

核准日期：2007 年 1 月 29 日

修改日期：2008 年 5 月 29 日； 2010 年 1 月 4 日； 2011 年 7 月 18 日； 2011 年 10 月 24 日；
2012 年 2 月 21 日

注射用甲泼尼龙琥珀酸钠说明书

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：注射用甲泼尼龙琥珀酸钠

商品名称：Solu-Medrol[®] 甲强龙[®]

英文名称：Methylprednisolone Sodium Succinate for Injection

汉语拼音：Zhusheyong Jiaponilong Huposuanna

【成份】

本品主要成份为：甲泼尼龙琥珀酸钠。

化学名称：11 β , 17 α , 21-三羟基-6 α -甲基孕甾-1, 4-二烯-3, 20-二酮-21-琥珀酸钠

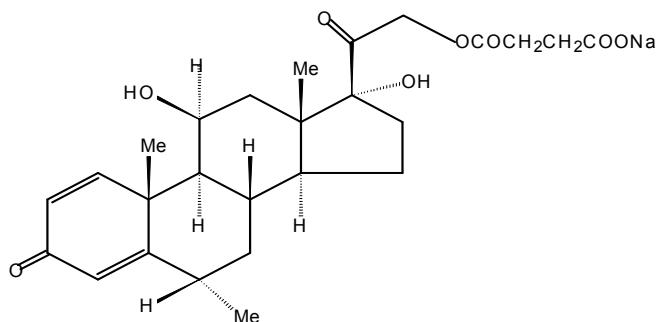
组成成份：

本品 40mg 规格，每只 1ml 双室瓶上室含稀释液（苯甲醇 9mg 及注射用水），下室为甲泼尼龙琥珀酸钠及辅料：一水磷酸二氢钠、磷酸氢二钠（无水）、乳糖、10%氢氧化钠溶液和注射用水。

本品 125mg 规格，每只 2ml 双室瓶上室含稀释液（苯甲醇 18mg 及注射用水），下室为甲泼尼龙琥珀酸钠及辅料：一水磷酸二氢钠、磷酸氢二钠（无水）、10%氢氧化钠溶液和注射用水。

本品 500mg 规格，含无菌粉末一瓶，另附带 1 瓶稀释液（7.8ml，含苯甲醇 70.2mg 及注射用水）。其中无菌粉末内含甲泼尼龙琥珀酸钠及辅料：一水磷酸二氢钠、磷酸氢二钠（无水）、10%氢氧化钠溶液和注射用水。

