

核准日期: 2006 年 10 月 12 日
修改日期: 2009 年 11 月 13 日
2015 年 12 月 01 日



苯磺酸氨氯地平片说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

【药品名称】

通用名称: 苯磺酸氨氯地平片

商品名称: 安内真

英文名称: Amlodipine Besylate Tablets

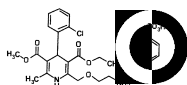
汉语拼音: Benhuangsuan Anluidiping Pian

【成份】

活性成份: 苯磺酸氨氯地平

化学名称: 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-吡啶二羧酸盐苯磺酸盐。

化学结构式:



東瑞製藥
DAWN RAYS

分子式: $C_{20}H_{25}ClN_2O_5 \cdot C_6H_5O_3S$

分子量: 567.06

【性状】

本品为白色或类白色片。

【适应症】

1. 高血压病。可单独使用本品治疗也可与其它抗高血压药物合用。

2. 慢性稳定性心绞痛及变异型心绞痛。可单独使用本品治疗也可与其它抗心绞痛药物合用。

【规格】

按 $C_{20}H_{25}ClN_2O_5$ 计 (1)2.5mg (2)5mg

(3)10mg

【用法用量】

1. 治疗高血压的初始剂量为 5mg, 每日一次, 最大剂量为 10mg, 每日一次。虚弱或老年患者、伴有肝功能不全患者初始剂量为 2.5mg, 每日一次, 此剂量也可作为原使用其它抗高血压药物治疗需加用本品治疗的剂量。剂量调整应根据患者个体反应进行。一般的剂量调整应在 7~14 天后开始进行。如临床需要, 在对患者进行严密观测后, 可更快地开始剂量调整。

2. 治疗心绞痛的初始剂量为 5~10mg, 每日一次, 老年及肝功能不全的患者建议使用较低剂量治疗。大多数人的有效剂量为 10mg/日。

【不良反应】

氨氯地平具有较好的耐受性。在安慰剂对照的治疗高血压或心绞痛的临床试验中, 最常见的不良事件是:

- 自主神经系统: 潮红
- 全身: 疲劳
- 心血管, 一般性: 水肿
- 中枢和外周神经系统: 眩晕, 头痛

- 胃肠道: 腹痛, 恶心
- 心率/心律: 心悸
- 心理性: 嗜睡

在这些临床试验中未发现与本品相关的显著的临床实验室检查异常。

上市后观察到的较少见不良事件有:

- 自主神经系统: 口干, 出汗增加
- 全身: 虚弱无力, 背痛, 全身不适, 疼痛, 体重增加/减少
- 心血管, 一般性: 低血压, 晕厥
- 中枢和外周神经系统: 肌张力高, 感觉减退/感觉异常, 周围神经病变, 震颤
- 内分泌: 乳腺增生
- 胃肠道: 排便习惯改变, 消化不良 (包括胃炎), 牙龈增生, 胰腺炎, 呕吐
- 代谢性/营养性: 高血糖
- 肌肉骨骼: 关节痛, 肌肉痉挛性疼痛, 肌痛
- 血小板/出血/凝血: 紫癜, 血小板减少性紫癜
- 心理性: 阳痿, 失眠, 态度改变
- 呼吸系统: 咳嗽, 呼吸困难
- 皮肤/附件: 脱发, 皮肤变色
- 特殊感觉: 味觉错乱, 耳鸣
- 泌尿系统: 尿频
- 血管 (心外的): 血管炎
- 视觉: 视力障碍
- 白细胞/网状内皮系统: 白细胞减少
- 过敏反应罕见, 包括痒疹症、皮疹、血管源性水肿和多形红斑。
- 曾有极罕见的肝炎、黄疸、转氨酶升高的报道 (通常伴随胆汁淤积相一致)。有报告一些严重的需住院治疗的病例与使用氨氯地平有关。但在多数情况下, 因果关系尚未确定。
- 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: 心肌梗死、心律失常 (包括心动过缓、室性心动过速和房颤) 和胸痛。

【禁忌】

对二氢吡啶类药物或本品中任何成分过敏的病人禁用。

【注意事项】

1. 警告: 极少数患者特别是伴有严重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, 出现心绞痛频率增加、时间延长和/或程度加重, 或发生急性心肌梗塞, 其作用机制目前尚不清楚。

2. 因本品的扩血管作用是逐渐产生的, 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, 当与其它外周血管扩张剂合用时, 应引起注意。

3. 心衰患者的使用: 充血性心衰患者使用钙拮抗剂应谨慎。在对非缺血引起心衰的病人 (NYHA III-IV 级) 进行的长期、安慰剂对照研究 (PRAISE-2) 中, 虽然心衰加重发生率与安慰剂相比无明显差异, 但与氨氯地平有关的肺水肿报道有增加。

