

研究計畫編號：DOH97-NNB-1034

科資中心編號：PG9701-0175

行政院衛生署管制藥品管理局

九十七年度委託科技研究計畫

管制藥品第三、四級品項藥物之毒性研究資料彙整

研究報告

執行機構：臺北醫學大學

計畫主持人：許秀蘊

研究人員：謝采蓓、陳婕妤、陳祐悌

執行期間：自 97 年 1 月 1 日至 97 年 12 月 31 日止

*本研究報告僅供參考，不代表本局意見

目 錄

頁碼

目 錄	2
中文摘要	3
Abstract	5
壹、前言	7
貳、材料與方法.....	12
參、結果	16
肆、討論	442
伍、結論與建議.....	478
陸、參考文獻	480

中文摘要

關鍵字：第三級管制藥品、第四級管制藥品、毒性分析、多重濫用、成癮治療

由行政院衛生署藥物濫用案件與統計資料可發現，藥物的濫用有逐年增加的趨勢，尤其是管制藥品、毒品的濫用。本研究計畫主要以收集國內外相關調查研究文獻、資料庫、國內外網站、學術資料書籍等相關內容，分別進行屬於第三、四級管制藥品的藥物資料庫之建置。包括其物理、化學性質、藥理作用及機轉、藥物動力學之探索、用途用法及副作用、檢測分析方法、多重濫用評估、危害評估、醫療政策之因應等資料之分析整合，有助於研制或訂定管制藥品毒性分析評估的可行性指標及毒性檢測方法，成癮治療之方法與成效等，以充實國內資料彙整之完整性及建構更完整之政策與對策。

本研究計畫主要以下列三個部份的資料庫，分別進行屬於第三、四級管制藥品的藥物資料之分析整合。

- 一、 由各國藥典如中華藥典、USP，及各國藥品集，如 PDR 等之藥物資料，建立屬於第三、四級管制藥品之藥物基本資料。
- 二、 由國內外期刊文獻收集屬於第三、四級管制藥品之藥物作用機轉、醫療用途、臨床使用方式、副作用、毒物分析檢驗方法等。
- 三、 由國內各大醫院與國內外藥品相關網站，收集在各國之第三、四級管制藥品之藥物濫用狀況、危害性評估等資料。

Abstract

keyword : The third and fourth grade controlled drug · Toxicity · Drug abuse

Drug abuse causes several serious problems worldwide and has become more serious in recent years. It could be found by drug abuse case and statistical data of National Health Administration of executive organ that the drug abuse of Taiwan has the tendency to increase year by year. In recent years, the first and second grade controlled drugs like amphetamine; methamphetamine, heroin, 3, 4-methylenedioxymethamphetamine (MDMA) and cannabis, etc. were ferreted out and found in tested samples. In addition, the drug abuse case of ketamine, a third grade controlled drug, also becomes serious. The evidences suggest that polydrug use is an important public health issue and forms significant adverse health outcomes, such as overdose and drug-drug interaction. After Taiwan established the National Health Insurance (NHI) to provide universal coverage to its residents and insure a comprehensive set of health benefits, the proportion of the patients with insomnia or psychiatric symptom is increasing and the third or fourth grade controlled drugs are often used to treat these disease. Although these drugs have less addiction and abuse, they have different drug-drug interactions like inhibition, accumulation or synergism that cause severe adverse drug events.

In this study, we investigated relevant references such as pharmacopeia (Chinese Pharmacopeia and The United States Pharmacopeia etc.), Physicians' Desk Reference (PDR), domestic and international website and database (Merck Index and Micromedex website etc.), and academic materials books in order to construct of the third and fourth grade controlled drug database. Our collected data are including drugs physics, chemical property, pharmacology; pharmacokinetics and the toxic-assessment of misuse multiple drugs that could

helpfully lead to design the feasible toxicity assay, analyzing indicator and treatment of controlled drugs. This database enrich the domestic control drugs information that may propose practical, feasible, and substantial suggestions in the construction more complete medical service policy.

壹、前言

藥物濫用已成為世界性的問題，也造成臺灣地區嚴重的社會問題。由行政院衛生署藥物濫用案件暨檢驗統計資料，可發現藥物的濫用有逐年增加的趨勢，尤其是管制藥品、毒品的濫用，甚至是多重濫用。國內管制藥品分級原則依民國 88 年 8 月 18 日行政院衛生署管制藥品審議委員會第二次會議，管制藥品限供醫藥及科學上之需要，依其習慣性、依賴性、濫用性及社會危害性之程度分為四級管理。其管制藥品分級之第三級原則為：

- (一) 藥物或其他物質，其濫用可能性較第一級及第二級為低者。
- (二) 國內核准使用於醫療用途之藥品、物質。
- (三) 濫用可能導致中度至輕度心理或生理依賴。(如 Flunitrazepam、ketamine、buprenorphine、pentobarbital 等)

管制藥品分級之第四級原則為：

- (一) 藥物或其他物質，其濫用可能性較第三級為低者。
- (二) 國內核准使用於醫療用途之藥品、物質或先驅化學品或有加強管理必要之藥品(如 methylephedrine、pseudoephedrine 等)。
- (三) 濫用產生之心理或生理依賴性較第三級低者。

依照最新公布的行政院九十六年二月十六日院臺衛字第 0960004264 號公告「管制藥品分級及品項範圍」內所收載之第三級、第四級管制藥品，三級管制藥品中，早期的巴比妥鹽 (Barbiturate) 原為治療焦慮、失眠之助眠劑，如 Secobarbital (俗稱「紅中」) 和 Amobarbital (俗稱「青發」) 會使身體產生放鬆安寧甚至歡愉的感覺，為青少年濫用的藥物，然而此類化合物有強烈的呼吸抑制作用、安全性較低、易產生生理依賴性，現已較少使用於臨床或單獨被查獲。近年來，取而代之的，尤以 Amphetamine (安非他命) 及其衍生物 (如甲基安非他命) 為甚，因其濫用性大增，隨著管制藥品分級及品項範圍不斷的修正，安非他命單及其衍生物被歸類而第二級管制藥品。近兩年列為第三級管制藥品 FM2 (Flunitrazepam) 由於無色、無味，服用後短時間內不易清醒，具有暫時性記憶喪失的功能，易成為侵犯的工具；K 他命 (Ketamine) 更取代安非他命的地位，為單獨驗出及查獲的最大宗。長期使用三、四級管制藥品其成癮性還有對於身心的傷害不亞於其他管制藥品，而新型的藥品毒品與日遽增，多重濫用更劇，已經非侷限於單一管制藥品使用。根據行政院衛生署藥物濫用案件資料顯示，國人常見藥物多重濫用為嗎啡 (Morphine)、可待因 (Codeine)、安非他命及甲基安非他命 ((Meth)Amphetamine) 等第一、二級管制藥品合併使用，而近年也驗出併用 K 他命，因此，可以預見的藥物濫用會延續到第三、四級管制藥品，

更嚴謹的三、四級管制藥品毒性與治療的評估則需收集更完整且全面之資料。如 Starcevic[1]等人所述，Diazepam 會抑制存在於心肌中的 cyclic nucleotide phosphodiesterase，同時又會加強 noradrenaline 及 adrenaline 的作用導致增加心肌收縮力，所以如果 diazepam 與 amphetamine 多重中毒，則其對心臟及冠狀動脈之傷害勢必更嚴重。Ketamine 除了在孕婦使用上的安全性尚未被完全建立之外，與 Tramadol 併用會增加呼吸抑制之風險且中樞神經系統被過度抑制[2]。因此除了成癮性和依賴性之外，不同藥品的代謝路徑和在身體的蓄積程度不同且藥物交互作用複雜，一旦有不慎使用，會對生理及精神創傷導致造成難以彌補的社會問題及家庭傷害。

除此之外，隨著全民健保的施行，一般民眾藥品濫用的問題也成為值得關注的一環，但這些卻往往成為被忽略掉但卻很重要的一群。有輕微精神官能症造成失眠或焦慮的民眾，常不願意面對自己有精神官能相關的問題，而請一般科目的醫生開立處方，甚至重複看診領藥，造成國內安眠類鎮定劑有使用浮濫的現象，而這些藥物大多是列管於第三、四級管制藥品。在民眾不瞭解藥物毒性及多重就診的情況下，造成藥品種類越用越多劑量越用越高，成效反而遞減，若貿然停藥甚至有禁斷現象的產生，最後只好求助精神科醫師，但此時常常已有藥品毒性產生的情形。然而因不同的代謝路徑造成肝臟或腎臟的損害，或併用其他的藥品產生交互作用影響到疾

病的治療。如 Benzodiazepines 類藥物經由肝臟 cytochrome p450 3A enzymes 代謝，而常用的azole類抑制黴菌藥物，如 Ketoconazole，會抑制 cytochrome p450 3A 的代謝造成體內的 benzodiazepine 類藥物濃度提高[3,4]。此外 Iqbal 提及因 benzodiazepine 類藥物有致畸胎性且部分能透過胎盤及乳汁分泌，所以必須建立此類藥品對孕婦及哺乳之母親之安全數據，尤其是長效作用的藥品如 diazepam 等[5]。Ketamine 帶來醫療上多方面之用途，不同劑量於臨床上常被用於短時間的手術需要直接麻醉使用或與當作其他麻醉劑使用的誘導麻醉劑，因為年齡性別的不同所需要的劑量與使用路徑則需注意，以減少恢復期間可能發生術後的混淆狀態（ Postoperative Confusional States ）[6]。然而不當使用造成依賴、成癮、加成、戒斷症狀等是毒品難以自拔之處，我們如何在成癮治療方面有所突破，建立輔導政策及社會關懷支持[7]，對健保制度可能造成之衝擊與影響，均需收集完整全面之資料，以為政策制訂之依據參考。

因此對於不同管制藥品資料之分析整合，有助於研議或制定管制藥品毒性分析評估的可行性指標及毒性檢測方法，成癮治療之方法與成效等，本研究收集與第三、四級管制藥品及藥物濫用相關的所有文獻書籍、期刊、網路藥品相關資料庫、法規等資料，將各品項依其藥品化學結構分類、彙整藥理特性、藥物動力學及臨床使用情形、毒性分析及檢測方法與各種濫

用藥物品項之相關研究文獻，加以整合成資料庫，以期以充實國內資料彙整之完整性及建構更完善之政策與對策。

貳、材料與方法

實施方法：

本研究計畫主要以下列三個部份的資料庫，分別進行屬於第三、四級管制藥品的藥物資料之分析整合。

由各國藥典如中華藥典、USP，及各國藥品集如 PDR 等之藥物資料，建立屬於第三、四級管制藥品之藥物基本資料。

由國內外期刊文獻收集屬於第三、四級管制藥品之藥物作用機轉、醫療用途、臨床使用方式、副作用、毒物分析檢驗方法等。

由國內各大醫院與國內外藥品相關網站收集在各國之第三、四級管制藥品之藥物濫用狀況、危害性評估等資料。

研究方法評估參數：當在彙整研究方法時，將從法規需求（特異性、線性、範圍、準確性、精確性、重覆性、再現性、最小檢測值、最低定量值等）、整合及持續性評估、整體計畫及評估設計、統計試驗等，依法公訂書之陳述方式，品名、化學名、結構式、物性、解離常數、層析方法、定量、代謝（therapeutic concentration、half-life、volume of distribution、clearance、distribution in blood、protein binding、dose）等參數，才能夠定質和定量敘述作科學性的具體呈現。

進行步驟：

按下列項目步驟分別建立第三、四級管制藥品的藥物資料庫。

名稱，包括 1.中文 2.英文 3.俗稱 4.CAS 編號。

製劑：劑型、劑量、廠商、照片。

化學性狀：1.外觀及性狀、2.結構式、3.分子式、4.分子量、5.熔點、6.結構圖。

藥理性質：1. 藥理類別、2.作用機轉、3.人體試驗、4.動物試驗。

藥動學特性：1.吸收、2.分佈、3.代謝（含半衰期）、4.排除、5.交互作用。

用途用法：1.醫療用途、2.施用方法。

危害及副作用：1. 中毒及致死量、2.副作用、3.成癮性(機制及強度評估)、4.依賴性、5.耐受性、6.戒斷症狀、7.其他危害。

檢驗方法：1.定性法、2.定量法、3.法醫學方法、4.尿檢方法。

各國管制狀況：1.本國、2.各國。

各國濫用現況：1.本國、2.各國。

多重濫用藥物併用(原因、交互作用，毒性及機轉)。

台灣和世界各國多重藥物濫用的研究：包括文獻回顧與資料收集。首先分析過去台灣多重藥物濫用的型態以及隨時間改變的趨勢，並藉由文獻的檢索來了解國內外並用多種濫用藥物的情形。

本研究主要參考資料來源為

1. 行政院衛生署 (2007) 藥物濫用案件計檢驗統計資料。
2. Merck (2007) Merck Index。
3. Micromedex (2007) USP NF。
4. Canadian Pharmacists Assoc (2004) Compendium of Pharmaceuticals and Specialties (CPS)。
5. BMJ (2001) BNF。
6. Thomson Healthcare (2007) Physicians' Desk Reference (PDR)。
7. FDA 網站 <http://www.fda.gov/default.htm>。
8. 行政院衛生署網站 <http://www.doh.gov.tw/>。
9. 管制藥品管理局網站 <http://www.nbcd.gov.tw/home/intro.aspx>。
10. 藥物食品檢驗局網站 <http://www.nlfd.gov.tw/>。
11. Micromedex 網站。
12. 法務部網站
13. United Nations Office on Drugs and Crime (UNDCP)(美國)
14. National institute on drug abuse (NIDA)(美國)
15. National drug & alcohol research centre (澳洲)
16. European monitoring centre for drugs and drug addiction (EMDCDDA)(歐洲)

- 17.厚生労働省醫藥食品局藥物亂用防止中心(The Drug Abuse Prevention Center, DAPC)(日本)
- 18.International narcotics control board(INCB)
- 19.National Mental Health Services Knowledge Network(KEN)
- 20.PubMed
- 21.Clarke's Isolation and Identification of Drugs
- 22.Disposition of Toxic Drugs and Chemicals in Man
- 23.Remington:The Science and Practice of Pharmacy
- 24.Martindale: The Complete Drug Reference
- 25.AHFS Drug Information
- 26.Drug Facts and Comparisons

參、結果

第三級管制藥品

第三級管制藥品 — 異戊巴比妥 (Amobarbital)

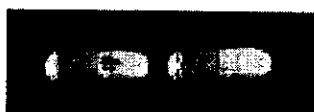
項次: 1

名稱:

1. 中文: 異戊巴比妥
2. 英文: Amobarbital
3. 俗稱: 青發
4. CAS 編號: 57-43-2

製劑:

1. 劑型: 注射劑型, 錠劑
2. 劑量: 錠劑 200 mg
3. 照片:



Trade Name: Amytal
Controlled Ingredient: amobarbital, 200 mg.

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀: 白色結晶性粉末, 無臭, 味苦。

溶解度: 極難溶於水, 易溶於乙醇、乙醚, 在氯仿、鹼金屬氫氧化

物及碳酸鹽溶液中溶解。pH 值:飽和溶液為約 5.6。[8]

2. 結構式:英文

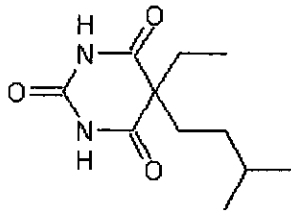
5-Ethyl-5-(3-methylbutyl)-2,4,6(1H,3H,5H)-pyrimidinetrione

3. 分子式: $C_{11}H_{18}N_2O_3$

4. 分子量: 226.27

5. 熔點: 為 156-161°C。

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為巴比妥類催眠藥、抗驚厥藥。中等作用時間（3~6 小時），對中樞的抑制作用隨著劑量加大，表現為鎮靜、催眠、抗驚厥及抗癲癇。大劑量對心血管系統、呼吸系統有明顯的抑制。過量可麻痹延髓呼吸中樞致死。體外電生理實驗本類藥物使神經細胞的氯離子通道開放，細胞過極化，擬似 γ -氨基丁酸(GABA)的作用。治療濃度的異戊巴比妥可降低谷氨酸的興奮作用、加強 γ -氨基丁酸的抑制作用，抑制中樞神經系統單突觸和多突觸傳遞，抑制癲灶的高頻放電及其向周圍擴散。可減少胃液分泌，降低胃張力。可產生依賴性，包括精神依賴和身體依賴。[9]

藥動學特性：

口服後在消化道吸收迅速，15~30 分鐘生效，約維持 3~6 小時。吸收後分佈於體內各組織及體液中，因本品脂溶性高，易通過血腦屏障，進入腦組織，起效比較快。本品血漿蛋白結合率約為 20~45%。T_{1/2} 約為 15~18 小時，血藥濃度達峰時間，個體差異大。本品在肝臟代謝，主要與葡萄糖醛酸結合後經腎臟排出，極少量 (<1%) 以原形從腎臟排出。[10]

用途用法：

深部肌肉（不能用於淺表）或靜脈注射。成人常用量：催眠，100~200 mg，晚上一次頓服；鎮靜，一次 30~50 mg，每日 2~3 次。極量一次 200 mg，一日 600 mg。小兒常用量：催眠，個體差異大；鎮靜，每次按體重 2 mg/Kg，或按體重表面積 60 mg/m²，每日 2~3 次。[11]

危害及副作用：

- 1、用於抗癲癇時最常見的不良反應為鎮靜，但隨著療程的持續，其鎮靜作用逐漸變得不明顯。
- 2、可能引起微妙的情感變化，出現認知和記憶的缺損。
- 3、長期用藥，偶見葉酸缺乏和低鈣血症。
- 4、罕見巨幼紅細胞性貧血和骨軟化。
- 5、大劑量時可產生眼球震顫、共濟失調和嚴重的呼吸抑制。

6、用本品的患者中約 1~3%的人出現皮膚反應，多見者為各種皮疹以及哮喘，嚴重者可出現剝脫性皮炎和多形紅斑（或 Stevens—Johnson 綜合症），中毒性表皮壞死極為罕見。

7、有報導用藥者出現肝炎和肝功能紊亂。

8、長時間使用可發生藥物依賴，停藥後易發生停藥綜合症。[11]

檢驗方法：

一、丙二醯脲類反應：藥典下銀鹽與銅鹽反應

1、與銀鹽反應：在碳酸鈉溶液中加入硝酸銀試液生成白色沉澱----溶解。

2、與銅鹽反應：在吡啶溶液中與銅吡啶試液作用，3、生成配位化合物，

4、顯紫色。硫噴妥顯綠色。

二、異戊巴比妥鈉的鑑別方法

(一)熔點測定法，鈉鹽的鑒別反應：

(二)本品 200 mg，加 1N 氫氧化鈉溶液煮沸，即放出氨臭。

三、含量測定

(一)、銀量法：異戊巴比妥及其鈉鹽

採用甲醇---3%無水碳酸鈉溶劑系統，用甲醇溶解，新鮮配製無水碳酸鈉，

照電位滴定法，用硝酸銀滴定。銀---玻璃電極 臨用硝酸浸洗 1-2 分。

(二)、紫外分光光度法：將本品溶於乙醇與鹼性硼酸緩衝液(pH9.6)之混液

(1→20)所成溶液(1→100,000)，按照紫外線吸光度測定法測定之，於波長239nm 附近呈最大吸收。

(三)、氣象層析法:

(四):紅外線光譜法: 本品吸收譜帶於 1725、1696、1758、1317、1240、850 cm-1 的位置。[12]

管制狀況：

本國：第三級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Adinazolam、Alfentanil、Alprazolam、Aprobarbital、Bromazepam、Brotizolam、Butabarbital、Butalbital、Calamus、Cannabis、Clobazam、Clonazepam、Clorazepate、Codeine、Diazepam、Estazolam、Ethchlorvynol、Fentanyl、Flunitrazepam、Flurazepam、Halazepam、Hydrocodone、Hydromorphone、Ketazolam、Levorphanol、Lorazepam、Lormetazepam、Medazepam、Meperidine、Mephenesin、Mephobarbital、Meprobamate、Metaxalone、Midazolam、Morphine、Nitrazepam、Nordazepam、Oxazepam、Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Prazepam、Secobarbital、Temazepam、Thiopental、Triazolam。本品與酒精併服時：過度中樞神經抑制作用，且作用快速。[13]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

15~20 倍的過量藥物可能引起昏迷、嚴重的呼吸和心血管抑制、低血壓和休克繼而引發腎功能衰竭、死亡。深度呼吸抑制是急性中毒的直接死亡原因。可致嚴重中毒，中毒致死的血藥濃度為 6~8 mg/100 ml。解救措施中最重要的是維持呼吸和迴圈功能，施行有效的人工呼吸，必要時行氣管切開，並輔之以有助於維持和改善呼吸和迴圈的相應藥物。經口服中毒者，在 3~5 小時內可用高錳酸鉀 (1:2000) 溶液洗胃。用 10~15 g 硫酸鈉溶液導泄 (禁用硫酸鎂)。為加速排泄可給甘露醇等滲透壓利尿藥，如腎功能正常可用速尿。可用碳酸氫鈉、乳酸鈉鹼化尿液加速排泄，嚴重者可透析。極度過量時，大腦一切電活動消失，腦電圖變為一條平線，並不一定代表為臨床死亡，若不併發缺氧性損害，尚有挽救的希望。[13]

成癮治療之方法與成效評估：

輕度中毒 頭痛、眩暈、乏力、語言不清、嗜睡、視物模糊、眼球震顫、瞳孔縮小 噁心、嘔吐，各種形態的皮疹，呼吸稍快，血壓正常或偏低，還可引起陰莖水腫。

重度中毒 開始病人可表現狂躁、驚厥、四肢強直；繼而進入抑制期，出現瞳孔散大 (對光反射存在)，全身弛緩，淺反射消失，脈搏細速，血壓下降，尿少或尿閉，中毒性肝炎等表現；最後可因呼吸抑制或因嘔吐物吸入而發

生窒息而死亡。

(一) 洗胃

(二) 促進毒物排泄

1、快速輸液 2、利尿脫水 3、導瀉 4、血液透析 5、鹼化尿液

(三) 中樞興奮劑的應用

僅適用於重度中毒者、呼吸高度抑制者及昏迷患者。[14][15]

第三級管制藥品 — 伯替唑他 (Brotizolam)

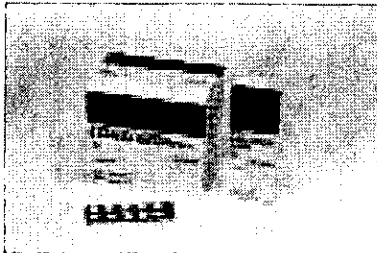
項次: 2

名稱:

1. 中文: 伯替唑他
2. 英文: **Brotizolam**
3. CAS 編號: 57801-81-7

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 0.25 mg
3. 照片:



化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀: 無色結晶

溶解度: 在室溫下 1.078 mg/L 水[16]

2. 結構式: 英文

2-Bromo-4-(2-chlorophenyl)-9-methyl-6H-thieno(3,2-f)(1,2,4)triazolo(4

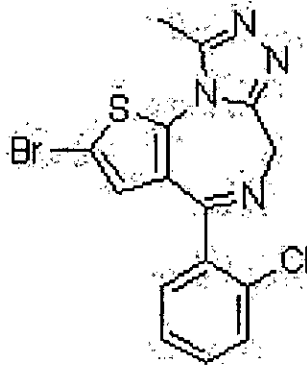
,3-a)(1,4)benzodiazepine

3. 分子式: $C_{15}H_{10}BrClN_4S$

4. 分子量: 393.7

5. 熔點: 212~214°C

6. 結構圖:



藥理性質：

苯二氮平類為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興

奮性遞質。苯二氮平類增加氯通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氯離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。[17]

藥動學特性：

口服後迅速被吸收。血漿蛋白結合率高，約為 89%~95%。t_{1/2} 為 3.6~7.9 小時。經肝臟代謝，大部分自腎臟排出。

服後在消化道吸收迅速，0.5~2 小時達峰濃度。吸收後分佈於體內各組織及體液中。本品血漿蛋白結合率約為 89%~95%。T_{1/2} 為 3.6~7.9 小時。

本品在肝臟代謝成 4-hydroxybrotizolam、1-methylhydroxybrotizolam 為非活性物，與葡萄糖醛酸及硫酸根結合後經腎臟排出，2%~3%以原形從腎臟排出。[16]

用途用法：

失眠症劑量為 0.25 mg，睡前服口服。老年人 0.125 mg。

術前催眠 0.5 mg。[17]

危害及副作用：

(1) 不良反應偶見胃腸道不適、頭痛、眩暈，高血壓患者血壓下降。大劑量用藥時（尤其對本品敏感的患者），可見次晨乏力、注意力不集中。

(2) 本品可能產生耐藥性或進展性健忘。

(3) 禁用於對苯二氮類過敏者，重症肌無力、精神病、急性閉角型青光眼、急性呼吸功能不全、肝功能不良等患者及妊娠、哺乳期婦女、18 歲以下青少年。

(4) 與中樞抑制藥、抗組胺藥、巴比妥類藥同服時，可增加本品作用。[18]

檢驗方法：

(一)、高效液相層析法：UV 偵測器於波長 254nm，C18 管柱，移動相為 acetonitrile:NH₄CO₃(0.01 mol/L):diethylamine(30:65:0.1)

(二)、氣相層析法

(三)、質譜分析：分裂於 m/z 394、245、316、210、291、176、365、313。

[19]

管制狀況：

本國：第三級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、

Butabarbital、Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、

Hydromorphone、Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、

Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、

Thiopental。增加本品的生體可用率及藥理作用：Ergotamine。本品與酒精

併服時：增加催眠、鎮靜效果，且作用快速。[20]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

每天 brotizolam 0.125 至 0.5 毫克，沒有證據顯示身體或心理的依賴或戒斷

症狀。但使用高於劑量由失眠症患，每晚 0.75 毫克會出與依賴和戒斷症狀

與反彈，突然停止 brotizolam 會導致失眠。症狀通常是最嚴重的就第一天停

止服藥夜間及減少其後。brotizolam 劑量應逐步盡量減少發生失眠反彈。

[21]

成癮治療之方法與成效評估：

催吐：吐根使用

活性炭吸收：使用最低 240 毫升的水百分之三十克活性炭。

洗胃

監測病人：監測生命體徵

減少呼吸功能：成人 Flumazenil- 0.2-3 mg。Flumazenil 拮抗中樞神經系統的

苯二氮類藥物作用，逆轉的苯二氮類的鎮靜作用。

血壓過低：0.9% NaCl 10-20 ml/kg 靜脈注射, dopamine, norepinephrine。[22]

第三級管制藥品 — 丁基原啡因 (Buprenorphine)

項次: 3

名稱:

1. 中文: 丁基原啡因
2. 英文: Buprenorphine
3. CAS 編號: 52485-79-7

製劑:

1. 劑型: 錠劑、注射劑
2. 劑量: 錠劑 0.2 毫克/錠

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀: 白或幾乎全白的結晶粉末。

溶解度: 非常微溶於水; 極溶於丙酮; 可溶於甲醇; 微溶於環己烷:

亦可溶於稀釋的酸溶液中。[23]

2. 結構式: 英文

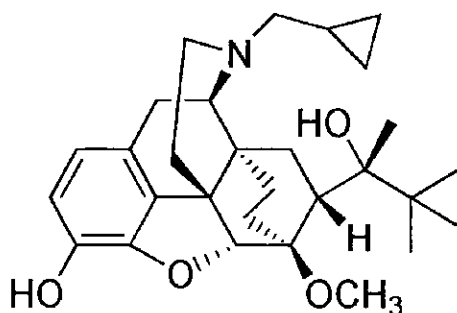
[5 α ,7 α (S)]-17(Cyclopropylmethyl)- α -(1,1-dimethylethyl)-4,5-epoxy-1,8,19-dihydro-3-hydroxy-6-methoxy- α -methyl-6,14-ethenomorphinan-7-methanol

3. 分子式: C₂₉H₄₁NO₄

4. 分子量: 467.65

5. 熔點: 為 209°C。

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為麻醉性止痛劑，用來治療中、重度疼痛。其作用強度為 morphine 的 30 倍，其拮抗作用相當於 Naloxone 的 3 倍。[24]

藥動學特性：

本品之血漿蛋白結合率約 96%，由肝臟 P450 酵素系統代謝，其活性代謝物為 norbuprenorphine。69%從糞便中排除，其中 33%是原型；另外有 30%從腎臟排除，其中 1%為原型。靜脈注射後其半衰期平均為 2.2 小時(1.2 小時-7.2 小時)；經舌下吸收其平均半衰期為 37 小時。[25]

用途用法：

劑型：錠劑 0.2 毫克/錠

注射劑 0.3 毫克/毫升 1

成人及 12 歲以上兒童：每 6-8 小時或必要時給予，每次 0.2-0.4 mg。2-12

歲兒童，按體重計，每 6-8 小時或必要時給予，每次劑量如下：16-25 公斤：

100 mg ; 25-37.5 公斤 : 100-200 mg ; 37.5-50 公斤 : 200-300 mg 。 [26]

危害及副作用：

- 1、本品最常見的副作用為鎮靜。
- 2、另外也有嘔吐、低血壓、縮瞳、發汗等。
- 3、使用本品偶而會有發生呼吸抑制。
- 4、呼吸抑制時，一般劑量的 naloxone 很難逆轉此情況，

須借助人工呼吸器及/或 doxapram 。 [27]

檢驗方法：

一、呈色分析：1.Liebermann's Test—黑色

2. Marquis Test—紫色

二、質譜：分裂於 m/z 55、378、43、29、57、410、379、84。

三、紫外分光光度法：本品溶於酸性水溶液於 286nm 有吸收；溶於鹼性水溶液中於 300nm 有吸收。

四、遠紅外光光譜：以 KCl 錠法檢測本品鹽酸鹽，主峰出現在 1320、1077、1503、1155、1120 及 947cm^{-1} 處。

五、氣相層析法。 [28]

管制狀況：

本國：第三級管制藥品

多重濫用藥物併用：

Codeine、Dihydrocodeine、Fentanyl、Hydrocodone、Hydromorphone、

Meperidine、Methadone、Morphine：本品與鴉片類止痛藥、嗎啡致效劑/拮

抗劑共同使用可能會產生戒斷症狀。Diazepam：本品與 diazepam 併用會使

呼吸系統及心血管系統崩潰，為嚴重之交互作用。[29]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

本品為鴉片類藥品之部分致效劑，利用靜脈注射途徑給予會產生欣快感及

類鴉片作用因而導致濫用。濫用本品會產生嗜睡、噁心、嘔吐、呼吸抑制、

便秘、尿滯留、瞳孔縮小等現象。戒斷症狀包括會打呵欠、盜汗、流眼淚、

流鼻水、皮膚起疙瘩、失眠、焦慮不安、易怒、發抖、嘔吐、腹痛、肌肉

痙攣、皮膚有蟲鑽感等。使用 88 毫克以上的過量藥物會有嚴重的鴉片戒斷

現象，超過 122 毫克會產生嚴重肝炎或急性腎衰竭。[29]

成癮治療之方法與成效評估：

1、使用活性炭清除。

2、投予 Naloxone：起始劑量為靜脈注射兩毫克，可能需重複給藥，用於反

轉 buprenorphine 引起之呼吸抑制可能要用到較高劑量(10 至 35 毫克/公

斤)。

3、中毒導致的肺部功能降低可能需提供病患氧氣。

4、病患若有低血壓情況：靜脈注射 0.9%氯化鈉、Hypotensive episode: IV
0.9% dopamine, 、norepinephrine。 [30]

第三級管制藥品 — 布他比妥 (Butalbital)

項次: 4

名稱:

1. 中文: 布他比妥
2. 英文: **Butalbital**
3. CAS 編號: 77-26-9

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 50 mg
3. 照片:



化學性狀:

1. 外觀及性狀:

性質: 又名丙烯異丁比妥, 烯丙基巴比妥酸。白色結晶性粉末, 無臭, 味苦, 微溶於冷水, 溶於乙醇、氯仿等。本品由 2-異丁基-1,3-丙二酸二乙酯為原料製得。[31]

2. 結構式:英文

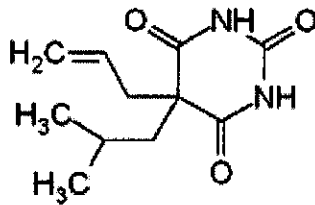
5-(2-methylpropyl)-5-(2-propenyl)-2,4,6(1H,3H,5H)-pyrimidinetrione

3. 分子式: $C_{11}H_{16}N_2O_3$

4. 分子量: 224.256

5. 熔點: 138~139°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為巴比妥類催眠藥、抗驚厥藥。中等作用時間（3~6 小時），對中樞的抑制作用隨著劑量加大，表現為鎮靜、催眠、抗驚厥及抗癲癇。大劑量對心血管系統、呼吸系統有明顯的抑制。過量可麻痹延髓呼吸中樞致死。體外電生理實驗本類藥物使神經細胞的氯離子通道開放，細胞過極化，擬似 γ -氨基丁酸(GABA)的作用。治療濃度的布他比妥可降低谷氨酸的興奮作用、加強 γ -氨基丁酸的抑制作用，抑制中樞神經系統單突觸和多突觸傳遞，抑制癲灶的高頻放電及其向周圍擴散。可減少胃液分泌，降低胃張力。可產生依賴性，包括精神依賴和身體依賴。[32]

藥動學特性：

口服後在消化道吸收迅速，15~30 分鐘生效，約維持 3~6 小時。吸收後分

佈於體內各組織及體液中，因本品脂溶性高，易通過血腦屏障，進入腦組織，起效比較快。T1/2 約為 35 小時，血藥濃度達峰時間，個體差異大。本品在肝臟代謝成 5-isobutyl-5-(2,3-dihydroxypropyl)-barbituric acid 、5-allyl-5-(3-hydroxy-2-methyl-1-propyl)-barbituric acid，5%以原形、59% 到 88%以代謝形經由腎臟排出。[33]

用途用法：

結合其他藥物，如對 acetaminophen 或 aspirin，是常見的明用於治療疼痛和頭痛。結合 codeine 是 FDA 批准用於治療緊張性頭痛。

以錠劑服用。[34]

危害及副作用：

- 1、可能引起微妙的情感變化，出現認知和記憶的缺損。
- 2、長期用藥，偶見葉酸缺乏和低鈣血症。
- 3、罕見巨幼紅細胞性貧血和骨軟化。
- 4、大劑量時可產生眼球震顫、共濟失調和嚴重的呼吸抑制。
- 5、用本品的患者中約 1~3%的人出現皮膚反應，多見者為各種皮疹以及哮喘，嚴重者可出現剝脫性皮炎和多形紅斑（或 Stevens—Johnson 綜合症），中毒性表皮壞死極為罕見。
- 6、肝炎和肝功能紊亂。

7、長時間使用可發生藥物依賴，停藥後易發生停藥綜合症。[35]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：將本品溶於乙醇與鹼性硼酸緩衝液(pH9.6)之混液(1→20)所成溶液(1→100,000)，按照紫外線吸光度測定法測定之，於波長240nm 附近呈最大吸收。溶於 1M 氫氧化鈉(pH13) ，於波長 255nm 附近呈最大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1690、1720、1740、1310、1290、1200 cm^{-1} 的位置。

(四)質譜分析：分裂於 m/z 41、167、168、39、124、97、141、181。[36]

管制狀況：

本國：第三級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Adinazolam、Alfentanil、Alprazolam、Amobarbital、Aprobarbital、Bromazepam、Brotizolam、Butabarbital、Calamus、Cannabis、Clobazam、Clonazepam、Clorazepate、Codeine、Diazepam、Estazolam、Ethchlorvynol、Fentanyl、Flunitrazepam、Flurazepam、Halazepam、Hydrocodone、Hydromorphone、Ketazolam、Levorphanol、Lorazepam、

Lormetazepam、Medazepam、Meperidine、Mephesisin、Mephobarbital、Meprobamate、Metaxalone、Midazolam、Morphine、Nitrazepam、Nordazepam、Oxazepam、Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Prazepam、Secobarbital、Temazepam、Thiopental、Triazolam。本品與酒精併服時：過度中樞神經抑制作用，且作用快速。[37]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

與短期治療具耐受性，治療效果鎮靜催眠，發生更迅速。不幸的是，由於耐受性增加治療指數降低。可能引起昏迷、嚴重的呼吸和心血管抑制、低血壓和休克繼而引發腎功能衰竭、死亡。深度呼吸抑制是急性中毒的直接死亡原因。[37]

成癮治療之方法與成效評估：

會導致戒斷症狀的中樞神經系統的刺激，如焦慮或煩躁不安和麻煩，睡覺，這可能會導致驚厥和幻覺。這些症狀可能出現在使用後 5 至 15 天。一般來說，劑量小於 400 毫克，每天不會產生身體依賴性或跡象。產生戒斷症狀，採取高達 1500 毫克 butalbital 每天長達 2 年的慢性頭痛。

(一) 洗胃

(二) 促進毒物排泄

1、快速輸液 2、利尿脫水 3、導瀉 4、血液透析 5、鹼化尿液

(三) 中樞興奮劑的應用

僅適用於重度中毒者、呼吸高度抑制者及昏迷患者。[38]

第三級管制藥品 — 去甲假麻黃 (Cathine、(+)-Norpseudoephedrine)

項次: 5

名稱:

1. 中文: 去甲假麻黃
2. 英文: Cathine、(+)-Norpseudoephedrine
3. CAS 編號: 492-39-7

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀: 結晶狀

溶解度: 可溶於乙醇、氯仿、乙醚及稀釋的酸之中。[39]

2. 結構式: 英文

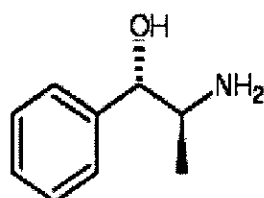
(αS)- α -[(1S)-1-Aminoethyl]benzenemethanol

3. 分子式: C₉H₁₃NO

4. 分子量: 151.21

5. 熔點: 77-78°C

6. 結構圖:



藥理性質:

本品為存在於 shrub *Catha edulis* 之中的生物鹼，結構上與安非他命相似，有抑制食慾及解充血作用。[40]

藥動學特性：

服用本品後 6 小時約有 40% 的藥物以原型從尿液排出。本品可代謝成 pseudoephedrine。本品之半衰期約 3 小時。[39]

用途用法：

每日口服劑量為 20-60 毫克。

危害及副作用：

- 1、使用本品會造成食慾不振、口乾、噁心、嘔吐、心脈不整、心悸亢進、心跳過快等現象。
- 2、其他副作用包括精神不安、暈眩、頭痛、嗜睡、四肢麻木感等。[41]

檢驗方法：

- 一、質譜：分裂於 m/z 44、57、43、40、55、41、79、77。
- 二、紫外分光光度法：本品溶於酸性水溶液中於 252、258 及 263nm 有吸收。
- 三、遠紅外光光譜：以 KBr 錠法檢測本品溴酸鹽，主峰出現在 1045、695、754、704、1091 及 947cm^{-1} 處。
- 四、氣相層析法。[39]

管制狀況：

本國：第三級管制藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

- 1、本品使用過量時可能造成心跳過速、高血壓、焦慮、幻覺、嘔吐等現象
- 2、使用本品於戒斷時會產生困乏感、感覺消失、夢魘及輕微的顫抖。
- 3、另有報導指出長期濫用本品而產生精神分裂、狂躁、抑鬱等病例。[42]

成癮治療之方法與成效評估：

- 1、使用活性碳除去本品。
- 2、發生心跳過速時：監測心跳，通常需要治療，使用苯二氮平類安眠劑可能可以改善症狀。發生嚴重心跳過速且血液動力學改變時才考慮使用乙型阻斷劑。
- 3、高血壓：監測血壓，通常不需給予藥物，可用苯二氮平類安眠劑使過於激動的病患鎮靜。
- 4、焦慮：給予苯二氮平類安眠劑，有嚴重焦慮症狀如顫抖、心悸則可給予 propranolol，劑量為成人每劑 1 毫克，靜脈注射 1 分鐘以上，每 5 分鐘重覆一次至到達最大劑量 5 毫克；孩童使用劑量為 0.1 毫克/公斤/劑，最大劑量為 1 毫克/劑。
- 5、痙攣：靜脈注射巴比妥鹽類或是苯二氮平類安眠劑。[43]

第三級管制藥品 — 環巴比妥 (Cyclobarbital)

項次: 6

名稱:

1. 中文: 環巴比妥
2. 英文: **Cyclobarbital**
3. CAS 編號: 52-31-3

製劑:

1. 劑型: 注射劑

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀: 白色結晶性粉末，無臭，味苦。

溶解度: 極難溶於水，易溶於乙醇、乙醚，在氯仿、鹼金屬氫氧化物及碳酸鹽溶液中溶解。[44]

2. 結構式: 英文

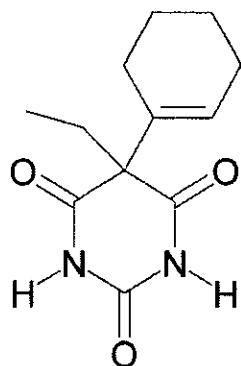
5-(1-cyclohexenyl)-5-ethyl-1,3-diazinane-2,4,6-trione

3. 分子式: $C_{12}H_{16}N_2O_3$

4. 分子量: 236.27

5. 熔點: 171-174°C

6. 結構圖：



藥理性質：

本品為巴比妥類催眠藥、抗驚厥藥。對中樞的抑制作用隨著劑量加大，表現為鎮靜、催眠、抗驚厥及抗癲癇。大劑量對心血管系統、呼吸系統有明顯的抑制。過量可麻痹延髓呼吸中樞致死。體外電生理實驗本類藥物使神經細胞的氯離子通道開放，細胞過極化，擬似 γ -氨基丁酸(GABA)的作用。治療濃度的環巴比妥可降低谷氨酸的興奮作用、加強 γ -氨基丁酸的抑制作用，抑制中樞神經系統單突觸和多突觸傳遞，抑制癲灶的高頻放電及其向周圍擴散。可減少胃液分泌，降低胃張力。可產生依賴性，包括精神依賴和身體依賴。[45]

藥動學特性：

口服後在消化道吸收迅速，15~30 分鐘生效，約維持 3~6 小時。吸收後分佈於體內各組織及體液中，因本品脂溶性高，易通過血腦屏障，進入腦組織，起效比較快。本品血漿蛋白結合率約為 70%。T_{1/2} 約為 8~17 小時，血藥濃度達峰時間，個體差異大。本品在肝臟代謝成 ketocyclobarbitol，極

少量 (<10%) 以原形從腎臟排出。[46]

用途用法：

注射劑

鎮靜 100 mg 到 400 mg 環巴比妥鈉鹽。

治療濃度：2 到 10 mg/L

危害及副作用：

- 1、用於抗癲癇時最常見的不良反應為鎮靜，但隨著療程的持續，其鎮靜作用逐漸變得不明顯。
- 2、可能引起微妙的情感變化，出現認知和記憶的缺損。
- 3、長期用藥，偶見葉酸缺乏和低鈣血症。
- 4、罕見巨幼紅細胞性貧血和骨軟化。
- 5、大劑量時可產生眼球震顫、共濟失調和嚴重的呼吸抑制。
- 6、用本品的患者中約 1~3% 的人出現皮膚反應，多見者為各種皮疹以及哮喘，嚴重者可出現剝脫性皮炎和多形紅斑（或 Stevens—Johnson 綜合症），中毒性表皮壞死極為罕見。
- 7、有報導用藥者出現肝炎和肝功能紊亂。
- 8、長時間使用可發生藥物依賴，停藥後易發生停藥綜合症。[47]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：將本品溶於乙醇與鹼性硼酸緩衝液(pH9.6)之混液(1→20)所成溶液(1→100,000)，按照紫外線吸光度測定法測定之，於波長239nm附近呈最大吸收。溶於1M 氫氧化鈉(pH13)，於波長256nm附近呈最大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於1693、1725、1745、1300、1210、830 cm^{-1} 的位置。

(四)質譜分析：分裂於 m/z 207、141、81、79、67、80、41、77。[44]

管制狀況：

本國：第三級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Adinazolam、Alfentanil、Alprazolam、Amobarbital、Aprobarbital、Bromazepam、Brotizolam、Butabarbital、Butalbital、Calamus、Cannabis、Clobazam、Clonazepam、Clorazepate、Codeine、Diazepam、Estazolam、Ethchlorvynol、Fentanyl、Flunitrazepam、Flurazepam、Halazepam、Hydrocodone、Hydromorphone、Ketazolam、Levorphanol、Lorazepam、Lormetazepam、Medazepam、Meperidine、Mephesisin、Mephobarbital、Meprobamate、Metaxalone、Midazolam、Morphine、

Nitrazepam、Nordazepam、Oxazepam、Oxycodone、Oxymorphone、
Pentobarbital、Phenobarbital、Prazepam、Secobarbital、Temazepam、
Thiopental、Triazolam。本品與酒精併服時：過度中樞神經抑制作用，且作
用快速。[48]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

過量藥物可能引起昏迷、嚴重的呼吸和心血管抑制、低血壓和休克繼而引
發腎功能衰竭、死亡。深度呼吸抑制是急性中毒的直接死亡原因。可致嚴
重中毒，中毒致死的血藥濃度為 1 mg/100ml。解救措施中最重要的是維持
呼吸和迴圈功能，施行有效的人工呼吸，必要時行氣管切開，並輔之以有
助於維持和改善呼吸和迴圈的相應藥物。經口服中毒者，在 3~5 小時內可
用高錳酸鉀（1：2000）溶液洗胃。用 10~15g 硫酸鈉溶液導泄（禁用硫酸
鎂）。為加速排泄可給甘露醇等滲透壓利尿藥，如腎功能正常可用速尿。可
用碳酸氫鈉、乳酸鈉鹼化尿液加速排泄，嚴重者可透析。[49]

成癮治療之方法與成效評估：

1、輕度中毒 頭痛、眩暈、乏力、語言不清、嗜睡、視物模糊、眼球震顫、
瞳孔縮小 噁心、嘔吐，各種形態的皮疹，呼吸稍快，血壓正常或偏低，
還可引起陰莖水腫。

2、重度中毒 開始病人可表現狂躁、驚厥、四肢強直；繼而進入抑制期，

出現瞳孔散大（對光反射存在），全身馳緩，淺反射消失，脈搏細速，血壓下降，尿少或尿閉，中毒性肝炎等表現；最後可因呼吸抑制或因嘔吐物吸入而發生窒息而死亡。

（一）洗胃

（二）促進毒物排泄

1、快速輸液 2、利尿脫水 3、導瀉 4、血液透析 5、鹼化尿液

（三）中樞興奮劑的應用

僅適用於重度中毒者、呼吸高度抑制者及昏迷患者。[50]

第三級管制藥品 — 格魯米特 (Glutethimide)

項次: 7

名稱:

1. 中文: 格魯米特
2. 英文: **Glutethimide**
3. CAS 編號: 77-21-4

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 250 毫克/錠
3. 照片:



Trade Name: Doriden
Controlled Ingredient, glutethimide, 500 mg

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀: 無色結晶或白色結晶狀粉末。

溶解度: 部分不溶於水中; 可溶於 1:5 的乙醇中、1:<1 的氯仿中及

1:12 的乙醚中; 極可溶於丙酮中。[51]

2. 結構式: 英文

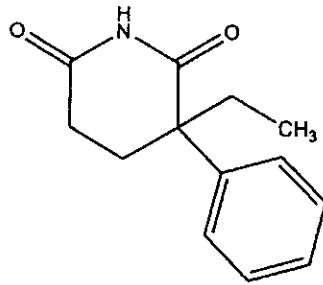
3-Ethyl-3-phenyl-2,6-piperidinedione

3. 分子式: $C_{13}H_{15}NO_2$

4. 分子量: 217.27

5. 熔點: 85-89°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品產生的中樞神經抑制作用與巴比妥鹽類相似。本品具有抗膽鹼作用，產生散瞳、分泌增加及腸胃蠕動減少等現象。本品會抑制快速動眼期睡眠，在停止使用藥物後會產生快速動眼期的反彈。[52]

藥動學特性：

本品口服後約 10-30 分鐘產生催眠效果，其血漿蛋白結合率約 47.3%-59.3%。本品可通過胎盤。其代謝產生活性代謝物 4-OH-GLUTETHIMIDE 及 4-hydroxy-2-ethyl-2-phenylglutarimide。0.13% 經膽汁排除。半衰期為 11.6-13.5 小時。[53]

用途用法：

口服，本藥物開始發揮藥效是在服藥 30 分鐘後，藥效能持續 4-6 小時。服用的時機與藥量可作以下的區分：1. 白天鎮靜用：每天於餐後服用 125

mg，一天服用 3 次。2. 夜晚幫助睡眠用：於睡前服用 250-500 mg，每晚最高服藥劑量不超過 1000 mg。[54]

危害及副作用：

思睡、視力模糊、頭痛、頭暈。[55]

檢驗方法：

一、呈色分析：1. Koppanyi-Zwicker Test—紫色

2. Liebermann's Test—紅至橘色

3. Mercurous Nitrate—黑色

二、質譜：分裂於 m/z 189、132、117、160、91、115、103、77。

三、紫外分光光度法：本品溶於乙醇中於 252、258、264nm 有吸收。

四、遠紅外光光譜：以 KBr 錠法檢測本品，主峰出現在 1686、1710、1200、1281 及 704cm^{-1} 處。[56]

管制狀況：

本國：第三級管制藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

- 1、低劑量之中毒時會有想睡、運動失調、強直性的肌肉痙攣及不正常的反射。
- 2、嚴重中毒時血壓、體溫降低，可能發生休克、昏迷、呼吸抑制及酸中毒

現象。其他器官的損害是由於休克及昏迷所造成。

3、診斷主要依靠病患的臨床表現及毒理學分析。

4、本品與酒精併用會提高鎮靜的作用，使病患之反應時間及心理性肌肉運動減緩。[57]

成癮治療之方法與成效評估：

1、若病患具有意識且有正常的喉部反射，則施與催吐。

2、輕度昏迷的病患於洗胃之前先插管。在服用過量後超過四小時則投予活性碳及給予瀉劑。

3、有呼吸抑制情形之病患要確定有足夠的氧氣，嚴重之病患要考慮插管，且需注意病患的血中氣體量。

4、給予病人足夠的液體，維持每日排尿量 2.5-3 公升。

5、嚴重之低血壓需補充體液且需要以 dopamine 或其他升壓藥物治療。

6、昏迷且有休克徵象之病患要監測腎臟功能，並且考慮可能發生罕見之腎前尿毒症。[58]

第三級管制藥品 — 派醋甲酯 (Methylphenidate)

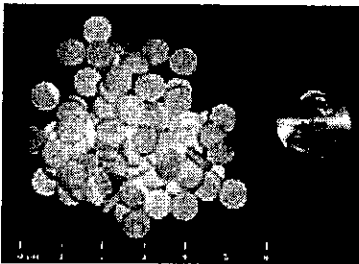
項次: 8

名稱:

1. 中文: 派醋甲酯
2. 英文: **Methylphenidate**
3. CAS 編號: 113-45-1

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 10 mg
3. 照片:



化學性狀:

1. 外觀及性狀:

性質: 又稱哌醋甲酯, 利他林。白色結晶性粉末, 無臭, 易溶于水、甲醇、氯仿, 微溶於乙醇, 不溶於丙酮。以 2-氯代吡啶為原料制得。常用其鹽酸鹽。[59]

2. 結構式:英文

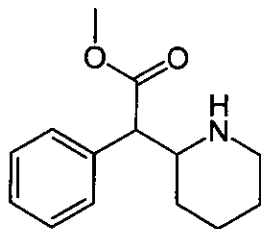
Methyl 2-phenyl-2-(2-piperidyl)acetate

3. 分子式: $C_{14}H_{19}NO_2$

4. 分子量: 233.31

5. 熔點: 135-137°C

6. 結構圖:



藥理性質：

對中樞神經有興奮作用，主要作用於大腦皮質、皮質下組織，增加活動力，精神警覺性，減少疲倦感。對於孩童運動機能亢進症候群，本品有鎮靜作用，減少過度活動及延長注意間隙。[60]

藥動學特性：

口服後在消化道吸收迅速，15~30 分鐘生效，生體可用率為 11-52%，。

T_{1/2} 約為 2~4 小時，蛋白質結合率為 30%，在肝臟代謝成

alpha-phenyl-piperidine acetic acid，在二十四小時內 80%藥物經尿液排出。

(3)

用途用法：

治療過動兒症候群，藥物引起的嗜眠，發作性嗜睡症。[61]

錠劑

1.平均劑量為每天 2~3 次，每次 10 mg，飯前 30~40 分次服用，為免發生不眠症，1 天中的最後 1 次服藥，不能在下午 4 點後服用。

2.孩童：行為症候群~6 歲以下劑量未確立。6 歲以下—每天 2 次，每次早、午餐前服用 5 mg，每隔 1 週增加劑量 5~10 mg 至每天最高 60 mg。[62]

危害及副作用：

發疹、關節痛，剝落性皮膚炎，紅斑。不眠，不安，焦躁興奮、神經、過敏、幻覺、妄想、頭痛、暈眩、震顫、抑鬱、攻擊，注意集中困難。若大量使用，則可能出現痙攣、運動亢進，中毒性精神障礙，食慾不振、噁心嘔吐、便秘、口渴、下痢、心悸亢進，胸部壓迫感，血壓 上昇或下降，頻尿，排尿困難，性慾減退，血小板減少性紫斑症。[63]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：於波長 264nm 附近呈最大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1735、1175、1210、1150、705、740 cm^{-1} 的位置。

(四)質譜分析：分裂於 m/z 84、91、85、56、55、150、41、118。[64]

管制狀況：

本國：第三級管制藥品

多重濫用藥物併用：

Phenobarbital：增加 Phenobarbital 血漿濃度，Phenobarbital 作用增加。[65]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

- 1.高血壓，有藥物依賴性或酒精中毒的記錄，孕婦應小心使用。
- 2.情緒不穩患者，會發生慢性濫用藥物。
- 3.逐漸停藥以避免嚴重抑鬱症狀或精神病行為發生。
- 4.治療期間，固定監測血壓、體重，在長期治療期間，定期做血球計數。
- 5.治療初期會發生神經質和失眠，但會隨時間而減輕，然而可能需要減低劑量。
- 6.最後一劑不得遲於臨睡前 4~5 小時給藥，以減少失眠之發生。
- 7.治療些微腦功能異常時，應定期暫時停藥以評估患者之情況，假若 1 個月內沒有明顯改善應停藥。
- 8.瞭解藥物治療並不適合於所有腦功能異常的孩童。[65]

成癮治療之方法與成效評估：

兒童服用少於 1 毫克/公斤的有沒有相關性顯著的毒性。不過兒童症狀使用

劑量約 2 至 4 毫克/公斤。不過，臨床觀察的到毒性作用是比預估攝入更高劑量。鼻內濫用已造成死亡的。

過量使用本品時治療方法：

1、生命支持：支持呼吸系統和心血管功能。

2、監測：

a 監測心率和血壓。

b 監測為體溫 40 度以上危及生命，立即降低體溫和鎮靜。

c 監測血清電解質，腎功能，酸鹼平衡，肝酶的病人有顯著的毒性。

d 在哌醋甲酯的無法尿液檢測濫用藥物。

3、使用吐根誘導嘔吐是不推薦，由於潛在的藥物量和心臟併發症。

4、使用活性炭吸收。使用最低 240 毫升的水百分之三十克活性碳。[66]

第三級管制藥品 — 納洛芬 (Nalorphine)

項次: 10

名稱:

1. 中文: 納洛芬
2. 英文: **Nalorphine**
3. CAS 編號: 62-67-9

製劑:

1. 劑型: 注射劑

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀: 白至奶油白色結晶粉末，無臭。

溶解度: 可溶於 1:24 的水及 1:35 的乙醇中。

pH 值: 飽和溶液約為 5。[67]

2. 結構式: 英文

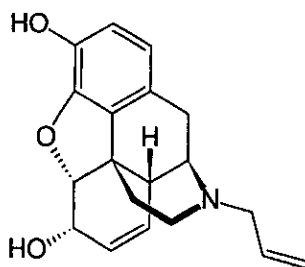
(5 α ,6 α)-7,8-Didehydro-4,5-epoxy-17-(2-propenyl)morphinan-3,6-diol

3. 分子式: C₁₉H₂₁NO₃

4. 分子量: 311.38

5. 熔點: 約 206°C

6. 結構圖：



藥理性質：

為麻醉藥品中毒呼吸抑制之解毒劑。可有效拮抗麻醉藥品之作用，具類似嗎啡之鎮痛作用，但有不快感，故臨床上並不做為鎮痛劑。[68]

藥動學特性：

本品於口服之後可被吸收，但大多數藥物會經首渡代謝。本品代謝後從腎臟排除為主，尿液中約 2-6% 為原型藥物。[67]

用途用法：

皮下（或肌肉）注射：一次量 2-5 ml，如有必要，每隔 10-15 分鐘重覆給藥。一天總量以不超過 40 mg 為原則。

危害及副作用：

偶有思睡，蒼白，縮瞳，血壓下降，心跳徐緩之現象。

檢驗方法：

一、呈色分析：Marquis Test—紫色

二、質譜：分裂於 m/z 311、312、41、188、80、82、81、241。

三、紫外分光光度法：本品溶於酸性水溶液中於 285nm 有吸收；溶於鹼性水溶液中於 251、298nm 有吸收。

四、遠紅外光光譜：以 KBr 錠法檢測本品溴酸鹽，主峰出現在 1505、1121、1155、1304、805 及 945 cm^{-1} 處。

五、氣相層析法。[67]

管制狀況：

本國：第三級管制藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

1、長期使用本品於戒斷時會有便秘、噁心、皮膚刺癢等現象。

2、病患會有作夢變多的情況。[69]

成癮治療之方法與成效評估：

1、本品使用過量時不建議給予吐根催吐。

2、活性炭：成人為 25 至 100 克；21 歲以下使用 25 至 50 克。

3、產生痙攣：靜脈注射 diazepam，成人劑量為 5 至 10 毫克，必要時每 10 至 15 分鐘重覆給藥一次；孩童給予 0.2 到 0.5 毫克/公斤。

4、監視病患的呼吸速率、脈搏。[70]

第四級管制藥品 — 戊巴比妥 (Pentobarbital)

項次: 11

名稱:

1. 中文: 戊巴比妥
2. 英文: Pentobarbital
3. CAS 編號: 76-74-4

製劑:

1. 劑型: 注射劑, 錠劑
2. 劑量: 錠劑 100 mg
3. 照片:



Trade Name: Nembutal
Controlled Ingredient: pentobarbital 100 mg

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀: 白色結晶性粉末, 無臭, 味微苦。

溶解度: 微溶於水, 易溶於乙醇、乙醚, 在氯仿、鹼金屬氫氧化物及碳酸鹽溶液中溶解。[71]

2. 結構式: 英文

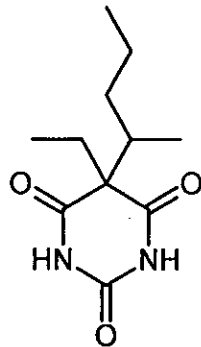
5-Ethyl-5-(1-methylbutyl)-2,4,6(1H,3H,5H)-pyrimidinetrione

3. 分子式: $C_{11}H_{18}N_2O_3$

4. 分子量: 226.1317

5. 熔點: 174-178°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為巴比妥類催眠藥。短效作用時間(2~3 小時)，對中樞的抑制作用隨著劑量加大，表現為鎮靜、催眠、抗驚厥及抗癲癇。大劑量對心血管系統、呼吸系統有明顯的抑制。過量可麻痺延髓呼吸中樞致死。體外電生理實驗本類藥物使神經細胞的氯離子通道開放，細胞過極化，擬似 γ -氨基丁酸 (GABA) 的作用。治療濃度的戊巴比妥可降低谷氨酸的興奮作用、加強 γ -氨基丁酸的抑制作用，抑制中樞神經系統單突觸和多突觸傳遞，抑制癲灶的高頻放電及其向周圍擴散。可減少胃液分泌，降低胃張力。可產生依賴性，包括精神依賴和身體依賴。[72]

藥動學特性：

口服後在消化道吸收迅速，15~30 分鐘生效，約維持 19 小時。吸收後分佈

於體內各組織及體液中，因本品脂溶性高，易通過血腦屏障，進入腦組織，起效比較快。本品血漿蛋白結合率約為 20-40%。T_{1/2} 約為 15~50 小時，血藥濃度達峰時間，個體差異大。本品 80%原形從尿液中排出。[73]

用途用法：

- 1.鎮靜、抗癲癇：每次 15~30 mg，1 日 3 次。
- 2.催眠：每次 30~90 mg，睡前服 1 次。
- 3.抗驚厥：鈉鹽肌肉注射，每次 100~200 mg。必要時，4~6 小時後重複 1 次。
- 4.麻醉前給藥：術前 1/2~1 小時肌肉注射 100~200 mg。
- 5.癲癇持續狀態：肌肉注射 1 次 100~200 mg。皮下、肌肉或緩慢靜脈注射 1 次 250 mg，1 日 500 mg。[74]

危害及副作用：

- 1、用於抗癲癇時最常見的不良反應為鎮靜，但隨著療程的持續，其鎮靜作用逐漸變得不明顯。
- 2、可能引起微妙的情感變化，出現認知和記憶的缺損。
- 3、長期用藥，偶見葉酸缺乏和低鈣血症。
- 4、罕見巨幼紅細胞性貧血和骨軟化。
- 5、大劑量時可產生眼球震顫、共濟失調和嚴重的呼吸抑制。

6、用本品的患者中約 1~3%的人出現皮膚反應，多見者為各種皮疹以及哮喘，嚴重者可出現剝脫性皮炎和多形紅斑（或 Stevens—Johnson 綜合症），中毒性表皮壞死極為罕見。

7、有報導用藥者出現肝炎和肝功能紊亂。

8、長時間使用可發生藥物依賴，停藥後易發生停藥綜合症。[75]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：將本品溶於乙醇與鹼性硼酸緩衝液(pH9.6)之混液(1→20)所成溶液(1→100,000)，按照紫外線吸光度測定法測定之，於波長 239nm 附近呈最大吸收。溶於 1M 氫氧化鈉(pH13)，於波長 255nm 附近呈最大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1685、1719、1744、1315、1218、845 cm^{-1} 的位置。

(四)質譜分析：分裂於 m/z 141、156、43、41、157、55、39、98。[76]

管制狀況：

本國：第三級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Adinazolam、Alfentanil、Alprazolam、

Amobarbital、Aprobarbital、Bromazepam、Brotizolam、Butabarbital、Butalbital、
Calamus、Cannabis、Clobazam、Clonazepam、Clorazepate、Codeine、
Diazepam、Estazolam、Ethchlorvynol、Fentanyl、Flunitrazepam、Flurazepam、
Halazepam、Hydrocodone、Hydromorphone、Ketazolam、Levorphanol、
Lorazepam、Lormetazepam、Medazepam、Meperidine、Mephesisin、
Mephobarbital、Meprobamate、Metaxalone、Midazolam、Morphine、
Nitrazepam、Nordazepam、Oxazepam、Oxycodone、Oxymorphone、
Phenobarbital、Prazepam、Secobarbital、Temazepam、Thiopental、Triazolam。

本品與酒精併服時：過度中樞神經抑制作用，且作用快速。[77]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

1、中樞神經系統：輕度中毒時，有頭脹、眩暈、頭痛是臨床上最常見的症狀之一，發病率僅次於感冒，通常是指頭顱上半部即眉毛以上至枕下部的疼痛。需引起重視的頭痛有哪些？頭痛、語言遲鈍、動作不協調、嗜睡、感覺障礙、瞳孔縮小等。重度中毒可有一段興奮期，病人可發生狂躁、譫妄、幻覺、驚厥、瞳孔散大（有時縮小）、肌肉鬆弛，角膜、咽、腱反射消失，昏迷逐漸加深。

2、呼吸系統：輕度中毒時，一般呼吸正常或稍緩慢。重度中毒時，呼吸減慢、變淺不規則，或呈潮式呼吸，嚴重時可引起呼吸衰竭。

3、循環系統 皮膚發紺、濕冷、脈搏快而微弱，少尿或無尿。血壓下降甚至休克。

4、黃疸及肝功能損害。[77]

成癮治療之方法與成效評估：

處理： 1、急性中毒者人工呼吸、給氧等支持治療。

2、服藥 5~6 小時內的中毒者立即洗胃。一般可用 1：5000 高錳酸鉀溶液，將胃內藥物儘量洗出；洗胃後可留置硫酸鈉溶液於胃內（成人 20~30 g），以促進藥物排泄。

3、應用利尿劑，加速毒物排泄，一般用 20%甘露醇注射液或 25%山梨醇注射液 200 mL 靜脈注射或快速滴注，3~4 小時後可重複使用。但須注意水、電解質平衡。

4、5%碳酸氫鈉注射液靜脈滴注以鹼化尿液，加速排泄。[78]

第三級管制藥品 — 苯甲嗎啉 (Phenmetrazine)

項次: 12

名稱:

1. 中文: 苯甲嗎啉
2. 英文: **Phenmetrazine**
3. CAS 編號: 134-49-6

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 35 mg

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

Phenmetrazine Hydrochloride

一般性狀: 白色結晶性粉末。

溶解度: 一份本品可溶於 0.4 份水、2 份乙醇、2 份氯仿，略溶於乙

醚。[79]

2. 結構式: 英文

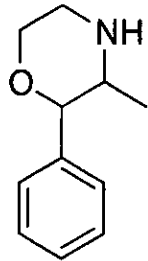
3-methyl-2-phenylmorpholine

3. 分子式: $C_{11}H_{15}NO$

4. 分子量: 177.2456

5. 熔點: 182°C

6. 結構圖:



藥理性質：

擬交感神經藥,與苯丙胺類似,作用較弱,作用於下丘腦飽感中樞,並影響糖代謝致食欲減退,體重下降。[80]

藥動學特性：

口服後在消化道吸收迅速。T_{1/2} 約為 8 小時。本品 19%代謝成

5-Methyl-3-oxo-6-phenylmorpholine 為活性代謝物，約 22%代謝成

3-Methyl-2-(4'-hydroxyphenyl)morpholine 及葡萄糖醛酸結合後經腎臟排出。[81]

用途用法：

治療肥胖症減少食慾。飯前口服:錠劑 12.5 mg-25 mg，2-3 mg/d；緩釋劑

50-75 mg/d，一天不超過突然 75 mg。[82]

危害及副作用：

口乾、上腹部不適、出汗、興奮、失眠、心動過速、血壓升高、長期服用

可產生精神和身體依賴。[83]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：於波長 264nm 附近呈最大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1083、757、695、965、990、1030 cm^{-1} 的位置。

(四)質譜分析：分裂於 m/z 71、42、56、43、177、77、178、105。[84]

管制狀況：

本國：第三級管制藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

長期高劑量治療突然中斷後，可能會導致抑鬱症和疲勞。

通常在一個數週後出現藥物依賴現象，如果這樣應當停止。

它是由一些被認為比安非他命有更大的潛力成癮，及已被濫用在許多國家，例如瑞典。在瑞典在 20 世紀 50 年代當興奮劑濫用首次成為普遍，phenmetrazine 是首選，以安非他明和甲基安非由吸毒成癮者，因為它被認為是優越的藥物。[85]

成癮治療之方法與成效評估：

具有較高的濫用的可能性，往往作為其他處方厭食症藥物 2 至 8 倍。

phenmetrazine 濫用。這是中常用的組合與海洛因或其他毒品，或者給予靜脈注射或口服，在長期使用可能導致嚴重的性皮炎，失眠，煩躁不安，多動，性格變化，思覺失調。一般可以停止藥物幾天或幾週後解決這些問題。

急性中毒時處理方式：

1、不誘導嘔吐。

2、使用活性炭。

2、抽搐時 diazepam 靜脈注射（劑量：成人：從 5 到 10 毫克。兒童： 0.2 至 0.5 毫克/公斤，重複每 5 分鐘視需要）或 lorazepam 靜脈注射（劑量：成人： 4 日至 8 毫克；兒童： 0.05 至 0.1 毫克/千克）。監測為低血壓，呼吸抑制，以及需要氣管插管。如果抽搐是無法控制或再次發生，考慮苯巴比妥。 [86]

