**碘解磷定**

文章版本号：2

最后发布时间：2014-4-15 9:48:03

**【药物名称】**

中文通用名称：碘解磷定

英文通用名称：Pralidoxime Iodide

其他名称：碘磷定、甲醛肟吡啶、解磷、解磷定、解磷毒、磷敌、派姆、醛肟吡啶、Pralidoxime、Pralidoximi Iodidum、Protopam Iodide、Pyraloxime Methiodide、Pyridine α-Aldoxime Methiodide。

**【药理分类】**

其它药物>>解毒药>>有机磷中毒解毒药

**【临床应用】**

**CFDA说明书适应症**

用于解救多种急性有机磷酸酯类杀虫剂中毒。但对马拉硫磷、敌百虫、敌敌畏、乐果、甲氟磷、丙胺氟磷和八甲磷等中毒效果较差；对氨基甲酸酯杀虫剂所抑制的胆碱酯酶无复活作用。

**其他临床应用参考**

1.用于胆碱酯酶抑制药过量引起的重症肌无力。(FDA批准适应症)

2.用于辅助治疗神经毒气引起的中毒。(FDA批准适应症)

**【用法与用量】**

**成人**

◆常规剂量

·一般用法

1.静脉注射  一次0.5-1g，根据病情需要可重复给药。

·轻度中毒

1.静脉注射  首次剂量0.4g，必要时2-4小时重复1次。

·中度中毒

1.静脉注射  首次剂量0.8-1.2g，以后每2-3小时给药0.4-0.8g，共2-3次。

2.静脉滴注  维持治疗，每小时0.4g，共4-6次。

·重度中毒

1.静脉注射  首次剂量1-1.2g，30分钟后视病情可再给0.8-1.2g，以后改为一次0.4g，共4-6次。

**儿童**

◆常规剂量

·轻度中毒

1.静脉注射  一次15mg/kg。

2.静脉滴注  参见“静脉注射”项。

·中度中毒

1.静脉注射  一次15-30mg/kg。

2.静脉滴注  参见“静脉注射”项。

·重度中毒

1.静脉注射  一次30mg/kg。

2.静脉滴注  参见“静脉注射”项。

**【国外用法用量参考】**

**成人**

◆常规剂量

·有机磷农药中毒

1.静脉滴注  将本药1-2g溶于100ml生理盐水中，静脉滴注15-30分钟。若肌肉持续无力可于1小时后重复给药，视需要可每10-12小时给药1次。

2.静脉注射  将本药用蒸馏水配制成5%的溶液，注射时间不少于5分钟。若肌肉持续无力可于1小时后重复给药，视需要可每10-12小时给药1次。

3.肌内注射  (1)轻度中毒：一次0.6g，15分钟后可重复用药1次。若轻度中毒症状持续，15分钟后可再用药1次；若发展为重度中毒症状，一次0.6g，连续快速给药2次，使得累积剂量达到1.8g。若此重度症状持续，1小时后可再用药1次。(2)重度中毒：一次0.6g，连续快速给药3次。若症状持续，1小时后可再用药1次。

·胆碱酯酶抑制药过量引起的重症肌无力

1.静脉注射  一次1-2g，随后每5分钟给药0.25g。

·辅助治疗神经毒气引起的中毒

1.肌内注射  一次0.6g，若症状持续，可每15分钟重复用药1次，直至累积注射3次。

◆肾功能不全时剂量

肾功能不全者用药应酌减。

**儿童**

◆常规剂量

·有机磷农药中毒

1.静脉滴注  16岁及以下者：(1)连续滴注，起始剂量为一次20-50mg/kg(剂量不应超过2g)，滴注15-30分钟，随后以10-20mg/(kg·h)的速度静脉滴注。(2)间断滴注，起始剂量为20-50mg/kg(剂量不超过2000mg)，缓慢注射15-30分钟，若肌无力症状无缓解，1小时后再给药1次。随后仍有持续肌无力时，视需要每10-12小时给药1次。

2.静脉注射  若由于存在肺水肿，或不适合连续或间断滴注，也可用蒸馏水将本药配制成5%的溶液静脉注射，剂量为20-50mg/kg，注射时间不少于5分钟。随后视需要每10-12小时给药1次。

3.肌内注射  (1)轻度中毒：16岁及16岁以下，体重小于40kg者，一次15mg/kg，于大腿内侧注射，15分钟后可重复用药1次。若轻度中毒症状持续，15分钟后可再用药1次；若发展为重度中毒症状，一次15mg/kg，连续快速给药2次，使得累积剂量达到45mg/kg。若此重度症状持续，1小时后可再用药1次。体重大于或等于40kg者，同成人用法用量。(2)重度中毒：16岁及16岁以下，体重小于40kg者，一次15mg/kg，连续快速给药3次。若症状持续，1小时后可再用药1次。体重大于或等于40kg者，同成人用法用量。

**【给药说明】**

**给药方式说明**

静脉滴注  本药静脉滴注速率不应超过0.2g/min。

**注射液的配制**

1.用葡萄糖注射液或生理盐水20-40ml稀释后，于10-15分钟内缓慢注射。

2.本药粉针剂较难溶解，可加温(40-50℃)或振摇以促溶。

**【禁忌症】**

对碘过敏者。

**【慎用】**

1.重症肌无力患者。

2.肾功能损害者。

3.哺乳期妇女。

(以上均选自国外资料)

