

药理基础与药物临床应用

(下)

孙 谦等◎主编

作用于呼吸系统的药物

第十八章 平喘药

第一节 β 受体激动剂

一、沙丁胺醇 (Salbutamol)

1. 其他名称 阿布叔醇、爱纳乐、爱纳灵、喘乐宁、喘宁蝶、达芬科闯、惠百适、康尔贝宁、伉尔舒宁、舒喘灵、柳氨醇、律克、品川、其苏、全宁碟、全特宁、萨姆、赛比舒、沙博特、舒布托、舒喘宁、万托林。

2. 药理作用 本品为选择性肾上腺素 β_2 受体激动剂，能选择性地激动支气管平滑肌上的肾上腺素 β_2 受体，有较强的支气管扩张作用，其作用机制部分是通过激活腺苷酸环化酶，增强细胞内环磷腺苷的合成，从而松弛平滑肌，并可通过抑制肥大细胞等致敏细胞释放过敏反应介质，解除支气管痉挛。本品用于支气管哮喘患者时，其支气管扩张作用与异丙肾上腺素相等。本品对心脏的肾上腺 β_1 受体的激动作用较弱，其增加心率作用仅为异丙肾上腺素的 1/10。

此外，本品可松弛一些其他器官（如子宫、血管等）的平滑肌，可降低子宫肌肉对刺激的应激性，抑制子宫收缩，有利于妊娠，还可降低眼内压。

3. 适应证

- (1) 用于防治支气管哮喘、喘息性支气管炎和肺气肿患者的支气管痉挛等。
- (2) 本品雾化吸入溶液还可用于运动性支气管痉挛及常规疗法无效的慢性支气管痉挛。
- (3) 还用于改善充血性心力衰竭。
- (4) 亦用于预防高危妊娠早产、先兆流产、胎儿宫内生长迟缓。

4. 用法用量

(1) 成人

1) 口服给药：一次 2~4mg，一日 3 次。缓释及控释制剂，一次 8mg，一日 2 次，早、晚服用。

2) 气雾吸入：每 4~6 小时 200~500 μ g，1 次或分 2 次吸入，2 次吸入时间隔 1 分钟。

3) 喷雾吸入: ①间歇性治疗: 一次 2.5~5mg, 一日 4 次, 从低剂量开始, 以注射用生理盐水稀释至 2ml 或 2.5ml, 喷雾可持续约 10 分钟。部分患者可能需要 10mg 的较大剂量, 可不经稀释, 取 10mg 直接置入喷雾装置中, 雾化吸入, 直至支气管得到扩张为止, 通常需要 3~5 分钟。②连续性治疗: 以注射用生理盐水稀释成 50~100mg/ml 的溶液, 给药速率通常为 1mg/h, 最大可增至 2mg/h。

4) 粉雾吸入: 一次 0.2~0.4mg, 一日 4 次。

5) 肌肉注射: 一次 0.4mg, 必要时 4 小时可重复注射。

6) 静脉注射: 一次 0.4mg, 用 5% 葡萄糖注射液或生理盐水 20ml 稀释后缓慢注射。

7) 静脉滴注: 一次 0.4mg, 用 5% 葡萄糖注射液 100ml 稀释后滴注。

(2) 老人剂量: 老年人使用时从小剂量开始, 逐渐加大剂量。

(3) 儿童

1) 口服给药: 一次 0.6mg, 一日 3~4 次。缓释及控释制剂, 一次 4mg, 一日 2 次, 早、晚服用。

2) 喷雾吸入: 间歇性治疗, 1.5~12 岁以下儿童, 一次 2.5mg, 一日 4 次, 从低剂量开始, 以注射用生理盐水稀释至 2ml 或 2.5ml。部分儿童可能需要增至 5mg, 由于可能发生短暂的低氧血症, 可考虑辅以氧气治疗。

3) 粉雾吸入: 一次 0.2mg, 一日 4 次。

5. 不良反应

(1) 较常见的不良反应有震颤、恶心、心悸、头痛、失眠、心率增快或心搏异常强烈。

(2) 较少见的不良反应有头晕、目眩、口咽发干。

(3) 罕见肌肉痉挛、过敏反应(表现为异常支气管痉挛、血管神经性水肿、荨麻疹、低血压和晕厥)。

(4) 还可见低钾血症(剂量过大时)及口咽刺激感。长期用药亦可形成耐受性, 不仅疗效降低, 且可能使哮喘加重。

6. 禁忌

(1) 对本品或其他肾上腺素受体激动药过敏者。

(2) 对氟利昂过敏的患者禁用本品气雾剂。

7. 注意事项

(1) 通常预防用药时口服给药, 控制发作时用气雾或粉雾吸入。

(2) 本品缓释及控释制剂应用温水整片吞服, 不得咀嚼。

(3) 本品雾化吸入溶液一般剂量无效时, 不能随意增加药物剂量或使用次数, 反复过量使用可导致支气管痉挛, 如有发生应立即停药, 更改治疗方案。

(4) 增加使用吸入的 β_2 受体激动剂可能是哮喘恶化的征象, 若出现此情况, 需重新评估对患者的治疗方法, 考虑合用糖皮质激素治疗。

(5) 用药期间应监测血钾浓度。

(6) 使用本品预防早产的妇女, 有患肺水肿的危险, 应密切监测心肺功能。

(7) 以下情况应慎用: ①高血压患者。②糖尿病患者。③冠状动脉供血不足患者。④甲状腺功能亢进患者。⑤老年人。⑥孕妇及哺乳期妇女, FDA 对本药的妊娠安全性分级为 C 级。⑦惊厥患者慎用本品雾化吸入溶液。

8. 药物相互作用

(1) 与其他肾上腺素受体激动剂或茶碱类药物合用时,可增强对支气管平滑肌的松弛作用,但也可增加不良反应。

(2) 可增强泮库溴铵、维库溴铵所引起的神经肌肉阻滞的程度。

(3) 单胺氧化酶抑制剂、三环类抗抑郁药、抗组胺药、甲状腺素等可增加本品的不良反应。

(4) 与磺胺类药物合用时,可降低磺胺类药物的吸收。

(5) 肾上腺素 β 受体阻滞药(如普萘洛尔)能拮抗本品的支气管扩张作用,故两者不宜合用。

(6) 与氟烷在产科手术中合用时,可加重子宫收缩无力,导致大出血。

(7) 与洋地黄类药物合用时,可增加洋地黄类药物诱发心律失常的危险性。

(8) 与皮质类固醇、利尿剂等合用时,可加重血钾浓度降低的程度。

(9) 与甲基多巴合用时,可出现严重的急性低血压反应。

9. 规格 片剂:2mg。胶囊剂:2mg;4mg;8mg。缓释片(胶囊):4mg;8mg。控释片(胶囊):4mg;8mg。糖浆剂:10ml:4mg。气雾剂:0.1mg×200 喷。粉雾剂(胶囊):0.2mg;0.4mg。雾化吸入溶液:20ml:100mg。注射剂:2ml:0.4mg。

