

苯磺酸氨氯地平 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/312/2021_2022__E8_8B_AF_E7_A3_BA_E9_85_B8_E6_c22_312153.htm 药品名称苯磺酸氨氯地平 药物别名阿莫洛地平，络活喜 Norvasc 英文名

称Amlodipine Besylate 类别防治心绞痛药制剂片剂：2.5mg

、5mg、10mg。本品为白色片。分子式成分化学名称为：3-乙基-5-甲基-2-(2-氨基乙氧甲基)-4-(2-氯苯基)-1,4-二氢-6-甲基-3,5-吡啶二乙酸酯苯磺酸盐。分子式：

C₂₀H₂₅N₂O₅ClC₆H₆O₃S。分子量：567.1 药理毒理本品为钙

离子拮剂，阻滞心肌和血管平滑肌细胞外钙离子经细胞膜的钙离子通道进入细胞。直接舒张血管平滑肌，具有抗高血压作用，本品缓解心绞痛是通过扩张外周小动脉，使外周阻力降低，从而降低心肌耗氧量，另外扩张正常和缺血区的冠状动脉及冠状小动脉，使冠状动脉痉挛病人的心肌供氧量增加。药动学口服生物利用度约为64%~90%，PB约93%。T_{max}约6~12h，30~50min起效，作用6~12h达高峰，持续24h。

肝脏代谢失活，原药和代谢物经肾脏排出。T_{1/2}约30~50h。

适应症高血压，心绞痛。不良反应头痛、水肿、疲惫、失眠、恶心、腹痛、面红、心悸和头晕；亦见瘙痒、皮疹、呼吸困难、咳嗽、出汗、肌肉痉挛等。过量易致持久低血压。患者对本品至10mg/日的剂量可很好耐受。在安慰剂对照的临床治疗高血压或心绞痛的试验中，最常见的副作用是头痛，水肿，疲惫，嗜睡，恶心，腹痛，潮红，心悸，和眩晕。在这些临床试验中未发现与本品相关的临床检验指标异常。上市后观察到较少的副作用有：秃头症、大便习惯改变、关节痛

、衰弱、背痛、消化不良、呼吸困难、牙龈增生、男子女性型乳房、高血糖症、阳痿、尿频、白血球减少症、全身不适、情绪变化、口干、肌肉痉挛、肌痛、四周神经病变、胰腺炎、出汗增加、晕厥、血小板减少症、血管炎和视觉障碍。在多数情况下，上述改变与本品的因果关系尚未确定。过敏反应罕见，包括瘙痒症、皮疹、血管源性水肿和多型红斑。曾有极罕见的肝炎、黄疸、肝酶升高的报道(通常与胆汁淤积相一致)。某些因病情较重而住院的病例据报道与使用氨氯地平相关。在许多情况下，其因果关系不能确定。与其他的钙拮抗剂相似，以下的不良事件也有少数报道，但事件难以与基础疾病的自然病程相区分，如：心肌梗塞、心律失常(包括室性心动过速和房颤)以及胸痛。相互作用本品与下列药物的合用是安全的：噻嗪类利尿剂、
- 肾上腺素能受体阻滞剂、血管紧张素转换酶抑制剂、长效硝酸酯类药物、舌下含服硝酸甘油、非甾体类抗炎药、抗生素和口服降糖药。对健康志愿者的研究显示本品与地高辛合用不改变血清地高辛浓度和地高辛的肾清除率，与西咪替丁合用不改变本品的药代动力学。用人血浆进行的体外研究数据显示本品不影响地高辛、苯妥英钠、华法林或吲哚美辛的血浆蛋白结合率。在男性健康志愿者研究中，本品与华法林合用没有显著改变华法林对于凝血酶原时间的影响。药物动力学研究表明本品未显著改变环孢素的药代动力学。用法用量成人，口服，2.5mg ~ 5mg/次，1次/日。根据临床疗效可增至10mg。与噻嗪类利尿药、
阻滞药和血管紧张素转换酶抑制药合用时一般不需调整剂量。#093.现有的资料提示，严重过量能导致外周血管过度扩张，继而出现显著而持久的全身性低血压。对本品的

过量，可采取洗胃，引起明显低血压时，要求积极的心血管支持治疗，包括心、肺功能监护、抬高肢体、注重循环量和尿量。为恢复血管张力和血压，在无禁忌症时亦可采用血管收缩剂。静脉注射葡萄糖酸钙对逆转钙拮抗剂的效应也是有益的。由于本品与血浆蛋白结合率高，所以透析治疗是无益的。注重事项妊娠、哺乳期妇女、肝功能不全者慎用。对二氢吡啶类钙拮抗剂过敏的病人禁用。

1. 警告：尤其是对那些有严重的冠状动脉阻塞性疾病的患者，在开始使用钙拮抗剂治疗或增加剂量时，罕有发生心绞痛频率增加、时间延长和/或程度加重或发生急性心肌梗塞。这些作用机制目前尚不清楚。
2. 本品引起的血管扩张是逐渐发生的，服用本品后发生急性低血压的情况罕有报道。然而在严重的主动脉狭窄患者，当与其它四周血管扩张剂合用时，应引起注重。
3. 充血性心衰患者的使用：总的来说，充血性心衰患者使用钙拮抗剂应谨慎。但在安慰剂对照的PRAISE研究中，同时接受地高辛、利尿剂和ACEI治疗的心功能不全病人(NYHA III-IV级)，联合本品治疗，随访平均14个月，未观察到对患者的生存率或发病率(指致死性心率失常、急性心肌梗塞及由于心衰加重而住院的发生率)有负面的影响。在697名NYHA II-III级心功能不全患者，8-12周的安慰剂对照临床研究中，通过测量运动耐量、左室射血分数和临床症状等指标显示本品不会使患者的心衰症状加重。
4. 肝功能受损病人的使用：与其他所有钙拮抗剂相同，本品的半衰期在肝功能受损时延长，但尚未确定相应的推荐剂量，因此，在这种情况下使用本品应谨慎。
5. 肾功能衰竭病人的使用：本品仅10%的药物以原形由尿液排泄。本品血药浓度的改变与肾功能损害程度无相关性。因

此，对这些患者可以采用正常剂量。本品不能被透析。#093. 本品用于妊娠期或哺乳期的安全性尚未确定。动物试验中，在推荐人用最大量的50倍剂量，本品除引起大鼠分娩延迟和滞产外，未显示任何生殖毒性。因此，仅在无其他更安全的代替药物和疾病本身对母子的危险性更大时才推荐使用本品。#093.尚无本品用于儿童的资料。#093.本品血药浓度的达峰时间在老年和年轻患者中是相似的，老年患者曲线下面积（AUC）增加和消除半衰期的延长使消除率有下降趋势。有报导在接受相似剂量的氨氯地平时，老年患者具有与年轻患者相同的良好耐受性。因此，老年患可用正常剂量。但开始宜用较小剂量，再渐增量为妥。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