味着它可能改变多巴胺介导的神经功能(如 肌张力障碍、伪帕金森氏神经机能障碍)。 研究还未证实有任何重要的神经精神样的活 性,不过已经报道有少数病人在治疗初期出 现短暂的不安宁症侯。

本品口服给药吸收迅速,并经受明显的 首过代谢效应。食物的存在可以降低首过效 应,但这种效应的临床重要性尚未研究。本 品血浆蛋白结合率约为95%,但似乎不会置 换能与血浆蛋白紧密结合的药物如华法令、 苯妥因钠和心得安。但它可以取代与血浆蛋 白结合得不太紧密的药物如地高辛,因而合 并用药时应该谨慎监测。

丁螺旋酮主要被氧化代谢,其代谢产物 之一仍具药理活性。由于它是在肝脏代谢并 由肾脏排泄,有严重的肝或肾脏损害的病人 不宜使用。

丁螺旋酮疗法开始之前,已经在使用其它抗焦虑药治疗的病人,最好逐渐减量至停止其他已用的药物,以免已经产生依赖性的病人因突然停药而发生撤药反应。

本品的推荐初始剂量是一日三次,每次5 mg。为达到最佳临床效应,根据需要每间隔2~3天,剂量可每天增加5 mg。通常维持剂量是每天20~30mg,分次服用;最大日剂量不能超过60mg/日。使用丁螺旋酮后,通常在7~10天内症状明显改善,而最佳效果通常要在治疗3~4周后达到。

盐酸丁螺旋酮片剂规格为含量5 mg和10mg。本品不大可能滥用,故"控制药品法规"未加限制。

◊ ◆ ◆ ◆ ◆ ◆ ◆ ◆ ◆ ◆◊ 中枢神经系统抑制剂 ◊◆ ◆ ◆ ◆ ◆ ◆ ◆ ◆ ◆

▲盐酸咪唑二氮䓬(Midazola m ,商品名: Versed,药厂: Roche/Dwpont)是一种注射给药,短效的苯二氮䓬类中枢神经系统抑制剂。肌肉注射适用于术前镇静和削弱手术过程事件的记忆;静脉注射可作为

短暂诊断和内窥镜检查,清醒状态下的镇静 (可单独用,也可与镇痛药同用),静注还 用于其它麻醉药的全麻的诱导,并且作为一 氧化亚氮和氧麻醉(平衡麻醉)的补充成分 用于短时间外科手术。

安定常用于术前和诊断操作的镇静。本品起效比安定快(静注3~5分钟后即可达到镇静),而且消除也快。有许多病人,使用本品后回忆有所降低,而且这种新药会产生比安定更强的遗忘症。

本品与硫喷妥钠的遗忘诱导作用比较表明,其产生诱导作用的时间更长(1.5~2.5分钟),但比硫喷妥钠引起的呼吸暂停发作少而短。

使用本品较常见的不良反应有潮气量减少和/或呼吸频率降低(静脉给药为23%)和呼吸暂停(静脉给药为15%)。其它镇静剂和阿片类激动剂会加重呼吸抑制,因而合并用药必须谨慎监护。有慢性阻塞性肺部疾病的患者对本品的呼吸抑制作用异常敏感。

本品的心血管效应如低血压已有所见, 特别要注意使用其它药物(麻醉药品)或有 其他危险因素增加并发症可能性的病人。自 本品上市以来经报道的严重不良反应中,多 数是由于呼吸或心跳骤停所致,并且在有心 血管或肺病史的老年患者中发生了。处于危 险状态的病人适合使用低剂量,并且治疗必 须严密监护。

据报道静注本品引起的 不 良 反应有呃 逆 (3.9%)、恶心 (2.8%)、呕吐 (2.6%)、呕吐 (2.6%)、镇静过度 (1.6%)和嗜睡 (1.2%),在肌注或静注部位可能发生疼痛和压痛 (发生率约为 5%)。然而不象其它注射给药的苯二氮䓬类(即安定、氮羟去甲安定、利眠宁),盐酸咪唑二氮䓬是水溶性的,并且以水溶液形式配成比其它药剂刺激性要小的制剂。

