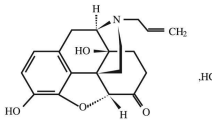
盐酸纳洛酮注射液说明书

请仔细阅读说明书并在医师或医师指导下使用

批准日期：2007.03.28
修改日期：2009.07.01
修改日期：2010.10.01
修改日期：2012.10.01
修改日期：2015.12.01
修改日期：2016.12.26
修改日期：2020.12.01
修改日期：2024.05.28
修改日期：2024.09.11

【药品名称】
通用名称：盐酸纳洛酮注射液
英文名称：Naloxone Hydrochloride Injection
汉语拼音：Yansuan Naluotong Zhusheye

【成　　份】
本品活性成份为盐酸纳洛酮。
化学名称：17-烯丙基-4,5α-环氧基-3,14-二羟基吗啡烯-6-酮盐酸盐二水合物
化学结构式：



,HCl,2H$_2$O

分子式：$C_{19}H_{21}NO_4 \cdot HCl \cdot 2H_2O$
分子量：399.87
辅料：氯化钠（供注射用）、依地酸钙钠、盐酸、氮氣化钠、注射用水。

【性　　状】本品为无色的澄明液体。

【适 应 症】
本品为阿片类受体拮抗药，
1. 用于阿片类药物复合麻醉术后，拮抗该类药物所致的呼吸抑制，促使病人苏醒。
2. 用于阿片类药物过量，完全或部分逆转阿片类药物引起的呼吸抑制。
3. 解救急性乙醇中毒。
4. 用于急性阿片类药物过量的诊断。

【规　　格】（1）1ml:0.4mg （2）1ml:1mg （3）2ml:2mg

【用法用量】
因本品存在明显的个体差异，应用时应根据患者具体情况由医生确定给药剂量及是否需多次给药。
本品可静脉输注、注射或肌内注射给药，静脉注射起效最快，适合在急诊时使用。
因为某些阿片类药物所作用或时间可能超过本品，所以，应对患者持续监护，必要时应重复给予本品。
静脉输注
静脉输注本品可用生理盐水或葡萄糖溶液稀释。把2mg本品加入500ml的以上任何一种液体中，使浓度达到0.004mg/ml，混合液应在24小时内使用，超过24小时未使用的剩余混合液必须丢弃。根据患者反应控制滴注速度。
成人使用
阿片类药物过量　首次可静脉注射本品0.4mg～2mg，如果未获呼吸功能的理想的对抗和改善作用，可隔2～3分钟重复注射给药，如果给10mg后还未见反应，就应考虑此诊断问题。如果不能静脉给药，可肌内给药。
本后阿片类药物抑制效应　　部分到正在手术使用阿片类药物后的阿片抑制效应，通常较小剂量本品即有效。本品给药剂量应根据患者反应来确定。首次纠正呼吸抑制时，应每隔2～3分钟，静脉注射0.1mg～0.2mg，直至产生理想的效果，即有通畅的呼吸和清醒度，无明显疼痛和不适。本品大于必需剂量时可明显逆转癌觉缺失和升高血压。同样，逆转大快可引起恶心、呕吐、出汗或循环负担增加。
1～2小时时间间隔内需要重复给予本品的量取决于最后一次使用的阿片类药物的剂量、给药类型（短作用型还是长作用型）与间隔时间。
儿童使用
重度乙醇中毒0.8mg～1.2mg，一个时后重复给药0.4mg～0.8mg。
儿童使用
阿片类药物过量　小儿静脉注射的首次剂量为0.01mg/kg，如果此剂量没有在临床上取得满意的效果，接下去则应给予0.1mg/kg。如果不能静脉注射，可以分次肌内注射。必要时可用灭菌注射用水将本品稀释。
本后阿片类药物抑制效应　参考成人术后阿片类抑制可用的药说明重复该剂量。
到理想逆转程度。
新生儿用药
阿片类药物引起的抑制　静注、肌注或皮下注射的常用初始剂量为每公斤体重0.01mg。可按照成人术后阿片类抑制的用药说明重复该剂量。
纳洛酮激发试验
用来诊断怀疑阿片耐受或急性阿片过量。
静脉注射本品0.2mg，观察30秒钟看是否出现阿片戒断的症状和体征，如果没有出现，每注射0.6mg，再观察20分钟。
本品不应给予有明显或断应状和体应的患者，或者尿中含阿片的患者。
有些患者特别是阿片耐受患者对低剂量本品发生反应，静脉注射本品0.1mg就可以起诊断作用。

