂	化学药	HZ001472
吸入用复方异丙托溴铵	化学药	HZ003640
异丙托溴铵气雾剂	化学药	HZ004528

HY002521　异丁司特

【外文名称】Ibudilast

药物理化信息

【化学名】2-甲基-1-［2-（1-甲基乙基）吡唑啉［1,5-*a*］吡啶-3-基］-1-丙酮

【分子式】$C_{14}H_{18}N_2O$

【分子量】230.31

药物药理信息

【药理毒理】本品对白三烯D4和血小板激活因子炎性介质等所致离体动物气道平滑肌的收缩有抑制作用；可缓解炎性介质所致豚鼠的气道平滑肌痉挛，并能抑制实验性动物的被动皮肤过敏反应。

【药代动力学】健康成人口服本品10mg后，约5.4小时血药浓度达峰值，峰浓度约为47.0μg/ml，清除半衰期约为7.4小时。72小时后，约60%以代谢物形式随尿液排出，尿中未检出原形药。

【不良反应】主要有食欲减退、嗳气、上腹不适、恶心、呕吐、眩晕、皮疹、皮肤瘙痒等。偶见心悸、血清谷氨酸草酰乙酸转氨酶、血清谷氨酸丙酮酸转氨酶、γ-谷氨酰转肽酶、总胆红素升高。这些不良反应大都可以耐受。罕见体位性低血压。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
异丁司特缓释胶囊	化学药	HZ004529
异丁司特缓释片	化学药	HZ004530

HY002522　异芳芥

【其他名称】抗瘤氨酸

【外文名称】Betamerphalan

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（二部）·第5册

药物理化信息

【化学名】对-［双-（β-氯乙基）胺基］-β-苯丙氨酸

【分子式】$C_{13}H_{18}Cl_2N_2O_2$

【分子量】305.20

【性状及组成】本品为白色或类白色的粉末，遇

光色渐变黄。

本品在甲醇或乙醇中极微溶解，在水或丙酮中几乎不溶，在冰醋酸、盐酸或氢氧化碱溶液中溶解。

本品的熔点为 188～192℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】 本品为溶肉瘤素的异构体，但毒性较低，等剂量时，疗效可能高于溶肉瘤素。本品为我国研制的抗肿瘤药物。与氮芥比较，疗效较好而毒性较低。为细胞非特异性药物，但对前期和中期细胞的作用更为明显。

【药代动力学】 口服后吸收较慢，6 小时后血浆中浓度达最高峰。静脉注射后在血中维持时间较长，24 小时排出 53%，主要经尿排出，少量从粪便中排出。

【不良反应】 主要为骨髓抑制，白细胞降低及胃肠道反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
异芳芥片	化学药	HZ004531

HY002523 异氟烷

【外文名称】 Isoflurane

药物管理信息

【依据标准】 国家药品标准新药转正标准·第 49 册

药物理化信息

【化学名】 2－氯－2－（二氟甲氧基）－1，1，1－三氟乙烷

【分子式】 $C_3H_2ClF_5O$

【分子量】 184.49

【性状及组成】 本品为无色的澄明液体；易挥发，具有轻微气味。

本品易溶于普通有机溶剂，不溶于水。

相对密度：1.495～1.498。

馏程：47～49℃。

折光率：1.2990～1.3005。

药物药理信息

【药理毒理】 药品作用类别：吸入全麻药。

本品为恩氟烷的异构体。MAC 为 1.15%，血/气分配系数较小，吸入后药物浓度在血中迅速达到平衡，肺泡内浓度很快上升并接近吸入气浓度，故诱导迅速，苏醒亦快。对中枢神经系统可产生进行性下行性抑制，脑耗氧量减少，脑血流量增多及颅内压上升，但过度通气即可纠正。能抑制神经肌肉接头，肌松良好。对循环系统的抑制作用小于恩氟烷，心脏麻醉指数为 5.7，大于甲氧氟烷（3.7）、恩氟烷（3.3）和氟烷（3.0）。对呼吸系统抑制小于恩氟烷，其严重程度与浓度有关。对呼吸道黏膜几无刺激性，并可扩张收缩的支气管。高浓度时可抑制子宫的张力和收缩，子宫血流量增多。可降低眼内压。不升高血糖。对胃肠道蠕动和张力有抑制作用，但术后恶心、呕吐少见。与肾上腺素合用不增加心肌的敏感性，不产生严重心律失常。对肝肾功能无明显损害。

临床适用于各种手术的麻醉，还可用以行控制性降压。缺点是镇痛作用较差。目前本品和恩氟烷在国内外已逐步成为较常用的吸入全麻药。

【药代动力学】 本品体内生物转化极少，几乎全部以原形从肺呼出。仅 0.17% 受肝微粒体酶催化，最终的代谢物为三氟乙酸和无机氟化物，随尿排出。

【不良反应】

1．本品的不良反应少而轻，但深麻醉仍可抑制循环和呼吸，可发生呼吸抑制，低血压及心律失常，术后可有恶心及呕吐等反应。

2．对呼吸道略有刺激性，诱导期可出现咳嗽、屏气，苏醒期偶见肢体活动和寒战。

3．深麻醉使产科病人术后失血增多。

若与氧化亚氮、静脉麻醉药和肌松药复合，吸入浓度缓慢增加，避免深麻醉，可减少以上不良反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
异氟烷	化学药	HZ004532

HY002524 异甘草酸镁

【外文名称】 Magnesium Isoglycyrrhizinate

药物理化信息

【化学名】 18α，20β－羧基－11－氧代正齐墩果烷－12－烯－3β－基－2－*O*－β－D－葡萄吡喃糖苷醛酸基－α－D－葡萄吡喃糖苷醛酸镁四水合物

【分子式】 $C_{42}H_{60}MgO_{16}\cdot 4H_2O$

【分子量】 917.28

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：异甘草酸镁是一种肝细胞保护剂，具有抗炎、保护肝细胞膜及改善肝功能的作用。药效试验表明，异甘草酸镁对 D－氨基半乳糖引起大鼠急性肝损伤具有防治作用，能阻止动物血清转氨酶升高，减轻肝细胞变性、坏死及炎症细胞浸润；对四氯化碳引起大鼠慢性肝损伤具有治疗效果，改善 CCl_4 引起慢性肝损伤大鼠的肝功能，降低 NO 水

平，减轻肝组织炎症活动度及纤维化程度；对 Gal/FCA 诱发小鼠免疫性肝损害也有保护作用，降低血清转氨酶及血浆 NO 水平，减轻肝组织损害，提高小鼠存活率。

2. 毒理研究

（1）遗传毒性：本品 Ames 细菌回复突变试验、中国仓鼠肺成纤维细胞染色体畸变试验和小鼠微核试验结果均为阴性。

（2）生殖毒性：未见异甘草酸镁对 SD 大鼠具有明显的致畸作用。大鼠一般生殖毒性试验的无毒性反应剂量为 40mg/kg，按体表面积折算，约相当于临床推荐剂量的 3 倍。

SD 雌性大鼠在妊娠末期和授乳期连续给予较大剂量的异甘草酸镁，无毒性反应剂量为 40mg/kg，按体表面积折算，约相当于临床推荐剂量的 3 倍。

【药代动力学】

1. 吸收、分布：

动物试验表明，本品吸收后主要分布在肝，给药 1 小时后肝组织药物浓度与血浆药物浓度几乎相同，其次为肠和肺，睾丸、肾及胃中分布极低，脑、心、脂肪、骨骼肌、脾及卵巢中药物浓度均低于检测限。给药后 3 小时及 7 小时，血浆药物浓度迅速降低，是给药后 1 小时的 12.3% 和 1.9%，而肝组织中异甘草酸镁浓度下降缓慢，分别为给药 1 小时后的 78.8 %和 77.3%，其他各主要组织脏器中异甘草酸镁浓度均极低，基本无法测出。

人体单次静滴本品后表现为一级消除二室模型，药物的分布较为迅速，分布半衰期 $t_{1/2\alpha}$ 为 1.13 ~ 1.72 小时，消除半衰期 $t_{1/2\beta}$ 为 23.10 ~ 24.60 小时。健康志愿者单次静滴本品 0.1g、0.2g 和 0.3g，消除速度常数 β、消除半衰期 $t_{1/2\beta}$、清除率 CL 各组间在统计学上无显著性差异，与给药剂量无关。各剂量组峰浓度 C_{max}、药时曲线下面积 AUC_{0-72}、$AUC_{0-\infty}$ 随给药剂量的增加而加大，而 C_{max}/dose、AUC_{0-72}/dose、$AUC_{0-\infty}$/dose 各剂量组间无显著性差异。其药－时曲线均符合二房室模型。

单剂量（健康志愿者单次静滴本品 0.1g、0.2g 和 0.3g）与多剂量（健康志愿者静滴本品 0.1g，每天 1 次，连续 9 天）静脉滴注给药的药动学参数：峰浓度 C_{max} 分别为 28. 8mg/l、42.8mg/l；表观分布容积 V_d 分别为 3.3L、3.2L；血浆清除率 CL 分别为 0.21 l/h、0.15 l/h；分布半衰期 $t_{1/2\alpha}$ 分别为 1.7 小时、1.6 小时；消除半衰期 $t_{1/2\beta}$ 分别为 23.1 小时、24.0 小时；用非室模型拟和的参数平均驻留时间 MRT_{0-72} 分别为 23.1 小时、23.3 小时，单剂量给药 $AUC_{0-\infty}$ 为 503.2 mg·h/l，多剂量给药 $AUCss_{0-\tau}$ 为 513.0mg·h/l。健康志愿者按本品每天 1 次，每次 0.1g 给药后，给药第 6 天达稳态。稳态时平均血药浓度为 21.4mg/L，波动系数为 1.06。

2. 代谢、消除：大鼠静注异甘草酸镁（60mg/kg）后，主要经胆汁排泄，24 小时内累计排出量占给药量的 90.3 %；经尿及粪便的 72 小时累计排泄量占给药量的 4.9%。经肝－肠循环维持异甘草酸镁在肝组织中较高的有效浓度。

【药物相互作用】与依他尼酸、呋塞米等噻嗪类及三氯甲噻嗪、氯噻酮等降压利尿剂并用时，其利尿作用可增强本品的排钾作用，易导致血清钾值的下降，应注意观察血清钾值的测定等。

【药物过量】目前尚未有这方面的用药数据。临床研究中每日最大用量为 0.2g。

【不良反应】

1. 假性醛固酮症：本品Ⅱ期Ⅲ期临床研究中未出现。据文献报道，甘草酸制剂由于增量或长期使用，可出现低钾血症，增加低钾血症的发病率，存在血压上升，钠、体液潴留、浮肿、体重增加等假性醛固酮症的危险，因此要充分注意观察血清钾值的测定等，发现异常情况，应停止给药。另外，作为低钾血症的结果可能出现乏力感、肌力低下等症状。

2. 其他不良反应：本品Ⅲ期临床研究中出现少数病人有心悸（0.3%）、眼睑水肿（0.3%）、头晕（0.3%）、皮疹（0.27%）、呕吐（0.27%），未出现血压升高和电解质改变。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
异甘草酸镁注射液	化学药	HZ0004537

HY002525　异环磷酰胺

【外文名称】Ifosfamide

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 49 册

药物理化信息

【化学名】3－（2－氯乙基）－2－［（2－氯乙基）氨基］四氢－2H－1,3,2－噁磷－2－氧化物

【分子式】$C_7H_{15}Cl_2N_2O_2P$

【分子量】261.09

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，无味；有较强的引湿性。

本品在水或乙醇中易溶，在三氯甲烷中溶解，在丙酮中略溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品在体外无抗癌活性，进入体内被肝脏或肿瘤内存在的磷酰胺酶或磷酸酶水解，变为活化作用型的磷酰胺氮芥而起作用。其作用机制为与 DNA 发生交叉联结，抑制 DNA 的合成，也可干扰 RNA 的功能，属细胞周期非特异性药物。本品抗瘤谱广，对多种肿瘤有抑制作用。

【药代动力学】按体表面积一次静注 3.8～5.0g/m^2，血药浓度呈双相，终末半衰期为 15 小时；按体表面积一次静注 1.6～2.4g/m^2，血药浓度呈单相，半衰期为 7 小时。可经肝降解，活性代谢产物仅少量通过血脑屏障。经肾脏排出 70%～80%；按体表面积一次静注 5.0g/m^2 时，61%以原形排出；按体表面积一次静注 1.2～2.4g/m^2 时，仅 12%～18%以原形排出。

【药物相互作用】

1. 先前应用顺铂患者，可加重异环磷酰胺的骨髓抑制、神经毒性和肾毒性。

2. 同时使用抗凝血药物，可能导致出血危险。

3. 同时使用降血糖药，可增强降血糖作用。

4. 与其他细胞毒药物联合应用时，应酌情减量。

【不良反应】

1. 骨髓抑制：白细胞减少较血小板减少为常见，最低值在用药后 1～2 周，多在 2～3 周后恢复。对肝功有影响。胃肠道反应：包括食欲减退、恶心及呕吐，一般停药 1～3 天即可消失。

2. 泌尿道反应：可致出血性膀胱炎，表现为排尿困难、尿频和尿痛、可在给药后几小时或几周内出现，通常在停药后几天内消失。

3. 中枢神经系统毒性：与剂量有关，通常表现为焦虑不安、神情慌乱、幻觉和嗜睡、昏睡等。少见晕厥、癫痫样发作甚至昏迷。

4. 少见的有一过性无症状肝肾功能异常；若高剂量用药可因肾毒性产生代谢性酸中毒。罕见心脏和肺毒性。

5. 其他反应尚包括脱发、恶心和呕吐等。注射部位可产生静脉炎。

6. 长期用药可产生免疫抑制、垂体功能低下、不育症和继发性肿瘤。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用异环磷酰胺	化学药	HZ005122

HY002526 异黄樟素

【外文名称】Isosafrole

药物管理信息

【特殊管理分类】易制毒药

药物药理信息

【药理毒理】本品为黄樟素的异构体，主要用于生产洋茉莉醛，较少用于日用香精，禁止用于食用香精。

《易制毒化学品管理条例》（国务院令第 445 号）规定本品为易制毒化学药品。

HY002527 异甲靛

【外文名称】N－methylisoindigotin

药物理化信息

【化学名】*N*－甲基－［$\Delta^{3,3'}$－双－二氢吲哚］－2,2′二酮

【分子式】$C_{17}H_{12}N_2O_2$

【分子量】276.29

药物药理信息

【药理毒理】本品为靛玉红的类似物。实验证明，本药对 L1210、1615 等均有抑制作用，能破坏白血病瘤细胞。其作用原理为抑制 DNA 聚合酶，影响了 DNA 聚合过程，从而使 DNA 合成受抑制。

【药代动力学】给小鼠服本药后，血中浓度逐渐升高，12 小时达到高峰，48 小时后开始下降，各组织器官中以肝、胆、肠的浓度最高，绝大部分以代谢产物随粪便排出。

【不良反应】常见食欲减退、恶心、呕吐，偶见关节痛、肌痛、有时可见骨髓抑制等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
异甲靛片	化学药	HZ004538

HY002528 异卡波肼

【其他名称】Marplan、闷可乐、异噁酰肼、异噁唑酰肼、异唑肼、异唑肼亚胺二联苄

【外文名称】Isocarboxazid

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】5－甲基－3－异噁唑甲酰－2－（苯基甲基）－肼

【分子式】$C_{12}H_{13}N_3O_2$

【分子量】231.25

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，具有微弱的异臭。本品在三氯甲烷中极易溶解，

在乙醇中溶解，在水中微溶。

熔点：本品的熔点为105～108℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为单胺氧化酶抑制剂类抗抑郁药，与脑内单胺氧化酶A和B产生不可逆性结合，影响单胺类神经递质的代谢，单胺氧化酶受抑制后，使中枢神经部位单胺（主要是去甲肾上腺素和5－羟色胺）含量增加，起到抗抑郁作用。

【药代动力学】本品胃肠吸收良好，在肝中氧化代谢。口服后3～5小时血药浓度达峰值，作用时间持续10天，代谢物经肾脏排泄。动物实验显示本品可自乳汁中排出。

【药物相互作用】

1．本品与乙醇或中枢神经抑制药合用，对中枢神经抑制作用增强。

2．本品可增强华法林等抗凝药的作用。

3．本品与三环类抗抑郁药合用，可产生高热与高血压危象，严重者可致死。

4．本品可增强抗胆碱药的效能。

5．本品与含咖啡因药物合用时，可产生严重心律紊乱或高血压危象。

6．本品与间羟胺、甲氧明、美芬丁胺合用，均可显著增强升压效应。

7．本品与左旋多巴合用，可发生急性肾上腺危象。

【药物过量】

1．中毒症状：服药过量后，经过12小时左右潜伏期，迅速出现中枢神经兴奋状态，表现激越、出汗、心动过速、肌强直、反射亢进、谵妄以及高血压和高热等。体温高达40℃以上，舒张压超过16kPa（120mmHg）时，可有剧烈头痛、呕吐、视神经乳头水肿和癫痫发作等高血压脑病征象。少数病人出现低血压，呼吸抑制及出血倾向。

2．处理：及时洗胃，输液并以渗透性利尿剂强迫利尿，尿液酸化（可输入大量维生素C）有利于加速药物的排泄，并依病情给予对症治疗及支持疗法。

【不良反应】体位性低血压、头晕、便秘、畏食、坐立不安、失眠、口干、视物模糊、水肿、月经过多等。长期应用易蓄积中毒。偶见中毒性肝炎、白细胞减少。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
异卡波肼片	化学药	HZ0004539

HY002529　异克舒令

【其他名称】苯氧丙酚胺、DU－VADILAN、VASODILAN、异舒普林

【外文名称】Isoxsuprine

药物药理信息

【药理毒理】本品具有阻断α－受体及激动β－受体的作用，也具有直接舒张血管平滑肌及子宫平滑肌的作用。故可舒张脑血管、骨骼肌血管及皮肤血管，也有正性肌力效应。临床用于治疗脑血管及外周血管痉挛性疾病。也可用于防止早产。

【药代动力学】口服后吸收良好。给药后1小时达血药浓度峰值。$t_{1/2}$为1.5小时。

【不良反应】不良反应有瞬时皮肤潮红及胃肠功能失常。大剂量可致心率加快及低血压。罕见皮疹。

HY002530　异喹胍

【其他名称】Decline、Equitonil、胍喹啶、硫酸咪喹啉、Tendor

【外文名称】Debrisoquine

药物药理信息

【药理毒理】本品有较强而持久的降压作用，其机制是抑制交感神经末梢去甲肾上腺素的释放，并耗竭其贮存。用于中度和重度舒张压高的高血压等。

【药物相互作用】不得与单胺氧化酶抑制药合用。

【不良反应】主要不良反应为直立性低血压，另有乏力、倦怠、呕吐、腹泻、心动过缓、呼吸困难、鼻塞、口干、阳痿、小便失禁、皮炎等。

HY002531　异亮氨酸

【外文名称】Isoleucine

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】L－2－氨基－3－甲基戊酸

【分子式】$C_6H_{13}NO_2$

【分子量】131.17

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末，无臭，味微苦。

本品在水中微溶，在乙醇或乙醚中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加6mol/L盐酸溶液溶解并释稀成每1ml中含40mg的溶液，依法测定，比旋度为+38.9°至+41.8°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：氨基酸类药。

人体必需氨基酸，该品还与其他必需氨基酸共用于氨基酸制备及氨基酸输液。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
11氨基酸注射液－833	化学药	HZ000212
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
低分子右旋糖酐氨基酸注射液	化学药	HZ000673
复方氨基酸胶囊（8－11）	化学药	HZ001047
复方氨基酸颗粒（14AA）	化学药	HZ001049
复方氨基酸口服溶液（14AA）	化学药	HZ001050
复方氨基酸（15）双肽（2）注射液	化学药	HZ001051
复方氨基酸注射液（3AA）	化学药	HZ001052
复方氨基酸注射液（6AA）	化学药	HZ001053
复方氨基酸注射液（9AA）	化学药	HZ001054
复方氨基酸注射液（14AA）	化学药	HZ001055
复方氨基酸注射液（15AA）	化学药	HZ001056
复方氨基酸注射液（15－HBC）	化学药	HZ001057
复方氨基酸注射液（17AA）	化学药	HZ001058
复方氨基酸注射液（17AA－Ⅰ）	化学药	HZ001059
复方氨基酸注射液（17AA－H）	化学药	HZ001060
复方氨基酸注射液（17种氨基酸）	化学药	HZ001061
复方氨基酸注射液（18）	化学药	HZ001062
复方氨基酸注射液（18AA）	化学药	HZ001063
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅰ）	化学药	HZ001064
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅱ）	化学药	HZ001065
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅲ）	化学药	HZ001066
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅳ）	化学药	HZ001067
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅴ）	化学药	HZ001068
复方氨基酸注射液（18AA－N）	化学药	HZ001069
复方氨基酸注射液（18－B）	化学药	HZ001070
复方氨基酸注射液（20AA）	化学药	HZ001071
六合氨基酸颗粒	化学药	HZ002444
小儿复方氨基酸注射液（18AA－Ⅰ）	化学药	HZ003749
小儿复方氨基酸注射液（18AA－Ⅱ）	化学药	HZ003750
小儿复方氨基酸注射液（19AA－Ⅰ）	化学药	HZ003751
脂肪乳氨基酸葡萄糖注射液	化学药	HZ004653

HY002532 异美沙酮

【外文名称】Isomethadone

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY002533 异米尼尔

【其他名称】DIMYRIL、咳得平、PEROGAN、异丙苯戊腈、异米丙苯戊脂

【外文名称】Isoaminile

药物药理信息

【药理毒理】镇咳作用主要是抑制咳嗽中枢，亦与其局麻作用和松弛支气管平滑肌作用有关。对呼吸、血压、肠蠕动极少影响，无成瘾性。用于各种原因引起的咳嗽。

【不良反应】偶有恶心、食欲减退、便秘等胃肠道反应及药疹。

HY002534 异山梨醇

【其他名称】脱水山梨醇

【外文名称】Isosorbide

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第60册

药物理化信息

【化学名】1,4:3,6－二脱水－D－山梨醇

【分子式】$C_6H_{10}O_4$

【分子量】146.14

【性状及组成】本品为白色或类白色针状结晶或粉末，无臭，味微苦；有引湿性。

本品在水中极易溶解，在乙醇中易溶，在三氯甲烷或乙醚中不溶。

熔点：本品的熔点为61～64℃。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每1ml中约含0.10g的溶液，依法测定，比旋度为+45.0°至+46.5°。

药物药理信息

【药理毒理】异山梨醇是D－山梨醇的脱水衍生物，由于脱水后羟基变成了醚键，其脂溶性大大增加，已完全不同于山梨醇，口服后立即吸收，是一

种有效的渗透性口服脱水利尿药。

作用机制类似于静脉注射的甘露醇和山梨醇，为一口服渗透性脱水利尿药。提高血浆渗透压，导致组织内（包括眼、脑、脑脊液等）水分进入血管内，从而减轻组织水肿，降低眼内压、颅内压和脑脊液容量及其压力。LD_{50}对小鼠和大鼠经口给药分别为23.3g/kg和25.8g/kg，腹腔给药分别为17.6g/kg和21.02g/kg。

【药代动力学】本品服给药后，98%的药物由胃肠道吸收，97%的药物在尿中以原形排出，不产生代谢作用，无热值产生，体内分布空间是整体动物和肾切除动物体重的54%，半衰期为8小时。

【药物相互作用】

1．可增加洋地黄毒性作用，与低血钾有关；

2．增加利尿药及碳酸酐抑制剂的利尿和降眼内压作用，与这些药物合并时应调整剂量。

【药物过量】易引起腹泻，并密切随防血压、电解质和肾功能。

【不良反应】主要不良反应有恶心、腹泻、食欲减退，偶有腹痛，长期服用常引起电解质紊乱。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
异山梨醇口服液	化学药	HZ004540

HY002535　异维A酸

【其他名称】13－顺式维A酸

【外文名称】Isotretinoin

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】3,7－二甲基－9－（2,6,6－三甲基－1－环己烯基）2顺－4反－6反－8反－壬四烯酸

【分子式】$C_{20}H_{28}O_2$

【分子量】300.44

【性状及组成】本品为黄色或橙黄色的结晶性粉末。

本品在三氯甲烷或乙醚中溶解，在乙醇或异丙醇中微溶，在水中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理学：本药的作用机制尚未完全清楚。用于治疗痤疮时具有缩小皮脂腺组织，抑制皮脂腺活性，减少皮脂分泌，减轻上皮细胞角化及毛囊皮脂腺口的角质栓塞，并抑制痤疮丙酸杆菌数的生长繁殖。近来研究还表明本药可调控与痤疮发病机制有关的炎症免疫介质以及选择性地结合维A酸核受体而发挥治疗作用。

2．毒理学：试验表明有严重致畸作用。

【药代动力学】本品口服后迅速由胃肠道吸收，2～4小时后达血浓度高峰，半衰期为10～20小时，主要在肝脏或肠壁代谢，以原形及代谢产物进入肝肠循环，口服生物利用度低，餐后服药可增加生物利用度，吸收后的血浆结合率高，未经改变的原形药从大便排出，代谢产物经尿排出。

【药物相互作用】

1．异维A酸与四环素类抗生素合用，可导致假“脑瘤”产生而引起良性脑压升高，临床表现为伴有头痛的高血压、眩晕和视觉障碍。

2．异维A酸与维生素A同时使用，可产生与维生素A超剂量时相似的症状。

3．异维A酸与卡马西平同时应用，可导致卡马西平的血药浓度下降，与华法林同时使用，可增强华法林的治疗效果，和甲氨蝶呤（MTX）同时使用，可因MTX的血药浓度增加而增加对肝脏的损害。

【不良反应】

1．本药的不良反应与维生素A过量的临床表现相似，常见的不良反应包括口唇及皮肤干燥、唇炎、脱屑、瘙痒、疼痛、皮疹、皮肤脆性增加、掌跖脱皮、瘀斑，还可出现继发感染等。

2．结膜炎、严重者角膜混浊、视力障碍、视乳头水肿，头痛、头晕、精神症状、抑郁、良性脑压增高。

3．毛发疏松，指甲变软。

4．骨质疏松、肌肉无力、疼痛、胃肠道症状、鼻衄等。

5．妊娠服药可导致自发性流产及胎儿发育畸形。

6．实验室检查可引起血沉快、肝酶升高、血脂升高、血糖升高、血小板下降等。

上述不良反应大多为可逆性，停药后可逐渐得到恢复。不良反应的轻重与本药的剂量大小、疗程长短及个体耐受性有关。

轻度不良反应可不必停药，或减量使用，重度不良反应应立即停药，并去医院由医师作相应处理。上述不良反应大多为可逆性，停药后可逐渐得到恢复。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
异维A酸胶丸	化学药	HZ004541
异维A酸凝胶	化学药	HZ004542

HY002536 异戊巴比妥

【外文名称】Amobarbital

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】5 - 乙基 - 5 - （3 - 甲基丁基） - 2,4,6,（1*H*,3*H*,5*H*） - 嘧啶三酮

【分子式】$C_{11}H_{18}N_2O_3$

【分子量】226.28

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，味苦。

本品在乙醇或乙醚中易溶，在三氯甲烷中溶解，在水中极微溶解；在氢氧化钠或碳酸钠溶液中溶解。

熔点：本品的熔点为 155 ~ 158.5 ℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为巴比妥类催眠药、抗惊厥药。中等作用时间（3 ~ 6 小时），对中枢的抑制作用随着剂量加大，表现为镇静、催眠、抗惊厥及抗癫痫。大剂量对心血管系统、呼吸系统有明显的抑制。过量可麻痹延髓呼吸中枢致死。体外电生理实验本类药物使神经细胞的氯离子通道开放，细胞过极化，拟似 γ - 氨基丁酸（GABA）的作用。治疗浓度的异戊巴比妥可降低谷氨酸的兴奋作用、加强 γ - 氨基丁酸的抑制作用，抑制中枢神经系统单突触和多突触传递，抑制痫灶的高频放电及其向周围扩散。可减少胃液分泌，降低胃张力。可产生依赖性，包括精神依赖和身体依赖。

【药代动力学】口服后在消化道吸收迅速，15 ~ 30 分钟生效，约维持 3 ~ 6 小时。吸收后分布于体内各组织及体液中，因本品脂溶性高，易通过血脑屏障，进入脑组织，起效比较快。本品血浆蛋白结合率约为 61%。$t_{1/2}$约为 14 ~ 40 小时，血药浓度达峰时间，个体差异大。本品在肝脏代谢，约 50% 转化为羟基异戊巴比妥，主要与葡萄糖醛酸结合后经肾脏排出，极少量（< 1%）以原形从肾脏排出。

【药物相互作用】

1. 本品为肝酶诱导剂，提高药酶活性，不但加速自身代谢，还可加速其他药物代谢。如饮酒、全麻药、中枢性抑制药或单胺氧化酶抑制药等与巴比妥类药合用时，可相互增强效能。与乙酰氨基酚类合用，会增加肝中毒的危险性。

2. 与口服抗凝药合用时，可降低后者的疗效，应定期测定凝血酶原时间，从而决定是否调整抗凝药的用量。

3. 与口服避孕药，可降低避孕药的可靠性。与雌激素合用降低雌激素作用。

4. 与皮质激素、洋地黄类（包括地高辛）、土霉素或三环抗抑郁药合用时，可降低这些药物的效应。

5. 与环磷酰胺合用，理论上可增加环磷酰胺烷基化代谢产物，但临床上的意义尚未明确。

6. 与奎尼丁合用时，由于增加奎尼丁的代谢而减弱其作用，应按需调整后者的用量。

7. 与钙离子拮抗剂合用，可引起血压下降。

8. 与氟哌丁醇合用治疗癫痫，可引起癫痫发作形式改变，需调整用量。

9. 与吩噻嗪类和四环类抗抑郁药合用时可降低抽搐阈值，增加抑制作用；与布洛芬类合用，可减少或缩短半衰期而减少作用强度。

【药物过量】15 ~ 20 倍的过量药物可能引起昏迷、严重的呼吸和心血管抑制、低血压和休克继而引发肾功能衰竭、死亡。深度呼吸抑制是急性中毒的直接死亡原因。可致严重中毒，中毒致死的血药浓度为 6 ~ 8mg/100ml。解救措施中最重要的是维持呼吸和循环功能，施行有效的人工呼吸，必要时行气管切开，并辅之以有助于维持和改善呼吸和循环的相应药物。经口服中毒者，在 3 ~ 5 小时内可用高锰酸钾（1:2000）溶液洗胃。用 10 ~ 15g 硫酸钠溶液导泄（禁用硫酸镁）。为加速排泄可给甘露醇等渗透压利尿药，如肾功能正常可用速尿。可用碳酸氢钠、乳酸钠碱化尿液加速排泄，严重者可透析。极度过量时，大脑一切电活动消失，脑电图变为一条平线，并不一定代表为临床死亡，若不并发缺氧性损害，尚有挽救的希望。

【不良反应】

1. 用于抗癫痫时最常见的不良反应为镇静，但随着疗程的持续，其镇静作用逐渐变得不明显。

2. 可能引起微妙的情感变化，出现认知和记忆的缺损。

3. 长期用药，偶见叶酸缺乏和低钙血症。

4. 罕见巨幼红细胞性贫血和骨软化。

5. 大剂量时可产生眼球震颤、共济失调和严重的呼吸抑制。

6. 用本品的患者中约 1% ~ 3% 的人出现皮肤反应，多见者为各种皮疹以及哮喘，严重者可出现剥脱性皮炎和多形红斑（或 Stevens - Johnson 综合征），中毒性表皮坏死极为罕见。

7. 有报道用药者出现肝炎和肝功能紊乱。

8. 长时间使用可发生药物依赖，停药后易发生停药综合征。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
异戊巴比妥片	化学药	HZ004543
新复方大青叶片	中成药	ZC006475

HY002537　异戊巴比妥钠

【外文名称】 Amobarbital Sodium

药物管理信息

【特殊管理分类】 二类精神药

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 5－乙基－5－（3－甲基丁基）－2,4,6－（1*H*,3*H*,5*H*）－嘧啶三酮一钠盐

【分子式】 $C_{11}H_{17}N_2NaO_3$

【分子量】 248.26

【性状及组成】 本品为白色的颗粒或粉末，无臭，味苦；有引湿性；水溶液显碱性反应。本品在水中极易溶解，在乙醇中溶解，在三氯甲烷或乙醚中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】 本品为催眠药、抗惊厥药。中等作用时间（3～6 小时），对中枢的抑制作用随着剂量加大，表现为镇静、催眠、抗惊厥及抗癫痫。大剂量对心血管系统、呼吸系统有明显的抑制。过量可麻痹延髓呼吸中枢致死。体外电生理实验表明：本类药物使神经细胞的氯离子通道开放，细胞过极化，拟似 γ－氨基丁酸（GABA）的作用。治疗浓度的异戊巴比妥可降低谷氨酸的兴奋作用、加强 γ－氨基丁酸的抑制作用，抑制中枢神经系统单突触和多突触传递，抑制病灶的高频放电及其向周围扩散。可减少胃液分泌，降低胃张力。可产生依赖性，包括精神依赖和身体依赖。

【药代动力学】 注射后迅速分布于体内各组织及体液中，因本品脂溶性高，易通过血脑屏障，进入脑组织，起效比较快。本品血浆蛋白结合率约为 61%。$t_{1/2}$约为 14～40 小时。本品在肝脏代谢，约 50%转化为羟基异戊巴比妥，主要与葡萄糖醛酸结合后经肾脏排出，极少量（＜1%）以原形从肾脏排出。

