



آشنایی با زنریک:

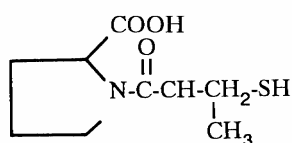
کاپتوپریل

فارماکولوژی:

مکانیسم دقیق عمل ضد افزایش فشار خون کاپتوپریل شناخته نشده است، اما به نظر می‌رسد که مهار رقابتی فعالیت ACE_1 ، میزان تبدیل آنژیوتانسین I به آنژیوتانسین II را که یک تنگ‌کننده عروق است کاهش می‌دهد. کاهش غلظت آنژیوتانسین II باعث افزایش ثانویه فعالیت رنین در پلاسما می‌شود که این عمل از طریق پس‌نورد منفی آزادی رنین و کاهش مستقیم ترشح آلدوسترون صورت می‌پذیرد.

کاپتوپریل یک داروی ضدافزایش فشار خون و گشادکننده عروق است که در نارسایی احتقانی قلب مصرف می‌شود. کاپتوپریل جزء گروه داروهای مهارکننده آنزیم مبدل آنژیوتانسین ACE است. این گروه به تنهایی و یا به همراه مدرهای تیازیدی در درمان افزایش فشار خون بکار می‌روند. کاپتوپریل همچنین همراه با داروهای مدر و یا همزمان با درمان بوسیله دیژیتال برای معالجه نارسایی احتقانی قلب که به سایر داروها جواب نمی‌دهد مصرف می‌شود.

□ کاپتوپریل همراه با داروهای مدر
 و یا همزمان با درمان به وسیله
 دیژیتال برای معالجه نارسایی
 احتقانی قلب که به سایر داروها
 جواب نمی دهد مصرف می شود.



1-[(2S)-3-MERCAPTO-2-METHYL-Propionyl]-PROLINE

قابل حل	حلالیت در الکل	۲۱۷/۳	وزن ملکولی
قابل حل	حلالیت در آب	۹/۸ و ۳/۷	PKa ₂ , PKa ₁
		۱/۹	ضریب تفکیک در اوکتانول / آب

خونی داشته باشند. مهارکننده های ACE باعث کاهش
 مقاومت شریانی محیطی می شوند.

مهارکننده های ACE ممکن است در مقایسه با فعالیت
 عادی یا بالای رنین، اثر کمتری بر روی بیماران فشار

■ جهت حصول نتیجه مطلوب درمانی، کاپتوپریل بایستی یک ساعت قبل از غذا با معده خالی مصرف شود.

در روز هیچگونه آثار سرطانزایی را نشان نداده است.

مصرف در حاملگی و شیردهی:

در آزمایشاتی که روی موش صحرایی به عمل آمده هیچگونه نقصی در جنین حیوانات بارور مشاهده نشده است.

کاپتوپریل از جفت عبور می‌کند و در شیر نیز ترشح می‌شود. غلظت کاپتوپریل در شیر مادر تقریباً ۱٪ غلظت آن در خون مادر است و تاکنون مشکلی در انسان از این بابت گزارش نشده است.

تداخلات دارویی:

الکل و دیورتیک‌ها با تمام مهارکننده‌های ACE تداخل دارند. مدرهای نگاهدارنده پتاسیم، داروهای شامل پتاسیم، فرآورده‌های دارویی حاوی پتاسیم، موادی که حاوی پتاسیم با غلظت بالا هستند و جانشین شونده‌های نمک که اغلب دارای مقداری پتاسیم هستند نیز با کاپتوپریل ناسازگار می‌باشند، زیرا با مهار ACE و کاهش ترشح آلدوسترون ناشی از آن، موجب هیپرکالمی می‌شود.

در صورتیکه مشکلات پزشکی ذیل در اثر مصرف کاپتوپریل ظاهر گردید می‌بایست منافع و مضار دارو مورد بررسی قرار گیرد. این مشکلات عبارتند از: سابقه آنژیوادم مربوط به استفاده قبلی از

اثر گشادکنندگی عروق و درمان نارسایی احتقانی قلب از طریق کاهش مقاومت عروق محیطی پس‌بار و نیز پیش‌بار قلب صورت می‌پذیرد.

