

临床常规与禁忌系列

心内科用药 常规与禁忌

总主编 郑长青 主 编 孙志军



人民军医出版社

PEOPLE'S MILITARY MEDICAL PRESS

临床常规与禁忌系列

心内科用药常规与禁忌

XINNEIKE YONGYAO CHANGGUI YU JINJI

总主编 郑长青

主 编 孙志军

副主编 王 力

编 者 (以姓氏笔画为序)

王 力 司兵兵 玄研华 冯琳琳

刘双双 孙志军 李 岩 李 想

孟庆坤 贾元春 董 晶 董玲玲



人民军医出版社

图书在版编目(CIP)数据

心内科用药常规与禁忌/孙志军主编. —北京:人民军医出版社, 2012. 1

(临床常规与禁忌系列)

ISBN 978-7-5091-5328-4

I. ①心… II. ①孙… III. ①心脏血管疾病—用药法
IV. ①R540.5

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2011)第 265057 号

策划编辑:郭颖 文字编辑:王三荣 伦踪启 责任审读:黄栩兵

出版人:石虹

出版发行:人民军医出版社

经销:新华书店

通信地址:北京市 100036 信箱 188 分箱

邮编:100036

质量反馈电话:(010)51927290;(010)51927283

邮购电话:(010)51927252

策划编辑电话:(010)51927300-8153

网址:www.pmmp.com.cn

印、装:北京国马印刷厂

开本:787mm×1092mm 1/32

印张:9.5 字数:227千字

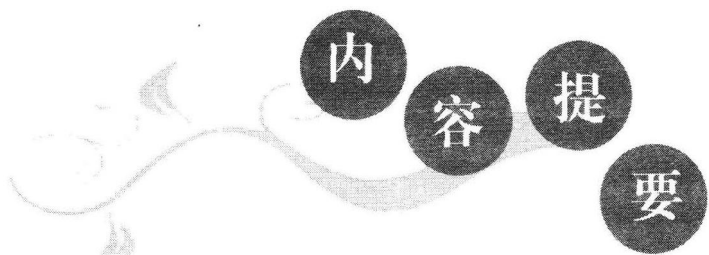
版、印次:2012年1月第1版第1次印刷

印数:0001—3500

定价:35.00元

版权所有 侵权必究

购买本社图书,凡有缺、倒、脱页者,本社负责调换



内 容 提 要

本书分 15 章详细介绍了血管紧张素转化酶抑制药、血管紧张素 II 受体阻滞药、 α 受体阻滞药、 β 受体阻滞药、钙拮抗药、利尿药、调血脂药、抗血小板药、抗凝血药、溶栓药、抗心律失常药、硝酸酯类药、抗休克药、高血压急症用药、洋地黄与其他正性肌力药等心内科常用药物的应用常规与禁忌,包括每种药物的规格、药理特性、用途、用法用量、不良反应、药物相互作用、注意事项、禁忌和特殊人群用药。本书内容实用,贴近临床,形式直观,便于查阅,适于各级医院的心内科医师、护理人员阅读参考。



前

言

心血管系统疾病是现代社会的严重威胁人类健康、引起死亡的主要疾病。目前高血压、冠心病、心力衰竭等疾病已成为全球范围内严重的公共卫生问题。如何降低心血管疾病，特别是冠心病和高血压病的发病率、致残率和病死率已成为社会、政府关注的焦点。近年来，介入治疗和外科手术等非药物治疗进展迅速，然而药物治疗仍为心血管疾病治疗的基础。如何在品种繁多的药物中科学地选择药物，制定合理的用药方案，是提高临床疗效的关键所在，也是每一名临床医师所必须掌握的基本功。为了给心内科专科医师、临床医师和实习医师提供一本实用性强的心内科用药指导参考书，我们组织了多位心血管病专家编写了此书。

本书的编者包括临床经验丰富的心内科专家和长期工作在临床第一线的心内科医师，所录药物均经过长期临床实践及循证医学检验。限于篇幅，本书取材多限于贴近临床、实用性较强的内容，如若读者在某方面需进一步了解，请参阅相应的参考书或有关专著。本书编写过程中力求简明实用，可读性强，概念清楚，贴近临床，坚持循证医学的原则，适用于各级医院的医护人

