

核准日期: 2006年08月09日
修改日期: 2010年04月30日
2011年02月14日
2013年12月26日
2014年12月04日
2015年02月01日
2016年12月01日
2020年11月30日
2020年12月31日
2023年05月23日
2024年03月12日
2024年10月28日

皇隆®达士®

注射用吡拉西坦说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

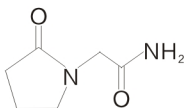


【药品名称】

通用名称: 注射用吡拉西坦
英文名称: Piracetam for Injection
汉语拼音: Zhushheyong Bilaxitan

【成份】

本品主要成份为吡拉西坦。
化学名称: 2-氧代-1-吡咯烷基乙酰胺。
化学结构式:



分子式: $C_5H_9N_2O_2$

分子量: 142.16

辅料: 本品未添加任何辅料。

【性状】本品为白色或类白色粉末或结晶性粉末, 或疏松块状物。

【适应症】

适用于急、慢性脑血管病、脑外伤、各种中毒性脑病等多种原因所致的记忆减退及轻、中度脑功能障碍。也用于儿童智能发育迟缓。

【规格】(1) 4.0g (2) 8.0g

【用法用量】

静脉滴注。每次4~8g, 一日1次, 用5%或10%葡萄糖注射液或氯化钠注射液稀释至250ml后使用, 或遵医嘱。

【不良反应】

根据文献报道, 安慰剂盲法对照临床试验和药物临床试验包括3000多例接受吡拉西坦的受试者(不论适应症、剂型、日剂量和人群特点)。下表列出了临床试验及上市后使用经验中报告的不良反应发生率。发生率定义如下: 非常常见($\geq 1/10$), 常见($\geq 1/100$ 至 $<1/10$), 不常见($\geq 1/1000$ 至 $<1/100$), 罕见($\geq 1/10000$ 至 $<1/1000$), 非常罕见($<1/10000$), 未知(现有数据无法对发生频率进行估计, 如上市后监测数据)。

血液和淋巴系统疾病:

未知: 出血性疾病

免疫系统疾病:

未知: 过敏反应, 超敏反应, 过敏性休克

精神疾病:

常见: 紧张

不常见: 抑郁

未知: 激动, 焦虑, 困惑, 幻觉, 失眠, 兴奋, 烦躁, 精神障碍, 易激惹, 情绪不稳定

神经系统疾病:

常见: 运动过度

不常见: 嗜睡

未知: 共济失调, 平衡障碍, 癫痫加重, 头痛, 头晕, 麻木, 抽搐, 震颤, 记忆减退, 意识丧失, 诱发癫痫发作, 锥体外系症状

耳及迷路类疾病:

未知: 眩晕

血管及淋巴管类疾病:

罕见: 血栓性静脉炎(仅适用于可注射形式), 低血压, 潮红, 静脉炎

胃肠类疾病:

未知: 腹痛, 上腹部疼痛, 腹泻, 恶心, 呕吐, 口干, 腹胀, 腹部不适, 便秘, 胃部不适, 反酸, 胃灼热

皮肤和皮下组织疾病:

未知: 斑丘疹、荨麻疹、红斑疹等各种皮疹, 瘙痒, 皮炎, 血管神经性水肿, 皮肤肿胀, 局部皮肤反应

全身性疾病及给药部位各种反应:

不常见: 虚弱

罕见: 注射部位疼痛(仅适用于注射剂), 发热

未知: 注射部位反应(肿胀、发红、瘙痒等), 疼痛, 畏寒, 寒战, 胸闷, 乏力, 水肿

各类检查:

常见: 体重增加

未知: 血压升高, 血压降低, 转氨酶升高

肝胆系统疾病:

未知: 肝功能异常, 肝细胞损害

心脏器官反应:

未知: 心悸, 心动过速, 心律失常

其他:

未知: 呼吸困难, 呼吸急促, 视物模糊, 食欲减退, 厌食

【禁忌】

1. 对本品任何成份过敏者禁用。
2. 脑出血患者禁用。
3. 严重肾功能损害患者禁用。
4. 重度肝功能障碍患者禁用。
5. 锥体外系疾病, Huntington舞蹈症者禁用, 以免加重症状。
6. 孕妇禁用。
7. 新生儿禁用。

【注意事项】

1. 由于吡拉西坦对于血小板聚集的影响, 在下列患者应谨慎使用: 严重出血或存在出血风险的患者, 如消化性溃疡、潜在凝血障碍、出血性脑血管病史、接受重大手术(包括牙科手术)、使用抗凝剂或抗血小板聚集药物(包括小剂量阿司匹林)的患者。