【药物相互作用】

1．本品为肝酶诱导剂，提高药酶活性，不但加速自身代谢，还可加速其他药物代谢。如饮酒、全麻药、中枢性抑制药或单胺氧化酶抑制药等与巴比妥类药合用时，可相互增强效能。与乙酰氨基酚类合用，会增加肝中毒的危险性。

2．与口服抗凝药合用时，可降低后者的疗效，应定期测定凝血酶原时间，从而决定是否调整抗凝药的用量。

3．与口服避孕药，可降低避孕药的可靠性。与雌激素合用降低雌激素作用。

4．与皮质激素、洋地黄类（包括地高辛）、土霉素或三环抗抑郁药合用时，可降低这些药物的效应。

5．与环磷酰胺合用，理论上可增加环磷酰胺烷基化代谢产物，但临床上的意义尚未明确。

6．与奎尼丁合用时，由于增加奎尼丁的代谢而减弱其作用，应按需调整后者的用量。

7．与钙离子拮抗剂合用，可引起血压下降。

8．与氟哌丁醇合用治疗癫痫，可引起癫痫发作形式改变，需调整用量。

9．与吩噻嗪类和四环类抗抑郁药合用时可降低抽搐阈值，增加抑制作用；与布洛芬类合用，可减少或缩短半衰期而减少作用强度。

【药物过量】 15～20 倍的过量药物可能引起昏迷、严重的呼吸和心血管抑制、低血压和休克继而引发肾功能衰竭、死亡。深度呼吸抑制是急性中毒的直接死亡原因。可致严重中毒，中毒致死的血药浓度为 6～8mg/100ml。解救措施中最重要的是维持呼吸和循环功能，施行有效的人工呼吸，必要时行气管切开，并辅之以有助于维持和改善呼吸和循环的相应药物。为加速排泄可给甘露醇等渗透压利尿药，如肾功能正常可用速尿。可用碳酸氢钠、乳酸钠碱化尿液加速排泄，严重者可透析。极度过量时，大脑一切电活动消失，脑电图变为一条平线，并不一定代表为临床死亡，若不并发缺氧性损害，尚有挽救的希望。

【不良反应】

1．用于抗癫痫时最常见的不良反应为镇静，但随着疗程的持续，其镇静作用逐渐变得不明显。

2．可能引起微妙的情感变化，出现认知和记忆的缺损。

3．长期用药，偶见叶酸缺乏和低钙血症。

4．罕见巨幼红细胞性贫血和骨软化。

5．大剂量时可产生眼球震颤、共济失调和严重的呼吸抑制。

6．用本品的患者中约 1%～3%的人出现皮肤反应，多见者为各种皮疹以及哮喘，严重者可出现剥脱性皮炎和多形性红斑（或 Stevens－Johnson 综合征），中毒性表皮坏死极为罕见。

7．有报道用药者出现肝炎和肝功能紊乱。

8．长时间使用可发生药物依赖，停药后易发生停药综合征。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用异戊巴比妥钠	化学药	HZ005123

HY002538 异烟肼

【其他名称】 INAH、INH、Isolyn、IsonicotinicAcid Hydrazide、雷米封（Rimifon）、Tubazid、异烟酰肼

【外文名称】 Isoniazid

药物管理信息

【依据标准】 中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】 4－吡啶甲酰肼

【分子式】 $C_6H_7N_3O$

【分子量】 137.14

【性状及组成】 本品为无色结晶，或白色至类白色的结晶性粉末，无臭，味微甜后苦；遇光渐变质。本品在水中易溶，在乙醇中微溶，在乙醚中极微溶解。

熔点：本品的熔点为 170～173℃。

药物药理信息

【药理毒理】 本品为抗结核药。异烟肼对各型结核分枝杆菌都有高度选择性抗菌作用，是目前抗结核药物中具有最强杀菌作用的合成抗菌药，对其他细菌几乎无作用。对生长繁殖期结核分枝杆菌作用强，对静止期作用较弱且慢。其作用机制可能是抑制敏感细菌分枝菌酸的合成而使细胞壁破裂。

【药代动力学】 本品口服后迅速自胃肠道吸收。可广泛分布于全身组织和体液中，并可穿过胎盘屏障。正常脑脊液中浓度可达血药浓度的 20%，脑膜有炎症时，脑脊液浓度几乎与血药浓度相等。本品能透入结核空洞和干酪样物质中。本品可快速进入胎儿循环，乳汁中的浓度几与血药浓度相等。在肝脏及皮肤中浓度也高，也易进入胸水、腹水、唾液、胆汁中。蛋白结合率为 0～10%。

本品主要在肝脏中乙酰化而成无活性代谢产物，其中部分具肝毒性。70%的给药量在 24 小时内经肾脏排泄，大部分为无活性代谢产物。快乙酰化者 93%以乙酰化型从尿中排出，慢乙酰化者为 63%。也可从乳汁、唾液、痰液和粪便中排出。相当量的本品可经血液透析和腹膜透析清除。

【药物相互作用】

1．服用异烟肼时每日饮酒，易引起本品诱发的肝脏毒性反应，并加速异烟肼的代谢，因此需调整异烟肼的剂量，并密切观察肝毒性征象。应劝告患者服药期间避免酒精饮料。

2．含铝制酸药可延缓并减少异烟肼口服后的吸收，使血药浓度减低，故应避免两者同时服用，或在口服制酸剂前至少 1 小时服用异烟肼。

3．抗凝血药（如香豆素或茚满双酮衍生物）与异烟肼同时应用时，由于抑制了抗凝药的酶代谢，使抗凝作用增强。

4．与环丝氨酸同服时可增加中枢神经系统不良反应（如头昏或嗜睡），需调整剂量，并密切观察中枢神经系统毒性征象，尤其对于从事需要灵敏度较高的工作的患者。

5．利福平与异烟肼合用时可增加肝毒性的危险性，尤其是已有肝功能损害者或为异烟肼快乙酰化者，因此在疗程的头 3 个月应密切随访有无肝毒性征象出现。

6．异烟肼为维生素 B_6 的拮抗剂，可增加维生素 B_6 经肾排出量，因而可能导致周围神经炎，因此使用异烟肼时维生素 B_6 的需要量增加。

7．与肾上腺皮质激素（尤其泼尼松龙）合用时，可增加异烟肼在肝内的代谢及排泄，导致后者血药浓度减低而影响疗效，在快乙酰化者更为显著，应适当调整剂量。

8．与阿芬太尼合用时，由于异烟肼为肝药酶抑制剂，可延长阿芬太尼的作用；与双硫仑合用可增强其中枢神经系统作用，产生眩晕、动作不协调、易激惹、失眠等；与安氟醚合用可增加具有肾毒性的无机氟代谢物的形成。

9．与乙硫异烟胺或其他抗结核药合用，可加重后二者的不良反应。与其他肝毒性药合用可增加本品的肝毒性，因此宜尽量避免。

10．异烟肼不宜与酮康唑或咪康唑合用，因可使后两者的血药浓度降低。

11．与苯妥英钠或氨茶碱合用时可抑制二者在肝脏中的代谢，而导致苯妥英钠或氨茶碱血药浓度增高，故异烟肼与两者先后应用或合用时，苯妥英钠或氨茶碱的剂量应适当调整。

12．与对乙酰氨基酚合用时，由于异烟肼可诱异肝细胞色素 P450，使前者形成毒性代谢物的量增加，可增加肝毒性及肾毒性。

13．与卡马西平同时应用时，异烟肼可抑制其代谢，使卡马西平的血药浓度增高，而引起毒性反应；卡马西平可诱导异烟肼的微粒体代谢，形成具有肝毒性的中间代谢物增加。

14．本品不宜与其他神经毒药物合用，以免增加神经毒性。

【药物过量】

1．药物过量的表现：除上述不良反应外，主要表现为抽搐、神志不清、昏迷等，处理不及时还可发生急性肝坏死。

2．药物过量的处理方法：①停药。②保持呼吸道通畅。③采用短效巴比妥制剂和维生素 B_6 静脉内给药。维生素 B_6 剂量为每 1mg 异烟肼用 1mg 维生素 B_6，如服用异烟肼的剂量不明，可给予维生素 B_6 5g，每 30 分钟 1 次，直至抽搐停止，患者恢复清醒。继以洗胃，洗胃应在服用本品后的 2～3 小时内进行。④立即抽血测定血气、电解质、尿素氮、血糖等。⑤立即静脉给予碳酸氢钠，纠正代谢性酸中毒，需要时重复给予。⑥采用渗透性利尿药，并在临床症状已改善后继续应用，促进异烟肼排泄，预防中毒症状复发。⑦严重中毒患者应及早配血，做好血液透析的准备，不能进行血液透析时，可进行腹膜透析，同时合用利尿剂。⑧采取有效措施，防止出现缺氧、低血压及吸入性肺炎。

【不良反应】常用剂量不良反应的发生率较低。剂量加大至 6mg/kg 时，不良反应发生率显著增加，主要为周围神经炎及肝脏毒性，加用维生素 B_6 虽可减少毒性反应，但也可影响疗效。

1．肝脏毒性：本品可引起轻度一过性肝损害如血清氨基转移酶升高及黄疸等，发生率约为 10%～20%。肝脏毒性与本品的代谢产物乙酰肼有关，快乙酰化者乙酰肼在肝脏积聚增多，故易引起肝损害。服药期间饮酒可使肝损害增加。毒性反应表现为食欲不佳、异常乏力或软弱、恶心或呕吐（肝毒性的前驱症状）及深色尿、眼或皮肤黄染（肝毒性）。

2．神经系统毒性：周围神经炎多见于慢乙酰化者，并与剂量有明显关系。较多患者表现为步态不稳、麻木针刺感、烧灼感或手脚疼痛。此种反应在铅中毒、动脉硬化、甲亢、糖尿病、酒精中毒、营养不良及孕妇等较易发生。其他毒性反应如兴奋、欣快感、失眠、丧失自主力、中毒性脑病或中毒性精神病则均属少见，视神经炎及萎缩等严重毒性反应偶有报道。

3．变态反应 包括发热、多形性皮疹、淋巴结病、脉管炎等。一旦发生，应立即停药，如需再用，应从小剂量开始，逐渐增加剂量。

4．血液系统可有粒细胞减少、嗜酸粒细胞增多、血小板减少、高铁血红蛋白血症等。

5．其他：如口干、维生素 B_6 缺乏症、高血糖症、代谢性酸中毒、内分泌功能障碍等偶有报道。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
乙胺吡嗪利福异烟片Ⅱ	化学药	HZ004492
异福胶囊	化学药	HZ004533
异福片	化学药	HZ004534

续表

制剂名称	类别	序号
异福酰胺胶囊	化学药	HZ004535
异福酰胺片	化学药	HZ004536
异烟肼片	化学药	HZ004544
异烟肼注射液	化学药	HZ004545
注射用异烟肼	化学药	HZ005124

HY002539　异烟腙

【其他名称】Isoniazon、Phthivazide、Vanizide

【外文名称】Ftivazide

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】*N*－（3－甲氧基－4－羟基苯亚甲基）－*N'*－异烟酰肼一水合物

【分子式】$C_{14}H_{13}N_3O_3 \cdot H_2O$

【分子量】289.29

【性状及组成】本品为淡黄色结晶性粉末。本品在乙醇中微溶，在水中不溶。

熔点：本品的溶点为 227～231℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为异烟肼衍生物，其作用机制与异烟肼相似，但抗菌作用稍差（最低抑菌浓度为 0.13mg/L）。

【药代动力学】口服后吸收慢，血药浓度低，结核杆菌对本品和异烟肼有交叉耐药性。

【不良反应】本品毒性比异烟肼小，不良反应与异烟肼相似，但较少见。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
异烟腙片	化学药	HZ004546

HY002540　抑肽酶

【其他名称】吉瑞（Gordox）

【外文名称】Aprotinin

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

【分子式】$C_{284}H_{432}N_{84}O_{79}S_7$

【分子量】6511.47

【性状及组成】本品系自牛胰或肺中提取、纯化制得的肽酶抑制剂。按干燥品计算，每 1mg 的效价

不得少于3.0单位。

本品为白色或微黄色粉末。本品在水或生理盐水中易溶，在乙醇、丙酮或乙醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品属天然多肽类纤溶抑制剂。适用于创伤及手术后局部或全身纤溶亢进出血；DIC引起的继发性纤溶亢进症；胎死宫内继发DIC时子宫收缩无力症；手术后伴尿路出血；减少心脏外科手术后渗血；休克型胰腺炎时可与生长抑素合用。

【药代动力学】静脉注射和静脉滴注，半衰期约10小时，经代谢后以无活性代谢产物形式由尿排出。

【药物相互作用】

1．本品可抑制血管紧张素转换酶抑制剂（如卡托普利）的降压作用（曾有报道，但尚无结论性意见）。

2．本品有拮抗纤维蛋白溶酶（如阿替普酶、阿尼普酶、链激酶、尿激酶等）的作用，可用于抑制这些药品所引起的出血。

3．本品可干扰下列检验：凝血时间、血清肌酐激酶、血清肌酐、氨基转移酶等的检验值。

【不良反应】偶有恶心、呕吐、腹泻等，极少数病人有血清肌酐一过性增高及过敏反应和类过敏反应发生。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
抑肽酶氯化钠注射液	化学药	HZ004547
注射用抑肽酶	化学药	HZ005125

HY002541 益多酯

【其他名称】羟乙茶碱安妥明

【外文名称】Etofylline Clofibrate

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（二部）·第2册

药物理化信息

【化学名】2－甲基－2－（4－氯苯氧基）－丙酸，2－（1,2,3,6－四氢－1,3－二甲基－2,6－二氧代－7H－嘌呤基）乙酯

【分子式】$C_{19}H_{21}ClN_4O_5$

【分子量】420.85

【性状及组成】本品为白色结晶性或无定形粉末，无臭。

本品在三氯甲烷中易溶，在丙酮中略溶，在乙醇微溶，在水中不溶。

熔点：本品的熔点为133～136 ℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品属氯贝丁酸衍生物类血脂调节药，其降血脂作用机制尚未完全明了，可能通过降低肝微粒体中的cAMP含量，提高脂蛋白酯酶活性，使脂蛋白中脂质分解。实验与临床研究证明本品降低血胆固醇及甘油三酯，增加血高密度脂蛋白。此外，本品尚有抗血小板聚集和抗血栓作用及降低血尿酸作用。

【药代动力学】本品口服吸收良好，服后1小时左右起效，2.5小时左右血药浓度达峰值。生物利用度为94%。半衰期为5.5～6.9小时。

【药物相互作用】

1．氯贝丁酸衍生物与HMG－CoA还原酶抑制剂，如普伐他汀、辛伐他汀等合用治疗高血脂，将增加两者严重肌肉毒性发生的危险，应尽量避免联合使用。

2．本品与其他高蛋白结合率的药物合用时，也可将它们从蛋白结合位点上替换下来，导致其作用加强，如甲苯磺丁脲及其他磺酰脲类降糖药、苯妥英钠、呋塞米等，在降血脂治疗期间服用上述药物，则应调整降糖药及其他药的剂量。

3．本品可增强口服抗凝药的作用，与其同用时应注意降低口服抗凝药的剂量。其作用机制尚不确定，可能是因为本品能将华法林等从其蛋白结合位点上替换出来，从而使其作用加强。

4．本品与免疫抑制剂，如环孢素合用时，可增加后者的血药浓度和肾毒性。本品与其他有肾毒性的药物合用时也应注意。

5．本品含茶碱，与茶碱同用时应注意反应。

【药物过量】当发生药物过量时，应采取系统性支持疗法。

【不良反应】

1．最常见的不良反应为胃肠道不适，如消化不良、恶心、饱胀感、胃部不适等，其他较少见的不良反应还有头痛、头晕、乏力、皮疹、瘙痒、阳痿，贫血及白细胞减少等。个别病例有血氨基转移酶升高。

2．本品属氯贝丁酸衍生物，有可能引起肌炎、肌病和横纹肌溶解综合征，导致血肌酸磷酸激酶升高；发生横纹肌溶解，主要表现为肌痛合并血肌酸磷酸激酶升高、肌红蛋白尿、并可导致肾衰，但较罕见；在患有肾病综合征及其他肾损害而导致血白蛋白减少的患者或甲状腺功能亢进的患者，发生肌病的危险性增加。

3．本品有增加患胆结石症的危险；氯贝丁酸衍生物类可从3方面影响类固醇的代谢，它们可抑制胆固醇的合成，抑制胆汁酸的合成，加强胆固醇从

胆汁中的排泌，后两个因素可使胆汁中的胆固醇饱和度增加，因此可能导致某些患者形成胆结石，但同时还可能存在其他影响因素。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
益多酯胶囊	化学药	HZ004548
益多酯片	化学药	HZ004549

HY002542　因卡膦酸二钠

【外文名称】Incadronate Disodium

药物理化信息

【化学名】环庚胺基甲撑二膦酸二钠一水合物

【分子式】$C_8H_{17}NNa_2O_6P_2 \cdot H_2O$

【分子量】349.17

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：本品为双膦酸盐类药物。国外临床研究结果显示，本品静脉滴注可以治疗恶性肿瘤引起的高钙血症。本品在小鼠颅骨培养试验中抑制骨吸收，抑制移植肿瘤大鼠尿液中脱氧吡啶磷酸盐浓度的升高。在大鼠和小鼠试验性高钙血症试验中，本品能够降低血中游离钙离子的浓度。

2．生殖毒性：可能由于低血钙症，静脉使用本品的围产期大鼠在妊娠末期出现死亡。此外，大鼠可通过乳汁排泄本品。

【药代动力学】文献报道，健康成人静脉滴注给药2小时，$t_{1/2\alpha}$和$t_{1/2\beta}$分别为0.26～0.40小时和1.58～1.98小时，药代动力学呈线性，给药后24小时有55%～70%原形药物通过尿液排泄；肿瘤病人滴注2小时，至24小时有10.5%的药物以原形从尿中排出，未排出的药物大部分进入骨组织。动物试验表明：给药后迅速从循环系统清除，主要分布在骨骼、肝脏、肾脏和脾脏中，本品可长期滞留于骨组织中，半衰期长达351天。

【药物相互作用】本品与降钙类制剂合用时如出现血钙降低，表现出低血钙症状时，应给予滴注钙剂。

【药物过量】当用药量超过推荐剂量时，应严密监测。

【不良反应】最常见的不良反应为发热。其他不良反应包括。

1．血压降低：血压降低只是偶然发生，如观察到异常情况，应作处理。

2．意识障碍：意识障碍很少发生，如观察到异常情况，应作处理。

3．急性肾功能不全：二膦酸盐的使用中这种报道极少，如出现这种情况，应适当处理。

4．低血钙：低血钙伴有手足抽搐，双手麻木等临床症状，在二膦酸盐的使用中这些报导极少，如出现这种情况，应注射钙剂等处理。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用因卡膦酸二钠	化学药	HZ005126

HY002543　吲达帕胺

【其他名称】楼奏力（Lozol）、钠催离（Natrix）、吲帕脉

【外文名称】Indapamide

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】*N*－（2－甲基－2，3－二氢－1*H*－吲哚基）－3－氨磺酰基－4－氯－苯甲酰胺

【分子式】$C_{16}H_{16}ClN_3O_3S$

【分子量】365.83

【性状及组成】本品为类白色针状结晶或结晶性粉末，无臭，无味。本品在丙酮、冰醋酸中易溶，在乙醇或醋酸乙酯中溶解，在三氯甲烷或乙醚中微溶；在水或稀盐酸中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为162～167℃（以形成弯月面时的温度作为全熔温度）。

药物药理信息

【药理毒理】本品是一种磺胺类利尿剂，通过抑制远端肾小管皮质稀释段的再吸收水与电解质而发挥作用。降压作用未明，其利尿作用不能解释降压作用，因降压作用出现的剂量远小于利尿作用的剂量，可能的机制包括以下几个方面：调节血管平滑肌细胞的钙内流；刺激前列腺素PGE_2和前列腺素PGI_2的合成；减低血管对血管加压胺的超敏感性，从而抑制血管收缩。本品降压时对心排血量、心率及心律影响小或无。长期用本品很少影响肾小球滤过率或肾血流量。本药不影响血脂及碳水化合物的代谢。

【药代动力学】本品口服吸收快而完全，生物利用度达93%，不受食物影响。血浆结合率为71%～79%，也与血管平滑肌的弹性蛋白结合。口服后1～2小时血药浓度达高峰。口服单剂后约24小时达高峰降压作用；多次给药约8～12周达高峰作用，作用维持8周。半衰期为14～18小时。在肝内代谢，产生19种代谢产物。约70%经肾排泄，其中7%为

原形，23%经胃肠道排出。肾功能衰竭者的药代动力学参数没有改变。

【药物相互作用】

（1）本品与肾上腺皮质激素同用时利尿利钠作用减弱。

（2）本品与胺碘酮同用时由于血钾低而易致心律失常。

（3）本品与口服抗凝药同用时抗凝效应减弱。

（4）本品与非甾体抗炎镇痛药同用时本品的利钠作用减弱。

（5）本品与多巴胺同用时利尿作用增强。

（6）本品与其他种类降压药同用时降压作用增强。

（7）本品与拟交感药同用时降压作用减弱。

（8）本品与锂剂合用时可增加血锂浓度并出现过量的征象。

（9）与大剂量水杨酸盐合用时，已脱水的患者可能发生急性肾功能衰竭。

（10）与二甲双胍合用易出现乳酸酸中毒。

【药物过量】剂量达 40mg 即为治疗量的 16 倍时未发现任何毒性作用。急性中毒的首要症状是水和电解质紊乱（低血压和低血钾症），临床上可能出现的症状包括恶心、呕吐、低血压、痉挛、易瞌睡、意识不清症状、多尿或少尿甚至无尿（低血容量所致）。采取的措施首先是快速消除所摄入的药物，可采用洗胃和（或）服用活性炭的方法，然后在专科中心纠正水和电解质紊乱直至正常。

【不良反应】比较轻而短暂，呈剂量相关。

1. 较少见的有：腹泻、头痛、食欲减低、失眠、反胃、直立性低血压。

2. 少见的有：皮疹、瘙痒等过敏反应；低血钠、低血钾、低氯性碱中毒。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
培哚普利吲达帕胺片	化学药	HZ002846
吲达帕胺片	化学药	HZ004555
吲达帕胺滴丸	化学药	HZ004556
吲达帕胺缓释胶囊	化学药	HZ004557
吲达帕胺缓释片	化学药	HZ004558
吲达帕胺胶囊	化学药	HZ004559

HY002544 吲哚布芬

【外文名称】Indobufen

药物药理信息

【药理毒理】本品可抑制引起血小板激活的一些因子（如 ADP、5－HT、血小板因子 4、β－小板球蛋白等）的释放以及影响花生四烯酸代谢而抗血小板聚集，但不影响 PGI_2 的血浓度。对血液凝固的各种参数无影响，但能中等程度地延长出血时间，停药后即可恢复。用于动脉硬化所致的缺血性心、脑血管和周围血管疾病、静脉血栓形成、血酯代谢障碍等；也可用于体外循环手术时防止血栓形成。

【药代动力学】口服后吸收迅速，血浆浓度达峰时间 2 小时；$t_{1/2}$为 8 小时；与血浆蛋白结合率为 99%。

【不良反应】偶有上腹不适、腹胀、胃肠道出血和鼻衄。有时出现过敏反应（荨麻疹）。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
吲哚布芬片	化学药	HZ004560

HY002545 吲哚菁绿

【外文名称】Indocyanine Green

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】2－［7－［1，1－二甲基－3－（4－磺丁基）－2*H*－苯并［*e*］二氢吲哚－2－亚基］1，3，5－庚三烯］－1，1－二甲基－3－（4－磺丁基）－1*H*－苯丙［*e*］二氢吲哚内鎓钠盐

【分子式】$C_{43}H_{47}N_2NaO_6S_2$

【分子量】774.96

【性状及组成】本品为暗绿青色或暗棕红色粉末，无臭；遇光与热易变质。

本品在水或甲醇中溶解，在丙酮中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为诊断用药。由于吲哚菁绿（ICG）静脉注入体内后，迅速和蛋白质结合，色素不沉着于皮肤，也不被其他组织吸收，其最大吸收峰由水溶液的 780nm 转变成 805nm，所以测血中 ICG 浓度不受黄疸及溶血标本影响。是用来检查肝脏功能和肝有效血流量的染料药。

【药代动力学】静脉注入体内后，立刻和血浆蛋白结合，随血循环迅速分布于全身血管内，高效率、选择地被肝细胞摄取，又从肝细胞以游离形式排泄到胆汁中，经胆道入肠，随粪便排出体外。由于排泄快，一般正常人静注 20 分钟后约有 97%从血中排除、不参与体内化学反应、无肠肝循环（进入肠管的 ICG 不再吸收入血）、无淋巴逆流、不从肾等其他

肝外脏器排泄。静注后2～3分钟瞬即形成均一单元达到动态平衡，约20分钟血中浓度被肝细胞以一级速率消失，即成指数函数下降。当肝脏病变，肝有效血流量和肝细胞总数降低时，血浆ICG消除率 K 值明显降低；血中ICG滞留率 R 值明显升高。

【不良反应】本制剂不完全溶解时，可能发生恶心、发烧、休克等反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用吲哚菁绿	化学药	HZ005127

HY002546　吲哚拉明

【外文名称】Indoramin

药物药理信息

【药理毒理】本品为α－肾上腺素受体阻断剂。能选择性地竞争周围血管突触后的α－受体，使周围血管平滑肌松弛，使血压下降。此外，本品还有局部麻醉作用，使心肌膜稳定性增加，故不产生类似其他受体阻断剂的代偿反射性心率加快现象。

口服可使血管舒张和血压降低，可单独或与利尿药合用治疗轻、中度高血压，也可治疗偏头痛。

【药代动力学】口服易吸收，1～2小时后血药浓度达峰值。与血浆蛋白结合率92%。有明显首过效应。

【药物相互作用】本品不能与单胺氧化酶抑制剂合用，与其他降压药合用时宜减量。

【不良反应】常见的不良反应有口干、鼻塞、眩晕、抑郁、射精困难和皮疹。减量时，可自行消失。

HY002547　吲哚洛尔

【其他名称】Calvisken、Decreten、Pvinodolol、VISKEN、维思康（Visken）、心得静、吲哚心安

【外文名称】Pindolol

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】3－［（1－甲基乙醇）氨基］－1－（1*H*－吲哚－4－氧基）－2－丙醇

【分子式】$C_{14}H_{20}N_2O_2$

【分子量】248.32

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶性粉末，略有异臭。本品有冰醋酸中易溶，在甲醇或乙醇中微溶，在水或苯中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为167～171℃。

药物药理信息

【药理毒理】本品为非选择性β－受体阻断剂，作用较强，其对心肌β_1－受体阻滞作用比普萘洛尔强10～20倍，而局麻作用及奎尼丁样作用较小，约为普萘洛尔的1/10。与普萘洛尔不同的是具有中等程度的内源性拟交感活性，因此在一般剂量下，不产生心肌抑制作用，耐受性亦较好。主要用于治疗高血压，可单独应用或与其他抗高血压药联合应用。也可用于治疗心绞痛、心肌梗死、心律失常、焦虑症、甲状腺功能亢进等。

【药代动力学】本品几乎完全从胃肠道吸收，口服后1～2小时达到血浆浓度峰值。表观分布容积2.0mg/L，约40%～60%结合于血浆蛋白，并具有中等程度的脂溶性。仅有少量从肝脏代谢，大部分以原形或代谢产物的形式从尿液里排出。健康成人血浆清除半衰期为3～4小时，老年高血压患者、合并肾脏病变或肝脏损害者半衰期可延长。清除率为0.4L/h·kg。本品分泌到乳汁中。

【药物相互作用】与硝酸酯类或降压药同用有协同作用。不宜与单胺氧化酶抑制剂（如帕吉林）合用。

【不良反应】

1．虽然吲哚洛尔具有内源性拟交感活性，但仍可诱发支气管哮喘，加重充血性心力衰竭及房室传导阻滞。

2．其他不良反应包括头痛、头晕、失眠、多梦及疲乏、恶心等。外周血管不良反应较普萘洛尔小，发生率低，症状多较轻。极少数病人可能出现血清转氨酶轻度增高。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
吲哚洛尔片	化学药	HZ004561

HY002548　吲哚美辛

【其他名称】Indocid、消炎痛

【外文名称】Indometacin

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】2－甲基－1－（4－氯苯甲酰基）－5－甲氧基－1*H*－吲哚－3－乙酸

【分子式】$C_{19}H_{16}ClNO_4$

【分子量】357.79

【性状及组成】本品为类白色或微黄色结晶性粉末，几乎无臭，无味。本品在丙酮中溶解，在甲醇、

乙醇、三氯甲烷或乙醚中略溶，在苯中微溶，在甲苯中极微溶解，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为 158～162℃。

吸收系数：取本品 50mg，精密称定，置 100ml 量瓶中，加甲醇 50ml，振摇使溶解，加磷酸盐缓冲液（pH7.2）稀释至刻度，摇匀，精密量取 5ml，置 100ml 量瓶中，加磷酸盐缓冲液（pH7.2）－甲醇（1:1）稀释至刻度，摇匀。照分光光度法，在 320±2nm 的波长处测定吸光度，吸收系数为 185～200。

药物药理信息

【药理毒理】本品为非甾体抗炎药，具有抗炎、解热及镇痛作用，其作用机制为通过对环氧合酶的抑制而减少前列腺素的合成。制止炎症组织痛觉神经冲动的形成，抑制炎性反应，包括抑制白细胞的趋化性及溶酶体酶的释放等。至于解热作用，由于作用于下视丘体温调节中枢，引起外周血管扩张及出汗，使散热增加。这种中枢性退热作用也可能与在下视丘的前列腺素合成受到抑制有关。

急性毒性试验结果：大鼠经口 LD_{50}为 12mg/kg；小鼠经口 LD_{50}为 50mg/kg。

【药代动力学】口服吸收迅速而完全，4 小时可达给药量的 90%，食物或服用含铝及镁的制酸药可稍使吸收缓慢，血浆蛋白结合率约为 99%。口服 1～4 小时血药浓度达峰值，用量 25mg 时血药浓度为 1.4μg/ml，50mg 时为 2.8μg/ml；$t_{1/2}$平均为 4.5 小时，早产儿明显延长。本品在肝脏代谢为去甲基化物和去氯苯甲酰化物，又可水解为吲哚美辛重新吸收再循环。60%从肾脏排泄，其中 10%～20%以原形排出；33%从胆汁排泄，其中 1.5%为原形药；在乳汁中也有排出（每天可达 0.5～2.0mg）。本品不能被透析清除。

本品缓释片吸收缓慢，5～6 小时后，血药浓度达高峰，血药浓度变化比较平稳。本品控释片口服 5～6 小时后，血药浓度达峰值，峰浓度为 16～18ng/ml，其血药浓度比较平稳，单次剂量药效可维持 24 小时。

在患处局部涂搽后，吲哚美辛经皮肤进入皮下组织，先在角质层潴留，进一步往肌肉等皮下组织渗透，再进入血流，经肝脏循环，在肝脏代谢为去甲基化物和去氯苯甲酰化物，又可水解为吲哚美辛重新吸收再循环。60%从肾脏排泄，其中 10%～20%以原形排出；33%从胆汁排泄，其中 1.5%为原形药；在乳汁中也有排出。

吲哚美辛直肠给药易吸收，约 4 小时后超过给药量的 90%，吸收入血的约 99%与血浆蛋白结合。肝脏代谢物可水解为吲哚美辛并重新吸收再循环。60%从肾脏排泄。硫酸沙丁胺醇代谢物大部分随尿排出，约 4%由粪便排出。

【药物相互作用】

1．与对乙酰氨基酚长期合用可增加肾脏毒性，与其他非甾体抗炎药同用时消化道溃疡的发病率增高。

2．与阿司匹林或其他水杨酸盐同用时并不能加强疗效，而胃肠道不良反应则明显增多，由于抑制血小板聚集的作用加强，可增加出血倾向。

3．饮酒或与皮质激素、促肾上腺皮质激素同用，可增加胃肠道溃疡或出血的危险。

4．与洋地黄类药物同用时，本品可使洋地黄的血浓度升高（因抑制从肾脏的清除）而增加毒性，因而需调整洋地黄剂量。

5．与肝素、口服抗凝药及溶栓药合用时，因本品与之竞争结合蛋白，使抗凝作用加强。同时本品有抑制血小板聚集作用，因此有增加出血的潜在危险。

6．本品与胰岛素或口服降糖药合用，可加强降糖效应、须调整降糖药物的剂量。

7．与呋塞米同用时，可减弱后者排钠及抗高血压作用。其原因可能是由于抑制了肾脏内前列腺素的合成．本品还有阻止呋塞米、布美他尼及吲达帕胺等对血浆肾素活性增强的作用，对高血压病人评议其血浆肾素活性的意义时应注意此点。

