

胃酸分泌抑制剂：H₂受体拮抗剂药师资格考试 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/542/2021_2022__E8_83_83_E9_85_B8_E5_88_86_E6_c23_542386.htm [主要品种] H₂受体拮抗剂包括西米替丁、雷尼替丁、法莫替丁等。[适应症] 主要用于治疗胃和十二指肠溃疡。[作用特点] H₂受体拮抗剂能选择性地阻断壁细胞膜上的H₂受体，使胃酸分泌减少。不仅抑制基础胃酸的分泌，而且能部分地阻断组胺、五肽胃泌素、拟胆碱药和刺激迷走神经等所致的胃酸分泌。[药理作用] H₂受体拮抗剂选择性地竞争结合壁细胞膜上的H₂受体，使壁细胞内cAMP产生，胃酸分泌减少。H₂受体拮抗剂不仅对组胺刺激的酸分泌有抑制作用，尚可部分地抑制胃泌素和乙酰胆碱刺激的酸分泌。常用的西咪替丁、雷尼替丁、法莫替丁等三种H₂受体拮抗剂抑制胃酸分泌的相对能力相差20~50倍，以甲氰咪胍最弱，法莫替丁最强。相应地抑制50%五肽胃泌素刺激的酸分泌所需的有效血浓度（EC₅₀），以甲氰咪胍最高，法莫替丁最低。在常规剂量下，血浓度超过EC₅₀的时间在甲氰咪胍约6小时，其他两种约10小时。[不良反应] H₂受体拮抗剂是相当安全的药物，严重不良反应的发生率很低。年龄大、伴肾功能和其他疾病时，易产生不良反应，常见腹泻、头痛、嗜睡、疲劳、肌痛、便秘等。[H₂受体拮抗剂新用法] H₂受体拮抗剂可高度选择性地与组胺H₂受体结合，竞争性地拮抗组胺与H₂受体结合后引起的胃酸分泌，产生抑酸作用，用于治疗消化性溃疡。传统的给药方法是一日剂量分次给药，如西咪替丁200毫克，每天四次或400毫克，每天二次；雷尼替丁150毫克，每天二次；法莫替丁20毫克，每天二

次；尼扎替丁150毫克，每天二次；罗沙替丁75毫克，每天二次。近年来的研究结果表明，组胺的基础分泌以夜间为主，并且夜间胃液酸度在消化性溃疡，特别是十二指肠溃疡考试，大收集整理发病机制中起重要作用。白天的胃酸分泌与乙酰胆碱、胃泌素相关，且排出量不但与溃疡的形成无关，而且还具有以下显著的生理性作用：维持正常的消化过程，特别是蛋白质的消化，因为胃蛋白酶原转变为胃蛋白酶只有在足够酸的环境中才能实现；一定的胃酸酸度与钙和铁的吸收有重要关系；白天正常的胃酸分泌可保持胃内无菌环境，避免念珠菌使溃疡愈合延缓、幽门螺杆菌感染引起部分患者溃疡病的过早复发、胃酸持久抑制引起一些患者腹泻。因此，有学者认为，H₂受体拮抗剂在白天的抑酸作用弱，而夜间给予此类药可以有效地抑制胃酸分泌，从而可以使溃疡快速愈合，症状缓解。临床观察也支持这一观点，即在睡前将H₂受体拮抗剂一日剂量一次给药，在溃疡愈合速度、症状缓解和安全性上均与一日剂量分次给药法相同，并且这种给药法可以提高溃疡病患者的用药依从性。已经在临床应用的H₂受体拮抗的一日剂量一次给药法为：睡前服，西咪替丁800毫克，雷尼替丁300毫克，法莫替丁40毫克，尼扎替丁300毫克，罗沙替丁150毫克。[H₂受体拮抗剂市场分析]随着新药成果转化率的不断提高，国产药品价格连续下调，百姓得到了实惠的同时，消化类用药消费比值已呈现出下降的趋势。与此同时，在新药的推广应用下，产品的更新换代较快，用药金额仍呈现出增长势头，2003年国内16个典型城市样本医院中，消化系统及代谢药物用药金额已达19.63亿元，同比上一年增长了17.03%。目前在抗溃疡抑酸剂药物市场上，已形成了由质

子泵抑制剂类、H₂受体拮抗剂和胃粘膜保护剂三足鼎立的局面，H₂受体拮抗剂：雷尼替丁、法莫替丁、西咪替丁、尼扎替丁已广泛用于临床，新药罗沙替丁、拉呋替丁、乙溴替丁的开发，将进一步加大胃炎和胃肠溃疡临床药物的选择范围，尽管奥美拉唑及其品牌药物"洛赛克"在我国市场形势很好，但是"替丁类"药物符合同情，也展示出较好的市场前景。 [消化系统疾病及其药物进展] 消化系统疾病是常见多发病，同时也是一种极易复发的慢性病，尚未有彻底根治的有效手段，这已成为药学领域研究的重点课题之一。统计分析表明：全球消化系统的发病率占人类的10 - 12%，我国城镇消化系统的发病率为11.43%，与欧美许多发达国家基本相似。由于饮食结构的特点，南方城市和西南地区居民的患病率比较偏高，而中老年人消化性溃疡的发生率较多，每年仍有数千万胃肠道病患者采用药物治疗。 伴随着胃肠治疗药物的快速增长，许多的抗溃疡新药如雨后春笋相继问世，消化系统用药在我国已成为仅次于抗感染类、心血管类的第三大治疗药物，据2002年全国医药工业信息年会资料报道：2001年世界13大药物市场营养代谢药品销售额已达373亿美元，占市场总额的15.29%，同比增长率为7%，其中畅销的前200种药品中五种抗溃疡药的销售额为112亿美元。 据中国医药商业协会统计：我国2001年各类药品的纯销售额为1530亿元，消化与代谢药品共320个品种，占药品销售额的9.55%，为146亿元。由于用药结构的调整，已显示出强劲的增长势头。消化与代谢药的另一特点是在零售市场中表现格外突出，南方医药经济研究所零售分析系统的数据表明，2002年上半年，消化系统用药占化学药品零售额的16.27%，仅次于抗感染药居于第二。

在我国消化系统治疗药物中，传统中成药的市场份额相对较小，尚不足该类药品总量的1/3，主要是由于中成药疗效不明确，显效率低，常作为胃肠调理保护性辅助用药。而临床中的西药已趋于成熟，抗溃疡药、胃粘膜保护剂是目前国内消化系统用药的中流砥柱，市场占有率已达62.35%，在国内抗溃疡药市场占据着主导地位，已成为大众认知的药品。

。"#F8F8F8" 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