

2012年口腔执业医师药理学辅导：吡唑酮类 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/656/2021_2022_2012_E5_B9_B4_E5_8F_A3_c22_656224.htm 吡唑酮类包括保泰松

(phenylbutazone；布他酮，butazolidin)及其代谢产物羟基保泰松(oxyphenbutazone)。本类药物包括保泰松

(phenylbutazone；布他酮，butazolidin)及其代谢产物羟基保泰松(oxyphenbutazone)。保泰松及羟基保泰松【体内过程】口服保泰松吸收迅速完全，2小时达峰血药浓度值，吸收后98%与血浆蛋白结合，再缓慢释出，故作用持久，血浆 $t_{1/2}$ 为50~65小时。保泰松可穿透滑液膜，在滑液膜间隙内的浓度可达血浓度的50%，停药后，关节组织中保持较高浓度可达3周之久。本药主要由肝药酶代谢为羟化物及其葡萄糖醛酸结合物。其苯环化物为羟基保泰松，为活性代谢物；羟基保泰松的血浆蛋白结合率也很高，血浆 $t_{1/2}$ 长达几天，长期服用保泰松时，羟基保泰松可在体内蓄积，造成毒性。保泰松可诱导肝药酶，加速自身代谢。保泰松及其代谢物由肾缓慢排泄。【药理作用及临床应用】保泰松抗炎抗风湿作用强而解热镇痛作用较弱；其抗炎作用也是通过抑制PG生物合成而实现。临床主要用于风湿性及类风湿性关节炎、强直性脊柱炎。本药对以上疾病的急性进展期疗效很好；较大剂量可减少肾小管对尿酸盐的再吸收，故可促进尿酸排泄，可用于急性痛风。偶也用于某些高热如恶性肿瘤及寄生虫病(急性丝虫病、急性血吸虫病)引起的发热。【不良反应】10%~45%患者有不良反应，其中10%~15%患者必须停药，故不宜大量长期用药。1. 胃肠反应最常见为恶心、上腹不适、

呕吐、腹泻。饭后服药可减轻。大剂量可引起胃、十二指肠出血、溃疡，与本药抑制PG合成有关。溃疡病者禁用。2. 水钠潴留保泰松能直接促进肾小管对氯化钠及水的再吸收，引起水肿。使心功能不全者出现心衰、肺水肿。故用本药时应忌盐。高血压、心功能不全患者禁用。3. 过敏反应有皮疹。偶致剥脱性皮炎、粒细胞缺乏、血小板减少及再生障碍性贫血，可能致死，应高度警惕。如见粒细胞减少，应立即停药并用抗菌药防治感染。4. 肝、肾损害 偶致肝炎及肾炎。肝、肾功能不良者禁用。5. 甲状腺肿大及粘液性水肿是保泰松抑制甲状腺摄取碘所致。羟基保泰松除无排尿酸作用及胃肠反应较轻外，作用、用途及不良反应同保泰松。【药物相互作用】保泰松诱导肝药酶，加速自身代谢，也加速强心甙代谢；还可通过血浆蛋白结合部位的置换，加强口服抗凝药、口服降糖药、苯妥英钠及肾上腺皮质激素的作用及毒性，当保泰松与这些药物合用时，应予注意。相关推荐：
#0000ff>2012年口腔执业医师药理学辅导：磺胺类药
#0000ff>2012年口腔执业医师药理学辅导：甲醛甲酚合剂
#0000ff>2012年口腔执业医师药理学辅导：氢氧化钙制剂
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