

核准日期：2007年04月17日
修改日期：2008年04月25日
2009年09月14日
2012年03月08日
2014年06月03日
2016年06月30日
2017年08月10日



注射用硫普罗宁说明书

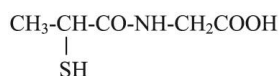
请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

【药品名称】

通用名称：注射用硫普罗宁
商品名称：凯西莱
英文名称：Tiopronin for Injection
汉语拼音：Zhushheyong Liupuluoning

【成份】

本品的主要成份为：硫普罗宁，辅料为右旋糖酐40。
硫普罗宁的化学名称为：N-(2-巯基丙酰基)-甘氨酸
化学结构式为：



分子式：C₅H₉NO₃S

分子量：163.20

【性状】本品为白色或类白色疏松块状物。

【适应症】

- 1、用于改善各类急慢性肝炎的肝功能。
- 2、用于脂肪肝、酒精肝、药物性肝损伤及重金属的解毒。
- 3、用于降低放疗的不良反应，并可预防放疗所致的外周白细胞减少。
- 4、用于老年性早期白内障和玻璃体浑浊。

【规格】0.1g。

【用法用量】静脉滴注，一次0.2g，一日一次，连续4周。

配制方法：临用前每0.1g注射用硫普罗宁先用5%的碳酸氢钠注射液2ml溶解，再扩容至5%~10%的葡萄糖注射液或0.9%氯化钠注射液250~500ml中，按常规静脉滴注。

【不良反应】

1. 过敏反应：在硫普罗宁注射剂型上市后收集的1560例不良反应病例报告中，严重不良反应病例报告115例，主要表现为过敏性休克的79例（死亡1例）。其他不良反应还有皮疹、瘙痒、恶心、呕吐、发热、寒战、头晕、心慌、胸闷、颌下腺腮腺肿大、喉水肿、呼吸困难、过敏样反应等。
2. 本药可能引起青霉素所具有的所有不良反应，但其不良反应的发生率较青霉素低。
3. 血液系统：少见粒细胞缺乏症，偶见血小板减少，如果外周白细胞计数降到每毫升 3.5×10^6 以下，或者血小板计数降到每毫升 10×10^6 以下，建议停药。
4. 泌尿系统：可出现蛋白尿，发生率约为10%，停药后通常很快即可完全恢复。另有个案报道本药可引起尿液变色。
5. 消化系统：可出现味觉减退、味觉异常、恶心、呕吐、腹痛、腹泻、食欲减退、胃胀气、口腔溃疡等。另有报道可出现胆汁淤积、肝功能检测指标（如丙氨酸氨基转移酶、天门冬氨酸氨基转移酶、总胆红素、碱性磷酸酶等）上升，如出现异常应停用本品，或进行相应治疗。
6. 皮肤：皮肤反应是本药最常见的不良反应，发生率约为10%~32%，表现为皮疹、皮肤瘙痒、皮肤发红、荨麻疹、皮肤皱纹、天疱疮、皮肤眼睛黄染等，其中皮肤皱纹通常仅在长期治疗后发生。
7. 呼吸系统：据报道，本药可引起肺炎、肺出血和支气管痉挛。另有个案报道可出现呼吸困难或呼吸窘迫，以及闭塞性细支气管炎。
8. 肌肉骨骼：有个案报道使用本药治疗可引起肌无力。
9. 长期、大量应用罕见蛋白尿或肾病综合症。
10. 其它：罕见胰岛素性自体免疫综合症，出现疲劳感和肢体麻木应停用。

【禁忌】

以下患者禁用：

1. 对本品成份过敏的患者。
2. 重症肝炎并伴有高度黄疸、顽固性腹水、消化道出血等并发症的肝病患者。
3. 肾功能不全合并糖尿病者。
4. 孕妇及哺乳妇女。
5. 儿童。
6. 急性重症铅、汞中毒患者。
7. 既往使用本药时发生过粒细胞缺乏症、再生障碍性贫血、血小板减少或其它严重不良反应者。

【注意事项】

1. 出现过敏反应的患者应停用本药。

以下患者慎用（1）老年患者。（2）有哮喘病史的患者。（3）既往曾使用过青霉胺或使用青霉胺时发生过严重不良反应的患者。对于曾出现过青霉胺毒性的患者，使用本药应从较小的剂量开始。

2. 用药前后及用药时应定期进行下列检查以监测本药的毒性作用：外周血细胞计数、血小板计数、血红蛋白量、血浆白蛋白量、肝功能、24小时尿蛋白。此外，治疗中每3个月或每6个月应检查一次尿常规。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

妊娠期妇女禁用本药。美国食品药品监督管理局（FDA）对本药的妊娠安全性分级为C级。本药可通过乳汁分泌，有使乳儿发生严重不良反应的潜在危险，故哺乳妇女禁用。

【儿童用药】

禁用。

【老年用药】

未进行该项实验且无可靠参考文献。

【药物相互作用】

本药不应与具有氧化作用的药物合用。

【药物过量】

当用药过量时，短时间内可引起血压下降，呼吸加快，此时应立即停药，同时应监测生命体征并予以支持对症处理。

【药理毒理】

硫普罗宁是一种与青霉胺性质相似的含巯基药物，具有保护肝脏组织及细胞的作用。动物试验显示，硫普罗宁能够通过提供巯基，防止四氯化碳、乙硫氨酸、对乙酰氨基酚等造成的肝脏损害，并对慢性肝损伤的甘油三酯的蓄积有抑制作用。硫普罗宁可以使肝细胞线粒体中ATP酶的活性降低，从而保护肝线粒体结构，改善肝功能。此外，硫普罗宁还可以通过巯基与自由基的可逆结合，清除自由基。

【药代动力学】

给大鼠口服硫普罗宁（MPG），自尿中排泄量较低（0.015%），静脉注射后尿中排泄量则明显增高（22.35%）。静脉注射后血中水平高，且至30分钟均可检出，口服60分钟血浆达高峰，直至120分钟可检出。

在人体口服、肌内注射后，尿中排泄量相近（肌注为10%~12%，口服15.47%），但肌注后排泄时间延长，需8~24小时，血浆水平也较口服为高。

【贮藏】 遮光，密闭，在阴凉（不超过20℃）处保存。

【包装】 低硼硅玻璃管制注射剂瓶、药用溴化丁基橡胶塞；（6支注射用硫普罗宁+6支专用溶剂）/盒。

【有效期】 24个月。

【执行标准】 国家食品药品监督管理局国家药品标准WS1-（X-001）-2005Z-2017。

【批准文号】 国药准字H10980086

【生产企业】

企业名称：上海凯宝新谊（新乡）药业有限公司

生产地址：新乡经济开发区青龙路399号

邮政编码：453731

电话号码：0373-5589178

传真号码：0373-5589380

注册地址：新乡经济开发区青龙路399号