二、特布他林(Terbutaline)

1. 其他名称 比艾、别力康纳、博利康尼、博力康尼都保、布瑞平、川婷、喘康速、菲科坦、慧邦、间羟舒丁肾上腺素、间羟舒喘灵、间羟嗽必妥、叔丁喘宁、苏顺、特林、伊坦宁。

2. 药理作用 本品是选择性肾上腺素 β_2 受体激动剂,与肾上腺素 β_2 受体结合后,可使细胞内环磷腺苷(cAMP)升高,从而舒张支气管平滑肌。并能抑制内源性致痉挛物质的释放及内源性介质引起的水肿,提高支气管黏膜纤毛廓清能力。对于哮喘患者,本品 2.5mg 的平喘作用与 25mg 麻黄碱相当。

试验证明,本品对心脏肾上腺素 β_1 受体的作用极小,对心脏的兴奋作用仅及异丙肾上腺素的 1/100、硫酸沙丁胺醇(喘乐宁)的 1/10。但临床应用时(特别是大量或注射给药)仍有明显心血管系统不良反应,因本品尚能激动血管平滑肌肾上腺素 β_2 受体,舒张血管,使血流量增加,通过压力感受器反射地兴奋心脏。

此外,连续静滴本品可激动子宫平滑肌肾上腺素 β_2 受体,抑制自发性子宫收缩和催产素引起的子宫收缩。

3. 适应证

(1) 用于治疗支气管哮喘、慢性喘息性支气管炎、阻塞性肺气肿和其他伴有支气管痉挛的肺部疾病。

(2) 静脉滴注可用于预防早产及胎儿窒息。

4. 用法用量

(1) 成人

1) 口服给药:①平喘:片剂:一次 2.5~5mg,一日 3 次。一日最大量不超过 15mg。胶囊剂、颗粒剂:一次 1.25mg,一日 2~3 次,1~2 周后可加至一次 2.5mg,一日 3 次。口

服溶液：一次 1.5~3mg，一日 3 次。②预防早产及胎儿窒息：用于静脉滴注后维持治疗。在停止静脉滴注前 30 分钟给予 5mg，以后每 4 小时口服 1 次。一日极量为 30mg。

2) 静脉注射：必要时每 15~30 分钟注射 0.25mg，4 小时内总剂量不能超过 0.5mg。

3) 静脉滴注：①平喘：一日 0.5~0.75mg，分 2~3 次给药。使用本品注射液时，需先将注射液 0.25mg 或 0.5mg 用生理盐水 100ml 稀释后缓慢 (2.5μg/min) 滴注。②预防早产及胎儿窒息：开始时滴速为 2.5μg/min，以后每 20 分钟增加 2.5μg/min，直至宫缩停止或滴速达到 17.5μg/min，以后可每 20 分钟减 2.5μg/min，直至最低有效滴速，维持 12 小时。若再出现宫缩，可再按上述方法增加滴速控制。

4) 皮下注射：一次 0.25mg，如 15~30 分钟无明显临床改善，可重复注射 1 次，但 4 小时内总量不能超过 0.5mg。一日最大剂量为 1mg。

5) 气雾吸入：每 4~6 小时 0.25~0.5mg，可 1 次或分 2 次吸入，2 次吸入间隔时间为 1 分钟。

6) 雾化吸入：一次 5mg (2ml) 加入雾化器中，24 小时内最多给药 4 次。如雾化器中药液未一次用完，可在 24 小时内使用。

7) 粉雾吸入：一次 0.25~0.5mg，每 4~6 小时 1 次，严重者可增至一次 1.5mg，一日最大量不超过 6mg。需要多次吸入时，每吸间隔时间 2~3 分钟。

(2) 老年人：老年患者应从小剂量开始用药。

(3) 儿童

1) 口服给药：12 岁以上儿童：一日 65μg/kg，分 3 次服用。

2) 雾化吸入：①体重大于 20kg 者：雾化溶液，一次 5mg (2ml) 加入雾化器中，24 小时内最多给药 4 次。如雾化器中药液未一次用完，可在 24 小时内使用。②体重小于 20kg 者：雾化溶液，一次 2.5mg (1ml)，24 小时内最多给药 4 次。如雾化器中药液未一次用完，可在 24 小时内使用。

3) 粉雾吸入：5~12 岁，一次 0.25~0.5mg，每 4~6 小时 1 次，严重者可增至一次 1mg，一日最大量不超过 4mg。需要多次吸入时，每吸间隔时间 2~3 分钟。

(4) 肾功能不全者：中度肾功能不全患儿用量为常规用量的 1/2。轻度肾功能不全者不必调整剂量。

5. 不良反应 本品引起的不良反应发生率低，多为轻度，可耐受，不影响继续治疗。

(1) 中枢神经系统：可见震颤 (连续用药数日后自行消失)、神经质、情绪变化、失眠、头晕、头痛，偶见嗜睡。

(2) 心血管系统：可见心悸 (减量后会好转)、心动过速。

(3) 代谢及内分泌系统：偶见高血糖和乳酸过多，并可能使血钾浓度降低。大剂量用药可使有癫痫病史者发生酮症酸中毒。大剂量静脉给药可使糖尿病和酮症酸中毒加重。

(4) 呼吸系统：可见鼻塞、胸部不适，少见呼吸困难，偶有超敏反应及支气管痉挛发作的报道。

(5) 肌肉骨骼系统：可见肌肉痉挛，偶见肌张力增高。

(6) 肝脏：偶见氨基转移酶升高。

(7) 胃肠道：可见口干、恶心、呕吐等。

(8) 过敏反应：偶见皮疹、荨麻疹、过敏性脉管炎。

(9) 其他：可见疲乏、面部潮红、出汗及注射局部疼痛。长期应用可形成耐药，使疗效降低。

6. 禁忌

- (1) 对本品过敏者。
- (2) 对其他拟交感胺类药过敏者。

7. 注意事项

(1) 用于治疗哮喘时推荐短期间断应用，以吸入为主，只在重症哮喘发作时才考虑静脉给药。使用本品的同时应注意使用肾上腺皮质激素等抗炎药。

(2) 以下情况应慎用：①心血管疾病患者（包括冠心病、原发性高血压、心律失常）。②糖尿病患者。③癫痫患者。④对拟交感胺类药物敏感性增加者（如未经适当控制的甲亢患者）。⑤老年患者慎用本品粉雾剂和气雾剂。⑥孕妇及哺乳期妇女。FDA 对本药的妊娠安全性分级为 C 级。⑦12 岁以下儿童不推荐使用除吸入粉雾剂外的其他制剂。

