

迪坦妥 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__E8_BF_AA_E5_9D_A6_E5_A6_A5_c22_311442.htm 药品名称迪坦妥药物别名布那唑嗪 bunazosin HCL 英文名称Detantol R 类别降血压药制剂本剂为白色缓释性膜衣片，3 mg的片剂上有E41的识别记号；6 mg的片剂上有E43的识别记号。分子式成分本品主要成分为盐酸布那唑嗪，其分子式为 $C_{19}H_{27}N_5O_3 \cdot HCl$ ，分子量为409.91。药理毒理盐酸布那唑嗪选择性地阻断心血管系统的 α_1 受体。用大白鼠输精管进行的体外试验表明，盐酸布那唑嗪可选择性地阻断 α_1 受体，而对 α_2 受体没有影响。因此，不妨碍由交感神经末梢 α_2 受体所介导的去甲肾上腺素释放的负反馈调节机制，从而不会导致去甲肾上腺素的过量释放。在用豚鼠肺动脉及肠系膜静脉进行的体外试验中，盐酸布那唑嗪可选择性地阻断 α_1 受体，即使高浓度也不影响 α_2 受体。本药通过降低外周血管阻力而显示降压作用。盐酸布那唑嗪选择性地阻断外周血管的 α_1 受体而扩张血管，对于自然发病的高血压大鼠，DOCA食盐高血压大鼠和肾性高血压犬均有降压作用。此外，盐酸布那唑嗪不增加因降压而产生生物反应的体液性升压因子。毒理学 急性毒性 $LD_{50}(mg/kg)$ ：经口给药，雄性小白鼠的 LD_{50} 为1201 mg/kg，雌性为1250 mg/kg；雄性大白鼠的 LD_{50} 为980 mg/kg，雌性为1280 mg/kg。慢性毒性：给大白鼠连续6个月至12个月经口给予本剂1、3、10、30 mg/kg/日，结果在10 mg/kg以上给药组可见肝细胞肿大，在30 mg/kg给药组可见肾脏、肾上腺的重量增加等变化。给犬连续54周经口给予1、5、25 mg/kg/日进行了观察，但在血液学检查、脏器重量、病理组织学检查等均未见异常。生殖毒性

：妊娠前及妊娠初期给药试验：在大白鼠的妊娠前及妊娠初期经口给与本剂6.25、25、50、100 mg/kg/日，结果在25 mg/kg以上给药组的母体动物可见妊娠率降低，但胎仔出生未见异常。胎仔器官形成期给药试验：在大白鼠的器官形成期经口给予本剂6.25、25、50、100、200、400 mg/kg/日，结果在25 mg/kg以上给药组可见对母体动物肝、肾的影响。同时也有迹象显示新生仔的发育迟缓。此外，在100 mg/kg/以上给药组发现胚胎死亡。在200 mg/kg分次给药组呈现致畸性，但在100 mg/kg以下给药组未发现有此现象。围产期及哺乳期给药试验：在大白鼠的围产期哺乳期经口给予本剂6.25、25、50、100 mg/kg/日进行了观察，结果新生仔的行为及功能发育、形态及生殖性能未见异常。但在50 mg/kg以上给药组发现对哺乳有影响。非凡毒性：抗原性试验、致突变性试验及致癌性试验均呈阴性。药动学健康成人的生物利用度：对健康成人（12名）经口给予盐酸布那唑嗪2mg（1 mg片剂2片）及盐酸布那唑嗪缓释片6 mg（6mg片剂1片）后，对血浆中药物浓度的变化所进行的比较表明，盐酸布那唑嗪缓释片的相对生物利用度为81.1%， C_{max} 、 T_{max} 和平均滞留时间（MRT）等指标也显示其具有持续性。此外，未发现饮食对盐酸布那唑嗪缓释片的吸收有影响。生物学等同性：以健康成人（24名）为对象探讨了盐酸布那唑嗪缓释片3 mg片剂与6 mg片剂的生物学等同性，结果指出两种制剂是等同的。肾功能障碍者的体内动态：高血压症患者（其中肾功能正常者6名、肾功能障碍者5名）一日1次口服6 mg片剂1片，连续服用8天时，对肾功能障碍患者在给药第1天及第8天的药物动态参数与肾功能正常患者进行了比较，结果显示，肾功能障碍患者的最

高血浆中药物浓度（Cmax）上升。适应症高血压症不良反应如出现过敏反应，应停止用药。相互作用注重与其他药物的并用：利尿剂或其他降压剂：并用时有可能使其作用增强，故应注重减量。利福平：由于利福平的肝药物代谢酶诱导作用，有时会减弱本剂的效果。用法用量通常，成人（以盐酸布那唑嗪计算）一日1次3-9 mg口服。但给药量从一日1次3 mg开始，一日量最多以9 mg为限。注重事项禁用于对本剂成分有过敏史的患者。重要的一般性注重：在给药初期或忽然增加用量的情况下，有时可出现由于体位性低血压所引起的起立时的眩晕、头晕等症状，因而对从事高空作业、驾驶汽车等伴有危险性工作的人，在给药时应予以注重。因有时会产生体位性低血压，故不仅应测定卧位血压，还应测定站立位或坐位血压。考虑到体位变换会引起血压变化，宜在坐位时控制血压。在给药初期或忽然增加用量的情况下，有时可致起立时眩晕、头晕、恶心或胸部不适、呼吸困难等。此时应采取让患者成仰卧位等适当措施。也可根据需要，在充分考虑患者的合并症、既往史等情况的基础上，采取给与升压剂等对症治疗。谨慎用药：有肝功能障碍的患者：本剂主要在肝结合后排泄于粪便中，因此，有可能导致肝功能低下的患者血药浓度升高。有肾功能障碍的患者：本药有时会导致有肾功能障碍患者的最高血药浓度升高。服药时的注重：服用时，把本剂嚼碎服用时，有随着一过性血药浓度升高而易于出现副作用的可能性，因此服用本剂时切勿咀嚼。其他：有1例报告指出，存在肾等处动脉狭窄、脚部以及其它动脉瘤等血管障碍的高血压患者因类似化合物（盐酸哌唑嗪）的作用而出现了急性发热性多发性关节炎。对妊娠和哺乳的影响

因在动物试验（大白鼠）中有致畸作用的报告，故对孕妇或可能怀孕的妇女给药时，应在判定其在治疗上的有益性高于危险性时，方可用药。因在动物试验（大白鼠）中有向乳汁中传递的报告，故对哺乳期妇女用药时停止哺乳为佳。对儿童的影响对儿童的安全性尚未确定。对老年人的影响对老年人应注重以下几点，随时观察患者，从小剂量（3 mg/日）开始谨慎给药。对于老年患者，一般认为不宜追求过度降压（有引起脑梗塞的危险）。老年患者多数肝、肾功能低下，且有体重减少等轻易发生副作用的倾向，应注重密切观察病情经过，谨慎地增加用量。当发觉降压过度时，应减量或停止用药，也可考虑换用其它降压剂。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