

宁倍妥®

盐酸乌拉地尔注射液说明书

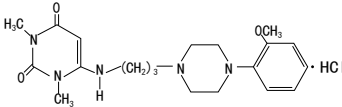
请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

【药品名称】

通用名称: 盐酸乌拉地尔注射液
英文名称: Urapidil Hydrochloride Injection
汉语拼音: Yansuan Wuladi'er Zhusheyey

【成份】

本品主要成份为盐酸乌拉地尔。
化学名称: 6-[[3-[4-(2-甲氧基苯基)-1-哌嗪基]丙基]氨基]-1,3-二甲基尿嘧啶盐酸盐
化学结构式:



分子式: $C_{20}H_{29}N_5O_3 \cdot HCl$

分子量: 423.94

辅料名称: 丙二醇 (供注射用), 磷酸二氢钠一水合物, 磷酸氢二钠十二水合物, 注射用水。

【性状】

本品为无色澄明液体。

【适应症】

用于治疗高血压危象 (如血压急剧升高), 重度和极重度高血压以及难治性高血压。
用于控制围手术期高血压。

【规格】

5ml: 25mg (按乌拉地尔计)

【用法用量】

1. 治疗高血压危象、重度和极重度高血压, 以及难治性高血压的给药方法:

1) 静脉注射

缓慢静注10-50mg乌拉地尔, 监测血压变化, 降压效果通常在5分钟内显示。若效果不够满意, 可重复用药。

2) 持续静脉点滴或使用输液泵

本品在静脉注射后, 为了维持其降压效果, 可持续静脉点滴, 液体按下述方法配制:

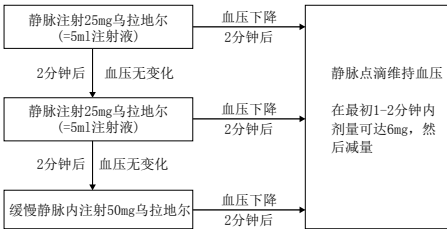
通常将250mg乌拉地尔 (相当于10支25mg盐酸乌拉地尔注射液) 加入到静脉输液中, 如生理盐水、5%或10%的葡萄糖。

如果使用输液泵, 可将20ml注射液 (=100mg乌拉地尔) 注入到输液泵中, 再将上述液体稀释到50ml。

静脉输液的最大药物浓度为每毫升4mg乌拉地尔。

输入速度根据病人的血压酌情调整, 初始输入速度可达2mg/min, 维持给药的速度为9mg/h。(若将250mg乌拉地尔溶解在500ml液体中, 则1mg乌拉地尔相当于44滴或2.2ml输入液)。

2. 围手术期高血压的给药方法



本品单次、重复静脉注射及长时间静脉输入均可, 亦可在静脉注射后持续静脉输入以维持血压的稳定。

静脉给药时患者应取卧位。

从毒理学方面考虑治疗时间一般不超过7天。

【配伍禁忌】

本品不能与碱性液体混合, 因其酸性性质可能引起溶液混浊或絮状物形成。

【不良反应】

使用本品后, 病人可能出现下列不良反应: 血管性水肿、荨麻疹、鼻塞、阴茎异常勃起、头痛、头晕、恶心、呕吐、出汗、烦躁、乏力、心悸、心律不齐、心动过速或过缓、呼吸困难、上胸部压迫感或疼痛等症状, 其原因多为血压降得太快所致, 通常在数分钟内即可消失, 一般无须中断治疗。

偶见因变换姿势而造成的血压下降。

过敏反应 (如瘙痒, 皮肤发红, 皮疹等) 少见。

极个别病例在口服本药时出现血小板计数减少, 但血清免疫学研究尚未证实其因果关系。

【禁忌】

禁用于对本品中成份过敏的患者。

主动脉峡部狭窄或动静脉分流的患者禁用 (肾透析时的分流除外)。

哺乳期妇女禁用。

【注意事项】

下列情况使用本品时需要特别注意:

- 机械功能障碍引起的心力衰竭，例如大动脉或者二尖瓣狭窄、肺栓塞或者由于心包疾病引起的心功能损害；
- 儿童，因为无相关研究；
- 肝功能障碍患者；
- 中度到重度肾功能不全患者；
- 老年患者；

