

核准日期：2019.05.05

修改日期：2020.07.17

盐酸法舒地尔注射液说明书

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：盐酸法舒地尔注射液

英文名称：Fasudil Hydrochloride Injection

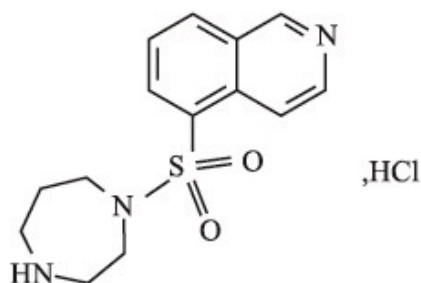
汉语拼音：Yansuan Fashudi'er Zhushuye

【成份】

本品主要成份为盐酸法舒地尔。

化学名称：六氢-1-（5-异喹啉磺酰基）-1（H）-1,4-二氮杂萘盐酸盐

化学结构式：



分子式：C₁₄H₁₇N₃O₂S·HCl

分子量：327.83

辅料：氯化钠、氢氧化钠（或盐酸）、注射用水

【性状】

本品为无色至微黄色的澄明液体。

【适应症】

改善和预防蛛网膜下腔出血术后的脑血管痉挛及引起的脑缺血症状。

【规格】

2ml：30mg

【用法用量】

成人每次 30mg，一日 2~3 次，以 50~100ml 的生理盐水或葡萄糖注射液稀释后静脉点滴，每次静滴时间为 30 分钟。

本品给药应在蛛网膜下腔出血术后早期开始，连用 2 周。

【不良反应】

- 1、有时会出现颅内出血（1.63%）。
- 2、有时会出现消化道出血、肺出血、鼻出血、皮下出血（0.29%）等出血，注意观察，若出现异常，应停药并予以适当处置。
- 3、循环系统：偶见低血压、颜面潮红。

- 4、血液系统：偶见贫血、白细胞减少、血小板减少。
- 5、有时会出现肝功能异常。AST (GOT)、ALT (GPT)、ALP、LDH 升高等。
- 6、泌尿系统：偶见肾功能异常 (BUN、肌酐升高等)、多尿。
- 7、消化系统：腹胀、恶心、呕吐等较少见。
- 8、过敏症：偶见皮疹等过敏症状。
- 9、其它：发热 (偶见)、头痛、意识水平低、呼吸抑制 (少见)。

【禁忌】

下述患者禁用本品：

- 1、出血患者：颅内出血。
- 2、可能发生颅内出血的患者：术中对出血的动脉瘤未能进行充分止血处置的患者。
- 3、低血压患者。

【注意事项】

1、本品只可静脉点滴使用，不可采用其它途径给药。下述患者应慎用：

(1) 术前合并糖尿病的患者、术中在主干动脉有动脉硬化的患者，使用本剂时，应充分观察临床症状及计算机断层摄影，若发现颅内出血，应速停药并予以适当处置；

(2) 肾功能障碍的患者 (例如，1 次 10mg)；

(3) 肝功能障碍的患者 (有可能延迟代谢，使血药浓度升高而增强作用)；

(4) 严重意识障碍的患者 (使用经验少，尚未确立有效性)；

(5) 70 岁以上的高龄患者 (对预后功能的改善可能无效，尚未确立有效性)；

(6) 蛛网膜下腔出血合并重症脑血管障碍 (烟雾病、巨大脑动脉瘤等) 的患者 (无使用经验，尚未确立有效性及安全性)。

2、本品使用时，应密切注意临床症状及 CT 改变，若发现颅内出血，应立即停药并进行适当处理。

3、本品可引起低血压，因此在用药过程中应注意血压变化及给药速度。

4、本品的用药时间为 2 周，不可长期使用。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

妊娠或可能妊娠妇女及哺乳期妇女应避免使用。

【儿童用药】

尚未确立儿童用药的安全性。

【老年用药】

70 岁以上的高龄患者应慎用。

【药物相互作用】

无与本项相关的报告。

【药物过量】

目前尚未收到药物过量的报道。

【药理毒理】

药理作用：

法舒地尔为血管扩张药，能抑制平滑肌收缩最终阶段的肌球蛋白轻链磷酸化使血管扩张。

- 1、脑血管痉挛的缓解及预防作用

向犬颅内两次注入自身血引起迟发性脑血管痉挛，静脉注射给予法舒地尔可缓解脑血管痉挛。早期连续给药可预防脑血管痉挛的发生。

2、脑血流改善作用

- (1) 改善犬迟发性脑血管痉挛模型的大脑皮质血流。
- (2) 对两侧颈总动脉闭塞引起的大鼠脑缺血模型，可增加缺血部位的脑局部血流量。
- (3) 对于脑血流量减少的患者，用正电子发射 CT (PAT) 定量测定脑缺血部位的血流量，结果脑血流量增加。