کاپتوپریل ممکن است مقدار پروتئین ادرار بیماران فشار خونی مبتلا به نفروپاتی دیابتیک را کاهش دهد. این اثر ممکن است به دلیل تغییرات مفید در همودینامیک داخل کلیوی (گشاد شدن عروق کلیه و کاهش فشار فیلتراسیون) بوسیله کاپتوپریل ایجاد شود، که نتیجه آن کاهش دفع پروتئین از ادرار است.

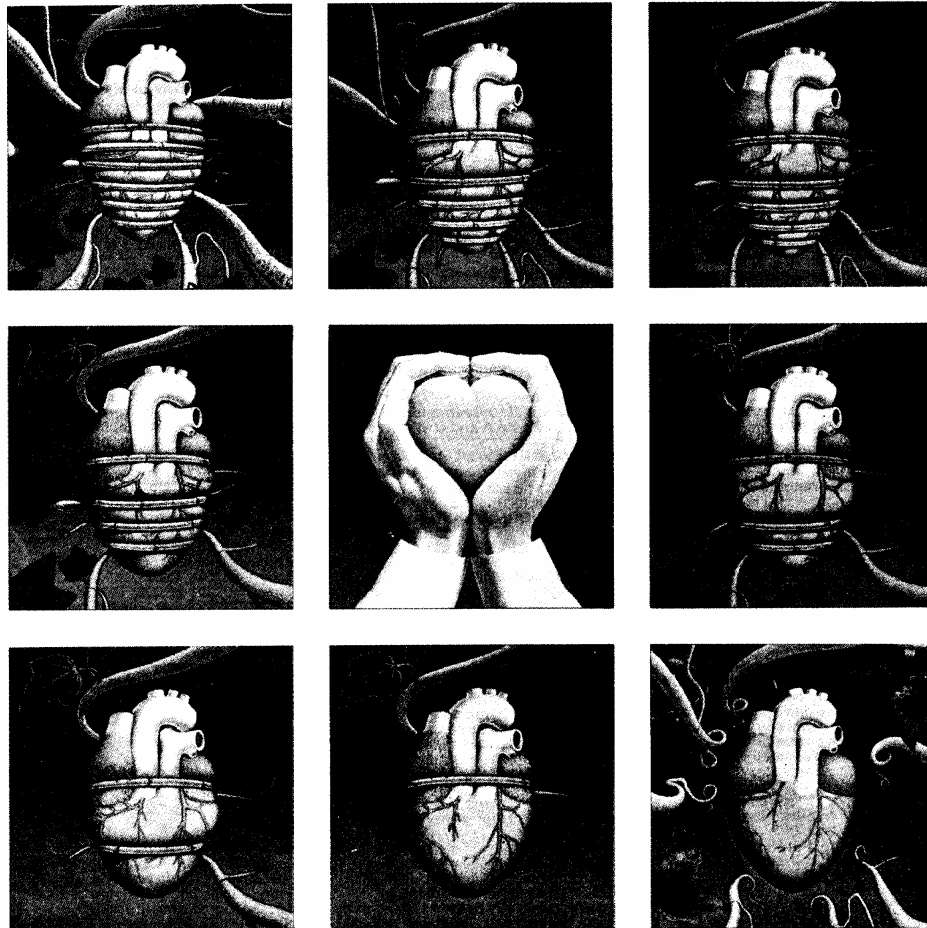
جذب کاپتوپریل سریع است و حداقل ۷۵٪ آن از طریق دستگاه معدی روده‌ای جذب می‌شود. ولی اگر همراه غذا مصرف شود جذب آن بین ۳۰ تا ۵۵٪ کاهش می‌یابد. به منظور حصول نتیجه مطلوب درمانی می‌بایست دارو یک ساعت قبل از غذا با معده خالی مصرف شود. نیمه عمر کاپتوپریل کمتر از ۳ ساعت است که در نارسایی‌های کلیوی افزایش می‌یابد (۳/۵ تا ۳۲ ساعت).

