

核准日期： 2006 年 11 月 30 日
发布或修订日期： 2014 年 02 月 08 日

甲钴胺注射液说明书
请仔细阅读说明书并在医师指导下使用
警示语： 对本品及成份过敏者禁用

【药品名称】 【通用名称】 甲钴胺注射液

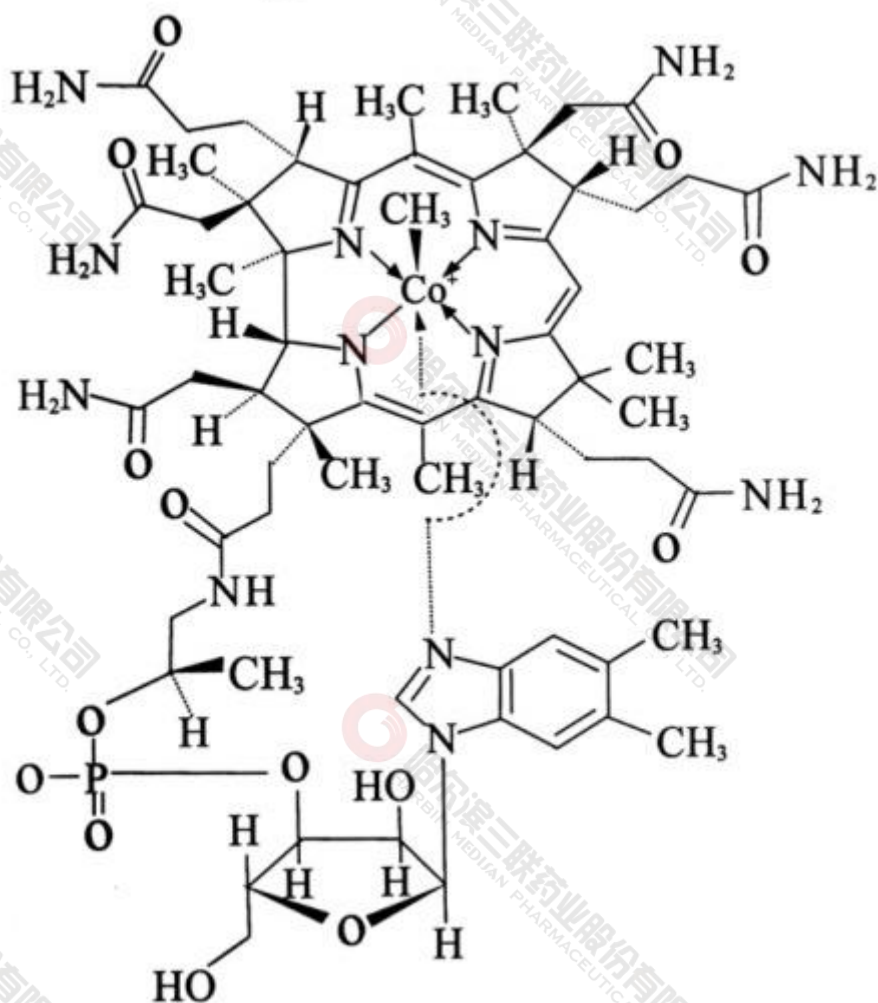
【商品名】

【英文名】 Mecobalamin Injection

【汉语拼音】 Jiagu' an Zhusheye

【成份】 【化学名称】 $\text{Co } \alpha$ -[α -(5,6-二甲基苯并咪唑基)]- $\text{Co } \beta$ -甲钴酰胺。

【化学结构式】



【分子式】 $C_{63}H_{91}CoN_{13}O_{14}P$

【分子量】 1344.38

【注射剂辅料】 甘露醇

【性状】 本品为红色的澄明液体。

【适应症】 1. 用于周围神经病。2. 因缺乏维生素 B12 引起的巨幼红细胞性贫血的治疗。

【规格】 1ml:0.5mg

【用法用量】 1. 周围神经病 成人一次 0.5mg，一日 1 次，一周 3 次，肌内注射或静脉注射，可按年龄、症状酌情增减。2. 巨幼红细胞性贫血 成人一次 0.5mg，一日 1 次，一周 3 次，肌内注射或静脉注射。给药约两个月后，作为维持治疗，每隔 1-3 个月可给与一次 0.5mg。

【不良反应】 1、严重不良反应（频度不明） 过敏反应：会引起血压下降、呼吸困难等过敏反应。应密切观察患者，如果出现这种反应，应立即中止用药，并采取适当的措施。

2、其他不良反应（1）过敏反应：皮疹（<0.1%），如果出现这些不良反应，应停止用药。

（2）其它：头痛、发烧感（<0.1%）；出汗、肌内注射部位疼痛、硬结（频度不明）。如果出现这些不良反应，应停止用药。

【禁忌】 对本品及成份过敏者禁用。

- 【注意事项】**
1. 如果使用一个月后仍不见效，则不必继续无目的地使用。
 2. 使用时的注意事项 (1) 给药时 见光易分解，开封后立即使用的同时，应注意避光。
(2) 肌内注射时 肌内注射时为避免对组织、神经的影响，应注意以下几点：1)避免同一部位反复注射，且对新生儿、早产儿、婴儿、幼儿要特别小心。2)注意避开神经分布密集的部位。3)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) 安瓿打开时 本品为一点折割安瓿，将安瓿的切割部位用酒精棉等擦拭后，再切割。
(4) 为了确保储存质量稳定，采用遮光材料包装，从遮光材料中取出后立即使用。