8．与氨苯蝶啶合用时可致肾功能减退（肌酐清除率下降、氮质血症）。

9．本品与硝苯地平或维拉帕米同用时，可致后二者血药浓度增高，因而毒性增加。

10．丙磺舒可减少本品自肾及胆汁的清除，增高血药浓度，使毒性增加，合用时须减量。

11．与秋水仙碱、磺吡酮合用时可增加胃肠溃疡及出血的危险。

12．与锂盐同用时，可减少锂自尿排泄，使血药浓度增高，毒性加大。

13．本品可使甲氨蝶呤血药浓度增高，并延长高血浓度时间。正在用本品的病人如需作中或大剂量甲氨蝶呤治疗，应于 24～48 小时前停用本品，以免增加其毒性。

14．与抗病毒药齐多夫定同用时，可使后者清除率降低，毒性增加。同时本品的毒性也增加，故应避免合用。

【药物过量】用量过大（尤其是一日超过 150mg 时）容易引起毒性反应，如恶心、呕吐、紧张性头痛、嗜睡、精神行为障碍等，采用催吐或洗胃，对症及支持治疗。

【不良反应】本品的不良反应较多。

1．胃肠道：出现消化不良、胃痛、胃烧灼感、

恶心、反酸等症状，出现溃疡、胃出血及胃穿孔。

2. 神经系统：出现头痛、头晕、焦虑及失眠等，严重者可有精神行为障碍或抽搐等。

3. 肾：出现血尿、水肿、肾功能不全，在老年人多见。

4. 各型皮疹，最严重的为大疱性多形红斑（Stevens－Johnson综合征）。

5. 造血系统受抑制而出现再生障碍性贫血，白细胞减少或血小板减少等。

6. 过敏反应，哮喘，血管性水肿及休克等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氨糖美辛肠溶片	化学药	HZ000249
复方川芎吲哚美辛吡罗昔康胶囊	化学药	HZ001110
复方吲哚美辛乳膏	化学药	HZ001477
美辛唑酮红古豆醇酯栓	化学药	HZ002656
美辛唑酮栓	化学药	HZ002657
舒肤特	化学药	HZ003212
吲哚美辛巴布膏	化学药	HZ004562
吲哚美辛搽剂	化学药	HZ004563
吲哚美辛肠溶片	化学药	HZ004564
吲哚美辛滴眼液	化学药	HZ004565
吲哚美辛缓释胶囊	化学药	HZ004566
吲哚美辛缓释片	化学药	HZ004567
吲哚美辛胶囊	化学药	HZ004568
吲哚美辛控释片	化学药	HZ004569
吲哚美辛口服混悬液	化学药	HZ004570
吲哚美辛片	化学药	HZ004571
吲哚美辛乳膏	化学药	HZ004572
吲哚美辛软膏	化学药	HZ004573
吲哚美辛三七冰片栓	化学药	HZ004574
吲哚美辛沙丁胺醇栓	化学药	HZ004575
吲哚美辛栓	化学药	HZ004576
吲哚美辛贴膏	化学药	HZ004577
吲哚美辛贴片	化学药	HZ004578
盆炎清栓	中成药	ZC003768
新癀片	中成药	ZC006476
志苓胶囊	中成药	ZC007412

HY002549　蚓激酶

【外文名称】Lumbrokinase

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第27册

【性状及组成】本品系人工养殖的赤子爱胜蚓中提取制备的一组蛋白水解酶。按干燥品计算，每1mg效价应不得少于12000单位。每1mg蛋白中蚓激酶比活力不得少于20000单位。

本品为淡黄色的粉末；味腥，有引湿性。

药物药理信息

【药理毒理】蚓激酶是一种蛋白水解酶。动物试验表明本品具有溶解家兔肺动脉血栓的作用，可明显缩短家兔的优球蛋白溶解时间。

【不良反应】极少数病人出现轻度头痛、头晕、便秘、恶心等不需特殊处理。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
蚓激酶肠溶胶囊	化学药	HZ004579
蚓激酶肠溶片	化学药	HZ004580

HY002550　茚达品

【外文名称】Indalpine

药物药理信息

【药理毒理】本品为5－HT再摄取的抑制剂，通过抑制突触前膜对5－HT的再摄取，提高突触间隙中5－HT的含量，促进突触间的传递，产生抗抑郁作用。不影响其他递质的再摄取。用于治疗各型抑郁症。

【药代动力学】本品口服吸收快，1次服50mg2小时后可达血药峰浓度，很快在脑内达到平衡，在血液中到第3日才能达到平衡。主要通过肾脏排泄，$t_{1/2}$为10小时。

【药物相互作用】不应与影响白细胞的药物合用，亦不可与MAOI合用。

【不良反应】本品常见的不良反应有嗜睡、颤抖（继续用药可减轻）、白细胞减少，粒细胞减少，偶见ALT增高，停药后可恢复。

HY002551　茚诺洛尔

【其他名称】PULSAN、SECUPRES、茚心安

【外文名称】Indenolol

药物药理信息

【药理毒理】对 β_1 - 受体阻断作用无选择性，具有内在拟交感活性。阻断 β - 受体作用程度似普萘洛尔，可降低外周阻力，不影响心输出量，可降低血浆肾素活性。

用于轻、中度高血压，心律失常。也用于全身麻醉的防止心律失常和血压、心率上升。

【不良反应】可见乏力、嗜睡、头晕、失眠、恶心、腹胀、皮疹、晕厥、低血压、心动过缓等。

HY002552 罂粟秆浓缩物

【外文名称】Concentrate of Poppy Straw

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633 号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品。

HY002553 罂粟果提取物

【外文名称】Poppy Capsule Extractive

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

【性状及组成】本品为罂粟科植物罂粟果实的提取物，经干燥后再加入干燥的罂粟果粉制成。含吗啡按无水吗啡（$C_{17}H_{19}NO_3$）计算，不得少于 11.0%。

本品为浅棕色粉末，臭特殊，味苦。

HY002554 罂粟果提取物粉

【外文名称】Powdered Poppy Capsule Extractive

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

【性状及组成】本品为罂粟果提取物在 70℃以下干燥，研细，测定吗啡含量后，加磷酸可待因及其他稀释剂，研匀，制成。

本品含吗啡按无水吗啡（$C_{17}H_{19}NO_3$）计算，应为 9.5% ~ 10.5%；含磷酸可待因（$C_{18}H_{21}NO_3 \cdot H_3PO_4 \cdot 1/2H_2O$）不得少于 4.5%。

本品为浅棕色粉末，臭特殊，味苦。

HY002555 荧光素钠

【外文名称】Fluorescein Sodium

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】9 -（邻羧基苯基）-6 - 羟基 - 3H - 呫吨 - 3 - 酮二钠盐

【分子式】$C_{20}H_{10}Na_2O_5$

【分子量】376.28

【性状及组成】本品为橙红色粉末，无臭，几乎无味；有引湿性。

本品在水中易溶，在乙醇中略溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为诊断用药，是一种染料，对正常角膜等上皮不能染色，但能对损伤的角膜上皮染成绿色，从而可显示出角膜损伤、溃疡等病变。

本品流经小血管时，能在紫外线或蓝色光激发下透过较薄的血管壁和黏膜呈现绿色荧光，从而显示小血管行经和形态等，据此可供眼底血管造影和循环时间测定。

本品几乎不能透过血脑屏障，但在结核性脑膜炎时脑脊液内含量有所增加，肌内注射后测定脑脊液内本品含量有助于对结核性脑膜炎的诊断和鉴别诊断。

【药代动力学】成人肌内注射 0.5 ~ 1g 后 2 小时脑脊液内含量低于 0.00002%。静脉注射后约 60% 与血浆白蛋白结合。

本品在体内不参与代谢，也不与组织牢固结合。主要经肾脏从尿液中排出，小部分经肝从胆汁排出，24 小时内从体内基本排尽。

【药物相互作用】

1. 在静脉注射本品前 30 分钟服用甲氧氯普胺（胃复安）10mg 和抗组胺药物，有助于减少恶心、呕吐反应。

2. 本品忌与酸、碱式盐和重金属盐混合使用。

【不良反应】本品过敏反应包括：荨麻疹、呼吸困难、哮喘发作、呼吸停止、血压下降、休克、心脏停搏、心肌梗死、肺水肿和脑梗死等。

常见反应有恶心、呕吐、眩晕，多在注射后 30 秒中内发生。反应发生率和严重程度与注射剂浓度和注入量有关。一次静脉注入量 > 5ml（5%），常可出现恶心和呕吐症状。本品血管造影时总的反应发生率约 0.6%，严重反应约 0.4%。肌内注射后可有局部疼痛。静脉注射后皮肤和尿液暂时染色，视物有黄色或粉红色感觉。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
荧光素钠注射液	化学药	HZ004581

HY002556　硬脂酸

【其他名称】十八酸、十八碳烷酸、十八烷酸

【外文名称】Stearic Acid

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】主要成分为硬脂酸（$C_{18}H_{36}O_2$）与棕榈酸（$C_{16}H_{32}O_2$）

【分子式】$C_{18}H_{36}O_2/C_{16}H_{32}O_2$

【分子量】284.48

【性状及组成】本品系从动、植物油脂中得到的固体脂肪酸，主要成分为硬脂酸与棕榈酸。

本品为白色或类白色有滑腻感的粉末或结晶性硬块，其剖面有微带光泽的细针状结晶；有类似油脂的微臭，无味。

本品在三氯甲烷或乙醚中易溶，在乙醇中溶解，在水中几乎不溶。

凝点：本品的凝点不低于 54℃。

碘值：本品的碘值不大于 4。

酸值：本品的酸值为 203～210。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料，赋形剂。

硬脂酸广泛用于口服、局部药剂中。主要用作片剂、胶囊剂的润滑剂。也可作为黏合剂，与虫胶合用于片剂包衣。也可用作缓释剂载体在局部用制剂中，硬脂酸用作乳化剂与增溶剂。用碱或三乙醇胺部分中和时，硬脂酸用于乳膏制备。部分中和的硬脂酸加入 5～15 倍水性液体形成乳膏基质；乳膏外观和塑性决定于碱的用量。硬脂酸可加到甘油栓剂中作为硬化剂。

硬脂酸亦广泛用于食品和化妆品中。

【药物相互作用】硬脂酸与金属氢氧化物、氧化剂有配伍禁忌。与许多金属形成水不溶性的硬脂酸盐；用硬脂酸制得的软膏基质与锌盐或钙盐反应可变成黏稠的胶块。

可用差热分析法来研究硬脂酸与一些药物的相容性，据报道，硬脂酸与萘普生不相容。

【不良反应】硬脂酸广泛用于口服及局部用制剂中，也用于化妆品和食品中。硬脂酸无毒、无刺激性。口服过量也可能有害。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方多维元素片（23）	化学药	HZ001152
日晒防治膏	民族药	MZ000451
消白软膏	民族药	MZ000661
消痔洁肤软膏	民族药	MZ000669
按摩乳	中成药	ZC000076
丹芎跌打膏	中成药	ZC000755
貂油治裂软膏	中成药	ZC000857
肤螨灵软膏	中成药	ZC001149
赛霉安乳膏	中成药	ZC004430
参皇软膏	中成药	ZC004765
新肤螨软膏	中成药	ZC006474
脂必妥片	中成药	ZC007311
治伤软膏	中成药	ZC007431

HY002557　硬脂酸红霉素

【外文名称】Erythromycin Stearate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】硬脂酸红霉素

【分子式】$C_{37}H_{67}NO_{13}\cdot C_{18}H_{36}O_2$

【分子量】1018.42

【性状及组成】本品为红霉素的硬脂酸盐及过量的硬脂酸。按无水物计算，每 1mg 的效价不得少于 550 红霉素单位。

本品为白色或类白色的结晶或粉末，无臭，味微苦。本品在甲醇、乙醇或三氯甲烷中溶解，在丙酮中微溶，在水中几乎不溶。

药物药理信息

【药理毒理】硬脂酸红霉素属大环内酯类抗生素，对葡萄球菌属、各组链球菌和革兰阳性杆菌均具抗菌活性。奈瑟菌属、流感嗜血杆菌、百日咳鲍特氏菌等也对本品呈现敏感。本品对除脆弱拟杆菌和梭杆菌属以外的各种厌氧菌亦具抗菌活性；对军团菌属、胎儿弯曲菌、某些螺旋体、肺炎支原体、立克次体属和衣原体属也有抑制作用。本品系抑菌剂，但在高浓度时对某些细菌也具杀菌作用。本品可透过细菌细胞膜，在接近供位（“P”位）处与细菌核糖体的 50S 亚基成可逆性结合，阻断了转移核糖核酸（t－RNA）结合至“P”位上，同时也阻断了多肽链自受位（“A”位）至“P”位的位移，因而细菌蛋白质合成受抑制。硬脂酸红霉素仅对分裂活跃

的细菌有效。

【药代动力学】本品对酸较稳定，故在胃中破坏较少，在十二指肠分离成具抗菌活性的红霉素，并以盐基形式从小肠吸收。口服0.25g本品后，达峰时间为2小时，血药浓度可达1～1.3mg/L。吸收后除脑脊液和脑组织外，广泛分布于各组织和体液中，尤以肝、胆汁和脾中的浓度为最高、在肾、肺等组织中的浓度可高出血药浓度数倍，在胆汁中的浓度可达血药浓度的10～40倍以上。在皮下组织、痰及支气管分泌物中的浓度也较高，痰中浓度与血药浓度相仿；在胸、腹水、脓液等中的浓度可达有效水平。本品有一定量（约为血药浓度的33%）进入前列腺及精囊中，但不易透过血脑屏障，脑膜有炎症时脑脊液中浓度仅为血药浓度的10%左右。可进入胎血和排入母乳中，胎儿血药浓度为母体血药浓度的5%～20%，母乳中药物浓度可达血药浓度的50%以上。表观分布容积为0.9L/kg。蛋白结合率为70%～90%。游离红霉素在肝内代谢，血半衰期为1.4～2小时，无尿患者的血半衰期可延长至4.8～6小时。红霉素主要在肝中浓缩和从胆汁排出，并进行肠肝循环，约2%～5%的口服量和10%～15%的注入量自肾小球滤过排除，尿中浓度可达10～100mg/L。粪便中也含有一定量。血或腹膜透析后极少被清除，故透析后无需加用。

【药物相互作用】

1．本品可抑制卡马西平和丙戊酸等抗癫痫药的代谢，导致后者的血药浓度增高而发生毒性反应。本品与阿芬太尼合用可抑制后者的代谢，延长其作用时间。本品与阿司咪唑或特非那定等抗组胺药合用可增加心脏毒性，与环孢素合用可使后者血药浓度增加而产生肾毒性。

2．与氯霉素和林可酰胺类有拮抗作用，不推荐同用。

3．本品为抑菌剂，可干扰青霉素的杀菌效能，故当需要快速杀菌作用如治疗脑膜炎时，两者不宜同用。

4．长期服用华法林的患者应用本品时可导致凝血酶原时间延长，从而增加出血的危险性，老年病人尤应注意。两者必须同用时，华法林的剂量宜适当调整，并严密观察凝血酶原时间。

5．除二羟丙茶碱外，本品与黄嘌呤类合用可使氨茶碱的肝清除减少，导致血清氨茶碱浓度升高和（或）毒性反应增加。这一现象在合用6日后较易发生，氨茶碱清除的减少幅度与红霉素血清峰值成正比。因此在两者合用疗程中和疗程后，黄嘌呤类的剂量应予调整。

6．与其他肝毒性药物合用可能增强肝毒性。

7．大剂量红霉素与耳毒性药物合用，尤其肾功能减退患者可能增加耳毒性。

8．与洛伐他丁合用时可抑制其代谢而使血药浓度上升，可能引起横纹肌溶解，与咪达唑仑或三唑仑合用时可减少二者的清除而增强其作用。

【药物过量】应及时停药给予对症和支持治疗。血或腹膜透析后极少被消除。

【不良反应】

1．胃肠道反应多见，有腹泻、恶心、呕吐、中上腹痛、口舌疼痛、胃纳减退等，其发生率与剂量大小有关。

2．肝毒性少见，患者可有乏力、恶心、呕吐、腹痛、发热及肝功能异常，偶见黄疸等。

3．大剂量（≥一日4g）应用时，尤其肝、肾疾病患者或老年患者，可能引起听力减退，主要与血药浓度过高（>12mg/L）有关，停药后大多可恢复。

4．过敏反应表现为药物热、皮疹、嗜酸粒细胞增多等，发生率约0.5%～1%。

5．其他：偶有心律失常、口腔或阴道念珠菌感染。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
硬脂酸红霉素胶囊	化学药	HZ004582
硬脂酸红霉素颗粒	化学药	HZ004583
硬脂酸红霉素片	化学药	HZ004584

HY002558 硬脂酸聚烃氧（40）酯

【外文名称】Polyoxyl（40）Stearate

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】聚乙二醇单硬脂酸酯

【性状及组成】本品为聚乙二醇单硬脂酸酯。分子式以$C_{17}H_{35}COO(CH_2CH_2O)_{[n]}H$表示，n约为40。

本品为白色或淡黄色蜡状固体，无臭。

本品在水、乙醇或乙醚中溶解，在乙二醇中不溶。

熔点：本品的熔点为46～51℃。

酸值：本品的酸值不大于2。

皂化值：本品的皂化值为25～35。

羟值：本品的羟值为22～38。

药物药理信息

【药理毒理】表面活性剂。

HY002559　硬脂酸镁

【外文名称】Magnesium Stearate

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】十八酸镁盐

【分子式】$C_{36}H_{70}MgO_4/C_{32}H_{62}MgO_4$

【分子量】591.34

【性状及组成】本品为以硬脂酸镁与棕榈酸镁为主要成分的混合物。

本品为白色轻松无砂性的细粉；微有特臭；与皮肤接触有滑腻感。本品在水、乙醇或乙醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料，赋形剂。

本品具有润滑、抗黏、助流等作用。主要用作片剂、胶囊剂的润滑剂、助流剂、抗黏剂。特别适宜油类、浸膏类药物的制粒，制成的颗粒具有很好的流动性和可压性。在直接压片中用作助流剂。还可作为助滤剂、澄清剂和滴泡剂，以及液体制剂的助悬剂、增稠剂。

【药物相互作用】硬脂酸镁与强酸、强碱和铁盐配伍禁忌。避免与强氧化混合。本品在含有阿司匹林、一些维生素、大多数生物碱盐的产品中不得使用。

【不良反应】

1．硬脂酸镁是广泛应用的药物辅料，通常认为口服无毒。然而，大量口服会引起腹泻或黏膜刺激。

2．有关正常的职业性接触毒性，未见报告资料。硬脂酸镁中重金属限度，系按硬脂酸镁品质最差者最大的日摄入量和重金属组成来评价。

3．硬脂酸镁对大鼠的试验表明对皮肤无刺激性，口服及吸入也无毒。

4．硬脂酸镁植入小鼠的膀胱中，无致癌性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方多维元素片（23）	化学药	HZ001152
富马酸酮替芬分散片	化学药	HZ001514
磷酸雌莫司汀胶囊	化学药	HZ002287
葡萄糖酸钙含片	化学药	HZ002884
三维亚铁咀嚼片	化学药	HZ003163
香菇多糖片	化学药	HZ003670

续表

制剂名称	类别	序号
盐酸氨溴索泡腾片	化学药	HZ003877
半支莲片	民族药	MZ000048
肠舒片	民族药	MZ000068
肠舒止泻胶囊	民族药	MZ000069
丹参益心胶囊	民族药	MZ000085
复方草玉梅含片	民族药	MZ000155
复方吉祥草含片	民族药	MZ000159
关通舒胶囊	民族药	MZ000192
灵丹草片	民族药	MZ000315
龙金通淋胶囊	民族药	MZ000339
露水草胶囊	民族药	MZ000341
鹿仙补肾片	民族药	MZ000343
七生力片	民族药	MZ000382
驱白巴布期片	民族药	MZ000441
乳癖安消胶囊	民族药	MZ000457
润伊容胶囊	民族药	MZ000460
胃复舒胶囊	民族药	MZ000624
血脉通胶囊	民族药	MZ000692
益肾健骨片	民族药	MZ000719
银龙清肝片	民族药	MZ000725
银芩胶囊	民族药	MZ000726
安神补脑片	中成药	ZC000040
白头翁止痢片	中成药	ZC000168
白杏片	中成药	ZC000169
百日咳片	中成药	ZC000201
痹欣片	中成药	ZC000341
槟榔四消片	中成药	ZC000355
冰七片	中成药	ZC000364
补血宁神片	中成药	ZC000444
苍莲感冒片	中成药	ZC000474
除翳明目片	中成药	ZC000584
穿王消炎片	中成药	ZC000626
穿心莲内酯胶囊	中成药	ZC000629
大山楂片	中成药	ZC000707
当归片	中成药	ZC000800
当药片	中成药	ZC000808
灯台叶片	中成药	ZC000820

续表

制剂名称	类别	序号
东山感冒片	中成药	ZC000911
二母宁嗽片	中成药	ZC001025
二夏清心片	中成药	ZC001030
肺毒清片	中成药	ZC001061
复方白头翁片	中成药	ZC001273
复方半夏片	中成药	ZC001282
复方贝母片	中成药	ZC001284
复方川贝精片	中成药	ZC001298
复方党参片	中成药	ZC001330
复方风湿宁片	中成药	ZC001353
复方感冒灵片	中成药	ZC001364
复方金蒲片	中成药	ZC001414
复方决明片	中成药	ZC001419
复方两面针含片	中成药	ZC001432
复方马缨丹片	中成药	ZC001450
复方木麻黄片	中成药	ZC001459
复方气管炎片	中成药	ZC001474
复方忍冬野菊感冒片	中成药	ZC001486
复方三七补血片	中成药	ZC001488
复方玄驹益气片	中成药	ZC001581
腹可安片	中成药	ZC001655
甘桔冰梅片	中成药	ZC001664
肝加欣片	中成药	ZC001688
肝喜乐片	中成药	ZC001716
肝悦片	中成药	ZC001722
感冒清片	中成药	ZC001740
感特灵片	中成药	ZC001763
海甘胃片	中成药	ZC002043
海墨止血片	中成药	ZC002058
和血明目片	中成药	ZC002099
红花逍遥胶囊	中成药	ZC002125
红龙镇痛片	中成药	ZC002131
黄龙咳喘胶囊	中成药	ZC002278
藿香正气片	中成药	ZC002377
佳蓉片	中成药	ZC002436
绞股蓝总苷分散片	中成药	ZC002586
金感欣片	中成药	ZC002662

续表

制剂名称	类别	序号
金槐冠心片	中成药	ZC002685
金莲胃舒片	中成药	ZC002711
金银三七胶囊	中成药	ZC002776
精制冠心片	中成药	ZC002832
颈康片	中成药	ZC002840
救必应胃痛片	中成药	ZC002888
咳喘清片	中成药	ZC003031
咳喘舒片	中成药	ZC003032
口腔溃疡含片	中成药	ZC003083
苦豆子片	中成药	ZC003094
兰花咳宁片	中成药	ZC003144
蓝蒲解毒片	中成药	ZC003148
理中片	中成药	ZC003178
利肺片	中成药	ZC003194
利肝康片	中成药	ZC003196
龙七胃康片	中成药	ZC003358
龙血竭散	中成药	ZC003370
陇马陆胃药胶囊	中成药	ZC003381
芦笋胶囊	中成药	ZC003385
罗已降压片	中成药	ZC003443
麻杏止咳片	中成药	ZC003469
脉平片	中成药	ZC003500
满山香片	中成药	ZC003511
毛冬青片	中成药	ZC003525
玫芦消痤膏	中成药	ZC003531
明目滋肾片	中成药	ZC003576
木香理气片	中成药	ZC003597
平胃片	中成药	ZC003791
七生静片	中成药	ZC003821
千金藤素片	中成药	ZC003917
前列安通片	中成药	ZC003928
青兰浸膏片	中成药	ZC004029
祛痰平喘片	中成药	ZC004261
人工牛黄片	中成药	ZC004299
人参茎叶皂苷片	中成药	ZC004318
人参片	中成药	ZC004324
茸地益肾胶囊	中成药	ZC004343

续表

制剂名称	类别	序号
茸地益肾口服液	中成药	ZC004344
乳安片	中成药	ZC004370
乳癖康片	中成药	ZC004389
三宝片	中成药	ZC004435
三黄清解片	中成药	ZC004452
三金胶囊	中成药	ZC004460
三七片	中成药	ZC004480
三味止咳片	中成药	ZC004507
散寒感冒片	中成药	ZC004520
沙棘片	中成药	ZC004553
山蜡梅叶片	中成药	ZC004580
上清片	中成药	ZC004641
参茸补肾片	中成药	ZC004861
参茸强肾片	中成药	ZC004884
参维冻干蜂王浆片	中成药	ZC004917
首乌片	中成药	ZC005126
首乌延寿片	中成药	ZC005130
顺气化痰片	中成药	ZC005298
四黄泻火片	中成药	ZC005307
四季青片	中成药	ZC005314
四季消炎喉片	中成药	ZC005318
速克感冒片	中成药	ZC005366
锁阳三味片	中成药	ZC005388
天王补心片	中成药	ZC005462
通脉刺五加胶囊	中成药	ZC005547
万通筋骨片	中成药	ZC005647
维C银翘片	中成药	ZC005669
胃得康片	中成药	ZC005696
胃刻宁片	中成药	ZC005707
胃舒止痛片	中成药	ZC005730
胃友新片	中成药	ZC005755
温经活血片	中成药	ZC005759
五酯片	中成药	ZC005884
西瓜霜润喉片	中成药	ZC005903
仙灵脾片	中成药	ZC005967
香砂养胃胶囊	中成药	ZC006014
香砂养胃片	中成药	ZC006019

续表

制剂名称	类别	序号
香砂养胃乳剂	中成药	ZC006020
消渴灵片	中成药	ZC006075
消食养胃片	中成药	ZC006102
消肿痔疮片	中成药	ZC006152
小儿和胃消食片	中成药	ZC006211
小儿麦枣片	中成药	ZC006268
小儿启脾片	中成药	ZC006285
小金片	中成药	ZC006381
泻肺定喘片	中成药	ZC006399
心神宁片	中成药	ZC006446
心舒乐片	中成药	ZC006450
炎痛净片	中成药	ZC006636
羊肝明目片	中成药	ZC006649
羊藿三七片	中成药	ZC006652
益肝灵片	中成药	ZC006827
益母草片	中成药	ZC006846
益肾消渴胶囊	中成药	ZC006901
益阴消渴胶囊	中成药	ZC006929
银阳虫草胶囊	中成药	ZC007027
玉叶清火片	中成药	ZC007091
云芝肝泰片	中成药	ZC007161
脂必妥片	中成药	ZC007311
止嗽片	中成药	ZC007360
止血祛瘀明目片	中成药	ZC007393
重感灵片	中成药	ZC007480
紫花杜鹃胶囊	中成药	ZC007599

HY002560　硬脂酸钠

【其他名称】十八酸钠

【外文名称】Sodium Stearate

【性状及组成】本品为白色的细微粉末。具有肥皂味，并具有牛脂臭气，可缓慢溶解于水和乙醇，易溶于热水和热醇，水溶液对酚酞显碱性。很浓的热皂液放冷后不结晶。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料。

本品具有乳化、增稠、润滑等作用。在药物制剂中，用于乳化剂、增稠剂、润滑剂，主要用于制

备片剂、乳膏剂、洗剂、搽剂、甘油栓剂等。在日化工业中，具有相似的作用，用于制备霜剂、香波、香皂等多种日化产品。

【药物相互作用】本品与硬脂酸镁基本相同，遇氧化剂、无机酸或较强的有机酸（如醋酸）等发生配伍变化。

【不良反应】本品安全、无毒，对皮肤无刺激性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
甘油栓	化学药	HZ001571

HY002561 蛹油 α－亚麻酸乙酯

【其他名称】蛹油脂肪酸

【外文名称】Bombyx Mori Oil Ethyl Linolenate

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第16册

药物理化信息

【化学名】十八碳三烯酸乙酯

【分子式】$C_{20}H_{34}O_2$

【分子量】306.47

【性状及组成】本品为蚕蛾科昆虫家蚕的蛹油经提取精制而得。含 α－亚麻酸乙酯（$C_{20}H_{34}O_2$）不得少于60.0%。

本品为微黄色或黄色澄明油状液体，易氧化。

本品在无水乙醇中极易溶解，在水中不溶。

相对密度：本品的相对密度为0.885～0.895。

折光率：本品的折光率为1.460～1.470。

酸值：取乙醇与乙醚各15ml，置锥形瓶中，加酚酞指示液5滴，滴加氢氧化钠滴定液（0.1mol/L）至微显粉红色，再加本品2.0g，振摇使完全溶解，用氢氧化钠滴定液（0.1mol/L）滴定，酸值不得过5.0。

药物药理信息

【药理毒理】降血脂药。

1．通过阻止脂肪酸、甘油三酯的合成及加速 β－氧化降低甘油三酯。

2．α－亚麻酸是 γ－亚麻酸的异构体，后者是将甘油三酯、胆固醇通过血液向肝脏转移而降低血脂，而 α－亚麻酸减低血脂的同时无肝脏积累脂质症状，不会导致脂肪肝

3．可代谢成EPA、DHA参与竞争环氧化酶和脂氧化酶，调整血栓素（TXA2）/前列腺素（PGI2）的平衡，抑制血栓形成、抗动脉粥样硬化。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
蛹油 α－亚麻酸乙酯胶丸	化学药	HZ004585

HY002562 尤瑞克林

【外文名称】Urinary Kallidinogenase

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：本品是自人尿液中提取得到的蛋白水解酶，能将激肽原转化为激肽和血管舒张素。体外研究显示，本品对离体动脉具有舒张作用，并可抑制血小板聚集、增强红细胞变形能力和氧解离能力。动物试验显示，本品静脉注射可增加麻醉犬椎间、颈总和股动脉血流量，增加麻醉全后肢家兔肌肉血流量。家兔颈内动脉注入玻璃珠导致脑微血管损伤，静脉注射给予尤瑞克林可舒张脑血管、增加脑血液中血红蛋白含量，降低脑梗死面积的扩展，改善梗塞引起的脑组织葡萄糖和氧摄取降低，改善葡萄糖代谢，并可改善自发性皮层脑电图异常。采用多中心、随机、双盲、安慰剂平行对照试验设计方法，以起病48小时之内的轻－中度颈动脉系统首发血栓性脑梗死患者为研究对象，观察注射用本品的临床疗效和安全性。受试者随机分为二组，在基础治疗（羟乙基芦丁注射液200mg加入5%葡萄糖液500ml中静脉滴注，每日1次）的基础上分别给予注射用本品、安慰剂。主要疗效指标为神经功能缺损评分（ESS）。结果：注射用尤瑞克林组330例，每天静脉滴注本品0.15PNA单位，连续21天，有效率为70.36%；安慰剂对照组116例，有效率为52.59%。统计分析表明，注射用本品的临床疗效明显优于对照组。

2．毒理研究

（1）单次给药毒性：小鼠、大鼠静脉注射本品100PNA单位/kg，在2周的观察期间未见动物死亡和药物引起的异常。犬快速静脉注射本品62.5PNA单位/kg，可见动物眼球结膜及口腔黏膜充血、皮肤潮红、眼睑下垂、虚脱、昏睡，呼吸频率、心率降低，呼吸停顿，发绀，流涎及尿便失禁，上述症状在给药后迅速出现，并迅速恢复，14天后剖检未见药物相关病理改变。推断与激肽过度释放引起血压和血流量显著降低有关。

（2）重复给药毒性：大鼠静脉注射给予本品0.2、1.0、5.0PNA单位/kg，连续12个月，可见中、高剂量组肾脏硬化并伴贫血、肝脏肥大，认为是长期注射异种蛋白所致。Beagle犬快速静脉注射给予本品0.025、0.25、2.5PNA单位/kg，连续12个月，给

药后可见眼球结膜及口腔黏膜充血、皮肤潮红、眼睑下垂、翻正反射消失、发绀，流涎及尿便失禁，具有剂量依赖性，未见动物死亡。病理学检查发现尿道壁肥厚，尿道上皮增生，黏膜下组织水肿性硬化，胆管增生。上述症状停药后可恢复。

(3) 生殖毒性：小鼠静脉注射给药的一般生殖毒性试验、致畸敏感期试验和围产期试验以及家兔静脉注射给药的致畸敏感期试验，仅见母体动物一般临床观察异常，包括镇静、俯卧、呼吸急促、缩瞳等，未见对生殖及子代发育等的影响。

【药代动力学】家兔、犬快速静脉注射后血浆药物浓度迅速降低，消除曲线呈二相性，家兔 $t_{1/2\alpha}$ 约为 5 分钟、$t_{1/2\beta}$ 约为 120 分钟，犬 $t_{1/2\alpha}$ 约为 3 分钟、$t_{1/2\beta}$ 约为 40 分钟；30 分钟内持续静脉注射血药浓度迅速上升，29 分钟达峰值，随后消除与快速静脉注射相同。大鼠快速静脉注射后药物主要分布在肝、肾上腺、脾、肾、血液等组织，主要由肝脏代谢，注射 5 分钟后肝分布达 86%，随后被代谢成低分子产物释放到血中，主要以低分子代谢物由尿液中排出；24 小时重复注射药代动力学无差异，药物在体内无积蓄；大鼠试验证实药物几乎不能透过胎盘屏障，也不能进入乳汁；药物在血浆中与抑制剂形成复合物，人体主要是 α_1 抗胰蛋白酶，犬和大鼠为 α_1 抗胰蛋白酶和 α_2 巨球蛋白。

健康成人 30 分钟静脉滴注后血药浓度迅速下降，$AUC_{0\sim180}$ 分钟与给药剂量呈正相关性，$t_{1/2\beta}$ 在 156～197 分钟；24 小时间隔多次给药，体内药动学参数无变化。