ظهور اثر کاپتوپریل ۱۵ تا ۶۰ دقیقه پس از مصرف بوده، غلظت سرمی آن پس از ۳۰ تا ۹۰ دقیقه به بالاترین حد خود می‌رسد و حدود ۶۰ تا ۹۰ دقیقه پس از مصرف کاپتوپریل اثر آن به حداکثر می‌رسد.

احتیاطات:

مطالعات دوساله بر روی موش و موش صحرایی با دوزهای ۵۰ تا ۱۳۵۰ میلی‌گرم برای هر کیلوگرم وزن

IN HYPERTENSION



**Reduce risks.
Care for the future.**

■ کاپتوپریل ممکن است مقدار پروتئین ادرار بیماران فشارخونی مبتلا به نفروپاتی دیابتیک را کاهش دهد.

بسندرت عکس‌العمل‌های LICHENOID و PENPHIGOID همراه با فاکتورهای حساس به نور در مورد کاپتوپریل گزارش شده است.

آرتزیوادم در دست‌ها و پاها، صورت، لبها، غشاء مخاطی، زبان، دهانه حنجره، حنجره و همچنین در قفسه سینه و افزایش پتاسیم خون، آگرانولوسیتوز و التهاب پانکراس از عوارضی است که به ندرت در درمان با کاپتوپریل دیده می‌شود.

عوارضی که در صورت ادامه‌دار بودن و یا ایجاد مزاحمت نیاز به توجه پزشکی دارند عبارتند از: سرفه خشک ممتد و سردرد. معمولاً سرفه در طول هفته اول درمان (مابین ۲۴ ساعت پس از شروع درمان و گاه هفته‌ها بعد از آغاز درمان) ایجاد می‌شود که با قطع دارو این عارضه از بین خواهد رفت.

اطلاعاتی در مورد نحوه مصرف دارو:

در مورد مصرف کاپتوپریل توصیه شده است که کلیه درمان‌های قبلی مربوط به افزایش فشارخون یک هفته قبل از شروع درمان با کاپتوپریل قطع شود. البته این اقدام در مورد بیماران مبتلا به افزایش فشارخون بالا و بدخیم و همچنین مبتلایان به افزایش فشارخون غیرقابل کنترل توصیه نمی‌شود. در این بیماران ممکن است شروع درمان با کاپتوپریل بلافاصله پس از قطع درمان‌های قبلی (بجز مدرها) با پایین‌ترین دوز مصرفی و تحت نظارت دقیق پزشکی صورت گیرد.

داروهای مهارکننده ACE، آرتزیوادم، آرتزیوادم ارثی، آرتزیوادم بدون علت مشخص، افزایش پتاسیم خون، تنگی شریان در یک یا دو کلیه، پیوند کلیه، صدمه دیدن عملکرد کلیوی و کبدی.

عوارض جانبی:

عوارضی که در اثر مصرف کاپتوپریل ایجاد می‌شوند و نیاز به توجه پزشکی دارند عبارتند از: کم شدن فشارخون همراه با گیجی، ضعف، به ویژه به دنبال مصرف دوز اولیه در بیمارانی که مبتلا به کمبود سدیم و یا آب بدن هستند، و یا در بیمارانی که مبتلا به کمبود سدیم و یا آب بدن هستند و یا در بیمارانی که یک مهارکننده ACE برای درمان نارسایی احتقانی قلب دریافت کرده‌اند. همچنین عوارضی شامل بثورات جلدی با و یا بدون خارش، تب و دردهای مفصلی نیازمند توجه پزشکی هستند.

