

利培酮 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/311/2021_2022__E5_88_A9_E5_9F_B9_E9_85_AE_c22_311058.htm 药品名称利培酮药物别名瑞司哌酮，维思通 Risperdal 英文名称Risperidone 类别长效抗精神病药制剂片剂：1mg、2mg。1 mg利培酮片为白色带薄膜包被的中心划痕的椭圆型片剂；2 mg利培酮片为桔黄色带薄膜包被的中心划痕的椭圆型片剂。分子式成分利培酮的化学名称为3-[2-[4-(6-氟-1,2-苯并异唑-3-基)-1-哌啶基]乙基]-6,7,8,9-四氢-2-甲基-4H-吡啶并[1,2-]嘧啶-4-酮。分子式为C₂₃H₂₇FN₄O₂，分子量为410.49。1 mg片剂为白色薄膜衣片，2 mg片剂为淡橙色薄膜衣片，除去包衣后均呈白色。药理毒理本品为苯并异唑衍生物，是新一代的抗精神病药。其活性成份利培酮是一种具有独特性质的选择性单胺拮抗剂，它与5-羟色胺能的5-HT₂受体和多巴胺能的D₂受体有很高的亲和力。利培酮也能与 α₁-肾上腺素能受体结合，并且以较低的亲和力与H₁-组胺能受体和 α₂-肾上腺素能受体结合。利培酮不与胆碱能受体结合。利培酮是强有力的D₂拮抗剂，可以改善精神分裂症的阳性症状，但它引起的运动功能抑制，以及强直性昏厥都要比经典的抗精神病药少。对中枢系统的5-羟色胺和多巴胺拮抗作用的平衡可以减少发生锥体外系副作用的可能，并将其治疗作用扩展到精神分裂症的阴性症状和情感症状。药动学口服后T_{max}1~2h，食物不影响其吸收，首过效应明显，生物利用度约60%，PB约88%，在血浆代谢为活性产物9-羟基利培酮，原形药T_{1/2}约3h，活性代谢物T_{1/2}约24h。具体见下 利培酮经口服后可被完全吸收，并在1-2 hr内达到血药浓度峰值。食物不影响利培酮的吸收，

因此利培酮与食物同服与否均可。利培酮部分代谢成9-羟基-利培酮，后者与利培酮有相似的药理作用。二者共同构成抗精神病的活性成份。精神病患者口服利培酮后，该药的消除半衰期为3 hr左右，9-羟基-利培酮以及抗精神病的有效成份的消除半衰期为24 hr。大多数病人可在一日内达到利培酮的稳态，而9-羟基-利培酮达到稳态要经过4-5日。在治疗剂量范围内，利培酮的血浆浓度与剂量成正比。利培酮在体内可迅速分布，分布容积为1-2 L/kg。在血浆中，利培酮与球蛋白和 α_1 -酸性糖蛋白结合。利培酮的血浆蛋白结合率为88%，9-羟基-利培酮的血浆蛋白结合率为77%。用药一周后，70%的药物经尿液排泄，14%的药物经粪便排泄。经尿液排泄的部分中，35%~45%为利培酮和9-羟基-利培酮，其余的为非活性代谢物。单剂量研究表明，在老年患者和肾功能不全患者中利培酮血浆浓度较高，清除速度较慢，而肝功能不全患者的血药浓度是正常的。适应症急、慢性精神分裂症。急性和慢性精神分裂症以及其它各种精神病性状态的明显的阳性症状（如幻觉、妄想、思维紊乱、敌视、怀疑）和明显的阴性症状（如反应迟钝、情绪淡漠及社交淡漠、少语）。本药也可减轻与精神分裂症有关的情感症状（如抑郁、负罪感、焦虑）。不良反应与服用本药有关的常见不良反应是：失眠、焦虑、激越、头痛、头晕、口干。较少见的不良反应有：嗜睡、疲惫、注意力下降、便秘、消化不良、恶心、呕吐、腹痛、视物模糊、阴茎异常勃起、勃起困难、射精无力、性淡漠、尿失禁、鼻炎、皮疹以及其它过敏反应。可能引起锥体外系症状，如肌紧张、震颤、僵直、流涎、运动迟缓、静坐不能、急性肌张力障碍。通过降低剂量或给予抗帕金森氏综

