

核准日期: 2006年10月27日
修改日期: 2008年06月05日
2010年09月11日
2011年02月11日
2011年12月29日
2013年01月29日
2020年11月30日
2024年10月28日



皇隆®

注射用呋塞米说明书

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: 注射用呋塞米

英文名称: Furosemide for Injection

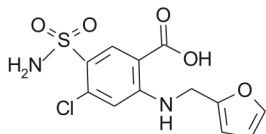
汉语拼音: Zhushuyong Fusaimi

【成份】本品主要成份为呋塞米。

化学名称: 2-[(2-呋喃甲基)氨基]-5-(磺酰基)-4-氧苯甲

酸。

化学结构式:



分子式: $C_{12}H_{11}ClN_2O_5S$

分子量: 330.75

辅料: 甘露醇、氢氧化钠

【性状】本品为白色或类白色疏松块状物或粉末。

【适应症】

1、水肿性疾病 包括充血性心力衰竭、肝硬化、肾脏疾病(肾炎、肾病及各种原因所致的急、慢性肾功能衰竭),尤其是应用其它利尿药效果不佳时,应用本类药物仍可能有效。与其它药物合用治疗急性肺水肿和急性脑水肿等。

2、高血压 在高血压的阶梯疗法中,不作为治疗原发性高血压的首选药物,但当噻嗪类药物疗效不佳,尤其当伴有肾功能不全或出现高血压危象时,本类药物尤为适用。

3、预防急性肾功能衰竭 用于各种原因导致肾脏血流灌注不足,例如失水、休克、中毒、麻醉意外以及循环功能不全等,在纠正血容量不足的同时及时应用,可减少急性肾小管坏死的机会。

4、高钾血症及高钙血症。

5、稀释性低钠血症 尤其是当血钠浓度低于120mmol/L时。

6、抗利尿激素分泌过多症(SIADH)。

7、急性药物中毒中毒 如巴比妥类药物中毒等。

【规格】(1)20mg (2)40mg

【用法用量】用氯化钠注射液溶解后,静脉注射或静脉滴注。

1、成人

(1)治疗水肿性疾病。紧急情况或不能口服者,可静脉注射,开始20~40mg,必要时每2小时追加剂量,直至出现满意疗效。维持用药阶段可分次给药。治疗急性左心衰竭时,起始40mg静脉注射,必要时每小时追加80mg,直至出现满意疗效。治疗急性肾功能衰竭时,可用200~400mg加于氯化钠注射液100ml内静脉滴注,滴注速度每分钟不超过4mg。有效者可按原剂量重复应用或酌情调整剂量,每日总剂量不超过1g。利尿效果差时不宜再增加剂量,以免出现肾毒性,对急性肾衰功能恢复不利。治疗慢性肾功能不全时,一般每日剂量40~120mg。

(2)治疗高血压危象时,起始40~80mg静脉注射,伴急性左

心衰竭或急性肾功能衰竭时,可酌情增加剂量。

(3)治疗高钙血症时,可静脉注射,一次20~80mg。

2、小儿

治疗水肿性疾病,起始按1mg/kg静脉注射,必要时每隔2小时追加1mg/kg。最大剂量可达每日6mg/kg。新生儿应延长用药间隔。

【不良反应】

常见者与水、电解质紊乱有关,尤其是大剂量或长期应用时,如体位性低血压、休克、低钾血症、低氯血症、低氯性碱中毒、低钠血症、低钙血症以及与此有关的口渴、乏力、肌肉酸痛、心律失常等。

少见者有过敏反应(包括皮疹、间质性肾炎、甚至心脏骤停)、视觉模糊、黄视症、光敏感、头晕、头痛、纳差、恶心、呕吐、腹痛、腹泻、胰腺炎、肌肉强直等,骨髓抑制导致粒细胞减少、血小板减少性紫癜和再生障碍性贫血、肝肾功能损害、指(趾)感觉异常、高糖血症、糖尿病性、原有糖尿病加重,高尿酸血症。

