

核准日期：2025 年 03 月 04 日
修改日期：2025 年 03 月 17 日



喷他佐辛注射液说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

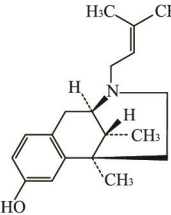
警示语：运动员慎用

【药品名称】

通用名称：喷他佐辛注射液
英文名称：Pentazocine Injection
汉语拼音：Pentazuoxin Zhushuye

【成份】

本品活性成份为喷他佐辛。
化学名称：（2RS, 6RS, 11RS）-1, 2, 3, 4, 5, 6-六氢-6, 11-二甲基-3-（3-甲基-2-丁烯基）-2, 6-甲撑-3-苯并哌啶因-8-醇
化学结构式：



及对映异构体

分子式：C₂₀H₂₇NO
分子量：285.42
辅料：乳酸、氯化钠、氢氧化钠、注射用水

【性状】本品为无色或几乎无色的澄明液体。

【适应症】

适用于各种慢性剧痛，如癌性疼痛、创伤性疼痛、手术后疼痛，也可用于手术前或麻醉前给药，作为外科手术麻醉的辅助用药。

【规格】1ml：30mg

【用法用量】

皮下、肌内注射或静脉给药，一次 30mg（1 支），必要时每 3-4 小时一次或遵医嘱。静脉给药时滴速每分钟不超过 5mg，一日最大剂量不超过 240mg（8 支）。

【不良反应】

1、重大副作用

（1）休克，全身性过敏反应（频率不明）：应对休克，全身性过敏反应现象进行充分观察，当出现面部苍白、呼吸困难、发绀、血压下降、心跳过速、全身发红、血管水肿、荨麻疹等症状时停止给药，并进行适当的处理。

（2）呼吸抑制（0.42%）：有时会出现呼吸抑制。这种情况下，应进行吸氧（必要时可采用人工呼吸）或服用多沙普仑，但麻醉药拮抗剂（左洛啡烷）无效。

（3）依赖性（频率不明）：因为连续使用会产生药物依赖，所以要充分进行观察，慎重给药，特别是有药物依赖史的患者。另外，连续使用后如果突然停止给药，会出现震颤、不安、兴奋、恶心、心悸、冷感、失眠等症状，因此停止给药时要逐渐减量。

（4）中毒性表皮坏死溶解症Toxic Epidermal Necrolysis: TEN(频率不明)：出现中毒性表皮坏死溶解的情况，应停止给药，并进行适当的处理。

（5）粒细胞缺乏症（频率不明）：要充分进行观察，当出现粒细胞缺乏症时要停止给药，并进行适当的处理。

（6）神经源性肌肉障碍（频率不明）：大剂量连续使用会引起神经源性的四肢肌肉萎缩，出现四肢无力、行走困难等症状，应充分进行观察，出现这种情况应停止给药。

（7）痉挛（频率不明）：有时会出现强直性痉挛或阵挛性痉挛，出现这种情况应停止给药，并进行适当的处理。

2、其他副作用

（1）神经系统：嗜睡、头晕、摇晃、出汗、幻觉、麻木感、幸福感、情绪紧张不安或难以入睡、兴奋、头痛、头重、痉挛、瞳孔缩到针尖大小时可出现视觉模糊或复视；错乱、镇静、意识障碍、震颤、漂浮感；中枢神经活动处于抑制状态时，临床表现可有嗜睡、梦幻、头痛眩晕等，继而觉口干、食欲不振、饮食乏味以及恶心呕吐等不适，后者更多见于急症和第一次给药时；

（2）循环系统：血压上升、皮肤潮红、发热、血压下降（体位改变血压下降时，常有晕眩感、步态不稳、以及疲乏感）；

（3）消化系统：恶心、呕吐、口渴、便秘、胃肠道刺激和胆管痉挛可致腹痛；

（4）过敏症：面部浮肿、皮疹、多形红斑、面颊潮红、汗多；

（5）血液：白细胞减少、贫血；
（6）肝脏：肝功能异常；
（7）泌尿系统：抗利尿作用以吗啡为明显，兼有输尿管痉挛时，可出现少尿、尿频、尿急、排尿困难；
（8）其他：胸闷、疲劳感、不快感、恶寒、发热、无力、倦怠感。

3、少见但有危险的不良反应：

（1）呼吸频繁减慢又很不规则、潮气量小、提示呼吸抑制严重，有些阿片类药物又可引起骨骼肌主要是胸壁呼吸肌低直，尤其是量大、快速静注时容易出现；
（2）中枢神经毒性表现，以惊厥、幻觉、耳鸣、震颤、动作不能自制等最为突出；
（3）中枢性抑制过度，以神智模糊、抑郁、消沉、迟钝等为多见，小儿且可出现阵发性兴奋激动，大剂量可引起呼吸抑制、血压上升及心率加速。

