

核准日期:



## 注射用磷酸肌酸钠说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

警示语: 对本品组分过敏者禁用。慢性肾功能不全患者禁止大剂量(5-10g/日)使用本品。

### 【药品名称】

通用名称: 注射用磷酸肌酸钠

英文名称: Creatine Phosphate Sodium for Injection

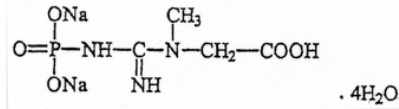
汉语拼音: Zhusheyong Linsuanjisuan

### 【成份】

本品主要成份为磷酸肌酸二钠盐四水合物

化学名称: N-[亚氨基(膦氨基)甲基]-N-甲基甘氨酸二钠盐四水合物

化学结构式:



分子式:  $\text{C}_4\text{H}_8\text{N}_5\text{O}_3\text{PNa}_2 \cdot 4\text{H}_2\text{O}$

分子量: 327.153

### 【性状】

本品为白色粉末或结晶性粉末。

### 【适应症】

心脏手术时加入心脏停搏液中保护心肌。

缺血状态下的心肌代谢异常。

### 【规格】

1.0g (按  $\text{C}_4\text{H}_8\text{N}_5\text{O}_3\text{PNa}_2$  计)

### 【用法用量】

遵医嘱静脉滴注, 每次 1g (1 瓶), 每日 1-2 次, 在 30-45 分钟内静脉滴注。

心脏手术时加入心脏停搏液中保护心肌: 心脏停搏液中的浓度为 10mmol/L。

### 【不良反应】

尚不明确。

用药过程中如有任何不适, 请立即通知医生。

### 【禁忌】

对本品组分过敏者禁用。

慢性肾功能不全患者禁止大剂量(5-10g/日)使用本品。

### 【注意事项】

快速静脉注射 1g 以上的磷酸肌酸钠可能会引起血压下降。

大剂量(5-10g/日)给药引起大量磷酸盐摄入, 可能会影响钙代谢和调节稳态的激素的分泌, 影响肾功能和嘌呤代谢。

上述大剂量需慎用且仅可短期使用。

配伍禁忌: 无。

对驾驶和操纵机械的影响: 无。

### 【孕妇及哺乳期妇女用药】

无禁忌。

### 【儿童用药】

尚不明确。

### 【老年者用药】

通常无需调整用药剂量, 但肾功能不全者应适当减少用药剂量。

### 【药物相互作用】

本品不与其它药物发生相互作用。

### 【药物过量】

无特异性解毒药。如过量可采取对症治疗。

### 【药理毒理】

药理作用:

磷酸肌酸在肌肉收缩的能量代谢中发挥重要作用。它是心肌和骨骼肌的化学能量储备, 并用于 ATP 的再合成, ATP 的水解为肌球蛋白收缩过程提供能量。

氧化代谢减慢导致的能量供给不足是心肌细胞损伤形成和发展的重要因素。磷酸肌酸水平不足在心收缩力和功能恢复能力的损伤中具有重要的临床意义。实际上，在心肌损伤中，细胞内高能磷酸化化合物的数量，与细胞的存活和收缩功能恢复能力之间存在紧密关系。所以保持高能磷酸化化合物的水平成为各种限制心肌损伤方法的基本原则，同时也是心脏代谢保护的基础。

动物试验和人体的心脏停搏试验显示了磷酸肌酸钠的作用及其保护心肌的可能性。

药理学试验显示：

- 预先肌内注射磷酸肌酸钠，对异丙肾上腺素（大鼠和鸽子）、甲状腺素（大鼠）、吐根碱（豚鼠）、p-硝基苯酚（大鼠）、劳力（大鼠）等原因导致的各种心肌疾病有剂量依赖性的保护作用。
- 磷酸肌酸钠对离体的青蛙、大鼠和豚鼠的心脏以及豚鼠的心耳发挥正性肌力作用。
- 磷酸肌酸钠可拮抗缺氧对离体豚鼠心房的负性肌力作用。
- 在对体内和离体的多种试验模型的试验中，向心脏停搏液中加入磷酸肌酸钠均可加强对心肌的保护。
- 磷酸肌酸钠对冠状动脉阻塞引起的实验性心肌梗塞及心率失常提供保护。
- 磷酸肌酸钠的心肌保护功能与以下作用相关：稳定肌纤维膜；通过抑制核苷酸分解酶而保持细胞内腺嘌呤核苷酸水平，抑制缺血心肌部位的磷脂降解；通过抑制 ADP-诱导的血小板聚集而改善缺血部位的微循环。

毒理作用：

动物试验显示，短期和长期使用磷酸肌酸钠进行治疗均无潜在毒性。

磷酸肌酸钠无致畸作用。

#### 【药代动力学】

兔肌注磷酸肌酸，20—40 分钟后血药浓度达到峰值，此时约有 25-28% 的给药剂量在血液中。然后数值缓慢下降，250 分钟后仍有 9% 外源性磷酸肌酸在血液中。

肌注磷酸肌酸后 40-250 分钟期间，可观察到血液 ATP 水平升高，100 分钟后达最高浓度，此时 ATP 水平升高 25%。

兔静脉给药后，磷酸肌酸以活性形式出现在血液中并在 30 分钟内逐渐减少。血液 ATP 水平升高（峰值时升高大于 24%），300 分钟后恢复正常。

人体静脉给予磷酸肌酸的消除半衰期为 0.09-0.2 小时。缓慢滴注 5g 的磷酸肌酸 40 分钟后，血药浓度下降至 5nmol/ml 以下。10g 剂量给药 40 分钟后，血药浓度可达 10nmol/ml。

肌内注射磷酸肌酸 500mg，5 分钟后磷酸肌酸出现在血液中，30 分钟后达峰值，约为 10 nmol/ml，1 小时后下降至 4-5nmol/ml。2 小时后，仍为 1-2nmol/ml。750mg 剂量给药的峰浓度为 11-12 nmol/ml。

对组织的分析显示，外源的磷酸肌酸主要分布在心肌和骨骼肌，脑和肾组织次之，肺和肝组织最少。体内代谢和排泄过程为磷酸肌酸经催化去磷酸化形成肌酸，然后肌酸环化为肌酐，最后经尿排泄。

【贮藏】密封，在凉暗（避光并不超过 20℃）干燥处保存。

【包装】钠钙玻璃输液瓶，1 瓶/盒。

【有效期】暂定 24 个月

【执行标准】YBH08642005

【批准文号】国药准字 H20054352

【生产企业】

企业名称：哈尔滨博莱制药有限公司

生产地址：哈尔滨市利民开发区北京路

邮政编码：150025

电话号码：0451-57351842、57351962

传真号码：0451-57351847

网 址：www.bolai.com.cn