

核准日期：2007年4月27日  
修改日期：2007年6月6日  
2008年5月15日  
2009年11月10日  
2011年3月11日  
2011年7月4日  
2013年2月19日  
2013年3月27日  
2014年4月14日  
2017年10月31日  
2019年02月02日  
2020年11月16日  
2021年10月15日  
2022年06月30日

## 盐酸屈他维林注射液说明书

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：盐酸屈他维林注射液

商品名称：诺仕帕®

英文名称：Drotaverine Hydrochloride Injection

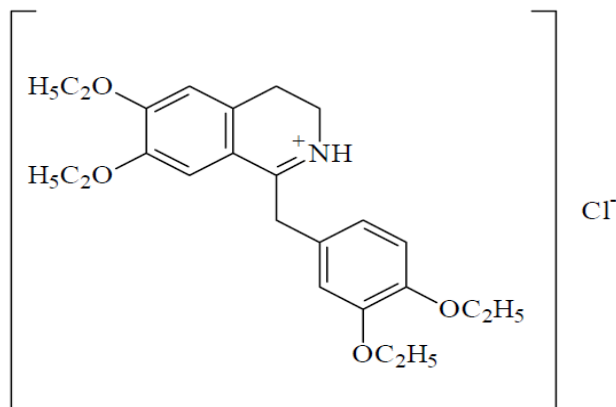
汉语拼音：Yansuan Qutaweilin Zhusheye

### 【成份】

主要成份：盐酸屈他维林

化学名称：1-（3，4-二乙氧基-苯甲基）-6，7-二乙氧基-3，4-二氢异喹啉盐酸  
盐

化学结构式：



分子式:  $C_{24}H_{31}NO_4 \cdot HCl$

分子量: 433.97

辅料: 焦亚硫酸钠, 96%乙醇, 注射用水

### 【性状】

本品为绿黄色的澄明液体。

### 【适应症】

- 胆道疾病（胆囊/胆管结石、胆囊/胆管炎等炎症）相关的平滑肌痉挛
- 泌尿系统疾病（肾/输尿管结石，肾盂/膀胱炎等炎症）所致的平滑肌痉挛；

本品还可用作下列疾病的辅助治疗：

- 胃肠道疾病（如胃和十二指肠溃疡、胃炎/肠炎/结肠炎等炎症）所致的平滑肌痉挛。

-缓解痛经。

### 【规格】

2ml:40mg（以  $C_{24}H_{31}NO_4 \cdot HCl$  计）

### 【用法用量】

推荐成人常规用量：本品每日使用 40-240mg（分 1-3 次使用），肌肉注射。

#### 急诊用药：

- 急性结石绞痛（肾性和/或胆源性）：本品 40-80mg，静脉内缓慢注射（大约 30 秒）。
- 其它腹部痉挛性疼痛：本品 40-80mg，肌注，必要时可重复使用，每日最多 3

次。

### 【不良反应】

临床研究报告表明，以下至少是可能和屈他维林的使用有关的不良反应，根据发生频率(十分常见： $\geq 10\%$ ；常见： $\geq 1\% < 10\%$ ；偶见： $\geq 0.1\% < 1\%$ ；罕见： $\geq 0.01\% < 0.1\%$ ；十分罕见： $< 0.01\%$ ；未知：不能从有效的数据中估计出来)和系统器官描述如下：

#### 心脏功能紊乱：

罕见：心悸，低血压

#### 神经系统失调：

罕见：头痛，眩晕，失眠

#### 胃肠道紊乱：

罕见：恶心，便秘

#### 免疫系统失调：

罕见：过敏反应（血管性水肿，荨麻疹，皮疹，搔痒症）（参考“禁忌”部分）

未知：使用注射剂有致死性及非致死性过敏性休克报道

#### 总体失调及用药部位反应：

注射部位的局部反应

### 【禁忌】

1. 对本品的有效成份或对任何赋形剂过敏者禁用（例如大豆卵磷脂）。
2. 对焦亚硫酸钠过敏者禁用（见【注意事项】部分）。
3. 严重的肾衰竭或肝衰竭的患者禁用。
4. 严重的心功能不全的患者（低输出综合征）禁用。
5. 儿童

### 【注意事项】

1. 在低血压的情况下使用本品时应更加小心。
2. 由于存在虚脱的风险，当通过静脉输液途径使用本品时，患者需严格卧床。
3. 本品含有焦亚硫酸盐，可能导致易感人群出现过敏反应，包括过敏症状和支气管痉挛，尤其是对那些有哮喘或过敏史的患者。
4. 对于焦亚硫酸钠过敏的患者，应避免胃肠外途径给药(见【禁忌】部分)。

5. 当妊娠妇女应用本品时应特别慎重(见【孕妇及哺乳期妇女用药】部分)。
6. 如果患者有眩晕经历, 使用本品应该避免进行有潜在危险性的作业, 如驾驶和操纵机器。

