

核准日期：2007年02月09日

发布或修订

日期：2014

年02月08

日

## 注射用甲钴胺说明书

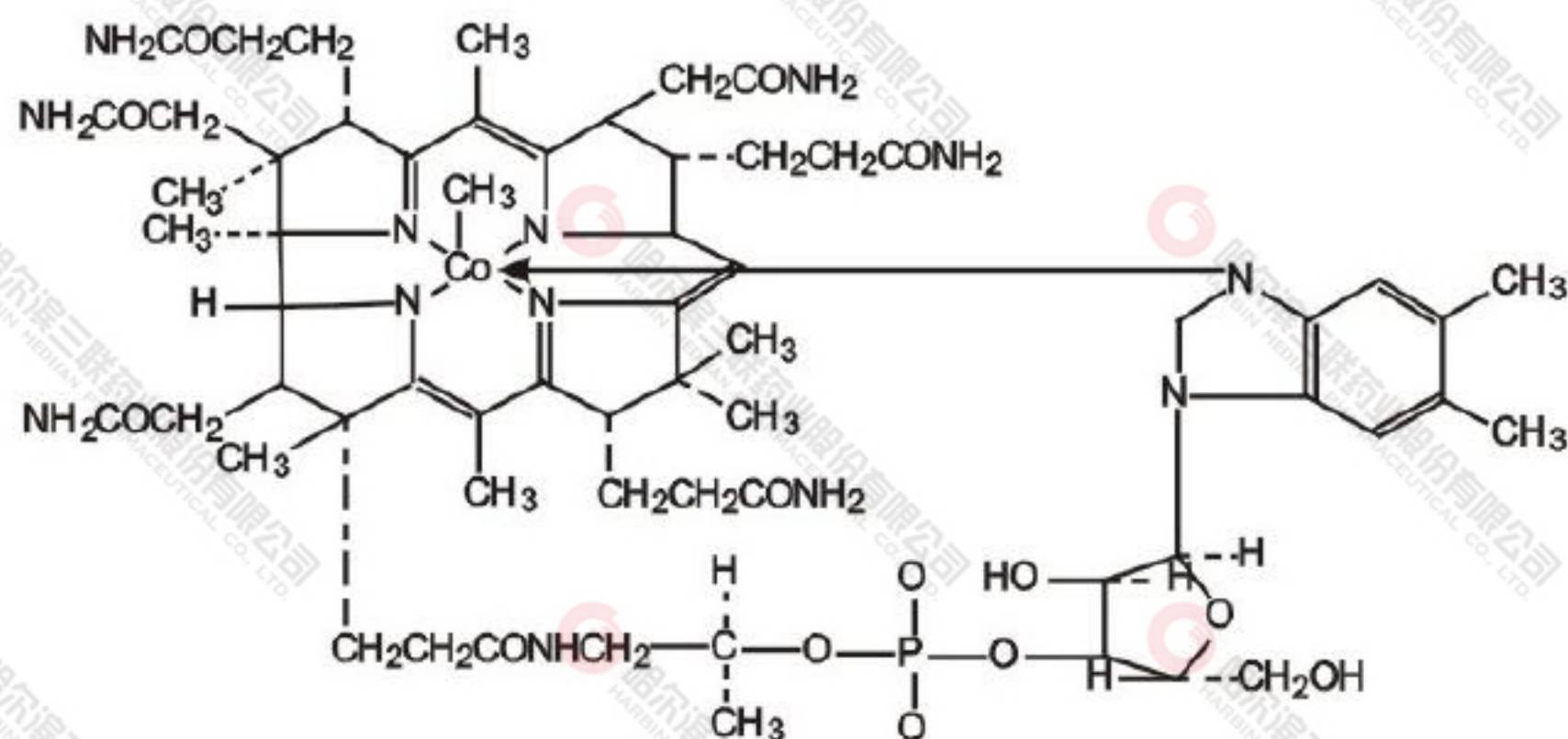
请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

警示语：对本品种任何成份过敏者禁用

【药品名称】	【通用名称】	注射用甲钴胺
	【商品名】	唐信
	【英文名】	Mecobalamin for Injection
	【汉语拼音】	Zhusheyong Jiagu'an