化学结构式：



分子式：C₂₆H₃₃NaO₈

分子量：496.53

【性状】

本品 40mg 规格为双室瓶，下室为白色至类白色冻干块状物或粉末，上室为无色澄明液体。

本品 125mg 规格为双室瓶，下室为白色至类白色冻干块状物或粉末，上室为无色澄明液体。

本品 500mg 规格为白色冻干块状物或粉末。

【适应症】

除非用于某些内分泌疾病的替代治疗，糖皮质激素仅仅是一种对症治疗的药物。

抗炎治疗

-- 风湿性疾病

作为短期使用的辅助药物（帮助患者度过急性期或危重期），用于：

创伤后骨关节炎

骨关节炎引发的滑膜炎

类风湿性关节炎，包括幼年型类风湿性关节炎（个别患者可能需要低剂量维持治疗）

急性或亚急性滑囊炎

上踝炎

急性非特异性腱鞘炎

急性痛风性关节炎

银屑病关节炎

强直性脊柱炎

-- 胶原疾病（免疫复合物疾病）

用于下列疾病危重期或维持治疗：

系统性红斑狼疮（和狼疮性肾炎）

急性风湿性心肌炎

全身性皮肌炎（多发性肌炎）

结节性多动脉炎

古德帕斯彻综合征（Good Pasture's Syndrome）

-- 皮肤疾病

天疱疮

严重的多形红斑（Stevens-Johnson 综合征）

剥脱性皮炎

大疱疱疹性皮炎

严重的脂溢性皮炎

严重的银屑病

蕈样真菌病

荨麻疹

-- 过敏状态

用于控制如下以常规疗法难以处理的严重的或造成机能损伤的过敏性疾病：

支气管哮喘

接触性皮炎

异位性皮炎

血清病

季节性或全年过敏性鼻炎

药物过敏反应

荨麻疹样输血反应

急性非感染性喉头水肿（肾上腺素为首选药物）

-- 眼部疾病

严重的眼部急、慢性过敏和炎症，例如：

眼部带状疱疹

虹膜炎、虹膜睫状体炎

脉络膜视网膜炎

扩散性后房色素层炎和脉络膜炎

视神经炎

交感性眼炎

-- 胃肠道疾病

帮助患者度过以下疾病的危重期：

溃疡性结肠炎（全身治疗）

局限性回肠炎（全身治疗）

-- 呼吸道疾病

肺部肉瘤病

铍中毒

与适当的抗结核化疗法合用于暴发性或扩散性肺结核

其它方法不能控制的吕弗勒氏综合征（Loeffler's Syndrom）

吸入性肺炎

-- 水肿状态

用于无尿毒症的自发性或狼疮性肾病综合征的利尿及缓解蛋白尿

免疫抑制治疗

-- 器官移植

治疗血液疾病及肿瘤

-- 血液疾病

获得性（自身免疫性）溶血性贫血

成人自发性血小板减少性紫癜（仅允许静脉注射，禁忌肌内注射）

成人继发性血小板减少

幼红细胞减少（红细胞性贫血）

先天性（红细胞）再生不良性贫血

-- 肿瘤

用于下列疾病的姑息治疗：

成人白血病和淋巴瘤

儿童急性白血病

治疗休克

继发于肾上腺皮质机能不全的休克，或因可能存在的肾上腺皮质机能不全而使休克对常规治疗无反应（常用药是氢化可的松；若不希望有盐皮质激素活性，可使用甲泼尼龙）。

对常规治疗无反应的失血性、创伤性及手术性休克。尽管没有完善的（双盲对照）临床研究，但动物实验的资料显示本品可能对常规疗法（例如：补液）无效的休克有效。同时请参阅【**注意事项**】中的“感染性休克”部分。

其它

-- 神经系统

由原发性或转移性肿瘤、或手术及放疗引起的脑水肿

多发性硬化症急性危重期

急性脊髓损伤。治疗应在创伤后 8 小时内开始。

-- 与适当的抗结核化疗法合用，用于伴有蛛网膜下腔阻塞或趋于阻塞的结核性脑膜炎

-- 累及神经或心肌的旋毛虫病

-- 预防癌症化疗引起的恶心、呕吐

内分泌失调

原发性或继发性肾上腺皮质机能不全

急性肾上腺皮质机能不全

以上疾病，氢化可的松或可的松为首选药物；如有需要，合成的糖皮质激素可与盐皮质激素合用。

已知患有或可能患有肾上腺机能不全的患者，在手术前和发生严重创伤或疾病时给药尚不明确。

先天性肾上腺增生

非化脓性甲状腺炎

癌症引起的高钙血症

【规格】

(1) 40mg（以甲泼尼龙计）；(2) 125mg（以甲泼尼龙计）；(3) 500mg（以甲泼尼龙计）。

【用法用量】

作为对生命构成威胁的情况的辅助药物时，推荐剂量为 30mg/kg，应至少用 30 分钟静脉注射。根据临床需要，此剂量可在医院内于 48 小时内每隔 4~6 小时重复一次（参阅【**注意事项**】）。

冲击疗法，用于疾病严重恶化和/或对常规治疗（如：非甾体类抗炎药，金盐及青霉胺）无反应的疾病。

建议方案：

-- 类风湿性关节炎：

- 1 g/天，静脉注射，用 1、2、3 或 4 天；
- 1 g/月，静脉注射，用 6 个月。

因大剂量皮质类固醇能引起心律失常，因此仅限在医院内使用本治疗方法，以便及时做心电图及除颤。

每次应至少用 30 分钟给药，如果治疗后一周内病情无好转，或因病情需要，本治疗方案可重复。预防肿瘤化疗引起的恶心及呕吐

建议方案：

-- 关于化疗引起的轻至中度呕吐：

在化疗前 1 小时、化疗开始时及化疗结束后，以至少 5 分钟静脉注射本品 250mg。在给予首剂本品时，可同时给予氯化酚噻嗪以增强效果。

-- 关于化疗引起的重度呕吐：

化疗前 1 小时，以至少 5 分钟静脉注射本品 250mg，同时给予适量的灭吐灵或丁酰苯类药物，随后在化疗开始时及结束时分别静脉注射本品 250mg。

急性脊髓损伤

治疗应在损伤后 8 小时内开始。

对于在损伤 3h内接受治疗的患者：初始剂量为每公斤体重 30mg甲泼尼龙，在持续的医疗监护下，以 15 分钟静脉注射。

大剂量注射后应暂停 45 分钟，随后以 5.4mg/kg/小时的速度持续静脉滴注 23 小时。应选择与大剂量注射不同的注射部位安置输液泵。

对于在损伤 3~8h内接受治疗的患者：初始剂量为每公斤体重 30mg甲泼尼龙，在持续的医疗监护下，以 15 分钟静脉注射。大剂量注射后应暂停 45 分钟，随后以 5.4 mg/kg/小时的速度持续静脉滴注 47 小时。

仅此适应症能以此速度进行大剂量注射，并且应在心电监护并能提供除颤器的情况下进行。短时间内静脉注射大剂量甲泼尼龙（以不到 10 分钟的时间给予大于 500 mg的甲泼尼龙）可能引起心律失常、循环性虚脱及心脏停搏。

其它适应症

初始剂量从 10mg 到 500mg 不等，依临床疾病而变化。大剂量甲泼尼龙可用于短期内控制某些急性重症疾病，如：支气管哮喘、血清病、荨麻疹样输血反应及多发性硬化症急性恶化期。小于等于 250mg 的初始剂量应至少用 5 分钟静脉注射；大于 250mg 的初始剂量应至少用 30 分钟静脉注射。根据患者的反应及临床需要，间隔一段时间后可静脉注射或肌肉注射下一剂量。皮质类固醇只可辅

助，不可替代常规疗法。

婴儿和儿童可减量，但不仅仅是依据年龄和体格大小，而更应考虑疾病的严重程度及患者的反应。每 24 小时总量不应少于 0.5mg/kg。

用药数天后，必须逐量递减用药剂量或逐步停药。如果慢性疾病自发缓解，应停止治疗。长期治疗的患者应定期作常规实验室检查，如：尿常规，饭后 2 小时血糖，血压和体重，胸部 X 线检查。有溃疡史或明显消化不良的患者应作上消化道 X 线检查。中断长期治疗的患者也需要作医疗监护。

