【药品名】坦度螺酮

【英文名】Tandospirone

【别名】枸橼酸坦度螺酮; 希德

【剂型】枸橼酸坦度螺酮片: 10mg。

【药理作用】本药为嘧啶哌嗪的氮杂螺酮衍生物,属 5-羟色胺 1A(5-HT_{IA})受体的部分激动剂,对 5-HT_{IA}受体有高亲和力,可激动海马锥体细胞突触后 5-HT_{IA} 受体和中缝核突触前 5-HT_{IA}受体,从而产生抗焦虑效应。和苯二氮卓类药(BDZ)相比,本药作用的靶点相对集中,抗焦虑作用的选择性更高,因而免除了 BDZ 的肌松、镇静、催眠作用和对认知、运动功能的损害。此外,本药亦可较强地抑制多巴胺能神经的兴奋作用。长期使用时,可使 5-HT_{IA}受体下调,这可能与其抗抑郁作用有关。

【药动学】本药口服吸收良好,达峰时间为 0.8h。在肝脏代谢为 1-嘧啶-哌嗪,后者的血药浓度为本药的 2~8 倍。肾排泄率为 70%,仅有 0.1%以原形排出,约 20%随粪便排出,半衰期为 1.2h,1-嘧啶-哌嗪的半衰期为 3~5h。

【适应症】1. 用于多种神经症所致的焦虑状态,如广泛性焦虑障碍。2. 亦用于原发性高血压、消化性溃疡等疾病伴发的焦虑状态。

【禁忌症】1. 对本药过敏者。2. 对本药及1-嘧啶-哌嗪有过敏史者。

【注意事项】1. 慎用: (1)对其他氮杂螺酮衍生物(如丁螺环酮、伊沙匹隆、吉哌隆)有过敏史者。(2)器质性脑功能障碍患者。(3)中度或重度呼吸功能衰竭患者。(4)心功能不全患者。(5)肝、肾功能不全患者。2. 药物对妊娠的影响: 尚不明确。3. 药物对哺乳的影响: 尚不明确。4. 本药一般不作为抗焦虑的首选药,且不得随意长期应用。5. 本药可能对催乳素、促性腺激素或睾酮有兴奋作用。6. 对病程较长(3 年以上),病情严重或 BDZ 无效的难治性焦虑患者,本药可能也难以产生疗效。7. 用药期间不得从事有危险性的机械性作业。8. 本药与BDZ 无交叉依赖性,若立即将 BDZ 换为本药时,可能出现 BDZ 的戒断现象,加重精神症状。故在需要停用 BDZ 时,需缓慢减量,充分观察。

【不良反应】不良反应少而轻,较常见心动过速、头痛、头晕、嗜睡、乏力、 口干、食欲缺乏、出汗。

【用法用量】1. 成人口服给药 一次 10~20mg, 3 次/d。可根据病情适当增减剂量, 一天最大剂量 60mg。2. 老年人剂量 老年患者用药时应从小剂量开始。

【**药物相互作用**】1. 与钙拮抗药(如硝苯吡啶等)合用可增强降压作用。2. 与氟哌啶醇合用可增强锥体外系症状。

【专家点评】