

核准日期:2008年06月16日  
修改日期:2010年09月03日  
2016年03月22日  
2019年07月26日  
2020年06月03日

凯那®

## 贝前列素钠片说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

### 【药品名称】

通用名: 贝前列素钠片

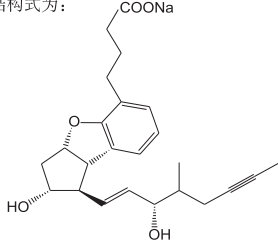
英文名: Beraprost Sodium Tablets

汉语拼音: Beiqianliesuna Pian

### 【成份】

本品主要成分贝前列素钠, 其化学名称为:  
(±)-2,3,3a,8b- 四氢-2- 羟基-1- (3-羟基-4-甲基-1- 辛  
烯-6-炔基)-1H-环戊并 [b] 苯并呋喃-5-丁酸钠

其结构式为:



分子式:  $C_{24}H_{29}NaO_5$  分子量: 420.48

### 【性状】

本品 20 $\mu$ g 规格为白色至类白色薄膜衣片, 一面刻有“BS20”, 除包衣后显白色; 40 $\mu$ g 规格为淡黄色薄膜衣片, 一面刻有“BS40”, 除包衣后显白色。

### 【适应症】

改善慢性动脉闭塞性疾病引起的溃疡、间歇性跛行、疼痛和冷感等症状。

### 【规格】

(1) 20  $\mu$ g; (2) 40  $\mu$ g

### 【用法用量】

通常, 成人饭后口服。一次40  $\mu$ g, 一日三次。

### 【不良反应】

1. 严重不良反应

(1) 出血倾向【脑出血(低于0.1%)、消化道出血(低于0.1%)、肺出血(发生率不明), 眼底出血(低于0.1%)】: 应密切观察, 如出现异常时, 应停止给药, 给予适当的处置。

(2) 休克(低于0.1%): 有引起休克的报告, 应密切观察, 如发现血压降低、心率加快、面色苍白、恶心等症状时, 应停止给药, 给予适当的处置。

(3) 间质性肺炎(发生率不明): 曾有出现间质性肺炎的报告, 应密切观察, 如出现异常时, 应停止给药, 给予适当的处置。

(4) 肝功能低下(发生率不明): 曾有出现黄疸

和GOT、GPT 升高等肝功能异常的报告, 应密切观察, 如出现异常时, 应停止给药, 给予适当的处置。

(5) 心绞痛(发生率不明): 曾有发生心绞痛的报告, 如出现异常时, 应停止给药, 给予适当的处置。

(6) 心肌梗塞(发生率不明): 曾有发生心肌梗塞的报告, 如出现异常时, 应停止给药, 给予适当的处置。

2. 其它不良反应

有发生下列不良反应的可能性, 应密切观察, 并给予适当的处置。

|         | 0.1~小于5%                           | 低于0.1%                      | 发生率不明       |
|---------|------------------------------------|-----------------------------|-------------|
| 出血倾向    |                                    | 出血倾向、皮下出血                   | 鼻出血         |
| 血液      |                                    | 贫血、嗜酸性粒细胞增多                 | 血小板减少、白细胞减少 |
| 过敏      | 皮疹                                 | 湿疹、瘙痒                       |             |
| 精神、神经系统 | 头痛、头晕                              | 眩晕、嗜睡、朦胧状态、麻木感              |             |
| 消化系统    | 恶心、腹泻、腹痛、食欲不振                      | 胃溃疡、呕吐、胃功能障碍、口渴、烧心          |             |
| 肝 脏     | GOT升高、GPT升高、 $\gamma$ -GTP升高、LDH升高 | 胆红素升高、ALP升高                 | 黄疸          |
| 肾 脏     | BUN升高                              | 血尿                          | 尿频          |
| 循环系统    | 颜面潮红、发热、头晕、心悸、皮肤潮红                 | 血压下降、心率加快                   |             |
| 其 它     | 甘油三酯升高                             | 浮肿、疼痛、胸痛、关节痛、胸闷、耳鸣、乏力、发热、出汗 | 背痛、脱毛、咳嗽    |

### 【禁忌】

下列情况禁用

1. 妊娠或可能妊娠的妇女禁用本品(有关妊娠期间用药的安全性尚未确定)。

2. 出血的患者(如血友病、毛细血管脆弱症、上消化道出血、尿路出血、咯血、眼底出血等患者服用本品可能导致出血增加)。

## 【注意事项】

下列患者请慎重服药：

- 1.正在使用抗凝血药、抗血小板药、血栓溶解剂的患者。
- 2.月经期的妇女。
- 3.有出血倾向及其因素的患者。

## 【孕妇及哺乳期妇女用药】

- 1.妊娠或可能妊娠的妇女禁服本品（有关妊娠期用药的安全性尚未确立）。
- 2.哺乳期妇女应避免服用本品，必须服用时，应停止哺乳（大鼠的动物实验表明，本药可以在乳汁中分布）。

