**硫酸沙丁胺醇**

文章版本号：4

最后发布时间：2014-6-16 14:23:27

**【药物名称】**

中文通用名称：硫酸沙丁胺醇

英文通用名称：Salbutamol Sulfate

其他名称：爱纳灵、布汾妥茜乐、喘宁碟、喘特宁、达芬科闯、惠百释、康尔贝宁、硫酸阿布叔醇、硫酸舒喘灵、律克、品川、平喘灵、全乐宁、全乐宁乐旋、全宁碟、全特宁、萨姆、赛比舒、沙博特、舒布托、万托林、西倍他、Albuterol Sulfate、Buventol Easyhaler、Etinoline、Salbutamol Sulphate、Ventodisks、Ventolin、Volmax。

**【药理分类】**

呼吸系统用药>>平喘药>>支气管扩张剂>>β2肾上腺素受体激动药

女性生殖系统用药>>子宫松弛药

**【临床应用】**

**CFDA说明书适应症**

1.用于治疗支气管哮喘或哮喘性支气管炎等伴有支气管痉挛的呼吸道疾病。

2.本药吸入气雾剂也可用于预防运动诱发的急性哮喘或其他过敏原诱发的支气管痉挛。

3.本药雾化吸入溶液还可用于常规疗法无效的慢性支气管痉挛及严重的急性哮喘发作。

**其他临床应用参考**

1.用于改善充血性心力衰竭。

2.用于预防高危妊娠早产、先兆流产(吸入剂除外)。

**【用法与用量】**

**成人**

◆常规剂量

·支气管哮喘或哮喘性支气管炎等伴有支气管痉挛的呼吸道疾病

1.口服给药  以沙丁胺醇计：(1)口服常释剂：一次2-4mg，一日3次。(2)口服缓释、控释制剂：一次8mg，一日2次。

2.气雾吸入  一次100μg(1揿)，可根据需要增至200μg(2揿)。

3.粉雾吸入  一次0.2-0.4mg，一日4次。

4.雾化吸入  (1)间歇疗法：一次2.5-5mg，一日4次，从低剂量开始。用注射用生理盐水将0.5ml本药(含2.5mg沙丁胺醇)稀释至2ml或将1ml本药稀释至2.5ml，通过驱动式喷雾器吸入，可维持10分钟喷雾，直至不再有气雾产生为止。部分患者可能需要10mg的较高剂量，可不经稀释而供间歇性使用，将2ml本药(含10mg沙丁胺醇)置于喷雾器中雾化吸入，直至支气管得到扩张为止，通常需3-5分钟。(2)连续疗法：以注射用生理盐水将本药稀释成50-100μg/ml的溶液(1-2ml药液稀释成100ml)，给药速率通常为1-2mg/h。

5.肌内注射  一次0.4mg，必要时4小时可重复注射。

6.静脉注射  一次0.4mg，用5%葡萄糖注射液或生理盐水20ml稀释后缓慢注射。

7.静脉滴注  一次0.4mg，用5%葡萄糖注射液100ml稀释后滴注。

·预防运动诱发的急性哮喘或其他过敏原诱发的支气管痉挛

1.气雾吸入  运动前或接触过敏原前10-15分钟给药。长期治疗时，最大剂量为一次200μg，一日4次。

2.粉雾吸入  一次0.2-0.4mg，一日4次。

◆肾功能不全时剂量

本药主要经肾随尿排泄，故肾功能损害者需减少用量。

◆肝功能不全时剂量

肝功能损害者用药可造成本药的蓄积。

◆老年人剂量

初始剂量应低于推荐的成人剂量，如未达到充分的支气管扩张作用，再逐渐增加剂量。

**儿童**

◆常规剂量

·支气管哮喘或哮喘性支气管炎等伴有支气管痉挛的呼吸道疾病

1.口服给药  以沙丁胺醇计：(1)口服常释剂：一次0.5mg，一日3-4次。(2)口服缓释、控释制剂：一次4mg，一日2次。

2.气雾吸入  同成人用法用量。

3.粉雾吸入  一次0.2mg，一日4次。

4.雾化吸入  (1)间歇疗法：12岁以下儿童的最小起始剂量为将0.5ml本药(含2.5mg沙丁胺醇)用注射用生理盐水稀释至2-2.5ml，部分儿童可能需要增至5mg。间歇疗法可每日重复4次。(2)连续疗法：尚无18个月以下儿童使用本药的研究资料，由于可能发生一过性低氧血症，故应考虑补充氧气疗法。

