

利舍平注射液 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_E8_88_8D_E5_B9_B3_E6_c22_311332.htm 药品名称利舍平注射液 药物别名利血平，蛇根碱 Serpasil 英文名称 Reserpine#093. 类别降血压药制剂注射液：1ml：1mg、1ml：2.5mg。分子式成分化学名：11，17-二甲氧基-18- [（3，4，5-三甲氧基苯甲酰）氧] 育亨烷-16-甲酸甲酯。分子式：C₃₃H₄₀N₂O₉。分子量：608.69 药理毒理 1.利血平是肾上腺素能神经元阻断性抗高血压药。 2.本品通过耗竭四周交感神经末梢的肾上腺素，心、脑及其他组织中的儿茶酚胺和5-羟色胺达到抗高血压、减慢心率和抑制中枢神经系统的作用。降压作用主要通过减少心输出量和降低外周阻力、部分抑制心血管反射实现。减慢心率的作用对正常心率者不明显，但对于窦性心动过速者则明显。 3.利血平作用于下丘脑部位产生镇静作用，但无致嗜睡和麻醉作用，不改变睡眠时脑电图，可缓解高血压病人焦虑、紧张和头痛。 4.实验动物给予低于临床剂量的利血平后，即出现瞳孔缩小、眼睑松弛和下垂、体温过低、胃肠道活动加快等症状。人的治疗应用剂量范围内，仅有胃肠道活动增加的表现。 致突变实验：体外微生物回复突变试验显示，利血平1-5000mcg 对*S. typhimurium*的四个菌株没有致突变作用，0.3-10mg不引起小鼠成纤维细胞的转化。利血平使培养的小鼠乳腺癌细胞出现了一些染色体畸变，但实验结果仍属于阴性；利血平对培养的人类外周白细胞无染色体畸变作用，但有丝分裂象增加。 一项研究报道某种利血平制剂在10mg/kg以内引起小鼠染色体畸变和显性致死突变；但另一项研究显示小鼠腹腔给药0.92-4.6mg/kg，未出现显性致死突

变。致畸试验：利血平可通过豚鼠的胎盘屏障并消耗胎鼠儿茶酚胺贮存。两项小型实验显示，大鼠口服利血平0.25mg/kg（相当于临床最大剂量的35倍）不影响生育；生殖研究显示，大鼠怀孕早期肌肉注射或腹腔给予利血平1~2mg/kg（相当于临床最大剂量的125-250倍）有致畸作用，产生各种胎儿异常如无眼畸形、无中轴骨骼、肾盂积水等。在兔子妊娠早期或晚期给予利血平0.04mg/kg（10倍于临床最大剂量）即可中止妊娠。致癌实验：对啮齿动物的实验显示利血平是一种动物致癌物质。将利血平以5-10ppm的浓度（100-300倍于临床常用剂量）放在食物中喂养动物，为期两年，导致雌性小鼠乳房纤维腺瘤、雄性小鼠精囊恶性肿瘤、雄性大鼠肾上腺髓质恶性肿瘤的发生率增加。乳腺肿瘤可能与利血平引起泌乳刺激素水平升高有关，因为其它数种有促泌乳刺激素作用的药物均涉及啮齿动物乳腺肿瘤发生率增加。药动学肌肉注射利血平4小时后降压作用达高峰，持续10小时；静脉推注后1小时起降压作用。代谢缓慢，停药后作用可持续1-6周，分布相半衰期（ $T_{1/2}$ ）和消除相半衰期（ $T_{1/2}$ ）分别为4.5小时和45-168小时，严重肾功能衰竭（无尿）者可达87-323小时。利血平在肝脏通过水解反应代谢，并缓慢经粪便和尿液排出体外。适应症轻、中度高血压，高血压危象。不良反应鼻塞、口干、胃肠不适、腹泻、乏力、眩晕、抑郁、嗜睡。大剂量可引起心律失常、心动过缓。偶可引起帕金森综合征、呼吸困难、乳房胀大、溢乳、性功能障碍、鼻衄、头痛、排尿困难、钠潴留、浮肿、紫癜、消化性溃疡、焦虑、视力模糊等相互作用1.与乙醇或中枢神经抑制剂合用可加重中枢抑制作用；2.与其它降压药或利尿药合用可加强降压作用，需

