

核准日期:2025年02月11日

修改日期:2025年04月27日



巧乐托林®

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

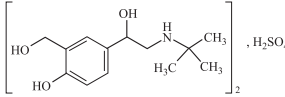
英文名称:Salbutamol Sulfate Oral Solution

汉语拼音:Liusuan Shading' anchun Koufufurongye

【成份】本品活性成份为硫酸沙丁胺醇。

化学名称:4-羟基- α' -(叔丁氨基)甲基-1, 3-苯二甲醇硫酸盐

化学结构式:



分子式: $(C_{13}H_{21}NO_3)_2 \cdot H_2SO_4$

分子量:576.70

辅料:羟丙甲纤维素, 枸橼酸钠, 枸橼酸, 苯甲酸钠, 三氯蔗糖, 氯化钠, 香橙香精, 纯化水

【性状】本品为无色至淡黄色的澄清液体, 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】5ml:2mg (按 $C_{13}H_{21}NO_3$ 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2 mg, 一日3次。

2至6岁儿童:口服, 一次1~2 mg, 一日3次。

【不良反应】原研产品7275例临床研究中, 报告不良反应65例(0.89%), 主要有心悸(0.27%)、头痛(0.19%)、震颤(0.19%)等。

(1) 严重不良反应

血清钾水平严重下降(发生率未知):据报道, β_2 -激动剂会严重降低血清钾水平。此外, β_2 -兴奋剂降低血钾的作用可能因黄嘌呤衍生物、类固醇和利尿剂的联合使用而增强, 故重度哮喘患者应特别注意。此外, 低氧血症可能增强降低血钾对心律的影响。在这种情况下, 需要监测血清钾水平。休克和过敏反应(发生率未知)

(2) 其他不良反应

过敏	0.1~5% (小于5%)	小于0.1%	频率未知
循环系统		皮疹、低血压	瘙痒、血管性水肿、荨麻疹
神经系统	心悸	脉搏增加, 血压波动	心律失常
消化系统	头痛、震颤	困倦	兴奋、下肢疼痛、睡眠障碍、头晕、烦躁
其他		食欲不振、恶心、呕吐、腹泻	
		出汗、湿疹	口干、口腔溃疡、发红、水肿、肌肉痉挛

【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 β_1 受体的作用, 有可能使血压上升)

(3) 有心脏疾病的患者 (由于 β_1 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。越来越多地使用短效 β_2 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。

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, $>1\text{mg}/\text{天}$ 二丙酸倍氯米松) 或口服皮质类固醇治疗。

使用 β_2 -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 β_2 受体激动剂相关的乳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。

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 β_2 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梗死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症状, 因为它们可能来自呼吸系统和心脏。

本品在每5ml中含有8.5mg 苯甲酸钠。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

对妊娠期或者可能处于妊娠期的妇女，仅可经过判断认为治疗获益大于风险时，才可使用本品。【动物实验（小鼠）中报告有致畸作用。】

【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	可能会引起心律不齐、在某些情况	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
肾上腺素 异丙肾上腺素等	下有心脏骤停的危险。	神经的刺激。这可能会导致心律不齐。
黄嘌呤衍生物，类固醇，利尿剂	可能会引起低血钾症相关的心律	黄嘌呤衍生物，增加肾上腺素能刺激神经，加强血钾水平下降。类固
	不齐、监测血钾水平。	醇和利尿剂具有在肾小管促进钾排泄效果，加强血钾水平下降。

【药物过量】

体征、症状：

最常见的过量给药症状是一过性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/小过量使用口服制剂时，报告有恶心、呕吐以及高血糖等症状。

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受体阻滞剂等，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。

虽然人心脏中主要是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胚胎可见腭裂。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），均未见致癌性。

其它毒性

硫酸沙丁胺醇静脉注射后可通过血脑屏障，大脑浓度约为血浆浓度的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、啮齿动物和犬）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】

血液浓度和尿液排泄：在海外的研究表明，2例健康成人口服3H标记的沙丁胺醇10mg，血浆放射性浓度在给药后1~2小时达最高值，然后显示出迅速下降。血中浓度半衰期为1.5至2小时。并且，约给药剂量的90%在给药后24小时内经尿被排泄。

【贮藏】遮光，密封，不超过30℃保存。请将本品放在儿童不能接触的地方。

【包装】口服溶液药用低密度聚乙烯安瓿，外加聚酯/铝/聚乙烯复合膜袋。配有带刻度的量杯。8支/板，1板/袋，1袋/盒，2袋/盒，3袋/盒，4袋/盒。

【有效期】18个月。

拆开复合膜袋后，未使用的安瓿放回复合膜袋中避光保存，并且在一周内使用，逾期丢弃。

单支药品首次开瓶使用后，瓶内剩余的药液应丢弃。

【执行标准】YBH01622025

【批准文号】国药准字H20253364

【上市许可持有人】

名称：安徽四环科宝制药有限公司

注册地址：安徽省阜阳市太和县经济开发区祥和路甲1号

邮政编码：236600

电话号码：0558-8585662

传真号码：0558-8583922

【生产企业】

企业名称：安徽四环科宝制药有限公司

生产地址：安徽省阜阳市太和县经济开发区祥和路甲1号

邮政编码：236600

电话号码：0558-8585662

传真号码：0558-8583922