

核准日期：2007 年 05 月 28 日 修订日期：2015 年 12 月 01 日
修订日期：2009 年 01 月 06 日 修订日期：2019 年 12 月 01 日
修订日期：2010 年 10 月 01 日 修订日期：2020 年 12 月 30 日
修订日期：2011 年 06 月 23 日 修订日期：2023 年 07 月 11 日



地西洋注射液说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

【药品名称】

通用名称：地西洋注射液

英文名称：Diazepam Injection

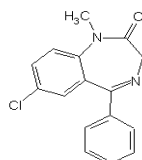
汉语拼音：Dixipan Zhusheye

【成份】

本品的主要成份为地西洋。

化学名称：1-甲基-5-苯基-7-氯-1,3-二氢-2H-1,4-苯并二氮杂草-2-酮。

化学结构式：



分子式：C₁₆H₁₃ClN₂O

分子量：284.74

辅料为：丙二醇、乙醇、苯甲醇、注射用水。

【性状】 本品为几乎无色至黄绿色的澄明液体。

【适应症】 1. 可用于抗癫痫和抗惊厥；静脉注射为治疗癫痫持续状态的首选药，对破伤风轻度阵发性惊厥也有效；2. 静注可用于全麻的诱导和麻醉前给药。

【规格】 2ml:10mg

【用法用量】 成人常用量：基础麻醉或静脉全麻，10-30mg。镇静、催眠或急性酒精戒断，开始 10mg，以后按需每隔 3-4 小时加 5-10mg。24 小时总量以 40-50mg 为限。癫痫持续状态和严重频发性癫痫，开始静注 10mg，每隔 10-15 分钟可按需增加甚至达最大限用量。破伤风可能需要较大剂量。静注宜缓慢，每分钟 2-5mg。小儿常用量：抗癫痫、癫痫持续状态和严重频发性癫痫，出生 30 天-5 岁，静注为宜，每 2-5 分钟 0.2-0.5mg，最大限用量为 5mg。5 岁以上每 2-5 分钟 1mg，最大限用量 10mg。如需要，2-4 小时后可重复治疗。重症破伤风解痉时，出生 30 天到 5 岁 1-2mg，必要时 3-4 小时后可重复注射，5 岁以上注射 5-10mg。小儿静注宜缓慢，3 分钟内按体重不超过 0.25mg/kg，间隔 15-30 分钟可重复。新生儿慎用。

【不良反应】 1. 常见的不良反应，嗜睡，头昏、乏力等，大剂量可有共济失调、震颤。2. 罕见的有皮疹，白细胞减少。3. 个别病人发生兴奋，多语，睡眠障碍，甚至幻觉。停药后，上述症状很快消失。4. 长期连续用药可产生依赖性和成瘾性，

停药可能发生撤药症状，表现为激动或忧郁。

【禁忌】 1、孕妇、妊娠期妇女、新生儿禁用。

2、严禁用于食品和饲料加工

【注意事项】 1. 对苯二氮草类药物过敏者，可能对本药过敏；2. 肝肾功能损害者能延长本药清除半衰期；3. 癫痫患者突然停药可引起癫痫持续状态；4. 严重的精神抑郁可使病情加重，甚至产生自杀倾向，应采取预防措施；5. 避免长期大量使用而成瘾，如长期使用应逐渐减量，不宜骤停；6. 对本类药耐受量小的患者初用量宜小，逐渐增加剂量；7、本品含苯甲醇，禁止用于儿童肌肉注射。

以下情况慎用：1. 严重的急性乙醇中毒，可加重中枢神经系统抑制作用；2. 重度重症肌无力，病情可能被加重；3. 急性或慢性发生闭角型青光眼可因本品的抗胆碱能效应而使病情加重；4. 低蛋白血症时，可导致易嗜睡难醒；5. 多动症者可有反常反应；6. 严重慢性阻塞性肺部病变，可加重呼吸衰竭；7. 外科或长期卧床病人，咳嗽反射可受到抑制；8. 有药物滥用和成瘾史者。

【孕妇及哺乳期妇女用药】1. 在妊娠三个月内，本药有增加胎儿致畸的危险，孕妇长期服用可成瘾，使新生儿呈现撤药症状激惹、震颤、呕吐、腹泻；妊娠后期用药影响新生儿中枢神经活动。分娩前及分娩时用药可导致新生儿肌张力较弱，应禁用。2. 本品可分泌入乳汁，哺乳期妇女应避免使用。

