

核准日期：2009年06月18日

发布或修订

日期：2014

年02月08

日

注射用盐酸托烷司琼说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

警示语：对盐酸托烷司琼有过敏者禁用、孕妇禁用

【药品名称】 【通用名称】 注射用盐酸托烷司琼

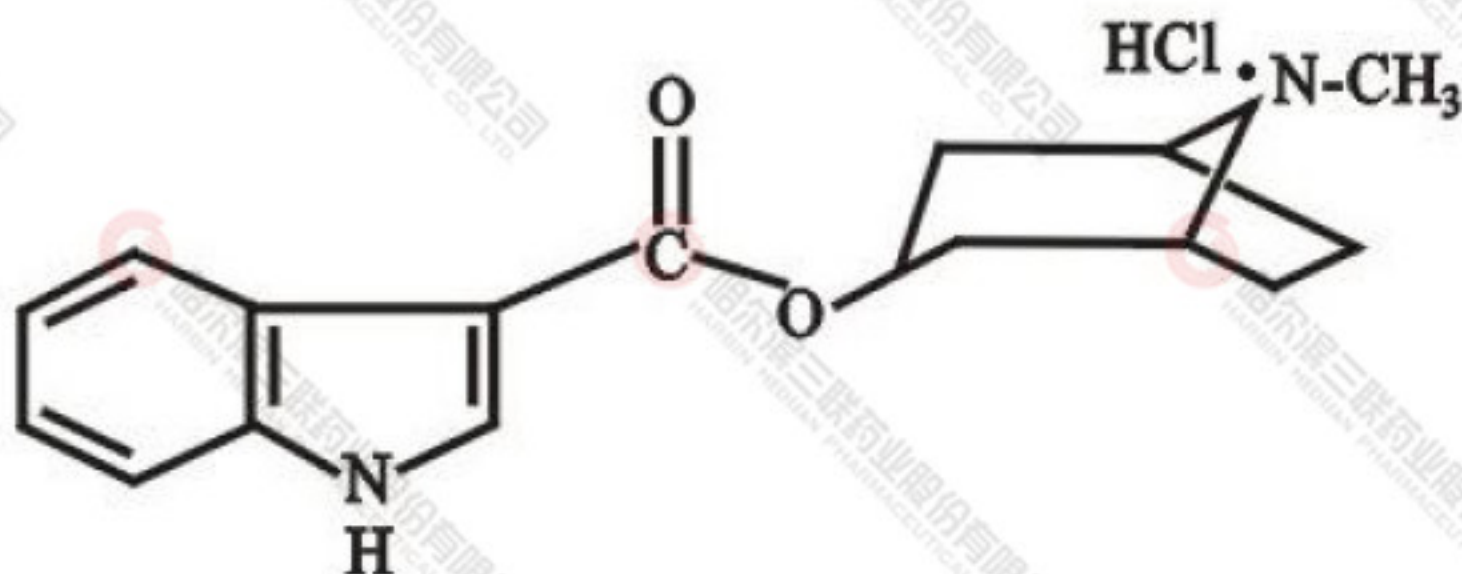
【商品名】 纾吉

【英文名】 Tropisetron Hydrochloride for Injection

【汉语拼音】 Zhusheyong Yansuan Tuowansiqiong

【成份】 【化学名称】 3-吲哚甲酸（8-甲基-8-氮杂双环[3.2.1]-3a-辛基）酯盐酸盐。

【化学结构式】



【分子式】 C₁₇H₂₀N₂O₂·HCl

【分子量】 320.81

【注射剂辅料】 甘露醇

【性状】 本品为白色疏松块状物。

【适应症】 预防和治疗癌症化疗引起的恶心和呕吐。用于外科手术后恶心和呕吐。

【规格】 2mg(按 $C_{17}H_{20}N_2O_2$ 计)

【用法用量】 用前将本品用生理盐水或葡萄糖溶解后使用。

预防和治疗癌症化疗引起的恶心和呕吐：

儿童：一般不推荐用于儿童，如病情需要必须使用时，可参照下列剂量：

在 2 岁以上的儿童剂量 0.2 毫克/公斤，最高可达 5 毫克/天。第 1 天静脉给药：将本品溶于 100 毫升常用输注液中（生理盐水、林格氏液或 5%葡萄糖液）于化疗前快速静脉滴注或缓慢静脉推注，第 2~6 天可口服给药。儿童口服给药：本品溶解后，可取适量的盐酸托烷司琼溶液，用桔子汁或可乐稀释后，在早晨起床时（至少于早餐前 1 小时）立即服用。

成人：成人推荐剂量为 5 毫克/天，每天一次，疗程为 6 天。第 1 天静脉给药：将本品溶于 100 毫升常用输注液中（生理盐水、林格氏液或 5%葡萄糖液）在化疗前快速静脉滴注或缓慢静脉推注。第 2~6 天可改为口服给药，于早晨起床时用生理盐水或葡萄糖溶解后（至少于早餐前一小时）用水送服。

