

O.T.C. 抗酸藥之處方組成研究

兼論成藥管理規則

黎漢德

我國目前藥政甚為混亂，很多衛生法規都不能符合時代之要求，成藥管理規則也是其中之一。此規則於民國十九年四月二十八日公佈，曾於民國三十七年三月廿九日修正，但對成藥之定義以不確，認為係「藥料經加工調製，不用其原有名稱，明示效能，用法用量，不待醫師指示即供醫療病用之者」，如此，則任何藥品，不論其毒劇性如何，只要做成製劑(Dosage form)就是成藥了，在該規則之第七條，對成藥中摻入毒劇藥品，規定其量不得超過中華藥典對該藥規定劑量之三分之一，此亦不切實際的，因為很多藥物的劑量，其範圍甚為寬廣，可能用其三分之一仍會顯現強烈之作用，如強安神藥(Major Tranquillizer)中之Chlorpromazine，其治療劑量為10~100 mg，有時甚至可高至500mg一次；有些如用其劑量之三分之一，可能劑量過低而無效，就誤醫藥，甚或產生不良後果，如用化學治療藥以治療病，如劑量不足，不能在體內產生有效濃度時，不僅不能產生殺死或抑制病菌之功效，反會使病菌產生抗藥性，有害病人之治療，甚或危害整個社會而造成醫療上之大問題，故不可不慎重。

成藥應該係民間藥(Folkmedicine)，即指經驗相傳之丸、散、膏、丹等草藥，而非現代之藥劑，英美等國將藥物分為處方藥(Prescription drug)及非處方藥(Non-Prescription drug))，甚為合理，前者必須在醫師監督下使用，後者由於作用緩和安全，無須醫師監督使用，因非處方藥可由病人自行購買服用，法律上規定無須醫師之處方即可售賣，故又名櫃檯藥(Over-the-Counter drug)，自己治療(Autotherapy)，本

非善策，但對於不嚴重之病或身體不舒適，可減輕醫師業務之負擔，病人亦可減少因看病所耗去之金錢和時間，故價格在市場上日有增加，各藥廠亦多予研究，藥局亦常自己設計，以期供應，故成爲醫師之責任，根據美國FAD之規定，O.T.C.藥必須經過二年之毒性試驗，確實證明其自行服用(Self-medication)，不會產生毒害者；對於組成O.T.C.藥之成份亦有嚴格之限制，譬如，多種維生素藥劑(Multiple Vitamin Preparations)，係非處方藥如美國韋廉士公司之克補(Stresscap)，可是其中加有男、女之性激素，如所富靈(Gevrine)，在美國却爲處方用藥了，因男女性激素，如服用不當可損害肝臟，對若干女性更易引起乳癌，又如下面要研究之抗酸藥，如係由單純之胃酸鹽，弱鹼性藥物；鎂、鋁之化合物等組成，可以核准爲O.T.C.藥，但其中含有胆素能神經傳導阻斷藥，巴比特魯藥等劇藥時，則不能成爲O.T.C.藥，如克補治兒(Kofantyl)，在美國係處方藥，因其中含有Dicyclomine之故。

O.T.C. 抗酸藥根據美國藥事新聞(Drug Trade News)，每年銷售量爲八千六百五十萬美元，其中三千六百八十萬美元爲錠劑，三千六百萬美元爲液劑，五百九十萬美元爲散劑，本省雖未見有類此統計數字發表，但由各大藥傳播事業之廣告頻頻，也可見出社會對此類藥物之需要了。

抗酸藥之主要用途爲除去過多之胃酸，胃酸過多時，普通人稱之爲胃氣痛、心氣痛、酸胃或消化不良等。胃酸過多之原因有些是由於吃食過飽、引起胃空時間(Gastric emptying time)延長，或由於吞食大量空氣，胃炎等引起。消化性潰瘍亦

常用抗酸藥治療。

抗酸藥產生藥效之機轉作用爲化學的中和作用，減少胃液中之鹽酸，對於治療消化性潰瘍，則除中和作用外，亦包含抑制胃酵素(Pepsin)活性之作用，此可由物理的吸着作用，使胃酵素吸着在藥物表面，亦可由於PH升高至4以上時，活性減小，胃酵素元(Pepsinogen)不能變成胃酵素，因胃酵素的活性過高時，即爲產生潰瘍之重要原因。抗酸藥劑之成分中，如含有碳酸鹽類，則與胃酸中和時產生二氧化碳氣體，對於食得過飽時有益，因突然產生之二氧化碳氣體可協助排除吞入之空氣，但過多之二氧化碳對於消化性潰瘍之病人無益且有害；其次胃液在中和後，由於PH增高，可加速胃空使病人舒適。

