

尼索地平 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__E5_B0_BC_E7_B4_A2_E5_9C_B0_E5_c22_311767.htm 药品名称尼索地平药

物别名尼尔欣、蒂益欣 英文名称Nisoldipine〔 〕类别钙拮

抗药制剂片剂：5mg；10mg。缓释片：10mg。胶囊：5mg。分

子式成分化学名为1，4--二氢--2，6--二甲基--4--(2--硝基

苯)--3，5--吡啶二羧酸异丁甲酯。药理毒理尼索地平是一种

新型二氢吡啶类钙通道阻滞剂，化学结构与硝苯地平相似，

临床用于治疗全身性高血压和心绞痛，少数用于治疗充血性

心衰。它通过抑制钙离子进入可兴奋的组织，引起外周血管

和冠脉血管舒张。尼索地平的舒张外周血管作用比维拉帕米

强，但对心脏传导的作用不如维拉帕米。1 降低全身血管的

阻力和血压钙通道阻滞剂具有舒张动脉血管的作用，舒张外

周血管的作用是硝苯地平的5-10倍。Soward等研究发现，正

常人口服尼索地平10-20mg，血压有稍微的剂量依赖性下降伴

有轻度的心率加快。同样剂量的尼索地平用于治疗高血压时

，对血压的作用更加明显。2 对心率的影响关于口服尼索地

平对心率的作用报道不一致，一项研究表明，在安静状态或

剧烈运动状态下，药物对心率无影响；另一项研究却报告，

口服尼索地平在上述两种状态下均引起心率加快。3 降低冠

脉血管阻力和增加冠状窦血流尼索地平是一种有效的冠状血

管舒张剂。它在人体内有减少冠状血管阻力和增加冠状血流

量的作用。尼索地平对正常心肌和局部缺血心肌均有增加血

流量的作用。尼索地平能明显扩张心外膜冠状动脉的正常段

和狭窄段。与其他冠状舒张药如双嘧达莫（潘生丁）等不同

，服用尼索地平并不引起冠状血流改道现象。Rousseau等的

研究表明，口服尼索地平10-20mg/d的长疗程中，并未发现冠状血流改道引起的心脑缺血的征候。

4 改善心脏和肺的血液流动力学

几名研究者将尼索地平iv、口服及冠状注射治疗冠状脉疾病，结果发现肺楔压没有变化。Freedman等报道尼索地平能减少运动下肺楔压的升高，而ram等的研究表明，在剧烈运动状态下口服尼索地平10mg，可使肺楔压降低。一切研究展示了尼索地平改善肺的血液流动力学。在另一研究中，剧烈运动状态下口服尼索地平5mg，使平均肺动脉压显著降低约15%。Amende等用冠状注射尼索地平发现，在局部缺血前对肺毛细血管压无影响，但对局部缺血引起的肺毛细血管压升高有微小的减弱作用。很多研究表明，心输出量/心脏指数在服用尼索地平后明显升高。Josephs等发现，口服尼索地平1.5 μ g/kg后，安静状态下心输出量增加17%，运动状态下增加6%。Ram等的研究表明，口服尼索地平10mg后心输出量在安静状态和运动下均增长。左心室功能受损的病人，服尼索地平后其心脏指数和心输出量均显著增加。大多数钙通道阻滞剂具有心肌抑制作用，一般不宜用于左心室功能不良/低射血分数者，而治疗剂量的尼索地平没有心肌抑制作用，而且可能提高左心室的射血分数。在剧烈运动时，尼索地平显著增加左心室射血分数。Serrings等研究表明，尼索地平2 μ g/kgmin,iv3min,25各部位的不正常收缩恢复正常，从而提高了射血分数。

4 . 其它作用

钙通道阻滞剂并不舒张肾的血管系统，因此没有血管紧张肽酶原血管紧张肽-醛固酮系统的激活作用。正在研究的钙通道阻滞剂对血小板的活化有抑制作用。运动对富含血小板血浆的聚集反应有增强作用,实验表明服尼索地平10mg\ d,每日一次将抑制这种作用.尽管结果不明显,

这项关于抑制血小板聚集反应的发现仍十分有意义,值得进一步研究。长期服用治疗剂量的尼索地平片对血糖和血脂浓度几乎没有影响。对血脂正常的高血压病人进行短期研究,结果表明病人的脂蛋白浓度发生了有利的变化。各种血管疾病病人服用治疗剂量的尼索地平的电生理学研究表明,心脏的传导时间和不应期无明显变化。药动学尼索地平口服后吸收良好,1.5h后达峰浓度,其血药浓度呈剂量依靠性。尼索地平在首次通过肝脏时即迅速代谢,故其生物利用度很低。药物的蛋白结合率很高,分布容积大,使其具有较高的组织穿透作用。尼索地平的半衰期已报道为2-15h,没有活性代谢产物。药物及其代谢产物主要通过尿排泄,患肝病者其消除半衰期延长,肾功能不全者对尼索地平的药代动力学的影响还未见报道。胶囊健康成人口服本品40mg后可很快吸收,达峰时间为 $0.94 \pm 0.28\text{h}$,消除半衰期为 $9.19 \pm 2.5\text{h}$ 。吸收后可在各组织中分布,体内几乎全部被代谢,主代谢途径为由1,4-二氢吡啶环脱氢生成吡啶环,异丁基羟基化生成三元醇,酯开裂生成一元羧酸。大部分经尿中排泄,少部分经粪便排泄。适应症钙离子拮抗剂,具冠状血管扩张作用和抗高血压作用。适应治疗心衰和高血压危象,作用迅速。不良反应有时出现轻度,一过性心悸、面红、头晕、耳鸣、乏力、恶心、皮疹等。(1)循环系统:有时出现心悸、血压降低、胸部痛、面红、热感。(2)精神神经系统:有时出现头痛、头晕、耳鸣、乏力。(3)消化系统:有时出现腹痛、腹泄、恶心。(4)肝脏:有时出现GOT、GPT、ALP的异常。(5)肾脏:有时出现BUN异常。(6)过敏症:有时出现皮疹。(7)偶见尿频、牙龈增生、男性乳房女性化。用法用量片剂:通常每次10mg,

一天2次，口服。胶囊：口服，成人每次5~10mg，每日2次。注重事项尼索地平的不良反 应，稍微而短暂与剂量有关。常见不良反 应与其它二氢吡啶类钙阻滞剂相似，有头痛、心悸、面色潮红、头晕、腿水肿、焦虑不安、疲惫、胃肠紊乱等。忽然停药会导致不稳定性心绞痛。休克患者禁用。孕妇及哺乳期妇女禁用。过度血压低的患者、严重肝功能障碍的患者、高龄患者应慎用。停药时应逐渐减量。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