

乙胺嘧啶 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__E4_B9_99_E8_83_BA_E5_98_A7_E5_c22_309798.htm 药品名称乙胺嘧啶药物别名（息疟定，DARAPRIM）英文名称Pyrimethamine 类别主要作用于预防疟疾的抗疟药性状白色结晶性粉末，无臭，无味。在冷水中不溶，在热水、乙醇、乙醚或氯仿中微溶，在稀硝酸中溶解。熔点239～242℃。制剂片剂：每片6.25mg。膜剂：每格6.25mg。药理及应用本品化学结构和氯胍、环氯胍、甲氧苄胺嘧啶（TMP）相似，都是二氢叶酸还原酶抑制剂，使二氢叶酸不能还原成四氢叶酸，最后使核酸合成减少，通过抑制细胞核的分裂而使疟原虫的繁殖受到抑制。本品口服后胃肠道吸收完全，但较缓慢，服后约4小时达到峰浓度。主要分布于肺、肝、肾等组织，代谢产物由肾脏缓慢排出， $t_{1/2}$ 为90小时。本品对某些恶性疟及间日疟的原发性红外期有抑制作用，是较好的预防药。由于排泄缓慢，作用较持久，1次服药，其预防作用可维持1周以上。每2周给药1次的效果较差，且可能产生耐药性。本品对疟原虫配子体无明显作用，但含药血液进入蚊体后，可影响配子体在蚊体内的发育，故可阻断传播。对疟原虫红外期有作用，故常与伯氨喹合用以抗复发。本品主要用于预防疟疾，也可用于预防中枢神经系统白血病。最近发现本品有抗药性虫株产生，合并应用其它抗疟药及磺胺类药物等，可提高其抗疟效果。用法用量（1）预防疟疾成人每次服25mg，每周1次，小儿酌减。（2）抗复发治疗成人每日服25～50mg，连用2日，小儿酌减（多与伯氨喹合用）。注重事项（1）本品排泄极慢，服药后前5日尿中排泄量仅占口服量的12%。因此，如1次误服过量

或连续长期服用，均能引起毒性反应，例如每日25mg用至1周以上，即可出现叶酸缺乏现象，从而影响代谢较快的骨髓和消化道，出现骨髓抑制和消化道症状，导致巨幼红细胞性贫血和白细胞减少，及时停药可自行恢复。给予甲酰叶酸钙可改善骨髓功能。长期应用本品应经常检查血象。（2）由于其味不苦而微香，为小儿所乐用，故小儿易服过量而引起中毒甚至死亡，宜加注重。（3）成人如1次服150~200mg，即有中毒危险，常在1~5小时内出现恶心、呕吐、头痛、头晕等症状，重者昏迷抽搐。6岁以下小儿有因顿服50~100mg而中毒致死者。急救法：洗胃、催吐、大量饮用10%糖水或萝卜汁，给以葡萄糖输液及利尿药，痉挛、抽搐者注射硫喷妥钠。（4）由于本品有高度蓄积性，肾功能不良者慎用。本品可通过乳汁排出，故授乳妇女亦应慎用。（5）偶可引起红斑样、水疱状药疹。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