本品可通过静脉注射、肌内注射或静脉滴注给药，紧急情况的治疗应使用静脉注射。静脉注射（肌内注射）时，按指导方法配制溶液。

关于使用双室瓶的指导

- 1.按下塑料推动器，使稀释液流入下层瓶室。
- 2.轻轻摇动药瓶。
- 3.除去塞子中心的塑料衬。
- 4.用适当的消毒剂消毒顶部橡皮头。
- 5.将针头垂直插入橡皮头中心直至可以见到针尖，倒转药瓶并抽取药液。

关于使用小瓶的指导

在无菌的环境下将稀释液加入含无菌粉末的小瓶。只可使用特殊的稀释液。

制备输注溶液

首先按指示制备溶液。起始治疗方法可能是用至少 5 分钟（剂量小于或等于 250mg）至少 30 分钟（剂量大于 250mg）静脉注射甲泼尼龙；下一剂量可能减少并用同样方法给药。如果需要，该药物可稀释后给药，方法为将已溶解的药品与 5%葡萄糖水溶液、生理盐水或 5%葡萄糖与 0.45%氯化钠的混合液混合。配制后的溶液在 48 小时内物理和化学性质保持稳定。

【不良反应】

可能会观察到全身性不良反应。尽管在短期治疗时很少出现，但仍应仔细随访。这是类固醇治疗的随访工作的一部分，并不针对某一药物。糖皮质激素（如甲泼尼龙）可能的不良反应为：
感染和侵染：感染、机会性感染。

免疫系统异常：药物过敏（包括类似严重过敏反应或严重过敏反应，伴有或不伴有循环虚脱、心脏停搏、支气管痉挛）。

内分泌异常：类库欣综合征、垂体功能减退症、类固醇停药综合征。。

代谢和营养异常：葡萄糖耐量受损、低钾性碱中毒、血脂异常、增加糖尿病患者对胰岛素或口服降糖药的需求。钠潴留、体液潴留、负氮平衡（由蛋白质分解造成）、血尿素氮增高、食欲增加（可能

会导致体重增加)、脂肪过多症。

精神异常：情感障碍（包括情绪不稳定、情绪低落、欣快、心理依赖、自杀意念）、精神病性异常（包括躁狂、妄想、幻觉、精神分裂症[加重]）、意识模糊状态、精神障碍、焦虑、人格改变、情绪波动、行为异常、失眠，易激惹。

神经系统异常：颅内压增高（可能出现视神经乳头水肿[良性颅高压]）、惊厥、健忘、认知障碍、头晕、头痛。

眼部异常：眼球突出、青光眼、白内障。

耳和迷路异常：眩晕。

心脏异常：充血性心力衰竭（易感患者）、心律失常。

血管异常：高血压、低血压。

呼吸系统、胸和纵隔异常：呃逆。

胃肠道异常：胃出血、肠穿孔、消化性溃疡（可能出现消化性溃疡穿孔和消化性溃疡出血）、胰腺炎、腹膜炎、溃疡性食管炎、食管炎、腹痛、腹胀、腹泻、消化不良、恶心。

皮肤和皮下组织异常：血管性水肿、外周水肿、瘀斑、瘀点、皮肤萎缩、条纹状皮肤、皮肤色素减退、多毛、皮疹、红斑、瘙痒、荨麻疹、痤疮、多汗症。

肌肉骨骼和结缔组织异常：骨坏死、病理性骨折、发育迟缓（儿童）、肌肉萎缩、肌病、骨质疏松症、神经病性关节炎、关节痛、肌肉痛、肌无力。

生殖系统和乳房异常：月经失调。

全身异常和给药部位情况：愈合不良、注射部位反应、疲劳感、不适。

检查：丙氨酸氨基转移酶升高、天门冬氨酸氨基转移酶升高、血碱性磷酸酶升高、眼内压升高、糖耐量降低、血钾降低、尿钙增加、皮试反应抑制。

损伤、中毒和操作并发症：肌腱断裂（特别是跟腱）、脊椎压缩性骨折。

【禁忌】

在下列情况下禁止使用甲泼尼龙琥珀酸钠：

- 全身性霉菌感染的患者。
- 已知对甲泼尼龙或者配方中的任何成分过敏的患者。
- 鞘内注射途径给药的使用。

禁止对正在接受皮质类固醇类免疫抑制剂量治疗的患者使用活疫苗或减毒活疫苗。

相对禁忌症

特殊危险人群：

对属于下列特殊危险人群的患者应采取严密的医疗监护并应尽可能缩短疗程（同时参阅【**注意事项**】和【**不良反应**】）：儿童；糖尿病患者；高血压患者；有精神病史者；有明显症状的某些感染性疾病，如结核病；或有明显症状的某些病毒性疾病，如波及眼部的疱疹及带状疱疹。

为避免相容性和稳定性问题，应尽可能将本品与其它药物分开给药。

【注意事项】

免疫抑制剂作用/感染易感性增高

皮质类固醇可能会增加感染的易感性，可能掩盖感染的一些症状，而且在皮质类固醇的使用过程中可能会出现新的感染。使用皮质类固醇可能会减弱抵抗力而无法使感染局限化。在人体任何部位出现的，由包括病毒、细菌、真菌、原生动物的任何一种病原体引发的感染，可能与皮质类固醇的单独使用或者它与其它影响细胞或体液免疫、或者中性粒细胞功能的免疫抑制剂的联合使用有关系。这些感染可能是轻度的，但也可以是严重的，有时甚至是致命的。随着皮质类固醇剂量的增加，感染并发症的发生率也会增加。