者。

2. 肾功能损害。由于吡拉西坦通过肾脏排泄, 因此轻、中度肾功能障碍者慎用并适当减少剂量。严重肾功能损害患者禁用。

3. 长期应用的老年人, 应定期监测肾功能, 如需要应适时进行剂量调整。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

怀孕

动物研究未显示对妊娠, 胚胎或胎儿发育, 分娩和产后发育的任何直接或间接的有害影响。吡拉西坦可穿过胎盘屏障。在新生儿中, 该药物约为母体的70%-90%。怀孕期间禁用吡拉西坦。

哺乳期

吡拉西坦可从母乳中排泄。因此, 在母乳喂养期间不应使用吡拉西坦。应在权衡母乳喂养对儿童的益处和妇女治疗的益处后, 决定停止使用吡拉西坦或停止母乳喂养。

【儿童用药】新生儿禁用。本品用于儿童患者的疗效、安全性尚未建立。

【老年用药】

老年患者可能会出现生理功能下降, 因此应慎用, 如需使用, 应注意酌情选择合适的剂量。肾功能受损的老年患者应调整剂量。长期应用的老年人, 应定期监测肾功能, 如需要应适时进行剂量调整。

【药物相互作用】

药代动力学相互作用

导致吡拉西坦药代动力学变化的药物相互作用潜力预计很低, 因为约90%剂量的吡拉西坦在尿中以原型药物形式排泄。在体外, 在142、426和1422 $\mu\text{g/ml}$ 的浓度下, 吡拉西坦不会抑制人体肝脏细胞色素P450亚型如CYP1A2, 2B6, 2C8, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1和4A9/11。浓度为1422 $\mu\text{g/ml}$ 时, 观察到轻微抑制CYP2A6(21%)和3A4/5(11%)的作用。然而这两种CYP亚型的抑制作用K_i值可能远超过1422 $\mu\text{g/ml}$ 。因此, 预计不会出现吡拉西坦与其它药物之间的代谢相互作用。

甲状腺激素

与甲状腺激素(T3+T4)合并治疗会引起意识模糊, 易怒和睡眠障碍。

醋酸香豆醇

在一项已发表的关于严重复发性静脉血栓形成患者的单盲研究中, 9.6g/d的吡拉西坦不会改变达到2.5-3.5INR(国际标准化比值)所需的醋酸香豆醇剂量, 但与单用醋酸香豆醇的作用相比, 加入9.5g/d吡拉西坦能显著减少血小板聚集, 减少 β -血小板球蛋白释放, 降低纤维蛋白原水平和血管性假血友病因子(VII: C; VII: vW; Ag; VII: vW: RCo), 降低血液和血浆的总粘度。

本品与华法林联合应用时, 可延长凝血酶原时间, 可诱导血小板聚集的抑制。在接受抗凝治疗的患者中, 同时应用吡拉西坦时应特别注意凝血时间、防止出血危险, 并调整抗凝治疗的药物剂量和用法。

抗癫痫药

在接受稳定剂量的癫痫患者中, 4周内每日20克的吡拉西坦剂量不会改变抗癫痫药物(卡马西平, 苯妥英钠, 苯巴比妥, 丙戊酸钠)的峰谷血清水平。

酒精

同时饮用酒精并未改变吡拉西坦的血清浓度, 口服吡拉西坦1.6g后酒精浓度并未改变。

【药物过量】

本品无特殊解救药, 一旦过量, 应按照药物过量治疗的一般原则进行处理, 并给予对症支持治疗。

【药理毒理】

吡拉西坦是一种 γ -氨基丁酸的环形衍生物。动物实验提示, 吡拉西坦可预防或保护动物因缺氧而导致的逆行性健忘, 另外, 吡拉西坦也能明显拮抗巴比妥盐对中枢的抑制作用, 这提示其可能增加细胞内ATP和细胞膜的兴奋性。

【药代动力学】

据文献报道, 吡拉西坦进入体内后, 半衰期约为5~6小时, 血浆蛋白结合率为30%, 分布于机体的大部分组织和器官, 并可透过血脑屏障到达脑组织和脑脊液中, 大脑皮层和嗅球的浓度较脑中浓度更高, 易通过胎盘屏障。吡拉西坦在体内基本不发生降解或生物转化, 主要以原形药物从尿中排出, 只有极少量(2%)从粪便中排出。

【贮藏】遮光, 密闭保存(10~30℃)。

【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】《中国药典》2020年版第一增补本

【批准文号】(1) 4.0g: 国药准字H20050638

(2) 8.0g: 国药准字H20050633

【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>