（4）组胺释放过多，可诱发弹性荨麻疹，皮肤瘙痒、颜面红润微肿、支气管痉挛、喉痉挛、喉水肿等。

【禁忌】

（1）对本品成分有过敏史的患者。
（2）有头部受伤或者颅内压升高的患者[可能会出现颅内压升高]。
（3）处于急性呼吸抑制，通气不足状态的患者和全身状况明显恶化的患者[可增强呼吸抑制作用]。
（4）正在使用盐酸纳美芬水合物或停药后一周内的患者[阿片类药物戒断症状有出现恶化的危险]。
（5）中毒性腹泻，毒物聚集于肠腔尚未排尽。
（6）遇有血液病或血管损伤出现凝血异常时，以及须作穿刺的局部有炎症时，不得作硬膜外或蛛网膜下腔给药，戒断时由此给药也并不能使症状改善或减轻。

【注意事项】

1、对诊断的干扰：

（1）可能促使脑脊液压升高；
（2）吗啡能使胆道括约肌收缩，使胆管系统的内压上升；可使血浆淀粉酶和脂肪酶均升高；
（3）停药至少 24 小时后才能作血清碱性磷酸酶、丙氨酸氨基转移酶、门冬氨酸氨基转移酶、胆红素、乳酸脱氢酶等测定，以免假阳性出现。

2、慎重给药（以下病人慎用）

（1）有药物依赖史的患者；
（2）毒品依赖患者[由于有轻度的毒品拮抗作用，有时会出现戒断症状]；
（3）有胆道疾病的患者[大量使用可收缩 Oddi 括约肌]；
（4）心肌梗塞患者[特别是静脉给药时，会使急性心肌梗死患者的动脉压、血管阻力上升]；
（5）肝功能障碍患者[可能会使本品的作用增强]；
（6）老年人；
（7）哮喘急性发作、慢性尤其是病理性呼吸功能不全；
（8）心律失常、心动过缓；
（9）惊厥或有惊厥史的患者；
（10）精神失常有自杀意图时；
（11）脑外伤颅内压高或颅内病变，可使呼吸抑制或颅内压升高更严重，给药后瞳孔缩小，对光反射不明，可因而延误诊断；
（12）肾功能不全，颅内压增高慎用。
（13）甲状腺功能低下；
（14）小儿、老年和恶病质等患者；
（15）对吗啡有耐受性的人，使用本品能减弱吗啡的镇痛作用，并可促成成瘾产生戒断症状。

3、特别注意

（1）给门诊患者注射后，要让其充分休息，确认安全后方可离开。
（2）因为会出现嗜睡、头晕、摇晃等症状，所以使用本品的患者不要从事驾驶汽车等有危险的机械操作。
（3）因为连续长期使用会产生药物依赖，所以要充分进行观察，慎重给药。特别是有药物依赖史的患者更要注意。有 2 例连续用药 1 年以上，也出现成瘾现象，切不可滥用。
（4）给药过程中应监测呼吸和循环等有关指标，其中以呼吸最为重要，硬膜外或蛛网膜下腔给药时，尤其是吗啡，呼吸的随访监测至少 12 小时左右，以便及早发现呼吸抑制。
（5）运动员慎用。

4、药物合用禁忌（禁止合用）

本品可产生戒断症状。想要得到更好的镇痛效果所需的剂量比平时剂量要大。因紧急手术等不得使用本品时，患者应逐渐增加剂量，并密切观察抑制呼吸等

中枢神经抑制症状。另外，在手术中事先给药，至少要在 1 周前停止使用盐酸纳美芬水合物。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

（1）孕妇或怀孕的妇女，在治疗上的有益性超过危险性时才可以给药。[对胎儿的安全性还没有确立]。

（2）分娩时给药，新生儿可能出现呼吸抑制。

（3）在分娩前给药时，出生后新生儿可能出现戒断症状（神经质，震颤，呕吐等）

【儿童用药】

小儿由于清除率缓慢，半衰期长，尤其容易引起呼吸抑制，用量应低于常用量。

【老年用药】

老年人应从低剂量开始给药，同时延长给药间隔，慎重给药。[血液中浓度持续高的倾向被认可]。

【药物相互作用】

（1）吗啡制剂有时会增强本剂的作用。需要联合使用时，应酌情减少其中一方或双方的剂量。另外，本品在高剂量时可能会拮抗吗啡的作用，因此通常应避免与吗啡同时使用。

（2）中枢性镇痛剂如盐酸丁丙诺啡，氢溴酸依他佐辛，酒石酸布托啡诺等；苯二氮类衍生物和其他镇静剂如地西洋，硝西洋，美西洋等；中枢药物（催眠药等）苯巴比妥酸衍生物（苯巴比妥等）及酒精，以上药物有时会增强本剂的作用，需要联合使用时，应酌情减少其中一方或双方的剂量。

