

缓释格列吡嗪 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文
https://www.100test.com/kao_ti2020/314/2021_2022__E7_BC_93_E9_87_8A_E6_A0_BC_E5_c22_314266.htm 药品名称缓释格列吡嗪 药物别名瑞易宁、唐贝克 Tonbac 英文名称Glipizide 类别胰岛素及其他影响血糖的药物制剂5MG/片。防湿存于室温下(15-30 °C)。胶囊：10mg/粒。分子式成分格列吡嗪的化学名称为1-环己基-3-(对-(2-(5-甲基吡嗪羰酰胺)乙基)磺酰基)脲。其分子式为C₂₁H₂₇N₅O₄S；分子量为445.55。是一种白色、无味的粉末，pH为5.9，不溶于水和乙醇，但可溶于二甲基甲酰胺。除活性成分外，本药还含有聚乙烯二醇氧化物、羟丙基甲基纤维素、硬脂酸镁、氯化钠、红氧化铁、醋酸纤维素、聚乙烯二醇、不透明干白粉(YS-2-7063)和黑墨(S-1-8106)。本药外观与传统的片剂相似，然而，它是由具有渗透活性的药物核心及包裹其外的半透膜组成。核心本身分为两层：一是含有药物的“活性”层；另一是含有药理学惰性(但具有渗透活性)成分的“挤压”层。包裹片剂的膜对水具有渗透性，但对药物或渗透赋形剂不具渗透性，当来自胃肠道的水进入片剂后，渗透层的压力增加，挤压药层，通过片剂药物那一侧膜上的一种小激光钻孔，释放药物。其释放速率，不受pH或胃肠运动的支配。瑞易宁的功能依靠存在于双层核心成分与胃肠道液体之间的渗透梯度。只要渗透压梯度保持恒定，药物释放基本上是恒定的，然后逐渐降低至零。该片剂的生物惰性成分在胃肠道转运期间保持完整，并以不溶性外壳的渣滓形式排出。药理毒理本品为第二代磺酰脲类口服降血糖药。即能促进胰脏β-细胞分泌胰岛素，又能增强胰岛素对靶组织的作用。药动学口服后的头2-3 hr血浆

药物浓度逐渐增加，服药后6-12 hr内达到最大浓度。随着天天服用，有效的血浆格列吡嗪浓度维持在给药后24 hr期间内，比天天3次给予速释格列吡嗪所观察到的峰-谷波动小。服用20 mg瑞易宁后，平均相对生物利用度在稳态时为90%。服用本药后至少第5天，可获得稳态的血浆浓度。老年(greater than or equal to 65岁)患者需要比年轻患者延长大约1-2天时间才达到稳态。长期服用期间未观察到药物累积。服用瑞易宁至药物吸收后2-3 hr，食物对其无影响。食用高脂早餐前马上服用瑞易宁，会引致格列吡嗪平均最大血峰浓度(C_{max})显著增加40%，但对曲线下面积(AUC)的影响无显著性，餐后和空腹状态血糖反应无变化。长期服用可显著降低其胃肠滞留，致血浆浓度降低，格列吡嗪的药代动力学在5-60 mg的剂量范围呈线性关系，因为血浆药物浓度与剂量成比例增加。格列吡嗪主要通过肝脏生物转化而消除，少于10%的剂量以未变化的药物形式经尿和粪便排泄：大约90%的剂量以生物转化产物经尿(80%)和粪便(10%)排泄。格列吡嗪的主要代谢物为芳香羟基化反应产物，无降糖活性。次要代谢物占少于2%的剂量，是一种乙酰胺乙苯衍生物，它具有母体化合物1/10-1/3的降糖活性。格列吡嗪98%-99%与血清蛋白结合，主要是白蛋白 适应症单凭饮食控制疗效不满足的轻、中度非胰岛素依靠型糖尿病，但病人胰岛B细胞须有一定的分泌胰岛素的功能且无严重的并发症。不良反应较常见为胃肠道症状（如恶心、腹胀）及头痛。减少剂量即可缓解。个别患者出现皮疹。老年体弱患者、活动过度者、不规则进食或饮酒患者及肝肾功能损害的患者，使用本品偶而可出现低血糖症。偶见可逆性的粒细胞减少。相互作用本药与双香豆素类、单胺氧化酶

抑制剂、保泰松、磺胺类药、氯霉素、环磷酰胺、丙磺舒、水杨酸类药合用可增加本药其降血糖作用；与肾上腺素、皮质激素、口服避孕药、噻嗪类利尿剂合并使用，与 β -阻断药并用时应谨慎。说明应完整吞服瑞易宁，不应咀嚼、掰开或压碎片剂。不必担心粪便中出现的片剂样东西。瑞易宁包裹于不可吸收的外壳内，这种设计的目的是为了缓慢释放药物，以便人体吸收。完成这一过程后，空片将从体内排出。用法用量口服，开始5mg/次，1次/日，多数人5-10mg/日即可控制血糖。最大量20mg/日。注重事项已知对本药过敏者，糖尿病酮症酸中毒者禁用。引起严重持久低血糖的危险性小。妊娠D类。急性卟啉症病人、孕妇及乳母不宜用。胰岛素依靠型糖尿病、非胰岛素依靠型糖尿病伴酮症酸中毒、昏迷、感染等应激情况及肝、肾功能不全者等禁用。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