【药物相互作用】

1．与血管紧张素转化酶抑制剂（ACEI）类药物有协同降血压作用，合并用药可能导致血压急剧下降。

2．与其他降压药物无协同降压作用。

【不良反应】共有 645 例患者进入尤瑞克林治疗急性脑梗死的Ⅱ、Ⅲ期临床试验，其中试验组（尤瑞克林组）462 例。试验组出现 4 例严重不良事件，其中 2 例死亡（1 例为 75 岁右侧小脑半球梗死伴基底节部腔隙性梗死，判定死亡原因为小脑梗死并发脑疝；1 例为 70 岁右侧额顶颞部梗死，判定死亡原因为心源性猝死）。判断与研究药物无关。另 2 例在第一次注射试验药时（均是用药开始 10 分钟内），引起血压突然下降伴意识障碍，立即停药并给予升压药后，血压很快恢复，无不良后果，判定与用药有关。Ⅲ期临床试验中共发生重要不良事件 9 例，其中 4 例出现梗死灶内发生出血，难以确定是否与药物有关；2 例并发心绞痛，1 例并发上消化道出血；2 例出现症状较重的不良反应：恶心、呕吐、胸闷、心慌等。对照组：在Ⅱa 期临床试验中死亡 1 例，在Ⅲ期临床试验中未发生严重不良事件。经过资料分析，试验中与药物有关或可能有关的不良反应主要为呕吐、颜面潮红和脸部发热感、头疼、腹泻、结膜充血、心慌胸闷、注射部位红痒等症状（见下表），一般都较轻，不需要特殊处理。有个别病例可能对尤瑞克林反应特别敏感，发生血压急剧下降。

表：治疗急性脑梗死安慰剂对照临床研究期间发生的不良反应

不良反应（N＝183）	尤瑞克林（N＝462）	对照组
心血管系统		
皮肤潮红	1.52%	0.55%
血压下降	1.08%	
结膜充血	0.87%	
胸闷	0.65%	0.55%
伴发心绞痛	0.22%	
心悸（包括心慌）	0.22%	0.55%
神经系统		
头痛	1.08%	2.19%
出汗	0.65%	0.55%
头晕	0.22%	
乏力	0.22%	
消化道		
恶心、呕吐	1.30%	
腹泻	0.87%	
消化道出血	0.22%	
全身		
发热	0.22%	0.55%
注射局部		
注射部位红、痒、痛	0.65%	
其他		
剧烈咳嗽	0.22%	
皮疹	0.22%	

其中，伴发心绞痛、心悸、头晕、乏力、发热、剧烈咳嗽属个别情况，是否与本品有关尚待进一步研究。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用尤瑞克林	化学药	HZ0005128

HY002563 右苯丙胺

【外文名称】Dexamfetamine

药物管理信息

【特殊管理分类】一类精神药

药物药理信息

【药理毒理】本品用于治疗肥胖症，其抑食作用是左旋体的3～4倍，还可用于发作性睡病，疲劳，慢性酒精中毒。

HY002564 右丙亚胺

【外文名称】Dexrazoxane

药物理化信息

【化学名】（S）－（+）－4，4′－（1－甲基－1，2－联亚甲基）－双（2，6－哌嗪二酮）

【分子式】$C_{11}H_{16}N4O_4$

【分子量】268.27

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：本品与阿霉素联合应用时对后者的心脏毒性有保护作用，但其发挥心脏保护作用的机制尚不十分清楚。右丙亚胺为EDTA的环状衍生物，容易穿透细胞膜。实验研究表明，右丙亚胺在细胞内转变为开环螯合剂，干扰铁离子中介的自由基的形成，而后者为蒽环类抗生素产生心脏毒性的部分原因。

2．毒理研究

（1）遗传毒性：本品Ames实验阴性，但对体外人淋巴细胞和体内小鼠骨髓红细胞（微核实验）均有致裂变作用。

（2）生殖毒性：本品对人和雌、雄实验动物可能的生殖毒性尚缺乏足够研究。大鼠连续给予本品6周，在剂量低至每周30mg/kg（以体表面积计算为人用量的1/3）时即引起睾丸萎缩。狗连续给予本品13周，剂量低至每周20mg/kg（以体表面积计算大约与人用量相同）时即可引起睾丸萎缩。

怀孕大鼠在器官形成期给予本品，在日剂量为2mg/kg（以体表面积计算约为人用量的1/40）时产生母鼠毒性，日剂量8mg/kg（以体表面积计算约为人用量的1/10）时出现胚胎毒性和致畸作用，后者包括肛门闭锁、小眼及无眼畸形，且发育成熟子代的生殖能力减退。怀孕兔在器官形成期给予本品，日剂量为5mg/kg（以体表面积计算约为人用量的1/10）时产生母体毒性，日剂量20mg/kg（以体表面积计算约为人用量的1/2）时出现胚胎毒性和致畸作用。对兔的致畸作用表现为骨髓畸形（诸如短尾、肋骨及胸骨畸形）、软组织异常、胆囊和肺中叶发育不良。

（3）致癌性：尚无本品动物长期致癌研究资料。

【药代动力学】右丙亚胺已在肝、肾功能正常的晚期肿瘤病人中进行了药代动力学的研究。通常，右丙亚胺药代动力学符合二室模型，呈一级动力学消除。用阿霉素60mg/m²，右丙亚胺的剂量60～900mg/m²和固定阿霉素50mg/m²，右丙亚胺500mg/m²，静脉滴注15分钟以上。结果表明在60～90mg/m²剂量范围内，血浆药物浓度与曲线下面积呈线性关系，平均血浆峰浓度为36.5μg/ml。两例亚洲女性病人500mg/m²右丙亚胺与50mg/m²阿霉素合用，平均总体内清除率和稳态分布容积分别为15.15L/（h·m²）和36.27L/m²，但右丙亚胺清除半衰期及肾清除率与同一研究中的Caucasian病人相似。对右丙亚胺定量代谢研究证实在人和动物的尿液中存在原形药、一种二元酸二酰胺裂解物及两种一元酸一酰胺环状产物。在药动学中未检测代谢物的浓度。右丙亚胺主要由尿排泄，500mg/m²右丙亚胺，有42%由尿排泄。体外实验证明右丙亚胺不与血浆蛋白结合。特殊人群：在儿童或肝、肾功能不全的病人没有进行药代动力学研究。药物相互作用：在癌症病人中进行的交叉研究显示，固定剂量阿霉素50mg/m²与右丙亚胺500mg/m²合用时，右丙亚胺对阿霉素及其主要代谢产物阿霉素醇，均未见有明显的影响。

【药物相互作用】右丙亚胺不影响阿霉素的药代动力学。

【药物过量】在临床研究过程中没有观察到右丙亚胺过量的情况，对心脏保护性试验中的右丙亚胺的用到的最大剂量为1000mg/m²，每周3次。

未在透析的癌症患者中进行右丙亚胺的药代动力学研究，但在血浆中观察到未经转化右丙亚胺明显滞留（>0.4），最小的组织分布或结合，系统未结合的药物水平大于90%，这提示可用常规的腹膜或血液透析方法来处置右丙亚胺。

右丙亚胺的解毒剂尚不清楚。对怀疑右丙亚胺过量患者，可采取支持疗法，以改善骨髓抑制和其他相关病情控制。对右丙亚胺过量的处理应包括控制感染、体液调节及补充必须的营养。

【不良反应】右丙亚胺可引注射部位疼痛。患者用FAC方案（氟尿嘧啶、阿霉素、环磷酰胺）加右丙亚胺比不加右丙亚胺更多引起严重粒细胞减少，血小板减少，但两组恢复是相同的。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用右丙亚胺	化学药	HZ0005129

HY002565　右吗拉胺

【外文名称】Dextromoramide

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】本品为镇痛药，适用于中度及重度疼痛。长期服用可产生吗啡类药物的依赖性。国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品。

HY002566　右旋布洛芬

【其他名称】右布洛芬

【外文名称】Dexibuprofen

药物理化信息

【化学名】*S*（+）-2（4-isobutylphenyl）Propionic Acid

药物药理信息

【药理毒理】右旋布洛芬为非甾体类消炎药，主要是抑制环氧化酶及前列腺素的合成而达到抗炎、镇痛作用，并通过下丘脑体温调节中心而起解热作用。

1. 右旋布洛芬是非甾体抗炎药布洛芬的纯空间对应体，疗效确切、毒性及不良反应小。

2. 其活性是其左旋体的160倍，是消旋体的1.6倍。

【药代动力学】本品口服易吸收，与食物同服用时吸收减慢，但吸收量不减少，与含铝和镁的抗酸药同服不影响吸收。血浆蛋白结合率为99%。服药后1.0~1.8小时血药浓度达峰值，用量300mg，最大血药浓度为15.8~21.6μg/ml，一次给药后 $t_{1/2}$ 一般为1.7~2.7小时。

本品在肝内代谢，60%~90%经肾由尿排出，约100%于24小时内排出，其中约1%为原形物，一部分随粪便排出。

【不良反应】消化道症状，神经系统症状，肾功能不全很少见。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
右旋布洛芬胶囊	化学药	HZ004588
右旋布洛芬片	化学药	HZ004589

HY002567　右旋芬氟拉明

【外文名称】Dexfenfluramine

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

药物药理信息

【药理毒理】本品作用同芬氟拉明，但活性较强，服用剂量较小。能选择性抑制葡萄糖的消耗，从而降低总热卡消耗，但不影响蛋白质的摄入。没有精神兴奋作用及升血压作用，亦无成瘾性。临床适用于各种肥胖症。

HY002568　右旋甲状腺素钠

【外文名称】Dextrothyroxine Sodium

【性状及组成】本品为浅黄色粉末，无臭、无味。微溶于水或乙醇，溶于氢氧化碱溶液及热碳酸碱溶液。饱和水溶液的pH为8.9。遇光色变深。

药物药理信息

【药理毒理】本品为人工合成品，天然的甲状腺素为左旋者，虽可降低血浆胆固醇含量，但对代谢的影响甚大。人工合成的右旋甲状腺素，虽其降低胆固醇作用仅为左旋者的1/5，但其影响代谢的作用亦仅为左旋者的1/10~1/20。

能促进胆固醇转化为胆酸而排泄，并加速低密度脂蛋白（LDL）的分解，从而降低血浆中的胆固醇和LDL水平。适用于Ⅰ、Ⅱ型高脂蛋白血症，尤以Ⅱ型者为佳。

【不良反应】

1. 不良反应类似甲状腺功能亢进症状。也可能出现神经过敏，失眠，震颤，多汗。长期应用还可出现心律失常。

2. 对碘过敏者服后可能出现皮疹和瘙痒。

HY002569　右旋糖酐20

【外文名称】Dextran 20

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】右旋糖酐20

【分子量】20000.00

【性状及组成】本品系蔗糖经肠膜状明串珠菌L.-M-1226号菌发酵后生成的高分子葡萄糖聚合物，经处理精制而得。右旋糖酐20的重均分子量应为16000~24000。

本品为白色粉末，无臭，无味。

本品在热水中易溶，在乙醇中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并稀释成每 1ml 中约含 10mg 的溶液，在 25℃时依法测定，比旋度为 + 190°至 + 200°。

药物药理信息

【药理毒理】本品为血容量扩充剂，静注后能提高血浆胶体渗透压，吸收血管外水分进入体循环而增加血容量，升高和维持血压。其扩充血容量作用比右旋糖酐 70 弱且短暂，但改善微循环的作用比右旋糖酐 70 强。它可使已经聚集的红细胞和血小板解聚，降低血液黏滞性，改善微循环，防止血栓形成。此外，还具有渗透性利尿作用。

本品具有强抗原性。鉴于正常肠道中有产生本品的细菌，因此，即使初次注射本品，部分病人也有过敏反应发生。主要为皮肤、黏膜过敏反应。

【药代动力学】本品在体内停留时间较短，静注后立即开始从血液中通过肾脏排出体外，用药后经肾脏排出，少部分进入胃肠道，从粪便中排出。体内存留部分经缓慢氧化代谢。

【药物相互作用】

1．与肝素合用时，由于有协同作用而增加出血可能。

2．与庆大霉素、巴龙霉素合用会增加肾毒性。

【药物过量】本品过量可出现低蛋白血症、出血倾向等。

【不良反应】

1．过敏反应：少数患者可出现过敏反应，表现为皮肤瘙痒、荨麻疹、恶心、呕吐、哮喘，重者口唇发绀、虚脱、血压剧降、支气管痉挛，个别患者甚至出现过敏性休克，直至死亡。过敏反应的发生率约 0.03% ~ 4.7%。过敏体质者用前应做皮试。

2．偶见发热、寒战、淋巴结肿大、关节炎等。

3．出血倾向：可引起凝血障碍，使出血时间延长，该反应常与剂量有关。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
右旋糖酐 20 氯化钠注射液	化学药	HZ004590
右旋糖酐 20 葡萄糖注射液	化学药	HZ004591

HY002570 右旋糖酐 40

【外文名称】Dextran 40

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】右旋糖酐 40

【分子量】40000.00

【性状及组成】本品系蔗糖经肠膜状明串珠菌 L. M - 1226 号菌发酵后生成的高分子葡萄糖聚合物，经处理精制而得。右旋糖酐 40 的重均分子量应为 32000 ~ 42000。

本品为白色粉末；无臭，无味。

本品在热水中易溶，在乙醇中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并稀释成每 1ml 中约含 10mg 的溶液，在 25℃时依法测定，比旋度为 + 190°至 + 200°。

药物药理信息

【药理毒理】本品为血容量扩充剂，静注后能提高血浆胶体渗透压，吸收血管外水分进入体循环而增加血容量，升高和维持血压。其扩充血容量作用比右旋糖酐 70 弱且短暂，但改善微循环的作用比右旋糖酐 70 强。它可使已经聚集的红细胞和血小板解聚，降低血液黏滞性，改善微循环，防止血栓形成。此外，还具有渗透性利尿作用。

本品具有强抗原性。鉴于正常肠道中有产生本品的细菌，因此，即使初次注射本品，部分病人也有过敏反应发生。主要为皮肤、黏膜过敏反应。

【药代动力学】本品在体内停留时间较短，静注后立即开始从血液中通过肾脏排出体外，用药 1 小时内经肾脏排出 50%，24 小时排出 70%，少部分进入胃肠道，从粪便中排出。体内存留部分经缓慢氧化代谢，$t_{1/2}$约为 3 小时。

【药物相互作用】

1．肝素合用时，由于有协同作用而增加出血可能。

2．与庆大霉素、巴龙霉素合用会增加肾毒性。

【药物过量】本品过量可出现低蛋白血症、出血倾向等。

【不良反应】

1．过敏反应：少数患者可出现过敏反应，表现为皮肤瘙痒、荨麻疹、恶心、呕吐、哮喘，重者口唇发绀、虚脱、血压剧降、支气管痉挛，个别患者甚至出现过敏性休克，直至死亡。过敏反应的发生率约 0.03% ~ 4.7%。过敏体质者用前应做皮试。

2．偶见发热、寒战、淋巴结肿大、关节炎等。

3．出血倾向：可引起凝血障碍，使出血时间延长，该反应常与剂量有关。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
低分子右旋糖酐氨基酸注射液	化学药	HZ000673
复方右旋糖酐 40 注射液	化学药	HZ001479

续表

制剂名称	类别	序号
右旋糖酐40氯化钠注射液	化学药	HZ004592
右旋糖酐40葡萄糖注射液	化学药	HZ004593
注射用三磷酸腺苷辅酶胰岛素	化学药	HZ004953
消痔灵注射液	中成药	ZC006143

HY002571　右旋糖酐70

【外文名称】Dextran 70

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】右旋糖酐70

【分子量】70000.00

【性状及组成】本品系蔗糖经肠膜状明串珠菌L.-M-1226号菌发酵后生成的高分子葡萄糖聚合物，经处理精制而得。右旋糖酐70的重均分子量为64000~76000。

本品为白色粉末；无臭、无味。

本品在热水中易溶，在乙醇中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并稀释成每1ml中约含10mg的溶液，在25℃时依法测定，比旋度为+190°至+200°。

药物药理信息

【药理毒理】本品为血容量扩充剂，静注后能提高血浆胶体渗透压，吸收血管外水分而增加血容量，升高和维持血压。血浆容量的增加与右旋糖酐的输入量有关。但其扩充血容量作用较右旋糖酐40强，几无改善微循环及渗透性利尿作用。此外，本品还可使某些凝血因子及血小板的活性降低、因而还有一定的抗血栓作用。

本品具有强抗原性。鉴于正常肠道中有产生本品的细菌，因此，即使初次注射本品，部分病人也有过敏反应发生。主要为皮肤、黏膜过敏反应。

【药代动力学】静脉注入后，本品血中浓度在最初3~4小时内下降较迅速，以后下降缓慢，在血循环中存留时间较长，部分暂时贮存于网状内皮系统被逐渐代谢成葡萄糖为机体利用。本品部分以原形经肾排泄，1小时排出30%，24小时60%，仅少量由肠道排泄。

【药物相互作用】

1．与肝素合用时，由于有协同作用而增加出血可能。

2．与庆大霉素、巴龙霉素合用会增加肾毒性。

【药物过量】本品过量可出现低蛋白血症、出血倾向等。

【不良反应】

1．过敏反应：少数患者可出现过敏反应，表现为皮肤瘙痒、荨麻疹、恶心、呕吐、哮喘，重者口唇发绀、虚脱、血压剧降、支气管痉挛，个别患者甚至出现过敏性休克，直至死亡。过敏反应的发生率约0.03%~4.7%。

2．偶见发热、寒战、淋巴结肿大、关节炎等。

3．出血倾向：可引起凝血障碍，使出血时间延长，该反应常与剂量有关。

4．红细胞聚集作用：随着右旋糖酐的分子量加大，红细胞聚集更多更明显。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
右旋糖酐70滴眼液	化学药	HZ004594
右旋糖酐70氯化钠注射液	化学药	HZ004595
右旋糖酐70葡萄糖注射液	化学药	HZ004596
注射用亚锡大分子右旋糖酐	化学药	HZ005026

HY002572　右旋糖酐硫酸酯钠

【其他名称】脉力寿、舒脉、糖酐酯

【外文名称】Dextran Sulfate Sodium

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第13册

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末，有吸湿性、易溶于水，水溶液呈微酸性（pH5.0~7.5）。

药物药理信息

【药理毒理】本品为降血脂及防治动脉粥样硬化的药物，具有降低血中胆固醇、活化组织及血液中脂蛋白酯酶、增强纤维蛋白溶解活性、防止纤维蛋白沉积、改善血管壁通透性等作用。临床用于高血脂症（Ⅱa及Ⅱb型）、动脉粥样硬化，对由于各种动脉硬化症引起的头痛、头重、眩晕、耳鸣、肩肌僵硬、气喘、心悸、胸闷、手颤等症状有明显改善。此外亦可用于急慢性肝炎、糖尿病性视网膜症等。

HY002573　右旋糖酐铁

【外文名称】Iron Dextran

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】右旋糖酐铁

【性状及组成】本品为氢氧化铁与重均分子量5000~7500的右旋糖酐的络合物。按干燥品计算，含铁（Fe）应不少25.0%。

本品为棕褐色或棕黑色结晶粉末；无臭。

本品在热水中略溶，在乙醇中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为抗贫血药。铁为血红蛋白及肌红蛋白的主要组成成分。血红蛋白为红细胞中主要携氧者。肌红蛋白系肌肉细胞贮存氧的部位，以助肌肉运动时供氧需要。与三羧酸循环有关的大多数酶均含铁，或仅在铁存在时才能发挥作用。所以对缺铁患者积极补充铁剂后，除血红蛋白合成加速外，与组织缺铁和含铁酶活性降低的有关症状如生长迟缓、行动异常、体力不足、黏膜组织变化以及皮肤指甲病变也均能逐渐得以纠正。

【药代动力学】本品由于分子较大，须由淋巴管吸收再转入血液，所以注射后血浓度提高较慢，约24~48小时血药浓度达高峰。铁吸收后与转铁蛋白结合在血中循环，以供造红细胞之用，也可以铁蛋白或含铁血黄素形式累积在肝、脾、骨髓及其他网状内皮组织。铁在人体中每日排泄极微量，见于尿、粪、汗液、脱落的肠黏膜细胞及酶内，丧失总量为0.5~1.0mg。

【药物相互作用】

1. 维生素C与本品同服，有利于本品吸收。

2. 本品与磷酸盐类、四环素类及鞣酸等同服，可妨碍铁的吸收。

3. 本品可减少左旋多巴、卡比多巴、甲基多巴及喹诺酮类药物的吸收。

【不良反应】本品注射后，可产生局部疼痛及色素沉着。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
右旋糖酐铁片	化学药	HZ004597
右旋糖酐铁注射液	化学药	HZ004598

HY002574 右旋酮洛芬氨丁三醇

【外文名称】Dexketoprofen Trometamol

药物理化信息

【化学名】（+）-（S）-α-甲基-3-苯甲酰基-苯乙酸·α-氨基-2（羟甲基）-1,3-丙二醇盐

【分子式】$C_{20}H_{25}NO_6$

【分子量】375.43

药物药理信息

【药理毒理】右旋酮洛芬氨丁三醇为非甾体抗炎药，具有抗炎，镇痛，解热作用，其作用机制可能与抑制前列腺素合成有关。

【药代动力学】文献报道，本品可在肠胃道快速和完全吸收，食物影响其生物利用度。健康受试者单次服用12.5mg或25mg，可在0.25~0.75小时血药浓度达峰值，峰浓度分别为1.4mg/L和3.1mg/L。本品在血浆中主要以原形药、羟化代谢物和相应的葡萄糖苷酸代谢物的形式存在。约70%~80%的药物主要以葡萄糖醛酸结合物形式在服药后12小时从尿中排泄。

【药物相互作用】

1. 饮酒或与其他非甾体抗炎药同时增加胃肠道不良反应及出血倾向。长期与对乙酰氨基酚同用时可增加对肾脏的毒性及不良反应。

2. 与肝素，双香豆素等抗凝药及血小板聚集抑制药同时有增加出血的危险。

3. 与呋塞米同用时，后者的排钠和降压作用减弱。

4. 与维拉帕米，硝苯地平同用时，本品的血药浓度增高。

5. 本品可增高地高辛的血浓度，同用时须注意调整地高辛的剂量。

6. 本品可增强口服抗糖尿病药的作用。

7. 本品与抗高血压药同用时可影响后者的降压效果。

8. 本品不应与丙磺舒同用，因后者可明显降低本品肾脏清除率（降低66%）和蛋白结合率（降低28%），导致血药浓度增高，而有引起中毒的危险。

9. 本品可降低甲氨蝶呤的排泄，增高其血浓度，甚至可达中毒水平，故本品不应与中或大剂量甲氨蝶呤同用。

【药物过量】服用常规剂量的5~10倍可导致嗜睡，恶心，呕吐和上腹部疼痛。大剂量的右旋酮洛芬可引起呼吸抑制和昏迷。胃肠道出血，低血压，高血压或急性肾功能衰竭也可发生，但较少见。服药超量时应作紧急处理，包括催吐或洗胃，口服活性炭，抗酸药或（和）利尿剂，并给予监测及其他支持治疗。

【不良反应】服用后最常见的不良反应是胃烧灼感，胃痛，头痛及眩晕，偶见恶心，呕吐，腹泻，便秘，瘙痒，心悸，失眠，寒战，四肢水肿及皮疹等，多为轻，中度。极少出现或偶尔复发胃十二指肠溃疡和消化道出血。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
右旋酮洛芬氨丁三醇片	化学药	HZ004599

HY002575　鱼肝油

【外文名称】Cod Liver Oil

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

【性状及组成】本品系自鲛类动物 Squalidae 等无毒海鱼肝脏中提出的一种脂肪油，在 0℃左右脱去部分固体脂肪后，用精炼食用植物油、浓度较高的鱼肝油或维生素 A 与维生素 D_3 调节浓度，再加适量的稳定剂制成。每 1g 含维生素 A1500 单位与维生素 D150 单位。

本品为黄色至橙红色的澄清液体；微有特异的鱼腥臭，但无败油臭。

药物药理信息

【药理毒理】维生素类药。维生素 A 缺乏引起的干眼病、Bitot 斑、角膜软化和夜盲症；妊娠或哺乳妇女、饮食习惯不良、接受胃肠道外营养、严重营养不良；肝功能损害、肝硬化、阻塞性黄疸；严重蛋白质缺乏等。

【药代动力学】维生素 A 口服易吸收，胆汁酸、胰腺酶、中性脂肪、维生素 E 均促进维生素 A 的吸收，吸收部位主要在十二指肠、空肠。正常情况下，体内维生素 A<5%与血浆脂蛋白结合，大量摄入维生素 A 时，肝内贮存已达饱和，蛋白结合率可达 65%。维生素 A 自肝内释放后与视网膜的视蛋白结合成视紫红质。维生素 A 在肝内代谢，随粪便排出，少量由乳汁排出。

维生素 D 由小肠吸收，维生素 D 的吸收需胆盐与特殊 α 球蛋白结合后转运到身体其他部位，贮蓄于肝和脂肪。维生素 D $t_{1/2}$为 19～48 小时，在脂肪组织内可长期贮存；其作用开始时间为 12～24 小时，治疗效应需 10～14 天，作用持续时间最长 6 个月，重复剂量有累积作用。

【药物相互作用】

1. 口服避孕药可提高血浆维生素 A 的浓度。

2. 与维生素 E 同用，可增加维生素 A 的吸收，增加其肝内贮存量，加速利用和降低毒性，但大量维生素 E 可消耗维生素 A 在体内的贮存。

3. 大量维生素 A 与抗凝药（如香豆素或茚满二酮衍生物）同服，可导致凝血酶原降低。

4. 考来烯胺、矿物油、新霉素、硫糖铝能干扰本品中维生素 A 的吸收。

5. 抗酸药（如氢氧化铝）可影响本品中维生素 A 的吸收，故不应同服。

6. 不应与含有大量镁、钙的药物合用。以免引起高镁、高钙血症。

【药物过量】

1. 维生素 A 中毒，发病缓慢，常见症状为毛发脱落、皮肤干燥、奇痒、食欲减退、脂溢性皮炎、容易激动、口角皲裂、肝脾肿大及颅压增高等症状。

2. 维生素 D 中毒，常表现为食欲减退、恶心呕吐、血钙过高、肾功能减退等。

3. 发生鱼肝油中毒现象，应立即停药，并去医院诊治。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方鱼肝油氧化锌软膏	化学药	HZ001480
九维鱼肝油乳	化学药	HZ001967
葡萄糖鱼肝油乳	化学药	HZ002913
三维鱼肝油乳（成人）	化学药	HZ003164
三维鱼肝油乳（儿童）	化学药	HZ003165
参芪鱼肝油凝胶	化学药	HZ003192
鱼肝油乳	化学药	HZ004601
强力蜂乳浆胶丸	中成药	ZC003971

HY002576　鱼肝油酸钠

【外文名称】Morrhuate Sodium

药物药理信息

【药理毒理】本品局部注射后可刺激血管内膜，促使其增生、逐渐闭塞血管使之硬化。本品对凝血无直接作用，但与钙离子有亲和力，易形成钙皂，从而激活内源性凝血机制，加速血液的凝结。它也能导致静脉内膜的内皮细胞损伤及脱落，使静脉腔内形成混合血栓而有利于止血。还能诱导血小板聚集，使受损的血管裂口封堵，促使血液流速变慢而瘀滞。本品对黏膜创口及一般创口均有止血作用。

【不良反应】偶有引起皮疹等不良反应，也可引起注射区疼痛、肿胀不适。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
鱼肝油酸钠溶液	化学药	HZ004602
鱼肝油酸钠注射液	化学药	HZ004603

HY002577　鱼石脂

【其他名称】Ammoni Ichthyolsulfonas、Bituminol、磺基鱼石油酸铵、磺基鱼石脂铵、依比、依克度、鱼石磺酸铵、鱼石硫酸铵

【外文名称】Ichthammol

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

【性状及组成】本品是由含沥青的油岩干馏所得的焦油，为棕黑色的黏稠性液体；有特臭。

本品在水中溶解，易在甘油中溶解，在乙醇和乙醚中部分溶解。

本品按干燥品计算，含有机硫（S）不得少于 10.5%，含无机硫（S）不得过总硫量的 25.0%。

药物药理信息

【药理毒理】本品为酚类防腐药，有温和的防腐和刺激作用，有抑菌、消炎、止痒、抑制分泌及消肿等作用。治疗各种皮肤炎症及软组织炎症、脓肿、疮疖等。

【药物相互作用】鱼石脂遇酸生成树脂状团块，与氢氧化碱、碳酸碱配合可放出氨气，故忌与酸、碱、生物碱和铁盐等配合，当受高热时易膨胀炭化，在制备制剂时应注意。

【不良反应】本品对皮肤有轻微的刺激，偶尔可致接触性皮炎。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
鱼石脂颠茄软膏	化学药	HZ004604
鱼石脂软膏	化学药	HZ004605

HY002578 鱼腥草素钠

【其他名称】合成鱼腥草素

【外文名称】Sodium Houttuyfonate

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第 1 册

药物理化信息

【化学名】癸酰乙醛亚硫酸氢钠

【分子式】$C_{12}H_{23}NaO_5S$

【分子量】302.36

【性状及组成】本品为癸酰乙醛的亚硫酸氢钠加成物。

本品为白色或类白色的针状或鳞片状结晶，或结晶性粉末；有微臭，遇水有特殊的鱼腥臭。

本品在热水中易溶，在水或乙醇中微溶，在三氯甲烷或苯中几乎不溶；在氢氧化钠溶液中易溶，但同时分解。

熔点：本品的熔点为 164 ~ 167℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】本品为三白草蕺菜属植物鱼腥草的主要有效成分和亚硫酸氢钠加成物，对细菌只有微弱的抗菌作用，对金黄色葡萄球菌、流感嗜血杆菌、白念珠菌等有一定抑制作用。

本品有提高血清备解素水平，增强白细胞吞噬能力的作用。

合成鱼腥草素为癸酰乙醛的亚硫酸氢钠加成物，性质稳定，保留了鱼腥草素的抗菌作用，对金黄色葡萄球菌及其耐药菌株、肺炎链球菌、甲型链球菌、流感杆菌、卡他球菌、伤寒杆菌以及结核杆菌等均有不同程度的抑制作用，对金黄色葡萄球菌及其耐药菌株的最小抑菌浓度（MIC）为 62.5 ~ 80μg/ml。

合成鱼腥草素能提高血清备解素的水平，用于慢性气管炎患者可观察到它能提高患者白细胞的吞噬功能，给药 4 日后与给药前比较，血清备介素量成倍增加。

合成鱼腥草素小鼠灌胃给药 LD_{50}为 1.6 ± 0.081g/kg，静脉注射每日 75 ~ 90mg/kg，约相当于人用量 200 倍，连续 7 日，未致死，解剖检查也未见异常变化。合成鱼腥草素体外实验有一定溶血作用，加入血清则此作用减弱或消失，体内应用未见溶血，可能因血清产生的保护作用。

【药代动力学】合成鱼腥草素给大鼠灌服，在胃肠道中半衰期为 3.5 小时，大鼠静注 20 分钟后，药物分布以肺最多，因此可能有利于对呼吸系统疾病的治疗，其次为心、肝、肾，血清内含量很低。在组织中代谢消除较快，2 小时后各组织已查不到药物存在。离体温孵也证明各种组织均能迅速使药物转化。尿中未能测得药物，表明药物主要在体内代谢消除。

【不良反应】不良反应少，个别有胃肠道反应。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方氯丙那林鱼腥草素钠片	化学药	HZ001295
鱼腥草素钠片	化学药	HZ004606
鱼腥草素钠栓	化学药	HZ004607
苍鹅鼻炎片	中成药	ZC000472
复方四季青片	中成药	ZC001527
化痰消咳片	中成药	ZC002227
芒果止咳片	中成药	ZC003522
热毒平胶囊	中成药	ZC004283
消痰咳片	中成药	ZC006112

HY002579　鱼油

【外文名称】Fish Oil

药物药理信息

【药理毒理】本品为不饱和脂肪酸，通过与胆固醇结合成酯、进而降解为胆酸排出。具有显著的降低血中胆固醇、甘油三酯及升高高密度脂蛋白的作用。并有抗血小板聚集、抗凝血作用、能预防血栓性疾病的发生。

本品能透过血脑屏障，对神经传导、对自身免疫性肾病的防护及抗炎都有一定的作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
维E三油胶丸	化学药	HZ003525
ω-3鱼油脂肪乳注射液	化学药	HZ004608

HY002580　玉米朊

【外文名称】Zein

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

【性状及组成】本品为黄色或淡黄色薄片，一面具有一定的光泽，无臭，无味。

本品在80%～92%乙醇或70%～80%丙酮中易溶，在水或无水乙醇中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】药用辅料。

HY002581　玉米油

【其他名称】精制玉米油

【外文名称】Refined Corn Oil

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

【性状及组成】本品系由植物玉蜀黍种子的胚芽，用热压法制得的脂肪油。

本品为淡黄色澄明油状液体；味淡，微有特殊臭味。

本品在乙醇中微溶，可与乙醚、三氯甲烷、石油醚、丙酮混溶。

相对密度：0.915～0.923。

折光率：1.472～1.475。

碘值：应为108～128。

皂化值：应为187～195。

药物药理信息

【药理毒理】本品作为高血压及高血脂症的食用油。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肠内营养粉剂（TP）	化学药	HZ000518
蛾贞胶丸	中成药	ZC000982

HY002582　育亨宾碱

【其他名称】安慰乐得、Corynine、萎必治、Yocon、Yohimbine

【外文名称】Aphrodyne

药物药理信息

【药理毒理】育亨宾是从茜草科柯楠树皮提炼出来的。最早用来治疗抑郁症的，在治疗抑郁症的过程中发现有催欲的作用。后来经过医药专家的验证，育亨宾具有治疗男性勃起功能障碍（ED）的作用，还是最早美国FDA批准上市的药物之一。

本品能选择性地阻断突触前的α_2-受体，促进去甲肾上腺素的释放。它使海绵体神经末梢释放较多的去甲肾上腺素，减少阴茎静脉回流，利于充血勃起。少量应用时，可使会阴部肿胀，刺激脊髓勃起中枢而使性功能亢进。盐酸育亨宾还能产生心理上的兴奋作用，增加性欲。可用于功能性阳痿。