8. 药物相互作用

- (1) 与其他肾上腺素受体激动剂合用，可使疗效增加，但不良反应也可能加重。
- (2) 单胺氧化酶抑制药、三环类抗抑郁药、抗组胺药、甲状腺素等可增加本品的不良反应。正使用单胺氧化酶抑制药及三环类抗抑郁药或停用 2 周以内的患者应慎用本品。
- (3) 与拟交感胺类药合用，对心血管系统会产生有害影响，故不推荐两者联用。
- (4) 与咖啡因或解充血药合用，可能增加心脏的不良反应。
- (5) 与琥珀酰胆碱合用，可增强后者的肌松作用。
- (6) 肾上腺素 β 受体阻断药（如醋丁洛尔、阿替洛尔、拉贝洛尔、美托洛尔、纳多洛尔、吡洛洛尔、普萘洛尔、噻吗洛尔等）能拮抗本品的作用，使疗效降低，还可能使哮喘患者产生严重的支气管痉挛。
- (7) 与茶碱合用时，可降低茶碱的血药浓度，增强舒张支气管平滑肌作用，但可能加重心悸等不良反应。
- (8) 使用非保钾利尿药（如噻嗪类利尿药）能引起心电图改变和低钾血症，服用（尤其是超剂量服用）肾上腺素 β 受体激动药可使症状急性恶化，其结果的临床意义尚不明确，本品与非保钾利尿药联用时需谨慎。

9. 规格 片剂：2.5mg；5mg。胶囊剂：1.25mg；2.5mg。颗粒剂：1.25mg。口服溶液：100ml；30mg。注射液：1ml：0.25mg；2ml：0.5mg。硫酸特布他林氯化钠注射液：100ml（硫酸特布他林 0.25mg、氯化钠 900mg）。注射用硫酸特布他林：0.25mg；1mg。气雾剂：2.5ml：25mg；2.5ml：50mg；10ml：100mg。吸入粉雾剂：0.5mg（每吸）。雾化溶液：2ml：5mg。

三、班布特罗（Bambuterol）

1. 其他名称 奥多利、邦尼、帮备、贝合健、啡爽、孚美特、汇杰、罗利。

2. 药理作用 本品为支气管扩张药，在体内转化为特布他林，可提高药物的吸水性以及在首过效应中水解代谢时的稳定性，从而延长作用维持时间。特布他林通过激动肾上腺素 β_2 受体，使支气管产生松弛作用；并抑制内源性致痉挛物质释放，抑制由内源性介质引起的水肿；还可提升支气管纤毛的廓清能力。

3. 适应证 用于治疗支气管哮喘、哮喘性支气管炎、阻塞性肺气肿及其他伴有支气管痉挛的肺部疾病。

4. 用法用量 成人口服给药，推荐起始剂量为 10mg，每晚睡前服用。根据临床疗效，在 1~2 周后可增加到 20mg。肾小球滤过率（GFR）小于 50ml/min 的患者，建议初始剂量用 5mg。老年患者应减小初始剂量。

5. 不良反应 本药不良反应较其他同类药物为轻，可见有震颤、头痛、精神紧张、强直性肌肉痉挛、心悸和心动过速等，其严重程度与剂量正相关，大部分在治疗 1~2 周后会自然消失。极少数患者可能出现氨基转移酶轻度升高以及口干、头晕和胃部不适等。

6. 禁忌

- (1) 对本品、特布他林及其他拟交感胺类药物过敏者。
- (2) 特发性肥厚性主动脉瓣下狭窄患者。
- (3) 快速型心律失常患者。
- (4) 肝硬化或肝功能不全者。

7. 注意事项

(1) 肝硬化患者或严重肝功能不全者本品转化为特布他林时有严重阻碍，应直接给予特布他林或其他肾上腺素 β_2 受体激动药。

(2) 下列情况应慎用：①新近发生过心肌梗死者。②高血压患者。③糖尿病患者。④甲状腺功能亢进者。⑤对拟交感胺类药物敏感性增加者。⑥孕妇及哺乳期妇女。

8. 药物相互作用

- (1) 本品可能延长琥珀胆碱对肌肉的松弛作用。
- (2) 与皮质激素、利尿药合用，可加重血钾降低的程度。
- (3) 肾上腺素 β_2 受体激动药会增加血糖浓度，从而降低降糖药物作用，因此患有糖尿病患者，服用本品时应调整降糖药物剂量。
- (4) 肾上腺素 β 受体阻滞剂（醋丁洛尔、阿替洛尔、拉贝洛尔、美托洛尔、纳多洛尔、吲哚洛尔、普萘洛尔、噻吗洛尔）能拮抗本品的作用，使其疗效降低。
- (5) 单胺氧化酶抑制剂、三环类抗抑郁药、抗组胺药、甲状腺素等可能增加本品的不良反应。
- (6) 与其他支气管扩张药合用时，可增加不良反应。

9. 规格 片剂：10mg；20mg。胶囊剂：10mg。颗粒剂：2g；100mg。口服液：100ml；100mg。

四、丙卡特罗（Procaterol）

1. 其他名称 川迪、曼普特、美喘清、美普清、普鲁卡地鲁、普鲁啞醇、异丙啞喘宁、希思宁。

2. 药理作用 本品为肾上腺素 β_2 受体激动剂，对支气管的 β_2 受体具有高度选择性，其支气管扩张作用强而持久。同时具有较强的抗过敏作用，抑制速发型的气道阻力增加，抑制迟发型的气道反应性增高。豚鼠肺切片试验显示，本品对用白蛋白诱发组胺释放的抑制作用比异丙肾上腺素强 10 倍，比舒喘灵强 100 倍。人体试验表明，本品能抑制哮喘患者以乙酰胆碱喷雾剂诱发的支气管收缩反应，并有轻微增加支气管纤毛运动的作用。

