

吲哚美辛肠溶片 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/309/2021_2022__E5_90_B2_E5_93_9A_E7_BE_8E_E8_c22_309553.htm

药品名称吲哚美辛肠溶片 英文名称Indometacin Enteric-coated Tablets 类别解热镇痛药制剂本品为肠溶包衣片，除去肠溶衣后显白色。25mg/片。分子式成分化学名为2-甲基-1-(4-氯苯甲酰基)-5-甲氧基-1H-吲哚-3-乙酸。分子式： $C_{19}H_{16}ClNO_4$ 。分子量：357.79药理毒理本品具有抗炎、解热及镇痛作用，其作用机理为通过对环氧酶的抑制而减少前列腺素的合成。制止炎症组织痛觉神经冲动的形成，抑制炎症反应，包括抑制白细胞的趋化性及溶酶体酶的释放等。至于退热作用，由于作用于下视丘体温调节中枢，引起外周血管扩张及出汗，使散热增加。这种中枢性退热作用也可能与在下视丘的前列腺素合成受到抑制有关。急性毒性试验结果：大鼠经口LD50为12mg/kg；小鼠经口LD50为50mg/kg。药动学口服吸收完全，食物或服用含铝及镁的制酸药可稍使吸收缓慢，吸收入血后，约有99%与血浆蛋白结合。口服1~4小时血药浓度达峰值，用量25mg时血药浓度为1.4 μ g/ml，50mg时为2.8 μ g/ml；T_{1/2}平均为4.5小时，早产儿明显延长。本品在肝脏代谢为去甲基化物和去氯苯甲酰化物，又可水解为吲哚美辛重新吸收再循环。60%从肾脏排泄，其中10%~20%以原形排出；33%从胆汁排泄，其中1.5%为原形药；在乳汁中也有排出(天天可达0.5~2.0mg)。本品不能被透析清除。适应症用于关节炎，可缓解疼痛和肿胀。 软组织损伤和炎症； 解热； 其他：用于治疗偏头痛、痛经、手术后痛、创伤后痛等

。不良反应本品的不良反应较多。 胃肠道：出现消化不良、胃痛、胃烧灼感、恶心反酸等症状，出现溃疡、胃出血及胃穿孔； 神经系统：出现头痛、头晕、焦虑及失眠等，严重者可有精神行为障碍或抽搐等； 肾：出现血尿、水肿、肾功能不全，在老年人多见； 各型皮疹，最严重的为大疱性多形红斑（Stevens-Johnson综合征），造血系统受抑制而出现再生障碍性贫血，白细胞减少或血小板减少等； 过敏反应，哮喘，血管性水肿及休克等。相互作用（1）与对乙酰氨基酚长期合用可增加肾脏毒性，与其他非甾体抗炎药同用时消化道溃疡的发病率增高。（2）与阿司匹林或其他水杨酸盐同用时并不能加强疗效，而胃肠道不良反应则明显增多，由于抑制血小板聚集的作用加强，可增加出血倾向。（3）饮酒或与皮质激素、促肾上腺皮质激素同用，可增加胃肠道溃疡或出血的危险。（4）与洋地黄类药物同用时，本品可使洋地黄的血浓度升高(因抑制从肾脏的清除)而增加毒性，因而需调整洋地黄剂量。（5）与肝素、口服抗凝药及溶栓药合用时，因本品与之竞争性结合蛋白，使抗凝作用加强。同时本品有抑制血小板聚集作用，因此有增加出血的潜在危险。（6）本品与胰岛素或口服降糖药合用，可加强降糖效应、须调整降糖药物的剂量。（7）与呋塞米同用时，可减弱后者排钠及抗高血压作用。其原因可能是由于抑制了肾脏内前列腺素的合成。本品还有阻止呋塞米、布美他尼及吲达帕胺等对血浆肾素活性增强的作用，对高血压病人评议其血浆肾素活性的意义时应注重此点。（8）与氨苯蝶啶合用时可致肾功能减退（肌酐清除率下降、氮质血症）。（9）本品与硝苯地平或维拉帕米同用时，可致后二者血药浓度增高，因而毒

性增加。(10)丙磺舒可减少本品自肾及胆汁的清除,增高血药浓度,使毒性增加,合用时须减量。(11)与秋水仙碱、磺吡酮合用时可增加胃肠溃疡及出血的危险。(12)与锂盐同用时,可减少锂自尿排泄,使血药浓度增高,毒性加大。(13)本品可使甲氨蝶呤血药浓度增高,并延长高血浓度时间。正在用本品的病人如需作中或大剂量甲氨蝶呤治疗,应于24~48小时前停用本品,以免增加其毒性。(14)与抗病毒药齐多夫定(zidovudine)同用时,可使后者清除率降低,毒性增加。同时本品的毒性也增加,故应避免合用。用法用量口服(1)成人常用量:抗风湿,初始剂量一次25~50mg,一日2~3次,一日最大量不应超过150mg。镇痛,首剂一次25~50mg,继之25mg,一日3次,直到疼痛缓解,可停药;退热,一次6.25~12.5mg,一日不超过3次。(2)小儿常用量:一日按体重1.5~2.5mg/kg,分3~4次。待有效后减至最低量。#093.用量过大(尤其是一日超过150mg时)轻易引起毒性反应,如恶心、呕吐、紧张性头痛、嗜睡、精神行为障碍等,采用催吐或洗胃,对症及支持治疗。注重事项活动性溃疡病、溃疡性结肠炎及病史者,癫痫,帕金森病及精神病患者,肝肾功能不全者,对本品或对阿司匹林或其他非甾体抗炎药过敏者,血管神经性水肿或支气管哮喘者禁用。(1)交叉过敏反应:本品与阿司匹林有交叉过敏性,由阿司匹林过敏引起的喘息病人,应用本品时可引起支气管痉挛。对其他非甾体抗炎、镇痛药过敏者也可能对本品过敏。(2)本品解热作用强,通常1次服6.25mg或12.5mg即可迅速大幅度退热,故应防止大汗和虚脱,补充足量液体,(3)本品因对血小板聚集有抑制作用,可使出血时间延长,停药后此作用

可持续1天，用药期间血尿素氮及血肌酐含量也常增高。（4）下列情况应慎用：本品能导致水钠潴留，故心功能不全及高血压等患者应慎用；因本品可使出血时间延长，加重出血倾向，故血友病及其他出血性疾病患者应慎用，此外，本品对造血系统有抑制作用，再生障碍性贫血、粒细胞减少等患者也应慎用。（5）用药期间应定期随访检查：血象及肝、肾功能；个案报道提及本品能导致角膜沉着及视网膜改变(包括黄斑病变)，遇有视力模糊时应立即作眼科检查。（6）为减少药物对胃肠道的刺激，本品宜于饭后服用或与食物或制酸药同服。（7）本品不能控制疾病过程的进展，故必须同时应用能使疾病过程改善的药物。由于本品的毒副反应较大，治疗关节炎一般已不作首选用药，仅在其他非甾体药无效时才考虑应用。#093.（1）本品用于妊娠的后3个月时可使胎儿动脉导管闭锁，引起持续性肺动脉高压，孕妇禁用。（2）本品可自乳汁排出，对婴儿可引起毒副反应，哺乳期妇女禁用。#093.14岁以下小儿一般不宜应用此药，如必须应用时应密切观察，以防止严重不良反应的发生。#093.老年患者易发生肾脏毒性，应慎用。100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 www.100test.com