

【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】

本药为咪唑啉的氮杂螺酮衍生物，属 5-羟色胺 1A (5-HT_{1A}) 受体的部分激动剂，对 5-HT_{1A} 受体有高亲和力，可激动海马锥体细胞突触后 5-HT_{1A} 受体和中缝核突触前 5-HT_{1A} 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_{1A} 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-咪唑啉-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-咪唑啉-哌嗪的半衰期为 3~5h。

【适应证】

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。

【禁忌证】

1. 对本药过敏者。
2. 对本药及 1-咪唑啉-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】