【不良反应】
术后
患者使用本品的不良反应偶见，低血压、高血压、室性心动过速和心室颤动、呼吸困难、肺水肿和心脏停搏，报道其后遗症有死亡、昏迷和脑病，术后患者使用本品过量可能逆转癌觉缺失并引起患者激动。
逆转阿片类抑制
类似逆转阿片类抑制可能会引起恶心、呕吐、出汗、心悸亢进、血压升高、发抖、癫痫发作、室性心动过速和心室颤动、肺水肿以及心脏停搏，甚至可能导致死亡。
类阿片依赖
对阿片类药物产生躯体依赖的患者突然逆转其阿片作用可能会引起急性戒断综合征，包括但不局限于下述症状和体征：躯体疼痛、发热、出汗、流鼻涕、喷嚏、竖毛、打哈欠、无力、寒颤或发抖、神经过敏、不安或易激怒、痛感、恶心或呕吐、腹部痛性痉挛、血压升高、心悸亢进。
对新生儿，阿片戒断症状可能有：惊厥；过度哭泣；反射性活动过多。
术后使用本品和减药时引起的不良反应按器官系统分类如下：
心脏：肺水肿、心脏停搏或窦颤、心悸亢进、心室颤动和室性心动过速。源报道由此引起的后遗症有死亡、昏迷和脑病
胃肠道：呕吐、恶心
神经系统：惊厥、感觉异常、癫痫大发作惊厥
精神病学：激动、幻觉、发抖
呼吸道：胸和脑：呼吸困难、呼吸抑制、低氧症
皮肤和皮下注射：非特异性注射点反应、出汗
血管病症：高血压、低血压、热潮红或发红
【禁　　忌】对本品过敏的患者禁用。

【注意事项】
1. 本品应慎用于已知或可疑的阿片类药物躯体依赖患者，包括其母亲为阿片类药物依赖患的新生儿。对这种病例，突然或完全逆转阿片作用可能会引起急性戒断综合征。
2. 由于某些阿片类药物的作用时间长于纳洛酮，因此应该对使用本品效果很好的患者进行持续监护，必要时应重复给药。
3. 本品对非阿片类药物引起的呼吸抑制和左西氧芬引起的急性毒性的控制无效。只能部分逆转部分性激动剂或混合激动剂／拮抗剂（如丁丙诺啡和喷他佐辛）引起的呼吸抑制，或需要加大纳洛酮的用量。如果不能完全响应，在临床上需要用机械辅助治疗呼吸抑制。
4. 在术后突然逆转阿片类抑制可能引起恶心、呕吐、出汗、发抖、心悸亢进、血压升高、癫痫发作、室性心动过速和心室颤动、肺水肿以及心脏停搏，严重的可导致死亡。术后患者使用本品过量可能逆转癌觉缺失并引起患者激动。
5. 有心血管疾病史，或接受其它有严重的心血管不良反应（低血压、室性心动过速或心室颤动、肺水肿）的药物治疗的患者应慎用本品。
6. 应用纳洛酮拮抗大剂量麻醉镇痛药后，由于癫觉恢复，可产生高度兴奋。表现为血压升高，心率增快，心律失常，甚至肺水肿和心室颤动。
7. 由于此药作用持续时间短，用药起作用后，一旦其作用消失，可使患者再度陷入昏睡和呼吸抑制。用药需注意维持药效。
8. 伴有肝脏疾病、肾功能不全／衰竭患者使用纳洛酮的安全性和有效性尚未确立，应慎用本品。

【孕妇及哺乳期妇女用药】
1. 对小鼠和大鼠进行生殖毒性试验的剂量分别为人常用剂量的4至8倍，结果未显示纳洛酮有胚胎毒性或致畸毒性。由于未在妊娠妇女进行足够的和有效的研究，因此妊娠妇女只有在必要时才考虑用药。
2. 母亲依赖阿片类药物生育新生儿呆痴，因此在对已知或可疑的阿片依赖妊娠妇女使用本品之前应考虑对胎儿的危险。纳洛酮可透过胎盘，诱发母亲和胎儿出现戒断症状，轻至中度高血压患者在临产时使用纳洛酮应密切监护，以免发生严重高血压。
3. 还不清楚本品是否会影响蛇产和／或分娩时间。不过，公布的研究显示在临产时使用纳洛酮不会对母亲和新生儿产生不良作用。
4. 还不清楚本品是否会通过人乳分泌，因为药物可能会分泌到人乳中，因此哺乳妇女应慎用本品。

【儿童用药】
1. 对婴儿或新生儿使用本品可逆转阿片类作用。阿片类中毒患儿对本品的反应很强，因此需要对其进行至少24小时的密切监护，直到本品完全代谢。
2. 分娩后开始不久给母亲使用本品，其效果仅能在新生儿出生后的头两个小时内维持。如果需要的话，在分娩后可直接给新生儿使用本品。

【老年用药】没有足够的65岁和65岁以上患者使用本品的临床试验，未发现老年患者与年轻患者对纳洛酮反应的差异。一般情况下，老年患者的剂量选择慎重，考虑到肝脏、肾脏或心脏功能降低和伴随疾病或其它药物治疗的几率较大，应从小剂量开始用药。

【药物相互作用】
1. 丁丙诺啡与阿片受体的结合率低、分离速度慢决定了其作用时间长，因此在拮抗丁丙诺啡的拮抗作用需要逐渐增强逆转效果，缩短呼吸抑制的时间。
2. 甲已炔巴比妥可阻断纳洛酮诱发阿片戒瘾者出现的急性戒断症状。
3. 不应把本品与含有硫酸氢钠、亚硫酸氢钠、长链高分子阴离子或任何碱性的制剂混合。在把药物或化学试剂加入本品溶液中以前，应首先确定其对溶液的化学和物理稳定性的影响。