### **【孕妇及哺乳期妇女用药】**

本品能获得的妊娠妇女的临床数据有限。

尽管本品对于妊娠和胚胎/胎儿的发育, 动物实验并没有表明存在直接或间接的有害影响(见【药理毒理】部分)。但孕妇使用仍需慎重。

目前没有关于动物乳汁中是否分泌本品的研究。因此不推荐哺乳期妇女使用本品。

对于针剂:

屈他维林在分娩时禁止使用。

### **【儿童用药】**

尚未在儿童临床研究中对本品加以评估。儿童禁用。

### **【老年用药】**

目前尚无有关老年患者服用本品的特殊注意事项。

### **【药物相互作用】**

磷酸二酯酶抑制剂(如罂粟碱)能减弱左旋多巴的抗震颤麻痹作用, 因此, 当本品和左旋多巴合并使用时, 可能会加重强直和震颤。

### **【药物过量】**

屈他维林过量可伴有心脏节律和传导异常, 包括完全性束支传导阻滞, 心脏骤停, 这些可能是致命的。本品药物过量的情况下, 应严密监测病人, 并给予对症和支持治疗。

### **【药理毒理】**

药理毒理:

屈他维林为异喹啉衍生物, 通过抑制磷酸二酯酶IV发挥平滑肌解痉作用。作为磷酸二酯酶IV抑制剂, 屈他维林使肌球蛋白轻链激酶(MLCK)失活, 导致CAMP浓度升高, 从而放松平滑肌。在体外, 屈他维林可抑制磷酸二酯酶IV, 而不抑制磷酸二酯酶III或V。功能上, 磷酸二酯酶IV对降低平滑肌的收缩活性具有很重要

的作用，提示选择性的磷酸二酯酶IV抑制剂有助于治疗高动力失调和胃肠道痉挛相关的各种疾病。

心肌和血管平滑肌细胞中水解 CAMP 的主要是磷酸二酯酶III同工酶，这就解释了屈他维林虽然具有解痉作用，但没有严重的心血管不良反应和心血管治疗作用的原因。

由于血管扩张作用，屈他维林可以增加组织循环。

屈他维林的作用强于罂粟碱，其吸收更为完全和迅速，并与血浆蛋白结合较少。屈他维林不会出现罂粟碱胃肠外给药时出现的呼吸兴奋不良反应。

毒性研究：

遗传毒性：在一系列体外和体内的致突变性研究，如细菌回复突变（Ames）试验,小鼠淋巴瘤细胞 TK<sup>+</sup>基因突变试验和大鼠骨髓微核试验中，没有发现屈他维林存在的潜在毒性。

生殖毒性：屈他维林在口服剂量达到 100mg/kg/d（超过母体动物的最大耐受剂量）时对 SD 大鼠的生育力和早期胚胎发育没有产生影响。妊娠大鼠经口给予屈他维林，在 50mg/kg/d 剂量下对胚胎和胎仔无明显毒性，在 150mg/kg/d 剂量（已达母体动物毒性剂量）下可引起胚胎重吸收增加。妊娠家兔经口给予屈他维林，在 120mg/kg/d 剂量（已达到母体动物毒性剂量）下对胚胎和胎仔无明显毒性。

### 【药代动力学】

屈他维林口服给药和胃肠外给药时都能快速并完全的吸收。屈他维林与人血浆蛋白高度结合（95-98%）。尤其是白蛋白， $\gamma$ -和  $\beta$ -球蛋白。口服后 45-60 分钟内达到血药峰浓度。首过效应后，65%的原型药物进入体循环。屈他维林和/或它的代谢产物几乎不能穿透胎盘屏障。

屈他维林在肝脏代谢，其生物半衰期为 8-10 小时，静脉给药后原型药物的终末消除半衰期为 2.4 小时。屈他维林通过氧一去乙基化几乎完全代谢为单酚类化合物。这些代谢物快速地和葡萄糖醛酸结合。主要为 4-去乙基屈他维林、6-去乙基屈他维林和 4-去乙基屈他维拉啉。

屈他维林几乎在 72 小时内从体内消失，50%多的药物通过尿液消除，约 30%的药物通过粪便消除。本品主要以代谢物形式消除；原型药物不能从尿液中测出。

**【贮藏】**

低于 25℃避光保存。

**【包装】**

棕色安瓿，5 支/盒

**【有效期】**

36 个月

**【执行标准】**

进口药品注册标准 JX20160232 和补充申请批件（批件号：2018B03648）

**【批准文号】**

药品批准文号：国药准字 HJ20170302

**【药品上市许可持有人】**

名 称：Opella Healthcare Commercial Ltd.

注册地址：1045 Budapest, Tó u. 1-5., Hungary

**【生产企业】**

企业名称：CHINOIN Pharmaceutical and Chemical Works Private Co. Ltd.

生产地址：3510 Miskolc, Csanyikvolgy, Hungary

**【分装企业】**

名 称：赛诺菲（杭州）制药有限公司

Sanofi (Hangzhou) Pharmaceutical Co., Ltd.

地 址：杭州市滨江区江陵路 325 号

传 真：0571—88076189

**【境内联系机构】**

名 称：赛诺菲（中国）投资有限公司

地 址：北京市朝阳区建国路 112 号 7 层

产品咨询电话： 800（400）-820-8884