

核准日期：2006年09月07日  
修改日期：2011年02月14日  
2013年12月26日  
2015年03月18日  
2020年11月30日  
2022年02月22日  
2024年08月21日

皇隆®

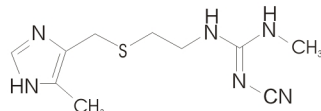
# 注射用西咪替丁说明书

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：注射用西咪替丁  
英文名称：Cimetidine for Injection  
汉语拼音：Zhusheyong Ximitiding

【成份】本品主要成份为西咪替丁。  
化学名称：1-甲基-2-氨基-3-[2-[[[(5-甲基咪唑-4-基)甲基]硫代]乙基]胍]。]  
化学结构式：



分子式：C<sub>10</sub>H<sub>10</sub>N<sub>6</sub>S  
分子量：252.34  
辅料：枸橼酸

【性状】本品为白色或类白色疏松块状物或粉末。  
【适应症】

1. 治疗已明确诊断的十二指肠溃疡，胃溃疡。
2. 十二指肠溃疡短期治疗后复发的患者。
3. 持久性胃食道返流性疾病，对抗返流措施和单一药物治疗如抗酸剂无效的患者。
4. 预防危急病人发生应激性溃疡及出血。
5. 胃泌素瘤（卓林格-艾利森氏综合征）。

【规格】0.4g（以C<sub>10</sub>H<sub>10</sub>N<sub>6</sub>S计）

【用法用量】

本品0.4g用5%葡萄糖注射液或0.9%氯化钠注射液或葡萄糖氯化钠注射液250ml~500ml溶解稀释后静脉滴注，0.4g/次；一日剂量不宜超过2g。通常正常时滴注速度在24小时内不应超过75mg/h。

【不良反应】

1. 消化系统反应。较常见腹泻、腹胀、口干、血清氨基转移酶浓度升高，偶见严重肝炎、肝坏死、脂肪性病变等。动物实验和临床均有应用本品导致急性胰腺炎的报道。突然停药，可能导致慢性消化性溃疡穿孔。  
2. 泌尿系统反应。有引起急性间质肾炎致衰竭的报道，但此种毒性反应是可逆的。  
3. 造血系统反应。对骨髓有一定抑制作用。少数病人发生可逆性中等度的白细胞或粒细胞减少。  
4. 中枢神经系统反应。可通过血脑屏障，具有一定的神经毒性。较常见有头晕、头痛、疲乏、嗜睡等。少数可出现不安，感觉迟钝，语言含糊，出汗或癫痫样发作，以及幻觉、妄想等症状，引起中毒症状的血药浓度多在2μg/ml，而且多发生于老人、幼儿或肝肾功能不全的患者。出现神经毒性后，一般只需适当减少剂量即可消失，用拟胆碱药毒扁豆碱治疗，其症状可得到改善。  
5. 心血管系统反应，可有心动过缓，面部潮红等。静脉注射时偶见血压骤降、房性早搏、心跳呼吸骤停、呼吸短促或呼吸困难。  
6. 对内分泌和皮肤的影响，本药具有抗雄性激素作用，用药剂量较大时可引起男性乳房发育、女性溢乳、性欲减退、阳痿、精子计数减少等，停药后即可消失；可抑制皮脂分泌、诱发剥脱性皮炎、脱发、口腔溃疡等。  
7. 上市后监测到西咪替丁注射剂以下不良反应/事件来自于无法确定样本量的自发报告，难以准确估计其发生频率）：

