

## 1984年下半年各国批准的药物简介 (二)

羟甲香豆素 Hymecromone (Hlmenromon; Zdravlje) 南斯拉夫。(Mendiaxon; Byk Gulden), 包衣片 200mg, 400mg。解痉和利胆剂, 适用于功能性胆道痉挛症。大剂量时可引起胆汁分泌过度 and 腹泻。具梗阻或传染性黄疸的病人须慎用。

异波帕明 Ibopamine (Scandine; Zambon) 意大利(Inopamil; Simes), 片剂 50mg、100mg、200mg。多巴胺拮抗剂, 适用于肾脏灌注受损导致的充血性心脏病和体液潴留。不适合用于最近心肌梗塞的患者。禁用于过敏患者、孕妇和具嗜铬细胞瘤的患者。

吲哚布芬 Indobufen (Ibustrin; Farmitalia-Carlo Erba) 意大利。片剂 100mg、200mg。粉针剂 100mg、200mg/安瓿。非甾体类抗炎药, 能抑制血小板聚集, 适用于血栓症的活疗, 包括血栓性静脉炎、心脏和大脑缺血、周围动脉病变和血栓, 以及体外循环。禁用于先天性或后天获得出血性素因患者, 对孕妇和哺乳妇的安全性尚未建立, 副作用有胃炎、齿龈出血和变态反应。

吲哚胺 Indoramin (Wydora; Wyeth) 新西兰、澳大利亚。片剂 25mg、50mg。 $\alpha$ -肾上腺素能受体阻断剂, 适用于原发性或继发性雷诺氏综合症的控制。具肝或肾功能不全或巴金森氏病的患者须慎用。本药可发生嗜睡, 故对从事驾驶或机械操作的患者会产生不良的影响, 对孕妇或哺乳妇的安全性尚未确定。

Inosine + Dimepranol + Acedoken (Immunovir; Burgess) 英国。片剂 120.25mg + 138.70mg + 241.05mg。抗病毒药, 适用于单纯性疱疹引起的粘膜与皮肤

感染。对孕妇的安全性尚未确定。偶可发生血清和尿酸浓度上升, 有肾功能障碍、高尿酸血症的患者或有痛风史的患者须慎用。

异康 Isoconazole (Travogen; Schering) 意大利。乳剂 10mg/g, 片剂 100mg。咪唑类衍生物, 适用于真菌或细菌性阴道炎和浅表皮肤真菌病, 过敏患者禁用, 与其他咪唑类衍生物可发生交叉耐药性。已报道的副作用有皮肤刺激和头痛。对孕妇的安全性尚未确定。

硝酸异山梨醇酯 Isosorbide mononitrate (Duramonit 20; Durachemie), (Duramonit 40; Durachemie) 西德。片剂 20mg、40mg, (Isomonit 20; Durachemie) 西德。片剂 20mg。二硝酸异山梨醇的活性代谢物, 适用于心绞痛的预防, 可与强心甙或利尿药合用。禁用于急性循环衰竭和灌注压低的急性心肌梗塞患者。对怀孕头三个月的孕妇的安全性尚未确定。副作用有短暂性头痛、低血压、和心动过速, 从事驾驶或机械操作的患者应用本药后其工作能力可有所损害。

异维甲酸 Isotretinoin (Roaccutan; Roche) 澳大利亚。胶囊 5mg、10mg、20mg。合成的维生素A酸立体异构物, 适用于其他治疗无效的痤疮。由于其致畸性故孕妇禁用, 在治疗期间和停止给药后至少四周内必须采取避孕措施。哺乳妇女、过敏患者以及具有肝功能不全、维生素A过多症或高脂血症的患者亦禁用。不能与四环素同服。

异恶噻酰胺 Isoxicam (Vectren; Parke Davis) 卢森堡。(Maxicam; Parke Davis), (Fluxicam; Menarini), 胶囊 100mg。非甾体类抗炎镇痛药, 适用于风