耳鸣、听力障碍多见于大剂量静脉快速注射时(每分剂量大于4~15mg),多为暂时性,少数为不可逆性,尤其当与其它有耳毒性的药物同时应用时。

在高钙血症时,可引起肾结石。

尚有报道本药可加重特发性水肿。

【禁忌】

尚不明确。

【注意事项】

1、交叉过敏:对磺胺药和噻嗪类利尿药过敏者,对本药可能亦过敏。

2、对诊断的干扰:可致血糖升高、尿糖阳性,尤其是糖尿病或糖尿病前期患者。过度脱水可使血尿酸和尿素氮水平暂时性升高。血 Na^+ 、 Cl^- 、 K^+ 、 Ca^{2+} 和 Mg^{2+} 浓度下降。

3、下列情况慎用

①无尿或严重肾功能损害者,后者因需加大剂量,故用药间隔时间应延长,以免出现耳毒性等副作用;

②糖尿病;

③高尿酸血症或有痛风病史者;

④严重肝功能损害者,因水电解质紊乱可诱发肝昏迷;

⑤急性心肌梗死,过度利尿可促发休克;

⑥胰腺炎或有此病史者;

⑦有低钾血症倾向者,尤其是应用洋地黄类药物或有室性心律失常者;

⑧红斑狼疮,本药可加重病情或诱发活动;

⑨前列腺肥大。

4、用药期间的随访检查

①电解质,尤其是合用洋地黄类药物或皮质激素类药物、肾功能损害者;

②血压,尤其是用于降压、大剂量应用或用于老年人;

③肾功能;

④肝功能;

⑤血糖;

⑥血尿酸;

⑦酸碱平衡情况;

⑧听力。

5、给药剂量应从最小有效剂量开始,然后根据利尿反应调整剂量,以减少水、电解质紊乱等不良反应的发生。

6、肠道外用宜静脉给药,不主张肌肉注射。常规剂量静脉注射时间应超过1~2分钟,大剂量静脉注射时每分钟不超过4mg。静脉用药剂量为口服用药剂量的1/2时即可达到同样疗效。

