**卡托普利**

文章版本号：2

最后发布时间：2014-4-15 9:46:31

**【特别警示】**

本药直接作用于肾素-血管紧张素系统，可引起胎儿损伤和死亡。一旦发现妊娠，应尽快停药。(FDA药品说明书-卡托普利片)

**【药物名称】**

中文通用名称：卡托普利

英文通用名称：Captopril

其他名称：安汀、邦德美、甲巯丙脯酸、开博通、开富林、开托普利、凯宝压苧、刻甫定、巯甲丙脯酸、欣力佳、Acepril、Capoten、Captoprilum、Captoril、Lopirin、Lopril、Mercaptopril、Tensiomin、Tensobon。

**【药理分类】**

心血管系统用药>>降血压药>>肾素－血管紧张素系统抑制药>>血管紧张素转换酶抑制药

其它药物>>诊断用药>>器官功能检查用药

心血管系统用药>>抗心力衰竭药>>肾素－血管紧张素系统抑制药

**【临床应用】**

**CFDA说明书适应症**

1.用于高血压。

2.用于心力衰竭。

**其他临床应用参考**

1.用于急性心肌梗死和肺动脉高压。

2.用于治疗1型糖尿病和视网膜病变患者的糖尿病肾病。(FDA批准适应症)

3.用于心肌梗死后左心室功能不全。(FDA批准适应症)

4.用于卡托普利刺激试验。

5.用于肾脏成像以诊断肾血管性高血压。

6.用于延缓肾病进程。

7.用于降低伴有高血压的1型或2型糖尿病患者发生心血管事件的风险。

8.用于高血压危象。

9.用于诊断肾动脉狭窄。

10.用于诊断醛固酮增多症。

11.用于特发性水肿。

12.用于巴特氏综合征。

13.用于心肌梗死后综合征预防左室衰竭。

14.用于促进雷诺现象血液流通。

15.用于类风湿关节炎。

**【用法与用量】**

**成人**

◆常规剂量

·高血压

1.口服给药  (1)普通片(滴丸)：一次12.5mg，一日2-3次，按需要在1-2周内增至一次50mg，一日2-3次。疗效仍不满意时可加用其他降压药。(2)缓释片：起始剂量为一次37.5mg，一日1次，必要时可逐渐增至75-150mg。

2.静脉给药  常用剂量为一次25mg，于10%葡萄糖注射液20ml中溶解后，缓慢静脉注射10分钟，随后取本药50mg，于10%葡萄糖注射液500ml中溶解后，静脉滴注1小时。

·心力衰竭

1.口服给药  (1)普通片(滴丸)：起始剂量一次12.5mg，一日2-3次，必要时可逐渐增至一次50mg，一日2-3次，若需进一步加量，宜观察疗效2周后再考虑。对近期大量使用利尿药、处于低钠(或低血容量)状态而血压正常或偏低者，初始剂量宜为一次6.25mg，一日3次，以后再逐渐增至常用量。(2)缓释片：同“高血压”治疗。

2.静脉给药  常用剂量为一次25mg，于10%葡萄糖注射液20ml中溶解后，缓慢静脉注射10分钟，随后取本药50mg，于10%葡萄糖注射液500ml中溶解后，静脉滴注1小时。

·急性心肌梗死

1.口服给药  宜用于收缩压超过12kPa(90mmHg)的患者。先给予试验剂量6.25mg，2小时后收缩压仍超过12kPa，则再试给12.5mg，再隔2小时后仍如此，方可用一次12.5mg，一日3次的剂量。对梗死后心功能不全者用量可达一日150mg。

◆老年人剂量

宜酌情减少本药剂量。

**儿童**

◆常规剂量

·高血压、心力衰竭

1.口服给药  普通片，起始剂量为一次0.3mg/kg，一日3次，必要时每隔8-24小时增加0.3mg/kg，直至达到最低有效量。

**【国外用法用量参考】**

**成人**

◆常规剂量

·高血压

1.口服给药  一次25mg，一日2-3次。可在1-2周后增加至一次50mg，一日2-3次，必要时还可继续增加至一次100-150mg，一日2-3次。一日最大剂量为450mg。

·充血性心力衰竭

1.口服给药  通常和利尿药和洋地黄类药物合用。普通片，血压正常或偏低的患者初始剂量为一次6.25-12.5mg，一日3次。其他心力衰竭患者的初始剂量为一次25mg，一日3次。维持剂量为一日50-100mg，一日3次，一日最大剂量为450mg。