（3）吩噻嗪类中枢性抑制药以及三环类抗抑郁药等与本类药同时并用，呼吸抑制和（或）低血压可更明显，便秘也增加，依赖性更容易产生，用量应彼此配合互减。

（4）静注硫酸镁后的中枢性抑制，尤其是呼吸抑制和低血压，会因同时使用阿片类药物而加剧。

（5）阿片类镇痛药，通过引起胃肠道蠕动迟缓，括约肌痉挛，可使甲氧氯普胺（胃复安）应有的效应不明。

（6）具有血清素神经系统赋活作用的抗抑郁剂盐酸阿米替林合用时作用会增强，有可能引起不安、恶心、出汗、潮红等。需要联合使用时，应酌情减少其中一方或双方的剂量。

（7）应先停用单胺氧化酶抑制药（如呋喃酮、丙卡巴胂等）14-21 天后，才可用本类药物，尤其是哌替啶、芬太尼等；而且应先试用小量（1/4 常用量），以免发生难以预料的、严重的、足以致死的循环虚脱，后者的先驱症状一般为：激动（烦躁）、多汗、僵直、血压很高或很低、呼吸抑制严重、昏迷、惊厥或（和）高热。

（8）有时会减弱盐酸美沙酮的镇痛作用，而且有可能引起戒断症状。

（9）高血压治疗用药不论是作用于神经节的如胍乙啶或美加明，利尿药如氢氯噻嗪，或其他药物如金刚烷胺、溴隐亭，左旋多巴、利多卡因、亚硝酸盐、普鲁卡因酰胺、奎尼丁等，与本类药同时用，有发生体位性低血压的危险，给药后立即随访监测。

（10）与 M 胆碱药尤其是阿托品并用时，不仅便秘严重，而且可有麻痹性肠梗阻和尿滞留的危险。

【药物过量】

本品过量时，较多见的征象有：

1、呼吸频率慢，每分钟通气量不足，提示已发生呼吸抑制，遇有上述征象出现，即应采取补救措施。至于迷倦入睡，晕眩疲乏、瞳孔缩小，常提示药效尚未完全消失；

2、神智恍惚嗜睡、激动不安、思路紊乱说话，提示中枢神经供血不足；
3、可能发生嗜睡，呼吸抑制，皮肤湿冷，血压降低，心动过缓等，且在严重的情况下，可能发生循环衰竭，昏迷，抽搐等；应保持充分的呼吸和循环系统的辅助治疗，对于惊厥的治疗是必要的；过量时常要用大量的纳洛酮才能拮抗，由于后者作用时效短，常须按时多次给药。烯丙吗啡作为拮抗药，早于纳洛酮，实际前者仍具有一定的激动性，喷他佐辛的呼吸抑制可因而加剧。

【药理毒理】

药理作用

喷他佐辛是一种阿片受体混合激动剂-拮抗剂，是 μ 受体部分激动剂和 κ 受体拮抗剂。

对中枢神经系统的影响

喷他佐辛通过对脑干呼吸中枢的直接作用而产生呼吸抑制。呼吸抑制包括脑干呼吸中枢对二氧化碳分压升高和电刺激的反应性降低。

喷他佐辛会引起瞳孔缩小，即使在完全黑暗环境中。针尖样瞳孔是阿片类药物过量的一种特征，但不是特异性病症（例如出血或缺血性脑桥损伤可能产生类似表现）。在用药过量的情况下，由于缺氧，可能出现明显的瞳孔放大而非瞳孔缩小。

对消化道和其它平滑肌的影响

喷他佐辛可引起胃窦和十二指肠平滑肌张力增加相关的蠕动减少；能延迟食物在小肠中的消化，并抑制推进性收缩；结肠的推进性蠕动波降低，但张力可能增加至产生痉挛的程度，从而导致便秘。其它阿片类诱导效应可能包括胆道和胰腺分泌减少、奥狄氏括约肌痉挛、血清淀粉酶的短暂升高。