設計抗酸藥劑處方組成時，要注意一些對於藥效有直接有關之重要因素，即總耗酸量(Total acid-Consuming Capacity)，中和速度，藥效期之長短，中和後胃內容物之PH，胃空時間，對於體內酸鹼平衡之影響，副作用、品質管制之方法等。

總耗酸量、中和速度、藥效長短及使胃內容物到達之PH值，均與藥物之物理性質有關，如溶解度，引濕性(wettability)表面面積，結晶形狀，亦與劑型(Dosage form)及服用時間有關，如係濕及溶解度大之藥物，中和迅速，但作用期短；固體藥劑當然不如液體藥劑之作用快，但固體藥劑作用較持久，不溶解不吸收者，不會影響體液之酸鹼平衡；非晶性藥物比結晶者藥效較快。

胃內容物之PH值最好在中和後，在4~5之間，因在此範圍內，可抑制可抑制胃酵素的生成及其減低其活性，亦不會產生續發性酸(Acid-rebound sequence)。系統性抗酸藥，如碳酸氫鈉，不僅作用期短，且可使胃內容物之PH值上升至7以上，可產生續發性胃酸過多，亦可改變體液PH而引起鹼中毒，故單純用碳酸氫鈉作消化性潰瘍之抗酸藥，最不符合理想。

適用於製成O.T.C.抗酸藥之成分有下各種：碳酸鈣(Calcium Carbonate)，價格便宜，爲一常用之成分。Kirsner發現其抗酸效比氫氧化鋁佳；Cook曾用含本品，碳酸鎂及奶粉之複方製劑以治療患胃酸過多之孕婦，發現其有88%之病人在治療後獲得進步。

在活體試驗時，Harrison等用PH電極測定胃內容物PH改變情形，發現服本品1Gm後，在15分鐘內，PH上升至7，可維持使PH在6以上，經45分鐘後，PH漸漸降至3，本品用作抗酸藥，其優點是經濟，作用迅速及藥效可靠，但缺點是產生大量氣體，便秘，長期服用大劑量可引起腎結石及有泥土樣不愉快之味，便秘之副作用，常可配伍以碳酸鎂或氧化鎂，矯正之，防止在泌尿系統中生結石，應禁止同時使用能使尿酸成鹼性藥物。

碳酸氫鈉(Sodium bicarbonate)由於價廉亦係常用之成分，其缺點已在上而敘述過，除外，對於老年人患高血壓及水腫等要限制食鹽攝入者。但對於吃食過飽而導致不適者，效用甚佳，因其中和胃酸後，使胃內容物迅速即入小腸內而消除過飽之不適。

氫氧化鋁(Aluminum hydroxide)亦係廣用之抗酸藥，除有中和胃酸之效用外，因其表面活性作用能吸着胃酵素，減少後者之活性，又可使食物中之磷酸鹽結合而減少磷酸鹽之吸收，故可使泌尿系統不易生結石或使結石不致變大，本品尚有一優點即不會影響體液之酸鹼平衡，本品之缺點和鈣鹽一樣，可引起便秘，故常須配伍鎂化合物，最常見之鎂化合物爲三磷酸鎂，本品另一缺點爲耗酸量不一定，且會老化而減少耗酸量。Hinckel等將之製成Hexitol之複合物，較不易生老化現象。

三磷酸鎂(Magnesium trisilicate)之吸着作用比氫氧化鋁佳，因中和後產生膠性之二氧化矽(SiO₂)之沉澱，故更適用於治療消化性潰瘍，但其耗酸能力則比碳酸鈣小而比氫氧化鋁大，三磷酸鎂係非系統性抗酸藥，不致使胃內容物之PH上升至7，亦不會影響體液之酸鹼平衡，但會有輕微之副作用，可用鈣化合物或鋁化合物矯正之。

水合氫氧化鎂(Hydrated magnesium aluminate)爲一較新之抗酸藥，有相當之抗酸效用，能維持胃內容物之PH值在3.0~5.5之間，其功效比現知之其他藥物之時間都長，在目前本省市場上尚未見有此原料出售。

氧化鎂(Magnesium oxide)和氫氧化鎂(Magnesium hydroxide)亦爲常用作抗酸藥之成份，價廉，亦不致改變體液之酸鹼平衡，但味苦

，又有致瀉之副作用為其缺點。

在抗酸藥中，有些配伍有 Simethicone (活性聚甲基矽化砂)，因能改變氣泡之表面張力，使胃腸道內氣體容易排出，但由於吸着作用，排除氣體之效用記伍後常減低。

在商業上，為改善成品之色及味，常加入色素及香料，常見者為甘草粉，豆蔻油，薄荷腦或油，薑粉，桂皮粉，糖及食鹽，加入食鹽對於老年人，患高血壓，腎臟病，肝及其他忌鹽之病人不適當，最好不用。

茲將著名之抗酸藥處方列釋如下：

一、鑑別：

1. 複方碳酸鎂錠 (Compound sodium bicarbonate tablets B.P.)

