

四、禁忌症及注意事项

禁忌症:东莨菪碱过敏病人、哺乳期妇女禁用。青光眼、肠梗阻、幽门梗阻、由前列腺疾病等引起的排尿困难及孕妇慎用。

不良反应及注意事项:“贴片”属透皮吸收系统,为恒速释药,避免了口服或注射

给药后出现的副作用,仅极少数病人贴药后稍感口渴,疲倦、脉搏徐缓,个别病人皮肤粘贴处在2~3天时有痒感,揭去“贴片”后自行消失。若有明显不良反应,应立刻去除贴片并洗净粘贴处。本药速释时间需5~6小时,临时用药效果不佳。

新型钙拮抗剂 苄普地尔 简介

南京军区卫生学校
山东武城县卫生局

许榕椿 苏开仲
许世民

苄普地尔(双苄吡乙胺, Bepridil) 1973年由法国合成,1981年在法国开始上市,及至1983年仅法国就已用本品治疗心绞痛患者8万余例;美国也于1979年开始对本品抗心绞痛的作用进行了大量的临床研究。

一、药理学

苄普地尔主要作用于心肌的慢通道,能扩张周围血管和冠状血管,与其它钙拮抗剂类似的作用是在动作电位的时程中,有效地阻止 Ca^{++} 透过细胞膜而进入慢通道,而不同的是本品还能影响 Na^{+} 运动(快通道)和 K^{+} 的运动,从而使心肌的动作电位时程延长。此外本品的脂溶性较高,能在细胞内保持较高的浓度,从而增强细胞内 Ca^{++} 释放的阻滞作用。血流动力学的研究显示,本品能减慢心率、降低心肌收缩力、增加冠脉血流量,从而减少心肌氧的需求与供给。

二、药物动力学

本品口服吸收完全,食物可降低本品的吸收率,但不减少其吸收程度。口服时的生物利用度因存在首过效应的影响,故仅有59%。口服一剂量后在2~3小时内血浆浓度达高峰,而静注给药15分钟后血浆浓度达高峰。本品的表观分布容积为 $8L/kg$ 。治疗作用的有效浓度为 $200\sim 2000ng/ml$,当血浆浓度到达 $4000ng/ml$ 时,其蛋白结合

程度降低,游离浓度增加。本品的代谢途径主要是芳香族的羟基化、异丁基和脂肪族的羟基化,代谢产物主要经尿和粪便中排泄(主要代谢产物为4-羟基双苄吡乙胺)。本品的血浆半衰期为33h。

三、药物的不良反应

本品耐受性良好,不良反应较少见,且较轻微,主要为腹泻、便秘和恶心等胃肠道反应;少数出现头痛、头晕、震颤等神经系统症状,一般不必停药。

本品与利尿剂、洋地黄类等并用可使其血清浓度增高,又可能导致低血钾和低血镁等不良反应。

四、药物相互作用

本品与利多卡因、奎尼丁、普鲁卡因胺、普萘洛尔、甲基多巴、速尿、地高辛、双氢克尿噻、水杨酸盐类并用,其疗效降低,而异搏定、硝苯吡啶、硫氮卓酮、双异丙吡胺和华法令与本品并用,可使其血浆游离浓度增加,从而使治疗效应增加。

五、小结

苄普地尔为一种抗心绞痛的钙通道阻滞剂,副作用少见,主要表现在胃肠道系统和中枢神经系统。本品半衰期较长,可每日用药一次。本品有着独特的血流动力学和电生理效应,与其他 β -阻滞剂不同的是,能改善

心肌的供氧, 而又不引起诸如支气管痉挛或周围血管病等严重的不良反应。至于本品能否作为治疗稳定型心绞痛的第一线药物尚未

肯定, 但半衰期长可减少用药次数的优点是显而易见的。

(参考文献略)

吖 噪 美 辛 可 治 频 繁 遗 精

南京军区卫生学校 黄 强

据报道, 在青年男子频繁遗精期间服用常规剂量(每次25~50mg, 每日3次, 饭后服用)的吖噪美辛, 其疗效甚好。本品治疗遗精的可能机理是: 因遗精是男子在某种因素影响下, 发生的一种自动射精现象, 即射精管、输精管、精囊、附睾、前列腺、尿

道等有节律性收缩, 使精液排出。射精过程中生殖器的收缩不仅与神经、内分泌有关, 而且与前列腺素分泌过多密切相关。吖噪美辛是最强效的前列腺素合成酶抑制剂, 能通过抑制前列腺素的合成而达到治疗遗精的目的。

本文经苏开仲讲师修改。

· 文摘 ·

金 在 人 乳 中 的 含 量

李颖凯译 汤 真校 张紫洞审

金制剂用于类风湿性关节炎的治疗。曾经有人研究了金进入人乳的途径, 但对所提供的数据和使用的方据认为是不适当的。

现已进行了对两名哺乳期妇女使用硫代苹果酸金(50mg和70mg, 分剂量给药数天)的研究。其中一名病人在妊娠前曾接受硫代苹果酸金治疗了2年, 但怀孕数周时停药。硫代苹果酸金由肌注给药。给药后采集乳汁和血样并分析硫代苹果酸金含量。

结果表明金的确通过血清进入乳汁。经过几天乳汁中浓度缓缓升高, 而且乳汁中的浓度时间曲线

形状与血清浓度完全不同。乳汁/血清比率在0.01~0.2之间变动。

作者说, “从现有结果看, 可以计算哺乳的婴儿吸收金的量约是母亲剂量的20%。尽管接受金制剂治疗的母亲用乳喂养的婴儿没有出现不良反应, 但仍应慎重。从现有的资料看来, 采用金制剂治疗期间, 避免人乳哺乳是明智的。”

[AJP《澳大利亚药 学 杂 志》, 68(9): 640, 1987(英文)]

活 性 炭 用 于 卡 马 西 平 中 毒 的 治 疗

陈明捷 李雪晨译 张紫洞校

据报道在联合王国和瑞典的中毒治疗中心, 用活性炭重复口服治疗15例卡马西平中毒患者取得一定的疗效。

对所有患者进行支持性措施, 同时每1~6小时服用12.5~100克悬浮于水中的活性炭。测定每例患者的血浆卡马西平浓度, 并计算其机体总清除率。服用活性炭后平均半衰期是8.6(2.4标准差)小时及机体总清除率是113(44) ml/min。曾有报道说12例卡马西平过量者的平均半衰期是19.0(6.9)小时。

作者报道说, “卡马西平是广泛代谢的并有较

高的蛋白结合率, 用腹膜透析和血透析来加速卡马西平的消除意义不大。在增加卡马西平机体总清除率方面, 多次口服活性炭同血液推注活性炭效果相同, 目前认为这种疗法可作为第一线治疗。”

由此推荐, 对于卡马西平中毒者可给予活性炭治疗, 比用鼻胃管给药更好, 在最初剂量50~100克后, 以每小时不少于12.5克的速率投予直到患者症状消失。

[AJP《澳大利亚药 学 杂 志》66(11): 766, 1987(英文)]