【成份】 【化学名称】  $\alpha$ -（5，6-二甲基苯并咪唑基）-Co-甲基-钴胺酰胺

【化学结构式】





【分子式】

C<sub>63</sub>H<sub>91</sub>CoN<sub>13</sub>O<sub>14</sub>P

【分子量】

1344.40

【注射剂辅料】

甘露醇。

【性状】 本品为粉红色的疏松块状物或无定形固体。

【适应症】 1、周围神经病。2、因缺乏维生素 B<sub>12</sub> 引起的巨红细胞性贫血。

【规格】 0.5mg

【用法用量】 用前加注射用水 1ml 溶解后使用。

#### 1、周围神经病

通常，成人一日 1 次，一次 0.5mg，一周 3 次，肌内注射或静脉注射，可按年龄、症状酌情增减。

#### 2、巨红细胞性贫血

通常，成人一日 1 次，一次 0.5mg，一周 3 次，肌内注射或静脉注射。

投药 2 个月后，作为维持治疗 1~3 个月给药 1 次 0.5mg。

【不良反应】 根据同品种相关报道可知：

在总病例 2872 例中，13 例（0.45%）出现不良反应。

#### 1、严重不良反应

过敏样反应：会引起血压下降、呼吸困难等过敏样反应。如果出现这种不良反应，应立即中止用药，并采取适当的措施。

#### 2、其他不良反应

	0.1~0.5%	频度不明
过敏		皮疹
其它	注射部分的硬结、出汗、发热感	注射部位疼痛、头痛

注) 如果出现这些副作用，应停止用药。

【禁忌】 对本品种任何成份过敏者禁用。

【注意事项】 1、给药时



本品见光易分解，开封后立即使用的同时，应注意避光。

## 2、肌肉注射时

肌肉注射时为避免对组织、神经的影响，应注意以下几点：

- 1) 注射避开神经走向部位。
- 2) 注射针扎入时，如有剧痛、血液逆流的情况，应立即拔出针头，换部位注射。
- 3) 为了确保储存质量稳定，采用遮光盒包装，在使用时从遮光保护盒中取出。
- 4) 从事汞及其化合物的工作人员，不宜长期大量用药。
- 5) 使用本品期间，如出现任何不良事件和/或不良反应，请咨询医生。
- 6) 同时使用其他药品，请告知医生。
- 7) 请放于儿童不能够触及的地方。

**【孕妇及哺乳期妇女用药】** 虽然甲钴胺在动物试验中未发现致畸作用，但其对怀孕妇女的安全性尚不明确。

**【女用药】** 尚不明确甲钴胺是否通过妇女乳汁分泌，但动物试验报告甲钴胺有乳汁分泌。

**【儿童用药】** 尚缺乏本品儿童用药的安全性研究资料。

**【老年用药】** 由于老年人机能减退，建议采取适当措施，在医生指导下减少用量。

**【药物相互作用】** 尚不明确。

**【药物过量】** 尚无药物过量的经验。如果发生药物过量，应立即停药进行整体性的对症和支持治疗。

**【药理毒理】** 1、 药理作用

据文献报道：

1) 向神经细胞内细胞器运转性良好，促进核酸、蛋白的合成与氰钴胺相比，向神经细胞内细胞器的转运性良好（大白鼠）。在由高半胱氨酸合成蛋氨酸过程中起辅酶作用。在脑起源细胞、脊髓神经细胞的实验中，尤其参与由脱氧核苷酸合成胸腺嘧啶的过程，促进核酸、蛋白的合成（小白鼠）。

2) 促进轴索内输送和轴索的再生

在由给与链脲菌素引起糖尿病大白鼠的坐骨神经细胞，可使轴索结构蛋白的输送正常化。对阿霉素、丙烯酰胺、长春新碱引起的药物性神经障碍（大白鼠、兔）以及对轴索变性小白鼠模型、自然发病大白鼠