·1型糖尿病伴视网膜病变患者的糖尿病肾病

1.口服给药  一次25mg，一日3次。

·心肌梗死后左心功能不全

1.口服给药  首次剂量为一次6.25mg；第一次剂量调整后，一次12.5mg，一日3次，持续数日；第二次剂量调整后，一次25mg，一日3次，持续数日；若可耐受，可在随后数周增加至一次50mg，一日3次。目标剂量为一次50mg，一日3次。

·卡托普利刺激试验

1.口服给药  单次25-50mg(碾碎并溶于水)。

·肾脏成像，以诊断肾血管性高血压

1.口服给药  单次25-50mg。

**【给药说明】**

**给药方式说明**

口服给药  本药缓释片应整片吞服，不能咀嚼或掰开服用。

**【禁忌症】**

1.对本药过敏或有过敏史、或对其他血管紧张素转换酶(ACE)抑制药过敏者。

2.有使用其他ACE抑制药曾出现血管神经性水肿者(国外资料)。

3.有使用其他ACE抑制药出现肾衰竭者(国外资料)。

4.急性肾衰竭(尤其双侧或单侧肾动脉狭窄)患者。

5.活动性肝脏疾病患者。

6.高钾血症患者。

7.青光眼患者。

8.自身免疫疾病活动期患者。

9.妊娠期妇女。

**【慎用】**

1.自身免疫性疾病(如系统性红斑狼疮)患者(可致白细胞或粒细胞减少的机会增多)。

2.骨髓抑制患者。

3.脑动脉或冠状动脉供血不足患者(血压降低可致缺血加剧)。

4.主动脉瓣狭窄患者(用药后可能使冠状动脉灌注减少)。

5.有对光线敏感史者。

6.肾功能不全者(可致血钾升高、白细胞及粒细胞减少等)。

7.肝功能不全者(国外资料)。

8.低血压患者(国外资料)。

9.胶原血管疾病患者(国外资料)。

10.流出道受阻的肥厚性心肌病患者(国外资料)。

11.老年人。

**【特殊人群】**

**儿童**

儿童用药的有效性和安全性尚未建立。有报道，婴儿用药后可引起血压过度和持久的下降，并伴少尿与抽搐，故儿童不宜使用本药。

**老人**

老年人对降压作用较敏感，宜减量慎用。

**妊娠期妇女**

1.本药可通过胎盘。妊娠期妇女用药后可影响胎儿发育，甚至引起胎儿死亡，故妊娠期妇女禁用本药。

2.美国食品药品管理局(FDA)对本药的妊娠安全性分级为D级。

**哺乳期妇女**

本药可随乳汁排泄，其浓度约为母体血药浓度的1%，故哺乳期妇女用药须权衡利弊。

**特殊疾病状态**

肾功能不全者：宜采用小剂量给药或减少给药次数，缓慢递增。如须合用利尿药，建议使用呋塞米，不宜使用噻嗪类利尿药。如出现血尿素氮和肌酸酐升高，应减少本药剂量，同时应停用利尿药。

**【不良反应】**

1.心血管系统  较常见心悸和心动过速不良反应。此外还可引起低血压，血压下降与以前是否用利尿药治疗有关，也与患者血浆肾素及血管紧张素Ⅱ浓度有关。长期应用治疗心力衰竭时，停药后可出现血压反跳，甚至发生高血压危象。也有报道，偶可引起心绞痛甚至心肌梗死。

2.代谢/内分泌系统  可致血钾轻度升高(肾功能障碍者表现较明显)及血钠降低。也可引起发热、低血糖。个别患者可引起男子乳腺发育并伴有疼痛，停药后可消退。偶有引起微量元素缺乏的报道。

3.呼吸系统  较常见咳嗽。此外可引起肺炎、呼吸困难。

4.肌肉骨骼系统  可引起关节痛，偶有引起Kaposi's肉瘤的报道。

5.泌尿生殖系统  (1)较少见蛋白尿(尿蛋白每日大于1g)，常发生于治疗开始8个月内，其中1/4的患者呈肾病综合征，但蛋白尿在6个月内渐减少，一般不影响治疗。(2)血尿素氮和肌酸酐升高，常为暂时性，在患有肾病或长期严重高血压而血压迅速下降后易出现。(3)可发生血尿、肾小球肾炎、肾病综合征或急性肾衰竭。有报道可引起性功能障碍。

