

硫酸沙丁胺醇口服溶液说明书

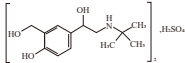
请仔细阅读说明书并在医师指导下使用
严禁用于食品和饲料加工

【药品名称】

通用名称：硫酸沙丁胺醇口服溶液
英文名称：Salbutamol Sulfate Oral Solution
汉语拼音：Liusuan Shading'anchun Koufufurongye

【成份】

本品活性成份为硫酸沙丁胺醇。
分子量：576.70
辅料：无水枸橼酸、枸橼酸钠、苯甲酸钠、羟丙甲纤维素、三氯蔗糖、氯化钠、柠檬香精和纯化水。



分子式：(C₁₃H₂₁NO₃)₂·H₂SO₄

分子量：576.70

本品为无色的澄清液体，气香、味甜。

【性状】

本品为无色的澄清液体，气香、味甜。

【适应症】

用于支气管哮喘或喘息型支气管炎等伴有支气管痉挛的呼吸道病。

【规格】

150ml：60mg (按 C₁₃H₂₁NO₃ 计)

【用法用量】

给药剂量可以根据患者的年龄和症状进行调整，通常推荐剂量为：

- 成人和12岁以上青少年：口服，一次2~4mg，一日3次。
- 6至12岁儿童：口服，一次2mg，一日3次。
- 2至6岁儿童：口服，一次1~2mg，一日3次。
- 1至2岁儿童：口服，一次0.8~1.2mg，一日3次。
- 1岁以下儿童：口服，一次0.4~0.8mg，一日3次。

【不良反应】

按系统器官类别和频率列出不良反应事件，频率定义为：非常常见 (≥1/10)、常见 (≥1/100 且 <1/10)、不常见 (≥1/1000 且 <1/100)、罕见 (≥1/10,000 且 <1/1000) 和非常罕见 (<1/10,000)，包括个别报告。非常常见和常见的事件一般是根据临床试验数据确定的。罕见、非常罕见和未知事件一般根据自发数据确定。

免疫系统疾病

非常罕见：过敏反应，包括血管性水肿、荨麻疹、支气管痉挛、低血压和昏厥。

代谢和营养障碍

罕见：低钾血症
β受体激动剂治疗可能会导致严重的低钾血症。

神经系统疾病

非常常见：震颤
常见：头痛
非常罕见：多动症。

心脏疾病

常见：心动过速、心悸。
罕见：心悸失常，包括心房颤动、室上性心动过速和期外收缩
未知：心肌缺血*
*在上市后数据中自发报告，因此频率被视为未知

血管疾病

罕见：外周血管扩张。
肌肉骨骼和结缔组织疾病
常见：肌肉痉挛。

非常罕见：感觉肌肉紧张。
不良反应报道

如果出现不良反应，请咨询医生、药剂师或护士。包括本说明书中未列出的任何可能的副作用。

通过报告副作用，可以帮助提供更多有关该药物安全性的信息。

【禁忌】

对本品成分有过敏史的患者禁用。

【注意事项】

1. 慎重给药 (以下患者慎重给药)

- (1) 甲亢患者 (通过促进甲状腺激素分泌，有可能使症状恶化)
- (2) 高血压患者 (由于α受体和β₂受体的作用，有可能使血压上升)
- (3) 有心脏病疾病的患者 (由于β₂受体的作用，有可能使症状恶化)
- (4) 糖尿病患者 (由于糖原分解，有可能使症状恶化)

2. 重要预防措施

- (1) 如果正确使用本品无预期效果时，则认为不适用本品，建议停止使用。给儿童服用时，请给出正确的使用说明，并仔细观察进展情况。
- (2) 如果持续过量使用，可能出现心律不齐，在某些情况下有心脏骤停的危险，注意不要过量使用。

3. 其他注意事项

- (1) 对其他肾上腺素受体激动剂过敏者可能对本品呈交叉过敏。
- (2) 长期使用可形成耐药性，不仅疗效降低，且有加重哮喘的危险。
- (3) 运动员慎用。

哮喘治疗通常应循序渐进，应通过临床和肺功能测试监测患者的反应。对于对沙丁胺醇无反应的持续性哮喘患者，建议使用吸入皮质类固醇治疗，以达到并维持病情控制。使用沙丁胺醇治疗无效可能意味着需要紧急就医或接受治疗。

越来越多地使用短效β₂受体激动剂来控制症状表明哮喘控制正在恶化。在这些情况下，应重新评估患者的治疗。哮喘控制突然和进行性恶化可能危及生命，应考虑开始或增加皮质类固醇治疗。对于被认为有高风险的患者，可进行每日峰值流量监测。

应提醒患者，如果通常的缓解效果减弱或作用持续时间缩短，不应自行增加剂量或给药频率，而应寻求医疗建议。

支气管扩张剂不应该是严重或不稳定哮喘患者的唯一或主要治疗方法。由于患者的生命可能面临风险，严重的哮喘需要定期进行医疗监测。重症哮喘患者症状持续，病情加重，体力下降，呼气流量峰值低于基线的60%，变异性超过30%。通常，这些患者在使用支气管扩张剂后不会完全恢复正常。这些患者需要大剂量吸入皮质类固醇治疗 (例如，>1mg/天，丙酸倍氯米松) 或口服皮质类固醇治疗。