【药代动力学】盐酸育亨宾溶于水，吸收速度快，生物半衰期$t_{1/2}$=0.5小时（口服）、0.68小时（静注）静注后药物在体内的经时过程符合二室模型。清除率为55.9ml/mim·kg（口服）和9.77ml/min·kg（静注），静注后快速进入脑中，药物主要在肝中代谢，此外还有肝外代谢途径，尿中约有0.5%～1%的原型药物排泄。

【药物相互作用】本品具有单胺氧化酶抑制剂作用，故在用药期间避免使用去氧肾上腺素及苯丙醇胺也避免食用含酪胺丰富的食物。利尿类抗高血压药氢氯噻嗪、呋塞米等，在降压同时，排出大量尿液，降低对膀胱三角区的刺激阈值，不利于阳痿治疗，应注意改变服药方法或改用其他抗高血压药。

【不良反应】心悸、亢进、不眠症、眩晕、直立性低血压、鼻塞、恶心、腹泻、神经质躁动、失眠（临床出现率高）、头痛、面部潮红、食欲减退、胃部不适、心跳加速、排尿困难、背痛、生殖器痛、血压增高（临床出现率较高）过敏性皮疹、特别是对心脏、肾的不良反应更大，甚至会威胁到心脏病患者及肾功能不全者的生命安全。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
盐酸育亨宾片	化学药	HZ004378
盐酸育亨宾注射液	化学药	HZ004379

HY002583 预胶化淀粉

【外文名称】Pregelatinized Starch

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】预胶化淀粉

【分子式】$(C_6H_{10}O_5)_n$（n = 300 ~ 1000）

【性状及组成】本品系通过物理方法加工制成，改善其流动性和可压性的淀粉。

本品为白色粉末，无臭、无味。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料，赋形剂。

预胶化淀粉是改型淀粉，主要用作片剂、丸剂、颗粒剂的填充剂、黏合剂，直接压片的黏合剂、崩解剂。

与淀粉比较，预胶化淀粉能增加流动性与可压性，用于干法压片工艺中用作黏合剂，其中，预胶化淀粉起到自润滑剂作用。与其他辅料合用时，还需要加入润滑剂，一般加入 0.25%（W/W）硬脂酸镁。用量太大对于片剂强度和溶出度不利。因此，一般最好用硬脂酸来润滑预胶化淀粉。

【不良反应】预胶化淀粉及淀粉广泛用于口服固体药物制剂中，预胶化淀粉无毒、无刺激性，但大量口服有害。另见淀粉品目。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
胆黄片	中成药	ZC000763

HY002584 愈创木酚甘油醚

【其他名称】愈创甘油醚

【外文名称】Guaifenesin

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第 1 册

药物理化信息

【化学名】3 - （2 - 甲氧基苯氧基） - 1,2 - 丙二醇

【分子式】$C_{10}H_{14}O_4$

【分子量】198.22

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，微有特臭，味微苦。

本品在乙醇或三氯甲烷中易溶，在水或丙二醇中略溶。

熔点：78 ~ 82℃。

吸收系数：取本品，精密称定，加无水乙醇制成每 1ml 含 40μg 的溶液，照分光光度法，在 275 ± 1nm 的波长处测定吸光度，按干燥品计算，吸收系数（$E^{1\%}_{1cm}$）为 117 ~ 123。

药物药理信息

【药理毒理】本品口服后刺激黏膜，反射性地引起呼吸道浆液腺分泌较稀的液体，使呼吸道浓稠黏液减除表面张力，吸收水分，润湿气管，去除黏膜刺激，使黏痰稀薄，易于咳出。另外，浆液腺分泌物又可覆盖在发炎的支气管黏膜表面，减少外界对黏膜的刺激而减轻咳嗽。

【不良反应】服用后可引起恶心、食欲减退、胃肠不适等症状。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氨咖愈敏溶液	化学药	HZ000231
氨愈美麻片	化学药	HZ000251
茶碱愈创甘油醚软胶囊	化学药	HZ000508
茶愈胶囊	化学药	HZ000510
酚美愈伪麻分散片	化学药	HZ000929
酚美愈伪麻口服溶液	化学药	HZ000930
复方氨酚美沙糖浆	化学药	HZ001033
复方福尔可定口服溶液	化学药	HZ001170
复方福尔可定糖浆	化学药	HZ001171
复方甘草口服溶液	化学药	HZ001173
复方甲麻黄碱口服溶液	化学药	HZ001222
复方桔梗枇杷糖浆	化学药	HZ001237
复方氢溴酸右美沙芬胶囊	化学药	HZ001348
复方氢溴酸右美沙芬糖浆	化学药	HZ001349
复方盐酸异丙肾上腺素气雾剂	化学药	HZ001466
复方愈酚麻黄糖浆	化学药	HZ001482
复方愈酚喷托那敏糖浆	化学药	HZ001483
可愈糖浆	化学药	HZ002093
美酚伪麻片	化学药	HZ002631
美愈伪麻胶囊	化学药	HZ002659
美愈伪麻颗粒	化学药	HZ002660

续表

制剂名称	类别	序号
美愈伪麻口服溶液	化学药	HZ002661
小儿愈美那敏溶液	化学药	HZ003782
右美沙芬愈创甘油醚糖浆	化学药	HZ004587
愈创甘油醚颗粒	化学药	HZ004610
愈创甘油醚片	化学药	HZ004611
愈创甘油醚糖浆	化学药	HZ004612
愈创维林那敏片	化学药	HZ004613
愈酚茶碱那敏片	化学药	HZ004614
愈酚甲麻那敏分散片	化学药	HZ004616
愈酚甲麻那敏糖浆	化学药	HZ004617
愈酚维林片	化学药	HZ004619
愈酚伪麻待因口服溶液	化学药	HZ004620
愈酚伪麻颗粒	化学药	HZ004621
愈酚伪麻片	化学药	HZ004622
愈美分散片	化学药	HZ004623
愈美缓释片	化学药	HZ004624
愈美甲麻敏糖浆	化学药	HZ004625
愈美胶囊	化学药	HZ004626
愈美颗粒	化学药	HZ004627
愈美片	化学药	HZ004628

HY002585　愈创木酚磺酸钾

【其他名称】磺酸钾知阿可尔

【外文名称】Kalii Guaiacolsulfonas

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第1册

【分子式】$C_7H_7KO_5S$

【分子量】242.29

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，微带香气，味先苦后甜；水溶液显中性或微碱性反应。

本品在水中易溶，在乙醇或乙醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】愈创木酚磺酸钾为刺激性祛痰药，促进支气管分泌，使痰液变稀易于咳出，尚有微弱抗炎作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方氨酚甲麻口服液	化学药	HZ001031
复方桔梗氯化铵口服溶液	化学药	HZ001233
复方可待因口服溶液	化学药	HZ001252
复方愈创木酚磺酸钾口服溶液	化学药	HZ001481
愈酚待因口服溶液	化学药	HZ004615
愈酚喷托异丙嗪颗粒	化学药	HZ004618

HY002586　月桂氮䓬酮

【其他名称】Azone、氮酮

【外文名称】Laurocapram

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】1－十二烷基－六氢－2H－氮杂䓬－2－酮

【分子式】$C_{13}H_{15}NO$

【分子量】281.48

【性状及组成】本品为无色透明的黏稠液体；几乎无臭，无味。

本品在无水乙醇、乙酸乙酯、乙醚、苯及环己烷中极易溶解，在水中不溶。

相对密度：0.906～0.926。

折光率：1.470～1.473。

黏度：本品的运动黏度（毛细管内径1.2mm±0.05mm），在25℃时为32～34m /s。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：药用辅料，皮肤渗透促进剂。

本品为非极性透皮促进剂，作用机制被认为是使角质软化，凝固组织蛋白，增强通透性，使药物透过皮肤屏障，提高局部或全身性血药浓度，提高制剂的生物利用度，从而获得更为理想的治疗目的。

据报道，本品对很多亲脂性和亲水性药物均有透皮促进作用，如红霉素、氯霉素、头孢西丁、甲硝唑、阿司匹林、水杨酸、雌二醇、睾丸素、强的松龙、可乐定、硝酸异山梨醇酯硝苯吡啶等等。本品对药物的透皮促进作用与药物浓度近乎成反比，当药物浓度低尚能发挥较佳的透皮促进作用，药物浓度增高其作用反而降低。产生最佳透皮促进作用所需本品的浓度因药物而异。对有些药物的透皮促进作用随本品浓度的增加而增加，但有一定极限，对这类药物，应选择产生略低于最大透皮促进作用的浓度；对另一些药物，本品浓度对促进作用成抛

物线，本品在一定浓度范围内具有最佳促进作用，以后，随着本品浓度的增加反而降低。所以，药物浓度、本品浓度，特别是后者是影响透皮作用效果的重要因素，处方中其他组分对透皮促进作用也有较大的影响，一般来讲，处方中含有其他类别的透皮促进剂可起到协同促进作用，但凡士林则会降低甚至抵消本品的刺进作用，其他成分含量较多会降低本品的促进作用。

本品可用于配制喷雾剂（驱虫、杀虫）、气雾剂、溶液剂、洗剂、搽剂、乳剂、霜计、软膏剂、栓剂、涂膜剂、膜剂、贴布剂等剂型中外用制剂的透皮促进剂。使用浓度为0.1%～10%，常用浓度为0.5%～2%，发挥透皮促进作用的滞留时间和流量与本品浓度近乎成正比，但当浓度在0.5%以上时，滞留时间的延长已不显著；浓度在2%以上时，流量增加已不显著。

【药物相互作用】本品不宜与强酸性药物配伍。不能与凡士林、聚羟乙基氢化蓖麻油酯配伍，否则会减弱甚至会抵消本品的透皮促进作用。

【不良反应】本品为无毒、安全的高效透皮促进剂。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方醋酸曲安奈德溶液	化学药	HZ001122
肝素钠乳膏	化学药	HZ001578
消痔洁肤软膏	民族药	MZ000669
百宝丹搽剂	中成药	ZC000178
冰栀伤痛气雾剂	中成药	ZC000371
貂油治裂软膏	中成药	ZC000857
络通酊	中成药	ZC003452
乳香风湿气雾剂	中成药	ZC004398
麝香祛风湿油	中成药	ZC004708
特制狗皮膏	中成药	ZC005422
天和追风膏	中成药	ZC005432
肇宁软膏	中成药	ZC007175

HY002587 月见草油

【外文名称】Oenothera Biennis Oil

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第7册

药物理化信息

【化学名】全顺式6，9，12－十八碳三烯酸。

【性状及组成】本品为柳叶菜科草本植物月见草种子制取的脂肪油。

本品主要成分为γ－亚麻酸，化学名称为：全顺式6，9，12－十八碳三烯酸。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理：本品含有丰富的γ－亚麻酸（GLA），可转化为PEG2、PGI2、PGF2a，具有明显的降血脂和抗血小板聚集作用。γ－亚麻酸具有明显的降胆固醇功效，其效力为亚油酸的163倍。月见草油可使高脂大鼠血清总胆固醇、低密度脂蛋白胆固醇、极低密度脂蛋白胆固醇降低，同时使高密度胆固醇水平显著升高。高密度脂蛋白胆固醇的变化是由于高密度脂蛋白亚组分胆固醇水平升高，高密度脂蛋白亚组分外胆固醇水平无显著改变。给Wistar大鼠灌服高血脂造型剂或乙硫酸造成高血脂病理模型，结果表明，月见草油及其钠盐具有较强的降血脂及抗动脉粥样硬化作用。

本品能参与前列腺素的合成和平衡。尚能明显抑制血小板聚集和血小板合成血栓素A2（TXA2）的作用。亚麻酸对棕色脂肪组织有刺激作用，促进棕色脂肪酸线粒体的活性，消耗过多的热量而达到一定的减肥效果。

2．毒理：月见草油急性毒性试验未能求出小鼠LD_{50}，对家兔按每日3g/kg，每日2次的剂量连续给药120天后处死，未发现心、肝、肾、脾、肾上腺、胸腺有任何病理改变。

【药代动力学】γ－亚麻酸是人体必需脂肪酸之一，在体内能够被代谢成二高－γ－亚麻酸或花生四烯酸，进而转化为前列腺素和白三烯。γ－亚麻酸和其系列代谢物在免疫系统、心血管系统、生殖系统、内分泌系统中都具有广泛的生理效应。

【不良反应】个别患者口服药初期见有恶心、便稀等不良反应，继续用药可好转。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
维E三油胶丸	化学药	HZ003525
月见草油胶丸	化学药	HZ004629
月见草油乳	化学药	HZ004630
羌月乳膏	中成药	ZC003956
月芝软胶囊	中成药	ZC007140

HY002588 云芝胞内糖肽

【其他名称】云芝胞内多糖、云芝多肽

【外文名称】Polystictus Glycopeptide

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第16册

【性状及组成】云芝胞内糖肽是将天然云芝菌子实体利用现代生物技术，深层发酵培养获得云芝菌丝体，采用科学方法提取细胞内活性物质，并成功地将此项技术实现了工业化生产。

药物药理信息

【药理毒理】

1. 本品能通过对单核－巨噬细胞的增殖增强及对每个吞噬细胞本身功能的激活从而增强网状内皮系统（RES）功能。可使小鼠诱生血清干扰素浓度明显增高；可在不增加白细胞数的情况下，通过对白细胞本身功能的激活而使中性白细胞吞噬活性增强；可促使SRBC单次免疫所致615小鼠特异性溶血素抗体的生成；可拮抗环磷酰胺、甲氨蝶呤、5－Fu、丝裂霉素C等所致细胞免疫强烈抑制，使细胞免疫功能改善，恢复正常。

2. 对于D－氨基半乳糖、四氯化碳所致大鼠和小鼠急性肝损伤，本品能显著抑制SGP的升高，肝细胞的脂肪性变出现率较对照组低，并能完全避免灶性坏死的出现。

3. 本品能使小鼠腹腔巨噬细胞对艾氏腹水癌细胞杀死率达41%～54%；能增强抗癌药物的作用；本品还能通过降低化生长因子TGF－β_1的水平，有效抑制肿瘤血管生成和移植性乳腺癌生长。

4. 本品能强烈地激活机体本身防御免疫系统，具有继发性的非特异性抗感染和抗休克作用，能明显降低黄金色葡萄球菌、大肠杆菌、痢疾杆菌感染所致的死亡率，对于流感病毒感染所致小鼠死亡，本品也有明显保护作用，保护率达50%～60%，平均生存时间可延长153%～188%。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
云芝胞内糖肽胶囊	化学药	HZ004631
云芝胞内糖肽口服溶液	化学药	HZ004632
云芝胞内糖肽片	化学药	HZ004633

HY002589　孕二烯酮

【其他名称】烯甲炔诺酮

【外文名称】Gestodene

药物理化信息

【化学名】17α－乙炔基－17β－羟基－18－甲基－4,15－雌甾二烯－3－酮

【分子式】$C_{21}H_{26}O_2$

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶粉末。

药物药理信息

【药理毒理】孕二烯酮是一种高效的孕激素甾烷的衍生物。它主要作用于丘脑－垂体－性腺轴系以及性激素作用的靶器官，通过阻止精子进入子宫而达到避孕效果，同时有抑制排卵作用。其孕激素活性为18－甲基炔诺酮的3～5倍，而雄激素相对较弱，具有较强的抗雌激素活性，是目前口服避孕药中活性最高的强效孕激素类药物，亦用于骨质疏松预防。

【药代动力学】口服吸收迅速而完全，经1～2小时血浓度达峰值，生物利用度100%，消除$t_{1/2}$为18小时。

【不良反应】可有恶心、呕吐、头痛、体重增加、乳房胀等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方孕二烯酮片	化学药	HZ001484

HY002590　孕三烯酮

【外文名称】Gestrinone

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第60册

药物理化信息

【化学名】D－18甲基－17α－乙炔基－17β－羟基－4,9,11－雌甾三烯－3－酮

【分子式】$C_{21}H_{24}O_2$

【分子量】308.42

【性状及组成】本品为淡黄色的结晶性粉末，无臭，无味。

本品在三氯甲烷、丙酮中易溶，在无水乙醇中溶解，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点为149～153℃。

比旋度：取本品，精密称定，加无水乙醇溶解并定量稀释制成，每1ml中含5mg的溶液，依法测定，比旋度为+81°至+86°。

药物药理信息

【药理毒理】本品是一种人工合成的三烯19－去甲甾类化合物，具有激素和抗激素的复杂特性，即它具有较强的抗孕激素和抗雌激素活性，又有很弱的雌激素和雄激素作用。动物实验表明它能抑制孕激素分泌，也具有黄体酮对子宫内膜的作用，使子宫内膜及异位病灶细胞失活、退化，从而导致异位病灶萎缩。其抗生育作用可能是抑制排卵及抑制子

宫内膜发育，改变宫颈黏液性质，影响卵子运行速度及拮抗内膜孕酮受体，从而干扰孕卵着床。

【药代动力学】本品口服后能完全从胃肠道吸收，2.1 小时左右血液浓度达峰值，血清 $t_{1/2}$为 27.3 小时。

【不良反应】少数人有头晕、乏力、胃部不适、痤疮、多毛及脂溢性皮炎、腿肿、体重增加、乳房缩小松弛等；也有月经周期缩短或延长、闭经、经量减少、不规则出血，但一般会自行减少。突破性出血发生率约 5%。国内临床观察见有氨基转移酶升高。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
孕三烯酮胶囊	化学药	HZ004634
孕三烯酮片	化学药	HZ004635

HY002591 藻酸双酯钠

【外文名称】Alginic Sodium Diester

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（二部）·第 4 册

【性状及组成】本品系海带提取物褐藻酸钠经水解、酯化而成的一种藻酸丙酯的硫酸酯钠盐。按干燥品计算，含有机硫应为 9.0% ~ 13.0%。

本品为微黄色无定形粉末；无臭，味微甜；有引湿性。

本品在水中易溶，在乙醇、丙酮或乙醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为酸性多糖类药物，是以藻酸为基础原料，用化学方法引入有效基团合成而得。其具有强分散乳化性能，且不易受外界因子影响，因其具有阴离子聚电解质纤维结构的特点，沿链电荷集中，在其电斥力的作用下，能使富含负电荷的细胞表面增强相互间的排斥力，故能阻抗红细胞之间和红细胞与血管壁之间的黏附，具有改善血液流变学的黏弹性的作用。另外，本品能使凝血酶失活，其抗凝血效力相当于肝素的 1/3 ~ 1/2，能阻止血小板对胶原蛋白的黏附，抑制由于血管内膜受损、腺苷二磷酸凝血酶激活，以及释放反应等所致的血小板聚集，因而具有抗血栓、降血黏度、微动静脉解痉、红细胞及血小板解聚等前列腺环素样作用。本品还有明显降低血脂的作用，应用后不仅能使血浆中胆固醇、甘油三酯、低密度脂蛋白、极低密度脂蛋白等迅速下降，同时又能升高血清高密度脂蛋白的水平，能抑制动脉粥样硬化病变的发生和发展，本品对外周血管有明显的扩张作用，能有效的改善微循环，抑制动静脉内血栓的形成，不仅具有治疗作用，同时有可靠的预防作用。此外，本品还有降血糖和降血压等多种功能。

【药代动力学】藻酸双酯钠静脉给药在小鼠体内的药代动力学符合开放三房室模型，静脉注射 3mg/kg，第一分布相血药浓度下降迅速，$t_{1/2}$为 1.21 分钟，第二分布相 $t_{1/2}$为 15.6 分钟，说明药物在体内分布较快，消除相 $t_{1/2}$为 37.95 小时，表观分布容积约为 3.90L/kg，表明药物在组织分布较广，给药 30 分钟后，药物在各组织的分布达峰值，其中以肝、肾最高，肺、脾、肠次之，脂肪、脑、骨骼含量较低。藻酸双酯钠主要经尿液排泄，静脉给药后 3 小时排泄达注射量的 40%，12 小时排泄 70%，72 小时排泄 80%。人血浆蛋白结合率为 98.1%。

【药物相互作用】藻酸双酯钠属酸性粘多糖类化合物，不宜与其他药物合并使用，以免发生配伍禁忌。

【不良反应】不良反应的发生率为 5% ~ 23%，可有发热、白细胞及血小板减少、血压降低、肝功能及心电图异常、子宫或眼结合膜下出血、过敏反应、头痛、心悸、烦躁、乏力、嗜睡等。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
藻酸双酯钠氯化钠注射液	化学药	HZ004636
藻酸双酯钠片	化学药	HZ004637
藻酸双酯钠注射液	化学药	HZ004638
注射用藻酸双酯钠	化学药	HZ005130

HY002592 扎来普隆

【外文名称】Zaleplon

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

药物理化信息

【化学名】N - ［3 - （3 - 氰基吡唑［1,5 - a］嘧啶 - 7 - 基）苯基］ - N - 乙基 - 乙胺

【分子式】$C_{17}H_{15}N_5O$

【分子量】305.34

药物药理信息

【药理毒理】扎来普隆为催眠药，其化学结构不同于苯二氮䓬类、巴比妥类及其他已知的催眠药，具有镇静催眠、肌肉松弛、抗焦虑和抗惊厥作用。它通过 GABA - 苯二氮䓬类受体复合物产生中枢抑制作用，对 ω_1 受体选择性强，同时亦能与 ω_2 受体结

合，但不与其他神经递质结合。具有半衰期极短，后遗效应较轻，诱发感知障碍作用轻微等特点。其镇静催眠作用低于三唑仑，强于氟西泮。

在瑞士进行的Ⅲ期临床试验中，437 例大于 65 岁的慢性失眠病人，服用本品 5 和 10mg，用药 14 天，与安慰剂相比，睡眠质量明显改善。本品用药 6 个月，未见撤药综合征，用药第二天未见有药物持续作用或再次失眠。本品不影响正常睡眠特性。在美国进行的有 244 例健康志愿者参加的研究显示，本品单剂 5mg 或 10mg，能明显减少睡眠开始 4 小时的睡眠潜伏期并提高睡眠效率，且无不良反应。

生殖毒性：生殖毒性试验中，大鼠在交配前经口给予扎来普隆 100mg/（kg·d）（按体表面积折算，约为推荐人用最大剂量的 49 倍），可导致动物死亡和生育力下降。后续研究显示扎来普隆主要引起雌性动物生育力受损。妊娠大鼠和家兔致畸敏感期分别经口给予扎来普隆达 100 和 50mg/（kg·d）（按体表面积折算，约为推荐人用最大剂量的 49 倍和 48 倍），未见明显致畸作用。但大鼠经口给予扎来普隆 100mg/（kg·d）后，胎仔在出生前、后均出现发育不良；此剂量也可产生母体毒性，使其在给药期间出现中毒体征和体重增加减慢。对大鼠仔代发育无影响剂量为 10 mg/（kg·d）（按体表面积折算，约为推荐人用最大剂量的 5 倍）。在所有给药剂量下家兔胚胎和胎仔的发育未受到影响。围产期试验中，雌性大鼠在妊娠后期和哺乳期给予扎来普隆 7mg/（kg·d），仔代动物死产和出生后死亡率升高，生长和身体发育减慢。此剂量下未见动物出现母体毒性。对仔代发育的无影响剂量为 1mg/（kg·d）（按体表面积折算，约为推荐人用最大剂量的 0.5 倍）。研究显示，子宫内和受乳期仔代动物暴露于药物，可能导致其出现生育能力和发育方面的不良反应。

遗传毒性：体外中国仓鼠卵巢细胞染色体畸变实验显示，无论是否存在代谢活化剂，扎来普隆均有诱裂变作用，可引起染色体结构和数目的畸变（多倍体和核内再复制）。体外人淋巴细胞试验中，仅在其最高试验浓度和有代谢活化剂的条件下引起染色体数目畸变。扎来普隆在体外 Ames 细菌试验和中国仓鼠卵巢 HGPRT 基因突变实验中均未见致突变性，在小鼠骨髓微核试验和大鼠骨髓染色体畸变试验中无诱裂作用，在大鼠肝细胞期外 DNA 合成试验中未引起 DNA 损伤。

致癌性：进行了大鼠和小鼠终生致癌试验。小鼠连续 2 年经口给予扎来普隆 25、50、100 和 200mg/(kg·d)（按体表面积折算，约为推荐人用最大剂量的 6～49 倍），高剂量组雌鼠的肝细胞腺瘤发生率显著升高。大鼠连续 2 年经口给予扎来普隆 1、10、20mg/（kg·d）（按体表面积折算，约为推荐人用最大剂量的 0.5～10 倍），未见明显致癌性。

【药代动力学】据国外文献报道，在 500 多名健康人（包括年轻和年老的）、哺乳妇女和有肝病或肾病的病人，进行了扎来普隆的药代动力学研究。在健康受试者中，进行了单量给药 60mg 和一天 1 次给药 15mg、30mg 共 10 天的药代动力学研究，扎来普隆很快地被吸收，达峰浓度时间大约为 1 小时，消除半衰期（$t_{1/2}$）大约为 1 小时，一天 1 次给药扎来普隆没有药物累积，而且在治疗范围内，它的药代动力学是与剂量成正比的。

1. 吸收：扎来普隆在口服后，吸收快速且完全。1 小时左右达到血浆峰浓度。其绝对生物利用度大约为 30%，有明显的首过效应。

2. 分布：扎来普隆是一个脂溶性化合物，静脉给药后，分布容积大约为 1.4L/kg，分布在血管外组织。体外血浆蛋白结合率大约是 60% ± 15%，并且不受扎来普隆浓度 10～1000ng/ml 浓度范围的限制，这表明扎来普隆的分布对蛋白结合率的变化是不敏感的，扎来普隆在血液和血浆中的比率大约是 1，这表明扎来普隆是均匀分布在整个血液而没有广泛地分布在红细胞里。

3. 代谢：在口服给药后，扎来普隆被广泛地代谢，在尿中，仅有不超过剂量的 1%是原药，扎来普隆主要被醛氧化酶代谢为 5－氧－扎来普隆，扎来普隆很少被 CYP3A4 代谢为脱乙基扎来普隆，并很快被醛氧化酶转化为 5－氧－脱乙基扎来普隆，这些代谢产物然后被转化为葡萄糖醛酸化合物，并在尿中消除，所有的扎来普隆代谢产物均无药理活性。

4. 清除：在口服或静脉给药后，扎来普隆很快被清除，平均 $t_{1/2}$大约是 1 小时，扎来普隆口服血浆清除率大约为 3L/（h·kg），静脉血浆清除率大约为 1L/（h·kg），如肝血流正常和忽略肾清除，估计扎来普隆的肝脏提取率是 0.7，表明扎来普隆的首过效应是非常明显的。

在服用有放射标记的扎来普隆后，在 48 小时内，可在尿中回收 70%（6 天内可回收 71%），包括所有的扎来普隆代谢物和它们的葡萄糖醛酸，另外在粪便中可回收 17%，主要是 5－氧－扎来普隆。

5. 食物作用：在健康成人中，高脂肪和难消化的饮食，可延长扎来普隆的吸收，延迟时间大约为 2 小时，并且 C_{max}减少大约 35%，扎来普隆 AUC 和清除半衰期没有明显的影响，这表明，在用完高脂肪食物或饱餐后，立即服用扎来普隆，其起效时间会有影响。

对老年人进行扎来普隆药代动力学的三项研究的结果显示，扎来普隆的药代动力学和年轻人没有

明显的不同。

性别：在男性和女性中，扎来普隆的药代动力学没有明显的不同。

人种：在以日本人作为亚洲人群代表作了扎来普隆药代动力学研究，对这个组，血药浓度峰值和血药浓度曲线下面积分别增强 37% 和 64%，这可能和体重不同有关，也有可能由于饮食、环境或别的因素而引起酶活性的不同。

肝脏损伤：扎来普隆主要由肝脏代谢，接着进行全身代谢，其口服清除率在代偿和代偿功能失调的病人减少 70% 和 87%，导致平均 C_{max} 和 AUC 明显减少，因此中、轻度肝脏损伤病人服用扎来普隆时，应适当减少剂量，患有严重的肝脏损伤的病人不建议服用扎来普隆。

肾脏损伤：因为由肾脏排泄的扎来普隆原药不到 1%，在肾功能不全的病人中，其药代动力学没有明显变化，因此对中、轻度肾脏损伤的病人没有必要调整剂量，但对严重的肾脏损伤病人还需进一步研究。

【药物相互作用】

1．与中枢神经系统药物

（1）乙醇：本品可增强乙醇对中枢神经系统的损伤作用，但不影响乙醇的药代动力学。

（2）丙咪嗪：本品与丙咪嗪合用后，清醒程度降低，运动精神行为能力损伤，相互作用是药效学，而没有药代动力学的变化。

（3）帕罗西汀：本品与帕罗西汀无相互作用。

（4）硫达利嗪：本品与硫达利嗪合用后，清醒程度降低，运动精神行为能力损伤，相互作用是药效学，而没有药代动力学的变化。

2．与酶诱导/抑制药物：与酶诱导剂比如利福平合用，会使本品的 C_{max} 和 AUC 降低 4 倍。

本品与苯海拉明合用无药代动力学相互影响，但由于两者都有镇静作用，合用需特别注意。

3．与影响肾消除药物合用：与布洛芬合用无明显药代动力学变化。

【药物过量】扎来普隆用药过量的临床研究较少，在临床前研究中注意到，过量用药有中枢神经系统抑制作用而表现，轻微的症状有：瞌睡、昏睡及意识模糊等。严重的症状有：共济失调、肌张力减退、低血压、有时昏迷直至死亡。

建议的治疗：按照药物过量处理的一般进行治疗，并保证支持、对症治疗。动物研究表明氟马西尼可拮抗扎来普隆，但还没有用于临床。

【不良反应】本品的主要不良反应为头痛、嗜睡、眩晕。剂量低于 15mg 时精神性运动损伤不明显。其成瘾性比苯二氮䓬类药物弱，但仍然应予注意。

其他不良反应包括：①血液学：偶见一过性白细胞减少。②中枢神经系统：剂量低于 30mg 时，最常见的不良反应是眩晕、头痛和嗜睡。当剂量较高（40～60mg）时，入睡时间进一步缩短，但会损害运动功能。一项大规模试验发现，每日本品 5～10mg 时发生中枢神经系统不良反应的程度和频度，与每日服用 0.25mg 三唑仑时相当。③精神性运动损伤：仅在剂量超过 15 或 20mg 时出现。其严重性和作用时间与剂量成正比：剂量为 20mg 时精神性运动损伤通常在 3～4 小时后消失；剂量达到 60mg 时精神性运动损伤可持续 25 小时消失以上。④记忆损伤：Allen 等，在 20mg 剂量时发现记忆损伤，而另一个研究在 60mg 剂量时未见对记忆有明显的影响。⑤肝功能：偶见一过性转氨酶（AST）升高。⑥眼：较高剂量（40～60mg）时曾发现视力模糊。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
扎来普隆分散片	化学药	HZ004639
扎来普隆胶囊	化学药	HZ004640
扎来普隆片	化学药	HZ004641

HY002593 扎鲁司特

【其他名称】Accolate、安可来、安可米、Zeneca

【外文名称】Zafirlukast

药物药理信息

【药理毒理】在哮喘发病的病理生理学中，认为白三烯产物（LT）与其受体结合后产生的作用包括平滑肌收缩、气道水肿和炎性细胞活性改变（如嗜酸细胞肺浸润）均与哮喘的症状和体征有关。本药作为一种抗炎药，能减少这些炎性介质的作用。本药作为一种强力口服多肽性 LTC4、LTD4 和 LTE4 等超敏反应的慢反应物质的白三烯受体拮抗剂，属于竞争性抑制，具有高选择性的特点。体外研究显示本药拮抗在人体传导气道平滑肌的所有 3 个白三烯多肽的收缩活性（白三烯 C4、D4 及 E4），并且程度相同。动物实验显示本药的作用主要是：有效地预防白三烯多肽所致的血管通透性增加，后者能引起气水肿；抑制白三烯多肽产生的气道嗜酸细胞的浸润。临床研究也证实本药的特异性，仅作用于白三烯受体，但不影响前列腺素、血栓素、胆碱能和组织胺受体。经临床验证显示，本药具有抗炎特性，5 日剂量的本药能减少气道因抗原刺激引起的细胞和非细胞性炎性物质。安慰剂对照研究发现抗原激发

48小时后的支气管肺泡灌洗液中，扎鲁司特能抑制嗜酸细胞、淋巴细胞和组织细胞的升高，以及减少因肺泡巨嗜细胞刺激所产生的过氧化物。本药能抑制抗原激发的气道高反应和血小板活性因子引起的支气管痉挛。再者，长期服用扎鲁司特（20mg，每天2次）能减低气道对乙酰甲基胆碱的敏感性。在评价使用本药长期治疗的临床观察中，其血浆水平在低谷时肺功能仍较基础水平有改善，这说明因炎性物质所致的气道阻塞得到持久缓解。本药对吸入白三烯D4所致的支气管痉挛的拮抗作用显示与剂量相关。哮喘患者对白三烯D4的敏感性较常人高10倍，单次口服剂量的本药使哮喘患者对吸入LTD4的耐受性高100倍并在12和24小时内有明显的保护作用。本药能抑制各种刺激引起的支气管痉挛，如二氧化硫、运动和冷空气。本药还能降低各种抗原（如花粉、猫毛屑、豚草和混合抗原）引起的早发性及迟发炎性反应。在一些病人，本药能完全预防运动和过敏原引起的哮喘发作。对按需要量使用β-受体激动剂治疗但未获充分控制的哮喘病人，本药可用于一线维持治疗。对有临床症状的病人，本药可缓解症状（减轻昼夜哮喘症状），改善肺功能，减少β-受体激动剂的用量及哮喘恶化的发生率。临床研究发现，服药2小时内，药物血浆浓度尚未达到峰值时便可在基础支气管运动张力上产生明显的首剂效应。使用本药治疗时，哮喘的症状在1周内初步改善，多在头几天即出现。本药为口服一日2次，故对顺从性差或难以用吸入药物维持治疗的患者具有特殊的意义。与处方有关的临床前安全资料在大鼠、小鼠和狗等动物实验中，给予本药的日剂量超过40mg/kg，给予12个月，可发现肝肿大伴有退行性和脂肪变性或糖元沉积，在狗的许多组织中可有组织细胞集聚。每日服扎鲁司特300mg/kg的雄性小鼠肝细胞腺瘤的发生率较对照组高，每天服扎鲁司特2000mg/kg的雄性大鼠，膀胱乳头状瘤的发生率高于对照组。各种实验证实，扎鲁司特无诱突变作用，但这些结果对长期服用本药的男性的临床意义尚不肯定。在临床前期实验中无其他特殊发现。

