

万络 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/310/2021\\_2022\\_\\_E4\\_B8\\_87\\_E7\\_BB\\_9C\\_c22\\_310222.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/310/2021_2022__E4_B8_87_E7_BB_9C_c22_310222.htm) 药品名称万络药物别名罗非昔布 rofecoxib 英文名称Vioxx 类别抗炎镇痛药制剂片剂：25mg分子式成分4-[4-(甲磺酰基)苯基]-3-苯基-2-咪唑酮药理毒理环氧酶(COX)的2个异构体COX-1和COX-2催化人体前列腺素的合成。COX-1是正常的细胞组成蛋白，在正常组织中表达，维持体内前列腺素的生理功能，包括胃肠粘膜的保护功能。COX-2是炎症时COX的诱导形式，主要在炎症细胞中表达，产生介导炎症和疼痛的前列腺素。NSAIDs对炎症的有效治疗作用源于其对COX-2的抑制。而胃肠道穿孔、溃疡、出血等不良反应则归于对COX-1的抑制。本品为口服有效的选择性COX-2抑制剂。每日1次服用足以保持有效的作用，疗效与剂量有关。体内外研究表明，使用10倍治疗剂量时，未见本品对COX-1有抑制作用，也不会抑制胃前列腺素的合成，且对出血时间无影响。临床评价：784例患有膝或髌骨关节炎患者随机分为3组，分别服用：罗非昔布12.5mg，qd，罗非昔布25mg，qd，双氯芬酸钠50mg，tid，持续观察1年。结果显示，在缓解骨关节炎炎症方面，罗非昔布12.5或25mgd<sup>-1</sup>的疗效与双氯芬酸钠50mg，tid具有相同的临床疗效，且本品耐受性良好#093。

本品用于缓解术后牙痛的随机、双盲研究，共观察了152例年龄16岁、牙科手术后出现中至重度疼痛的患者，在24h内完成镇痛效果的有效评估显示，本品50mg与布洛芬400mg疗效相同，并优于安慰剂#093。

一项在1516例骨关节炎患者(年龄50岁)中进行的胃镜检查研究发现：服用本品25

或50mg与服用布洛芬的患者在为期6个月的治疗过程中，消化道溃疡发生率分别为9.6%，14.7%，45.8%。且在为期12周的安慰剂治疗期间，本品胃镜下消化道溃疡发生率与安慰剂组相似#093。 在另一项研究中，本品与布洛芬、双氯芬酸和萘丁美酮比较（n#061.1500），经12周治疗的溃疡发生率分别为4.7%和7.3%#093。 本品不能完全消除NSAIDs引起的胃肠道不良反应，且可能在镇痛及抑制炎症方面的效果较以往的NSAIDs弱。药动学本品口服物利用度为93%，约87%与血浆蛋白结合，Tmax约为2~3h。口服单剂量25mg时，Cmax为207  $\mu\text{g/L}$ ，AUC为3628  $\mu\text{g/L}\cdot\text{h}$ ，5次25mg剂量后，稳态Cmax为321  $\mu\text{g/L}$ ，稳态AUC0~24h为4018  $\mu\text{g}\cdot\text{h/L}$ 。稳态水平T1/2约为17h，本品主要在肝脏代谢消除，小于1%以原形从尿中排出。主要代谢产物是顺式二氢和反式二氢衍生物和一个葡萄糖苷酸氢氧衍生物。适应症缓解骨关节炎症状和体征，缓解疼痛及原发性痛经。不良反应常见下肢水肿、体液潴留、高血压、胃灼热、消化不良、上腹不适、恶心、腹泻，罕见口腔溃疡。相互作用利福平600mgd-1可引起本品血浆浓度下降50%。本品75mgd-1（治疗骨关节炎最高推荐剂量的3倍）与甲氨蝶呤每周7.7~15mg合用，可使甲氨蝶呤的血浆浓度增加23%，引起其肾脏清除率下降。长期使用华法林治疗稳定的患者，给予本品25mgd-1，凝血酶原时间国际标准化比率增加8%。用法用量成人骨关节炎：po12.5mgqd。必要时可增至最大剂量25mg，qd。成人急性疼痛及原发性痛经：po25mg，qd。最大推荐剂量为po50mg，qd。可连续服5d。注重事项禁用于对本品任一成分过敏患者。有活动性消化性溃疡或胃肠道出血的患者，以及中重度肝功能障碍者，肌酐

清除率  $< 30\text{mLmin}^{-1}$ ，以及孕妇和哺乳期妇女禁用本品。肌酐清除率在  $30 \sim 80\text{mLmin}^{-1}$  者无需调整本品剂量，肝功能不全者应使用维持剂量。肝酶活性高于正常值3倍时应停药。对心、肾、肝功能障碍的患者应进行血药浓度监测。老年患者剂量增加时应谨慎。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](http://www.100test.com)