

茶碱 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/312/2021_2022__E8_8C_B6_E7_A2_B1_c22_312510.htm 药品名称茶碱 英文名

称Theophylline 类别磷酸二酯酶抑制剂制剂片剂(葆乐

辉Protheo)：400mg；胶囊剂(埃斯玛隆Asmalon)：50mg

、100mg、200mg。本品为白色片。分子式成分化学名称为1

, 3-二甲基-3, 7-二氢-1H-嘌呤-2, 6-二酮-水合物。分子式：

(C₇H₈N₄O₂)·H₂O。分子量：198.18 药理毒理本品对呼吸

道平滑肌有直接松弛作用。其作用机理比较复杂，过去认为通过抑制磷酸二酯酶，使细胞内cAMP含量提高所致。近来实验认为茶碱的支气管扩张作用部分是由于内源性肾上腺素与

去甲肾上腺素释放的结果，此外，茶碱是嘌呤受体阻滞剂，能对抗腺嘌呤等对呼吸道的收缩作用。茶碱能增强膈肌收缩力，尤其在膈肌收缩无力时作用更显著，因此有益于改善呼吸功能。

药动学口服后活性成分缓慢释放，吸收迅速，PB约50%，90%经肝脏代谢，有效的血药浓度在10(g ~ 15(g/ml之间，可维持长达24h。缓释片：口服易被吸收，血药浓度达峰时间为4-7小时，每日口服一次，体内茶碱血药浓度可维持在治疗范围内(5 ~ 20 μg/ml)达12小时，血药浓度相对较平稳。蛋白结合率约60%。T_{1/2}新生儿(6个月内) > 24小时，小儿(6月以上) 3.7小时 ± 1.1小时，成人(不吸烟并无哮喘者) 8.7小时 ± 2.2小时，吸烟者(一日吸1-2包) 4-5小时。本品主要在肝脏代谢，由尿排出，其中约10%为原形物。适应症支气管哮喘、伴有慢性支气管炎和肺气肿的可逆性支气管炎痉挛，对夜间发作的哮喘更适合。不良反应可见头痛、恶心、失眠，少见消化不良、震颤和眩晕。茶碱的毒性常出现

在血清浓度为15-20 $\mu\text{g/ml}$ ，非凡是在治疗开始，早期多见的有恶心、呕吐、易激动、失眠等，当血清浓度超过20 $\mu\text{g/ml}$ ，可出现心动过速、心律失常，血清中茶碱超过40 $\mu\text{g/ml}$ ，可发生发热、失水、惊厥等症状，严重的甚至呼吸、心跳停止致死。相互作用与别嘌醇、西咪替丁、环丙沙星、红霉素及口服避孕药等合用可升高本品血药浓度，利福平则相反。与苯妥英钠合用时两者血药浓度均降低。非选择性的 β -阻滞剂可拮抗本品作用。地尔硫卓、维拉帕米可干扰茶碱在肝内的代谢，与本品合用，增加本品血药浓度和毒性。西咪替丁可降低本品肝清除率，合用时可增加茶碱的血清浓度和（或）毒性。某些抗菌药物，如大环内酯类的红霉素、罗红霉素、克拉霉素、氟喹诺酮类的依诺沙星、环丙沙星、氧氟沙星、左氧氟沙星、克林霉素、林可霉素等可降低茶碱清除率，增高其血药浓度，尤以红霉素和依诺沙星为著，当茶碱与上述药物伍用时，应适当减量。苯巴比妥、苯妥英、利福平可诱导肝药酶，加快茶碱的肝清除率；茶碱也干扰苯妥英的吸收，两者血浆中浓度均下降，合用时应调整剂量。与锂盐合用，可使锂的肾排泄增加。影响锂盐的作用。与美西律合用，可减低茶碱清除率，增加血浆中茶碱浓度，需调整剂量。与咖啡因或其他黄嘌呤类药并用，可增加其作用和毒性。用法用量口服，成人，开始，胶囊剂200mg/日，片剂400mg/日，晚餐后服。根据疗效和血药浓度以及耐受程度，可每隔3日增加200mg，最大用量，胶囊600mg/日，片剂900mg/日，2次/日。3岁以上儿童的起始剂量为每日10mg/kg。注重事项对本品过敏的患者，活动性消化溃疡和未经控制的惊厥性疾病患者禁用。妊娠C类。妊娠、哺乳期

妇女和12岁以下的儿童慎用。应将胶囊或片剂整粒吞服。 1、与其他茶碱缓释制剂一样，本品不适用于哮喘持续状态或急性支气管痉挛发作的患者。 2、应定期监测血清茶碱浓度，以保证最大的疗效而不发生血药浓度过高的危险。 3、肾功能或肝功能不全的患者，年龄超过55岁非凡是男性和伴发慢性肺部疾病的患者，任何原因引起的心力衰竭患者，持续发热患者。使用某些药物的患者及茶碱清除率减低者，在停用合用药物后，血清茶碱浓度的维持时间往往显著延长。应酌情调整用药剂量或延长用药间隔时间。 4、茶碱制剂可致心律失常和（或）使原有的心律失常恶化；患者心率和（或）节律的任何改变均应进行监测和研究。 5、低氧血症、高血压或者消化道溃疡病史的患者慎用本品。 #093. 本品可通过胎盘屏障，也能分泌入乳汁，随乳汁排出，孕妇、产妇及哺乳期妇女慎用。 #093. 新生儿血浆清除率可降低，血清浓度增加，应慎用。 12岁以下儿童服用本品的安全性、有效性尚不确定。 12岁以上儿童使用时请遵医嘱。 #093. 老年人因血浆清除率降低，潜在毒性增加，55岁以上患者慎用。 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