

罗沙替丁乙酸酯 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__E7_BD_97_E6_B2_99_E6_9B_BF_E4_c22_311909.htm 药品名称罗沙替丁乙酸酯 药物别名哌芳替丁，哌芳酯丁，Aceroxatidine，Pifatidine，ALTAT 英文名称Roxatidine Acetate 类别抗酸药及治疗消化性溃疡病药 性状结晶状，熔点为59～60℃；常用其盐酸盐，熔点为145～146℃。制剂缓释胶囊：每胶囊75mg。分子式成分药理及应用本品及体内代谢物罗沙替丁为选择性H₂受体拮抗剂，其抗分泌效力为西咪替丁的3～6倍、雷尼替丁的2倍。本品显著及呈剂量依靠性地抑制胃酸分泌。健康志愿者或消化性溃疡病人单剂口服50mg 3小时后基础胃酸分泌量减少超过90%。与安慰剂比较，早晚各服用75mg可显著减少健康志愿者白天和夜间的胃酸分泌量（超过75%）。本品还显著减少消化性溃疡患者的胃蛋白酶总量，而对血清中胃蛋白酶原和胃泌素水平无明显影响。本品与西咪替丁、雷尼替丁和法莫替丁不同的是，它对坏死药物所致大鼠的胃粘膜损伤有预防作用。因此，对这种实验模型具有粘膜保护作用。本品对下丘脑-垂体-性腺或下丘脑肾上腺功能无显著影响，因此它没有抗雄激素活性。与西咪替丁相反，本品对肝脏混合功能氧化酶系统无显著影响，所以它不干扰经肝脏代谢药物的清除。本品口服后吸收迅速、完全（>95%），并通过酯解作用脱乙酰基，迅速转化为活性代谢物罗沙替丁。健康人口服75mg，t_{max}为3小时，健康人的t_{1/2}为4～8小时，CL为21～24L/h，单剂口服后的V_d为1.7～3.2L/kg。本品主要在血浆和尿中代谢，主要代谢物为罗沙替丁，从尿中回收总

的放射性活性物质大约占给药量的96%，罗沙替丁约占其中55%，尿中没有罗沙替丁乙酸酯。食物和抗酸剂几乎不影响本品的药动学。在小规模临床单盲和大规模临床双盲试验中，天天给予本品150mg，胃溃疡患者服药8周后的治愈率为50%~96%，十二指肠溃疡患者服药6周后的治愈率为63%~93%。在大规模比较试验中，服用本品75mg，每日2次或150mg，每晚一次的疗效与200mg，每日4次或800mg，每晚1次的西咪替丁和150mg，每日2次的雷尼替丁相似。本品可用于胃溃疡、十二指肠溃疡、吻合口溃疡，卓-艾氏综合征、反流性食道炎等，也可用于麻醉前给药防止吸入性肺炎。用法用量口服，胃溃疡、十二指肠溃疡、吻合口溃疡、卓-艾氏综合征及反流性食管炎通常成人每次75mg，每日2次，早餐后及睡前服用。可按年龄和症状适当增减。麻醉前给药，通常成人于手术前1日临睡前及手术诱导麻醉前2小时各服75mg。肝、肾功能不全患者应适当调整剂量。注重事项（1）有药物过敏史患者慎用，孕妇和儿童用药的安全性尚未明确，一般不宜应用。（2）哺乳妇女给药时应停止授乳。（3）用药前诊断未明确者不宜应用，因本品可能掩盖胃癌的症状。

（4）不良反应发生率约为1.7%。主要有皮疹、瘙痒感（均应停药）、嗜酸性粒细胞增多、白细胞减少、便秘或腹泻、恶心、腹胀、AST与ALT升高、嗜睡等。罕见头痛、失眠、倦怠及血压上升。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