正在服用抑制免疫系统药物的人比健康个体更容易患感染。例如，水痘和麻疹，对正在使用皮质类固醇的未免疫性儿童或成人来说，会更加严重，甚至是致命的。

同样地，对于已知患有或怀疑患有寄生虫感染的患者，如类圆线虫（蛲虫）感染，可能会导致类圆线虫高度感染及伴随广泛幼虫迁移的散播，常常伴有重度的小肠结肠炎和潜在致命的革兰阴性菌败血症，应非常谨慎地使用皮质类固醇。

皮质类固醇在感染性休克中的作用一直存在争议，早期研究报告了其有益的和不利的影响。最近，补充皮质类固醇显示对那些表现出肾上腺皮质功能不全的确诊感染性休克患者是有益的，但是，并不推荐常规用于感染性休克。一项对短期高剂量皮质类固醇应用的系统综述并不支持其使用。然而，荟萃分析和一项综述建议，较长疗程（5~11天）的低剂量皮质类固醇可能会降低死亡率。

禁止对正在接受皮质类固醇免疫抑制剂量治疗的患者使用活疫苗或减毒活疫苗。灭活疫苗可能可用于正在接受皮质类固醇免疫抑制剂量治疗的患者，但是，这种疫苗的反应可能会被减弱。这表明，正在接受非皮质类固醇免疫抑制剂量治疗的患者可接受适用的免疫接种程序。

皮质类固醇在活动性结核病中的使用应仅限于暴发性或扩散性结核病，皮质类固醇与适当的抗结核病疗法联合使用以控制病情。

如果皮质类固醇用于潜伏性结核病或结核菌素阳性反应的患者时，必须密切观察以防病情复发。这些患者在长期服用皮质类固醇期间，应接受化学预防治疗。

曾有正在接受皮质类固醇治疗的患者发生卡波济氏肉瘤的报道。皮质类固醇停药可能会带来临床缓解。

血液和淋巴系统

阿司匹林和非甾体抗炎药与皮质类固醇一起使用时应慎重。

免疫系统影响

可能会发生过敏反应。因为正在接受皮质类固醇治疗的患者罕有发生皮肤反应和严重过敏反应/类似严重过敏反应，所以在给药之前，特别是对有任何药物过敏史的病人，应采取适当的预防措施。

内分泌影响

长期给予药理剂量的皮质类固醇药物可能会导致下丘脑-垂体-肾上腺（HPA）抑制（继发性肾上腺皮质功能不全）。引起的肾上腺皮质功能不全的程度和持续时间在不同的患者各不相同，取决于给药的剂量、频率、给药时间，以及糖皮质激素治疗的疗程。隔日治疗可能会减小这一影响。

此外，如果突然停用糖皮质激素，可能会发生由急性肾上腺皮质功能不全导致的致命性结果。

因此，逐渐减少剂量可能会减少由药物引起的继发性肾上腺皮质功能不全。这种相对功能不全在治疗停止后可能会持续数月，因此，在此期间出现任何应激情况，都应重新恢复激素治疗。由于盐皮质激素的分泌可能受到损害，所以应同时给予盐和/或盐皮质激素。

接受皮质类固醇治疗的患者经受不寻常的应激时，在应激情况发生前、发生时和发生后需要迅速增加皮质类固醇的剂量。

类固醇“停药综合征”似乎与肾上腺皮质功能不全无关，也可能在糖皮质激素突然停药后出现。这种综合征包括的症状诸如：厌食、恶心、呕吐、嗜睡、头痛、发热、关节疼痛、脱屑、肌痛、体重减轻和/或低血压。这些影响被认为是由于糖皮质激素浓度的突然变化，而不是因为皮质类固醇的水平低引起的。

因为糖皮质激素能引发或加重库欣综合征，所以应避免对库欣病患者使用糖皮质激素。

皮质类固醇在对患有甲状腺功能减退症的患者效应具有增强效果。

代谢和营养

包括甲泼尼龙在内的皮质类固醇，能使血糖增加，使原有糖尿病恶化，使那些长期接受皮质类固醇治疗的患者易患糖尿病。

精神影响

服用皮质类固醇时，可能会出现精神紊乱，表现为欣快、失眠、情绪波动、人格改变以及重度抑郁直至明显的精神病表现。此外，皮质类固醇可能会加剧原有的情绪不稳或精神病倾向。

全身性类固醇治疗时可能会发生潜在的严重精神不良反应。在治疗开始后的数天或数周内出现典型的症状。尽管可能需要针对性的治疗，大多数反应在减少剂量或停药后恢复。根据报道，在皮质类固醇停药后会出现心理效应，但频率尚不知晓。如果患者出现心理症状，特别是如果怀疑出现抑郁情绪或自杀意念，应鼓励患者/看护者马上就医。患者/看护者应警惕可能在全身性类固醇剂量递减/停药过程中或者之后立即出现的精神错乱。