员阅读参考。

在编写过程中,本书得到中国医科大学附属盛京医院院领导的大力支持。此书由郑长青教授担任总主编,为本书把握方向,认真负责地参与全部编写过程,协调组织本书编写。本书编写的过程中,中国医科大学附属盛京医院吴可光教授、李晓东教授、马淑梅教授、张贺教授提出许多宝贵意见,在此一并表示衷心的感谢。

书中有不尽完善之处,敬请广大读者和专家不吝赐教和指正。

编 者

于中国医科大学附属盛京医院

第1章 血管紧张素转化酶抑制药	1
一、概述	1
二、常用药物	5
卡托普利(5) 依那普利(8) 贝那普利(10) 培哚普利(15) 雷米普利(17) 咪达普利(21) 赖诺普利(22) 福辛普利(26)	
第2章 血管紧张素Ⅱ受体阻滞药	29
一、概述	29
二、常用药物	30
氯沙坦(30) 缬沙坦(32) 厄贝沙坦(34) 坎地沙坦(36) 替米沙坦(39)	
第3章 α受体阻滞药	42
一、概述	42
二、常用药物	43
(一) α_1 及 α_2 受体阻滞药	43
酚妥拉明(43) 妥拉唑林(45) 酚苄明(46) 哌唑拉明(48)	
(二) α_1 受体阻滞药	49
哌唑嗪(49) 多沙唑嗪(52) 曲马唑嗪(54) 特拉	

唑嗪(55) 乌拉地尔(57)	
第4章 β受体阻滞药	60
一、概述	60
二、常用药物	61
美托洛尔(61) 艾司洛尔(63) 普萘洛尔(65) 阿替洛尔(68) 比索洛尔(70) 阿罗洛尔(72) 卡维地洛(74) 拉贝洛尔(78)	
第5章 钙拮抗药	82
一、概述	82
二、常用药物	84
(一)双氢吡啶类	84
硝苯地平(84) 非洛地平(86) 氟桂地平(88) 拉西地平(90) 尼卡地平(92) 尼群地平(94) 尼莫地平(96)	
(二)苯噻氮革类	98
地尔硫革(98)	
(三)苯烷胺类	100
维拉帕米(100)	
第6章 利尿药	105
一、概述	105
二、常用药物	106
(一)噻嗪类和氯噻酮利尿药	106
氢氯噻嗪(106) 氯噻酮(110) 环戊噻嗪(114) 氯噻嗪(115)	
(二)襻利尿药	118
呋塞米(118) 布美他尼(123) 依他尼酸(128) 托拉塞米(133)	
(三)保钾利尿药	137
螺内酯(137) 氨苯蝶啶(141)	

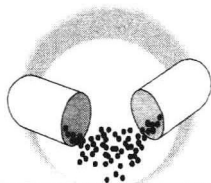
(四)其他	144
吲达帕胺(144)	
第7章 调血脂药	146
一、概述	146
二、常用药物	147
(一)他汀类	147
洛伐他汀(147) 辛伐他汀(149) 普伐他汀(152)	
氟伐他汀(154) 阿托伐他汀(157) 瑞舒伐他汀(160)	
(二)贝特类	163
苯扎贝特(163) 非诺贝特(166) 吉非贝齐(169)	
(三)胆酸螯合剂(树脂类)	172
考来烯胺(172) 考来替泊(174)	
(四)烟酸及其衍生物	175
阿昔莫司(175)	
(五)多烯脂肪酸	177
多烯酸乙酯(177)	
(六)其他	177
普罗布考(177) 依折麦布(179) 甘油酯(182)	
硫酸软骨素(182)	
第8章 抗血小板药	185
一、概述	185
二、常用药物	185
阿司匹林(185) 氯吡格雷(187) 双嘧达莫(189)	
噻氯匹定(191) 替罗非班(194)	
第9章 抗凝血药物	197
一、概述	197
二、常用药物	197
肝素(197) 低分子肝素(198) 华法林(200)	