治疗手术后的恶心和呕吐：

儿童本品的推荐剂量为 0.1mg/公斤体重，静脉输注（溶于生理盐水、林格氏溶液、5%的葡萄糖溶液或果糖溶液等）或缓慢静脉注射（30 秒以上）。

成人推荐剂量为 2mg，静脉输注（溶于生理盐水、林格氏溶液、5%的葡萄糖溶液或果糖溶液等）或缓慢静脉注射（30 秒以上）。

特殊使用：单用本品疗效不佳时，不增加药物剂量而同时合用地塞米松可提高止吐疗效。

代谢不良者应用：在为期 6 天的应用中，无需减少剂量。

肝或肾功能不全患者的应用：在急性肝炎或脂肪肝患者中，盐酸托烷司琼的药代动力学无改变。但是，

肝硬化或肾功能不全患者的血浆药物浓度则较正常的健康志愿者高约 50%，然而，如果采用 5 毫克/天共 6 天的给药方案，则不必减量。

在任何化疗周期中，盐酸托烷司琼最多应用 6 天。

【不良反应】 盐酸托烷司琼通常耐受性良好，推荐剂量下的不良反应为一过性。最常报道的不良反应为 5mg 应用引起的便秘（11%），这些不良反应在慢性代谢者中比正常代谢者中更为常见。其他常见的不良反应有头痛、头昏、眩晕、疲劳和胃肠功能紊乱如腹痛和腹泻等。也有虚脱、晕厥和心跳停止的个案报道，但尚不能确定与盐酸托烷司琼的因果关系。也有以下一种或多种 I 型变态反应的个案报道：面部潮红和/或全身麻疹、胸部压迫感、呼吸困难、急性支气管痉挛和低血压。

【禁忌】 对盐酸托烷司琼有过敏者禁用。

【注意事项】

1. 高血压未控制的患者，用药后可能引起血压进一步升高，故高血压患者应慎用，其用量不宜超过 10 毫克/天。
2. 盐酸托烷司琼常见不良反应是头晕和疲劳，患者服药后在驾车或操纵机械者应慎用。
3. 肝肾功能障碍者使用本品半衰期延长，但这种变化在每天 5mg，连续用药 6 天的治疗中不会发生药物蓄积，因此不必调整用药剂量。
4. 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】

孕妇禁用。盐酸托烷司琼是否泌入人乳尚未证实，故用药患者不应授乳。

【老年用药】

【老年用药】 老年人应用无需调整剂量。

【药物相互作用】

1. 盐酸托烷司琼若与利福平或其他肝酶诱导药物（如苯巴比妥）同时使用，则可导致盐酸托烷司琼的血浆浓度降低，因此代谢正常者需增加剂量（代谢不良者不需增加）。
2. 细胞色素 P450 酶抑制剂如西咪替丁对盐酸托烷司琼的血浆浓度的影响，在正常使用的情况下无需调整剂量。
3. 接受静脉高剂量（80mg）盐酸托烷司琼注射液的患者中观察到临床无意义的 QTc 延长，因此当与其他可能会导致 QTc 延长的药物合用时应非常注意。
4. 有心率或传导异常疾病的患者以及同时服用抗心率失常药物或β受体阻滞剂的患者应用盐酸托烷司琼

注射液应谨慎。

【药物过量】 症状：多次大剂量使用时可有幻视。高血压患者的血压可升高。

处理：对症治疗，应对患者的重要生命体征做严密观察。

【药理毒理】 药理作用

本品是一种外周神经原及中枢神经系统 5-羟色胺₃ (5-HT₃) 受体的强效、高选择性的竞争拮抗剂。某些物质包括一些化疗药可激发内脏黏膜的类嗜铬细胞释放出 5-羟色胺，从而诱发伴恶心的呕吐反射。本品主要通过选择性地阻断外周神经原的突触前 5-HT₃ 受体而抑制呕吐反射，另外，其止吐作用也可能与其通过对中枢 5-HT₃ 受体的直接阻断而抑制最后区的迷走神经的刺激作用有关。

毒理研究

遗传毒性：文献报道盐酸托烷司琼对小鼠骨髓微核无明显影响，体外高浓度也未见染色体畸变和致突变作用。

生殖毒性：动物生殖毒性试验提示本品有潜在胚胎毒性。尚不清楚本品是否可进入乳汁，因此哺乳期妇女不应使用本品。

【药代动力学】 健康志愿者静脉注射盐酸托烷司琼，消除半衰期 ($t_{1/2\beta}$) 约为 7.3~30.3 小时，表观分布容积 (V) 约为 400~600 升，蛋白结合率为 59~71%。

托烷司琼的代谢与司巴丁/多聚异喹啉相关 (细胞色素 P450 2D6)，高加索人种中约 8% 人缺乏这种酶。托烷司琼的代谢主要是吲哚环上 5、6 和 7 位的羟化，再进一步形成葡萄糖醛酸和硫酸的结合产物，最后经尿或胆汁排出 (代谢物经尿和粪排出比例为 5: 1)。代谢物对 5-HT₃ 受体的作用极弱，故不呈现药理作用。代谢正常者的消除半衰期 (β 相) 约 7~10 小时，在代谢不良者中，该值可能延长至 45 小时。本品的总体清除率约为 1 升/分钟，其中经肾清除的约为 10%。在代谢不良的患者中，尽管经肾消除的比例不变，但总体清除率却降为 0.1~0.2 升/分钟。这种降低可导致消除半衰期延长约 4~5 倍、AUC 值提高 5~7 倍，而 C_{\max} 和分布容积与正常代谢者无显著差别。在代谢不良者中，经尿液排出的药物原型比例较代谢正常者大。

在剂量超过 10 毫克、每天二次的多天用药期间，参与本品代谢的肝酶系统的代谢能力可达饱和，并可造成本品血药浓度的剂量依赖性增高。然而，即使在代谢不良者中，这类剂量所产生的血药浓度仍属

可较好耐受的水平。因此，如果采用 5 毫克/天、共六天的给药方案，不必担心药物的蓄积作用。

【贮藏】 密封，在阴凉干燥处（不超过 20℃）保存。

【包装】 低硼硅玻璃管制注射剂瓶，6 瓶/盒。

【有效期】 暂定 24 个月

【执行标准】 《中国药典》2015 年版二部

【批准文号】 国药准字 H20060646