神经系统影响

皮质类固醇应谨慎用于癫痫患者。

皮质类固醇应谨慎用于重症肌无力患者。（另见下面章节肌肉骨骼影响中有关肌病的陈述。）

眼部影响

因为可能会引起角膜穿孔，所以皮质类固醇应谨慎用于眼部单纯疱疹患者。

长期使用皮质类固醇可能会引发后房囊下白内障和核性白内障（尤其在儿童中）、眼球突出或者眼内压增高，可能会导致可能损害视神经的青光眼。也可能增加正在接受糖皮质激素治疗的患者眼部继发性真菌和病毒感染。

心脏影响

糖皮质激素对心血管系统具有不良反应，例如血脂异常和高血压，如果高剂量且长期使用，可能会使原有心血管危险因素的患者易于发生心血管不良反应。因此，皮质类固醇应谨慎用于这类患者，如果需要，应注意风险修正以及增加心脏监测。低剂量和隔日疗法可能会减少皮质类固醇治疗的并发症发生率。

据报道，快速静脉注射大剂量甲泼尼龙琥珀酸钠（10分钟内给药量超过0.5g）会引发心律失常、和/或循环虚脱、和/或心脏停搏。已有报道，给予大剂量甲泼尼龙琥珀酸钠的过程中或者之后发生心动过缓，且可能与滴注速度或时间无关。

除非绝对必要时，全身性皮质类固醇应谨慎用于充血性心脏衰竭病。

血管影响

类固醇应谨慎用于高血压患者。

胃肠道影响

对于皮质类固醇本身是否与治疗过程中出现的消化性溃疡有关，没有达成普遍的共识。但是，糖皮质激素治疗可能会掩盖消化性溃疡的症状，以至于发生穿孔或者出血而无明显的疼痛。

非特异性溃疡性结肠炎患者，如果有即将穿孔、脓肿、或其它化脓性感染、憩室炎、新近肠吻合术、或者活跃的或潜在的消化性溃疡的可能，应谨慎使用皮质类固醇。

肝胆影响

高剂量的皮质类固醇可能会引发急性胰腺炎。

肌肉骨骼影响

已有报道，高剂量皮质类固醇的使用会引起急性肌病，最常发生在患有神经肌肉传递障碍（例如，重症肌无力）的患者身上，或者发生在正在同时接受抗胆碱能药物如神经肌肉阻断药（例如，泮库溴铵）治疗的患者身上。急性肌病是全身性的，可能累及眼部和呼吸系统的肌肉，并可能导致四肢瘫痪。可能会发生肌酸激酶的升高。皮质类固醇停药后的临床改善或恢复可能需要几周到几年时间。

骨质疏松症是一种常见的但不常被识别的副作用，与长期大剂量使用糖皮质激素有关。

肾和泌尿系统异常

皮质类固醇应谨慎用于患有肾功能不全的患者。

检查

氢化可的松或可的松的平均剂量和大剂量能够引起血压升高、盐和水潴留以及增加钾的排泄。除非大剂量使用，合成的衍生物较少发生这些作用。限制盐的摄入量和补充钾可能是必要的。所有皮质类固醇都会增加钙的排泄。

损伤、中毒和操作并发症

一项多中心研究结果表明，甲泼尼龙琥珀酸钠不应用于颅脑损伤的常规治疗。研究结果显示与安慰剂相比，给予甲泼尼龙琥珀酸钠的患者在创伤后 2 周或 6 个月内死亡率增加。与甲泼尼龙琥珀酸钠治疗的因果关系尚未确定。

其它不良事件

因为糖皮质激素治疗的并发症与用药剂量大小和疗程有关，所以必须对每个病例就剂量和疗程以及采用每日给药或者间歇治疗做出风险/效益决定。

应尽可能使用低剂量的皮质类固醇来控制治疗情况，而且当可能减少剂量时，应逐步减少。

如用药时发现不良反应/不良事件应告知医生。

本品使用苯甲醇作为溶媒，禁止用于儿童肌肉内注射。

运动员慎用。

对驾驶和使用机器能力的影响

对于皮质类固醇对驾驶或使用机器能力的影响尚未做出系统性评价。使用皮质类固醇治疗后可

能出现不良反应，例如，头晕、眩晕、视觉障碍和疲劳感。患者如果受到影响，不应驾车或操作机器。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

生育力

没有证据证明皮质类固醇损害生育力。

妊娠

动物研究表明，妊娠期间使用大剂量的皮质类固醇，可能会导致胎儿畸形。然而，怀孕妇女使用皮质类固醇似乎并不会引起先天性异常。然而，因为人类研究并不能排除危害的可能性，所以只有确实需要时，甲泼尼龙琥珀酸钠才可用于孕妇。

一些皮质类固醇容易穿过胎盘。一项回顾性研究发现，正在接受皮质类固醇治疗的母亲所生的婴儿低出生体重的发生率增加。尽管在子宫内接触过皮质类固醇的婴儿似乎极少出现新生儿肾上腺皮质功能不全，但是对于那些接触过大剂量皮质类固醇的婴儿，必须仔细观察并且评估其肾上腺皮质功能不全的迹象。

皮质类固醇对产痛和分娩的影响尚不知晓。

已经发现，怀孕期间接受过长期皮质类固醇治疗的母亲所生的婴儿在出生时患有白内障。

哺乳

皮质类固醇随乳汁分泌。

分布到母乳中的皮质类固醇可能会抑制哺乳期婴儿的生长并干扰其内源性糖皮质激素的生成。因为未做过足够的关于糖皮质激素的人类生殖研究，所以只有在判断治疗的益处要大过它对婴儿的潜在风险之后，才能够将这些药物用于哺乳母亲。

