

葆乐辉 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/313/2021\\_2022\\_\\_E8\\_91\\_86\\_E4\\_B9\\_90\\_E8\\_BE\\_89\\_c22\\_313291.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/313/2021_2022__E8_91_86_E4_B9_90_E8_BE_89_c22_313291.htm) 药品名称葆乐辉药物别名茶碱缓释片、优喘平 英文名称Protheo 类别其他药物制剂缓释片剂 400 mg。分子式成分本品主要成分是茶碱，其化学名为1, 3-二甲基-3, 7-二氢-1H-嘌呤-2, 6-二酮，分子式为C<sub>7</sub>H<sub>8</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>，分子量为180.17。本品为白色片。药理毒理本品具有直接松弛支气管和肺血管平滑肌的作用。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。药动学口服茶碱能迅速而完全地从胃肠道吸收，食物不会影响药物的吸收。茶碱的生物半衰期因人而异，在成人为3~15 hr，儿童1~9 hr。可在体内缓慢释放的茶碱缓释片，可延长茶碱的半衰期，每日口服1次，可在24 hr内维持体内茶碱血药浓度。在治疗范围内，24 hr内的血药浓度相对较平稳，表观分布容积在400~500 mL/kg之间，约有50%和血浆蛋白结合。茶碱在尿中的主要代谢物是1, 3-二甲基尿酸，其它还有1-甲基尿酸和3-甲基黄嘌呤。服药3日后，假如临床反应不满足（症状持续存在或功能检查时很少改善），又无不良反应，则可将剂量递增25%。假如不能测定血药浓度，则应将每日剂量限制在不超过13 mg/kg或900 mg。假如在产生治疗作用时伴有不良反应，则应根据不良反应的严重程度停药1次

或减量25%左右。在确定茶碱剂量后，血药浓度通常保持稳定，但某些外因可改变茶碱消除速度，因而需作药物监测并调节每日剂量。假如患者的临床情况稳定，亦未见改变茶碱消除的因素，则可每隔6-12个月测定1次血药浓度。适应症缓解和预防成人及12岁以上小儿的支气管哮喘症状和伴有慢性支气管炎和肺气肿的可逆性支气管痉挛。不良反应头痛、恶心和失眠，较少见消化不良、震颤和头晕等症状，其程度多数病人较轻至中度，偶见严重不良反应。相互作用茶碱与麻黄碱或其它拟交感神经类支气管扩张药合用，可使毒性增强。已有报告，茶碱与别嘌醇(大剂量)、西咪替丁、环丙沙星、红霉素、醋竹桃霉素、普萘洛尔及口服避孕药合用，可使茶碱血清浓度增高。据报道，茶碱与利福平合用，可使茶碱血清浓度降低。茶碱与苯妥因合用时，两药血清浓度均降低。对于需用茶碱的患者，最好避免使用非选择性 $\beta$ -受体阻滞剂，因它们的药理作用相互拮抗，此外，茶碱的清除率会减低。茶碱与巴比妥类、卡马西平及其它肝微粒体酶诱导剂合用，可加快茶碱的代谢和清除。空腹服用或高脂餐后服用本品时，茶碱的吸收程度相仿，食物可延缓达峰时间，但无临床意义。用法用量本品不可咀嚼或压碎，只能沿划痕处掰开。起始剂量为0.4g，一天一次，可根据疗效，血液浓度及病人对药物耐受情况调整剂，可以每隔3天增加0.2g，最大剂量每次不超过0.9g，分二次服用。用药过量假如无惊厥发作，应予吐根糖浆催吐，身体活动和饮水240 - 360 mL，可增强吐根的作用，假如15分钟内不发生呕吐，则应重复给药。必须注重防止异物吸入，非凡是婴幼儿。假如催吐失败或存在禁忌症，则应进行洗胃。但对于服药时间超过1 hr的患者，洗胃的

效果不佳。服用缓释制剂者，服用泻药尤为重要，亦可重复使用活性炭。假如发生惊厥，则应保持呼吸道通畅并给氧，静脉注射地西洋100 - 300  $\mu\text{g}/\text{kg}$ 体重，最大剂量10 mg。假如惊厥未能控制，则应考虑使用全身麻醉药。应监测生命指征，维持血压和补给足够液体。对于惊厥后发生昏迷的患者，应保持呼吸道通畅和给氧。按照以上推荐的方法减少药物吸收，但以插管和洗胃代替催吐。通过大口径胃管给予泻药和活性炭。给予充分的支持疗法和足量的液体，直至药物被代谢掉。假如反复口服活性炭后茶碱血清浓度仍保持不变或升高，那么应进行活性炭血液灌注。注重事项对本品过敏患者，活动性消化性溃疡和未经控制的惊厥性疾病患者禁用。本品不适用于哮喘发作症状或急性支气管痉挛发作的患者。应定期监测茶碱血清浓度，防止血药浓度过高。与其他茶碱缓释剂一样，本品不适用于哮喘发作状态或急性支气管痉挛发作的患者。应定期监测茶碱血清浓度，以保证最大的疗效，而不发生血药浓度过高的危险。在合理使用本品推荐剂量后，很少见血药浓度超过20  $\mu\text{g}/\text{mL}$ ，但对于茶碱血浆清除率减低的患者，为避免毒性反应，宜减少剂量和进行实验室监测。肾功能或肝功能不全的患者，年龄超过55岁，非凡是男性和伴有慢性肺部疾病的患者，任何原因引起的心力衰竭，持续高热的患者，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，茶碱血清浓度的维持时间往往显著延长。服用本品可发生心律失常、惊厥甚或死亡等严重不良反应。不很严重的茶碱中毒症状（如恶心和不安）常在开始服药时发生，通常是一过性的。在维持用药时，当血药浓度超过20  $\mu\text{g}/\text{mL}$ 时，不良反应常持续存在。血药浓度监测对于猜

测潜在的危及生命的毒性反应可提供有意义的信息。许多需用茶碱的患者可因基础病变而发生心动过速，从而不能正确评价其与茶碱血清浓度升高之间的相互关系。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。低氧血症、高血压或者有消化道溃疡病史的患者慎用本品。虽然茶碱偶可在胃肠道引起局部刺激，但胃肠道症状常为中枢性的，同时往往发生于血药浓度超过20  $\mu\text{g/mL}$ 时。对妊娠和哺乳的影响 尚未对茶碱进行动物生殖研究，亦不清楚孕妇服用茶碱是否引起胎儿损伤或影响生殖能力。对于孕妇，只有必须使用时才给用黄嘌呤类药物。哺乳期妇女：茶碱可进入乳汁，使婴儿发生烦躁或其它中毒征象，建议停止哺乳或停止服药。对儿童的影响 对于12岁以下儿童，每24小时服用本品的安全性及疗效尚未被确定。 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)