【孕妇及哺乳期妇女用药】 用于孕妇及哺乳期妇女的安全性尚不明确。

【儿童用药】 尚不明确。

【老年用药】 尚不明确。

【药物相互作用】 尚不明确。

【药物过量】 尚不明确，如发生过量请予以对症支持处理。

【药理毒理】 药理 (1) 甲钴胺是一种内源性的辅酶 B12。在由同型半胱氨酸合成蛋氨酸的转甲基反应过程中，作为蛋氨酸合成酶的辅酶起重要作用。

(2) 甲钴胺易转移至神经细胞的细胞器，从而促进核酸和蛋白质的合成。甲钴胺较氰钴胺更易转移入大白鼠的神经细胞的细胞器。在小鼠的脑细胞和脊髓神经细胞的实验中，参与由脱氧尿嘧啶核苷合成胸腺嘧啶核苷的过程，促进叶酸的利用和核酸的代谢。而且，甲钴胺比钴酰胺更能促进大鼠的核酸和蛋白质的合成。

(3) 促进轴索内输送和轴索的再生 对由链脲菌素引起糖尿病大白鼠的坐骨神经细胞，可使轴索结构蛋白质的输送正常化。对由阿霉素、丙烯酰胺、长春新碱引起的药物性神经障碍(大白鼠、兔)以及轴索变性小白鼠模型，自然发病糖尿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。

(4) 促进髓鞘的形成(磷脂合成) 较腺苷钴胺更能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(大白鼠)。

(5) 恢复神经键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，从而恢复终端电位的诱发(大白鼠)。另外可使喂养缺胆碱大白鼠低下的脑内乙酰胆碱量正常化。

(6) 促进正红血母细胞的成熟、分裂，改善贫血血象。缺乏维生素 B12 可能导致巨幼红细胞性贫血，本药促进在骨髓中核酸的合成及正红血母细胞的成熟、分裂，增加红细胞的产生。本药可迅速恢复因 B12 缺乏而降低的大白鼠红细胞数、血红蛋白、血细胞比容值。

毒理 1、急性毒性 LD50 (mg/kg)

2、亚急性毒性 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、血液及器官重量等均无特殊变化，病理组织学检查中，通过显微镜观察发现，剂量为 50.0mg/kg 的肾近位尿细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。

3、慢性毒性 给狗静注 12 个月 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 以上的肾近位尿细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 试验中发现了在肾小球系膜细胞的溶酶体及肝枯否氏细胞的增加。

4、生殖试验 在大白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，对胎仔及新生仔无异常所见及致畸作用。

【药代动力学】 1. 人体药代动力学 (1) 单次给药 给 12 位健康成年男子一次肌肉注射以及静脉注射甲钴胺 (CH13 -B12)0.5mg，达到血清中最高总维生素 B12 (简称 B12) 浓度的时间 (Tmax) 时，肌肉注射为 0.9±0.1 小时，静脉注射为给药后立刻~3 分钟，血清中最高总 B12 浓度增加部分 (除去内源性血清总 B12) (△Cmax) 各自为 22.4ng/ml, 85.0ng/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 B12 浓度时间曲线下面积 (△AUC)，肌肉注射、静脉注射给药各自为 204.1h·ng/ml, 358.6h·ng/ml，另一方面，在结合饱和率上两个给药组在给药后截止 144 小时中显示了大体相等的增加。

单剂量注射甲钴胺注射液 0.5mg 的药代动力学参数 (n=12)

(2)连续给药 给 6 位健康成年男子静脉注射每天一次甲钴胺 0.5mg 连用 10 天，每次给药前，血清中总 B12 浓度 (△Cmin) 随着给药天数的增加而不断上升，给药两天后与初次给药后 24 小时值 (3.9±1.2ng/ml) 相比约达 1.4 倍 (5.3±1.8ng/ml)，给药第三天给药后则达约 1.7 倍 (6.8±1.5ng/ml)。该浓度一直持续到最后给药。

2. 动物药代动力学 给大白鼠静脉注射 57Co-CH13 -B1210 μg/kg，24 小时后，组织内浓度由高到低依次为肾、肾上腺、肠、胰、脑垂体，在眼、脊髓、脑、肌肉等处浓度低。

【贮藏】 遮光,密闭保存。

【包装】 棕色曲颈易折玻璃安瓿，1 支/盒。

【有效期】 24 个月

【执行标准】 YBH11932004

【批准文号】 国药准字 H20044627