

乐卡地平 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\\_\\_E4\\_B9\\_90\\_E5\\_8D\\_A1\\_E5\\_9C\\_B0\\_E5\\_c22\\_311235.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/311/2021_2022__E4_B9_90_E5_8D_A1_E5_9C_B0_E5_c22_311235.htm) 药品名称乐卡地平药

物别名再宁平 Lerdip，Zanidip，Masnidipine 英文名

称lercanidipine 类别钙拮抗药制剂薄膜衣片 10 mg分子式成分

(±)-2-[(3,3)-二苯丙基]甲氨基-1,1-二甲乙基1,4-二羟基-2,6-二甲基-4-(间-硝基苯基)-5-二羧酸吡啶盐酸盐

。药理毒理本品为第三代二氢吡啶类钙通道阻滞剂，作用机制与同类药物相似，即可逆地阻滞血管平滑肌细胞膜L型钙通道的Ca<sup>2+</sup>内流，扩张外周血管而降低血压。本品亲脂性较高，因此起效时间较慢，而作用持续时间较长。体内外试验表明，本品选择性血管扩张作用所致的负性肌力作用较硝苯地平、尼群地平和非洛地平弱；而血管选择性强于氨氯地平、非洛地平、尼群地平及拉西地平。此外，本品还具有抗动脉粥样硬化和保护终末器官作用。本品在治疗剂量时不干扰高血压患者的正常心脏兴奋性和传导性。动物实验表明，本品对肾脏有保护作用，其机制可能与血流动力学无关。药动学本品为消旋体，有效部分为S型异构体。轻中度高血压患者口服10或20mg后，其T<sub>max</sub>为2~3h，C<sub>max</sub>分别为1.75和4.09 μg/L，其AUC与剂量呈现非线性相关，表明此药物具有首过代谢的饱和性。食物可增加本品的吸收，12例健康受试者单剂量口服20mg，其C<sub>max</sub>由禁食的3.20 μg/L增至高脂肪餐后的10.21 μg/L，故推荐饭后服用。本品吸收后迅速分布、积聚在细胞膜脂质双层，蛋白结合率高于98%。本品口服后，主要由CYP3A4代谢而具有广泛首过效应，无活性代谢产物约50%由粪便排出，44%由尿排出。药物呈双相消除

，终末消除半衰期（ $T_{1/2}$ ）为2.8~3.7h。适应症在欧洲本品用于各型高血压；在英国只用于轻中度高血压。不良反应本品耐受性良性，据20个临床试验中心、共约1800例患者参与的试验结果表明，不良反应发生率为11.8%，安慰剂组为7%。最常见不良反应是头痛、面约、无力、疲惫、心悸及踝关节水肿，约3%~5%患者因此而停药。对9605例临床观察表明，本品耐受性良性，其中7469例轻中度高血压患者口服10或20mgd<sup>-1</sup>，疗程3个月，不良反应发生率7.6%，最常见的是头痛（2.7%）和踝关节水肿（2.1%）。本品不良反应多属于轻中度，且与血管扩张作用相关。相互作用与b-阻断剂同有协同作用。同时服用地高辛或西米替丁（高于800 mg/日）需注重观察。慎与酮康唑、伊曲康唑、红霉素、氟西汀、利福平、特非那定、阿司咪唑、环孢素、胺碘酮、奎尼丁、某些苯二氮类，如地西洋和咪达唑仑、普奈洛尔和美托洛尔同时服用。慎与抗惊厥药，如苯妥英或卡马西平同时服用。西柚汁可增强本品的作用，应避免同时使用。服用本品时应戒除或严格限制含酒精饮料的摄入。用法用量推荐剂量为10mg，qd，至少在饭前15min口服，必要时2周以后增至20mg，qd。注重事项对二氢吡啶类过敏者禁用；左心室传出通道阻滞、未经治疗的充血性心力衰竭、不稳定型心绞痛、有严重肾脏或肝脏疾病、以及在一个月內发生过心肌梗塞的患者禁用；妊娠和哺乳期妇女，未采取任何避孕措施的高龄妇女；18岁以下患者不得服用禁用。本品生物利用度不受年龄和肝硬化的影响，但严重肝、肾功能不全者禁用。本品与药酶抑制剂，如酮康唑、依曲康唑、红霉素、氟西汀；或药酶诱导剂如苯妥英、依曲康唑、红霉素、氟西汀；及药酶底物如特非

那定、阿司咪唑、环孢素、胺碘酮、奎尼丁、地西洋、咪达唑仑、普萘洛尔和美托洛尔合用时应谨慎。此外，本品也不能与葡萄柚汁合用，以免因血药浓度升高而产生不良反应。

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](http://www.100test.com)