



“小药片，大使命”之坦索罗辛

文 / 北京市密云区鼓楼社区卫生服务中心 高艳玲



高艳玲，北京市密云区鼓楼社区卫生服务中心主管药师、临床药师，执业西药师；药学硕士。擅长慢病患者的用药重整、用药指导、用药宣教以及特殊给药装置使用，目前主要从事药品不良反应上报及科普宣传等工作。

每种药片一从药厂出来就带着自己的使命，有的发挥抗菌作用，有的发挥抗凝作用，有的发挥降压作用……，而坦索罗辛在老年男性前列腺增生疾病中发挥着重要作用，现在已经成为一线药物，解决了部分老年男性的“难言之隐”。

随着年龄增长，人体各项生理机能不断下降，而前列腺增生属于一种退行性病变，因此老年男性前列腺增生的发生率相比中青年更高，严重影响老年男性的生活质量。主要症状包括排尿障碍、尿不尽、尿频、夜间多尿等，严重时还可能导致无法排尿，进而由于尿道闭塞而引起肾功能降低。

目前临床上对于良性前列腺增生（见图1）除了外科手术治疗外，最常用的方法是使用药物缓解症状，延缓疾病的进展。可供选择的药物包括 α_1 受体阻滞剂、5 α

还原酶抑制剂、M受体拮抗剂、5型磷酸二酯酶抑制剂、 β_3 受体激动剂。在这几类药物中， α_1 受体阻滞剂（如多沙唑嗪、特拉唑嗪、坦索罗辛）不仅可以单药使用，也可以与其他几类药物联合使用治疗前列腺增生。而坦索罗辛作为高选择性 α_1 受体阻滞剂具有更多的临床优势。

一、坦索罗辛的作用机制

谈到坦索罗辛的作用机制，我们应先了解 α 受体的分布情况。

α 受体可以分为两类： α_1 受体和 α_2 受体。 α_1 受体大多分布在血管平滑肌上，如皮肤、胃肠道系统的括约肌、膀胱和前列腺等； α_2 受体大多分布在去甲肾上腺素能神经末突触前膜、胰岛 β 细胞、血管平滑肌等。

而 α_1 受体还可以进一步细分为 α_{1A} 受体、 α_{1B} 受体和 α_{1D} 受体。

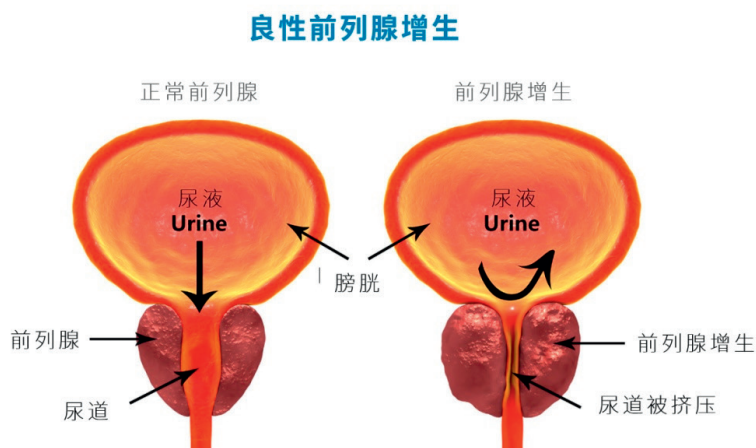


图1 良性前列腺增生(注: 图片摘自凤凰网旗下自媒体平台“大风号”)

其中, α_1 A受体主要负责调控膀胱颈和前列腺部位平滑肌张力, α_1 B受体通过松弛动脉血管平滑肌可以调控血压, α_1 D受体与膀胱肌肉收缩及骶脊髓神经支配相关。

由上可知, α_1 A受体与前列腺健康之间有很深的联系; 坦索罗辛能够高选择性地阻断前列腺中的 α_1 A受体, 松弛前列腺平滑肌, 从而改善良性前列腺增生症所致的排尿困难。该药属于对症药物, 治疗起效迅速, 一般用药后数小时或数天即可改善症状; 不会影响前列腺体积和血清前列腺特异性抗原(PSA)水平。

二、坦索罗辛与其他 α 受体阻滞剂的比较

坦索罗辛是一种高选择性的 α_1 受体阻滞剂, 目前最常见的是盐酸坦索罗辛缓释胶囊。每日1次, 每次0.2 mg; 餐后服用。用于治疗前列腺增生引起的排尿困难。常见的不良反应有直立性低血压、心动过速或心律失常、头晕、乏力、困倦、

