

启维 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\\_90\\_AF\\_E7\\_BB\\_B4\\_c22\\_310501.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/310/2021_2022__E5_90_AF_E7_BB_B4_c22_310501.htm) 药品名称启维药物别名富马酸奎硫平、奎的平 英文名称quetiapine fumarate 类别吩噻嗪类制剂片剂，25mg，100mg分子式成分 11-{4-[2-(2-羟乙氧基)乙基-1-哌嗪]}二苯并[b, f][1, 4]硫氮杂卓1/2富马酸盐。本品为类白色或微黄色结晶性粉末，无臭无味，在冰醋酸中溶解，在甲醇或乙醇中微溶，在丙酮或氯仿中极微溶解，在水中几乎不溶。熔点170~174。药理毒理启维是一种新型的吩噻嗪类抗精神病药，可阻断脑内多种神经质受体。其机制主要是通过阻断中枢多巴胺（DA）的D1，D2和5-羟色胺2（5-HT2），5-羟色胺1A（5-HT1A）等多种受体而起作用，其与5-HT/DA受体结合之比为2，在非典型抗精神病药物中最高的。患者服用启维单剂量12h后，PET扫描显示50%以上的5-HT受体被阻断，而仅25%的DA受体最少的非典型抗精神病药。D2阻断与锥体外系（EPS）症状有关，临床前研究显示，启维很少有EPS效应。与典型抗精神病药氟哌啶醇相比，运动系统障碍、高泌乳素血症的发生率显著降低。启维很少或不引起对氟哌啶醇敏感的猴发生肌张力障碍，表明迟发生运动障碍（TD）发生率低。该品还能阻断肾上腺素1受体，导致用药早期约有7%的患者出现短暂性低血压，阻断H1受体引起嗜睡。在模拟精神病阴性症状的爪哇猴子和大鼠的模型上，启维改变了动物的社会孤独行为，有改善阴性症状的有益作用。逆转苯丙胺诱发的行为模型可临床观察抗精神病药物的作用提供了一种可信的临床前指标，启维对该模型的作用表明启维与氯氮平至少是等儿的。药动学口服

吸收迅速，不受胃中食物影响，1~1.5h后血药浓度达峰值，治疗剂量范围血浆半衰期为6~8h，达稳态血浓时间48h，表观分布容积约10Lkg<sup>-1</sup>，血浆蛋白结合率为80%~83%，主要由肝细胞色素P450代谢，其主要代谢途径是CYP3A4同功酶，对由CYP450极代谢的药物的干扰素极小，但影响CYP3A4同功酶的药物可能干扰本品，该药代谢产物无药理活性。基本通过肾脏排泄，约占给药剂量的73%，经粪便排泄占给药剂量的20%。单次服药后，低于给药剂量1%的药物以原形排泄。种族、性别及吸烟对本品的药代动力学均无影响。口服清除率老年患者比年轻患者减少30%~35%，肝功能损害的患者减少25%~30%，故严重肝损害者需降低剂量，但肾损害的患者无需调整剂量。适应症精神分裂症，精神分裂样障碍。不良反应常见不良反应为头晕、嗜睡、激惹、失眠、口干、消化不良和便秘。服药早期有体位性低压，与剂量无关，该不良反应有自限性，服药1,2周内可消失，老年或体弱患者在这段时间需要监护。剂量依靠性的不良反应为消化不良、腹痛及体重增加。临床试验中还观察到构词障碍、畏食、心悸、四周性水肿、多汗等。少数患者可能发生肌紧张、震颤和静坐不能等EPS症状。实验室检查发现，ALT增高及血清总胆固醇和三酰甘油增高。相互作用本品能加强酒精对认知和运动的损害作用，有诱发竖立性低血压的潜在危险，有可能阻断左旋多巴和多巴胺激动剂的交通。体外抑酶试验提示，启维及代谢物对体内由细胞色素P4501A2, 2C9, 2C19, 2D6和3A4介导的代谢几乎没有抑制。启维口服清除率受P4503A4诱导剂苯妥英钠的诱导，与苯妥英钠或其他诱导剂如卡马西平和苯巴比妥合用时，需要调整本品的剂量。甲硫

哒嗪降低启维的血浆浓度，与本品合用时须提高启维的剂量。注重事项哺乳期妇女和对本品过敏者禁用。暂不推荐给妊娠妇女及儿童。老年患者剂量宜小，增量宜慢。有心脑血管疾病、可能诱发低血压的情况、肾功能损害、甲状腺疾病、有癫痫发作史、抽搐阈值降低、阿尔茨海默病、阻塞性肺病及吞咽困难的患者慎用。所从事的工作需要高度精神集中的患者，如驾驶汽车或操作危险机器者服用本品时应慎重。建议在治疗初期和长期服药时，采用适当的方法如裂隙灯或其他敏感方法监测白内障的发生，每半年检查一次。

由于抗精神病药物影响体温调节中枢，故有体温升高情况的患者在使用本品时应适当注重。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)