



舒必利、利培酮、坦度螺酮

讲课药师：蔡紫峰

讲课日期：2018.08.23

大纲

content

药品基本信息

作用机制 & 适应症

药动学

用法用量 (含特殊人群、用药指导)

不良反应 & 禁忌症

相互作用 & 注意事项

	舒必利片 Sulpiride	利培酮片 Risperidone	枸橼酸坦度螺酮片 Tandospirone Citrate
规格	100mg	1mg	10mg
性状	白色片	白色片	白色片
料位号	H13	H01	H12
厂商	江苏天士力帝益药业有限公司	西安杨森制药有限公司	住友制药有限公司
单价(元)	0.24元	2.47元	2.72元
贮藏	遮光，密闭	密封保存	室温保存

舒必利片
Sulpiride

❑ 苯甲酸胺类抗精神病药，作用特点是选择性阻断中脑边缘系统的多巴胺 (DA₂) 受体。还具有强止吐和抑制胃液分泌作用。

利培酮片
Risperidone

❑ 选择性的单胺能拮抗剂，对5HT₂受体、D₂受体、 α_1 及 α_2 受体和H₁受体亲和力高。认为其治疗作用是对D₂受体及5HT₂受体拮抗联合效应的结果。对D₂及5HT₂以外其它受体的拮抗作用可能与利培酮的其它作用有关。

枸橼酸坦度螺
酮片
Tandospirone
Citrate

❑ 抗焦虑药，可选择性的作用于脑内5-HT_{1A}受体。可抑制下丘脑刺激所致升压反应和电休克应激负荷所致的血浆肾素活性升高，抑制心里应激负荷所致的胃溃疡发生和强制浸水应激负荷所致的食欲下降。

舒必利片
Sulpiride

- ❑ 适用于精神分裂症单纯型、偏执型，紧张型及慢性精神分裂症的孤僻、退缩、淡漠症状
- ❑ 对抑郁症状有一定疗效
- ❑ 止呕

利培酮片
Risperidone

- ❑ 用于治疗急性和慢性精神分裂症以及其它各种精神病性状态的明显阳性症状和明显的阴性症状
- ❑ 用于治疗双相情感障碍的躁狂发作

枸橼酸坦度螺
酮片
Tandospirone
Citrate

- ❑ 各种神经症所致的焦虑状态
- ❑ 原发性高血压、消化性溃疡等躯体疾病伴发的焦虑状态

	舒必利片 Sulpiride	利培酮片 Risperidone	枸橼酸坦度螺酮片 Tandospirone Citrate
吸收	T _{max} : 2h	T _{max} : 1-2h	T _{max} : 0.8-1.4h
分布	无	无	肝脏、肾脏、脑
代谢	T _{1/2} : 8-9h	T _{1/2} : 3h	T _{1/2} : 1.2-1.4h
排泄	肾脏 母乳	尿液: 70% 粪便: 14%	尿液: 70% 粪便: 21%

说明书		UpToDate
治疗精神分裂症	开始剂量为一次100mg，一日2--3次，逐渐增至治疗量一日600 --1200mg 。维持剂量为一日200--600mg 。	无
止呕	一次100--200mg一日2---3次。	无

说明书		UpToDate
治疗双相情感障碍的躁狂发作	QD，每次1~2mg，剂量可根据个体需要进行调整。 剂量增加的幅度为每日1~2mg，剂量增加至少隔日或间隔更多天数进行。 大多数患者的理想剂量为每日2~6mg。	QD，1-2mg， 可根据需要进行剂量调整。调整间隔时间不少于24小时，增减剂量幅度为一日1mg。 多数患者的理想剂量为一日2-6mg。

说明书		UpToDate
精神分裂症	QD or BID, 起始剂量1mg, 在1周左右的时间逐渐将剂量加大到每日2~4mg, 第2周内可逐渐加量到每日4~6mg。一般情况下, 最适剂量为每日2~6mg。 MAX=10mg/d。	BID, 起始剂量为一次1mg; 第2日增至一次2mg; 若能耐受, 第3日可增至一次3mg。 剂量调整应缓慢, 调整间隔时间一般不少于1周, 推荐增减剂量幅度为1-2mg。本药的最大有效剂量范围为一日4-8mg。 MAX=16mg/d。

