

西沙必利 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_A5_BF_E6_B2_99_E5_BF_85_E5_c22_312925.htm 药品名称西沙必利药物别名普瑞博思，Prepulsid 英文名称Cisapride 类别止吐药、催吐药及胃肠推动药性状本品顺式（±）型为结晶状，熔点131～133℃，其盐酸盐自乙醇中结晶，熔点为250℃；本品反式（±）型的熔点为108℃。制剂片剂：每片5mg；10mg。分子式成分药理及应用本品为一种胃肠道动力药，可加强并协调胃肠运动，防止食物滞留与反流。其作用机制主要是选择性地促进肠肌层神经丛节后处乙酰胆碱的释放（在时间上和数量上），从而增强胃肠的运动；但不影响粘膜下神经丛，因此不改变粘膜的分泌。在动物试验中，本品能加速胃蠕动和排空，增强胃窦-十二指肠的消化活性，并能增加小肠、大肠的蠕动，缩短肠运动时间。在人体，本品可增强食管、胃和十二指肠的收缩与蠕动，改善胃窦-十二指肠部的协调功能，从而防止胃-食管和十二指肠-胃反流，加强胃和十二指肠的排空；并可促进小肠和大肠的蠕动。由于本品不抑制乙酰胆碱酶的活性，也无多巴胺受体阻断作用，因此不增加胃酸分泌，也不影响血浆催乳激素的水平。本品口服后吸收迅速，1～2小时达峰值血浓度， $t_{1/2}$ 约为10小时，口服给药的绝对生物利用度约为40%，血药浓度随口服剂量（5～20mg）成比例增加，在稳定状态下，口服5mg或10mg每日3次，早晨服药前与晚上的谷、峰血浓度分别波动在10～20ng/ml和30～60ng/ml与20～40ng/ml和50～100ng/ml之间，稳态血浆浓度与治疗持续时间无关。血浆蛋白结合率约为97.5%，主要经氧化脱羟和芳香族的羟基化作用被代谢，几乎全部的代谢

产物近似均等地经粪、尿排泄，乳汁排泄很少。本品可用于由神经损伤、神经性食欲缺乏、迷走神经切断术或部分胃切除引起的胃轻瘫。主要并发症状为：早饱、食欲缺乏、恶心和呕吐、胃胀和暖气等；也用于X线、内镜检查呈阴性的上消化道不适；对胃-食管反流和食管炎也有良好作用，其疗效与雷尼替丁相同，与后者合用时其疗效可能得到加强；还可用于假性肠梗阻导致的推进性蠕动不足和胃肠内容物滞留及慢性便秘；对于采取体位和饮食措施仍不能控制的幼儿慢性、过多性反胃及呕吐也可试用本品治疗。不良反应（1）由于本品系通过促进肠肌层节后神经释放乙酰胆碱而发挥胃肠动力作用，因此抗胆碱药可降低本品效应。（2）服用本品后，胃排空速率加快，如同经胃吸收的药物，其吸收速率可能降低，而经小肠吸收的药物其吸收速率可能会增加（如苯二氮类、抗凝剂、醋氨酚及H₂受体阻断剂等）。（3）对于个别与本品相关的药物需确定其剂量时，最好监测其血药浓度。注重事项（1）由于本品促进胃肠活动，可能发生瞬时性腹部痉挛、腹鸣或腹泻，此时可考虑酌减剂量。当幼儿或婴儿发生腹泻时应酌减剂量。本品对胃肠道功能增加的病人可能有害，必须使用时应注重观察。（2）曾有过敏、轻度短暂头痛或头晕的报道。（3）偶见可逆性肝功能异常，并可能伴有胆汁淤积。（4）个别报道，本品可影响中枢神经系统，导致惊厥性癫痫、锥体外系反应和尿频等。（5）本品虽不影响精神运动功能，不引起镇静和嗜睡，但加速中枢抑制剂如巴比妥类和酒精等的吸收，因此使用时应注重。（6）本品无胚胎毒性，也无致畸作用，但小于34周的早产儿应慎重用药。（7）对本品过敏者禁用，哺乳妇女勿用本品。

(8) 对于老年人，由于半衰期延长，故治疗剂量应酌减。肝、肾机能不全患者开始剂量可减半，以后可根据治疗效果及可能发生的副作用及时调整剂量。 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