

丙酸氟替卡松 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_99_E9_85_B8_E6_B0_9F_E6_c22_310721.htm 药品名称丙酸氟替卡松
药物别名辅舒良、辅舒酮、舒利迭、沙美特罗 Flixonase
、Flixotide 英文名称fluticasone propionate 类别四代头孢制剂辅舒良喷鼻剂 50 μg x 120喷：本品是丙酸氟替卡松微粒的水性混悬液，通过一定量喷雾泵将药液喷于鼻粘膜局部。每100 mg药液中除了含50 μg丙酸氟替卡松之外，还含有微晶纤维素、羟甲基纤维素钠、右旋糖、吐温80、苯扎氯胺和苯乙醇等。丙酸替卡松鼻喷雾剂装在琥珀色玻璃瓶内，玻璃瓶与定量喷雾泵、鼻接合器及防尘盖相连，当按照推荐剂量使用时，每瓶可提供120喷。 辅舒酮气雾剂：125 μg x 60 揿 分子式成分本品的主要成分是丙酸氟替卡松，其化学名称为6，9-二氟-11-羟-16-甲基-3-氧代-17-（1-氧代丙氧基）-雄甾-1，4-二烯-17-硫代羧酸（6a，11b，16a，17a）-S-（氟甲基）酯，分子式为C₂₅H₃₁F₃O₅S，分子量为500.6。药理毒理丙酸氟替卡松是一种作用于局部的皮质激素，具有较高的治疗指数和强效的抗炎活性。当它局部作用于鼻粘膜时，未检测出其全身性活性，因而对下丘脑-垂体-肾上腺轴的抑制作用极小。药动学本药的推荐剂量经鼻腔给药后，丙酸氟替卡松的血浆浓度很低，水溶性鼻喷雾剂的系统生物利用度也很低，平均值为0.51%，中值为0.36%。静脉给药后，丙酸氟替卡松的药代动力学与剂量成正比。由于经胃肠道吸收不完全和广泛的首过代谢，其绝对口服生物利用度可忽略不计（<1%）。丙酸氟替卡松在体内分布广泛（V_{ss}约为300 L），血浆蛋白结合率为91%。静脉给药后，丙酸氟替卡松具有很高的清除率，

大约为1.1 L/分，表明肝脏的吸收广泛。丙酸氟替卡松由CYP3A4酶代谢为无活性的羧基衍生物。在3-4小时内，其血浆峰浓度减少约98%，这与终末半衰期（约为8小时）有关。口服丙酸氟替卡松后，87-100%以原药或代谢物的形式经粪便排泄。对于大多数经鼻腔给药的病人，丙酸氟替卡松不会引起丘脑-垂体-肾上腺轴抑制。然而，由于不同的患者可能发生全身反应的差异很大，所以应采用能有效地控制症状的最小剂量。本药的最大疗效会在治疗后3-4天获得。适应症预防和季节性过敏性鼻炎（包括枯草热）和常年性过敏性鼻炎。不良反应经鼻应用皮质激素后曾有发生鼻中隔穿孔的报道，但极为罕见，通常见于作过鼻手术的患者。与其他鼻部吸入剂一样，本品可引起鼻、喉部干燥、刺激，令人不愉快的味道和气味。鼻衄、头痛、过敏反应，包括皮疹、面部或舌部水肿曾有报道，罕有过敏性/过敏样反应和支气管痉挛的报道。长期、大剂量经鼻腔给予皮质激素可能导致全身性反应。用法用量气雾剂：16岁以上的患者开始剂量为轻度哮喘：100-250 μg bid，中度哮喘：250-500 μg bid，严重哮喘：500-1000 μg bid，然后根据治疗效果调整剂量至哮喘控制或降低至最小有效剂量。4岁以上儿童：开始剂量为50 μg 或100 μg bid。然后根据治疗效果调整剂量至哮喘控制或降低至最小有效剂量。辅舒良喷鼻剂使用前轻轻摇动药瓶。成人和12岁以上儿童：每日1次，每个鼻孔各2喷，以早晨用药为好，某些患者需每日2次，每个鼻孔各2喷。当症状得到控制时，维持剂量为每日1次，每鼻孔各1喷。若症状复发，可相应增加剂量，每日最大剂量为每个鼻孔不超过4喷。老年患者用量同成年患者。4-11岁的儿童：每日1次，每个鼻孔各1

喷。某些患者需每日2次，每鼻孔各1喷，最大剂量为每鼻孔不超过2喷。本药仅用于鼻腔吸入。用药过量：目前尚无资料报道短期或长期过量应用丙酸氟替卡松的不良后果，健康志愿受试者经鼻使用2 mg的丙酸氟替卡松，每日2次，疗程7天，未曾发现影响下丘脑-垂体-肾上腺轴功能。长期口腔吸入或口服高剂量的皮质激素可引起对丘脑-垂体-肾上腺轴功能的抑制。注重事项对本药的任何组成成分过敏者禁用。鼻腔感染时，应予恰当治疗。经鼻腔给予过量的类固醇可造成肾上腺功能的显著抑制，假如有证据表明用药超过推荐的剂量，则应在应激或择期手术期间，考虑给予其它全身性类固醇。存在肾上腺功能受损的情况时，若由全身应用皮质激素治疗转换为丙酸氟替卡松鼻喷雾剂，必须非凡谨慎小心。虽然对于大多数患者来说，丙酸氟替卡松鼻喷雾剂可控制季节性过敏性鼻炎，但是在受到严重的夏季过敏源激发时，在某些情况下，应进行适当的辅助治疗，非凡是要控制眼部症状。不良反应的发生与患者的个体差异和所使用的类固醇不同而异。长期大剂量经鼻腔给予类固醇可能引起全身性反应。

对妊娠和哺乳的影响 孕期：尚无充分证据表明人在怀孕期应用此药是否安全。给怀孕的动物使用皮质激素可造成胚胎的畸形，包括腭裂和宫内生长迟缓。然而，只有在大量地全身应用皮质激素的情况下才会发生。这种作用发生于人类的危险性可能很小。而直接经鼻腔用药时，全身皮质激素的水平很低。正如其他药物一样，怀孕期间使用本药时，需权衡其益处和可能的危险性。哺乳期：丙酸氟替卡松是否会分泌到人乳中，尚无研究。在对哺乳期实验大鼠皮下应用丙酸氟替卡松后，当血浆中测得药物时，发现乳汁中也有丙酸氟替卡

松。然而，在按照推荐剂量给患者鼻内喷入丙酸氟替卡松时，血浆药物水平可能很低。当给哺乳的母亲使用丙酸氟替卡松时，应权衡药物益处及对母亲和婴儿的潜在危害。对儿童的影响曾有报道，在相应的剂量下经鼻腔使用某些类固醇，会引起儿童发育迟缓。对长期需要这种治疗的儿童患者，应定期监测其身高。假如生长变慢，应减量治疗，尽可能使用可有效控制症状的最低剂量。此外，应考虑向儿科专家咨询。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