3. 适应证 适用于支气管哮喘、哮喘性支气管炎、伴有支气管反应性增高的急性支气管炎和慢性阻塞性肺疾病所致的喘息症状。

4. 用法用量

(1) 成人

1) 口服给药：一次 $50\mu\text{g}$ ，一日 1 次，临睡前服用，或一次 $50\mu\text{g}$ ，一日 2 次，早晨及临睡前口服。

2) 气雾吸入：一次吸入 $10\sim 20\mu\text{g}$ ，一日 3 次，10 日为一疗程，可连续 3 个疗程或视病情需要而定。

3) 直肠给药：以栓剂 $100\mu\text{g}$ 塞肛，每晚 1 次或早晚各 1 次。

(2) 老年人：一般高龄者生理功能降低，注意减量。

(3) 儿童

1) 口服给药：6 岁以上儿童：每晚睡前 1 次服 $25\mu\text{g}$ ，或一次 $25\mu\text{g}$ ，早晚（睡前）各服 1 次。6 岁以下儿童：一次 $1.25\mu\text{g}/\text{kg}$ ，一日 2 次。可依据年龄和症状的严重程度调整剂量。

2) 气雾吸入：一次 $10\mu\text{g}$ 。

5. 不良反应 本品引起的不良反应较少。

(1) 心血管系统：可引起面部潮红、血压升高、室性心律不齐、心动过速。偶有心电图改变。

(2) 精神神经系统：可引起紧张、头痛、震颤、嗜睡、眩晕、失眠、肌肉颤动、耳鸣等。

(3) 呼吸系统：有时出现气管、咽喉异常感，偶见鼻塞，较少发生呼吸困难。

(4) 胃肠道：可引起恶心、胃部不适、口渴等。

(5) 血液：偶见血小板减少。

(6) 过敏反应：偶见皮疹。

(7) 其他：可见一过性血钾降低。长期应用可形成耐药性，疗效降低。

6. 禁忌 对本品及肾上腺素受体激动药过敏者禁用。

7. 注意事项

(1) 本品对变应原引起的皮肤反应有抑制作用，故进行皮肤试验时，应提前 12 小时终止服用本品。

(2) 下列情况应慎用：①甲状腺功能亢进。②高血压患者。③冠心病等心脏病患者。④糖尿病患者。⑤孕妇及哺乳期妇女。

8. 药物相互作用

(1) 本药与肾上腺素及异丙肾上腺素等儿茶酚胺类合用时会引起心律失常、心率增加，故应避免与上述药物合用。

(2) 合用茶碱类药时，可增加舒张支气管平滑肌作用，但不良反应也增加。

(3) 与单胺氧化酶抑制剂及三环类抗抑郁药合用，可增加本品的不良反应。

(4) 与黄嘌呤衍生物、甾体激素及利尿药合用时有增加肾上腺素 β_2 受体激动剂降低血钾的作用，对重症哮喘患者应特别注意。低氧血症在血钾低下时增加了对心率的作用，在这种情况下要对血清钾进行监测。

(5) 非选择性肾上腺素 β_2 受体阻断药可部分或全部拮抗本品的作用。

9. 规格 片剂: 25 μg ; 50 μg 。胶囊剂: 25 μg 。口服溶液: 500ml: 2.5mg。气雾剂: 2mg (每揿)。

五、沙美特罗 (Salmeterol)

1. 其他名称 喘必灵、祺泰、强力安喘通、司多米、施立碟、施立稳。

2. 药理作用 本品为长效选择性肾上腺素 β_2 受体激动剂。其作用机理是通过刺激细胞内的腺苷酸环化酶提高 cAMP 水平, 从而使支气管平滑肌松弛, 并抑制细胞 (特别是肥大细胞) 的速发型超敏反应介质释放。本品能够持续停留在作用部位, 可产生 12 小时的支气管扩张作用。吸入本品 25 μg 引起的支气管扩张程度与吸入沙丁胺醇 200 μg 相当。作用特点: ①直接作用于呼吸道平滑肌受体, 使平滑肌扩张, 并增强其纤毛的黏液清除功能。②作用于炎症细胞表面的 β_2 受体, 如肺泡巨噬细胞、肥大细胞、嗜酸性粒细胞、中性粒细胞和淋巴细胞, 对该类炎症细胞的激活具有抑制作用。且有阻止肺组织释放组胺和白介素的作用, 从而抑制炎症递质。③抑制哮喘患者吸入抗原诱发的气道反应性增高, 和 IgE 引起的皮肤红斑反应。

