

磷酸伯氨喹 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__E7_A3_B7_E9_85_B8_E4_BC_AF_E6_c22_309728.htm 药品名称磷酸伯氨喹
药物别名伯氨喹啉 Avion 英文名称Primaquine Diphosphate
#093. 类别主要用于防止疟疾复发的抗疟药制剂片剂：13.2mg
(相当于伯氨喹7.5mg)。本品为糖衣片，除去糖衣后显橙红色。分子式成分化学名：N4-(6-甲氧基-8-喹啉基)-1-戊二胺二磷酸盐。分子式：C₁₅H₂₁N₃O₄P₂。分子量：455.34。药理毒理本品是8氨基喹啉类，对间日疟原虫红细胞外期及各型疟原虫配子体，有较强的杀灭作用，为阻止复发及中断传播的有效药物。本品可杀灭间日疟、三日疟、恶性疟和卵形疟组织期的虫株，尤以间日疟为著，也可杀灭各种疟原虫的配子体，对恶性疟的作用尤强，使之不能在蚊体内发育，以阻断传播。本品对红内期虫体的作用很弱。伯氨喹的抗疟机制还不完全清楚，可能与干扰DNA的合成有关，将疟原虫红外期虫体与组织细胞一起置伯氨喹溶液中培养8小时，电镜观察可见，伯氨喹可使疟原虫线粒体形态发生改变，表现为线粒体肿胀，并出现胞浆空泡。该药能抑制线粒体的氧化作用，使疟原虫摄氧量显著减少。伯氨喹在体内经过代谢，转变为具有较强氧化性能的喹啉醌衍生物，能将红细胞内的还原型谷胱甘肽(GSH)转变为氧化型谷胱甘肽(GSSH)，当后者还原时，需要消耗还原型辅酶(NADPH)。由于疟原虫红外期在肝实质细胞内发育本已消耗辅酶(NADP)，而伯氨喹的作用又干扰辅酶的还原过程，使辅酶减少，严重地破坏疟原虫的糖代谢及氧化过程。药动学口服后在肠内吸收快而完全，生物利用度约96%，口服45mg(基质)，在1小

时内血浆中浓度达峰值，约250mg/L。主要分布在肝组织内，其次为肺、脑和心等组织。T_{1/2}为5.8小时（3.7-7.4小时），大部分在体内代谢，仅1%由尿中排出，一般于24小时内完成。因血中浓度维持不久，故需反复多次服药才能收效。适应症防治间日疟、三日疟的复发和传播，以及防止恶性疟的传播。不良反应易发生疲惫、头昏、恶心、呕吐、腹痛、药热。

（1）本品毒性反应较其他抗疟药为高。当每日用量超过30mg（基质）时，易发生倦怠、头晕、恶心、呕吐、腹痛等不良反应；少数人可出现药物热，粒细胞缺乏等，停药后即可恢复。（2）葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏者服用本品可发生急性溶血型贫血，这种溶血反映仅限于衰老的红细胞，并能自行停止发展，一般不严重。一旦发生应停药，作适当的对症治疗。当葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏时，会引起高铁血红蛋白过多症，出现紫绀、胸闷等症状，应用亚甲蓝1~2mg/kg作静脉注射，能迅速改善症状。

相互作用（1）本品作用于间日疟原虫的红外期，与作用于红内期的氯喹合用，可根治间日疟。（2）米帕林（阿的平）及氯胍可抑制伯氨喹的代谢，故伯氨喹与此二药同用后，其血药浓度大大提高，维持时间也延长，毒性增加，但疗效未见增加。（3）不宜与其它具有溶血作用和抑制骨髓造血功能的药物合用。

用法用量口服：26.4mg/日，顿服，连服14日；或39.6mg/日，连服8日；或52.8mg/日，连服4日。服此药前3日，先服氯喹；或在第一、二日同服乙胺嘧啶。小儿常用量：口服，按氨喹计，根治间日疟每日按体重0.39mg/kg，连服14日。用于杀灭恶性疟配子体时，剂量相同，连服3日。注重事项妊娠C类。孕妇、哺乳期妇女慎用；肝、肾、血液系统疾患及糖尿病患者慎用。

对少数红细胞中缺少葡糖 - 6 - 磷酸脱氢酶的患者，可发生急性溶血性贫血，应立即停药，并静滴5%葡萄糖盐水；严重者需输血。如发生变性血红蛋白血症，可静注亚甲蓝，每次1 ~ 2mg/kg，以25%葡萄糖液稀释后静注。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