湿性关节炎、骨关节炎、急性痛风和急性运动系统疾病。已报道的副作用有胃肠道反应和皮疹。本药可增强香豆素类生物的作用。

L-色氨酸 L-tryptophane (Kalma-500; Fresenius) 卢森堡。片剂500mg。为必需氨基酸，适用于抑郁症和睡眠紊乱者；已报道的副作用有恶心、食欲不振、和嗜睡。本药可加强单胺氧化酶的作用。

Leuprorelin (Carcinil; Abbott) 西德。注射液0.5mg/ml,多肽类,适用于进行性前列腺癌的症状改善,在治疗初期可发生短暂性症状加重和血清雄激素水平上升。已报道的副作用有热潮红、注射部位炎症、阳痿和性欲减低。

Lonazolac (Irritren Byk) 澳大利亚。包衣片200mg。非甾体类抗炎药,适用于慢性多关节炎、关节僵硬性脊椎炎、急性退化性关节炎和脊椎关节僵硬、软组织风湿病、创伤疼痛和肿胀。禁用于过敏患者和具胃肠道疾病、严重肝或肾功能障碍和出血性素因的患者。对孕妇和哺乳妇的安全性尚未确定。副作用有胃肠道反应,偶有眩晕、头痛和皮肤反应。

特戊酸劳拉安定 Lorazepam Pivalate (Placinar, Robert) 西班牙, (Dru-pal; Novag) 包衣片1mg、2mg。苯并二氮杂草类,适用于焦虑、狂躁、紧张和睡眠紊乱。禁忌症、副作用和注意点同其他苯并二氮杂草类。

劳甲安定 Lormetazepam (Lorameth, Wyeth) 西德。片剂2mg。短效苯并二氮杂草类,适用于睡眠紊乱,手术前预防和手术后治疗。禁忌症、注意点和副作用同其他苯并二氮杂草类。

Mepindolol (Betagon; Schering) 意大利、澳大利亚。片剂2.5mg, 5mg。非选择性 $\beta$ -肾上腺素能受体阻断剂适用于高血压和心绞痛。禁忌症、注意点和副作用似

其他同类药。

巯乙磺酸钠 Mesna (Mistabron; UCB) 澳大利亚。气雾剂600mg/3ml安瓿。(Uromitexan; Asta-werke) 澳大利亚、西德、荷兰。口服液1g/10ml。含有巯基的化合物,其气雾剂由于粘痰溶解作用而作为祛痰剂,哮喘和严重虚弱的患者禁用。副作用有支气管痉挛和严重咳嗽。其口服给药后经尿排泄。可与环磷酰胺的毒性代谢物和其他类物螯合。在用环磷酰胺、异环磷酰胺和氯乙环磷酰胺治疗出血性膀胱炎期间可作为一个辅助药。对孕妇的安全性尚未确定。

美替洛尔 Metipranolol (Beta Ophtholol; Dr Gerhard Mann) 荷兰。滴眼液0.3%。非选择性 $\beta$ -肾上腺素能受体阻断剂,具有低内在活性和膜稳定活性。适用于慢性单纯性青光眼。禁用于支气管痉挛症、不能控制的心功能代偿失调和过敏的患者。对孕妇和哺乳妇的安全性尚未确定,已报道局部应用时有变态反应和烧灼感。

咪达唑仑 Midazolam (Dormicum; Roche) 荷兰。注射液3mg/ml。短效苯并二氮杂草类,在局部或全身麻醉前给药。禁用于重症肌无力和对苯并二氮杂草类过敏的患者。年老患者和心脏呼吸功能不全的患者慎用。相互作用和副作用同其他苯并二氮杂草类。

Minaprine (Cantor; Midy) 意大利。片剂50mg,能增加大脑乙酰胆碱浓度和减少多巴胺周转量的精神病用药。适用于各种抑郁综合症,禁用于过度亢奋的患者。对孕妇和哺乳妇女的安全性尚未确定。已报道的副作用有失眠和神经紧张。

丝裂黄素 Mitoxantrone (Novantrone; Lederle) 英国。注射液2mg/ml。抗癌药,适用于进行性乳房癌。禁忌症、注意点和副作用同其他类似药。