·预防运动诱发的急性哮喘或其他过敏原诱发的支气管痉挛

1.气雾吸入  同成人用法用量。

2.粉雾吸入  同成人用法用量。

**【国外用法用量参考】**

**成人**

◆常规剂量

·支气管哮喘

1.口服给药  (1)糖浆或片剂：一次2-4mg，一日3-4次，最大日剂量为32mg，分次给药。(2)缓释片：一次4-8mg，每12小时1次，最大日剂量为32mg，分次给药。

2.气雾吸入  (1)急性哮喘恶化：每20分钟4-8次，持续4小时，然后每1-4小时根据需要用药。(2)支气管痉挛：每4-6小时2次或根据需要每4小时1次。

3.雾化吸入  (1)急性哮喘恶化：一次2.5-5mg，每20分钟1次，持续3次，然后每1-4小时根据需要吸入2.5-10mg或每小时10-15mg连续雾化吸入。(2)支气管痉挛：0.083%本药吸入溶液，一次2.5mg(本药3ml)，持续5-15分钟，根据需要给予一日3-4次；0.5%本药吸入溶液，一次2.5mg(本药0.5ml稀释于2.5ml氯化钠溶液中)，持续5-15分钟，根据需要给予一日3-4次。

·预防运动性哮喘

1.气雾吸入  运动前15-30分钟吸入2次。

**儿童**

◆常规剂量

·支气管哮喘

1.口服给药  (1)糖浆：2-6岁儿童，一次0.1mg/kg，一日3次，最大初始剂量为一次2mg，一日3次，最大日剂量为12mg，分次服用；6-12岁儿童，一次2mg，一日3-4次，最大日剂量为24mg，分次服用；12岁以上儿童，同成人用法用量。(2)片剂：6岁及6岁以上儿童，同“糖浆”剂量。(3)缓释片：6-12岁儿童，一次4mg，每12小时1次，最大日剂量为24mg，分次服用；12岁以上儿童，同成人用法用量。

2.气雾吸入  (1)急性哮喘恶化：一次4-8次，每20分钟1次，持续3次，然后每1-4小时根据需要用药。(2)支气管痉挛：同成人用法用量。

3.雾化吸入  (1)急性哮喘恶化：一次0.15mg/kg(最小剂量为2.5mg)，每20分钟1次，连续3次，然后每1-4小时根据需要给予0.15-0.3mg/kg，最大剂量不超过10mg，或每小时0.5mg/kg连续雾化吸入。(2)支气管痉挛：①VENT OLIN(R)，0.083%本药吸入溶液，2岁及2岁以上，且体重大于或等于15kg的儿童，同成人用法用量；0.5%本药吸入溶液，2岁及2岁以上儿童，一次0.1-0.15mg/kg(于氯化钠溶液中稀释成3ml)，可根据需要增加到最大剂量为一次2.5mg，一日3-4次；②ACCUNEB(TM)，2-12岁儿童，一次1.25mg或0.63mg，持续5-15分钟，可根据需要一日3-4次。

·预防运动性哮喘

1.气雾吸入  4岁及4岁以上儿童，同成人用法用量。

**【给药说明】**

**给药方式说明**

1.口服给药  (1)本药缓释及控释制剂应整片吞服，不可咀嚼和咬碎。(2)本药口腔崩解片置于舌面，可迅速崩解，并随唾液吞咽入胃，不可用水送服，不可咀嚼。

2.粉雾吸入  本药粉雾剂的使用方法：临用前，取粉雾吸入用胶囊1粒放入专用吸入器的刺孔槽内，用手指揿压侧按钮，胶囊两端分别被4根细针刺孔，然后将口吸器放入口腔深部，用力吸气，胶囊随着气流产生快速旋转，胶囊中的药粉即喷出胶壳，并随气流进入呼吸道。

