

盐酸西布曲明 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文
https://www.100test.com/kao_ti2020/314/2021_2022__E7_9B_90_E9_85_B8_E8_A5_BF_E5_c22_314693.htm 药品名称盐酸西布曲明
药物别名曲美、奥丽娜、诺美亭 Aolina、Reductil 英文名称SibutramineHydrochloride 类别减肥药制剂10mg：胶囊剂，内容物为白色或类白色粉末。片剂：10mg/片。分子式成分(\pm)N- { 1-(1-4-氯苯基)环丁基)-3-甲基丁基 } -N，N-二甲胺盐酸盐-水合物
药理毒理本品为作用于中枢的肥胖症治疗药。主要通过其胺类（仲胺和伯胺类）代谢产物而产生作用，其主要机理为抑制去甲肾上腺素、5-羟色胺和多巴胺的再摄取而增强饱食感，而对去甲肾上腺素、5-羟色胺和多巴胺的释放无明显影响。研究还表明，本品及其胺类活性代谢产物无明显抗胆碱、抗组胺和单胺氧化酶抑制作用。药动学口服盐酸西布曲明后迅速在消化道吸收，血药浓度达峰时间为1.2小时，口服清除率1750L/h，半衰期为1.1小时。单次服药平均最少可吸收77%。盐酸西布曲明经肝脏首过效应，主要被肝脏的细胞色素P450同工酶代谢为单和双去甲基的M1和M2。这些活性代谢物进一步羟基化和结合代谢为非药理活性代谢物M5和M6。体外试验表明，动物放射标记实验表明药物可迅速、广泛地分布到组织中，浓度最高的为清除器官：肝和肾。适应症减肥药。饮食控制、运动不能减轻和控制体重的肥胖症治疗，包括减轻体重和维持体重的减轻，治疗应与低热量饮食和运动结合进行。推荐用于治疗体重指数 $30\text{kg}/\text{m}^2$ 或 $27\text{kg}/\text{m}^2$ （有其它危险因素如高血压、糖尿病、血脂异常等）的肥胖症患者。不良反应本品常见的不良反应有：口干、厌食、失眠、便秘等。在临床试验中发生率 1%的不良反应

还有：全身反应：发热；心血管系统：心率增快、血压升高；呼吸系统：气管炎、呼吸困难；消化系统：腹泻、胃肠炎、牙病、胃肠胀气；神经系统：不安、肢体痉挛、张力增加、思维异常、癫痫发作；泌尿生殖系统：间质性肾炎、月经紊乱；血液系统：因出血时间延长引起的皮肤瘀斑；代谢和营养：外周性水肿；肌肉/骨骼系统：关节炎；皮肤和相关组织：瘙痒；非凡感觉：弱视。实验室检查：盐酸西布曲明可引起肝功检查的异常，包括AST、ALT、GGT、LDH、碱性磷酸酶、胆红素的增加，化验值多为轻度增高，常随着进一步的治疗而消失，没有明确的剂量反应关系。相互作用中枢神经活性药物：本品不能与单胺氧化酶抑制（MAOI）同时使用。在开始使用本品治疗前应至少停用MAOI两周，同理，在使用MAOI前应至少停用本品两周。由于本品抑制5-羟色胺再摄取，因此不宜与其它5-羟色胺能药物合用。影响血压和心率的药物：正在服用含去甲麻黄碱、麻黄碱、或伪麻黄碱等成分药物的病人，慎用本品。抑制细胞色素P450（3A4）代谢的药物：临床试验表明本品与酮康唑、红霉素有潜在相互作用，但影响幅度不大。药物滥用和依赖性：医生应仔细评估既往有药物滥用病史的病人，并对这类病人加强随访，观察他们是否正确服用和有无滥用现象（如产生药物耐受性、服药剂量增加、觅药行为等。）服用过量的处理：现无盐酸西布曲明的特效解毒药，治疗方法包括处理药物过量的一般方法，如保证呼吸畅通，监测心脏和重要生命指征，采取对症和支持疗法。可小心地使用阻滞剂来控制升高的血压和心动过速。还未证实利尿和血液透析的效果。用法用量体重指数（BMI）计算：体重（kg）除以身高（米）的平方值

(kg/m²)。推荐起始剂量为天天服药一次，每次10mg，可于早晨单独服用或与食物同服。如体重减轻不足，4周后剂量可调整至天天15mg。若病人无法耐受10mg剂量，可降至5mg。应根据患者的血压、心率情况调整剂量。不推荐使用15mg/日以上的剂量。注重事项禁忌用于接受单胺氧化酶抑制剂 (MAOI) 治疗的病人。禁忌用于对本品成分过敏的病人。禁忌用于神经性厌食症病人。禁忌用于接受其它中枢性食欲抑制药的患者。肥胖症的治疗应以饮食控制和运动为基础。器质性肥胖 (如没有治疗的甲状腺功能低下) 者应排除在应用本品范围之外。在接受本品治疗前应检查血压和脉搏，且在用药期间应定期进行监测。对于那些使用本品时血压和脉搏持续升高的人应考虑减量或停药。对于有高血压病史的病人应谨慎使用，血压不能控制或控制不好的高血压病人应禁止使用。由于本品可能引起心率加快和/或血压升高，因此本品不应用于有冠脉疾病、心衰、心率失常和中风病史的病人。某些能引起神经末梢释放5-羟色胺的中枢性减肥药与心脏瓣膜功能不全有关。关于心脏瓣膜疾病发生的可能性国外进行了2项研究：在一项研究中210名病人 (平均年龄54岁) 使用2维和彩色多普勒心脏超声仪进行观察，这些病人在长达2周到16个月期间天天服用15mg盐酸西布曲明或安慰剂，且没有心瓣膜病的病史，结果盐酸西布曲明组心脏瓣膜病发生率为3/132 (2.3%)，3个病例均为轻度的主动脉瓣功能不全，安慰剂组的发生率为2/77 (2.6%)，一例为轻度的主动脉瓣功能不全，一例为严重的主动脉瓣功能不全。在另一项研究中使用2维和彩色多普勒心脏超声仪进行观察，25例病人在3个月内天天使用5 ~ 30mg盐酸西布曲明，结果未观察到心脏瓣膜

病变。某些可引起神经末梢释放5-羟色胺的中枢性减肥药能诱发肺动脉高压（PPH），一种罕见的但可致命的疾病。在本品上市前的临床研究中并没有发现类似病例，但因这种疾病在人群中的出现率很低，现还不能肯定本品是否会引起这种疾病。严重肝肾功能不全的病人不应服用本品。由于体重减轻可增加和加重胆结石的形成，故患胆结石的病人应慎用本品。由于本品可引起瞳孔扩大，所以慎用用于闭角型青光眼的病人。有癫痫病史的病人慎用。对于有癫痫发作的病人应停止使用。虽然盐酸西布曲明在健康志愿者中并不影响精神运动和思维行为，但任何作用于中枢神经系统的药物均有可能影响判定、思维或运动技能。动物试验观察到盐酸西布曲明有致畸胎作用，未观察到有致癌，致突变作用，建议妊娠、预备妊娠及哺乳期妇女不服用本品。由于低于16岁的儿童使用盐酸西布曲明的安全性和有效性尚未确定，故不推荐16岁以下的儿童使用本品。由于老年人心、肾、肝功能减低或合并其它疾病治疗方案可能性增加，因此对于老年人的剂量选择应小心。 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