沙丁胺醇会导致外周血管扩张，从而可能引起反射性心动过速和心输出量增加。心绞痛、严重心动过速或甲状腺毒症患者应慎用。

使用β₂-激动剂治疗可能导致潜在的严重低钾血症，主要是在胃肠外给药和雾化给药后。建议在严重急性哮喘中特别小心，因为与黄嘌呤衍生物、类固醇、利尿剂和缺氧同时治疗可能会增强这种作用。建议在这种情况下监测血清钾水平。

据报道，与高治疗剂量的静脉内和吸入短效β₂受体激动剂相关的乳酸酸中毒病例非常罕见，主要发生在接受哮喘急性发作治疗的患者中。

与其他β肾上腺素受体激动剂一样，硫酸沙丁胺醇口服溶液也会引起可逆的代谢变化，例如血糖水平升高。糖尿病患者可能无法对此进行补偿，并有酮症酸中毒的报道。同时服用皮质类固醇会加剧这种效应。

乳酸水平升高可能导致呼吸困难和代偿性过度通气，这可能被误解为哮喘治疗失败的征兆，并导致短效β₂受体激动剂治疗的不当增加。因此，建议监测患者血清乳酸水平升高和随之而来的代谢性酸中毒的出现。

任何拟交感神经药物 (包括沙丁胺醇) 都可能对心血管产生影响。有一些关于沙丁胺醇相关心肌缺血的上市后数据和科学文献。正在接受沙丁胺醇治疗的患有严重潜在心脏病 (例如心脏病、心律失常或严重心力衰竭) 的患者如果出现胸痛或其他心脏病恶化的症状，应建议就医。应仔细评估呼吸困难和胸痛等状况，因为它们可能来自

呼吸系统和心脏。

本品每 5ml 中含有 8.5mg 苯甲酸钠。苯甲醇与严重副作用的风险有关，包括胎儿的呼吸问题（称为“喘息综合征”）。苯甲醇可能会引起过敏反应。肝脏或肾脏疾病患者、孕妇或哺乳期患者应注意，大量苯甲醇会在体内积累，并可能导致代谢性酸中毒。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

怀孕

只有当对母亲的预期益处大于对胎儿可能造成的风险时，才应考虑在怀孕期间用药。

沙丁胺醇已在人类中广泛使用多年，没有出现严重的不良反应；这表明其在早孕治疗中的应用已得到广泛认可。然而，与大多数药物一样，几乎没有公开发表的证据表明它在人类妊娠早期阶段的安全性，但在动物实验中，有证据表明在非常高的剂量水平下，这种药物会对胎儿产生一些有害影响。

在全球销售期间，曾有报告称，接受沙丁胺醇治疗的患者中的后代出现了各种先天畸形畸形的罕见病例，包括腭裂和肢体缺陷。其中一些母亲在怀孕期间服用了多种药物。由于无法辨别一致的缺陷模式，并且先天性畸形的基线率为 2-3%，因此无法确定其与使用沙丁胺醇的关系。

哺乳

由于沙丁胺醇可能分泌到母乳中，因此不建议哺乳期妇女使用，除非预期的益处大于任何潜在风险。

目前尚不清楚沙丁胺醇是否会对新生儿产生有害影响。

生育

没有关于沙丁胺醇对人类生育能力影响的信息。对动物的生育能力没有不良影响。

【儿童用药】见【用法用量】。

【老年用药】观察患者状况，慎用（一般老年人生理功能下降）。

【药物相互作用】

药名名称	临床症状/治疗	机制/风险因素
儿茶酚胺 肾上腺素 异丙肾上腺素等	可能会引起心律失常，在某些情况下有心脏骤停的危险。	与肾上腺素、盐酸异丙肾上腺素等儿茶酚胺合用，肾上腺素能增加神经的刺激，这可能会导致心律失常。
黄嘌呤衍生物、 类固醇、利尿剂	可能会引起低钾血症相关的心律不齐、监测钾水平。	黄嘌呤衍生物，增加肾上腺素能刺激神经，加强钾水平下降。类固醇和利尿剂具有在肾小管促进钾排泄，加强低钾水平下降。

通常不应同时使用沙丁胺醇和普萘洛尔等非选择性β-受体阻滞剂。

使用单胺氧化酶抑制剂（MAOIs）治疗的患者不禁用沙丁胺醇，但服乙哌、利血平、甲基多巴和三环类抗抑郁药可能会改变沙丁胺醇的作用。

应谨慎同时使用氯仿、丙烷、氟烷和其他卤代烃等麻醉剂。

【药物过量】

体征、症状：

最常见的过量临床症状为一次过性β受体作用介导的症状（参见【注意事项】以及【不良反应】项），因可出现低钾血症，因此必须监测血钾。

因有报告称，在国外过剂量的吸入剂或注射剂用药时，会出现包括乳酸中毒的代谢性酸中毒，因此应密切观察呼吸状况以及患者的状态。另外，小儿过量使用口服制剂时，报告有恶心、呕吐以及高血糖等症。