第 10 章 溶栓药	202
一、概述	202
二、常用药物	204
(一) 非纤维蛋白特异溶栓药	204
链激酶(204) 尿激酶(205)	
(二) 纤维蛋白特异溶栓药	206
阿替普酶(206) 瑞替普酶(207) 替特普酶(208)	
第 11 章 抗心律失常药	210
一、概述	210
二、常用药物	211
(一) Ia 类抗心律失常药物	211
奎尼丁(211) 普鲁卡因胺(212)	
(二) Ib 类抗心律失常药物	213
利多卡因(213) 美西律(215) 阿普林定(216)	
妥卡胺(217)	
(三) Ic 类抗心律失常药物	218
普罗帕酮(218)	
(四) II 类抗心律失常药物	219
普萘洛尔(219) 艾司洛尔(221) 阿替洛尔(223)	
美托洛尔(226)	
(五) III 类抗心律失常药物	228
胺碘酮(228) 索他洛尔(230)	
(六) IV 类抗心律失常药物	232
维拉帕米(232) 地尔硫革(236)	
(七) 其他	238
腺苷(238) 硫酸镁(239)	
第 12 章 硝酸酯类药	240
一、概述	240
二、常用药物	241

硝酸甘油(241) 硝酸异山梨醇酯(244) 单硝酸异
山梨酯(246)

第 13 章 抗休克药	248
一、概述	248
二、常用药物	248
多巴胺(248) 肾上腺素(252) 多巴酚丁胺(254)	
异丙肾上腺素(256) 间羟胺(258) 去甲肾上腺	
素(259) 阿托品(261)	
第 14 章 高血压急症用药	263
一、概述	263
二、常用药物	263
硝普钠(263) 乌拉地尔(267) 酚妥拉明(269)	
拉贝洛尔(271) 尼卡地平(273) 地尔硫革(275)	
第 15 章 洋地黄与其他正性肌力药	277
一、概述	277
二、常用药物	277
地高辛(277) 毛花苷 C(281) 米力农(286) 左	
西孟旦(287)	

第 1 章



血管紧张素转化酶抑制药

血管紧张素转化酶抑制药(angiotension converting enzyme inhibitors, ACEI),亦称血管紧张素转化酶抑制因子,即降压多肽。最早应用于临床的是从蛇毒中提取的九肽——替普罗肽,近年来人们研制出了 20 余种 ACEI 类药物。除有效降压外,ACEI 还具有心肾保护作用,可降低各类心血管事件的发生,尤其适用于合并心功能不全、心肌梗死、2 型糖尿病患者。

一、概 述

【作用机制】

1. 阻止血管紧张素 II (Ang II) 生成 ACEI 阻止 Ang II 的生成,从而抑制 Ang II 收缩血管、刺激醛固酮释放、增加血容量、升高血压与促心血管肥大增生等作用,有利于高血压、心力衰竭的防治与心血管重构。

2. 保存缓激肽活性 ACEI 在阻止 Ang II 生成的同时也抑制了缓激肽的降解,目前认为缓激肽经激活激肽 B₂ 受体使 NO 和 PGI₂ 生成增加,而 NO 与 PGI₂ 都有舒张血管、降低血压、抗血小板聚集、抗心血管细胞肥大增生和重构作用。

3. 保护血管内皮细胞 ACEI 有保护血管内皮细胞的作用,能逆转高血压、心力衰竭、动脉硬化与高血脂引起的内皮细胞功能损伤,恢复内皮细胞依赖性的血管舒张作用。

4. 抗心肌缺血与心肌保护 动物实验显示,ACEI 有抗心肌缺血与梗死的作用,能减轻心肌缺血再灌注损伤,保护心肌对抗自由基的损伤。此心肌保护作用可能与激肽 B₂ 受体、PKC 等有关。

5. 增敏胰岛素受体 卡托普利及其他多种 ACEI 能增加糖尿病与高血压病患者对胰岛素的敏感性。此作用在高血压病患者似与阻止 Ang II 无关,因氯沙坦与依普沙坦无此作用,推测是由缓激肽介导的。

【临床应用】

1. 治疗高血压 ACEI 类药物治疗高血压效果好。国际上各个高血压标准指南都推荐“ACEI 类药物+利尿药”组合。单用 ACEI 类药物对轻中度高血压病患者能降低舒张压 20%,约 70%的病人可控制血压;加用利尿药后 95%的病人有效,对肾血管性高血压特别有效,对心、肾、脑等器官有保护作用;能减轻心肌肥厚,阻止或逆转心血管病理性重构。有报道卡托普利能改善对胰岛素的敏感性,胜过其他降压药。