该药物用于孕妇、哺乳母亲或有怀孕可能的妇女时，应权衡药物的益处与其对母亲和胚胎或胎儿的潜在风险。

【儿童用药】

婴儿和儿童可减量，但不仅仅是依据年龄和体积大小，而更应考虑疾病的严重程度及患者的反应。每 24 小时总量不应少于 0.5mg/kg。

本品中含有苯甲醇。据报道，苯甲醇与致命的早产儿“喘息综合征”有关。

应注意观察长期接受皮质类固醇治疗的婴儿和儿童的生长发育。正在接受长期每天分剂量糖皮质激素治疗的儿童的生长可能受到抑制，这种治疗方案应被限制使用在最紧急的适应症。通常，隔日糖皮质激素治疗可避免或者减少这种副作用。

接受长期皮质类固醇治疗的婴儿和儿童具有颅内压升高的特殊风险。

高剂量的皮质类固醇可能会引发儿童患胰腺炎。

【老年用药】

目前尚缺乏本品老年患者用药的安全性及有效性研究资料。请遵医嘱用药。

由于对骨质疏松症的潜在风险增加，以及对体液潴留伴随可能产生高血压的风险增加，所以建议对老年人采用长期皮质类固醇治疗应谨慎。

【药物相互作用】

甲泼尼龙是细胞色素P450酶（CYP）的底物，其主要经CYP3A4酶代谢。CYP3A4是成人肝脏内最丰富的CYP亚家族中占主导地位的酶。它催化类固醇的6 β -羟基化，这是内源性的和合成的皮质类固醇基本的第一阶段代谢。许多其它化合物也是CYP3A4的底物，通过CYP3A4酶的诱导（上调）或者抑制，其中一些（以及其它药物）显示能够改变糖皮质激素的代谢。

CYP3A4 抑制剂——抑制 CYP3A4 活性的药物，通常降低肝脏清除，并增加 CYP3A4 底物药物的血浆浓度，例如甲泼尼龙。由于 CYP3A4 抑制剂的存在，可能需要调整甲泼尼龙的剂量，以避免类固醇毒性。

CYP3A4 诱导剂——诱导 CYP3A4 活性的药物通常增加肝脏清除，导致 CYP3A4 底物药物的血浆浓度降低。同时服用可能需要增加甲泼尼龙的剂量，以达到预期的效果。

CYP3A4 底物——由于另一个 CYP3A4 底物的存在，甲泼尼龙的肝脏清除可能受到抑制或者诱导，需要调整相应的剂量。使用任一种药物引起的不良反应可能在两种药物同时使用时更容易发生。

非 CYP3A4 介导的影响——与甲泼尼龙发生的其它相互作用和影响见下表所述。

下表提供了一份与甲泼尼龙发生相互作用或影响的最常见的和/或临床上重要的药物清单和说明。

与甲泼尼龙发生相互作用/影响的重要药物或者物质

药物分类或者类型 - 药物或者物质	相互作用/影响
抗菌药物 - 异烟肼	CYP3A4抑制剂。此外，甲泼尼龙对异烟肼的乙酰化速度以及清除具有潜在的影响。
抗生素，抗结核药物 - 利福平	CYP3A4诱导剂
抗凝药（口服）	甲泼尼龙对口服抗凝药的影响各异。当抗凝药与皮质类固醇同时使用时，其抗凝血作用有增强也有减弱的报道。因此，应监测凝血指标，以维持所需的抗凝血作用。
抗惊厥药 - 卡马西平	CYP3A4诱导剂（和底物）
抗惊厥药 - 苯巴比妥 - 苯妥英	CYP3A4诱导剂
抗胆碱能药 - 神经肌肉阻断剂	皮质类固醇可能会影响抗胆碱能药物的作用。 1) 根据报道，高剂量皮质类固醇和抗胆碱能药物如神经肌肉阻断药物的同时使用会引起急性肌病。（更多信息参见【注意事项】中的肌肉骨骼系统部分） 2) 根据报道，正在服用皮质类固醇的患者中洋库溴铵和维库溴铵的神经肌肉阻断作用出现拮抗作用。所有竞争性神经肌肉阻断剂的这种相互作用是可以预见的。
抗糖尿病药	因为皮质类固醇可能会增加血糖浓度，所以可能需要调整抗糖尿病药的剂量。
止吐药 - 阿瑞吡坦 - 福沙吡坦	CYP3A4抑制剂（和底物）
抗真菌药 - 伊曲康唑 - 酮康唑	CYP3A4抑制剂（和底物）
抗病毒药 - HIV-蛋白酶抑制剂	CYP3A4抑制剂（和底物） 蛋白酶抑制剂，例如茚地那韦和利托那韦，可能增加皮质类固醇的血浆浓度。
芳香酶抑制剂 - 氨鲁米特	氨鲁米特诱发的肾上腺抑制可能会阻碍由长期糖皮质激素治疗引起的内分泌变化。
钙通道阻断剂 - 地尔硫卓	CYP3A4抑制剂（和底物）
避孕药（口服） - 乙炔雌二醇/炔诺酮	CYP3A4抑制剂（和底物）
- 葡萄柚汁	CYP3A4抑制剂
免疫抑制剂 - 环孢霉素	CYP3A4抑制剂（和底物） 1) 同时使用环孢菌素和甲泼尼龙会引起代谢的相互抑制，这可能会增加其中一种药物或者这两种药物的血浆浓度。因此，使用任