说明书

UpToDate

- ❑ 各种神经症所致的焦虑状态
- ❑ 原发性高血压、消化性溃疡等躯体疾病伴发的焦虑状态

10mg TID。根据病人年龄、症状等适当增减剂量，
MAX=60mg/d。

无

	说明书	UpToDate
□ 适用于精神分裂症单纯型、偏执型，紧张型及慢性精神分裂症的孤僻、退缩、淡漠症状 □ 对抑郁症状有一定疗效 □ 止呕	6岁以上儿童按成人剂量换算，应小剂量开始，缓慢增加剂量。	无

	说明书	UpToDate	UpToDate用法
精神分裂症	目前尚缺乏15岁以下儿童的足够的临床经验。	13岁以下儿童使用本药口服制剂的安全性和有效性尚不明确	青少年：起始剂量为一次0.5mg，一日1次，晨间或晚间服用。 对出现持续嗜睡的患者，可能适宜按一日2次给药。剂量调整间隔时间不少于24小时，剂量增幅为一日0.5mg或1mg。 若耐受，推荐剂量为一日3mg。有效剂量范围为一日1-6mg。

	说明书	UpToDate	UpToDate用法
双相情感障碍的躁发作	目前尚缺乏18岁以下儿童及青少年的足够临床经验。	10岁以下儿童使用本药口服制剂的安全性和有效性尚不明确	儿童或青少年：起始剂量为一次0.5mg，一日1次，晨间或晚间服用。 对出现持续嗜睡的患者，可能适宜按一日2次给药。剂量调整间隔时间不少于24小时，剂量增幅为一日0.5mg或1mg。若耐受，推荐剂量为一日1-2.5mg。有效剂量范围为一日0.5-6mg。

	说明书	UpToDate	UpToDate用法
对于孤独性障碍相关的易激惹性	无	已证实了5-16岁儿童使用本药口服制剂的安全性和有效性	儿童或青少年： 体重等于或大于15kg且小于20kg者，起始剂量为一日0.25mg，至少连用4日后，可增至推荐剂量一日0.5mg； 体重等于或大于20kg者，起始剂量为一日0.5mg，至少连用4日后，可增至推荐剂量一日1mg。之后维持该剂量至少再连用14日。

说明书		UpToDate用法
Tourette 综合征	无	儿童或青少年：起始剂量为一次0.125-0.5mg，一日1次。根据应答和耐受性逐渐增量至常规剂量一日0.75-3mg。临床研究中的剂量增幅通常小于一次0.5mg、一日2次，且调整间隔时间等于或大于3日。有儿童用药最高达一日4mg、青少年用药最高达一日6mg的研究数据。

	说明书	UpToDate
❑ 各种神经症所致的焦虑状态 ❑ 原发性高血压、消化性溃疡等躯体疾病伴发的焦虑状态	尚无本药对早产儿、新生儿、婴儿、幼儿及小儿的安全性资料。	无

	肝功能不全	肾功能不全
舒必利片 Sulpiride	减量	减量
利培酮片 Risperidone	起始及维持剂量应减半	起始及维持剂量应减半
枸橼酸坦度螺 酮片 Tandospirone Citrate	慎重给药	慎重给药

	妊娠期	哺乳期
舒必利片 Sulpiride	慎用，使用时应减低剂量	停止哺乳
利培酮片 Risperidone	权衡利弊	停止哺乳
枸橼酸坦度螺 酮片 Tandospirone Citrate	权衡利弊	停止哺乳