第三級管制藥品 — 西可巴比妥 (Secobarbital)

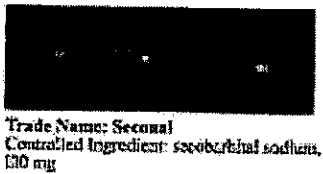
項次: 13

名稱:

1. 中文: 西可巴比妥
2. 英文: Secobarbital
3. CAS 編號: 76-73-3

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 100 mg
3. 照片:



化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀: 白色粉末; 無臭, 味苦, 有引濕性

溶解度: 易溶於水, 易溶於乙醇, 在乙醚中極不溶解。

pH 值: 飽和溶液為約 9.7。

由 α -(1-甲基丁基)丙二酸二乙酯為原料製得。[87]

2. 結構式:英文

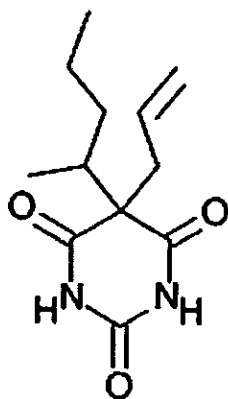
5-(1-methylbutyl)-5-prop-2-enyl-hexahydropyrimidine-2,4,6-trione

3. 分子式: $C_{12}H_{18}N_2O_3$

4. 分子量: 238.283

5. 熔點: $100^{\circ}C$

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為巴比妥類催眠藥。短效作用時間（2~3 小時），對中樞的抑制作用隨著劑量加大，表現為鎮靜、催眠、抗驚厥及抗癲癇。大劑量對心血管系統、呼吸系統有明顯的抑制。過量可麻痺延髓呼吸中樞致死。體外電生理實驗本類藥物使神經細胞的氯離子通道開放，細胞過極化，擬似 γ -氨基丁酸 (GABA) 的作用。治療濃度的西可巴比妥可降低谷氨酸的興奮作用、加強 γ -氨基丁酸的抑制作用，抑制中樞神經系統單突觸和多突觸傳遞，抑制癲灶的高頻放電及其向周圍擴散。可減少胃液分泌，降低胃張力。可產生依賴性，包括精神依賴和身體依賴。[88]

藥動學特性：

口服後在消化道吸收迅速，15~30 分鐘生效，約維持 2~6 小時。吸收後分佈於體內各組織及體液中，因本品脂溶性高，易通過血腦屏障，進入腦組織，起效比較快。本品血漿蛋白結合率約為 45~60%。T_{1/2} 約為 15~40 小時，血藥濃度達峰時間，個體差異大。本品在肝臟代謝，主要代謝為 methyl carboxypropyl, hydroxy methylbutyl, dihydroxypropyl methylbutyl 衍生物，<5%以原形從腎臟排出。[89]

用途用法：

成人劑量

麻醉;輔助：口服 1-2 小時手術前 200~300 mg。

在失眠，短期治療：口服 100mg 就寢時間，肌肉注射 100 至 200 mg，靜脈注射 50 至 250 mg。[90]

危害及副作用：

嗜睡

受損的運動功能：:受損的協調、受損的平衡

頭暈、焦慮、混亂、易怒，或興奮、頭痛、噁心、嘔吐、惡夢。

增加對疼痛的敏感性、過敏反應、呼吸困難、水腫、蕁麻疹。

長時間使用可發生藥物依賴，停藥後易發生停藥綜合症。[90]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：將本品溶於乙醇與鹼性硼酸緩衝液(pH9.2)之混液(1→20)所成溶液(1→100,000)，按照紫外線吸光度測定法測定之，於波長239nm附近呈最大吸收。溶於1M 氫氧化鈉(pH13)，於波長254nm附近呈最大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於1559、1648、1690、1298、1270、925 cm^{-1} 的位置。

(四)質譜分析：分裂於 m/z 167、168、41、43、97、124、39、55。

5-(2,3-dihydroxypropyl)secobarbital 171, 43, 143, 41, 128, 55, 141, 159。

3'-hydroxysecobarbital 41, 45, 43, 168, 39, 70, 69, 167。

3'-ketosecobabital 43, 69, 168, 42, 85, 167, 86, 169。[91]

管制狀況：

本國：第三級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Adinazolam、Alfentanil、Alprazolam、

Amobarbital、Aprobarbital、Bromazepam、Brotizolam、Butabarbital、Butalbital、

Calamus、Cannabis、Clobazam、Clonazepam、Clorazepate、Codeine、

Diazepam、Estazolam、Ethchlorvynol、Fentanyl、Flunitrazepam、Flurazepam、Halazepam、Hydrocodone、Hydromorphone、Ketazolam、Levorphanol、Lorazepam、Lormetazepam、Medazepam、Meperidine、Mephesisin、Mephobarbital、Meprobamate、Metaxalone、Midazolam、Morphine、Nitrazepam、Nordazepam、Oxazepam、Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Prazepam、Temazepam、Thiopental、Triazolam。

本品與酒精併服時：過度中樞神經抑制作用，且作用快速。[92]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

2週後使用後會影響睡眠，總睡眠時間可減少高達50%。15~20倍的過量藥物可能引起昏迷、嚴重的呼吸和心血管抑制、低血壓和休克繼而引發腎功能衰竭、死亡。深度呼吸抑制是急性中毒的直接死亡原因。可致嚴重中毒，中毒的血中藥物濃度為8 mg/L。[92]

成癮治療之方法與成效評估：

1. 輕度中毒 頭痛、眩暈、乏力、語言不清、嗜睡、視物模糊、眼球震顫、瞳孔縮小 噁心、嘔吐，各種形態的皮疹，呼吸稍快，血壓正常或偏低。
2. 重度中毒 開始病人可表現狂躁、驚厥、四肢強直；繼而進入抑制期，出現瞳孔散大（對光反射存在），全身弛緩，淺反射消失，脈搏細速，血壓下降，尿少或尿閉，中毒性肝炎等表現；最後可因呼吸抑制或因嘔吐物吸

入而發生窒息而死亡。

(一) 洗胃

(二) 促進毒物排泄

1、快速輸液 2、利尿脫水 3、導瀉 4、血液透析 5、鹼化尿液

(三) 中樞興奮劑的應用

僅適用於重度中毒者、呼吸高度抑制者及昏迷患者。 [93]

第三級管制藥品 — 三唑他 (三唑倫) (Triazolam)

項次: 15

名稱:

1. 中文: 三唑他 (三唑倫)
2. 英文: Triazolam
3. CAS 編號: 28911-01-5

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 0.5 mg / 0.25 mg
3. 照片:



Trade Name: Halcion
Controlled ingredient: triazolam,
0.25 mg



Trade Name: Halcion
Controlled ingredient: triazolam,
0.50 mg

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀: 白或淡黃色結晶粉末。

溶解度: 部分溶解於水及乙醚中; 以 1:1000 溶於乙醇; 1:25 溶於氯

仿；1:600 溶於 0.1M 鹽酸。[94]

2. 結構式:英文

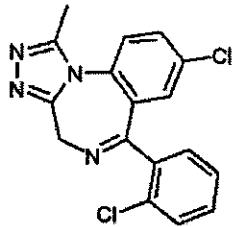
8-Chloro-6-(2-chlorophenyl)-1-methyl-4*H*-[1,2,4,]-triazolo[4,3-*a*]-[1,4]-benzodiazepine

3. 分子式: $C_{17}H_{12}Cl_2N_4$

4. 分子量: 343.2

5. 熔點: 233-235°C

6. 結構圖:



藥理性質：

苯二氮平類為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開

放，使氯離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氯通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氯離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癲灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。[95]

藥動學特性：

本品為短效型半衰期苯二氮平類藥。本品口服吸收快速且完整，其血漿蛋白結合率為 89%到 94%。本品主要經肝臟代謝，主要代謝路徑為水解作用

及與尿甘酸的共軛作用，alpha-hydroxytriazolam 為其活性代謝物。代謝物 80%經腎臟排除，半衰期約 2.3 小時。[96]

用途用法：

劑型：錠劑 0.25、0.5、1 毫克/錠

口服，成人一般劑量 0.25 mg。老年病人及未治療病人 0.125-0.25 mg。[97]

危害及副作用：

無力、暈眩、頭昏眼花，出現時間及嚴重程度一般與劑量有關。嚴重鎮靜及共濟失調代表對藥物不能耐受或用藥過量。[98]

檢驗方法：

一、質譜：分裂於 m/z 313、238、342、315、75、344、239、137。

二、遠紅外光光譜：以 KBr 錠法檢測本品，主峰出現在 761、842、1618、1003、1310 及 827cm^{-1} 處。

三、氣相層析法。[99]

管制狀況：

本國：第三級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、Butabarbital、Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、

Hydromorphone、Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、Thiopental。本品與酒精併用會造成鎮靜作用增加。增加本品的生體可用率及藥理作用：Ergotamine。[100]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

過量使用本品會影響中樞神經並造成呼吸抑制。病患會有矛盾的興奮，但單獨使用本品少見引起死亡。診斷主要依照過去病人是否曾使用過量或是觀察臨床表徵。另可投予 flumazenil 來診斷是否為過量使用。[100]

成癮治療之方法與成效評估：

- 1、大多數苯重氮基鹽類安眠劑之中毒只需要臨床上的觀察及支持性照護。
- 2、可使用活性碳清除腸胃內殘餘之藥物，不常利用洗胃。
- 3、不可催吐。
- 4、使用 flumazenil 可反轉嚴重的呼吸抑制或是心血管系統之併發症。但病患患有癲癇發作時禁忌使用 flumazenil。[101]

1. 第三級管制藥品 — 可待因 (Codeine) 製劑含量每 100 毫升
(或 100 公克) 1.0 公克以上，未滿 5.0 公克

項次: 16

名稱:

1. 中文: 可待因
2. 英文: Codeine
3. CAS 編號: 76-57-3

製劑:

2. 劑型: 錠劑
3. 劑量: 製劑含量每 100 毫升 (或 100 公克) 1.0 公克以上，未滿
5.0 公克

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀: 無色結晶或白色結晶狀粉末，在乾燥空氣中慢慢風化且受光影響。

溶解度: 可溶於 1:120 的水; 1:15 的沸水; 1:2 的乙醇; 1:0.5 的氯仿;

1:13 的苯; 1:18 的乙醚中; 極可溶於戊醇、甲醇及稀釋的酸中;

幾乎不溶於石油醚或鹼金屬氫氧化物溶液中。[102]

2. 結構式:英文

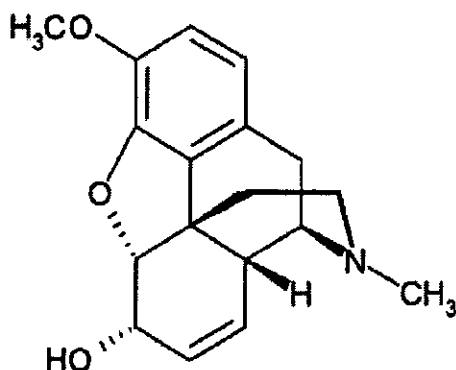
(5 α ,6 α)-7,8-Didehydro-4,5-epoxy-3-methoxy-17-methylmorphinan-6-ol

3. 分子式: C₁₈H₂₁NO₃

4. 分子量: 299.4

5. 熔點: 154-156°C

6. 結構圖:



藥理性質：

- 1、鎮咳及鎮痛劑，其鎮痛及成癮性較嗎啡為低。
- 2、由於作用在延髓上的咳嗽反射區而有鎮咳功效。 [103]

藥動學特性：

本品口服吸收良好；經直腸吸收其生體可用率為 63%。本品不與血漿蛋白結合。本品 24-89%由肝臟代謝，主要代謝途徑是與尿甘酸的共軛作用形成 codeine-6-glucuronide；另外也會經 CYP2D6 酵素作用形成嗎啡。本品代謝物 90%從腎臟排除，半衰期約 2.5-3.5 小時。[104]

用途用法：

劑型：錠劑 20、30 毫克

注射劑 15、30、60 毫克／毫升

口服：一日量 60 mg，一次量 15-30 mg，一次極量 100 mg，一日極量 300 mg

注射：皮下，肌肉注射一次量 15-30 mg。[105]

危害及副作用：

- 1、久服具成癮性，正常劑量下，極少產生副作用。
- 2、過量投與之副作用包括嘔吐，噁心，暈眩，膽管痙攣，呼吸抑制等。
- 3、服用過量而致死的原因為肺水腫。[106]

檢驗方法：

一、呈色分析：1.Liebermann's Test—黑色

2.Mandelin's Test—綠色

3.Marquis Test—紫色

二、質譜：分裂於 m/z 299、42、162、124、229、59、300、69。

三、紫外分光光度法：本品溶於酸性水溶液中於 285nm 有吸收。

四、遠紅外光光譜：以 KBr 錠法檢測本品，主峰出現在 1052、1268、1500、1111、793 及 934cm^{-1} 處。

五、氣相層析法

六、經以氫試液中和之本品溶液(1→50)，加硝酸銀試液，即生黃色沉澱，此沉澱可溶於 2N 硝酸或氫試液中。[107]

管制狀況：

本國：第三級管制藥品

多重濫用藥物併用：

增加中樞神經系統及呼吸系統的抑制作用：Adinazolam、Alprazolam、Amobarbital、Aprobarbita、Bromazepam、Butalbital、Clobazam、Clonazepam、Clorazepate、Diazepam、Estazolam、Fentanyl、Flunitrazepam、Hydrocodone、Lormetazepam、Meperidine、Morphine、Phenobarbital、Triazolam。

產生戒斷症狀：Buprenorphine。本品與酒精併用會產生加成或是協同之中樞神經抑制作用，可能造成病患之肌肉動作不協調。[108]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

中毒劑量之可待因會造成失去意識、瞳孔成針狀、呼吸緩慢、發紺等等。最危險的作用是呼吸抑制，於口服後 2-4 小時內可能引起呼吸衰竭。本品也可能引發痙攣。可能可以觀察到病患有幻覺、發抖、無法控制肌肉動作、精神上的壓抑及皮膚疹等情形。戒斷症狀包括打呵欠、流淚、嚴重腸胃道不適、發燒或冷顫、流汗、瞳孔放大、肌痛、失眠、增加呼吸速率等。

診斷：昏迷、針狀瞳孔及呼吸抑制為鴉片類藥物中毒時最典型的症狀，可待因中毒時也常見有蕁麻疹產生。病患的尿液及血液可作生化及毒理分析。[108]

成癮治療之方法與成效評估：

- 1、於急性、嚴重中毒之病患，需建立暢通之呼吸道，提供人工通氣、氧氣及監視血液動力學狀態。
- 2、具有意識之病患，考慮給予洗胃。
- 3、病患於服用後一至二小時內可投予活性碳。
- 4、建議的解毒劑為靜脈注射投予 0.4 毫克 naloxone，需要時每二至三分鐘反覆給藥直到恢復。
- 5、休克時經靜脈給予生壓藥物及其他支持治療，但需維持體溫。[109]

第三級管制藥品 — 氟硝西洋 (Flunitrazepam)

項次: 17

名稱:

1. 中文: 氟硝西洋
2. 英文: Flunitrazepam
3. CAS 編號: 1622-62-4

製劑:

1. 劑型: 錠劑, 注射劑
2. 劑量: 錠劑 1、2 毫克; 注射劑 2 毫克/毫升
3. 照片:



化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀: 淡黃色針狀粉末。[110]

2. 結構式: 英文

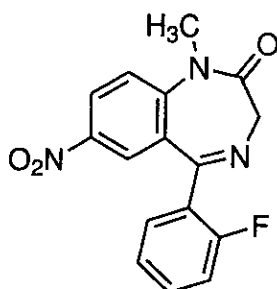
5-(2-Fluorophenyl)-1,3-dihydro-1-methyl-7-nitro-2*H*-1,4-benzodiazepi
n-2-one

3. 分子式: $C_{16}H_{12}FN_3O_3$

4. 分子量: 313.28

5. 熔點: 166-167°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本藥作用於中樞神經系統，為苯二氮平類安眠劑中的鎮靜安眠劑之一，是中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化

GABA 受體與氯離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。有良好的抗焦慮作用。本品具鎮靜、安眠、麻醉及肌肉鬆弛等作用。[111]

藥動學特性：

本品肌肉注射吸收良好；口服吸收其生體可用率約 80%到 90%。本品之血漿蛋白結合率為 78%-80%，本品之代謝主要在肝臟經由混合功能之氧化酵素系統作用。7 位胺基化的代謝物為其活性代謝物。本品之代謝物主要經腎臟排除，另有 10%從糞便排除。[112]

用途用法：

劑型：錠劑 1、2 毫克

注射劑 2 毫克/毫升

用於失眠症病患或麻醉用，可用口服、點滴注射及靜脈或肌肉注射等方式給予，大部分病人在恢復正常睡眠習慣後幾天就可以停止治療。

口服錠劑應於睡前服用。其劑量若為一般性失眠 0.5-1 mg，若為其他種安眠藥無效之症狀可增至 2 mg，睡前服用。[113]

危害及副作用：

本品耐受性良好，使用高劑量時（超過 4 mg）偶而有副作用發生。因本品具有鎮靜和肌肉鬆弛作用（倦怠，肌肉無力）。

有些病人在本發生作用之 6~8 小時內不會記得在此期間被叫醒之任何事情。[114]

檢驗方法：

一、呈色分析：1.本品遇 Formaldehyde-Sulfuric Acid—呈橘色。

二、質譜：分裂於 m/z 285、312、313、286、266、238、294、284。

三、紫外分光光度法：本品溶於甲醇中於 252 及 308nm 有吸收。

四、遠紅外光光譜：以 KBr 錠法檢測本品，主峰出現在 1697、1620、1490、1528、1107 及 783cm^{-1} 處。

五、氣相層析法。[115]

管制狀況：

本國：第三級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、
Butabarbital、Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、
Hydromorphone、Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、
Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、
Thiopental。增加本品的生體可用率及藥理作用：Ergotamine。本品與酒精
併用會增加鎮靜作用，即使為小量的酒精也會產生很大的鎮靜效果及使病
患肌肉動作不協調。[116]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

過量使用本品會影響中樞神經並造成呼吸抑制。病患會有矛盾的興奮，但
單獨使用本品少見引起死亡。診斷主要依照過去病人是否曾使用過量或是
觀察臨床表徵。另可投予 flumazenil 來診斷是否為過量使用。[116]

成癮治療之方法與成效評估：

- 1、大多數苯重氮基鹽類安眠劑之中毒只需要臨床上的觀察及支持性照護。
- 2、可使用活性碳清除腸胃內殘餘之藥物，不常利用洗胃。

3、不可催吐。

4、使用 flumazenil 可反轉嚴重的呼吸抑制或是心血管系統之併發症。但病患患有癲癇發作時禁忌使用 flumazenil。[117]

第三級管制藥品 — 洁吡普洛 (Zipeprol)

項次: 18

名稱:

1. 中文: 洁吡普洛
2. 英文: Zipeprol
3. CAS 編號: 34758-83-3

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 37.5 mg

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀: 其鹽酸鹽為白色結晶或結晶性粉末。

溶解度: 易溶於水及甲醇。[118]

2. 結構式: 英文

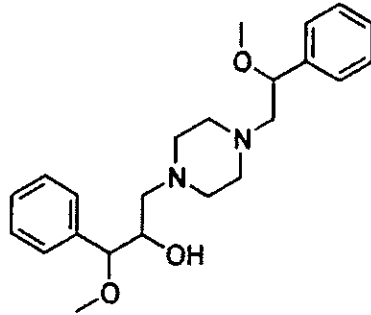
1-methoxy-3-[4-(2-methoxy-2-phenyl-ethyl)piperazin-1-yl]-1-phenyl-
propan-2-ol

3. 分子式: $C_{23}H_{32}N_2O_3$

4. 分子量: 384.51

5. 熔點: 231°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為止咳劑，主要作用為減少氣管痙攣及分解黏液。有報導指出本品亦具有抗組織胺、抗膽鹼、抗心跳過速等作用。[119]

藥動學特性：

本品口服吸收快速，在肝臟經由去烷基化、水解、氧化、甲基化等作用代謝。本品主要由腎臟排除，其中 1%-5% 以原型排出。本品使用超過 800 毫克會引起痙攣。[120]

用途用法：

劑型：錠劑

止咳：成人每天口服劑量為 150-300 毫克，分為數次使用。14 歲以下使用 15-120 毫克，依年齡而定。[121]

危害及副作用：

- 1、使用本品可能會引起高血壓。
- 2、於腸胃道可能造成便秘、噁心等現象。

3、由於本品主要經肝臟代謝，肝衰竭病患需視情況調整劑量。

4、於神經方面可能會有頭昏、困倦情形。[122]

檢驗方法：

質譜：分裂於 m/z 44、56、70、84、94、105、121、122、264、384。

管制狀況：

本國：第三級管制藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

1、本品於動物實驗中，給予猴子 10-18 毫克/公斤之劑量會造成抽搐。

2、過量使用本品(>治療劑量 2-4.5 毫克/公斤)會產生似鴉片的作用及幻

覺，於更高的劑量會產生抽搐。[118][121]

成癮治療之方法與成效評估：

1、本品使用過量時不建議使用吐根催吐，可能造成痙攣及中樞神經抑制。

2、本品之使用量可能造成生命威脅時考慮洗胃。

3、活性炭：成人為 25 至 100 克；21 歲以下使用 25 至 50 克。

4、產生痙攣：靜脈注射 diazepam，成人劑量為 5 至 10 毫克，必要時每 10

至 15 分鐘重覆給藥一次；孩童給予 0.2 到 0.5 毫克/公斤

5、監視病患的呼吸速率、脈搏。

6、使用 Naloxone 可輕微反轉本品成癮後造成的精神狀態低下，使用劑量

為靜脈注射 0.4 至 2.0 毫克，必要時可重覆給藥。[118][121]

第三級管制藥品 — 愷他命 (Ketamine)

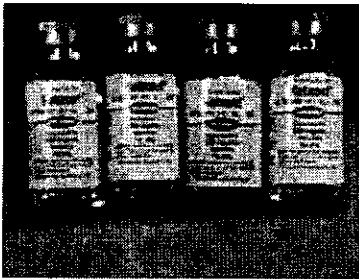
項次: 19

名稱:

1. 中文: 愷他命
2. 英文: Ketamine
3. 俗稱: SPECIAL K 或 K
4. CAS 編號: 6740-88-1

製劑:

1. 劑型: 注射劑
2. 劑量: 50 毫克
3. 照片:



化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀: 白色結晶粉末。

溶解度: 可溶於 1:4 的水; 1:14 的乙醇及 1:6 的甲醇中; 微溶於氯仿

中；部分不溶於乙醚中。[123]

2. 結構式:英文

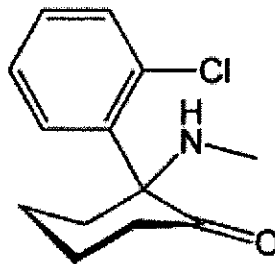
2-(2-Chlorophenyl)-2-methylamino-cyclohexan-1-one

3. 分子式: $C_{13}H_{16}ClNO$

4. 分子量: 237.09

5. 熔點: 262-263°C。

6. 結構圖:



藥理性質：

本品能夠產生解離狀態的一種迅速作用的麻醉劑，他可能產生深度的麻醉作用，維持著正常骨骼肌張力和喉的反射，和各種心臟血管及呼吸的刺激作用。一般認為他的作用是在產生感覺途徑，專一性的效應之前，先遮斷腦中的聯想途徑。

1. 極適合用於需要短時間麻醉之情況，可藉加劑量以延長作用。
2. 在不需骨骼肌鬆弛劑配合的情況下，可單獨使用於診斷及手術時之麻醉。
3. 當作低效力全身麻醉劑，例如 Nitrous Oxide 之輔助劑。
4. 當作其他全身麻醉劑之誘導麻醉劑。
5. 麻醉特色為極深的鎮痛，正當的咽喉反射，正當或微增的骨骼肌張力，心

血管與呼吸刺激，偶而短暫且稍微的呼吸抑制，氣道通暢。[124]

藥動學特性：

本品肌肉注射之生體可用率為 90%-93%；口服之生體可用率僅 16%。本品

主要在肝臟代謝，經 P450 酵素系統進行去甲基化作用，活性代謝物為

Norketamine。本品的代謝物多經由腎臟排除，半衰期為 2-3 小時。[125]

用途用法：

劑型：注射劑 50 毫克

誘導時 (Induction) 靜脈注射 1-4.5 mg/kg 體重

肌肉注射 6.5~13mg/kg 體重 (15 分~25 分)。

維持時 (Maintenance)：重覆使用誘導劑量一半的劑量。一般成人以 0.1-0.5

mg/kg 體重/分鐘的速度輸注，必要時可配合靜脈注射 Diazepam，將不

會超過 20 mg。[126]

危害及副作用：

1、於麻醉時使用本品可能造成高血壓及心跳過速。

2、注射部位可能有疼痛感。

3、曾有報導指出使用本品產生紅疹。[127]

檢驗方法：

一、質譜：分裂於 m/z 180、209、182、152、181、30、211、138。

二、紫外分光光度法：本品溶於酸性水溶液中於 269、276nm 有吸收。

三、遠紅外光光譜：以 KBr 錠法檢測本品，主峰出現在 1696、747、1142、1120、712 及 1027 cm^{-1} 處。

四、氣相層析法。[128]

管制狀況：

本國：第三級管制藥品

多重濫用藥物併用：

Tramadol：增加呼吸抑制之風險及中樞神經系統被過度抑制。[129]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

本品之毒性劑量尚未建立，使用 900 至 1000 毫克曾有致死病例。

本品因其幻覺作用而易被濫用，過量時可能產生如癲癇發作、多發性神經病變、顱內壓上升、呼吸停止等現象。另外在心血管方面會有心悸、心跳過速、高血壓；於中樞神經有頭昏、焦慮、生動的夢境及精神錯亂等情形。
[129]

成癮治療之方法與成效評估：

1、癲癇發作：靜脈注射苯重氮基鹽類安眠劑及巴比妥鹽類。

2、焦慮：減少感覺的刺激，苯重氮基鹽類安眠劑可降低生動的夢境之發生率。極度激動可投予 diazepam，成人以靜脈注射緩慢給予 10 毫克；孩童則靜脈注射緩慢給予 0.1-0.3 毫克/公斤。

- 3、給予 75 微克/公斤之 Droperidol:可減低本品造成之似精神病的作用。
- 4、可能需要較早投予利尿劑及體液之置換。
- 5、監視病患之生命徵象、神經學狀態及心血管系統。[130]

第三級管制藥品 — 二氫可待因 (Dihydrocodeine) 32 mg (製劑含量每 100

毫升(或 100 公克) 1.0 公克以上，未滿 5.0 公克)

項次: 20

名稱:

1. 中文: 二氫可待因
2. 英文: Dihydrocodeine
3. CAS 編號: 125-28-0

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 32 mg (製劑含量每 100 毫升(或 100 公克) 1.0 公克以上，未滿 5.0 公克)
3. 照片:



化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀: 白至黃白色結晶粉末。

溶解度: 可溶於 1:3 的水中；微溶於乙醇中。

pH 值:本品溶液(1:10)之 pH 約為 3-5。[131]

2. 結構式:英文

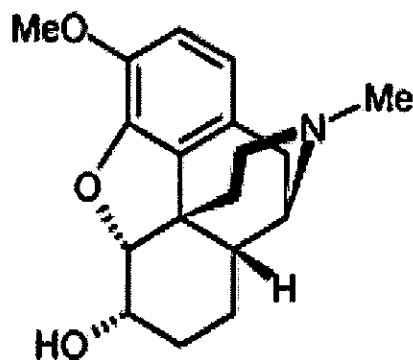
3-methoxy-17-methylmorphinan-6-ol

3. 分子式: $C_{18}H_{23}NO_3$

4. 分子量: 301.39

5. 熔點: 112-113°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品具有類似嗎啡的結構，其鎮痛效果介於嗎啡及可待因之間。本品為中樞作用的止咳劑。[132]

藥動學特性：

本品吸收快速，會有首渡代謝現象。本品也會經由去甲基化作用產生 dihydromorphine。本品有 35% 經腎臟排除，半衰期為 3.4-4.5 小時。[133]

用途用法：

止咳：成人每次使用 10-30 毫克，一天三次。12 歲以上亦同。6-12 歲兒童

每次使用 5-10 毫克，一天用一到三次。2-5 歲幼兒每次使用 2.5-5 毫克，一天用一到三次。[134]

危害及副作用：

- 1、本品可能造成噁心、腹瀉、嘔吐、便秘、腹痛或消化不良等現象。
- 2、曾有報導指出使用本品產生蕁麻疹及過敏反應。
- 3、於神經系統方面可能有頭昏、想睡、頭痛及混亂情形。[135]

檢驗方法：

一、呈色分析：1. Mandelin's Test—黃色

2. Nessler's Reagent—黑色

二、質譜：分裂於 m/z 301、44、42、59、164、70、302、242。

三、紫外分光光度法：本品溶於酸性水溶液中於 240、274 及 306nm 有吸收。

四、遠紅外光光譜：以 KBr 錠法檢測本品，主峰出現在 1608、1575、1537、1136、769 及 1100cm^{-1} 處。

五、氣相層析法。[136]

管制狀況：

本國：第三級管制藥品

多重濫用藥物併用：

Buprenorphine：產生戒斷症狀。本品與酒精併用會產生加成或是協同之中

樞神經抑制作用，可能造成病患之肌肉動作不協調。[137]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

中毒劑量之可待因會造成失去意識、瞳孔成針狀、呼吸緩慢、發紺等等。

最危險的作用是呼吸抑制，於口服後 2-4 小時內可能引起呼吸衰竭。本品也

可能引發痙攣。可能可以觀察到病患有幻覺、發抖、無法控制肌肉動作、

精神上的壓抑及皮膚疹等情形。戒斷症狀包括打呵欠、流淚、嚴重腸胃道

不適、胃排空減慢、發燒或冷顫、流汗、瞳孔放大、肌痛、失眠、增加呼

吸速率等。診斷：昏迷、針狀瞳孔及呼吸抑制為鴉片類藥物中毒時最典型

的症狀，可待因中毒時也常見有蕁麻疹產生。病患的尿液及血液可作生化

及毒理分析。[137]

成癮治療之方法與成效評估：

於急性、嚴重中毒之病患，需暢通其呼吸道，提供人工通氣、氧氣及監視血液動力學狀態。

具有意識之病患，考慮給予洗胃。

病患於服用後一至二小時內可投予活性碳。

建議的解毒劑為靜脈注射投予 0.4 至 2.0 毫克 naloxone，需要時每二至三分鐘反覆給藥直到恢復。

休克時經靜脈給予液體、加壓藥物及其他支持治療且需維持體溫。[138]

第三級管制藥品 — 4-溴-2,5-二甲氧基苯基乙基胺

(4-Bromo-2,5-dimethoxyphenethylamine、2C-B)

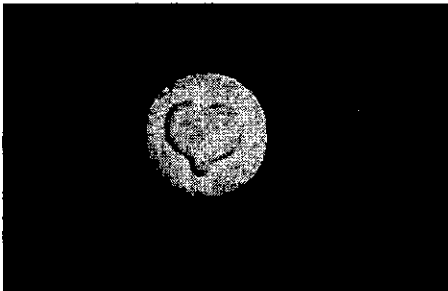
項次: 21

名稱:

1. 中文: 4-溴-2,5-二甲氧基苯基乙基胺
2. 英文: 4-Bromo-2,5-dimethoxyphenethylamine、2C-B
3. CAS 編號: 66142-81-2

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 照片:



化學性狀:

1. 外觀及性狀:

性質: 白色粉末。[139]

2. 結構式: 英文

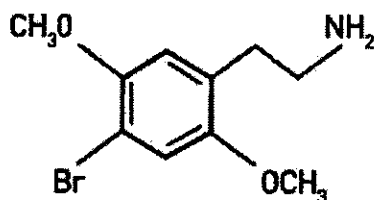
4-Bromo-2,5-dimethoxyphenethylamine

3. 分子式: $C_{10}H_{14}BrNO_2$

4. 分子量: 260.13

5. 熔點: 237-239°C

6. 結構圖:



藥理性質：

主要神經生化改變為其對血清胺和腎上腺接受體擁有部份促效劑之特性，也會扮演血清胺接受體競爭之拮劑。[140]

藥動學特性：

2C-B 攝取是 20 至 30 分鐘，高峰期發生的影響在 1.5 到 2 小時。的影響，可以長達 6-8 小時。主要代謝物為

4-bromo-2-hydroxy-5-methoxyphenethylamine。T1/2 約為 1.1 小時分布體積為 16L/kg。[141]

用途用法：

對 2C-B 產生劑量依賴性精神的效果。影響的閾值在大約 4 毫克劑量口服。有興奮與增加身體意識和增強接受視覺，聽覺，嗅覺，觸覺。口服劑量的 8 至 10 毫克，產生刺激的效果和事業的全面陶醉狀態。在劑量範圍內 20 至 40 毫克，產生迷幻劑一樣的幻覺。劑量大於 50 毫克，產生了極為可怕的幻覺和病態的幻想。[140]

危害及副作用：

智能損傷、視力下降、惡心感、失眠、肌肉緊縮、血壓增加、心悸、體溫上升、意識混亂等亦常見，甚至因肌肉緊縮導致磨牙不停。口服會帶來腸胃道不適，而用鼻吸食會引起鼻腔疼痛和呼吸道症狀。[140]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：於波長 294 nm 附近呈最大吸收。

(二)、氣相層析：

(三)、高效液相層析：使用 C18 ODS2 管柱，移動相 methanol:ammonium acetate buffer 0.05 m 包含 0.1% triethylamine, pH 3.9。[141]

管制狀況：

本國：第三級管制藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

導致使用者產生幻覺、空間改變、視覺扭曲、驚恐、幽閉恐懼感、妄想、情緒激動、憂鬱、嚴重焦慮，甚至精神、神經疾病；有人因有瀕死經驗因而精神崩潰。神經傷害是累積而成，所以使用者在初期使用並不自覺，當症狀出現時，傷害已成事實。[142]

成癮治療之方法與成效評估：

急性中毒時處理方式：

1、不誘導嘔吐。

2、使用活性炭。

2、抽搐時 diazepam 靜脈注射（劑量：成人：從 5 到 10 毫克。兒童： 0.2 至 0.5 毫克/公斤，重複每 5 分鐘視需要）或 lorazepam 靜脈注射（劑量：成人： 4 日至 8 毫克;兒童： 0.05 至 0.1 毫克/千克）。監測為低血壓，呼吸抑制，以及需要氣管插管。如果抽搐是無法控制或再次發生，考慮苯巴比妥。[142]

第三級管制藥品 — 硝甲西洋 (硝甲氮平) (Nimetazepam)

項次: 22

名稱:

1. 中文: 硝甲西洋 (硝甲氮平)
2. 英文: Nimetazepam
3. 俗稱: 一粒眠、K5
4. CAS 編號: 2011-67-8

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 5 毫克
3. 照片:



化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀: 淡黃色粉末。

溶解度: 可溶於氯仿、冰醋酸中, 不易溶於水、乙醇及乙醚中。[143]

2. 結構式: 英文

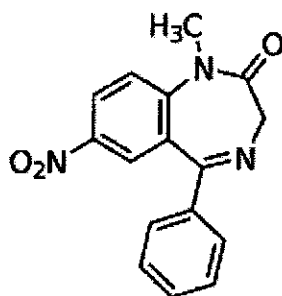
1,3-Dihydro-1-methyl-7-nitro-5-phenyl-1,4-benzodiazepin-2-one

3. 分子式: $C_{16}H_{13}N_3O_3$

4. 分子量: 295.3

5. 熔點: 156.5-157.5°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為，有強的安眠、抗焦慮、鎮靜及肌肉放鬆效果。

藥動學特性：

本品經口服吸收後於肝臟代謝，主要代謝物為 7-aminonimetazepam。本品代謝物由腎臟排除。[143]

用途用法：

劑型：錠劑

治療失眠：睡前口服使用 5 毫克。

危害及副作用：

使用本品可能有鎮靜、頭昏、手腳無力等現象。

腸胃道方面可能造成腸胃不適、噁心、嘔吐或口乾等情形。

長期使用本品可能有輕微的記憶喪失情形。[144]

檢驗方法：

一、紫外分光光度法：本品溶液於 265nm 有吸收。

二、質譜：分裂於 m/z 50、85、102、110、150、178、190、205、250、267、305。

三、氣相層析法。[143]

管制狀況：

本國：第三級管制藥品

多重濫用藥物併用：

加強中樞神經及呼吸系統之抑制作用：Amobarbital、Aprobarbital、Butobarbital、Codein、Fentanyl、Hydrocodone、Hydromophone、Kava、Meperidine、Morphine、Phenobarbital、Secobarbital。本品與酒精併用會增加鎮靜作用。[145]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

過量使用本品會影響中樞神經並造成呼吸抑制。病患會有矛盾的興奮，但單獨使用本品少見引起死亡。診斷主要依照過去病人是否曾使用過量或是觀察臨床表徵。另可投予 flumazenil 來診斷是否為過量使用。[146]

成癮治療之方法與成效評估：

1、大多數苯重氮基鹽類安眠劑之中毒只需要臨床上的觀察及支持性照護。

2、可使用活性碳清除腸胃內殘餘之藥物，不常利用洗胃。

3、不可催吐。

4、使用 flumazenil 可反轉嚴重的呼吸抑制或是心血管系統之併發症。但病

患有癲癇發作時禁忌使用 flumazenil。[146]

第四級管制藥品

第四級管制藥品 — 二丙烯基巴比妥 (Allobarbital)

項次: 1

名稱:

1. 中文: 二丙烯基巴比妥
2. 英文: Allobarbital
3. CAS 編號: 52-43-7

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 90~200 mg

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

性質: 白色結晶性粉末, 無臭, 味苦, 微溶於冷水, 溶於乙醇、氯仿等。[147]

2. 結構式: 英文

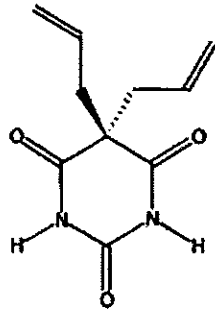
5,5-diprop-2-enyl-1,3-diazinane-2,4,6-trione

3. 分子式: $C_{10}H_{12}N_2O_3$

4. 分子量: 208.214

5. 熔點: 173°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為巴比妥類催眠藥、抗驚厥藥。中等作用時間（3~6小時），對中樞的抑制作用隨著劑量加大，表現為鎮靜、催眠、抗驚厥及抗癲癇。大劑量對心血管系統、呼吸系統有明顯的抑制。過量可麻痺延髓呼吸中樞致死。體外電生理實驗本類藥物使神經細胞的氯離子通道開放，細胞過極化，擬似 γ -氨基丁酸(GABA)的作用。治療濃度的二丙烯基巴比妥可降低谷氨酸的興奮作用、加強 γ -氨基丁酸的抑制作用，抑制中樞神經系統單突觸和多突觸傳遞，抑制癲灶的高頻放電及其向周圍擴散。可減少胃液分泌，降低胃張力。可產生依賴性，包括精神依賴和身體依賴。[148]

藥動學特性：

口服後在消化道吸收迅速，15~30分鐘生效，約維持3~6小時。吸收後分佈於體內各組織及體液中，因本品脂溶性高，易通過血腦屏障，進入腦組織，起效比較快。10~35%以原形緩慢經由尿液排出，大約一星期才可將藥物以原形狀態完全排出。[147]

用途用法：

錠劑

每日劑量給予 90~200 mg。

危害及副作用：

- 1、用於抗癲癇時最常見的不良反應為鎮靜，但隨著療程的持續，其鎮靜作用逐漸變得不明顯。
- 2、可能引起微妙的情感變化，出現認知和記憶的缺損。
- 3、長期用藥，偶見葉酸缺乏和低鈣血症。
- 4、罕見巨幼紅細胞性貧血和骨軟化。
- 5、大劑量時可產生眼球震顫、共濟失調和嚴重的呼吸抑制。
- 6、用本品的患者中約 1~3%的人出現皮膚反應，多見者為各種皮疹以及哮喘，嚴重者可出現剝脫性皮炎和多形紅斑（或 Stevens—Johnson 綜合症），中毒性表皮壞死極為罕見。
- 7、有報導用藥者出現肝炎和肝功能紊亂。
- 8、長時間使用可發生藥物依賴，停藥後易發生停藥綜合症。[149]

檢驗方法：

- (一)、紫外分光光度法：將本品溶於乙醇與鹼性硼酸緩衝液(pH9.2)之混液(1→20)所成溶液(1→100,000)，按照紫外線吸光度測定法測定之，於波長

241nm 附近呈最大吸收。 溶於 1M 氫氧化鈉(pH13) ，於波長 256nm 附近呈最大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1687、1315、925、1219、847、1640 cm^{-1} 的位置。

(四)質譜分析：分裂於 m/z 41、167、124、39、80、53、68、141。 [147]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Adinazolam、Alfentanil、Alprazolam、
Amobarbital、Aprobarbital、Bromazepam、Brotizolam、Butabarbital、Butalbital、
Calamus、Cannabis、Clobazam、Clonazepam、Clorazepate、Codeine、
Diazepam、Estazolam、Ethchlorvynol、Fentanyl、Flunitrazepam、Flurazepam、
Halazepam、Hydrocodone、Hydromorphone、Ketazolam、Levorphanol、
Lorazepam、Lormetazepam、Medazepam、Meperidine、Mephenesin、
Mephobarbital、Meprobamate、Metaxalone、Midazolam、Morphine、
Nitrazepam、Nordazepam、Oxazepam、
Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Prazepam、

Secobarbital、Temazepam、Thiopental、Triazolam。本品與酒精併服時：過度中樞神經抑制作用，且作用快速。[150]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

過量藥物可能引起昏迷、嚴重的呼吸和心血管抑制、低血壓和休克繼而引發腎功能衰竭、死亡。深度呼吸抑制是急性中毒的直接死亡原因。可致嚴重中毒，中毒血藥濃度為 5 mg/100ml。解救措施中最重要的是維持呼吸和迴圈功能，施行有效的人工呼吸，必要時行氣管切開，並輔之以有助於維持和改善呼吸和迴圈的相應藥物。經口服中毒者，在 3~5 小時內可用高錳酸鉀 (1:2000) 溶液洗胃。用 10~15 g 硫酸鈉溶液導泄 (禁用硫酸鎂)。為加速排泄可給甘露醇等滲透壓利尿藥，如腎功能正常可用速尿。可用碳酸氫鈉、乳酸鈉鹼化尿液加速排泄，嚴重者可透析。極度過量時，大腦一切電活動消失，腦電圖變為一條平線，並不一定代表為臨床死亡，若不併發缺氧性損害，尚有挽救的希望。[151]

成癮治療之方法與成效評估：

1. 輕度中毒 頭痛、眩暈、乏力、語言不清、嗜睡、視物模糊、眼球震顫、瞳孔縮小 噁心、嘔吐，各種形態的皮疹，呼吸稍快，血壓正常或偏低，還可引起陰莖水腫。
2. 重度中毒 開始病人可表現狂躁、驚厥、四肢強直；繼而進入抑制期，

出現瞳孔散大（對光反射存在），全身馳緩，淺反射消失，脈搏細速，血壓下降，尿少或尿閉，中毒性肝炎等表現；最後可因呼吸抑制或因嘔吐物吸入而發生窒息而死亡。

會導致戒斷症狀的中樞神經系統的刺激，如焦慮或煩躁不安和麻煩，睡覺，這可能會導致驚厥和幻覺。這些症狀可能出現在使用後 5 至 15 天。

（一）洗胃

（二）促進毒物排泄

1、快速輸液 2、利尿脫水 3、導瀉 4、血液透析 5、鹼化尿液

（三）中樞興奮劑的應用

僅適用於重度中毒者、呼吸高度抑制者及昏迷患者。[152]

第四級管制藥品 — 阿普唑他 (Alprazolam)

項次: 2

名稱:

1. 中文: 阿普唑他
2. 英文: Alprazolam
3. CAS 編號: 28981-97-7

製劑:

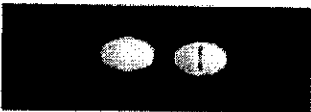
1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 0.25 mg / 0.5 mg / 1.0 mg
3. 照片:



Trade Name: Xanax
Controlled Ingredient: alprazolam,
0.25 mg



Trade Name: Xanax
Controlled Ingredient: alprazolam,
0.5 mg



Trade Name: Xanax
Controlled Ingredient: alprazolam,
1.0 mg

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

性質：白色結晶性粉末，不溶於水，略溶於丙酮，可溶於氯仿、二氯甲烷。[153]

2. 結構式:英文

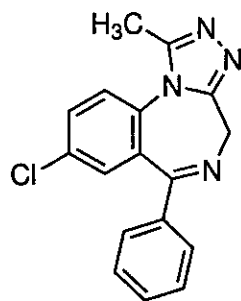
8-chloro-1-methyl-6-phenyl-4H-[1,2,4]triazolo[4,3-a][1,4]benzodiazepine

3. 分子式: $C_{17}H_{13}ClN_4$

4. 分子量: 308.765

5. 熔點: 228~228.5°C

6. 結構圖:



藥理性質：

苯二氮平類為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調

節細胞的放電，主要起氯通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氯通道開放，使氯離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氯通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氯離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。

①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。

②遺忘作用：地西洋和蘿拉西洋在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。

③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。

④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。地西洋由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。[154]

藥動學特性：

口服易吸收，達峰時間 1~2h，頓服 0.5~3.0 ng，峰濃度為 8~37 ng/ml。

T_{1/2} 為 12~15h，主要代謝產物為 α-hydroxyalprazolam 和 benzophenone，前者的生物活性為原藥的 1/2，後者無活性。血漿蛋白結合率為 80%，80% 藥物從尿中排泄。[155]

用途用法：

成人常用量口服。

抗焦慮：開始一次 0.4 mg，一日 3 次，用量按需遞增。最大限量一日可達 4 mg。

鎮靜催眠：睡前服 0.4—0.8 mg。

老年和體弱患者開始用小量，一次 0.2 mg，一日 3 次，逐漸遞增至最大耐受量。

抗恐懼 0.4 mg：一日 3 次，需要時逐漸增加劑量，每日最大量可達 10 mg。

[156]

危害及副作用：

可能會發生在病人和更有可能較高的劑量。過敏反應的發生，如蕁麻疹，呼吸困難，腫脹的臉，嘴唇。醫療也應注意要求立即跡象，如果黃疸出現，如泛黃的皮膚或眼睛。其他副作用可能發生的內容如下：

昏睡

下跌禁忌，沒有恐懼的危險（風險增加行為）

抑鬱情緒與思想的自殺或自我傷害

幻覺，情緒和敵意

感覺頭暈，輕為首的或昏厥

小便比平時少或沒有在所有

頭痛，疲勞，關節痛及不尋常的弱點（流感樣症狀）

言語問題，

完整的記憶喪失，（失憶症）和濃度的問題

胃口的變化（包括變化的重量）

視力模糊，不穩定和（受損的協調和平衡）

便秘，腹瀉，噁心和嘔吐

減少性別驅動器

口乾或增加

緊張，不安，失眠和出汗

的衝擊，在胸部或快速的心跳

皮膚炎症

肌肉抽搐，震顫及檢取（驚厥）[157]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：酸性溶液中於波長 260 nm 附近呈最大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1490、1610、697、1316、1540、827 cm^{-1} 的位置。

(四)質譜分析：分裂於 m/z 308、279、204、273、77、307、310。[158]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、Butobarbital、Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、Hydromorphone、Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、Thiopental。

增加本品的生體可用率及藥理作用：Ergotamine。本品與酒精併服時：增加催眠、鎮靜效果，且作用快速。[159]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

阿普唑他和其他的苯二氮類藥物戒斷症狀後，長期治療和停止應做的時期內逐漸個月（或長達一年），以避免嚴重的戒斷症狀，如焦慮，恐慌襲擊，反彈的焦慮，肌肉痙攣和癲癇發作。治療的病人與阿普唑他或其他苯二氮類藥物為廣泛性焦慮症的發現戒斷症狀，如日益嚴重的焦慮。

病人服用一劑量大於 4 毫克，每天有一個上升的潛力依賴。這可能會導致

藥物戒斷症狀，在某些情況下已知會導致癲癇發作。停止服藥，這也可能導致反應的所謂反彈的焦慮。其他戒斷的影響，報告從中斷阿普唑他治療，包括殺人的意念，憤怒的反應，增加惡夢，和侵入的想法。

使用本品採取在一個固定劑量 8-9 週後，已發現突發性中斷過程中發生以下症狀：情緒低落，疲勞，能耗低，混亂，收縮壓升高的壓力，嚴重的焦慮。

當病人終止使用，他們可能會遇到的症狀他們，然後才採取藥物治療。症狀也可能伴隨其他的反應，包括情緒的變化，焦慮，或睡眠。反彈的焦慮，通常是因突然停止遇到這些症狀。

身體依賴性是主要限制因素對長期使用阿普唑他和其他苯二氮類藥物。

苯二氮類戒斷症狀的經驗嚴重性因素，在劑量減少阿普唑他，包括：劑量、長度使用、頻率、停藥方法。 [159]

成癮治療之方法與成效評估：

催吐：吐根使用

活性炭吸收：使用最低 240 毫升的水百分之三十克活性碳。

洗胃

監測病人：監測生命體徵

減少呼吸功能：成人 Flumazenil- 0.2-3 mg。Flumazenil 拮抗中樞神經系統

的苯二氮類藥物作用，逆轉的苯二氮類的鎮靜作用。

血壓過低： 0.9% NaCl 10-20 ml/kg 靜脈注射, dopamine, norepinephrine。

[160]

第四級管制藥品 — 二乙胺苯丙酮 (Amfepramone)

項次: 3

名稱:

1. 中文: 二乙胺苯丙酮
2. 英文: Amfepramone
3. CAS 編號: 90-84-6

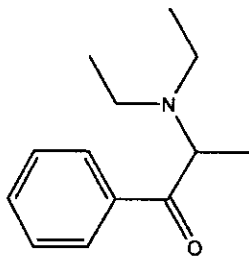
製劑:

1. 劑型: 錠劑。又名: Diethylpropion
2. 劑量: 緩釋錠 75 mg。立即釋放錠 25 mg

化學性狀:

1. 外觀及性狀: 白色至灰白色結晶性粉末。溶於水、氯仿、乙醇。[161]
2. 結構式: 2-diethylamino-1-phenyl-propan-1-one
3. 分子式: $C_{13}H_{19}NO$
4. 分子量: 205.30
5. 熔點: $175^{\circ}C$

6. 結構圖:



藥理性質：

藥理特性與安非他命類似。雖然確切的作用機轉尚未建立，被認為食慾抑制的產生是藉由刺激興奮作用在腦視丘下部和邊緣地區的飽足中心。

繼發作用包括中樞神經興奮作用和血壓升高。主要作用於腎上腺素激導性即似交感神經作用途徑，增加正腎上腺素從神經末梢釋放並抑制其再攝取，因此被認為是間接的擬交感神經興奮作用。有證據顯示，可能也對神經末梢提供一些直接刺激興奮作用產生藥理反應。[162]

藥動學特性：

半衰期 4~6 小時。藥物會經由腎臟排除，有 3~6% 為原形未經代謝，已代謝的藥佔了 64~67%。[163]

用途用法：

用於治療肥胖：

口服劑量（立即釋放錠）

成人：推薦劑量是每次 25 毫克每日 3 次，餐前一小時服用。25 毫克錠劑一錠也可能在晚上中段時間給予，克服夜間飢餓。

口服劑量（緩釋錠）：

成人：推薦劑量為 75 毫克每日 1 次，在上午中段時間給予。[164]

危害及副作用：

心血管效應:最常見的心血管效應為心悸、輕度心跳過速、輕度血壓升高。

皮膚效應:與蕁麻疹、皮疹、瘀血、紅斑和脫髮相關，嚴重的皮膚病可能會出現在慢性中毒的興奮劑濫用者。

胃腸道效應:便秘和口乾似乎是最常見的副作用。

神經系統效應: 最常見的副作用，似乎是躁動。其他包括緊張，眩暈，失眠，焦慮，欣快感，憂鬱，頭痛，震顫。

眼睛效應: 視力模糊和散瞳。

精神效應: 精神異常。[165]

管制狀況：

本國: 第四級管制藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀):

聯合國國際麻醉藥品管制委員會 2007 年 3 月 1 日發表調查報告指出，巴西是全球減肥藥品濫用最嚴重的國家，而且是兩種具有潛在危險性減肥藥品的最大生產者，其中之一為 amfepramone；急性過量則引起恐慌狀態、攻擊暴力行為、幻覺、驚厥、昏迷甚至死亡。濫用可能性低與在治療劑量和 amphetamines 比較產生欣快感程度較低有關。

長期濫用可導致特徵為妄想、刻板行為、聽覺和視覺幻覺的精神病。

長期濫用突然停藥可導致慢性疲勞典型症狀(精神抑鬱、虛弱、震顫、和胃腸道受到干擾)，其次是睏倦和長期睡眠或昏睡；精神異常反應也可能發生。

[166]

成癮治療之方法與成效評估：

兒童服用少於 1 毫克/公斤的有沒有相關性顯著的毒性。不過兒童症狀使用劑量約 2 至 4 毫克/公斤。不過，臨床觀察的到毒性作用是比預估攝入更高劑量。鼻內濫用已造成死亡的。

過量使用本品時治療方法：

- 1、生命支持：支持呼吸系統和心血管功能。
- 2、監測：
 - a 監測心率和血壓。
 - b 監測為體溫 40 度以上危及生命，立即降低體溫和鎮靜。
 - c 監測血清電解質，腎功能，酸鹼平衡，肝酶的病人有顯著的毒性。
 - d 在哌醋甲酯的無法尿液檢測濫用藥物。
- 3、使用吐根誘導嘔吐是不推薦，由於潛在的藥物量和心臟併發症。
- 4、使用活性炭吸收。使用最低 240 毫升的水百分之三十克活性碳。[66]

第四級管制藥品 — 阿米雷斯 (Aminorex)

項次: 4

名稱:

1. 中文: 阿米雷斯
2. 英文: Aminorex
3. CAS 編號: 2207-50-3

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

性質: 白色結晶性粉末。[167]

2. 結構式: 英文

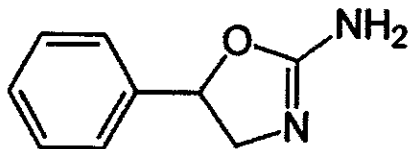
5-phenyl-4,5-dihydro-1,3-oxazol-2-amine

3. 分子式: $C_9H_{10}N_2O$

4. 分子量: 162.19

5. 熔點: 136-138 °C

6. 結構圖:



藥理性質：

擬交感神經藥,與苯丙胺類似，作用較弱，作用於下丘腦飽感中樞，並影響糖代謝致食欲減退，體重下降。[1]

藥動學特性：

在人體無相關研究資料。在馬中，注射藥品後， $T_{1/2}$ 約為 18.82 (8.13 ~ 46.64) 小時；口服後， $T_{1/2}$ 約為 23.57 (15.16 ~ 47.45)。[168]

用途用法：

治療肥胖症減少食慾。

危害及副作用：

心臟瓣膜病變和原發性肺動脈高壓。口乾、上腹部不適、出汗、興奮、失眠、心動過速、血壓升高、長期服用可產生精神和身體依賴。[167]

檢驗方法：

(一)、質譜分析：分裂於 M^+ peak：162 m/z ，CONH₂ fragment：118 m/z ，protonated benzyl alcohol $m/z = 107$ 。tropylium ion：91 m/z ，phenyl cation：77 m/z ，NH₂-C=N-CH₂⁺：56 m/z 。[168]

(二)、氣相層析法：

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

長期高劑量治療突然中斷後，可能會導致抑鬱症和疲勞。

通常在數週後出現藥物依賴現象，如果這樣應當停止。

成癮治療之方法與成效評估：

在長期使用可能導致嚴重的性皮炎，失眠，煩躁不安，多動，性格變化，

思覺失調。一般可以停止藥物幾天或幾週後解決這些問題。

急性中毒時處理方式：

1、不誘導嘔吐。

2、使用活性炭。

2、抽搐時 diazepam 靜脈注射（劑量：成人：從 5 到 10 毫克。兒童： 0.2

至 0.5 毫克/公斤，重複每 5 分鐘視需要）或 lorazepam 靜脈注射（劑量：

成人： 4 日至 8 毫克；兒童： 0.05 至 0.1 毫克/千克） 。監測為低血壓，呼

吸抑制，以及需要氣管插管。如果抽搐是無法控制或再次發生，考慮苯巴

比妥。 [169]

第四級管制藥品 — 巴比妥 (Barbital)

項次: 5

名稱:

1. 中文: 巴比妥
2. 英文: Barbital
3. CAS 編號: 57-44-3

製劑:

1. 劑型: 錠劑

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

性質: 白色結晶粉末。無臭微苦。在空氣中穩定。微溶于水, 溶於熱水和乙醇, 易溶於鹼性溶液。[170]

2. 結構式: 英文

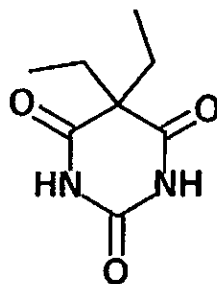
5,5-diethyl-1,3-diazinane-2,4,6-trione Ethylbarbital

3. 分子式: $C_8H_{12}N_2O_3$

4. 分子量: 184.193

5. 熔點: 189~191°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為巴比妥類催眠藥、抗驚厥藥。長時作用時間（10~12 小時），對中樞的抑制作用隨著劑量加大，表現為鎮靜、催眠、抗驚厥及抗癲癇。大劑量對心血管系統、呼吸系統有明顯的抑制。過量可麻痺延髓呼吸中樞致死。體外電生理實驗本類藥物使神經細胞的氯離子通道開放，細胞過極化，擬似 γ -氨基丁酸(GABA)的作用。治療濃度的巴比妥可降低谷氨酸的興奮作用、加強 γ -氨基丁酸的抑制作用，抑制中樞神經系統單突觸和多突觸傳遞，抑制癲灶的高頻放電及其向周圍擴散。可減少胃液分泌，降低胃張力。可產生依賴性，包括精神依賴和身體依賴。[171]

藥動學特性：

口服後在消化道吸收迅速，15~30 分鐘生效，約維持 10~12 小時。吸收後分佈於體內各組織及體液中，因本品脂溶性高，易通過血腦屏障，進入腦組織，起效比較快。血漿中蛋白結合少於 20%， $T_{1/2}$ 約為兩天，血藥濃度達峰時間，個體差異大。在起始的 8 小時內只有約 2%的藥物以原形經尿液排出，16%會在 32 小時內排出，其餘藥物可能在十六天後還可以在尿液中

存在。[170]

用途用法：

口服使用,催眠：300-600 mg。

鎮靜：100-200 mg。

極量 600 mg，一天最多服用 1 g。

危害及副作用：

- 1、用於抗癲癇時最常見的不良反應為鎮靜，但隨著療程的持續，其鎮靜作用逐漸變得不明顯。
- 2、可能引起微妙的情感變化，出現認知和記憶的缺損。
- 3、長期用藥，偶見葉酸缺乏和低鈣血症。
- 4、罕見巨幼紅細胞性貧血和骨軟化。
- 5、大劑量時可產生眼球震顫、共濟失調和嚴重的呼吸抑制。
- 6、用本品的患者中約 1~3%的人出現皮膚反應，多見者為各種皮疹以及哮喘，嚴重者可出現剝脫性皮炎和多形紅斑（或 Stevens—Johnson 綜合症），中毒性表皮壞死極為罕見。
- 7、有報導用藥者出現肝炎和肝功能紊亂。
- 8、長時間使用可發生藥物依賴，停藥後易發生停藥綜合症。[172]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：將本品溶於乙醇與鹼性硼酸緩衝液(pH9.2)之混液(1→20)所成溶液(1→100,000)，按照紫外線吸光度測定法測定之，於波長239nm附近呈最大吸收。溶於1M 氫氧化鈉(pH13)，於波長254nm附近呈最大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於1680、1720、1767、1320、1245、875 cm^{-1} 的位置。

(四)質譜分析：分裂於 m/z 156、141、55、155、98、39、82、43。[170]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Adinazolam、Alfentanil、Alprazolam、Amobarbital、Aprobarbital、Bromazepam、Brotizolam、Butabarbital、Butalbital、Calamus、Cannabis、Clobazam、Clonazepam、Clorazepate、Codeine、Diazepam、Estazolam、Ethchlorvynol、Fentanyl、Flunitrazepam、Flurazepam、Halazepam、Hydrocodone、Hydromorphone、Ketazolam、Levorphanol、Lorazepam、Lormetazepam、Medazepam、Meperidine、Mephesisin、

Mephobarbital、Meprobamate、Metaxalone、Midazolam、Morphine、
Nitrazepam、Nordazepam、Oxazepam、
Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Prazepam、
Secobarbital、Temazepam、Thiopental、Triazolam。本品與酒精併服時：過
度中樞神經抑制作用，且作用快速。[173]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

過量藥物可能引起昏迷、嚴重的呼吸和心血管抑制、低血壓和休克繼而引
發腎功能衰竭、死亡。深度呼吸抑制是急性中毒的直接死亡原因。可致嚴
重中毒，中毒血藥濃度為 2 mg/100ml，致死的血藥濃度為 9 mg/100ml。解
救措施中最重要的是維持呼吸和迴圈功能，施行有效的人工呼吸，必要時
行氣管切開，並輔之以有助於維持和改善呼吸和迴圈的相應藥物。經口服
中毒者，在 3~5 小時內可用高錳酸鉀（1：2000）溶液洗胃。用 10~15 g 硫
酸鈉溶液導泄（禁用硫酸鎂）。為加速排泄可給甘露醇等滲透壓利尿藥，如
腎功能正常可用速尿。可用碳酸氫鈉、乳酸鈉鹼化尿液加速排泄，嚴重者
可透析。極度過量時，大腦一切電活動消失，腦電圖變為一條平線，並不
一定代表為臨床死亡，若不併發缺氧性損害，尚有挽救的希望。[174]

成癮治療之方法與成效評估：

1、輕度中毒 頭痛、眩暈、乏力、語言不清、嗜睡、視物模糊、眼球震顫、

瞳孔縮小 噁心、嘔吐，各種形態的皮疹，呼吸稍快，血壓正常或偏低，還可引起陰莖水腫。

2、重度中毒 開始病人可表現狂躁、驚厥、四肢強直；繼而進入抑制期，出現瞳孔散大（對光反射存在），全身遲緩，淺反射消失，脈搏細速，血壓下降，尿少或尿閉，中毒性肝炎等表現；最後可因呼吸抑制或因嘔吐物吸入而發生窒息而死亡。

會導致戒斷症狀的中樞神經系統的刺激，如焦慮或煩躁不安和麻煩，睡覺，這可能會導致驚厥和幻覺。這些症狀可能出現在使用後 5 至 15 天。

（一）洗胃

（二）促進毒物排泄

1、快速輸液 2、利尿脫水 3、導瀉 4、血液透析 5、鹼化尿液

（三）中樞興奮劑的應用

僅適用於重度中毒者、呼吸高度抑制者及昏迷患者。[175]

第四級管制藥品 — 甲苯異丙胺(Benzphetamine)

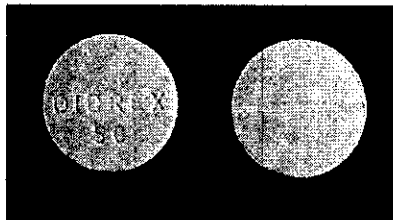
項次: 6

名稱:

4. 中文: 甲苯異丙胺
5. 英文: Benzphetamine
6. CAS 編號: 156-08-1

製劑:

3. 劑型: 錠劑
4. 劑量: 50 毫克
5. 照片:

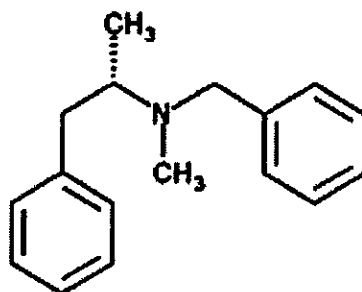


化學性狀:

1. 外觀及性狀: 液態, 不溶於水, 但可溶於甲醇、乙醇、氯仿、丙酮、
苯, 乙醚。[176]
2. 結構式: N-benzyl-N-methyl-1-phenyl-propan-2-amine
3. 分子式: $C_{17}H_{21}N$
4. 分子量: 239.355

5. 沸點：127°C

6. 結構圖：



藥理性質：

本品屬於安非他命類藥物，主要作用在中樞系統，能增加血壓，藉著神經傳導物質的改變而減少饑餓感或增加飽食感。adrenergic 類：作用在腎上腺素、正腎上腺素系統，增加這些神經傳導物質在腦中的可利用率而抑制食慾（作用於下視丘而抑制食慾），這類藥物還包括 benzphetamine, phendimetrazine, phentermine, mazindol, diethylpropion 及 phenylpropanolamine 等。[176]

藥動學特性：

蛋白質結合率 75-99% 口服之後可以快速的被人體吸收，且主要以 amphetamine 和 metamphetamine 的形式排出到尿液中。大部分的 Benzphetamine 在體內會被代謝成 desmethylbenzphetamine，其副產物（p-hydroxy-N-benzylamphetamine glucuronide 和 p-hydroxy-benzphetamine glucuronide）也會被分泌到尿液，只有極少部分未經代謝的 Benzphetamine 會被分泌進入尿液中。[176]

用途用法：

每日用量在 25~150mg 的 benzphetamine hydrochloride。[176]

危害及副作用：

失眠、焦慮、易怒、頭痛、噁心、便秘、血壓升高。[176]

檢驗方法：

1. 呈色分析：Marquis Test—橘色。
2. 紫外分光光度法：本品溶於酸性水溶液中於 252、258nm 有較強的吸收。
3. 氣相層析法
4. 紅外線光譜法：以 KBr 錠法檢測本品，主峰出現在 1497、740、698、1028、1125、1220 cm^{-1} 處。
5. 質譜分析：分裂於 m/z 91、148、149、65、92、42、56、39。[177]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

高血壓，有藥物依賴性或酒精中毒的記錄，孕婦應小心使用。情緒不穩患者，會發生慢性濫用藥物。逐漸停藥以避免嚴重抑鬱症狀或精神病行為發生。治療期間，固定監測血壓、體重，在長期治療期間，定期做血球計數。治療初期會發生神經質和失眠，但會隨時間而減輕，然而可能需要減低劑

量。[178]

成癮治療方法：

過量使用本品時治療方法：

1、生命支持：支持呼吸系統和心血管功能。

2、監測：

a 監測心率和血壓。

b 監測為體溫 40 度以上危及生命，立即降低體溫和鎮靜。

c 監測血清電解質，腎功能，酸鹼平衡，肝酶的病人有顯著的毒性。

抽搐時 diazepam 靜脈注射（劑量：成人：從 5 到 10 毫克。兒童： 0.2 至 0.5 毫克/公斤，重複每 5 分鐘視需要）或 lorazepam 靜脈注射（劑量：成人：4 日至 8 毫克；兒童： 0.05 至 0.1 毫克/千克）。監測為低血壓，呼吸抑制，以及需要氣管插管。如果抽搐是無法控制或再次發生，考慮苯巴比妥。[179]

第四級管制藥品 — 溴西洋 (溴氮平) (Bromazepam)

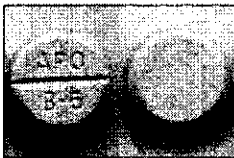
項次: 7

名稱:

1. 中文: 溴西洋 (溴氮平)
2. 英文: Bromazepam
3. CAS 編號: 1812-30-2

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 6 mg
3. 照片:



化學性狀:

1. 外觀及性狀:

性質: 白色或微黃結晶性粉末, 不溶於水, 略溶於乙醇、二氯甲烷。

[180]

2. 結構式: 英文

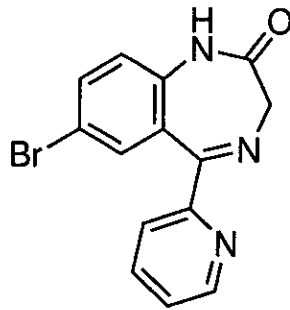
9-bromo-6-pyridin-2-yl-2,5-diazabicyclo[5.4.0]undeca-5,8,10,12-tetraen-3-one

3. 分子式: $C_{14}H_{10}BrN_3O$

4. 分子量: 316.2

5. 熔點: 237~238.5°C

6. 結構圖:



藥理性質：

苯二氮平類為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體

的結合或易化 GABA 受體與氯離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。[181]

藥動學特性：

口服吸收較快，1~4 小時血藥濃度達峰值，屬短至中等半衰期苯二氮平類藥。本品血漿蛋白結合率約為 70%，T_{1/2} 為 8~20 小時。重複用藥蓄積甚少，本品在肝臟代謝成 3-hydroxy-bromazepam、3-hydroxybenzoylpyridine 與葡萄糖醛酸根結合後經尿液排出，僅 2%~3% 以原形從尿液排出。[182]

用途用法：

主要用於抗焦慮，亦可用于鎮靜催眠。口服一日 3—18 mg，分次服，按反應和病情調整劑量；老年體弱者由每日 3 mg 開始，按需調整劑量。[183]

危害及副作用：

較少見的不良反應有；精神混亂，情緒抑鬱，頭痛、噁心、嘔吐、排尿障礙等。

老年、體弱、幼兒、肝病和低蛋白血症患者，對本類藥的中樞性抑制較敏感。注射用藥時容易引起呼吸抑制、低血壓、肌無力、心動過緩或心跳停止；高齡衰老、危重、肺功能不全以及心血管功能不穩定等患者，靜注過速或與中樞抑制藥合用時，發生率更高，情況也更嚴重。持續的精神紊亂，嗜睡深沉，震顫，持續的說話不清，站立不穩，心動過緩，呼吸短促或困難，嚴重的肌無力。[184]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：酸性溶液中於波長 239、345 nm 附近呈較大吸收。鹼性溶液中於波長 237、348 nm 附近呈較大吸收。甲醇溶液中於波長 233、320 nm 附近呈較大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1685、825、750、802、1315、1230

cm⁻¹ 的位置。

(四)質譜分析：分裂於 m/z 265、317、315、288、316、286、208、78。

3-hydroxy-bromazepam 分裂於 m/z 79、78、52、105、304、314、316、51。

[185]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、

Butabarbital、Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、

Hydromorphone、Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、

Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、

Thiopental。增加本品的生體可用率及藥理作用：Ergotamine。本品與酒精

併服時：增加催眠、鎮靜效果，且作用快速。[186]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

突然停藥後要注意可能發生撤藥症狀。一般半衰期短或中等的本類藥，停

藥後 2—3 天出現，半衰期長者則在停藥後 10—20 天發生。戒斷症狀：較

多見的為睡眠困難，異常的激惹狀態和神經質；較少見或罕見的有腹部或

胃痙攣、精神錯亂、驚厥、肌肉痙攣、噁心或嘔吐、顫抖、異常的多汗。

嚴重的戒斷症狀比較多見於長期服用過量的患者。也有曾在連續服用，血

藥濃度一直保持在安全有效範圍內，幾個月後突然停藥而發生。失眠反跳現象、神經質、激惹，多數病人為長時期單次夜間服藥，戒斷後發生。半衰期短的停藥後發生快而嚴重。[186]

成癮治療之方法與成效評估：

催吐：吐根使用

活性炭吸收：使用最低 240 毫升的水百分之三十克活性碳。

洗胃。

監測病人：監測生命體徵。

減少呼吸功能：成人 Flumazenil- 0.2-3 mg。Flumazenil 拮抗中樞神經系統的苯二氮類藥物作用，逆轉的苯二氮類的鎮靜作用。

血壓過低： 0.9% NaCl 10-20ml/kg 靜脈注射, dopamine, norepinephrine。

[187]

第四級管制藥品 — 丁巴比妥(Butobarbital)

項次: 8

名稱:

1. 中文: 丁巴比妥
2. 英文: **Butobarbital**
3. CAS 編號: 77-28-1

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

性質: 白色結晶性粉末, 無臭, 味苦, 不溶於水, 溶於乙醇、乙醚。

[188]

2. 結構式: 英文

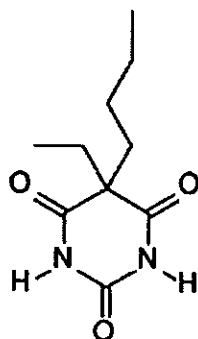
5-butyl-5-ethyl-1,3-diazinane-2,4,6-trione

3. 分子式: $C_{10}H_{16}N_2O_3$

4. 分子量: 212.246

5. 熔點: 124~127°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為巴比妥類催眠藥、抗驚厥藥。中等作用時間（3~6 小時），對中樞的抑制作用隨著劑量加大，表現為鎮靜、催眠、抗驚厥及抗癲癇。大劑量對心血管系統、呼吸系統有明顯的抑制。過量可麻痹延髓呼吸中樞致死。體外電生理實驗本類藥物使神經細胞的氯離子通道開放，細胞過極化，擬似 γ -氨基丁酸(GABA)的作用。治療濃度的丁巴比妥可降低谷氨酸的興奮作用、加強 γ -氨基丁酸的抑制作用，抑制中樞神經系統單突觸和多突觸傳遞，抑制癲癇灶的高頻放電及其向周圍擴散。可減少胃液分泌，降低胃張力。可產生依賴性，包括精神依賴和身體依賴。[189]

藥動學特性：

口服後在消化道吸收迅速，15~30 分鐘生效，約維持 3~6 小時。吸收後分佈於體內各組織及體液中，因本品脂溶性高，易通過血腦屏障，進入腦組織，起效比較快。血漿中蛋白結合約 26%， $T_{1/2}$ 約為 40 小時，血藥濃度達峰時間，個體差異大。本品在肝臟代謝成 3'-hydroxy、3'-oxo、3'-carboxypropyl 代謝物，5%以原形、22%~28%以 3'-hydroxybutobarbital、14%~18%以 3'-oxobutobarbital、4%~8%以 5-(3'-carboxypropyl)-5-ethylbituric acid 經由尿液排出。[188]

用途用法：

口服使用，催眠 100~200 mg 睡前服用。

危害及副作用：

- 1、可能引起微妙的情感變化，出現認知和記憶的缺損。
- 2、長期用藥，偶見葉酸缺乏和低鈣血症。
- 3、罕見巨幼紅細胞性貧血和骨軟化。
- 4、大劑量時可產生眼球震顫、共濟失調和嚴重的呼吸抑制。
- 5、用本品的患者中約 1~3%的人出現皮膚反應，多見者為各種皮疹以及哮喘，嚴重者可出現剝脫性皮炎和多形紅斑（或 Stevens—Johnson 綜合症），中毒性表皮壞死極為罕見。
- 6、肝炎和肝功能紊亂。
- 7、長時間使用可發生藥物依賴，停藥後易發生停藥綜合症。[190]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：將本品溶於乙醇與鹼性硼酸緩衝液(pH9.2)之混液(1→20)所成溶液(1→100,000)，按照紫外線吸光度測定法測定之，於波長 239nm 附近呈最大吸收。溶於 1M 氫氧化鈉(pH13)，於波長 254nm 附近呈最大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1696、1727、1760、1242、850、1215 cm^{-1} 的位置。

(四)質譜分析：分裂於 m/z 141、156、41、55、98、39、142、155。代謝物 3'-hydroxybutobarbitone m/z 156、141、45、157、41、29、55、27。[188]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Adinazolam、Alfentanil、Alprazolam、Amobarbital、Aprobarbital、Bromazepam、Brotizolam、Butabarbital、Butalbital、Calamus、Cannabis、Clobazam、Clonazepam、Clorazepate、Codeine、Diazepam、Estazolam、Ethchlorvynol、Fentanyl、Flunitrazepam、Flurazepam、Halazepam、Hydrocodone、Hydromorphone、Ketazolam、Levorphanol、Lorazepam、Lormetazepam、Medazepam、Meperidine、Mephesisin、Mephobarbital、Meprobamate、Metaxalone、Midazolam、Morphine、Nitrazepam、Nordazepam、Oxazepam、Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Prazepam、Secobarbital、Temazepam、Thiopental、Triazolam。本品與酒精併服時：過度中樞神經抑制作用，且作用快速。[191]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

與短期治療具耐受性，治療效果鎮靜催眠，發生更迅速。不幸的是，由於耐受性增加治療指數降低。可能引起昏迷、嚴重的呼吸和心血管抑制、低血壓和休克繼而引發腎功能衰竭、死亡。深度呼吸抑制是急性中毒的直接死亡原因。[192]

成癮治療之方法與成效評估：

會導致戒斷症狀的中樞神經系統的刺激，如焦慮或煩躁不安和麻煩，睡覺，這可能會導致驚厥和幻覺。這些症狀可能發生在使用後 5 至 15 天。

(一) 洗胃

(二) 促進毒物排泄

1、快速輸液 2、利尿脫水 3、導瀉 4、血液透析 5、鹼化尿液

(三) 中樞興奮劑的應用

僅適用於重度中毒者、呼吸高度抑制者及昏迷患者。[193]

第四級管制藥品 — 卡嗎西洋 (卡氮平) (Camazepam)

項次: 9

名稱:

1. 中文: 卡嗎西洋 (卡氮平)
2. 英文: Camazepam
3. CAS 編號: 36104-80-0

製劑:

1. 劑型: 錠劑

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

性質: 白色結晶性粉末, 易溶於酒精; 可溶於水。[194]

2. 結構式: 英文

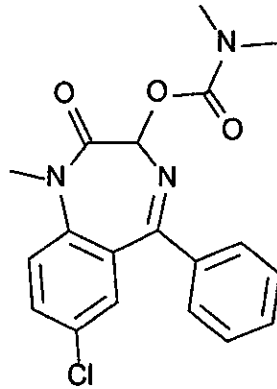
(9-chloro-2-methyl-3-oxo-6-phenyl-2,5-diazabicyclo[5.4.0]undeca-5,8,
10,12-tetraen-4-yl) N,N-dimethylcarbamate

3. 分子式: $C_{19}H_{18}ClN_3O_3$

4. 分子量: 371.8

5. 熔點: 173-174 °C

6. 結構圖：



藥理性質：

苯二氮平類為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氫離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系

統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。[195]

藥動學特性：

本品在肝臟代謝成 oxazepam、temazepam。[196]

用途用法：

治療焦慮狀態和失眠：口服 10 mg/次，每日 2-3 次。

危害及副作用：

較少見的不良反應有；精神混亂，情緒抑鬱，頭痛、噁心、嘔吐、排尿障礙等。

老年、體弱、幼兒、肝病和低蛋白血症患者，對本類藥的中樞性抑制較敏

感。注射用藥時容易引起呼吸抑制、低血壓、肌無力、心動過緩或心跳停止；高齡衰老、危重、肺功能不全以及心血管功能不穩定等患者，靜注過速或與中樞抑制藥合用時，發生率更高，情況也更嚴重。持續的精神紊亂，嗜睡深沉，震顫，持續的說話不清，站立不穩，心動過緩，呼吸短促或困難，嚴重的肌無力。 [197]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：甲醇溶液中於波長 231、315 nm 附近呈較大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1685、1718、1193、1318、1110、730 cm^{-1} 的位置。

(四)質譜分析：分裂於 m/z 58、72、43、78、271、57、44、77。 [194]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、

Butabarbital、Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、

Hydromorphone、Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、

Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、

Thiopental。增加本品的生體可用率及藥理作用： Ergotamine。本品與酒精併服時：增加催眠、鎮靜效果，且作用快速。[198]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

突然停藥後要注意可能發生撤藥症狀。一般半衰期短或中等的本類藥，停藥後 2—3 天出現，半衰期長者則在停藥後 10—20 天發生。戒斷症狀：較多見的為睡眠困難，異常的激惹狀態和神經質；較少見或罕見的有腹部或胃痙攣、精神錯亂、驚厥、肌肉痙攣、噁心或嘔吐、顫抖、異常的多汗。嚴重的戒斷症狀比較多見於長期服用過量的患者。也有曾在連續服用，血藥濃度一直保持在安全有效範圍內，幾個月後突然停藥而發生。失眠反跳現象、神經質、激惹，多數病人為長時期單次夜間服藥，戒斷後發生。半衰期短的停藥後發生快而嚴重。[199]

成癮治療之方法與成效評估：

催吐：吐根使用

活性炭吸收：使用最低 240 毫升的水百分之三十克活性碳。

洗胃。監測病人：監測生命體徵減少呼吸功能：成人 Flumazenil- 0.2-3 mg。

Flumazenil 拮抗中樞神經系統的苯二氮類藥物作用，逆轉的苯二氮類的鎮靜作用。血壓過低： 0.9% NaCl 10-20ml/kg 靜脈注射, dopamine, norepinephrine。[200]

第四級管制藥品 — 氯二氮平 (Chlordiazepoxide)

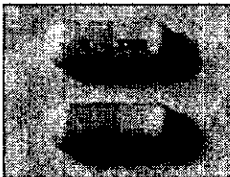
項次: 10

名稱:

1. 中文: 氯二氮平
2. 英文: Chlordiazepoxide
3. 俗稱: 氣氮
4. CAS 編號: 58-25-3

製劑:

1. 劑型: 錠劑膠囊
2. 劑量: 5mg / 10mg / 25mg
3. 照片:



化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀: 淡黃色結晶粉末，對光敏感。

溶解度: 部分不溶於水；可溶於 1:50 的乙醇中及 1:130 的乙醚中；

微溶於氯仿。[201]

2. 結構式:英文

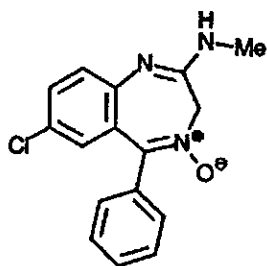
7-Chloro-4-oxy-5-phenyl-3H-benzo[e][1,4]diazepin-2-yl)-methyl-amine

3. 分子式: $C_{16}H_{14}ClN_3O$

4. 分子量: 299.76

5. 熔點: 236-236.5°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為苯二氮平類安眠劑之一，為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經

元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氯通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氯離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。本品被核准使用於治療焦慮。

本品具有安神，抗痙攣，由抑制脊椎反射所致之橫紋肌鬆弛，增進食慾的功能。[201]

藥動學特性：

本品口服後數小時到達血中尖峰濃度，1%-2%以原型式而3%-6%以共軛型式從腎臟排除。半衰期約24-48小時。[202]

用途用法：

- 1、治療酒精戒斷症候群：成人以口服途徑取代非腸道給予途徑時，初始劑量為50-100毫克，每日最大劑量不超過300毫克。
- 2、治療焦慮：緩解輕至中度焦慮症狀成人口服5-10毫克，一天三到四次；治療嚴重焦慮成人口服使用20-25毫克，一天三到四次。
- 3、6歲以上兒童使用最低劑量投予，每次5毫克，一天兩次。[203]

危害及副作用：

- 1、使用本品可能產生紅疹及對光敏感的現象。
- 2、於代謝方面曾有咯紫質沉著症及高血糖的案例。
- 3、嚴重者可能產生全身紅斑性狼瘡。[204]

檢驗方法：

- 一、呈色分析：1. Marquis Test—黃色
- 二、質譜：分裂於 m/z 282、299、284、283、241、56、301、253。
- 三、紫外分光光度法：本品溶於酸性水溶液中於246、308nm有吸收；溶於鹼性水溶液中於262nm有吸收。

四、遠紅外光光譜：以 KBr 錠法檢測本品，主峰出現在 1625、760、1260、690、1590 及 850 cm^{-1} 處。

五、氣相層析法。[205]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

加強中樞神經及呼吸系統之抑制作用：Amobarbital、Aprobarbital、

Butobarbital、Codeine、Fentanyl、Hydrocodone、Hydromorphone、Kava、

Meperidine、Morphine、Phenobarbital、Secobarbital。本品與酒精併用會造

成鎮靜作用增加。[206]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

過量使用本品會影響中樞神經並造成呼吸抑制。病患會有矛盾的興奮，但

單獨使用本品少見引起死亡。診斷主要依照過去病人是否曾使用過量或是

觀察臨床表徵。另可投予 flumazenil 來診斷是否為過量使用。[206]

成癮治療之方法與成效評估：

大多數苯重氮基鹽類安眠劑之中毒只需要臨床上的觀察及支持性照護。

可使用活性炭清除腸胃內殘餘之藥物，不常利用洗胃。

不可催吐。

使用 flumazenil 可反轉嚴重的呼吸抑制或是心血管系統之併發症。但病患患有癲癇發作時禁忌使用 flumazenil。[207]

第四級管制藥品 — 氯巴占(甲酮氮平) (Clobazam)

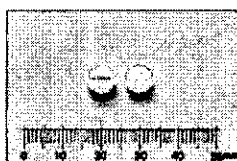
項次: 11

名稱:

1. 中文: 氯巴占(甲酮氮平)
2. 英文: Clobazam
3. CAS 編號: 22316-47-8

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 10 mg
3. 照片:



化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀: 白色結晶粉末。

溶解度: 部分不溶於水; 微溶於乙醇; 極可溶於丙酮及氯仿中。[208]

2. 結構式: 英文

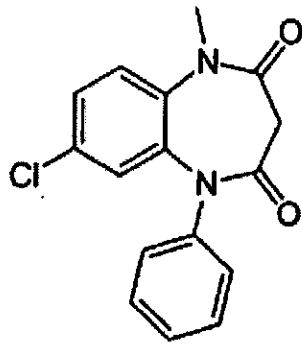
7-Chloro-1,5-dihydro-1-methyl-5-phenyl-1,5-benzodiazepine-2,4(3H)-dione

3. 分子式: $C_{16}H_{13}ClN_2O_2$

4. 分子量: 300.74

5. 熔點: 180-182°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為苯二氮平類安眠劑中的短效鎮靜安眠劑之一，為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫

通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氯離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究體示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：地西洋和蘿拉西洋在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。地西洋由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。有良好的抗焦慮作用。[209]

藥動學特性：

本品口服生體可用率約 87%。主要在肝臟經去烷基化及水解而代謝，N-desmethyloclobazam (norclobazam) 為其活性代謝物。代謝產物 87%-91% 由腎臟排除，其半衰期在年輕男性約 17 小時而女性約 31 小時；於年長男性約 48 小時而女性約 49 小時。[210]

用途用法：

- 1、癲癇發作：成人口服每天 20-30 毫克。
- 2、抗焦慮：3 歲以上，每天口服使用 10-15 毫克。
- 3、反覆發作的癲癇：起始劑量為 0.1-0.83 毫克/公斤/天；維持劑量為 0.2-1.82 毫克/公斤/天。[211]

危害及副作用：

- 1、使用本品可能產生直立性低血壓，嚴重可能有昏倒情況。
- 2、罕見有皮膚紅疹產生。
- 3、使用本品曾發生乳溢及體重增加現象。
- 4、於神經系統方面有想睡、鎮靜等作用。
- 5、在腸胃道有噁心、嘔吐、腹瀉或口乾等現象，另有報導指出曾發生有流涎之案例。[212]

檢驗方法：

- 一、呈色分析：1.以芳香性分析方法 2 分析呈無色，加熱 3 分鐘後呈紅色。
- 二、質譜：分裂於 m/z 300、258、77、259、283、302、231、256。
- 三、紫外分光光度法：本品溶於酸性水溶液中於 231 及 289nm 有吸收。本品溶於鹼性水溶液中於 286 nm 有吸收。
- 四、遠紅外光光譜：以 KBr 錠法檢測本品，主峰出現在 1684、1664、704、

1490、764 及 845 cm^{-1} 處。

五、氣相層析法。[213]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

加強中樞神經及呼吸系統之抑制作用：Amobarbital、Aprobarbital、Butobarbital、Codeine、Fentanyl、Hydrocodone、Hydromophone、Kava、Meperidine、Morphine、Phenobarbital、Secobarbital。本品與酒精併用會造成鎮靜作用增加。[214]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

過量使用本品會影響中樞神經並造成呼吸抑制。病患會有矛盾的興奮，但單獨使用本品少見引起死亡。診斷主要依照過去病人是否曾使用過量或是觀察臨床表徵。另可投予 flumazenil 來診斷是否為過量使用。[214]

成癮治療之方法與成效評估：

大多數苯重氮基鹽類安眠劑之中毒只需要臨床上的觀察及支持性照護。可使用活性碳清除腸胃內殘餘之藥物，不常利用洗胃。不可催吐。使用 flumazenil 可反轉嚴重的呼吸抑制或是心血管系統之併發症。但病患有癲癇發作時禁忌使用 flumazenil。[215]

第四級管制藥品 — 氯硝西洋 (可那氮平、氯硝氮平) (Clonazepam)

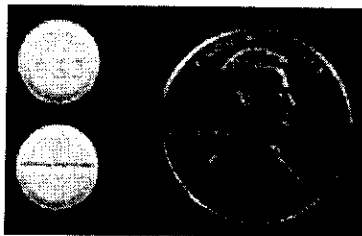
項次: 12

名稱:

1. 中文: 氯硝西洋 (可那氮平、氯硝氮平)
2. 英文: Clonazepam
3. CAS 編號: 1622-61-3

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 1 mg
3. 照片:



化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀: 淡黃色結晶粉末。

溶解度: 25°C 時之溶解度為 31 毫克/毫升丙酮; 15 毫克/毫升氯仿;

8.6 毫克/毫升甲醇; <0.1 毫克/毫升水。[216]

2. 結構式: 英文

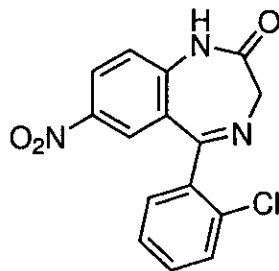
6-(2-chlorophenyl)-9-nitro-2,5-diazabicyclo[5.4.0]undeca-5,8,10,12-tetraen-3-one

3. 分子式: $C_{15}H_{10}ClN_3O_3$

4. 分子量: 315.72

5. 熔點: 236.5-238.5°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為苯二氮平類安眠劑中的鎮靜安眠劑之一，為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為

降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氯通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氯離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。有良好的抗焦慮作用。本品會抑制腦部棘波的放電,加強腦部皮質結構的抑制機轉，在腦部調控 GABA 的作用，有強的抗焦慮及解痙攣效果。[217]

藥動學特性：

本品口服後約 1-4 小時達到血中尖峰濃度，生體可用率約 90%；血漿蛋白

結合率約 85%。在肝臟被 P450 酵素系統高度代謝，進行還原與氧化作用。

從腎臟排除的藥物中少於 2%是原型，其半衰期為 30-40 小時。[218]

用途用法：

恐慌症：成人起始劑量為一天兩次口服 0.25 毫克，3 天後改為一天兩次口服 0.5 毫克；維持劑量為一天兩次口服 0.125 至 0.25 mg，最大劑量為每天 1-4 毫克。

治療兒童的癲癇：10 歲或 30 公斤以上口服起始劑量為 0.01-0.03 毫克/公斤/天，分數次使用；維持劑量為 0.25-0.5 毫克/公斤/天，最大劑量為每天 0.1-0.2 毫克/公斤/天。[219]

危害及副作用：

使用本品常見之副作用為頭昏、判斷力下降、嗜睡或運動不能等等。

偶爾發生嚴重不安、血小板低下及精神狀態改變現象。

罕見的有精神異常、失禁、憤怒或過度興奮情形。[220]

檢驗方法：

一、呈色分析：本品遇到 Formaldehyde-Sulfuric Acid 呈橘色。

二、質譜：分裂於 m/z 280、314、315、286、234、288、316、240。

三、紫外分光光度法：溶於甲醇中於 245 及 309nm 有吸收。

四、遠紅外光光譜：以 KBr 錠法檢測本品，主峰出現在 1685、1610、748、

1255、1578 及 1532 cm^{-1} 處。

五、氣相層析法。[221]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

加強中樞神經及呼吸系統之抑制作用：Amobarbital、Aprobarbital、Butobarbital、Codeine、Fentanyl、Hydrocodone、Hydromorphone、Kava、Meperidine、Morphine、Phenobarbital、Secobarbital。[222]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

過量使用本品會影響中樞神經並造成呼吸抑制。病患會有矛盾的興奮，但單獨使用本品少見引起死亡。診斷主要依照過去病人是否曾使用過量或是觀察臨床表徵。另可投予 flumazenil 來診斷是否為過量使用。[222]

成癮治療之方法與成效評估：

大多數苯重氮基鹽類安眠劑之中毒只需要臨床上的觀察及支持性照護。可使用活性碳清除腸胃內殘餘之藥物，不常利用洗胃。不可催吐。使用 flumazenil 可反轉嚴重的呼吸抑制或是心血管系統之併發症。但病患患有癲癇發作時禁忌使用 flumazenil。[223]

第四級管制藥品 — 氯拉酸(氯氮平酸鹽) (Clorazepate)

項次: 13

名稱:

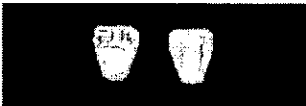
1. 中文: 氯拉酸(氯氮平酸鹽)
2. 英文: Clorazepate
3. CAS 編號: 23887-31-2

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 3.75 mg / 7.5 mg / 15 mg
3. 照片:



Trade Name: Tranxene
Controlled Ingredient: clorazepate dipotassium,
15 mg



Trade Name: Tranxene
Controlled Ingredient: clorazepate dipotassium,
3.75 mg



Trade Name: Tranxene
Controlled Ingredient: clorazepate dipotassium,
7.5 mg

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀：細小的灰白色粉末。

溶解度：極可溶於水中；極難溶於乙醇中；部份不溶於乙醚及氯仿中。本品在水溶液中會轉變為單鉀鹽型式。[224]

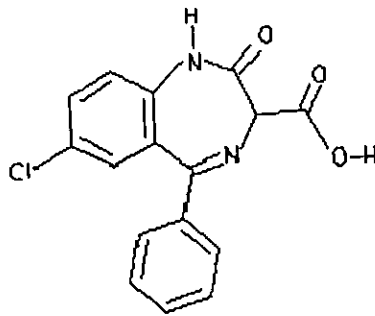
2. 結構式：英文

Potassium
7-chloro-2,3-dihydro-2-oxo-5-phenyl-1H-1,4-benzodiazepine-3-carboxylate with potassium hydroxide

3. 分子式： $C_{16}H_{11}ClK_2N_2O_4$

4. 分子量：407.97

5. 結構圖：



藥理性質：

本品為苯二氮平類安眠劑中的鎮靜安眠劑之一，為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子

(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氯離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氯通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氯通道開放，使氯離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氯通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氯離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。有良好的抗焦慮作用。[225]

藥動學特性：

本品以肌肉注射其生體可用率為 100%，口服之生體可用率為 91%。血漿蛋白結合率為 97-98%，主要由肝臟代謝，Nordiazepam、Desmethyldiazepam 為其活性代謝物。62%-67%由腎臟排除；15%-19%由糞便排除。[226]

用途用法：

焦慮：成人每次口服 15-60 毫克，一天用一次到數次。

癲癇小發作之輔助治療：12 歲以上，建議最大起始劑量為每次 7.5 毫克一日三次，之後每周提高劑量至最大不超過每日 90 毫克。[227]

危害及副作用：

使用本品可能會有失眠、眩暈情況產生，偶有鹼磷酸酯值上升的情形。

偶而有噁心、嘔吐、胃腸障礙、口渴等不舒服症狀。

產生發疹、蕁疹等過敏症狀。曾有靜坐困難、健忘等案例發生。[228]

檢驗方法：

一、呈色分析：1.本品遇 Formaldehyde-Sulfuric Acid—呈橘色。

二、質譜：分裂於 m/z 242、43、270、269、241、103、243、76。

三、紫外分光光度法：本品之雙鉀鹽溶於酸性水溶液中於 237 及 287nm 有吸收。

四、遠紅外光光譜：以 KBr 錠法檢測本品，主峰出現在 1597、1548、1300、

702、1230 及 830 cm^{-1} 處。

五、氣相層析法。[229]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

加強中樞神經及呼吸系統之抑制作用：Amobarbital、Aprobarbital、Butabarbital、Codeine、Fentanyl、Hydrocodone、Hydromophone、Kava、Meperidine、Morphine、Phenobarbital、Secobarbital。本品與酒精併用會造成鎮靜作用增加。[230]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

過量使用本品會影響中樞神經並造成呼吸抑制。病患會有矛盾的興奮，但單獨使用本品少見引起死亡。診斷主要依照過去病人是否曾使用過量或是觀察臨床表徵。另可投予 flumazenil 來診斷是否為過量使用。[230]

成癮治療之方法與成效評估：

大多數苯重氮基鹽類安眠劑之中毒只需要臨床上的觀察及支持性照護。

可使用活性碳清除腸胃內殘餘之藥物，不常利用洗胃。

不可催吐。使用 flumazenil 可反轉嚴重的呼吸抑制或是心血管系統之併發症。但病患患有癲癇發作時禁忌使用 flumazenil。[231]

第四級管制藥品 — 氯噻西洋（氯噻氮平）(Clotiazepam)

項次: 14

名稱:

1. 中文: 氯噻西洋（氯噻氮平）
2. 英文: Clotiazepam
3. CAS 編號: 33671-46-4

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 5 mg

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

溶解度: 微溶於水。[232]

2. 結構式: 英文

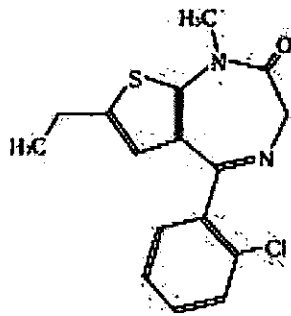
2-(2-chlorophenyl)-9-ethyl-6-methyl-8-thia-3,6-diazabicyclo[5.3.0]dec
a-2,9,11-trien-5-one

3. 分子式: $C_{16}H_{15}ClN_2OS$

4. 分子量: 318.06

5. 熔點: 118-120°C

6. 結構圖：



藥理性質：

本品為苯二氮平類安眠劑中的鎮靜安眠劑之一，為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子 (supramolecular) 功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氫離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦

慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。有良好的抗焦慮作用。本品具有抗焦慮、抗痙攣、鎮靜及骨骼肌放鬆作用。[233]

藥動學特性：

本品之血漿蛋白結合率為 99%，Hydroxyclozepam、Desmethylozepam 為其活性代謝物。半衰期約 4.6-10 小時。[234]

用途用法：

1、焦慮：成人口服使用 5-15 毫克，一天 1-3 次。兒童之劑量為 0.2 至 0.6 毫克/公斤/天，分為數次使用。[235]

2、幻聽：治療慢性精神分裂症患者，使用 50-100 毫克，晚上服用。

危害及副作用：

使用本品可能產生蕁麻疹。

腸胃方面偶見噁心及嘔吐情況。

神經系統方面可能有鎮靜、失眠、疲勞、眩暈或思睡現象。(5)

檢驗方法：

一、將本品 0.01 克溶於 3 毫升之 sulfuric acid 中，此溶液在紫外光下呈現淡黃色螢光，最大吸收在 365nm。

二、質譜：分裂於 m/z 52、54、65、69、144、145、284、289、290、318、320。

三、氣相層析法。[236]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

加強中樞神經及呼吸系統之抑制作用：Amobarbital、Aprobarbital、

Butabarbital、Codeine、Fentanyl、Hydrocodone、Hydromophone、Kava、

Meperidine、Morphine、Phenobarbital、Secobarbital。本品與酒精併用會造

成鎮靜作用增加。[237]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

過量使用本品會影響中樞神經並造成呼吸抑制。病患會有矛盾的興奮，但單獨使用本品少見引起死亡。診斷主要依照過去病人是否曾使用過量或是觀察臨床表徵。另可投予 flumazenil 來診斷是否為過量使用。 [237]

成癮治療之方法與成效評估：

- 1、大多數苯重氮基鹽類安眠劑之中毒只需要臨床上的觀察及支持性照護。
- 2、可使用活性碳清除腸胃內殘餘之藥物，不常利用洗胃。
- 3、不可催吐。
- 4、使用 flumazenil 可反轉嚴重的呼吸抑制或是心血管系統之併發症。但病患患有癲癇發作時禁忌使用 flumazenil。 [238]

第四級管制藥品 — 氯噁唑他（氯唑侖）(Cloxazolam)

項次: 15

名稱:

1. 中文: 氯噁唑他（氯唑侖）
2. 英文: Cloxazolam
3. CAS 編號: 27223-35-4

製劑:

1. 劑型: 錠劑。
2. 劑量: 1 mg

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀: 白色結晶或結晶狀粉末，無臭無味。

溶解度: 可溶於醋酸中；微溶於乙醇中；不溶於水。[239]

2. 結構式: 英文

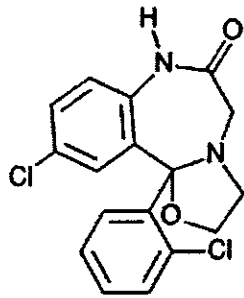
10-chloro-11b-(2-chlorophenyl)-2,3,5,7-tetrahydro-[1,3]oxazolo[3,2-d][1,4]benzodiazepin-6-one

3. 分子式: $C_{17}H_{14}Cl_2N_2O_2$

4. 分子量: 349.22

5. 熔點: 約 200°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為長效苯二氮平類安眠劑中的鎮靜安眠劑之一，為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氫離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦

慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。具有抗焦慮、抗痙攣、鎮靜及骨骼肌放鬆作用。[240]

藥動學特性：

本品之口服吸收速率中等，其主要代謝處為肝臟，之後從腎臟排除。

用途用法：

劑型：錠劑。

治療焦慮。成人每日 3-12 錠，分 3 次服用。手術前服用之劑量為:0.1-0.2 毫克/公斤體重。可依年齡、症狀適宜增減。

危害及副作用：

使用本品通常有口乾、想睡、噁心嘔吐、視覺模糊、頭痛、頭暈目眩、發抖的情形。可能出現手腳及眼睛不能自主運動、興奮、不正常瘀青。本品也可能造成皮膚起紅疹、發癢、幻覺等情形。[240]

檢驗方法：

一、將本品 0.01 克溶於 10 毫克 99.5%乙醇中，加熱後加入 1 滴 hydrochloric acid，溶液為淡黃色，且於紫外光下呈黃綠色螢光，最大吸收在 365nm。

二、質譜：分裂於 m/z 45、62、90、101、102、150、176、190、204、205、348、349、307、308、237、245。

三、氣相層析法。[239]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

加強中樞神經及呼吸系統之抑制作用：Amobarbital、Aprobarbital、Butabarbital、Codeine、Fentanyl、Hydrocodone、Hydromophone、Kava、Meperidine、Morphine、Phenobarbital、Secobarbital。[241]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

過量使用本品會影響中樞神經並造成呼吸抑制。病患會有矛盾的興奮，但單獨使用本品少見引起死亡。診斷主要依照過去病人是否曾使用過量或是

觀察臨床表徵。另可投予 flumazenil 來診斷是否為過量使用。

本品與酒精併用會造成鎮靜作用增加。[242]

成癮治療之方法與成效評估：

- 1、大多數苯二氮平類安眠劑之中毒只需要臨床上的觀察及支持性照護。
- 2、可使用活性炭清除腸胃內殘餘之藥物，不常利用洗胃。
- 3、不可催吐。
- 4、使用 flumazenil 可反轉嚴重的呼吸抑制或是心血管系統之併發症。但病患有癲癇發作時禁忌使用 flumazenil。[243]

第四級管制藥品 —可待因內服液（含糖漿劑）含量每 100 毫升未滿 1.0 公克之醫師處方用藥 Physician prescribes Codeine oral liquid (including syrup) with codeine content less than 1.0 gram per 100 milliliters

項次: 16

名稱：

1. 中文：可待因內服液（含糖漿劑）含量每 100 毫升未滿 1.0 公克之醫師處方用藥
2. 英文：Physician prescribes Codeine oral liquid (including syrup) with codeine content less than 1.0 gram per 100 milliliters
3. CAS 編號：76-57-3

製劑：

1. 劑型：糖漿。
2. 劑量：60cc/瓶。

化學性狀：

1. 外觀及性狀：一般性狀：無色結晶或白色結晶狀粉末，在乾燥空氣中慢慢風化且受光影響。溶解度：可溶於 1:120 的水；1:15 的沸水；1:2 的乙醇；1:0.5 的氯仿；1:13 的苯；1:18 的乙醚中；極可溶於戊醇、甲醇及稀釋的酸中；幾乎不溶於石油醚或鹼金屬氫氧化物溶液中。[102]

2. 結構式：

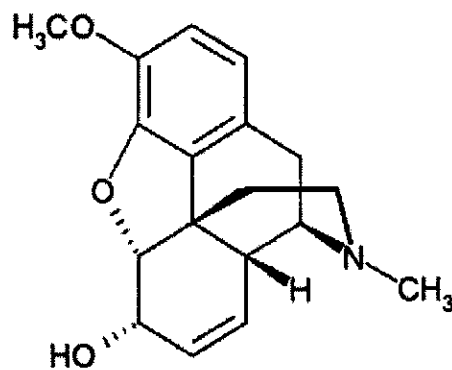
(5 α ,6 α)-7,8-Didehydro-4,5-epoxy-3-methoxy-17-methylmorphinan-6-ol

3. 分子式：C₁₈H₂₁NO₃

4. 分子量：299.4

5. 熔點：154-156°C

6. 結構圖：



藥理性質：

鎮咳及鎮痛劑，其鎮痛及成癮性較嗎啡為低。由於作用在延髓上的咳嗽反射區而有鎮咳功效。[103]

藥動學特性：

本品口服吸收良好；經直腸吸收其生體可用率為 63%。本品不與血漿蛋白結合。本品 24-89%由肝臟代謝，主要代謝途徑是與尿甘酸的共軛作用形成 codeine-6-glucuronide；另外也會經 CYP2D6 酵素作用形成嗎啡。本品代謝物 90%從腎臟排除，半衰期約 2.5-3.5 小時。[104]

用途用法：用於治療乾咳及劇烈、頻繁的咳嗽。劑型：錠劑 20、30 毫克。

注射劑 15、30、60 毫克／毫升。口服：一日量 60mg，一次量 15-30mg，一次極量 100mg，一日極量 300mg。注射：皮下，肌肉注射一次量 15-30mg。

[105]

危害及副作用：

久服具成癮性，正常劑量下，極少產生副作用。過量投與之副作用包括嘔吐，噁心，暈眩，膽管痙攣，呼吸抑制等。服用過量而致死的原因為肺水腫。[106]

檢驗方法：

1. 呈色分析：Liebermann's Test—黑色。Mandelin's Test—綠色。
Marquis Test—紫色。
2. 紫外分光光度法：本品溶於酸性水溶液中於 285nm 有吸收。
3. 氣相層析法
4. 紅外線光譜法：以 KBr 錠法檢測本品，主峰出現在 1052、1268、1500、1111、793 及 934cm^{-1} 處。
5. 質譜分析：分裂於 m/z 299、42、162、124、229、59、300、69。
6. 經以氫試液中和之本品溶液(1→50)，加硝酸銀試液，即生黃色沉澱，此沉澱可溶於 2N 硝酸或氫試液中。[107]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

增加中樞神經系統及呼吸系統的抑制作用：Adinazolam、Alprazolam、Amobarbital、Aprobarbita、Bromazepam、Butalbital、Clobazam、Clonazepam、Clorazepate、Diazepam、Estazolam、Fentanyl、Flunitrazepam、Hydrocodone、Lormetazepam、Meperidine、Morphine、Phenobarbital、Triazolam。

產生戒斷症狀：Buprenorphine。本品與酒精併用會產生加成或是協同之中樞神經抑制作用，可能造成病患之肌肉動作不協調。[108]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

中毒劑量之可待因會造成失去意識、瞳孔成針狀、呼吸緩慢、發紺等等。最危險的作用是呼吸抑制，於口服後 2-4 小時內可能引起呼吸衰竭。本品也可能引發痙攣。可能可以觀察到病患有幻覺、發抖、無法控制肌肉動作、精神上的壓抑及皮膚疹等情形。戒斷症狀包括打呵欠、流淚、嚴重腸胃道不適、發燒或冷顫、流汗、瞳孔放大、肌痛、失眠、增加呼吸速率等。診斷：昏迷、針狀瞳孔及呼吸抑制為鴉片類藥物中毒時最典型的症狀，可待因中毒時也常見有蕁麻疹產生。病患的尿液及血液可作生化及毒理分析。[108]

成癮治療方法：

於急性、嚴重中毒之病患，需建立暢通之呼吸道，提供人工通氣、氧氣及監視血液動力學狀態。具有意識之病患，考慮給予洗胃。病患於服用後一

至二小時內可投予活性炭。建議的解毒劑為靜脈注射投予 0.4 毫克 naloxone，需要時每二至三分鐘反覆給藥直到恢復。休克時經靜脈給予液體、加壓藥物及其他支持治療需維持體溫。[109]

第四級管制藥品 — 地洛西洋（地洛氮平）(Delorazepam)

項次: 17

名稱:

1. 中文: 地洛西洋（地洛氮平）
2. 英文: Delorazepam

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 20 mg
3. 照片:



化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀: 白色粉末。[244]

2. 結構式: 英文

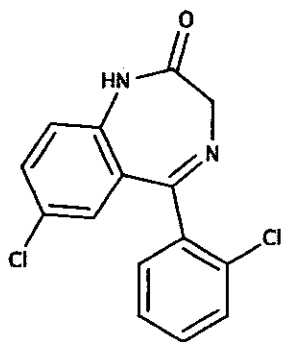
7-Chloro-5-[o-chlorophenyl]-1,3-dihydro-2H-1,4-benzodiazepin-2-one

3. 分子式: $C_{15}H_{10}Cl_2N_2O$

4. 分子量: 304.02

5. 熔點: 198-200°C

6. 結構圖：



藥理性質：

本品為品為長效苯二氮平類安眠劑中的鎮靜安眠劑之一，為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氫離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA

在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。參與 GABA 的調控。本品臨床上用作抗焦慮劑及安眠劑。[245]

藥動學特性：

本品之滴劑口服生體可用率約 79%，錠劑為 77%。主要由肝臟代謝，經水解作用產生其活性代謝物 lorazepam。由腎臟排除。本品之半數致死劑量於大鼠為口服劑量 2000 毫克/公斤，小鼠為 940 毫克/公斤。[246]

用途用法：

用於內視鏡檢查：成人使用肌肉注射途徑，劑量為 2 毫克。靜脈注射給藥則劑量為 0.02 毫克/公斤。

焦慮：成人口服 0.5-2 毫克，一天二至三次。

失眠：成人口服 0.5-2 毫克，睡前使用。[247]

危害及副作用：

靜脈注射本品可能產生中等程度的低血壓。

偶見皮膚產生紅疹。

本品可能造成無力、暈眩、頭昏眼花或複視等情況。[248]

檢驗方法：

一、質譜：分裂於 m/z 50、52、64、69、74、75、76、89、100、114、120、141、150、151、304、269、271。

二、氣相層析法[244]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

加強中樞神經及呼吸系統之抑制作用：Amobarbital、Aprobarbital、Butabarbital、Codeine、Fentanyl、Hydrocodone、Hydromophone、Kava、Meperidine、Morphine、Phenobarbital、Secobarbital。本品與酒精併用會造成鎮靜作用增加。[249]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

過量使用本品會影響中樞神經並造成呼吸抑制。病患會有矛盾的興奮，但

單獨使用本品少見引起死亡。診斷主要依照過去病人是否曾使用過量或是觀察臨床表徵。另可投予 flumazenil 來診斷是否為過量使用。[249]

成癮治療之方法與成效評估：

大多數苯二氮平類安眠劑之中毒只需要臨床上的觀察及支持性照護。

可使用活性碳清除腸胃內殘餘之藥物，不常利用洗胃。

不可催吐。使用 flumazenil 可反轉嚴重的呼吸抑制或是心血管系統之併發症。但病患有癲癇發作時禁忌使用 flumazenil。[250]

第四級管制藥品 — 右旋普帕西芬複方製劑 Dextropropoxyphene

Mix-ture Preparation

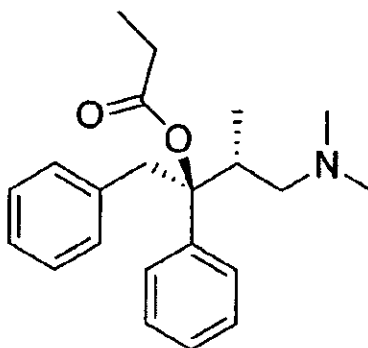
項次:18

名稱：

1. 中文：右旋普帕西芬複方製劑
2. 英文：Dextropropoxyphene Mix-ture Preparation
3. CAS 編號：469-62-5

化學性狀：

1. 外觀及性狀：微溶於水。[251]
2. 結構式：[(2R,3R)-4-dimethylamino- 3-methyl-1,2-diphenyl-butan-2-yl] propanoate
3. 分子式：C₂₂H₂₉NO₂
4. 分子量：339.471
5. 熔點：75 -76°C
6. 結構圖：



藥理性質：

鴉片類止痛藥品影響腦部疼痛訊息的傳送，dextropropoxyphene，像可待因，是弱的阿片類藥物。可待因較常用；然而，有些人（約 10-20 % 的高加索人口）無法代謝，由於 CYP2D6 酵素作用力較弱的關係。

dextropropoxyphene 對這些人特別有用，因為它不會很快被 CYP2D6 代謝。

[252]

藥動學特性：

可以立即且完全的被人體吸收分布於腦部、肺臟、肝臟、腎臟，但會有首渡代謝（first pass metabolism）。經直腸吸收其生體可用率為 40%。血漿清除率 15mL/min/kg，在血漿中與蛋白質的結合率有 70~80%，半衰期約 3.6~6.5 小時。主要的代謝反應是 N-去甲基化，產生 norpropoxyphene 和 dinorpropoxyphene。在體內 24 之內會有約 35% 的本品被排出到尿液中，其中包含 13% norpropoxyphene 和至少 5% Dextropropoxyphene，整體劑量的 60~70% 會在五天之內被排泄到尿液中，約有 18% 的劑量回由糞便排除。在血漿中的有效濃度 0.05~0.75mg/mL。[253]

用途用法：

每三至四小時一次，每次 32-64 毫克。[254]

危害及副作用：

過量投與之副作用包括嘔吐，暈眩，膽管痙攣，呼吸抑制、昏睡、噁心、

嘔吐或便秘、黑色的尿液、不規律的心跳、幻覺、出汗等。[255]

檢驗方法：

1. 呈色分析：Liebermann's Test—棕色。Mandelin's Test—灰棕色。

Marquis Test—紫黑色到綠色。

2. 紫外分光光度法：酸性水溶液下於波長 252、257nm 附近有較大吸收。

3. 氣相層析法

4. 紅外線光譜法：以 KBr 錠法檢測本品，主峰出現在 1730、1175、725、704、776 及 1026 cm^{-1} 處。

5. 質譜分析：分裂於 m/z 55、117、208、115、193、91、179、130。

[256]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

Dextropropoxyphene 是一種很常用的止痛劑。煙草能刺激肝酵素，導致此藥被快速清除，降低其藥效。吸煙者可能需要較大的劑量才可控制病情，但同時亦可能增加此藥的副作用。在肝硬化的患者中，口服

Dextropropoxyphene 藥物在體內的生體可用率會增加，同時血液中藥物清除率會減少，藥物作用強度和時效均會增加。此藥可增加 Warfarin 的抗凝血

功效。[257]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

估計最小致死量是 0.5 克，成癮者在出現中毒症狀之前可以吸收普通劑量的

十倍藥量。但小孩只要服用普通劑量的 1/12 就會出現中毒症狀。血中濃度

達到 1mg/L 就會出現中毒症狀，達到 2mg/L 便可能會致死。藥物過量治療

方法：護理者會衡量和監測病人的生命體徵，包括溫度，脈搏，呼吸率，

及血液的壓力。[258]

第四級管制藥品 — 安定 (二氮平) (Diazepam)

項次: 19

名稱:

1. 中文: 安定 (二氮平)
2. 英文: Diazepam
3. CAS 編號: 439-14-5

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 2 mg / 5 mg / 10 mg
3. 照片:



Trade Name: Valium
Controlled Ingredient: diazepam,
10 mg



Trade Name: Valium
Controlled Ingredient: diazepam,
5 mg



Trade Name: Valium
Controlled Ingredient: diazepam,
2 mg

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀:白或黃色結晶粉末。

溶解度:微溶於水；可溶於 1:25 的乙醇中；1:2 的氯仿中；1:39 的乙醚中。[259]

2. 結構式:英文

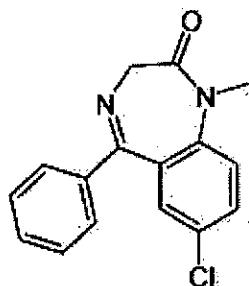
7-chloro-1-methyl-5-phenyl-1,3-dihydro-2H-1,4-benzodiazepin-2-one

3. 分子式: $C_{16}H_{13}ClN_2O$

4. 分子量: 284.75

5. 熔點: 131-135°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為長效苯二氮平類安眠劑中的鎮靜安眠劑之一，為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制

作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子 (supramolecular) 功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氯離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氯通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氯通道開放，使氯離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氯通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氯離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經

和肌肉功能。有良好的抗焦慮作用。本品具有抗焦慮、抗痙攣及骨骼肌放鬆作用。[260]

藥動學特性：

本品之血漿蛋白結合率約 94%-99%。在胎盤的濃度與母體血漿中的濃度相近。本品主要經肝臟代謝，N-desmethyldiazepam、N-methyloxazepam (temazepam) 為其活性代謝物。75% 從腎臟排除，半衰期為 7-10 小時。[261]

成人口服劑量，決定於症狀的嚴重性，一日 5-20 mg，單一口服劑量正常下不應該超過 10 mg。年長者：應給與低劑量，在開始治療時，這些患者應定期檢查血中濃度，以最小劑量和/或投藥頻率給予，避免由於蓄積而造成過量。孩童：劑量每日 0.1-0.3 mg/kg 體重。[262]

危害及副作用：

用本品通常有口乾、想睡、噁心嘔吐、視覺模糊、頭痛、頭暈目眩、發抖的情形。可能出現手腳及眼睛不能自主運動、興奮、不正常瘀青。本品也可能造成皮膚起紅疹、發癢、幻覺等情形。[263]

檢驗方法：

- 一、呈色分析：1. 本品遇 Formaldehyde-Sulfuric Acid 呈橘色。
- 二、質譜：分裂於 m/z 256、283、284、285、257、255、258、286。
- 三、紫外分光光度法：本品溶於酸性水溶液中於 242、284 及 366nm 有吸收。

四、遠紅外光光譜：以 KBr 錠法檢測本品，主峰出現在 1681、1313、705、840、1125 及 740 cm^{-1} 處。

五、氣相層析法。[264]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

加強中樞神經及呼吸系統之抑制作用：Amobarbital、Aprobarbital、Butobarbital、Codeine、Fentanyl、Hydrocodone、Hydromorphone、Kava、Meperidine、Morphine、Phenobarbital、Secobarbital。本品與酒精併用會造成鎮靜作用增加。[265]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

過量使用本品會影響中樞神經並造成呼吸抑制。病患會有矛盾的興奮，但單獨使用本品少見引起死亡。診斷主要依照過去病人是否曾使用過量或是觀察臨床表徵。另可投予 flumazenil 來診斷是否為過量使用。[265]

成癮治療之方法與成效評估：

大多數苯重氮基鹽類安眠劑之中毒只需要臨床上的觀察及支持性照護。

可使用活性碳清除腸胃內殘餘之藥物，不常利用洗胃。不可催吐。使用 flumazenil 可反轉嚴重的呼吸抑制或是心血管系統之併發症。但病患有癲癇發作時禁忌使用 flumazenil。[266]

第四級管制藥品 — 舒樂安定 (伊疊唑侖) (Estazolam)

項次: 20

名稱:

1. 中文: 舒樂安定 (伊疊唑侖)
2. 英文: Estazolam
3. CAS 編號: 29975-16-4

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 2 mg
3. 照片:



化學性狀:

1. 外觀及性狀:

一般性狀: 結晶狀粉末。

溶解度: 部分不溶於水，溶解度為 1.5 mg/L。[267]

2. 結構式: 英文

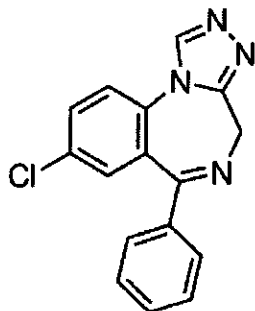
8-Chloro-6-phenyl-4*H*-1,2,4-triazolo(4,3-*a*)-1,4-benzodiazepine

3. 分子式: $C_{16}H_{11}ClN_4$

4. 分子量: 294.07

5. 熔點: 228.5°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為苯二氮平類安眠劑，為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸 (GABA) 的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氫離子通道的聯繫來實現。苯二氮平

類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。有良好的抗焦慮作用。[268]

藥動學特性：

本品口服吸收迅速，血漿蛋白結合率約 93%。最主要的代謝物為不具生物活性的 4-Hydroxyestazolam。代謝物主要由腎臟排除，其餘有 4%從糞便排除。半衰期為 10-24 小時。[269]

用途用法：

治療失眠:成人在睡前口服 1 毫克，腎臟病病患不需調整劑量；年長失眠患

者建議初使劑量為 0.5 毫克。對於 18 歲以下個體之安全性與有效性尚未建立。[270]

危害及副作用：

心血管系統：心悸、心跳過速及暈厥曾發生但罕見。

腸胃道：可能造成便秘、口乾、厭食、脹氣或嘔吐。

血液方面：曾造成顆粒性白血球缺乏症、白血球減少。

肌肉方面：可能產生關節炎、關節痛、肌痛及肌肉痙攣。

神經系統：使用本品可能會頭昏、方向感不協調、頭痛、動作變慢及想睡。

[271]

檢驗方法：

一、紫外分光光度法：本品溶液於 225nm 有吸收。

二、質譜：分裂於 m/z 40、50、64、65、69、74、75、76、89、90、100、150、204、205、231、232、260、294。

三、氣相層析法。[267]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

加強中樞神經及呼吸系統之抑制作用：Amobarbital、Aprobarbital、

Butabarbital、Codeine、Fentanyl、Hydrocodone、Hydromorphone、Kava、

Meperidine、Morphine、Phenobarbital、Secobarbital。本品與酒精併用會造成鎮靜作用增加。[272]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

過量使用本品會影響中樞神經並造成呼吸抑制。病患會有矛盾的興奮，但單獨使用本品少見引起死亡。診斷主要依照過去病人是否曾使用過量或是觀察臨床表徵。另可投予 flumazenil 來診斷是否為過量使用。[272]

成癮治療之方法與成效評估：

大多數苯重氮基鹽類安眠劑之中毒只需要臨床上的觀察及支持性照護。

可使用活性炭清除腸胃內殘餘之藥物，不常利用洗胃。

不可催吐。使用 flumazenil 可反轉嚴重的呼吸抑制或是心血管系統之併發症。但病患有癲癇發作時禁忌使用 flumazenil。[273]

第四級管制藥品 — 乙氯維諾 (乙氯烯醇) Ethchlorvynol

項次:21

名稱：

1. 中文：乙氯維諾 (乙氯烯醇)

2. 英文：Ethchlorvynol

3. CAS 編號：113-18-8

製劑：

6. 劑型：膠囊

7. 劑量：200 毫克、500 毫克、750 毫克

化學性狀：

1. 外觀及性狀：無色或黃色的黏稠液體，接觸到空氣或是光線時顏色變深。密度：每毫升的重量在 1.072 克。溶解度：可溶於乙醇、氯仿、乙醚、含其他有機溶劑，特別不與水互融。[274]

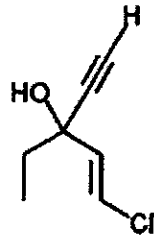
2. 結構式：1-chloro-3-ethyl-pent-1-en-4-yn-3-ol

3. 分子式：C₇H₉ClO

4. 分子量：144.598

5. 沸點：173-174°C (也有數據顯示是 181°C)

6. 結構圖：



藥理性質：

在化學上與水化氯醛密切相關，水化氯醛(chloral hydrate)是一早期的安眠藥，雖然目前使用的適應症少，但仍然用在臨床上，尤其當小兒科病人必需鎮定以從事檢查時，常由直腸灌注使用。水化氯醛口服之後，由粘膜吸收很快，代謝也快，但其代謝產物、trichloroethanol 具活性，是水化氯醛產生鎮靜作用的主要化學成份。[275]

藥動學特性：

與食物或牛奶併服可以減少副作用，蛋白質結合率 35~50%，血漿與全血比 1.1，分布半衰期 1~3 小時，分布體積(Volume of Distribution) 3 to 4 L/kg，有 33%劑量由腎臟排除，排除半衰期 10~25 小時。90%本品在肝臟代謝，有投與劑量的 40% 被代謝成 1-chloro-3-ethynylpent-1-en-3,4-diol 一種 Ethchlorvynol 的二級醇類。[276][277][278]

用途用法：

鎮靜、催眠藥。劑量在 0.2~1.0 克。[279]

危害及副作用：

長期使用：中毒性精神病、定向障礙、意識模糊、幻覺、眼球震顫、排尿困難、複視。久用成癮：血小板減少、大皰疹；此藥可產生自身免疫性血小板減少症，可出現過敏反應及黃疸。慢性中毒的症狀：眼球震顫、語言不流利、共濟失調、複視。[280]

檢驗方法：

呈色分析：Ammoniacal Silver Nitrate 有白色或黃色沉澱物。

氣相層析法

紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 935、950、830、1010、1063、980 cm^{-1} 的位置。

質譜分析：principal ions at m/z 115、117、89、53、109、51、91、39。[281]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

增加呼吸抑制作用：Adinazolam、Alprazolam、Amobarbital、Aprobarbital、Bromazepam、Brotizolam、Butabarbital、Butalbital、Chlordiazepoxide、Clobazam、Clonazepam、Clorazepate、Codeine、Diazepam、Estazolam、Fentanyl、Flunitrazepam、Flurazepam、Halazepam、Hydrocodone、

Hydromorphone、Ketazolam、Lorazepam、Lormetazepam、Medazepam、
Meperidine、Mephobarbital、Meprobamate、Methocarbamol、Methohexital、
Midazolam、Moclobemide、Morphine、Morphine Sulfate Liposome、
Nitrazepam、Nordazepam、Oxazepam、Oxycodone、Oxymorphone、
Pentobarbital、Phenobarbital、Prazepam、Quazepam、Secobarbital、
Temazepam、Thiopental、Triazolam。[282]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

服用過量的本品會出現下列症狀：持續的恐慌；視覺降低或產生變化；雙重視野；發燒、發冷、或咽喉痛，低體溫；麻木、刺痛、疼痛、虛弱、皮膚臉色蒼白、無法穩定步行、顫抖、或其他肌肉控制協調問題；氣促，呼吸困難，緩慢的心跳，講話不清、不尋常的出血或瘀傷、不尋常的疲倦或覺得虛弱。[283]

成癮治療方法：

血液灌流 (Hemoperfusion)：血液灌流活性炭、塗有 acetate 的纖維素活性炭或樹脂，去除本品之最有效方法。[284]

第四級管制藥品 — 炔己蟻胺（環己炔胺）Ethinamate

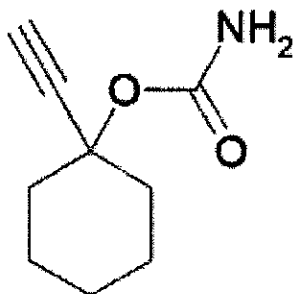
項次: 22

名稱:

1. 中文: 炔己蟻胺（環己炔胺）
2. 英文: Ethinamate
3. CAS 編號: 126-52-3

化學性狀:

1. 外觀及性狀: 本品為白色粉末，溶解度：可溶於氯仿和乙醚；一份本品溶於 400 份的水；一份本品溶於 3 份乙醇。[285]
2. 結構式: (1-ethynylcyclohexyl)carbamate
3. 分子式: $C_9H_{13}NO_2$
4. 分子量: 167.205
5. 熔點: 96~98°C
6. 結構圖:



藥理性質：

短效的鎮靜安眠藥，但沒有肌肉放鬆劑的作用。本品屬於巴比妥鹽藥物。

巴比妥鹽 (barbiturates)，是巴比妥酸的衍生物。這類藥物口服或肌肉注射均易吸收，並迅速分布於全身組織及體液。脂溶性高低是決定巴比妥類藥物進入腦組織快慢的主要因素，脂溶性高的巴比妥類藥主要由肝臟代謝，作用維持時間短，脂溶性低的巴比妥類藥則大部分以原形由腎臟排泄，但排泄速度甚慢，故作用時間長。巴比妥酸鹽是早期開發用於治療焦慮、失眠之安眠鎮靜劑，因白天使用產生之宿醉作用(hangover)較苯二氮洋類 (benzodiazepines)嚴重，且安全性較低，易產生生理賴性，現已較少使用。

[286]

藥動學特性：

血漿半衰期 1.9~2.5 小時，口服後可以很快的被吸收。本品在肝臟代謝，在體內會代謝成 4-hydroxyethinamate，約有 40%的本品在身體裡 24 小時之內以 trans-4-hydroxyethinamate 或是 glucuronide 的共軛形式排出到尿液中，只有少部份以原形排出到尿液。2-hydroxyethinamate 和 3-hydroxyethinamate 亦可在尿液中被偵測到。[287]

用途用法：

0.5~1.0 克，或是血中本品濃度達到 5~10mg/L 當作鎮靜安眠藥。[288]

危害及副作用：

本品使用後會有放鬆安詳或愉悅感，長期使用會產生耐藥性、依賴性及出現嗜睡、步履不穩、注意力不集中、記憶力和判斷力減退等症狀。[289]

檢驗方法：

1. 呈色分析：Ammoniacal Silver Nitrate—黃色或棕色。
2. 紫外分光光度法：本品並沒有明顯的特定吸收波長，但在 230~360nm 這個範圍有吸收。
3. 氣相層析法
4. 紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1713、1041、1694、1030、1052、1250 cm^{-1} 的位置。
5. 質譜分析：分裂於 m/z 91、81、106、78、39、95、68、43。[290]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

巴比妥鹽類和其它的鎮靜—安眠藥對中樞的抑制有相加的作用；它也與含酒精的飲料、抗組織胺類、抗精神病藥物、類鴉片鎮痛劑，以及三環抗憂鬱藥對中樞的抑制有相加的作用。[287]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

估計最小致死用量在 15 克，血中本品濃度超過 100mg/L 亦會致死，長期使

用本品會導致 barbiturate-alcohol 型的成癮，突然停藥，會產生戒斷現象症狀，包括噁心、嘔吐、焦慮、易怒、失眠，嚴重者甚至產生幻覺、譫妄。急性中毒會產生意識障礙、眼顫、血壓下降、呼吸抑制等症狀，嚴重者甚至致死。[291]

成癮治療方法：

中毒的治療需要維持順暢的呼吸和血壓。[292]

第四級管制藥品 — 氟氮平酸酯 (Ethyl loflazepate)

項次: 23

名稱:

1. 中文: 氟氮平酸酯
2. 英文: Ethyl loflazepate
3. CAS 編號: 28911-01-5

製劑:

1. 劑型: 錠劑

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

性質: 白色乙醚晶性粉末。[293]

2. 結構式: 英文

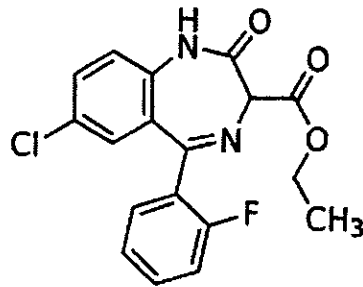
ethyl-9-chloro-6-(2-fluorophenyl)-3-oxo-2,5-diazabicyclo[5.4.0]undec
a-5,8,10,12-tetraene-4-carboxylate

3. 分子式: $C_{18}H_{14}ClN_2O_3$

4. 分子量: 360.7

5. 熔點: 193-194°C

6. 結構圖:



藥理性質：

苯二氮平類為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氫離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系

統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。[294]

藥動學特性：

口服吸收較快，1~4 小時血藥濃度達峰值，屬長等半衰期苯二氮平類藥。T_{1/2} 為 51~105 小時。本品在肝臟代謝成 descarboxyloflazepate、3-hydroxydescarboxyloflazepate、loflazepate 與葡萄糖醛酸根結合後經尿液排出。[295]

用途用法：

主要用於抗焦慮。口服每日 1~3 mg。

危害及副作用：

較少見的不良反應有；精神混亂，情緒抑鬱，頭痛、噁心、嘔吐、排尿障礙等。

老年、體弱、幼兒、肝病和低蛋白血症患者，對本類藥的中樞性抑制較敏感。注射用藥時容易引起呼吸抑制、低血壓、肌無力、心動過緩或心跳停止；高齡衰老、危重、肺功能不全以及心血管功能不穩定等患者，靜注過速或與中樞抑制藥合用時，發生率更高，情況也更嚴重。持續的精神紊亂，嗜睡深沉，震顫，持續的說話不清，站立不穩，心動過緩，呼吸短促或困難，嚴重的肌無力。 [296]

檢驗方法：

(一)氣相層析法：利用Fused silica capillary管柱。 [293]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、Butabarbital、Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、Hydromorphone、Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、Thiopental。增加本品的生體可用率及藥理作用：Ergotamine。本品與酒精

併服時：增加催眠、鎮靜效果，且作用快速。 [297]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

突然停藥後要注意可能發生撤藥症狀。一般半衰期短或中等的本類藥，停藥後 2—3 天出現，半衰期長者則在停藥後 10—20 天發生。戒斷症狀：較多見的為睡眠困難，異常的激惹狀態和神經質；較少見或罕見的有腹部或胃痙攣、精神錯亂、驚厥、肌肉痙攣、噁心或嘔吐、顫抖、異常的多汗。嚴重的戒斷症狀比較多見於長期服用過量的患者。也有曾在連續服用，血藥濃度一直保持在安全有效範圍內，幾個月後突然停藥而發生。失眠反跳現象、神經質、激惹，多數病人為長時期單次夜間服藥，戒斷後發生。半衰期短的停藥後發生快而嚴重。 [298]

成癮治療之方法與成效評估：

催吐：吐根使用

活性炭吸收：使用最低 240 毫升的水百分之三十克活性碳。

洗胃

監測病人：監測生命體徵

減少呼吸功能：成人 Flumazenil- 0.2-3 mg。Flumazenil 拮抗中樞神經系統的苯二氮類藥物作用，逆轉的苯二氮類的鎮靜作用。

血壓過低： 0.9% NaCl 10-20 ml/kg 靜脈注射 dopamine, norepinephrine。

[299]

第四級管制藥品 — 芬坎法明 (苯苄甲胺) Fencamfamin

項次: 25

名稱:

1. 中文：芬坎法明（苯苄甲胺）
2. 英文：Fencamfamin
3. CAS 編號：2240-14-4

化學性狀：

1. 外觀及性狀：白色結晶固體。可溶於氯仿，不溶於水。容離係數在 25°C 之下 pK_a 8.7。[300]

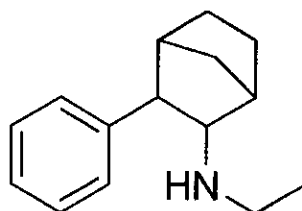
2. 結構式：N-ethyl-3-phenyl-norbornan-2-amine

3. 分子式： $C_{15}H_{21}N$

4. 分子量：215.3

5. 熔點：192°C

6. 結構圖：



藥理性質：

本品為多巴胺的類似劑，其增加多巴胺的方式類似於 amphetamines，但效

率是 dexamphetamine 的十分之一。fencamfamine 並不會抑制 monoamine oxidase 酵素的活性，也因此安全性較高，有些實驗則顯示 opioid receptors 會影響 fencamfamine 的活性，低劑量會導致 paradoxical sedation, 部份 fencamfamine 的作用會被 naloxone 所阻斷。[301]