的神经障碍在神经病理学、电生理学上可抑制变性神经的出现。

### 3) 促进髓鞘的形成（磷脂合成）

由于提高蛋氨酸合成酶的活性，促进髓鞘的主要结构磷脂酰胆碱合成从而提高髓鞘的形成。

### 4) 恢复神经的传达延迟和神经传达物质的减少

在挫刮的坐骨神经实验中由于提高神经纤维的兴奋，从而早期恢复终端电位的诱发（大白鼠）。

另外可使喂养缺胆碱饲料大白鼠的脑内乙酰胆碱量正常化。

### 5) 促进正红血母细胞的成熟、分裂，改善贫血血像

本药促进在骨髓中核酸的合成及正红母细胞的成熟、分裂，增加红细胞的产生。本药可迅速恢复因 B<sub>12</sub> 缺乏而降低的大白鼠红细胞数、血红蛋白、血细胞比容值。

## 2、毒理研究

### 1) 分布

给大白鼠静脉注射 <sup>57</sup>Co-CH<sub>3</sub>-B<sub>12</sub>10μg/kg，24 小时后，组织内浓度为肾、副肾、肠、胰、脑垂体的顺序，顺次检测出高浓度，在眼、脊髓、脑、肌肉等处浓度低。

### 2) 急性毒性资料

动物种类 给药途径	小白鼠	大白鼠	兔子	狗
经口	>1000	>500	—	—
静注	>666	>333	>60	>200

### 3) 亚急性毒性资料

给狗静注 90 天 0.5、5.0、50.0mg/kg/日，在各个给药组中，一般症状、体重、血液及器官重量均无特殊变化。病理组织学检查中通过显微镜观察发现，剂量为 50.0mg/kg 的肾近曲小管上皮细胞内增加了嗜酸性颗粒，通过电子显微镜观察发现了溶酶体的增加，其他器官无变化。

### 4) 慢性毒性资料

给狗静脉注射 12 个月 0.5、5.0、50.0mg/kg/日，各个给药组中，一般症状、体重、血液及器官重量等均无变化。

病理组织学检查中，通过显微镜观察发现，剂量为 5.0mg/kg 以上的肾近曲小管上皮细胞内增加了嗜酸性



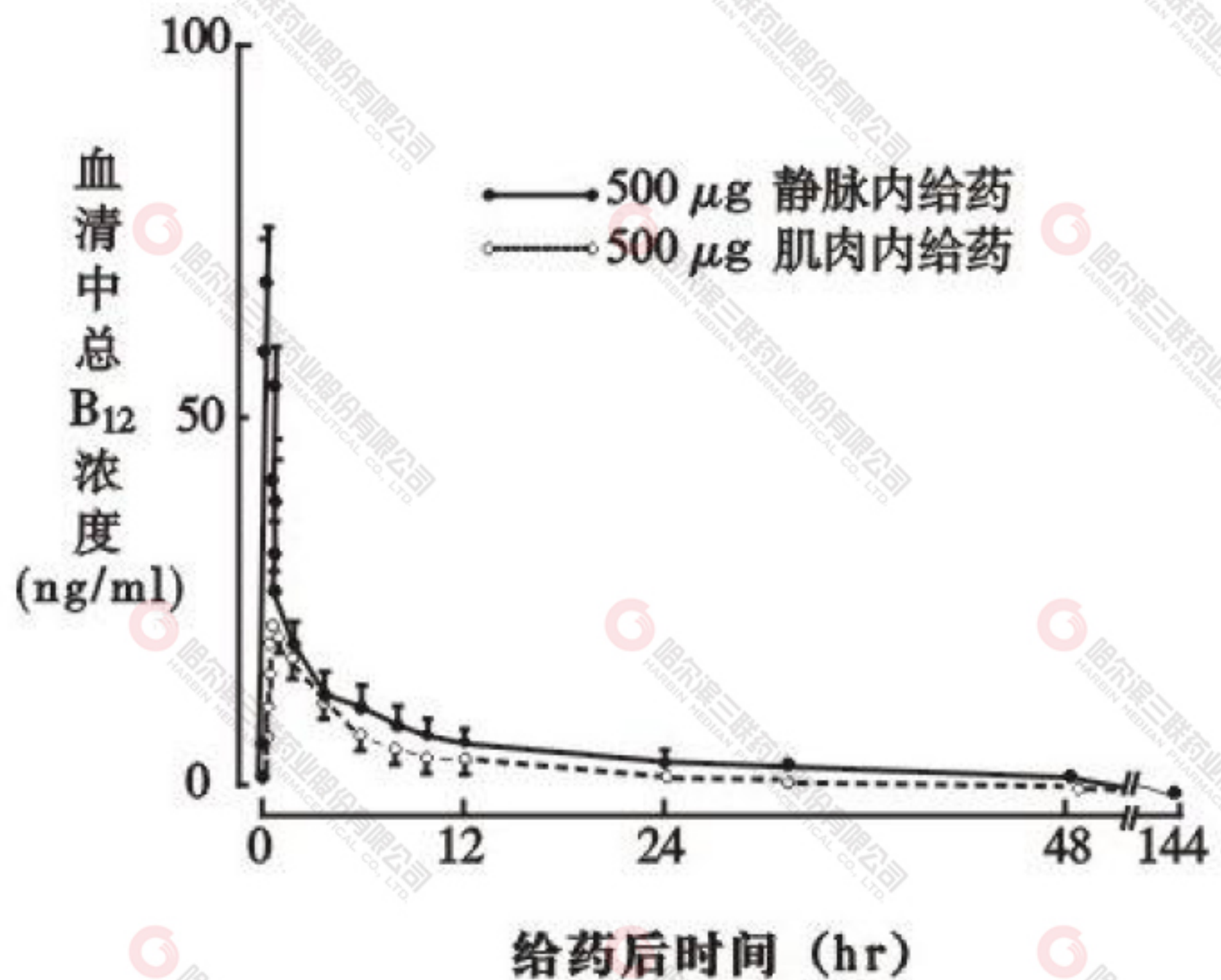
颗粒，通过电子显微镜观察发现了溶酶体的增加。又在剂量 50.0mg/kg 试验中发现了肾小球系膜细胞的溶酶体及肝枯否氏细胞的增加。