对心血管系统的影响

喷他佐辛能扩张外周血管而可能导致体位性低血压或晕厥。组胺释放和 / 或外周血管扩张的表现可包括瘙痒、潮红、红眼、出汗和 / 或体位性低血压。

对内分泌系统的影响

阿片类药物可抑制人体内促肾上腺皮质激素（ACTH）、皮质醇和黄体生成素（LH）的分泌；还可刺激催乳素、生长激素的分泌，以及胰岛素和胰高血糖素的胰腺分泌。

长期使用阿片类药物可能会影响下丘脑-垂体-性腺轴，导致雄激素缺乏，可能表现为性欲低下、阳痿、勃起功能障碍、闭经或不育。阿片类药物在性腺功能减退临床综合征中的因果关系尚不清楚，因为在迄今为止所进行的研究中，可能影响性腺激素水平的各种医疗、身体、生活方式和心理应激源未得到充分控制。

对免疫系统的影响

在体外和动物模型中，阿片类药物显示对免疫系统的组份有多种影响，这些发现的临床意义尚不清楚。总体来说，阿片类物质的效应似乎是适度的免疫抑制。

浓度-效应关系

喷他佐辛是一种强效镇痛药，30mg 通常与吗啡 10mg 或哌替啶 100mg 镇痛作用相当；然而，一些研究显示，喷他佐辛在 20 ~ 40mg 剂量间的镇痛作用与吗啡 10mg 的镇痛作用相当。喷他佐辛镇痛的持续时间有可能比吗啡短。喷他佐辛镇痛作用通常发生于肌内注射或皮下注射 15 ~ 20 分钟内、静脉注射 2 ~ 3 分钟内。喷他佐辛对吗啡、哌替啶的镇痛作用有弱的拮抗作用，此外，还能部分逆转吗啡和哌替啶引起的心血管、呼吸和行为抑制。喷他佐辛的拮抗活性约为纳洛酮的 1/50。喷他佐辛还具有镇静作用。

喷他佐辛的最低有效镇痛浓度在患者之间存在很大差异，特别是在既往接受过强效阿片类激动剂治疗的患者之间。由于疼痛的增加、新疼痛综合征的发展和 / 或镇痛耐受性的发展，喷他佐辛对患者的最低有效镇痛浓度可能随着时间的推移而增加。

浓度-不良反应关系

喷他佐辛血浆浓度升高与剂量相关的阿片类不良反应（如恶心、呕吐、中枢神经系统反应和呼吸抑制）频率增加具有相关性。在阿片类药物耐受患者中，这种情况可能随着对阿片类相关不良反应的耐受性的发展而改变。

毒理研究

遗传毒性

喷他佐辛未进行遗传毒性试验。

生殖毒性

喷他佐辛未进行动物生育力试验。

在一篇发表的文献中，仓鼠于妊娠第 8 天单次皮下注射给予喷他佐辛，在 196mg/kg（以体表面积计，相当于人最大日用量 360mg/ 日的 4.4 倍）剂量下增加了神经管缺陷（无脑畸形和颅裂）的发生率，在 98mg/kg（以体表面积计，相当于人最大日用量 360mg/ 日的 2.2 倍）剂量下未见。

致癌性

喷他佐辛未进行动物长期致癌性试验。

【药代动力学】

1、血中浓度

肌注后 15 分钟血浆浓度达高峰，静注后 2-3 分钟血浆浓度高峰，t_{1/2} 约为 2 小时。

2、代谢、排泄

主要在肝脏代谢，经肾脏排泄。24 小时约排出总量的 60%。

3、血浆蛋白结合率

研究对健康成人（20 例）和神经外科手术后患者（22 例）的喷他佐辛血浆蛋白结合率，结果分别为 61.1% 和 65.8%。

4、老年人血中浓度

青年（22 ~ 48 岁）的健康成人（8 例）、手术后患者（1 例）及高龄（60 ~ 90 岁）的手术后患者（5 例），疼痛患者（3 例），喷他佐辛分别 30mg，80mg，45 ~ 60mg，30mg，静脉内注射时，老年人和健康成人比较总清除率下降约 1/2，清除半衰期延长了约 1.6 倍。老年人使用本品时，需要适当调整剂量和给药间隔。

【贮藏】避光，密闭，室温（10 ~ 30℃）保存。

【包装】中硼硅玻璃安瓿包装，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 YBH02632025

【批准文号】国药准字 H20253528

【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：0533-2184991

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鲁泰大道 1 号

邮政编码：255086

电话号码：0533-2196361

传真号码：0533-2196365

网址：www. xhzy. com

301031262A

品名规格	喷他佐辛注射液说明书	改版项目	说明书
包装材质		版本号	301031262A
成品尺寸	150mm × 180mm	印刷颜色	（印刷与提供色样有偏差，以最后印刷稿为准。）
修订日期		字体	

签字及日期

马建华 2025.05.15