6.神经系统  较少见眩晕、头痛、昏厥不良反应。此外在个别患者可引起神经病变、共济失调。

7.精神  可引起抑郁、神经质、意识混乱等。

8.肝脏  偶有血清肝酶值升高。有胆红素升高的个案报道。此外，有胆汁淤积性黄疸的报道，停药后恢复，但极个别患者可发展为暴发性肝坏死。

9.胃肠道  可出现恶心、呕吐、畏食、上腹不适、腹痛、腹泻、便秘、舌溃疡、消化性溃疡、胰腺炎或食管炎。可引起味觉障碍，发生率与剂量及肾功能有关。

10.血液  (1)少见粒细胞减少、发热、寒战。(2)白细胞减少，与剂量相关，治疗开始后3-12周出现，以10-30日最显著，停药后可持续2周。(3)再生障碍性贫血或溶血性贫血。

11.皮肤  较多见皮疹及血管神经性水肿。

12.其他  较多见味觉迟钝。可引起视物模糊。另有报道应用本药治疗可引起抗核抗体滴度升高。

**【药物相互作用】**

**药物-药物相互作用**

1.氯丙嗪：

结果：合用呈相互协同作用，可导致低血压。

处理：两者联用时应谨慎。

2.利尿药：

结果：合用可增强降压作用，可能引起严重低血压，如与保钾利尿药(如螺内酯、氨苯蝶啶、阿米洛利)或含钾药、库存血合用可能引起血钾过高。

处理：原利尿药宜停用或减量，本药宜从小剂量开始用药。与保钾利尿药或含钾药、库存血合用时应监测血钾。

3.其他降压药：

结果：合用可增强降压作用，与引起肾素释放或影响交感活性的药物合用呈大于两者相加的作用，而与β-肾上腺素受体阻断药合用呈小于两者相加的作用。

4.丙磺舒：

结果：合用可抑制肾脏对本药的排泄。

5.其他扩血管药：

结果：合用可能致低血压。

处理：两者联用，宜从小剂量开始。

6.布比卡因：

结果：合用可引起严重心动过缓和低血压，甚至意识丧失。

机制：对肾素-血管紧张素系统的抑制。

7.锂剂：

结果：合用可引起血锂浓度升高，同时也可引起肾脏毒性，出现蛋白尿和血肌酸酐升高。

8.骨髓抑制药(如硫唑嘌呤)：

结果：合用可引起严重贫血。

9.环孢素：

结果：合用可使肾功能下降。

10.别嘌醇：

结果：合用可引起过敏反应。

11.麻黄：

结果：麻黄中的麻黄碱和伪麻黄碱可拮抗本药的降压作用，降低本药的疗效。

处理：接受本药治疗的高血压患者应避免使用含麻黄的制剂。

12.内源性前列腺素合成抑制药(如吲哚美辛)：

结果：合用可减弱本药的降压作用。

13.硫酸亚铁：

结果：合用可降低本药的生物利用度，降低未结合卡托普利的血药浓度，从而导致血压升高。

14.洋地黄毒苷、地高辛：

结果：合用尚未观察到明显的药效学和药动学参数的改变。但对肾功能损害的患者，地高辛血药浓度可能增高。

**药物-食物相互作用**

食物：

结果：进食时服药，可使本药吸收减少，生物利用度降低。

处理：宜在餐前1小时服药。

**【注意事项】**

**用药警示**

1.使用本药后可因血压降低而出现头晕、步态不稳等，故服药后禁止驾驶及高空作业。

2.合用利尿降压药、重度高血压、血液透析、严格饮食限制钠盐摄入的患者，初次服用本药可引起血压过低，故宜从小剂量开始用药，根据患者的疗效逐渐增加剂量。

**不良反应的处理方法**

1.血管神经性水肿：应立即停药，并进行对症治疗，如给予1:1000的肾上腺素0.3-0.5ml皮下注射。

2.蛋白尿逐渐增多：应暂停用药或减少用量。

3.白细胞计数降低：应暂停用药。

4.在手术或麻醉时出现低血压：可扩容纠正。

5.出现顽固性干咳时：应停药观察。

**药物对检验值或诊断的影响**

使用本药可出现尿醋酮试验假阳性。

**用药前后及用药时应当检查或监测**

1.白细胞计数及分类计数，最初3个月内每2周1次，此后定期检查，有感染迹象时随即检查。

