

2011年药理学辅导：左旋多巴药理作用及应用 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/647/2021_2022_2011_E5_B9_B4_E8_8D_AF_c23_647914.htm 讲述了左旋多巴体内过程，药理作用及应用，不良反应，药物相互作用。左旋多巴又称L-多巴，为酪氨酸的羟化物，在体内是左旋酪氨酸合成儿茶酚胺的中间产物。【体内过程】口服左旋多巴后，通过芳香族氨基酸的主动转运系统从小肠迅速吸收，约0.5~2小时，血药浓度达峰值，血浆 $t_{1/2}$ 为1~3小时。其吸收速率受多种因素影响，如胃排空延缓（同服胆碱受体阻断药）、胃液酸度高或小肠中有其他氨基酸与之竞争主动转运系统（如高蛋白饮食）等，均可降低其生物利用度。吸收后，首次通过肝时大部分即被脱羧，转变成多巴胺。也有相当部分在肠、心、肾中被脱羧生成多巴胺。而多巴胺又不易透过血脑屏障，因此进入中枢神经系统的左旋多巴不到用量的1%。在外周组织中形成大量多巴胺是造成不良反应的原因。若同时服用外周脱羧酶抑制剂（卡比多巴）可减少不良反应。小部分左旋多巴转变为黑色素（melannin）；另有一部分左旋多巴经儿茶酚氧位甲基转移酶（COMT）而甲基化，转变为3-甲氧基多巴；以上代谢物均由肾迅速排泄。这种代谢过程消耗较多的COMT，而COMT反应中甲基主要来自食物中的蛋氨酸，故长期服用左旋多巴可导致蛋氨酸缺乏。【药理作用及应用】1.抗帕金森病左旋多巴在脑内转变为多巴胺，补充纹状体中多巴胺的不足，因而具有抗帕金森病的疗效。研究表明，曾用过大量左旋多巴治疗的患者，死后纹状体中多巴胺浓度比未用药治疗者高5~8倍；而且脑内多巴胺浓度与左旋多巴的疗效相

一致。说明患者黑质-纹状体通路中残存的多巴胺能神经元仍有储存多巴胺的能力。其纹状体多巴脱羧酶仍有足够的酶活性可使左旋多巴转变为多巴胺。用左旋多巴治疗后，约75%的患者获得较好疗效。治疗初期疗效更显。左旋多巴的作用特点是：对轻症及较年轻患者疗效较好，而重症及年老衰弱患者疗效差；对肌肉僵直及运动困难疗效较好，而对肌肉震颤症状疗效差，如长期用药及较大剂量对后者仍可见效；作用较慢，常需用药2~3周才出现客观体征的改善，1~6个月以上才获得最大疗效，但作用持久，且随用药时间延长而递增。左旋多巴对其他原因引起的帕金森综合征也有效。但对吩噻嗪类等抗精神病药所引起的无效，因这些药有阻断中枢多巴胺受体的作用。

2.治疗肝昏迷肝昏迷发病学说中的伪递质学说认为，正常机体蛋白质代谢产物苯乙胺和酪胺都在肝内被氧化解毒。肝功能障碍时，血中苯乙胺和酪胺升高，在神经细胞内经β-羟化酶分别生成伪递质，苯乙醇胺和羟苯乙醇胺（胺），它们取代了正常递质去甲肾上腺素，妨碍神经功能。用左旋多巴能在脑内转变去甲肾上腺素。使正常神经活动得以恢复，患者可由昏迷转为苏醒。因不能改善肝功能，作用只是暂时性的。

【不良反应】左旋多巴的不良反应较多，因其在体内转变为多巴胺所致

- 1.胃肠道反应 治疗初期约80%患者出现恶心、呕吐、食欲减退等。用量过大或加量过快更易引起，继续用药可以消失。偶见溃疡出血或穿孔。
- 2.心血管反应 治疗初期，约30%患者出现轻度体位性低血压，原因未明。少数患者头晕，继续用药可减轻。多巴胺对α受体有激动作用，可引起心动过速或心律失常。
- 3.不自主异常运动为长期用药所引起的不随意运动，多见于面部肌

群，如张口、咬牙、伸舌、皱眉、头颈部扭动等。也可累及肢体或躯体肌群，偶见喘息样呼吸或过度呼吸。另外还可出现“开-关现象”（on off phenomenon），患者突然多动不安（开），而后再出现全身性或肌强直性运动不能（关），严重妨碍病人的正常活动。疗程延长，发生率也相应增加。此时宜适当减少左旋多巴的用量。4.精神障碍出现失眠、焦虑、恶梦、狂躁、幻觉、妄想、抑郁等。需减量或停药。此反应可能与多巴胺作用于大脑边缘叶有关。【药物相互作用】

1.维生素B6是多巴脱羧酶的辅基，可增强左旋多巴的外周副作用。2.抗精神病药能引起帕金森综合征，又能阻断中枢多巴胺受体，所以能对抗左旋多巴的作用。更多信息请访问

：[#0000ff>执业药师课程免费试听](#) [#0000ff>执业药师互动交流](#)
[#0000ff>执业药师在线测试模拟题](#) [red>2011年执业药师药学专业](#)
[知识一基础习题汇总](#) 特别推荐：[#0000ff>2011年执业药师考](#)
[试报名时间](#) [#0000ff>2011年执业药师考试大纲新变化](#)

[#0000ff>2011年执业药师资格考试时间及科目](#) [#0000ff>2011年](#)
[执业药师考试大纲](#) 相关推荐：[#0000ff>2011年药理学辅导：](#)

[卡比多巴的临床应用](#) [#0000ff>2011年药理学辅导：金刚烷胺的](#)
[临床应用](#) 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