藥動學特性：

半衰期：由尿液中取得的資料為 16 小時。以去乙基化的方式代謝，約有投與劑量的 10~30% 藥物，結構未經改變，以原形的型式直接由尿液排除，或是在三天之內，藥物會被代謝成 desethylfencamfamin 排出。實際藥物排除速率會受到尿液的酸鹼值影響。[302]

用途用法：

每日用量 30 mg fencamfamin hydrochloride

危害及副作用：

口乾、食慾減低、坐立不安、興奮顫抖。

檢驗方法：

1. 呈色分析：Marquis Test—橘色。Liebermann's Test—橘紅色。
2. 紫外分光光度法：於波長 253、259nm 附近有較大吸收。
3. 氣相層析法
4. 紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 708、756、1042、797、738、1492 cm^{-1}

的位置。

5. 質譜分析：principal ions at m/z 98、215、58、84、91、56、71、186。

[300]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

長期高劑量治療突然中斷後，可能會導致抑鬱症和疲勞。

通常在數週後出現藥物依賴現象，如果這樣應當停止。[301]

成癮治療之方法與成效評估：

在長期使用可能導致嚴重的性皮炎，失眠，煩躁不安，多動，性格變化，思覺失調。一般可以停止藥物幾天或幾週後解決這些問題。

急性中毒時處理方式：

1、不誘導嘔吐。

2、使用活性炭。

2、抽搐時 diazepam 靜脈注射（劑量：成人：從 5 到 10 毫克。兒童： 0.2

至 0.5 毫克/公斤，重複每 5 分鐘視需要）或 lorazepam 靜脈注射（劑量：

成人： 4 日至 8 毫克；兒童： 0.05 至 0.1 毫克/千克）。監測為低血壓，呼

吸抑制，以及需要氣管插管。如果抽搐是無法控制或再次發生，考慮苯巴

比妥。 [302]

第四級管制藥品 — 芬普雷司 (氰乙基安非他命) (Fenproporex)

項次: 26

名稱:

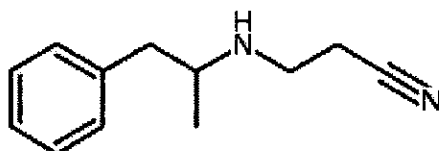
1. 中文: 芬普雷司 (氰乙基安非他命)
2. 英文: Fenproporex
3. CAS 編號: 16397-28-7

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 20 mg

化學性狀:

1. 外觀及性狀: 白色結晶性粉末。溶於水、95%乙醇。[303]
2. 結構式: 3-(1-phenylpropan-2-ylamino)propanenitrile
3. 分子式: $C_{12}H_{16}N_2$
4. 分子量: 188.269
5. 熔點: $146^{\circ}C$
6. 結構圖:



藥理性質：

中樞神經興奮劑。間接擬交感神經興奮作用與 amphetamine 類似。[303]

藥動學特性：

半衰期約 2 小時。

快速代謝，至少 14 種代謝物，主要代謝產物為 amphetamine；其半衰期為給予相等莫耳劑量 amphetamine 所測得半衰期之 2.04 倍。

Amphetamine 蛋白質結合率為 20%，分布體積 3.5-6.11L/kg，半衰期約 10 小時，酸化尿液則加速 amphetamine 的排除。[303]

用途用法：

口服 Fenproporex hydrochloride 每日劑量不超過 20 mg。

危害及副作用：

可有失眠、不安、神經過敏、頭暈、震顫、血壓升高、頭痛、心悸、口幹、噁心、散瞳等。過敏者慎用；高血壓、心血管疾病、甲狀腺功能亢進症患者忌用。由於本品能產生欣快感，故易成癮和產生精神依賴性，不宜長期大量應用。不可同時應用單胺氧化酶抑制劑。

檢驗方法：

4. 紫外分光光度法：於波長 252、257、263nm 附近有較大吸收。

5. 氣相層析法。

6.紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 745、1583、697、1019、707、1139cm-1 的位置。

7.質譜分析：principal ions at m/z 97、56、91、68、132、173。[303]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

主要代謝產物 amphetamine 可能延遲 phenobarbital 的吸收。

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

聯合國國際麻醉藥品管制委員會 2007 年 3 月 1 日發表調查報告指出，巴西是全球減肥藥品濫用最嚴重的國家，而且是兩種具有潛在危險性減肥藥品的最大生產者，其中之一為 fenproporex；急性過量則引起恐慌狀態、攻擊暴力行為、幻覺、驚厥、昏迷甚至死亡。

作為食慾抑制劑，治療肥胖，案例報告顯示，每天使用一錠 fenproporex retard 20mg 五年(建議不超過三個月)，案例逐漸停止了專業活動，接著是社交活動，如案例所言，若沒有服用 fenproporex 錠，已不再能夠執行其日常活動；案例描述 fenproporex 對其作用為具欣快感，接著為攻擊行為，然後沮喪的“循環”。停用後，產生戒斷症狀，強迫性的尋求藥物，伴隨攻擊行為、焦慮、易怒、夢魘、失眠及嚴重憂鬱症。幾年後，案例憂鬱症持續且有自

殺意念。

成癮治療之方法與成效評估:

使用 fenproporex 案例的症狀符合於服用 amphetamine 引起的症狀。安非他命成癮後，大約在停藥廿四小時內，便會有戒斷症狀出現。先是一種被擊垮的感覺、虛脫感，會昏睡二到三天，此時儘量不要干擾，給予支持性療法。之後，會較為清醒，但仍呈現疲倦狀態及情緒低落等情況。較嚴重的時期為時約三星期，建議可用抗憂鬱劑治療，以縮短病程，不過並非必要。至於心理及生理成癮，會有渴望藥物的心理，則需要心理的治療和環境的配合。曾經也有使用藥物治療成功的例子，如服用三環類抗憂鬱劑和鋰鹽等。

有時，有些個案因為長期使用而出現了耐藥性，需要很大的藥量，以致於逐漸有過度使用的傾向，而導致急性中毒。

急性中毒處理:

使用活性炭限制吸收。

Benzodiazepines 為首選初步治療藥物使用於中樞神經系統興奮、癲癇發作、心跳過速、高血壓。

Propofol 與機械性換氣使用於嚴重焦慮、緊張不安。

取決於高血壓的嚴重度，nitrates 與其他抗高血壓劑使用於對 benzodiazepines

未產生反應的高血壓。

β 阻斷劑如 metoprolol 使用於嚴重心室心律不整、心跳過速。

體溫過高(40°C)則降溫與鎮靜。

第四級管制藥品 — 氟地西洋（氟二氮平）(Fludiazepam)

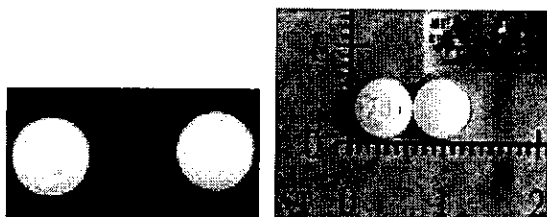
項次: 27

名稱:

1. 中文: 氟地西洋（氟二氮平）
2. 英文: Fludiazepam
3. CAS 編號: 3900-31-0

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 0.25 mg
3. 照片:



化學性狀:

1. 外觀及性狀:

性質: 白色晶性粉末，丙酮、氯仿: 極易溶解。在冰醋酸、甲醇、乙醇和醋酸乙酯、四氯化碳容易溶解。在水中幾乎不溶。

2. 結構式: 英文

9-chloro-6-(2-fluorophenyl)-2-methyl-2,5-diazabicyclo[5.4.0]undeca-5

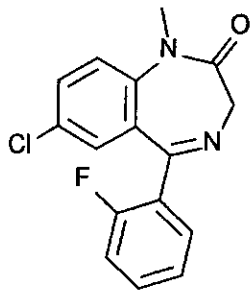
,8,10,12-tetraen-3-one

3. 分子式: $C_{16}H_{12}ClFN_2O$

4. 分子量: 302.7

5. 熔點: 88-92°C

6. 結構圖:



藥理性質：

苯二氮平類為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興

奮性遞質。苯二氮平類增加氯通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氯離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。[304]

藥動學特性：

口服吸收較快，1~4 小時血藥濃度達峰值，屬短半衰期苯二氮平類藥，作用類似於安定（二氮平）(Diazepam)。 $t_{1/2}$ 為 23 小時。重複用藥蓄積甚少，本品在肝臟代謝成血中活性代謝物氟地西洋脫甲基，與葡萄糖醛酸根結合後經尿液排出。

用途用法：

主要用於自律神經失調症、腦性麻痺、半身麻痺引起之不安、緊張、焦躁、抑鬱。建議每日劑量 0.75 mg，分三回口服，且可依年齡，症狀適宜增減之。

危害及副作用：

(1)大量連用，罕見藥物依賴性產生。大量或連用過程中急劇停藥，罕見痙攣，偶見譫妄、震顫、妄想等戒斷症狀。

(2)精神分裂症用藥可出現興奮、錯亂；偶見困倦、頭暈、頭痛、頭重，罕見振奮、焦躁、震顫、眼調節障礙、複視、譫妄、語言障礙。

(3)罕見黃疸。偶見口渴、食欲不振、噁心、噯氣、腹部不適、腹脹、便秘，罕見腹瀉、軟便、流涎增加、燒心。

(4)偶見皮疹，應停藥。偶見疲勞、倦怠、無力感，罕見肌肉鬆弛。

(5)其他：罕見性欲減退、排尿困難、嘶啞、喉塞感、舌尖刺痛感、手麻木、冒汗、微熱、浮腫、尿失禁、經前期緊張、毛髮脫落。 [305]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：於波長 235 nm 附近呈較大吸收。

(二)、高效液相層析：移動相：10mM HClO₄ + 10mM NaClO₄ 70%及 CH₃CN 30% 流速：1.0mL/min. 管柱： ODS。

(三)、氣相層析法：

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、
Butabarbital、Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、
Hydromorphone、Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、
Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、
Thiopental。增加本品的生體可用率及藥理作用：Ergotamine。本品與酒精
併服時：增加催眠、鎮靜效果，且作用快速。[306]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

突然停藥後要注意可能發生撤藥症狀。一般半衰期短或中等的本類藥，停藥後 2—3 天出現，半衰期長者則在停藥後 10—20 天發生。戒斷症狀：較多見的為睡眠困難，異常的激惹狀態和神經質；較少見或罕見的有腹部或胃痙攣、精神錯亂、驚厥、肌肉痙攣、噁心或嘔吐、顫抖、異常的多汗。嚴重的戒斷症狀比較多見於長期服用過量的患者。也有曾在連續服用，血藥濃度一直保持在安全有效範圍內，幾個月後突然停藥而發生。失眠反跳現象、神經質、激惹，多數病人為長時期單次夜間服藥，戒斷後發生。半衰期短的停藥後發生快而嚴重。[307]

成癮治療之方法與成效評估：

催吐：吐根使用

活性炭吸收：使用最低 240 毫升的水百分之三十克活性碳。

洗胃

監測病人：監測生命體徵

減少呼吸功能：成人 Flumazenil- 0.2-3 mg。Flumazenil 拮抗中樞神經系統的

苯二氮類藥物作用，逆轉的苯二氮類的鎮靜作用。

血壓過低：0.9% NaCl 10-20 ml/kg 靜脈注射 dopamine, norepinephrine。

[308]

第四級管制藥品 — 氟安定（氟路洛）(Flurazepam)

項次: 28

名稱:

1. 中文: 氟安定（氟路洛）
2. 英文: Flurazepam
3. CAS 編號: 17617-23-1

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 15 mg
3. 照片:



化學性狀:

1. 外觀及性狀:

性質: 白色結晶性粉末, 可溶於氯仿。[309]

2. 結構式: 英文

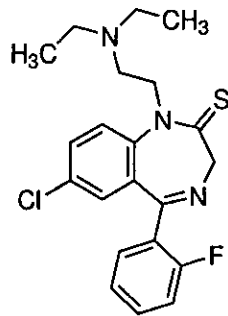
9-chloro-2-(2-diethylaminoethyl)-6-(2-fluorophenyl)-2,5-diazabicyclo[5.4.0]undeca-5,8,10,12-tetraen-3-one

3. 分子式: $C_{21}H_{23}ClFN_3O$

4. 分子量: 387.88

5. 熔點: 77~82°C

6. 結構圖:



藥理性質：

苯二氮平類為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強GABA與其受體

的結合或易化 GABA 受體與氯離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。[310]

藥動學特性：

口服易吸收，70%經由肝臟首渡代謝，主要代謝產物為

N-1-hydroxyethylflurazepam 和 N-1-desalkylflurazepam 皆為活性代謝物。本品 T_{1/2} 為 2~3 時，N-1-desalkylflurazepam T_{1/2} 為 2~3 天，

N-1-hydroxyethylflurazepam T_{1/2} 為 10~20 時。血漿蛋白結合率為 97%，

N-1-desalkylflurazepam T_{1/2} 為 98%，N-1-hydroxyethylflurazepam T_{1/2} 為

90%。屬長效型苯二氮平類藥。口服後 15~45 分鐘作用開始，0.5~1 小時血藥濃度達峰值。7~10 天血藥濃度達穩態。經腎排泄，代謝物可滯留在血液中數天。[311]

用途用法：

成人常用量口服。

治療各種失眠，如入睡困難、夜間多夢易醒和早醒。口服 15~30 mg，睡前服。老年或體弱者一次 15 mg。[312]

危害及副作用：

可能會發生在病人和更有可能較高的劑量。過敏反應的發生，如蕁麻疹，呼吸困難，腫脹的臉，嘴唇。醫療也應注意要求立即跡象，如果黃疸出現，如泛黃的皮膚或眼睛。其他副作用可能發生的內容如下：

昏睡

下跌禁忌，沒有恐懼的危險（風險增加行為）

抑鬱情緒與思想的自殺或自我傷害

幻覺，情緒和敵意

感覺頭暈，輕為首的或昏厥

小便比平時少或沒有在所有

頭痛，疲勞，關節痛及不尋常的弱點（流感樣症狀）

言語問題，

完整的記憶喪失，（失憶症）和濃度的問題

胃口的變化（包括變化的重量）

視力模糊，不穩定和（受損的協調和平衡）

便秘，腹瀉，噁心和嘔吐

減少性別驅動器

口乾或增加

緊張，不安，失眠和出汗

的衝擊，在胸部或快速的心跳

皮膚炎症

肌肉抽搐，震顫及檢取（驚厥）。[313]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：酸性溶液中於波長 236 nm 附近呈最大吸收。鹼性溶液中於波長 231、312 nm 附近呈較大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1672、1613、1316、1211、1171、1100 cm^{-1} 的位置。

(四)質譜分析：分裂於 m/z 86、87、99、58、84、387、315、56。

N-1-desalkylflurazepam m/z 30、313、246、211、273、274、302、183。

N-1-hydroxyethylflurazepam m/z 288、273、331、287、304、290、289、275。

[314]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、

Butobarbital、Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、

Hydromorphone、Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、

Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、

Thiopental。增加本品的生體可用率及藥理作用：Ergotamine。本品與酒精

併服時：增加催眠、鎮靜效果，且作用快速。[315]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

突然停藥後要注意可能發生撤藥症狀。一般半衰期短或中等的本類藥，停

藥後 2—3 天出現，半衰期長者則在停藥後 10—20 天發生。戒斷症狀：較

多見的為睡眠困難，異常的激惹狀態和神經質；較少見或罕見的有腹部或

胃痙攣、精神錯亂、驚厥、肌肉痙攣、噁心或嘔吐、顫抖、異常的多汗。

嚴重的戒斷症狀比較多見於長期服用過量的患者。也有曾在連續服用，血

藥濃度一直保持在安全有效範圍內，幾個月後突然停藥而發生。失眠反跳

現象、神經質、激惹，多數病人為長時期單次夜間服藥，戒斷後發生。半衰期短的停藥後發生快而嚴重。[315]

成癮治療之方法與成效評估：

催吐：吐根使用

活性炭吸收：使用最低 240 毫升的水百分之三十克活性碳。

洗胃

監測病人：監測生命體徵

減少呼吸功能：成人 Flumazenil- 0.2-3 mg。Flumazenil 拮抗中樞神經系統的苯二氮類藥物作用，逆轉的苯二氮類的鎮靜作用。

血壓過低： 0.9% NaCl 10-20 ml/kg 靜脈注射 dopamine, norepinephrine。

[316]

第四級管制藥品 — 哈拉西洋 (三氟氮平) (Halazepam)

項次: 29

名稱:

1. 中文: 哈拉西洋 (三氟氮平)
2. 英文: Halazepam
3. CAS 編號: 23092-17-3

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 0.25 mg

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

性質: 白色乙醚晶性粉末。[317]

2. 結構式: 英文

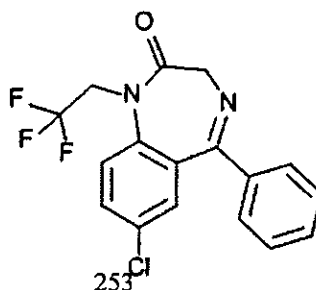
9-chloro-6-phenyl-2-(2,2,2-trifluoroethyl)-2,5-diazabicyclo[5.4.0]undeca-5,8,10,12-tetraen-3-one

3. 分子式: $C_{17}H_{12}ClF_3N_2O$

4. 分子量: 352.7

5. 熔點: 193-194°C

6. 結構圖:



藥理性質：

苯二氮平類為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氫離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：

在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。[318]

藥動學特性：

口服吸收較快，屬長等半衰期苯二氮平類藥。本品在肝臟代謝成 desmethyldiazepam，雖然本品在血漿中 12 小時內為不穩定，但是代謝物在血漿後 14 天內仍穩定存在。本品 T_{1/2} 為 34.7 小時，代謝物 desmethyldiazepam T_{1/2} 為 50~100 小時。屬高蛋白質結合藥物。[317]

用途用法：

主要用於抗焦慮。口服每日 20-40 mg 3-4 次，每日劑量為 80-160 mg/day。

危害及副作用：

較少見的不良反應有；精神混亂，情緒抑鬱，頭痛、噁心、嘔吐、排尿障礙等。老年、體弱、幼兒、肝病和低蛋白血症患者，對本類藥的中樞性抑制較敏感。注射用藥時容易引起呼吸抑制、低血壓、肌無力、心動過緩或心跳停止；高齡衰老、危重、肺功能不全以及心血管功能不穩定等患者，

靜注過速或與中樞抑制藥合用時，發生率更高，情況也更嚴重。持續的精神紊亂，嗜睡深沉，震顫，持續的說話不清，站立不穩，心動過緩，呼吸短促或困難，嚴重的肌無力。[319]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：溶液中於波長230 nm附近呈最大吸收。

(二)高效液相層析法：利用 silica capillary 管柱。

(三)質譜分析：

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、Butabarbital、Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、Hydromorphone、Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、Thiopental。增加本品的生體可用率及藥理作用：Ergotamine。本品與酒精併服時：增加催眠、鎮靜效果，且作用快速。[320]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

突然停藥後要注意可能發生撤藥症狀。一般半衰期短或中等的本類藥，停

藥後 2—3 天出現，半衰期長者則在停藥後 10—20 天發生。戒斷症狀：較多見的為睡眠困難，異常的激惹狀態和神經質；較少見或罕見的有腹部或胃痙攣、精神錯亂、驚厥、肌肉痙攣、噁心或嘔吐、顫抖、異常的多汗。嚴重的戒斷症狀比較多見於長期服用過量的患者。也有曾在連續服用，血藥濃度一直保持在安全有效範圍內，幾個月後突然停藥而發生。失眠反跳現象、神經質、激惹，多數病人為長時期單次夜間服藥，戒斷後發生。半衰期短的停藥後發生快而嚴重。[321]

成癮治療之方法與成效評估：

催吐：吐根使用

活性炭吸收：使用最低 240 毫升的水百分之三十克活性碳。

洗胃

監測病人：監測生命體徵

減少呼吸功能：成人 Flumazenil- 0.2-3 mg。Flumazenil 拮抗中樞神經系統的苯二氮類藥物作用，逆轉的苯二氮類的鎮靜作用。

血壓過低： 0.9% NaCl 10-20 ml/kg 靜脈注射 dopamine, norepinephrine。

[322]

第四級管制藥品 — 鹵噁唑他（鹵 唑侖）(Haloxazolam)

項次: 30

名稱:

1. 中文: 鹵噁唑他（鹵 唑侖）
2. 英文: Haloxazolam
3. CAS 編號: 59128-97-1

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 10 mg

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

性質: 本品為白色結晶或結晶性粉末, 易溶於冰醋酸, 難溶於甲醇、無水乙醇, 幾乎不溶於水。

2. 結構式: 英文

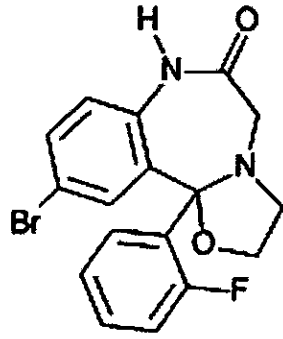
10-Bromo-11b-(2-fluorophenyl)-2,3,7,11b-tetrahydrooxazolo[3,2-*d*][1,4]benzodiazepin-6(5*H*)-one

3. 分子式: $C_{17}H_{14}BrFN_2O_2$

4. 分子量: 377.208

5. 熔點: 179~184°C

6. 結構圖：



藥理性質：

苯二氮平類為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氫離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦

幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。[323]

藥動學特性：

口服後迅速吸收，30 分鐘分佈於全身組織，60 分鐘達峰濃度，2~3 天幾乎自體內全部消失。主要由肝臟代謝，腎臟排出。

用途用法：

本品治療神經障礙所致的失眠、焦慮或焦慮抑鬱症。口服：5~10 mg，睡前服。片劑：4 mg；10 mg。顆粒劑：每 g 含 10 mg。

危害及副作用：

較少見的不良反應有；精神混亂，情緒抑鬱，頭痛、噁心、嘔吐、排尿障礙等。老年、體弱、幼兒、肝病和低蛋白血症患者，對本類藥的中樞性抑

制較敏感。注射用藥時容易引起呼吸抑制、低血壓、肌無力、心動過緩或心跳停止；高齡衰老、危重、肺功能不全以及心血管功能不穩定等患者，靜注過速或與中樞抑制藥合用時，發生率更高，情況也更嚴重。持續的精神紊亂，嗜睡深沉，震顫，持續的說話不清，站立不穩，心動過緩，呼吸短促或困難，嚴重的肌無力。 [324]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：溶液中於波長230 nm附近呈最大吸收。

(二)高效液相層析法：利用 silica capillary 管柱。

(三)質譜分析：

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、

Butabarbital、Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、

Hydromorphone、Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、

Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、

Thiopental。增加本品的生體可用率及藥理作用：Ergotamine。本品與酒精

併服時：增加催眠、鎮靜效果，且作用快速。[335]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

突然停藥後要注意可能發生撤藥症狀。一般半衰期短或中等的本類藥，停藥後 2—3 天出現，半衰期長者則在停藥後 10—20 天發生。戒斷症狀：較多見的為睡眠困難，異常的激惹狀態和神經質；較少見或罕見的有腹部或胃痙攣、精神錯亂、驚厥、肌肉痙攣、噁心或嘔吐、顫抖、異常的多汗。嚴重的戒斷症狀比較多見於長期服用過量的患者。也有曾在連續服用，血藥濃度一直保持在安全有效範圍內，幾個月後突然停藥而發生。失眠反跳現象、神經質、激惹，多數病人為長時期單次夜間服藥，戒斷後發生。半衰期短的停藥後發生快而嚴重。[325]

成癮治療之方法與成效評估：

催吐：吐根使用

活性炭吸收：使用最低 240 毫升的水百分之三十克活性碳。

洗胃

監測病人：監測生命體徵

減少呼吸功能：成人 Flumazenil- 0.2-3 mg。Flumazenil 拮抗中樞神經系統的苯二氮類藥物作用，逆轉的苯二氮類的鎮靜作用。

血壓過低： 0.9% NaCl 10-20 ml/kg 靜脈注射 dopamine, norepinephrine。

[326]

第四級管制藥品 — 凱他唑他 (酮 唑 侖) (Ketazolam)

項次: 31

名稱:

1. 中文: 凱他唑他 (酮 唑 侖)

2. 英文: Ketazolam

3. CAS 編號: 27223-35-4

製劑:

8. 劑型: 膠囊劑

9. 劑量: 15mg、30 mg

化學性狀:

1. 外觀及性狀: 白色結晶性粉末，微溶於水。[327]

2. 結構式: (R)-11-chloro-2,8-dimethyl-

12b-phenyl-8,12b-dihydro-4H-benzo

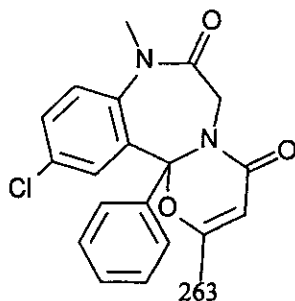
[f][1,3]oxazino[3,2-d][1,4]diazepine-4,7(6H)-dione

3. 分子式: $C_{20}H_{17}ClN_2O_3$

4. 分子量: 368.8

5. 熔點: 183°C

6. 結構圖:



藥理性質：

苯二氮平類為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氫離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：

在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。[328]

藥動學特性：

口服吸收較快，屬長半衰期苯二氮平類藥。本品血漿蛋白結合率約為 93%。本品在肝臟代謝成活性代謝物 Diazepam、Oxazepam、N-desmethyldiazepam，僅 2%~3%以原形從尿液排出。本品 T_{1/2} 為 1.5 小時，其活性代謝物 Oxazepam 為 4~25 小時，Diazepam 為 20~100 小時。[329]

用途用法：

主要用於抗焦慮，亦可用于鎮靜催眠。口服一日 15—60mg，分次服，按反應和病情調整劑量。[327]

危害及副作用：

較少見的不良反應有；精神混亂，情緒抑鬱，頭痛、噁心、嘔吐、排尿障礙等。老年、體弱、幼兒、肝病和低蛋白血症患者，對本類藥的中樞性抑制較敏感。注射用藥時容易引起呼吸抑制、低血壓、肌無力、心動過緩或

心跳停止；高齡衰老、危重、肺功能不全以及心血管功能不穩定等患者，靜注過速或與中樞抑制藥合用時，發生率更高，情況也更嚴重。持續的精神紊亂，嗜睡深沉，震顫，持續的說話不清，站立不穩，心動過緩，呼吸短促或困難，嚴重的肌無力。[330]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：乙醇溶液中於波長 242 nm 附近呈較大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1675、820、1105、1195、1308、1242 cm^{-1} 的位置。

(四)、質譜分析：分裂於 m/z 256、284、283、285、84、257、258、255。

Oxazepam 分裂於 m/z 257、77、268、239、205、267、233、259。

(五)、呈色反應：甲醛-硫酸成橘色。[331]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、Butobarbital、Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、Hydromorphone、Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、

Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、Thiopental。本品與酒精併服時：增加催眠、鎮靜效果，且作用快速。[332]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀):

突然停藥後要注意可能發生撤藥症狀。停藥後 2—3 天出現，半衰期長者則在停藥後 10—20 天發生。戒斷症狀：較多見的為睡眠困難，異常的激惹狀態和神經質；較少見或罕見的有腹部或胃痙攣、精神錯亂、驚厥、肌肉痙攣、噁心或嘔吐、顫抖、異常的多汗。嚴重的戒斷症狀比較多見於長期服用過量的患者。也有曾在連續服用，血藥濃度一直保持在安全有效範圍內，幾個月後突然停藥而發生。失眠反跳現象、神經質、激惹，多數病人為長時期單次夜間服藥，戒斷後發生。半衰期短的停藥後發生快而嚴重。[333]

成癮治療之方法與成效評估:

催吐：吐根使用

活性炭吸收：使用最低 240 毫升的水百分之三十克活性碳。

洗胃

監測病人：監測生命體徵

減少呼吸功能：成人 Flumazenil- 0.2-3 mg。Flumazenil 拮抗中樞神經系統的苯二氮類藥物作用，逆轉的苯二氮類的鎮靜作用。

血壓過低：0.9% NaCl 10-20ml/kg 靜脈注射 dopamine、norepinephrine。[334]

第四級管制藥品 — 勒非他命 (二甲二苯乙胺) Lefetamine、

1-dimethylamino-1,2-diphenylethane、SPA

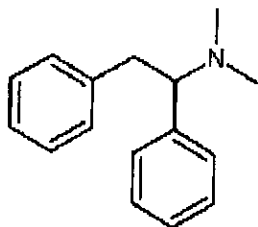
項次:32

名稱：

1. 中文：勒非他命 (二甲二苯乙胺)
2. 英文：Lefetamine、1-dimethylamino-1,2-diphenylethane、SPA
3. CAS 編號：7262-75-1

化學性狀：

1. 結構式：(R)-N,N-dimethyl-1,2-diphenylethanamine
2. 分子式：C₁₆H₁₉N
3. 分子量：225.329
4. 沸點：142-147°C
5. 結構圖：



藥理性質：

麻醉藥，屬於半類似鴉片藥物 (opioid partial agonist) lefetamine 是一種精神科藥物，其中有類似的效果都嗎啡和哌醋甲酯(methylphenidate)。由於其化學結構，它結合到鴉片受體的同時抑制多巴胺和正腎上腺素的再吸收。

lefetamine 有必須有四級胺的官能機結構，用於鴉片受體的識別，以及 phenethylamine 骨架（該部分產生和安非他明一樣的效果）。其販售的商品名為 Santenol。Lefetamine 用於鴉片成癮者可以減輕鴉片戒斷且不會突然出現戒斷症狀。[335]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

增加中樞神經系統及呼吸系統的抑制作用：Adinazolam、Alprazolam、Amobarbital、Aprobarbita、Bromazepam、Butalbital、Clobazam、Clonazepam、Clorazepate、Diazepam、Estazolam、Fentanyl、Flunitrazepam、Hydrocodone、Lormetazepam、Meperidine、Morphine、Phenobarbital、Triazolam。產生戒斷症狀：Buprenorphine。本品與酒精併用會產生加成或是協同之中樞神經抑制作用，可能造成病患之肌肉動作不協調。[336]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

中毒劑量之可待因會造成失去意識、瞳孔成針狀、呼吸緩慢、發紺等等。最危險的作用是呼吸抑制，於口服後 2-4 小時內可能引起呼吸衰竭。本品也可能引發痙攣。可能可以觀察到病患有幻覺、發抖、無法控制肌肉動作、精神上的壓抑及皮膚疹等情形。戒斷症狀包括打呵欠、流淚、嚴重腸胃道

不適、發燒或冷顫、流汗、瞳孔放大、肌痛、失眠、增加呼吸速率等。診斷：昏迷、針狀瞳孔及呼吸抑制為鴉片類藥物中毒時最典型的症狀，可待因中毒時也常見有蕁麻疹產生。病患的尿液及血液可作生化及毒理分析。

[337]

成癮治療方法：

於急性、嚴重中毒之病患，需建立暢通之呼吸道，提供人工通氣、氧氣及監視血液動力學狀態。具有意識之病患，考慮給予洗胃。病患於服用後一至二小時內可投予活性碳。建議的解毒劑為靜脈注射投予 0.4 毫克

naloxone，需要時每二至三分鐘反覆給藥直到恢復。休克時經靜脈給予液體、加壓藥物及其他支持治療需維持體溫。[337]

第四級管制藥品 — 氯普唑他 (氯 唑侖) (Loprazolam)

項次: 33

名稱:

1. 中文: 氯普唑他 (氯 唑侖)
2. 英文: Loprazolam
3. CAS 編號: 61197-73-7

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 1 mg

化學性狀:

1. 外觀及性狀: 白色結晶粉末。

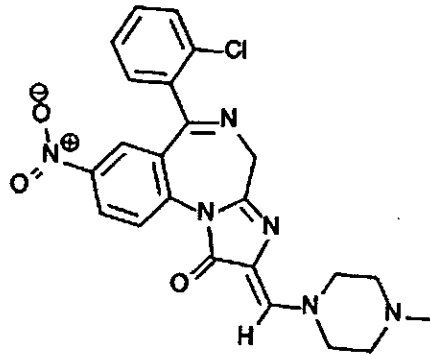
Loprazolam Mesilate: 黃色結晶粉末, 熔融溫度: 為 242-245°C。[338]

2. 結構式:

(2Z)-6-(2-Chlorophenyl)-2-[(4-methyl-1-piperazinyl)methylene]-
8-nitro-2,4-dihydro-1H-imidazo[1,2-a][1,4]benzodiazepin-1-on

3. 分子式: $C_{23}H_{21}ClN_6O_3$
4. 分子量: 464.904
5. 熔點: 為 214-215°C

6. 結構圖：



藥理性質：

本品為短中效型苯二氮平類安眠劑之一，為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氫離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。

刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。有良好的抗焦慮作用。本品具有抗焦慮、抗痙攣及骨骼肌放鬆作用。[339]

藥動學特性：

本品之血漿蛋白結合率約 80%。本品主要經肝臟代謝

Piperazine-N-oxide 為其活性代謝物。半衰期為 4-11 小時。[340]

用途用法：

口服：每次 1mg，睡前服，必要時可增至 1.5—2mg。

年老或體弱者初次劑量宜從 0.5mg 開始，最大不得超過 1mg。[338]

危害及副作用：

使用本品通常有口乾、想睡、噁心嘔吐、視覺模糊、頭痛、頭暈目眩、發抖的情形。

可能出現手腳及眼睛不能自主運動、興奮、不正常瘀青。

本品也可能造成皮膚起紅疹、發癢、幻覺等情形。[341]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：本品溶於乙醇溶液中於 330nm 有最大吸收。

(二)、遠紅外光光譜：主峰出現在 1628、1610、1045、1182、1192 及 1518 cm^{-1} 處。

(三)、氣相層析法[342]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

加強中樞神經及呼吸系統之抑制作用：Amobarbital、Aprobarbital、

Butobarbital、Codeine、Fentanyl、Hydrocodone、Hydromophone、Kava、

Meperidine、Morphine、Phenobarbital、Secobarbital。本品與酒精併用會造成鎮靜作用增加。[343]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀):

過量使用本品會影響中樞神經並造成呼吸抑制。病患會有矛盾的興奮，但單獨使用本品少見引起死亡。診斷主要依照過去病人是否曾使用過量或是觀察臨床表徵。另可投予 flumazenil 來診斷是否為過量使用。[344]

成癮治療之方法與成效評估：

- 1、大多數苯重氮基鹽類安眠劑之中毒只需要臨床上的觀察及支持性照護。
- 2、可使用活性碳清除腸胃內殘餘之藥物，不常利用洗胃。
- 3、不可催吐。
- 4、使用 flumazenil 可反轉嚴重的呼吸抑制或是心血管系統之併發症。但病患患有癲癇發作時禁忌使用 flumazenil。[345]

第四級管制藥品 — 勞拉西洋 (樂耐平) (Lorazepam)

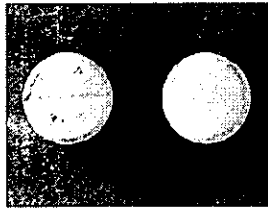
項次: 34

名稱:

1. 中文: 勞拉西洋 (樂耐平)
2. 英文: Lorazepam
3. CAS 編號: 846-49-1

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 0.5 mg、1 mg、2 mg
3. 照片:



化學性狀:

1. 外觀及性狀: 白色粉末。溶解度: 25°C 時之溶解度為 0.08 毫克/毫升水; 3 毫克/毫升氯仿; 14 毫克/毫升乙醇; 30 毫克/毫升乙酸乙酯。

[346]

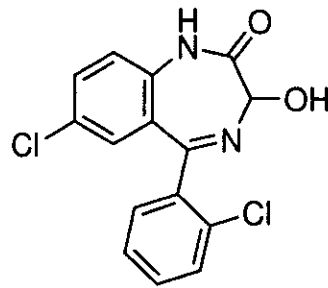
2. 結構式: 9-chloro-6-(2-chlorophenyl)-4-hydroxy-2,5-diazabicyclo[5.4.0]undeca-5,8,10,12-tetraen-3-one

3. 分子式: $C_{15}H_{10}Cl_2N_2O_2$

4. 分子量: 321.2

5. 熔點: 166-168°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為短效型苯二氮平類安眠劑中的鎮靜安眠劑之一，為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯

為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氯通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氯離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癲灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。[347]

藥動學特性：

本品口服快速吸收，口服之生體可用率為 95%，可以通過血腦屏障及胎盤。血漿蛋白結合率為 90%，主要由肝臟代謝與葡萄糖醛酸結合後經尿液排出。T_{1/2} 為 9~24 小時。[348]

用途用法：

焦慮：一天 1~6mg，分 2~3 次服用。極量：一天 10mg。

失眠又焦慮：1~4mg，睡前服用。[346]

危害及副作用：

較少見的不良反應有；精神混亂，情緒抑鬱，頭痛、噁心、嘔吐、排尿障礙等。

老年、體弱、幼兒、肝病和低蛋白血症患者，對本類藥的中樞性抑制較敏感。注射用藥時容易引起呼吸抑制、低血壓、肌無力、心動過緩或心跳停止；高齡衰老、危重、肺功能不全以及心血管功能不穩定等患者，靜注過速或與中樞抑制藥合用時，發生率更高，情況也更嚴重。持續的精神紊亂，嗜睡深沉，震顫，持續的說話不清，站立不穩，心動過緩，呼吸短促或困難，嚴重的肌無力。[350]

檢驗方法：

一、呈色分析：1.本品遇 Formaldehyde-Sulfuric Acid—呈橘色。

二、質譜：分裂於 m/z 291、239、274、293、75、302、276、138。

三、紫外分光光度法：本品於乙醇溶液中 230 及 316 nm 有吸收。四、遠紅

外光光譜：以 KBr 錠法檢測本品，主峰出現在 1685、1149、1317、1120、1605、826 cm^{-1} 處。

五、氣相層析法。[351]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

加強中樞神經及呼吸系統之抑制作用：Amobarbital、Aprobarbital、Butabarbital、Codeine、Fentanyl、Hydrocodone、Hydromorphone、Kava、Meperidine、Morphine、Phenobarbital、Secobarbital。[352]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

突然停藥後要注意可能發生撤藥症狀。一般半衰期短或中等的本類藥，停藥後 2—3 天出現，半衰期長者則在停藥後 10—20 天發生。戒斷症狀：較多見的為睡眠困難，異常的激惹狀態和神經質；較少見或罕見的有腹部或胃痙攣、精神錯亂、驚厥、肌肉痙攣、噁心或嘔吐、顫抖、異常的多汗。嚴重的戒斷症狀比較多見於長期服用過量的患者。也有曾在連續服用，血藥濃度一直保持在安全有效範圍內，幾個月後突然停藥而發生。失眠反跳現象、神經質、激惹，多數病人為長時期單次夜間服藥，戒斷後發生。半衰期短的停藥後發生快而嚴重。[352]

成癮治療之方法與成效評估：

- 1、大多數苯重氮基鹽類安眠劑之中毒只需要臨床上的觀察及支持性照護。
- 2、可使用活性炭清除腸胃內殘餘之藥物，不常利用洗胃。

3、不可催吐。

4、使用 flumazenil 可反轉嚴重的呼吸抑制或是心血管系統之併發症。但病患有癲癇發作時禁忌使用 flumazenil。[353]

第四級管制藥品—氯甲西洋（甲基樂耐平）（Lormetazepam）

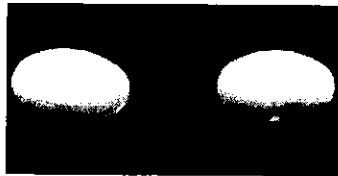
項次: 35

名稱:

1. 中文: 氯甲西洋（甲基樂耐平）
2. 英文: Lormetazepam
3. CAS 編號: 848-75-9

製劑:

1. 劑型: 錠劑、膠囊劑
2. 劑量: 0.5 mg、1mg、2mg
3. 照片:

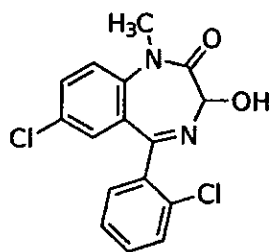


化學性狀:

1. 外觀及性狀: 白色結晶性粉末，不溶於水，略溶於甲醇、乙醇，易溶於氯仿。[354]
2. 結構式: 9-chloro-6-(2-chlorophenyl)-4-hydroxy-2-methyl-2,5-diazabicyclo[5.4.0]undeca-5,8,10,12-tetraen-3-one
3. 分子式: $C_{16}H_{12}Cl_2N_2O_2$
4. 分子量: 335.2

5. 熔點: 209~211°C

6. 結構圖:



藥理性質：

苯二氮平類為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氫離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系

統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。[355]

藥動學特性：

口服吸收較快，1~4 小時血藥濃度達峰值，屬短至中等半衰期苯二氮平類藥。本品血漿蛋白結合率約為 90%，T_{1/2} 為 10 小時。本品在肝臟代謝由 N-demethylation 代謝成 Lorazepam。將近 80% 會在 72 小時中以 Lormetazepam 葡萄糖醛酸結合物經尿液排出，僅 6% Lorazepam 葡萄糖醛酸結合物排出。[356]

用途用法：

用于鎮靜催眠。口服一日 0.5~2 mg，分次服，按反應和病情調整劑量。[354]

危害及副作用：

較少見的不良反應有；精神混亂，情緒抑鬱，頭痛、噁心、嘔吐、排尿障礙等。老年、體弱、幼兒、肝病和低蛋白血症患者，對本類藥的中樞性抑制較敏感。注射用藥時容易引起呼吸抑制、低血壓、肌無力、心動過緩或心跳停止；高齡衰老、危重、肺功能不全以及心血管功能不穩定等患者，靜注過速或與中樞抑制藥合用時，發生率更高，情況也更嚴重。持續的精神紊亂，嗜睡深沉，震顫，持續的說話不清，站立不穩，心動過緩，呼吸短促或困難，嚴重的肌無力。[357]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：酸性溶液中於波長 231、311 nm 附近呈較大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1682、1153、1121、1315、1610、843 cm^{-1} 的位置。

(四)質譜分析：分裂於 m/z 305、307、306、309、308、334、102、75。

(五)、呈色分析：本品遇到 Formaldehyde-Sulfuric Acid 呈橘色。[358]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、
Butabarbital、Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、
Hydromorphone、Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、
Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、
Thiopental。增加本品的生體可用率及藥理作用：Ergotamine。本品與酒精
併服時：增加催眠、鎮靜效果，且作用快速。[359]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀):

突然停藥後要注意可能發生撤藥症狀。一般半衰期短或中等的本類藥，停藥後 2~3 天出現，半衰期長者則在停藥後 10~20 天發生。戒斷症狀：較多見的為睡眠困難，異常的激惹狀態和神經質；較少見或罕見的有腹部或胃痙攣、精神錯亂、驚厥、肌肉痙攣、噁心或嘔吐、顫抖、異常的多汗。嚴重的戒斷症狀比較多見於長期服用過量的患者。也有曾在連續服用，血藥濃度一直保持在安全有效範圍內，幾個月後突然停藥而發生。失眠反跳現象、神經質、激惹，多數病人為長時期單次夜間服藥，戒斷後發生。半衰期短的停藥後發生快而嚴重。[360]

成癮治療之方法與成效評估:

催吐：吐根使用

活性炭吸收：使用最低 240 毫升的水百分之三十克活性炭。

洗胃

監測病人：監測生命體徵

減少呼吸功能：成人 Flumazenil- 0.2-3 mg， 0.2mg。Flumazenil 拮抗中樞

神經系統的苯二氮類藥物作用，逆轉的苯二氮類的鎮靜作用。

血壓過低： 0.9% NaCl 10-20ml/kg 靜脈注射, dopamine, norepinephrine。

[361]

第四級管制藥品 一嗎引哌（咪唑引哌）Mazindol

項次: 36

名稱：

1. 中文：嗎引哌（咪唑引哌）
2. 英文：Mazindol
3. CAS 編號：22232-71-9

製劑：

1. 劑型：錠劑
2. 劑量：1.0 毫克；2.0 毫克

化學性狀：

1. 外觀及性狀：結晶型，可溶於酒精，不溶於水。[362]

2. 結構式：

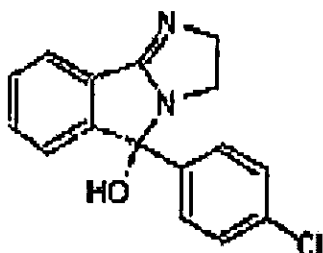
5-(4-Chlorophenyl)-2,5-dihydro-3H-imidazo[2,1-a]isoindol-5-ol

3. 分子式：C₁₆H₁₃ClN₂O

4. 分子量：284.74

5. 熔點：198~199°C

6. 結構圖：



藥理性質：

Mazindol 是仿交感神經作用的胺類，類似安非他命。Mazindol 是三環咪唑異吡啶結構，不同於芳香胺類食欲抑制劑，它主要通過大腦中隔區調節擬交感神經作用，刺激飽腹中樞，使人產生飽食感，並抑制胃酸分泌，促進代謝，減輕體重，同時在降重過程中降低對胰島素的抵抗及調脂作用。因本品抑制食慾的效果在使用幾週之後便會下降。所以，只用在減肥療程的前幾週。用於短期治療肥胖症。[363]

藥動學特性：

口服後易被胃腸道吸收，2~4 小時達血濃度峰值，作用週期 8~15 小時，半衰期為 12~24 小時，排除半衰期（Elimination Half-life）為 30~50 小時，蛋白質結合率 93%。本品經由肝臟代謝，本品經口服吸收之後，會緩慢的藉由尿液或是糞便排除，單一 2-mg 的口服劑量，在體內經過 96 小時之後，有 39% 會在尿液中被發現；少於 10% 的劑量，未經代謝，直接被排除到尿液中。2-(p-chlorobenzoyl)-N-2(aminoethyl) benzamide 代謝物的排除半衰期（Elimination Half-life）為 5.25 天。[364][365]

用途用法：

口服。食欲抑制劑，適用於治療單純性肥胖症。一般劑量為一次 0.5mg，一日 1 次，飯前服用。一日最大劑量不超過 1.5mg，分 2~3 次飯前服用，8

~12周為一個療程。本品可用於治療癌症、Cataplexy - Narcolepsy (猝倒症—嗜眠病)、古柯鹼成癮 (Cocaine dependence)、Duchenne muscular dystrophy、嗜睡、肥胖、精神分裂症。[366]

危害及副作用：

對過敏者禁用。嚴重腎、肝、心功能不全及心律不齊，嚴重高血壓，興奮過度者和青光眼患者禁用，孕婦及哺乳期婦女，少兒禁用。服用同時禁服神經元阻斷型降壓藥，如胍乙啶，貝坦尼啶等，服用單胺氧化酶抑制劑期間或用後二周內不得服用。糖尿病患者使用可能影響胰島素及降血糖藥物效果，故在治療期間應監測患者代謝狀況，必要時應適當調整胰島素及降糖藥物劑量。高血壓患者使用時，應注意血壓監測。可能增加外源性兒茶酚胺效應，故使用腎上腺素類藥物應密切監測患者心血管系統反應。具有興奮作用，司機或操縱機器者須慎用。[367]

檢驗方法：

1. 呈色分析：Sulfuric acid—橘色。
2. 紫外分光光度法：本品溶於酸性水溶液中於波長 271nm 有吸收。
3. 氣相層析法
4. 紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 763、1656、1063、1175、674、 1093cm^{-1} 的位置。

5. 質譜分析：principal ions at m/z 266、268、267、255、231、102、88、176。[362]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

馬吶哝過量症狀，包括躁動，震顫，呼吸急促，意識混亂，幻覺，恐慌，有傾犯傾向，噁心，嘔吐，腹瀉，心律不整。[368]

成癮治療方法：

過量使用本品時治療方法：

1、生命支持：支持呼吸系統和心血管功能。

2、監測：

a 監測心率和血壓。

b 監測為體溫 40 度以上危及生命，立即降低體溫和鎮靜。

c 監測血清電解質，腎功能，酸鹼平衡，肝酶的病人有顯著的毒性。

抽搐時 diazepam 靜脈注射（劑量：成人：從 5 到 10 毫克。兒童： 0.2 至 0.5 毫克/公斤，重複每 5 分鐘視需要）或 lorazepam 靜脈注射（劑量：成人：4 日至 8 毫克；兒童： 0.05 至 0.1 毫克/千克）。監測為低血壓，呼吸抑制，以及需要氣管插管。如果抽搐是無法控制或再次發生，考慮苯巴比妥。[369]

第四級管制藥品 — 美達西洋 (美達氮平) (Medazepam)

項次: 37

名稱:

1. 中文: 美達西洋 (美達氮平)
2. 英文: Medazepam
3. CAS 編號: 2898-12-6

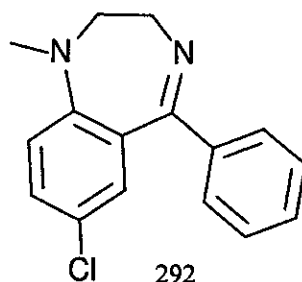
製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 10 mg

化學性狀:

1. 外觀及性狀: 白色或微黃色結晶性粉末，難溶於水；可 1:8 溶於乙醇中；1:1 於氯仿中；1:5 於乙醚中。[370]
2. 結構式: 9-chloro-2-methyl-6-phenyl-2,5-diazabicyclo[5.4.0]undeca-5,8,10,12-tetraene
3. 分子式: $C_{16}H_{15}ClN_2$
4. 分子量: 270.8
5. 熔點: 95~97°C

6. 結構圖:



藥理性質：

苯二氮平類為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氫離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究體示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：

在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。[371]

藥動學特性：

口服吸收較快，屬長半衰期苯二氮平類藥。本品血漿蛋白結合率約為 100%。本品在肝臟代謝成活性代謝物 Diazepam、Oxazepam、N-desmethyldiazepam、Desmethyldiazepam，僅 2%~3%以原形從尿液排出。本品 T_{1/2} 為 1~2 小時，其活性代謝物 Oxazepam 為 4~25 小時，Diazepam 為 20~100 小時，Desmethyldiazepam 為 40~100 小時。[372]

用途用法：

主要用於抗焦慮，亦可用于鎮靜催眠。口服一次 10~20mg，分次服，按反應和病情調整劑量，每日不可超過 60mg。[370]

危害及副作用：

較少見的不良反應有；精神混亂，情緒抑鬱，頭痛、噁心、嘔吐、排尿障礙等。

老年、體弱、幼兒、肝病和低蛋白血症患者，對本類藥的中樞性抑制較敏感。注射用藥時容易引起呼吸抑制、低血壓、肌無力、心動過緩或心跳停止；高齡衰老、危重、肺功能不全以及心血管功能不穩定等患者，靜注過速或與中樞抑制藥合用時，發生率更高，情況也更嚴重。持續的精神紊亂，嗜睡深沉，震顫，持續的說話不清，站立不穩，心動過緩，呼吸短促或困難，嚴重的肌無力。[373]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：於酸性溶液中於波長 253 nm 附近呈較大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶 1610、1178、1298、700、1255、815 cm^{-1} 的位置。

(四)、質譜分析：分裂於 m/z 242、207、244、270、243、271、269、165。

Oxazepam 分裂於 m/z 257、77、268、239、205、267、233、259。

Nordazepam 分裂於 m/z 242、269、270、241、243、271、244、272。

Desmethylnedazepam 分裂於 m/z 195、255、228、256、257、165、230、258。

Diazepam 分裂於 m/z 256、283、284、285、257、255、258、286。

(五) 呈色反應：甲醛-硫酸成橘色。[374]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、

Butabarbital、Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、

Hydromorphone、Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、

Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、

Thiopental。本品與酒精併服時：增加催眠、鎮靜效果，且作用快速。[375]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

突然停藥後要注意可能發生撤藥症狀。停藥後 2~3 天出現，半衰期長者則

在停藥後 10~20 天發生。戒斷症狀：較多見的為睡眠困難，異常的激惹狀

態和神經質；較少見或罕見的有腹部或胃痙攣、精神錯亂、驚厥、肌肉痙

攣、噁心或嘔吐、顫抖、異常的多汗。嚴重的戒斷症狀比較多見於長期服

用過量的患者。也有曾在連續服用，血藥濃度一直保持在安全有效範圍內，

幾個月後突然停藥而發生。失眠反跳現象、神經質、易激怒，多數病人為

長時期單次夜間服藥，戒斷後發生。半衰期短的藥物，停藥後發生快而嚴

重。[376]

成癮治療之方法與成效評估：

催吐：吐根使用

活性炭吸收：使用最低 240 毫升的水百分之三十克活性碳。

洗胃

監測病人：監測生命體徵

減少呼吸功能：成人 Flumazenil- 0.2-3 mg， 0.2mg。Flumazenil 拮抗中樞

神經系統的苯二氮類藥物作用，逆轉的苯二氮類的鎮靜作用。

血壓過低： 0.9% NaCl 10-20ml/kg 靜脈注射, dopamine, norepinephrine。

[377]

第四級管制藥品 — 美芬雷司(Mefenorex)

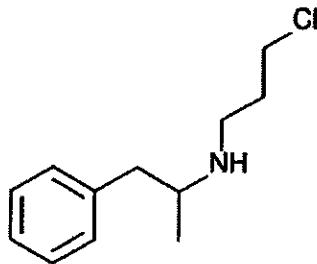
項次: 38

名稱:

1. 中文：美芬雷司
2. 英文：Mefenorex
3. CAS 編號：17243-57-1

化學性狀:

1. 結構式：N-(3-chloropropyl)-1-phenylpropan-2-amine
2. 分子式：C₁₂H₁₈ClN
3. 分子量：211.731
4. 熔點：128-130°C
5. 結構圖：



藥理性質:

興奮劑，安非他命的衍生物，可以用於抑制食慾，當作減肥藥物。[378]

用途用法:

治療肥胖症減少食慾。

危害及副作用:

心臟瓣膜病變和原發性肺動脈高壓。口乾、上腹部不適、出汗、興奮、失眠、心動過速、血壓升高、長期服用可產生精神和身體依賴。[379]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

長期高劑量治療突然中斷後，可能會導致抑鬱症和疲勞。

通常在數週後出現藥物依賴現象，如果這樣應當停止。

成癮治療之方法與成效評估：

在長期使用可能導致嚴重的性皮炎，失眠，煩躁不安，多動，性格變化，思覺失調。一般可以停止藥物幾天或幾週後解決這些問題。

急性中毒時處理方式：

1、不誘導嘔吐。

2、使用活性炭。

2、抽搐時 diazepam 靜脈注射（劑量：成人：從 5 到 10 毫克。兒童： 0.2

至 0.5 毫克/公斤，重複每 5 分鐘視需要）或 lorazepam 靜脈注射（劑量：

成人： 4 日至 8 毫克;兒童： 0.05 至 0.1 毫克/千克）。監測為低血壓，呼

吸抑制，以及需要氣管插管。如果抽搐是無法控制或再次發生，考慮苯巴

比妥。 [380]

第四級管制藥品—甲丙氨酯（美普巴邁）Meprobamate

項次:39

名稱：

1. 中文：甲丙氨酯（美普巴邁）
2. 英文：Meprobamate
3. CAS 編號：57-53-4

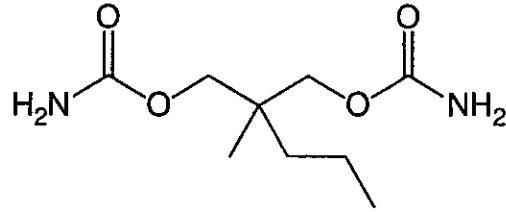
製劑：

10. 劑型：錠劑
11. 劑量：200 毫克

化學性狀：

1. 外觀及性狀：結晶體。有苦味。水中溶解度：於 20°C 下為 0.34% (w/w)，於 37°C 下為 0.79% (w/w)。在熱水中本品易形成過飽合溶液，本品可溶於各種有機溶劑，水溶液為中性，在稀酸、稀鹼性的溶液中安定。對小鼠的半致死量：800 mg/kg。[381]
2. 結構式：[2-(carbamoyloxymethyl)-2-methyl-pentyl] carbamate
3. 分子式：C₉H₁₈N₂O₄
4. 分子量：218.250
5. 熔點：104-106°C

6. 結構圖:



藥理性質：本品主要作用是在不影響自律神經的功能之下，抑制在介於大腦皮質和視丘間的長神經細胞間迴路。[382]

藥動學特性：

本品的蛋白質結合率 0%~30%；血中擴散率：0.2~0.3（血漿：全血）；VD 0.5 to 0.8 L/kg；半衰期：6~17 小時（平均約 11 小時）。本品在口服之後可以很快的被人體吸收，在體內分布廣泛，大部分的本品在肝臟被代謝。服藥後的 24 小時之內，會有約服藥劑量的 90% 藥物被排除到尿液中，其中有 10%~20% 以原型排除，而其餘代謝物主要是 2-hydroxypropylmeprobamate 和 meprobamate *N*-glucuronide；約有服藥劑量的 10% 藥物，會由糞便排除。本品可通過胎盤，而在母乳中發現的濃度，高於在血漿中濃度有四倍之多。本品是 tybamate 的少量代謝物，和 carisoprodol 的代謝物。[383]

用途用法：

主要用於神經官能症的緊張、焦慮狀態，輕度失眠及破傷風所致肌肉緊張狀態。1.鎮靜：每次口服 0.2 g，每日 3~4 次。2.催眠：於睡前半小時服 0.2~0.4 g。3.抗驚厥：每隔 4~6 小時 1 次，每次肌注或靜注 0.4 g。[384]

危害及副作用：

腳步笨拙或不穩，昏昏欲睡、運動失調；影響記憶、認知、精細動作、以及情緒；它會抑制呼吸，造成缺氧，也可能誘發喉部痙攣；會加快肝臟代謝速率，讓許多藥物、維生素降低效用；劑量高時，還可能抑制腦部呼吸中樞、抑制心臟收縮、抑制小腸蠕動、影響腎臟功能。[385]

檢驗方法：

1. 呈色分析：Furfuraldehyde — 黑色。Nessler's Reagent— 灰黑色。
2. 紫外分光光度法：並沒有明顯的特定吸收波長，但在波長 230~360nm 附近有較大吸收。
3. 氣相層析法
4. 紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1688、1069、1090、1590、1310、1140 cm^{-1} 的位置。
5. 質譜分析：主要分裂於 m/z 83、84、55、56、43、71、41、62。[386]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

增加呼吸抑制作用：Adinazolam、Alprazolam、Amobarbital、Aprobarbital、Bromazepam、Brotizolam、Butabarbital、Butalbital、Chlordiazepoxide、Clobazam、Clonazepam、Clorazepate、Codeine、

Dantrolene、Diazepam、Estazolam、Ethchlorvynol、Fentanyl、
Flunitrazepam、Flurazepam、Halazepam、Hydrocodone、Hydromorphone、
Ketazolam、Levorphanol、Lorazepam、Lormetazepam、Medazepam、
Meperidine、Mephobarbital、Midazolam、Morphine、Morphine Sulfate
Liposome、Nitrazepam、Nordazepam、Oxazepam、Oxycodone、
Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Prazepam、Quazepam、
Secobarbital、Temazepam、Thiopental、Triazolam。[387]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

肺部問題：呼吸困難、喘鳴、雙重視野、視力模糊、眼睛快速運動、心律
緩慢、心悸、驚厥、紅點、藍色嘴唇和指甲、嘔吐、昏睡、昏迷(缺乏警
覺性)、頭暈、興奮、講話不清、虛弱、震顫、不協調的運動。估計最小致
死量為 12 克，本品血液濃度若超過 50mg/L 可能導致昏迷，血液濃度若超
過 70mg/L 能致死。[388]

成癮治療方法：

中毒的治療需要維持順暢的呼吸和血壓。[389]

第四級管制藥品 — 美舒卡 (Mesocarb)

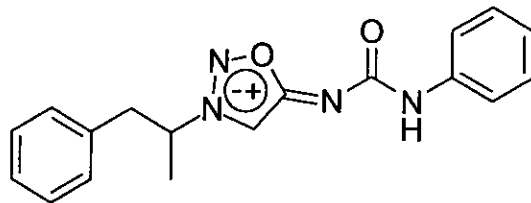
項次: 40

名稱:

1. 中文: 美舒卡
2. 英文: Mesocarb
3. CAS 編號: 34262-84-5

化學性狀:

1. 外觀及性狀: 白色至黃綠白色結晶性粉末。幾乎不溶於水，難溶於乙醇。[390]
2. 結構式: 5-(Phenylcarbamoylimino)-3-(1-phenylpropan-2-yl)-5H-1,2,3-oxadiazol-3-ium-2-ide
3. 分子式: $C_{18}H_{18}N_4O_2$
4. 分子量: 322.36
5. 結構圖:



藥理性質:

中樞神經興奮劑。

Dopamine 再攝取抑製劑。由於刺激 dopamine 受體，增加運動作用。

藥動學特性：

最高濃度 64.5 ± 3.7 ng/mL。到達最高濃度時間 1.61 ± 0.01 小時。半衰期 2.73 ± 0.19 小時。原型藥物僅排出微量，活性代謝物為 amphetamine。[390]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

第四級管制藥品 — 甲基苯巴比妥 (Methylphenobarbital、Mephobarbital)

項次: 41

名稱:

1. 中文: 甲基苯巴比妥
2. 英文: Methylphenobarbital、Mephobarbital
3. CAS 編號: 115-38-8

製劑:

1. 劑型: 錠劑

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

性質: 白色結晶性粉末, 無臭, 味苦, 微溶於冷水, 溶於乙醇、氯仿等。[391]

2. 結構式: 英文

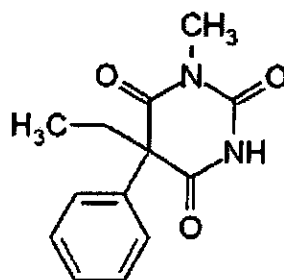
5-phenyl-5-ethyl-3-methylbarbituric acid

3. 分子式: $C_{13}H_{14}N_2O_3$

4. 分子量: 246.3

5. 熔點: $176^{\circ}C$

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為巴比妥類催眠藥、抗驚厥藥。長效作用時間（10~12小時），對中樞的抑制作用隨著劑量加大，表現為鎮靜、催眠、抗驚厥及抗癲癇。大劑量對心血管系統、呼吸系統有明顯的抑制。過量可麻痺延髓呼吸中樞致死。體外電生理實驗本類藥物使神經細胞的氯離子通道開放，細胞過極化，擬似 γ -氨基丁酸(GABA)的作用。治療濃度的甲基苯巴比妥可降低谷氨酸的興奮作用、加強 γ -氨基丁酸的抑制作用，抑制中樞神經系統單突觸和多突觸傳遞，抑制癲灶的高頻放電及其向周圍擴散。可減少胃液分泌，降低胃張力。可產生依賴性，包括精神依賴和身體依賴。[392]

藥動學特性：

口服後在消化道吸收迅速，15~30分鐘生效，約維持10~12小時。吸收後分佈於體內各組織及體液中，因本品脂溶性高，易通過血腦屏障，進入腦組織，起效比較快。血漿中蛋白結合70-76%， $T_{1/2}$ 約為50~60小時，血藥濃度達峰時間，個體差異大。本品口服內在二十四小時內，在肝臟中大約會有75%代謝成phenobarbital為活性化合物，phenobarbital的 $T_{1/2}$ 約為100小時，部份會以phenobarbital經尿液排出，或是再代謝成P-hydroxyphenobarbital以自由形或是葡糖苷酸或硫酸結合物經由尿液排出。此外，在尿液中還可以偵測到

5-ethyl-5-(4-hydroxy-3-methoxyphenyl)barbituric acid 和

5-ethyl-5-(4-hydroxy-3-methoxyphenyl)-1-methylbarbituric acid。[393]

用途用法：

鎮靜：一般成人劑量是 32~100 mg 每日給予 3 或 4 次，最佳劑量為大多數患者 50 mg 每日給予 3 或 4 次。

癲癇：一般成人劑量是 400~600 mg，每天分劑量或在就寢時間服用。初始劑量通常是小，逐步增加超過 4 至 5 天，直到最佳用量。

如果病人已採取另一種抗癲癇藥物，其他藥物劑量應逐漸減少，甲基苯巴比妥劑量增加，以防止癲癇產生。同樣地，當甲基苯巴比妥是要減少或中止，其劑量應當逐步減少超過 4 至 5 天。[394]

危害及副作用：

- 1、可能引起微妙的情感變化，出現認知和記憶的缺損。
- 2、長期用藥，偶見葉酸缺乏和低鈣血症。
- 3、罕見巨幼紅細胞性貧血和骨軟化。
- 4、大劑量時可產生眼球震顫、共濟失調和嚴重的呼吸抑制。
- 5、用本品的患者中約 1~3% 的人出現皮膚反應，多見者為各種皮疹以及哮喘，嚴重者可出現剝脫性皮炎和多形紅斑（或 Stevens—Johnson 綜合症），中毒性表皮壞死極為罕見。

6、肝炎和肝功能紊亂。

7、長時間使用可發生藥物依賴，停藥後易發生停藥綜合症。[395]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：將本品溶於乙醇與鹼性硼酸緩衝液(pH9.6)之混液

(1→20)所成溶液(1→100,000)，按照紫外線吸光度測定法測定之，於波長

244nm 附近呈最大吸收。溶於 1M 氫氧化鈉(pH13)，於波長 243nm 附近

呈最大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1707、1648、1754、720、1298、1050

cm⁻¹ 的位置。

(四)質譜分析：分裂於 m/z 218、117、118、146、103、77、91、115。

代謝物 phenobartital m/z 204、117、146、161、77、103、115、118。[396]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Adinazolam、Alfentanil、Alprazolam、

Amobarbital、Aprobarbital、Bromazepam、Brotizolam、Butabarbital、Butalbital、

Calamus、Cannabis、Clobazam、Clonazepam、Clorazepate、Codeine、

Diazepam、Estazolam、Ethchlorvynol、Fentanyl、Flunitrazepam、Flurazepam、Halazepam、Hydrocodone、Hydromorphone、Ketazolam、Levorphanol、Lorazepam、Lormetazepam、Medazepam、Meperidine、Mephesisin、Meprobamate、Metaxalone、Midazolam、Morphine、Nitrazepam、Nordazepam、Oxazepam、Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Prazepam、Secobarbital、Temazepam、Thiopental、Triazolam。本品與酒精併服時：過度中樞神經抑制作用，且作用快速。[397]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

過量藥物可能引起昏迷、嚴重的呼吸和心血管抑制、低血壓和休克繼而引發腎功能衰竭、死亡。深度呼吸抑制是急性中毒的直接死亡原因。解救措施中最重要的是維持呼吸和迴圈功能，施行有效的人工呼吸，必要時行氣管切開，並輔之以有助於維持和改善呼吸和迴圈的相應藥物。經口服中毒者，在3~5小時內可用高錳酸鉀（1：2000）溶液洗胃。用10~15 g 硫酸鈉溶液導泄（禁用硫酸鎂）。為加速排泄可給甘露醇等滲透壓利尿藥，如腎功能正常可用速尿。可用碳酸氫鈉、乳酸鈉鹼化尿液加速排泄，嚴重者可透析。極度過量時，大腦一切電活動消失，腦電圖變為一條平線，並不一定代表為臨床死亡，若不併發缺氧性損害，尚有挽救的希望。 [397]

成癮治療之方法與成效評估：

輕度中毒 頭痛、眩暈、乏力、語言不清、嗜睡、視物模糊、眼球震顫、瞳孔縮小 噁心、嘔吐，各種形態的皮疹，呼吸稍快，血壓正常或偏低，還可引起陰莖水腫。

重度中毒 開始病人可表現狂躁、驚厥、四肢強直；繼而進入抑制期，出現瞳孔散大（對光反射存在），全身弛緩，淺反射消失，脈搏細速，血壓下降，尿少或尿閉，中毒性肝炎等表現；最後可因呼吸抑制或因嘔吐物吸入而發生窒息而死亡。會導致戒斷症狀的中樞神經系統的刺激，如焦慮或煩躁不安和麻煩，睡覺，這可能會導致驚厥和幻覺。這些症狀可能發生在使用後 5 至 15 天。