氟氟灭酸 Niflumic acid (Nifluril; Irmesan) 西班牙。栓剂700mg,镇痛消炎

药。禁用于孕妇和消化性溃疡患者。未叙及与抗凝药的关系。

氟哌酸 Norfloxacin (Noroxin; MS D) 新西兰。片剂200mg、400mg。广谱抗菌药，适用于由敏感微生物引起的尿路感染。禁用于过敏患者。对孕妇、哺乳妇女和儿童的安全性尚未确定。

诺昔硫脲 Noxytiolin (Noxyflex; Lab. Innotech International) 卢森堡。滴注射液用粉末2.5mg/安瓿。抗菌和抗真菌药，适用于全身性或局部性腹膜炎以及消化性溃疡穿孔的腹膜冲洗。

奥沙米特 Oxatomide (Tinset; Fansen) 意大利。片剂30mg，抗组胺药，适用于变态疾病、荨麻疹和哮喘的预防和治疗。禁用于急性变态症和气喘危象的患者。对孕妇和哺乳妇女的安全性尚未确定。

奥拉酰胺 Oxiracetam (Neuromet; ISF) 意大利。注射液1g/安瓿，片剂400mg、800mg。对大脑神经系统有刺激作用的吡咯烷醋酸衍生物。适用于大脑功能不全和记忆力障碍的年老患者，禁用于过敏和严重肾功能不全的患者。副作用包括剂量依赖性精神运动性兴奋和睡眠紊乱。

吡哌酸 Pipemidic acid (Uropedil; Eستي) 西班牙。胶囊400mg。抗尿道感染药，适用于敏感菌引起的感染。禁用于过敏患者。副作用有皮肤反应和胃肠道反应。禁用于妊娠有三个月的孕妇或分娩前最后一月的孕妇。

吡唑氮苄青霉素十吡唑氮草脒青霉素 Pivampicillin+Pivmecilinam (Miraxid; Leo) 西德。包衣片250mg+200mg、125mg+100mg。含有两个杀菌性青霉素酯的抗菌复方药，适用于由敏感菌引起的感染。禁用于对青霉素类或头孢菌素类过敏的患者、患有传染性单核细胞增多症、淋巴性白血病的病人以及肝、肾功能不全者。对孕妇的安全性尚未建立。副作用包括皮肤反应和恶

心。

聚维酮 Polyvidone (Vidimann Oph-tiole; Dr Mann Pharma) 荷兰。滴眼液50mg/ml。聚维酮滴眼液，适用于泪生成过少、角膜干燥的患者，并且可作为角膜结膜炎的辅助药。禁用于过敏患者。带有角膜接触镜的患者禁用。

泼尼氮芥 Prednimustine (Sterecyt; Leo) 澳大利亚。片剂20mg、100mg。烷基化细胞抑制剂，与细胞抑制剂和激素治疗配合适用于慢性淋巴性白血病、非何杰金氏淋巴瘤和迁移性乳房癌。禁用于孕妇和哺乳妇女以及患有骨髓障碍、骨质疏松、肌病、精神障碍、疱疹和阿米巴感染的患者。此外，亦可治疗糖尿病和结核病。副作用同其他细胞抑制剂。

普罗雌醚 Promestriene (Delipoder; Theramed) 西班牙。乳剂1%。用于治疗皮脂溢、糠疹、脂溢性皮炎和痤疮。

丝拉肽酶 Serrapeptase (Aniflazym; Takeda) 西德。肠溶衣片5mg。肽酶制剂，适用于炎症的症状治疗，既可作为辅助药又可用于难治性疾患。禁用于过敏患者、年幼患者以及患有消化性溃疡的患者。患有血凝障碍、肝或肾功能障碍的病人在治疗前须提高警惕。已报道的副作用包括食欲不振、恶心和皮肤反应。

生长抑放素 Somatostatin (Sfilamin; Serono) 西德。注射用粉末250mg、3mg/安瓿。合成止血药，适用于胃十二指肠溃疡引起的严重出血或出血性胃炎、胰或回肠瘘管，并可预防性地用于胰脏手术出血，重复治疗可提高过敏性的风险。禁用于孕妇、产后期和哺乳妇女。报道过的副作用包括低血糖等。糖尿病患者在治疗前须谨慎。

