

治疗后方可用于开角型青光眼的病人。因与某些苯二氮草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。

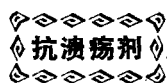
本品给药前已先用诸如麻醉药品(如吗啡)，司可巴比妥和芬太尼/达哌啶醇可增强其催眠作用。本品的剂量须相应地低一些(通常降低25~30%)。应告诫患者有关正常活动恢复的问题，尤其是本品有时用于门诊病人。建议患者不要操纵危险的机器和驾驶机动车辆，直到药物的作用如倦睡已经消失，或直到麻醉和手术后的一天，总之时间应长一些。因为本品给药后遗忘效应可持续几小时，因此也要建议向使用本药治疗的门诊患者发给一份书面的术后指导。

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正服用其它抑制剂，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。

本品采用小玻璃瓶包装，每ml含相当于咪唑二氮草5mg。此药已列入“控制药品法规”中，属于第Ⅳ类。

曹明译 魏文树 苏开仲校 张紫洞审



### 抗溃疡剂

▲法莫替丁(Famotidine, 商品名: Pepcid, 药厂: Merck Sharp and Dohme)是一种组织胺 $H_2$ 受体拮抗剂，其抑制胃酸分泌的能力与甲氰咪胍和甲硝咪胍类似。本品适用于活动性十二指肠溃疡的短期疗

法和活动性溃疡愈合后十二指肠溃疡的维持治疗(减少剂量)以及病理性分泌亢进(如卓-艾氏综合症 Zollinger-Ellison Syndrome, 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咪胍均适用的胃溃疡或甲硝咪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萎的反应。本品在与其它治疗药物同时并用的研究中，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。

法莫替丁口服后吸收不完全，口服剂量的生物利用度为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。

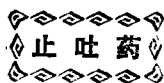
本品通常的口服剂量为40mg，每天一次，睡前服用；而对活动期十二指肠溃疡的维持治疗则为20mg睡前服用。多数患活动性十二指肠溃疡的病人可在4周内治愈，很少患者需要长达6~8周的全天服药。甲氰咪胍和甲硝咪胍最初上市时分别为每天四次和两次给药。然而这些药品的高效剂型最近已经应用，可减少用药次数，故上述三药一天一次服用即可获得疗效。

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，

每6小时服用一次。

虽然法莫替丁通常为口服给药,但对某些患顽固性溃疡或病理性分泌亢进的住院病人,也可注射给药,或者对不能口服的病人作为短期给药。推荐的剂量为20mg,每12小时一次,静脉注射(不得少于2分钟)或静脉输注(经15~30分钟)。甲氰咪胍和甲硝咪胍可肌注,亦可静注,但比法莫替丁给药间隔更短(即每6~8小时肌注或静注)。

本品片剂供应规格为含量20mg和40mg;瓶装的药物浓度为每ml含10mg。



### 止吐药

▲屈大麻酚(Dronabinol,商品名:Marinol,药厂:Roxane)也称为 $\delta$ -9-四氢大麻酚或 $\delta$ -9-THC或THC,是大麻中主要的精神活性物质。尽管大麻至今不能通过合法途径而获得,但通常认为此物质,是广泛被滥用和误用。大麻(通常指屈大麻酚的可能治疗作用已评价多年,目前已用于治疗癌症化疗导致的恶心和呕吐,而这些病人对常用的止吐治疗已感无效。

经对照研究,屈大麻酚预防恶心呕吐较甲哌氯丙嗪(Prochlorperazine)相似或更有效,对那些常规药物已无效的患者来说无疑是一个重要代替品。然而本品可能较静注灭吐灵的效果弱些;同时本品对顺氯氨铂引起的恶心和呕吐往往无效。

本品用于治疗几种其他病症也经过研究,例如青光眼和类似多发性硬化的神经疾病。不过目前评价其价值的资料尚不充分。

本品能大量滥用,以致对身体和精神产生依赖性。现已列入“控制药品法规”的表II(药物管制管理局已将它从表I重排是作为上市的先决条件)。至1986年底多数的州已对屈大麻酚重新排入新表。

本品最常报道的不良反应涉及中枢神经系统症状,依次为嗜睡、头晕、心烦、以及

协调、感觉和知觉功能暂时障碍。较少报道的反应有共济失调、注意力分散、人格解体、幻觉和暂时性精神反应。在对照试验中时,约有24%患者易发笑、情绪高昂和高度警觉,通常称之为“极度兴奋”。

开方服用屈大麻酚的患者应告诫不能操作机器、驾驶机动车辆或从事需要充分协调和判断声音的工作。应避免饮用含酒精的饮料,因有可能增加CNS的抑制。患者在使用CNS镇静药和其它对精神起作用的药物时,最好避免服用本品。若两药必须应用时,治疗过程应严密监护。

高血压或心脏病患者应小心使用本品,因会导致中枢拟交感神经的兴奋。临床研究表明有些病人会出现心动过速和体位性低血压,以及口干等反应。

本品口服给药的生物利用度相当于静注给药的10~20%,表明本品受到广泛的首过代谢效应。本品转化的多数代谢产物包括11-羟基四氢大麻酚,也是一种精神活性剂。胆汁分泌是本品的主要消除途径。

本品及其活性代谢物均有较长的半衰期;并延长药物的作用可能导致蓄积和增加不良反应的危险性。

由于本品有可能引起严重的CNS效应如拟精神病反应,故本品应保留用于标准止吐药无明显效果的患者。建议处方的剂量限于单一化疗过程所需要的剂量(亦即数天)。

本品初始剂量为 $5\text{mg}/\text{M}^2$ ,于化疗给药前1~3小时服用。然后在化疗后每2~4小时给药一次,每天共给4~6次剂量。某些临床医生使用的首次剂量为 $10\text{mg}/\text{M}^2$ ,也有些人在化疗前的夜晚开始应用本品。需要时剂量可按 $2.5\text{mg}/\text{M}^2$ 不断增至最大每次剂量为 $15\text{mg}/\text{M}^2$ 。由于剂量的升高,不良反应发生率随之增加。

本品经化学合成,用麻油配方包于胶软囊中,每粒软胶囊含量为2.5mg、5mg和10mg。