

硝苯地平胶丸 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文
https://www.100test.com/kao_ti2020/311/2021_2022__E7_A1_9D_E8_8B_AF_E5_9C_B0_E5_c22_311158.htm 药品名称硝苯地平胶丸 英文名称Nifedipine soft capsules 类别钙拮抗药制剂胶丸

: 5mg。分子式成分化学名: 2, 6-二甲基-4(2-硝基苯基)-1, 4-二氢-3, 5-吡啶二甲酸二甲酯。分子式: C₁₇H₁₈N₂O₆。分子量: 346.34。药理毒理硝苯地平为二氢吡啶类钙拮抗剂, 可选择性抑制钙离子进入心肌细胞和平滑肌细胞的跨膜转运, 并抑制钙离子从细胞内库释放, 而不改变血浆钙离子浓度。药理作用 1.本品能同时舒张正常供血区和缺血区的冠状动脉, 拮抗自发的或麦角新碱诱发的冠状动脉痉挛, 增加冠状动脉痉挛病人心肌氧的递送, 解除和预防冠状动脉痉挛。 2.本品可抑制心肌收缩, 降低心肌代谢, 减少心肌耗氧量。 3.本品能舒张外周阻力血管, 降低外周阻力, 可使收缩血压和舒张血压降低, 减轻心脏后负荷。 4.本品可延缓离体心脏的窦房结功能和房室传导; 整体动物和人的电生理研究未发现本品有延缓房室传导、延长窦房结恢复时间和减慢窦房结率的作用。 致癌、致突变及生殖毒性无致癌作用。无致突变性。大剂量应用可降低雌性鼠生殖力; 可致畸; 可引起流产(胎鼠药物吸收率增加、胎鼠死亡率上升、新生鼠存活率下降)。孕猴服用2/3-2倍于人类最大剂量, 可导致小胎盘和绒毛发育不全; 给大鼠3倍于人类最大剂量, 可引起妊娠延长。对人类的生殖力影响尚不明确。药动学口服后吸收迅速、完全。口服后10分钟即可测出其血药浓度, 约30分钟后达血药峰浓度, 嚼碎服或舌下含服达峰时间提前。硝苯地平10-30mg, 生物利用度和半衰期无显著差别。吞服、嚼碎服或舌下含服硝苯

地平片，相对生物利用度基本无差异。硝苯地平与血浆蛋白高度结合，约为90%。口服15分钟起效，1~2小时作用达高峰，作用持续4~8小时；舌下给药2-3分钟起效，20分钟达高峰。T_{1/2}呈双相，T_{1/2} 2.5-3小时，T_{1/2} 为5小时。药物在肝脏内转换为无活性的代谢产物，约80%经肾排泄，20%随粪便排出。肝肾功能不全的患者，硝苯地平代谢和排泄速率降低。

适应症心绞痛：变异型心绞痛；不稳定型心绞痛；慢性稳定型心绞痛。高血压（单独或与其它降压药合用）。不良反应

- 1.常见服药后出现外周水肿（外周水肿与剂量相关，服用60mg/日时的发生率为4%，服用120mg/日则为12.5%）；头晕；头痛；恶心；乏力和面部潮红（10%）。一过性低血压（5%），多不需要停药（一过性低血压与剂量相关，在剂量lt.0.5%）。
- 3.可能产生的严重不良反应：心肌梗塞和充血性心力衰竭发生率4%；肺水肿的发生率2%；心律失常和传导阻滞的发生率各小于0.5%。
- 4.本品过敏者可出现过敏性肝炎、皮疹，甚至剥脱性皮炎等。

相互作用

- 1.硝酸酯类与本品合用控制心绞痛发作，有较好的耐受性。
2. -受体阻滞剂绝大多数患者合用本品有较好的耐受性和疗效，但个别患者可能诱发和加重低血压、心力衰竭和心绞痛。
- 3.洋地黄本品可能增加血地高辛浓度，提示在初次使用、调整剂量或停用本品时应监测地高辛的血药浓度。
- 4.蛋白结合率高的药物如双香豆素类、苯妥英钠、奎尼丁、奎宁、华法林等与本品同用时，这些药的游离浓度常发生改变。
- 5.西米替丁与本品同用时本品的血浆峰浓度增加，注重调整剂量。

