

核准日期：2007年2月2日
修改日期：2009年1月4日
修改日期：2012年2月21日
修改日期：2013年3月29日
修改日期：2014年6月4日
修改日期：2016年7月5日
修改日期：2020年9月15日
修改日期：2021年5月17日
修改日期：2021年9月26日



盐酸乌拉地尔注射液说明书

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：盐酸乌拉地尔注射液

商品名称：亚宁定®

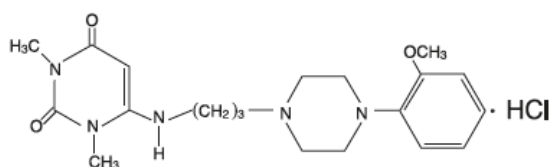
英文名称：Urapidil Hydrochloride Injection

汉语拼音：Yan Suan Wu La Di Er Zhu She Ye

【成份】

本品主要成份为：盐酸乌拉地尔

化学名称：6-{[3-[4-(2-甲氧基苯基)-1-哌嗪基]-丙基]氨基}-1,3-二甲基-2,4-(1H,3H)-嘧啶二酮化学结构式：



$C_{20}H_{29}N_5O_3 \cdot HCl$

分子量：423.94

辅料名称：1,2-丙二醇，磷酸氢二钠，磷酸二氢钠，注射用水

【性状】

无色澄明液体

【适应症】

- 用于治疗高血压危象（如血压急剧升高），重度和极重度高血压以及难治性高血压。
- 用于控制围手术期高血压。

【规格】

5ml:25mg

每支（5ml）注射液含 27.35mg 盐酸乌拉地尔（相当于 25mg 乌拉地尔）。

【用法用量】

1. 治疗高血压危象、重度和极重度高血压，以及难治性高血压的给药方法：

1) 静脉注射

缓慢静注 10-50mg 乌拉地尔，监测血压变化，降压效果通常在 5 分钟内显示。若效果不够满意，可重复用药。

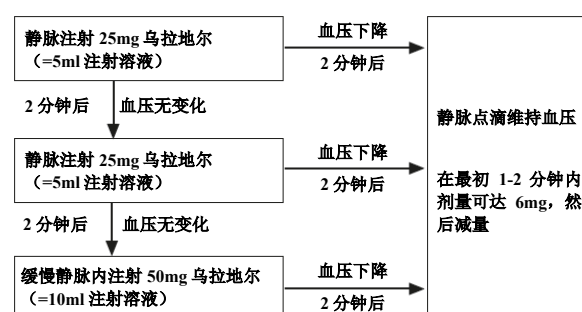
2) 持续静脉点滴或使用输液泵

本品在静脉注射后，为了维持其降压效果，可持续静脉点滴，液体按下述方法配制：

通常将 250mg 乌拉地尔（相当于 10 支 25mg 盐酸乌拉地尔注射液）加入到静脉输液中，如生理盐水、5%或 10%的葡萄糖。

如果使用输液泵，可将 20ml 注射液（=100mg 乌拉地尔）注入到输液泵中，再将上述液体稀释到 50ml。静脉输液的 最大药物浓度为每毫升 4mg 乌拉地尔。输入速度根据病人的 血压酌情调整，初始输入速度可达 2mg/min，维持给药的 速度为 9mg/h。（若将 250mg 乌拉地尔溶解在 500ml 液体 中，则 1mg 乌拉地尔相当于 44 滴或 2.2ml 输入液）。

2. 围手术期高血压的给药方法



本品单次、重复静脉注射及长时间静脉输入均可，亦可在 静脉注射后持续静脉输入以维持血压的稳定。静脉给药时 患者应取卧位。

从毒理学方面考虑治疗时间一般不超过 7 天。

【配伍禁忌】

本品不能与碱性液体混合，因其酸性性质可能引起溶液混 浊或絮状物形成。

【不良反应】

使用本品后，病人可能出现下列不良反应：血管性水肿、 荨麻疹、鼻塞、阴茎异常勃起、头痛、头晕、恶心、呕吐、 出汗、烦躁、乏力、心悸、心律不齐、心动过速或过缓、 呼吸困难、上胸部压迫感或疼痛等症状，其原因多为血压 降得太快所致，通常在数分钟内即可消失，一般无须中断 治疗。