3. 适应证

(1) 慢性支气管哮喘 (包括夜间哮喘和运动型哮喘) 的预防和维持治疗, 特别适于防治夜间哮喘发作。

(2) 慢性阻塞性肺疾病 (包括肺气肿和慢性支气管炎) 伴气道痉挛时的治疗。

4. 用法用量

(1) 成人

1) 气雾吸入: 一次 50 μg , 一日 2 次; 严重病例一次 100 μg , 一日 2 次; 甚至可用至一次 200 μg , 一日 2 次。

2) 粉雾吸入: 一次 50 μg , 一日 2 次。

(2) 儿童

1) 气雾吸入: 一次 25 μg , 一日 2 次。

2) 粉雾吸入: 一次 25 μg , 一日 2 次。

5. 不良反应 本品耐受性好, 不良反应轻微。

(1) 最常见恶心、呕吐、倦怠、不适、肌痉挛、颤抖。

(2) 还可见血钾过低、心动过速、速发型过敏反应 (如皮疹、气道痉挛)、异常的支气管痉挛 (这时须改用其他治疗方法)。

(3) 较少见头痛、心悸。

(4) 极少见震颤反应 (常是暂时性的, 与剂量有关, 经定期使用后即可减弱), 极少数患者在吸入本品后可发生咽喉痉挛、刺激或肿胀, 表现为喘鸣和窒息等。

6. 禁忌 对本品过敏者、主动脉瓣狭窄者、心动过速者、严重甲状腺功能亢进者禁用。

7. 注意事项

(1) 由于起效相对较慢, 故不适用于急性哮喘发作患者, 不适用于重度或危重哮喘发作患者。

(2) 不适用于冠心病、高血压、心律失常、惊厥、甲状腺毒症的哮喘患者及对所有拟

交感神经药物高度敏感的哮喘患者。

(3) 虽然本品具有抗炎作用,但不能取代糖皮质激素口服及吸入制剂的使用,临床常需与糖皮质激素类抗炎药物合用,以增强疗效。

(4) 同其他吸入性药物相同,使用本品治疗后可出现异常的支气管痉挛反应,使哮喘加剧,须立即停药,并使用短效肾上腺素 β_2 受体激动药(如沙丁胺醇)。

(5) FDA 对本药的妊娠安全性分级为 C 级。

8. 药物相互作用

(1) 本品与茶碱类等支气管扩张药合用可产生协同作用,合用时应注意调整剂量。

(2) 与黄嘌呤衍生物、激素、利尿药合用,可加重血钾降低。

(3) 与单胺氧化酶抑制药合用,可增加心悸、激动或躁狂发生的危险性,两者不宜合用。

(4) 与三环类抗抑郁药合用可增强心血管兴奋性,两者不宜合用。

(5) 与非选择性肾上腺素 β 受体阻滞药合用,可降低本药疗效,两者不宜合用。

(6) 与保钾利尿剂合用,尤其本品超剂量时,可使患者心电图异常或低血钾加重,合用时须慎重。

9. 规格 羟萘酸沙美特罗气雾剂: $25\mu\text{g} \times 200$ 揿。沙美特罗气雾剂: $25\mu\text{g} \times 60$ 揿; $25\mu\text{g} \times 120$ 揿。蝶式吸入剂: 每个药泡含本药 $50\mu\text{g}$ 。粉雾剂胶囊: $50\mu\text{g}$ 。

六、福莫特罗 (Formoterol)

1. 其他名称 安通克、安咳通、奥克斯都保、福莫待若。

2. 药理作用 本品结构类似延胡索素,为长效选择性肾上腺素 β_2 受体激动药,具有强力而持续的支气管扩张作用,且呈剂量依赖关系。能使第 1 秒用力呼气量 (FEV_1)、用力肺活量 (FVC) 和呼气峰流速 (PER) 增加。并在吸入数分钟后可扩张支气管,减少气道阻力,此作用明显比同等剂量的沙丁胺醇和特布他林强。本品还有抗过敏及抑制毛细血管通透性作用,能抑制肺肥大细胞释放组胺,其作用与组胺 H_1 受体拮抗药、肥大细胞稳定药酮替芬类似。

3. 适应证 用于缓解支气管哮喘、急性支气管炎、喘息性支气管炎或肺气肿等气道阻塞性疾病所引起的呼吸困难。尤其适用于需要长期服用肾上腺素 β_2 受体激动药的患者和夜间发作的哮喘患者。

4. 用法用量

(1) 成人

1) 吸入给药: 吸入给药剂量应个体化,常规剂量为一次 $4.5 \sim 9\mu\text{g}$,一日 1~2 次。严重患者,一次 $9 \sim 18\mu\text{g}$,一日 1~2 次。早晨或(和)晚间给药,哮喘夜间发作可于晚间给药 1 次。一日最大剂量为 $36\mu\text{g}$ 。

2) 口服给药: 一次 $40 \sim 80\mu\text{g}$,一日 2 次。也可根据年龄、症状的不同适当增减。

(2) 老年人: 高龄患者通常伴有生理功能性低下,应适当减量。

(3) 儿童: 口服给药,一日 $4\mu\text{g}/\text{kg}$,分 2~3 次口服。

5. 不良反应

(1) 心血管系统: 常见心悸,偶见心动过速、室性期前收缩、面部潮红、胸部压迫

感等。

(2) 神经系统：常见头痛，偶见震颤、兴奋、发热、嗜睡、盗汗等，罕见耳鸣、麻木感、不安、头昏、眩晕等。

(3) 消化系统：偶见恶心、呕吐、暖气、腹痛、胃酸过多等。

(4) 肌肉骨骼系统：常见震颤，偶见肌肉痉挛。

(5) 呼吸道：罕见支气管痉挛。

(6) 过敏反应：偶见瘙痒，罕见皮疹，出现时应停药。

(7) 其他：偶见口渴、疲劳、倦怠感等，罕见低钾（或高钾）血症。

6. 禁忌

(1) 对本品过敏者。

(2) 对吸入乳糖过敏者禁用本品干粉吸入剂。

7. 注意事项

(1) 本品不宜用于治疗急性支气管痉挛。

(2) 正确使用本品无效时应停药。

(3) 以下情况应慎用：①肝功能不全者。②肾功能不全者。③低钾血症患者。④糖尿病患者。⑤嗜铬细胞瘤患者。⑥甲状腺功能亢进症患者。⑦肥厚性梗阻性心脏病、特发性主动脉瓣狭窄、高血压、颈内动脉-后交通动脉动脉瘤或其他严重心血管疾病（如心肌缺血、心动过速、严重心衰、QT 间期延长等）患者。

(4) FDA 对本药的妊娠安全性分级为 C 级。

8. 药物相互作用

(1) 与皮质类固醇类药、利尿药合用可能因低钾血症而导致心律不齐，应监测血钾值。

(2) 与肾上腺素及异丙肾上腺素等儿茶酚胺类药物合用时，容易引起心律不齐，甚至可能导致心脏停搏，应通过减量等方法慎重给药。

(3) 可增强由泮库溴铵、维库溴铵产生的神经肌肉阻滞作用。

(4) 与黄嘌呤衍生物（茶碱、氨茶碱等）合用，可能因低钾血症而导致心律不齐，应监测血钾值。

(5) 与单胺氧化酶抑制药合用，可增加出现室性心律失常、轻度躁动的危险，并可加重高血压反应。

(6) 与洋地黄类药物合用可增加后者诱导的心律失常的易感性，合用应谨慎。

(7) 与呋喃唑酮、甲基苯胍合用可加重高血压反应。

(8) 与抗组胺药（特非那定）、三环类抗抑郁药合用可延长 QT 间期，增加出现室性心律失常的危险。

(9) 与左旋多巴、甲状腺素、缩宫素合用，可降低心脏对 β_2 拟交感神经药物的耐受性。

(10) 乙醇可降低心脏对 β_2 拟交感神经药物的耐受性。

9. 规格 干粉吸入剂：1g：10mg（4.5 μ g $\times$ 60 吸）；1g：20mg（9.0 μ g $\times$ 60 吸）。片剂：20 μ g；40 μ g。干糖浆：500mg：20 μ g；500mg：40 μ g。

七、妥洛特罗 (Tulobuterol)

