

核准日期：2007 年 3 月 10 日
修改日期：2009 年 11 月 10 日
2010 年 10 月 1 日
2011 年 7 月 4 日
2013 年 4 月 3 日
2013 年 12 月 3 日
2015 年 12 月 1 日

地高辛片说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用



【药品名称】

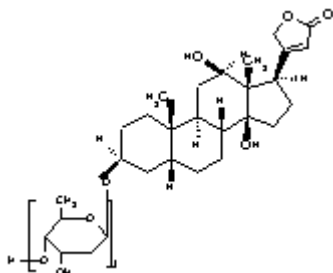
通用名称：地高辛片
商品名称：可力®
英文名称：Digoxin Tablets
汉语拼音：Digaoxin Pian

【成份】

本品主要成份为：地高辛

化学名称：3β-[[[0-2, 6-二脱氧-β-D-核-己吡喃糖基-(1→4)-0-2, 6-二脱氧-β-D-核-己吡喃糖基-(1→4)-2, 6-二脱氧-β-D-核-己吡喃糖基氧代]-12β, 14β-二羟基-5β-心甙-20(22)烯内酯。

化学结构式：



分子式：C₄₁H₆₄O₁₄

分子量：780.95

【性状】 本品为白色片。

【适应症】1、用于高血压、瓣膜性心脏病、先天性心脏病等急性和慢性心功能不全。尤其适用于伴有快速心室率的心房颤动的心功能不全；对于肺源性心脏病、心肌严重缺血、活动性心肌炎及心外因素如严重贫血、甲状腺功能低下及维生素 B1 缺乏症的心功能不全疗效差；

2、用于控制伴有快速心室率的心房颤动、心房扑动患者的心室率及室上性心动过速。

【规格】 0.25mg

【用法用量】成人常用量 口服：常用 0.125~0.5 mg (即 1/2 片~2 片)，每日一次，7 天可达稳态血药浓度；若达快速负荷量，可每 6~8 小时给药 0.25 mg (1 片)，总剂量 0.75~1.25 mg/日 (每日 3 片~5 片)；维持量，每日一次 0.125~0.5 mg (每日 1 次，每次 1/2 片~2 片)。

小儿常用量 口服：本品总量，早产儿 0.02~0.03 mg/kg；1 月以下新生儿，0.03~0.04 mg/kg；1 月~2 岁，0.05~0.06 mg/kg；2~5 岁，0.03~0.04 mg/kg；5~10 岁，0.02~0.035mg/kg；10 岁或 10 岁以上，照成人常用量；本品总量分 3 次或每 6~8 小时给予。维持量为总量的 1/5~1/3，分 2 次，每 12 小时 1 次或每日 1 次。在小婴幼儿 (尤其早产儿) 需仔细滴定

剂量和密切监测血药浓度和心电图。近年通过研究证明，地高辛逐日给予一定剂量，经 6~7 天能在体内达到稳定的浓度而发挥全效作用，因此，病情不急而又易中毒者，可逐日按 5.5ug/kg 给药，也能获得满意的治疗效果，并能减少中毒发生率。

【不良反应】

(1) 常见的不良反应包括：促心律失常作用、胃纳不佳或恶心、呕吐（刺激延髓中枢）、下腹痛、异常的无力、软弱。

(2) 少见的反应包括：视力模糊或“色视”，如黄视、绿视、腹泻、中枢神经系统反应如精神抑郁或错乱。

(3) 罕见的反应包括：嗜睡、头痛及皮疹、寻麻疹（过敏反应）。

(4) 在洋地黄的中毒表现中，促心律失常最重要，最常见者为室性早搏，约占促心律失常不良反应的 33%。其次为房室传导阻滞，阵发性或加速性交界性心动过速，阵发性房性心动过速伴房室传导阻滞，室性心动过速、窦性停搏、心室颤动等。儿童心律失常比其他反应多见，但室性心律失常比成人少见。新生儿可有 P-R 间期延长。

【禁忌】 与钙注射剂合用；任何洋地黄类制剂中毒；室性心动过速、心室颤动；梗阻性肥厚型心肌病（若伴收缩功能不全或心房颤动仍可考虑）；预激综合征伴心房颤动或扑动。

【注意事项】

(1) 不宜与酸、碱类配伍。

(2) 慎用：

- ① 低钾血症；
- ② 不完全性房室传导阻滞；
- ③ 高钙血症；
- ④ 甲状腺功能低下；
- ⑤ 缺血性心脏病；
- ⑥ 心肌梗死；
- ⑦ 心肌炎；
- ⑧ 肾功能损害。

(3) 用药期间应注意随访检查：

- ① 血压、心率及心律；
- ② 心电图；
- ③ 心功能监测；
- ④ 电解质尤其钾、钙、镁；
- ⑤ 肾功能；
- ⑥ 疑有洋地黄中毒时，应作地高辛血药浓度测定。过量时，由于蓄积性小，一般于停药后 1—2 天中毒表现可以消退。