	儿童	老年人
舒必利片 Sulpiride	6岁以上儿童按成人剂量换算，应小剂量开始，缓慢增加剂量	老年患者应从小剂量开始，缓慢增加剂量
利培酮片 Risperidone	1、对于精神分裂症，目前尚缺乏15岁以下儿童的足够的临床经验。 2、对于品行障碍和其它行为紊乱，目前尚缺乏5岁以下儿童的足够的临床经验。 3、对于双相情感障碍的狂躁发作，目前尚缺乏18岁以下儿童及青少年的足够临床经验。	治疗精神分裂症：建议起始剂量为每次0.5mg、每日2次，剂量可根据个体需要进行调整。剂量增加的幅度为每次0.5mg，直至一次1~2mg。
枸橼酸坦度螺酮片 Tandospirone Citrate	尚无本药对早产儿、新生儿、婴儿、幼儿及小儿的安全性资料。	从小剂量(例如，每次5mg)开始。

舒必利片
Sulpiride

无

利培酮片
Risperidone

❑ 患者在治疗期间不应驾驶汽车或操作机器。

❑ 食物不影响本品的吸收。

枸橼酸坦度螺
酮片
Tandospirone
Citrate

❑ 在服用本药过程中不得从事伴有危险的机械性作业。

不良反应	说明书
胃肠道	食欲不振、口干、便秘
神经系统	失眠、早醒、头痛、烦躁、迟发型运动障碍
心血管系统	心动过速、心电图异常
泌尿系统	排尿困难
生殖系统	男子女性化乳房、月经失调、闭经

不良反应—利培酮片

在双盲、安慰剂对照试验中，不少于1%的利培酮组成成年患者报告的不良反应

机体系统/器官分类 不良反应名称	利培酮 ≤8 mg/天 (N=853) %
眼部	
视力模糊	2.1
耳部和迷路	
耳痛	0.1
心脏	
心动过速	1.1
血管	
直立性低血压	1.3
低血压	0.2
呼吸系统、胸、膈	
鼻充血	2.0
呼吸困难	0.8
鼻出血	0.5
鼻窦充血	0.5
胃肠道	
恶心	6.4
便秘	4.6
消化不良	4.3
呕吐	3.9
腹泻	2.3

不良反应—利培酮片

在双盲、安慰剂对照试验中，不少于1%的利培酮组成年患者报告的不良反应

机体系统/器官分类 不良反应名称	利培酮 ≤8 mg/天 (N=853) %
感染	
鼻咽炎	2.1
上呼吸道感染	1.5
鼻窦炎	0.7
泌尿道感染	0.5
血液和淋巴系统	
贫血	0.1
免疫系统	
超敏反应	0.1
精神病性障碍	
失眠	16.2
焦虑	7.7
神经质	0.5
神经系统	
帕金森(氏)综合征*	19.3
静坐不能*	9.8
嗜睡	6.8
头晕	6.3
镇静	4.6

不良反应—利培酮片

在双盲、安慰剂对照试验中，不少于1%的利培酮组成年患者报告的不良反应

机体系统/器官分类 不良反应名称	利培酮 ≤8 mg/天 (N=853) %
皮肤及皮下组织	
皮疹	0.8
皮肤干燥	0.5
皮屑	0.2
脂溢性皮炎	0.2
过度角化	0
骨骼肌和结缔组织	
背痛	2.5
关节痛	1.5
末端疼痛	1.2
肾脏和泌尿系统	
尿失禁	0.2
生殖系统和乳腺	
射精失败	0.4

不良反应—坦度螺酮片 常见/严重

不良反应	说明书
神经系统	嗜睡、情绪不佳
消化系统	恶心、呕吐、食欲下降、
肝脏	AST、ALT↑、黄疸
其他	步态蹒跚、倦怠感
循环系统	心悸、心动过速、胸闷
过敏反应	皮疹、荨麻疹、瘙痒