2.尿蛋白检查，一月1次。

**【国外专科用药信息参考】**

**牙科用药信息**

与牙科治疗相关的主要不良反应：味觉的损害或丧失及直立性低血压。

**精神状况信息**

1.对精神状态的影响：用药后可能引起嗜睡或失眠。

2.对精神障碍治疗的影响：(1)本药可引起粒细胞减少，与氯氮平和卡马西平合用时需谨慎。(2)本药可降低锂的清除引起血清锂水平的增加而导致锂中毒，使用时监测血清锂水平。

**心血管注意事项**

1.对心力衰竭患者的影响：美国心脏协会心力衰竭诊治指南(2009)指出血管紧张素转换酶抑制药治疗可降低有或无症状心力衰竭患者的死亡率。

2.对高血压患者的影响：美国心脏协会心力衰竭诊治指南(2009)指出血管紧张素转换酶抑制药对高血压患者和无症状的左心肥大的心力衰竭患者有益。

3.潜在不良反应：血管紧张素转换酶抑制药可使血清钾和肌酸酐快速增加，在伴有双肾动脉狭窄的患者尤为明显。

**麻醉注意事项**

对于用血管紧张素转换酶抑制药治疗的患者，在全身麻醉的诱导和维持时可发生低血压；然而，手术前停药存在争议，手术期间应避免使用降压药物。

**护理注意事项**

1.评估患者使用的其他可能影响肾功能的药物。

2.用药时严密监测患者过敏及血管神经性水肿情况。监测血压，评估肾功能状况。

**【药物过量】**

**过量的表现**

用药过量可导致低血压。

**过量的处理**

一旦出现过量应立即停药，并扩容以纠正，在成人还可用血液透析清除。

**【药理】**

**药效学**

本药为ACE抑制药，能竞争性抑制ACE。ACE可将无活性的血管紧张素Ⅰ转化为血管紧张素Ⅱ，后者为强血管收缩物质。本药能抑制血管紧张素Ⅰ转化为血管紧张素Ⅱ，减少血管紧张素Ⅱ的生成，从而抑制血管收缩，并减少醛固酮的分泌。还能抑制激肽酶Ⅱ，使激肽积聚，以及增加前列腺素及其代谢产物生成，促使血管扩张，血压下降。此外，本药也可直接作用于周围血管，降低血管阻力，使肾血流量增加，但不影响肾小球滤过。尚未观察到卧位与立位时降压作用的差别。

本药能同时扩张动脉与静脉，降低周围血管阻力(后负荷)和肺毛细血管楔压(前负荷)，因而能改善心排血量，提高运动耐量，从而改善心力衰竭。

**药动学**

本药口服吸收迅速，吸收率在75%以上，进食可影响吸收。口服后约15分钟开始起效，达峰时间为1-1.5小时，有效血药浓度可持续至服药后24小时，肝肾功能不全时持续时间更长。本药注射后15分钟开始起效，达峰时间为1-2小时，作用持续4-6小时。降压作用为进行性，约数周达最大治疗作用。本药不能透过血-脑脊液屏障，可通过胎盘，少量经乳汁分泌。在肝内代谢为二硫化物等。主要经肾脏排泄，40%-50%为原形，其余为代谢物。半衰期小于3小时，肾衰竭者半衰期延长。

**遗传、生殖毒性与致癌性**

◆生殖毒性  动物试验结果显示本药无生殖毒性。

◆致癌性  动物试验显示本药无致癌性。

**【制剂与规格】**

卡托普利片  (1)12.5mg。(2)25mg。(3)50mg。(4)100mg。

卡托普利缓释片  37.5mg。

卡托普利滴丸  6.25mg。

卡托普利注射液  (1)1ml:25mg。(2)2ml:50mg。

注射用卡托普利  (1)12.5mg。(2)25mg。(3)50mg。

**【贮藏】**

片剂：避光、密封保存。

缓释片：30℃以下，避光、密闭保存。

滴丸：避光、密封保存。

注射液：避光、密封保存。

粉针剂：避光、密封保存。

使用UpToDate临床顾问须遵循[用户协议](http://www.uptodate.com/contents/license)。

专题 92235 版本 1.0