

核准日期 2007 年 1 月 29 日

修改日期

单硝酸异山梨酯缓释胶囊说明书

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：单硝酸异山梨酯缓释胶囊

商品名称：异乐定®

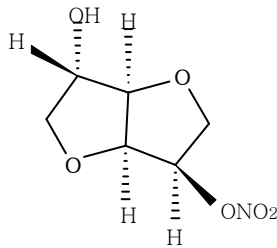
英文名称：Isosorbide Mononitrate Sustained-release Capsules

汉语拼音：Danxiaosuan Yishanlizhi Huanshijiaonang

【成份】

化学名称：1, 4: 3, 6-二脱水-D-山梨糖醇-5-硝酸酯

化学结构式：



分子式：C₆H₉NO₆

分子量：191.14

【性状】 本品为胶囊剂，内容物为白色至类白色小丸。

【适应症】

冠心病的长期治疗

心绞痛（包括心肌梗塞后）的长期治疗和预防

与洋地黄及/或利尿剂合用治疗慢性充血性心力衰竭。

【规格】 50mg

【用法用量】

除另有医嘱，否则每日一次，每次 1 粒（50mg），用适量温水整粒吞服（不可咀嚼）。对循环不稳定的患者，首次服药可能引起血管性虚脱症状，也可能产生硝酸盐性头痛。可在

开始治疗时服用非长效制剂-单硝酸异山梨酯（如艾复宁[®]20mg）早晚各半片以明显减少上述症状。

【不良反应】

使用本品最常见的不良反应为头痛（>10%患者），但随着时间的推移和持续应用会逐渐减退。

在首次用药或增加剂量时，常可见直立位低血压和/或轻度头痛。这些症状可能与头昏、嗜睡、反射性心动过速和乏力有关。

罕见（<1%患者）恶心、呕吐、潮红和皮肤过敏反应（如红斑），有时可能很严重。个别病例出现剥脱性皮炎。

有使用有机硝酸盐出现严重低血压的报道，包括恶心、呕吐、坐立不安、苍白、多汗。罕见虚脱现象（常伴有心动过缓和晕厥）。罕见严重低血压导致心绞痛症状加重现象。

有几例硝酸盐诱导的括约肌松弛引起的心口灼热的报道。

使用本品治疗期间因可使换气不良肺泡的血供增加（形成肺“旁路”）而导致一过性低氧血症。特别是在冠心病患者可导致心肌缺氧。

【禁忌】

对本品中任一成分过敏者

急性循环衰竭（休克，血管性虚脱）

心源性休克（除采用适当措施保证舒张末期压足够高外）

严重低血压（收缩压低于 90mmHg）

硝酸盐治疗期间，不能使用西地那非

急性心肌梗塞伴低充盈压（除非在有持续血液动力学监护条件下的监护病室使用）

【注意事项】

下列患者的用药需医生特别监护：

肥厚性阻塞性心肌病

缩窄性心包炎

急性心压塞

低充盈压，如急性心肌梗塞，左室功能损伤（左室衰竭）

主动脉和/或二尖瓣狭窄

伴有颅内压升高的疾病

体位性循环调节障碍

本品不适用于急性心绞痛发作。尽管本品的释放分两个阶段进行，如服药后 30%的有效成分迅速释放，但对于急性心绞痛发作并不能马上奏效。

有耐药性，且与其他硝基化合物有交叉耐药现象。

持续使用本品的患者应被告知不能使用含西地那非的产品。使用本品进行治疗不应因使用含西地那非的产品中断，因为那样容易增加心绞痛发作的危险。

本品可在一定程度上影响人的反应速度，例如驾驶及操作机械的能力受到影响，若同时饮用酒精，这种情况会更显著。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

妊娠初 3 个月的妇女禁用，哺乳期妇女应慎用本品。

【儿童用药】

本品在儿童的安全性、有效性尚未确立。

【老年用药】

无影响。

【药物相互作用】

同时服用具降血压作用的药物，如 β -受体阻滞剂、钙通道阻滞剂、血管扩张药和/或酒精，精神安定剂，三环类抗抑郁药可增强本品的降血压作用。

和治疗勃起功能障碍的西地那非合用会增加本品的降压作用，可能引起致命的心血管并发症，因此使用本品时不能使用西地那非。

有报道同时服用二氢麦角胺，本品可能会提高前者的血药浓度而增强其升压作用。

【药物过量】

大鼠和小鼠分别灌胃给予 1965 和 2581mg/kg 的单硝酸异山梨酯可见明显的死亡。

人类使用本品过量的临床症状有：血压 \leq 90mmHg，苍白，出汗，脉搏微弱，心动过速，直立时轻度头痛，头痛，虚弱，头昏，恶心，呕吐，腹泻，使用其他有机硝酸盐药物的患者有高铁血红蛋白血症的报道。单硝酸异山梨酯可生物转化释放亚硝基离子，可能引起高铁血红蛋白血症和发绀，呼吸急促，焦虑，意识丧失，心脏停搏。极高剂量可造成颅内压升高而出现脑部症状。

常规措施

终止药物的给予

硝酸盐引起的低血压的常用方法

患者应水平放置，头低位，脚抬起

给氧

增加血容量

针对休克的治疗（患者应严密监护）

特殊措施

如果血压很低，应升高血压，给予去甲肾上腺素或肾上腺素等拟交感神经药。

高铁血红蛋白血症的治疗

使用维生素 C、亚甲基蓝或甲苯胺蓝

给氧（如果必要）

人工通气

透析（如果必要）

复苏

如果出现呼吸和循环停止，请立即采用复苏术。

【药理毒理】

药理作用

单硝酸异山梨酯为硝酸异山梨酯的主要活性代谢产物。可通过扩张外周血管，特别是增加静脉血容量，减少回心血量，降低心脏前后负荷，从而减少心肌耗氧量；同时还可以通过促进心肌血流重新分布，改善缺血区血流供应，可能通过这两方面发挥抗心肌缺血作用。

毒性研究

大鼠和犬分别服用单硝酸异山梨酯 78 和 52 周，分别在 405 和 90mg/kg 水平下出现毒性反应。

【药代动力学】

本品中的小丸在服药后迅速释放 30%，其余 70% 以缓释方式释放。单硝酸异山梨酯口服吸收迅速且完全，服用本品 25mg，生物利用度为速释制剂的 80-90%。若与食物同时服用，吸收未受明显影响。表观分布容积大约为 50L，消除半衰期为 4-5 小时。单硝酸异山梨酯广泛代谢为 NO 和山梨醇，前者为活性成分，后者为无活性成分。微量的单硝酸异山梨酯和山梨醇经肾排泄。单次给予本品 25mg， C_{max} 为 216ng/ml， T_{max} 为 0.75h。健康志愿者和慢性稳定型心绞痛患者的药代特征相似。

【贮藏】 密封（10~30℃）保存

【包装】 铝塑包装，10 粒/盒，20 粒/盒。

【有效期】 60 个月。

【执行标准】 WS₁-(X-116)-2006Z

【批准文号】 国药准字 H20031224

【生产企业】

企业名称：珠海许瓦兹制药有限公司

地址：珠海前山镇长沙工业区 A 栋

邮政编码：519070

电话号码：0756-8629777

传真号码：0756-8629224

免费咨询热线：800 820 6339

网址：www.schwarzpharma.com