

核准日期: 2008年09月01日
修改日期: 2008年11月07日
2009年04月13日
2009年07月21日
2010年10月20日
2011年02月14日
2013年04月11日
2013年12月26日
2019年02月25日
2020年11月30日
2023年04月17日
2024年11月25日

皇隆® 博格®

注射用盐酸丙帕他莫说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

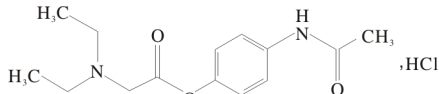


【药品名称】

通用名称: 注射用盐酸丙帕他莫
英文名称: Propacetamol Hydrochloride for Injection
汉语拼音: Zhushheyong Yansuan Bingpatamo

【成份】

本品主要成份为盐酸丙帕他莫。
化学名称: 2-(N,N-二乙氨基)乙酸-4-乙酰基苯酯盐酸盐
化学结构式:



分子式: $C_{14}H_{20}N_2O_3 \cdot HCl$

分子量: 300.78

辅料: 本品未添加任何辅料。

【性状】

本品为白色或类白色结晶性粉末。

【适应症】

在临床急需静脉给药治疗疼痛或高度发热时, 其他给药方式不适合的情况下, 用于中度疼痛的短期治疗, 尤其是外科手术疼痛。也可用于发热的短期治疗。

【规格】

(1) 1.0g (2) 2.0g

【用法用量】

成人及15岁以上儿童: 静注或滴注, 1~2g/次, 2~4次/日, 给药间隔最少不得短于4小时, 日剂量不超过8g。对于体质虚弱的成人每次给药剂量为1g。

本品临用前先用适量0.9%氯化钠注射液(或所附专用溶媒枸橼酸钠溶液)完全溶解。将1g的丙帕他莫用50ml或2g用100ml 0.9%氯化钠注射液稀释后使用(终浓度为20mg/ml), 在15分钟内输注完毕。

【不良反应】

常见不良反应主要是注射部位局部疼痛(10%)。发生率低于万分之一的不良反应有头晕、身体不适、红斑或荨麻疹等轻度过敏反应、血小板减少、白细胞减少、贫血、低血压、转氨酶升高和接触性皮炎。有发生急性性休克和医护人员发生接触性皮炎和严重过敏反应的报道。

【禁忌】

- 1、已知对本品过敏的患者。
- 2、服用阿司匹林或其它非甾体类抗炎药后诱发哮喘、荨麻疹或过敏反应的患者。
- 3、禁用于冠状动脉搭桥手术(CABG)围手术期疼痛的治疗。
- 4、有应用非甾体抗炎药后发生胃肠道出血或穿孔病史的患者。
- 5、有活动性消化道溃疡/出血, 或者既往曾复发溃疡/出血的患者。
- 6、重度心力衰竭患者。

【注意事项】

- 1、避免与其它非甾体抗炎药, 包括选择性COX-2抑制剂合用。
- 2、根据控制症状的需要, 在最短治疗时间内使用最低有效剂量, 可以使不良反应降到最低。
- 3、在使用所有非甾体抗炎药治疗过程中的任何时候, 都可能出现胃肠道出血、溃疡和穿孔的不良反应, 其风险可能是致命的。这些不良反应可能伴有或不伴有警示症状, 也无论患者是否有胃肠道不良反应史或严重的胃肠事件病史。既往有胃肠道病史(溃疡性大肠炎, 克隆氏病)的患者应谨慎使用非甾体抗炎药, 以免使病情恶化。当患者服用该药发生胃肠道出血或溃疡时, 应停药。老年患者使用非甾体抗炎药出现不良反应的频率增加, 尤其是胃肠道出血和穿孔, 其风险可能是致命的。
- 4、针对多种COX-2选择性或非选择性NSAIDs药物持续时间达3年的临床试验显示, 本品可能引起严重心血管血栓性不良事件、心肌梗塞和中风的风险增加, 其风险可能是致命的。所有的NSAIDs, 包括COX-2选择性或非选择性药物, 可能有相似的风险。有心血管疾病或心血管疾病危险因素的患者, 其风险更大。即使既往没有心血管症状, 医生和患者也应对此类事件的发生保持警惕。应告知患者严重心血管安全性的症状和/或体征以及如果发生应采取的步骤。

患者应该警惕诸如胸痛、气短、无力、言语含糊等症状和体征, 而且当有任何上述症状或体征发生后应该马上寻求医生

帮助。

5、和所有非甾体抗炎药(NSAIDs)一样, 本品可导致新发高血压或使已有的高血压症状加重, 其中的任何一种都可能导致心血管事件的发生率增加。服用噻嗪类或髓袢利尿剂的患者服用非甾体抗炎药(NSAIDs)时, 可能会影响这些药物的疗效。高血压病患者应慎用非甾体抗炎药(NSAIDs), 包括本品。在开始本品治疗和整个治疗过程中应密切监测血压。

6、有高血压和/或心力衰竭(如液体潴留和水肿)病史的患者应慎用。

7、NSAIDs, 包括本品可能引起致命的、严重的皮肤不良反应, 例如剥脱性皮炎、Stevens Johnson综合征(SJS)和中毒性表皮坏死溶解症(TEN)。这些严重事件可在没有征兆的情况下出现。应告知患者严重皮肤反应的征状和体征, 在第一次出现皮肤皮疹或过敏反应的其他征象时, 应停用本品。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