(4) 应用时注意监测地高辛血药浓度。

(5) 应用本品剂量应个体化。

【孕妇及哺乳期妇女用药】本品可通过胎盘，故妊娠后期母体用量可能增加，分娩后 6 周须减量。本品可排入乳汁，哺乳期妇女应用须权衡利弊。

【儿童用药】新生儿对本品的耐受性不定，其肾清除减少；早产儿与未成熟儿对本品敏感，按其不成熟程度而减小剂量。按体重或体表面积，1 月以上婴儿比成人用量略大。

【老年用药】老年人肝肾功能不全，表观分布容积减小或电解质平衡失调者，对本品耐受性低，必须减少剂量。

【药物相互作用】

(1)与两性霉素 B、皮质激素或失钾利尿剂如布美他尼（Bumetanide，制品为丁尿胺）、依他

尿酸 (Ethacrynic Acid, 利尿酸) 等同用时, 可引起低血钾而致洋地黄中毒。

(2) 与制酸药 (尤其三硅酸镁) 或止泻吸附药如白陶土、果胶、考来烯胺 (Colestyramine, 消胆胺) 和其他阴离子交换树脂、柳氮磺吡啶 (Sulfasalazine) 或新霉素、对氨基水杨酸同用时, 可抑制洋地黄强心甙吸收而导致强心甙作用减弱。

(3) 与抗心律失常药、钙盐注射剂、可卡因、泮库溴胺 (Pancuronium Bromide, 潘可龙, 巴活郎)、萝芙木碱、琥珀胆碱 (司可林, Scoline; Suxamethonium Chloride) 或拟肾上腺素类药物同用时, 可因作用相加而导致心律失常。

(4) 有严重或完全性房室传导阻滞且伴正常血钾者的应用洋地黄患者不应同时应用钾盐, 但噻嗪类利尿剂与本品同用时, 常须给予钾盐, 以防止低钾血症。

(5) β 受体阻滞剂与本品同用, 有导致房室传导阻滞发生严重心动过缓的可能, 应重视。但并不排除 β 阻滞剂用于洋地黄不能控制心室率的室上性快速心律失常。

(6) 与奎尼丁同用, 可使本品血药浓度提高约一倍, 提高程度与奎尼丁用量相关, 甚至可达到中毒浓度, 即使停用地高辛, 其血药浓度仍继续上升, 这是奎尼丁从组织结合处置换出地高辛, 减少其分布容积之故。两药合用时应酌减地高辛用量 1/2—1/3。

(7) 与维拉帕米、地尔硫卓、胺碘酮合用, 由于降低肾及全身对地高辛的清除率而提高其血药浓度, 可引起严重心动过缓。

(8) 螺内酯可延长本品半衰期, 需调整剂量或给药间期, 随访监测本品的血药浓度。

(9) 血管紧张素转换酶抑制剂及其受体拮抗剂可使本品血药浓度增高。

(10) 依酚氯胺 (Edrophonium Chloride, Tensilon 腾喜龙) 与本品合用可致明显心动过缓。

(11) 吲哚美辛 (Indometacin, 消炎痛) 可减少本品的肾清除, 使本品半衰期延长, 有中毒危险, 需监测血药浓度及心电图。

(12) 与肝素同用, 由于本品可能部分抵消肝素的抗凝作用, 需调整肝素用量。

(13) 洋地黄化时静脉用硫酸镁应极其谨慎, 尤其是也静注钙盐时, 可发生心脏传导阻滞。

(14) 红霉素由于改变胃肠道菌群, 可增加本品在胃肠道的吸收。

(15) 甲氧氯普胺 (Metoclopramide, Maxolon 灭吐灵) 因促进肠道运动而减少地高辛的生物利用度约 25%。普鲁本辛因抑制肠道蠕动而提高地高辛生物利用度约 25%。

【药物过量】

(1) 若地高辛血药浓度为 $> 2.0 \sim 2.5 \text{ ng/ml}$, 应警惕地高辛药物过量或毒性反应。

(2) 患者在 2—3 周之前服用过任何洋地黄制剂, 宜予小剂量给药, 以免中毒。

(3) 强心甙剂量计算应按标准体重, 因脂肪组织不摄取强心甙。

(4) 推荐剂量只是平均剂量, 必须按照患者需要调整每次剂量。

(5) 肝功能不全者, 应选用不以肝脏代谢为主的洋地黄制剂。

(6) 肾功能不全者, 应选用主要经肾脏排泄的洋地黄制剂。

(7) 应用洋地黄患者对电复律极为敏感, 应高度警惕。

(8) 透析不能从体内迅速去除本品。

(9) 在本品引起严重或完全性房室传导阻滞时, 不宜补钾。

(10) 肾功能不全、老年及虚弱者在常用剂量及血药浓度时就可有中毒反应。婴幼儿尤其是早产儿和发育不全儿, 要在血药浓度及心电监测下调整剂量。

(11) 当患者由强心甙注射液改为本品时, 为补偿药物间药动学差别, 需要调整剂量。

(12) 应静脉给药, 因为肌肉注射有明显局部反应, 且作用慢、生物利用度差。

(13) 本品过量及毒性反应的处理: 轻度中毒者, 停用本品及利尿治疗, 如有低钾血症而肾功能尚好, 可给以钾盐。发生促心律失常者可用:

