

雷诺嗪 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/312/2021_2022__E9_9B_B7_E8_AF_BA_E5_97_AA_c22_312082.htm 药品名称雷诺嗪 英文名称Ranolazine 类别防治心绞痛药分子式成分化学名：(±)-N-

(2,6-二甲基苯基)-4-[2-羟基-3-(2-甲氧苯氧基)丙基]-1-哌嗪乙酰胺。分子式：C₂₄H₃₃N₃O₄。分子量：427.54。药理毒理 有效抗心绞痛：体外研究表明狗麻醉后，十二指肠内给Ranolazine或阿替洛尔均明显减弱电心脏起搏（200次/分）期间冠状动脉结扎引起的ST-T段上抬。Ranolazine的这种作用持续3个小时，不改变任何血液动力学参数；而使用阿替洛尔后却伴有舒张期血压、心率的升高或降低。大鼠灌胃给予Ranolazine，减弱由肾上腺素引起的ST段上抬。这些结果表明Ranolazine可有效地抗心绞痛，且不改变任何动力学参数。

不影响心率和血压：14名慢性稳定型心绞痛患者参加的单盲安慰剂对照试验中，病人服用安慰剂两周后，口服Ranolazine 30mg（一日三次），连续2周后改为口服60mg（一日三次），连续两周。结果表明：服用两种剂量后测定静息时心率和收缩压、剧烈运动后心率和收缩压分别与安慰剂对照组相比均无明显改变。全新作用机制：现有的治疗心绞痛药物都是通过直接减少心脏做功（心率和/或血压）而起作用。Ranolazine为pFOX（部分脂肪酸氧化酶）抑制剂，通过改变心脏代谢方式减少心脏需氧量。心脏代谢是利用氧气氧化脂肪酸或葡萄糖产能。正常生理状态下，心肌细胞主要利用脂肪酸氧化产能，而较少利用葡萄糖。pFOX抑制剂减少脂肪酸氧化，而增加葡萄糖氧化。利用每单位氧气，葡萄糖代谢产能较脂肪酸代谢产能多，那么由利用脂肪酸代谢产能

变为利用葡萄糖代谢产能则使心脏利用氧做更多功，从而降低心绞痛发作的可能性。鉴于上述全新的作用机制，口服Ranolazine后不引起心率减慢和血压下降。还可防止乳酸酸中毒，大大增强了使用安全性。药动学Ranolazine的最低有效血药浓度为500ng/ml，在此血药浓度下，可明显推迟心绞痛的发作，抑制运动期间ST段压低，延长踏车运动持续时间。由此得出服用Ranolazine的剂量为240mg。服用Ranolazine 1小时后测定血药浓度峰值范围为1576-2492ng/ml，早餐后1小时测定血中药物谷浓度范围为275-602ng/ml。血浆中Ranolazine的相代谢产物有11种，主要从肾中排泄。适应症心绞痛不良反应 期临床试验中使用Ranolazine最常见的不良反应是头痛、眩晕、疲乏。通过肝功、肾功及其它检查未发现明显异常。 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