药物分类或者类型 - 药物或者物质	相互作用/影响
	一种药物引起的不良反应在同时使用这两种药物时可能更容易发生 2) 同时使用甲泼尼龙和环孢菌素有引起惊厥的报道
免疫抑制剂 - 环磷酰胺 - 他克莫司	CYP3A4底物
大环内酯类抗菌药物 - 克拉霉素 - 红霉素	CYP3A4抑制剂（和底物）
大环内酯类抗菌药物 - 醋竹桃霉素	CYP3A4抑制剂
NSAIDs（非甾体抗炎药） - 高剂量阿司匹林 （乙酰水杨酸）	1) 皮质类固醇与非甾体抗炎药同时服用，可能会增加胃肠道出血和溃疡的发生率。 2) 甲泼尼龙可能会增加高剂量阿司匹林的清除，水杨酸盐血清水平降低，当甲泼尼龙停药时，能导致水杨酸盐中毒危险增加。
排钾药物	当皮质类固醇与排钾药物（即，利尿剂，两性霉素B）同时给药时，应密切观察患者低血钾症的发展。皮质类固醇与两性霉素B、黄嘌呤或β2受体激动剂的同时使用也会增加低钾血症的风险。

配伍禁忌

为了避免相容性和稳定性问题，建议将甲泼尼龙琥珀酸钠与其它那些经由静脉注射给药的化合物分开进行给药。那些与甲泼尼龙琥珀酸钠在溶液中物理不相容的药物包括但不限于：别嘌呤醇钠、盐酸多沙普仑、替加环素、盐酸地尔硫卓，葡萄糖酸钙、维库溴铵，罗库溴铵、顺苯磺阿曲库铵、甘罗溴铵、异丙酚。

静脉注射甲泼尼龙琥珀酸钠溶液以及它与其它静脉注射剂药物混合的相容性和稳定性取决于混合溶液的 pH 值、浓度、时间、温度以及甲泼尼龙自身的溶解性。因此，为了避免相容性和稳定性问题，建议无论是通过静脉药物腔室进行静脉注射，还是作为“piggy-back”溶液静脉输注，都尽可能的将甲泼尼龙琥珀酸钠与其它药物分开给药。

【药物过量】

未发现皮质类固醇急性过量引起的临床综合征。皮质类固醇用药过量引起的急性毒性和/或死亡罕有报道。如果发生药物过量，没有特效的解毒剂，治疗是支持对症性的。本品可经透析排出。

【药理毒理】

本品为可供静脉及肌肉注射用的甲泼尼龙，是一种合成的糖皮质激素。这种高浓度的水溶液特别适用于需用作用强、起效快的激素治疗的疾病状态。甲泼尼龙具有很强的抗炎、免疫抑制及抗过敏活性。

糖皮质激素扩散透过细胞膜，并与胞浆内特异的受体相结合。此结合物随后进入细胞核内与

DNA（染色质）结合，启动信使核糖核酸（mRNA）的转录，继而合成各种酶蛋白，据认为，糖皮质激素最终即靠这些酶得以发挥其多种全身作用。糖皮质激素不仅对炎症和免疫过程有重要作用，而且影响碳水化合物、蛋白质和脂肪代谢，并且对心血管系统、骨骼肌肉系统及中枢神经系统也有作用。

-- 作用于炎症和免疫过程：

糖皮质激素的大部分治疗作用都与它的抗炎、免疫抑制和抗过敏特性有关，这些特性会导致下列结果：

- 减少炎症病灶周围的免疫活性细胞
- 减少血管扩张
- 稳定溶酶体膜
- 抑制吞噬作用
- 减少前列腺素和相关物质的产生

4mg 甲泼尼龙的糖皮质激素作用（抗炎作用）与 20mg 氢化可的松相同。甲泼尼龙仅有很低的盐皮质激素作用（200mg 甲泼尼龙等价于 1mg 脱氧皮质酮）。

-- 对碳水化合物及蛋白质代谢的作用：

糖皮质激素具有分解蛋白质的作用，释放出的氨基酸经糖异生过程在肝脏内转化为葡萄糖和糖原；同时，外周组织对葡萄糖的吸收减少，从而导致血糖增高和葡萄糖尿。有糖尿病倾向的患者尤其明显。

-- 对脂肪代谢的作用：

糖皮质激素具有分解脂肪的作用，该作用主要影响四肢；另外，糖皮质激素又具有脂肪合成作用，该作用在胸部、颈部和头部尤为明显。所有这些导致了脂肪的重新分布。

糖皮质激素的最大药理作用出现在血药峰浓度之后，表明其大部分作用是通过改变酶活性引起的，而不是药物的直接作用。

临床前安全性数据

根据安全药理学的常规研究，对小鼠、大鼠、兔子和犬经静脉注射、腹腔注射、皮下注射、肌肉注射和口服途径给药，进行重复剂量毒性研究，未发现非预期的危害。甲泼尼龙是一种强效类固醇，其药理活性与糖皮质激素的药理活性一致，包括对碳水化合物代谢、电解质与水平衡、血液有形成分、淋巴组织、蛋白质代谢导致体重增加下降或缺乏、淋巴细胞减少、脾脏萎缩、胸腺、淋巴结、肾上腺皮质和睾丸以及肝脏脂肪变性和胰岛细胞增殖的作用。一项用甲泼尼龙治疗大鼠进行的 30 天可逆性研究显示，正常器官功能在停药后大约一个月内得到恢复。大鼠在接受 52 周的磺庚甲泼尼龙治疗后，经过 9 周的可逆转期，许多参数恢复正常。在重复给药毒性研究中发现的毒性是那些持续暴露于外源性肾上腺皮质类固醇所预期引发的毒性。