3.雾化吸入  本药雾化吸入溶液只供吸入使用，并需配一适宜的雾化器。

**【禁忌症】**

1.对本药或其他肾上腺素受体激动药过敏者。

2.先兆性流产患者禁用本药吸入剂。

**【慎用】**

1.高血压患者。

2.糖尿病患者。

3.心功能不全患者。

4.冠状动脉供血不足者。

5.甲状腺功能亢进患者。

6.肾上腺素受体兴奋药敏感者(应从小剂量开始使用)。

7.心律不齐患者。

8.惊厥患者。

9.青光眼患者(国外资料)。

10.低钾血症患者(国外资料)。

11.癫痫患者(国外资料)。

12.嗜铬细胞瘤患者(国外资料)。

13.有动脉瘤病史者(国外资料)。

14.特发性主动脉瓣肥厚性狭窄患者(国外资料)。

15.老年人。

**【特殊人群】**

**儿童**

4岁以下儿童使用本药气雾剂应戴防护面罩。

**老人**

1.因本药对β1-肾上腺素受体作用较小且作用时间长，可使用β-肾上腺素受体激动药的老年患者宜使用本药。本药口腔崩解片适用于吞咽困难的老年患者使用。

2.老年人慎用本药，如使用，应从小剂量开始。

**妊娠期妇女**

1.动物试验显示，本药可致畸胎，且β2-肾上腺素受体激动药可舒张子宫平滑肌，故妊娠期妇女用药应权衡利弊。

2.本药可通过胎盘，虽有安胎作用，但有妊娠期妇女通过口服或静脉使用本药引起高糖血症，而继发胎儿心动过速和胎儿低血糖症的报道。

3.美国食品和药品管理局(FDA)对本药的妊娠安全性分级为C级。

**哺乳期妇女**

本药可能随乳汁排泄，哺乳期妇女用药应权衡利弊。

**特殊疾病状态**

1.心律不齐、高血压、心力衰竭患者：β-肾上腺素受体激动药可引起血压升高、心跳加速和中枢神经系统刺激或兴奋。β2-肾上腺素受体激动药同样可增加心律失常的风险，故以上患者慎用。

