

醋酸亮丙瑞林 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文
https://www.100test.com/kao_ti2020/312/2021_2022__E9_86_8B_E9_85_B8_E4_BA_AE_E4_c22_312723.htm 药品名称醋酸亮丙瑞林
药物别名LEUPROLIDE ACETATE、ELIGARD 英文名
称Leuprorelin acetate 类别脑垂体激素及其有关药物制剂注射液：3.75mg、10mg
药理毒理重复给予大剂量的促黄体生成释放激素（LH-RH）或其高活性衍生物醋酸亮丙瑞林，在首次给药后能立即产生一过性的垂体-性腺系统兴奋作用（急性作用），然后抑制垂体生成和释放促性腺激素。它还进一步抑制卵巢和睾丸对促性腺激素的反应，从而降低雌二醇和睾丸酮的生成（慢性作用）。醋酸亮丙瑞林的促黄体生成激素（LH）释放活性约为LH-RH的100倍，它的抑制垂体-性腺系统功能的作用也强于LH-RH。醋酸亮丙瑞林是高活性的LH-RH衍生物，由于它对蛋白分解酶的反抗力和对LH-RH受体的亲和力都比LH-RH强，所以能有效地抑制垂体-性腺系统的功能。此外，醋酸亮丙瑞林又是一种缓释制剂，它恒定地向血液中释放醋酸亮丙瑞林，故能有效地降低卵巢和睾丸的反应，产生高度有利的垂体-性腺系统的抑制作用。对子宫内膜异位症、子宫肌瘤或绝经前乳腺癌患者，每4周1次皮下注射醋酸亮丙瑞林，使血清中雌二醇下降到接近绝经期的水平。因此本品有卵巢功能抑制作用，可抑制正常排卵和使月经停止。对前列腺癌患者皮下注射醋酸亮丙瑞林，每4周1次，使血清睾丸酮浓度降至去势水平之下，表明本品有药理学的去势作用。对患有中枢性性早熟的男孩和女孩每4周1次，皮下注射醋酸亮丙瑞林后，血清中促性腺激素的水平降至青春期前的水平，表明对第二性征有进行性抑制作用。给大鼠

皮下注射醋酸亮丙瑞林后发现有下列垂体良性腺瘤。适应症子宫内膜异位症.伴有月经过多、下腹痛、腰痛及贫血等的子宫肌瘤；绝经前乳腺癌，且雌激素受体阳性患者；前列腺癌；中枢性性早熟症。不良反应内分泌系统：发热，颜面潮红，发汗，性欲减退，阳痿，男子女性化乳房，睾丸萎缩，会阴不适等现象。肌肉骨骼系统：可见骨疼痛，肩腰四肢疼痛。泌尿系统：可见排尿障碍，血尿等。循环系统：可见心电图异常，心胸比例增大等。消化系统：恶心，呕吐食欲不振等。过敏反应：可见皮疹搔痒等。注射局部疼痛，硬结，发红。其他：可见浮肿，胸部压迫感，发冷，倦怠，体重增加，知觉异常，听力衰退，耳鸣，头部多毛，尿酸，BUN，LDH，GOT，GPT上升等。由于雌激素降低作用而出现的更年期综合征样的精神抑郁状态。用法用量皮下注射，成人3.75mg/次，1次/4周。子宫内膜异位症：通常，成人每4周1次，皮下注射醋酸亮丙瑞林3.75mg。当患者体重低于50kg时，可以使用1.88mg的制剂。初次给药应从月经周期的1~5日开始。子宫肌瘤：通常，成人每4周1次，皮下注射醋酸亮丙瑞林1.88mg。但对于体重过重或子宫明显肿大的患者，应注射3.75mg。初次给药应从月经周期的1~5日开始。前列腺癌、闭经前乳腺癌：通常，成人每4周1次，皮下注射醋酸亮丙瑞林3.75mg。中枢性性早熟症：通常，每4周1次，皮下注射醋酸亮丙瑞林30mg/kg，根据患者症状可增量至90mg/kg。注意事项对本药成份、合成的LH-RH或LH-RH衍生物有过敏史者禁用。孕妇或有可能怀孕的妇女，或哺乳期妇女；有性质不明的、异常的阴道出血者#093.禁用。皮下注射部位选上臂部、腹部、臀部，注射后不得揉搓注射部位。首次用药初期

，由于高活性LH - RH衍生物对垂体 - 性腺系统的刺激作用，使血清睾丸素浓度上升，可见骨性疼痛暂时加重，尿储留或脊髓压迫症状，对症处理。已存在由脊髓压迫或尿储留引起的肾功能障碍者或者是有重新发作可能性的患者及高龄者慎用。治疗时一定要确认患者未妊娠，且于月经周期的1-5天开始给药，在治疗期内应采用非激素性方法避孕。给药时应留心与类似疾患(恶性肿瘤等)鉴别，如给药过程中肿瘤增大，临床症状未见改善时应中止给药。由于雌激素降低可引起骨质的损失，故需长期给药或再次给药时，应尽可能检查骨密度，慎重用药。对含有明胶的药物或含有明胶的食物有过敏史者，例如休克、过敏性症状（荨麻疹、呼吸困难、口唇浮肿、喉头水肿等）应慎重用药；已有因使用本品引起血栓形成及肺栓塞症的报告。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