（一）洗胃

（二）促進毒物排泄

1、快速輸液 2、利尿脫水 3、導瀉 4、血液透析 5、鹼化尿液

（三）中樞興奮劑的應用

僅適用於重度中毒者、呼吸高度抑制者及昏迷患者。[392]

第四級管制藥品 — 甲乙哌啶酮 (Methyprylon)

項次: 42

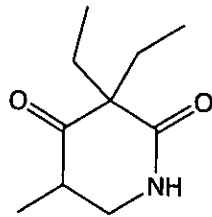
名稱:

1. 中文: 甲乙哌啶酮
2. 英文: Methyprylon
3. CAS 編號: 125-64-4

化學性狀:

1. 外觀及性狀: 白色結晶粉末。一份本品可溶於 14 份水、0.7 份乙醇、0.6 份氯仿、3.5 份乙醚。[398]
2. 結構式: 3,3-diethyl-5-methylpiperidine-2,4-dione
3. 分子式: $C_{10}H_{17}NO_2$
4. 分子量: 183.248
5. 熔點: 74~77°C

6. 結構圖:



藥理性質:

用於鎮靜、催眠及焦慮患者。巴比妥酸鹽的作用機轉主要為中樞神經的抑制作用，可以促使 GABA 與 GABA 接受器的親合力增加，增加氯離子通透，

而使神經細胞興奮性降低，同時也可以加強苯重氮基鹽與其接受器的親合力。在臨床劑量，巴比妥鹽類與 γ -氨基丁酸受體結合，增強 γ -氨基丁酸的作用，延長氯離子管道開放的時間。在沒有 γ -氨基丁酸的存在下，臨床劑量的巴比妥鹽類並不會產生作用；但高劑量的巴比妥鹽類則不需要 γ -氨基丁酸即可打開氯離子管道，抑制神經元的活生，此為高劑量巴比妥鹽致死的原因。長期使用巴比妥鹽會引起耐藥性 (tolerance)，其機制為藥物動力學的改變，也就是長期使用可增加微粒體細胞色素 P450 的活性，而增加巴比妥鹽的代謝。被同樣細胞色素 P450 代謝的藥物，其代謝速率也會因長期使用巴比妥鹽而增加。巴比妥鹽類與其它的鎮靜—安眠藥會產生交叉耐藥性。[399]

藥動學特性：

口服之後可以快速被吸收，主要的代謝物是具有活性的

2,4-dioxo-3,3-diethyl-5-methyltetrahydropyridine (methylpersedon)、

6-oxomethyprylone、5-hydroxymethyprylone、5-carboxymethyprylone。約有

投與劑量的 60% 於 24 小時之內被分泌到尿液中，投與劑量 3% 則是以原型

藥形式排除。[398]

用途用法：

鎮靜催眠藥。200~400mg

危害及副作用：

巴比妥鹽類一個比較特殊的副作用為可能在敏感的病人引起急性的紫質病 (porphyria)；此病為血紅素 (hemoglobin) 生合成紊亂所引起的。其症狀包括腹痛、週圍神經病變和精神障礙。有眩暈、噁心、嘔吐、倦怠、頭痛和腹瀉等；久用成癮；超過劑量會中毒。[400]

檢驗方法：

氣相層析法

紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1660、1693、1085、1310、750、869 cm^{-1} 的位置。

質譜分析：分裂於 m/z 155、140、83、98、55、41、84、69。[398]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

巴比妥鹽類和其它的鎮靜—安眠藥對中樞的抑制有相加的作用；它也與含酒精的飲料、抗組織胺類、抗精神病藥物、類鴉片鎮痛劑，以及三環抗憂鬱藥對中樞的抑制有相加的作用。中樞神經抑制及呼吸抑制：Adinazolam、Alfentanil、Alprazolam、Amobarbital、Aprobarbital、Bromazepam、Brotizolam、Butabarbital、Butalbital、Calamus、Cannabis、Clobazam、Clonazepam、

Clorazepate、Codeine、Diazepam、Estazolam、Ethchlorvynol、Fentanyl、
Flunitrazepam、Flurazepam、Halazepam、Hydrocodone、Hydromorphone、
Ketazolam、Levorphanol、Lorazepam、Lormetazepam、Medazepam、
Meperidine、Mephenesin、Mephobarbital、Meprobamate、Metaxalone、
Midazolam、Morphine、Nitrazepam、Nordazepam、Oxazepam、Oxycodone、
Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Prazepam、Secobarbital、
Temazepam、Thiopental、Triazolam。本品與酒精併服時：過度中樞神經抑
制作用，且作用快速。[401]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

過量藥物可能引起昏迷、嚴重的呼吸和心血管抑制、低血壓和休克繼而引
發腎功能衰竭、死亡。深度呼吸抑制是急性中毒的直接死亡原因。可致嚴
重中毒，中毒血藥濃度為 5 mg/100ml。解救措施中最重要的是維持呼吸和
迴圈功能，施行有效的人工呼吸，必要時行氣管切開，並輔之以有助於維
持和改善呼吸和迴圈的相應藥物。經口服中毒者，在 3~5 小時內可用高錳
酸鉀 (1：2000) 溶液洗胃。用 10~15 g 硫酸鈉溶液導泄 (禁用硫酸鎂)。為
加速排泄可給甘露醇等滲透壓利尿藥，如腎功能正常可用速尿。可用碳酸
氫鈉、乳酸鈉鹼化尿液加速排泄，嚴重者可透析。極度過量時，大腦一切
電活動消失，腦電圖變為一條平線，並不一定代表為臨床死亡，若不併發

缺氧性損害，尚有挽救的希望。[402]

成癮治療之方法與成效評估：

輕度中毒 頭痛、眩暈、乏力、語言不清、嗜睡、視物模糊、眼球震顫、瞳孔縮小 噁心、嘔吐，各種形態的皮疹，呼吸稍快，血壓正常或偏低，還可引起陰莖水腫。 重度中毒 開始病人可表現狂躁、驚厥、四肢強直；繼而進入抑制期，出現瞳孔散大（對光反射存在），全身弛緩，淺反射消失，脈搏細速，血壓下降，尿少或尿閉，中毒性肝炎等表現；最後可因呼吸抑制或因嘔吐物吸入而發生窒息而死亡。會導致戒斷症狀的中樞神經系統的刺激，如焦慮或煩躁不安和麻煩，睡覺，這可能會導致驚厥和幻覺。這些症狀可能出現在使用後 5 至 15 天。

（一）洗胃

（二）促進毒物排泄

1、快速輸液 2、利尿脫水 3、導瀉 4、血液透析 5、鹼化尿液

（三）中樞興奮劑的應用

僅適用於重度中毒者、呼吸高度抑制者及昏迷患者。[403]

第四級管制藥品 — 咪達唑他 (咪氟唑侖) (Midazolam)

項次: 43

名稱:

1. 中文: 咪達唑他 (咪氟唑侖)
2. 英文: Midazolam
3. CAS 編號: 59467-70-8

製劑:

1. 劑型: 注射液; 口服糖漿; 錠劑
2. 劑量: 1 mg/ml、2 mg/ml、5 mg/ml; 2 mg/ml; 15 mg

3. 照片:

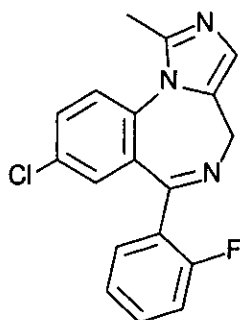


化學性狀:

1. 外觀及性狀: 無色結晶, 可溶於水。[404]
2. 結構式:
8-chloro-6-(2-fluorophenyl)-1-methyl-4H-imidazo[1,5-a][1,4]benzodiazepine
3. 分子式: $C_{18}H_{13}ClFN_3$
4. 分子量: 325.8

5. 熔點: 158-160°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為短效型苯二氮平類中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸 (GABA) 的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氫離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。本品具有典型的苯二氮卓類藥理活性，可

產生抗焦慮、鎮靜、催眠、抗驚厥及肌肉鬆弛作用。肌注或靜注後，可產生短暫的順行性記憶缺失，使患者不能回憶起在藥物高峰期間所發生的事情。本品作用特點為起效快而持續時間短。服藥後可縮短入睡時間(一般自服藥到入睡只需 20 分鐘)，延長總睡眠時間，而對快波睡眠(REM)無影響。次晨醒後，患者可感到精力充沛、輕鬆愉快。無耐藥性和戒斷症狀或反跳。毒性小，安全範圍大。類似地西洋；本品有較強的遺忘作用，可用於手術前給藥，鎮靜效應約在肌內注射後 15min 出現,30~60min 達峰值；因其作用快，也用於誘導麻醉，靜脈注射後 2.0~2.5min 可出現麻醉狀態。本品也是有效的安眠藥，誘導睡眠快，維持睡眠時間適中，次晨可保持清醒狀態。

[405]

藥動學特性：

口服吸收較快，屬短半衰期苯二氮平類藥。本品血漿蛋白結合率約為 95~98%。本品在肝臟酵素 CYP450 代謝成活性代謝物 Alpha-hydroxy-midazolam，與葡萄糖醛酸結合後經腎臟排出，超過 90%從尿液排出，出少於 1%以原形排出。本品 T1/2 為 1 小時。[406]

用途用法：

口服：治療失眠症，每次 15mg，睡前服用。

靜脈注射：手術前 20~30 分鐘注射，成人一般為 10~15mg(每公斤體重 0.10~0.15mg)。可單用亦可與鎮痛藥合用。兒童劑量可稍高，每公斤體重 0.15

~0.2mg。用於維持麻醉，小劑量靜脈注射，劑量和時間間隔視病人個體差異而定。[404]

危害及副作用：

不良反應少見，極少數病人可出現短時間的呼吸功能影響，多半由於劑量過高或靜注過快所致，因此，靜注時速度勿過快。[407]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：於波長 225 nm 附近呈較大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶 1608、820、767、1310、1210、995 cm^{-1} 的位置。

(四)、質譜分析：分裂於 m/z 310、312、311、163、325、75、39、297。[408]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、

Butabarbital、Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、

Hydromorphone、Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、

Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、

Thiopental。本品與酒精併服時：增加催眠、鎮靜效果，且作用快速。[409]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀):

本品過量症狀包括：嗜睡（困難，在下榻的清醒）、精神混亂、低血壓、受損的運動功能、受損的反射、受損的協調、受損的平衡、頭暈、昏迷、死亡。在動物模型，經口服本品 LD50 是 825 毫克/公斤。本品過量被認為是緊急醫療，一般需要使用立即予以注意。[410]

成癮治療之方法與成效評估:

過量解為毒劑成人 Flumazenil- 0.2-3 mg，0.2 mg。Flumazenil 拮抗中樞神經系統的苯二氮類藥物作用，逆轉的苯二氮類的鎮靜作用。

血壓過低：0.9% NaCl 10-20ml/kg 靜脈注射, dopamine、norepinephrine。[411]

第四級管制藥品 — 硝西洋（耐妥眠）（Nitrazepam）

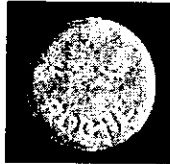
項次: 45

名稱：

1. 中文: 硝西洋（耐妥眠）
2. 英文: Nitrazepam
3. CAS 編號: 146-22-5

製劑：

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 5 mg, 10 mg
3. 照片:



化學性狀：

1. 外觀及性狀: 微黃色結晶粉末。不溶於水、苯、己烷，可溶於丙酮、乙酸乙酯。一份本品可溶於 120 份乙醇、45 份氯仿、900 份乙醚中。

[412]

2. 結構式:

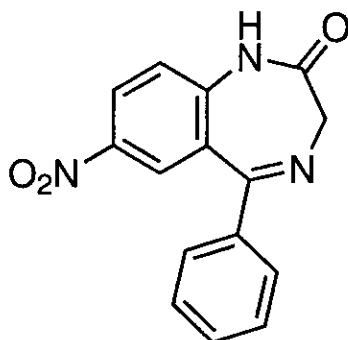
9-nitro-6-phenyl-2,5-diazabicyclo[5.4.0]undeca-5,8,10,12-tetraen-3-one

3. 分子式: $C_{15}H_{11}N_3O_3$

4. 分子量: 281.3

5. 熔點: 224~226 °C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為短中效型苯二氮平類中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸 (GABA) 的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子 (supramolecular) 功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氫離子通道的聯繫來實現。苯二氮平

類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。[413]

藥動學特性：

口服吸收較快，屬短中半衰期苯二氮平類藥。可通過血腦屏障。本品血漿蛋白結合率約為 85%~88%。本品在肝臟代謝成 7-aminonitrazepam 及 7-acetoamidonitrazepam 非活性代謝物。本品 T_{1/2} 為 24~29 小時。[414]

用途用法：催眠：每晚 5~10 mg。抗癲癇：每日 5~30 mg，分 3 次服。[412]

危害及副作用：

較少見的不良反應有；精神混亂，情緒抑鬱，頭痛、噁心、嘔吐、排尿障

礙等。老年、體弱、幼兒、肝病和低蛋白血症患者，對本類藥的中樞性抑制較敏感。注射用藥時容易引起呼吸抑制、低血壓、肌無力、心動過緩或心跳停止；高齡衰老、危重、肺功能不全以及心血管功能不穩定等患者，靜注過速或與中樞抑制藥合用時，發生率更高，情況也更嚴重。持續的精神紊亂，嗜睡深沉，震顫，持續的說話不清，站立不穩，心動過緩，呼吸短促或困難，嚴重的肌無力。[415]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：於波長 280 nm 附近呈較大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1690、1610、698、1536、745、784 cm^{-1} 的位置。

(四)、質譜分析：分裂於 m/z 280、253、281、206、234、252、254、264。

(五) 呈色反應：甲醛-硫酸成橘色。[416]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、Butabarbital、Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、

Hydromorphone、Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、Thiopental。本品與酒精併服時：增加催眠、鎮靜效果，且作用快速。[417]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀):

突然停藥後要注意可能發生撤藥症狀。停藥後 2—3 天出現，半衰期長者則在停藥後 10—20 天發生。戒斷症狀：較多見的為睡眠困難，異常的激惹狀態和神經質；較少見或罕見的有腹部或胃痙攣、精神錯亂、驚厥、肌肉痙攣、噁心或嘔吐、顫抖、異常的多汗。嚴重的戒斷症狀比較多見於長期服用過量的患者。也有曾在連續服用，血藥濃度一直保持在安全有效範圍內，幾個月後突然停藥而發生。失眠反跳現象、神經質、激惹，多數病人為長時期單次夜間服藥，戒斷後發生。半衰期短的停藥後發生快而嚴重。[418]

成癮治療之方法與成效評估:

催吐：吐根使用

活性炭吸收：使用最低 240 毫升的水百分之三十克活性碳。

洗胃。監測病人：監測生命體徵

減少呼吸功能：成人 Flumazenil- 0.2-3 mg， 0.2mg。Flumazenil 拮抗中樞神經系統的苯二氮類藥物作用，逆轉的苯二氮類的鎮靜作用。

血壓過低：0.9% NaCl 10-20ml/kg 靜脈注射，dopamine、norepinephrine。[419]

第四級管制藥品 一去甲西洋（原氮平）(Nordiazepam)

項次: 46

名稱:

1. 中文: 去甲西洋（原氮平）

2. 英文: Nordiazepam

3. CAS 編號: 1088-11-5

化學性狀:

1. 外觀及性狀: 白色或微黃色結晶粉末。不溶於水，略溶於乙醇及氯仿。[420]

2. 結構式: $C_{15}H_{11}ClN_2O$

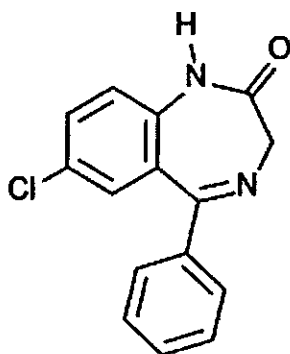
3. 分子式:

9-chloro-6-phenyl-2,5-diazabicyclo[5.4.0]undeca-5,8,10,12-tetraen-3-one

4. 分子量: 270.71

5. 熔點: 216~217°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為長效型苯二氮平類安眠劑，為中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氫離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究體示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠

作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。有良好的抗焦慮作用。本品具有抗焦慮、抗痙攣及骨骼肌放鬆作用。[421]

藥動學特性：

口服吸收較快，屬長半衰期苯二氮平類藥。本品血漿蛋白結合率約為97%。本品在肝臟代謝成活性代謝物 Oxazepam，僅2%~3%以原形從尿液排出。本品 T_{1/2} 為 50-120 小時，其活性代謝物 Oxazepam 為 4~25 小時。[420]

危害及副作用：

使用本品通常有口乾、想睡、噁心嘔吐、視覺模糊、頭痛、頭暈目眩、發抖的情形。

可能出現手腳及眼睛不能自主運動、興奮、不正常瘀青。

本品也可能造成皮膚起紅疹、發癢、幻覺等情形。[422]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：本品在酸性溶液中 238、283、361 nm 有較大吸收，

在鹼性溶液中 240、340 nm 有較大吸收。

(二)、遠紅外光光譜：主峰出現在 1680、700、1602、820、738、790 cm^{-1} 處。

三、氣相層析法：

(四)、質譜分析：分裂於 m/z 242、269、270、241、243、271、244、272。

Oxazepam 分裂於 m/z 257、77、268、239、205、267、233、259。[420]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、Butabarbital、

Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、Hydromorphone、

Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、Oxycodone、

Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、Thiopental。本

品與酒精併服時：增加催眠、鎮靜效果，且作用快速。[423]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

過量使用本品會影響中樞神經並造成呼吸抑制。病患會有矛盾的興奮，但

單獨使用本品少見引起死亡。診斷主要依照過去病人是否曾使用過量或是

觀察臨床表徵。另可投予 flumazenil 來診斷是否為過量使用。[424]

成癮治療之方法與成效評估:

- 1、大多數苯重氮基鹽類安眠劑之中毒只需要臨床上的觀察及支持性照護。
- 2、可使用活性碳清除腸胃內殘餘之藥物，不常利用洗胃。
- 3、不可催吐。
- 4、使用 flumazenil 可反轉嚴重的呼吸抑制或是心血管系統之併發症。但病患患有癲癇發作時禁忌使用 flumazenil。[425]

第四級管制藥品 — 鴉片複方製劑含量每 100 毫升(或 100 公克) 0.5 公克以上
上 Opium mixed preparations containing opium more than 0.5 gram per

100 milliliters (or 100 grams)

項次: 47

名稱:

1. 中文：鴉片複方製劑含量每 100 毫升(或 100 公克) 0.5 公克以上
2. 英文：Opium mixed preparations containing opium more than 0.5 gram per 100 milliliters (or 100 grams)

化學性狀：

1. 外觀及性狀：本品罌粟科植物罌粟 (*Papaver somniferum* L.) 未成熟蒴果中採得之乳汁，於空氣中乾燥所得。本品經 100~105°C 乾燥後，所含嗎啡(C₁₇H₁₉NO₃)不得少於 10.0%，可待因 (C₁₈H₂₁NO₃) 不得少於 2.0%。一般性狀：本品為磚形，類圓形，微扁形圓塊，或為不規則形之塊體。外面現暗棕色，有時包以破碎之罌粟葉。新鮮時質頗軟，可任意揉捏，久藏則質變硬。內部現較暗之淡棕色，折斷面成顆粒狀，或殆平滑，有強烈而特殊之臭，味特殊而甚苦。

[426]

藥理性質：

鎮咳及鎮痛劑，其鎮痛及成癮性較嗎啡為低。由於作用在延髓上的咳嗽反射區而有鎮咳功效。[427]

藥動學特性：

本品口服吸收良好；經直腸吸收其生體可用率為 63%。本品不與血漿蛋白結合。本品 24-89%由肝臟代謝，主要代謝途徑是與尿甘酸的共軛作用形成 codeine-6-glucuronide；另外也會經 CYP2D6 酵素作用形成嗎啡。本品代謝物 90%從腎臟排除，半衰期約 2.5-3.5 小時。[428]

用途用法：

劑型：錠劑 20、30 毫克。注射劑 15、30、60 毫克／毫升。口服：一日量 60mg，一次量 15-30mg，一次極量 100mg，一日極量 300mg。注射：皮下，肌肉注射一次量 15-30mg。[429]

危害及副作用：

久服具成癮性，正常劑量下，極少產生副作用。過量投與之副作用包括嘔吐，噁心，暈眩，膽管痙攣，呼吸抑制等。服用過量而致死的原因為肺水腫。[430]

檢驗方法：

1. 呈色分析：Liebermann's Test—黑色。Mandelin's Test—綠色。

Marquis Test—紫色。

2. 紫外分光光度法：本品溶於酸性水溶液中於 285nm 有吸收。
3. 氣相層析法
4. 紅外線光譜法：以 KBr 錠法檢測本品，主峰出現在 1052、1268、1500、1111、793 及 934 cm^{-1} 處。
5. 質譜分析：分裂於 m/z 299、42、162、124、229、59、300、69。
6. 經以氫試液中和之本品溶液(1→50)，加硝酸銀試液，即生黃色沉澱，此沉澱可溶於 2N 硝酸或氫試液中。[431]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

增加中樞神經系統及呼吸系統的抑制作用：Adinazolam、Alprazolam、Amobarbital、Aprobarbita、Bromazepam、Butalbital、Clobazam、Clonazepam、Clorazepate、Diazepam、Estazolam、Fentanyl、Flunitrazepam、Hydrocodone、Lormetazepam、Meperidine、Morphine、Phenobarbital、Triazolam。產生戒斷症狀：Buprenorphine。[432]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

中毒劑量之可待因會造成失去意識、瞳孔成針狀、呼吸緩慢、發紺等等。

最危險的作用是呼吸抑制，於口服後 2-4 小時內可能引起呼吸衰竭。本品也可能引發痙攣。可能可以觀察到病患有幻覺、發抖、無法控制肌肉動作、精神上的壓抑及皮膚疹等情形。戒斷症狀包括打呵欠、流淚、嚴重腸胃道不適、發燒或冷顫、流汗、瞳孔放大、肌痛、失眠、增加呼吸速率等。診斷：昏迷、針狀瞳孔及呼吸抑制為鴉片類藥物中毒時最典型的症狀，可待因中毒時也常見有蕁麻疹產生。病患的尿液及血液可作生化及毒理分析。本品與酒精併用會產生加成或是協同之中樞神經抑制作用，可能造成病患之肌肉動作不協調。[433]

成癮治療方法：

於急性、嚴重中毒之病患，需建立暢通之呼吸道，提供人工通氣、氧氣及監視血液動力學狀態。具有意識之病患，考慮給予洗胃。病患於服用後一至二小時內可投予活性炭。建議的解毒劑為靜脈注射投予 0.4 毫克 naloxone，需要時每二至三分鐘反覆給藥直到恢復。休克時經靜脈給予液體、加壓藥物及其他支持治療需維持體溫。[434]

第四級管制藥品 — 去甲羥安定 (歐沙氮平、去甲羥氮平) (Oxazepam)

項次: 48

名稱:

1. 中文: 去甲羥安定 (歐沙氮平、去甲羥氮平)
2. 英文: Oxazepam
3. CAS 編號: 604-75-1

製劑:

1. 劑型: 錠劑、膠囊劑
2. 劑量: 10mg、15 mg、30 mg

3. 照片:



Trade Name: Serax
Controlled Ingredient: oxazepam,
15 mg



Trade Name: Serax
Controlled Ingredient: oxazepam,
15 mg



Trade Name: Serax
Controlled Ingredient: oxazepam,
30 mg

化學性狀:

1. 外觀及性狀: 白色偏微黃色結晶粉末。不溶於水。一份本品可溶於

120 份乙醇、270 份氯仿、2200 份乙醚中。[435]

2. 結構式:

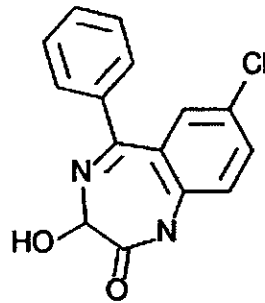
9-chloro-4-hydroxy-6-phenyl-2,5-diazabicyclo[5.4.0]undeca-5,8,10,12-tetraen-3-one

3. 分子式: $C_{15}H_{11}ClN_2O_2$

4. 分子量: 286.71

5. 熔點: 205~206°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為短中效型苯二氮平類中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。

本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸 (GABA) 的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子 (supramolecular) 功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經

細胞膜，調節細胞的放電，主要起氯通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氯通道開放，使氯離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氯通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氯離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。[436]

藥動學特性：

口服吸收較快，屬短中效型苯二氮平類藥。本品血漿蛋白結合率約為 86%~

99%。本品在肝臟代謝，經葡萄糖醛酸化。50%以原形從尿液排出。本品 T_{1/2} 為 2.8~8.6 小時。[437]

用途用法：

- (1) 器質性疾病或情緒壓力引起之焦慮：15mg，一天 3~4 次。
- (2) 嚴重焦慮及惡化反應：15~30mg，一天 3~4 次。
- (3) 老年人的焦慮：7.5~15mg，一天 2~3 次。
- (4) 兒童：六歲以下不建議使用。六歲以上一天 0.5mg/Kg。
- (5) 最大極量 90~120mg/Day。[435]

危害及副作用：

較少見的不良反應有；精神混亂，情緒抑鬱，頭痛、噁心、嘔吐、排尿障礙等。老年、體弱、幼兒、肝病和低蛋白血症患者，對本類藥的中樞性抑制較敏感。注射用藥時容易引起呼吸抑制、低血壓、肌無力、心動過緩或心跳停止；高齡衰老、危重、肺功能不全以及心血管功能不穩定等患者，靜注過速或與中樞抑制藥合用時，發生率更高，情況也更嚴重。持續的精神紊亂，嗜睡深沉，震顫，持續的說話不清，站立不穩，心動過緩，呼吸短促或困難，嚴重的肌無力。[438]

檢驗方法：

- (一)、紫外分光光度法：酸性溶液中於波長 243、280 nm 附近呈較大吸收。

鹼性溶液中於波長 233、344 nm 附近呈較大吸收。乙醇溶液中於波長 230、315 nm 附近呈較大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1687、1706、693、830、1136、1123 cm^{-1} 的位置。

(四)、質譜分析：分裂於 m/z 257、77、268、239、205、267、233、259。

[439]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、Butabarbital、Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、Hydromorphone、Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、Thiopental。本品與酒精併服時：增加催眠、鎮靜效果，且作用快速。[440]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

突然停藥後要注意可能發生撤藥症狀。停藥後 2—3 天出現，半衰期長者則在停藥後 10—20 天發生。戒斷症狀：較多見的為睡眠困難，異常的激惹狀態和神經質；較少見或罕見的有腹部或胃痙攣、精神錯亂、驚厥、肌肉痙

攣、噁心或嘔吐、顫抖、異常的多汗。嚴重的戒斷症狀比較多見於長期服用過量的患者。也有曾在連續服用，血藥濃度一直保持在安全有效範圍內，幾個月後突然停藥而發生。失眠反跳現象、神經質、激惹，多數病人為長時期單次夜間服藥，戒斷後發生。半衰期短的停藥後發生快而嚴重。[441]

成癮治療之方法與成效評估：

催吐：吐根使用

活性炭吸收：使用最低 240 毫升的水百分之三十克活性碳。

洗胃

監測病人：監測生命體徵

減少呼吸功能：成人 Flumazenil- 0.2-3 mg。Flumazenil 拮抗中樞神經系統的苯二氮類藥物作用，逆轉的苯二氮類的鎮靜作用。

血壓過低：0.9% NaCl 10-20ml/kg 靜脈注射 dopamine、norepinephrine。[442]

第四級管制藥品 — 噁唑他 (甲唑侖) (Oxazolam)

項次: 49

名稱:

1. 中文: 噁唑他 (甲唑侖)
2. 英文: Oxazolam
3. CAS 編號: 24143-17-7

製劑:

1. 劑型: 錠劑、膠囊劑
2. 劑量: 10 mg

3. 照片:

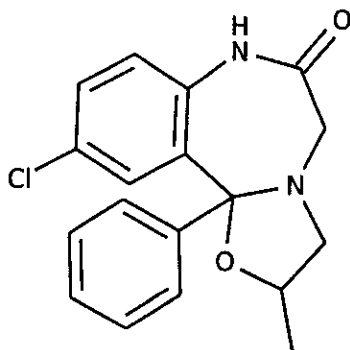


化學性狀:

1. 外觀及性狀: 白色結晶形粉末，無臭、無味，易溶於冰醋酸、氯仿，難溶於丙酮、苯、乙酸乙酯、甲醇、乙醇，幾乎不溶於水。[443]
2. 結構式:
$$10\text{-Chloro-}2,3,7,11\text{b-tetrahydro-}2\text{-methyl-}11\text{b-phenyloxazolo}[3,2\text{-d}][1,4]\text{benzodiazepin-}6(5\text{H})\text{-one}$$
3. 分子式: $\text{C}_{18}\text{H}_{17}\text{ClN}_2\text{O}_2$
4. 分子量: 328.8

5. 熔點: 185~189°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為苯二氮平類中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸(GABA) 的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氫離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類

還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。[444]

藥動學特性：

口服吸收較快，屬短中效型苯二氮平類藥。[443]

用途用法：

口服：抗焦慮每次 10~20mg，每日 3 次。

麻醉前給藥：術前給 1~2mg/kg。[443]

危害及副作用：

較少見的不良反應有；精神混亂，情緒抑鬱，頭痛、噁心、嘔吐、排尿障

凝等。老年、體弱、幼兒、肝病和低蛋白血症患者，對本類藥的中樞性抑制較敏感。注射用藥時容易引起呼吸抑制、低血壓、肌無力、心動過緩或心跳停止；高齡衰老、危重、肺功能不全以及心血管功能不穩定等患者，靜注過速或與中樞抑制藥合用時，發生率更高，情況也更嚴重。持續的精神紊亂，嗜睡深沉，震顫，持續的說話不清，站立不穩，心動過緩，呼吸短促或困難，嚴重的肌無力。[445]

檢驗方法：

(一)、氣相層析法：

(二)、質譜分析：分裂於 m/z 251、70、253、202、283。[443]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、Butabarbital、Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、Hydromorphone、Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、Thiopental。本品與酒精併服時：增加催眠、鎮靜效果，且作用快速。[446]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀):

突然停藥後要注意可能發生撤藥症狀。停藥後 2—3 天出現，半衰期長者則在停藥後 10—20 天發生。戒斷症狀：較多見的為睡眠困難，異常的激惹狀態和神經質；較少見或罕見的有腹部或胃痙攣、精神錯亂、驚厥、肌肉痙攣、噁心或嘔吐、顫抖、異常的多汗。嚴重的戒斷症狀比較多見於長期服用過量的患者。也有曾在連續服用，血藥濃度一直保持在安全有效範圍內，幾個月後突然停藥而發生。失眠反跳現象、神經質、激惹，多數病人為長時期單次夜間服藥，戒斷後發生。半衰期短的停藥後發生快而嚴重。[447]

成癮治療之方法與成效評估:

催吐：吐根使用

活性炭吸收：使用最低 240 毫升的水百分之三十克活性碳。

洗胃

監測病人：監測生命體徵

減少呼吸功能：成人 Flumazenil- 0.2-3 mg。Flumazenil 拮抗中樞神經系統的苯二氮類藥物作用，逆轉的苯二氮類的鎮靜作用。

血壓過低：0.9% NaCl 10-20ml/kg 靜脈注射 dopamine、norepinephrine。[448]

第四級管制藥品 — 匹嗎啉 (苯唑啉) (Pemoline)

項次: 50

名稱:

1. 中文: 匹嗎啉 (苯唑啉)
2. 英文: Pemoline
3. CAS 編號: 2152-34-3

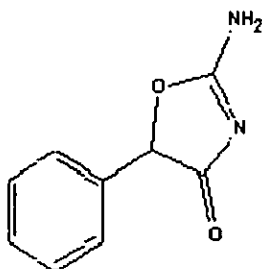
製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 18.75 毫克、37.5 毫克、75 毫克

化學性狀:

1. 外觀及性狀: 白色晶體粉末。本品一份可溶於 100 份丙二醇 (propylene glycol), 不溶於水、丙酮、乙醚。[449]
2. 結構式: 2-amino-5-phenyl-1,3-oxazol-4-one
3. 分子式: $C_9H_8N_2O_2$
4. 分子量: 176.172
5. 熔點: 256~257°C

6. 結構圖:



藥理性質：本品是中樞神經興奮劑，其藥理活性與其他興奮劑如安非他命相類似，但並非安非他命類的藥物。中樞興奮作用介於苯丙胺和咖啡因之間，約相當於咖啡因的5倍。拿老鼠做實驗，發現本品增加多巴胺合成的能力並不大。本品刺激CNS和呼吸系統並有弱的擬交感神經活性。特點為作用溫和，對精神活動作用較明顯，而對運動的興奮作用較弱。本品可以增強運動神經活性，減少疲勞感，也有抑制食慾的作用。本品可以改善過動兒的行為能力，但不影響兒茶胺酚(catecholamines)的分泌，血清素的分泌也不會被改變，但是，phenylethylamine (PEA)和5-hydroxyindoleacetic acid (5-HIAA)則會大幅下降。本品不會影響泌尿系統 monoamine 的代謝，故在治療注意力不足過動症 ADHD 上有效。[450]

藥動學特性：口服可被吸收，蛋白質結合率50%，本品主要在肝臟被代謝，50%以原型藥在腎臟被分泌，剩下由糞便或其他方式排除。排除半衰期7~13小時。[451][452][453]

用途用法：治療輕度腦功能失調、輕度抑鬱症及發作性睡眠病、遺傳過敏性皮炎。中樞興奮劑。治療MBD、治過動、注意力問題。每天0.5-3.0mg/kg/天，單次0.5-2.5mg/kg/次。治療輕度腦功能失調：口服：每日晨1次服20mg，一般劑量不超過60mg。另據國外報導，本品有效劑量一般為每日56mg（25~75mg），最大劑量為每日112.5mg，低於50mg

往往無效。一般生效時間在用藥後第3~4周。治療遺傳過敏性皮炎：從每日服1片(20mg)開始，每2~3日遞增1片，直至止癢或日劑量達4片為止。每週用6日，停用1日，共2周。[454]

危害及副作用：此藥可導致谷草轉氨酶增加，Gaffe(1989)曾報導二例死於嚴重的肝損害，肝、腎功能明顯損害者慎用，故需定期檢查肝功能，若持續異常者應停藥，有肝病歷史者禁用。其他副作用有失眠、食欲減退、頭痛、頭昏、噁心、胃痛、皮疹、輕度憂鬱等，一般較輕微，在用藥過程中可行消失。Brown(1985)報導長期用藥者，可出現嚴重憂鬱，自殺企圖、社會退縮等。大劑量偶可見精神官能症症狀、心跳過速及幻覺。肝功能不正常、煩躁不安者、癲癇、心臟病及六歲以下兒童禁用。[455]

檢驗方法：

1. 呈色分析：Koppanyi-Zwicker Test—紫色
2. 紫外分光光度法：在酸性水溶液之下於波長256、262、268nm附近較有較大吸收。
3. 氣相層析法
4. 紅外線光譜法：本品吸收譜帶於1218、1653、695、1560、1137、1275 cm^{-1} 的位置。
5. 質譜分析：分裂於 m/z 107、176、90、77、70、105、42、79。[456]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

高血壓，有藥物依賴性或酒精中毒的記錄，孕婦應小心使用。情緒不穩患者，會發生慢性濫用藥物。逐漸停藥以避免嚴重抑鬱症狀或精神病行為發生。治療期間，固定監測血壓、體重，在長期治療期間，定期做血球計數。治療初期會發生神經質和失眠，但會隨時間而減輕，然而可能需要減低劑量。[457]

成癮治療方法：

過量使用本品時治療方法：

1、生命支持：支持呼吸系統和心血管功能。

2、監測：

a 監測心率和血壓。b 監測為體溫 40 度以上危及生命，立即降低體溫和鎮靜。c 監測血清電解質，腎功能，酸鹼平衡，肝酶的病人有顯著的毒性。抽搐時 diazepam 靜脈注射（劑量：成人：從 5 到 10 毫克。兒童： 0.2 至 0.5 毫克/公斤，重複每 5 分鐘視需要）或 lorazepam 靜脈注射（劑量：成人：4 日至 8 毫克；兒童： 0.05 至 0.1 毫克/千克）。監測為低血壓，呼吸抑制，以及需要氣管插管。如果抽搐是無法控制或再次發生，考慮苯巴比妥。[458]

第四級管制藥品 — 苯雙甲嗎啉 (二苯甲嗎啉) Phendimetrazine

項次: 51

名稱:

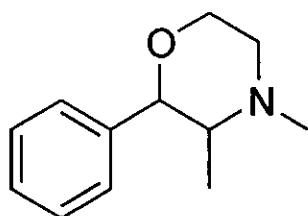
1. 中文：苯雙甲嗎啉 (二苯甲嗎啉)
2. 英文：Phendimetrazine
3. CAS 編號：634-03-7

製劑:

1. 劑型：錠劑、膠囊
2. 劑量：35 毫克(錠劑)、105 毫克(膠囊)

化學性狀:

1. 外觀及性狀：白色結晶性粉末。溶解度:本品可溶於水，微溶於乙醇，不溶於丙酮、苯、氯仿，乙醚。[459]
2. 結構式：3,4-Dimethyl-2-phenyl-morpholine
3. 分子式： $C_{12}H_{17}NO$
4. 分子量：191.27
5. 結構圖：



藥理性質：

約有給予劑量的 30% 會代謝成 Phenmetrazine 擬交感神經藥，其藥理作用與安非他命類似，刺激中樞神經和使血壓上升，作用於下丘腦飽感中樞，並影響糖代謝致食欲減退，體重下降，刺激交感神經的活性進而抑制食慾，是一種減肥藥品。[460]

藥動學特性：

口服後在消化道吸收迅速，分配半衰期 36 分鐘。T_{1/2} 約為 2~4 小時。80% 的本品經由腎臟排除，投與藥物之後的 24 小時之內，會有給予劑量 30% 之本品以原型藥的方式直接分泌到尿液中，30% 的 Phenmetrazine，20% 的 Phendimetrazine N-oxide。[461]

用途用法：

治療肥胖症減少食慾。一天的用量在 70~105 毫克之間，最多不可超過 210 毫克。[462]

危害及副作用：

口乾、上腹部不適、出汗、興奮、失眠、心動過速、血壓升高、長期服用可產生精神和身體依賴。[463]

檢驗方法：

1. 紫外分光光度法：在酸性水溶液之下於波長 251、257、261、267nm

附近呈較大吸收。

2. 氣相層析法

3. 紅外線光譜法：以 KBr 法檢測本品，主峰出現在 1120、1105、697、1083、752、1630 cm^{-1} 的位置。

4. 質譜分析：分裂於 m/z 57、85、42、56、76、191、70、77。[464]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

長期高劑量治療突然中斷後，可能會導致抑鬱症和疲勞。通常在一個數週後出現藥物依賴現象，如果出現上述情形應當停止用藥。本品在血中濃度達到每公升血液中含有 300 毫克以上的濃度時，便會致命。[465]

成癮治療方法：Phendimetrazine 濫用。這是中常用的組合與海洛因或其他毒品，或者給予靜脈注射或口服，在長期使用可能導致嚴重的性皮炎，失眠，煩躁不安，多動，性格變化，思覺失調。一般可以停止藥物幾天或幾週後解決這些問題。

急性中毒時處理方式：

1. 不誘導嘔吐。
2. 使用活性炭。

3. 抽搐時 diazepam 靜脈注射（劑量：成人：從 5 到 10 毫克。兒童： 0.2 至 0.5 毫克/公斤，重複每 5 分鐘視需要）或 lorazepam 靜脈注射（劑量：成人： 4 日至 8 毫克；兒童： 0.05 至 0.1 毫克/千克）。監測為低血壓，呼吸抑制，以及需要氣管插管。如果抽搐是無法控制或再次發生，考慮苯巴比妥。[463]

第四級管制藥品 — 苯巴比妥 (Phenobarbital)

項次: 52

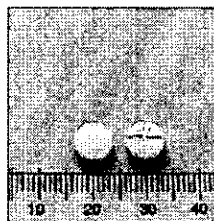
名稱:

1. 中文: 苯巴比妥
2. 英文: Phenobarbital
3. CAS 編號: 50-06-6

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 30 mg

3. 照片:



化學性狀:

1. 外觀及性狀:

性質: 白色結晶粉末。無臭微苦。微溶于水, 溶於熱水, 乙醇、乙醚、氯仿、氫氧化鈉和碳酸鈉溶液。水溶液呈酸性。可由乙基苯基丙二酸二乙酯與尿素在乙醇鈉作用下經縮合反應製得。[466]

2. 結構式: 英文

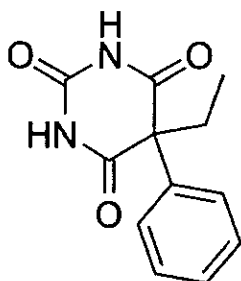
5-ethyl-5-phenylpyrimidine-2,4,6(1H,3H,5H)-trione

3. 分子式: $C_{12}H_{12}N_2O_3$

4. 分子量: 232.235

5. 熔點: 174~178°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為巴比妥類催眠藥、抗驚厥藥。長效作用時間(10~12小時),對中樞的抑制作用隨著劑量加大,表現為鎮靜、催眠、抗驚厥及抗癲癇。大劑量對心血管系統、呼吸系統有明顯的抑制。過量可麻痺延髓呼吸中樞致死。體外電生理實驗本類藥物使神經細胞的氯離子通道開放,細胞過極化,擬似 γ -氨基丁酸(GABA)的作用。治療濃度的苯巴比妥可降低谷氨酸的興奮作用、加強 γ -氨基丁酸的抑制作用,抑制中樞神經系統單突觸和多突觸傳遞,抑制癲灶的高頻放電及其向周圍擴散。可減少胃液分泌,降低胃張力。可產生依賴性,包括精神依賴和身體依賴。[467]

藥動學特性：

口服後在消化道吸收迅速,15~30分鐘生效,約維持10~12小時。吸收後分佈於體內各組織及體液中,因本品脂溶性高,易通過血腦屏障,進入腦組織,起效比較快。血漿中蛋白結合20~60%, $T_{1/2}$ 約為53~118小時,血藥濃度達峰時間,個體差異大。本品在肝臟代謝成

N-glucopyranosylphenobarbital、 p-hydroxy-phenobarbital 與葡糖苷酸結合物
經由尿液排出。[468]

用途用法：

癲癇：在 50 mg 至 100 mg，每天口服 2 或 3 次，或緩慢靜脈注射多次 100 mg
至 320 mg，最高總劑量為 600 mg/天。

高膽紅素血症：30-60 mg，口服每日 3 次。

失眠：在就寢時間前口服 100-320 mg。

鎮靜、以紓緩焦慮、緊張：口服 30 mg 至 120 mg 分為 2 或 3 次。緩慢靜脈
注射多次 100 mg 至 320 mg，最高總劑量為 600 mg/天

癲癇、急性痙攣：100 mg 至 320 mg，緩慢靜脈注射不超過 600 mg 每 24 小
時。癲癇持續狀態，為緊急情況時使用：初始劑量 10 mg/公斤，注射速率
為 100 mg/分鐘，如果繼續後 10 分鐘和苯巴比妥可能會繼續注射速率為 50
mg/分鐘，直到痙攣停止。最高累積劑量 20 mg/公斤；全身麻醉，可能需要上
述的累積劑量 30 mg/公斤。停止用藥，減少苯巴比妥每日劑量由 10 %。[469]

危害及副作用：

- 1、用於抗癲癇時最常見的不良反應為鎮靜，但隨著療程的持續，其鎮靜作
用逐漸變得不明顯。
- 2、可能引起微妙的情感變化，出現認知和記憶的缺損。

- 3、長期用藥，偶見葉酸缺乏和低鈣血症。
- 4、罕見巨幼紅細胞性貧血和骨軟化。
- 5、大劑量時可產生眼球震顫、共濟失調和嚴重的呼吸抑制。
- 6、用本品的患者中約 1~3% 的人出現皮膚反應，多見者為各種皮疹以及哮喘，嚴重者可出現剝脫性皮炎和多形紅斑（或 Stevens—Johnson 綜合症），中毒性表皮壞死極為罕見。
- 7、有報導用藥者出現肝炎和肝功能紊亂。
- 8、長時間使用可發生藥物依賴，停藥後易發生停藥綜合症。[470]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：將本品溶於乙醇與鹼性硼酸緩衝液(pH9.6)之混液(1→20)所成溶液(1→100,000)，按照紫外線吸光度測定法測定之，於波長 239nm 附近呈最大吸收。溶於 1M 氫氧化鈉(pH13)，於波長 254nm 附近呈最大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1712、1684、1670、1770、1310、1300 cm^{-1} 的位置。

(四)質譜分析：分裂於 m/z 204、117、146、161、77、103、115、118。

4-hydroxyphenobarbital 於 m/z 219、248、148、220、120、218、133、64。

[471]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Adinazolam、Alfentanil、Alprazolam、

Amobarbital、Aprobarbital、Bromazepam、Brotizolam、Butabarbital、Butalbital、

Calamus、Cannabis、Clobazam、Clonazepam、Clorazepate、Codeine、

Diazepam、Estazolam、Ethchlorvynol、Fentanyl、Flunitrazepam、Flurazepam、

Halazepam、Hydrocodone、Hydromorphone、Ketazolam、Levorphanol、

Lorazepam、Lormetazepam、Medazepam、Meperidine、Mephesisin、

Mephobarbital、Meprobamate、Metaxalone、Midazolam、Morphine、

Nitrazepam、Nordazepam、Oxazepam、Oxycodone、Oxymorphone、

Pentobarbital、Prazepam、Secobarbital、Temazepam、Thiopental、Triazolam。

本品與酒精併服時：過度中樞神經抑制作用，且作用快速。[472]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

一般應用 5~10 倍催眠量時可引起中度中毒，10~15 倍則重度中毒，血濃

度高於 8~10 mg/100 ml 時，有生命危險。急性中毒症狀為昏睡，進而呼吸

淺表，通氣量大減，最後呼吸衰竭而死亡。5、本品或其他巴比妥類藥物中

毒的急救：口服本品未超過 3 小時者，可用大量溫生理鹽水或 1：2000 的

高錳酸鉀溶液洗胃（注意防止液體流入氣管內，以免引起吸入性肺炎）。洗畢，再以 10~15g 硫酸鈉（忌用硫酸鎂）導瀉。並給予碳酸氫鈉或乳酸鈉鹼化尿液，減少在腎小管中的重吸收，加速藥物排泄。亦可用甘露醇等利尿劑增加尿量，促進藥物排除。又因呼吸抑制所致的呼吸性酸中毒時，可促進藥物進入中樞，加重中毒反應，因此保證呼吸道通暢尤為重要，必要時進行氣管切開或氣管插管，吸氧或人工呼吸。亦可適當給予中樞興奮藥。血壓偏低時，可靜滴葡萄糖鹽水或低分子右旋糖酐。苯巴比妥為肝藥酶誘導劑，因此可使雙香豆素、氫化可的松、地塞米松、睪丸酮、雌激素、孕激素、口服避孕藥、氯丙嗪、氯黴素、多西環素、灰黃黴素、地高辛、洋地黃毒苷及苯妥英鈉等藥，合用時代謝加速，療效降低；也可使在體內活化的藥物作用增加，如環磷醯胺等。[473]

成癮治療之方法與成效評估：

- 1、輕度中毒 頭痛、眩暈、乏力、語言不清、嗜睡、視物模糊、眼球震顫、瞳孔縮小 噁心、嘔吐，各種形態的皮疹，呼吸稍快，血壓正常或偏低，還可引起陰莖水腫。
- 2、重度中毒 開始病人可表現狂躁、驚厥、四肢強直；繼而進入抑制期，出現瞳孔散大（對光反射存在），全身弛緩，淺反射消失，脈搏細速，血壓下降，尿少或尿閉，中毒性肝炎等表現；最後可因呼吸抑制或因嘔吐物吸

入而發生窒息而死亡。會導致戒斷症狀的中樞神經系統的刺激，如焦慮或煩躁不安和麻煩，睡覺，這可能會導致驚厥和幻覺。這些症狀可能發生在使用後 5 至 15 天。

(一) 洗胃

(二) 促進毒物排泄

1、快速輸液 2、利尿脫水 3、導瀉 4、血液透析 5、鹼化尿液

(三) 中樞興奮劑的應用

僅適用於重度中毒者、呼吸高度抑制者及昏迷患者。[474]

第四級管制藥品 — 甲基苯乙基胺 (二甲苯乙胺) Phentermine

項次:53

名稱：

1. 中文：甲基苯乙基胺 (二甲苯乙胺)
2. 英文：Phentermine
3. CAS 編號：122-09-8

製劑：

1. 劑型：膠囊
2. 劑量：30 毫克

化學性狀：

1. 外觀及性狀：無色油狀液體，可溶於酒精、氯仿、乙醚，微溶於水。

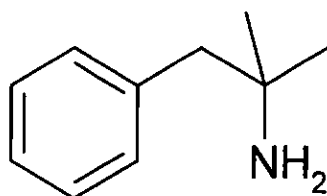
本品是 metamfetamine 的同分異構物。[474]

2. 結構式：2-methyl-1-phenylpropan-2-amine and
2-methyl-amphetamine

3. 分子式：C₁₀H₁₅N

4. 分子量：149.233

5. 結構圖：



藥理性質：

本品的藥理似安非他命興奮劑(交感神經興奮劑)，具抑制正腎上腺素回收的作用，用來控制食慾。美國食品及藥物管理局（FDA）建議，藥物用於治療體重指標（BMI）逾30的肥胖患者，又或患有高血壓、糖尿病、膽固醇高的肥胖人士，療程最長為數星期，不能長期服用，以免造成依賴。它刺激中樞神經叢釋放神經遞物質兒茶酚胺，其中包括多巴胺，腎上腺素，和正腎上腺素。[475]

藥動學特性：

蛋白質結合率約為96.3%，半衰期約20小時，在尿液維持pH值酸性下投藥後的24之內會有藥量的70~80%的原型藥和少量其他代謝物，被排除到尿液中。[476]

用途用法：每日用量若是松香複合物（resin complex）15~30 mg，若為Phentermine hydrochloride 則是15~37.5mg。[477]

危害及副作用：

本品最多只可連續吃兩個月，否則會出現嚴重的副作用，美國規定醫生最多只可為病人處方一個月分量的有關藥物。芬特明會影響中樞神經及心血管系統服用過量會出現交感神經興奮現象(口乾、嘔心、流汗、心跳加快、血壓上升、散瞳)、中樞神經興奮現象(煩躁、失眠、抽痙、譫妄)、以及戒

斷效應、精神依賴、妄想型精神分裂症等。本品與其他藥物使用，副作用的影響更嚴重，即使停藥亦不能減低；亦因其會令人上癮，不可長期服用。

[478]

檢驗方法：

1. 呈色分析：Marquis Test—橘色
2. 紫外分光光度法：於波長 247、251、257nm 附近有較大吸收。
3. 氣相層析法
4. 紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 730、1285、705、1495、1610、
1510 cm^{-1} 的位置。
5. 質譜分析：principal ions at m/z 58、91、42、41、134、65、59、40。

[479]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

藥劑過量的普通的症狀包括：腹瀉、頭暈、身體抽搐、侵略性、幻覺、不規則的心跳、噁心、混亂、不安定性、震顫。[480]

成癮治療方法：

在長期使用可能導致嚴重的性皮炎，失眠，煩躁不安，多動，性格變化，思覺失調。一般可以停止藥物幾天或幾週後解決這些問題。

急性中毒時處理方式：

1、不誘導嘔吐。

2、使用活性炭。

2、抽搐時 diazepam 靜脈注射（劑量：成人：從 5 到 10 毫克。兒童： 0.2 至 0.5 毫克/公斤，重複每 5 分鐘視需要）或 lorazepam 靜脈注射（劑量：成人： 4 日至 8 毫克;兒童： 0.05 至 0.1 毫克/千克）。監測為低血壓，呼吸抑制，以及需要氣管插管。如果抽搐是無法控制或再次發生，考慮苯巴比妥。[481]

第四級管制藥品 — 匹那西洋 (丙炔氮平) (Pinazepam)

項次: 54

名稱:

1. 中文: 匹那西洋 (丙炔氮平)
2. 英文: Pinazepam
3. CAS 編號: 52463-83-9

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 5 mg

化學性狀:

1. 外觀及性狀: 白色結晶性粉末。[482]

2. 結構式:

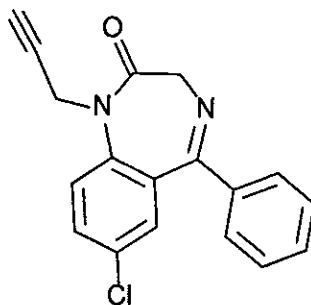
9-chloro-6-phenyl-2-prop-2-ynyl-2,5-diazabicyclo[5.4.0]undeca-5,8,10,12-tetraen-3-one

3. 分子式: $C_{18}H_{13}ClN_2O$

4. 分子量: 308.8

5. 熔點: 140-142°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為長效型苯二氮平類中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸 (GABA) 的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氫離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究體示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺

忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③

抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌

鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。

由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。[483]

藥動學特性：

口服吸收較快，屬長半衰期苯二氮平類藥。本品血漿蛋白結合率約為 93%。

本品在肝臟代謝成活性代謝物 N-desmethyldiazepam、Oxazepam，僅 0.05%

以原形從尿液排出。本品 T_{1/2} 為 10~15 小時，其活性代謝物

N-desmethyldiazepam 為 70 小時。[484]

用途用法：

主要用於抗焦慮，亦可用於鎮靜催眠。口服一次 5 mg，一日兩次，按反應和病情調整劑量。一日最終劑量不超過 20 mg。[482]

危害及副作用：

較少見的不良反應有；精神混亂，情緒抑鬱，頭痛、噁心、嘔吐、排尿障礙等。老年、體弱、幼兒、肝病和低蛋白血症患者，對本類藥的中樞性抑制較敏感。注射用藥時容易引起呼吸抑制、低血壓、肌無力、心動過緩或

心跳停止；高齡衰老、危重、肺功能不全以及心血管功能不穩定等患者，靜注過速或與中樞抑制藥合用時，發生率更高，情況也更嚴重。持續的精神紊亂，嗜睡深沉，震顫，持續的說話不清，站立不穩，心動過緩，呼吸短促或困難，嚴重的肌無力。[485]

檢驗方法：

(一)、氣相層析法：

(二)、質譜分析：分裂於m/z 280、307、308。

(三)、呈色反應：甲醛-硫酸成橘色。[486]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、

Butabarbital、Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、

Hydromorphone、Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、

Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、

Thiopental。本品與酒精併服時：增加催眠、鎮靜效果，且作用快速。[487]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

突然停藥後要注意可能發生撤藥症狀。停藥後 2—3 天出現，半衰期長者則

在停藥後 10—20 天發生。戒斷症狀：較多見的為睡眠困難，異常的激惹狀態和神經質；較少見或罕見的有腹部或胃痙攣、精神錯亂、驚厥、肌肉痙攣、噁心或嘔吐、顫抖、異常的多汗。嚴重的戒斷症狀比較多見於長期服用過量的患者。也有曾在連續服用，血藥濃度一直保持在安全有效範圍內，幾個月後突然停藥而發生。失眠反跳現象、神經質、激惹，多數病人為長時期單次夜間服藥，戒斷後發生。半衰期短的停藥後發生快而嚴重。[488]

成癮治療之方法與成效評估：

催吐：吐根使用

活性炭吸收：使用最低 240 毫升的水百分之三十克活性碳。

洗胃

監測病人：監測生命體徵

減少呼吸功能：成人 Flumazenil- 0.2-3 mg。Flumazenil 拮抗中樞神經系統的苯二氮類藥物作用，逆轉的苯二氮類的鎮靜作用。

血壓過低：0.9% NaCl 10-20ml/kg 靜脈注射 dopamine、norepinephrine。[489]

第四級管制藥品 一呱苯甲醇(吡苯甲醇) (Pipradrol)

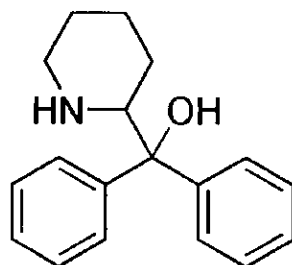
項次: 55

名稱:

1. 中文：苯甲醇
2. 英文：Pipradrol
3. CAS 編號：467-60-7

化學性狀：

1. 外觀及性狀：小的白色結晶體，或白色結晶粉末。1 份的本品可溶於 60 份的熱水，35 份的乙醇，1000 份的氯仿(chloroform)，8 份的甲醇，但不溶於乙醚。[490]
2. 結構式： α,α -Diphenyl-2-piperidinemethanol
3. 分子式： $C_{18}H_{21}NO$
4. 分子量：267.37
5. 熔點：308~309°C
6. 結構圖：



藥理性質：

為精神興奮藥。能提高精神活動，可對抗抑鬱症。作用比苯丙胺弱，毒副作用亦較少。[490]

藥動學特性：

口服易吸收，1次服藥作用可維持4小時左右。在體內迅速代謝，經尿排出。
 $t_{1/2}$ 230分鐘。[490]

用途用法：

主要用於輕微腦功能失調 (MBD)。口服每次1~2mg，1日2~3次

危害及副作用：

超量可引起失眠、噁心、食欲不振、焦慮，一般停藥後即可消失。焦慮及煩躁不安等病人忌用。[490]

檢驗方法：

1. 呈色分析：Marquis Test—橘黃色。
2. 紫外分光光度法：酸性水溶液(aqueous acid)於波長252、258nm附近
近有較大吸收。
3. 氣相層析法
4. 紅外線光譜法：本品吸收譜帶於701、740、690、1585、1300、1065
 cm^{-1} 的位置。

5. 質譜分析：分裂於 m/z 84、56、85、77、105、55、30、42。[490]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品。

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

長期高劑量治療突然中斷後，可能會導致抑鬱症和疲勞。通常在一個數週後出現藥物依賴現象，如果出現上述情形應當停止用藥。 [491]

成癮治療方法：

急性中毒時處理方式：

4. 不誘導嘔吐。
5. 使用活性炭。
6. 抽搐時 diazepam 靜脈注射（劑量：成人：從 5 到 10 毫克。兒童： 0.2 至 0.5 毫克/公斤，重複每 5 分鐘視需要）或 lorazepam 靜脈注射（劑量：成人： 4 日至 8 毫克；兒童： 0.05 至 0.1 毫克/千克）。監測為低血壓，呼吸抑制，以及需要氣管插管。如果抽搐是無法控制或再次發生，考慮苯巴比妥。[492]

第四級管制藥品 — 普拉西洋（環丙氮平）(Prazepam)

項次: 56

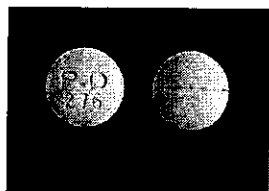
名稱:

1. 中文: 普拉西洋 (環丙氮平)
2. 英文: Prazepam
3. CAS 編號: 2955-38-6

製劑:

1. 劑型: 錠劑、膠囊劑
2. 劑量: 5 mg、10 mg、15 mg

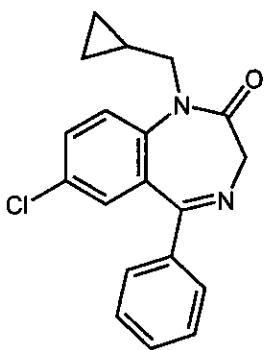
3. 照片:



化學性狀:

1. 外觀及性狀: 白色結晶性粉末。可溶於乙醇、氯仿。[493]
2. 結構式:
O=C1CN2C(=O)C(C1)C2C3=CC=CC=C3C4CC5CC(C4)N5
9-chloro-2-(cyclopropylmethyl)-6-phenyl-2,5-diazabicyclo[5.4.0]undeca-5,8,10,12-tetraen-3-one
3. 分子式: $C_{19}H_{17}ClN_2O$
4. 分子量: 324.8
5. 熔點: 145~146°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為長效型苯二氮平類中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸 (GABA) 的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氫離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑

制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。[494]

藥動學特性：

口服吸收緩慢，屬長半衰期苯二氮平類藥。本品血漿蛋白結合率約為 97%。本品在肝臟代謝成活性代謝物 Diazepam、Oxazepam、N-desmethyldiazepam，在二十四小時內僅 14%藥物排除，而四十八小時內只有 22% 從尿液排出。本品 T_{1/2} 為 78 小時，其活性代謝物 Oxazepam 為 4~25 小時，Diazepam 為 20~100 小時，N-desmethyldiazepam 為 70 小時。[495]

用途用法：

主要用於抗焦慮，亦可用于鎮靜催眠。口服一日 15—60mg，分次服，按反應和病情調整劑量。[493]

危害及副作用：

較少見的不良反應有；精神混亂，情緒抑鬱，頭痛、噁心、嘔吐、排尿障礙等。老年、體弱、幼兒、肝病和低蛋白血症患者，對本類藥的中樞性抑制較敏感。注射用藥時容易引起呼吸抑制、低血壓、肌無力、心動過緩或心跳停止；高齡衰老、危重、肺功能不全以及心血管功能不穩定等患者，靜注過速或與中樞抑制藥合用時，發生率更高，情況也更嚴重。持續的精神紊亂，嗜睡深沉，震顫，持續的說話不清，站立不穩，心動過緩，呼吸短促或困難，嚴重的肌無力。[493]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：在酸性溶液中於波長 240、285、360 nm 附近呈較大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1667、1316、740、694、1602、704 cm^{-1} 的位置。

(四)、質譜分析：分裂於 m/z 91、269、324、55、296、323、297。Oxazepam 分裂於 m/z 257、77、268、239、205、267、233、259。nordazepam 分裂於 m/z 242、269、270、241、243、271、244、272。

(五)、呈色反應：甲醛-硫酸成橘色。[496]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、
Butabarbital、Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、
Hydromorphone、Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、
Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、
Thiopental。本品與酒精併服時：增加催眠、鎮靜效果，且作用快速。[497]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

突然停藥後要注意可能發生撤藥症狀。停藥後 2—3 天出現，半衰期長者則在停藥後 10—20 天發生。戒斷症狀：較多見的為睡眠困難，異常的激惹狀態和神經質；較少見或罕見的有腹部或胃痙攣、精神錯亂、驚厥、肌肉痙攣、噁心或嘔吐、顫抖、異常的多汗。嚴重的戒斷症狀比較多見於長期服用過量的患者。也有曾在連續服用，血藥濃度一直保持在安全有效範圍內，幾個月後突然停藥而發生。失眠反跳現象、神經質、激惹，多數病人為長時期單次夜間服藥，戒斷後發生。半衰期短的停藥後發生快而嚴重。[498]

成癮治療之方法與成效評估：

催吐：吐根使用

活性炭吸收：使用最低 240 毫升的水百分之三十克活性炭。

洗胃

監測病人：監測生命體徵

減少呼吸功能：成人 Flumazenil- 0.2-3 mg。Flumazenil 拮抗中樞神經系統的

苯二氮類藥物作用，逆轉的苯二氮類的鎮靜作用。

血壓過低：0.9% NaCl 10-20ml/kg 靜脈注射 dopamine、norepinephrine。[499]

第四級管制藥品 一丙已君 (普西卓林、甲環乙胺) (Propylhexedrine)

項次: 57

名稱:

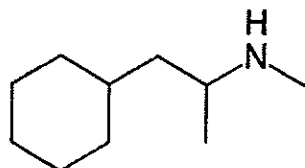
1. 中文: 丙已君 (普西卓林、甲環乙胺)
2. 英文: Propylhexedrine
3. CAS 編號: 3595-11-7

製劑:

1. 劑型: 鼻噴劑、包覆錠劑
2. 劑量: 包覆錠劑 25 mg

化學性狀:

1. 外觀及性狀: 澄清無味的液體，在室溫下會慢慢氣化，易從空氣中吸收二氧化碳，本品微溶於水，可與酒精、氯仿、乙醚混溶。[500]
2. 結構式: N, α -dimethyl-cyclohexylethylamine
3. 分子式: $C_{10}H_{21}N$
4. 分子量: 155.29
5. 沸點: 204°C
6. 結構圖:



藥理性質：

中樞神經興奮劑。

擬交感神經興奮作用，作用於 α -腎上腺素激導性受體。[501]

藥動學特性：

在腎臟代謝成 norpropylhexedrine、cyclohexylacetoxime、

cis/trans-4-hydroxypropylhexedrine。[502]

用途用法：

口服:每日的用量在 75~100mg propylhexedrine hydrochloride。[503]

危害及副作用：

內分泌/代謝效應:中暑。

神經系統效應:頭痛。

呼吸系統效應:肺循環血壓過高；過量吸入可能造成刺痛、回彈充血和鼻甲

暫時擴大。慢性鼻炎則可能與長期使用有關。[504]

檢驗方法：

1.紫外分光光度法：在 230~360nm 附近都有吸收，但沒有較明顯的吸收波長。

2.氣相層析法。

3.紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1058、1015、885、913、1153、966cm⁻¹

的位置。

4. 質譜分析：principal ions at m/z 58、140、67、72、83、81、155、156。[500]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

猝死發生於靜脈注射濫用者。屍檢結果包括肺部異物肉芽腫、伴隨血管變化的肺纖維化與心臟肥大。

案例報告顯示，使用於控制肥胖，口服 propylhexedrine hydrochloride 八年，發生肺循環血壓過高；停藥 12 個月後，臨床檢查和心電圖研究恢復正常。

[504]

第四級管制藥品 — 焦二異丁基酮（焦洛戊酮） Pyrovalerone

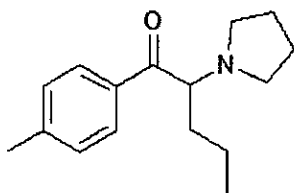
項次: 58

名稱:

1. 中文：焦二異丁基酮（焦洛戊酮）
2. 英文：Pyrovalerone
3. CAS 編號：3563-49-3

化學性狀：

1. 結構式：1-(4-methylphenyl)-2-(1-pyrrolidinyl)pentan-1- pentanone
2. 分子式：C₁₆H₂₃NO
3. 分子量：245.36
4. 沸點：104°C



5. 結構圖：

藥理性質：

本品為中樞神經興奮劑。抑制 dopamine 和 norepinephrine 再回收。[505]

用途用法：本品為中樞神經興奮劑。

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

第四級管制藥品 — 仲丁比妥 (Secbutabarbital、Butabarbital)

項次: 59

名稱:

1. 中文: 仲丁比妥
2. 英文: Secbutabarbital、Butabarbital
3. CAS 編號: 143-81-7

製劑:

1. 劑型: 錠劑

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

性質: 白色結晶性粉末, 微溶於冷水, 溶於乙醇、氯仿、乙醚等。

[506]

2. 結構式: 英文

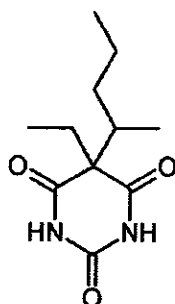
5-butan-2-yl-5-ethyl-1,3-diazinane-2,4,6-trione

3. 分子式: $C_{10}H_{16}N_2O_3$

4. 分子量: 212.246

5. 熔點: 165~168°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為巴比妥類催眠藥、抗驚厥藥。中等作用時間（3~6 小時），對中樞的抑制作用隨著劑量加大，表現為鎮靜、催眠、抗驚厥及抗癲癇。大劑量對心血管系統、呼吸系統有明顯的抑制。過量可麻痹延髓呼吸中樞致死。體外電生理實驗本類藥物使神經細胞的氯離子通道開放，細胞過極化，擬似 γ -氨基丁酸(GABA)的作用。治療濃度的仲丁比妥可降低谷氨酸的興奮作用、加強 γ -氨基丁酸的抑制作用，抑制中樞神經系統單突觸和多突觸傳遞，抑制癲灶的高頻放電及其向周圍擴散。可減少胃液分泌，降低胃張力。可產生依賴性，包括精神依賴和身體依賴。[507]