**【特殊人群】**

**儿童**

用于神经性毒剂中毒时，儿童用药的安全性和有效性尚不明确。

**老人**

老年人心、肾代偿功能减退，用药应酌减并减慢静脉注射速度。

**妊娠期妇女**

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**

本药是否随乳汁排泄尚不明确，哺乳期妇女应慎用。

**【不良反应】**

1.心血管系统  可见心率加快、心电图出现暂时性ST段降低和QT间期延长。

2.呼吸系统  咽痛。

3.胃肠道  可见恶心、呕吐。有报道本药偶可引起口苦、腮腺肿大，这可能与所含碘离子有关。

4.其他  注射速度过快会引起眩晕、视物模糊、复视、动作不协调。局部刺激性较强，注射时漏至皮下可致剧痛、周围皮肤发麻。

**【药物相互作用】**

**药物-药物相互作用**

1.阿托品：

结果：本药可增强阿托品的生物效应。

机制：本药间接减少乙酰胆碱的积聚，而阿托品可直接拮抗乙酰胆碱的积聚。

处理：合用时应减少阿托品剂量。

2.维生素B1：

结果：合用能延长本药半衰期。

3.羟苯磺铵：

结果：合用不延迟本药的排泄。

**【注意事项】**

**用药警示**

1.对碘过敏者，可改用氯解磷定。

2.有机磷杀虫剂中毒患者越早使用本药越好。

3.治疗轻度急性有机磷中毒时，可单独使用阿托品或本药。当治疗中、重度急性有机磷中毒时，本药必须与阿托品合用，但需适当减少阿托品剂量。一般可肌内或静脉注射给予阿托品，一般中毒时阿托品的首次剂量为2-4mg，每10分钟1次；严重中毒时剂量为4-6mg，每5-10分钟1次，直至出现阿托品化。维持阿托品化48小时后，可逐渐减少阿托品剂量或延长注射阿托品的时间。严重有机磷中毒或口服中毒者，应用本药治疗需持续数日。

**用药前后及用药时应当检查或监测**

1.用药过程中应随时监测血胆碱酯酶活性，要求血胆碱酯酶活性维持在50%-60%以上。

2.用药期间应监测心率、呼吸频率、肌震颤、肌力、动脉血氧、血压，并进行心电监护。

**其他注意事项**

1.皮肤吸收引起中毒的患者：应用本药的同时要脱去被污染的衣服，并用肥皂清洗头发和皮肤。

2.眼部进入杀虫剂者：用2.5%碳酸氢钠溶液和生理盐水冲洗。

3.口服中毒患者：用2.5%碳酸氢钠溶液洗胃，由于有机磷杀虫剂可在下消化道吸收，故口服中毒者至少要维持治疗48-72小时，以防延迟吸收后中毒加重，甚至致死。

4.昏迷患者：应保持呼吸道通畅，若出现呼吸抑制，应立即进行人工呼吸。

**【国外专科用药信息参考】**

**精神状况信息**

1.对精神状态的影响：可引起头晕或嗜睡。

2.对精神障碍治疗的影响：避免与吩噻嗪类药物合用，本药可增强巴比妥酸的疗效。

**心血管注意事项**

可用酚妥拉明治疗由本药引起的高血压(儿童：1mg，成人：5mg)。

**护理注意事项**

密切监测血压、心率、呼吸频率、意识改变、肌震颤与肌力以及液体平衡(如少尿)。必要时连续进行心电监护和监测血流动力学。

**【药物过量】**

**过量的表现**

剂量过大时，可抑制胆碱酯酶、抑制呼吸和引起癫痫发作。

**【药理】**

**药效学**

有机磷酸酯类杀虫剂进入机体后，与体内乙酰胆碱酯酶(AchE)结合，形成磷酰化酶而失去其水解乙酰胆碱的作用，导致体内乙酰胆碱(Ach)蓄积，从而出现一系列Ach中毒症状。本药为肟类化合物，能恢复被有机磷酸酯类抑制的AchE活性。进入体内后，本药吡啶环上带正电荷的季铵氮即与磷酰化AchE的阴离子部位以静电引力相结合，使肟基趋向磷酰化AchE的磷原子，进而与磷酰基形成共价键，生成磷酰化解磷定，同时使AchE游离出来，恢复其水解Ach的活性。同时，本药还能与体内游离的有机磷酸酯类直接结合，生成无毒的磷酰化碘解磷定随尿液排出，从而阻止游离毒物继续抑制AchE活性，故本药可明显改善有机磷酸酯类所引起的烟碱样症状，但是对毒蕈碱样症状作用较弱，对中枢神经系统症状作用不明显。

另外，本药对被有机磷酸酯类抑制超过36小时已“老化”的胆碱酯酶的解毒作用效果甚差，对慢性有机磷杀虫剂中毒抑制的胆碱酯酶无复活作用，故本药治疗急性有机磷中毒时，早期效果好。

**药动学**

本药静脉注射后迅速吸收并分布全身，主要分布于肝、肾、脾和心，其次是肺、骨骼肌和血液中。尚不明确本药是否能透过血-脑脊液屏障，但中毒动物注射本药后，其脑组织和脑脊液中被抑制的胆碱酯酶活性有所恢复。本药不与血浆蛋白结合，在肝脏迅速代谢。4小时内由肾脏排泄83%，24小时内完全经肾排出，血中半衰期为54分钟，药物在体内无蓄积作用。

**【制剂与规格】**

碘解磷定注射液  (1)10ml:0.4g。(2)20ml:0.5g。

注射用碘解磷定  0.4g。

**【贮藏】**

注射液：遮光，密闭保存。

粉针剂：避光贮存于阴暗处。

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

专题 92021 版本 1.0