### 5) 生殖毒性资料

在大鼠的妊娠前及妊娠初期、器官形成期、围产期及哺乳期静注 0.5、5.0、50.0mg/kg/日，对胎仔和新生仔无异常所见及致畸作用。

### 【药代动力学】 1、一次性给药

给健康人一次肌肉注射或静脉注射甲钴胺 500 $\mu$ g，达到最高血清中总 B<sub>12</sub> 浓度的时间 ( $t_{max}$ )：肌肉注射为 0.9 $\pm$ 0.1 小时，静脉注射部位给药后立刻~3 分钟。最高血清中总 B<sub>12</sub> 浓度增加部分 ( $\Delta C_{max}$ ) 分别为 22.4 $\pm$ 1.1 ng/ml、85.0 $\pm$ 8.9ng/ml。另外，给药后截止 144 小时，从实测值的增加部分计算的血清中总 B<sub>12</sub> 浓度时间曲线下面积 ( $\Delta AUC$ )，肌肉注射、静脉注射给药的分别为 204.1 $\pm$ 12.9 hr·ng/ml，358.6 $\pm$ 34.4 hr·ng/ml。另一方面，在结合饱和率上两个给药组均为给药截止 144 小时显示了大体相等的增加。



### 2、连续给药

给健康人静注甲钴胺连用 10 天，给药前，血清中总 B<sub>12</sub> 浓度 ( $\Delta C_{min}$ ) 随着给药天数的增加而不断上升，初次给药后 24 小时值 (3.9 $\pm$ 1.2ng/ml) 与第二天给药 24 小时 (5.3 $\pm$ 1.8ng/ml) 相比约达 1.4 倍，第三天给药后则达 1.7 倍 (6.8 $\pm$ 1.5ng/ml)，该浓度一直维持到最后给药。



【贮藏】 遮光,在阴凉处（不超过 20℃）保存。

【包装】 低硼硅玻璃管制注射剂瓶，6 瓶/盒。

【有效期】 24 个月

【执行标准】 YBH04292005-2014Z

【批准文号】 国药准字 H20050332

【生产企业】 【企业名称】 哈尔滨三联药业股份有限公司

【生产地址】 哈尔滨市利民开发区北京路

【邮政编码】 150025

【电话号码】 0451-57355668

【传真号码】 0451-57354698

【网址】 [www.medisan.com.cn](http://www.medisan.com.cn)