处理：

应考虑停用本品，对于出现有心血管系统病症（心率增快、心悸等）患者，应考虑给予心脏选择性β受体阻滞剂者，进行适宜处理。但是，在使用β受体阻滞剂时，对有支气管痉挛病史的患者必须密切注意。

【药理毒理】

药理作用

沙丁胺醇为β₂肾上腺素能受体激动剂。激动呼吸道平滑肌上β₂肾上腺素能受体可激活腺苷酸环化酶，增加细胞内3',5'-环磷酸腺苷（cAMP）的浓度，cAMP增加可激活蛋白激酶A，抑制肌球蛋白的磷酸化，降低细胞内钙离子浓度，导致平滑肌舒张。沙丁胺醇可舒张从气管到末端细支气管所有呼吸道平滑肌。作为功能性拮抗剂，沙丁胺醇可抑制不同原因引起的支气管收缩，cAMP浓度增加还与呼吸道中肥大细胞释放介质有关。

虽然人心中主要是β₁肾上腺素能受体，但β₂肾上腺素能受体也占β肾上腺素能受体的10%-50%，因此选择性β₂激动剂理论上也可引起心血管效应。

毒理研究

遗传毒性

硫酸沙丁胺醇的 Ames 试验、人外周血淋巴细胞试验以及 AH1 小鼠微核试验结果均为阴性。

生殖毒性

大鼠经口给药剂量达 50mg/kg（按体表面积换算，相当于成人临床推荐最大剂量的 40 倍）时，未见对生育力和早期胚胎发育的影响。

妊娠小鼠皮下注射硫酸沙丁胺醇可见腭裂发生率增加（按体表面积换算，低于成人临床推荐最大剂量）。妊娠兔经口给予硫酸沙丁胺醇 50mg/kg（按体表面积换算，约为成人临床推荐最大剂量的 80 倍），7/19 胚胎可见颅裂。妊娠大鼠经口给予放射性硫酸沙丁胺醇，放射性可通过胎盘屏障。

致癌性

大鼠 2 年致癌性试验中，通过饮食经口给予硫酸沙丁胺醇 2mg/kg 及以上剂量时（按体表面积换算，约为临床最大推荐剂量的 1.5 倍），可剂量依赖性增加卵巢良性平滑肌瘤发生率；在另一研究中，卵巢良性平滑肌瘤发生率增加效应可被非选择性β肾上腺素能拮抗剂普萘洛尔所阻断。CD-1 小鼠的 18 个月致癌性试验通过饮食经口给予硫酸沙丁胺醇的剂量达 500mg/kg（按体表面积换算，约为临床最大推荐剂量的 200 倍），黄金仓鼠的 22 个月致癌性试验通过饮食经口给予硫酸沙丁胺醇的剂量达 50mg/kg 时（按体表面积换算，约为临床最大推荐剂量的 20 倍），均未发现致癌性。

其它毒性

硫酸沙丁胺醇静脉注射后可通过血脑屏障，大脑浓度为血浆浓度的 5%；血脑屏障外的其它组织（松果体、垂体）中，沙丁胺醇浓度为全脑浓度的 100 倍。动物试验（小型猪、啮齿动物和大鼠）中，β激动剂和甲基黄嘌呤联用可诱导心律失常和猝死（组织病理学检查可见心肌坏死），临床相关性尚不明确。

【药代动力学】

静脉注射沙丁胺醇的半衰期为 4 至 6 小时，部分经肾脏清除，部分经代谢生成无活性的 4'-O-硫酸盐（酚硫酸盐），后者也主要经尿液排出。粪便为次要的排泄途径。静脉注射、口服或吸入的沙丁胺醇大部分会在 72 小时内排出体外。沙丁胺醇与血浆蛋白的结合率为 10%。

口服给药后，沙丁胺醇从胃肠道吸收，并经过大量的首过代谢成酚类硫酸盐。未改变的药物和结合物均主要通过尿液排出。

口服沙丁胺醇的生物利用度约为 50%。

【贮藏】

遮光，密封，不超过 25℃ 保存。请将本品放在儿童不能接触的地方。

【包装】

口服液体药用高密度聚乙烯含热封垫片瓶。配备口服给药器。150ml/瓶，1 瓶/盒。

【有效期】

24 个月。
首次开启后使用期限为 1 个月，并且不得超出本品的药品有效期。

【执行标准】YBH15812025

【批准文号】国药准字 H20254838

【上市许可持有人】

名称：浙江高拓医药科技股份有限公司
注册地址：浙江省杭州市钱塘区下沙街道银海科创中心 20幢 101 室
邮政编码：310018
联系方式：0571-88885280

【生产企业】

企业名称：浙江赛默制药有限公司
生产地址：浙江省金华市婺城区汤溪镇水湖街 788 号
邮政编码：321075
联系方式：0579-88970118