3、脑葡萄糖利用率的改善作用

对两侧颈总动脉闭塞引起的大鼠脑缺血模型，可部分增加脑局部葡萄糖利用率。

4、脑神经细胞损伤的抑制作用

可抑制一过性两侧颈总动脉闭塞引起的沙鼠脑缺血模型的迟发性神经细胞损伤。

5、作用机理 (体外实验)

- (1) 使离体脑血管松弛。
- (2) 抑制因钙离子引起的离体血管的收缩。
- (3) 抑制多种脑血管收缩药物引起的收缩作用。
- (4) 抑制细胞内钙离子导致的血管收缩。此时，不会降低细胞内钙浓度。
- (5) 抑制血管收缩时肌球蛋白轻链磷酸化物的生成。在试管内构成与体内相似条件时，同样出现抑制肌球蛋白轻链磷酸化酶的效果。

毒理研究：

重复给药毒性：大鼠、猴分别静脉内给药 6 个月，主要毒性表现为自主活动减少、腹卧位。本品的毒性靶器官为肾脏，可见肾脏重量增加、肾小管变性、间质水肿等。无毒剂量大鼠为 9 mg/kg，猴为 3.125 mg/kg (以 mg/m² 计分别相当于人临床最大推荐剂量的 1 和 0.69 倍)。

遗传毒性：法舒地尔 Ames 试验、哺乳动物细胞染色体畸变试验、啮齿类动物微核试验结果均为阴性。

生殖毒性：大鼠生育力与早期胚胎发育毒性试验中，静脉给予法舒地尔 1.56、6.25 和 25mg/kg，25mg/kg 组亲代动物体重增加受抑制、黄体数及着床数减少。交配率、受孕率及胚胎发生未见异常，对亲代动物的无毒剂量为 6.25 mg/kg。大鼠胚胎-胎仔发育毒性试验中，静脉给予法舒地尔 1.6、8 和 40 mg/kg，40mg/kg 组母体动物体重增加受抑制、胎仔体重偏低、新生仔体重增加受抑制，未发现对胎仔的致死作用及致畸作用，对子代无毒剂量为 8mg/kg。家兔胚胎-胎仔发育毒性试验中，静脉给予法舒地尔 0.7、2 和 6mg/kg (分别相当于人临床最大推荐剂量的 0.16、0.44 和 1.33 倍)，未见对胚胎发育有显著影响。大鼠围产期毒性试验中，静脉给予法舒地尔 1.6、8 和 40mg/kg，40 mg/kg 组母体动物一般状态不良，新生仔体重增加受抑制，无毒剂量为 8mg/kg。

【药代动力学】

据国外文献资料报道：

健康成人单次 30 分钟内静脉持续给予盐酸法舒地尔 0.4mg/kg 时，血浆中原形药物浓度在给药结束时达峰值，其后迅速衰减，消除半衰期约为 16 分钟。盐酸法舒地尔主要在肝脏

代谢为羟基异喹啉及其络合体。给药后 24 小时内从尿中累积排泄的原形药物及其代谢产物为给药剂量的 67%。

在蛛网膜下腔出血术后的患者，反复静脉滴注盐酸法舒地尔 30mg，1 日 3 次，共 14 日的血浆中浓度变化，与健康成人类似。

【贮藏】 遮光、密闭保存。

【包装】 棕色中硼硅玻璃安瓿，3 支/盒、5 支/盒、6 支/盒、8 支/盒和 10 支/盒。

【有效期】 24 个月

【执行标准】 国家药品监督管理局标准 YBH00982019

【批准文号】 国药准字 H20193118

【生产企业】



企业名称：山东新华制药股份有限公司

生产地址：山东省淄博市高新区鲁泰大道 1 号

邮政编码：255086

电话号码：0533-2196361

传真号码：0533-2196365

网 址：www.xhzy.com

【药品上市许可持有人】

企业名称：山东新华制药股份有限公司

生产地址：淄博市高新技术产业开发区化工区

邮政编码：255000

电话号码：0533-2166666

传真号码：0533-2184991

网 址：www.xhzy.com