如同其它苯二氮䓬类一样,本品禁用于 急性闭角性青光眼患者,只有病人进行适当

治疗后方可用于开角型青光眼的病人。因与 某些苯二氮䓬类可增加先天畸形的危险,故 患者须知,在怀孕期间使用本品可能对胎儿 会有损害。

本品给药前已先用诸如麻醉药品(如吗啡),司可巴比妥和芬太尼/达哌啶醇可增强其催眠作用。本品的剂量须相应地低一些(通常降低25~30%)。应告减患者有关正常活动恢复的问题,尤其是本品有时用于门诊病人。建议患者不要操纵危险的机器和驾驶机动车辆,直到药物的作用如倦睡已经消失,或直到麻醉和手术后的一天,总之时间应长一些。因为本品给药后遗忘效应可持续几小时,因此也要建议向使用本药治疗的门诊患者发给一份书面的术后指导。

据报道甲氰咪胍能增加本品的 血清 浓度,因此应重视效应增加的可能性。

本品的剂量必须个体化并根据一系列因素而定。如果患者已预先用麻醉药品或证服用其它抑制剂,剂量就应用小一些。对于老年人,体弱和其他高危险病人通常剂量至少应降低30%,同时应认识到在这些病人中药物作用可能显著和/或延长。产品的标示应提出特殊的剂量指导,然而 已 经 发现这些推荐的剂量对某些患者也许太高。自从该药上市以来,某些剂量指导进行过修订,同时,进一步的改变变化也正在考虑。

本品采用小玻瓶包装,每ml含相当于 咪唑二氮 5 mg。此药已列入"控制药品 法规"中,属于第 V类。

曽 明译 魏文树 苏开仲校 张紫洞审

▲法莫替丁 (Famotidine, 商品名: Pepcid, 药厂: Merck Sharp and Dohme) 是一种组织胺H₂受体拮抗剂, 其抑制胃酸分泌的能力与甲氰咪胍和甲硝 呋 胍 类似。本品适用于活动性十二指溃疡的短期疗

法和活动性溃疡愈合后十二指肠溃的维持治疗(减少剂量)以及病理性分泌亢进(如卓-艾氏综合症Zolliger Ellison Sgndrome,多发生内分泌腺瘤)。目前本品标示的适应症未包括甲氰咪胍和甲硝呋胍均适用的胃溃疡或甲硝呋胍适用的胃食管反逆性疾病。然而这三种药物对上述病症均具有同等疗效。

本品用药后发生的不良反应较少见。可考虑因药物引起的反应有头痛(4.7%)、眩晕(1.3%)、便秘(1.2%)、腹泻(1.7%)和静脉给药时静注部位的短暂刺激性。本品不象甲氰咪胍具有弱的抗雄性激素作用,本品尚无报道引起诸如男子女性型乳房或阳畴,由治无报道引起诸如男子女性型乳房或阳时,也未证实有任何临床意义的药物相互作用。这表明本品优于甲氰咪胍,已知甲氰咪胍可抑制其他几种药物的肝脏代谢来增加其活性。

的生物利用度为40%~45%。虽然食物可稍微增加,而抗酸剂轻微降低其生物利用度,但这些效应并无临床重要性。本品通过肾脏排泄(65~70%)和代谢途径消除,故对严重的肾功能不全患者应减少剂量或延长给药间隔。

本品通常的口服剂量为40mg,每天一次,睡时服用;而对活动期十二指肠溃疡的维持治疗则为20mg睡前服用。多数患活动性十二指肠溃疡的病人可在4周内治愈,很少患者需要长达6~8周的全天服药。甲氰咪胍和甲硝呋胍最初上市时分别为每天四次和两次给药。然而这些药品的高效剂型最近已经应用,可减少用药次数,故上述三药一天一次服用即可获得疗效。

本品治疗病理性分泌亢进时适用于大剂量给药。推荐的口服初始剂为20mg,每6小时一次,必要时可增加剂量。某些严重的卓-艾氏综合症病人用药剂量可达160mg,