(14) 氯化钾静脉滴注, 对消除异位心律往往有效。

(15) 苯妥英钠, 该药能与强心甙竞争性争夺 $\text{Na}-\text{K}-\text{ATP}$ 酶, 因而有解毒效应。成人

用 100—200 mg加注射用水 20ml 缓慢静注，如情况不紧急，亦可口服，每次 0.1 mg，每日 3—4 次。

(16) 利多卡因，对消除室性心律失常有效，成人用 50—100 mg加入葡萄糖注射液中静脉注射，必要时可重复。

(17) 阿托品，对缓慢性心律失常者可用。成人用 0.5—2 mg皮下或静脉注射。

(18) 心动过缓或完全房室传导阻滞有发生阿斯综合症的可能时，可植入临时起搏器。应用异丙肾上腺素，可以提高缓慢的心率。

(19) 依地酸钙钠 (Calcium Disodium Edetate)，以其与钙螯合的作用，也可用于治疗洋地黄所致的心律失常。

(20) 对可能有生命危险的洋地黄中毒可经膜滤器静脉给与地高辛免疫 Fab 片段，每 40 mg地高辛免疫 Fab 片段，大约结合 0.6 mg地高辛或洋地黄毒甙。

【药理毒理】治疗剂量时

1、正性肌力作用：本品选择性地与心肌细胞膜 $\text{Na}^+ - \text{K}^+$ ATP 酶结合而抑制该酶活性，使心肌细胞膜内外 $\text{Na}^+ - \text{K}^+$ 主动偶联转运受损，心肌细胞内 Na^+ 浓度升高，从而使肌膜上 $\text{Na}^+\text{Ca}^{2+}$ 交换趋于活跃，使细胞浆内 Ca^{2+} 增多，肌浆网内 Ca^{2+} 储量亦增多，心肌兴奋时，有较多的 Ca^{2+} 释放；心肌细胞内 Ca^{2+} 浓度增高，激动心肌收缩蛋白从而增加心肌收缩力。

2、负性频率作用：由于其正性肌力作用，使衰竭心脏心输出量增加，血流动力学状态改善，消除交感神经张力的反射性增高，并增强迷走神经张力，因而减慢心率。此外，小剂量时提高窦房结对迷走神经冲动的敏感性，可增强其减慢心率作用。大剂量（通常接近中毒量）则可直接抑制窦房结、房室结和希氏束而呈现窦性心动过缓和不同程度的房室传导阻滞。

3、心脏电生理作用：通过对心肌电活动的直接作用和对迷走神经的间接作用，降低窦房结自律性；提高普肯野氏纤维自律性；减慢房室结传导速度，延长其有效不应期，导致房室结隐匿性传导增加，可减慢心房纤颤或心房扑动的心室率；由于本药缩短心房有效不应期，当用于房性心动过速和房扑时，可能导致心房率的加速和心房扑动转为心房纤颤；缩短普肯野氏纤维有效不应期。

【药代动力学】本品为由毛花洋地黄提纯制得的强心甙，其特点是排泄较快而蓄积性较小。口服主要经小肠上部吸收，吸收不完全，也不规则，口服吸收率约 75%，生物利用度：片剂为 60% - 80%，口服起效时间 0.5 - 2 小时，血浆浓度达峰时间 2 - 3 小时，获最大效应时间为 4 - 6 小时。地高辛消除半衰期平均为 36 小时。分布：吸收后广泛分布到各组织，部分经胆道吸收入血，形成肝 - 肠循环。血浆蛋白结合率低，为 20% - 25%，表观分布容积为 6 - 10L/kg。代谢与排泄：地高辛在体内转化代谢很少，主要以原形由肾排除，尿中排出量为用量的 50% - 70%。

【贮藏】密封保存。

【包装】铝塑包装，30 片/板/盒。

【有效期】24 个月

【执行标准】《中国药典》2015 年版二部

【批准文号】国药准字 H33021738

【生产企业】

企业名称：赛诺菲（杭州）制药有限公司

Sanofi (Hangzhou) Pharmaceuticals Co., Ltd.

生产地址：杭州市滨江区江陵路 325 号

邮政编码：310051

传真号码：0571-88076189

产品咨询电话：800(400)-820-8884