

复习指导：阿扎丙宗使用方法执业医师资格考试 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/508/2021\\_2022\\_\\_E5\\_A4\\_8D\\_E4\\_B9\\_A0\\_E6\\_8C\\_87\\_E5\\_c22\\_508006.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/508/2021_2022__E5_A4_8D_E4_B9_A0_E6_8C_87_E5_c22_508006.htm)

药理：本品是吡唑衍生物，有止痛、抗炎、退热作用。广泛的研究表明，AZP对炎症介质的产生，对白细胞和防止软骨损伤具有多种作用。在体外AZP对黄嘌呤氧化酶活性和各种多形核白细胞（PMN）功能，包括聚集、脱颗粒、游走、超氧化物阴离子和过氧化氢的产生均有抑制作用。在这些体外试验中，AZP的有效浓度低于抑制前列腺素合成所需的浓度（ $> 100 \mu\text{M}$ ）。体外抑制溶酶体酶释放发生在低于作用于多形核白细胞和前列腺素生成所需的浓度（ $1 \sim 10 \mu\text{M}$ ）。口服AZP可抑制大鼠由分枝杆菌佐剂诱导的多关节炎的进展，其疗效与布洛芬、甲芬那酸、保泰松相当。腹腔注射本品（20或40mg/kg）可抑制局部注射福马林引起的足跖肿胀；腹腔注射AZP5mg能减轻足跖关节炎。经3种动物模型试验，AZP能在体内抑制多形核白细胞的功能。口服剂量为100mg/kg的AZP能明显抑制中性粒细胞移行进入受损伤或有炎症的组织。在所用的各模型中，与未经处理的对照组比较，经AZP处理的动物，组织损伤均见减轻。来自猪局部缺血/再灌注模型的数据，表明心肌组织的黄嘌呤氧化酶水平是低的，提示AZP作为黄嘌呤氧化酶抑制剂的作用可能是对多形核白细胞功能这一初级作用所引起的次级作用。对人使用水疱抽吸技术，表明AZP在次最大耐受剂量时能抑制多形核白细胞游走。在临床能产生对中性粒细胞游走和功能的抑制作用。AZP导致胃肠道溃疡和出血的倾向较低，这可用以下几点来解释：本品在胃内吸

收很慢，且其独特的理化特性可使吸收快的羧酸类非甾体抗炎药对粘膜细胞的刺激减到最小；它对粘膜保护物质前列腺素合成的抑制作用很弱；本品对溶酶体酶释放的稳定作用；以及本品可能显示抗氧作用和对氧游离基产生的抑制作用，从而保护细胞膜。药动学用AZP600mg，每日2次，治疗类风湿性关节炎（RA）5天，治疗期间能达到稳态血浆浓度60~150 μg/ml。给本品300mg一次，RA患者关节滑液中浓度约为10 μg/ml，5天给药1.5g之后，其稳态浓度在7~106 μg/ml范围内。滑膜组织浓度为10~30 μg/ml，表明AZP能分布到炎症部位。滑膜细胞相应药物浓度为10~40 μg/ml。AZP口服后几乎完全从胃肠道吸收，生物利用度接近80%。AZP的血浆蛋白结合率大于99%。AZP能蓄积于人体炎症组织。60%以上的AZP以原形经肾排泄。其主要代谢物8-羟基AZP无毒性作用，仅有很弱的抗炎作用。适应症：适用于急性痛风性关节炎的治疗，以及血内尿酸过多或复发性痛风性关节炎患者（须给予降尿酸药物的治疗）。也用于类风湿性关节炎、骨关节炎、关节强直性脊椎炎。用法用量：口服每日1.2g，分2或4次。急性痛风24小时内分次给2.4g，然后每日1.8g，再减至每日1.2g，直到症状缓解。老年人早、晚各给300mg，如肾功能正常，增加到最大剂量每日900mg。[制剂与规格]胶囊300mg；片剂600mg 禁用慎用：1.急性消化性溃疡、肾功能不全者禁用。百考试题网站整理 2.妊娠、肝脏疾病患者慎用，长期治疗应进行监测。心力衰竭者、老年患者、有消化性溃疡史者亦慎用。不良反应：对光过敏、水肿、胃肠道出血、肺泡炎、库姆斯氏试验阳性（应停药）。相互作用：AZP与苯妥因，磺胺类、甲氨碟呤、苯磺丁脲有相互作用。"#F8F8F8"

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)