معمولاً لکه‌های برجسته و بندرت بثورات خارش‌دار در چهار هفته اول درمان با کاپتوپریل بر روی پوست دیده می‌شوند. این عوارض با کم کردن دوز دارو و یا قطع مصرف آن و یا تجویز آنتی‌هیستامینیک از بین می‌رود. ۷ تا ۱۰٪ این گروه بیماران ممکن است آئوزینوفیل‌های خونشان افزایش یابد و یا اینکه تیترا آنتی‌بادی آنتی‌نوکلئار ANA آنها مثبت شود. این واکنش ممکن است در مورد دیگر داروهای گروه مهارکننده ACE کمتر باشد. همچنین

□ در آزمایشاتی که روی موش صحرایی به عمل آمده، هیچگونه نقصی در جنین حیوانات بارور مشاهده نشده است.

مقدار مصرف اولیه کاپتوپریل در کودکان ۳۰۰ میکروگرم (۰/۳ میلی گرم) به ازای هر کیلوگرم وزن بدن ۲ یا ۳ بار در روز است. در صورت نیاز مقدار ۳۰۰ میکروگرم (۰/۳ میلی گرم) به ازای هر کیلوگرم وزن بدن پس از یک قطع مصرف ۸ تا ۲۴ ساعته افزایش پیدا می کند تا به حداقل دوز موثر برسد.

نکته قابل توجه در اینجا این است که دوز اولیه ۱۵۰ میکروگرم (۰/۱۵ میلی گرم) به ازای هر کیلوگرم وزن بدن، سه بار در روز باید برای بیمارانی بکار رود که آب و سدیم بدنشان به دلیل مصرف داروهای مدر تخلیه شده و یا بیمارانی که تحت درمان با دیورتیک ها هستند و یا کسانی که دارای نقص کار کلیوی می باشند.

بسته بندی و نگاهداری:

کاپتوپریل به صورت قرص های ۲۵ میلی گرمی عرضه می شود و باید در حرارت ۱۵ تا ۳۰ درجه سانتیگراد نگاهداری شود.

مآخذ:

- 1- USP DI-Drug Information for the Health Care professional 13th ed. Rockville. United States Pharmacopeial Convention, Inc. PP: 168-175, 1993.
- 2- USP DI-Advice for the patient-Vol II, 13th ed. Rockville. The United States Pharmacopeial Convention, Inc. PP: 84-87, 1993.
- 3- Dollery, S.C; Therapeutic drugs, Vol I, 1st ed., Churchill Livingstone, England. PP: C44-C48, 1991.

سپس در هر ۲۴ ساعت و یا کمتر دوز مصرفی افزایش داده می شود، تا دارو موثر واقع گردد، و به ماکزیمم دوز مورد نیاز برسد.

مقدار مصرف قرص کاپتوپریل در نوجوانان و بزرگسالان:

برای درمان افزایش فشار خون، دوز اولیه کاپتوپریل ۱۲/۵ میلی گرم است که ۲ یا ۳ بار در روز مصرف می شود. این مقدار در صورت ضرورت، بعد از دو تا سه هفته به ۲۵ میلی گرم می رسد که ۲ یا ۳ بار در روز مصرف می شود. دوز اولیه کاپتوپریل به عنوان گشادکننده عروق و در درمان نارسایی احتقانی قلب ۱۲/۵ میلی گرم دو یا سه بار در روز است. این مقدار در صورت ضرورت به تدریج تا ۵۰ میلی گرم در روز در ۲ یا ۳ نوبت افزایش می یابد. در صورتی که مصرف مقدار بیشتری از کاپتوپریل مورد نیاز باشد مناسب است که این مقدار بعد از قطع دو هفته ای دارو مصرف شود، زیرا در این صورت حداکثر اثر کاپتوپریل ظاهر خواهد شد. دوز نگهداری کاپتوپریل ۲۵ تا ۱۰۰ میلی گرم ۲ یا ۳ بار در روز است. حداکثر مقدار مصرف کاپتوپریل ۴۵۰ میلی گرم در روز است.

مقدار مصرف معمولی اولیه کاپتوپریل برای خردسالان ۱۰ میکروگرم (۰/۱۰ میلی گرم) برای هر کیلوگرم وزن بدن ۲ یا ۳ بار در روز می باشد. این مقدار در صورت نیاز و یا ایجاد مقاومت تنظیم می شود.