【儿童用药】 幼儿中枢神经系统对本药异常敏感，应谨慎给药。

【老年患者用药】 老年人对本药较敏感，用量应酌减。

【药物相互作用】1. 与中枢抑制药合用可增加呼吸抑制作用。2. 与易成瘾和其他可能成瘾药合用时，成瘾的危险性增加。3. 与酒及全麻药、可乐定、镇痛药、吩噻嗪类、单胺氧化酶 A 型抑制药和三环类抗抑郁药合用时，可彼此增效，应调整用量。4. 与抗高血压药和利尿降压药合用，可使降压作用增强。5. 与西咪替丁、普奈洛尔合用本药清除减慢，血浆半衰期延长。6. 与扑米酮合用由于减慢后者代谢，需调整扑米酮的用量。7. 与左旋多巴合用时，可降低后者的疗效。8. 与利福平合用，增加本品的消除，血药浓度降低。9. 异烟肼抑制本品的消除，致血药浓度增高。10. 与地高辛合用，可增加地高辛血药浓度而致中毒。

【药物过量】 出现持续的精神错乱、严重嗜睡、抖动、语言不清、蹒跚、心跳异常减慢、呼吸短促或困难、严重乏力。超量或中毒宜及早对症处理，最重要的是对呼吸循环方面的支持疗法，此外苯二氮草受体拮抗剂氟马西尼(flumazenil)可用于该类药物治疗中毒的解救和诊断。中毒出现兴奋异常时，不能用巴比妥类药物。

【药理毒理】 本品为长效苯二氮草类药物。苯二氮草类为中枢神经系统抑制药，可引起中枢神经系统不同部位的抑制，随着用量的加大，临床表现可自轻度的镇静到催眠甚至昏迷。本类药的作用部位与机制尚未完全阐明，认为可以加强或易化 γ -氨基丁酸(GABA)的抑制性神经递质的作用，GABA 在苯二氮草受体相互作用下，主要在中枢神经各个部位，起突触前和突触后的抑制作用。本类药为苯二氮草受体的激动剂，苯二氮草受体为功能性超分子(supramolecular)功能单位，

又称为苯二氮草 - GABA 受体-亲氯离子复合物的组成部分。受体复合物位于神经细胞膜，调节细胞的放电，主要起氯通道的闕閥(gating)功能。GABA 受体激活导致氯通道开发，使氯离子通过神经细胞膜流动，引起突触后神经元的超极化，抑制神经元的放电，这个抑制转译为降低神经元兴奋性，减少下一步去极化兴奋性递质。苯二氮草类增加氯通道开发的频率，可能通过增强 GABA 与其受体的结合或易化 GABA 受体与氯离子通道的联系来实现。苯二氮草类还作用在 GABA 依赖性受体。(1) 抗焦虑、镇静催眠作用。通过刺激上行性网状激活系统内的 GABA 受体，提高 GABA 在中枢神经系统的抑制，增强脑干网状结构受刺激后的皮层和边缘性觉醒反应的抑制和阻断。分子药理学研究提示，减少或拮抗 GABA 的合成，本类药的镇静催眠作用降低，如增加其浓度则能加强苯二氮草类药的催眠作用。

(2) 遗忘作用。地西洋在治疗剂量时可以干扰记忆通路的建立，从而影响近事记忆。(3) 抗惊厥作用。可能由于增强突触前抑制，抑制皮质-丘脑和边缘系统的致痫灶引起癫痫活动的扩散，但不能消除病灶的异常活动。(4) 骨骼肌松弛作用。主要抑制脊髓多突触传出通路和单突触传出通路。地西洋由于具有抑制性神经递质或阻断兴奋性突触传递而抑制多突触和单突触反射。苯二氮草类也可能直接抑制运动神经和肌肉功能。

【药代动力学】 肌注吸收慢而不规则，亦不完全，急需发挥疗效时应静脉注射。肌注 20 分钟内、静注 1-3 分钟起效。开始静注后迅速经血流进入中枢神经，作用快，但转移进入其他组织也快，作用消失也快。肌注 0.5-1.5 小时、静注 0.25 小时血药浓度达峰值，4-10 天血药浓度达稳态， $T_{1/2}$ 为 20-70 小时，血浆蛋白结合率高达 99%。本品主要在肝脏代谢，代谢产物有去甲地西洋、去甲羟地西洋等，亦有不同程度的药理活性，去甲地西洋的 $T_{1/2}$ 可达 30-100 小时。本品有肠肝循环，长期用药有蓄积作用。代谢产物可滞留在血液中数天甚至数周，停药后消除较慢。地西洋主要以代谢物的游离或结合形式经肾排泄。

【贮藏】 遮光，密闭保存。

【包装】 低硼硅玻璃安瓿、纸盒，10 支/盒。

【有效期】 36 个月。

【执行标准】 中国药典 2020 年版二部。

【批准文号】 国药准字 H41025470

【上市许可持有人】 海南制药厂有限公司制药二厂

【地址】 林州市史家河工业园区

【生产企业】

企业名称：海南制药厂有限公司制药二厂

生产地址：林州市史家河工业园区

邮政编码：456592

电话号码：0372-6515111

传真号码：0372-6515111