

核准日期： 2007 年 01 月 24 日
发布或修订日期： 2014 年 02 月 08 日

奥拉西坦注射液说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

警示语： 对本品过敏者、严重肾功能损害者禁用

【药品名称】 【通用名称】 奥拉西坦注射液

【商品名】 欧兰同

【英文名】 Oxiracetam Injection

【汉语拼音】 Aolaxitan Zhushuye

【成份】 【化学名称】 4-羟基-2-氧代-1-吡咯烷乙酰胺。

【化学结构式】



【分子式】 C₆H₁₀N₂O₃

【分子量】 158.16

【注射剂辅料】

【性状】 本品为无色或几乎无色的澄明液体。

【适应症】 用于脑损伤及引起的神经功能缺失、记忆与智能障碍等症的治疗。

【规格】 5ml:1g

【用法用量】 静脉滴注。每日一次，每次 4~6g，用前加入到 5%葡萄糖注射液或 0.9%氯化钠注射液 100~250ml 中，摇匀后静脉滴注。可酌情增减用量，用药疗程为 2~3 周。国外上市奥拉西坦注射液的用量范围是 2~8g，但国内尚 无低于 4g、高于 6g 的用药经验。

【不良反应】 据国外文献报道，奥拉西坦的不良反应少见，偶见皮肤瘙痒、恶心、精神兴奋、睡眠紊乱，但症状较轻，停药后可自行恢复。

应用本品进行了临床试验，结果显示奥拉西坦注射液组与吡拉西坦注射液的不良事件发生率无统计学差异，未发现严重不良事件。

【禁忌】 对本品过敏者、严重肾功能损害者禁用。

【注意事项】 1、轻、中度肾功能不全者应慎用，必需使用本品时，须减量。

2、患者出现精神兴奋和睡眠紊乱时，应减量。

3、当药品性状发生改变时：如瓶内有异物、颜色改变请勿使用。

【孕妇及哺乳期妇女用药】 本品在孕妇及哺乳期妇女使用的安全性尚不明确，因此，不应使用。

【儿童用药】 尚不明确。

【老年用药】 Lecaillon J B 等对老年病人的奥拉西坦药物代谢情况进行了研究，老年人由于生理性肾功能减退，消除半衰期 ($t_{1/2\beta}$)较健康青年人延长，曲线下面积 (AUC)及血药峰浓度 (C_{max})均略有升高，老年人在使用本品后消除速度稍慢，但与青年人相比无显著性差异。

【药物相互作用】 尚不明确。

【药物过量】 在超剂量使用本品的情况下偶有病人出现兴奋、失眠等不良反应，停药或减少剂量后症状可逐渐消失。

【药理毒理】 药理作用

奥拉西坦为吡拉西坦的类似物，可改善老年性痴呆和记忆障碍症患者的记忆和学习功能。机理研究结果提示，奥拉西坦可促进磷酰胆碱和磷酰乙醇胺合成，提高大脑中 ATP/ADP 的比值，使大脑中蛋白质和核酸的合成增加。

毒理研究

动物研究显示，奥拉西坦小鼠灌胃给药 10g/kg、静注给药 2g/kg 和大鼠灌胃给药 10g/kg 均未见动物死亡；未见致突变性、致癌作用及生殖毒性。

【药代动力学】 应用本品进行了人体药代动力学研究，结果：单次静脉滴注 (2.0g)血药峰浓度 (C_{max})为 $96.15 \pm 3.58 \mu\text{g} \cdot \text{ml}^{-1}$ ，半衰期 ($t_{1/2}$)为 $3.84 \pm 0.64 \text{h}$ ，曲线下面积 ($AUC_{0 \sim 12}$)为 $256.26 \pm 16.84 \mu\text{g} \cdot \text{ml}^{-1} \cdot \text{h}^{-1}$ ，曲线下面积 ($AUC_{0 \sim \infty}$)为 $276.74 \pm 18.11 \mu\text{g} \cdot \text{ml}^{-1} \cdot \text{h}^{-1}$ ，肾排泄速率常数 (k_e)为 $0.18 \pm 0.03 \text{h}^{-1}$ ，平均滞留时间 (MRT)为 $4.39 \pm 0.39 \text{h}$ 。多次静脉滴注 (2.0g)血药峰浓度 C_{max} 为 $97.92 \pm 3.26 \mu\text{g} \cdot \text{ml}^{-1}$ ，半衰期 ($T_{1/2}$)为 $4.14 \pm 0.82 \text{h}$ ，曲线下面积 ($AUC_{0 \sim 12}$)为 $259.36 \pm 25.43 \mu\text{g} \cdot \text{ml}^{-1} \cdot \text{h}^{-1}$ ，曲线下面积 ($AUC_{0 \sim \infty}$)为 $285.59 \pm 27.38 \mu\text{g} \cdot \text{ml}^{-1} \cdot \text{h}^{-1}$ ，肾排泄速率常数 (k_e)为 $0.17 \pm 0.04 \text{h}^{-1}$ ，平均滞留时间 (MRT)为 $4.87 \pm 0.69 \text{h}$ 。奥拉西坦多次静脉给药体内无蓄积；静脉给药后，血药浓度水平以及主要的药代动力学参数在个体间差异较小；

文献资料显示：奥拉西坦在肝、肾中分布浓度较高，除脑脊液中的半衰期为 300 分钟（口服 2.0g）、140 分钟（静脉注射 2.0g）外，在其余组织的半衰期与血浆中相似。奥拉西坦主要通过肾脏代谢，48 小时内 90% 以上的药物以原型从尿中排出，个体间差异很小；老年人与

健康年轻人的肾脏消除速度无显著性差异。

【贮藏】 遮光，密闭，在阴凉干燥处（不超过 20℃）保存。

【包装】 曲颈易折玻璃安瓿，6 支/盒。

【有效期】 暂定 24 个月

【执行标准】 YBH01692006-2014Z

【批准文号】 国药准字 H20060070