

第二十一章 第三节 常用钙拮抗药药师资格考试 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/565/2021_2022__E7_AC_AC_E4_BA_8C_E5_8D_81_E4_c23_565243.htm 维拉帕米 维拉帕米

(verapamil) 又名异搏定 (isoptin) 。 「药理作用」维拉帕米在离体实验能降低窦房结起搏细胞自律性，减慢窦性频率，但在整体实验中，此作用被反射性的交感神经兴奋所部分抵消，人体用药后窦性频率减慢约10%，对房室结的传导性也能抑制，主要对房室结的上部、中部有作用，对下部作用较差。过大剂量可使窦房结、房室结电活动消失。口服120mg使心电图P-R间期延长。以上作用使维拉帕米成为治疗阵发性室上性心动过速的首选药物。维拉帕米能舒张冠状血管及外周血管，增加缺血心肌冠脉流量，增加侧枝循环流量，也降低外周阻力，降低血压。「不良反应」约10%患者出现不良反应，有1%患者需停用药物。口服易致胃肠道症状，静脉注射可致血压下降，偶见房室传导阻滞及心收缩性下降，故禁用于严重心衰及中、重度房室传导阻滞。同类药物有加洛帕米 (gallopamil) 即D600，有较强的心抑制作用，应用价值同维拉帕米。地尔硫 地尔硫 (diltiazem) 「药理作用」地尔硫对心的电生理作用和维拉帕米相似。能明显抑制窦房结自律性而减慢心率。也减慢房室结传导性，适于治疗阵发性室上性心动过速。它对血管的作用接近硝苯地平，能增加冠脉流量。对心肌还有非竞争性拮抗 β -受体的作用，可防治心绞痛。雷诺病及偏头痛等。「不良反应」较少，约2%~5%患者可能出现，注射给药可引起房室传导阻滞及低血压。其他副作用有皮疹、头痛、面部潮红等。硝苯地平 硝苯地平

(nifedipine) ，又名心痛定。「药理作用」硝苯地平的作用与维拉帕米不同，它对窦房结房室结及心收缩性的抑制作用较弱，对血管的舒张作用明显。给药量略大反能加速房室传导，是交感神经活性反射性增高之故。与此同理，在整体中它对心肌也不降低收缩性，因此可与 β -受体阻断药合用。硝苯地平舒张冠脉特别是已痉挛收缩的狭窄冠脉，故能增加缺血区流量，可治心绞痛。也能舒张外周小动脉，降低血压，可治高血压，硝苯地平还降低肺血管阻力及肺动脉压，可治肺动脉高压症。「不良反应」发生率达20%，一般较轻，主要是低血压。长期用药约有5%患者出现头痛。少数患者偶见心肌缺血症状加重，可能是严重冠脉阻塞、心率加快、血压过低所致。硝苯地平在化学结构上属二氢吡啶类，这类钙拮抗药发展较快，在作用和药代动力学方面都有所改进，主要有以下几种：尼卡地平 (nifedipine) 舒张血管较硝苯地平强，对脑血管有一定选择作用。尼索地平 (nisoldipine) 舒张血管作用更强，对冠状血管选择性较强，治疗心绞痛及高血压良效。尼莫地平 (nimodipine) 对脑血管有选择作用而降压作用较弱，用于治疗脑血管痉挛收缩及脑供血不足等疾病，也可防治偏头痛。尼群地平 (nitrendipine) 血管舒张作用强大，用于治疗高血压。非洛地平 (felodipine) 对冠状血管及外周血管作用明显，持效较久，用于治疗心绞痛及高血压。伊拉地平 (isradipine) 对冠脉、脑及外周血管作用较强较久，用于治疗高血压及稳定型心绞痛。氨氯地平 (amlodipine) 舒张冠脉及外周血管，用于治疗中、轻度高血压作用缓慢持久，降低血压10%~18%，无反射性心动过速。治疗稳定型心绞痛效果明显。它的消除 $t_{1/2}$ 较久，达35~45小时，日服一次即

可。拉西地平（lacidipine）也为长效药物，日服一次，因它有良好的对细胞膜的亲和力及穿透性。作用逐渐开始，不引发心悸及头痛，也不致反射性增高交感神经活性。有抗动脉粥样硬化的作用，还能减少自由基的形成。适于治疗高血压及冠心病心绞痛。除上述三类药物外，还有其他钙拮抗药：苜蓿地尔（bepridil），作用似维拉帕米，能降低窦房结自律性和房室结传导性。还能阻滞钠通道而降低快反应细胞的自律性和传导性，也阻滞钾通道而延长不应期。临床用于治疗室上性及室性心动过速。对冠脉的舒张作用较维拉帕米为弱，但仍可用于治疗心绞痛。严重的不良反应是致心律失常作用，引起尖端扭转型室性心动过速，值得注意。氟桂嗪（flunarizine）对脑血管有选择性舒张作用，解除其痉挛，能防止缺血缺氧后神经细胞内Ca²⁺积储所致的细胞损害。还能促进红细胞的变形能力，改善微循环，保护大脑功能。氟桂嗪主要用于治疗脑血管功能障碍，如脑血管性痴呆及脑供血障碍，能增加智力，改善记忆。也用于治疗偏头痛或各种眩晕。不良反应较少，偶见嗜眠、皮疹。哌克昔林（perhexiline）的钙拮抗作用较弱，其舒张冠脉、抑制心肌收缩性等作用也弱。主要用于治疗稳定型心绞痛。不良反应有眩晕、无力，偶见周围神经炎。普尼拉明（prenylamine），又名心可定（segontin），有非特异性钙拮抗作用，可治疗心绞痛及室性早搏、室性心动过速等。不良反应有食欲不振、乏力、皮疹等。

制剂及用法 维拉帕米（verapamil）口服40~80mg/次，3次/日。维持量为40mg/次，3次/日。静脉注射5~10mg/次，隔15分钟可重复1-2次，若无效即停用。硝苯地平（nifedipine）口服或舌下含化10~20mg/次，3次/日。地尔硫（diltiazem

) 口服30 ~ 60mg/次，3次/日。氟桂嗪 (flunarizine) 口服10mg/日，晚上顿服。开始时早、晚各一次。普尼拉明 (prenylamine) 口服15 ~ 30mg/次，3次/日。哌克昔林 (perhexiline) 口服100mg/次，2次/日，可递增至300 ~ 400mg/日。苜普地尔 (bepridil) 口服100mg/次，3次/日。尼卡地平 (nifedipine) 口服10 ~ 20mg/次，3次/日。尼莫地平 (nimodipine) 静滴治脑血管痉挛，开始1mg/小时，2小时后2mg/小时。尼群地平 (nitrendipine) 口服开始10mg/日，可递增至30mg/日。更多信息请访问：执业药师网校 百考试题论坛 百考试题在线考试系统 百考试题执业药师加入收藏 特别推荐：2009年药师资格考试报名时间汇总"#F8F8F8" 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