进行剂量调整；与 阻滞剂合用可使后者作用增强；3.与洋地黄或奎尼丁合用，大剂量时可引起心律失常；4.与左旋多巴合用可使多巴胺耗竭，导致帕金森氏症；5.与间接性拟肾上腺素药如麻黄碱、苯丙胺等合用，可使儿茶酚胺贮存耗竭，抑制拟肾上腺素药的作用；6.与直接性拟肾上腺素药如肾上腺素、异丙肾上腺素、去甲肾上腺素、间羟胺、去氧肾上腺素等合用，可使之作用延长；7.与三环类抗抑郁药合用，利血平和抗抑郁药作用均减弱；8.巴比妥类可加强利血平的中枢镇静作用。用法用量高血压危象：肌注0.5mg~1mg，以后按需要每4~6h肌注0.4mg~0.6mg。#093.药物过量导致呼吸抑制、昏迷、低血压、抽搐和体温过低。利血平不能通过透析排除。严重低血压者置于卧位，双脚上抬，并慎重给予直接性拟肾上腺素升压药；呼吸抑制者予以吸氧和人工呼吸；纠正脱水、电解质失衡、肝昏迷和低血压。由于利血平作用持续较长，病人需至少观察72小时。注重事项妊娠C类。妊娠、哺乳期妇女禁用。精神抑郁病史、癫痫、震颤麻痹、消化性溃疡、溃疡性结肠炎、胆石症、嗜铬细胞瘤、心律失常者慎用。老年体弱者减量，出现清晨失眠或精神抑郁等症时应停药，电休克治疗前二周即应停药。治疗期间若手术应告知麻醉医师，可给予阿托品以防心动过缓。抑郁症，尤其是有自杀倾向的抑郁症禁用。

- 1.对罗芙木制剂过敏者对本品过敏。
- 2.利血平可以增加胃酸分泌和胃肠动力，慎用于有胃溃疡、溃疡性结肠炎或胃肠功能失调等病史者。
- 3.利血平慎用于胆结石患者以防发生胆绞痛，慎用于过敏患者以防发生支气管哮喘。
- 4.利血平慎用于体弱和老年患者、肾功能不全、帕金森氏症、癫痫、心律失常和心肌梗塞。
- 5.利血平可能导

致低血压，包括体位性低血压。 6.治疗期间，可能发生焦虑、抑郁以及精神病。在服药剂量不大于0.25mg/日时，少见抑郁症发生；若之前就有抑郁症，用药可加重病症。一旦有抑郁症状立即停药；有抑郁病史的病人用药需非常慎重，并警惕自杀的可能性。 7.当两种或两种以上抗高血压药合用时，需减少每种药物的用量以防止血压过度下降，这对有冠心病的高血压病人尤为重要。 8.正在服用利血平的患者不能同时进行电休克治疗，小的惊厥性电休克剂量即可引起严重的甚至是致命的反应。停用利血平至少7天后方可开始电休克治疗。 9.需周期性检查血电解质以防电解质失衡。 10.麻醉期间用利血平可能加重中枢镇静，导致严重低血压和心动过缓。必须告诉麻醉师，事先给予阿托品防止心动过缓，用肾上腺素纠正低血压。 11.利血平对化验的影响：以改良的Glenn-Nelson法或Holtroff Koch改良的Zimmerman 反应作尿类固醇测定，可致结果假性低值；使血清催乳素浓度升高；短期大量注射使尿中儿茶酚胺排出增多，长期使用则减少；肌肉注射后尿中香草杏仁酸最初排出增加40%，第二天减少，长期给药排出锐减。 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