因本品活性代谢物对乙酰氨基酚可通过胎盘, 并可在乳汁中分泌, 故孕妇及哺乳期妇女不推荐使用。

【儿童用药】

严格用于年龄在15岁以上的少年及成人。

【老年用药】

老年患者由于肝、肾功能发生减退, 本品半衰期有所延长, 易发生不良反应, 应慎用或适当减量使用。

【药物相互作用】

1、在长期饮酒或应用其它肝酶诱导剂, 尤其是应用巴比妥类或其它抗惊厥药的患者, 长期或大量服用本品时, 更有发生肝脏毒性的危险。

2、本品与氯霉素合用, 可延长后者的半衰期, 增强其毒性。

3、本品与丙磺舒合用, 其清除率降低, 因此需减量使用。

4、长期使用本品会产生华法林样效应。与抗凝血药合用, 因可减少凝血因子在肝内的合成, 可增强凝血作用, 故抗凝血药的用量应根据凝血酶原时间进行调整。

5、长期大量与阿司匹林或其它非甾体抗炎药合用时(如每年累积用量至1000g, 应用3年以上时), 可明显增加肾毒性(包括肾乳头坏死、肾及膀胱癌等)的危险。

6、与抗病毒药齐多夫定(Zidovudine)合用时, 由于两药可相互降低与葡萄糖醛酸的结合作用而降低清除率, 从而增加毒性, 应避免同时应用。

【药物过量】

症状: 本品给药过量时因耗尽体内谷胱甘肽会导致严重肝脏损伤, 初期症状出现于过量给药后1~2天内, 表现为肝区疼痛、肝肿大或黄疸; 第4~6天可出现明显的肝功能衰竭以及凝血障碍、消化道出血、DIC、低血糖、酸中毒、心律失常、心衰或肾小管坏死。曾有报道一次服用对乙酰氨基酚8~15g可致严重肝坏死, 并于数日内死亡。

治疗: 解救应及时洗胃或催吐, 给予拮抗剂N-乙酰半胱氨酸(开始时按体重给予140mg/kg口服, 然后70mg/kg每4小时1次, 共17次; 病情严重时可静脉给药, 将药物溶于5%葡萄糖溶液200ml中静滴)或口服甲硫氨酸, 对肝脏有保护作用。拮抗剂宜尽早应用, 8~10小时内给药疗效满意, 超过24小时则疗效较差。同时还应给予其他疗法, 如血液透析等。极端情况时需进行肝脏移植。

【药理毒理】

本品是对乙酰氨基酚的前体药物, 具有解热镇痛作用。静注或肌注后, 可迅速被血浆酯酶水解, 释出对乙酰氨基酚而起作用, 通过对乙酰氨基酚抑制中枢COX活性, 减少PGE类的合成, 发挥其解热镇痛作用, 导致外周血管扩张、出汗而达到解热的作用, 其解热作用强度与阿司匹林相似; 通过抑制前列腺素PGE1、缓激肽和组胺等的合成和释放, 提高痛阈而起镇痛作用, 属于外周性镇痛药, 作用较阿司匹林弱, 仅对轻、中度疼痛有效。本品无明显抗炎作用。1g本品在血液中分解为0.5g对乙酰氨基酚。

【药代动力学】

丙帕他莫在血浆中99%迅速水解而成(水解半衰期约11分钟)对乙酰氨基酚及N,N-二乙基甘氨酸。静脉给药1g本品后产生的对乙酰氨基酚的血药峰值浓度(12.7mg/ml)明显高于口服0.5g对乙酰氨基酚所产生的血药峰值(5.5mg/ml)。在丙帕他莫推荐剂量范围内, 其产物对乙酰氨基酚的药代特征呈线性, 重复给药其药代参数不改变, 平均血浆半衰期为2.5~3.6小时。本品15分钟静脉输注后, 于15分钟开始起效, 1~2小时达药效峰值, 镇痛作用持续约4~6小时, 解热作用维持约4小时。

本品产物对乙酰氨基酚主要在肝脏代谢, 约60%~80%与葡萄糖醛酸结合后随尿排泄, 约20%~30%与硫酸结合后排泄, 有5%以上以原形排出。还有4%被细胞色素P450转化为一种与谷胱甘肽结合的代谢物, 主要通过尿液排泄。二乙基甘氨酸部分在尿中以原形分泌。

【贮藏】

密封, 置阴凉(不超过20℃)干燥处保存。

【包装】

(1) 1.0g: 低硼硅玻璃管制注射剂瓶, 1瓶/盒; 10瓶/盒。

(2) 2.0g: 低硼硅玻璃管制注射剂瓶, 1瓶/盒。

【有效期】

24个月

【执行标准】

YBH09502008

【批准文号】(1) 1.0g: 国药准字H20083986

(2) 2.0g: 国药准字H20083985

【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药谷三横路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药谷三横路8号

邮政编码: 570311

电话号码: 0898-68616800

传真号码: 0898-68616811

网 址: <http://www.hnluanglong.com>