2. 治疗充血性心力衰竭 ACEI 类药物能降低心力衰竭患者病死率,改善充血性心力衰竭预后,延长生命,其效果比其他血管舒张药和强心药好,为近代心力衰竭治疗的一大进步,

3. 治疗心肌梗死 对心肌梗死发生 24h 及无心功能不全者 6 个月的存活率无改善(CONSENSUS II,1992,依那普利);对心肌梗死发生 3~16d 者,42 个月病死率降低(SAVE,1992,卡托普利)。

4. 抗动脉粥样硬化作用

5. 抗心肌缺血与心肌保护作用 ACEI 类药物能减轻心肌缺血性再灌注损伤引起的心律失常,能缩小心肌梗死范围。

【临床优点】 ACEI 对中枢神经和自主神经功能没有影响,也不影响性功能。与其他直接血管扩张药不同,其产生的降压效应并无反射性心动过速,并能防止由利尿药产生的继发性高醛固酮血症。

ACEI 对代谢亦无影响,血钾稳定,血浆尿酸可能下降,胆固醇及血脂无明显改变。因此,对冠状动脉病及血管性损害的危险因素的影响是中性的或者有利。有些研究认为,ACEI 可减少胰岛素抵抗并对糖代谢有益。

对下列伴随疾病的病人可以安全使用:①哮喘或慢性阻塞性呼吸道疾病;②周围血管疾病,包括雷诺现象;③抑郁;④糖尿病。

【临床应用的特殊指征】

1. 心肌肥厚 ACEI 类药物有减轻左心室肥厚的作用,较其他抗高血压药物大 2 倍,此种效应也对血管性肥厚有效。

2. 左心室功能不全或心力衰竭 ACEI 类药物能使症状性充血性心力衰竭病人降低病死率,对轻度有症状的心力衰竭病人亦明显降低心血管病病死率。

3. 糖尿病及糖尿病性病 ACEI 类药物能用于治疗胰岛素依赖或非依赖性高血压糖尿病病人,卡托普利已表明,可使糖尿病病人减缓慢性肾衰竭的进展。

4. 肾病 对肾小球滤过率减少的其他类型肾病病人能减少尿蛋白。已有报道长期应用 ACEI 类药物治疗可增加滤过率及肾血流量。但是对原因不明的肾衰竭病人使用要特别小心,因为若双侧肾动脉狭窄可促使急性肾衰竭。

【禁忌证及慎用】 妊娠高血压绝对禁用 ACEI 类药物,可使胎儿畸形,所有育龄妇女尽量慎用。对严重血容量下降或低盐及血浆肾素水平很高的病人(利尿多度),常在首次服用 ACEI 时发生血压下降,此种病人提前 1~2d 停用利尿药。

同样,心输出量固定的病人在严重主动脉瓣或二尖瓣狭窄

可发生显著下降,因为由 ACEI 产生的周围阻力下降不能被心输出量增加所代偿。

ACEI 在下列情况下慎用:重度血容量减少;重度主动脉、二尖瓣狭窄;限制性心包炎;重度充血性心力衰竭(NYHA4 级);肾性高血压尤其是双侧神经血管病变或孤立肾伴肾动脉狭窄;原因未明的肾功能不全;有血管杂音的老年吸烟者;服用非甾体消炎药的肾功能不全者。

【不良反应】

1. 首剂低血压 口服吸收快、生物利用度高的 ACEI 类药物,首剂低血压多见。以卡托普利为例,约 3.3% 的病人首次服用 5mg 后平均动脉压降低 30% 以上。口服吸收慢、生物利用度低的 ACEI 类药物,如赖诺普利此反应较少见。

2. 咳嗽 无痰干咳是 ACEI 类药物较常见的不良反应。西方报道发生率为 6%~12%。东方女性不吸烟者与老年人更高,是被迫停药的主要原因。偶尔有支气管痉挛性呼吸困难,可不伴有咳嗽。吸入色苷酸二钠可以缓解。咳嗽与支气管痉挛的原因可能是 ACEI 类药物使缓激肽和(或)前列腺素、P 物质在肺内蓄积的结果,不同 ACEI 类药物引起咳嗽有交叉性,但发生率稍有不同。依那普利与赖诺普利咳嗽的发生率比卡托普利高,而福辛普利则较低。

