

伊贝沙坦 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_BC_8A_E8_B4_9D_E6_B2_99_E5_c22_311304.htm 药品名称伊贝沙坦药物别名安博维 Aprovel 英文名称irbesartan 类别降血压药制剂片剂：150mg。分子式成分化学名：2-丁基-3-[邻-1H-5-四唑基苯基]苄基]-1,3-二氮杂螺[4,4]壬-1-烯-4-酮。英文化学名：3-butyl-3-[p-(0-1H-tetrazol-5-yl-phenyl)benzyl]-1,3-diazospiro[4,4]non-1-en-4-one

药理毒理伊沙贝坦是一种强力高选择性口服血管紧张素II受体（AT1亚型）拮抗剂，它能完全阻断由AT1体介导的血管紧张素II的全部活性，与血管紧张素II的来源或合成途径无关。血管紧张素II受体的抑制引起血浆中肾素和血管紧张素II浓度增加，同时降低血浆中醛固酮的浓度。推荐服用剂量，对血清中血钾浓度无影响。伊贝沙坦对ACE（激肽酶）无抑制作用，后者能产生血管紧张素II，也能将缓激肽降解成无活性的代谢物。伊贝沙坦的活性无需代谢活化。药动学口服给药后，本品吸收很好，绝对生物利用度大约60~80%，饮食对本品的生物利用度无显著影响。血浆蛋白结合近似90%，与血液中其它细胞成分结合很少，分布容积达53-93升。14C本品口服或静脉途径给药后，循环血浆中80~85%的放射标记活性物为本品。通过葡糖苷酸结合和氧化，本品经肝脏代谢，主要代谢产物为伊贝沙坦葡糖苷酸（约6%）。体外研究表明，本品主要通过细胞色素P450酶CYP2C9氧化，同功酶CYP3A5影响很小。在10-600mg剂量范围内，本品呈现线性，与剂量成正比的药代动力学。口服剂量超过600mg（最大推荐剂量的2倍）时，这种正比例的增加减弱，但其机理到目前为止并不清楚。口服

后1.5 - 2小时达到峰值血浆浓度。全身清除和肾清除分别为157 - 176ml/min和3 - 3.5ml/min。本品终末清除半衰期为11 - 15小时。每日一次服药，服药3天达稳态血浆浓度。天天一次的剂量重复给药，本品血浆中蓄积有限（<20%）。在一项研究中发现，在女性高血压病人中本品血浆浓度略高，但半衰期与蓄积不变。因此女性病人无需调整剂量。在老年组（65岁）中本品的AUC和C_{max}比青年组（18-40岁）略大，但两组末半衰期无明显改变，老年病人无需调整剂量。本品和其代谢产物均经胆汁和肾脏途径清除。适应症原发性高血压 不良反应不良反应稍微且短暂，偶有头痛，肌肉骨骼损伤，潮红。相互作用其他抗高血压药物可增加本品的降压作用。与保钾利尿剂、补钾药物、高钾食品或其它增加血钾浓度的药物合用，导致血钾增加。与锂盐制剂合用时，应监测血清锂水平。同服地高辛、双氢氯噻嗪、华法令、硝苯地平无药物间相互作用。用法用量常用量为150 mg qd。进行血液透析和年龄超过75岁的老年患者，初始剂量可考虑给予75 mg qd。肾功能和轻到中度肝功能受损的患者无需调整剂量。注重事项孕妇和哺乳妇女禁用。首次服药，血容量不足或失钠，限制钠摄入量，腹泻或呕吐的病人可能发生症状性低血压，服用本药之前应纠正上述情况。肾功能衰竭和肾移植，肾血管性高血压，主动脉、二尖瓣狭窄和梗塞性心肌肥大患者慎用。原发性醛固酮增多症的病人一般不推荐使用本药。

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