

核准日期：2023年06月27日
修改日期：2023年07月21日
2023年08月02日

皇隆® 司隆®



注射用特利加压素说明书

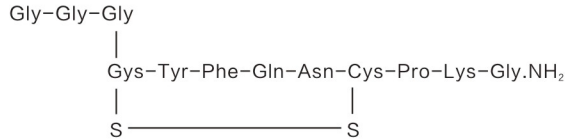
请仔细阅读说明书并在医师或药师指导下使用

【药品名称】

通用名称：注射用特利加压素
英文名称：Terlipressin for Injection
汉语拼音：Zhusheyong Telijiyasu

【成份】

本品活性成份为特利加压素。
化学名称：三甘氨酸-8-赖氨酸-加压素
化学结构式：



分子式：C₅₇H₇₄N₁₆O₁₅S₂
分子量：1227.4
辅料：甘露醇、稀盐酸。

【性状】

本品为白色疏松块状物和粉末。

【适应症】

治疗食管静脉曲张出血。

【规格】

1mg（相当于0.86mg特利加压素）

【用法用量】

每1mg冻干粉针剂用附带注射用溶剂（5ml）溶解，溶液配好后应立即使用。

本品推荐开始剂量为2mg，缓慢进行静脉注射（超过1分钟），同时监测血压及心率。维持剂量每4~6小时静脉给药1~2mg，直至出血得到控制，治疗时间为24~48小时。

建议每日最大剂量120~150 μg/kg。如出血还未得到控制，应考虑采用其它治疗方法。

【不良反应】

临床试验中最常见的不良反应（发生率1~10%）为皮肤苍白、血压升高、腹痛、腹泻和头痛。
本品不良反应发生率见下表：

发生率系统分类	常见（10~1%）	偶见（1~0.1%）	十分罕见（0.1~0.01%）	未知（从已有数据无法预测）
代谢		低钠血症，除非体液平衡得到控制		
神经系统	头痛			
心脏	心动过缓	心房纤维性颤动； 室性期外收缩； 心动过速； 胸痛； 心肌梗死； 体液过量伴随肺水肿；		尖端扭转型室性心动过速（TdP）； 心衰
血管	外周血管收缩； 外周缺血； 脸色苍白； 血压升高	肠道缺血； 周围性紫绀； 潮热		
呼吸系统		呼吸窘迫； 呼吸衰竭	呼吸困难	
胃肠道系统	短暂性腹部痉挛； 短暂性腹泻	短暂性恶心； 短暂性呕吐		
皮肤及皮下组织				皮肤坏死
怀孕，产后及产期				子宫肌张力过高； 子宫血流量降低
一般症状		注射部位局部坏死		

【禁忌】

本品禁用于：
1. 对本品特利加压素及其组分过敏者；

2. 败血症性休克；
3. 妊娠妇女和儿童。

【注意事项】

有下述合并症的患者应该在监测下慎用本品：
支气管哮喘、高血压、心血管疾病（严重动脉硬化、冠状动脉供血不足、心律失常）、肾功能不全。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

本品禁用于孕妇。由于特利加压素对平滑肌的作用，在妊娠首三个月使用可能引起自发性流产。另外，在孕中中进行的研究显示药物可以导致器官畸形，因此在人体中也不能排除此作用。

本品对哺乳期妇女影响的资料不足。

【儿童用药】

尚无儿童使用本品的临床经验。因此本品不适用于儿童。

【老年用药】

老年患者应用本品的临床经验有限，目前尚无该人群推荐剂量的相关数据。因此使用本品时应特别慎重。

【药物相互作用】

本品同时应用降低心率的药物如丙泊酚，舒芬太尼时可导致严重心动过缓。

【药物过量】

高血压患者应用本品而增高血压时，可静脉注射可乐定150 μg处理。

【药理毒理】

药理作用

特利加压素可以降低门静脉高压，同时减少门静脉区的血流，收缩食管平滑肌，持续压迫食管静脉曲张。具有生物活性的赖氨酸-加压素（LVP）从无活性的特利加压素中缓慢释放，由于LVP的代谢消除与释放平行，因此其浓度可在最低有效浓度和毒性浓度之间维持4~6小时。特利加压素的特别作用：

消化道系统：

特利加压素增加血管和血管外平滑肌细胞的张力。由于终末动脉血管的阻力增加，内脏神经的血流量降低，动脉血流降低使门静脉循环压力降低。肠道肌肉同时收缩引起蠕动增加。另外，食管壁肌肉收缩，因此把静脉曲张部位“结扎”起来。

肾脏：

特利加压素的利尿作用只有天然加压素的3%。因此这种作用无临床相关性。正常血容量情况下肾循环不受影响。低血容量时，肾循环则会增加。

血压：

使用特利加压素可缓慢产生血液动力学作用，作用可维持2~4小时。收缩压和舒张压轻度增加。肾血管张力过高和广泛动脉硬化患者可观察到血压明显升高。

心脏：

最高剂量时未见心脏毒性作用。

子宫：

特利加压素可以使子宫平滑肌和内膜的血流明显减少。

皮肤：

由于收缩血管的作用，特利加压素可以使皮肤血液循环不足，因此使患者的体表和面部苍白。

特利加压素的主要药理学效应是其血液动力学作用和对平滑肌的作用。低血容量状态下的集中作用对于出血性食道静脉曲张患者是有益的副反应。

【毒理研究】

遗传毒性：

特利加压素的Ames试验、染色体畸变试验和微核试验结果均为阴性。

生殖毒性：

大鼠每日皮下注射特利加压素10、50 μg/kg，对子宫着床点的平均数、平均活胎数或新生仔鼠数、胚胎或新生仔鼠的平均体重、新生仔鼠的生长未见毒性影响，胚胎和新生仔鼠未见畸形。

在妊娠兔中进行的研究显示特利加压素可导致自发流产和畸形。

致癌性：

尚未进行特利加压素的致癌性研究。

【药代动力学】

本品特利加压素（三甘氨酸赖氨酸加压素）几乎没有药理活性，静脉注射后特利加压素经蛋白酶作用后缓慢释放具有药理活性的代谢物赖氨酸加压素，同时持续释放甘氨酸。

特利加压素的平均血浆半衰期为24 ± 2分钟，单次静脉注射后，特利加压素以二级药理学形式消除，分布项（达到40分钟）的血浆半衰期为12分钟。本品经释放单一的甘氨酸后，赖氨酸加压素被缓慢释放，120分钟后达到峰浓度。注射后尿中仅可检测到1%的特利加压素，这表明经肝肾的内肽酶和肽链端酶作用后，本品近乎完全被降解。

【贮藏】

避光、避湿、室温保存。

【包装】

中硼硅玻璃管制注射剂瓶、冷冻干燥注射用无菌粉末用溴化丁基橡胶塞。1瓶/盒，5瓶/盒。每瓶附带无菌稀释溶剂1支（5ml：45mg），安瓿包装。

【有效期】24个月

【执行标准】YBH09412023

【批准文号】国药准字H20233814

【上市许可持有人】

名称：海南皇隆制药股份有限公司
注册地址：海南省海口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.hnhuanglong.com

【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.hnhuanglong.com