3. 高血钾 由于 ACEI 类药物能减少 Ang II 生成,使依赖 Ang II 的醛固酮减少,因此血钾可以升高,在肾功能障碍的患者与同时服用保钾利尿药的病人更多见。不同的 ACEI 类药物对血钾的影响大同小异。

4. 低血糖 由于 ACEI 类药物特别是卡托普利能增强对胰岛素的敏感性,因此常伴有降低血糖的作用。对 1 型与 2 型糖尿病患者均可有此作用。

5. 肾损伤 在肾动脉阻塞或肾动脉硬化造成的双侧肾血管病患者,ACEI 类药物能加重肾损伤,升高血浆肌酐浓度,甚

至产生氮质血症。这是因为 Ang II 可通过出球小动脉维持肾灌注压, ACEI 类药物舒张出球小动脉, 降低肾灌注压, 导致肾滤过率与肾功能降低, 停药后常可恢复。偶有不可逆性肾功能减退发展为持续性肾衰竭者, 应予注意。

6. 妊娠与哺乳 ACEI 类药物用于妊娠的第二期与第三期时, 可引起胎儿畸形、胎儿发育不良甚至死胎。在妊娠第一期内虽尚无损伤胎儿报道, 但为慎重起见, 一旦证实妊娠, 应立即停药。亲脂性强的 ACEI 类药物如雷米普利与福辛普利从乳汁中分泌, 故哺乳妇女忌用。

7. 血管神经性水肿 可发生于嘴唇、舌头、口腔、鼻部与面部其他部位。偶可发生于喉头, 威胁生命。血管神经性水肿发生机制与缓激肽或其他代谢产物有关, 多发于用药的第一个月, 一旦发生即停药。

8. 含-SH 化学结构的 ACEI 类药物的不良反应 含-SH 基团的卡托普利可产生味觉障碍、皮疹与白细胞缺乏等与其他含-SH 的药物(如青霉胺)相似的反应。皮疹多为瘙痒性丘疹, 常发生于用药几周内, 继续服药常可自行减退。服用卡托普利的皮疹发生率比其他 ACEI 类药物要高, 且不交叉发生。白细胞缺乏症仅见于肾功能障碍患者, 特别是有免疫障碍或用免疫抑制药的患者。

二、常用药物

卡托普利 (Captopril, 开搏通、开富林)

【规格】 片剂: 12.5mg, 25mg。

【药理特性】

1. 药效学特征 具有抗高血压作用, 是一种口服有效的特异性竞争型抑制药。主要作用于肾素-血管紧张素-醛固酮系统(RAA 系统)。抑制 RAA 系统的血管紧张素转换酶(ACE), 阻

止血管紧张素Ⅰ转换成血管紧张素Ⅱ，并能抑制醛固酮分泌，减少水钠潴留。对心力衰竭患者，本品能明显降低外周血管阻力，肺毛细血管楔压及肺血管阻力，增加心输出量及运动耐受时间。

2. 药动学 本品口服后吸收迅速，吸收率在75%以上。口服后15min起效，1~1.5h达血药峰浓度。持续6~12h。血循环中本品的25%~30%与蛋白结合。半衰期短于3h，肾损害时会产生药物潴留。降压作用为进行性，约数周达最大治疗作用。在肝内代谢为二硫化物等。本品经肾排泄，40%~60%以原型排出，其余为代谢物，可在血液透析时被清除。

本品不能通过血-脑脊液屏障。本品可通过乳汁分泌，可以通过胎盘。

【用途】 用于高血压病，也用于对利尿药、洋地黄类治疗无效的心力衰竭患者。

【用法用量】

1. 高血压 口服每次12.5mg，2~3/d。按需要1~2周内可增至50mg，2~3/d，一般不主张超过150mg/d，疗效仍不满意可加用其他降压药。

2. 慢性心力衰竭 初始剂量宜用6.25mg，3/d，以后通过测试逐步增加至常用量，常用量25~100mg，2~3/d，靶剂量为50mg，3/d，饭前1h服。

3. 心肌梗死后左心室功能异常 维持剂量一般为50mg，3/d。

【不良反应】

1. 较常见的有

(1) 皮疹，可能伴有瘙痒和发热，常发生于治疗4周内，呈斑丘疹或荨麻疹，减药或停药或给抗组胺药后消失，7%~10%伴嗜酸性细胞增多，或抗核抗体阳性。

(2) 心悸、心动过速、胸痛。