用法用量

- 1.硝苯地平的剂量应视患者的耐受性和对心绞痛的控制情况逐渐调整。过量服用硝苯地平可导致低血压。
- 2.从小剂量开始服用，

一般起始剂量10mg/次，一日3次口服；常用的维持剂量为口服10-20mg/次，一日3次。部分有明显冠脉痉挛的患者，可用至20-30mg/次，一日3-4次。最大剂量不宜超过120mg/日。假如病情紧急，可嚼碎服或舌下含服10mg/次，根据患者对药物的反应，决定再次给药。3.通常调整剂量需7-14天。假如患者症状明显，病情紧急，剂量调整期可缩短。根据患者对药物的反应、发作的频率和舌下含化硝酸甘油的剂量，可在3天内将硝苯地平的用量从10-20mg调至30mg/次，一日3次。4.在严格监测下的住院患者，可根据心绞痛或缺血性心律失常的控制情况，每隔4~6小时增加1次，每次10mg。#093.尚无足够的研究资料。现有文献表明，增加剂量可使外周血管过度扩张，导致或加重低血压状态。药物过量导致临床上出现低血压的患者，应及时给予心血管支持治疗，包括心肺监测、抬高下肢、注重循环血容量和尿量。若无禁忌症，可用血管收缩药（去甲肾上腺素）恢复血管张力和血压。肝功能损害的患者药物清除时间延长。血液透析不能清除硝苯地平。注重事项对硝苯地平过敏者禁用。1.低血压绝大多数患者服用硝苯地平后仅有轻度低血压反应，个别患者出现严重的低血压症状。这种反应常发生在剂量调整期或加量时，非凡是合用 α -受体阻滞剂时。在此期间需监测血压，尤其合用其它降压药时。2.芬太尼麻醉接受冠脉旁路血管移植术(或者其他手术)的患者，单独服用硝苯地平或与 α -受体阻滞剂合用可导致严重的低血压，如条件许可应至少停药36小时。3.心绞痛和/或心肌梗塞极少数患者，非凡是严重冠脉狭窄患者，在服用硝苯地平或加量期间，降压后出现反射性交感兴奋而心率加快，心绞痛或心肌梗塞的发生率增加。4.外周水肿10%的患

者发生轻中度外周水肿，与动脉扩张有关。水肿多初发于下肢末端，可用利尿剂治疗。对于伴充血性心力衰竭的患者，需分辩水肿是否由于左室功能进一步恶化所致。

5. -受体阻滞剂反跳症状忽然停用 -受体阻滞剂而启用硝苯地平，偶可加重心绞痛。须逐步递减前者用量。

6.充血性心力衰竭少数接受 -受体阻滞剂的患者开始服用硝苯地平后可发生心力衰竭，严重主动脉狭窄患者危险更大。

7.对诊断的干扰 应用本品时偶可有碱性磷酸酶、肌酸磷酸激酶、乳酸脱氢酶、门冬氨酸氨基转移酶和丙氨酸氨基转移酶升高，一般无临床症状，但曾有报道胆汁淤积和黄疸；血小板聚集度降低，出血时间延长；直接Coomb实验阳性伴/不伴溶血性贫血

8.肝肾功能不全、正在服用 -受体阻滞剂者应慎用，宜从小剂量开始，以防诱发或加重低血压，增加心绞痛、心力衰竭、甚至心肌梗塞的发生率。慢性肾衰患者应用本品时偶有可逆性血尿素氮和肌酐升高，与硝苯地平的关係不够明确。

9.长期给药不宜骤停，以避免发生停药综合症而出现反跳现象。

#093.无详尽的临床研究资料。临床上有硝苯地平用于高血压的孕妇。硝苯地平可分泌入乳汁，哺乳妇女应停药或停止哺乳。

#093.硝苯地平在老年人的半衰期延长，应用时注重调整剂量。

100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 www.100test.com