Stepronin (Valase; Cristalfarma) 意大利。胶囊20mg、粉针剂335mg/安瓿、糖浆剂1.65%、2.85%。含有巯基的化合物，适

用于急性和慢性中毒性肝炎。禁用于过敏患者。报道过的副作用包括胃肠道反应和头痛等。

Sulodexide (Ronatil forte; Almirall) 西班牙。注射剂 300单位/安瓿。降血脂药,适用于高脂血症、动脉硬化、糖尿病症的血管并发症和血栓栓塞症。对肝素过敏的患者禁用。当与抗凝药同时服用时须调节本药剂量。

疏前列腺素 Sulprostone (Nalador; Schering) 澳大利亚。粉针剂 100mg/安瓿。可促进颈部扩张和收缩受孕子宫的合成前列腺素类,适用于刮宫术,妊娠首三月和中三月的堕胎、流产和子宫内死胎。禁用于支气管哮喘、痉挛性支气管炎、代偿失调性心功能不全、严重高血压、严重肝或肾功能不全、不能控制性糖尿病、癫痫、青光眼、甲状腺毒症、急性妇科感染、溃疡性结肠炎、急性胃、十二指肠溃疡、镰状细胞性贫血和地中海贫血、风湿病和各种子宫手术的患者。当胎儿可能生存时,禁止将本药用于引产。只能经静脉给药。禁止与催产素或非甾体类抗炎药配伍应用。报道过的副作用包括恶心、呕吐、腹绞痛、腹泻和头痛。本药只能经专科医师在专门诊所里使用。

四氧普林+磺胺嘧啶 Tetroxoprim + Sulfadiazine (Tibirox Roche; Roche) 意大利。(Oxosint; Proter), 片剂 100mg + 250mg。由一个甲氧苄氨嘧啶的衍生物和一个长效磺胺药所组成的复方抗菌药,适用于由敏感微生物引起的呼吸道和泌尿生殖道感染。禁用过敏患者和患有血质不调或肝、肾功能不全的病人。非必需时不用于孕妇和哺乳妇女。已报道的副作用包括过敏反应、皮疹、恶心、头痛和胆汁郁滞。应避免与止痛药或解热药配伍应用。

噻洛芬酸 Tiaprofenic acid (Arliflam; Erfa) 卢森堡。(Surgamyl; Roussel) 澳大利亚。栓剂 300mg。苯丙酸类非

甾体消炎镇痛药,适用于风湿症和手术后镇痛消炎。禁忌症、注意点和副作用同其他类似药。

三唑仑 Triazolam (Halcion; Upjohn) 澳大利亚。片剂 0.25mg、0.5mg。短效苯并二氮杂卓药,适用于失眠症。疗程须在三个月以上。孕妇、哺乳妇女和患有过敏、重症肌无力、严重休克或酒精中毒的患者须禁用。副作用包括胃肠道反应和神经系统反应,偶有反常反应如幻觉、梦魇、焦虑、抑郁和兴奋。

辅酶Q<sub>10</sub> Ubidecarenone (Ubilen; Italfarma) 意大利。(Ubimalor; Masterfarma) (Mitocor; Zambo) (Dymicon; Zambelletti) (Cordiect; Neopharmaed) (Caomet; Simes), 包衣片 10mg。为天然存在的辅酶,参与心肌线粒体间的电传导。适用于充血性心功能不全和肺原性心脏病。亦可与洋地黄类或其他强心药合用。据称对抗癌药引起的心脏毒性具有保护作用。禁用于过敏患者。副作用包括胃肠道反应,偶有皮疹。

熊去氧胆酸 Ursodeoxycholic acid (Ursobilane; Estedi) 西班牙。胶囊 150mg。肝胆固醇合成抑制剂,适用于患有功能性胆囊炎患者的X线可透的胆固醇性胆石所引起的胆石病,禁用于孕妇、患有消化性溃疡的病人以及由胆盐的肠肝循环引起的肝或十二指肠损害的病人。育龄妇女禁用,本药不能与降血脂药、雌激素和激素类避孕药同时应用。