2.糖尿病患者：β2-肾上腺素受体激动药可增加血糖浓度，故此类患者慎用。

3.青光眼患者：本药可增加眼内压，故此类患者慎用。

4.甲状腺功能亢进患者：本药可能促进甲状腺活动，故此类患者慎用。

5.低钾血症患者：β2-肾上腺素受体激动药可降低血钾浓度，故此类患者慎用。

6.癫痫患者：β2-肾上腺素受体激动药可导致中枢神经系统刺激或兴奋，故此类患者慎用。

**【不良反应】**

1.心血管系统  较常见心悸，也可见血压波动、心率加快，偶见高血压，罕见外周血管舒张，极罕见心律失常(包括房颤、室上性心动过速、期前收缩)。

2.代谢/内分泌系统  β2-肾上腺素受体激动药可能引起严重的低钾血症。在本药静脉内和雾化治疗哮喘急性加重的患者中，极罕见乳酸性酸中毒的报道。

3.呼吸系统  罕见异常支气管痉挛。

4.肌肉骨骼系统  较常见肌肉痉挛及骨骼肌震颤。有注意缺陷多动障碍的极个别报道。

5.神经系统  常见头痛、震颤，较少见头晕、目眩，罕见亢进。

6.精神  可见失眠、心烦。

7.胃肠道  常见恶心，偶见口干、呕吐，较少见口咽刺激感。

8.皮肤  偶见颜面潮红等。

9.过敏反应  极罕见过敏反应(包括血管神经性水肿、荨麻疹、支气管痉挛、低血压、虚脱、肌肉痉挛)的报道。

10.其他  长期用药可形成耐受性，不仅疗效降低，还可能使哮喘加重。

**【药物相互作用】**

**药物-药物相互作用**

1.其他肾上腺素受体激动药、茶碱类药物：

结果：合用可增强对支气管平滑肌的松弛作用，但也可增加不良反应。

2.单胺氧化酶抑制药、三环类抗抑郁药、抗组胺药、左甲状腺素：

结果：以上药物可增强本药对心血管系统的不良反应。

3.泮库溴铵、维库溴铵：

结果：本药可增强以上药物引起的神经肌肉阻滞的程度。

4.皮质类固醇、利尿药：

结果：合用可加重血钾浓度降低的程度。

5.洋地黄类药：

结果：合用可增加洋地黄类药诱发心律失常的危险性。

6.氟烷：

结果：在产科手术中合用，可加重子宫收缩无力，导致大出血。

7.β-肾上腺素受体阻断药(如普萘洛尔)：

结果：β-肾上腺素受体阻断药可拮抗本药的支气管扩张作用。

处理：两者不宜合用。

8.磺胺类药物：

结果：合用可降低磺胺类药物的吸收。

9.甲基多巴：

结果：合用可出现严重的急性低血压反应。

**【注意事项】**

**用药警示**

1.使用本药维持治疗哮喘前应完善抗炎治疗，长期治疗时不可单独使用，应与抗炎药物联用，仅最轻微程度的哮喘(1级或运动相关性)可单独使用本药治疗。

2.本药雾化吸入溶液常规剂量无效时，不可随意增加药物剂量或使用次数，反复过量使用可导致支气管痉挛，如有发生应立即停药，更改治疗方案。

3.增加使用吸入的β2-肾上腺素受体激动药可能是哮喘恶化的征象，若出现此情况，需重新评估治疗方法，考虑合用糖皮质激素治疗。

**交叉过敏**

对其他肾上腺素受体激动药过敏者也可能对本药过敏。

**用药前后及用药时应当检查或监测**

1.使用本药过量可引起低钾血症，应监测血钾水平。

2.使用本药预防早产的妇女，有患肺水肿的危险，应密切监测心肺功能。

3.使用本药治疗哮喘时应进行肺功能试验监测患者的治疗反应，危险患者应监测每日峰流速。

**其他注意事项**

高剂量吸入β-肾上腺素受体激动药可作为急性高钾血症治疗措施的一部分，本药可通过刺激钠钾泵使钾离子向细胞内转移。这种降血钾作用通常在30分钟后起效并持续数小时，但是钾的细胞内转移只是暂时的，需要通过离子交换树脂或血液透析来排除体内的钾离子。

**【国外专科用药信息参考】**

**牙科用药信息**

牙科治疗相关主要不良反应：口腔干燥(停药后唾液流量恢复正常)。

**精神状况信息**

1.对精神状态的影响：本药可引起中枢神经系统刺激，导致焦虑、震颤和失眠。

2.对精神障碍治疗的影响：本药可降低普奈洛尔的药效，与单胺氧化酶抑制药、三环类抗抑郁药和安非他命合用可能增加心血管作用(如心动过速、心悸)。

**心血管注意事项**

1.β-肾上腺素受体激动药可导致心率加快，故有静止型心动过速的患者应慎用本药。

2.房颤患者频繁使用β-肾上腺素受体激动药吸入剂可抵消心率控制药物的作用。

**护理注意事项**

1.体质评估/监测：应评估患者气道梗阻缓解情况，有无中枢神经系统刺激及哮喘症状。还应监测血压、心率。

2.实验室检查：应监测血清葡萄糖、血钾浓度、动脉或毛细血管血气分析(如患者状态允许)、第一秒用力呼气量(FEV1)、最大呼气量和(或)其他肺功能检查。

**【药物过量】**

**过量的表现**

1.本药使用过量中毒的早期表现：持续性且严重的胸痛、头痛、头晕、高血压、恶心、呕吐、烦躁不安、心率加快或心搏强烈等。

2.反复过量使用本药偶可引起支气管痉挛，应立即停药并改变治疗方案。

**过量的处理**

过量时可选用选择性β-肾上腺素受体阻断药(如美托洛尔、阿替洛尔)或地西泮治疗。但有支气管痉挛病史的患者应谨慎。

**【药理】**

**药效学**

本药为选择性肾上腺素β2-肾上腺素受体激动药，可选择性地激动支气管平滑肌上的肾上腺素β2受体，有较强的支气管扩张作用。其作用机制是通过激活腺苷酸环化酶，增加细胞内环磷腺苷的合成，从而松弛平滑肌；并可通过抑制肥大细胞等致敏细胞释放过敏反应介质，解除支气管痉挛。本药用于支气管哮喘患者时，其支气管扩张作用与异丙肾上腺素相等。本药对心脏的肾上腺素β1受体的激动作用较弱，其增加心率作用仅为异丙肾上腺素的1/10。