1. 其他名称 喘舒、阿米迪、丁氯喘、氯丁喘胺、叔丁氯喘通、妥布特罗、息克平。

2. 药理作用 本品为选择性肾上腺素 β_2 受体激动剂, 对支气管平滑肌具有较强而持久的扩张作用。对心脏兴奋作用较弱。离体动物实验表明, 其松弛气管平滑肌作用是氯丙那林的 2~10 倍, 作用维持时间较异丙肾上腺素长 10 倍多, 而对心脏的兴奋作用是异丙肾上腺素的 1/1 000。临床试验表明, 本品除有明显平喘作用外, 还有一定的止咳、祛痰作用。

3. 适应证 主要用于防治支气管哮喘及喘息型支气管炎等。

4. 用法用量 成人口服给药, 一次 0.5~2mg, 一日 3 次。

5. 不良反应

(1) 偶有心悸、手指震颤、心动过速、头晕、恶心、胃部不适等反应, 一般停药后即可消失。

(2) 偶有过敏反应, 表现为皮疹, 发现后须立即停药。

6. 禁忌 对本品过敏者禁用。

7. 注意事项 以下情况应慎用: ①肝功能不全者。②肾功能不全者。③甲状腺功能亢进者。④心血管疾病如高血压、心律失常、冠状动脉病变及特发性肥厚性主动脉瓣狭窄患者。⑤糖尿病患者。⑥使用洋地黄者。⑦低钾血症患者。⑧嗜铬细胞瘤患者。⑨孕妇。

8. 药物相互作用

(1) 与肾上腺素、异丙肾上腺素合用, 可加强本品心脏兴奋作用, 易致心律失常, 故应避免合用。

(2) 与单胺氧化酶抑制药合用, 可出现心动过速、躁狂等不良反应, 应避免同用。

9. 规格 片剂: 0.5mg; 1mg。

八、甲氧那明 (Methoxyphenamine)

1. 其他名称 克之、阿斯美、奥索克新、喘咳宁、甲氧苯丙胺、甲氧非那明、哮喘宁。

2. 药理作用 本品为肾上腺素 β 受体激动药, 作用类似于麻黄碱, 主要激动肾上腺素 β 受体, 对肾上腺素 α 受体作用极弱, 能舒张支气管平滑肌, 平喘作用较麻黄碱强, 对心血管系统和中枢神经系统的影响较弱。此外尚具有轻度抗组胺、镇静和抑制咳嗽中枢的作用。

3. 适应证

(1) 用于咳嗽以及支气管哮喘, 适于不能耐受麻黄碱者。

(2) 用于过敏性鼻炎和荨麻疹。

4. 用法用量

(1) 成人: ①口服给药: 一次 50~100mg, 一日 3 次。②肌肉注射: 一次 20~40mg。③灌肠给药: 一次 20mg。

(2) 儿童: ①口服给药: 5 岁以上儿童, 一次 25~50mg, 一日 3 次。②灌肠给药: 一次 5~10mg。

5. 不良反应 偶有口干、恶心、眩晕、头痛、失眠、心悸等。

6. 禁忌 尚不明确。

7. 注意事项 甲状腺功能亢进、糖尿病、高血压、冠心病患者慎用。

8. 药物相互作用

(1) 本品与可待因、茶碱、水合氯醛等药物合用，有协同作用，可增强疗效。

(2) 本品与单胺氧化酶抑制药合用，可引起血压过度升高，甚至产生高血压危象，应禁止合用。

9. 规格 片剂：50mg。注射液：2ml：40mg。

九、氯丙那林 (Clorprenaline)

1. 其他名称 喘通、氯喘、氯喘通。

2. 药理作用 本品为肾上腺素 β_2 受体激动剂，对支气管有明显的扩张作用，平喘效果比异丙肾上腺素略弱，但对心脏毒性明显降低，对心脏的兴奋作用仅为异丙肾上腺素的 $1/10 \sim 1/3$ 。

3. 适应证 用于缓解支气管哮喘、喘息型支气管炎、慢性支气管炎合并肺气肿患者的支气管痉挛，起到平喘并改善肺功能的作用。

4. 用法用量 成人常规剂量：①口服给药：一次 $5 \sim 10\text{mg}$ ，一日 3 次。预防哮喘夜间发作可于睡前加服 $5 \sim 10\text{mg}$ 。②气雾吸入：一次 $6 \sim 10\text{mg}$ 。

5. 不良反应 少数患者可见口干、轻度心悸、手指震颤、头晕等。

6. 禁忌 对本品过敏者。

7. 注意事项

(1) 用药初期 $1 \sim 3$ 日，个别患者可见心悸、手指震颤、头痛及胃肠道反应，继续服药，多能自行消失。

(2) 避免与单胺氧化酶抑制剂及三环类抗抑郁药同时应用。

(3) 本品有抑制过敏引起的皮肤反应作用，故评估皮肤试验反应时，应考虑到本药对反应的影响。

(4) 以下情况应慎用：①心律失常者。②高血压患者。③甲状腺功能亢进者。④心、肾功能不全者。⑤老年患者。

8. 药物相互作用

(1) 本品与肾上腺素及异丙肾上腺素等儿茶酚胺类并用时会引起心律失常、心率增加，故应避免与上述药物并用。

(2) 并用茶碱类药时，可增加舒张支气管平滑肌作用，但不良反应也增加。

9. 规格 片剂：5mg。气雾剂：2%。

(袁冬冬)

第二节 M 胆碱受体拮抗剂

【异丙托溴铵】(Ipratropium Bromide)

1. 其他名称 异丙阿托品、爱喘乐定量喷雾剂、溴化异丙托品、异丙托品、爱喘乐。

2. 药理作用 本品为抗胆碱类药，具有较强的支气管平滑肌松弛作用，对慢性阻塞性肺疾病有平喘作用，其作用较明显，起效快，持续时间较长。本品还具有控制黏液腺体的分泌及改善纤毛运动的作用，从而减少痰液阻塞以改善通气，同时痰液的减少也减轻对支气管

的刺激所引起的支气管痉挛。与肾上腺素 β 受体兴奋剂（如异丙基肾上腺素）相比，本品对心血管的副作用小，与 β_2 受体兴奋剂（如舒喘灵）相比，本品对痰量的调节作用较强。