藥動學特性：

口服後在消化道吸收迅速，15~60 分鐘生效，約維持 3~6 小時。吸收後分佈於體內各組織及體液中，因本品脂溶性高，易通過血腦屏障，進入腦組織，起效比較快。血漿中蛋白結合 26%，T1/2 約為 34~42 小時。本品在 60% 以原形經由尿液排出，30% 以 5-(2-carboxy-1-methylehtyl)-5-ehylbarbituric acid。[508]

用途用法：

失眠：就寢時間口服 50~100 mg

鎮靜：每日白天口服 3 或 4 次，每次 15 至 30 mg。[509]

危害及副作用：

- 1、可能引起微妙的情感變化，出現認知和記憶的缺損。
- 2、長期用藥，偶見葉酸缺乏和低鈣血症。
- 3、罕見巨幼紅細胞性貧血和骨軟化。
- 4、大劑量時可產生眼球震顫、共濟失調和嚴重的呼吸抑制。
- 5、用本品的患者中約 1~3% 的人出現皮膚反應，多見者為各種皮疹以及哮喘，嚴重者可出現剝脫性皮炎和多形紅斑（或 Stevens—Johnson 綜合症），中毒性表皮壞死極為罕見。
- 6、肝炎和肝功能紊亂。
- 7、長時間使用可發生藥物依賴，停藥後易發生停藥綜合症。[510]

檢驗方法：

- (一)、紫外分光光度法：將本品溶於乙醇與鹼性硼酸緩衝液(pH9.2)之混液(1→20)所成溶液(1→100,000)，按照紫外線吸光度測定法測定之，於波長 239nm 附近呈最大吸收。溶於 1M 氫氧化鈉(pH13)，於波長 254nm 附近呈最大吸收。
- (二)、氣相層析法：
- (三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1675、1760、1317、1303、1230、853 cm^{-1} 的位置。

(四)質譜分析：分裂於 m/z 141、156、41、57、39、98、157、47。[511]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Adinazolam、Alfentanil、Alprazolam、
Amobarbital、Aprobarbital、Bromazepam、Brotizolam、Butabarbital、Butalbital、
Calamus、Cannabis、Clobazam、Clonazepam、Clorazepate、Codeine、
Diazepam、Estazolam、Ethchlorvynol、Fentanyl、Flunitrazepam、Flurazepam、
Halazepam、Hydrocodone、Hydromorphone、Ketazolam、Levorphanol、
Lorazepam、Lormetazepam、Medazepam、Meperidine、Mephesisin、
Mephobarbital、Meprobamate、Metaxalone、Midazolam、Morphine、
Nitrazepam、Nordazepam、Oxazepam、Oxycodone、Oxymorphone、
Pentobarbital、Phenobarbital、Prazepam、Secobarbital、Temazepam、
Thiopental、Triazolam。本品與酒精併服時：過度中樞神經抑制作用，且作用快速。[512]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

與短期治療具耐受性，治療效果鎮靜催眠，發生更迅速。不幸的是，由於耐受性增加治療指數降低。可能引起昏迷、嚴重的呼吸和心血管抑制、低

血壓和休克繼而引發腎功能衰竭、死亡。深度呼吸抑制是急性中毒的直接死亡原因。 [512]

成癮治療之方法與成效評估：

會導致戒斷症狀的中樞神經系統的刺激，如焦慮或煩躁不安和麻煩，睡覺，這可能會導致驚厥和幻覺。這些症狀可能在使用後 5 至 15 天。血中濃度高於 1 mg/100 ml 時會出現毒性，大於 3 mg/100 ml 時有生命危險。

(一) 洗胃

(二) 促進毒物排泄

1、快速輸液 2、利尿脫水 3、導瀉 4、血液透析 5、鹼化尿液

(三) 中樞興奮劑的應用

僅適用於重度中毒者、呼吸高度抑制者及昏迷患者。[513]

第四級管制藥品 — 替馬西洋 (羶二氮平、甲羶氮平) (Temazepam)

項次: 60

名稱:

1. 中文: 替馬西洋 (羶二氮平、甲羶氮平)
2. 英文: Temazepam
3. CAS 編號: 846-50-4

製劑:

1. 劑型: 膠囊劑
2. 劑量: 10 mg、15 mg、20 mg、30 mg

化學性狀:

1. 外觀及性狀: 白色結晶粉末。微溶於水，一份本品可溶於十份的乙醇，十份的氯仿。[514]

2. 結構式:

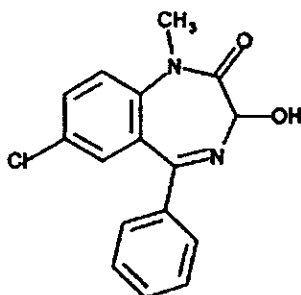
7-Chloro-1,3-dihydro-3-hydroxy-1-methyl-5-phenyl-1,4-benzodiazepin-2-one

3. 分子式: $C_{16}H_{13}ClN_2O_2$

4. 分子量: 300.7

5. 熔點: 156~159°C

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為中效型苯二氮平類中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸 (GABA) 的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氫離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究顯示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺

忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③

抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④

骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。

由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反

射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。[515]

藥動學特性：

口服吸收較快，屬中半衰期苯二氮平類藥。本品血漿蛋白結合率約為 96%。

本品由肝臟酵素經葡萄糖醛酸代謝物，僅 2%~3%以原形從尿液排出。本品

T_{1/2} 為 3.5~18.4 小時。[516]

用途用法：

催眠 10~30mg 睡前頓服。[514]

危害及副作用：

較少見的不良反應有；精神混亂，情緒抑鬱，頭痛、噁心、嘔吐、排尿障礙等。老年、體弱、幼兒、肝病和低蛋白血症患者，對本類藥的中樞性抑制較敏感。注射用藥時容易引起呼吸抑制、低血壓、肌無力、心動過緩或心跳停止；高齡衰老、危重、肺功能不全以及心血管功能不穩定等患者，靜注過速或與中樞抑制藥合用時，發生率更高，情況也更嚴重。持續的精

神紊亂，嗜睡深沉，震顫，持續的說話不清，站立不穩，心動過緩，呼吸短促或困難，嚴重的肌無力。[517]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：在酸性溶液中於波長 237、284、358 nm 附近呈較大吸收。在鹼性溶液中於波長 231、313 nm 附近呈較大吸收。在甲醇溶液中於波長 230、314 nm 附近呈較大吸收。

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1687、1670、1112、1603、705、1150 cm^{-1} 的位置。

(四)、質譜分析：分裂於 m/z 271、273、300、272、256、77、255、257。

(五)、呈色反應：甲醛-硫酸成橘色。[518]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、Butabarbital、Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、Hydromorphone、Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、

Thiopental。本品與酒精併服時：增加催眠、鎮靜效果，且作用快速。[519]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀):

突然停藥後要注意可能發生撤藥症狀。停藥後 2—3 天出現，半衰期長者則在停藥後 10—20 天發生。戒斷症狀：較多見的為睡眠困難，異常的激惹狀態和神經質；較少見或罕見的有腹部或胃痙攣、精神錯亂、驚厥、肌肉痙攣、噁心或嘔吐、顫抖、異常的多汗。嚴重的戒斷症狀比較多見於長期服用過量的患者。也有曾在連續服用，血藥濃度一直保持在安全有效範圍內，幾個月後突然停藥而發生。失眠反跳現象、神經質、激惹，多數病人為長時期單次夜間服藥，戒斷後發生。半衰期短的停藥後發生快而嚴重。[520]

成癮治療之方法與成效評估:

催吐：吐根使用

活性炭吸收：使用最低 240 毫升的水百分之三十克活性碳。

洗胃。監測病人：監測生命體徵減少呼吸功能：成人 Flumazenil- 0.2-3 mg。

Flumazenil 拮抗中樞神經系統的苯二氮類藥物作用，逆轉的苯二氮類的鎮靜

作用。血壓過低： 0.9% NaCl 10-20ml/kg 靜脈注射 dopamine、

norepinephrine。[521]

第四級管制藥品 — 四氫西洋（四氫二氮平）（Tetrazepam）

項次: 61

名稱:

1. 中文: 四氫西洋（四氫二氮平）
2. 英文: Tetrazepam
3. CAS 編號: 10379-14-3

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 50 mg

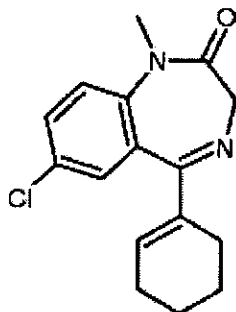
化學性狀:

1. 外觀及性狀: 黃褐色結晶。[522]
2. 結構式:

7-Chloro-5-(cyclohex-1-enyl)-1,3-dihydro-1-methyl-2H-1,4-benzodiazepin-2-one

3. 分子式: $C_{16}H_{17}ClN_2O$
4. 分子量: 288.8
5. 熔點: $144^{\circ}C$

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為中效型苯二氮平類中樞神經抑制藥，可引起中樞神經系統不同部位的抑制，隨著用量的加大，臨床表現可自輕度的鎮靜到催眠甚至昏迷。本類藥的作用部位與機制尚未完全闡明，認為可以加強或異化 γ -氨基丁酸 (GABA) 的抑制性神經遞質的作用，GABA 在苯二氮平受體相互作用下，主要在中樞神經各部位起突觸前和突觸後的抑制作用。本類藥為苯二氮平受體的激動劑，苯二氮平受體為功能性超分子(supramolecular)功能單位，又稱為苯二氮平-GABA 受體-親氫離子複合物的組成部分。受體複合物位於神經細胞膜，調節細胞的放電，主要起氫通道的閾值功能。GABA 受體啟動導致氫通道開放，使氫離子通過神經細胞膜流動，引起突觸後神經元的超極化，抑制神經元的放電，這個抑制傳譯為降低神經元的興奮性，減少下一步去極化興奮性遞質。苯二氮平類增加氫通道開放的頻率，可能增強 GABA 與其受體的結合或易化 GABA 受體與氫離子通道的聯繫來實現。苯二氮平類還作用在 GABA 依賴性受體。①抗焦慮、鎮靜催眠作用。刺激上行性網狀啟動系統內的 GABA 受體，因 GABA 在中樞神經系統為抑制性遞質，其受體的刺激增強了在腦幹網狀結構受刺激後的皮質和邊緣性覺醒反應的抑制和阻斷。分子藥理學研究體示，減少或拮抗 GABA 的合成，本類藥的鎮靜催眠作用降低，如增加其濃度則能加強苯二氮平類藥的催眠作用。②遺

忘作用：在治療劑量時可以干擾記憶通道的建立，從而影響近事記憶。③

抗驚厥作用：部分地可能由於增強突觸前抑制，抑制皮質丘腦和邊緣系統的致癇灶引起的癲癇活動的擴散，但不能消除病灶的異常活動。④

骨骼肌鬆弛作用：主要抑制脊髓多突觸傳出通路，也可能抑制單突觸傳出通路。

由於起抑制性神經遞質或阻斷興奮性突觸傳遞而抑制單突觸和多突觸反射。苯二氮平類也可能直接抑制運動神經和肌肉功能。[523]

藥動學特性：

口服吸收較快，屬中半衰期苯二氮平類藥。本品血漿蛋白結合率約為 90%。

本品由肝臟酵素經去甲基化及羥基化代謝成 Nortetrazepam、

3-hydroxytetrazepam、3-hydroxynortetrazepam，再經由葡萄糖醛酸化後排

出。本品 T_{1/2} 為 13~45 小時，其代謝物 Nortetrazepam T_{1/2} 為 25~51 小時。

[524]

用途用法：

催眠 50 mg 睡前頓服。[522]

危害及副作用：

較少見的不良反應有；精神混亂，情緒抑鬱，頭痛、噁心、嘔吐、排尿障礙等。老年、體弱、幼兒、肝病和低蛋白血症患者，對本類藥的中樞性抑制較敏感。注射用藥時容易引起呼吸抑制、低血壓、肌無力、心動過緩或心跳停止；高齡衰老、危重、肺功能不全以及心血管功能不穩定等患者，

靜注過速或與中樞抑制藥合用時，發生率更高，情況也更嚴重。持續的精神紊亂，嗜睡深沉，震顫，持續的說話不清，站立不穩，心動過緩，呼吸短促或困難，嚴重的肌無力。[525]

檢驗方法：

(一)、紫外分光光度法：在酸性溶液中於波長 239、284、345 nm 附近呈較大吸收。在鹼性溶液中於波長 305 nm 附近呈較大吸收

(二)、氣相層析法：

(三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1678、1602、825、1132、1305、800 cm^{-1} 的位置。

(四)、質譜分析：分裂於 m/z 253、288、287、225、259、254、41。

(五)、呈色反應：甲醛-硫酸成橘色。[526]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Amobarbital、Aprobarbital、Butobarbital、Butalbital、Codeine、Ethchlorvynol、Fentanyl、Hydrocodone、Hydromorphone、Levorphanol、Mephobarbital、Meprobamate、Morphine、Oxycodone、Oxymorphone、Pentobarbital、Phenobarbital、Secobarbital、

Thiopental。本品與酒精併服時：增加催眠、鎮靜效果，且作用快速。[527]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀):

突然停藥後要注意可能發生撤藥症狀。停藥後 2—3 天出現，半衰期長者則在停藥後 10—20 天發生。戒斷症狀：較多見的為睡眠困難，異常的激惹狀態和神經質；較少見或罕見的有腹部或胃痙攣、精神錯亂、驚厥、肌肉痙攣、噁心或嘔吐、顫抖、異常的多汗。嚴重的戒斷症狀比較多見於長期服用過量的患者。也有曾在連續服用，血藥濃度一直保持在安全有效範圍內，幾個月後突然停藥而發生。失眠反跳現象、神經質、激惹，多數病人為長時期單次夜間服藥，戒斷後發生。半衰期短的停藥後發生快而嚴重。[528]

成癮治療之方法與成效評估:

催吐：吐根使用

活性炭吸收：使用最低 240 毫升的水百分之三十克活性碳。

洗胃

監測病人：監測生命體徵

減少呼吸功能：成人 Flumazenil- 0.2-3 mg。Flumazenil 拮抗中樞神經系統的苯二氮類藥物作用，逆轉的苯二氮類的鎮靜作用。

血壓過低;0.9% NaCl 10-20ml/kg 靜脈注射 dopamine、norepinephrine。[529]

第四級管制藥品 — 乙烯比妥（乙烯丁巴比妥）(Vinylbital)

項次: 62

名稱:

1. 中文: 乙烯比妥（乙烯丁巴比妥）
2. 英文: Vinylbital
3. CAS 編號: 2430-49-1

製劑:

1. 劑型: 錠劑

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

性質: 白色結晶性粉末

2. 結構式: 英文

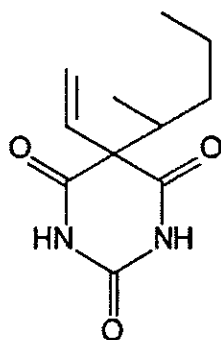
5-ethenyl-5-pentan-2-yl-1,3-diazinane-2,4,6-trione

3. 分子式: $C_{11}H_{16}N_2O_3$

4. 分子量: 224.3

5. 熔點: $90^{\circ}C$

6. 結構圖:



藥理性質：

本品為巴比妥類催眠藥、抗驚厥藥。中等作用時間（3~6 小時），對中樞的抑制作用隨著劑量加大，表現為鎮靜、催眠、抗驚厥及抗癲癇。大劑量對心血管系統、呼吸系統有明顯的抑制。過量可麻痹延髓呼吸中樞致死。體外電生理實驗本類藥物使神經細胞的氯離子通道開放，細胞過極化，擬似 γ -氨基丁酸(GABA)的作用。治療濃度的乙烯比妥可降低谷氨酸的興奮作用、加強 γ -氨基丁酸的抑制作用，抑制中樞神經系統單突觸和多突觸傳遞，抑制癲癇灶的高頻放電及其向周圍擴散。可減少胃液分泌，降低胃張力。可產生依賴性，包括精神依賴和身體依賴。[530]

藥動學特性：

口服後在消化道吸收迅速，15~30 分鐘生效，約維持 3~6 小時。吸收後分佈於體內各組織及體液中，因本品脂溶性高，易通過血腦屏障，進入腦組織，起效比較快。T_{1/2} 約為 18~34 小時。本品在肝臟代謝成

3'-hydroxyvinylbital 以其他相關衍生物

5-(3-hydroxy-1-methylbutyl)-barbituric acid，少於 5%以原形、經由尿液排出。[531]

用途用法：

鎮靜：口服 100~200 mg

危害及副作用：

- 1、可能引起微妙的情感變化，出現認知和記憶的缺損。
- 2、長期用藥，偶見葉酸缺乏和低鈣血症。
- 3、罕見巨幼紅細胞性貧血和骨軟化。
- 4、大劑量時可產生眼球震顫、共濟失調和嚴重的呼吸抑制。
- 5、用本品的患者中約 1~3% 的人出現皮膚反應，多見者為各種皮疹以及哮喘，嚴重者可出現剝脫性皮炎和多形紅斑（或 Stevens—Johnson 綜合症），中毒性表皮壞死極為罕見。
- 6、肝炎和肝功能紊亂。
- 7、長時間使用可發生藥物依賴，停藥後易發生停藥綜合症。[532]

檢驗方法：

- (一)、紫外分光光度法：在鹼性水溶液中，於波長 247nm 附近呈最大吸收。
- (二)、氣相層析法：
- (三)、紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1692、1730、1750、1318、1220、1630 cm^{-1} 的位置。[531]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

中樞神經抑制及呼吸抑制：Adinazolam、Alfentanil、Alprazolam、
Amobarbital、Aprobarbital、Bromazepam、Brotizolam、Butabarbital、Butalbital、
Calamus、Cannabis、Clobazam、Clonazepam、Clorazepate、Codeine、
Diazepam、Estazolam、Ethchlorvynol、Fentanyl、Flunitrazepam、Flurazepam、
Halazepam、Hydrocodone、Hydromorphone、Ketazolam、Levorphanol、
Lorazepam、Lormetazepam、Medazepam、Meperidine、Mephesisin、
Mephobarbital、Meprobamate、Metaxalone、Midazolam、Morphine、
Nitrazepam、Nordazepam、Oxazepam、Oxycodone、Oxymorphone、
Pentobarbital、Phenobarbital、Prazepam、Secobarbital、Temazepam、
Thiopental、Triazolam。本品與酒精併服時：過度中樞神經抑制作用，且作
用快速。[533]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

與短期治療具耐受性，治療效果鎮靜催眠，發生更迅速。不幸的是，由於
耐受性增加治療指數降低。可能引起昏迷、嚴重的呼吸和心血管抑制、低
血壓和休克繼而引發腎功能衰竭、死亡。深度呼吸抑制是急性中毒的直接
死亡原因。

成癮治療之方法與成效評估：

會導致戒斷症狀的中樞神經系統的刺激，如焦慮或煩躁不安和麻煩，睡覺，

這可能會導致驚厥和幻覺。這些症狀可能在使用後 5 至 15 天。

(一) 洗胃

(二) 促進毒物排泄

1、快速輸液 2、利尿脫水 3、導瀉 4、血液透析 5、鹼化尿液

(三) 中樞興奮劑的應用

僅適用於重度中毒者、呼吸高度抑制者及昏迷患者。[534]

第四級管制藥品 — 唑匹可隆 (Zopiclone)

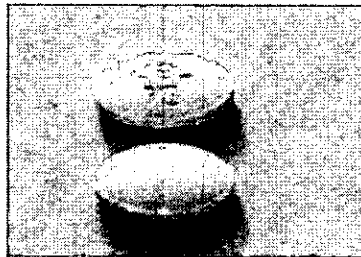
項次: 63

名稱:

1. 中文: 唑匹可隆
2. 英文: Zopiclone
3. CAS 編號: 43200-80-2

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 7.5 mg
3. 照片:



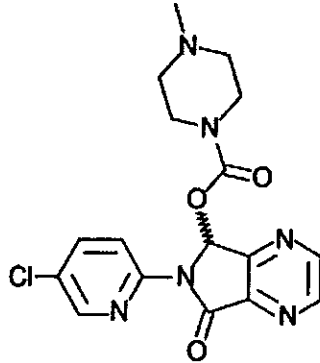
化學性狀:

1. 外觀及性狀: 白色或微黃色粉末，不溶於水和酒精，微量溶於丙酮，可溶於二氯甲烷，亦可溶於稀無機酸。[535]
2. 結構式: [8-(5-chloropyridin-2-yl)- 7-oxo-2,5,8-triazabicyclo [4.3.0]nona-1,3,5-trien-9-yl] 4- methylpiperazine-1-carboxylate
3. 分子式: $C_{17}H_{17}ClN_6O_3$

4. 分子量: 388.808

5. 熔點: 178°C

6. 結構圖:



藥理性質：新的非 benzodiazepine 安眠劑，本品是 cyclopyrrolone 衍生物，用於改善克服 benzodiazepine 類藥物會產生的副作用，特別在依賴性和藥物殘留造成白天的鎮靜作用。本品雖然與 benzodiazepine 無關，但是其藥理作用和 benzodiazepine 相似。雖然在動物實驗本品會出現焦慮、抗痙攣、肌肉鬆弛等症狀，但是由於其鎮定作用，本品還是可以用來當作安眠藥。Zopiclone 的藥理活性與它的 benzodiazepine 受器複合體(receptor complex)結合位置和 GABA 功能有關。[536]

藥動學特性：

由腸胃道快速吸收；血漿濃度在投藥後 1~1.5 小時達到高峰。口服生體可用率接近 80%，首渡效應不高。本品吸收特性並不受性別限制影響，在老年人與小孩身上也無顯著差異。本品的蛋白質結合率 45%，唾液中所含的本品濃度 50 mcg/L 或更大，高於血中濃度，也造成服用本品之後會覺得苦苦的原因，本品會快速分散到身體組織中，包含腦部。本品大量在肝臟中代謝的方式是去碳酸基化、側鏈氧化、去甲基

化，代謝物為具有活性的 Zopiclone-N-oxide(佔投與劑量的 11~15%)、N-desmethyl zopiclone (佔投與劑量的 15~20%)，約有 50%投與劑量藉由去碳酸基化轉變成無活性的代謝物。腎臟排除，腎清除率每小時 14 公升；zopiclone、zopiclone-N-oxide、N-desmethyl zopiclone、和其他無活性代謝物會被排除到尿液中，原型藥佔的比例只有 4~5%。大部份藥物會在 24~48 小時之內排除；去碳酸基化的本品無活性代謝物部分會以二氧化碳的形式，藉由肺臟排除。半衰期 3.5~6.5 小時，老年人或是患有肝硬化的病人，半衰期會稍微延長到 8 小時。

[537][538][539]

用途用法：

適應症為失眠症作用：具安眠、鎮靜、抗焦慮、抗痙攣、肌肉鬆弛作用。成人臨睡前口服 7.5 毫克；老年人在用藥初期服量為臨睡前口服 3.75 毫克，其後可按需要增加至 7.5 毫克；兒童不宜服用。[540]

危害及副作用：

口中有苦味、暈眩、頭痛、白天思睡、噁心、口乾、皮疹、健忘、興奮、過敏等。[541]

檢驗方法：

紫外分光光度法：酸性水溶液下(0.2M H₂SO₄)於波長 304、216 nm 附近有較大吸收；0.1M HCl 於波長 306、214 nm 附近有較大吸收；鹼性水溶液(0.1M NaOH) 於波長 237、277 nm 附近有較大吸收

氣相層析法

紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1715、1372、1463、1087 cm^{-1} 的位置。

質譜分析：分裂於 m/z 143、245、112、99、56、139、217、247。[542]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

與短期治療具耐受性，治療效果鎮靜催眠，發生更迅速。不幸的是，由於耐受性增加治療指數降低。可能引起昏迷、嚴重的呼吸和心血管抑制、低血壓和休克繼而引發腎功能衰竭、死亡。深度呼吸抑制是急性中毒的直接死亡原因。[543]

成癮治療之方法與成效評估：

會導致戒斷症狀的中樞神經系統的刺激，如焦慮或煩躁不安和麻煩，睡覺，這可能會導致驚厥和幻覺。這些症狀可能在使用後 5 至 15 天。

(一) 洗胃

(二) 促進毒物排泄

1、快速輸液 2、利尿脫水 3、導瀉 4、血液透析 5、鹼化尿液

(三) 中樞興奮劑的應用

僅適用於重度中毒者、呼吸高度抑制者及昏迷患者。[544]

第四級管制藥品 — 美服培酮 (Mifepristone)

項次: 64

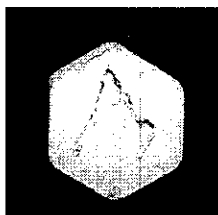
名稱:

1. 中文: 美服培酮
2. 英文: Mifepristone
3. 俗稱: RU-486
4. CAS 編號: 84371-65-3

製劑:

1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 200mg

3. 照片:



化學性狀:

1. 結構式: 11β -[p-(Dimethylamino)phenyl]-
 17β -hydroxy-17-(1-propynyl)estra-4,9-dien-3-one [545]
2. 分子式: $C_{29}H_{35}NO_2$
3. 分子量: 429.60
4. 熔點: $150^{\circ}C$

receptor , ER)與黃體激素接受體(progesterone receptor , PR)的質會減少。這可能與使用本品來終止早期妊娠所造成的延長性子宮出血 (prolonged uterine bleeding)有關。Qiu X.等人認為在使用 mifepristone 來終止早期妊娠之後，所造成的子宮異常出血與蛻膜剝落之阻礙和子宮內膜再生之損害有關。而蛻膜剝落(decidua shedding)及不完全性流產，則可能是基底蛻膜(basal decidua)的網狀纖維(reticular fibers)之不完全溶解(incomplete dissolution)所誘發的。在瑞典 Bygdeman M.等人的研究，發現單獨使用 mifepristone 並無法有效地終止早期妊娠；但是，在排卵後立即使用，則可抑制子宮內膜發育，因而預防受精卵的著床。因為子宮在早期妊娠是不活化的(inactive)，用抗黃體激素製劑治療之後，可以增加子宮收縮力(uterine contractility)及明顯增加子宮肌層對前列腺素的敏感性(myometrial sensitivity to prostaglandin)。抗黃體激素製劑除了可以活化子宮之外，還可以引起子宮頸的成熟(ripening)。而在懷孕前 8 週，RU486 合併陰道使用 gemeprost 或肌肉注射 Nalador，可以提供安全且有效的藥物人工流產。[546]

藥動學特性：

Mifepristone 屬於快速吸收，其口服生體可用率約為 70%，在口服單一劑量後的 1 到 2 個小時血中濃度達到高峰。蛋白質合率 98%，Mifepristone 主要是與白蛋白、血漿蛋白、 α_1 -醣蛋白酸 (α_1 -acid

glycoprotein , AAG) 結合。與 α_1 -糖蛋白質結合是可飽和的，此藥物於血漿中濃度與清除率呈現非線性動力學；與 AAG 結合後的 mifepristone，所顯現的是代謝清除率(metabolic clearance)0.55 L / kg / day 及容積分佈率(volume of distribution) 1.5 L/kg。在分佈的階段後，mifepristone 的排除在一開始是緩慢的(50 % 在 12 到 72 小時之間排除)，然後開始變快，血中排除半衰期為長半衰期(約為 25 ~ 30 小時)。Mifepristone 主要是經由 N-去甲基作用(N-demethylation)及 17-propynyl chain 的末端氫氧化(terminal hydroxylation)來代謝。體外實驗顯示，起始的代謝步驟主要由 Cytochrome 450 (CYP) 酵素 CYP 3A4 來負責。人類 3 個主要可辨識的代謝物為：(1) RU42 633，普遍存在血漿內，是 N-單去甲基代謝物。(2) RU42 848，是 11 位的 4-dimethylaminophenyl 失去 2 個甲基之後的代謝物。(3) RU42 698，是 17-propynyl chain 上去氫氧化後的代謝物。在一次服用劑量 600 mg 的氬合成物之 11 天後，83 % 的藥物以糞便形式排除，9 % 的藥物以尿液形式排除。在第 11 天時，血清中的 mifepristone 的含量就檢測不出來了。[547][548][549][550][551]

用途用法：

墮胎藥；依優生保健法嚴格限定僅婦產科醫師對懷孕小於 7 週子宮內的治療性人工流產使用，每次口服三顆、共 600 毫克為主。用藥後 36

- 48 小時後回診，再口服前列腺素藥物 misoprostol 400 微毫克以誘發子宮收縮。三小時內未見出血，再額外服用 200 微毫克的前列腺素加強子宮收縮。服用前列腺素及服用後 3 個小時內，病人應留在醫療院所觀察。衛生署強調，使用 Mifepristone 類墮胎藥物施行人工流產，必須符合「優生保健法」相關規定，未婚未成年人或禁治產人必須經法定代理人同意，才可使用。這類藥物不可使用於尚未確認的懷孕，或者是對懷孕日期還有所質疑、及子宮外孕的案例。診治醫師在用藥前，應對所有案例執行骨盆腔檢查、超音波掃描等，確定子宮內妊娠在 49 天之內，才可使用。長期使用低劑量 Mifepristone (2mg / kg / week)，可使子宮內膜萎縮，因此臨床醫師也開始使用於治療子宮內膜異位症及子宮腺肌症所引起的非功能性子宮出血之臨床試驗上。此外，子宮肌瘤的增生因受黃體素影響，在若干臨床試驗上，Mifepristone 也被用作控制子宮肌瘤增大的藥物。[552]

危害及副作用：

可能會發生嚴重噁心及嘔吐的副作用，通常在 RU486 及 cytotec 服用的同時，會合併給予 primperan 或 novamine 來預防或治療。可能會發生腹痛或子宮痛，故會合併使用止痛藥，一般會使用 panadol 或其它非 NSAIDs 類止痛藥。可能會發生腹瀉，則使用止瀉藥或減緩腸道蠕動藥物。若發生不完全性流產(incomplete abortion)，則用子宮內膜搔

刮術來作治療。有下列禁忌症的患者不能使用 RU486：(1)慢性腎上腺衰竭者、肝臟衰竭或營養不良者。(2)已知對 RU486(Mifepristone)或其他內含物會產生過敏者。(3)長期併用類固醇治療者。(4)罹患出血性疾病或併用抗凝血劑治療者。(5)尚未經由超音波掃描或血液尿液等生化檢測確認懷孕者。(6)懷孕日數超過七週者。(7)疑似子宮外孕者。(8)因前列腺素藥物而產生的禁忌者(如已知對前列腺素過敏)、現有或曾有心血管疾病的人(如心絞痛、雷諾氏症候群、心律不整、心臟衰竭、嚴重高血壓)。(9)遺傳性咯紫質沉著症患者(患者會出現皮膚不適等症狀)。(10)年紀超過 35 歲及一天抽煙超過 10 支者。[553]

檢驗方法：

1. 紫外分光光度法：酸性溶液下(0.1M HCl 在 95%乙醇中)於波長 302nm 附近有較大吸收。鹼性溶液下(0.1M NaOH 在 95%乙醇中)於波長 256、305 nm 附近有較大吸收。
2. 氣相層析法。
3. 紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1657、1517、1592、1378、1348、1038 cm^{-1} 的位置。
4. 質譜分析：分裂於 m/z 121、429、280、430、389、134、122、281。[554]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

誘導 CYP3A4 加速本品代謝，降低藥效：Methylphenobarbital。[555]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

頭暈、昏厥、視力模糊、胃擾亂、疲倦、虛弱、氣促、心跳快速。[556]

成癮治療方法：

RU486 為國內第一個不具成癮性，卻列入管制藥品管理的新藥。

第四級管制藥品 — 佐沛眠 (Zolpidem)

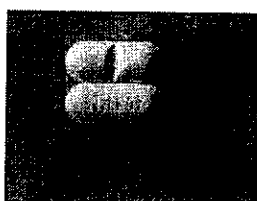
項次: 65

名稱:

1. 中文: 佐沛眠
2. 英文: Zolpidem
3. CAS 編號: 82626-48-0

製劑:

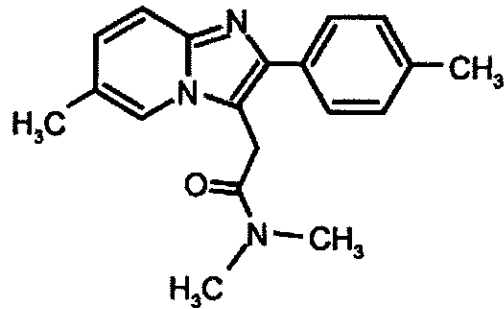
1. 劑型: 錠劑
2. 劑量: 10 公絲
3. 照片:



化學性狀:

1. 結構式: N,N,6-trimethyl-2-(4-methylphenyl)-imidazo
(1,2-a)pyridine-3-acetamide [557]
2. 分子式: $C_{19}H_{21}N_3O$
3. 分子量: 307.395
4. 熔點: $196^{\circ}C$

5. 結構圖：



藥理性質：

在 1980 年代末發展出主要作用於苯環接受器第一型的非苯環類安眠藥，zolpidem (stilnox[®])，具有藥效快，促睡效果佳，藥效短，無白天殘留效果，白天行動能力和記憶的損害和影響很小，無停藥後失眠回彈現象，無耐受性且依賴性較苯環鎮靜藥成癮性小。zolpidem 並不屬於 benzodiazepines(苯重氮基鹽，BZD)，是屬於 imidazopyridine 的衍生物，與 BZD，具有相似的 GABA 調節功能，適用於短期治療失眠症。zolpidem 結構上與傳統的安眠藥不同，它與位於小腦與大腦皮層的 benzodiazepines omega 1 接受器結合，這些接受器不存在於脊髓與周邊組織。Omega 1 接受器是 BZD 接受器別稱，BZD 接受器和身體的安眠鎮定功能有關。當 Zolpidem 和 Omega 1 接受器結合時，會增加 GABA(Gama-amino butyric acid)神經傳導物質 gamma-胺基丁酸)對 GABA binding site 的親和力。zolpidem 並沒有明顯的肌肉鬆弛功能、抗癲癇活性、或是抗焦慮作用，它僅是一個極強的鎮靜劑。由於對 BZD1 接受器有較高的選擇性，能快速的誘導入睡，會增加深度睡眠

的時間而不會影響快速動眼時期，可以避免改變正常睡眠型態。Zolpidem 與 benzodiazepines 安眠藥、鎮靜抗憂鬱劑(trazodone)、OTC 藥物(doxylamine)的比較試驗，顯示對失眠患者的安眠起始作用，zolpidem 的療效與之相當或甚至比較優異。而且與 benzodiazepines 比較，zolpidem 對失眠患者或健康人的睡眠結構(特別是 REM 睡眠)以及認知功能影響很低，zolpidem 能保留或有傾向增加能夠恢復體力之第三、四階段睡眠。正常女性於夜晚服用 zolpidem 不會改變日節律的內分泌標的物，不會影響生長激素的分泌，所以能增進睡眠型態突然轉變之適應性(輪班、飛越時差)。[558]

藥動學特性：

Zolpidem 口服後，在胃腸道內會被迅速吸收，催眠作用約在半小時內產生，二到三小時內，就會達到藥物濃度巔峰 Zolpidem tartrate 由於首渡效應的關係，生體可用率 70%，要快速達到藥效不能與食物並用，與食物並服會降低吸收。蛋白質結合率 92.5%，分布體積(Volume of Distribution)0.54 L/kg。本品大部分在肝臟代謝，沒有活性代謝物。腎臟清除率小於 1%，全身體清除率 (Total Body Clearance) 0.26L/h/kg，有 79%~96%的投與劑量出現在膽汁、尿液、和糞便中。半衰期 2.5~2.8 小時，在老年人身上半衰期會增加 16%~32%。

[559][560][561][562][563][564]

用途用法：

誘導睡眠、安眠效果 zolpidem 每一錠為 10mg，65 歲以下成人，睡前一顆；65 歲以上成人，睡前半顆。[565]

危害及副作用：

Zolpidem 的副作用發生少，主要是出現在中樞神經與胃腸道，最常見的副作用是頭痛、頭暈、眼花、運動失調、白天想睡、肌肉無力、胃腸障礙和健忘等。隨著年齡及劑量的增加，副作用的發生機率愈高。Zolpidem 禁用於阻塞性睡眠中止(obstructive sleep apnea)、呼吸抑制或衰竭、嚴重肝病與重症肌無力。Zolpidem 是經由肝臟 CYP3A4 的酵素代謝，與抗凝血劑(warfarin)、抑制胃酸分泌藥物 cimetidine、ranitidine 使用、抗精神病藥物併用，沒有明顯的交互作用。Zolpidem 與其它的中樞神經抑制劑一起使用，例如酒精，有加強的作用。[566]

檢驗方法：

紫外分光光度法：酸性水溶液下於波長 207 nm 附近有較大吸收。

氣相層析法

紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1637、1402、1511、1136 cm^{-1} 的位置。

質譜分析：分裂於 m/z 235、236、307、219、92、65、43、220。[567]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

昏睡、昏迷（在一段時間內意識喪失）、呼吸或心跳放慢。[568]

第四級管制藥品 — 二氫可待因內服液（含糖漿劑）含量每 100 毫升未滿 1.0 公克之醫師處方用藥 **Physician prescribes Dihydrocodeine oral liqu- id [including syrup] with dihydrocodeine content less than 1 .0 gram per 100 milliliters**

項次: 66

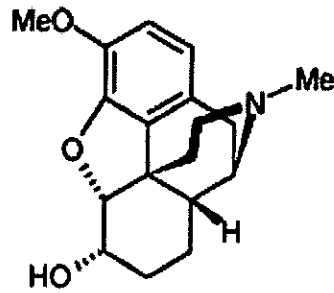
名稱：

1. 中文：二氫可待因內服液（含糖漿劑）含量每 100 毫升未滿 1.0 公克之醫師處方用藥
2. 英文：Physician prescribes Dihydrocodeine oral liqu- id [including syrup] with dihydrocodeine content less than 1 .0 gram per 100 milliliters
3. CAS 編號：125-28-0

化學性狀：

1. 外觀及性狀：白至黃白色結晶粉末。可溶於 1:3 的水中；微溶於乙醇中。pH 值：本品溶液(1:10)之 pH 約為 3-5。[131]
2. 結構式：(5 α ,6 α)
-4,5-epoxy-3-methoxy-17-methylmorphinan-6-ol
3. 分子式：C₁₈H₂₃NO₃
4. 分子量：301.39
5. 熔點：112-113°C

6. 結構圖：



藥理性質：

本品具有類似嗎啡的結構，其鎮痛效果介於嗎啡及可待因之間。本品為中樞作用的止咳劑。[132]

藥動學特性：

本品吸收快速，會有首渡代謝現象。本品也會經由去甲基化作用產生 dihydromorphine。本品有 35% 經腎臟排除，半衰期為 3.4-4.5 小時。[133]

用途用法：

止咳：成人每次使用 10-30 毫克，一天三次。12 歲以上亦同。6-12 歲兒童每次使用 5-10 毫克，一天用一到三次。2-5 歲幼兒每次使用 2.5-5 毫克，一天用一到三次。[134]

危害及副作用：

- 4、本品可能造成噁心、腹瀉、嘔吐、便秘、腹痛或消化不良等現象。
- 5、曾有報導指出使用本品產生蕁麻疹及過敏反應。
- 6、於神經系統方面可能有頭昏、想睡、頭痛及混亂情形。[135]

檢驗方法：

一、呈色分析：1. Mandelin's Test—黃色

2. Nessler's Reagent—黑色

二、質譜：分裂於 m/z 301、44、42、59、164、70、302、242。

三、紫外分光光度法：本品溶於酸性水溶液中於 240、274 及 306nm 有

吸收。四、遠紅外光光譜：以 KBr 錠法檢測本品，主峰出現在 1608、1575、1537、1136、769 及 1100cm^{-1} 處。

五、氣相層析法。[136]

管制狀況：

本國：第三級管制藥品

多重濫用藥物併用：

Buprenorphine：產生戒斷症狀。本品與酒精併用會產生加成或是協同之中樞神經抑制作用，可能造成病患之肌肉動作不協調。[137]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

中毒劑量之可待因會造成失去意識、瞳孔成針狀、呼吸緩慢、發紺等等。最危險的作用是呼吸抑制，於口服後 2-4 小時內可能引起呼吸衰竭。本品也可能引發痙攣。可能可以觀察到病患有幻覺、發抖、無法控制肌肉動作、精神上的壓抑及皮膚疹等情形。戒斷症狀包括打呵欠、流淚、嚴重腸胃道不適、胃排空減慢、發燒或冷顫、流汗、瞳孔放大、肌痛、失眠、增加呼吸速率等。診斷：昏迷、針狀瞳孔及呼吸抑制為鴉片類藥物中毒時最典型的症狀，可待因中毒時也常見有蕁麻疹產生。病患的尿液及血液可作生化及毒理分析。[137]

成癮治療之方法與成效評估：

於急性、嚴重中毒之病患，需暢通其呼吸道，提供人工通氣、氧氣及監視血液動力學狀態。

具有意識之病患，考慮給予洗胃。

病患於服用後一至二小時內可投予活性碳。

建議的解毒劑為靜脈注射投予 0.4 至 2.0 毫克 naloxone，需要時每二至三分鐘反覆給藥直到恢復。

休克時經靜脈給予液體、加壓藥物及其他支持治療且需維持體溫。

[138]

第四級管制藥品 — 莫待芬寧 (Modafinil)

項次: 67

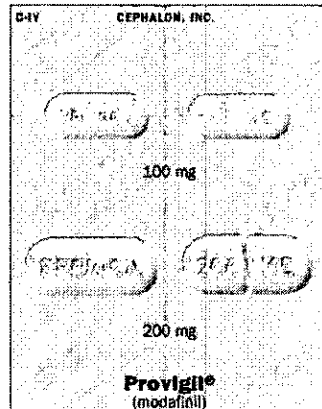
名稱:

1. 中文：莫待芬寧
2. 英文：Modafinil
3. CAS 編號：68693-11-8

製劑:

1. 劑型：錠劑
2. 劑量：100 mg、200 mg

3. 照片:

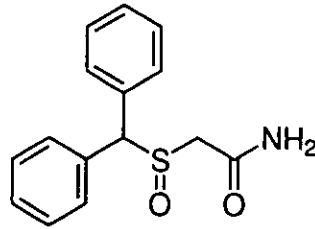


化學性狀:

1. 外觀及性狀：白色結晶粉末，不溶於水和環己烷，微溶於甲醇和丙酮。[569]
2. 結構式：2-benzhydrylsulfinylethanamide
3. 分子式：C₁₅H₁₅NO₂S
4. 分子量：273.351

5. 熔點：164~166°C

6. 結構圖：



藥理性質：

Modafinil 用來治療嗜睡症知名覺醒促進劑；與安非他命最大的不同是，modafinil 不產生耐受性。組織胺為控制睡眠和覺醒狀態的重要神經傳遞物，且有許多證據顯示，組織胺激性系統和 orexinergic system 之間的關係密切，因為 orexin 可活化位於下丘腦中 tuberomammillary nucleus 的組織胺激性神經元，促使組織胺釋出而致覺醒。目前的研究報告指出，modafinil 可能是直接活化含有 orexin 的神經元，以達到促進覺醒的作用。[570]

藥動學特性：

口服錠劑迅速吸收，但若病患者有肝臟方面的疾病，口服吸收的速度會降低。蛋白質結合率 60%，擴散體積 0.9 L/kg。大約 90% 本品在肝臟中代謝。代謝過程，包括水解脫氨，硫氧化，芳環羥基化，和葡糖苷酸共軛，低於 10% 是原型藥。代謝物無活性的 Modafinil acid、Modafinil sulfone、2-(Diphenylmethylsulfonyl)acetic、4-Hydroxy modafinil。腎臟清除率 80%，約 10% 以原型藥的方式排除到尿液中。大部份在尿中發

現的是莫達非尼酸（投與劑量的 40%至 60%）。約有 1%藥物是由糞便排除。半衰期 7.5 到 15 小時，若病患有肝臟方面的疾病，藥物的半衰期增加到兩倍；給 10 例重症腎功能衰竭（肌酐清除率 16.6 毫升/分鐘）的病患，單劑量口服 200 毫克，半衰期為 22 小時，莫達非尼是一種消旋化合物，L 型異構體半衰期約為 D-異構體的三倍。[571][572]573]

用途用法：

改善因猝睡症引起的日間過度睡眠症患者的失眠。成人：每日 200-400 毫克，分二次在早晨及晚上給藥，或在早上一次給予。老年人：初始時每日 100 毫克。[574]

危害及副作用：

出疹的病徵、水泡、皮膚脫皮、口腔潰瘍、蕁麻疹、癢、聲音沙啞、呼吸或吞嚥困難，臉部、喉嚨、舌頭、嘴唇、眼睛、手、腳、踝關節、或下肢腫脹，胸痛、心跳快速，或心律不整、心情異常興奮、產生幻覺（看到的東西，或聽覺的聲音，是不存在的）、焦慮、抑鬱症、有自殺傾向、史蒂文生氏強生症候群（Stevens Johnson Syndrome，SJS）、毒性表皮溶解症（Toxic Epidermal Necrolysis，TEN）、伴隨嗜伊紅性白血球增高全身症狀之藥物疹（Drug Rash with Eosinophil and Systemic Symptoms，DRESS）[575]

檢驗方法：

氣相層析法 [576]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

過量的症狀可能包括：入睡困難，或處在睡眠狀態、興奮、躁動，迷亂、幻覺（看到的東西，或聽覺的聲音，是不存在的）、緊張、不能控制的搖頭或是搖晃身體的一部分、心跳或快或慢、胸痛、噁心、腹瀉。

[577]

第四級管制藥品 — 美妥芬諾 (Butorphanol)

項次:68

名稱：

1. 中文：美妥芬諾
2. 英文：Butorphanol
3. CAS 編號：42408-82-2

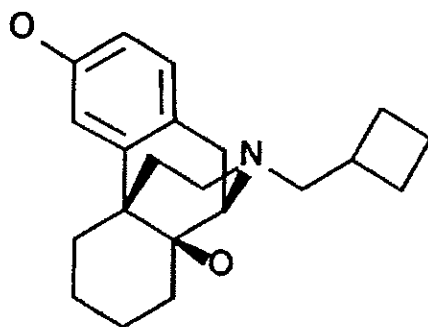
製劑：

1. 劑型：注射劑
2. 劑量：1mg/mL

化學性狀：

1. 外觀及性狀：固體。Butorphanol tartrate 白色結晶粉末，熔點 217~219°C，可溶於水，微溶於甲醇，不溶於乙醇、氯仿、乙醚，可溶於稀酸。[578]
2. 結構式：17-cyclobutylmethyl-morphinan-3,14-diol
3. 分子式：C₂₁H₂₉NO₂
4. 分子量：327.473
5. 熔點：215~217°C

6. 結構圖：



藥理性質：

Butorphanol 為一種合成的鴉片類麻醉止痛劑。本品屬於鴉片生物鹼之 μ 型感受器拮抗劑，故較不易出現呼吸抑制的副作用。亦為 κ 型鴉片生物鹼感受器之協同劑。它與中樞神經系統中的這些感受器產生交互作用，具有低內因性作用—協同拮抗混合的效果（agonist-antagonist narcotic analgesic），調控包括止痛在內的藥理作用。止痛之外，對於中樞神經系統的作用還有自發性呼吸及咳嗽的抑制、刺激嘔吐中樞、瞳孔縮小、鎮靜作用。可能藉非中樞神經機制的影響，包括心血管阻力與容量的改變，支氣管緊張、胃腸道的分泌與運動，以及膀胱括約肌的活動。[579]

藥動學特性：

受到投予途徑影響，butorphanol 的止痛效果不同，口服 butorphanol tartrate 生體可用率約 17%，吸收後大部份會受肝臟首渡代謝。噴鼻給藥生體可用率約 70%，吸收劑量並不受過敏性鼻炎 rhinitis 或併用其他鼻血管收縮藥物影響（吸收時間延長並不影響吸收量）。藥物分佈方

面，藥品吸收後，蛋白結合率約 80-83%，與濃度高低無關，分佈體積約 10-13L/kg。此藥物能通過血腦及胎盤障蔽，與進入母乳中。主要在肝臟代謝，其代謝物 hydroxybutorphanol 與 norbutorphanol 在人體的藥理作用尚未被研究，而在動物實驗中顯示 butorphanol 的代謝物具有止痛效果。排除路徑是經由尿液及糞便排泄，其中 75%由腎臟排除，15%由糞便排除，11-14%由膽汁排除。其藥物代謝半生期約 4-7 小時。butorphanol 的藥物動力學在高齡者與青壯年患者有所不同，高齡女性使用噴鼻給藥其生體可用率（48%）低於高齡男性（75%）、青壯男性（68%）青壯女性（70%）。高齡者的半衰期也相對提高（6.6 小時，青壯年者為 4.7 小時）。[580]

用途用法：

Butorphanol 噴鼻給藥用於治療中度到重度的手術後疼痛及偏頭痛，每一噴可提供 1mg 劑量，一般建議初始劑量為 1mg，若是在 60-90 分鐘內沒有充分得到疼痛紓解可以追加 1mg。在第二次用藥之後視需要得以 3-4 小時為間隔反覆使用，每日最大劑量為 6 Sprays。對於重度疼痛的處理，初始劑量 2mg 得用於能夠維持躺臥的患者以防嗜睡或暈眩的發生。腎功能不良的患者，須調整使用劑量，一般 glomerular filtration rate (GFR)若介於 10~50 mL/分鐘，則使用一般劑量的 75%，每日最大劑量為 4 次，每次間隔 6 小時。若 GFR 小於 10 mL/

分鐘，則使用一般劑量的 50%，每日最大劑量為 3 次，每次間隔 8 小時。由於 butorphanol 大部份經由肝臟代謝，肝功能不佳的患者使用需特別留意，必要時須調低劑量。[579]

危害及副作用：

幾乎所有使用 butorphanol 的人都出現鴉片類止痛劑會發生的副作用。最多的不良反應有：嗜睡(43%)、暈眩(19%)、噁心嘔吐(13%)。噴鼻給藥的長期試驗則是以鼻充血(13%)失眠(11%)最多。[579]

檢驗方法：

1. 呈色分析：Liebermann's Test—黑色。Marquis Test—灰色。
2. 紫外分光光度法：本品溶於酸性水溶液中於 278nm 有吸收。
3. 氣相層析法
4. 紅外線光譜法：以 KBr 錠法檢測本品，主峰出現在 1269、1130、1233、1575、1249、1303 cm^{-1} 處。
5. 質譜分析：分裂於 m/z 272、273、41、327、145、76、42、29。[581]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：增加中樞神經系統的抑制：酒精、barbiturates、tranquilizers、antihistamine。butorphanol 與某些中樞神經系統的抑制

劑，共同使用時，可能會增加中樞神經系統的抑制效果。故當與這些藥物同時使用時，butorphanol 需降低至最低有效劑量，並且與鴉片類作用之藥物一同使用時，儘可能減少 butorphanol 投與的次數。[582]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

過高劑量產生包括焦慮，激動，tremulousness，腹瀉，發冷，出汗，失眠，精神錯亂，不協調，並有幻覺。臨床上 butorphanol 過量，是阿片類藥物的普遍問題。過量的後果，隨著 butorphanol 劑量的不同因人而異，阿片類藥物最嚴重的症狀是換氣不足，心血管功能不全，昏迷和死亡。butorphanol 過量可能與服用多種藥物有關。治療 butorphanol 過量，包括維持通風，注射點滴(peripheral perfusion)，維持正常體溫，及保護呼吸道。應連續監測病人精神狀態、反應和生命體徵。提供氧氣和呼吸器，並以脈搏血氧儀持續監測。靜脈門戶應予維持，以方便治療血管舒張造成的低血壓。[583]

成癮治療方法：

可以考慮使用阿片類藥物拮抗劑如納絡酮(naloxone)。由於時間 butorphanol 作用時間較納絡酮長，故納洛酮需要重複給藥。[584]

第四級管制藥品 — 氯苄雷司 Clobenzorex

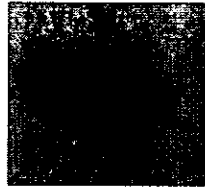
項次: 69

名稱:

1. 中文：氯苄雷司
2. 英文：Clobenzorex
3. CAS 編號：13364-32-4

製劑:

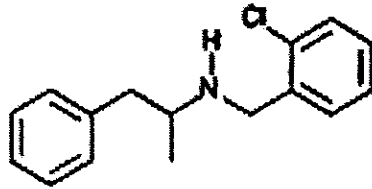
1. 劑型：膠囊(Asenlix®)
2. 劑量：30mg
3. 照片：



化學性狀:

1. 外觀及性狀：(Clobenzorex Hydrochloride)固體。可溶於酒精、水，微溶於甲醇、氯仿。小鼠的半致死量 LD_{50} ：103 mg/kg。
2. 結構式：
 $(+)-N-[(2\text{-Chlorophenyl})\text{methyl}]-\alpha\text{-methylphenethylamine}$
3. 分子式： $C_{16}H_{18}ClN$
4. 分子量：259.78
5. 熔點：182-183°C

6. 結構圖：



藥理性質：

Clobenzorex 是安非他命的類似物，常被濫用於減肥，長期使用會嚴重影響精神狀態，產生行為異常。

危害及副作用：

口乾、上腹部不適、出汗、興奮、失眠、心動過速、血壓升高、長期服用可產生精神和身體依賴。[585]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

長期高劑量治療突然中斷後，可能會導致抑鬱症和疲勞。通常在一個數週後出現藥物依賴現象，如果出現上述情形應當停止用藥。

成癮治療方法：長期使用可能導致嚴重的性皮炎，失眠，煩躁不安，多動，性格變化，思覺失調。一般可以停止藥物幾天或幾週後解決這些問題。

急性中毒時處理方式：

1. 不誘導嘔吐。
2. 使用活性炭。

3. 抽搐時 diazepam 靜脈注射（劑量：成人：從 5 到 10 毫克。兒童：0.2 至 0.5 毫克/公斤，重複每 5 分鐘視需要）或 lorazepam 靜脈注射（劑量：成人：4 日至 8 毫克；兒童：0.05 至 0.1 毫克/千克）。監測為低血壓，呼吸抑制，以及需要氣管插管。如果抽搐是無法控制或再次發生，考慮苯巴比妥。[585]

第四級管制藥品 — 特拉嗎竇 (Tramadol)

項次: 70

名稱:

1. 中文：特拉嗎竇
2. 英文：Tramadol
3. CAS 編號：27203-92-5

製劑:

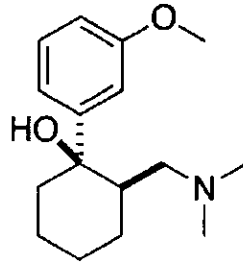
1. 劑型：錠劑
2. 劑量：50 毫克
3. 照片：



化學性狀:

1. 外觀及性狀：白色無嗅有苦味的結晶粉末，可溶於水和酒精中。[586]
2. 結構式： $(\pm)\text{cis-2-}[(\text{dimethylamino})\text{methyl}]\text{-1-(3-methoxyphenyl)}$
cyclohexanol hydrochloride
3. 分子式： $\text{C}_{16}\text{H}_{25}\text{NO}_2$
4. 分子量：263.4
5. 熔點：180~181°C

6. 結構圖：



藥理性質：

本品的化學結構與 morphine 相似，是一左右旋混合的合成異構物。作用在中樞及週邊的非成癮性止痛劑。具有 opioid 及 non-opioid 雙重作用機轉。其中一個異構物作用在 opioid receptor，阻斷疼痛訊息的接收。另一個異構物抑制 Serotonin 及 Noradrenaline 的再吸收，阻斷疼痛訊息的傳遞。因此，具有類似麻醉性止痛效果，但它不存在有呼吸抑制、便秘、心血管疾病等副作用，且耐受性比 morphine 好，止痛效果仍可被 Naloxone 及 Nalorphine 所拮抗。臨床上，可用在中度及嚴重疼痛的病人。它的主代謝產物 O-Desmethyltramadol 是一種非選擇性的作用劑(增效藥)。它在 μ -opioid receptor， δ -opioid receptor， χ -opioid receptor 中，對 μ -Receptor(μ 受體)具有較大的親和性。[587]

藥動學特性：

服吸收率為 90%，生體可用率約 65%；口服後 2 小時即達血中最高濃度。半衰期：6.3-7.4 h；蛋白質結合率：20%；血漿清除率：6mL/min/kg，女性比男性略高；Vd：2.7 Liter/kg 經肝臟代謝為多種代謝物，其中 O-Demethyl tramadol 為主要的活性代謝產物，比 Tramadol 對 μ -receptor 有更好、更具選擇性的親和力，故有更好止痛效果。90%

由 urine 排除，其中 30% unchanged form，<1% 由糞便排除。SR 劑型是將藥品嵌入 hydrophilic polymer matrix，液化後，藥品慢慢釋出可達 12 小時，polymer matrix 則排出體外。血清濃度在 100-300mg/ml 時，通常會達到良好的鎮痛效果。[588]

用途用法：

口服：tramadol hydrochloride 50~100 毫克，一天不超過 400 毫克。肌肉注射、靜脈注射：每四到六小時注射 50~100 毫克的劑量（手術後止痛的劑量一開始先注射 100 毫克，往後每 10~20 分鐘注射 50 毫克，第一小時的總劑量不可超過 250 毫克）。[589]

危害及副作用：

tramadol 常見的副作用有蕁麻疹、噁心、嘔吐、便秘、嗜睡、眩暈、頭痛等。長期使用後臨時停藥也會產生禁斷症狀如：焦慮、失眠、冒冷汗、僵直、顫抖、嘔吐、拉肚子、反彈性痛及幻覺等。不造成明顯的呼吸抑制，及便秘。仍有噁心、口乾、眩暈、疲倦，不能與 MAOI 合用。SR 劑型具有較低的副作用。[590]

檢驗方法：

1. 紫外分光光度法：本品溶於酸性水溶液中於 272nm 有吸收。
2. 氣相層析法
3. 紅外線光譜法：以 KBr 錠法檢測本品，主峰出現在 1284、

1601、1042、1238、1575、702 cm^{-1} 處。[591]

管制狀況：

本國：第四級管制藥品

多重濫用藥物併用：

在動物試驗中，本藥和巴比妥酸鹽類的藥物併用會使動物被麻醉的時間變長。若與安神藥（Tranquillizer）併用，則可以得到更好的鎮痛效果。若同時併用（或之前曾經用過）Clmetiaine，並不會使 Tramadol 的藥效造成值得一提的影響。若同時併用（或之前曾經用過）

Carbamazepine，會使 Tramadol 的鎮痛效果降低，藥效（鎮痛）持續時間也會縮短，因此正在使用 Carbamazepine 的病人若要用 Tramadol 來止痛，醫生必須特別注意劑量的斟酌。有些個案指出，同時使用 Tramadol 和精神抑制藥會造成病人的癲癇症發作，Tramadol 造成的若干副作用可能是因為併用其他藥物造成的，這些藥物包括會刺激腎上腺素系統的三環抗抑鬱藥和單胺氧化酉每的藥物如（Selegline），應避免同時使用 Tramadol 及單胺氧化酉每抑制劑。[587]

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

凡對 Tramadol 過敏的病人，以及有急性酒精中毒、安眠藥、鎮痛劑中毒、精神藥物中毒的病人，目前正在服用或是過去 14 天以內曾服用胃酸抑制藥物的病人，都必須禁用。毒癮患者亦不得使用本藥，雖

然 Tramadol 是一種有鴉片成份的鎮痛劑，但它並不能抑制嗎啡戒斷綜合症。Tramadol 產生中毒症狀的血中濃度為 1.0mg/L，致死 2.0mg/L。[592]

成癮治療方法：

於急性、嚴重中毒之病患，需建立暢通之呼吸道，提供人工通氣、氧氣及監視血液動力學狀態。具有意識之病患，考慮給予洗胃。病患於服用後一至二小時內可投予活性碳。建議的解毒劑為靜脈注射投予 0.4 毫克 naloxone，需要時每二至三分鐘反覆給藥直到恢復。休克時經靜脈給予液體、加壓藥物及其他支持治療需維持體溫。[593]

第四級管制原料藥品

第四級管制原料藥品 — 麻黃(Ephedrine)

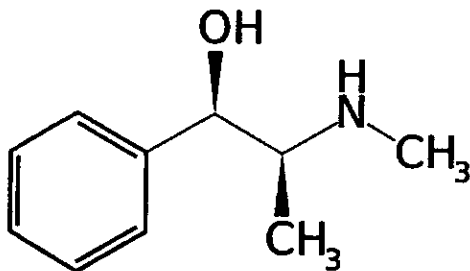
項次: 1

名稱:

1. 中文:麻黃
2. 英文:Ephedrine
3. CAS 編號: 299-4-23

化學性狀:

1. 外觀及性狀:無色的結晶或是白色的結晶粉末，在光照下會被分解。[594]
2. 結構式:(1*R*,2*S*)-2-(methylamino)-1-phenylpropan-1-ol
3. 分子式: $C_{10}H_{15}NO$
4. 分子量: 165.23
5. 熔點: 40°C
6. 結構圖:



藥理性質：

麻黃素為一種擬交感神經作用的生物鹼，作用在 α -腎上腺素和 β -腎上腺素受器上，使之活化；由於正腎上腺素被釋放出來，所以對腎上腺素受器會有直接和間接的效用。麻黃素會藉由血管收縮作用以及增加心輸出量來刺激中樞神經系統以及增加血壓。在肺中對 β -腎上腺素受器的刺激會導致支氣管的擴張作用；由於它會使膀胱壁擴約肌收縮以及膀胱壁舒張，所以會產生尿液滯留的作用。麻黃素會使收縮壓及舒張壓提高，且由於血管收縮作用及對心臟的刺激，所以會使脈搏增加，它也會提高心輸出量以及收縮的力量。[595]

藥動學特性：

口服後約 0.25-1 小時會產生支氣管擴張的作用，會持續 3-5 小時，口服生體可用率為 85%，經由肝臟代謝，產生的代謝物為苯甲酸、馬尿酸、norephedrine，此三種為非活性物，另外還有 p-hydroxyephedrine、p-hydroxynorephedrine；經由腎臟排出，以口服給藥途徑的麻黃素，約 77% 會以原形藥的形式存在於尿液中，而一般來說，尿液的酸鹼度會決定於存在於尿液中的麻黃素以原形藥形式存在的多寡。[596]

危害及副作用：

1. 對於心血管的副作用：心悸、高血壓、心跳過快。
2. 對於皮膚的影響：出疹。

3. 對於中樞神經系統的影響：緊張、興奮及廣泛的焦慮狀態。
4. 對於精神上的影響：出現妄想、幻覺、憂鬱的症狀。
5. 對於腎臟的影響：腎結石、尿液滯留。
6. 具有成癮作用。[597][[598]

檢驗方法：

1. 質譜分析：分裂於 m/z 58、146、56、105、77、42、106、40。
2. 紫外分光光度法：本品溶於酸性水溶液中對 251、257、263nm 有吸收。
3. 紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 994、699、754、1049、1242、670 cm^{-1} 的位置。
4. 氣相層析法。
5. 高效液相層析法。 [599]

管制狀況：

本國：第四級管制原料藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀):

本品使用過量時可能造成心跳過速、高血壓、焦慮、幻覺、嘔吐等現象。使用本品於戒斷時會產生困乏感、感覺消失、夢魘及輕微的顫抖。另有報導指出長期濫用本品而產生精神分裂、狂躁、抑鬱等病例。[600]

成癮治療之方法與成效評估:

使用活性碳除去本品。

發生心跳過速時：監測心跳，通常需要治療，使用苯二氮平類安眠劑可能可以改善症狀。發生嚴重心跳過速且血液動力學改變時才考慮使用乙型阻斷劑。

高血壓：監測血壓，通常不需給予藥物，可用苯二氮平類安眠劑使過於激動的病患鎮靜。

焦慮：給予苯二氮平類安眠劑，有嚴重焦慮症狀如顫抖、心悸則可給予 propranolol，劑量為成人每劑 1 毫克，靜脈注射 1 分鐘以上，每 5 分鐘重覆一次至到達最大劑量 5 毫克；孩童使用劑量為 0.1 毫克/公斤/劑，最大劑量為 1 毫克/劑。

痙攣：靜脈注射巴比妥鹽類或是苯二氮平類安眠劑。[601]

第四級管制原料藥品 — 麥角新 (Ergometrine, Ergonovine)

項次: 2

名稱:

1. 中文: 麥角新
2. 英文: Ergometrine, Ergonovine
4. CAS 編號: 478-94-4

化學性狀:

1. 外觀及性狀: 為無色結晶，在水溶液中會產生藍色螢光，微溶於水，可溶於酒精，易溶於乙酸乙酯，極易溶於氯仿。[602]

2. 結構式:

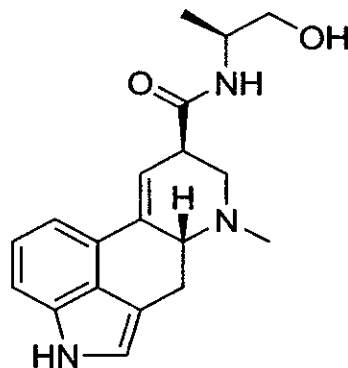
[8 β (S)]-9,10-Didehydro-N-(2-hydroxy-1-methylethyl)-6-methylergoline-8-carboxamide

3. 分子式: C₁₉H₂₃N₃O₂

4. 分子量: 325.41

4. 熔點: 162°C

5. 結構圖:



藥理性質:

麥角新會增加子宮收縮的強度、頻率以及延長子宮收縮的時間；也會降低子宮出血的機率，由於它在 α -腎上腺素、多巴胺以及tryptaminergic受器上具有混和的增效劑-拮抗劑效果，所以它被認為能夠使平滑肌收縮。[603]

藥動學特性：

使用肌肉內注射的給藥途徑，約 7-8 分鐘會開始產生子宮收縮的效果，而使用靜脈注射則只需要 40 秒就可達到，而利用口服途徑則需要 10 分鐘才可達到效果；一般來說，一次的給藥劑量經過肌肉內注射或是靜脈注射的給藥途徑，約持續 3 個小時的子宮收縮效果。[604]

用途用法：

成人用量，以肌肉內注射給藥途徑，一次需要 0.5mg，每隔 2-4 小時需要重複給藥一次；以靜脈注射給藥途徑，一次需要 0.05-0.2mg；以口服給藥途徑，一次需要 1-2 顆錠劑(約 0.2-0.4mg)，每隔 6-12 小時重複給藥一次。[605]

危害及副作用：

1. 對心血管系統的影響：會產生嚴重的高血壓，慢性及急性心肌梗塞，冠狀動脈血管痙攣，心室心律不整，發紺，呼吸抑制。
2. 對消化道的影響：噁心、嘔吐、腸繫膜局部缺血、食道痙攣。
3. 對免疫系統的影響：過敏反應(包含休克等反應)。

4. 對骨骼肌的影響：重症肌無力。
5. 對神經系統的影響：特別是對於中樞神經系統會有影響，主要症狀有頭痛、發紺、呼吸系統衰竭
6. 對呼吸系統的影響：肺水腫、肋膜增厚、發紺、呼吸系統衰竭。[606]

檢驗方法：

1. 質譜分析：分裂於 m/z 221、72、325、54、196、55、207、181。
2. 紫外分光光度法：在酸性溶液中對 313nm 有吸收；在鹼性溶液中對 310nm 有吸收。
3. 紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1634、754、748、1044、1212、1541 cm^{-1}
4. 高效液相層析法。[607]

管制狀況：

本國：第四級管制原料藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀):

長期過量毒性治療表現為中心或動脈痙攣肢體或器官缺血。急性藥物過量還可能引起噁心、嘔吐、昏迷、癲癇發作、與自然流產。血管功能不全可能導致下肢壞疽或器官梗塞。缺血的症狀（例如：手腳變得寒冷、面色蒼白、麻木），急性過量可能會推遲中毒症狀 12 至 24 小時後。動脈痙攣會持續多久的 3 天。在活動或休息中肌肉疼痛可能會發