致癌作用：

因为该药物只适用于短期治疗，而且没有任何迹象表明其具有潜在致癌性，所以未在动物中进行评估其致癌作用的长期研究。目前没有证据表明皮质类固醇会致癌。

致畸作用:

对中国仓鼠 V79 细胞进行了 DNA 损伤/碱性洗脱分析试验, 没有可能发生基因和染色体突变的证据。在肝活化系统缺乏的情况下, 甲泼尼龙不会诱导染色体损伤。

生殖毒性:

在关于甲泼尼龙的胚胎毒性作用的动物研究中, 每天对小鼠或大鼠经腹腔注射分别给予 125mg/kg/天或 100mg/kg/天的剂量, 未发现甲泼尼龙有致畸作用。对大鼠经皮下注射给予 20mg/kg/天剂量的甲泼尼龙, 具有致畸作用。对大鼠经皮下注射给予 1.0mg/kg/天剂量的醋丙甲泼尼龙, 醋丙甲泼尼龙具有致畸作用。

【药代动力学】

甲泼尼龙的药代动力学呈线性, 不受给药途径的影响。

采用高效液相色谱分析方法测定甲泼尼龙的血浆浓度。对 14 例健康成年男性志愿者经肌肉注射给予 40mg 剂量的甲泼尼龙琥珀酸钠, 给药后 1 小时达到平均峰浓度 454ng/mL。给药后 12 小时, 甲泼尼龙的血浆浓度下降至 31.9ng/mL。给药后 18 小时检测不到甲泼尼龙。根据浓度时间曲线下面积, 提示总的药物吸收的一个指标, 发现肌肉注射甲泼尼龙琥珀酸钠与静脉注射相同剂量的甲泼尼龙琥珀酸钠等效。

研究结果证明, 经过所有的给药途径, 甲泼尼龙的琥珀酸钠酯都能迅速、广泛地转化为等量的活性成分甲泼尼龙。经静脉注射和肌肉注射给药后的游离甲泼尼龙的吸收程度相等, 而且显著高于那些经口服溶液或者口服甲泼尼龙片剂给药的吸收程度。经静脉注射和肌肉注射给药的甲泼尼龙的吸收程度相当, 尽管经静脉注射给药后到达体循环的半琥珀酸酯的量较高, 这表明经肌肉注射给药后药物在组织中转化, 随后以游离甲泼尼龙的形式吸收。

甲泼尼龙广泛地分布到组织中, 穿过血脑屏障, 可经乳汁分泌。甲泼尼龙的人血浆蛋白结合率约为 77%。

甲泼尼龙经人肝脏代谢为无活性的代谢产物, 其中主要有 20 α -羟基甲泼尼龙和 20 β -羟基甲泼尼龙。

在肝脏主要通过 CYP3A4 代谢。(参见【药物相互作用】, 提供了一份基于 CYP3A4 介导代谢的药物相互作用列表。)

总甲泼尼龙的平均消除半衰期在 1.8~5.2 小时范围, 其表观分布容积约为 1.4mL/kg, 总清除率约为 5~6mL/min/kg。

与许多 CYP3A4 底物类似, 甲泼尼龙也可能是三磷酸腺苷结合盒 (ABC) 转运蛋白 P-糖蛋白的底物, 影响组织分布以及与其它药物的相互作用。

对于肾功能衰竭的患者不需要调整剂量。甲泼尼龙可经血透析。

【贮藏】

未溶解的药品, 密闭, 15~25°C 保存。

用所附稀释液溶解所得的溶液可在室温 (15~25°C) 下贮藏 48 小时。

【包装】

- (1) 40mg 规格：双室瓶包装，1 瓶/盒。
- (2) 125mg 规格：双室瓶包装，1 瓶/盒。
- (3) 500mg 规格：西林瓶装，1 瓶/盒，每盒同时附带 1 瓶稀释液。

【有效期】

- (1) 40mg 规格：24 个月
- (2) 125mg 规格：24 个月
- (3) 500mg 规格：60 个月

【执行标准】

- (1) 40mg 规格：进口药品注册标准 JX20000424
- (2) 125mg 规格：进口药品注册标准 JX20030293
- (3) 500mg 规格：进口药品注册标准 JX20000147

【批准文号】

进口药品注册证号：

- (1) 40mg 规格：H20080284
- (2) 125mg 规格：H20080286
- (3) 500mg 规格：H20080285

【生产企业】

企业名称：Pfizer Manufacturing Belgium NV

生产地址：Rijksweg 12, 2870 Puurs, Belgium

国内联系地址：

北京市东城区朝阳门北大街 3-7 号第五广场 B 座 12 层

邮编：100010

电话：010-85167000