

对氨基水杨酸钠 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_AF_B9_E6_B0_A8_E6_B0_B4_E6_c22_309962.htm 药品名称对氨基水杨酸钠
药物别名对氨基水杨酸钠、对氨基柳酸钠、对氨基柳酸钠、对氨基水杨酸钠、派斯钠 英文名称Sodium Aminosalicylate 类别抗结核病药
制剂片剂：0.5g；粉针剂：2g、4g、6g。肠溶片0.5g。分子式成分 化学名：4-氨基-2-羟基苯甲酸钠盐二水合物。分子式： $C_7H_6NNaO_3 \cdot 2H_2O$ 。分子量：211.14。性状：本品为白色或类白色结晶或结晶性粉末。无臭，味甜带咸。在水中易溶，在乙醇中略溶，在乙醚中不溶。其2%水溶液的pH值为6.5-8.5。本品水溶液不稳定，遇热可分解，遇光迅速变色。药理毒理本品的结构类似对氨基苯甲酸，通过对结核杆菌叶酸合成而起抑菌作用，对细胞外的结核杆菌有抑制作用；因不易产生耐药性，常与链霉素或异烟肼联用，能延缓耐药性的产生。本品作用原理尚未完全阐明，一般认为本品的化学结构与对氨基苯甲酸(PABA)近似，结核杆菌在代谢的过程中需要PABA的参加，故本品竞争性的替代PABA参加叶酸的合成，抑制二氢叶酸合成酶，影响二氢叶酸的合成，造成结核杆菌蛋白质合成受阻，细菌不能繁殖。本品与链霉素、异烟肼合用，可加强后二者的抗结核杆菌的作用，与异烟肼合用时由于竞争乙酰化而减慢异烟肼在体内的酰化的速度，使游离异烟肼的浓度增高，故有协同的抗结核杆菌的作用，并能使耐药菌延缓产生。单用本品约半年即可产生耐药性，但比单用异烟肼或链霉素要慢。本品尚有较强的降血脂作用。抗菌谱：本品对结核杆菌有选择性的抑制作用，仅作用于吞噬细胞外的结核杆菌，最低抑菌浓度(MIC)为 $1 \mu g/mL$ ，

在有对氨基苯甲酸的环境中(如干酪病灶内)其抑菌作用减小，本品抗菌谱较窄，除结核杆菌外对其它分枝杆菌和细菌、病毒等均无作用。药动学口服吸收良好， T_{max} 约0.5~1h，PB为50%~73%，约50%药物在体内乙酰化，约80%由尿排出， $T_{1/2}$ 为1h。自胃肠道吸收良好，较其它水杨酸类吸收更为迅速。吸收后迅速分布至各种体液中，同时迅速弥散至肾、肺和肝组织。在胸水及干酪样组织中达到很高浓度，但脑脊液中的浓度很低。蛋白结合率60~70%。口服后1~2小时血药浓度达峰值，持续时间约4小时。半衰期为45-60分钟，但肾功能损害者可达23小时。本品在肝中代谢，50%以上经乙酰化成为无活性代谢物。给药后85%在7-10小时内经肾小球滤过和肾小管分泌迅速排出，其中14~33%为原形，50%为代谢物。本品亦可经乳汁分泌。血液透析可清除。适应症活动性结核病。多与其它抗结核药物联用。本品对分枝杆菌有效，但对不典型分枝杆菌无效。不良反应有寒战、皮疹、喉痛与发热、极度疲乏或软弱等。

- 1.消化系统较多见恶心、呕吐、食欲不振、腹泻、腹痛等症状。也可有肝损害、黄疸，此时应停药。
- 2.泌尿系统本品在酸性尿中可引起结晶尿、蛋白尿、管形尿及血尿等，可有尿痛，长期应用者可致肾功能衰竭。
- 3.其它 (1)较多见的不良反应有：寒战、喉痛与发热、极度疲乏或软弱(较常见的原因因为过敏)、瘙痒(过敏)、下背部疼痛等。可见皮疹、剥脱性皮炎、药热、白细胞减少、肝损害、黄疸，此时应停药。(2)发生较少的不良反应有：月经失调、发冷、男性性欲减低、皮肤干燥、颈前部肿胀、体重增加、头痛、两眼对光过敏等。

相互作用药物-药物相互作用 1.本品与丙磺舒或苯磺唑酮合用，可减少本品从肾小管的分泌量，导致

血药浓度增高和作用持续时间延长及不良反应发生。(因此本品与丙磺舒或苯磺唑酮合用时或合用后，本品的剂量应调整，并密切随访患者)。

- 2.本品忌与水杨酸类同服，以免胃肠道反应加重及导致胃溃疡。
- 3.本品可增强抗凝药(香豆素或茚满二酮衍生物)的作用，因此合用时，口服抗凝药的剂量应适当调整。
- 4.本品可能影响利福平的吸收，导致利福平的血药浓度降低，故合用时，两者给药时间应相隔8-12小时。
- 5.本品和维生素B12同服时可影响后者从胃肠道吸收，因此合用时维生素B12的量应增加。
- 6.本品可降低强心苷的血药浓度。
- 7.苯海拉明略减少肠道本品的吸收(约10%)。
- 8.本品能使异烟肼血药浓度升高，提高后者的药效和增强肝毒性。
- 9.本品可增强苯妥英钠的作用。
- 10.本品与乙硫异烟胺合用时可增加不良反应。
- 11.本品可增强甲氨蝶呤的不良反应。
- 12.本品与对氨基苯甲酸有拮抗作用，两者不宜合用。

药物-酒精/尼古丁相互作用 乙醇可完全消除本品的降血脂作用。

用法用量口服：成人，8g～12g/日，3～4次/日。儿童：每日0.2g～0.3g/kg。静滴：成人，4g～12g/日，从小剂量开始，溶于5%葡萄糖液500ml中或配成3.6%等渗溶液，于2～3h滴完，每日或隔日1次。胸腔注射：用20%溶液10-20ml，注入胸膜腔内，用于治疗结核性脓胸。外用：用10%软膏治疗结核性溃疡。溃疡性结肠炎：保留灌肠。

注重事项孕妇、哺乳期妇女、对其他含有对氨基苯基团(如磺胺药和染料)和水杨酸类的药物过敏的患者、充血性心力衰竭患者、胃溃疡患、葡萄糖-6-磷酸脱氢酶(G-6-PD)缺乏者、严重肝功能损害者、严重肾功能损害者者慎用。口服可与氢氧化铝或碳酸氢钠同服，以减轻刺激性；滴注时药液应避光，变色不可用。药物对妊娠的影响：未

证实对孕妇有害，但必须权衡利弊后才可选用。药物对哺乳的影响：本品可由乳汁中分泌，哺乳期妇女须权衡利弊。使硫酸铜法测定尿糖出现假阳性。使尿液中尿胆原测定呈假阳性反应(氨基水杨酸类与Ehrlich试剂发生反应，产生桔红色混浊或黄色，某些根据上述原理做成的市售试验纸条的结果也可受影响)。使丙氨酸氨基转移酶(ALT)和门冬氨酸氨基转移酶(AST)增高。对其它水杨酸类包括水杨酸甲酯(冬青油)或其它含对氨基苯基团(如某些磺胺药和染料)过敏的患者对本品亦可过敏。 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