

万拉法新 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__E4_B8_87_E6_8B_89_E6_B3_95_E6_c22_311834.htm 药品名称万拉法新药物

别名博乐欣、文拉法辛、凡拉克辛 Effexor、Efexor 英文名称venlafaxime 类别抗抑郁症药制剂胶囊剂，25mg分子式成分化学名： (\pm) -1-[2-(二甲氨基)-1-(4-甲氧苯基)-乙基]环己醇。药理毒理本品是一种不同于其他抗抑郁药物的具有独特化学结构和神经药理学作用的新型抗抑郁药，属5-羟色胺(5-HT)-去甲肾上腺素(NE)再摄取抑制剂，通过显著抑制5-HT和NE的重摄取而发挥抗抑郁作用，其抗抑郁效能较三环类(TCAS)抗抑郁药强或相似，单次或多次给药均可降低由异丙肾上腺素刺激大鼠松果体而产生的cAMP浓度，起效快，而TCAs则需长期给药才有此效能。同时对多巴胺(DA)的重摄取也有稍微抑制作用。本品对单胺氧化酶无抑制作用，与胆碱能、组胺能、肾上腺能等受体无亲和力，因而没有与这些受体相关的镇静、口干、便秘、尿潴留及视物模糊等不良反应。药动学口服后从胃肠道吸收，并经首过效应在肝脏中由细胞色素P450 D6酶代谢，主要代谢产物为O-去甲基万拉法新(ODV)，其抗抑郁作用与母体药相似。本品与ODV各项药动学参数分别为达峰时间为 (1.7 ± 0.5) 及 (2.1 ± 0.8) h，分布容积为 (7.5 ± 3.7) 及 (5.7 ± 1.8) L/kg；消除半衰期为 (4.9 ± 2.4) 及 (10.6 ± 2.4) h；血浆蛋白结合率为 $(27 \pm 2)\%$ 及 $(30 \pm 12)\%$ 。健康受试者服用75mg约2h后其血浆浓度达 $0.1 \mu\text{g/L}$ 。本品主要经肾消除，原形药在尿中仅4.7%，代谢产物ODV为56%。肝硬化和肾衰患者单次服药后其母体药物及主要代谢物ODV总体清除率分别降低55%和33%，消除半衰期显著延长。适应症

各种抑郁症，包括神经衰弱症、各种疾病伴发的抑郁状态、焦虑症、恐怖症、妇女经前综合征、儿童多动症、慢性疲惫综合症及慢性疼痛、失眠等。不良反应常见不良反应为恶心、盗汗、嗜睡、失眠、头昏等。在短期内使用本品30~450mg/d均有良好耐受性，不良反应大多暖和，并存在剂量相关性，一般在治疗早期发生，随着继续用药，可逐渐减轻。其他个别患者有肝酶、血清胆固醇升高，曾有引起癫痫的报道，日剂量高于200mg时可使血压轻度升高，但与安慰剂对照或其他抗抑郁药无差异。用法用量推荐起始剂量为75mg/d，分2~3次服用。可酌情逐渐增加剂量至最大剂量375mg/d，分3次服。有自杀倾向者应迅速加大剂量至200mg/d以上。

注重事项 对本品过敏者禁用。本品与单胺氧化酶抑制剂合用将产生严重的甚至致命的不良反应，故不能合用。使用过单胺氧化酶抑制剂的患者需停药14d后方可使用本品；使用过本品的患者需停药7d后方可使用单胺氧化酶抑制剂。癫痫和血液病患者慎用，孕妇和儿童也应小心服用。肾衰患者和肝硬化患者母体药物及其主要代谢产物消除半衰期显著延长，故肝、肾功能不全患者必须相应调整剂量。本品对细胞色素P450 酶有抑制作用，与西咪替丁合用时可使其清除率降低，与其他经此酶代谢的药物合用时也可能发生药物相互作用。用药过程中不能忽然停药。

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