生。缺血性神經功能障礙可能是長期的，慢慢減緩幾星期到幾個月。急性過量症狀產生敗血症或損害腎或肝功能有可能會發生。在一些病人身上發生毒性其劑量小於 5 毫克。[608]

成癮治療之方法與成效評估：

催嘔-吐根引起的嘔吐不建議，因為它可能對中樞神經系統引起的麥角抑鬱症和癲癇發作。

活性炭吸附：常用劑量：25 至 100 克的成年人/青少年， 25 至 50 克的兒童（ 1 至 12 歲） ， 1 克/千克的嬰兒不到 1 歲。

血管收縮與高血壓- 建議使用 Nitroprusside，以扭轉周圍缺血繼發血管收縮和治療高血壓。靜脈注射 1 至 2 mcg /公斤/分鐘，同時定期監測生命體徵。通常劑量是 200 至 500 mcg /分鐘。靜脈硝酸甘油也應考慮。

患者缺血時考慮靜脈注射肝素預防凝血。

外科手術或機械干預應該只考慮持謹慎態度，如果壞疽是迫在眉睫。

低血壓：注入 10 至 20 毫升/公斤等滲液體。如果持續性低血壓，使用多巴胺（ 5 至 20 微克/千克/分鐘）或去甲腎上腺素（成人：開始輸液在 0.5 至 1 微克/分鐘；孩子：開始輸液在 0.1 毫克/千克/分鐘）。

癲癇：使用 Diazepam（成人：從 5 到 10 毫克，重複每 10 至 15 分鐘。兒童： 0.2 至 0.5 毫克/公斤，重複每 5 分鐘視需要）或勞拉西泮（成人：24 毫克，兒童：0.05 至 0.1 毫克/公斤）。[609]

第四級管制原料藥品 — 麥角胺(Ergotamine)

項次: 3

名稱:

1. 中文: 麥角胺
2. 英文: Ergotamine
3. CAS 編號: 113-15-5

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

具有吸濕性質的結晶，在空氣、熱氣及光照的暴露下，會變黑且分解；幾乎不溶於水，微溶於乙醇及苯中，可溶於乙酸乙酯中，易溶於氯仿、嘓啶及冰醋酸中。[610]

2. 結構式:

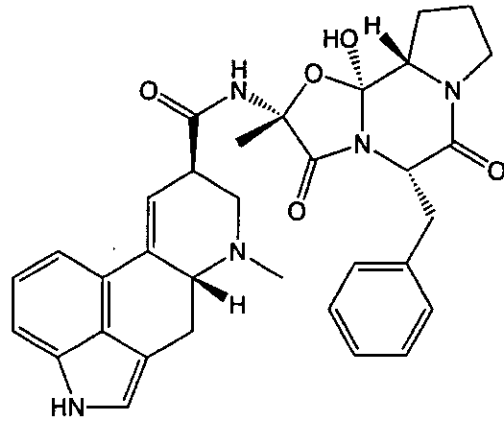
(6a*R*,9*R*)-*N*-((2*R*,5*S*,10a*S*,10b*S*)- 5-benzyl-10b-hydroxy-2-methyl-3,6-dioxooctahydro-2*H*-oxazolo[3,2-*a*] pyrrolo[2,1-*c*]pyrazin-2-yl)-7-methyl-4,6,6a,7,8,9-hexahydroindolo[4,3-*fg*]quinoline-9-carboxamide

3. 分子式: C₃₃H₃₅N₅O₅

4. 分子量: 581.66

5. 熔點: 212-214°C

6. 結構圖:



藥理性質：

麥角胺是由麥角獲得的生物鹼類，而麥角是由黴菌 *Claviceps purpurea* 得來的，麥角胺的構造和生物胺類，也就是正腎上腺素、腎上腺素、多巴胺、血清素相似，由於構造很相像，麥角胺會和生物胺受器反應；此種藥物是一個很強烈的血管收縮劑，但也可以產生血管舒張的效果，取決於對於脈管系統的耐受性程度，當之前存在的耐受性很低時，血管收縮作用就會發生，導致動脈血壓增加；而當血管網的耐受性增加時，血管舒張作用就會發生；對於血清素受器的直接作用構成了麥角胺的血管收縮作用。

在偏頭痛當中，麥角胺會在腦動脈血管網中產生選擇性的血管收縮作用。根據動物的實驗數據顯示，麥角胺對於治療偏頭痛是有效的。

[611]

藥動學特性：

單一劑量靜脈注射(0.5 mg/70 kg)的效用可持續 22 小時，而利用直腸給

藥途徑(2 to 4 mg)效用能夠持續 48 小時；利用口服給藥途徑(2mg)會在 0.5-2 小時達到藥物最高濃度(0.33-0.36 nanogram/mL)，而利用吸入途徑(2.16mg)則在 5 分鐘後達到藥物最高濃度(0.4 ng/mL)，利用肌肉內注射給藥途徑(0.5mg)則在 30 分鐘後達到藥物最高濃度(2 nanograms/mL)。

本品的口服吸收生體可用率為小於 5%(由消化道吸收)，而經由直腸給藥途徑的生體可用率也小於 5%，經由吸入給藥途徑的平均生體可用率則為 1.8%-2%，經由肌肉內注射途徑的生體可用率為 47%。

藥物其他分布位置：腦脊髓液(poor)。

藥物分布動力學：藥物分布半衰期→口服：2.7 小時，肌肉內注射：3 分鐘，靜脈注射：2.5 分鐘。

代謝：經由肝臟廣泛代謝。

排泄：經由腎臟：1.96%，經由膽汁：90%(主要由此排泄)。[612]

危害及副作用：

1. 對心血管的影響：冠狀動脈硬化症、心肌梗塞、冠狀動脈痙攣、心肌纖維化疾病、周圍組織局部缺血、動脈狹窄、冠狀系統血液流回、心律不整。
2. 對內分泌系統的影響：嗜鉻細胞瘤、高血壓、心跳過速。
3. 對消化道的影響：食慾減退之機能障礙、痛管、直腸狹窄症、噁心、

嘔吐、腹部疼痛、腹部局部缺血、位於咽部之後的纖維化、重複性感染、麻木無知覺、舌頭腫脹。

4. 對骨骼肌的影響：反射交感神經營養障礙、腳無力、四肢肌肉疼痛、皮膚感覺異常、抽筋。
5. 對中樞神經系統的影響：支氣管痙攣、噁心、嘔吐、手指皮膚感覺異常、頭痛。
6. 對眼睛的影響：直體低血壓。
7. 對精神的影響：神經錯亂。
8. 對腎臟的影響：間歇性的跛足、腎毒性、急性腎衰竭。
9. 對呼吸系統的影響：胸膜及肺的纖維化、纖維性肋膜炎。[613][614]

檢驗方法：

1. 質譜分析：分裂於 m/z 125、44、70、91、41、244、153。
2. 紫外分光光度法：在酸性水溶液中對 316nm 有吸收；在鹼性水溶液對 310nm 有吸收。
3. 紅外線光譜法：本品吸收譜帶於 1631、1712、750、1208、1136、 1160cm^{-1} 。
4. 氣相層析法
5. 高效液相層析法[615]

管制狀況：

本國：第四級管制原料藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀):

長期過量毒性治療表現為中心或動脈痙攣肢體或器官缺血。急性藥物過量還可能引起噁心、嘔吐、昏迷、癲癇發作、與自然流產。血管功能不全可能導致下肢壞疽或器官梗塞。缺血的症狀（例如：手腳變得寒冷、面色蒼白、麻木），急性過量可能會推遲中毒症狀 12 至 24 小時後。動脈痙攣會持續多久的 3 天。在活動或休息中肌肉疼痛可能會發生。缺血性神經功能障礙可能是長期的，慢慢減緩幾星期到幾個月。急性過量症狀產生敗血症或損害腎或肝功能有可能會發生。在一些病人身上發生毒性其劑量小於 5 毫克。[616]

成癮治療之方法與成效評估:

催嘔-吐根引起的嘔吐不建議，因為它可能對中樞神經系統引起的麥角抑鬱症和癲癇發作。

活性炭吸附:常用劑量：25 至 100 克的成年人/青少年， 25 至 50 克的兒童（ 1 至 12 歲） ， 1 克/千克的嬰兒不到 1 歲。

血管收縮與高血壓- 建議使用 Nitroprusside，以扭轉周圍缺血繼發血管收縮和治療高血壓。靜脈注射 1 至 2 mcg /公斤/分鐘，同時定期監測

生命體徵。通常劑量是 200 至 500 mcg /分鐘。靜脈硝酸甘油也應考慮。

患者缺血時考慮靜脈注射肝素預防凝血。

外科手術或機械干預應該只考慮持謹慎態度，如果壞疽是迫在眉睫。

低血壓：注入 10 至 20 毫升/公斤等滲液體。如果持續性低血壓，使用

多巴胺（ 5 至 20 微克/千克/分鐘）或去甲腎上腺素（成人：開始輸液

在 0.5 至 1 微克/分鐘;孩子：開始輸液在 0.1 毫克/千克/分鐘）。

癲癇：使用 Diazepam（成人：從 5 到 10 毫克，重複每 10 至 15 分鐘。

兒童： 0.2 至 0.5 毫克/公斤，重複每 5 分鐘視需要）或勞拉西泮（成

人: 24 毫克，兒童：0.05 至 0.1 毫克/公斤）。[617]

第四級管制原料藥品 — 麥角酸(Lysergic acid)

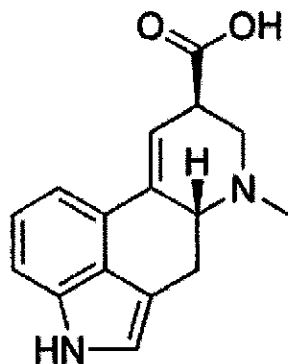
項次: 4

名稱:

1. 中文: 麥角酸
2. 英文: Lysergic acid
4. CAS 編號: 82-58-6, 478-95-5, 6915-32-8, 23953-76-6, 68985-97-7, 68985-98-8

化學性狀:

1. 外觀及性狀: 降解後為白色結晶粉末。[618]
2. 結構式: 6-Methyl-9,10-didehydro-ergoline-8-carboxylic acid or 7-methyl-4,6,6a,7,8,9-hexahydro-indolo[4,3-fg]quinoline-9-carboxylic acid
3. 分子式: $C_{16}H_{16}N_2O_2$
4. 分子量: 268.31
5. 熔點: 238 - 240 °C
6. 結構圖:



藥理性質：

本品影響了大量偶聯受體 G 蛋白，其中包括所有多巴胺受體亞型，所有的腎上腺素受體亞型以及其他許多人。本品結合與最羥色胺受體亞型除 5-HT₃ 和 5-HT₂ 外。然而，大多數這些受體在腦中被激活的濃度大約 10-20 nM。究竟如何產生的藥物效果是未知的，但被認為通過提高谷氨酸釋放，從而激發大腦皮質。[619]

藥動學特性：

本品口服吸收快速。經由肝臟代謝成非活性物 2-oxy-lysergic acid，；經由腎臟排出，約 80% 會以非活性物 2-oxy-lysergic acid 或其共軛物形式存在於尿液中。本品藥物半衰期約 2.5 小時。[620]

危害及副作用：

心搏過速、血壓上升、震顫、肌肉緊張而呈強直性、陣攣性運動。[621]

檢驗方法：

1. 質譜分析：分裂於 m/z 268、224、154、180、207、223、192、179。
2. 紫外分光光度法：在酸性水溶液中對 305nm 有吸收；在鹼性水溶液對 308nm 有吸收。
3. 紅外線光譜法：本品吸收帶於 1592、787、758、1308、691、1015 cm^{-1} 。
4. 高液相層析法。[618]

管制狀況：

本國：第四級管制原料藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀)：

可以合成 LSD (Lysergic acid diethylamide)，為常見精神用藥，具有迷幻作用。會出現神經性併發症，像是抽搐、腦病變。急性腎衰竭及橫紋肌溶解症。精神性併發症：急性恐懼發作、倒敘式精神異常、毒性精神病、急性躁症。[622]

成癮治療之方法與成效評估：

以口服為主。靜脈注射，吸食等方式則非常少見。因為會很快有藥物忍受性出現，因此濫用者以間斷使用較常見。生理上的戒斷症狀幾乎沒有，但是心理上的依賴卻容易發生。濫用者經常與安非他命，酒精、大麻合用。催嘔-吐根引起的嘔吐不建議，因為它可能對中樞神經系統引起的麥角抑鬱症和癲癇發作。

活性炭吸附：常用劑量：25 至 100 克的成年人/青少年， 25 至 50 克的兒童（ 1 至 12 歲） ， 1 克/千克的嬰兒不到 1 歲。

血管收縮與高血壓- 建議使用 Nitroprusside，以扭轉周圍缺血繼發血管收縮和治療高血壓。靜脈注射 1 至 2 mcg /公斤/分鐘，同時定期監測生命體徵。通常劑量是 200 至 500 mcg /分鐘。靜脈硝酸甘油也應考慮。患者缺血時考慮靜脈注射肝素預防凝血。

外科手術或機械干預應該只考慮持謹慎態度，如果壞疽是迫在眉睫。

低血壓：注入 10 至 20 毫升/公斤等滲液體。如果持續性低血壓，使用多巴胺（5 至 20 微克/千克/分鐘）或去甲腎上腺素（成人：開始輸液在 0.5 至 1 微克/分鐘；孩子：開始輸液在 0.1 毫克/千克/分鐘）。

癲癇：使用 Diazepam（成人：從 5 到 10 毫克，重複每 10 至 15 分鐘。

兒童：0.2 至 0.5 毫克/公斤，重複每 5 分鐘視需要）或勞拉西泮（成人：24 毫克，兒童：0.05 至 0.1 毫克/公斤）。[623]

第四級管制原料藥品 — 甲基麻黃(Methylephedrine)

項次: 5

名稱:

1. 中文: 甲基麻黃
2. 英文: Methylephedrine
4. CAS 編號: 522-79-4

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

白色結晶粉末狀，易溶於水，可溶於乙醇，部分不溶於乙醚。

[624]

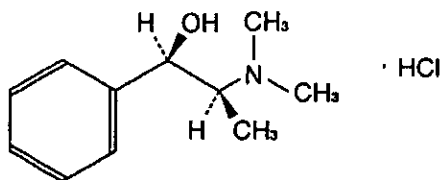
2. 結構式: x-[1-(Dimethylamino)ethyl]benzenemethanol

3. 分子式: $C_{11}H_{17}NO$, HCl

4. 分子量: 215.7

5. 熔點: 207-208°C

6. 結構圖:



藥理性質:

為一種擬交感神經作用的生物鹼，作用在 α -腎上腺素和 β -腎上腺素

受器上，使之活化；由於正腎上腺素被釋放出來，所以對腎上腺素受器會有直接和間接的效用。會藉由血管收縮作用以及增加心輸出量來刺激中樞神經系統以及增加血壓。在肺中對 β -腎上腺素受器的刺激會導致支氣管的擴張作用；由於它會使膀胱壁擴約肌收縮以及膀胱壁舒張，所以會產生尿液滯留的作用。麻黃素會使收縮壓及舒張壓提高，且由於血管收縮作用及對心臟的刺激，所以會使脈搏增加，它也會提高心輸出量以及收縮的力量。[625]

藥動學特性：

口服後約 0.25-1 小時會產生支氣管擴張的作用，會持續 3-5 小時，口服生體可用率為 85%，經由肝臟代謝，產生的代謝物為苯甲酸、馬尿酸、norephedrine，此三種為非活性物，另外還有 p-hydroxyephedrine、p-hydroxynorephedrine；經由腎臟排出，以口服給藥途徑的麻黃素，約 77% 會以原形藥的形式存在於尿液中，而一般來說，尿液的酸鹼度會決定於存在於尿液中的麻黃素以原形藥形式存在的多寡。[626]

危害及副作用：

對於心血管的副作用：心悸、高血壓、心跳過快。

對於皮膚的影響：出疹。

對於中樞神經系統的影響：緊張、興奮及廣泛的焦慮狀態。

對於精神上的影響：出現妄想、幻覺、憂鬱的症狀。

對於腎臟的影響：腎結石、尿液滯留。具有成癮作用。[627]

檢驗方法：

1.質譜分析：分裂於 m/z 58、72、30、77、56、44、42、73。

2.紫外分光光度法：在酸性水溶液中對 251nm、257nm、263nm 有吸收。

3.紅外線光譜法：本品吸收帶於 742、1039、702、1052、990、1162 cm^{-1} 。

4.氣相層析法

5.高液相層析法。[624]

管制狀況：

本國：第四級管制原料藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀):

本品使用過量時可能造成心跳過速、高血壓、焦慮、幻覺、嘔吐等現象

使用本品於戒斷時會產生困乏感、感覺消失、夢魘及輕微的顫抖。

另有報導指出長期濫用本品而產生精神分裂、狂躁、抑鬱等病例。[628]

成癮治療之方法與成效評估:

使用活性碳除去本品。

發生心跳過速時：監測心跳，通常需要治療，使用苯二氮平類安眠劑

可能可以改善症狀。發生嚴重心跳過速且血液動力學改變時才考慮使

用乙型阻斷劑。

高血壓：監測血壓，通常不需給予藥物，可用苯二氮平類安眠劑使過於激動的病患鎮靜。

焦慮：給予苯二氮平類安眠劑，有嚴重焦慮症狀如顫抖、心悸則可給予 propranolol，劑量為成人每劑 1 毫克，靜脈注射 1 分鐘以上，每 5 分鐘重覆一次至到達最大劑量 5 毫克；孩童使用劑量為 0.1 毫克/公斤/劑，最大劑量為 1 毫克/劑。

痙攣：靜脈注射巴比妥鹽類或是苯二氮平類安眠劑。[629]

第四級管制原料藥品 — 去甲基麻黃
(Phenylpropanolamine, Norephedrine)

項次: 6

名稱:

1. 中文: 去甲基麻黃
2. 英文: Phenylpropanolamine, Norephedrine
3. CAS 編號: 14838-15-4

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

白色結晶粉末，可溶於水及乙醇中，部分不溶於氯仿及乙醚中。

[630]

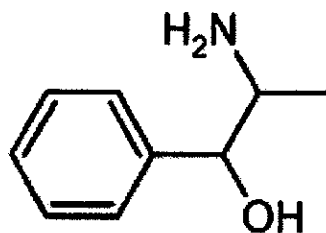
2. 結構式: (1R,2S)-2-amino-1-phenyl-propan-1-ol

3. 分子式: $C_9H_{13}NO$

4. 分子量: 151.206

5. 熔點: 190-194°C

6. 結構圖:



藥理性質：

去甲基麻黃是一種仿交感神經作用的胺類，其藥理性質和麻黃素很像，除了去甲基麻黃對中樞神經系統的效用較弱之外，它們的效價幾乎是相等的，它會刺激 α 和 β -腎上腺素受器，其部分的效用來自於內生性的正腎上腺素釋放，它會產生血管收縮的效用，有去除鼻塞的作用，因為具有血管收縮以及對心臟的刺激作用，所以它會導致高血壓的產生；而它對 CNS 有刺激作用，也會產生食慾抑制的作用。[631]

藥動學特性：

到達藥物最高濃度的時間：口服立即釋放劑型→5.5 小時；口服緩慢釋放劑型→10 小時；口服液態劑型→2.1-2.7 小時。

吸收：口服生體可用率→100%。

分布：其他分布位置→血腦障礙；分布動力學→分布體積：4.4L/Kg。

排泄：由腎臟排泄。[632]

危害及副作用：

- 1.對心血管的影響：高血壓、對心肌產生傷害、對房室的阻塞、心跳過速、心律不整、高血壓引起的腦病、腦內出血。
- 2.對肝臟系統的影響：具有肝毒性。
- 3.對免疫系統的影響：過敏反應、蕁麻疹、過敏性紫斑症。

- 4.對骨骼肌的影響：橫紋肌溶解症、急性腎衰竭。
- 5.對神經系統的影響：腦內出血、頭痛、發抖、失語症、不眠症、緊張、顫抖、嘔吐、中風、對腦的破壞、急性的記憶喪失、健忘症。
- 6.對眼睛的影響：視線模糊、視覺突然喪失、中樞視網膜靜脈閉合。
- 7.對心理的影響：精神病，包括具有犯罪傾向、出現偏執症狀、精神分裂症；心理狀態改變；精神干擾。
- 8.對腎臟的影響：具有腎毒性、急性腎小管壞死、急性腎衰竭、尿液滯留、腎炎。[633]

檢驗方法：

- 1.質譜分析：分裂於 m/z 44、77、79、51、45、42、107、105。
- 2.紫外分光光度法：在酸性水溶液中對 251nm、257nm、262nm 有吸收，在鹼性水溶液中沒有吸收。
- 3.紅外線光譜法：本品吸收帶於 700、746、1030、1500、1055、1590 cm^{-1} 。
- 4.氣相層析法
- 5.高液相層析法。[630]

管制狀況：

本國：第四級管制原料藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀):

本品使用過量時可能造成心跳過速、高血壓、焦慮、幻覺、嘔吐等現

象

使用本品於戒斷時會產生困乏感、感覺消失、夢魘及輕微的顫抖。

另有報導指出長期濫用本品而產生精神分裂、狂躁、抑鬱等病例。[634]

成癮治療之方法與成效評估：

使用活性炭除去本品。

發生心跳過速時：監測心跳，通常需要治療，使用苯二氮平類安眠劑可能可以改善症狀。發生嚴重心跳過速且血液動力學改變時才考慮使用乙型阻斷劑。

高血壓：監測血壓，通常不需給予藥物，可用苯二氮平類安眠劑使過於激動的病患鎮靜。

焦慮：給予苯二氮平類安眠劑，有嚴重焦慮症狀如顫抖、心悸則可給予 propranolol，劑量為成人每劑 1 毫克，靜脈注射 1 分鐘以上，每 5 分鐘重覆一次至到達最大劑量 5 毫克；孩童使用劑量為 0.1 毫克/公斤/劑，最大劑量為 1 毫克/劑。

痙攣：靜脈注射巴比妥鹽類或是苯二氮平類安眠劑。[635]

第四級管制原料藥品 — 假麻黃(Pseudoephedrine)

項次: 7

名稱:

1. 中文: 假麻黃
2. 英文: Pseudoephedrine
3. CAS 編號: 90-82-4

化學性狀:

1. 外觀及性狀:

它是一個從 Ephedra spp. 獲得的生物鹼類，它是麻黃素的立體異構物，亦溶於乙醇及乙醚，微溶於水。[636]

2. 結構式: 英文

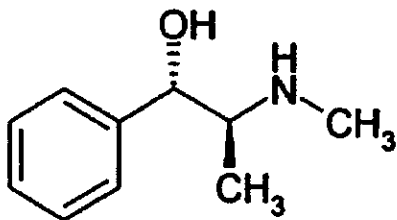
(1*S*,2*S*)-2-methylamino-1-phenylpropan-1-ol

3. 分子式: C₁₀H₁₅NO

4. 分子量: 165.23

5. 熔點: 118.0-118.7°C

6. 結構圖:



藥理性質：

甲基麻黃是麻黃的左旋異構物，可當作增血壓劑，但其效價為麻黃的四分之一，在相同效價的增加作用下，甲基麻黃的支氣管擴張效用小於麻黃的二分之一，它會刺激血管平滑肌的 α -腎上腺素受器，所以可當作一個解鼻充血劑，將鼻黏膜中擴張的小動脈收縮，減少血流的流量到腫脹的部位。[637]

藥動學特性：

用於過敏性鼻炎上，以口服給藥途徑，在經過 15-30 分鐘後可開始產生效用，在 30-60 分鐘後會產生最高反應；而單一劑量在口服給藥途徑下，可持續 3-4 小時；在口服錠劑給藥途徑下，1.5-2.4 小時會到達藥物最高濃度；而在口服溶液(糖漿)給藥途徑下，1.5-2.4 小時會到達藥物最高濃度。

吸收：口服生體可用率並不一定。

分布：分布體積→2.4-2.6L/Kg

代謝：10%-30%會在肝臟代謝，而單胺酶無法代謝甲基麻黃，代謝物為 norpseudoephedrine，具有活性，會對中樞神經系統產生作用。

排泄：70-90%在腎臟排泄。[638]

危害及副作用：

1. 對心血管的影響：心房纖維性顫動、高血壓、些微的心跳過速、心

肌梗塞、過早的心室收縮、低血壓。

2. 對皮膚的影響：接觸性皮炎、發疹、偽猩紅熱。
3. 對內分泌系統的影響：身體溫度過高。
4. 對腸胃道的影響：局部缺血性結腸炎。
5. 對神經系統的影響：不眠症、肌肉顫抖、運動失調、過度興奮、瞳孔擴張。
6. 對精神系統的影響：出現幻覺、過動、焦慮、不安、緊張、易怒。

[639]

檢驗方法：

1. 質譜分析：分裂於 m/z 58、77、59、56、51、42、105、91。
2. 紫外分光光度法：在酸性水溶液中對 251nm、257nm、263nm 有吸收，在鹼性水溶液中沒有吸收。
3. 紅外線光譜法：本品吸收帶於 704、1036、764、1005、1210、1595 cm^{-1} 。
4. 氣相層析法
5. 高效液相層析法。[636]

管制狀況：

本國：第四級管制原料藥品

多重濫用評估、危害評估(中毒症狀):

本品使用過量時可能造成心跳過速、高血壓、焦慮、幻覺、嘔吐等現

象

使用本品於戒斷時會產生困乏感、感覺消失、夢魘及輕微的顫抖。

另有報導指出長期濫用本品而產生精神分裂、狂躁、抑鬱等病例。[640]

成癮治療之方法與成效評估:

使用活性碳除去本品。

發生心跳過速時：監測心跳，通常需要治療，使用苯二氮平類安眠劑可能可以改善症狀。發生嚴重心跳過速且血液動力學改變時才考慮使用乙型阻斷劑。

高血壓：監測血壓，通常不需給予藥物，可用苯二氮平類安眠劑使過於激動的病患鎮靜。

焦慮：給予苯二氮平類安眠劑，有嚴重焦慮症狀如顫抖、心悸則可給予 propranolol，劑量為成人每劑 1 毫克，靜脈注射 1 分鐘以上，每 5 分鐘重覆一次至到達最大劑量 5 毫克；孩童使用劑量為 0.1 毫克/公斤/劑，最大劑量為 1 毫克/劑。

痙攣：靜脈注射巴比妥鹽類或是苯二氮平類安眠劑。[641]

肆、討論

藥物濫用已成為世界性的問題，也造成臺灣地區嚴重的社會問題。由行政院衛生署藥物濫用案件暨檢驗統計資料，可發現藥物的濫用有逐年增加的趨勢，尤其是管制藥品、毒品的濫用，甚至是多重濫用。國內管制藥品分級原則依民國 88 年 8 月 18 日行政院衛生署管制藥品審議委員會第二次會議，管制藥品限供醫藥及科學上之需要，依其習慣性、依賴性、濫用性及社會危害性之程度分為四級管理。

依照最新公布的行政院九十六年二月十六日院臺衛字第 0960004264 號公告「管制藥品分級及品項範圍」內所收載之第三級、第四級管制藥品，三級管制藥品中，早期的巴比妥鹽 (Barbiturate) 原為治療焦慮、失眠之助眠劑，如 Secobarbital (俗稱「紅中」) 和 Amobarbital (俗稱「青發」) 會使身體產生放鬆安寧甚至歡愉的感覺，為青少年濫用的藥物，然而此類化合物有強烈的呼吸抑制作用、安全性較低、易產生生理依賴性，現已較少使用於臨床或單獨被查獲。近年來，取而代之的，尤以 Amphetamine (安非他命) 及其衍生物 (如甲基安非他命) 為甚，因其濫用性大增，隨著管制藥品分級及品項範圍不斷的修正，安非他命單及其衍生物被歸類而第二級管制藥品。近兩年列為第三級管制藥品 FM2 (Flunitrazepam) 由於無色、無味，服用後短

時間內不易清醒，具有暫時性記憶喪失的功能，易成為侵犯的工具；K 他命 (Ketamine) 更取代安非他命的地位，為單獨驗出及查獲的最大宗。長期使用三、四級管制藥品其成癮性還有對於身心的傷害不亞於其他管制藥品，而新型的藥品毒品與日遽增，多重濫用更劇，已經非侷限於單一管制藥品使用。根據行政院衛生署藥物濫用案件資料顯示，國人常見藥物多重濫用為嗎啡 (Morphine)、可待因 (Codeine)、安非他命及甲基安非他命 ((Meth)Amphetamine) 等第一、二級管制藥品合併使用，而近年也驗出併用 K 他命，因此，可以預見的藥物濫用會延續到第三、四級管制藥品。除此之外，隨著全民健保的施行，一般民眾藥品濫用的問題也成為值得關注的一環，但這些卻往往成為被忽略掉但卻很重要的一群。有輕微精神官能症造成失眠或焦慮的民眾，常不願意面對自己有精神官能相關的問題，而請一般科目的醫生開立處方，甚至重複看診領藥，造成國內安眠類鎮定劑有使用浮濫的現象，而這些藥物大多是列管於第三、四級管制藥品。在民眾不瞭解藥物毒性及多重就診的情況下，造成藥品種類越用越多劑量越用越高，成效反而遞減，若貿然停藥甚至有禁斷現象的產生，最後只好求助精神科醫師，但此時常常已有藥品毒性產生的情形。然而因不同的代謝路徑造成肝臟或腎臟的損害，或併用其他的藥品產生交互作用影響到疾病的治療。

過去我們對於藥物濫用的定義往往侷限於傳統的街頭濫用藥物，例如：海洛因，大麻，古柯鹼，甲基安非他命等藥物。依據近年法務部之統計及行政院衛生署彙整民國八十七年至九十四年十一月台灣地區毒品檢驗案件顯示，多重組合之濫用藥物有年年增加的趨勢[642]。又由管制藥品管理局九十四年所委託執行之研究計畫「由法醫病理解剖中毒死亡案件中監測多種濫用藥物之交叉毒性致毒機轉疾病裡組織診斷特徵評估」中結果顯示，發現多重藥物濫用死亡案件有大幅增加的趨勢，在九十三年度的調查中，已佔藥物濫用死亡案例總數的 41.2%，顯示國內藥物濫用種類日趨複雜之危害。根據其研究結果顯示，並用多種藥物濫用導致死亡的情形以青少年族群居多。事實上不僅在我國，其實多重藥物濫用的問題，已朝向全球化的趨勢發展[643][644][654]，加上跨境毒品來源不斷，使國人面對藥物濫用之威脅與日驟增。依據聯合國統計，目前全球非法藥物濫用人口高達二億，約占總人口的 3.4%。而大麻是目前國際上濫用人口最多的毒品，其次分別為(甲基)安非他命、快樂丸(搖頭丸)、鴉片、古柯鹼及海洛因。而且根據警方查緝結果，我國濫用藥物者多以併用多種藥物為主，少則 3 種甚至有多達 10 種藥物包括：搖頭丸、安非他命、K 他命、咖啡因、安眠鎮靜劑合用之例子。但這幾年來隨著俱樂部藥物的盛行，例如 K 他命，以及 MDMA。然而俱樂部藥物的進展隨著網路的發達是日新月異的。

隨著我國管制藥品的訂定日趨嚴格，這些濫用藥物使用者和製造者轉而趨向一些更容易製造且目前可能尚未被認為是管制藥品的方面著手。由於這些製藥為非法，所以這些濫用藥物的特別組合雖然在流行病學上已被證實，但在學理的討論研究上是非常少的。在國外目前合併濫用藥物最多的是海洛英和古柯鹼，以及快樂丸和大麻，甚至有流行病學調查結果顯示有高達 97% 得快樂丸濫用者同時併用大麻 [646][647]。由於不合法的濫用藥物管制越來越嚴格，故許多濫用藥物者就企圖尋找合法的藥物當作受到管制的濫用藥物的替代品。根據舊金山大規模研究不僅僅是多重濫用藥物者所使用的濫用藥物不僅包含濫用藥物本身，可能也會與其他合法藥物共同使用。根據本院過去的觀察及本次回顧管制藥品管理局過去一年來的調查發現，發現有多重濫用藥物者合併有濫用咳嗽藥物 dextromethorphan (d-3-methoxy-N-methylmorphine) 的現象，而在美國此現象在青少年間使用已經特別明顯 [648]，由於 dextromethorphan 可任意在藥房買到，在我國常見的藥物名為 Robitussin 的止咳藥水，Medicon 的止咳 160 藥丸，或任何含有止咳成分的感冒藥複方皆含有之。過去雖認為 dextromethorphan 乃藉由刺激在延腦中的 σ 接受器來抑制咳嗽，和常見的嗎啡作用於鴉片接受器作用不同，dextromethorphan 並不會作用在 $\kappa\delta$ 和 μ 接受器上，故理論上並無成癮性 [649]。但確有許多研究

發現只要飲用兩瓶 Robitussin (其中所含的 dextromethorphan 的量) 就具有類似 phencyclidine(天使塵)的作用，可以抑制 N-methy-D-aspartate(NMDA) receptors[650]。

因此對於不同管制藥品資料之分析整合，有助於研議或制定管制藥品毒性分析評估的可行性指標及毒性檢測方法，成癮治療之方法與成效等，本研究收集與第三、四級管制藥品及藥物濫用相關的所有文獻書籍、期刊、網路藥品相關資料庫、法規等資料，將各品項依其藥品化學結構分類、彙整藥理特性、藥物動力學及臨床使用情形、毒性分析及檢測方法與各種濫用藥物品項之相關研究文獻，加以整合成資料庫，以期以充實國內資料彙整之完整性及建構更完善之政策與對策。

伍、結論與建議

本研究計畫主要以收集國內外相關調查研究文獻、資料庫、國內外網站、學術資料書籍等相關內容，分別進行屬於第三、四級管制藥品的藥物資料庫之建置。包括其物理、化學性質、藥理作用及機轉、藥物動力學之探索、用途用法及副作用、檢測分析方法、多重濫用評估、危害評估、醫療政策之因應等資料之分析整合，有助於研制或訂定管制藥品毒性分析評估的可行性指標及毒性檢測方法，成癮治療之方法與成效等，以充實國內資料彙整之完整性及建構更完整之政策與對策。

建立屬於第三、四級的管制藥品如 Benzodiazepine 類、Barbital 類與 Ephedrine 類藥物等之整合資料庫包括藥品基本性質、商品產品、臨床使用、毒性分析等，並可提供其他國家管理第三、四級的管制藥品之相關資訊。提供國內產官學各機構對於第三、四級的管制藥品毒性研究發展、毒性評估的可行性指標及檢測方法，或臨床上因藥物併用產生交互作用之毒性評估模式的參考依據，以及劑量上之差異帶來醫療上多方面之用途，諸如性別、年齡、作用機轉等。

彙整所得之各濫用藥物品項及研究文獻，可有效且及時的反應在政策應用上，並可據以研訂管制藥品毒性評估的可行性指標及毒性檢

測方法，或併用產生交互作用之毒性評估模式。取得彙整相關科學證據，進行管制藥品分級、宣導及戒治政策之應用。

陸、參考文獻

1. Starcevic, Boris. and Sicaja, Mario. *Medical Hypotheses* 2007 ; 69 (2):377-380.
2. Toft P and Helbo-Hansen S: Interaction of ketamine with atracurium. *Br J Anaesth* 1989; 62:319-320
3. Iqbal, Mohammad M. Sobhan, Tanveer. Aftab, Syed R. Mahmud, and Syed Z. *Delaware Medical J.* 2002; 74(3):127-135
4. Visser, E. and Schug, SA. *Biomedicine & Pharmacotherapy* 2006; 60(7):341-348
5. Gan, Tong J. *Clinical Pharmacokinetics* 2006 ; 45(9): 855-870.
6. Wolff K. Winstock AR. *CNS Drugs* 2006; 20(3):199-218
7. Haddad, P. J. *Psychopharmacology* 1999; 13(3): 300-307
8. 中華藥典 第四版 1995;49
9. Gilman AG, Rall TW, Nies AS, et al Gilman AG, Rall TW, Nies AS, et al (Eds): *Goodman and Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics*, 8th. Pergamon Press, New York, NY, 1990.
10. Reynolds JEF (ed): *Martindale: The Extra Pharmacopoeia* (electronic version). Micromedex, Inc. Denver CO. 1990.
11. Product Information: AMYTAL(R) SODIUM injection, amobarbital sodium injection. Ranbaxy, Princeton, NJ, 2003
12. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: *Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material.* 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;630
13. McCarron MM, Schulze BW, & Walberg CB: Short acting barbiturate overdose. Correlation of intoxication score with serum barbiturate concentration. *JAMA* 1982; 248:55-61.
14. Guenther Skokan E, Junkins EP, & Corneli HM: Taste test: children rate flavoring agents used with activated charcoal. *Arch Pediatr Adolesc Med* 2001; 155:683-686.
15. Dagnone D, Matsui D, & Rieder MJ: Assessment of the palatability of vehicles for activated charcoal in pediatric volunteers. *Pediatr Emerg Care* 2002; 18:19-21.
16. S Sweetman: *Martindale: The Complete Drug Reference.* London: Pharmaceutical Press. Electronic Version, Thomson MICROMEDEX. Greenwood Village, CO, USA. 2004
17. Abernethy DR, Greenblatt DJ, Steel K, et al: Impairment of hepatic drug oxidation by propoxyphene. *Ann Intern Med* 1982; 97:223-224
18. Rickels K, Morris RJ, Mauriello R, et al: Brotizolam, a triazolothienodiazepine, in insomnia. *Clin Pharmacol Ther* 1986; 40:293-299
19. Langley MS & Clissold SP: Brotizolam: a review of its pharmacodynamic and pharmacokinetic properties, and therapeutic efficacy as an hypnotic. *Drugs* 1988; 35:104-122

20. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;713
21. Abernethy DR, Greenblatt DJ, Steel K, et al: Impairment of hepatic drug oxidation by propoxyphene. *Ann Intern Med* 1982a; 97:223-224
22. Laub M, Espersen K, Ejlersen E, et al: Sublingual premedication with brotizolam. *Acta Anaesthesiol Scand* 1992; 36:764-766
23. Fleeger CA: USAN 1994. USAN and the USP dictionary of drug names., The United States Pharmacopeial Convention, Inc., Rockville, MD, 1993, pp 103
24. Downing JW, Goodwin NM, & Hicks J: The respiratory depressive effects of intravenous buprenorphine in patients in an intensive care unit. *S Afr Med J* 1979; 55:1023-1027
25. Mok MS, Lippmann M, & Steen SN: Evaluation of multiple intramuscular doses of buprenorphine and morphine in patients with acute postoperative pain. *Clin Pharmacol Ther* 1980; 27:272
26. Khan FA & Kamal RS: The effect of increasing the dose of buprenorphine on the haemodynamic response associated with tracheal intubation. *Anaesthesia* 1996; 51:274-279
27. Product Information: BUPRENEX(R) injection, buprenorphine hcl injection. Reckitt Benckiser Pharmaceuticals, Inc, Richmond, VA, 2001
28. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;722
29. Product Information: Avinza(TM), morphine sulfate extended release capsules. Ligand Pharmaceuticals Incorporated, San Diego, CA, 2002
30. Carroll D, Frankland T, Nagle C, et al: Oral bromfenac 10 and 25 mg compared with sublingual buprenorphine 0.2 and 0.4 mg for postoperative pain relief. *Br J Anaesthesia* 1993; 71:814-817
31. Reynolds JEF (Ed): Martindale: The Extra Pharmacopoeia, (electronic version). Micromedex, Inc. Denver, CO. 1990
32. Gilman AG, Goodman LS, Rall TW, et al (Eds): Goodman and Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics, 7th. Macmillan Publishing Co, New York, NY, 1985a
33. Drost ML & Walter L: Blood and plasma concentrations of butalbital following single oral doses in man. *J Anal Toxicol* 1988; 12:322-324
34. Gilman AG, Goodman LS, Rall TW, et al (Eds): Goodman and Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics, 7th. Macmillan Publishing Co, New York, NY, 1985a
35. USPDI: Drug Information for the Health Care Professional, 10th. US

- Pharmaceutical Convention, Inc, Rockville, MD, 1990
36. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;729
 37. Mikkelsen B & Birket-Smith E: A clinical study of the benzodiazepine RO5-4023 (clonazepam) in the treatment of epilepsy. *Acta Neurol Scand* 1973; 49(suppl 53):91-96
 38. Chierichetti SM, Moise G, Galeone M, et al: Beta-blockers and psychic stress: a double-blind, placebo-controlled study of bopindolol vs lorazepam and butalbital in surgical patients. *Int J Clin Pharmacol Ther Toxicol* 1985; 23:510-514
 39. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004; 761
 40. AMA Department of DrugsAMA Department of Drugs: AMA Drug Evaluations, 6th. American Medical Association, Chicago, IL, 1986
 41. Product Information: Preludin(R), phenmetrazine. Boehringer Ingelheim Pharmaceuticals, Inc., Ridgefield, CT, 1991
 42. Dobrescu D & Cicotti A: Antagonistic effect of propranolol upon secondary actions of phenmetrazine. *Curr Ther Res* 1970; 12:446-450
 43. Kornhaber A: Obesity-depression: clinical evaluation with a new anorexigenic agent. *Psychosomatics* 1973; 14:162-167
 44. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;858
 45. Gilman AG, Rall TW, Nies AS, et alGilman AG, Rall TW, Nies AS, et al (Eds): Goodman and Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics, 8th. Pergamon Press, New York, NY, 1990.
 46. Reynolds JEF (ed): Martindale: The Extra Pharmacopoeia (electronic version). Micromedex, Inc. Denver CO. 1990.
 47. Product Information: AMYTAL(R) SODIUM injection, amobarbital sodium injection. Ranbaxy, Princeton, NJ, 2003
 48. McCarron MM, Schulze BW, & Walberg CB: Short acting barbiturate overdose. Correlation of intoxication score with serum barbiturate concentration. *JAMA* 1982; 248:55-61.
 49. Guenther Skokan E, Junkins EP, & Corneli HM: Taste test: children rate flavoring agents used with activated charcoal. *Arch Pediatr Adolesc Med* 2001; 155:683-686.
 50. Dagnone D, Matsui D, & Rieder MJ: Assessment of the palatability of vehicles for activated charcoal in pediatric volunteers. *Pediatr Emerg Care* 2002; 18:19-21.

51. Product Information: Doriden(R), glutethimide. Rorer Pharmaceuticals, Fort Washington, PA, 1990
52. Gilman AG, Rall TW, Nies AS, et al Gilman AG, Rall TW, Nies AS, et al (Eds): Goodman and Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics, 8th. Macmillan Publishing Co, New York, NY, 1990
53. Curry SH, Gordon JS, Riddall D, et al: Disposition of glutethimide in man. Clin Pharmacol Ther 1971; 12:849-857
54. Graupner RD: On safety of Doriden(R) in pregnancy. Ohio St Med J 1965; 973-974
55. Fisher M & Lerman JS: Fixed eruption due to glutethimide. Arch Dermatol 1971; 104:87
56. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1083
57. Corn M: Effect of phenobarbital and glutethimide on biological half-life of warfarin. Thromb Diath Haemorrh 1966a; 16:606
58. McDowell FH: The use of glutethimide for treatment of essential tremor. Movement Disorders 1989; 4:75-80
59. Fleeger: USP dictionary of USAN and international drug names 1995, The United States Pharmacopeial Convention, Rockville, MD, 1994, pp 427
60. Product Information: Ritalin (R), methylphenidate. Novartis Pharmaceuticals, East Hanover, NJ, 2001
61. Product Information: DAYTRANA(TM) transdermal system, methylphenidate transdermal system. Shire US Inc., Wayne, PA, 2006
62. Product Information: Concerta(R), methylphenidate HCl extended-release tablets. McNeil Consumer & Specialty Pharmaceuticals, Fort Washington, PA, 2004
63. Product Information: DAYTRANA(TM) transdermal system, methylphenidate transdermal system. Shire US Inc., Wayne, PA, 2006
64. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1260
65. Product Information: VYVANSE(TM) oral capsules, lisdexamfetamine dimesylate oral capsules. New River Pharmaceuticals, Inc, Blacksburg, VA, 2007
66. Pelham WE, Aronoff HR, Midlam JK, et al: A comparison of ritalin and adderall: efficacy and time-course in children with attention-deficit/hyperactivity disorder. Pediatrics 1999; 103(4):1-14
67. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1315

68. Snyder SH, Pert CB, & Posternak GW: The opiate receptor. *Ann Intern Med* 1976; 81:534-540
69. Way EL & Adler TK: The pharmacologic implications of the fate of morphine and its surrogates. *Pharmacol Rev* 1960; 12:383
70. Clark E, Plint AC, Correll R, et al: A randomized, controlled trial of acetaminophen, ibuprofen, and codeine for acute pain relief in children with musculoskeletal trauma. *Pediatrics* 2007; 119(3):460-467
71. Product Information: Brevital(R), methohexital. Eli Lilly and Company, Indianapolis, IN, 2001
72. Gilman AG, Goodman LS, & Gilman A Gilman AG, Goodman LS, & Gilman A (Eds): *The Pharmacological Basis of Therapeutics*, 6th. Macmillan Publishing Co, New York, 1980
73. Smith MC: The dextrans. *Am J Hosp Pharm* 1965; 22:273-275
74. Product Information: NEMBUTAL(R) injection solution, phenobarbital sodium injection solution. Ovation Pharmaceuticals, Deerfield, IL, 2005
75. Meyler L (Ed): *Meyler's side effects of Drugs*, V, Excerpta medica, Amsterdam, 1966
76. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: *Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material*. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1408
77. Mikkelsen B & Birket-Smith E: A clinical study of the benzodiazepine RO5-4023 (clonazepam) in the treatment of epilepsy. *Acta Neurol Scand* 1973; 49(suppl 53):91-96
78. Pereira JK, Burrows PE, Richards HM, et al: Comparison of sedation regimens for pediatric outpatient CT. *Pediatr Radiol* 1993; 23:341-344
79. Product Information: ADDERALL(R) oral tablets, dextroamphetamine saccharate, amphetamine aspartate monohydrate, dextroamphetamine sulfate, amphetamine sulfate oral tablets. Shire US Inc, Wayne, PA, 2006
80. AMA Department of Drugs AMA Department of Drugs: *AMA Drug Evaluations*, 6th. American Medical Association, Chicago, IL, 1986
81. Franklin RB, Dring LG, & Williams RT: The metabolism of phenmetrazine in man and laboratory animals. *Drug Metab Dispos* 1977; 5:223-233
82. Product Information: Preludin(R), phenmetrazine. Boehringer Ingelheim Pharmaceuticals, Inc., Ridgefield, CT, 1991
83. Dobrescu D & Cicotti A: Antagonistic effect of propranolol upon secondary actions of phenmetrazine. *Curr Ther Res* 1970; 12:446-450
84. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: *Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material*. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1430

85. Flemenbaum A: Methylphenidate: a catalyst for the tricyclic antidepressants?. *Am J Psychiatry* 1971a; 128:239
86. Kornhaber A: Obesity-depression: clinical evaluation with a new anorexigenic agent. *Psychosomatics* 1973; 14:162-167
87. Product Information: Brevital(R), methohexital. Eli Lilly and Company, Indianapolis, IN, 2001
88. Harvey SC: Hypnotics and sedatives In: Harvey SC: Goodman & Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics, 7th. Macmillan Publishing Company, New York, 1985
89. AHFS: American Hospital Formulary Service Drug Information 88, American Society of Hospital Pharmacists, Bethesda, MD, 1988
90. Morgan NR, Waugh TR, & Boback MD: Volkmann's ischemic contracture after intra-arterial injection of secobarbital. *JAMA* 1970; 212:476
91. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1553
92. Birket-Smith E & Mikkelsen B: Preliminary observations on the effect of a new benzodiazepine (RO-5-4023) in epilepsy. *Acta Neurol Scand* 1972; 48(suppl):385-395
93. Sjoqvist F & Lasagna L: The hypnotic efficacy of doxylamine. *Clin Pharmacol Ther* 1967; 8:48-54
94. Product Information: Halcion(R) triazolam. Upjohn Laboratories, Kalamazoo, MI, 1994
95. Costa E Silva JA, Acioli A, Naylor C, et al: Midazolam and triazolam in out-patients: a double-blind comparison of hypnotic efficacy. *Br J Clin Pharmacol* 1983; 16:179S-183S
96. Wincor MZ: Insomnia and the new benzodiazepines. *Clin Pharm* 1982; 1:425-431
97. Anon: Breastfeeding and Maternal Medication. World Health Organization, Geneva, Switzerland, 1995
98. Muzet A, Johnson LC, & Spinweber CL: Benzodiazepine hypnotics increase heart rate during sleep. *Sleep* 1982; 5:256-261
99. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1662
100. Greenblatt DJ, Abernethy DR, Divoll M, et al: Noninteraction of temazepam and cimetidine. *J Pharm Sci* 1984; 73:399-401
101. Smirne S, Cassano GB, Ferrillo F, et al: Brotizolam versus triazolam for the treatment of insomnia in anxious patients. *Curr Ther Res* 1993; 53:9-17
102. Product Information: Avinza(TM), morphine sulfate extended release capsules.

- Ligand Pharmaceuticals Incorporated, San Diego, CA, 2002.
103. Snyder SH, Pert CB, & Posternak GW: The opiate receptor. *Ann Intern Med* 1976; 81:534-540
 104. Way EL & Adler TK: The pharmacologic implications of the fate of morphine and its surrogates. *Pharmacol Rev* 1960; 12:383
 105. Product Information: Codeprex(TM) Pennkinetic(R), codeine polistirex and chlorpheniramine polistirex. Celltech Pharmaceuticals, Inc., Rochester, NY, 2004
 106. Jasinski DR, Martin WR, & Hoeldtke R: Studies of the dependence-producing properties of GPA-1657, profadol, and propiram in man. *Clin Pharmacol Ther* 1971; 12:613
 107. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;845
 108. Product Information: Versed(R), midazolam HCl injection. Roche Pharmaceuticals, Nutley, NJ, 2000
 109. Clark E, Plint AC, Correll R, et al: A randomized, controlled trial of acetaminophen, ibuprofen, and codeine for acute pain relief in children with musculoskeletal trauma. *Pediatrics* 2007; 119(3):460-467
 110. Anon: Breastfeeding and Maternal Medication. World Health Organization, Geneva, Switzerland, 1995
 111. Waltzman ML: Flunitrazepam(sic): a review of "roofies.". *Pediatr Emerg Care* 1999; 15(1):59-60
 112. Mattila MAK & Larni HM: Flunitrazepam: a review of its pharmacological properties and therapeutic use. *Drugs* 1980; 20:353-374
 113. Mattila MAK, Martikainen P, & Saila K: Flunitrazepam compared with althesin as an induction agent in balanced anaesthesia. *Br J Anaesth* 1977; 49:1041-1046
 114. Nitenberg A, Marty J, Blanchet F, et al: Effects of flunitrazepam on left ventricular performance, coronary haemodynamics and myocardial metabolism in patients with coronary artery disease. *Br J Anaesth* 1983; 55:1179-1184
 115. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1044
 116. Abernethy DR, Greenblatt DJ, Steel K, et al: Impairment of hepatic drug oxidation by propoxyphene. *Ann Intern Med* 1982a; 97:223-224
 117. Ahmad F, Rittmeyer P, Goetzke E, et al: Brotizolam as a pre-operative hypnotic. *Br J Clin Pharmacol* 1983; 16:419S-423S
 118. Schlessler JL (Ed): *Drugs Available Abroad*, Gale Research Inc, Detroit, MI, 1991
 119. Crippa O, Poletini A & Avato FM: Lethal poisoning by zipeprol in drug addicts. *J Forensic Sci* 1990; 992-999, 1990

120. Constantin M & Pognat JF: Zipeprol metabolism in man and in the animal. *Arzneimittelforschung* 1978; 64-72, 1978
121. Reynolds JEF (ed): *Martindale: The Extra Pharmacopoeia* (electronic version). Micromedex, Inc. Denver, CO. 1994
122. Tempesta E, Janiri L, Mannelli P, et al: Clinical reports on recent abuse of an antitussive (letter). *Br J Addiction* 1990; 85:815-816
123. Canada JR: *USP dictionary of USAN and international drug names 1998*, The United States Pharmacopoeial Convention Inc, Rockville, MD, 1997, pp 403
124. Reich DL & Silvay G: Ketamine: an update on the first twenty-five years of clinical experience. *Can J Anaesth* 1989b; 36:186-197
125. Grant IS, Nimmo WS, & Clements JA: Pharmacokinetics and analgesic effects of IM and oral ketamine. *Br J Anaesth* 1981; 53:805-810
126. AMA Department of Drugs: *Drug Evaluations Subscription*, American Medical Association, Chicago, IL, 1991b
127. White PF, Dworsky WA, Horai Y, et al: Comparison of continuous infusion fentanyl or ketamine versus thiopental - determining the mean effective serum concentrations for outpatient surgery. *Anesthesiology* 1983; 59:564-569
128. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: *Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material*. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1152
129. Toft P & Helbo-Hansen S: Interaction of ketamine with atracurium. *Br J Anaesth* 1989; 62:319-320
130. Ozbek H, Bilen A, Ozcengiz D, et al: The comparison of caudal ketamine, alfentanil and ketamine plus alfentanil administration for postoperative analgesia in children. *Paediatr Anaesth* 2002; 12(7):610-616
131. Product Information: *Paracodin(R), dihydrocodeine*. Knoll AG, Ludwigshafen, 1996a
132. Chan GLC & Matzke GR: Effects of renal insufficiency on the pharmacokinetics and pharmacodynamics of opioid analgesics. *Drug Intell Clin Pharm* 1987; 21:773-783
133. Rowell FJ, Seymour RA, & Rawlins MD: Pharmacokinetics of intravenous and oral dihydrocodeine and its acid metabolites. *Eur J Clin Pharmacol* 1983; 25:419-424
134. Park GR, Shelly MP, Quinn K, et al: Dihydrocodeine--a reversible cause of renal failure?. *Eur J Anaesthesiol* 1989; 6:303-314
135. Palmer RN, Eade OE, O'Shea PJ, et al: Incidence of unwanted effects of dihydrocodeine bitartrate in healthy volunteers. *Lancet* 1966; 2(464):620-621
136. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: *Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material*. 3rd ed.

- Pharmaceutical Press, 2004;919
137. Product Information: Avinza(TM), morphine sulfate extended release capsules. Ligand Pharmaceuticals Incorporated, San Diego, CA, 2002
 138. Habib S, Matthews RW, Scully C, et al: A study of the comparative efficacy of four common analgesics in the control of postsurgical dental pain. *Oral Surg Oral Med Oral Pathol* 1990; 70:559-563
 139. Drug Enforcement Administration. National Drug Intelligence Center 2001
 140. "2C-B (Nexus) Reappears on the Club Drug Scene". National Drug Intelligence Center 2006
 141. Carmo H, Hengstler JG, de Boer D, et al: Metabolic pathways of 4-bromo-2,5-dimethoxyphenethylamine (2C-B): analysis of phase I metabolism with hepatocytes of six species including human. *Toxicology* 2005; 206:75-89.
 142. Pelham WE, Aronoff HR, Midlam JK, et al: A comparison of ritalin and adderall: efficacy and time-course in children with attention-deficit/hyperactivity disorder. *Pediatrics* 1999; 103(4):1-14
 143. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004
 144. Evans SM, Troisi JR II, & Griffiths RR: Tandospirone and alprazolam: comparison of behavioral effects and abuse liability in humans. *J Pharmacol Exp Ther* 1994; 271:683-694
 145. Product Information: Demerol(R), meperidine hydrochloride. Sanofi-Synthelabo Inc., New York, NY, 2002
 146. Pyke RE & Greenberg HS: Double-blind comparison of alprazolam and adinazolam for panic and phobic disorders. *J Clin Psychopharmacol* 1989; 9:15-21
 147. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;600
 148. Gilman AG, Rall TW, Nies AS, et al Gilman AG, Rall TW, Nies AS, et al (Eds): Goodman and Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics, 8th. Pergamon Press, New York, NY, 1990.
 149. Product Information: AMYTAL(R) SODIUM injection, amobarbital sodium injection. Ranbaxy, Princeton, NJ, 2003
 150. McCarron MM, Schulze BW, & Walberg CB: Short acting barbiturate overdose. Correlation of intoxication score with serum barbiturate concentration. *JAMA* 1982; 248:55-61.
 151. Guenther Skokan E, Junkins EP, & Corneli HM: Taste test: children rate flavoring agents used with activated charcoal. *Arch Pediatr Adolesc Med* 2001;

- 155:683-686.
152. Dagnone D, Matsui D, & Rieder MJ: Assessment of the palatability of vehicles for activated charcoal in pediatric volunteers. *Pediatr Emerg Care* 2002; 18:19-21.
 153. Product Information: Alprazolam Intensol(TM), alprazolam oral solution. Roxane Laboratories, Inc, Columbus, OH, USA, 2000
 154. Evans SM, Troisi JR II, & Griffiths RR: Tandospirone and alprazolam: comparison of behavioral effects and abuse liability in humans. *J Pharmacol Exp Ther* 1994; 271:683-694
 155. Product Information: XANAX XR(R) extended release oral tablets, alprazolam extended release oral tablets. Pharmacia & Upjohn, Kalamazoo, MI, 2003
 156. Kolin IS & Linet OI: Double-blind comparison of alprazolam and diazepam for subchronic withdrawal from alcohol. *J Clin Psychiatry* 1981; 42:169-174
 157. Product Information: Xanax(R), alprazolam. Pharmacia & Upjohn Company, Kalamazoo, MI, 1997
 158. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;605
 159. Product Information: Demerol(R), meperidine hydrochloride. Sanofi-Synthelabo Inc., New York, NY, 2002
 160. Pyke RE & Greenberg HS: Double-blind comparison of alprazolam and adinazolam for panic and phobic disorders. *J Clin Psychopharmacol* 1989; 9:15-21
 161. Product Information: TENUATE(R) oral immediate-release tablet, TENUATE(R) DOSPAN(R) oral controlled-release tablet, diethylpropion hydrochloride oral immediate-release tablet, diethylpropion controlled-release tablet. Merrell Pharmaceuticals, Inc, Bridgewater, NJ, 2003
 162. Gilman AG, Goodman LS, & Rall TW: *The Pharmacological Basis of Therapeutics*, 7th. Macmillan Publishing Co, New York, NY, 1985
 163. Beckett AH & Stanojcic M: Re-evaluation of the metabolism and excretion of diethylpropion in non-sustained and sustained release formulations. *J Pharm Pharmacol* 1987; 39:409-415
 164. Product Information: DEXEDRINE(R) sustained-release oral capsules, oral tablets, dextroamphetamine sulfate sustained-release oral capsules, oral tablets. GlaxoSmithKline, Research Triangle Park, NC, 2006
 165. Schreiber EC, Min BH, Zeiger AV, et al: Metabolism of diethylpropion hydrochloride-1-C(14) by the human. *J Pharmacol Exp Ther* 1968; 159:372-378
 166. Doglas JG & Munro JF: The role of drugs in the treatment of obesity. *Drugs* 1981; 21:362-373
 167. Product Information: ADDERALL(R) oral tablets, dextroamphetamine saccharate,

- amphetamine aspartate monohydrate, dextroamphetamine sulfate, amphetamine sulfate oral tablets. Shire US Inc, Wayne, PA, 2006
168. Soma LR, Rudy JA, Uboh CE, Xu F, Snapp HM. Pharmacokinetics and effects of aminorex in horses. *Am J Vet Res.* 2008 May;69(5):675
 169. Kornhaber A: Obesity-depression: clinical evaluation with a new anorexigenic agent. *Psychosomatics* 1973; 14:162-167
 170. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;670
 171. Gilman AG, Rall TW, Nies AS, et al Gilman AG, Rall TW, Nies AS, et al (Eds): Goodman and Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics, 8th. Pergamon Press, New York, NY, 1990.
 172. Product Information: AMYTAL(R) SODIUM injection, **amobarbital** sodium injection. Ranbaxy, Princeton, NJ, 2003
 173. McCarron MM, Schulze BW, & Walberg CB: Short acting barbiturate overdose. Correlation of intoxication score with serum barbiturate concentration. *JAMA* 1982; 248:55-61.
 174. Guenther Skokan E, Junkins EP, & Corneli HM: Taste test: children rate flavoring agents used with activated charcoal. *Arch Pediatr Adolesc Med* 2001; 155:683-686.
 175. Dagnone D, Matsui D, & Rieder MJ: Assessment of the palatability of vehicles for activated charcoal in pediatric volunteers. *Pediatr Emerg Care* 2002; 18:19-21.
 176. Product Information: DIDREX(R) oral tablet, benzphetamine hydrochloride oral tablet. Pharmacia & Upjohn Company, Kalamazoo, MI, 2003.
 177. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;683
 178. Kolecki P: Inadvertent methamphetamine poisoning in pediatric patients. *Ped Emerg Care* 1998; 14:385-387.
 179. Rappley MD: Safety issues in the use of methylphenidate. *Drug Saf* 1997; 17:143-148
 180. Reynolds JEF (Ed): Martindale: The Extra Pharmacopoeia, (electronic version). Micromedex, Inc. Denver, CO. 1990a
 181. Mao CC, Marco E, Revuelta A, et al: The turnover rate of gamma - aminobutyric acid in the nuclei of telencephalon: implications in the pharmacology of antipsychotics and of a minor tranquilizer. *Biol Psychiatry* 1977; 12:359-371
 182. Raaflaub J & Speiser-Couroisier J: Pharmacokinetics of Bromazepam in Men. *Arzneim Forsch* 1974; 24:1841-1
 183. Montandon A & Halpern A: Treatment of functional disorders of patients of a

- medical outpatient department with bromazepam in a single daily dose. *Ther Umsch* 1977; 34:701-707
184. De Geyter J, Dumont E, & Steiner P: Clinical assay of a new tranquilizer, Lexotan, in the treatment of neurotic troubles. *Sem Hop Ther* 1975; 51:247-252
 185. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;708
 186. Greenblatt DJ, Abernethy DR, Divoll M, et al: Noninteraction of temazepam and cimetidine. *J Pharm Sci* 1984; 73:399-401
 187. Bertolino A, Mastucci E, Porro V, et al: Etizolam in the treatment of generalized anxiety disorder: a controlled clinical trial. *J Int Med Res* 1989; 17:455-460
 188. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;683
 189. Gilman AG, Rall TW, Nies AS, et al Gilman AG, Rall TW, Nies AS, et al (Eds): Goodman and Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics, 8th. Pergamon Press, New York, NY, 1990
 190. Product Information: AMYTAL(R) SODIUM injection, amobarbital sodium injection. Ranbaxy, Princeton, NJ, 2003
 191. McCarron MM, Schulze BW, & Walberg CB: Short acting barbiturate overdose. Correlation of intoxication score with serum barbiturate concentration. *JAMA* 1982; 248:55-61
 192. Guenther Skokan E, Junkins EP, & Corneli HM: Taste test: children rate flavoring agents used with activated charcoal. *Arch Pediatr Adolesc Med* 2001; 155:683-686
 193. Dagnone D, Matsui D, & Rieder MJ: Assessment of the palatability of vehicles for activated charcoal in pediatric volunteers. *Pediatr Emerg Care* 2002; 18:19-21
 194. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;738
 195. Mao CC, Marco E, Revuelta A, et al: The turnover rate of gamma - aminobutyric acid in the nuclei of telencephalon: implications in the pharmacology of antipsychotics and of a minor tranquilizer. *Biol Psychiatry* 1977; 12:359-371
 196. Raaflaub J & Speiser-Couroisier J: Pharmacokinetics of Bromazepam in Men. *Arzneim Forsch* 1974; 24:1841-1
 197. Montandon A & Halpern A: Treatment of functional disorders of patients of a medical outpatient department with bromazepam in a single daily dose. *Ther Umsch* 1977; 34:701-707
 198. De Geyter J, Dumont E, & Steiner P: Clinical assay of a new tranquilizer, Lexotan,

- in the treatment of neurotic troubles. *Sem Hop Ther* 1975; 51:247-252
199. Greenblatt DJ, Abernethy DR, Divoll M, et al: Noninteraction of temazepam and cimetidine. *J Pharm Sci* 1984; 73:399-401
200. Bertolino A, Mastucci E, Porro V, et al: Etizolam in the treatment of generalized anxiety disorder: a controlled clinical trial. *J Int Med Res* 1989; 17:455-460
201. Study RE & Barker JL: Cellular mechanism of benzodiazepines action. *JAMA* 1982; 247:2147-2151
202. Baskin SI & Esdale A: Is chlordiazepoxide the rational choice among benzodiazepines?. *Pharmacotherapy* 1982; 2:110-119
203. Product Information: chlordiazepoxide hydrochloride oral capsule usp, chlordiazepoxide hydrochloride oral capsule usp. Watson Laboratories, Inc, Corona, CA, 2003
204. Blair HM III: Fixed drug eruption from chlordiazepoxide. *Arch Dermatol* 1974; 109:914
205. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;775
206. Abernethy DR, Greenblatt DJ, Steel K, et al: Impairment of hepatic drug oxidation by propoxyphene. *Ann Intern Med* 1982a; 97:223-224.
207. McLendon DM & Fabre LF: A double-blind comparison of the anxiolytic efficacy of alprazolam and chlordiazepoxide hydrochloride in the chronic withdrawal period from alcohol. *Curr Ther Res* 1979; 26:430-439
208. Franceschi M, Ferin-Strambi L, Mastrangelo M, et al: Clobazam in drug-resistant and alcohol withdrawal seizures. *Clin Trials J* 1983a; 20:119-125
209. Fielding S & Hoffman I: Pharmacology of antianxiety drugs with special reference to clobazam. *Br J Clin Pharmacol* 1979; 7:7S-15S
210. Rupp W, Badian M, Christ O, et al: Pharmacokinetics of single and multiple doses of clobazam in humans. *Br J Clin Pharmacol* 1979; 7:51S-57S
211. Lapierre YD, Tremblay A, Gagnon A, et al: A therapeutic and discontinuation study of clobazam and diazepam in anxiety neurosis. *J Clin Psychiatry* 1982; 43:372-374
212. Brogden RN, Heel RC, Speight TM, et al: Clobazam: A review of its pharmacological properties and therapeutic use in anxiety. *Drugs* 1980; 20:161-178
213. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;820
214. Product Information: Versed(R), midazolam HCl injection. Roche Pharmaceuticals, Nutley, NJ, 2000

215. Castillo A, Sotillo C, & Mariategui J: Alprazolam compared to clobazam and placebo in anxious outpatients. *Neuropsychobiology* 1987; 18:189-194
216. Budavari S (Ed): *The Merck Index: An encyclopedia of chemicals, drugs, and biologicals*, 12th. Merck & Co., Inc., Whitehouse Station, NJ, USA, 1996
217. Freeman S: The realities of clonazepam discontinuation. *Psychiatr Serv* 1997; 48:881-882
218. Pacifici GM, Viani A, Rizzo G, et al: Plasma protein binding of clonazepam in hepatic and renal insufficiency and after hemodialysis. *Ther Drug Monit* 1987; 9:369-373
219. Product Information: KILONOPIN(R) Oral Tablet, KILONOPIN(R) WAFER orally disintegrating tablet, clonazepam oral tablet, orally disintegrating tablet. Roche Laboratories Inc, Nutley, NJ, 2001
220. Lund M: Clonazepam in the treatment of epilepsy. *Acta Neurol Scand* 1973; 49(suppl 53):82
221. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: *Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material*. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;829
222. Abernethy DR, Greenblatt DJ, Steel K, et al: Impairment of hepatic drug oxidation by propoxyphene. *Ann Intern Med* 1982a; 97:223-224
223. Tesar GE, Rosenbaum JF, Pollack MH, et al: Clonazepam versus alprazolam in the treatment of panic disorder: interim analysis of data from a prospective, double-blind, placebo-controlled trial. *J Clin Psychiatry* 1987; 48:16-21
224. Bianchi C, Airaud CB, & Gayte-Sorbier A: Sorption studies of chlorazepate dipotassium salt (Tranxene(R)) and midazolam hydrochloride (Hypnovel(R)) in polyvinylchloride and glass infusion containers. *J Clin Pharm Ther* 1992; 17:23-228
225. AMA Department of DrugsAMA Department of Drugs: *AMA Drug Evaluations*, 5th. American Medical Association, Chicago, 1983
226. Bertler A, Lindgren S, Magnusson J-O, et al: Intramuscular bioavailability of clorazepate as compared to diazepam. *Eur J Clin Pharmacol* 1985; 28:229-230
227. Product Information: TRANXENE(R) Oral Tablet, clorazepate dipotassium oral tablet. Abbott Laboratories, North Chicago, IL, 2002
228. Torras H, Mascaro JM Jr, & Mascaro JM: Photo-onycholysis caused by clorazepate dipotassium. *J Am Acad Dermatol* 1989; 21:1304-1305
229. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: *Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material*. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;836
230. Abernethy DR, Greenblatt DJ, Divoll M, et al: Prolongation of drug half-life due to obesity: studies of desmethyldiazepam (chlorazepate). *J Pharm Sci* 1982b;