逆行射精或射精无力等。其他常见的 α 受体阻滞剂包括:

(1) 选择性 α_1 受体阻滞剂盐酸特拉唑嗪片/胶囊。用于治疗轻至中度的高血压, 以及良性前列腺增生引起的症状。用于高血压时, 一般初始睡前服用1 mg, 常规维持剂量为每日1次, 每次2~10 mg。用于前列腺增生时, 一般初始睡前服用1 mg, 常规维持剂量为每日1次, 每次2 mg、5 mg或10 mg。常见的不良反应与坦索罗辛相同。

(2) 非选择性 α 受体阻滞剂甲磺酸酚妥拉明注射液/片。其中, 注射剂型主要用于诊断嗜铬细胞瘤及其所致的高血压, 治疗左心室衰竭, 以及防止去甲肾上腺素静脉给药外溢导致的皮肤坏死; 口服剂型主要用于勃起功能障碍的治疗。常见的不良反应亦与坦索罗辛相同。

三、坦索罗辛与非那雄胺的联合使用

在临床实践中, 我们不仅能看到坦索罗辛单独使用, 有些时候还

会与非那雄胺联合使用。

非那雄胺通过抑制II型5 α 还原酶的活性, 可以抑制睾酮向双氢睾酮转变, 有效减少血液和前列腺内的双氢睾酮, 从而达到缩小前列腺体积、改善排尿困难的目的。与非那雄胺作用机制相似的还有同为II型5 α 还原酶抑制剂的爱普列特, 以及药效更强的I型和II型5 α 还原酶双重抑制剂量他雄胺。

对于前列腺增生伴有明显前列腺体积肥大的患者, 选择 α_1 受体阻滞剂联合II型5 α 还原酶抑制剂不仅仅能改善症状, 还能缩小前列腺的体积。临床实践也表明, 联合治疗对于症状及最大尿流率的改善优于单药治疗。

但需要注意: ①当两种药物联合使用时, 不良反应为每种药物的不良反应之和。②非那雄胺等II型5 α 还原酶抑制剂可以影响血清PSA水平, 因此对于使用II型5 α 还原酶抑制剂的患者, 在做前列腺癌筛查时需要考虑该药物对PSA的影响。

四、注意事项

(1) 市售的坦索罗辛一般为盐酸坦索罗辛缓释胶囊, 其使用时不应打开胶囊、压碎或咀嚼后服用, 否则会破坏缓释结构导致药物大量迅速释放, 引起低血压等不良反应。

(2) 食物能够影响坦索罗辛的吸收, 因此建议餐后服用。

(3) 坦索罗辛可能引起直立性低血压, 因此建议晚上睡前服用。

(4) 坦索罗辛具有磺酰胺结构, 因此对磺胺类药物过敏者慎用。

(5) 与其他降压药联合使用



时,需要密切监测血压变化。

(6) 在使用坦索罗辛治疗前,需要筛查其他可能引起前列腺增生的疾病(如前列腺癌),防止延误治疗。

(7) 坦索罗辛可以用于女性尿潴留的治疗。

(8) 避免与其他 α 受体阻滞剂联合使用。

(9) 重度肝肾功能异常的患者慎用。

五、生活方式干预

前列腺增生目前已经成为老

年男性一种常见的慢性病,防大于治,老年男性应该规范自己的日常行为,养成良好的生活习惯。

(1) 不要憋尿:长时间憋尿会导致前列腺充血肿胀,膀胱逼尿肌张力减弱,加重排尿困难。

(2) 不要久坐:久坐会压迫前列腺,造成充血和局部循环障碍,建议每隔一段时间就起身活动。

(3) 规律排精:排出精液的同时能够排出前列腺液,可以减少结石等形成。

(4) 减少酒精和咖啡的摄入,

因为酒精和咖啡具有利尿和刺激作用,可以引起尿量增多及前列腺炎的相关症状(如尿频、尿急等)。

(5) 每日饮水要适量,不能过多,但不能少于1500 mL。

总之,无论是单独使用还是与其他药物联合使用,坦索罗辛都可以改善前列腺增生患者的症状。除了规律用药,患者还应保持良好的生活习惯,以达到事半功倍的效果。

药物与人