**毛果芸香碱**

文章版本号：2

最后发布时间：2014-4-15 9:47:42

**【药物名称】**

中文通用名称：毛果芸香碱

英文通用名称：Pilocarpine

其他名称：匹鲁卡品、匹罗卡品、Ocusert、Pilocarpinum、Pilogel。

**【药理分类】**

神经系统用药>>作用于自主神经系统药>>拟胆碱药>>其它拟胆碱药

眼科用药>>降眼内压药

眼科用药>>其它眼科用药

其它药物>>解毒药>>药物中毒解毒药

**【临床应用】**

**CFDA说明书适应症**

1.口服用于头颈部肿瘤患者放疗后引发的口干症、药源性口干症、涎腺疾患性口干症。

2.注射液用于急性闭角型青光眼、慢性闭角型青光眼、开角型青光眼、继发性青光眼、白内障人工晶体植入手术中缩瞳和阿托品类药物中毒对症治疗。

3.滴眼液用于：(1)急性闭角型青光眼、慢性闭角型青光眼、开角型青光眼、继发性青光眼等，可与其他缩瞳药、β-肾上腺素受体阻滞药、碳酸酐酶抑制药、拟交感神经药物或高渗脱水剂联用。(2)检眼镜检查后缩瞳以抵消睫状肌麻痹药或扩瞳药的作用。

**其他临床应用参考**

用于治疗调节性内斜视。

**【用法与用量】**

**成人**

◆常规剂量

·头颈部肿瘤患者放疗后引发的口干症、药源性口干症、涎腺疾患性口干症

1.口服给药  一次4mg，一日3次。

·慢性闭角型青光眼

1.眼部注射  一次2-10mg。

2.经眼给药  本药0.5%-4%滴眼液滴眼，一次1滴，一日1-4次。

·急性闭角型青光眼急性发作期

1.经眼给药  本药1%-2%滴眼液滴眼，一次1滴，每5-10分钟1次，3-6次后每1-3小时1次，直至眼压下降(注意：对侧眼也应每6-8小时滴1次，以防对侧眼闭角型青光眼发作)。

·缩瞳

1.眼部注射  白内障人工晶体植入手术中缩瞳，一次2-10mg。

2.经眼给药  (1)对抗散瞳作用时，用本药1%的滴眼液滴眼1滴2-3次。(2)先天性青光眼房角切开或外路小梁切开术前用药时，用本药1%滴眼液滴眼1-2次。(3)虹膜切除术前用药时，用本药2%滴眼液滴眼，一次1滴。

**【国外用法用量参考】**

**成人**

◆常规剂量

·头颈部肿瘤患者放疗后引发的口干症

1.口服给药  初始剂量为一次5mg，一日3次。如对低剂量无效者，可增至最大剂量一次10mg，一日3次。

·干燥综合征(Sjogren综合征)

1.口服给药  一次5mg，一日4次。6周内可见效。

·开角型青光眼和闭角型青光眼所致的眼内压升高

1.经眼给药  (1)本药1%、2%、4%或6%滴眼液滴眼，患侧一次2滴，一日3-4次。(2)本药4%眼用凝胶，睡前涂于患侧下结膜囊内，一次0.5英寸，一日1次。

·Adie's综合征诊断试验

1.经眼给药  80%的Adie's综合征患者使用本药0.125%滴眼液，其患侧瞳孔可产生更明显的缩瞳作用。方法为：在双眼内各滴入1滴药液并在30秒后重复使用。30分钟后分析结果。

◆肝功能不全时剂量

轻度肝功能损害(Child-Pugh分级为5-6)者使用本药无需调整剂量；中度肝功能损害(Child-Pugh分级为7-9)者，初始剂量应减至一次5mg，一日2次，随后应根据患者的治疗效果和耐受性调整剂量；重度肝功能损害(Child-Pugh分级为10-15)者不推荐使用本药。