【药代动力学】扎鲁司特的血浆浓度多在口服本药后约3小时到达峰值。如一日2次服用本药（30~80mg，每天2次），则可见扎鲁司特的血浆蓄积从难以检测到首剂值的2.9倍，平均1.45，中值1.27。扎鲁司特的消除半衰期可用单剂量药代动力学资料推算。扎鲁司特在哮喘青年和成年人的药代动力学与健康成人相似。按体重用药时，扎鲁司特的药物代谢无性别差异。与食物同服，将增加本药生物利用度的差异性，大部分患者（75%）的生物利用度降低，下降幅度可达40%。扎鲁司特代谢完全，通过同位素标记证实，尿排泄为口服剂量的10%，粪便排泄为89%。

肾功能不全者不需调整剂量。

在酒精性肝硬化稳定期患者，扎鲁司特清除率降低，峰浓度和曲线下面积大约为正常人的2倍。起始剂量应是20mg，每天2次，然后根据临床反应调整。尚未对本药在其他原因所致的肝功能损害病人中的应用进行观察，也未对肝硬化患者进行长期观察。

【药物过量】暂无有关人类过量服用本药的资料，但应积极处理，洗胃有助于清除过量的药物。

【不良反应】本药的耐受性良好，使用时可能引起头痛或胃肠道反应，这些症状通常较轻微。包括荨麻疹及血管神经性水肿的过敏反应已见报道，皮疹及水疱也见报道。临床实验中已观察到服用本药可出现转氨酶升高，但不常见。继续治疗或停药后可恢复正常。极少数患者因药物介导的肝炎而转氨酶持续异常，这种情况常在停用本药后恢复正常。通过安慰剂的对照观察发现，使用本药的老年患者感染的发生率增加，但症状较轻，主要影响呼吸道，不必中止治疗。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
扎鲁司特片	化学药	HZ004642

HY002594　樟脑

【外文名称】Camphor

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】1,7,7-三甲基二环［2,2,1］庚烷-2-酮

【分子式】$C_{10}H_{16}O$

【分子量】152.24

【性状及组成】系自樟科植物中提取（天然樟脑）或用化学合成法制得（合成樟脑）。

本品为白色结晶性粉末或无色半透明的硬块，加少量的乙醇、三氯甲烷或乙醚，易研碎成细粉；有刺激性特臭，味初辛、后清凉；在常温中易挥发，燃烧时发生黑烟及有光的火焰。

本品在氯仿中极易溶解，在乙醇、乙醚、脂肪油或挥发油中易溶，在水中极微溶解。

熔点：取本品，置内径2.0~2.5mm并一端熔封的薄壁玻璃管中，依法测定。天然樟脑的熔点为176~181℃，合成樟脑的熔点为174~179℃。

比旋度：取本品，精密称定，加乙醇溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 0.1g 的溶液，依法测定，天然樟脑的比旋度为 +41°至 +44°；合成樟脑的比旋度为 -1.5°至 +1.5°。

药物药理信息

【药理毒理】局部有刺激兴奋作用，为皮肤刺激药，可增进局部血液循环以缓解肿胀，并有止痛、止痒作用。

【药物过量】

1. 中毒症状：误服樟脑搽剂可引起恶心、呕吐、腹绞痛、头痛、头晕、发热感、谵妄、肌肉颤搐、癫痫样抽搐、中枢神经系统抑制和昏迷。亦可引起尿闭、呼吸困难，偶见呼吸衰竭至死亡。小儿服 1g 可致死。

2. 处理：依病情给予对症治疗和支持疗法。

【不良反应】有轻度刺激作用。可引起接触性皮炎。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
冰樟桉氟轻松贴膏	化学药	HZ000419
薄荷麝香草酚搽剂	化学药	HZ000456
冻疮膏	化学药	HZ000747
复方苯巴比妥溴化钠片	化学药	HZ001082
复方苯海拉明搽剂	化学药	HZ001083
复方苯海拉明克罗米通酊	化学药	HZ001084
复方薄荷柳酯搽剂	化学药	HZ001099
复方薄荷脑鼻用吸入剂	化学药	HZ001100
复方薄荷脑软膏	化学药	HZ001101
复方薄樟桉油溶液	化学药	HZ001103
复方醋酸地塞米松乳膏	化学药	HZ001114
复方达克罗宁薄荷溶液	化学药	HZ001124
复方地塞米松软膏	化学药	HZ001132
复方甘草氯化铵片	化学药	HZ001174
复方甘草氯化铵糖浆	化学药	HZ001175
复方甘草片	化学药	HZ001177
复方辣椒碱乳膏	化学药	HZ001256
复方柳唑气雾剂	化学药	HZ001283
复方氢溴酸东莨菪碱贴膏	化学药	HZ001347
复方水杨酸甲酯苯海拉明喷雾剂	化学药	HZ001389
复方水杨酸甲酯薄荷脑油	化学药	HZ001390
复方水杨酸樟碘溶液Ⅰ	化学药	HZ001394

续表

制剂名称	类别	序号
复方水杨酸樟碘溶液Ⅱ	化学药	HZ001395
复方硝酸咪康唑软膏	化学药	HZ001441
复方盐酸麻黄碱软膏	化学药	HZ001459
复方氧化锌软膏	化学药	HZ001467
复方樟脑酊	化学药	HZ001486
复方樟脑乳膏	化学药	HZ001487
松节油搽剂	化学药	HZ003323
无极膏	化学药	HZ003600
樟脑苯酚溶液	化学药	HZ004643
樟脑薄荷柳酯乳膏	化学药	HZ004644
樟脑搽剂	化学药	HZ004645
樟脑软膏	化学药	HZ004647
樟脑醑	化学药	HZ004649
清凉止痒搽剂	中成药	ZC004115
小儿清凉止痒酊	中成药	ZC006297

HY002595 樟脑磺酸钠

【外文名称】Sodium Camphor Sulfonate

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（化学药品与制剂）·第 1 册

【分子式】$C_{10}H_{15}NaO_4S$

【分子量】254.29

【性状及组成】本品为白色的结晶或结晶性粉末；无臭或几乎无臭；味初微苦、后甜。

本品在水或热乙醇中易溶。

比旋度：取本品，按干燥品计算制成每 1ml 中含 50mg 的水溶液，依法测定，比旋度不得低于 +18°。

药物药理信息

【药理毒理】本品为呼吸兴奋剂，可刺激呼吸中枢，使呼吸兴奋。

【药代动力学】注射后吸收快，与磺酸钠形成复盐吸收较好。在肝内羟化形成樟脑代谢产物。与葡萄糖醛酸结合，从肾排出，可穿过胎盘屏障。

【药物相互作用】不应与降压药及抗抑郁药合用。

【药物过量】

1. 中毒症状：恶心、呕吐、腹绞痛、头痛、头晕、发热感、谵妄、肌肉颤搐、癫痫样抽搐、中枢

神经系统抑制和昏迷，亦可有呼吸困难、尿闭，偶见呼吸衰竭。

2. 处理：依病情给予相应的对症治疗和支持疗法。

【不良反应】可引起恶心、呕吐。可用地西泮或短效巴比妥类药物来控制。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
樟脑磺酸钠注射液	化学药	HZ004646

HY002596　樟脑油

【外文名称】Camphor Oil

药物药理信息

【药理毒理】本品用于配制皂用香料和药物等，也用于制清漆和鞋油等。

【药代动力学】在体内，樟脑油被代谢成 camphorol，并被转运至肝脏解毒。去毒性的过程先由羟基化，然后和葡萄糖醛酸结合。最后此失活化物被转运至肾脏而排出。

【药物过量】

1. 樟脑油中毒的临床表现：樟脑油为具有中枢神经兴奋作用的药物，其中毒症状主要以全身抽搐及伴随之呼吸抑制。除了重复难控制的抽搐为其临床主要特征外，另外也可产生瞳孔扩大、神志不清、躁动不安、颤抖、口腔及上腹部烧灼感、呕吐、呼吸抑制、低血压、发绀、心律不齐、及呼出气体中有强烈的樟脑味，轻微肝功能异常。

一般成人中毒剂量约为 35mg/kg 以上，暴露量大于 50 mg/kg 者几乎一定会产生症状；而如暴露剂量在 10mg/kg 以下者，则不至于有中毒症状。

2. 临床中毒的治疗：主要以支持性疗法为主，尤其是呼吸道的适当保护，避免产生吸入性肺炎。另外，对于抽搐严重病患的治疗，给予苯二氮䓬类或是巴比妥类，以控制抽搐及可能伴随而来的横纹肌溶解症、电解质异常、代谢性酸中毒、及肾衰竭等并发症，也是极其重要的。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方苯海拉明克罗米通酊	化学药	HZ001084
复方龙脑樟脑油	化学药	HZ001285
复方水杨酸甲酯薄荷脑油	化学药	HZ001390
驱风油	化学药	HZ003048
玉树油	化学药	HZ004609

续表

制剂名称	类别	序号
白树油	中成药	ZC000167
跌打万花油	中成药	ZC000878
金龙驱风油	中成药	ZC002716
强力狮子油	中成药	ZC003981
清凉油	中成药	ZC004112
清凉油（白色）	中成药	ZC004113
清凉油（棕色）	中成药	ZC004114
液体清凉油	中成药	ZC006769

HY002597　蔗糖

【其他名称】Beat Sugar、白糖、Cane Sugar

【外文名称】Sucrose

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】β－D－呋喃果糖基－α－D－吡喃葡萄糖苷

【分子式】$C_{12}H_{22}O_{11}$

【分子量】342.30

【性状及组成】本品为无色结晶或白色结晶性的松散粉末，无臭，味甜。

本品在水中极易溶解，在乙醇中微溶，在三氯甲烷或乙醚中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 0.1g 的溶液，依法测定，比旋度不得少于 +66°。

药物药理信息

【药理毒理】药用辅料，矫味剂，赋形剂。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
氨酚麻美糖浆	化学药	HZ000174
薄荷桉油含片 I	化学药	HZ000451
肠内营养粉剂（TP）	化学药	HZ000518
醋酸钙颗粒	化学药	HZ000569
单糖浆	化学药	HZ000631
碘化铵含片	化学药	HZ000712
多维铁口服溶液	化学药	HZ000800
二维葡磷钙咀嚼片	化学药	HZ000857
复方苯海拉明麻黄碱糖浆	化学药	HZ001086

续表

制剂名称	类别	序号
复方肝浸膏糖浆	化学药	HZ001190
复方含糖胃蛋白酶颗粒	化学药	HZ001202
复方酵母碳酸铋片	化学药	HZ001232
复方桔梗氯化铵口服溶液	化学药	HZ001233
复方桔梗氯化胺糖浆	化学药	HZ001234
复方桔梗枇杷糖浆	化学药	HZ001237
复方枸橼酸喷托维林颗粒	化学药	HZ001243
复方枇杷氯化铵糖浆	化学药	HZ001337
复方三维右旋泛酸钙糖浆	化学药	HZ001369
复方碳酸钙咀嚼片	化学药	HZ001400
复方五味子糖浆	化学药	HZ001434
含糖胃蛋白酶	化学药	HZ001680
九维鱼肝油乳	化学药	HZ001967
硫酸亚铁糖浆	化学药	HZ002419
蒙脱石颗粒	化学药	HZ002679
浓维磷糖浆	化学药	HZ002824
葡钙维 B_1 片	化学药	HZ002874
葡萄糖酸钙含片	化学药	HZ002884
葡萄糖酸钙维 D_2 散	化学药	HZ002891
葡萄糖鱼肝油乳	化学药	HZ002913
乳酸亚铁口服液	化学药	HZ003119
三维亚铁咀嚼片	化学药	HZ003163
铁铵锌铜维 B_1 糖浆	化学药	HZ003402
五维他口服溶液	化学药	HZ003611
小儿复方麻黄碱桔梗糖浆	化学药	HZ003758
小儿复方四维亚铁散	化学药	HZ003760
小儿硫酸亚铁糖浆	化学药	HZ003763
小儿五维赖氨酸糖浆	化学药	HZ003781
愈酚待因口服溶液	化学药	HZ004615
愈酚甲麻那敏糖浆	化学药	HZ004617
巴特日六味汤散	民族药	MZ000040
白沙糖浆	民族药	MZ000043
表热清颗粒	民族药	MZ000053
柴银感冒颗粒	民族药	MZ000065
丹莪妇康煎膏	民族药	MZ000083
儿脾醒颗粒	民族药	MZ000101
复方吉祥草含片	民族药	MZ000159

续表

制剂名称	类别	序号
复方一枝蒿颗粒	民族药	MZ000175
肝复颗粒	民族药	MZ000182
感清糖浆	民族药	MZ000184
隔山消积颗粒	民族药	MZ000187
固本明目颗粒	民族药	MZ000190
花栀清肝颗粒	民族药	MZ000220
黄香颗粒	民族药	MZ000223
康肾颗粒	民族药	MZ000282
咳康含片	民族药	MZ000284
咳速停糖浆	民族药	MZ000288
咳痰合剂	民族药	MZ000289
灵丹草合剂	民族药	MZ000312
六味枸杞糖浆	民族药	MZ000325
六味西红花口服液	民族药	MZ000336
绿及咳喘颗粒	民族药	MZ000344
泌淋颗粒	民族药	MZ000354
蜜桶花颗粒	民族药	MZ000359
尿路康颗粒	民族药	MZ000368
尿清舒颗粒	民族药	MZ000369
七生力片	民族药	MZ000382
三味檀香颗粒	民族药	MZ000477
参贝止咳颗粒	民族药	MZ000495
十三味疏肝胶囊	民族药	MZ000526
十一味黄精颗粒	民族药	MZ000560
石椒草咳喘颗粒	民族药	MZ000568
石榴补血糖浆	民族药	MZ000569
手掌参三十七味丸	民族药	MZ000576
双羊喉痹通颗粒	民族药	MZ000585
四味雪莲花颗粒	民族药	MZ000595
胃舒欣颗粒	民族药	MZ000626
五根油丸	民族药	MZ000638
小儿功劳止泻颗粒	民族药	MZ000673
小儿消食开胃颗粒	民族药	MZ000675
欣力康颗粒	民族药	MZ000681
醒脾养儿颗粒	民族药	MZ000688
雅解片	民族药	MZ000699
咽喉清喉片	民族药	MZ000700

续表

制剂名称	类别	序号
咽舒口服液	民族药	MZ000703
养阴口香合剂	民族药	MZ000710
宜肝乐颗粒	民族药	MZ000714
益康补元颗粒	民族药	MZ000717
止眩安神颗粒	民族药	MZ000750
竺黄安宁丸	民族药	MZ000765
安儿宁颗粒	中成药	ZC000009
安眠补脑口服液	中成药	ZC000033
八珍鹿胎颗粒	中成药	ZC000107
白百抗痨颗粒	中成药	ZC000131
白酱感冒颗粒	中成药	ZC000153
白头翁止痢片	中成药	ZC000168
白芝颗粒	中成药	ZC000173
白纸扇感冒颗粒	中成药	ZC000174
板蓝根口服液	中成药	ZC000226
半夏露糖浆	中成药	ZC000235
贝桔止咳糖浆	中成药	ZC000298
鼻血止颗粒	中成药	ZC000315
碧云砂乙肝颗粒	中成药	ZC000344
冰霜梅苏丸	中成药	ZC000367
补白颗粒	中成药	ZC000388
补脾安神合剂	中成药	ZC000397
补虚通瘀颗粒	中成药	ZC000440
补血益母颗粒	中成药	ZC000447
产妇安合剂	中成药	ZC000504
产复欣颗粒	中成药	ZC000510
虫草川贝止咳膏	中成药	ZC000568
虫草金钱龟口服液	中成药	ZC000569
川贝枇杷颗粒	中成药	ZC000592
川贝枇杷糖浆	中成药	ZC000595
川贝雪梨糖浆	中成药	ZC000599
春梅颗粒	中成药	ZC000648
刺乌养心口服液	中成药	ZC000656
檵木胃痛颗粒	中成药	ZC000670
大黄通便颗粒	中成药	ZC000695
丹参颗粒	中成药	ZC000742
当归补血口服液	中成药	ZC000786

续表

制剂名称	类别	序号
东梅止咳颗粒	中成药	ZC000910
阿归养血口服液	中成药	ZC000955
阿胶口服液	中成药	ZC000964
阿胶养血膏	中成药	ZC000972
阿胶远志膏	中成药	ZC000976
儿咳糖浆	中成药	ZC000990
肥儿口服液	中成药	ZC001055
肥儿糖浆	中成药	ZC001058
风寒感冒宁颗粒	中成药	ZC001074
风梅颗粒	中成药	ZC001081
妇康宝煎膏	中成药	ZC001186
妇科白凤口服液	中成药	ZC001196
妇血康颗粒	中成药	ZC001237
复方丹栀颗粒	中成药	ZC001326
复方阿胶补血颗粒	中成药	ZC001347
复方和血丸	中成药	ZC001384
复方降脂片	中成药	ZC001411
复方金连颗粒	中成药	ZC001413
复方决明片	中成药	ZC001419
复方两面针含片	中成药	ZC001432
复方满山白糖浆	中成药	ZC001454
复方枇杷喷托维林颗粒	中成药	ZC001465
复方天麻益阴酒	中成药	ZC001539
复方乌梅祛暑颗粒	中成药	ZC001551
复方鲜石斛颗粒	中成药	ZC001564
复方鱼腥草合剂	中成药	ZC001613
甘桔止咳糖浆	中成药	ZC001665
肝肾安糖浆	中成药	ZC001698
肝肾康糖浆	中成药	ZC001701
肝爽颗粒	中成药	ZC001706
肝喜乐片	中成药	ZC001716
肝悦片	中成药	ZC001722
感冒解毒灵颗粒	中成药	ZC001730
感冒灵颗粒	中成药	ZC001737
感冒灵片	中成药	ZC001738
龟黄补酒	中成药	ZC001988
海龙胶口服液	中成药	ZC002049

续表

制剂名称	类别	序号
蒿蓝感冒颗粒	中成药	ZC002082
和胃疗疳颗粒	中成药	ZC002093
红草止鼾颗粒	中成药	ZC002118
滑膜炎胶囊	中成药	ZC002215
黄疸茵陈颗粒	中成药	ZC002255
黄精养阴糖浆	中成药	ZC002263
黄英咳喘糖浆	中成药	ZC002301
黄枣颗粒	中成药	ZC002302
藿香正气片	中成药	ZC002377
鸡血藤颗粒	中成药	ZC002389
减味小儿化痰散	中成药	ZC002443
健儿止泻颗粒	中成药	ZC002465
健脾化滞锭	中成药	ZC002491
健脾止泻宁颗粒	中成药	ZC002509
健身长春颗粒	中成药	ZC002515
健肾益肺颗粒	中成药	ZC002525
健血颗粒	中成药	ZC002539
降脂宁颗粒	中成药	ZC002575
桔远止咳片	中成药	ZC002649
金防感冒颗粒	中成药	ZC002655
金鹃咳喘停合剂	中成药	ZC002698
金钱草颗粒	中成药	ZC002733
金银花颗粒	中成药	ZC002773
精制冠心颗粒	中成药	ZC002831
颈通颗粒	中成药	ZC002842
景天虫草含片	中成药	ZC002847
橘半止咳颗粒	中成药	ZC002904
菌白敏片	中成药	ZC002926
抗骨增生口服液	中成药	ZC002997
抗衰灵口服液	中成药	ZC003018
咳感康口服液	中成药	ZC003036
咳立停糖浆	中成药	ZC003037
咳露口服液	中成药	ZC003039
咳舒糖浆	中成药	ZC003043
咳痰清糖浆	中成药	ZC003046
口腔溃疡含片	中成药	ZC003083
苦豆子片	中成药	ZC003094

续表

制剂名称	类别	序号
兰草颗粒	中成药	ZC003142
乐孕宁口服液	中成药	ZC003164
痢特敏颗粒	中成药	ZC003213
灵芪加口服液	中成药	ZC003257
灵芝绞股蓝口服液	中成药	ZC003268
六味壮骨颗粒	中成药	ZC003333
龙苓春合剂	中成药	ZC003352
龙血竭含片	中成药	ZC003367
龙血竭片	中成药	ZC003369
芦根枇杷叶颗粒	中成药	ZC003384
陆英颗粒	中成药	ZC003391
鹿茸洋参片	中成药	ZC003407
绿梅止泻颗粒	中成药	ZC003421
罗汉果止咳膏	中成药	ZC003439
麻姜颗粒	中成药	ZC003457
麻杏止咳颗粒	中成药	ZC003468
麻杏止咳糖浆	中成药	ZC003470
麦味地黄合剂	中成药	ZC003483
玫果口服液	中成药	ZC003530
美诺平颗粒	中成药	ZC003543
泌感颗粒	中成药	ZC003549
明蕊降脂颗粒	中成药	ZC003565
明目滋肾片	中成药	ZC003576
木香理气片	中成药	ZC003597
脑宁糖浆	中成药	ZC003633
宁嗽露糖浆	中成药	ZC003672
浓缩水牛角颗粒	中成药	ZC003731
女贞子糖浆	中成药	ZC003741
暖胃舒乐颗粒	中成药	ZC003746
蒲公英颗粒	中成药	ZC003800
七生静片	中成药	ZC003821
强骨生血口服液	中成药	ZC003965
青梅感冒颗粒	中成药	ZC004034
清肝颗粒	中成药	ZC004060
清热解毒口服液	中成药	ZC004143
祛痰平喘片	中成药	ZC004261
人参片	中成药	ZC004324

续表

制剂名称	类别	序号
人参五味子糖浆	中成药	ZC004331
忍冬感冒颗粒	中成药	ZC004342
三肾温阳酒	中成药	ZC004503
三乌胶	中成药	ZC004509
三乌胶丸	中成药	ZC004510
三香跌打损伤酒	中成药	ZC004511
沙棘片	中成药	ZC004553
沙棘糖浆	中成药	ZC004554
沙棘丸	中成药	ZC004555
沙棘油软胶囊	中成药	ZC004556
山地岗感冒颗粒	中成药	ZC004569
山蜡梅叶颗粒	中成药	ZC004579
山楂调中丸	中成药	ZC004600
伤风止咳糖浆	中成药	ZC004610
蛇胆川贝液	中成药	ZC004674
参坤养血颗粒	中成药	ZC004772
参坤养血口服液	中成药	ZC004773
参鹿扶正合剂	中成药	ZC004801
参南星口服液	中成药	ZC004812
参芪阿胶胶囊	中成药	ZC004816
参芪颗粒	中成药	ZC004829
参芪益气酒	中成药	ZC004847
参杞颗粒	中成药	ZC004851
参杞糖浆	中成药	ZC004854
参茸补酒	中成药	ZC004860
参茸加口服液	中成药	ZC004874
参茸酒	中成药	ZC004875
参茸颗粒	中成药	ZC004876
参芝安神口服液	中成药	ZC004925
参术儿康糖浆	中成药	ZC004928
升提颗粒	中成药	ZC004996
生脉饮（党参方）	中成药	ZC005027
首乌延寿颗粒	中成药	ZC005129
首乌延寿片	中成药	ZC005130
首志健脑颗粒	中成药	ZC005131
舒筋风湿酒	中成药	ZC005178
双黄连合剂	中成药	ZC005245

续表

制剂名称	类别	序号
双山颗粒	中成药	ZC005274
双参补肾口服液	中成药	ZC005276
双辛鼻窦炎颗粒	中成药	ZC005284
顺气化痰颗粒	中成药	ZC005297
顺气化痰片	中成药	ZC005298
四季抗病毒合剂	中成药	ZC005311
四季消炎喉片	中成药	ZC005318
四味脾胃舒颗粒	中成药	ZC005334
四物膏	中成药	ZC005339
苏菲咳糖浆	中成药	ZC005356
锁仙补肾口服液	中成药	ZC005385
锁阳三味片	中成药	ZC005388
田基黄糖浆	中成药	ZC005470
通络止痛药酒	中成药	ZC005545
通宣理肺颗粒	中成药	ZC005573
痛经宁颗粒	中成药	ZC005593
维C银翘颗粒	中成药	ZC005668
胃痛平糖浆	中成药	ZC005740
乌鸡养血糖浆	中成药	ZC005798
乌梅人丹	中成药	ZC005807
乌阳补心糖浆	中成药	ZC005813
五味健脑口服液	中成药	ZC005866
五味子颗粒	中成药	ZC005873
西瓜霜清咽含片	中成药	ZC005902
西瓜霜润喉片	中成药	ZC005903
西洋参金钱龟合剂	中成药	ZC005915
西洋参颗粒	中成药	ZC005916
仙鹿补酒	中成药	ZC005968
消咳颗粒	中成药	ZC006066
消咳平喘口服液	中成药	ZC006068
消食颗粒	中成药	ZC006098
消炎退热颗粒	中成药	ZC006126
小儿柴芩清解颗粒	中成药	ZC006179
小儿肺咳颗粒	中成药	ZC006185
小儿扶脾颗粒	中成药	ZC006193
小儿感冒退热糖浆	中成药	ZC006208
小儿健胃宁口服液	中成药	ZC006238

续表

制剂名称	类别	序号
小儿咳嗽糖浆	中成药	ZC006263
小儿利湿止泻颗粒	中成药	ZC006264
小儿麦枣片	中成药	ZC006268
小儿秘通口服液	中成药	ZC006269
小儿清热止咳颗粒	中成药	ZC006307
小儿喜食颗粒	中成药	ZC006333
小儿夜啼颗粒	中成药	ZC006352
小儿止咳糖浆	中成药	ZC006359
小儿止泻灵颗粒	中成药	ZC006367
熊胆川贝口服液	中成药	ZC006518
熊胆酒	中成药	ZC006523
血脂宁丸	中成药	ZC006610
畏食康颗粒	中成药	ZC006646
养血安神糖浆	中成药	ZC006694
野菊花颗粒	中成药	ZC006752
一清颗粒	中成药	ZC006778
蚊陈固涩口服液	中成药	ZC006804
益肺健脾颗粒	中成药	ZC006813
益肝灵片	中成药	ZC006827
益气养血补酒	中成药	ZC006880
益肾养元合剂	中成药	ZC006904
益心酮片	中成药	ZC006921
益元黄精糖浆	中成药	ZC006930
茵陈酒	中成药	ZC006943
银柴颗粒	中成药	ZC006961
银翘颗粒	中成药	ZC007002
愈肝龙颗粒	中成药	ZC007111
苑叶止咳糖浆	中成药	ZC007138
云芝肝泰颗粒	中成药	ZC007160
云芝肝泰片	中成药	ZC007161
枣参合剂	中成药	ZC007190
楂麦健脾颗粒	中成药	ZC007203
珍红颗粒	中成药	ZC007222
镇咳糖浆	中成药	ZC007267
止咳梨糖浆	中成药	ZC007335
止咳枇杷颗粒	中成药	ZC007338
止咳祛痰糖浆	中成药	ZC007344

续表

制剂名称	类别	序号
治咳枇杷露	中成药	ZC007423
痔疮止血颗粒	中成药	ZC007441
珠芽蓼止泻颗粒	中成药	ZC007499
壮肾安神片	中成药	ZC007535
紫桔止咳糖浆	中成药	ZC007602

HY002598 蔗糖铁

【外文名称】Ferrous Saccharose

药物理化信息

【化学名】氢氧化铁蔗糖复合物

【分子式】$[Na_2Fe_5O_8(OH)]N\cdot M(C_{12}H_{22}O_{11})$

【分子量】34000.00

【性状及组成】本品为蔗糖、亚铁按4:1摩尔比络合，通过碱化蔗糖与硫酸亚铁铵反应，酸化后制得，可制成固体或液体制品。分子量：34000～60000Da。

药物药理信息

【药理毒理】一种补充人体微量元素铁、治疗缺铁性贫血的铁的络合物蔗糖铁。具有无胃肠道刺激性和不良口感，其亚铁不易氧化，生物利用度高，原料来源易得，价格低廉的优点，是一种新型的补铁剂。

多核氢氧化铁（Ⅲ）核心表面被大量非共价结合的蔗糖分子所包围，从而形成一个平均分子量为43kDa的复合物。这种大分子结构可以避免从肾脏被消除。这种复合物结构稳定，在生理条件下不会释放出铁离子。多核核心的铁被环绕的结构与生理状态下的铁蛋白结构相似。使用本品会引起人体生理的改变，其中包括对铁的摄入。

本品毒性很低。白色小鼠静脉给予本品后的Dsa＞200mg铁/kg体重，因此治疗指数约为30（200/7）。

【药代动力学】给健康志愿者单剂量静脉注射含100mg铁的本品，10分钟后的水平达到最高，平均为538μmol/L。中央室分布容积与血浆容积相等。注射的铁在血浆中被快速排除，半衰期约为6小时。稳态分布容积约为8L，说明铁在人体中分布少。由于本品比转铁蛋白稳定性低，可以看到铁到转铁蛋白的竞争性交换。结果铁的转运速率为31mg铁/24小时。

注射本品后的前4小时铁清除量不到全部清除量的5%。在24小时后，血浆中铁的水平下降到注射前铁的水平，约75%的蔗糖被排泄。

【药物相互作用】和所有的非肠道铁剂一样，本品会减少口服铁剂的吸收。所以本品不能与口服铁剂同时使用。因此口服铁剂的治疗应在注射完本品的5天之后开始使用。

【药物过量】用药过量会导致急性铁过载，表现为高铁血症。用药过量应采用有效的方法必使用铁螯合剂。

【不良反应】罕见过敏反应。

据报道偶而会出现下列不良反应：金属味，头痛，恶心，呕吐，腹泻，低血压，肝酶升高，痉挛/腿部痉挛，胸痛，嗜睡，呼吸困难，肺炎，咳嗽，瘙痒等。

极少出现副交感神经兴奋，胃肠功能障碍，肌肉痛，发热，风疹，面部潮红，四肢肿胀，呼吸困难，在输液的部位发生过静脉曲张，静脉痉挛。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
蔗糖铁注射液	化学药	HZ004650

HY002599　蔗糖硬脂酸酯

【外文名称】Sucrose Stearate

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

【性状及组成】本品为蔗糖的硬脂酸酯混合物。

本品为白色至淡黄褐色的块状固体或粉末；无臭或略有臭，无味。

本品在热的正丁醇、三氯甲烷或四氢呋喃中溶解。

药物药理信息

【药理毒理】药用辅料。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
貂胰防裂软膏	民族药	MZ000093
日晒防治膏	民族药	MZ000451

HY002600　蒸馏水

【外文名称】Destilled Water

【性状及组成】本品为无色的澄明液体；无臭，无味。

药物药理信息

【药理毒理】溶剂、稀释剂。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
丹芎跌打膏	中成药	ZC000755

HY002601　植酸钠

【外文名称】Sodium Phytate

【分子式】$C_6H_{18}O_{24}P_6$

【分子量】660.00

药物药理信息

【药理毒理】本品不直接使用，无单独的药理毒理作用

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用亚锡植酸钠	化学药	HZ005041

HY002602　止咳酮

【外文名称】Antitussone

药物药理信息

【药理毒理】本品为烈香杜鹃的主要有效成分4-苯基丁酮-（2）亚硫酸氢钾加成物，为中枢性镇咳药，尚有一定的祛痰、平喘和镇静作用。主要用于上呼吸道感染所致的咳嗽。

【不良反应】个别患者有口干、胸闷、恶心、头晕等副作用。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
化痰消咳片	中成药	ZC002227

HY002603　制霉素

【其他名称】制霉菌素

【外文名称】Nysfungin

药物管理信息

【依据标准】卫生部颁药品标准（抗生素药品）·第1册

【性状及组成】本品为黄色或棕黄色粉末，有引湿性；对光、空气、酸或碱均不稳定。

本品在二甲基甲酰胺中溶解，在甲醇中微溶。在水中极微溶解，在丙酮、三氯甲烷或乙醚中不溶。

药物药理信息

【药理毒理】本品为多烯类抗真菌药，具广谱抗真菌作用，对念珠菌属的抗菌活性高，新型隐球菌、曲菌、毛霉菌、小孢子菌、荚膜组织浆胞菌、皮炎

芽生菌及皮肤癣菌通常对本品亦敏感。

本品可与真菌细胞膜上的甾醇相结合，致细胞膜通透性的改变，以致重要细胞内容物漏失而发挥抗真菌作用。

【药代动力学】本品口服后胃肠道不吸收，给常用口服量后血药浓度极低，对全身真菌感染无治疗作用。几乎全部服药量自粪便内排出。局部外用亦不被皮肤和黏膜吸收。

【不良反应】口服较大剂量时可发生腹泻、恶心、呕吐和上腹疼痛等消化道反应，减量或停药后迅速消失。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
三维制霉素栓	化学药	HZ003167
硝呋太尔制霉素阴道软胶囊	化学药	HZ003690
硝呋太尔制霉素阴道栓	化学药	HZ003691
制霉素片	化学药	HZ004660
制霉素阴道泡腾片	化学药	HZ004661
制霉素阴道栓	化学药	HZ004662