每錠含：

Sodium bicarbonate 300mg

Peppermint oil 0.003ml

2. 複方三矽酸鎂錠 (Compound Magnesium Trisilicate Tablets B.P.C.)

每錠含：

Magnesium Trisilicate 250mg

Dried Aluminum Hydroxide gel 120mg

Peppermint oil 0.003ml

3. Aludrox Co Tablets (Wyeth)

每錠含：

Dried Aluminum Hydroxide gel 420mg

Light magnesium Carbonate 65mg

4. Gelusil (warner)

每錠含：

Dried Aluminum Hydroxide Gel 250mg

Magnesium Trisilicate 500mg

5. Alkets Tablets (Upjohn)

每錠含：

Calcium Carbonate 300mg

Magnesium Oxide 65mg

Magnesium Carbonate 130mg

6. Alupecc (Pitman moore)

每錠含：

Dried Aluminum Hydroxide Gel 650mg

Magnesium Carbonate 81mg

7. A.M.T. (Wyeth)

每錠含：

Dried Aluminum Hydroxide Gel 150mg

Magnesium Trisilicate 250mg

8. Creamalin (Winthrop)

每錠含：

Dried Aluminum Hydroxide gel 320mg

Magnesium Trisilicate 750mg

二、液劑

1. Sodium Bicarbonate mixture for Infants (B.P.C.)

Sodium Bicarbonate 1gr.

Weak Ginger Tincture 1min.

Concentrated Dill water 2min.

Syrup 30min

Distilled water to 60min.

2. Aromatic Magnesium Carbonate Mixture (B.P.C.)

Light Magnesium Carbonate 5gr

Sodium Bicarbonate 10gr

Aromatic Cardamon Tincture 5min

Distilled water, to 1/2 fl. oz.

3. Magnesium Carbonate Mixture (B.P.C.)

Light Magnesium Carbonate 10gr.

Sodium Bicarbonate 15gr.

Chloroform water 120min.

Peppermint water, to 1/2 fl. oz.

4. Magnesium Trisilicate Mixture (A.P.F.)

Magnesium Trisilicate 1.0Gm

Calcium Carbonate 0.5Gm

Light Magnesium Carbonate 0.5Gm

Concentrated Peppermint water 0.25ml

Distilled water, to 10ml.

5. Magnesium Trisilicate Mixture (B.P.C.)

Magnesium Trisilicate 10gr.

Light Magnesium Carbonate 10gr.

Sodium Bicarbonate 10gr

Peppermint water, to 1/2 fl. oz.

6. Dijex (Boots)

Aluminum Hydroxide Gel 98.0

Magnesium Hydroxide 1.6

7. Diovol (wallace)

Aluminum Hydroxide 200mg

Magnesium Hydroxide 200mg

Simethicone 25mg

三、散劑：

1. Sippy's Powder No.1 (U.S.N.F.XI)

Precipitated Calcium Carbonate 23.0

Sodium Bicarbonate 77.0

Sippy's powder, No.2 50.0

Magnesium Oxide 50.0

Sodium Bicarbonate 50.0

以上兩種散劑交叉服用，以矯正便秘或腹瀉之副作用。

2. Compound magnesium Trisilicate Powder

Magnesium Trisilicate 50.0

Heavy Magnesium Carbonate

Chalk

Sodium Bicarbonate aa

四、膠囊劑：

Trisogel Capsule (Lilly)

Dried Aluminum Hydroxide Gel 100mg

Magnesium Trisilicate 300mg

參攷資料：

1. 謝清雲：藥事六法

2. Martindale Extra Pharmacopeia 25th ed.

3. B.P.C.1968

4. U.S.N.F.XI.

5. Cutting: Handbook of Pharmacology - 3rd ed.

6. Handbook of Non-Prescription Drugs 1969.

*作者本學院藥物化學教授

宏昌書局

中國醫藥學院特約店

專 營

各國名牌鋼筆毛筆一般文具
紙張張筆記簿、日記簿名
片承印一般印刷、各種運
動器材、各大專、高初中
、小學等參考書、課本、
簿本附設綉學號

歡迎駕臨賜顧

地址：臺中市中華路二段127號

TEL: 93345轉

福興文具店

專 營

各種運動器材一般文具

紙張各國名牌鋼筆毛筆

筆記簿日記簿像簿

價錢公道

歡迎賜顧

地址：台中市太平路52號