7、本品为钠盐注射液,碱性较高,故静脉注射时用氯化钠注射液稀释,而不宜用葡萄糖注射液稀释。

8、存在低钾血症或低钾血症倾向时,应注意补充钾盐。

9、与降压药合用时,后者剂量应酌情调整。

10、少尿或无尿患者应用最大剂量后24小时仍无效时应停药。

11、运动员慎用。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

1、本药可通过胎盘屏障,孕妇尤其是妊娠前3个月应尽量避免应用。对妊娠高血压综合征无预防作用。动物实验表明本品可致胎仔肾盂积水,流产和胎仔死亡率升高。

2、本药可经乳汁分泌,哺乳期妇女应慎用。

【儿童用药】

本药在新生儿的半衰期明显延长,故新生儿用药间隔应延长。

【老年用药】

老年人应用本药时发生低血压、电解质紊乱、血栓形成和肾功能损害的机会增多,应慎用。

【药物相互作用】

1、肾上腺糖、盐皮质激素、促肾上腺皮质激素及雌激素能降低本药的利尿作用,并增加电解质紊乱尤其是低钾血症的发生机会。

2、非甾体类消炎镇痛药能降低本药的利尿作用,肾损害机会也增加,这与前者抑制前列腺素合成,减少肾血流量有关。

3、与拟交感神经药物及抗惊厥药物合用,利尿作用减弱。

4、与氧贝丁酯(安妥明)合用,两药的作用均增强,并可出现肌肉酸痛、强直。

5、与多巴胺合用,利尿作用加强。

6、饮酒及含酒精制剂和可引起血压下降的药物能增强本药的利尿和降压作用;与巴比妥类药物、麻醉药合用,易引起体位性低血压。

7、本品可使尿酸排泄减少、血尿酸升高,故与治疗痛风的药物合用时,后者的剂量应作适当调整。

8、降低降血糖药的疗效。

9、降低抗凝药物和抗纤溶药物的作用,主要是利尿后血容量下降,致血中凝血因子浓度升高,以及利尿使肝血液供应改善、肝脏合成凝血因子增多有关。

10、本品可加强非去极化肌松药的作用,与血钾下降有关。

11、与两性霉素、头孢菌素、氨基糖苷类等抗生素合用,肾毒性和耳毒性增加,尤其是原有肾损害时。

12、与抗组胺药物合用时耳毒性增加,易出现耳鸣、头晕、眩晕。

13、与锂合用肾毒性明显增加,应尽量避免。

14、服用水合氯醛后静注本药可致出汗、面色潮红和血压升高,此与甲状腺素由结合状态转为游离状态增多,导致分解代谢加强有关。

15、与碳酸氢钠合用发生低氯性碱中毒机会增加。

【药物过量】

未进行该项实验且无可靠参考文献。

【药理毒理】

1、对水和电解质排泄的作用。

能增加水、钠、氯、钾、钙和镁等的排泄。主要通过抑制肾小管髓样厚壁段对 $NaCl$ 的主动重吸收,结果管腔液 Na^+ 、 Cl^- 浓度升高,而髓质间液 Na^+ 、 Cl^- 浓度降低,使渗透压梯度差降低,肾小管浓缩功能下降,从而导致水、 Na^+ 、 Cl^- 排泄增多。由于 Na^+ 重吸收减少,远端小管 Na^+ 浓度升高,促进 Na^+ - K^+ 和 Na^+ - H^+ 交换增加, K^+ 和 H^+ 排出增多。至于呋塞米抑制肾小管髓样厚壁段重吸收 Cl^- 的机制,过去曾认为该部位存在氯泵,目前研究表明该部位基底膜外侧存在与 Na^+ - K^+ ATP酶有关的 Na^+ 、 Cl^- 配体转运系统,呋塞米通过抑制该系统有关 Na^+ 、 Cl^- 的重吸收。另外,呋塞米可能尚能抑制近端小管和远端小管对 Na^+ 、 Cl^- 的重吸收,促进远端小管分泌 K^+ 。呋塞米通过抑制亨利祥对 Ca^{2+} 、 Mg^{2+} 的重吸收而增加 Ca^{2+} 、 Mg^{2+} 排泄。短期用药能增加尿酸排泄,而长期用药则可引起高尿酸血症。

2、对血流动力学的影响

呋塞米能抑制前列腺素的分解,使前列腺素E₂含量升高,从而具有扩张血管作用。扩张肾血管,降低肾血管阻力,增加肾血流量,增加髓质部的血流供应,但对肾小球的滤过率无影响。呋塞米还能减少充血性心力衰竭患者的肺充血和降低左室充盈压。

【药代动力学】

口服吸收率为60%~70%,进食者能减慢吸收,但不影响吸收率及其疗效。终末期肾脏病患者的口服吸收率降至43%~46%。充血性心力衰竭和肾功能综合征等水肿性疾病时,由于肠壁水肿,口服吸收率也下降,故在上述情况应肠外途径用药。

主要分布于细胞外液,分布容积平均为体重的11.4%,血浆蛋白结合率为91%~97%,几乎均与白蛋白结合。本药能通过胎盘屏障,并可泌入乳汁中。口服和静脉用药后作用开始时间分别为30~60分钟和5分钟,达峰时间为1~2小时和0.33~1小时。作用持续时间分别为6~8小时和2小时。 $T_{1/2\alpha}$ 存在较大的个体差异,正常人为30~60分钟,无尿患者延长至75~155分钟,肾功能同时严重受损者延长至11~20小时。新生儿由于肝肾清除能力较差, $T_{1/2\alpha}$ 延长至4~8小时。88%以原形经肾脏排泄,肾功能受损者经肾脏代谢增多。本药不被透析清除。

【包装】遮光,密闭保存(10~30℃)。

【贮藏】低硼硅玻璃管制注射剂,10ml/盒。

【有效期】24个月

【执行标准】WS₃-(X-066)-2010Z-2011

【批准文号】(1)20mg; 国药准字H20060659

(2)40mg; 国药准字H20051116

药品上市许可持有人】

名称: 海南皇隆制药股份有限公司

地址: 海南省海口国家高新技术产业开发区药谷三横路8号

【生产企业】

企业名称: 海南皇隆制药股份有限公司

生产地址: 海南省海口国家高新技术产业开发区药谷三横路8号

邮政编码: 570311

电话号码: 0898-68616800

传真号码: 0898-68616811

网址: http://www.hnhuanglong.com