合征的药物可消除。偶然会出现（体位性）低血压、（反射性）心动过速或高血压的症状。会出现体重增加、水肿和肝酶水平升高的现象。偶然会由于病人烦渴或抗利尿激素分泌失调引发水中毒。会引起血浆中催乳素浓度增加，其相关症状为：溢乳、男子女性型乳房、月经失调、闭经。偶见迟发性运动障碍、恶性症状群、体温失调以及癫痫发作。有轻度中性粒细胞和/或血小板计数下降的个别报导。相互作用可增强抗高血压药的作用，可拮抗多巴胺类药的作用，增加奎尼丁、华法林等药的毒性反应。吩噻嗪类药、三环抗抑郁药、阻滞药等可升高本品血药浓度。具体见下。鉴于本药对中枢神经系统的作用，在与其它作用于中枢的药物同时服用时应慎重。本药可拮抗左旋多巴及其它多巴胺促效剂的作用。酰胺咪嗪会降低本药之活性成份的血浆浓度。其它的肝酶诱导剂也会有相似的作用。一旦停止使用酰胺咪嗪或其它肝酶诱导剂，则应重新确定使用本药的剂量，必要时可减量。吩噻嗪、三环抗抑郁药和一些 α -阻断剂会增加利培酮的血药浓度，但不增加抗精神病活性成份的血药浓度。当和其它与蛋白高度结合的药物一起服用时，不存在有临床意义的从血浆蛋白的相互置换。用法用量口服，成人，0.5mg~2mg/次，2次/日。视疗逐渐增加剂量至4mg~6mg/日，不宜超过10mg/日。具体见下。由使用其它抗精神病药改用本药者假如从医学上考虑合适，开始使用本药时，应渐停用原先使用的抗精神病药。若病人原来使用的是长效抗精神病药，则可用本药的治疗来替代下一疗程的用药。已用的抗-帕金森氏综合征的药是否需要继续则应定期地进行重新评定。本药可每日一次或两次口服给药，对大多数病人，应从低剂量（0.5-1 mg）开始

，缓慢加量。每周一次调整剂量。每次增减药量为1-2 mg/日。本药最佳剂量为4-6 mg/日。现已证实，每日一次给药8 mg是安全的。剂量增加并不一定有更好的疗效，反而会引起较多的锥体外系反应。老年人建议起始剂量为每日二次，每次0.5 mg，根据个体需要，剂量逐渐加大到每日二次，每次1-2 mg。在获得更多的经验前，老年人应慎用本药。肾病和肝病者建议起始剂量为每日二次，每次0.5 mg。根据个体需要，剂量可逐渐加大到每日二次，每次1-2 mg。在获得更多的经验前，肾病和肝病者应慎用本药。注重事项妊娠C类。妊娠、哺乳期妇女、儿童禁用。帕金森、癫痫、心血管疾病患者慎用。治疗期间避免驾驶等精密操作。具体见下。妊娠C类。患有心血管疾病的人（如心衰、心肌梗塞、传导异常、脱水、失血及脑血管病变）应慎用本药，并应逐渐增加剂量（见用法和用量）。由于本药的 α -阻断活性，尤其在药物初用期，会发生体位性低血压，此时则应考虑减量。具有多巴胺受体拮抗剂性质的药物会引起迟发性运动障碍，其特征为有节律的不随意运动，主要见于舌及面部。老年患者及肾功能不全和肝功能不全患者的起始剂量应减半，随后的剂量增加也应减半。患有帕金森氏综合征的病人应慎用本药，因为在理论上该药会引起此病的恶化。经典的抗精神病药会降低癫痫的发作用阈值，故患有癫痫的病人仍应慎用本药。服用本药的患者应避免进食过多，以免发胖。本药对需要警觉性的活动有影响。因此，在了解到病人对该药的敏感性前，建议病人不应驾驶汽车或操作机器。妊娠、哺乳期妇女，已知对本药过敏的患者以及15岁以下儿童禁用。

100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问