**【给药说明】**

**给药方式说明**

经眼给药  使用本药滴眼液时为避免全身吸收过多，用药后可用手指压迫泪囊部1-2分钟。避免频繁用药。

**【禁忌症】**

1.对本药过敏者。

2.不应缩瞳的眼病(如虹膜睫状体炎、瞳孔阻滞性青光眼、急性虹膜炎等)患者禁用本药滴眼液和注射液。

3.白内障手术后青光眼患者(国外资料)。

4.心动过缓者。

5.低血压患者。

6.冠心病患者。

7.胃肠道痉挛、腹泻、腹痛、消化性溃疡患者。

8.尿路梗塞，机械性肠梗阻、输尿管痉挛、胆道疾病患者。

9.甲状腺功能亢进患者。

10.癫痫患者。

11.震颤麻痹患者。

**【慎用】**

1.帕金森病患者(国外资料)。

2.肾结石患者(可能引起肾绞痛或输尿管反流)(国外资料)。

3.认知能力低下或有精神障碍者(可能影响中枢神经系统)(国外资料)。

4.慢性支气管炎患者。

5.慢性阻塞性肺疾病患者。

6.肝肾功能损害者。

7.有视网膜脱落史者。

8.支气管哮喘患者。

9.急性角膜炎、结膜炎患者慎用本药滴眼液。

10.妊娠期妇女。

11.哺乳期妇女。

12.儿童。

**【特殊人群】**

**儿童**

儿童体重相对较轻，易发生用药过量导致全身中毒，故应慎用。

**老人**

尚不明确。

**妊娠期妇女**

1.妊娠期妇女用药安全性尚未确立，应慎用。

2.美国食品药品管理局(FDA)对本药的妊娠安全性分级为C级。

**哺乳期妇女**

尚不明确本药是否随乳汁排泄，哺乳期妇女用药安全性尚未确定，应慎用。

**【不良反应】**

1.心血管系统  可见高血压、低血压、心律失常(如心动过缓)。

2.呼吸系统  可见支气管痉挛、呼吸困难、哮喘。哮喘患者用药后可见最大呼气量下降，使用口服制剂者还可见鼻炎。

3.肌肉骨骼系统  可见肌肉震颤、抽搐。

4.泌尿生殖系统  可见膀胱紧缩感和尿频。

5.神经系统  可见头晕、无力、头痛、神经质。

6.胃肠道  可见恶心、呕吐、腹痛、腹泻和流涎。

7.眼  可见视物模糊、视物发暗、调节痉挛、结膜充血、眼痛、眉间痛、眼刺激、烧灼感和浅表角膜炎。长期使用本药可出现晶体混浊、虹膜后粘连、虹膜囊肿、白内障和近视程度加深等。罕有使用缩瞳药后出现视网膜脱离的报道。还可见眼部瘙痒、夜视困难、红眼、阅读困难。