【药物过量】对使用本品过量的患者应进行对症治疗，并严密监护。
成人患者
在一项小型试验中，志愿者接受24mg/70kg药物的治疗未出现毒性。
在另一项试验中，36例急性脑卒中患者接受了4mg/kg(10mg/m^2/min)纳洛酮的治疗，随后剂量改为2mg/kg/hr，共用药24小时。23例患者在使用纳洛酮后出现了不良反应，7例患者因不良反应而停药。最严重的不良反应为：癫痫发作（2例）、严重高血压（1例）以及低血压和／或心搏徐缓（3例）。
对健康自愿者给药2mg/kg，有报道称，出现了认识阻滞和行为异常包括躁狂、焦虑、压力大、多疑、思伤、注意力不集中和厌食。此外，还报道了躯体症状包括头晕、心悸沉重、出汗、恶心和胃痛，报道的行为症状持续2～3天。
儿科患者
地介诺酯盐酸盐和硫酸阿托品过量的患儿最多只能使用2.2mg纳洛酮。几科报道了一个2岁半的患儿在治疗地芬诺酯盐酸盐和硫酸阿托品过量引起的呼吸抑制时，不少心使用了20mg纳洛酮，患儿情况良好，恢复后无后遗症。还有报道称一个4岁半患儿在12小时内使用了2.2mg纳洛酮，未出现后遗症。

【药理毒理】
药理作用
纳洛酮为阿片受体拮抗剂，可预防或逆转阿片类药物的作用，包括呼吸抑制、镇静和低血压，此外，纳洛酮还可以逆转激动-拮抗剂(如喷他佐辛)的拟精神病和惊躁作用。纳洛酮本身有其他阿片受体拮抗剂的“激动性”或吗啡样效应，不引起呼吸抑制、拟精神病反应或烟瘾反应。纳洛酮尚未显示出麻药性，也未发生理成瘾神依赖性。纳洛酮的作用机制尚不完全清楚，体外证据显示，纳洛酮通过竞争中枢神经系统中的μ、κ和σ阿片受体位点来拮抗阿片类药物的作用，对μ受体的亲和力最强。
毒理作用
遗传毒性
纳洛酮Ames试验和体外人淋巴细胞染色体畸变试验结果为阳性，体外中国仓鼠V79细胞HGPRT基因突变试验和大鼠体内骨髓染色体畸变试验结果为阴性。
生殖毒性
小鼠和大鼠中分别给予相应剂量纳洛酮后（以体表面积或mg/m^{2}折算，约为50kg人用剂量10mg/天的4倍及8倍），未见明显胚胎毒性或致畸作用。
致癌性
尚未开展纳洛酮的动物长期致癌性研究。

【药代动力学】
静脉注射给药时，通常在2分钟内起效，当肌肉注射或皮下注射给药时起效稍慢。作用持续时间长短取决于给药剂量和给药途径。肌肉注射作用时间长于静脉注射。但是否需要反复给药取决于所拮抗的阿片类物质的给药剂量、类型和途径。
非胃肠道给药时，本品在体内快速分布并迅速透过胎盘。与血浆蛋白结合但发生率低。纳洛酮主要与血浆白蛋白结合，还可与血浆中的其它成分结合，还不清楚纳洛酮是否会通过人乳排泄。
本品在肝脏代谢，主要与葡萄糖醛酸苷结合，纳洛酮-3-葡萄糖醛酸化合物为主要代谢产物。在一项研究中，药物在成人体内的血清半衰期为30至81分钟（平均为64±12分钟），新生儿平均血浆半衰期为3.1±0.5小时。口服或静注后，约25-40%的药物以代谢物形式在6小时内通过尿液排出，24小时排出50%左右，72小时排出60-70%。

【贮　　藏】避光，密闭，不超过25℃保存。
【包　　装】中硼硅玻璃安瓿，5支／盒；10支／盒。
【有 效 期】24个月
【执行标准】国家药品监督管理局药品注册标准编号 YBH11842024
【批准文号】
（1）1ml:0.4mg 规格：国药准字 H20055761
（2）1ml:1mg 规格：国药准字 H20055762
（3）2ml:2mg 规格：国药准字 H20055763
【上市许可持有人】
名　　称：山东新华制药股份有限公司
注册地址：淄博市高新技术产业开发区化工区
邮政编码：255000
电话号码：0533-2166666
传真号码：0533-2184891
网　　址：www.xhzy.com
【生产企业】
企业名称：山东新华制药股份有限公司
生产地址：山东省淄博市高新区泰泰大道1号
邮政编码：255086
电话号码：0533-2196361
传真号码：0533-2196365
网　　址：www.xhzy.com

301031301G

品名规格	盐酸纳洛酮注射液	改版项目	说明书	签字及日期	马建华 2024.09.29
包装材质		版本号	301031301		
成品尺寸	120mm × 130mm	印刷颜色			
修订日期		字体	4.3 号，宋体		