71:942-944

231. Musch B, Morselli PL, & Priore P: Clinical studies with the new anxiolytic alpidem in anxious patients: an overview of the European experiences. *Pharmacol Biochem Behav* 1988; 29:803-806
232. Cerimele D, Tulli A, & Rauco M: Valutazione dell'efficacia e tollerabilità del clotiazepam nella terapia della componente ansiosa di pazienti psoriasici. *J Ital Dermatol Venereol* 1993; 128:31-36
233. Haefely W: Synaptic pharmacology of barbiturates and benzodiazepines. *Agents Actions* 1977; 7:353-359
234. Arendt R, Ochs HR, & Greenblatt DJ: Electron capture GLC analysis of the thienodiazepine clotiazepam. *Arzneimittelforschung* 1982; 32:453-455
235. Cerimele D, Tulli A, & Rauco M: Valutazione dell'efficacia e tollerabilità del clotiazepam nella terapia della componente ansiosa di pazienti psoriasici. *J Ital Dermatol Venereol* 1993; 128:31-36
236. Garcia F, Blanco JG, Marcos ML, et al: Systemic reaction to clotiazepam. *Allergy* 1997; 52:784-786
237. Ochs HR, Greenblatt DJ, & Knuchel M: Effect of cirrhosis and renal failure on the kinetics of clotiazepam. *Eur J Clin Pharmacol* 1986; 30:89-92
238. Martucci N, Manna V, & Agnoli A: A clinical and neurophysiological evaluation of clotiazepam, a new thienodiazepine derivative. *Int Clin Psychopharmacol* 1987; 2:121-128
239. Cerimele D, Tulli A, & Rauco M: Valutazione dell'efficacia e tollerabilità del clotiazepam nella terapia della componente ansiosa di pazienti psoriasici. *J Ital Dermatol Venereol* 1993; 128:31-36
240. Haefely W: Synaptic pharmacology of barbiturates and benzodiazepines. *Agents Actions* 1977; 7:353-359
241. Garcia F, Blanco JG, Marcos ML, et al: Systemic reaction to clotiazepam. *Allergy* 1997; 52:784-786
242. Ochs HR, Greenblatt DJ, & Knuchel M: Effect of cirrhosis and renal failure on the kinetics of clotiazepam. *Eur J Clin Pharmacol* 1986; 30:89-92
243. Martucci N, Manna V, & Agnoli A: A clinical and neurophysiological evaluation of clotiazepam, a new thienodiazepine derivative. *Int Clin Psychopharmacol* 1987; 2:121-128
244. Sennesael J, Verbeelen D, Vanhaelst, et al: Pharmacokinetics of intravenous and oral chlordesmethyldiazepam in patients on regular haemodialysis. *Eur J Clin Pharmacol* 1991; 41:65-68
245. Bareggi SR, Nielsen NP, Leva S, et al: Age-related multiple-dose pharmacokinetics and anxiolytic effects of delorazepam (chlordesmethyldiazepam). *Int J Clin Pharm Res* 1986a; 6:309-314

246. Conti I, Tridico RS, & Caccia S: Effect of chronic oral delorazepam on in vitro and in vivo hepatic drug- metabolizing enzyme activities in the rat. *Res Comm Chem Pathol Pharmacol* 1990; 67:87-99
247. Product Information En(R), 1998
248. Bertin I, Colombo G, Furlanut M, et al: Double-blind placebo cross-over study of long-acting (chlordesmethyldiazepam) versus short-acting (lorazepam) benzodiazepines in generalized anxiety disorders. *Int J Clin Pharm Res* 1989; 9:203-208
249. Ishihara K, Kushida J, Yuzurihara M, et al: Interaction of drugs and Chinese herbs: pharmacokinetic changes of tolbutamide and diazepam caused by extract of *Angelica dahurica*. *J Pharm Pharmacol* 2000; 52(8):1023-1029
250. D'Eramo C, Stocchetti N, Iacovelli W, et al: Control of the side effects of ketamine: chlordesmethyldiazepam vs diazepam in pre-anaesthesia. *Minerva Anesthesiologica* 1989; 55:413-417
251. Product Information: DARVON(R) oral capsules, propoxyphene hcl oral capsules. aai Pharma, Wilmington, NC, 2003
252. Wang RIH, Kochar C, Hasegawa AT, et al: Propoxyphene napsylate compared to methadone for opiate dependence. *Psychopharmacology* 1981; 75:335-338
253. Pearson RM: Pharmacokinetics of propoxyphene. *Hum Toxicol* 1984; 3:37S-40
254. Product Information: DARVON-N(R) oral tablet, propoxyphene napsylate oral tablet. AAI Pharma, Wilmington, NC, 2003
255. Almirall J, Montoliu J, Torras A, et al: Propoxyphene-induced hypoglycemia in a patient with chronic renal failure. *Nephron* 1989; 53:273-275
256. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: *Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material*. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;892
257. Orme M, Breckenridge A, & Cook P: Warfarin and distalgesic interaction. *Br Med J* 1976; 1:200
258. Bloomfield SS, Barden TP, & Mitchell J: Nefopam and propoxyphene in episiotomy pain. *Clin Pharm Therap* 1980; 27:502-507
259. Product Information: VALIUM(R) oral tablets, diazepam oral tablets. Roche Laboratories Inc, Nutley, NJ, 2000
260. Foreman PA: Control of the anxiety/pain complex in dentistry. *Oral Surg Oral Med Oral Path* 1974; 37:337-349
261. Locniskar A, Greenblatt DJ, Harmatz JS, et al: Interaction of diazepam with famotidine and cimetidine, two H₂-receptor antagonists. *J Clin Pharmacol* 1986; 26:299-303
262. Product Information: Diazepam Autoinjector injection solution , diazepam injection solution. Meridian Medical Technologies Inc, Columbia, MD, 2003

263. Donaldson D & Gibson G: Systemic complications with intravenous diazepam. *Oral Surg Oral Med Oral Pathol* 1980; 49:126-130
264. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;897
265. Product Information: Demerol(R), meperidine hydrochloride. Sanofi-Synthelabo Inc., New York, NY, 2002
266. Rickels D, Case WG, Downing RW, et al: Long-term diazepam therapy and clinical outcome. *JAMA* 1983a; 250:767-771
267. Product Information: ProSom(TM), estazolam tablets. Abbott Laboratories, North Chicago, IL, USA, 2004
268. Richter JJ: Current theories about mechanism of benzodiazepines in neuroleptic drugs. *Anesthesiology* 1981; 54:66-72
269. Gustavson LE & Carrigan PJ: The clinical pharmacokinetics of single doses of estazolam. *Am J Med* 1990; 88(Suppl 3A):S2-S5
270. Anon: American academy of pediatrics committee on drugs: transfer of drugs and other chemicals into human milk. *Pediatrics* 2001; 108(3):776-789
271. Product Information: ProSom(R), estazolam. Abbott Laboratories, Abbott Park, IL, 1996
272. Product Information: Demerol(R), meperidine hydrochloride. Sanofi-Synthelabo Inc., New York, NY, 2002
273. Cohn JB, Wilcox CS, Bremner J, et al: Hypnotic efficacy of estazolam compared with flurazepam in outpatients with insomnia. *J Clin Pharmacol* 1991; 31:747-750
274. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;992
275. Product Information: Placidyl(R), ethchlorvynol. Abbott Laboratories, Chicago, IL, 1990
276. Reynolds JEF (ed): Martindale: The Extra Pharmacopoeia, (electronic version). Micromedex, Inc. Denver, CO. 1990
277. Welch LT, Bower JD, Ott CE, et al: Oil dialysis for ethchlorvynol intoxication. *Clin Pharmacol Ther* 1972; 13:745-749
278. Bennett WA & 1987: Drug prescribing in renal failure: dosing guidelines in adults., *Am Coll Phys*, Philadelphia, PA., 1987
279. Product Information: Placidyl(R), ethchlorvynol. Abbott Laboratories, Chicago, IL, 1990
280. Miller KS & Sahn SA: Bilateral exudative pleural effusions following intravenous ethchlorvynol administration. *Chest* 1989; 95:464-465
281. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs

- and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;992
282. Product Information: Demerol(R), meperidine hydrochloride. Sanofi-Synthelabo Inc., New York, NY, 2002
283. Bailey DN & Shaw RF: Ethchlorvynol ingestion in San Diego county: a 14-year review of cases with blood concentrations and findings. *J Anal Toxicol* 1990; 14:348-352
284. S Sweetman : Martindale: The Complete Drug Reference. Pharmaceutical Press. London, UK (Internet Version). Edition expires 2001; provided by Thomson MICROMEDEX, Greenwood Village, CO
285. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;993
286. Product Information: Valmid(R), ethinamate. Dista Products Company, Indianapolis, IN, 1988.
287. Gilman AG, Rall TW, Nies AS, et al Gilman AG, Rall TW, Nies AS, et al (Eds): Goodman and Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics, 8th. Pergamon Press, New York, NY, 1990a.
288. Product Information: Valmid(R), ethinamate. Dista Products Company, Indianapolis, IN, 1988b
289. Reynolds JEF (Ed): Martindale: The Extra Pharmacopoeia (CD-ROM Version). Micromedex, Inc, 1989, 1989.
290. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;993
291. JEF Reynolds : Martindale: The Extra Pharmacopoeia (CD-ROM Version). The Pharmaceutical Press. London, UK (Internet Version). Edition expires 1989; provided by Thomson Healthcare Inc., Greenwood Village, CO.
292. Alaspaa AO, Kuisma MJ, Hoppu K, et al: Out-of-hospital administration of activated charcoal by emergency medical services. *Ann Emerg Med* 2005; 45:207-12.
293. Kamijo Y, Hayashi I, Nishikawa T, Yoshimura K, Soma K. Pharmacokinetics of the active metabolites of ethyl loflazepate in elderly patients who died of asphyxia associated with benzodiazepine-related toxicity. *J Anal Toxicol*. 2005 Mar;29(2):140-4.
294. Richter JJ: Current theories about mechanism of benzodiazepines in neuroleptic drugs. *Anesthesiology* 1981; 54:66-72
295. Gustavson LE & Carrigan PJ: The clinical pharmacokinetics of single doses of estazolam. *Am J Med* 1990; 88(Suppl 3A):S2-S5

296. Anon: American academy of pediatrics committee on drugs: transfer of drugs and other chemicals into human milk. *Pediatrics* 2001; 108(3):776-789
297. Product Information: ProSom(R), estazolam. Abbott Laboratories, Abbott Park, IL, 1996
298. Product Information: Demerol(R), meperidine hydrochloride. Sanofi-Synthelabo Inc., New York, NY, 2002
299. Cohn JB, Wilcox CS, Bremner J, et al: Hypnotic efficacy of estazolam compared with flurazepam in outpatients with insomnia. *J Clin Pharmacol* 1991; 31:747-750
300. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1022
301. Soma LR, Rudy JA, Uboh CE, Xu F, Snapp HM. Pharmacokinetics and effects of aminorex in horses. *Am J Vet Res.* 2008 May;69(5):675
302. Kornhaber A: Obesity-depression: clinical evaluation with a new anorexigenic agent. *Psychosomatics* 1973; 14:162-167
303. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1029
304. Richter JJ: Current theories about mechanism of benzodiazepines in neuroleptic drugs. *Anesthesiology* 1981; 54:66-72
305. Anon: American academy of pediatrics committee on drugs: transfer of drugs and other chemicals into human milk. *Pediatrics* 2001; 108(3):776-789
306. Wilder-Smith OHG, Ravussin PA, Decosterd LA, et al: Midazolam premedication and thiopental induction of anaesthesia: interactions at multiple end-points. *Br J Anaesth* 1999; 83:590-595.
307. Pons P, Cason D, & American College of Emergency Physicians (Eds): *Paramedic Field Care: A Complaint-Based Approach*, Mosby, St Louis, MO, 1997.
308. Pyke RE & Greenberg HS: Double-blind comparison of alprazolam and adinazolam for panic and phobic disorders. *J Clin Psychopharmacol* 1989; 9:15-21
309. Baselt RC & Cravey RH: *Disposition of Toxic Drugs and Chemicals in Man*, 3rd ed. Year Book Medical Publishers, Chicago, IL, 1989
310. Greenblatt DJ, Abernethy DR, Koepke HH, et al: Interaction of cimetidine with oxazepam, lorazepam, and flurazepam. *J Clin Pharmacol* 1984a; 24:187-193
311. Cooper SF & Drolet D: Protein binding of flurazepam and its major metabolites in plasma. *Curr Ther Res* 1982; 32(5):757-760
312. Product Information: DALMANE(R) oral capsule, flurazepam hydrochloride oral capsule. ICN Pharmaceuticals, Costa Mesa, CA, 2001
313. Muzet A, Johnson LC, & Spinweber CL: Benzodiazepine hypnotics increase heart

- rate during sleep. *Sleep* 1982; 5(3):256-261
314. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: *Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material*. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1054
 315. Abernethy DR, Greenblatt DJ, Steel K, et al: Impairment of hepatic drug oxidation by propoxyphene. *Ann Intern Med* 1982; 97:223-224
 316. Linnoila M, Erwin CW, & Logue PE: Efficacy and side effects of flurazepam and a combination of amobarbital and secobarbital in insomniac patients. *J Clin Pharm* 1980a; 20:117-123
 317. Product Information: Paxipam(R), halazepam. Schering Corp, Kenilworth, NJ, 1990
 318. Schallek W, Horst WD, & Schlosser W Schallek W, Horst WD, & Schlosser W: *Mechanisms of action of benzodiazepines*, *Advances in Pharmacology and Chemotherapy*, Academic Press, New York, 1979
 319. Itil TM, Shrivastava RK, Collins DM, et al: A double-blind study comparing the efficacy and safety of a single bedtime dose of halazepam with clorazepate and placebo in anxious outpatients. *Curr Ther Res* 1983a; 34:441-452
 320. Griffiths RR & Wolf B: Relative abuse liability of different benzodiazepines in drug abusers. *J Clin Psychopharmacol* 1990; 10:237-243
 321. Fann WE, Garcia J, & Richman BW: High-dose benzodiazepine therapy in hospitalized anxious patients. *J Clin Pharmacol* 1983; 23:100-105
 322. Richter JJ: Current theories about mechanism of benzodiazepines in neuroleptic drugs. *Anesthesiology* 1981; 54:66-72
 323. Anon: American academy of pediatrics committee on drugs: transfer of drugs and other chemicals into human milk. *Pediatrics* 2001; 108(3):776-789
 324. Wilder-Smith OHG, Ravussin PA, Decosterd LA, et al: Midazolam premedication and thiopental induction of anaesthesia: interactions at multiple end-points. *Br J Anaesth* 1999; 83:590-595.
 325. Pons P, Cason D, & American College of Emergency Physicians (Eds): *Paramedic Field Care: A Complaint-Based Approach*, Mosby, St Louis, MO, 1997.
 326. Pyke RE & Greenberg HS: Double-blind comparison of alprazolam and adinazolam for panic and phobic disorders. *J Clin Psychopharmacol* 1989; 9:15-21
 327. Personal Communication: Monte S Cohon, Pharm D, Manager, Drug Information Services, The Upjohn Company, Kalamazoo, MI. Monte S Cohon, Pharm D, Manager, Drug Information Services, The Upjohn Company, Kalamazoo, MI, May, 1990a
 328. Cohn JB & Gottschalk LA: Double-blind comparison of ketazolam and placebo using once-a-day dosing. *J Clin Pharmacol* 1980; 20:676-680.

329. Deberdt R: Ketazolam (Solatran), an open study of once-a day treatment in ambulatory patients with anxiety. *J Int Med Res* 1981; 9:69-73.
330. Basmajian JV, Shankardass K, & Russell D: Ketazolam once daily for spasticity: double-blind cross-over study. *Arch Phys Med Rehabil* 1986; 67:556-557.
331. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: *Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material*. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004
332. Product Information: Demerol(R), meperidine hydrochloride. Sanofi-Synthelabo Inc., New York, NY, 2002.
333. Pons P, Cason D, & American College of Emergency Physicians (Eds): *Paramedic Field Care: A Complaint-Based Approach*, Mosby, St Louis, MO, 1997
334. Pyke RE & Greenberg HS: Double-blind comparison of alprazolam and adinazolam for panic and phobic disorders. *J Clin Psychopharmacol* 1989; 9:15-21
335. Mannelli P, Janiri L, De Marinis M, Tempesta E. Lefetamine: new abuse of an old drug--clinical evaluation of opioid activity
336. Product Information: Demerol(R), meperidine hydrochloride. Sanofi-Synthelabo Inc., New York, NY, 2002
337. Lifshitz M, Gavrilov V, & Galil A: A four year survey of neonatal narcotic withdrawal: evaluation and treatment. *Israel Med Assoc J* 2001; 3:17-20
338. Product Information: Sonin(R), loprozalam. Lipha Arzneimittel GmbH & Co, Darmstadt, 1997
339. Mendelson WB & Jain B: An assessment of short-acting hypnotics. *Drug Safety* 1995; 13:257-270
340. Bareggi SR, Pirola R, Truci G, et al: Effect of after-dinner administration on the pharmacokinetics of oral flunitrazepam and loprozalam. *J Clin Pharmacol* 1988; 28:371-375
341. Clark BG, Jue SG, Dawson GW, et al: Loprozalam, a preliminary review of its pharmacodynamic and pharmacokinetic properties and therapeutic efficacy in insomnia. *Drugs* 1986; 31:500-516
342. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: *Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material*. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004
343. Jussofie, SA, & Hiemke C: Kavapyrone enriched extract from Piper methysticum as modulator of the GABA binding site in different regions of rat brain. *Psychopharmacology (Berl)* 1994; 116:469-474
344. Pons P, Cason D, & American College of Emergency Physicians (Eds): *Paramedic Field Care: A Complaint-Based Approach*, Mosby, St Louis, MO, 1997
345. Pyke RE & Greenberg HS: Double-blind comparison of alprazolam and

- adinazolam for panic and phobic disorders. *J Clin Psychopharmacol* 1989; 9:15-21
346. Product Information: Ativan(R) Injection compatibility charts. Wyeth-Ayerst Laboratories, Philadelphia, PA, 1988.
347. Greenblatt DJ & Miller LG: Mechanism of the anticonvulsant action of benzodiazepines. *Cleve Clin J Med* 1990; 57:S6-S8.
348. Hardman JG, Gilman AG, & Limbird LE (Eds): Goodman and Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics, 9th. McGraw-Hill, New York, NY, 1996.
349. Product Information: ATIVAN(R) oral tablets, lorazepam oral tablets. Biovail Pharmaceuticals, Inc, Bridgewater, NJ, 2007.
350. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004
351. Product Information: lorazepam powder for solution injection, lorazepam powder for solution injection. Hospira, Inc., Lake Forest, IL, 2005.
352. Pons P, Cason D, & American College of Emergency Physicians (Eds): Paramedic Field Care: A Complaint-Based Approach, Mosby, St Louis, MO, 1997.
353. Pyke RE & Greenberg HS: Double-blind comparison of alprazolam and adinazolam for panic and phobic disorders. *J Clin Psychopharmacol* 1989; 9:15-21
354. Product Information: Loretam(R), lormetazepam. Wyeth Pharma GmbH, Muenster, 1992.
355. Greenblatt DJ, Divoll M, Abernethy DR, et al: Clinical pharmacokinetics of the newer benzodiazepines. *Clin Pharmacokinet* 1983; 8:233-252.
356. Hildebrand M, Hellstern A, Huempel M, et al: Plasma levels and urinary excretion of lormetazepam in patients with liver cirrhosis and in healthy volunteers. *Eur J Drug Metab Pharmacokinet* 1990; 15:19-26.
357. Heidrich H, Ott H, & Beach RC: Lormetazepam - a benzodiazepine derivative without hangover effect? A double-blind study with chronic insomniacs in a general practice setting. *Int J Clin Pharmacol Ther Toxicol* 1981; 19:11-19.
358. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004
359. Product Information: Versed(R), midazolam HCl injection. Roche Pharmaceuticals, Nutley, NJ, 2000.
360. Pons P, Cason D, & American College of Emergency Physicians (Eds): Paramedic Field Care: A Complaint-Based Approach, Mosby, St Louis, MO, 1997.
361. Pyke RE & Greenberg HS: Double-blind comparison of alprazolam and adinazolam for panic and phobic disorders. *J Clin Psychopharmacol* 1989;

9:15-21

362. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1200
363. AMA Department of Drugs: Drug Evaluations Subscription, American Medical Association, Chicago, IL, 1993
364. Dugger HA & Heider JG: Biotransformation of mazindol. II. Absorption and excretion in the dog and man. *Drug Metab Dispos* 1979; 7:129-131
365. Dugger HA, Madrid VO, Talbot KC, et al: Biotransformation of mazindol. III. Comparison of metabolism in rat, dog, and man. *Drug Metab Dispos* 1979; 7:132-137
366. Product Information: Sanorex(R), mazindol tablets. Sandoz Pharmaceuticals, East Hanover, NJ, USA, 1999
367. Nishikawa T, Iizuka T, Omura M, et al: Effect of mazindol on body weight and insulin sensitivity in severely obese patients after a very-low-calorie diet therapy. *Endocrine J* 1996; 43:671-677
368. Li JH, Hu HC, Chen WB, et al: Genetic toxicity of methamphetamine in vitro and in human abusers. *Environ Mol Mutagen* 2003; 42:233-242
369. Hung Y & Chang J: Weight-reducing regimen associated with polymorphic ventricular tachycardia. *Am J Emerg Med* 2006; 24(6):714-716
370. ABDA-Datenbank: Medazepam monograph. WuV, Eschborn and Micromedex, Inc, 1996.
371. Hailey DM & Baird ES: Plasma concentrations of medazepam and its metabolites after oral administration. *Br J Anaesth* 1979; 51:493-496.
372. Jochemsen R & Breimer DD: Pharmacokinetics of benzodiazepines: metabolic pathways and plasma level profiles. *Curr Med Res Opin* 1984; 8(suppl 4):60-79.
373. Anon: Systematic review of the benzodiazepines. Guidelines for data sheets on diazepam, chlordiazepoxide, medazepam, clorazepate, lorazepam, oxazepam, temazepam, triazolam, nitrazepam, and flurazepam. *Br J Med* 1980; 280:910-912.
374. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004
375. Wilder-Smith OHG, Ravussin PA, Decosterd LA, et al: Hypnotic and anaesthetic action of thiopentone and midazolam alone and in combination. *Br J Anaesth* 1999; 83:590-595.
376. Pons P, Cason D, & American College of Emergency Physicians (Eds): Paramedic Field Care: A Complaint-Based Approach, Mosby, St Louis, MO, 1997.
377. Pyke RE & Greenberg HS: Double-blind comparison of alprazolam and adinazolam for panic and phobic disorders. *J Clin Psychopharmacol* 1989;

9:15-21

378. Product Information: ADDERALL(R) oral tablets, dextroamphetamine saccharate, amphetamine aspartate monohydrate, dextroamphetamine sulfate, amphetamine sulfate oral tablets. Shire US Inc, Wayne, PA, 2006
379. Soma LR, Rudy JA, Uboh CE, Xu F, Snapp HM. Pharmacokinetics and effects of aminorex in horses. *Am J Vet Res.* 2008 May;69(5):675
380. Kornhaber A: Obesity-depression: clinical evaluation with a new anorexigenic agent. *Psychosomatics* 1973; 14:162-167
381. Product Information: Miltown(R), Meprobamate. Wallace Laboratories, Cranbury, NJ, 2001b.
382. Bissada NK, Finkbeiner AE, & Welch LT: Uro pharmacology: X. Central nervous system stimulants and depressants. *Urology* 1979; 13:464-473
383. Bennett WM, Aronoff GR, Golper TA, et al Bennett WM, Aronoff GR, Golper TA, et al: Drug Prescribing In Renal Failure, 3rd. American College of Physicians, Philadelphia, PA, 1994
384. Product Information: Miltown(R), Meprobamate. Wallace Laboratories, Cranbury, NJ, 2001b
385. Barkin RL & Stein ZLG: Withdrawal symptoms in a postoperative patient. *Hosp Pract* 1992; 27:106-108
386. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1216
387. Reeves R & Mack J: Possible dangerous interaction of oxycontin and carisoprodol (letter). *Am Fam Phys* 2003; June 1:2273
388. Charron C, Mekontso-Dessap A, Chergui K, et al: Incidence, causes and prognosis of hypotension related to meprobamate poisoning. *Intensive Care Med* 2005; 31:1582-1586
389. Tasdemir HA, Yildiran A, & Islek I: Haemoperfusion may be useful in phenprobamate and polypharmacy intoxication of paediatric patients (letter). *Nephrol Dial Transplant* 2002; 17:941
390. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1222
391. Product Information: Matulane(R), procarbazine hydrochloride. Sigma-Tau Pharmaceuticals, Inc., Gaithersburg, MD, 2002
392. Product Information: Mebaral(R), mephobarbital. Winthrop Laboratories, New York, NY, 1988
393. Hooper WD, Kunze HE, & Eadie MJ: Pharmacokinetics and bioavailability of methylphenobarbital in man. *Ther Drug Monit* 1981; 3:39-44

394. Product Information: Nipolept(R), zotepine. Klinge Pharma GmbH, Munich, Germany, 1994
395. Heinonen OP, Slone D, & Shapiro S: Heinonen OP, Slone D, & Shapiro S: Birth Defects and Drugs in Pregnancy, Publishing Sciences Group, Inc, Littleton, MA, 1977
396. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1262
397. Birket-Smith E & Mikkelsen B: Preliminary observations on the effect of a new benzodiazepine (RO-5-4023) in epilepsy. *Acta Neurol Scand* 1972; 48(suppl):385-395
398. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1266
399. Gilman AG, Rall TW, Nies AS, et al: Gilman AG, Rall TW, Nies AS, et al (Eds): Goodman and Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics, 8th. Pergamon Press, New York, NY, 1990.
400. Product Information: AMYTAL(R) SODIUM injection, amobarbital sodium injection. Ranbaxy, Princeton, NJ, 2003
401. McCarron MM, Schulze BW, & Walberg CB: Short acting barbiturate overdose. Correlation of intoxication score with serum barbiturate concentration. *JAMA* 1982; 248:55-61.
402. Guenther Skokan E, Junkins EP, & Corneli HM: Taste test: children rate flavoring agents used with activated charcoal. *Arch Pediatr Adolesc Med* 2001; 155:683-686.
403. Dagnone D, Matsui D, & Rieder MJ: Assessment of the palatability of vehicles for activated charcoal in pediatric volunteers. *Pediatr Emerg Care* 2002; 18:19-21.
404. Product Information: midazolam hcl syrup, midazolam hcl syrup. Paddock Laboratories, Minneapolis, MN, 2004.
405. Fragen RJ, Funk DI, Avram MJ, et al: Midazolam versus hydroxyzine as intramuscular premedicant. *Can Anaesth Soc J* 1983; 30:136.
406. Shelly MP, Sultan MA, Bodenham A, et al: Midazolam infusions in critically ill patients. *Eur J Anaesthesiol* 1991; 8:21-27.
407. Roelofse JA, Van Der Bijl P, Stegmann DH, et al: Preanesthetic medication with rectal midazolam in children undergoing dental extractions. *J Oral Maxillofac Surg* 1990; 48:791-796.
408. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1283

409. Wilder-Smith OHG, Ravussin PA, Decosterd LA, et al: Hypnotic and anaesthetic action of thiopentone and midazolam alone and in combination. *Br J Anaesth* 1999; 83:590-595.
410. Pons P, Cason D, & American College of Emergency Physicians (Eds): *Paramedic Field Care: A Complaint-Based Approach*, Mosby, St Louis, MO, 1997.
411. Pyke RE & Greenberg HS: Double-blind comparison of alprazolam and adinazolam for panic and phobic disorders. *J Clin Psychopharmacol* 1989; 9:15-21
412. Chima P & Beaumont G: Transfer of long term insomniac nitrazepam users to lormetazepam. *Br J Clin Pract* 1986; 40:140-144.
413. Johns MW: Sleep and hypnotic drugs. *Drugs* 1975; 9:448-478.
414. Breimer DD: Pharmacokinetics and metabolism of various benzodiazepines used as hypnotics. *Br J Clin Pharmacol* 1979; 8:7S-13S.
415. Adam K & Oswald I: A comparison of the effects of chlormezanone and nitrazepam on sleep. *Br J Clin Pharmacol* 1982; 14:57-65.
416. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: *Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material*. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1343
417. Wilder-Smith OHG, Ravussin PA, Decosterd LA, et al: Hypnotic and anaesthetic action of thiopentone and midazolam alone and in combination. *Br J Anaesth* 1999; 83:590-595.
418. Pons P, Cason D, & American College of Emergency Physicians (Eds): *Paramedic Field Care: A Complaint-Based Approach*, Mosby, St Louis, MO, 1997.
419. Pyke RE & Greenberg HS: Double-blind comparison of alprazolam and adinazolam for panic and phobic disorders. *J Clin Psychopharmacol* 1989; 9:15-21.
420. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: *Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material*. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004
421. Johns MW: Sleep and hypnotic drugs. *Drugs* 1975; 9:448-478.
422. Breimer DD: Pharmacokinetics and metabolism of various benzodiazepines used as hypnotics. *Br J Clin Pharmacol* 1979; 8:7S-13S.
423. Wilder-Smith OHG, Ravussin PA, Decosterd LA, et al: Hypnotic and anaesthetic action of thiopentone and midazolam alone and in combination. *Br J Anaesth* 1999; 83:590-595.
424. Pons P, Cason D, & American College of Emergency Physicians (Eds): *Paramedic Field Care: A Complaint-Based Approach*, Mosby, St Louis, MO, 1997.
425. Pyke RE & Greenberg HS: Double-blind comparison of alprazolam and adinazolam for panic and phobic disorders. *J Clin Psychopharmacol* 1989;

- 9:15-21.
426. 中華藥典第四版,578
 427. Product Information: B & O SUPPRETTES(R) powdered, powdered opium and belladonna extract. Poly Medica Pharmaceuticals Incorporated, Woburn, MA, 1993.
 428. Product Information: B & O SUPPRETTES(R) powdered, powdered opium and belladonna extract. Poly Medica Pharmaceuticals Incorporated, Woburn, MA, 1993.
 429. Olin BR (Ed): Drug Facts and Comparisons, Facts and Comparisons, St Louis, Missouri, 1990.
 430. Product Information: Pantopon(R), anhydrous morphine and secondary opium alkaloids. Roche, Nutley, NJ, 1990.
 431. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1303
 432. Product Information: Demerol(R), meperidine hydrochloride. Sanofi-Synthelabo Inc., New York, NY, 2002
 433. Lifshitz M, Gavrilov V, & Galil A: A four year survey of neonatal narcotic withdrawal: evaluation and treatment. Israel Med Assoc J 2001; 3:17-20.
 434. Darke S, Hall W, & Kaye S: Hair morphine concentrations of fatal heroin overdose cases and living heroin users. Addiction 2002; 97:977-984.
 435. Product Information: Serax(R), oxazepam. Faulding Laboratories Inc and Wyeth-Ayerst Laboratories, Philadelphia, PA, USA, 2000.
 436. Schallek W, Horst WD, & Schlosser W: Schallek W, Horst WD, & Schlosser W: Mechanisms of action of benzodiazepines, in Advances in Pharmacology and Chemotherapy, Academic Press, New York, NY, 1979.
 437. Sonne J, Andreasen PB, Loft S, et al: Glucuronidation of oxazepam is not spared in patients with hepatic encephalopathy. Hepatology 1990a; 11:951-956.
 438. Krischer J, Prins C, Ruffieux P, et al: Extensive fixed drug eruption induced by oxazepam. Arch Dermatol 1996; 132:718.
 439. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004,1375
 440. Wilder-Smith OHG, Ravussin PA, Decosterd LA, et al: Hypnotic and anaesthetic action of thiopentone and midazolam alone and in combination. Br J Anaesth 1999; 83:590-595.
 441. Pons P, Cason D, & American College of Emergency Physicians (Eds): Paramedic Field Care: A Complaint-Based Approach, Mosby, St Louis, MO, 1997.
 442. Pyke RE & Greenberg HS: Double-blind comparison of alprazolam and

- adinazolam for panic and phobic disorders. *J Clin Psychopharmacol* 1989; 9:15-21.
443. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: *Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material*. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004
444. Johns MW: Sleep and hypnotic drugs. *Drugs* 1975; 9:448-478.
445. Breimer DD: Pharmacokinetics and metabolism of various benzodiazepines used as hypnotics. *Br J Clin Pharmacol* 1979; 8:7S-13S.
446. Wilder-Smith OHG, Ravussin PA, Decosterd LA, et al: Hypnotic and anaesthetic action of thiopentone and midazolam alone and in combination. *Br J Anaesth* 1999; 83:590-595.
447. Pons P, Cason D, & American College of Emergency Physicians (Eds): *Paramedic Field Care: A Complaint-Based Approach*, Mosby, St Louis, MO, 1997.
448. Pyke RE & Greenberg HS: Double-blind comparison of alprazolam and adinazolam for panic and phobic disorders. *J Clin Psychopharmacol* 1989; 9:15-21.
449. Hogan V: Pemoline (Cylert(R)): market withdrawal. *Can Med Assoc J* 2000a; 162(1):106.
450. Product Information: Cylert(R), pemoline tablets and chewable tablets. Physician's Desk Reference (electronic version), MICROMEDEX, Inc, Englewood, CO, 1999.
451. Page JG: Pemoline (Cylert(R)) in the treatment of childhood hyperkinesis. *J Learning Disabilities* 1974; 7:42.
452. Product Information: Cylert. Abbott, US, 96.
453. Collier CP, Soldin SJ, Swanson JM, et al: Pemoline pharmacokinetics and long term therapy in children with attention deficit disorder and hyperactivity. *Clin Pharmacokinet* 1985; 10:269-278.
454. Product Information: Cylert(R), pemoline. Abbott Laboratories, Abbott Park, IL, 1999a.
455. Anon: FDC Reports: Abbott Cyclert boxed warning for liver failure added - The Pink Sheet. : T&G9, January 27, 1997.
456. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: *Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material*. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1400
457. Cortes-Belen E, Suvak MK, & Benitez JG: Clenbuterol overdose in a young female. *J Tox-Clin Tox* 1998; 36:510-511.
458. Olin B: *Facts and Comparisons*, Facts and Comparisons, Inc, St. Louis, MO, 1995.
459. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: *Clarke's analysis of drugs*

- and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1423
460. AMA Department of DrugsAMA Department of Drugs: AMA Drug Evaluations, 6th. American Medical Association, Chicago, IL, 1986.
 461. Beckett AH & Raisi A: Bioavailability in man of phendimetrazine from various dosage forms. *J Pharm Pharmacol* 1976; 28:900-902.
 462. Product Information: Plegine(R) phendimetrazine tartrate. Wyeth-Ayerst Laboratories, Philadelphia, PA, 98a
 463. Rostagno C, Caciolli S, Felici M, et al: Dilated cardiomyopathy associated with chronic consumption of phendimetrazine. *Am Heart J* 1996; 131:407-409.
 464. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1423
 465. Krolecki P: Inadvertent methamphetamine poisoning in pediatric patients. *Ped Emerg Care* 1998; 14:385-387.
 466. Phelps SJ & Cochran EB: Guidelines for Administration of Intravenous Medications to Pediatric Patients., 4th. American Society of Hospital Pharmacists, Bethesda, MD, 1993
 467. Gilman AG, Goodman LS, & Gilman AGilman AG, Goodman LS, & Gilman A (Eds): Goodman & Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics, 6th. Macmillan Publishing Co, New York, NY, 1980
 468. Nelson E, Powell JR, Conrad K, et al: Phenobarbital pharmacokinetics and bioavailability in adults. *J Clin Pharmacol* 1982; 22:141-148
 469. Smith DB, Mattson RH, Cramer JA, et al: Results of a nationwide Veterans Administration Cooperative Study comparing the efficacy and toxicity of carbamazepine, phenobarbital, phenytoin, and primidone. *Epilepsia* 1987; 28(suppl 3):S50-S58
 470. De Nicola LK & Hays DP: Phlebothrombosis as a complication of barbiturate-induced coma for neuroresuscitation. *Drug Intell Clin Pharm* 1981; 15:601-602
 471. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1431
 472. Udall JA: Clinical implications of warfarin interactions with five sedatives. *Am J Cardiol* 1975; 35:67-71
 473. Muittari A: Bronchodilator effect of oral salbutamol and of a low-ephedrine combination in asthmatic patients. *Curr Ther Res* 1978; 23:33-39
 474. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed.

- Pharmaceutical Press, 2004;1439
475. Product Information: Fastin(R), phentermine. SmithKline Beecham Pharmaceuticals, Philadelphia, PA, 1996.
 476. Product Information: Ionamin(R), phentermine. Medeva Pharmaceuticals, Rochester, NY, 99.
 477. Product Information: phentermine hcl oral capsules, phentermine hcl oral capsules. Sandoz, Inc, Princeton, NJ, 2006.
 478. Dahl CF & Allen MR: Regression and progression of valvulopathy associated with fenfluramine and phentermine (letter). *Ann Intern Med* 2002; 136(6):489.
 479. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1439
 480. Suchard J & Saba P: Recovery from severe hyperthermia (45 degrees C) and rhabdomyolysis after methamphetamine body-stuffing (abstract). *J Tox - Clin Tox* 1999; 36:646.
 481. Mark EJ, Patalas ED, Chang HT, et al: Fatal pulmonary hypertension associated with short-term use of fenfluramine and phentermine. *N Engl J Med* 1997a; 337:602-606.
 482. Product Information: Domar(R), pinazepam. Zambelletti Pharmaceuticals, Milan, Italy, 1999.
 483. Johns MW: Sleep and hypnotic drugs. *Drugs* 1975; 9:448-478.
 484. Janbroers JM: Pinazepam: review of pharmacological properties and therapeutic efficacy. *Clin Ther* 1984; 6(4):434-450.
 485. Maggini C, Guazzelli M, Mauri M et al: Valutazione degli effetti del pinazepam sul pattern di sonno e sulla performance di soggetti normali. *Soc Ital EEG Neurofis Clin* 1976; pp 609-618, 1976.
 486. Frison G, Tedeschi L, Maietti S, Ferrara SD. Determination of midazolam in human plasma by solid-phase microextraction and gas chromatography/mass spectrometry. *Rapid Commun Mass Spectrom*. 2001;15(24):2497-501.
 487. Wilder-Smith OHG, Ravussin PA, Decosterd LA, et al: Hypnotic and anaesthetic action of thiopentone and midazolam alone and in combination. *Br J Anaesth* 1999; 83:590-595.
 488. Pons P, Cason D, & American College of Emergency Physicians (Eds): *Paramedic Field Care: A Complaint-Based Approach*, Mosby, St Louis, MO, 1997.
 489. Pyke RE & Greenberg HS: Double-blind comparison of alprazolam and adiazolam for panic and phobic disorders. *J Clin Psychopharmacol* 1989; 9:15-21.
 490. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons: in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed.

- Pharmaceutical Press, 2004;1461
491. Kolecki P: Inadvertent methamphetamine poisoning in pediatric patients. *Ped Emerg Care* 1998; 14:385-387.
 492. Rostagno C, Caciolli S, Felici M, et al: Dilated cardiomyopathy associated with chronic consumption of phendimetrazine. *Am Heart J* 1996; 131:407-409
 493. Product Information: Centrax(R), prazepam. Parke-Davis, Morris Plains, NJ, 1990.
 494. Greenblatt DJ, Shader RI, & Abernethy DR: Current status of benzodiazepines. *N Engl J Med* 1983a; 309:354-358.
 495. Allen MD, Greenblatt DJ, Harmatz JS, et al: Single-dose kinetics of prazepam, a precursor of desmethyldiazepam. *J Clin Pharmacol* 1979; 19:445-450.
 496. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: *Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material*. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1470
 497. Wilder-Smith OHG, Ravussin PA, Decosterd LA, et al: Hypnotic and anaesthetic action of thiopentone and midazolam alone and in combination. *Br J Anaesth* 1999; 83:590-595.
 498. Pons P, Cason D, & American College of Emergency Physicians (Eds): *Paramedic Field Care: A Complaint-Based Approach*, Mosby, St Louis, MO, 1997.
 499. Pyke RE & Greenberg HS: Double-blind comparison of alprazolam and adinazolam for panic and phobic disorders. *J Clin Psychopharmacol* 1989; 9:15-21.
 500. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: *Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material*. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1497
 501. Gilman AG, Rall TW, Nies AS, et al Gilman AG, Rall TW, Nies AS, et al (Eds): *Goodman and Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics*, 8th. Pergamon Press, New York, NY, 1990
 502. Wesson DR: Propylhexdrine. *Drug Alcohol Depend* 1986; 17:273-278
 503. Product Information: DAYTRANA(TM) transdermal system, methylphenidate transdermal system. Shire US Inc., Wayne, PA, 2006
 504. Reynolds JEF (Ed): *Martindale: The Extra Pharmacopoeia (electronic version)*. Micromedex, Inc. Denver, CO. 1990
 505. Meltzer PC, Butler D, Deschamps JR, Madras BK.: 1-(4-Methylphenyl)-2-pyrrolidin-1-yl-pentan-1-one (Pyrovalerone) analogues: a promising class of monoamine uptake inhibitors. *J Med Chem* 2006; 49:1420-32
 506. Stotsky BA: Sodium butabarbital for emotional disorders and insomnia. *Dis Nerv Syst* 1972; 33:798-803
 507. Product Information: Butisol(R), butabarbital. Wallace Laboratories, Cranbury, NJ,

1994

508. Robinson AE & McDowall RD: The distribution of amylobarbitone, butobarbitone, pentobarbitone and quinalbarbitone and the hydroxylated metabolites in man. *J Pharm Pharmacol* 1979; 31:357-365
509. Stotsky BA, Cole JO, Tang YT, et al: Sodium butabarbital (butisol sodium) as an hypnotic agent for aged psychiatric patients with sleep disorders. *J Am Geriatr Soc* 1971; 19:860-870
510. Product Information: BUTISOL SODIUM(R)CIII oral tablets, solution, butabarbital sodium oral tablets, solution. MedPointe Pharmaceuticals, Somerset, NJ, 2007
511. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1552
512. Birket-Smith E & Mikkelsen B: Preliminary observations on the effect of a new benzodiazepine (RO-5-4023) in epilepsy. *Acta Neurol Scand* 1972; 48(suppl):385-395
513. Hindle TH III: Comparison of carisoprodol, butabarbital, and placebo in treatment of low back syndrome. *West J Med* 1972; 117:7-11
514. Product Information: RESTORIL(R) oral capsules, temazepam oral capsules. Mallinckrodt, St. Louis, MO, 2002.
515. Gilman AG, Goodman LS, & Gilman AG, Goodman LS, & Gilman A (Eds): Goodman and Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics, 6th. Macmillan Publishing Co, New York, NY, 1980.
516. Divoll M, Greenblatt DJ, Harmatz JS, et al: Effect of age and gender on disposition of temazepam. *J Pharm Sci* 1981; 70:1104-1107.
517. Product Information: Restoril(R), temazepam. Mallinckrodt Inc, St Louis, MO, 2002.
518. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1602
519. Wilder-Smith OHG, Ravussin PA, Decosterd LA, et al: Hypnotic and anaesthetic action of thiopentone and midazolam alone and in combination. *Br J Anaesth* 1999; 83:590-595.
520. Pons P, Cason D, & American College of Emergency Physicians (Eds): Paramedic Field Care: A Complaint-Based Approach, Mosby, St Louis, MO, 1997.
521. Pyke RE & Greenberg HS: Double-blind comparison of alprazolam and adinazolam for panic and phobic disorders. *J Clin Psychopharmacol* 1989; 9:15-21.
522. Product Information: Musaril(R), tetrazepam. Sanofi Winthrop GmbH, Munich,

1997

523. Keane PE, Simiand J, Morre M, et al: Tetrazepam: A benzodiazepine which dissociates sedation from other benzodiazepine activities. I. Psychopharmacological profile in rodents. *The Journal of Pharmacological and Experimental Therapeutics* 1988; 245:692-698
524. Baumgaertner MG, Cautreels W, & Langenbahn H: Biotransformation and pharmacokinetics of tetrazepam in man. *Arzneimittelforschung* 1984; 34:724-729
525. Collet E, Dalac S, Morvan C, et al: Tetrazepam allergy once more detected by patch test. *Contact Dermatitis* 1992; 26:281
526. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1614
527. Wilder-Smith OHG, Ravussin PA, Decosterd LA, et al: Hypnotic and anaesthetic action of thiopentone and midazolam alone and in combination. *Br J Anaesth* 1999; 83:590-595
528. Pons P, Cason D, & American College of Emergency Physicians (Eds): *Paramedic Field Care: A Complaint-Based Approach*, Mosby, St Louis, MO, 1997.
529. Pyke RE & Greenberg HS: Double-blind comparison of alprazolam and adinazolam for panic and phobic disorders. *J Clin Psychopharmacol* 1989; 9:15-21
530. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1702
531. Product Information: Butisol(R), butabarbital. Wallace Laboratories, Cranbury, NJ, 1994
532. Robinson AE & McDowall RD: The distribution of amylobarbitone, butobarbitone, pentobarbitone and quinalbarbitone and the hydroxylated metabolites in man. *J Pharm Pharmacol* 1979; 31:357-365
533. Birket-Smith E & Mikkelsen B: Preliminary observations on the effect of a new benzodiazepine (RO-5-4023) in epilepsy. *Acta Neurol Scand* 1972; 48(suppl):385-395
534. Hindle TH III: Comparison of carisoprodol, butabarbital, and placebo in treatment of low back syndrome. *West J Med* 1972; 117:7-11
535. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1717
536. Hajak G & Rodenbeck A: Clinical management of patients with insomnia: the role of zopiclone. *PharmacoEconomics* 1996; 10(suppl 1):29-38.
537. Gaillot J, Heusse D, Houghton G, et al: Pharmacokinetics and metabolism of

- zopiclone. *Pharmacology* 1983; 27(suppl 2):76-91
538. Houghton GW, Dennis MJ, Templeton R, et al: A repeated dose pharmacokinetic study of a new hypnotic agent, zopiclone (Imovane(R)). *Int J Clin Pharmacol Ther Toxicol* 1985; 23:97-100.
539. Goa KL & Heel RC: Zopiclone: a review of its pharmacodynamic and pharmacokinetic properties and therapeutic efficacy as an hypnotic. *Drugs* 1986; 32:48-65.
540. Kelly F, O'Grady J, & Champey Y: Zopiclone (letter). *Lancet* 1990; 335:1033-1034.
541. Fava GA: Amnestic syndrome induced by zopiclone (letter). *Eur J Clin Pharmacol* 1996; 50(6):509.
542. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1717
543. Product Information: Imovane(R), zopiclone. Aventis Pharmaceuticals, Inc, Quebec, Canada, 2000.
544. Product Information: Lunesta (TM), eszopiclone. Sepracor, Inc, Marlborough, MA, 2004.
545. Product Information: Mifeprex™, mifepristone. Danco Laboratories, New York, NY, 2000
546. Henshaw RC & Templeton AA: Mifepristone: separating fact from fiction. *Drugs* 1992; 44:531-536
547. Product Information: Mifeprex™, mifepristone.. Danco Laboratories, New York, NY, PI reviewed, 10/2000
548. Liu JH, Garzo VG, & Yen SSC: Pharmacodynamics of the antiprogestone RU486 in women after oral administration. *Fertil Steril* 1988; 50:245-249.
549. Kawai S, Nieman LK, Brandon DD, et al: Pharmacokinetic properties of the antigluco-corticoid and antiprogestone steroid RU 486 in man. *J Pharm Exp Ther* 1987; 241:401-406
550. Swahn ML, Wang G, Aedo AR, et al: Plasma levels of antiprogestin RU 486 following oral administration to non-pregnant and early pregnant women. *Contraception* 1986; 34:469-481
551. Product Information: MIFEPREX(R) oral tablets, mifepristone oral tablets. Danco Laboratories,LLC, New York, NY, 2005
552. Xiao BL, Herten H, Zhao H, et al: A randomized double-blind comparison of two single doses of mifepristone for emergency contraception. *Hum Reprod* 2002; 17(12):3084-3089
553. Product Information: Mifeprex®, mifepristone. Danco Laboratories, New York, NY, 2004

554. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1285
555. Anon : Dear Health Care Provider letter (mifepristone). Danco Laboratories. New York, NY. 2002
556. Martineau PA & Levental M: Large endometrial polyp in a patient on long-term mifepristone therapy. *J Ultrasound Med* 2000; 19:487-489
557. Reynolds: Martindale, the extra pharmacopeia 30th ed, The Pharmaceutical Press, London, England, 1993, pp 622
558. Besset A, Tafti M, Villemin E, et al: Effects of zolpidem on the architecture and cyclical structure of sleep in poor sleepers. *Drugs Exptl Clin Res* 1995; 21(4):161-169
559. Ascalone V, Flaminio L, Guinebault P, et al: Determination of zolpidem, a new sleep-inducing agent, and its metabolites in biological fluids: pharmacokinetics, drug metabolism and overdosing investigations in humans. *J Chromatogr* 1992; 581:237-250
560. Langtry HD & Benfield P: Zolpidem a review of its pharmacodynamic and pharmacokinetic properties and therapeutic potential. *Drugs* 1990a; 40:291-313.
561. Product Information: AMBIEN(R) Oral Tablet, zolpidem tartrate oral tablet. Sanofi-Synthelabo Inc, New York, NY, 2004
562. Pacifici GM, Viani A, Rizzo G, et al: Plasma protein binding of zolpidem in liver and renal insufficiency. *Int J Clin Pharmacol Ther Toxicol* 1988; 26:439-443
563. Pons G, Francoual C, Guillet P, et al: Zolpidem excretion in breast milk. *Eur J Clin Pharmacol* 1989b; 37:245-248
564. Product Information: AMBIEN CR(TM) oral tablets , zolpidem tartrate oral extended-release tablets. Sanofi-Synthelabo Inc, New York, NY, 2005.
565. Product Information: AMBIEN(R) Oral Tablet, zolpidem tartrate oral tablet. Sanofi-Synthelabo Inc, New York, NY, 2004
566. Product Information: Ambien(R), zolpidem. G D Searle and Company, Skokie, IL, 1999
567. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1715
568. Lheureux P, Debailleul G, & De Witte O: Zolpidem intoxication mimicking narcotic overdose: response to flumazenil. *Human Exp Toxicol* 1990; 9:105-107
569. Canada: USP dictionary of USAN and international drug names 1998, The United States Pharmacopeial Convention, Rockville, MD, 1997, pp 482.
570. Lyons TJ & French J: Modafinil: the unique properties of a new stimulant. *Aviat Space Environ Med* 1991; 62:432-435

571. Product Information: Provigil(R), modafinil tablets. Cephalon, Inc, West Chester, PA, 1998b.
572. Moachon G, Kanmacher I, Clenet M, et al: Pharmacokinetic profile of modafinil. *Drugs Today* 1996; 32(suppl I):23-33.
573. McClellan KJ & Spencer CM: Modafinil: a review of its pharmacology and clinical efficacy in the management of narcolepsy. *CNS Drugs* 1998; 9(4):311-324.
574. Product Information: Provigil(R), modafinil. Cephalon, Inc., West Chester, PA, 2004.
575. Product Information: PROVIGIL(R) oral tablets, modafinil oral tablets. Cephalon, Inc, Frazer, PA, 2007.
576. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1294
577. Product Information: Provigil(R), modafinil. Cephalon, Inc., West Chester, PA, 2004.
578. Fleeger CA: USP dictionary of USAN and International drug names., The United States Pharmacopeial Convention, Inc., Rockville, MD, 1995, pp 114.
579. Product Information: Stadol(R), butorphanol. Bristol-Meyers Squibb Company, Princeton, NJ, 1996.
580. Vachharajani NN, Shyu C, & Barbhaiya RH: Pharmacokinetic interaction between butorphanol nasal spray and oral metoclopramide in healthy women. *J Clin Pharmacol* 1997; 37:979-985
581. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;732
582. Product Information: Avinza(TM), morphine sulfate extended release capsules. Ligand Pharmaceuticals Incorporated, San Diego, CA, 2002
583. Lifshitz M, Gavrillov V, & Galil A: A four year survey of neonatal narcotic withdrawal: evaluation and treatment. *Israel Med Assoc J* 2001; 3:17-20
584. Umbricht A, Montoya ID, & Hoover DR: Naltrexone shortened opioid detoxification with buprenorphine. *Drug Alcohol Depend* 1999; 56:181-190
585. Rostagno C, Caciolli S, Felici M, et al: Dilated cardiomyopathy associated with chronic consumption of phendimetrazine. *Am Heart J* 1996; 131:407-409
586. Fleeger: USP dictionary of USAN and international drug names 1997, The United States Pharmacopeial Convention, Rockville, MD, 1996, pp 715
587. Shipton EA: Tramadol - present and future. *Anaesth Intensive Care* 2000; 28:363-374
588. Product Information: tramadol hydrochloride extended-release tablet, tramadol

- hydrochloride extended-release tablet. Bioavail Laboratories International SRL, Mississauga, Canada, 2005
589. Product Information: ULTRAM(R) oral tablets, tramadol hydrochloride oral tablets. Ortho-McNeil Pharmaceutical Inc, Raritan, NJ, 2007
590. Product Information: ULTRAM(R) ER oral extended-release tablets, tramadol HCl oral extended-release tablets. PriCara, Raritan, NJ, 2008.
591. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1654
592. Garrett PM: Tramadol overdose and serotonin syndrome manifesting as acute right heart dysfunction. *Anaesth Intensive Care* 2004; 32:575-577
593. PDR : The Physician's Desk Reference, (CD-ROM version). Medical Economics Inc. Montvale, NJ (Internet Version). Edition expires 1995; provided by Thomson Healthcare Inc., Greenwood Village, CO.
594. Anon: Warning issued about street drugs containing botanical sources of ephedrine. *JAMA* 1996; 275:1533-1534
595. Gilman AG, Goodman LS, & Rall TW Gilman AG, Goodman LS, & Rall TW: The Pharmacological Basis of Therapeutics, 9th. Macmillan Publishing Co, New York, NY, 1990e
596. Baba S: Studies on the metabolism in man by use of 2H-labeled drug: quantitative determination of the metabolites of 1-ephedrine (arom-2(5)) in man. *J Pharm Soc Japan* 1972; 92:1569
597. Olin B (Ed): Facts and Comparisons, JB Lippincott Co, St Louis, MO, 1990a
598. Dukes MNG: Meyler's Side Effects of Drugs, 8, Excerpta Medica, New York, NY, 1975
599. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;978
600. Parr MJA & Willatts SM: Fatal theophylline poisoning with rhabdomyolysis. *Anaesthesia* 1991; 46:557-559
601. USPDI : Drug Information for the Health Care Professional, (Internet version). US Pharmacopeial Convention, Inc. Rockville, MD (Internet Version). Edition expires 2001; provided by Thomson Healthcare Inc., Greenwood Village, CO
602. Anon: American academy of pediatrics committee on drugs: transfer of drugs and other chemicals into human milk. *Pediatrics* 2001; 108(3):776-789
603. Product Information: ERGOTRATE(R) injection, ergonovine maleate injection. Pharmacist Pharmaceutical, LLC, Roanoke, VA, 2006
604. Olin B (Ed): Facts and Comparisons, JB Lippincott Co, St Louis, MO, 1990a
605. Perrin VL: Clinical pharmacokinetics of ergotamine in migraine and cluster headache. *Clin Pharmacokinet* 1985; 10:334-352
606. Browning DJ: Serious side effects of ergometrine and its use in routine obstetric

- practice. *Med J Aust* 1974; 1:957-958
607. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: *Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material*. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;982
608. Aeby A, Johansson AB, De Schuiteneer B, et al: *Methylergometrine Poisoning in Children: Review of 34 Cases*. *J Toxicol Clin Toxicol* 2003; 41(3):249-253
609. Dargaville PA & Campbell NT: *Overdose of ergometrine in the newborn infant: Acute symptomatology and long-term outcome*. *J Paediat. Child Health* 1998; 34:83-89
610. Fleeger CA: *USAN and the USP dictionary of drug names*, U.S. Pharmacopeial Convention, Inc, Rockville, MD, 1994.
611. Silberstein SD: *The pharmacology of ergotamine and dihydroergotamine. Headache*; 37(suppl 1)S15-S25, 1997.
612. Ibraheem JJ, Paalzow L, & Tfelt-Hansen P: *Kinetics of ergotamine after intravenous and intramuscular administration to migraine sufferers*. *Eur J Clin Pharmacol* 1982; 23:235-240.
613. Reynolds JEF (Ed): *Martindale: The Extra Pharmacopoeia, (CD-ROM Version)*, Micromedex, Inc, Denver, CO, 1990.
614. Gnecci-Ruscione T, Lorenzoni R, Anderson D, et al: *Effects of ergotamine on myocardial blood flow in migraineurs without evidence of atherosclerotic coronary artery disease*. *Am J Cardiol* 1998; 81:1165-1168.
615. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: *Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material*. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;982
616. Aeby A, Johansson AB, De Schuiteneer B, et al: *Methylergometrine Poisoning in Children: Review of 34 Cases*. *J Toxicol Clin Toxicol* 2003; 41(3):249-253
617. Dargaville PA & Campbell NT: *Overdose of ergometrine in the newborn infant: Acute symptomatology and long-term outcome*. *J Paediat. Child Health* 1998; 34:83-89
618. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: *Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material*. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1194
619. Gilman AG, Hardman JG, & Limbird LE: *Goodman and Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics*, 9th ed, McGraw-Hill, New York, NY, 1996
620. Ellenhorn MJ: *Medical Toxicology: Diagnosis and Treatment of Human Poisoning*, 2nd ed, Williams and Wilkins, Baltimore, MD, 1997
621. Haddad LM, Shannon MW, & Winchester JF: *Clinical Management of Poisoning and Drug Overdose*, 3rd ed, WB Saunders Co, Philadelphia, PA, 1998

622. Ellenhorn MJ & Barceloux DG: Medical Toxicology: Diagnosis and Treatment of Human Poisoning, Elsevier, New York, NY, 1988
623. Dargaville PA & Campbell NT: Overdose of ergometrine in the newborn infant: Acute symptomatology and long-term outcome. *J Paediat. Child Health* 1998; 34:83-89
624. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1258
625. Gilman AG, Goodman LS, & Rall TW Gilman AG, Goodman LS, & Rall TW: The Pharmacological Basis of Therapeutics, 9th. Macmillan Publishing Co, New York, NY, 1990e.
626. Baba S: Studies on the metabolism in man by use of 2H-labeled drug: quantitative determination of the metabolites of 1-ephedrine (arom-2(5)) in man. *J Pharm Soc Japan* 1972; 92:1569.
627. Olin B (Ed): Facts and Comparisons, JB Lippincott Co, St Louis, MO, 1990a.
628. Parr MJA & Willatts SM: Fatal theophylline poisoning with rhabdomyolysis. *Anaesthesia* 1991; 46:557-559.
629. USPDI : Drug Information for the Health Care Professional, (Internet version). US Pharmacopeial Convention, Inc. Rockville, MD (Internet Version). Edition expires 2001; provided by Thomson Healthcare Inc., Greenwood Village, CO
630. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed. Pharmaceutical Press, 2004;1444
631. Gilman AG, Rall TW, Nies AS, et al Gilman AG, Rall TW, Nies AS, et al (Eds): Goodman and Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics, 8th. Pergamon Press, New York, NY, 1990k.
632. Saltzman MB, Dolan MM, & Doyne N: Comparison of effects of two dosage regimens of phenylpropanolamine on blood pressure and plasma levels in normal subjects under steady-state conditions. *Drug Intell Clin Pharm* 1983; 17:746-750.
633. Conway EE, Walsh CA, & Palomba AL: Supraventricular tachycardia following the administration of phenylpropanolamine in an infant. *Pediatr Emerg Care* 1989; 5:173-174.
634. Parr MJA & Willatts SM: Fatal theophylline poisoning with rhabdomyolysis. *Anaesthesia* 1991; 46:557-559.
635. USPDI : Drug Information for the Health Care Professional, (Internet version). US Pharmacopeial Convention, Inc. Rockville, MD (Internet Version). Edition expires 2001; provided by Thomson Healthcare Inc., Greenwood Village, CO
636. Anthony C. Moffat, M. David Osselton, Brian Widdop: Clarke's analysis of drugs and poisons : in pharmaceuticals, body fluids and postmortem material. 3rd ed.

- Pharmaceutical Press, 2004;1504
637. Bye CE, Cooper J, Empey DW et al: Effects of pseudoephedrine and triprolidine, alone and in combination, on symptoms of the common cold. *Br Med J* 1980; p 189-190, 1980a
638. Roth RP, Cantekin EI, Bluestone CD, et al: Nasal decongestant activity of pseudoephedrine. *Ann Otol Rhinol Laryngol* 1977; 86:235-242.
639. MacMahon JR: Atrial fibrillation and sympathomimetics (letter). *J Pediatr* 1974; 84:613.
640. Parr MJA & Willatts SM: Fatal theophylline poisoning with rhabdomyolysis. *Anaesthesia* 1991; 46:557-559
641. USPDI : Drug Information for the Health Care Professional, (Internet version). US Pharmacopeial Convention, Inc. Rockville, MD (Internet Version). Edition expires 2001; provided by Thomson Healthcare Inc., Greenwood Village, CO
642. Teng SF, Wu SC, Liu C, Li JH, Chien CS. Characteristics and trends of 3,4-methylenedioxymethamphetamine (MDMA) tablets found in Taiwan from 2002 to February 2005. *Forensic Sci Int* 2006;161(2-3):202-8.
643. Leri F, Bruneau J, Stewart J. Understanding polydrug use: review of heroin and cocaine co-use. *Addiction* 2003;98(1):7-22.
644. Haroz R, Greenberg MI. Emerging drugs of abuse. *Med Clin North Am* 2005;89(6):1259-76.
645. Rimsza ME, Moses KS. Substance abuse on the college campus. *Pediatr Clin North Am* 2005;52(1):307-19, xii.
646. Parrott AC. MDMA in humans: factors which affect the neuropsychobiological profiles of recreational ecstasy users, the integrative role of bioenergetic stress. *J Psychopharmacol* 2006;20(2):147-63.
647. Schuster P, Lieb R, Lamertz C, Wittchen HU. Is the use of ecstasy and hallucinogens increasing Results from a community study. *Eur Addict Res* 1998;4(1-2):75-82.
648. Wolfe TR, Caravati EM. Massive dextromethorphan ingestion and abuse. *Am J Emerg Med* 1995;13(2):174-6.
649. Bem JL, Peck R. Dextromethorphan. An overview of safety issues. *Drug Saf* 1992;7(3):190-9.
650. Price LH, Lebel J. Dextromethorphan-induced psychosis. *Am J Psychiatry* 2000;157(2):304.

97 年度計畫執行成果報告表

(本資料須另附乙份於成果報告中)

計畫名稱	管制藥品第三、四級品項藥物之毒性研究資料彙整		
計畫編號	DOH97-NNB-1034	填寫日期	97 年 11 月 12 日
執行機構	臺北醫學大學 藥學系	計畫主持人	許秀蘊
計畫期程	<input checked="" type="checkbox"/> 一年期計畫； <input type="checkbox"/> 多年期計畫，共 _____ 年，本年度為第 _____ 年		
原計畫書擬達成目標	<p>本研究計畫主要以收集國內外相關調查研究文獻、資料庫、國內外網站、學術資料書籍等相關內容，分別進行屬於第三、四級管制藥品的藥物資料庫之建置。包括其物理、化學性質、藥理作用及機轉、藥物動力學之探索、用途用法及副作用、檢測分析方法、多重濫用評估、危害評估、醫療政策之因應等資料之分析整合，有助於研制或訂定管制藥品毒性分析評估的可行性指標及毒性檢測方法，成癮治療之方法與成效等，以充實國內資料彙整之完整性及建構更完整之政策與對策。</p>		
已達成目標及其他成果	<p>本計畫已達成目標及其他成果：</p> <ol style="list-style-type: none"> (1) 建立屬於第三、四級的管制藥品如 Benzodiazepine 類、Barbital 類與 Ephedrine 類藥物等之整合資料庫包括藥品基本性質、商品產品、臨床使用、毒性分析等，並可提供其他國家管理第三、四級的管制藥品之相關資訊。 (2) 提供國內產官學各機構對於第三、四級的管制藥品毒性研究發展、毒性評估的可行性指標及檢測方法，或臨床上因藥物併用產生交互作用之毒性評估模式的參考依據，以及劑量上之差異帶來醫療上多方面之用途，諸如性別、年齡、作用機轉等。 (3) 彙整所得之各濫用藥物品項及研究文獻，可有效且及時的反應在政策應用上，並可據以研訂管制藥品毒性評估的可行性指標及毒性檢測方法，或併用產生交互作用之毒性評估模式。取得彙整相關科學證據，進行管制藥品分級、宣導及戒治政策之應用。 		

(計畫主持人以條列方式逐項填寫，若篇幅不足，可另附頁說明)

97 年度計畫重要研究成果及對本局之具體建議

(本資料須另附乙份於成果報告中)

計畫編號：	DOH97-NNB-1034		
計畫名稱：	管制藥品第三、四級品項藥物之毒性研究資料彙整		
計畫主持人：	許秀蘊	執行單位：	臺北醫學大學 藥學系

1.本計畫之新發現或新發明

本計畫建立屬於第三、四級的管制藥品如 Benzodiazepine 類、Barbital 類與 Ephedrine 類藥物等之整合資料庫包括藥品基本性質、商品產品、臨床使用、毒性分析等，並可提供其他國家管理第三、四級的管制藥品之相關資訊。

2.本計畫對民眾具教育宣導之成果

本計畫彙整所得之於第三、四級的管制藥品各濫用藥物品項及研究文獻，可有效且及時的反應在政策應用上，並可據以研訂管制藥品毒性評估的可行性指標及毒性檢測方法，或併用產生交互作用之毒性評估模式。取得彙整相關科學證據，進行管制藥品分級、宣導及戒治政策之應用。

3.本計畫對醫藥衛生政策之具體建議

提供國內產官學各機構對於第三、四級的管制藥品毒性研究發展、毒性評估的可行性指標及檢測方法，或臨床上因藥物併用產生交互作用之毒性評估模式的參考依據，以及劑量上之差異帶來醫療上多方面之用途，諸如性別、年齡、作用機轉等。彙整所得之各濫用藥物品項及研究文獻，可有效且及時的反應在政策應用上，並可據以研訂管制藥品毒性評估的可行性指標及毒性檢測方法，或併用產生交互作用之毒性評估模式。有助於研制或訂定管制藥品毒性分析評估的可行性指標及毒性檢測方法，成癮治療之方法與成效等，以充實國內資料彙整之完整性及建構更完整之政策與對策。