本药也可松弛一些其他器官(如子宫、血管等部位的平滑肌)，可降低子宫肌肉对刺激的应激性，有利于妊娠。此外还可降低眼内压。

**药动学**

本药吸入后5分钟内起效，60-90分钟达最大效应，作用持续3-6小时。半衰期为3.8小时，72%随尿排出，其中28%为原形，44%为代谢产物。

本药口服后15分钟起效，2小时达血药峰浓度，可维持4-6小时，生物利用度约30%。口服本药常规制剂30分钟后起效，2-3小时达最大效应，作用持续6小时，2.5小时达血药峰浓度，半衰期为2.7-5小时。而分别单次服用本药缓释片、缓释胶囊、控释片、控释胶囊8mg，缓释片、缓释胶囊、控释胶囊达峰时间分别为4.16小时、4.4小时、4.5小时，血药峰浓度分别为9.02ng/ml、14.9ng/ml、(10.121±3.93)ng/ml、14.6ng/ml，缓释片、缓释胶囊、控释片半衰期分别为8.63小时、7.7小时、(10.5±2.5)小时。口服本药常规制剂后约76%随尿排出，大部分发生在24小时内，其中60%为代谢产物，约4%随粪便排出。

**【制剂与规格】**

硫酸沙丁胺醇片  2mg(以沙丁胺醇计)。

硫酸沙丁胺醇口腔崩解片  (1)0.5mg(以沙丁胺醇计)。(2)2mg(以沙丁胺醇计)。

硫酸沙丁胺醇缓释片  (1)4mg(以沙丁胺醇计)。(2)8mg(以沙丁胺醇计)。

硫酸沙丁胺醇控释片  (1)4mg(以沙丁胺醇计)。(2)8mg(以沙丁胺醇计)。

硫酸沙丁胺醇胶囊  (1)2mg(以沙丁胺醇计)。(2)4mg(以沙丁胺醇计)。(3)8mg(以沙丁胺醇计)。

硫酸沙丁胺醇缓释胶囊  (1)4mg(以沙丁胺醇计)。(2)8mg(以沙丁胺醇计)。

硫酸沙丁胺醇控释胶囊  (1)4mg(以沙丁胺醇计)。(2)8mg(以沙丁胺醇计)。

硫酸沙丁胺醇糖浆  10ml:4mg。

硫酸沙丁胺醇吸入气雾剂  100μg/揿。

硫酸沙丁胺醇粉雾剂  (1)0.2mg(以沙丁胺醇计)。(2)0.4mg(以沙丁胺醇计)。

硫酸沙丁胺醇雾化吸入溶液  (1)0.083%(3ml：2.5mg)。(2)0.5%(10ml:50mg)。(3)0.5%(20ml:100mg)。(4)1%(2.5ml:2.5mg)。

硫酸沙丁胺醇注射液  2ml:0.4mg。

**【贮藏】**

片剂：遮光、密封保存。

口腔崩解片：遮光、密封保存。

缓释片：密封，阴凉(不超过20℃)干燥处保存。

控释片：遮光、密闭，阴凉处(不超过20℃)保存。

胶囊：遮光、密封保存。

缓释胶囊：遮光、密封，干燥处保存。

控释胶囊：遮光、密封，干燥处(10-30℃)保存。

气雾剂：遮光，避免冻结、阳光直射，30℃以下保存。

粉雾剂：遮光、密封，干燥处保存。

雾化吸入溶液：遮光，25℃以下保存。

使用UpToDate临床顾问须遵循[用户协议](http://www.uptodate.com/contents/license)。

专题 92123 版本 1.0