## 【儿童用药】

儿童服药的安全性尚未确立（没有使用经验）。

## 【老年用药】

老年患者服用时应注意用量（通常老年人生理功能有所下降）。

## 【药物相互作用】

| 药 名                                         | 临床症状、处置方法                                    | 机制、危险因素 |
|---------------------------------------------|----------------------------------------------|---------|
| 抗凝血药：华法林等<br>抗血小板药：阿司匹林、噻氯匹定等<br>血栓溶解剂：尿激酶等 | 有增加出血倾向的可能，应密切观察，如发现异常，应给予减少剂量或停止合并用药等适当的处置。 | 有协同作用   |
| 前列腺素E <sub>2</sub> 制剂                       | 有可能导致血压下降，需密切监测血压。                           | 可能有协同作用 |

## 【药物过量】

每日服药180 μg时，有不良反应发生率增加的报道。

## 【药理毒理】

药理作用

与前列环素一样，本药通过血小板和血管平滑肌的前列环素受体，激活腺苷酸环化酶，使细胞内cAMP浓度升高，抑制Ca<sup>2+</sup>流入及血栓素A<sub>2</sub>生成等，从而有抗血小板和扩张血管的作用。

1.抗血小板作用

(1)末梢循环障碍的患者和健康人口服本品，可抑制血小板聚集和血小板粘附。

(2)能抑制聚集诱导物质引起的人血小板聚集，对人血小板聚集块有溶解作用（体外实验）。

2.扩张血管、增加血流量作用

(1)健康人口服本品后，皮肤血流量增加。

(2)末梢循环障碍的患者口服本品，可以提高安静时组织内氧分压，缩短肢体缺血试验的缺血恢复时间，用激光多普勒方法可测出皮肤血流量的增加。

(3)另外，对K<sup>+</sup>、PGF<sub>2α</sub>引起收缩的狗股动脉、肠系膜动脉等各种离体动脉显示扩张作用(体外实验)。增加狗各脏器血管的血流量。

3.对病理模型的作用

(1)慢性动脉闭塞性疾病模型

在月桂酸诱发的大鼠后肢循环障碍、麦角胺-肾上腺素诱发的大鼠尾循环障碍以及电刺激诱发的家兔动脉血栓模型中，可抑制缺血性病变的恶化和血栓形成。

(2)血栓模型

对大鼠动脉血栓性疾病和大鼠静脉血栓性疾病有抑制血栓形成的作用。

(3)皮肤溃疡模型

促进由醋酸引起的大鼠皮肤溃疡的愈合。

毒理研究

1.急性毒性试验

经口给予小鼠和大鼠本品的LD<sub>50</sub>为11.6-48.3mg/kg，狗经口给予本品5、10、20mg/kg时未出现死亡。

2.抗原性试验

用豚鼠及大鼠血清进行的抗原性试验中，没有发现本品有抗原性。

## 【药代动力学】

1.血浆中浓度

8名健康成人1次口服贝前列素钠100 μg时，Tmax、Cmax、半衰期如下表所示：

| Tmax   | Cmax      | 半衰期    |
|--------|-----------|--------|
| 1.42小时 | 0.44ng/ml | 1.11小时 |

另外，连续10日口服贝前列素钠50 μg/次，1日3次，最高血浆原药浓度是0.3-0.5ng/ml，没有出现因反复给药引起的药物蓄积。

2.代谢、排泄

12名健康成人1次口服贝前列素钠50 μg后，24小时内尿中原形药物的排泄量是2.8 μg，β-氧化物的排泄量是5.4 μg。原形药物和β-氧化物也可以葡萄糖醛酸结合物的形式排泄，总排泄量中游离形式的原形药物和β-氧化物的比率分别是14%和70%。

【贮藏】密封、常温（10-30℃）保存。

【包装】铝塑包装，10片/盒，30片/盒。

【有效期】36个月。

【执行标准】国家食品药品监督管理局标准YBH07042008

【批准文号】20 μg：国药准字H20083588

40 μg：国药准字H20083589

## 【药品上市许可持有人】

名称：北京泰德制药股份有限公司

注册地址：北京市北京经济技术开发区荣京东街8号

邮政编码：100176

联系方式：(010) 67880648

传 真：(010) 67860459

网 址：http://www.tidepharm.com

## 【生产企业】

企业名称：北京泰德制药股份有限公司

生产地址：北京市北京经济技术开发区科创八街19号院

邮政编码：100176

联系方式：(010) 67880648

传 真：(010) 67860459

网 址：http://www.tidepharm.com

10000449 (02) G