- 合用西咪替丁的患者（参见【药物相互作用】）

另外乌拉地尔可能会影响驾驶或操作机器的能力。

如果本品不是最先使用的降压药，那么在使用本品之前应间隔充分的时间，使先服用的其他降压药显示效应，必要时应当减少本品的剂量。

血压骤然下降可能引起心动过缓甚至心脏停搏。

使用本品疗程一般不超过7天。

已经证实，配制好的溶液化学和物理稳定性为15-25℃时50小时。从微生物学角度来看，配制好的溶液应立即使用。如果不能立即使用，使用者应对贮存的时间和条件负责。

本品含有丙二醇：

本品每10ml注射液中含有1000mg丙二醇，相当于每1ml注射液100mg丙二醇。

除非医生建议，否则在怀孕或哺乳期间不得使用本品。

如果您患有肝脏或肾脏疾病，则不得使用本品，除非医生建议。

本品不应该给5岁以下的儿童使用。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

哺乳期妇女禁用。

对于孕妇，仅在绝对必要的情况下方可使用本品。目前尚无资料说明本品在妊娠期前6个月使用的安全性，妊娠后期三个月使用的资料亦很有限。

【儿童用药】

目前尚缺乏儿童使用本品的资料。

【老年用药】

老年患者须谨慎使用降压药，且初始剂量宜小，因为他们对药物的敏感性有时难以估计。

【药物相互作用】

若患者同时使用 α 受体阻断剂、血管舒张剂或其他抗高血压药物；饮酒或病人存在血容量不足的情况（如腹泻、呕吐），可增强本品的降压作用。同时使用西咪替丁可使本品的血药浓度上升，最高达15%。

由于目前还没有足够的与ACE抑制剂合用的信息，所以目前暂不推荐这种联合疗法。

【药物过量】

药物过量的症状包括：

- 循环系统症状：头晕、直立性低血压、虚脱
- 中枢神经系统症状：疲劳、反应迟钝

药物过量的治疗：

发生严重低血压可抬高下肢，补充血容量。如果无效，可缓慢静脉注射缩血管药物，不断监测血压变化。极少数病例需给予儿茶酚胺（例如肾上腺素0.5-1.0mg，用等渗氯化钠溶液稀释至10ml）。

【临床药理】

药效学

药物治疗学分类：抗肾上腺素药物，外周作用， α 肾上腺素受体拮抗剂。

ATC编号：C02CA06。

乌拉地尔通过降低外周阻力来降低收缩压和舒张压。心率基本保持不变。

药代动力学

静脉注射乌拉地尔后，在体内分布呈二室模型，分布相半衰期约为35分钟。分布容积0.8（0.6-1.2）L/Kg。血浆清除半衰期为2.7（1.8-3.9）小时，蛋白结合率80%。乌拉地尔主要在肝脏代谢，主要代谢产物为苯基4位羟基化乌拉地尔，无明显的降压作用；另一种代谢产物为O-去甲基乌拉地尔，可以产生和乌拉地尔大致相同的生物活性，但量很少。50-70%的乌拉地尔通过肾脏排泄，其余由胆道排出。排泄物中约10%为药物原形，其余为代谢产物。主要代谢物为无抗高血压活性的药物羟化形式。

【药理毒理】

药理作用：

盐酸乌拉地尔具有中枢和外周双重的作用机制。在外周，它可阻断突触后 α_1 受体、抑制儿茶酚胺的缩血管作用，从而降低外周血管阻力和心脏负荷；在中枢，通过兴奋5-羟色胺-1A受体，调整循环中枢的活性，防止因交感反射引起的血压升高及心率加快。

毒理研究：

急性毒性研究表明：动物（小鼠、大鼠、兔、狗）应用本品后的LD50与人类每日治疗剂量之比，在静脉注射后为70-180倍；在静脉点滴后为100-840倍；口服给药后为610-870倍。

慢性毒性研究未发现致畸、致癌及致突变作用。

通过对大鼠和小鼠所做的实验表明，本品可提高动物催乳素的水平，刺激乳房组织的生长。但人类使用推荐的治疗剂量后无上述效应。根据药物作用机制的研究，本品不会使人类激素调节异常。

【贮藏】

不超过25℃保存。

不要使用过期的药物。药品放在儿童够不到的地方。

【包装】

中硼硅玻璃安瓿，5支/盒

【有效期】

24个月

【执行标准】

YBH07022023

【批准文号】

国药准字H20233621

【上市许可持有人】

名称：江西科睿药业有限公司

注册地址：江西省赣州市章贡区青峰大道188号

邮政编码：341000

电话号码：400-0797-096（销售）400-0797-606（质量）

【生产企业】

企业名称：江西青峰药业有限公司

生产地址：江西省赣州市沙河工业园

邮政编码：341000

电话号码：400-882-6066（销售）0797-7020096（质量）

传真号码：0797-5560615