维洛沙秦 Viloxazine (Vivarint; Ici) 澳大利亚。包衣片 50mg。不同于三环类的抗抑郁药。适用于内源性抑郁。禁用于孕妇、哺乳妇女、躁狂患者、严重肝脏疾病者、酒精中毒者以及服用镇静剂或其他精神病用药的患者。所报导的副作用包括胃肠道反应、抗胆碱能反应、血清转氨酶上升、体重减轻,偶有神经紊乱。

长春酰胺 Vindesine (Eldisine; Lilly) 澳大利亚。粉针剂 5 mg/安瓿。细胞抑制剂，是长春碱的半合成衍生物，适用于急性白血病、骨髓白血病、恶性淋巴瘤、恶性黑色素瘤、鳃裂癌（不同于小细胞损害）。禁用于患有严重细菌感染、药物诱导

的粒细胞减少或血小板减少的患者，副作用有神经系统反应、胃肠道反应和血液系统反应。

[Drug Information 《药物情报》，July-September, 16228, 1984 (英文)]

朱为敏译 郑绳一校

## 血管舒张药的临床药理学

RFW MouIds (澳大利亚，墨尔本皇家医院临床药理和治疗科主任)

血管舒张药用于医疗已有100多年的历史。最初，其应用只是依据经验观察，近20年来由于对许多药物临床药理学的深入了解，才使这类药在各种疾病的治疗应用中更趋合理。

不同的血管舒张药的作用主要取决于如下三个因素：(1) 药物对血管平滑肌收缩作用的机理；(2) 药物动力学，这决定药物在其作用部位的浓度及浓度随时间的变化；(3) 在不同血管床（正常的和病态的）各种影响静止时血管紧张度的各种因素。前两种因素虽然在我们的知识中仍有重要的空白，但一般说比较理解。第三个因素复杂的多，特别是涉及不同疾病状态（如充血性心力衰竭和高血压）的各种因素。不幸的是我们知识中的那些空白仍然导致了在各种临床条件下应用各种血管舒张药中的一定程度的经验主义。

### 血管平滑肌收缩的控制

了解血管舒张药作用机理的核心是对血管平滑肌收缩控制的详尽知识。在组织水平上，可设想交感神经象管弦乐队指挥那样调节着血管张力度（见图1）。交感神经冲动从神经末梢囊泡释放去甲肾上腺素(NE)，弥散通过突触间隙进入血管平滑肌，激动突触后 $\alpha$ -受体。在多数血管中的突触后 $\alpha$ -受体是 $\alpha_1$ -亚型，但越来越多的证据表明，在某些

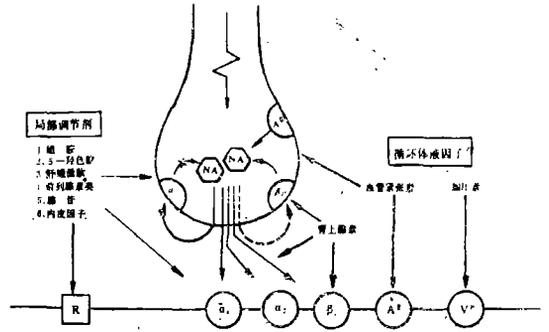


图1 血管交感神经末梢效应模式图

血管也存在突触后 $\alpha_2$ -受体。递质(NE)对突触前 $\alpha_2$ -受体也有负反馈作用， $\alpha_2$ -受体存在于神经末梢，抑制NE的释放。递质对突触前 $\beta_2$ -受体也起正反馈作用，但在人血管中目前尚缺少确凿的证据。

静止的交感神经张力受多种其它因素的影响。循环中的体液因子，如血管紧张素、肾上腺素、和加压素可作用于突触前受体，调节突触后 $\alpha_1$ -受体的效应，或作用于其细胞膜上的突触后受体。所有局部释放的血管活性物质如组胺、5-羟色胺、舒缓激肽及新近报道的内皮松弛因子等都可强烈影响血管张力。在细胞水平， $Ca^{2+}$ 在血管平滑肌收缩机理中起核心作用（见图2）。当细胞膜受体（ $\alpha_1$ -受体）受刺激时，即发生一系列的反应。 $Ca^{2+}$ 通过由受体操纵也可能由