

核准日期：
修改日期：

盐酸格拉司琼注射液说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用。

【药品名称】

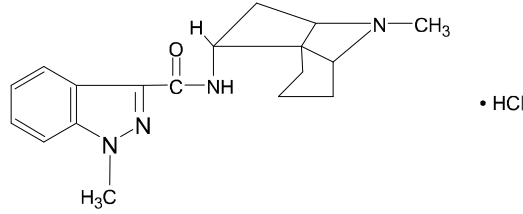
通用名称：盐酸格拉司琼注射液
英文名称：Gransetron Hydrochloride Injection
汉语拼音：Yansuan Gelasiqiong Zhushuye

【成份】

本品的活性成份：盐酸格拉司琼。

化学名称：1-甲基-N-(内向-9-甲基-9-氮杂双环[3.3.1]壬烷-3-基)-IH-吲唑-3-甲酰胺盐酸盐。

化学结构式：



分子式： $C_{14}H_{20}N_4$
分子量：348.88
辅料：氯化钠

【性状】

本品为无色澄明液体。

【适应症】

用于放射治疗、细胞毒类药物化疗引起的恶心和呕吐。

【规格】

3ml:3mg

【用法用量】

成人用量通常为 3mg，用 20 ~ 50ml 5% 葡萄糖注射液或 0.9% 氯化钠注射液稀释后，于治疗前 30 分钟静脉注射，给药时间应超过 5 分钟。大多数病人只需给药一次，对恶心和呕吐的预防作用便可超过 24 小时。必要时可增加给药次数 1 ~ 2 次，但每日最高剂量不应超过 9mg。老年人和肝、肾功能不全者无需调整剂量。

【不良反应】

常见的副作用为头痛、倦怠、发热、便秘、偶有短暂性无症状肝转氨酶升高。上述反应轻微，无须特殊处理。

【禁忌】

- 对本品或有关化合物过敏者禁用。
- 胃肠道梗阻者禁用。

【注意事项】

- 由于本品可减慢消化道运动，故消化道运动障碍患者使用本品时应严密观察。
- 本品不应与其他药物混合使用。
- 本品应在配制 24 小时内使用。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

- 孕妇除非必需，否则不宜使用。
- 哺乳期妇女需慎用，若使用本品时应停止哺乳。

【儿童用药】

2 到 16 岁的儿童推荐剂量是 10 μ g/kg；2 岁以下儿童用药情况尚不明确。

【老年用药】

老年人无需调整剂量。

【药物相互作用】

- 格拉司琼不会诱导或抑制细胞色素 P-450 药物代谢酶系统。

2、因为格拉司琼是通过肝细胞色素 P-450 药物代谢酶进行代谢，诱导或抑制此酶可以改变

清

除率和格拉司琼的半衰期。

【药物过量】

尚不明确。

【药理毒理】

药理作用

本品是一种高选择性的 5-HT₃ 受体拮抗剂，对因放疗、化疗及手术引起的恶心和呕吐具有良

好

的预防和治疗作用。放疗、化疗及外科手术等因素可引起肠嗜铬细胞释放 5-HT，5-HT 可激活中枢或迷走神经的 5-HT₃ 受体而引起呕吐反射。本品控制恶心和呕吐的机理，是通过拮抗中枢化学感受区及外周迷走神经末梢的 5-HT₃ 受体，抑制恶心、呕吐的发生。本品选择性高，无锥体外系反应和过度镇静等副反应。

毒理研究

遗传毒性：本品 Ames 试验、小鼠淋巴瘤细胞正向突变试验、小鼠微核试验及体内、外大鼠

肝

细胞 UDS 试验结果均未表现出致突变作用。但在 HeLa 细胞体外试验中出现 UDS 明显增加，体外人淋巴细胞染色体畸变试验中，多倍体细胞的数量明显增加。

生殖毒性：本品皮下给药剂量达 6mg/kg/天（以体表面积算，为临床静脉给药推荐剂量的 97 倍）

时，未表现出对雌、雄大鼠生育力和生殖行为的影响。妊娠大鼠和家兔静脉给予本品剂量分别为

9mg/kg/天（54mg/m²/天，按体表面积算，相当于临床静脉给药推荐剂量的 146 倍）及 3mg/kg/天

（35.4mg/m²/天，按体表面积算，相当于临床静脉给药推荐剂量的 96 倍）时，均未表现出对动物生育力和胎仔发育的影响，但尚无充分和严格对照的妊娠妇女给药的临床研究。由于动物试验并不总能预测药品对人体的影响，故只有在确实必需时，孕妇才可在妊娠期间服用本品。

目前尚不清楚本品是否通过乳汁分泌。因为许多药物可以经乳汁分泌，故哺乳妇女服用本品

时

应慎重考虑对其后代的影响。

致癌性：在两年的致癌试验中，大鼠经口给予本品的剂量分别为 1、5、50mg/kg（6、30、300mg/m²/天），其中高剂量组在第 59 周时因毒性反应而将剂量降至 25mg/kg。结果显示，5mg/kg/天以上组（包括该剂量组）雄性大鼠和 25mg/kg/天组雌性大鼠（以体表面积算，其剂量分别相当于临床静脉给药推荐剂量的 81 倍以上和 405 倍）肝细胞癌和腺瘤的发生率显著增加，而 1mg/kg 组雄性大鼠和 5mg/kg 组雌性大鼠（以体表面积算，分别为临床静脉给药推荐剂量的 16 倍和 81 倍）

的肝肿瘤发生率未见增加。在 12 个月的试验中，经口给予本品 100mg/kg/天（60mg/m²，以体表面积算，相当于临床静脉给药推荐剂量的 1622 倍）的雌、雄大鼠均发生肝细胞腺瘤，而空白对照组未出现。本品给药 24 个月的小鼠致癌性试验结果显示，肿瘤的发生率未见有统计学意义的明显增加，但该试验尚未得出最后结论，因为在大鼠致癌性研究中出现肿瘤，故本品只应在说明书中推荐的剂量下和适应症范围内应用。

【药代动力学】

健康志愿者静脉注射本品 20 或 40μg/kg 体重后，平均血浆浓度峰值分别为 13.7 和 42.8μg/L，

血浆清除半衰期约 3.1 ~ 5.9 小时。

本品在体内分布广泛，血清蛋白结合率为 65%，大部分迅速代谢，主要代谢途径为 N-去烷基化

及芳香环氧化后再被共轭化，通过粪便和尿液排泄。

【贮藏】 遮光，密闭保存。

【包装】 安瓿，5 支 / 盒。

【有效期】 24 个月

【执行标准】 YBH12132005

【批准文号】 国药准字 H20055244

【生产企业】

企业名称：北京双鹭药业股份有限公司

生产地址：北京市石景山区八大处高科技园区中园路 9 号

邮政编码：100041

销售：北京海淀区西三环北路 100 号金玉大厦 1103-1105 室

邮政编码：100037

电话号码：010-68727137/88512259

传真号码：010-68428099

网 址：<http://www.slpharm.com.cn>

01-24