舒必利片
Sulpiride

❑ 嗜铬细胞瘤、高血压患者严重心血管病和严重肝病患者、对本品过敏者禁用。

利培酮片
Risperidone

❑ 已知对本品过敏的患者禁用。

枸橼酸坦度螺
酮片
Tandospirone
Citrate

❑ 对本品中任何成份过敏者禁用。

B药 \ A药	舒必利片 Sulpiride
除氯氮平外，几乎所有抗精神病药和中枢抑制药均与共存在相互作用，应充分注意。	

B药 \ A药	利培酮片 Risperidone
左旋多巴及其它多巴胺激动剂	拮抗
抗高血压药物	血压 ↓
卡马西平及其它CYP3A4肝酶诱导剂	A血浆浓度 ↓
呋塞米	死亡率 ↑

B药 \ A药	枸橼酸坦度螺酮片 Tandospirone Citrate
丁酰苯类药物： 氟哌啶醇、螺哌隆等	锥体外系 ↑
钙拮抗剂： 尼卡地平、氨氯地平、硝苯吡啶等	B降压 ↑

- 1. 患有心血管疾病(如:心率失常、心肌梗死、传导异常)应慎用。
- 2. 出现迟发性运动障碍, 应停用所有的抗精神病药。
- 3. 出现过敏性皮疹及恶性症状群应立即停药并进行相应处理。
- 4. 基底神经节病变, 帕金森综合症, 严重中枢神经抑制状态者慎用。
- 5. 肝、肾功能不全者应减量。
- 6. 癫痫患者慎用。

- 1. 老年痴呆患者，与呋塞米合用→死亡率↑
- 2. 脑血管意外（CAE）↑
- 3. 对 α 受体的阻断活性→血压↓
- 4. 迟发性运动障碍/锥体外系症状（TD/EPS）↑
- 5. 抗精神病药的恶性综合征（NMS）→高热、肌肉僵直、颤抖、意识障碍和血清肌酸磷酸激酶水平升高，还可能出现肌红蛋白尿症（横纹肌溶解症）和急性肾衰。
- 6. 高血糖和糖尿病↑
- 7. 体重↑

- 1. 慎重给药(下列病人慎重给药)
 - (1) 器质性脑功能障碍的病人→药效↑
 - (2) 中度或严重呼吸功能衰竭病人→症状恶化
 - (3) 心功能障碍的病人→症状恶化
 - (4) 肝功能、肾功能障碍的病人→影响药代动力学
 - (5) 老年人→小剂量开始

- 2. 重要注意事项
- - (1) 用于神经症病人时，若病人病程长(3年以上)，病情严重或其它药物(苯二氮草类药物)无效的难治型焦虑患者，本药可能也难以产生疗效。当1天用药剂量达60mg仍未见明显疗效时，应及时与医师联系，不得随意长期应用。
 - (2) 本药用于伴有严重焦虑症状的病人，难以产生疗效时，应慎重观察症状。
 - (3) 本药可引起嗜睡、眩晕等，故应嘱病人在服用本药过程中不得从事伴有危险的机械性作业。
 - (4) 本药与苯二氮草类药物无交叉依赖性，若立即将苯二氮草类药物换为本药时，有可能出现苯二氮草类药物的戒断现象，加重症状，故在需要停用苯二氮草类药物时，须缓慢减量，充分观察。

药物过量的处理			
	舒必利片 Sulpiride	利培酮片 Risperidone	枸橼酸坦度螺酮片 Tandospirone Citrate
表现	严重意识障碍，从嗜睡、注意力不集中到昏睡，最后进入昏迷。检查时可发现瞳孔缩小，对光反应迟钝。同时伴有中枢性体温过低。	嗜睡和镇静、心动过速和低血压、以及锥体外系症状。药物过量时，曾有QT间期延长和癫痫的报告。过量的本品合用帕罗西汀时，曾有扭转型室性心动过速的报告。	无资料
给予对症治疗及支持疗法			
过量处理	洗胃、导泻、输液	维持气道的通畅、洗胃出现严重的锥体外系症状时，则应给予抗胆碱药	无资料

1. 坦度螺酮严重的不良反应有（ B ）

- A. 嗜睡、情绪不佳
- B. AST、ALT↑、黄疸
- C. 步态蹒跚、倦怠感
- D. 皮疹、荨麻疹、瘙痒



敬 请 指 导

