

盐酸金曲林 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\\_E9\\_87\\_91\\_E6\\_c22\\_311848.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/311/2021_2022__E7_9B_90_E9_85_B8_E9_87_91_E6_c22_311848.htm) 药品名称盐酸金曲林药物别名郁乐复，左洛复 Zoloft，Sertraline Hydrochloride 英文名称Sertraline Hydrochloride 类别抗抑郁症药制剂本品为白色薄膜衣片，片芯也为白色。片剂：50mg/片分子式成分化学名称为：（1S-顺式）-4-（3，4-二氯苯基）-1，2，3，4-四氢-N-甲基-1-萘啶胺盐酸盐。分子式C<sub>17</sub>H<sub>17</sub>NCI<sub>2</sub>HCl；分子量342.7 药理毒理舍曲林在体外是神经元强效和特异的5-羟色胺再摄取抑制剂，能导致动物体内5-羟色胺效应的增强。舍曲林对神经元中去甲肾上腺素和多巴胺的再摄取仅有极稍微的作用。在临床剂量下，舍曲林阻断人类血小板对5-羟色胺的摄取。在动物体内，舍曲林没有中枢兴奋作用、镇静作用、抗胆碱能作用和心脏毒性。在健康志愿者所做的对照研究中，舍曲林不引起镇静作用，因而不影响各种精神运动的操作。由于它选择性地抑制5-羟色胺的再摄取，因此它并不增强儿茶酚类神经介质的活性。舍曲林与毒蕈碱受体（胆碱能）、5-羟色胺能受体、多巴胺受体、肾上腺素受体、组织胺受体、GABA受体以及苯二氮类受体没有亲和性。动物长期给予舍曲林后可使脑内去甲肾上腺素受体下调，这与临床其它抗抑郁药物作用相一致。与三环类抗抑郁药物不同，舍曲林在治疗抑郁症和强迫症的临床对照研究中并不引起体重增加，某些病人可能会出现体重减轻。舍曲林未表现出滥用的可能性。在舍曲林、阿普唑仑和右旋苯丙胺的安慰剂对照、双盲随机研究中，比较它们的滥用倾向，舍曲林没有产生滥用倾向所特有的正性主观效应。试验对象在一些反映药物滥

用的指标如对药物的喜欢程度、欣快和滥用倾向方面都评价阿普唑伦和右旋苯丙胺显著地大于安慰剂。舍曲林既没有右旋苯丙胺伴随的兴奋刺激和致焦虑作用，也没有阿普唑伦伴随的镇静作用和对精神运动功能的损伤。舍曲林既没有在功能上成为经练习后可自行摄用可卡因的恒河猴的正性增强剂，也没有做为对恒河猴的选择性刺激物而取代右旋苯丙胺或苯巴比妥。长期给药的动物试验表明：舍曲林具有良好的安全性。应用相当于临床有效治疗剂量数倍的药物剂量动物也能够良好耐受。舍曲林无致畸作用。药动学男性每日口服舍曲林一次50-200mg，舍曲林表现出与用药剂量成正比的药代动力学特性，连续用药14天，服药4.5-8.4小时人体血药浓度达峰值（C<sub>max</sub>）。青少年和老年人的药代动力学参数与18-65岁之间成人无明显差别。舍曲林平均半衰期为22-36小时。与终末清除半衰期相一致，天天给药一次，一星期后达稳态浓度，在这过程中有两倍的浓度蓄积。舍曲林的血浆蛋白结合率为98%。动物实验结果表明，舍曲林有较大的分布容积。舍曲林主要首先通过肝脏代谢，血浆中的主要代谢产物N-去甲基舍曲林的药理活性在体外明显低于舍曲林，约是舍曲林的1/20，没有证据表明其在抗抑郁模型体内有药理活性，它的半衰期是62-104小时。舍曲林和N-去甲基舍曲林的最终代谢产物从粪便和尿中等量排泄，只有少量（#091.药物过量#091.孕妇及哺乳期妇女用药#091.儿童用药#091.老年患者用药gt.65岁）参加了证实舍曲林在这部分人群中疗效的临床试验。老年患者中不良反应的形式和发生率与年轻患者中的相似。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)