

盐酸可乐定片 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\\_\\_E7\\_9B\\_90\\_E9\\_85\\_B8\\_E5\\_8F\\_AF\\_E4\\_c22\\_311369.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/311/2021_2022__E7_9B_90_E9_85_B8_E5_8F_AF_E4_c22_311369.htm) 药品名称盐酸可乐定片 英文名称Clonidine Hydrochloride Tablets 类别降血压药制剂 本品为白色片：75、150 μg。分子式成分化学名：[2-(2,6-二氯苯基)亚氨基]咪唑烷盐酸盐。分子式：C<sub>9</sub>H<sub>9</sub>Cl<sub>2</sub>N<sub>3</sub>HCl。分子量：266.56。药理毒理1.可乐定是 α<sub>2</sub>受体激动剂。2.可乐定直接激动下丘脑及延脑的中枢突触后膜 α<sub>2</sub>受体，使抑制性神经元激动，减少中枢交感神经冲动传出，从而抑制外周交感神经活动。可乐定还激动外周交感神经突触前膜 α<sub>2</sub>受体，增强其负反馈作用，减少末梢神经释放去甲肾上腺素，降低外周血管和肾血管阻力，减慢心率，降低血压。肾血流和肾小球滤过率基本保持不变。直立性症状较轻或较少见，很少发生体位性低血压。3.盐酸可乐定使卧位心输出量中度（15%~20%）减少，而不改变四周血管阻力；45°倾斜时轻度减少心输出量和四周血管阻力。长期治疗后心输出量趋于正常，但四周血管阻力持续降低。使用可乐定的患者大部分有心率减慢，但药物对血液动力学无影响。4.临床研究证实可乐定降低血浆肾素活性、减少醛固酮及儿茶酚胺分泌，但这些药理作用与抗高血压作用的确切关系并不完全清楚。5.急性使用盐酸可乐定刺激儿童和成人的生长激素释放，但长期使用不引起生长激素水平持续增高。6.可乐定可以治疗偏头疼、痛经及绝经期潮热，但其治疗机制不明，可能通过稳定四周血管发挥作用。可能通过抑制脑内 α<sub>2</sub>受体活性戒阿片瘾。致癌、致突变及生殖毒性小鼠服用32至46倍人体最大推荐剂量的盐酸可乐定132周，无致癌事件。3倍于人体最大推

荐剂量的盐酸可乐定对兔子无致畸作用，无红细胞毒性作用。盐酸可乐定150mcg/kg或约3倍于人体最大推荐剂量时不影响雄性或雌性小鼠的繁殖能力；但500~2000mcg/kg或10~40倍人体最大推荐剂量，影响雌性小鼠繁殖能力。药动学本品口服后70%~80%吸收，并很快分布到各器官，组织内药物浓度比血浆中高，能通过血脑屏障蓄积于脑组织。蛋白结合率为20%~40%。口服本品后半小时到1小时发挥降压作用，3~5小时血药浓度达峰值，一般为1.35ng/ml，作用持续时间6~8小时。消除半衰期为12.7(6~23)小时，肾功能不全时延长。表观分布容积为 $2.1 \pm 0.4$ L/kg。肌酐清除率 $3.1 \pm 1.2$ ml/(min.kg)。在肝脏代谢，约50%吸收的剂量经肝内转化。40%~60%以原形于24小时内经肾排泄，20%经肝肠循环由胆汁排出。不良反应大部分不良反应稍微，并随用药过程而减轻。常见：最常见口干(与剂量有关)，昏睡，头晕，精神抑郁，便秘和镇静，性功能降低和夜尿多，瘙痒，恶心、呕吐，失眠，荨麻疹、血管神经性水肿和风疹，疲惫，竖立性症状，紧张和焦躁，脱发，皮疹，厌食和全身不适，体重增加，头痛，乏力，戒断综合征，短暂肝功能异常。少见：肌肉关节痛，心悸、心动过速、心动过缓，下肢痉挛，排尿困难，男性乳房发育，尿潴留，更少见有多梦、夜游症、烦躁不安、兴奋、幻视幻听、谵妄、雷诺现象、心力衰竭，心电图异常如传导紊乱、心律失常、乙醇过敏、发烧、短暂血糖升高、血清肌酸磷酸激酶升高、肝炎和腮腺炎等。相互作用大部分不良反应稍微，并随用药过程而减轻。常见：最常见口干(与剂量有关)，昏睡，头晕，精神抑郁，便秘和镇静，性功能降低和夜尿多，瘙痒，恶心、呕吐，失眠，荨

麻疹、血管神经性水肿和风疹，疲惫，竖立性症状，紧张和焦躁，脱发，皮疹，厌食和全身不适，体重增加，头痛，乏力，戒断综合征，短暂肝功能异常。少见：肌肉关节痛，心悸、心动过速、心动过缓，下肢痉挛，排尿困难，男性乳房发育，尿潴留，更少见有多梦、夜游症、烦躁不安、兴奋、幻视幻听、谵妄、雷诺现象、心力衰竭，心电图异常如传导紊乱、心律失常、乙醇过敏、发烧、短暂血糖升高、血清肌酸磷酸激酶升高、肝炎和腮腺炎等。用法用量1.降低血压口服，起始剂量0.1 mg，一日2次；需要时隔2~4天递增，每日0.1~0.2mg。常用维持剂量为0.3~0.9mg/日，分2~4次口服。严重高血压需紧急治疗时开始口服0.2mg，继以每小时0.1mg，直到舒张压控制或总量达0.7mg，然后用维持剂量。2.绝经期潮热一次0.025~0.075mg，每日2次。3.严重痛经口服0.025mg，每日2次，在月经前及月经时，共服14日。4.偏头痛一次0.025mg，每日2~4次，最多为0.05mg，每日3次。5.极量一次0.6mg，一日2.4mg。#093.过量的症状和体征包括低血压、心动过缓、嗜睡、烦躁、乏力、困倦、反射减低或丧失、恶心、呕吐和通气不足。过大剂量可有可逆性心脏传导障碍或心律失常，短暂高血压。低血压时应平卧，抬高床脚，必要时静脉输液，给多巴胺升血压。高血压时静脉给咪噻米、二氮嗪、酚妥拉明或硝普钠对症治疗。注重事项对可乐定过敏者禁用。1.长期用药由于液体潴留及血容量扩充，可产生耐药性，降压作用减弱，但加利尿剂可纠正。2.治疗时忽然停药或连续漏服数剂，可发生血压反跳性增高。多于12-48小时出现，可持续数天，其中5%~20%的病人伴有神经紧张、胸痛、失眠、脸红、头痛、恶心、唾液增多、呕吐

、手指颤抖等症状。日剂量超过1.2mg或与 受体阻滞剂合用时，忽然停药后发生反跳性高血压的机会增多。因此，停药必须在1-2周内逐渐减量，同时加以其他降压治疗。血压过高时可给二氮嗪或 阻滞剂，或再用本品。若手术必须停药，应在术前4~6小时停药，术中静滴降压药，术后复用本品。

3.为保证控制夜间血压，天天末次服药宜在睡前。 4.下列情况慎用：脑血管病、冠状动脉供血不足、精神抑郁史、近期心肌梗死、雷诺病、慢性肾功能障碍、窦房结或房室结功能低下、血栓闭塞性脉管炎。 5.对诊断的干扰：应用本品时可使直接抗球蛋白（Coombs）实验弱阳性，尿儿茶酚胺和香草杏仁酸（VMA）排出减少。

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)