4. 肝功能受损患者的使用: 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, 使用本品应谨慎。

5. 肾功能衰竭患者的使用: 氨氯地平的血药浓度改变与肾功能损害程度无相关性。因此, 可以采用正常剂量。本品不能被透析清除。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

对孕妇用药缺乏相应的研究资料。但动物试验结果显示 10mg/kg 本品可引起大鼠窝仔数减少、死产增加、分娩延迟和滞产, 故本品只在非常必要时方可用于孕妇。尚不知本品能否通过乳汁分泌, 服药的哺乳期妇女应中止哺乳。

【儿童用药】

尚无本品用于儿童的资料。

【老年用药】

本品血药浓度的达峰时间在老年和年轻患者中是相似的, 老年患者药-时曲线下面积 (AUC) 增加和消除半衰期的延长使清除率有下降趋势。有报导在接受相似剂量的氨氯平时, 老年患者具有与年轻患者相同的良好耐受性。因此, 老年患者可用正常剂量。但开始宜用较小剂量, 再渐增量为妥。

【药物相互作用】

本品与下列药物的合用是安全的: 噻嗪类利尿剂、 α -肾上腺素能受体阻滞剂、 β -肾上腺素能受体阻滞剂、血管紧张素转换酶抑制剂、长效硝酸盐类药物、舌下含服硝酸甘油、非甾体类抗炎药、抗生素和口服降糖药。

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、华法林或咪唑美辛的血浆蛋白结合率。

其他药物对氨氯地平的作用:

西咪替丁: 与西咪替丁合用不改变氨氯地平的药代动力学。

柚子汁: 20 名健康志愿者同时服用 24ml 柚子汁和 10mg 氨氯地平, 未见对氨氯地平的药代动力学有明显影响。

铝/镁 (抗酸剂): 同时服用铝/镁抗酸剂和单剂量氨氯地平, 未见对氨氯地平的药代动力学有明显影响。

西地那非 (万艾可) (SILDENAFIL): 单剂量 100mg 西地那非不影响原发性高血压病人氨氯地平的药代动力学。二药合用, 每种药品独立地发挥其降压效应。

氨氯地平对其他药物的作用:

阿托伐他汀 (ATORVASTATIN): 同时服用 10mg 氨氯地平 和 80mg 阿托伐他汀, 阿托伐他汀的稳态药代动力学参数无明显改变。

地高辛: 合用氨氯地平 和地高辛, 正常志愿者血浆地高辛浓度或肾脏清除率无变化。

乙醇 (酒精): 10mg 氨氯地平单次或多次给药, 对乙醇的药代动力学无影响。

华法林: 氨氯地平与华法林合用不改变华法林的凝血酶原反应时间。

环孢菌素: 药代动力学研究表明氨氯地平不明显改变环孢菌素的药代动力学。

药物/实验室试验相互作用: 未知。

【药物过量】

现有资料提示, 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。

使用本品过量可洗胃。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、注意循环血量和尿量。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。

【药理毒理】

氨氯地平为钙通道阻滞剂 (亦即慢通道阻滞剂或钙离子拮抗剂), 阻滞钙离子跨膜进入心肌和血管平滑肌细胞。

氨氯地平抗高血压作用的机制是直接松弛血管平滑肌。缓解心绞痛的确切机制还未完全肯定, 但它可以通过扩张外周小动脉和冠状动脉, 减少总外周血管阻力, 解除冠状动脉痉挛, 降低心脏的后负荷, 减少心脏能量消耗和对氧的需求, 从而缓解心绞痛。

【药代动力学】

氨氯地平口服吸收良好, 且不受摄入食物的影响。给药后 6~12 小时血药浓度达至高峰, 绝对生物利用度约为 64~80%, 表观分布容积约为 21L/kg, 终末消除半衰期约为 35~50 小时, 每日一次, 连续给药 7~8 天后血药浓度达至稳态, 氨氯地平通过肝脏广泛代谢为无活性的代谢物, 以 10% 的原药和 60% 的代谢物由尿液排出, 血浆蛋白结合率约为 97.5%。

【贮藏】

遮光, 密封保存。

【包装】

铝塑板包装。7 片/板 $\times$ 1 板/盒; 7 片/板 $\times$ 2 板/盒; 7 片/板 $\times$ 4 板/盒; 7 片/板 $\times$ 8 板/盒 (2.5mg, 5mg); 7 片/板 $\times$ 14 板/盒 (2.5mg, 5mg)。

【有效期】

24 个月

【执行标准】

《中国药典》2015 年版二部

【批准文号】

国药准字 H20031087 (2.5mg)

国药准字 H20020390 (5mg)

国药准字 H20031088 (10mg)

【生产企业】

企业名称: 苏州东瑞制药有限公司

生产地址: 江苏省苏州吴中经济开发区民丰路 268 号

邮政编码: 215124

电话号码: 0512-65626868

传真号码: 0512-65626868

网 址: www.dawnrays.com