

重酒石酸卡巴拉汀 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/313/2021_2022__E9_87_8D_E9_85_92_E7_9F_B3_E9_c22_313769.htm 药品名称重酒石酸卡巴拉汀 药物别名艾斯能、利凡斯的明 英文名称rivastigmine 类别用于治疗老年性痴呆的药物制剂硬胶囊由重酒石酸卡巴拉汀1.5、3.0、4.5、6.0mg组成。非活性成分 3.0、6.0mg胶囊：由明胶；氧化铁，红色(E172)；氧化铁，黄色(E172)；硬脂酸镁；羟丙基纤维素；微晶纤维素；氧化铁，红色(E172)印字墨水；无水硅胶；二氧化钛(E171)等组成。1.5mg胶囊：由明胶；氧化铁，黄色(E172)；硬脂酸镁；羟丙基纤维素；微晶纤维素；氧化铁，红色(E172)印字墨水；无水硅胶；二氧化钛(E171)组成。4.5mg胶囊：由明胶；氧化铁，红色(E172)；氧化铁，黄色(E172)；硬脂酸镁；羟丙基纤维素；微晶纤维素；二氧化钛(E171)印字墨水；无水硅胶；二氧化钛(E171)组成。分子式成分化学结构为(S)-N-乙基-N-甲基-3-[1-(二甲氨基)乙基]-氨基甲酸苯酯-(2R,3R)-酒石酸氢盐] 药理毒理阿尔茨海默病的病理改变主要累及从前脑基底部发出至大脑皮质和海马的胆碱能神经通路。已知这些通路与注重力、学习能力、记忆力及其它认知过程有关。重酒石酸卡巴拉汀，是一种氨基甲酸类脑选择性乙酰胆碱酯酶抑制剂，通过延缓功能完整的胆碱能神经元对释放乙酰胆碱的降解而促进胆碱能神经传导。动物实验结果表明，重酒石酸卡巴拉汀能选择性增强脑皮质和海马等部位乙酰胆碱的效应。所以，艾斯能可以改善阿尔茨海默病患者胆碱能介导的认知功能障碍。另外，胆碱酯酶抑制剂可以减慢淀粉样蛋白b-

淀粉样前体蛋白(APP)片段的形成。淀粉样斑块是阿尔茨海默病的重酒石酸卡巴拉汀通过与靶酶结合成共价复合物而使后者暂时丧失活性。人体服用3mg后约1.5小时内，脑脊液(CSF)乙酰胆碱酯酶活性下降近40%。药物达到最大抑制作用后，该酶活性恢复至基础水平约需9小时。阿尔茨海默病患者CSF中重酒石酸卡巴拉汀对乙酰胆碱酯酶的抑制作用呈剂量依赖性，最高试验剂量为6mg，每日2次。临床研究艾斯能与安慰剂对照试验治疗阿尔茨海默病的疗效已被验证。经过两项为期26周服用艾斯能1~4mg/日和6-12mg/日与安慰剂对照比较及综合分析 期临床试验资料后得到的结果证实，艾斯能可以明显改善患者的主要认知功能、全脑功能状况、日常生活能力、以及病情严重程度。由低至高的剂用于这些研究的要害性结果测试方法如下所示：阿尔茨海默病评分(ADAS-Cog)：对阿尔茨海默病患者认知范围如注重力、学习能力、记忆力及语言能力等进行测试的基本系统。医生查房对症状变化的评定(CIBIC-Plus)：通过医生与患者和护理人员的交谈，对患者的认知、行为和功能活动能力范围的整体变化进行评定。进行性病情恶化评分(PDS)：指定护理人员对患者日常生活能力如上厕所、盥洗、吃饭、帮助操持家务和购物等进行评价。研究表明，药物一般在第12周起效并维持至6个月治疗结束。服用6至12mg治疗的患者感到认知能力、日常生活能力和全脑功能状况均有改善。而服用安慰剂的患者病情则进一步恶化。服药达6个月后采用上述测试方法（如根据ADAS-Cog评分后发现，艾斯能治疗至第26周时与安慰剂有5分差异）评价艾斯能的疗效，结果表明患者病情恶化率降低。根据ADAS-Cog和CIBIC-Plus有关子项目和症状的检查分

别对艾斯能治疗后病情改善情况进行评定和分析。结果表明，服用艾斯能 6-12mg 达 26 周后其 ADAS-Cog 有关子项目（如：思维能力、定向力、测试练习、词汇回忆、语言能力和识字能力等）都明显得到改善。

药动学吸收：重酒石酸卡巴拉汀完全迅速吸收。约 1 小时达到血浆峰浓度。因其与靶酶相互作用，所以药物增加的生物利用度超过其增加剂量预计值约 1.5 倍。服用 3mg 的绝对生物利用度约 36%。重酒石酸卡巴拉汀与食物同服可使其吸收 T_{max} 延长 90 分钟，使其 C_{max} 降低、AUC 增加近 30%。

分布：重酒石酸卡巴拉汀与血浆蛋白结合力较弱（约 40%）。它轻易通过血脑屏障，体表分布容积为 1.8-2.7L/kg。

代谢：重酒石酸卡巴拉汀主要通过胆碱酯酶介导的水解作用而迅速、广泛地代谢（血浆半衰期约 1 小时）。体外实验结果表明，这种代谢物仅有微弱的胆碱酯酶抑制作用 (gt.90%)，仅有 #091. 用药过量 #091. 妊娠期和哺乳期用药]. 妊娠期：动物实验表明，重酒石酸卡巴拉汀无致畸作用。妊娠时服用艾斯能的安全性迄今未明。该药仅在对胎儿的益处超过危害时才能应用于妊娠妇女。

哺乳期：艾斯能能否从人体乳汁中分泌目前尚不清楚。服用艾斯能的患者应停止哺乳喂养。

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