HY002604 中链甘油三酯

【其他名称】MCT

【外文名称】MCT Fat

药物理化信息

【化学名】为中性的辛酸（约60%）和癸酸（约40%）的混合物。

药物药理信息

【药理毒理】中链甘油三酯比长链甘油三酯更快从血中清除及更快氧化供能。更适合为机体提供能量，尤其是那些因肉毒碱转运酶缺乏或活性降低而不能利用长链甘油三酯的患者。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
脂肪乳注射液（中链及长链复合剂）	化学药	HZ004655

HY002605 中性胰岛素

【外文名称】Neutral Insulin

【性状及组成】胰岛素（猪或牛）的灭菌水溶液。每100ml中可含甘氨酸1.4～1.6g与间甲酚0.22g。

药物药理信息

【药理毒理】本品为降血糖药。胰岛素的主要药效为降血糖，同时影响蛋白质和脂肪代谢，包括以下多方面的作用。

1．抑制肝糖原分解及糖原异生作用，减少肝输出葡萄糖。

2．促使肝摄取葡萄糖及肝糖原的合成。

3．促使肌肉和脂肪组织摄取葡萄糖和氨基酸，促使蛋白质和脂肪的合成和贮存。

4．促使肝生成极低密度脂蛋白并激活脂蛋白脂酶，促使极低密度脂蛋白的分解。

5．抑制脂肪及肌肉中脂肪和蛋白质的分解，抑制酮体的生成并促进周围组织对酮体的利用。

【药代动力学】口服易被胃肠道消化酶破坏。皮下给药吸收迅速，皮下注射后0.5～1小时开始生效，2～4小时作用达高峰，维持时间5～7小时；静脉注射10～30分钟起效，15～30分钟达高峰，持续时间0.5～1小时。静注的胰岛素在血液循环中半衰期为5～10分钟，皮下注射后半衰期为2小时。皮下注射后吸收很不规则，不同注射部位胰岛素的吸收可有差别，腹壁吸收最快，上臂外侧比股前外侧吸收快；不同病人吸收差异很大，即使同一病人，不同时间也可能不同。胰岛素吸收到血液循环后，只有5%与血浆蛋白结合，但可与胰岛素抗体相结合，后者使胰岛素作用时间延长。主要在肾与肝中代谢，少量由尿排出。

【药物相互作用】

1．糖皮质类固醇、促肾上腺皮质激素、胰高血糖素、雌激素、口服避孕药、肾上腺素、苯妥英钠、噻嗪类利尿剂、甲状腺素等可不同程度地升高血糖浓度，同用时应调整这些药或胰岛素的剂量。

2．口服降糖药与胰岛素有协同降血糖作用。

3．抗凝血药、水杨酸盐、磺胺类药及抗肿瘤药甲氨蝶呤等可与胰岛素竞争和血浆蛋白结合，从而使血液中游离胰岛素水平增高。非甾体消炎镇痛药可增强胰岛素降血糖作用。

4．β－受体阻滞剂如普萘洛尔可阻止肾上腺素升高血糖的反应，干扰肌体调节血糖功能，与胰岛素同用可增加低血糖的危险，而且可掩盖低血糖的症状，延长低血糖时间。合用时应注意调整胰岛素剂量。

5．中等量至大量的酒精可增强胰岛素引起的低血糖的作用，可引起严重、持续的低血糖，在空腹或肝糖原贮备较少的情况下更易发生。

6．氯喹、奎尼丁、奎宁等可延缓胰岛素的降解，在血中胰岛素浓度升高从而加强其降血糖作用。

7．升血糖药物如某些钙通道阻滞剂、可乐定、丹那唑、二氮嗪、生长激素、肝素、H_2受体拮抗剂、

大麻、吗啡、尼古丁、磺吡酮等可改变糖代谢，使血糖升高，因此胰岛素同上述药物合用时应适当加量。

8．血管紧张素转化酶抑制剂、溴隐亭、氯贝特、酮康唑、锂、甲苯咪唑、吡多辛、茶碱等可通过不同方式直接或间接致血糖降低，胰岛素与上述药物合用时应适当减量。

9．奥曲肽可抑制生长激素、胰高血糖素及胰岛素的分泌，并使胃排空延迟及胃肠道蠕动减缓，引起食物吸收延迟，从而降低餐后高血糖，在开始用奥曲肽时，胰岛素应适当减量，以后再根据血糖调整。

10．吸烟：可通过释放儿茶酚胺而拮抗胰岛素的降血糖作用，吸烟还能减少皮肤对胰岛素的吸收，所以正在使用胰岛素治疗的吸烟患者突然戒烟时，应观察血糖变化，考虑是否需适当减少胰岛素用量。

【药物过量】对糖尿病患者，如用量过大或未按规定进食，均可引起血糖过低甚至产生低血糖性昏迷，有先兆症状时应口服葡萄糖、进食糕饼或糖水，如病人失去知觉，应肌肉、皮下或静脉注射胰高血糖素，神志清醒后，口服糖类物质。对胰高血糖素无反应者，须静注葡萄糖溶液。

【不良反应】

1．过敏反应、注射部位红肿、瘙痒、荨麻疹、血管神经性水肿。

2．低血糖反应，出汗、心悸、乏力，重者出现意识障碍、共济失调、心动过速甚至昏迷。

3．胰岛素抵抗，日剂量需超过200单位以上。

4．注射部位脂肪萎缩、脂肪增生。

5．眼屈光失调。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
中性胰岛素注射液	化学药	HZ004663

HY002606　仲丁比妥

【外文名称】Secbutabarbital

药物管理信息

【特殊管理分类】二类精神药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安〔2007〕633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为精神药品，但我国未生产或使用。

HY002607　重质碳酸镁

【外文名称】Heavy Magnesium Carbonate

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】水合碱式碳酸镁

【分子式】〔$(MgCO_3)_3 \cdot Mg(OH)_2 \cdot 4H_2O$〕

【分子量】383.20

【性状及组成】本品为白色颗粒性粉末，无臭，几乎无味。

本品在水或乙醇中几乎不溶，但能使水显弱碱性；在稀酸中能泡沸溶解。

药物药理信息

【药理毒理】抗酸药。用于胃及十二指肠溃疡的治疗。

【药物相互作用】本品与苯巴比妥钠，pH≥5的地西泮溶液，某些两元混合物（粉末）及兰索拉唑配伍禁忌。酸可以溶解碳酸镁并释放二氧化碳。其水溶液稍带碱性。碳酸镁在pH1.12时可增加乙酰唑胺的溶解度，在pH7.4时阻滞其溶解。

【不良反应】碳酸镁作为口服固体制剂的辅料，通常被认为无毒、无刺激性，但肾损伤的患者忌用镁盐，如碳酸镁。

碳酸镁与胃酸反应，生成氯化镁和CO_2，因此，对于不能忍受胃中CO_2作用的患者来说，不可用作抗酸剂。某些镁吸收后由尿排泄。与其他镁盐一样，碳酸镁有轻微通便作用，可以引起腹泻。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
铋镁碳酸氢钠片	化学药	HZ000409
复方甘铋镁片	化学药	HZ001172
复方铝酸铋胶囊	化学药	HZ001289
复方铝酸铋颗粒	化学药	HZ001290
复方铝酸铋片（1）	化学药	HZ001291
复方铝酸铋片（2）	化学药	HZ001292
复方石菖蒲碱式碳酸铋片	化学药	HZ001377
复方碳酸钙咀嚼片	化学药	HZ001400
复方胃膜素胶囊	化学药	HZ001430
铝镁司片	化学药	HZ002463

HY002608　猪去氧胆酸

【其他名称】异去氧胆酸、猪脱氧胆酸

【外文名称】Hyodeoxycholic Acid

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 1 部

药物理化信息

【化学名】3α，6α－二羟基－5β－胆烷酸

【分子式】$C_{24}H_{40}O_4$

【分子量】392.58

【性状及组成】本品由猪胆汁经提取、加工制得。

本品为白色或类白色的粉末，无臭，味微苦。

本品在乙醇中易溶，在丙酮中微溶。在乙酸乙酯、三氯甲烷或乙醚中极微溶解，在水中几乎不溶。

熔点：本品的熔点不得低于 170℃，熔融时同时分解。

药物药理信息

【药理毒理】

1．人工牛黄原料药。

2．能抑制胆酸形成及溶解脂肪，降低血中胆固醇及甘油三酯。用于Ⅱ型高脂蛋白血症，疗效不显著。

【不良反应】口服偶可引起肠胃不适、轻泻。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
贝羚胶囊	中成药	ZC000300
贝羚散	中成药	ZC000301
冠通片	中成药	ZC001924
解热消炎胶囊	中成药	ZC002637
清开灵滴丸	中成药	ZC004094
清开灵分散片	中成药	ZC004095
清开灵口服液	中成药	ZC004098
清开灵泡腾片	中成药	ZC004099
清开灵片	中成药	ZC004100
清开灵软胶囊	中成药	ZC004101
清开灵注射液	中成药	ZC004102
注射用清开灵	中成药	ZC007518

HY002609 注射用水

【外文名称】Water for Injection

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

【分子式】H_2O

【分子量】18.02

【性状及组成】本品为纯化水经蒸馏所得的水。

本品为无色的澄明液体；无臭，无味。

药物药理信息

【药理毒理】配制注射剂用的溶剂。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
安乃近氯丙嗪注射液	化学药	HZ000136
复方氨基酸注射液（17AA－Ⅰ）	化学药	HZ001059
灭菌注射用水	化学药	HZ002705
维 D_2 果糖酸钙注射液	化学药	HZ003521
溴米那普鲁卡因注射液	化学药	HZ003813
盐酸奈福泮氯化钠注射液	化学药	HZ004209
盐酸奈福泮葡萄糖注射液	化学药	HZ004211

HY002610 紫杉醇

【外文名称】Paclitaxel

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第 25 册

药物理化信息

【化学名】（2*S*，5*R*，7*S*，10*R*，13*S*）－10，20－双（乙酰氧基）－2－苯甲酰氧基－1，7－二羟基－9－氧代－5，20－环氧紫杉烷－11－烯－13－基（3*S*）－3－苯甲酰氨基－3－苯基－D－乳酸酯

【分子式】$C_{47}H_{51}NO_{14}$

【分子量】853.92

【性状及组成】本品为白色结晶性粉末，无臭，无味。

本品在甲醇、乙醇或三氯甲烷中溶解，在乙醚中微溶，在水中几乎不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加甲醇溶解并定量稀释制成每 1ml 中含 3mg 的溶液，依法测定，比旋度应为－48°至－56°。

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：本品为细胞毒类抗肿瘤药，可促进微管双聚体装配并阻止其解聚，也可导致整个细胞周期微管的排列异常和细胞分裂期间微管星状体的产生，从而阻碍细胞分裂，抑制肿瘤生长。

体外实验证明紫杉醇具有显著的放射增敏作用，可能是使细胞中止于对放疗敏感的 G_2 和 M 期。

2．毒理

（1）遗传毒性：体外（人淋巴细胞染色体畸变试验）和体内（小鼠微核试验）试验显示紫杉醇是一种诱裂剂，但在 Ames 试验和 CHO/HGPRT 基因突

变试验中未见其有致突变性。

（2）生殖毒性：大鼠在交配前和交配期间给予紫杉醇，日剂量达1mg/kg（按体表面积折算，约为临床日推荐最大剂量的0.04倍）或以上时，可导致雌、雄大鼠生育力损伤，在此剂量下，本品引起生育力和生殖指数下降及胚胎毒性增加。

家兔在器官形成期给予紫杉醇3mg/kg·d，（按体表面积折算，约为临床日推荐最大剂量的0.2倍），可引起子宫内死亡、吸收胎增加、死胎增加等胚胎和胎仔毒性，同时可见母体毒性。日剂量为1mg/kg（按体表面积折算，约为临床日推荐最大剂量的1/15）时，未见致畸作用。在更高剂量下，由于胎仔大量死亡，无法对本品的致畸性进行评价。尚无充分的和严格对照的孕妇临床研究资料，如果患者在妊娠期间使用本品，或在使用本品期间怀孕，应被告之本品对胎儿的潜在危害。接受本品治疗的育龄妇女应避免怀孕。

尚不清楚本品是否从人乳中排泄，大鼠在产后9～10天静脉给予^{14}C标记的紫杉醇，可见其乳汁中的放射浓度高于血浆，并与血浆浓度平行衰减。鉴于许多药物都能从人乳中排泄和本品可能给哺乳婴儿带来严重不良反应，在接受本品治疗时，建议停止哺乳。

【药代动力学】肿瘤病人滴注紫杉醇后，血浆中药物呈双相消除，消除半衰期平均为5.3～17.4小时。本品蛋白结合率89%～98%，紫杉醇在肝脏代谢。紫杉醇主要在肝脏代谢，随胆汁进入肠道，经粪便排出体外（>90%）。经肾清除只占总清除的1%～8%，肾功能不全者一般紫杉醇在肝肾功能不全的病人体内代谢尚不明确。

【药物相互作用】药代动力学资料证明顺铂后给予本品，本品清除率大约降低30%，骨髓毒性较为严重。同时应用酮康唑影响本品的代谢。

【药物过量】尚无相应的解毒药。用药过量最主要的，可预测的并发症包括骨髓抑制，外周神经毒性及黏膜炎。

【不良反应】

1．过敏反应：发生率为39%，其中严重过敏反应发生率为2%。多数为Ⅰ型变态反应，表现为支气管痉挛性呼吸困难，荨麻疹和低血压。几乎所有的反应发生在用药后最初的10分钟。

2．骨髓抑制：为主要剂量限制性毒性，表现为中性粒细胞减少，血小板降低少见，一般发生在用药后8～10日。严重中性粒细胞发生率为47%，严重的血小板降低发生率为5%。贫血较常见。

3．神经毒性：周围神经病变发生率为62%，最常见的表现为轻度麻木和感觉异常，严重的神经毒性发生率为6%。

4．心血管毒性：可有低血压和无症状的短时间心动过缓。肌肉关节疼痛：发生率为55%，发生于四肢关节，发生率和严重程度呈剂量依赖性。

5．胃肠道反应：恶心，呕吐，腹泻和黏膜炎发生率分别为59%，43%和39%，一般为轻和中度。

6．肝脏毒性：为ALT，AST和AKP升高。

7．脱发：发生率为80%。

8．局部反应：输注药物的静脉和药物外渗局部的炎症。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用紫杉醇脂质体	化学药	HZ005135
紫杉醇注射液	化学药	HZ005140
复方红豆杉胶囊	中成药	ZC001386

HY002611　紫氧化铁

【外文名称】Purple Ferric Oxide

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

【分子式】Fe_2O_3

【分子量】159.69

【性状及组成】本品为暗紫红色粉末，无臭，无味。

本品在水中不溶，在沸盐酸中易溶。

本品按灼炽至恒重后计算，含Fe2O3不得少于98.0%。

药物药理信息

【药理毒理】药用辅料，着色剂。

HY002612　棕榈氯霉素

【外文名称】Chloramphenicol Palmitate

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】为A晶型或B晶型的D－苏－（－）－N－［α－（羟基甲基）－β－羟基－对硝基苯乙基］－2,2－二氯乙酰胺－α－棕榈酸酯

【分子式】$C_{27}H_{42}Cl_2N_2O_6$

【分子量】561.55

【性状及组成】本品为白色或类白色粉末，几乎无臭，无味。本品在丙酮或三氯甲烷中易溶，在乙醇中略溶，在水中不溶。

熔点：本品经60℃干燥2小时，依法测定，A晶型的熔点为89～95℃；B晶型的熔点为89～91℃。

比旋度：取本品，精密称定，加无水乙醇溶解并稀释成每1ml中含50mg的溶液，依法测定，比旋度为+22°至+25°。

药物药理信息

【药理毒理】本品为氯霉素的棕榈酸酯，在体外无抗菌活性，口服后在十二指肠中经胰脂酶水解成氯霉素吸收入体内而发挥抗菌作用。对需氧革兰阴性菌及革兰阳性菌、厌氧菌、立克次体属、螺旋体和衣原体属均具抗菌活性。对下列细菌具杀菌作用：流感杆菌、肺炎链球菌和脑膜炎奈瑟菌。对以下细菌仅具抑菌作用：金黄色葡萄球菌、化脓性链球菌、草绿色链球菌、B组溶血性链球菌、大肠杆菌、肺炎克雷伯菌、奇异变形杆菌、伤寒沙门菌、副伤寒沙门菌、志贺菌属、脆弱拟杆菌等厌氧菌。下列细菌通常对氯霉素耐药：铜绿假单胞菌、不动杆菌属、肠杆菌属、黏质沙雷菌、吲哚阳性变形杆菌属、甲氧西林耐药葡萄球菌和肠球菌属。

本品属抑菌剂。氯霉素为脂溶性，通过弥散进入细菌细胞内，并可逆性地结合在细菌核糖体的50S亚基上，使肽链增长受阻（可能由于抑制了转肽酶的作用），因此抑制肽链的形成，从而阻止蛋白质的合成。

【药代动力学】本品口服后在十二指肠经胰脂酶缓慢水解成氯霉素吸收入人体内，所以其吸收过程较氯霉素为长，达峰时间较迟，血药峰浓度亦较低，但血药浓度维持时间则稍长。本品的生物利用度尚不明确，曾有报道2个月至14岁小儿一日剂量60～70mg/kg，服药后90分钟血药浓度为15.5～29mg/ml（平均为20.2mg/ml）。氯霉素吸收后广泛分布于全身组织和体液，在肝、肾组织中浓度高，其余依次为肺、脾、心肌、肠和脑组织。氯霉素可透过血脑屏障进入脑脊液中。脑膜无炎症时，脑脊液药物浓度为血药浓度的21%～50%，脑膜有炎症时可达血药浓度的45%～89%，新生儿及婴儿患者中可达50%～99%。本品也可透过血－胎盘屏障进入胎儿循环，胎儿血药浓度可达母体血药浓度的30%～80%。药物也可穿透血－眼屏障进入房水、玻璃体液内达治疗浓度。氯霉素尚可分泌至乳汁、唾液、腹水、胸水以及滑膜液中。分布容积为0.6～1L/kg。蛋白结合率约为50%～60%。在肝内游离药物的90%与葡萄糖醛酸结合为无活性的氯霉素单葡萄糖醛酸酯。24小时内5%～10%的给药量以原形由肾小球滤过排泄，80%以无活性的代谢产物由肾小管分泌排泄。口服后约有给药量的3%由胆汁分泌排出，1%由粪便中排出。透析对氯霉素的清除无明显影响。

【药物相互作用】

1．抗癫痫药（乙内酰脲类）。由于氯霉素可抑制肝细胞微粒体酶的活性，导致此类药物的代谢降低，或氯霉素替代该类药物的血清蛋白结合部位，均可使药物的作用增强或毒性增加，故当与氯霉素同用时或在其后应用须调整此类药物的剂量。

2．与降血糖药（如甲苯磺丁脲）同用时，由于蛋白结合部位被替代，可增强其降糖作用，因此需调整该类药物剂量。格列吡嗪和格列本脲的非离子结合特点，使其所受影响较其他口服降糖药为小，但同用时仍须谨慎。

3．长期口服含雌激素的避孕药，如同时服用氯霉素，可使避孕的可靠性降低，以及经期外出血增加。

4．由于本品可具有维生素B_6拮抗剂的作用或使后者经肾排泄量增加，可导致贫血或周围神经炎。因此维生素B_2与本品合用时机体对前者的需要量增加。

5．本品可拮抗维生素B_{12}的造血作用，因此两者不宜同用。

6．与某些骨髓抑制药同用时，可增强骨髓抑制作用，如抗肿瘤药物、秋水仙碱、羟基保泰松、保泰松和青霉胺等，同时进行放射治疗时，亦可增强骨髓抑制作用，须调整骨髓抑制剂或放射治疗的剂量。

7．如在术前或术中应用，由于本品对肝酶的抑制作用，可降低诱导麻醉药阿芬他尼的清除，延长其作用时间。

8．苯巴比妥、利福平等肝药酶诱导剂与本品同用时，可增强其代谢，致使血药浓度降低。

9．与林可霉素类或红霉素等大环内酯类抗生素合用可发生拮抗作用，因此不宜联合应用。

【药物过量】本品无特异性拮抗药，药物过量时应给予对症和支持治疗，如洗胃、催吐、补液及大量饮水等。

【不良反应】

1．对造血系统的毒性反应是氯霉素最严重的不良反应。有两种不同表现形式：①与剂量有关的可逆性骨髓抑制，常见于血药浓度超过25mg/L的患者，临床表现为贫血，并可伴白细胞和血小板减少。②与剂量无关的骨髓毒性反应，常表现为严重的、不可逆性再生障碍性贫血，发生再生障碍性贫血者可有数周至数月的潜伏期，不易早期发现，其临床表现有血小板减少引起的出血倾向，如瘀点、瘀斑和鼻衄等，以及由粒细胞减少所致感染征象，如高热、咽痛、黄疸、苍白等。绝大多数再生障碍性贫血于口服氯霉素后发生。

2．溶血性贫血，可发生在某些先天性葡萄糖－6－磷酸脱氢酶不足的患者。

3．灰婴综合征，典型的病例发生在出生后48小时内即投予高剂量的氯霉素，治疗持续3～4日后可发生灰婴综合征，血药浓度可高达40～200mg/L。临床表现为腹胀、呕吐、进行性苍白、发绀、微循环障碍，体温不升、呼吸不规则。常发生在早产儿或新生儿应用大剂量氯霉素（按体重一日超过25mg/kg）时，类似表现亦可发生在成人或较大儿童应用更大剂量（按体重一日约100mg/kg）时。及早停药，尚可完全恢复。

4．用本品长程治疗可诱发出血倾向，可能与骨髓抑制、肠道菌群减少致维生素K合成受阻、凝血酶原时间延长等均有关。

5．周围神经炎和视神经炎，常在长程治疗时发生，及早停药，常属可逆，也有发生视神经萎缩而致盲者。

6．消化道反应，可有腹泻、恶心、呕吐等。

7．过敏反应较少见。可致各种皮疹、日光性皮炎、血管神经性水肿。一般较轻，停药后可迅速好转。

8．二重感染，可致变形杆菌、铜绿假单胞菌、金黄色葡萄球菌、真菌等的肺、胃肠道及尿路感染。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
棕榈氯霉素（B型）颗粒	化学药	HZ005141
棕榈氯霉素（B型）片	化学药	HZ005142
棕榈氯霉素混悬液	化学药	HZ005143

HY002613　棕榈油

【外文名称】Palm Oil

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
月芝软胶囊	中成药	ZC007140

HY002614　棕氧化铁

【外文名称】Brown Ferric Oxide

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

【性状及组成】本品由红氧化铁、黑氧化铁及黄氧化铁按一定比例混合而成，按干燥品计算，含Fe_2O_3不得少于98.0%。

本品为红棕色的粉末，无臭，无味。

本品在水中不溶，在沸盐酸中易溶。

药物药理信息

【药理毒理】药用辅料，着色剂。

HY002615　组氨酸

【其他名称】L－Histidine、L－组氨酸

【外文名称】Histidine

药物管理信息

【依据标准】中国药典2005年版·第2部

药物理化信息

【化学名】L－2－氨基－3－（1*H*－咪唑－4）丙酸

【分子式】$C_6H_9N_3O_2$

【分子量】155.16

【性状及组成】本品为白色结晶或结晶性粉末，无臭，味微苦。

本品在水中溶解，在乙醇中极微溶，在乙醚中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加6mol/L盐酸溶液溶解并稀释成每1ml中约含0.11g的溶液，依法测定，比旋度为+12.0°至+12.8°。

药物药理信息

【药理毒理】药品作用类别：氨基酸类药。

用作营养增补剂；氨基酸输液；综合氨基酸制剂；医药用作消化道溃疡及心血管病。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
11氨基酸注射液－833	化学药	HZ000212
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
低分子右旋糖酐氨基酸注射液	化学药	HZ000673
复方氨基酸颗粒（14AA）	化学药	HZ001049
复方氨基酸口服溶液（14AA）	化学药	HZ001050
复方氨基酸（15）双肽（2）注射液	化学药	HZ001051
复方氨基酸注射液（9AA）	化学药	HZ001054
复方氨基酸注射液（14AA）	化学药	HZ001055
复方氨基酸注射液（15AA）	化学药	HZ001056
复方氨基酸注射液（15－HBC）	化学药	HZ001057
复方氨基酸注射液（17AA）	化学药	HZ001058
复方氨基酸注射液（17AA－H）	化学药	HZ001060
复方氨基酸注射液（17种氨基酸）	化学药	HZ001061

续表

制剂名称	类别	序号
复方氨基酸注射液（18）	化学药	HZ001062
复方氨基酸注射液（18AA）	化学药	HZ001063
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅰ）	化学药	HZ001064
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅱ）	化学药	HZ001065
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅲ）	化学药	HZ001066
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅳ）	化学药	HZ001067
复方氨基酸注射液（18AA－Ⅴ）	化学药	HZ001068
复方氨基酸注射液（18AA－N）	化学药	HZ001069
复方氨基酸注射液（18－B）	化学药	HZ001070
复方氨基酸注射液（20AA）	化学药	HZ001071
小儿复方氨基酸注射液（18AA－Ⅰ）	化学药	HZ003749
小儿复方氨基酸注射液（18AA－Ⅱ）	化学药	HZ003750
小儿复方氨基酸注射液（19AA－Ⅰ）	化学药	HZ003751
脂肪乳氨基酸葡萄糖注射液	化学药	HZ004653

HY002616 左苯丙胺

【外文名称】Levamfetamine

药物管理信息

【特殊管理分类】一类精神药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为精神药品，但我国未生产或使用。

HY002617 左啡诺

【外文名称】Levorphanol

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】本品为麻醉性镇痛药。用于中度至重度的疼痛止痛。

国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY002618 左芬啡烷

【外文名称】Levophenacylmorphan

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY002619 左甲苯丙胺

【外文名称】Levomethamphetamine

药物管理信息

【特殊管理分类】一类精神药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为精神药品，但我国未生产或使用。

HY002620 左甲状腺素钠

【其他名称】左旋甲状腺素

【外文名称】Levothyroxine Sodium

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第57册

药物理化信息

【化学名】*O*－（4－羟基－3,5－二碘苯基）－3,5－二碘－L－酪氨酸单钠盐水合物。

【分子式】$C_{15}H_{10}I_4NNaO_4$

【分子量】798.86

【性状及组成】本品为白色或微黄色结晶性粉末，无臭，无味；微有引湿性。

比旋度：取本品，精密称定，加1mol/L氢氧化钠溶液－乙醇（1:2）溶液溶解并稀释制成每1ml中约含30mg的溶液，必要时过滤，依法测定，比旋度为－5°至－6°

药物药理信息

【药理毒理】甲状腺激素，本品为人工合成的四碘甲状腺原氨酸钠，在体内转变成三碘甲腺氨酸而活性增强，具有维持人体正常生长发育、促进代谢、增加产热和提高交感－肾上腺系统的感受性。

【药代动力学】经用^{131}I标记的左甲状腺素钠研究证明，血清$t_{1/2}$为7天，组织中为0.4天，停药后仍可维持药效数周。口服后平均吸收50%。主要在肝中代谢，大部分由尿中排泄。

【药物相互作用】

1．左甲状腺素钠会增加抗凝剂作用。

2．左甲状腺素钠会升高血中苯妥英钠水平。

3．抗惊厥药如卡马西平和苯妥英钠加快左甲状腺素钠代谢，可将甲状腺素从血浆蛋白中置换出来。

4. 本品与强心苷一起使用，须相应调整强心苷用量。

5. 左甲状腺素钠也会增加拟交感性药物的作用。

6. 左甲状腺素钠增加儿茶酚胺受体敏感性，因此会增强三环抗抑郁药的作用。

7. 消胆胺减少左甲状腺素钠吸收，同时用口服避孕药，需增加左甲状腺素钠用量。

【药物过量】过量可引起毒性反应，如心悸、多汗、激动、震颤、消瘦、体温升高、中枢兴奋失眠，重者可引起呕吐、腹泻、发热、心动过速且不规则、心绞痛、肌肉震动甚至痉挛、心衰等。一旦发生需立即停药1周，再从小剂量开始。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
左甲状腺素钠片	化学药	HZ005144

HY002621　左卡尼汀

【其他名称】贝康亭、盖雷、卡尔特、L－carnitine、Vitamin BT、维生素BT、左旋肉毒碱、左旋肉碱

【外文名称】Levocarnitine

药物理化信息

【化学名】（*R*）－3－羧基－2－羟基－*N*，*N*，*N*－三甲基－1－丙胺氢氧化物内盐

【分子式】$C_7H_{15}NO_3$

【分子量】161.20

药物药理信息

【药理毒理】左卡尼汀是哺乳动物能量代谢中需要的体内天然物质，其主要功能是促进脂类代谢。在缺氧、缺血时，脂酰－CoA堆积，线粒体内的长链脂酰卡尼汀也堆积，游离卡尼汀因大量消耗而减低。缺血缺氧导致细胞死亡。另外，缺氧时以糖无氧酵解为主，脂肪酸等堆积导致酸中毒，离子紊乱，细胞自溶死亡。足够量的游离卡尼汀可以使堆积的脂酰－CoA进入线粒体内，减少其对腺嘌呤核苷酸转位酶的抑制，使氧化磷酸化得以顺利进行。左卡尼汀是肌肉细胞尤其是心肌细胞的主要能量来源，脑、肾等许多组织器官亦主要靠脂肪酸氧化供能。卡尼汀还能增加还原型烟酰胺腺嘌呤核苷酸（NADH）细胞色素C还原酶、细胞色素氧化酶的活性、加速ATP的产生，参与某些药物的解毒作用。对于各种组织缺血缺氧，左卡尼汀通过增加能量产生而提高组织器官的供能。左卡尼汀的其他功能有：中等长链脂肪酸的氧化作用；脂肪酸过氧化物酶的氧化作用；对结合的辅酶A和游离辅酶A二者比率的缓冲作用；从酮类物质、丙酮酸、氨基酸（包括支链氨基酸）中产生能量，去除过高辅酶A的毒性，调节血中氨浓度。

毒理作用：对鼠伤寒沙门菌，酿酒酵母菌，人体酵母菌致突变试验表明，左卡尼汀无致突变性。没有长期的动物研究来评估左卡尼汀是否具有潜在的致癌性。

在鼠和兔生殖研究中，按体表面积计。3.8倍的人用剂量对生殖器或胎儿未造成损害，然而，没有足够满意的怀孕妇女的研究，由于动物生殖研究并不能预示人类反应，这种药只有在孕妇确切需要时才能使用。

【药代动力学】按20mg/kg的剂量，在3分钟内缓慢静脉注射后，血浆左卡尼汀符合二室模型。单次静脉管给药，在0～24小时内，大约76%左卡尼汀经尿排出。不计内源性左卡尼汀，血浆左卡尼汀的平均分布半衰期为0.585小时，平均终末清除半衰期为17.4小时，总的人体清除率平均为4.0L/h，本品不与血浆蛋白或蛋白结合，主要代谢产物为三甲胺－*N*－氧化物和^3H－r－丁酸甜菜碱，约有58%～65%由尿和粪排泄。

【药物相互作用】根据临床潜在的意义：接受丙戊酸的患者需增加左卡尼汀的用量。

【药物过量】还没有过量左卡尼汀引起毒性的报道。口服左卡尼汀可以很容易通过血透清除，口服左卡尼汀在老鼠的LD_{50}是19.2g/kg，静脉是5.4g/kg。大剂量左卡尼汀可引起腹泻。

【不良反应】主要为一过性的恶心和呕吐，身体出现特殊气味，恶心和胃炎不常发生，由于引起这些反应和病理复杂，很难估测这些反应的发生率。

口服或静脉注射左卡尼汀可引起癫痫发作，不论先前是否有癫痫病史，先前有癫痫发作的患者，可诱发癫痫或使癫痫加重。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
肠内营养粉（AA）	化学药	HZ000517
维生素BT胶囊	化学药	HZ003552
维生素BT片	化学药	HZ003553
注射用左卡尼汀	化学药	HZ005136
左卡尼汀胶囊	化学药	HZ005145
左卡尼汀口服溶液	化学药	HZ005146
左卡尼汀葡萄糖注射液	化学药	HZ005147
左卡尼汀注射液	化学药	HZ005148

HY002622 左氯甲箭毒

【其他名称】Dimethyltubocurarinium Chloride、二甲筒箭毒碱、海轮碱Ⅱ、氯二甲箭毒、氯甲二甲左箭毒次碱、氯甲左箭毒、Metocurine Chloride、银不换Ⅱ、左旋氯甲箭毒

【外文名称】Lavocurarine Methylchloride

药物管理信息

【依据标准】化学药品地标升国标·第7册

药物理化信息

【化学名】氯化－*N*，*N*，*O*，*O*－四甲基左旋箭次碱

【分子式】$C_{40}H_{48}Cl_2N_2O_6$

【分子量】723.74

【性状及组成】本品为从海南轮环藤的茎中或同一科植物毛叶轮环藤的根部提出的左旋箭毒碱经甲基化后形成。

本品为淡黄色或淡棕黄色的结晶性粉末，有氨臭，具引湿性。

本品在水中极易溶解，在乙醇和甲醇中易溶，在三氯甲烷或乙醚中不溶。

比旋度：取本品，精密称定，加水溶解并稀释制成每1ml中含5mg的溶液，依法测定，比旋度为－140°至－170°。

药物药理信息

【药理毒理】本品为非去极化型肌肉松弛剂，作用及其原理均与筒箭毒碱相似，但对动物的治疗指数为筒箭毒碱的1.4倍。主要作用于神经肌肉接头处，封闭了终极区的乙酰胆碱受体，导致神经肌肉阻滞，从而产生肌肉松弛。