8.其他  口服可见出汗或颜面潮红。

**【药物相互作用】**

**药物-药物相互作用**

1.β-肾上腺素受体阻滞药、碳酸酐酶抑制药、a-肾上腺受体激动药、β-肾上腺受体激动药、高渗脱水剂：

结果：合用有协同作用。

2.其他拟胆碱药或抗胆碱酯酶药(如新斯的明)：

结果：合用可增加本药作用。

处理：合用需调整本药剂量。

3.地匹福林：

结果：合用可导致近视程度暂时增加。

4.阿托品、环戊醇胺酯：

结果：合用可干扰本药的抗青光眼作用，而这些药物的散瞳作用也会被抵消。

5.拉坦前列素：

结果：合用可减低拉坦前列素的降眼压作用。

机制：降低葡萄膜巩膜途径房水流出量。

6.抗胆碱药：

结果：与局部抗胆碱药合用将干扰本药的降眼压作用；与全身抗胆碱药合用，因全身用药到达眼部的浓度很低，通常不影响本药的降眼压作用。

7.磺胺醋酰钠滴眼液(pH8-9.5)：

结果：合用可使结膜液的pH值一过性升高达7.4，并可导致本药沉淀。

**【注意事项】**

**用药警示**

瞳孔缩小常引起暗适应困难，应告知夜间驾驶或从事照明不佳的危险职业患者需特别谨慎。

**用药前后及用药时应当检查或监测**

1.定期检查眼压。如出现视力改变，需检查视力、视野、眼压描记及房角等。

2.心血管疾病患者应监测本药诱导的心律改变或血流动力学改变。

**【国外专科用药信息参考】**

**牙科用药信息**

1.与牙科治疗相关的主要不良反应：增加唾液分泌(治疗作用)。

2.牙科用药的常规剂量：用于治疗口腔干燥，成人，一次1-2片，一日3-4次，一日最大剂量为30mg，达到最佳治疗效果常需用药至少90日。

**精神状况信息**

对精神障碍治疗的影响：对接受β-肾上腺素受体阻滞药的患者，本药可能会拮抗抗胆碱能的作用，引起心脏传导异常。

**护理注意事项**

应定期进行眼内压监测、眼底监测及视野监测。

**【药物过量】**

**过量的表现**

药物过量可见出汗、流涎、恶心、呕吐、腹痛、腹泻、震颤、血压下降、瞳孔缩小、心跳先快后慢、支气管痉挛、呼吸困难(过多的黏液分泌)、抽搐、哮喘、肺水肿、视物模糊、头痛、衰弱、胸痛或意识障碍等。

**过量的处理**

1.本药眼局部滴用过量时，可用温水冲洗眼部。

2.中度药物过量时，可自行恢复。静脉补液可纠正脱水，有助于恢复。

3.严重过量可使用阿托品，0.5-1mg皮下注射或肌内注射。

4.对严重心血管抑制或支气管收缩者应当使用肾上腺素。

**【药理】**

**药效学**

本药是一种节后拟胆碱药，能直接作用于M胆碱受体，使胆碱能神经节后纤维兴奋，产生毒蕈碱样作用。滴眼后可直接作用于瞳孔括约肌和睫状肌的胆碱受体，使这两种平滑肌收缩，导致瞳孔缩小和睫状肌收缩，从而使房水排出阻力减少，使青光眼的眼压下降。本药降眼压的机制为：(1)瞳孔缩小使虹膜向中心拉紧，虹膜变薄，房角加宽，房水经小梁网、Schlemm管排出眼外。(2)睫状肌的纵行纤维及小梁网均附着在巩膜突上，睫状肌收缩时牵拉巩膜突，可使小梁网间隙加大，增加房水排出。(3)睫状肌收缩时，使从其中穿过的前睫状动脉的供血减少，并牵拉相邻部位的脉络膜静脉网，有利于房水向静脉回流。(4)也可能有抑制房水生成的作用。另外，本药降眼压的幅度与用药前的眼压水平成正比，故主要对青光眼有降眼压作用，对眼压正常者作用不明显。

全身用药后能促进汗腺、唾液腺、泪腺、胃肠道腺体和呼吸道黏液腺的分泌，使胃肠道、胆道、膀胱、呼吸道、子宫等平滑肌兴奋。对心血管系统有抑制作用，静脉小剂量注射即可引起血压下降。

**药动学**

本药水溶性和脂溶性均较好，故其滴眼液的通透性良好。1%滴眼液滴眼后10-30分钟出现缩瞳作用，持续时间达4-8小时；75分钟达最大降眼压作用，持续4-14小时(降眼压作用的持续时间与浓度有关)。眼药膜降眼压作用的达峰时间为1.5-2小时。

据国外资料报道，食物可减少本药口服的吸收率和吸收范围。用于缓解口干时，20分钟起效，单次使用作用持续3-5小时，多次使用可持续10小时以上。母体化合物的半衰期为0.76-1.35小时。

**遗传、生殖毒性与致癌性**

◆遗传毒性  尚无遗传毒性的动物研究数据。

◆生殖毒性  尚无生殖毒性的动物研究数据。

◆致癌性  尚无长期潜在致癌性的动物研究数据。

**【制剂与规格】**

硝酸毛果芸香碱片  2mg。

硝酸毛果芸香碱滴眼液  (1)5ml:25mg。(2)10ml:50mg。(3)5ml:50mg。(4)8ml:80mg。(5)10ml:100mg。(6)5ml:100mg。(7)10ml:200mg。

硝酸毛果芸香碱眼膏  (1)2g:40mg。(2)2g:80mg。

硝酸毛果芸香碱眼药膜  2.5mg。

硝酸毛果芸香碱注射液  1ml:2mg。

**【贮藏】**

片剂：遮光，密闭保存。

滴眼液：遮光、密闭，凉暗处(不超过20℃)保存。

注射液：遮光，密闭保存。

使用UpToDate临床顾问须遵循[用户协议](http://www.uptodate.com/contents/license)。

专题 92694 版本 1.0