

氟伐他汀 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__E6_B0_9F_E4_BC_90_E4_BB_96_E6_c22_312345.htm 药品名称氟伐他汀 药物别名来适可 英文名称fluvastatin 类别调节血脂药及抗动脉粥样硬化药制剂40mg/粒 药理及应用是一种全合成的亲水性降胆固醇药物，是HMG-CoA还原酶的竞争性抑制剂，可将HMG-CoA转化为3-甲基-3，5-二羟戊酸（一种包括胆固醇的固醇类前体）。主要作用部位在肝。它是两种同异构体的消旋体，其中一种异构体呈药理学活性。胆固醇合成的减少可降低肝细胞内胆固醇量，该过程可刺激低密度脂蛋白（LDL）受体的合成，并由此提高LDL微粒的摄取，最终使血浆胆固醇浓度降低。药动学口服后吸收迅速而完全(98%)，进食则吸收减慢。肝脏是氟伐他汀的主要作用部位，也是其代谢的主要器官。从体循环血测得的绝对生物利用度为24%，表现分布容积为330L，血浆蛋白结合率为98%以上，该结合不受药物浓度的影响。循环血液中的主要成分为氟伐他汀，以及无药理活性的N-去异丙基-丙酸代谢物。经羟化的代谢产物有药理活性，但并不呈全身作用。给予本药3hr后，尿中的放射活性约为6%，粪中为93%，氟伐他汀在总排出放射活性的2%以下，血浆清除率为 1.8 ± 0.8 L/分。给予本药40mg/天后，稳态血药浓度未显示蓄积证据。终末消除半衰期为 2.3 ± 0.9 hr。在晚餐时或晚餐后4hr服药者，两者的药-时曲线下面积无明显差别。在一般人群中，氟伐他汀的血浓度并不受年龄或性别的影响。本药主要经胆道清除，并经循环前代谢，故肝功能不全的病人可能会产生蓄积。本药为HMG-CoA还原酶的竞争性抑制剂，是一种全合成的降胆固醇药物

。HMG-CoA还原酶可将HMG-CoA转化为3-甲基-3、5二羟戊酸(一种包括胆固醇在内的固醇类前体)。本药主要作用于肝脏，是2种同异构体的消旋体，其中一种具有药理活性，可抑制胆固醇的生物合成，降低肝细胞内胆固醇含量，从而刺激低密度脂蛋白(LDL)受体的合成，并由此增加对LDL微粒的摄取，最终使血浆胆固醇浓度降低。高胆固醇血症病人服用本药能明显降低总胆固醇、低密度脂蛋白胆固醇和载脂蛋白B的水平，同时提高高密度脂蛋白胆固醇及中等度地降低甘油三酯的水平。适应症饮食不能完全控制的高脂血症。不良反应稍微而短暂的消化不良，恶心，腹痛，失眠，头痛，肝功能异常。相互作用服用胆酸多价螯合剂(考来烯胺)4 hr后，本药表现出明显的相加作用。本药应于服用离子交换树脂(如考来烯胺)后至少4 hr进食，以免与离子交换剂结合而相互作用。慎与免疫抑制剂(包括环孢素)、吉非贝齐、烟酸和红霉素合用。本药不影响安替比林的代谢和排泄。利福平治疗者，本药的生物利用度降低约50%。用法用量20 - 40 mg/日，傍晚或睡前顿服。当血脂浓度很高时，剂量可增加到40 mg/次，每日2次。轻或中度肾功能损害者不必调整剂量。注重事项对本药及其赋形剂过敏者，活动性肝炎或无法解释的血清转氨酶持续升高者禁用。治疗前应作肝功能检查，用药后定期复查。若谷草转氨酶或谷丙转氨酶持续超过正常上限3倍者，应中止治疗。有肝病及过量饮酒史者需慎用。对伴有无法解释的弥漫性肌痛，肌触痛，肌无力以及肌酸磷酸激酶明显升高(超过正常上限10倍)的病人，应考虑肌病的可能性，病人被诊断或怀疑为肌病时，应停止治疗。对易造成继发于横纹肌溶解的肾功能衰竭的急性或严重情况的病人，必须暂停治疗。严

重肾功能不全病人(肌酐 ≥ 30 mL/分)不推荐应用本药。对妊娠和哺乳的影响 给予孕妇可能对胎儿造成损害。故孕妇、无可靠避孕措施的育龄妇女、哺乳妇女禁用。若病人在用药期间怀孕，则应中止治疗。对儿童的影响 尚无用于18岁以下患者的经验，故不推荐用于此类病人。 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