胃肠损害：恶心、呕吐、腹痛、腹泻、腹胀、口干、口苦。

全身性损害：寒战、发热、胸闷、胸痛、晕厥、乏力、面色苍白、水肿（包括四肢水肿、面部水肿、眶周水肿）。

皮肤及其附件损害：皮疹、斑丘疹、荨麻疹、瘙痒、多汗、出汗、中毒性表皮坏死松解症（Toxic Epidermal Necrolysis）。

神经系统损害：头晕、头痛、抽搐、麻木、言语不清、眩晕、震颤、意识模糊、锥体外系反应。

心血管系统损害：心悸、紫绀、血压下降、心动过缓、心动过速、房室传导阻滞。

呼吸系统反应：呼吸困难、呼吸急促、气短、咳嗽、咽喉不适、喉头水肿。

免疫功能紊乱和感染：过敏反应、过激样反应、过敏性休克。

血管损害和出血性障碍：潮红、静脉炎、血小板减少、过敏性紫癜。

精神障碍：嗜睡、烦躁、幻觉、精神异常、精神障碍。

用药部位损害：用药部位红肿、疼痛、瘙痒。

肝胆损害：肝功能异常、转氨酶升高、黄疸。

泌尿系统：尿频、尿潴留、肾功能异常。

血液系统损害：白细胞减少、粒细胞减少、骨髓抑制。

生殖系统损害：性欲减退、男性乳房肥大、阳痿。

## 【禁忌】

1. 对本品过敏者禁用。
2. 本品能透过胎盘屏障，并能进入乳汁，引起胎儿和婴儿肝功能障碍，孕妇及哺乳期妇女禁用。

## 【注意事项】

1. 不宜用于急性胰腺炎。
2. 用药期间应注意监测肝、肾功能和血常规。
3. 应避免本品与中枢抗胆碱药同时使用，以防加重中枢神经毒性反应。
4. 用本品时应禁用咖啡因及含咖啡因的饮料。
5. 老年人、儿童应慎用。
6. 突然停药，可能导致慢性消化性溃疡穿孔，可能为停药后反跳的高酸度所致。故完成治疗后尚需继续服药（每晚400mg）3个月。
7. 对诊断的干扰：胃液隐血试验可出现假阳性；血液水杨酸浓度、血清肌酐、催乳素、氨基转移酶等浓度均可能增高；甲状腺激素浓度则可能降低。
8. 本品可透过血脑屏障，具有一定的神经毒性。引起中毒症状的血药浓度多在2μg/ml，而且多发生于老年人、幼儿或肝肾功能不全的患者。出现神经毒性后，一般只需适当减少剂量即可消失，用拟胆碱药毒扁豆碱治疗，其症状可得到改善。
9. 本药具有抗雄性激素作用，用药剂量较大时可引起男性乳房发育、女性溢乳、性欲减退、阳痿、精子计数减少。
10. 下列情况应慎用：
  - （1）老年人慎用。用药间隔时间可延长，剂量酌减。
  - （2）儿童慎用。
  - （3）严重心脏及呼吸系统疾患、心、肝、肾功能不全患者慎用。
  - （4）慢性炎症，如系统性红斑狼疮（SLE），西咪替丁的骨髓毒性可能增高。
  - （5）器质性脑病慎用。
  - （6）肾功能损害（中度或重度）。

【孕妇及哺乳期妇女用药】本品能透过胎盘屏障，并能进入乳汁，引起胎儿和婴儿肝功能障碍，故禁用。

【儿童用药】儿童慎用。

【老年用药】老年患者慎用。用药间隔时间可延长，剂量酌减。

## 【药物相互作用】

1. 与制酸药伍用，对十二指肠溃疡有缓解疼痛之效，但西咪替丁的吸收可能减少，故一般不提倡。
2. 本品与硫酸铝合用可能降低硫酸铝疗效（因硫酸铝需经胃酸水解后才能发挥作用）。加重镇静及其他中枢神经抑制症状，并可发展为呼吸及循环衰竭。如必须与抗酸剂合用，两者应至少相隔1小时。
3. 与香豆素类抗凝药伍用时，凝血酶原时间可进一步延长，因此须密切注意病情变化，并调整抗凝药用量。
4. 与其他肝内代谢药伍用均应慎用。
5. 与茶妥英钠伍用时，后者血药浓度增高，毒性可能增强，注意定期复查周围血象。
6. 本品可使维拉帕米的绝对生物利用度提高近一倍，应注意。
7. 病人同时服用地高辛和奎尼丁时，不宜再用本品。
8. 本品可减弱四环素的作用及增强阿司匹林的作用。
9. 可干扰酮康唑的吸收，降低其抗真菌活性。
10. 本品与卡托普利合用有可能引起精神症状。
11. 由于本品与氨基糖苷类相似的肌神经阻断作用，这种作用不被新斯的明对抗，只能被氯化钙对抗，因此与氨基糖苷类抗生素合用时可能导致呼吸抑制或呼吸停止。
12. 与普萘洛尔、美托洛尔、甲硝唑伍用时，血药浓度可能增高。
13. 与茶碱、咖啡因、氨茶碱等黄嘌呤类药伍用时，肝代谢降低，可导致清除延缓，血药浓度升高，可能发生中毒反应。

## 【药物过量】

常见的过量征象有呼吸短促或呼吸困难以及心动过速。处理：首先清除胃肠道内尚未吸收的药物，并给予临床监护及支持疗法，出现呼吸衰竭者，立即进行人工呼吸，心动过速者给予β肾上腺素阻滞药。

## 【药理毒理】

### 1、药理作用

主要作用于壁细胞上H<sub>2</sub>受体，起竞争性抑制组胺作用，抑制基础胃酸分泌，也抑制由食物、组胺胃泌素、咖啡因及胰岛素等刺激所刺激的胃酸分泌。注射300mg，4~5小时后，抑制基础胃酸分泌可达80%，可抑制基础胃酸分泌达4~5小时。

### 2、毒理研究

大鼠和狗的亚急性、慢性中毒性试验证明，本品有轻度抗雄激素作用而引起前列腺和精囊重量减少以及乳汁分泌，但停药后消失。无致突变、致癌、致畸胎作用，亦无依赖性和耐受性。

### 【药代动力学】

本品吸收后广泛分布于除脑以外的全身组织中，本品能透过胎盘屏障，乳汁中本品浓度可高于血浆浓度。蛋白结合率为15%~20%，部分在肝脏内代谢，代谢产物为Sulphoxide和hydroxymethylcimetiding，主要经肾排泄。24小时后注射量的约75%以原形自肾排出；10%可从粪便排出。经血液透析清除。肾功能正常时t<sub>1/2</sub>为2小时，肌酐清除率在20~50ml/min者其半衰期（t<sub>1/2</sub>）为2.9小时，<20ml/min者为3.7小时，肾功能不全者为5小时。

【贮藏】遮光，密闭，在阴凉处（不超过20℃）保存。

【包装】低硼硅玻璃管制注射剂瓶，10瓶/盒。

【有效期】24个月

【执行标准】WS-XG-040-2014

【批准文号】国药准字H20050689

【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：海南省海口市国家高新技术产业开发区区谷三横路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：海南省海口市国家高新技术产业开发区区谷三横路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