

西咪替了 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/311/2021_2022__E8_A5_BF_E5_92_AA_E6_9B_BF_E4_c22_311904.htm 药品名称西咪替了药物别名甲氰咪胍，甲氰咪胺，泰胃美，TAGAMET

，ALIRAMET，CIMETUM，ITACEM 英文名称Cimetidine 类别抗酸药及治疗消化性溃疡病药性状白色或类白色结晶性粉末；几乎无臭，味苦。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。制剂片剂：每片0.2g；0.8g。胶囊：每胶囊0.2g。注射液：每支0.2g（2ml）。分子式成分药理及应用为一种H₂受体拮抗剂，能明显地抑制食物、组胺或五肽胃泌素等刺激引起的胃酸分泌，并使其酸度降低。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。口服300mg后，迅速由小肠吸收，半小时即达有效血药浓度（0.5 μg / yml），90分钟达峰浓度，平均C_{max}为1.44 μg / ml。有效血药浓度可保持4小时。口服生物利用度约为70%，年轻人对本品的吸收情况往往较老年人为好；肌注与静注生物利用度基本相同。血浆蛋白结合率为15% ~ 20%，t_{1/2}约为2小时（慢性肾功能不全病人t_{1/2}明显延长，约为4.9小时，应注重减量或调整给药间隔），V_d为2.1 ± 1L / kg，肾清除率为12 ± 3ml / kg / 分。广泛分布于全身组织（除脑以外），44% ~ 70%以原形从尿中排出，12小时可排除口服量的80% ~ 90%。用于治疗十二指肠溃疡、胃溃疡、上消化道出血等。治疗十二指肠溃疡愈合率为74%（

对照组为37%) , 愈合时间大多在4周左右。对胃溃疡疗效不及十二指肠溃疡。另据报道, 还可用于治疗带状疱疹和包括生殖器在内的其它疱疹性感染。本品停药后复发率很高, 6个月复发率为24%, 1年复发率可高达85%。目前认为采用长期眼药或每日400~800mg或反复足量短期疗法可显著降低复发率。相互作用 (1) 氢氧化铝、氧化镁或甲氧氯普胺 (胃复安) 与本品同时服用, 可使本品的血药浓度降低。如必须与抗酸剂合用, 两者应至少相隔1小时服; 如与甲氧氯普胺合用, 本品的剂量需适当增加。 (2) 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, 二者合用可能使硫糖铝疗效降低。 (3) 本品为肝药酶抑制剂, 通过其咪唑环与细胞色素P450结合而降低药酶活性, 同时也可减少进入肝脏血流。故与普茶洛尔合用, 使后者血清浓度升高, 休息时心率减慢; 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。 (4) 与阿片类药物合用, 有报告在慢性肾功能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制剂的用量。 (5) 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, 因此应引起注重。

(6) 与茶碱合用时, 可使后者的去甲基代谢清除率降低20%~30%, 升高其血浓度。 (7) 与苯二氮革类安定药 (地西洋、硝西洋、氟硝西洋、氯氮) 合用, 可能增加地西洋等的血浓度, 加重镇静及其他中枢神经抑制症状, 并可发展为呼吸及循环衰竭。 (8) 患者同时服用地高辛和奎尼丁时, 不宜

再并用本品，因为本品可抑制奎尼丁代谢，而后者可将地高辛从其结合部位置换出来，结果使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。（9）本品可延缓咖啡因的代谢，与之合用时，能加强后者的作用，并易出现毒性反应。胃溃疡患者本来忌用咖啡因，服用本品时更应禁用咖啡因及含咖啡因饮料。（10）与华法林类抗凝剂并用，可使后者自体内排出率下降，导致出血倾向。（11）由于本品使胃液pH升高，与四环素合用时，可使四环素的溶解速率降低，吸收减少，作用减弱（但本品的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，可使阿司匹林作用增强。（12）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。（13）本品与卡托普利合用有可能引起精神病症状。（14）由于本品有与氨基糖苷类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。因此与氨基糖苷类抗生素合用时可能导致呼吸抑制或呼吸停止。

用法用量（1）口服：每次200~400mg，1日800~1600mg，一般于饭后及睡前各服1次，疗程一般为4~6周。亦有主张1次400mg，1日2次的疗法，据称按此法服用3个月，可使十二指肠溃疡患者几乎全部治愈。另外，也有报道夜间一次给予双倍剂量（800mg）的疗法，这样可不影响白天的胃酸酸度，符合人体生理特征，按此法治疗8周后，溃疡愈合率可达95%，且副作用可减少。（2）注射：用葡萄糖注射液或葡萄糖氯化钠注射液稀释后静滴，每次200~600mg；或用上述溶液20ml稀释后缓慢静注，每次200mg，4~6小时1次。1日剂量不宜超过2g。也可直接肌注。注重事项由于本品在体内分布

广泛，药理作用复杂，故副作用及不良反应较多。（1）消化系统反应：较常见的有腹泻、腹胀、口苦、口干、血清氨基转移酶轻度升高，偶见严重肝炎、肝坏死、肝脂肪性变等。由于能通过胎盘屏障，并能进入乳汁，故孕妇和哺乳期妇女禁用，以避免引起胎儿和婴儿肝功能障碍。忽然停药，可能引起慢性消化性溃疡穿孔，估计为停用后回跳的高酸度所致。故完成治疗后尚需继续服药（每晚400mg）3个月。动物实验和临床均有应用本品导致急性胰腺炎的报道，故不宜用于急性胰腺炎患者。（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，用药期间应注重检查肾功能。（3）造血系统反应：本品对骨髓有一定的抑制作用，少数病人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。用药期间应注重检查血象。（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。引起中毒症状的血药浓度多在 $2\mu\text{g}/\text{ml}$ 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。严重肝功能不全者服用常规剂量后，其脑脊液的药物浓度为正常人的两倍，故轻易中毒。出现神经毒性后，一般只需适当减少剂量即可消失。本品的神经毒性症状与中枢抗胆碱药所致者极为相似，且用拟胆碱药毒扁豆碱治疗，其症状可得到改善。故应避免本品与

中枢抗胆碱药同时使用，以防加重中枢神经毒性反应。（5）心血管系统反应：可有心动过缓、面部潮红等。静脉注射时偶见血压骤降、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（每日在1.6g以上）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。

100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 www.100test.com