临床试用于静脉复合麻醉、中药麻醉及乙醚麻醉，也用于气管插管、胸部手术、腹部手术，效果良好。

【药代动力学】生效快，持续时间30～60分钟。

【药物过量】个别患者用药累计量达100mg时未见毒性反应。

【不良反应】不良反应较小。部分患者血压轻度上升或下降，心率稍增快（每分增10次左右），呼吸减慢。对心电图及肝、肾功能未见明显影响。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
左氯甲箭毒注射液	化学药	HZ005149

HY002623 左吗拉胺

【外文名称】Levomoramide

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY002624 左美沙芬

【外文名称】Levomethorphan

药物管理信息

【特殊管理分类】麻醉药

药物药理信息

【药理毒理】国食药监安［2007］633号文件《关于公布麻醉药品和精神药品品种目录的通知》规定本品为麻醉药品，但我国未生产或使用。

HY002625 左羟丙哌嗪

【外文名称】Levodropropizine

药物理化信息

【化学名】*S*（－）－3－（4－苯基－1－哌嗪）－1,2－丙二醇

【分子式】$C_{13}H_{20}N_2O_2$

【分子量】236.00

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末。

本品在三氯甲烷中易溶，在乙醇中溶解，水和丙醇中略溶，在乙醚中几乎不溶。

比旋度：－29.0°～－30.8°。

药物药理信息

【药理毒理】本品为外周性镇咳药，通过对气管、支气管C－纤维外周选择性抑制作用而发挥镇咳作用。它的作用部位在外周节后与感觉性神经肽相关的位点。它镇咳作用强，维持时间长。由于与*β*－肾上腺素受体、M胆碱受体和阿片受体均无作用，因此它的中枢抑制的不良反应较少，是一种高效安全的镇咳药物。

对大鼠和狗进行亚急性和长期毒性试验资料显示，用药期间的主要现象有大鼠流涎，摄食量和体重下降，狗的中枢镇静、外周扩血管及心率增加；高剂量时对两种动物有肝毒性。试验发现两种动物最大耐受口服日剂量为24mg/kg，此剂量为临床用量的10倍。在临床用量30倍时左羟丙哌嗪才有微小作用。

【药代动力学】口服后迅速吸收，生物利用度>75%。健康人口服单剂量30～90mg时，0.25～1

小时达到血药高峰，与剂量相关；口服本品 30、60、90mg 时，血清峰浓度分别为 81～263、122～436、279～651ng/ml；血浆蛋白结合率 11%～14%，$t_{1/2}$为 1～2 小时左右。

本品在体内被广泛代谢，代谢产物为共轭体、羟基化、共轭羟基化产物，活性不明。35%原形和代谢产物在口服 48 小时内从尿排出。尚无有关食物影响本药品吸收的资料。

【药物相互作用】

1．经对实验动物进行的药理研究，本品在神经系统的药物吸收迅速。

2．对胰岛素的降糖作用以及消化系统药物亦有影响。

3．对特别敏感的病人，同时服用抑制性药物时需慎重。

4．临床研究未发现对同时服用其他治疗支气管肺炎的药物有不良作用。

【药物过量】过量服用，可能导致轻度间歇性心跳加速，应立即采取措施，如洗胃，服用活性炭，或肠道灌液等。

【不良反应】不良反应较少，主要表现为胃肠道反应，恶心、上腹部疼痛、消化不良、呕吐、腹泻，中枢神经系统反应，疲乏、眩晕、嗜睡、头痛，及心悸、口干等，偶见视觉障碍，皮疹、呼吸困难罕见。高剂量时可见转氨酶的短暂性升高。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
左羟丙哌嗪含片	化学药	HZ005150
左羟丙哌嗪胶囊	化学药	HZ005151
左羟丙哌嗪片	化学药	HZ005152

HY002626　左炔诺孕酮

【其他名称】左旋甲基炔诺酮

【外文名称】Levonorgestrel

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（－）－13－乙基－17－羟基－18，19－双去甲基－17α－孕甾－4－烯－20－炔－3－酮

【分子式】$C_{21}H_{28}O_2$

【分子量】312.47

【性状及组成】本品为白色或类白色结晶性粉末，无臭，无味。本品在三氯甲烷中溶解，在甲醇中微溶，在水中不溶。

熔点：本品的熔点为 233～239℃，熔距在 5℃以内。

比旋度：取本品，精密称定，加三氯甲烷溶解并定量稀释制成每 1ml 中约含 20mg 的溶液，依法测定，比旋度为－30°至－35°。

药物药理信息

【药理毒理】左炔诺孕酮为孕激素。具有较强抑制垂体分泌促性腺激素的作用而抑制排卵；它能使宫颈黏液变稠，阻碍精子穿透，又能使子宫内膜萎缩不利于孕卵着床，因而起到避孕作用。

【药代动力学】口服易自胃肠道吸收。口服左炔诺孕酮 1mg，2、8 及 24 小时测定血药浓度，依次为 8.1、3.8 及 1.3ng/ml。$t_{1/2}$为 5.5～10.4 小时。

口服后主要分布：肝、肾、卵巢及子宫。主要在肝内代谢。代谢物主要为 3α、5β－四氢甲基炔诺酮。24 小时即可排除绝大部分，且体内无滞留。

硅胶棒埋植于皮下，属零级释放型。一日释放 68μg，以后每日释放量逐渐下降，一年末为 40μg，5 年末为 30μg。

【药物相互作用】如正在使用其他药品。尤其是苯巴比妥、苯妥英钠、解热镇痛药、保泰松、利福平、卡马西平、大环内酯类抗生素，四环素等药物，可影响本品的避孕效果。

【不良反应】偶有轻度恶心、呕吐，一般不需处理、可自行消失，如症状较重应向医师咨询。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
复方左炔诺孕酮滴丸	化学药	HZ001489
复方左炔诺孕酮片	化学药	HZ001490
三相避孕片	化学药	HZ003168
左炔诺孕酮硅胶棒（Ⅰ）	化学药	HZ005153
左炔诺孕酮硅胶棒（Ⅱ）	化学药	HZ005154
左炔诺孕酮聚己内酯棒	化学药	HZ005155
左炔诺孕酮片	化学药	HZ005156
左炔诺孕酮炔雌醇（三相）片	化学药	HZ005157
左炔诺孕酮炔雌醚片	化学药	HZ005158

HY002627　左旋多巴

【其他名称】Dopar、Larodopa、L－Dopa、左多巴

【外文名称】Levodopa

药物管理信息

【依据标准】中国药典 2005 年版·第 2 部

药物理化信息

【化学名】（－）－3－（3，4－二羟基苯基）－L－丙氨酸

【分子式】$C_9H_{11}NO_4$

【分子量】197.19

【性状及组成】本品为白色或类白色的结晶性粉末，无臭、无味。本品在水中微溶，在乙醇、三氯甲烷或乙醚中不溶；在稀酸中易溶。

比旋度：取本品约0.2g，精密称定，置25ml棕色量瓶中，加乌洛托品5g，再加盐酸溶液（9→100）溶解并稀释至刻度，摇匀，避光放置3小时，依法测定，比旋度为－159°至－168°。

吸收系数：取本品，精密称定，加盐酸溶液（9→1000）溶解并定量稀释制成每1ml中约含30μg的溶液，照分光光度法，在280nm的波长处测定吸光度，吸收系数为136～146。

药物药理信息

【药理毒理】本品为拟多巴胺类抗帕金森病药，左旋多巴为体内合成多巴胺的前体物质，本身并无药理活性，通过血脑屏障进入中枢，经多巴脱羧酶作用转化成多巴胺而发挥药理作用，改善帕金森病症状。由于本品可以增加脑内多巴胺及去甲肾上腺素等神经递质，还可以提高大脑对氨的耐受，而用于治疗肝昏迷，改善中枢功能，使病人清醒，症状改善。

【药代动力学】口服后由小肠吸收。空腹服后1～2小时血药浓度达峰值，广泛分布于体内各组织，1%进入中枢转化成多巴胺而发挥作用，其余大部分均在脑外代谢脱羧成多巴胺，故起效缓慢。半衰期为1～3小时，如用外周多巴脱羧酶抑制剂，可减少左旋多巴的用量，使之进入脑内的量增多，并可减少外周多巴胺引起的不良反应。口服后80%于24小时内降解成多巴胺代谢物，主要为高香草酸及二羟苯乙酸，由肾脏排泄，有些代谢物可使尿变红色。原形排出体外约5%，可通过乳汁分泌。

【药物相互作用】

1．本品与非选择性单胺氧化酶抑制剂合用可致急性肾上腺危象。

2．本品与罂粟碱或维生素B_2合用，可降低本品的药效。

3．本品与乙酰螺旋霉素合用，可显著降低本品的血药浓度，药效减弱。

4．本品与利血平合用，可抑制本品的作用，应避免合用。

5．本品与抗精神病药物合用，因为两者互相拮抗，应避免合用。

6．本品与甲基多巴合用，可增加本品的不良反应并使甲基多巴的抗高血压作用增强。

【药物过量】

1．中毒症状：超剂量时可使上述不良反应明显加重，并可导致严重心律失常。

2．处理：立即催吐、洗胃，采取增加排泄措施，并依病情进行相应对症治疗和支持疗法。

【不良反应】常见的不良反应有：恶心，呕吐，直立性低血压，头、面部、舌、上肢和身体上部的异常不随意运动，精神抑郁、排尿困难。较少见的不良反应有：高血压、心律失常、溶血性贫血。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
多巴丝肼胶囊	化学药	HZ000780
多巴丝肼片	化学药	HZ000781
复方卡比多巴片	化学药	HZ001248
左旋多巴胶囊	化学药	HZ005159
左旋多巴/卡比多巴控释片	化学药	HZ005160
左旋多巴/卡比多巴片	化学药	HZ005161
左旋多巴片	化学药	HZ005162
左旋多巴注射液	化学药	HZ005163

HY002628 左氧氟沙星

【外文名称】Levofloxacin

药物理化信息

【化学名】（*S*）－（－）－9－氟－2,3－二氢－3－甲基－10－（4－甲基－1－哌嗪基）－7－氧代－7*H*－吡啶并［1,2,3－*de*］－［1,4］苯并噁嗪－6－羧酸半水合物

【分子式】$C_{18}H_{20}FN_3O_4 \cdot 1/2H_2O$

【分子量】370.38

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理：本品为氧氟沙星的左旋体，其抗菌活性约为氧氟沙星的两倍，它的主要作用机制是通过抑制细菌DNA旋转酶（细菌拓扑异构酶Ⅱ）的活性，阻碍细菌DNA的复制而达到抗菌作用。

本品具有抗菌谱广、抗菌作用强的特点，对大多数肠杆菌科细菌，如大肠埃希菌、克雷伯菌属、沙雷菌属、变形杆菌属、志贺菌属、沙门菌属、枸橼酸杆菌、不动杆菌属以及铜绿假单胞菌、流感嗜血杆菌、淋球菌等革兰阴性菌有较强的抗菌活性。对部分甲氧西林敏感葡萄球菌、肺炎链球菌、化脓性链球菌、溶血性链球菌等革兰阳性菌和军团菌、支原体、衣原体也有良好的抗菌作用，但对厌氧菌和肠球菌的作用较差。

2. 毒理

（1）重复给药毒性：大鼠连续4周经口给予本品剂量分别为50、200、800mg/kg，仅见800mg/kg用药组动物出现中性白细胞的减少和骨髓M/E的上升；病理组织学可见肢关节表面出现轻度变性。猕猴经口投药4周，100mg/kg组动物出现流涎、腹泻、体重轻度减少和尿中pH降低。大鼠经口给药26周，80mg/kg和320mg/kg剂量组动物出现流涎、尿中pH升高。320mg/kg剂量组动物的排粪量增加，盲肠黏膜的杯状细胞出现肿大。猕猴经口给药26周时，在10mg/kg、25 mg/kg、62.5mg/kg剂量下均未出现明显毒性反应。

（2）对关节软骨的影响：幼年和3～4周龄大鼠、4月龄猎兔犬经口给药7天，大鼠在300mg/kg以上、猎兔犬在10mg/kg以上剂量时，出现关节软骨病变，并在幼、年轻猎兔犬中易发现关节毒性。13月龄犬，经口投药7天，在40mg/kg剂量时出现极轻度的关节毒性。但18月龄犬静脉注射14天，30mg/kg剂量时未出现关节毒性。

（3）生殖毒性：大鼠妊娠前、妊娠初期经口给药剂量达360mg/kg时，对雌、雄动物的生殖能力和胎儿均未见影响。大鼠在器官形成期给药，剂量达90mg/kg时，对胎儿和新生儿均无明显影响。家兔经口给药50mg/kg时，未出现胚胎、胎儿致死以及胎儿生长迟缓作用，也未出现致畸作用。大鼠围产期、授乳期经口给药达360mg/kg时，对动物的分娩、授乳以及出生儿均未见明显影响。

（4）光毒性：采用长波长紫外线（320～400nm）照射，以小鼠耳廓厚度变化为指标进行了光毒性研究，结果经口给药剂量达200mg/kg时，未见明显异常变化。

【药代动力学】

1. 吸收：本品口服后吸收迅速，1～2小时后血浆浓度达峰值。500mg和750mg本药口服后其绝对生物利用度约为99%。在剂量范围内单次或多次口服或静脉滴注的药代动力学呈线性关系，500mg或750mg剂量一日1次，48小时内达稳态。500mg，每日1次的峰谷浓度分别为（5.7±1.4）μg/ml和（0.5±0.2）μg/ml，750mg，一日1次的峰谷浓度分别为（8.6±1.9）μg/ml和（1.1±0.4）μg/ml。本药与食物同服，达峰时间延迟1小时，峰浓度下降约14%。等量本药口服或静脉滴注，血浆浓度谱变化相似，所以静脉途径和口服途径可以相互转化。

2. 分布：本品500mg或750mg单剂和多剂口服后，其平均分布容积为74～112L。

3. 代谢：本品在血浆或尿中稳定，不转化为其对映体D－氧氟沙星，主要以原形从尿中排出。本药口服后，48小时内约87%药物原形从尿中检出，72小时内粪中检出约4%。不到口服剂量的5%以去甲基代谢产物和氧化代谢产物的形式从尿中排出。

4. 排出：左氧氟沙星主要以原形从尿中排出，平均血浆消除半衰期为6～8小时。

5. 特殊人群

（1）肾功能不全患者：左氧氟沙星肾清除率下降，消除相半衰期延长，为避免药物蓄积，应进行剂量调整。血液透析和连续腹膜透析不影响左氧氟沙星从体内排除。

（2）肝功能不全患者：尚无肝功能不全患者药代动力学研究资料。由于本药在体内基本没有代谢，推测可能没有太大影响。

【药物相互作用】

1. 尿碱化剂可减低本品在尿中的溶解度，导致结晶尿和肾毒性。

2. 喹诺酮类抗菌药与茶碱类合用时可能由于与细胞色素P450结合部位的竞争性抑制，导致茶碱类的肝消除明显减少，血消除半衰期延长，血药浓度升高，出现茶碱中毒症状，如恶心、呕吐、震颤、不安、激动、抽搐、心悸等。本品对茶碱的代谢虽影响较小，但合用时仍应测定茶碱类血药浓度和调整剂量。

3. 本品与环孢素合用，可使环孢素的血药浓度升高，必须监测环孢素血浓度，并调整剂量。

4. 本品与抗凝药华法林合用时虽对后者的抗凝作用增强较小，但合用时也应严密监测患者的凝血酶原时间。

5. 丙磺舒可减少本品自肾小管分泌约50%，合用时可因本品血浓度增高而产生毒性。

6. 本品可干扰咖啡因的代谢，从而导致咖啡因消除减少，血消除半衰期延长，并可能产生中枢神经系统毒性。

7. 含铝、镁的制酸药、铁剂均可减少本品的口服吸收，不宜合用。

8. 本品与非甾体类抗炎药芬布芬合用时，偶有抽搐发生，因此不宜与芬布芬合用。

9. 本品与口服降血糖药合用可能会引起血糖失调，因此用药过程中应注意监测血糖浓度，一旦发生低血糖时应立即停用本品，并给予适当处理。

【药物过量】喹诺酮类药物过量时，可出现以下症状：恶心、呕吐、胃痛、胃灼热、腹泻、口渴、口腔炎、蹒跚、头晕、头痛、全身倦怠、麻木感、发冷、发热、锥体外系症状、兴奋、幻觉、抽搐、谵妄、小脑共济失调、颅内压升高（头痛、呕吐、淤血性乳头症状）、代谢性酸中毒、血糖增高、AST/

ALT/ALP增高、白细胞减少、嗜酸粒细胞增加、血小板减少、溶血性贫血、血尿、软骨/关节障碍、白内障、视力障碍、色觉异常及复视。

急救措施及解毒药：①洗胃；②吸附药：活性炭（40～60g加水200ml口服）；③泻药：硫酸镁（30g加水200ml），或其他缓泻药；④输液（加保肝药物）：代谢性酸中毒给予碳酸氢钠注射液，尿碱化给予碳酸氢钠注射液，以增加本品由肾脏的排泄；⑤强制利尿：给予呋喃苯氨酸注射液；⑥对症疗法：抽搐时应反复投以安定静脉注射液。

【不良反应】

1. 胃肠道反应：腹部不适或疼痛、腹泻、恶心或呕吐。

2. 中枢神经系统反应可有头昏、头痛、嗜睡或失眠。

3. 过敏反应：皮疹、皮肤瘙痒，偶可发生渗出性多形性红斑及血管神经性水肿。光敏反应较少见。

4. 偶可发生：①癫痫发作、精神异常、烦躁不安、意识混乱、幻觉、震颤；②血尿、发热、皮疹等间质性肾炎表现；③静脉炎；④结晶尿，多见于高剂量应用时；⑤关节疼痛。

5. 少数患者可发生血清氨基转移酶升高、血尿素氮增高及血常规白细胞降低，多属轻度，并呈一过性。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
左氧氟沙星滴耳液	化学药	HZ005164
左氧氟沙星氯化钠注射液	化学药	HZ005165
左氧氟沙星片	化学药	HZ005166

HY002629 佐芬普利

【其他名称】Bifril、Zofenil、Zopranol

【外文名称】Zofenopril

药物理化信息

【化学名】[1（R^*），2α，4α]－1－[3－（苯甲酰巯基）－2－甲基－1－氧代丙基]－4－（苯硫基）－L－脯氨酸

【分子式】$C_{15}H_{19}NO_3S_2$

【分子量】325.45

药物药理信息

【药理毒理】本品为首个含有巯基的长效ACE抑制剂，由于本品含有巯基，因此使之具有亲脂性和抗氧化特性，本品可水解为活性物佐芬普利拉。高血压患者接受本品可同时降低坐位和立位血压，同时不引起心率的增加。

本品用于轻至中度原发性高血压治疗，以及用于急性心肌梗死24小时内有或无症状、血流动力学稳定并未接受溶栓治疗的患者。

猴口服本品一年的毒性研究显示，P450酶未见明显改变。小鼠和大鼠试验显示，本品无致畸性。仅在小鼠试验中显示本品引起睾丸萎缩，但其临床意义尚不明了。

【药代动力学】本品口服后快速且完全地吸收，几乎完全转化为佐芬普利拉，给药后1.5小时，血液中的佐芬普利拉浓度达到峰值，单剂10～80mg剂量给药的药动学呈线性。15～60mg给药3周未见有药物蓄积。胃肠道有食物存在会影响药物的吸收速率但吸收程度不受影响。佐芬普利拉的AUC几乎保持不变。

有关本品分布的研究显示，本品约有88%与体内血浆蛋白结合，体内稳态分布容积为96L。本品的半衰期为5.5小时。口服的总清除率为每分钟1300ml。

本品静注给药，76%随尿排泄，16%随粪便排泄。而本品口服69%随尿排泄，26%随粪便排泄。提示，本品经肝肾双重代谢途径消除。

【药物过量】高于推荐剂量时，可出现红细胞参数降低，血清尿素氮增加，心脏质量减轻，肾小管旁细胞增生。

【不良反应】本品常见不良反应为有头晕（3.9%）、疲劳（2.6%）、头痛（2.4%）、咳嗽（1.2%）、恶心或呕吐（1.2%）。

不常见的不良反应为潮红（0.8%）、肌痉挛（0.8%）和虚弱（0.5%）。

其他尚有与ACE抑制剂治疗有关的不良反应：心血管系统的严重低血压，罕见周围血管性水肿、体位性低血压和胸痛。骨骼肌肉系统的肌痛和肌痉挛。肾脏系统的肾功能不全和急性肾衰。呼吸系统的咳嗽、呼吸困难、鼻窦炎、鼻炎、舌炎、支气管炎和支气管痉挛。个别患者因出现上呼吸道水肿而引起致命性呼吸阻塞。胃肠道则可见呕吐、腹痛、腹泻、便秘和口干等。

HY002630 佐米曲普坦

【其他名称】佐米格、佐咪曲坦、Zomig

【外文名称】Zolmitriptan

药物理化信息

【化学名】（S）－4－[[3－[2－（二甲胺基）乙基]－1*H*－吲哚－5－基]甲基]－2－噁唑烷酮

【分子式】$C_{16}H_{21}N_3O_2$

【分子量】287.36

【性状及组成】本品为类白色结晶性粉末。

熔点：本品的熔点为136～141℃。

药物药理信息

【药理毒理】佐米曲普坦是一种对5－HT1A受体中度亲和，而对5－HT1D受体高度亲合的选择性受体激动剂。在外周通过使血管收缩和抑制神经肽的释放缓解偏头痛的发作，同时它能进入周围中枢及偏头痛中枢，阻断三叉神经反射通道及血管活性肽（VIP）的释放，达到治疗目的。

【药代动力学】口服佐米曲普坦吸收迅速、完全，1小时内达75%的峰浓度，平均绝对生物利用度大约为40%，本品血浆蛋白结合率低（大约为25%），平均清除半衰期为2.5～3小时。佐米曲普坦的清除主要先经过肝脏生物转换，其代谢物由尿中排泄，另约30%以原形由粪便排泄。

【药物相互作用】使用12小时内应避免使用其他5－HT1D激动剂，使用单胺氧化酶－A抑制剂吗氯贝胺后，佐米曲普坦的作用增强。因而对于使用单胺氧化酶A抑制剂的患者，建议24小时内服用本品的最大量为7.5mg。

【不良反应】最常见的不良反应包括：恶心、头晕、嗜睡、无力、口干。少数人出现感觉异常或感觉障碍、咽喉部、颈部、四肢及胸部可能出现沉重感、紧缩感和压迫感（心电图上没有缺血改变的证据），还可出现肌痛、肌肉无力、感觉异常和迟钝。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
佐米曲普坦胶囊	化学药	HZ0005167
佐米曲普坦片	化学药	HZ0005168

HY002631　佐匹克隆

【外文名称】Zopiclone

药物管理信息

【依据标准】国家药品标准新药转正标准·第52册

药物理化信息

【化学名】6－（5－氯吡啶－2－基）－7－［（4－甲基哌嗪－1－基）羰氧基］－5,6－二氢吡咯［3,4－b］吡嗪－5－酮

【分子式】$C_{17}H_{17}ClN_6O_3$

【分子量】388.81

【性状及组成】本品为白色、类白色或微黄色的结晶性粉末，无臭，味苦；遇光溶，在水中几乎不溶或不溶。

本品在三氯甲烷或二氯乙烷中易溶，在甲醇或二甲基甲酰胺中略溶，在乙醇中微溶，在水中几乎不溶或不溶。

熔点：本品的熔点为175～178℃。

旋光度：精密称取本品0.25g，置25ml量瓶中，加二甲基甲酰胺溶液稀释至刻度，摇匀，依法测定，旋光度为－0.05°至＋0.05°。

药物药理信息

【药理毒理】本品常规剂量具有镇静催眠和肌肉松弛作用。其作用于苯二氮䓬受体，但结合方式不同于苯二氮䓬类药物。本品为速效催眠药，能延长睡眠时间，提高睡眠质量，减少夜间觉醒和早醒次数。本品的特点为次晨残余作用低。

【药代动力学】据资料报道，健康人口服本品生物利用度为80%，口服吸收迅速，1.5～2.0小时后可达血药浓度峰值，给药3.75、7.5和15mg后，分别为30、60和115mg/ml。药物吸收不受患者性别、给药时间和重复给药影响。药物迅速由血管分布至全身，分布容积为100L。血浆蛋白结合率均为45%，消除半衰期约5小时。连续多次给药无蓄积作用。

本品在体内广泛代谢（主要是经P450酶系统生物转化），主要代谢产物为*N*－氧化物（对动物有药理活性）和*N*－脱甲基物（无活性）。代谢物主要经肺脏排出（约占剂量50%），其余由尿液排出。仅剂量的4%～5%以原型随尿排出。老年人半衰期约7小时。肝硬化者因脱甲基作用减慢，血浆消除能力明显降低，应调整剂量。本品能通过透析膜。

【药物相互作用】

1．与神经肌肉阻滞药（筒箭毒，肌松药）或其他中枢神经抑制药同服可增强镇静作用。

2．与苯二氮䓬类抗焦虑药和催眠药同服，戒断综合征的出现可增加。

【药物过量】服用过量的药物可出现熟睡甚至昏迷，应对症治疗。

【不良反应】与剂量及患者的敏感性有关。偶见思睡、口苦、口干、肌无力、遗忘、醉态，有些人出现异常的易恐、好斗、易受刺激或精神错乱、头痛、乏力。长期服药后突然停药会出现戒断症状（因药物半衰期短故出现较快），可能有较轻的激动、焦虑、肌痛、震颤、反跳性失眠及恶梦、恶心及呕吐，罕见较重的痉挛、肌肉颤抖、神志模糊（往往继发于较轻的症状）。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
佐匹克隆胶囊	化学药	HZ0005169
佐匹克隆片	化学药	HZ0005170

HY002632 佐替平

【其他名称】苯噻庚乙胺、Lodopin、唑替平

【外文名称】Zotepine

药物药理信息

【药理毒理】本品有较强的中枢性抗5羟色胺和较弱的抗多巴胺、抗去甲肾上腺素的作用，可使痉挛值下降。对兴奋吵闹、激动躁狂、激若性增高、冲动行为、焦虑紧张有特别好的效果，此外对多动徘徊、情绪不稳、自语、痴笑、幻觉妄想、刻板行为等也都有较好的效果。起效速度较氯丙嗪、氟哌啶快。用于治疗精神分裂症。

【药代动力学】口服吸收良好，1～4小时达血药峰浓度，血浆 $t_{1/2}$为8小时。肝代谢，最后自肾脏排泄。

【不良反应】主要副作用有困倦、失眠、乏力、便秘、头昏、指颤，血压下降、心律不齐、心电图改变、偶有ALT、AST升高者。

HY002633 唑来膦酸

【外文名称】Zoledronic Acid

药物理化信息

【化学名】1－羟基－2－（1－咪唑基）亚乙基－1，1－二膦酸一水合物

【分子式】$C5H_{10}N_2O_7P_2H_{20}$

【分子量】290.11

药物药理信息

【药理毒理】

1．药理作用：唑来膦酸的药理作用主要是抑制骨吸收，其作用机制尚不完全清楚，可能与多方面作用有关。唑来膦酸在体外可抑制破骨细胞活动，诱导破骨细胞凋亡，还可通过与骨的结合阻断破骨细胞对矿化骨和软骨的吸收。唑来膦酸还可以抑制由肿瘤释放的多种刺激因子引起的破骨细胞活动增强和骨钙释放。

2．毒理研究

（1）遗传毒性：本品Ames细菌回复突变试验、中国仓鼠卵巢细胞染色体畸变试验、中国仓鼠基因突变试验和大鼠微核试验结果均为阴性。

（2）生殖毒性：雌性大鼠从交配前15天至怀孕期结束皮下注射本品0.01、0.03或0.1mg/（kg·d）（AUC为人静脉注射4mg时的0.07、0.2和1.2倍），高剂量组动物出现排卵抑制和受孕率下降。中剂量和高剂量组动物均出现胚胎植入前丢失增加、植入胚胎数及活胎数减少，新生鼠的存活率下降。所有剂量组母鼠均出现难产及围产期死亡率增加。母鼠死亡的原因可能与药物抑制骨钙动员，导致围产期低血钙有关，这可能是双膦酸类药物共有的作用。

雌性大鼠怀孕期间皮下注射本品0.1、0.2或0.4mg/（kg·d）（AUC为人静脉注射4mg时的1.2、2.4或4.8倍），中、高剂量组动物出现胚胎植入前或植入后丢失增加、活胎数减少、胎仔骨骼、内脏和外观畸形。高剂量组动物胎仔的骨骼畸形表现为未骨化和骨化不全，骨骼增厚、弯曲或缩短等。高剂量组还可见晶状体缩小、小脑发育不全、肝小叶缩小或缺失、肺叶变形、血管扩张、腭裂、水肿等毒性反应。低剂量组动物胎仔也出现骨骼畸形。本试验中高剂量组母体动物出现体重和摄食量下降，提示试验已达到最高药物暴露水平。

妊娠家兔皮下给予本品0.01、0.03、0.1mg/（kg·d）（AUC小于或等于人静脉注射4mg时的0.5倍），未观察到本品对胎仔的毒性。各用药组动物（按相对体表面积折算，剂量大于或等于人静脉用药剂量4mg的0.05倍）均出现母体死亡和流产，此现象可能与药物引起的低血钙有关。

致癌性：采用小鼠和大鼠进行了常规终生致癌试验研究。小鼠经口给予本品0.1、0.5、2.0mg/（kg·d）（按相对体表面积折算，剂量大于或等于人静脉用药剂量4mg的0.002倍），所有给药组动物Harderian（副泪腺）腺瘤的发生率增加。大鼠经口给予本品0.1、0.5、2.0mg/（kg·d）（按相对体表面积折算，剂量小于或等于人静脉用药剂量4mg的0.2倍），未见肿瘤发生率的增加。

【药代动力学】

1．分布：64名癌症或骨转移患者静脉滴注单剂量或多剂量（28天4次）2、4、8或16mg，滴注时间5或15分钟，滴注后血浆中唑来膦酸浓度的降低符合三相消除过程，滴注完毕迅速从峰浓度值下降，24小时后血药浓度不到 C_{max}的1%。最初两相的半衰期 $t_{1/2\alpha}$为0.24小时，$t_{1/2\beta}$为1.87小时，唑来膦酸最终清除相的时间较长，在滴注后的2～28天内在血浆中仍保持很低的浓度，最终清除半衰期 $t_{1/2\gamma}$为146小时，在给药剂量2～16mg范围内，血浆中0～24小时药物浓度－时间曲线下面积与给药剂量呈正比。在3相中唑来膦酸的蓄积率均较低，其中2、3相相对于第1相的平均0～24小时AUC值比率分别为1.13±0.3和1.16±0.36。体内及体外试验表明唑来膦酸与人血细胞的亲和率低，与人血浆蛋白结合率

大约为22%，结合率与浓度无关。

2. 代谢：体外试验表明唑来膦酸对人P450酶无抑制作用，唑来膦酸在体内不经过生物转化，主要以原形经肾脏排泄。

3. 排泄：64位患者在给予唑来膦酸24小时内尿液中平均回收率为（39±16）%，给药后第2日尿液中仅发现痕迹量的药物，给药0~24小时内尿液中累计排泄百分比率与药物的浓度无关，0~24小时内尿液中的药物回收未达到平衡，推测药物先与骨结合，再缓慢释放进入全身循环，从而出现所观察到的血浆中长期含有很低浓度药物的现象。给药后0~24小时内唑来膦酸的肾脏清除率为（3.7±2.0）L/h，唑来膦酸的清除率与剂量无关，而取决于肌酸酐清除率。在一项研究中，将癌症及骨转移患者给予4mg唑来膦酸的滴注时间从5分钟（$n=5$）延长至15分钟（$n=7$），结果滴完时唑来膦酸的浓度同比降低了34%，AUC总值提升了10%，AUC值的差异并无统计学意义。

【药物相互作用】本品与氨其糖苷类药物合用时应慎重，因氨其糖苷类药物具有降低血钙的协同作用，可能延长低血糖持续的时间；与利尿剂合用时可能会增大低血钙的危险性；与沙利度胺合用时会增加多发性骨髓瘤患者肾功能异常的危险性。

【药物过量】患者接受高剂量本品可能引起血清中钙、磷和镁的水平过低，可通过静脉给予葡萄糖酸钙、磷酸钾或钠以及硫酸镁来补充。此外，高剂量的本品会增加肾毒性的危险性。

【不良反应】本品最常见的不良反应为发热，其他不良反应主要包括。

1. 全身反应：乏力、胸痛、腿水肿、结膜炎。

2. 消化系统：恶心、呕吐、便秘、腹泻、腹痛、吞咽困难、畏食。

3. 心脑血管系统：低血压。

4. 血液和淋巴系统：贫血，低钾血症，低镁血症，低磷血症，低钙血症，粒细胞减少，血小板减少，全血细胞减少。

5. 肌肉与骨骼：骨痛，骨关节，肌肉痛。

6. 肾脏：血清中肌酸酐值升高（与给药的时间有关）。

7. 神经系统：失眠，焦虑，兴奋，头痛，嗜眠。

8. 呼吸系统：呼吸困难，咳嗽，胸腔积液。

9. 感染：泌尿系统感染，上呼吸道感染。

10. 代谢系统：畏食，体重下降，脱水。

11. 其他：流感样症状，注射部位红肿，皮疹，瘙痒等。

唑来膦酸的毒副反应多为轻度和一过性的，大多数情况下无需特殊处理，会在24~48小时内自动消退。

药物制剂信息

制剂名称	类别	序号
注射用唑来膦酸	化学药	HZ0005137
唑来膦酸注射液	化学药	HZ0005171