偶见因变换姿势而造成的血压下降。

过敏反应（如瘙痒，皮肤发红，皮疹等）少见。

极个别病例在口服本药时出现血小板计数减少，但血清免 疫学研究尚未证实其因果关系。

【禁忌】

禁用于对本品中成份过敏的患者。



主动脉峡部狭窄或动静脉分流的患者禁用（肾透析时的分流除外）。

哺乳期妇女禁用。

【注意事项】

下列情况使用本品时需要特别注意：

- 机械功能障碍引起的心力衰竭，例如大动脉或者二尖瓣狭窄、肺栓塞或者由于心包疾病引起的心功能损害；
- 儿童，因为无相关研究；
- 肝功能障碍患者；
- 中度到重度肾功能不全患者；
- 老年患者；
- 合用西咪替丁的患者（参见【药物相互作用】）。

另外乌拉地尔可能会影响驾驶或操作机器的能力。

如果本品不是最先使用的降压药，那么在使用本品之前应间隔充分的时间，使先服用的其他降压药显示效应，必要时应当减少本品的剂量。

血压骤然下降可能引起心动过缓甚至心脏停搏。

使用本品疗程一般不超过 7 天。

已经证实，配制好的溶液化学和物理稳定性为 15-25℃时 50 小时。从微生物学角度来看，配制好的溶液应立即使用。如果不能立即使用，使用者应对贮存的时间和条件负责。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

哺乳期妇女禁用。

对于孕妇，仅在绝对必要的情况下方可使用本品。目前尚无资料说明本品在妊娠期前 6 个月使用的安全性，妊娠期后三个月使用的资料亦很有限。

【儿童用药】

儿童很少使用本药，目前尚缺乏这方面的资料。

【老年用药】

老年患者须谨慎使用降压药，且初始剂量宜小，因为他们对药物的敏感性有时难以估计。

【药物相互作用】

若患者同时使用 α 受体阻断剂、血管舒张剂或其他抗高血压药物；饮酒或病人存在血容量不足的情况（如腹泻、呕吐），可增强本品的降压作用。同时使用西咪替丁可使本品的血药浓度上升，最高达 15%。

由于目前还没有足够的与 ACE 抑制剂合用的信息，所以目前暂不推荐这种联合疗法。

【药物过量】

药物过量的症状包括：

- 循环系统症状：头晕、直立性低血压、虚脱
- 中枢神经系统症状：疲劳、反应迟钝

药物过量的治疗：

发生严重低血压可抬高下肢，补充血容量。如果无效，可缓慢静脉注射缩血管药物，不断监测血压变化。极少数病例需给予儿茶酚胺（例如肾上腺素 0.5- 1.0mg，用等渗氯化钠溶液稀释至 10ml）。

【药理毒理】

药理作用

盐酸乌拉地尔具有中枢和外周双重的作用机制。在外周，它可阻断突触后 α_1 受体、抑制儿茶酚胺的缩血管作用，从而降低外周血管阻力和心脏负荷；在中枢，通过兴奋 5-羟色胺-1A 受体，调整循环中枢的活性，防止因交感反射引起的血压升高及心率加快。

毒理研究

急性毒性研究表明：动物（小鼠、大鼠、兔、狗）应用本品后的 LD50 与人类每日治疗剂量之比，在静脉注射后为 70-180 倍；在静脉点滴后为 100-840 倍；口服给药后为 610-870 倍。

慢性毒性研究未发现致畸、致癌及致突变作用。

通过对大鼠和小鼠所做的实验表明，本品可提高动物催乳素的水平，刺激乳房组织的生长。但人类使用推荐的治疗剂量后无上述效应。根据药物作用机制的研究，本品不会使人类激素调节异常。

【药代动力学】

静脉注射乌拉地尔后，在体内分布呈二室模型，分布相半衰期约为 35 分钟。分布容积 0.8 (0.6-1.2) L/Kg。血浆清除半衰期为 2.7 (1.8-3.9) 小时，蛋白结合率 80%。50-70% 的乌拉地尔通过肾脏排泄，其余由胆道排出。排泄物中约 10% 为药物原形，其余为代谢产物。主要代谢物为无抗高血压活性的药物羟化形式。

【贮藏】

本品应在 25℃ 以下保存。

不要使用过期的药物。药品放在儿童够不到的地方。

【包装】

安瓿，5 支 / 盒

【有效期】

24 个月

【执行标准】

进口药品注册标准：JX20190094

【批准文号】

国药准字 HJ20160363

【上市许可持有人】

企业名称：Takeda GmbH

注册地址：Byk-Gulden-Str. β e 2, 78467 Konstanz, Germany

邮政编码：78467

电话号码：+49-7531-84-0

传真号码：+49-7531-84-2474

网址：<http://www.takeda.com>

【生产企业】

企业名称：Takeda Austria GmbH

注册地址：St. Peter-Str. 25, AT-4020 Linz, Austria