

塞来昔布 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__E5_A1_9E_E6_9D_A5_E6_98_94_E5_c22_310272.htm 药品名称塞来昔布药物别名西乐葆 Celebrex 英文名称CELECOXIB 类别抗炎镇痛药制剂硬胶囊：200mg/片。分子式成分本药为口服硬胶囊，除活性成分外，尚含有一水乳糖、十二烷基硫酸钠、聚乙烯吡咯烷酮、羟甲基纤维素钠和硬脂酸镁。200mg胶囊为不透明，白色，金带标记标有7767和200字样。药理毒理是一种新一代的化合物，具有独特的作用机制即特异性地抑制环氧化酶-2（COX-2）。炎症刺激可诱导COX-2生成，因而导致炎症前列腺素类物质的合成和聚积，尤其是前列腺素E₂，引起炎症、水肿和疼痛。塞来昔布可通过抑制COX-2阻止炎症前列腺素类物质的产生，达到抗炎、镇痛及退热作用。药动学空腹给药的塞来昔布吸收良好，约2~3小时达到血浆峰浓度，胶囊口服后的生物利用度为口服混悬后生物利用度的99%（混悬液为口服利用的最佳剂型）。在整个治疗剂量范围内，塞来昔布具有线性、且与剂量成正比的药代动力学特征。本药的血浆蛋白结合率与浓度无关，在治疗血浆浓度时，血浆蛋白结合率约为97%。药物在血中并不是优先与红细胞结合。与进食（高脂食物）同时给药，则本药的延迟吸收，T_{max}延至4个小时，生物利用度增加约20%。健康受试者每日1次或分2次口服400mg本品后其生物利用度相同。而在骨关节炎患者，每日1次或分2次口服200mg本品后，其临床疗效及安全性相当。代谢和要通过细胞色素P450-CYP2C9。原形药具有药理活性，循环中其主要代谢产物未测得COX-1和COX-2抑制活性。本品的清除主要通过肝脏进行，少于1%剂量的药物以原形从

尿中排出。多剂服药后清除半衰期为8~12小时，清除率约为500mL/分。连续给药5天内达到其稳态分布容积均值，约为500L/70kg，表明塞来昔布在组织中的广泛分布。临床前研究表明本药可通过血脑屏障。适应症急性期或慢性期骨关节炎和类风湿关节炎的症状和体征。不良反应主要有头痛、眩晕、便秘、恶心、腹痛、腹泻、消化不良、胀气、呕吐等。相互作用可与氨甲喋呤、酮康唑、抗酸剂（铝剂和镁剂）、苯妥英、格列苯脲、甲苯磺丁脲联合使用。在西乐葆和华法令或其他类似药物联合应用的头几天，或西乐葆的剂量改变后数天内，应密切监测其抗凝血作用。用法用量骨关节炎：西乐葆治疗骨关节炎的症状和体征推荐剂量为200mg，每日一次口服。临床研究中也曾用至每日400mg的剂量。类风湿关节炎：西乐葆治疗类风湿关节炎的症状和体征推荐剂量为100mg或200mg每日2次。临床研究中的剂量曾用至每日800mg。老年人：不必调整剂量。肝功能损害患者：轻至中度肝功能损害患者无需调整剂量。肾功能损害患者：轻至中度肾功能损害患者无需调整剂量，对于重度肾功能损害患者无临床经验。儿童：塞来昔布没有在18岁以下人群中进行过临床研究。注意事项对本产品中任何成份过敏者；已知对磺胺过敏者禁用。塞来昔布含有磺胺基团，临床研究中哮喘病人服用西乐葆后未发生支气管痉挛。但由于未在阿司匹林或其他非甾体抗炎药诱发哮喘、荨麻疹或急性鼻炎的患者中评估西乐葆，因此，尚未有研究资料以前，此类病人应避免服用西乐葆。妊娠期：没有关于妊娠期应用西乐葆的资料，只有潜在益处大于对胎儿的危害时，妊娠期妇女才可以考虑用西乐葆治疗。哺乳期：因没有在人体中进行类似研究，故西乐葆不

应用于哺乳期妇女。 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