3. 适应证

（1）用于缓解慢性阻塞性肺疾病（如慢性支气管炎、肺气肿等）引起的支气管痉挛、喘息症状，并可作为维持用药。

（2）用于防治支气管哮喘，尤其适用于因不能耐受肾上腺素 β 受体激动药所致肌肉震颤、心动过速的患者。

4. 用法用量

（1）成人

1) 气雾吸入：①一般用法：一次 $40\mu\text{g}$ ，一日 3~4 次，或每隔 4~6 小时 1 次。②严重发作：一次 $40\sim 60\mu\text{g}$ ，每 2 小时可重复 1 次。

2) 雾化吸入：一次 $100\sim 500\mu\text{g}$ ，用生理盐水稀释至 $3\sim 4\text{ml}$ ，置雾化器中吸入，至症状缓解，剩余的药液应废弃。

（2）儿童

1) 气雾吸入：14 岁以上儿童同成人。

2) 雾化吸入：应用本品溶液剂。14 岁以下者：一次 $50\sim 250\mu\text{g}$ ，用生理盐水稀释至 $3\sim 4\text{ml}$ ，置雾化器中吸入，一般一日 3~4 次，必要时每隔 2 小时重复 1 次。14 岁以上者：同成人。

5. 不良反应

（1）心血管系统：少见心动过速、心悸。

（2）中枢神经系统：常见头痛，可有头晕、神经质。

（3）呼吸系统：可见咳嗽、局部刺激，极少见支气管痉挛。

（4）肌肉骨骼系统：可有震颤。

（5）泌尿生殖系统：少见尿潴留（已有尿道梗阻的患者发生率增加）。

（6）胃肠道：常见口干，可有恶心、呕吐，少见口苦、胃肠动力障碍（尤其对于纤维囊泡症的患者，停药后可恢复正常）。

（7）眼：可有视物模糊，少见眼部调节障碍。

（8）过敏反应：极少见过敏反应，表现为恶心、头晕、皮疹、荨麻疹、皮肤或黏膜肿胀、喉痉挛、血压下降、舌唇和面部神经血管性水肿及过敏症等，大多数患者对其他药物或食物尤其是大豆有既往过敏史。

6. 禁忌

（1）对本品及阿托品和其衍生物过敏者。

（2）幽门梗阻者。

7. 注意事项

（1）本品雾化溶液不能与含有防腐剂苯扎氯铵的色苷酸钠雾化吸入液在同一个雾化器中使用，可以与祛痰药盐酸氨溴索雾化吸入液、盐酸溴己新雾化吸入液和非诺特罗雾化吸入液共同使用。

（2）有青光眼易患性的患者应用本品时应使用眼罩保护眼睛。与眼结膜充血和角膜水肿相关的眼痛或不适、视物模糊、虹视或有色成像等可能是急性闭角型青光眼的征象，若上

述症状加重,需用缩瞳药。

(3) 气雾剂含有大豆卵磷脂,故对上述物质过敏者不能使用本品气雾剂。

(4) 本品误入眼内时,会出现瞳孔散大和轻度、可逆的视力调节紊乱,一旦出现此症状以及其他严重的眼部并发症发生,可予以缩瞳治疗。

(5) 以下情况应慎用:①闭角型青光眼患者。②前列腺增生者。③膀胱颈梗阻者。

(6) FDA 对本药的妊娠安全性分级为 B 级。

8. 药物相互作用

(1) 本品与非诺特罗、色甘酸钠、茶碱、沙丁胺醇等合用,可相互增强疗效。

(2) 金刚烷胺、吩噻类抗精神病药、三环类抗抑郁药、单胺氧化酶抑制药以及某些抗组胺药可增强本品的作用。

(3) 肾上腺素 β 受体激动药或黄嘌呤制剂可增强本品的支气管扩张作用。有闭角型青光眼病史的患者合用本品与 β 受体激动药时,可增加急性青光眼发作的危险。

(4) 本品与其他治疗慢性阻塞性肺疾病的常用药物包括拟交感神经性支气管扩张药、甲基黄嘌呤、类固醇、色甘酸钠等合用,药物间无不良相互作用。

9. 规格 气雾剂:10ml ($20\mu\text{g} \times 200$ 喷)。雾化溶液剂:2ml:0.5mg;2ml:0.5mg;20ml:5mg (0.025%)。

(袁冬冬)

第三节 磷酸二酯酶抑制剂

一、氨茶碱 (Aminophylline)

1. 其他名称 胺非林、茶碱乙二胺盐、茶碱乙烯双胺、乙二氨茶碱、乙二胺茶碱。

2. 药理作用 为茶碱与二乙胺的复盐,其药理作用主要来自茶碱,乙二胺使其水溶性增强。①松弛支气管平滑肌,也能松弛肠道、胆道等多种平滑肌,对支气管黏膜的充血、水肿有缓解作用。②增加心排出量,扩张输出和输入肾小动脉,增加肾小球滤过率和肾血流量,抑制远端肾小管重吸收钠和氯离子。③增加离体骨骼肌的收缩力;在慢性阻塞性肺疾病情况下,改善肌收缩力。

3. 适应证

(1) 用于支气管哮喘、慢性喘息型支气管炎、慢性阻塞性肺气肿等缓解喘息症状。

(2) 用于心源性哮喘。

4. 用法用量

(1) 成人

1) 口服给药:一次 100~200mg,一日 300~600mg;极量为一次 500mg,一日 1g。

2) 肌肉注射:一次 250~500mg;极量为一次 500mg,一日 1g。

3) 静脉注射:一次 125~250mg,一日 500~1 000mg,每 125~250mg 用 50% 葡萄糖注射液稀释至 20~40ml,注射时间不得少于 10 分钟;极量为一次 500mg,一日 1g。

4) 静脉滴注:一次 250~500mg,一日 500~1 000mg,用 5% 或 10% 葡萄糖注射液稀释后缓慢滴注;极量为一次 500mg,一日 1g。

5) 直肠给药: 一次 250 ~ 500mg, 一日 1 ~ 2 次。宜于睡前或便后使用。

(2) 老年人: 55 岁以上者应酌情减量。

(3) 儿童

1) 口服给药: 一次 3 ~ 5mg/kg, 一日 3 次。

2) 静脉注射: 一次 2 ~ 4mg/kg, 用 5% 或 25% 葡萄糖注射液稀释后缓慢注射。

3) 静脉滴注: ①一般用量: 一次 2 ~ 3mg/kg, 用 5% 葡萄糖注射液 500ml 稀释后滴注。

②新生儿呼吸暂停: 负荷量为 4 ~ 6mg/kg, 12 小时后给予维持量, 一次 1.5 ~ 2mg/kg, 一日 2 ~ 3 次。

5. 不良反应

(1) 常见恶心、呕吐、胃部不适、食欲减退等。也可见头痛、烦躁、易激动、失眠等。

(2) 少数患者可出现过敏反应, 表现为接触性皮炎、湿疹或脱皮。少数患者由于胃肠道刺激, 可见血性呕吐物或柏油样便。

(3) 可导致心律失常和(或)使原有心律失常加重。

(4) 肌肉注射可引起局部红肿、疼痛。

6. 禁忌 对本品过敏的患者、活动性消化性溃疡患者和未经控制的惊厥性疾病患者禁用。

7. 注意事项

(1) 本品严禁与下列药物配伍静脉使用: 葡萄糖酸钙、异戊巴比妥钠、维生素 B₆、氨苄西林、泛酸钙、盐酸氯酯醑、琥珀酸钠、氯霉素、庆大霉素、溴化钙、盐酸氯丙嗪、头孢噻吩、青霉素、苯巴比妥钠、毒毛花苷 K、四环素及其盐酸盐、肾上腺素、去甲肾上腺素、促皮质激素、毛花苷 C、万古霉素、水解蛋白、盐酸羟嗪、维生素 C、酒石酸吉他霉素、酚磺乙胺。

(2) 本品的有效血药浓度范围窄, 个体差异大, 应根据血药浓度调整剂量或延长用药间隔时间。长期使用本品者的用量常须大于一般患者用量。具体用量应根据标准体重计算, 因茶碱不分布于体内脂肪组织, 理论上给予茶碱 0.5mg/kg, 即可使茶碱血药浓度升高 1μg/ml。用于慢性病的治疗, 测定用药 3 日的血茶碱浓度以 10 ~ 20μg/ml 为宜。

(3) 使用影响茶碱代谢的药或茶碱清除率降低者用药时应谨慎。长期高热可使茶碱排出减少减慢。

(4) 不同制剂给药时注意: ①肠溶片: 吸收延缓, 生物利用度极不规则, 不宜使用。②栓剂: 经直肠给药后, 吸收缓慢, 生物利用度尚不确定, 且可引起局部刺激, 故仅偶用于短期非急症的治疗。给药后 6 ~ 8 小时内应避免再次使用。如给药后 12 小时内再口服或注射本品, 须注意观察患者的反应, 因栓剂经直肠给药后吸收速度的快慢不一致。

(5) 不同给药途径时注意: ①口服给药: 空腹时(餐前半小时至 1 小时, 或餐后 2 小时)服药, 吸收较快; 如在进餐时或餐后服用, 可减少对胃肠道的刺激, 但吸收较慢。②保留灌肠: 吸收迅速, 生物利用度确定, 但可引起局部刺激。多次给药可致药物在体内蓄积, 从而引起毒性反应, 尤其是婴幼儿和老年人。③肌肉注射: 因可刺激局部引起疼痛, 目前已少用。必须肌肉注射时, 须与 2% 盐酸普鲁卡因合用。④静脉注射: 需稀释至浓度低于 25mg/ml。注射速度一般以不高于 10mg/min 为宜, 或再次稀释后改用静脉滴注。

(6) 使用常规剂量时, 如发生急性不良反应, 应立即停止给药 5 ~ 10 分钟或减慢给药

速度。

(7) FDA 对本药的妊娠安全性分级为 C 级。

8. 药物相互作用

(1) 与其他茶碱类药或其他黄嘌呤类药合用，可使本品作用增强，不良反应增多。

(2) 与美西律合用，可使茶碱清除率减低，血药浓度升高，需调整剂量。

(3) 与地尔硫草、维拉帕米合用，可干扰茶碱在肝内的代谢，使本品血药浓度升高，毒性增强。

(4) 与某些抗菌药（大环内酯类的红霉素、罗红霉素、克拉霉素；喹诺酮类的依诺沙星、环丙沙星、氧氟沙星、左氧氟沙星；克林霉素、林可霉素等）合用，可使茶碱清除率降低，血药浓度升高，甚至出现毒性反应，其中尤以与红霉素、依诺沙星合用作用更显著。故与以上药物合用时，本品应适当减量或监测其血药浓度。

(5) 与西咪替丁合用，可使本品在肝脏的清除率降低，血药浓度升高，甚至出现毒性反应。

(6) 与别嘌呤合用，可使本品血药浓度升高，并引起恶心、呕吐、心悸等不良反应。

(7) 普罗帕酮对本品代谢有竞争性抑制作用，可使茶碱血药浓度升高，甚至引起中毒，必要时适当调整本品用量。

(8) 妥卡尼对本品代谢有轻度抑制作用，可使其清除率降低，半衰期延长。

(9) 与咖啡因合用，可使本品的半衰期延长，其作用与毒性增强。

(10) 与大蒜新素合用，可使茶碱代谢减慢，半衰期延长，合用时本品应减量。

(11) 与口服避孕药合用，可使本品血浆清除率降低。

(12) 与麻黄碱及其他拟交感胺类支气管扩张药合用，具有协同作用，但毒性也增加。

(13) 与普萘洛尔等非选择性肾上腺素 β 受体阻断药合用，药理作用相互拮抗，本品的支气管扩张作用可能受到抑制，同时可使本品清除率降低，血药浓度升高。

(14) 本品可提高心肌对洋地黄类药物的敏感性，合用时洋地黄毒性增强。

(15) 与氟烷合用，易导致心律失常。

(16) 硫酸镁可拮抗本品所致的室性心律失常。

(17) 与碱性药物合用，可使本品排泄减少。

(18) 与酸性药物合用，可使本品排泄增加。

(19) 与稀盐酸合用，可使本品在小肠的吸收减少。

(20) 活性炭可吸附肠道内的本品及其代谢物，从而使茶碱血药浓度降低。

(21) 与泼尼松合用，可使本品的生物利用度降低。

(22) 与巴比妥类、利福平、卡马西平及其他肝微粒体酶诱导药合用，可使茶碱的代谢和清除加速，血药浓度降低。

(23) 与异丙肾上腺素、异烟肼、呋塞米合用，可使本品的血药浓度降低。

(24) 与苯妥英钠合用，可使本品代谢加速，两者血药浓度均降低，合用时本品用量应酌情增加，并监测血药浓度。

(25) 与锂盐合用时，可加速肾脏对锂的排出，使锂剂疗效降低。

(26) 本品可使青霉素灭活、失效。

(27) 与氯胺酮合用，可降低机体的惊厥阈值，从而促发惊厥。