

核准日期：2021年12月14日
修改日期：2022年03月09日 2022年04月21日
2024年03月12日 2024年06月14日
2025年08月08日

凯莱通®
2mg(按C₁₄H₁₁ClN₃S计)

盐酸替扎尼定片说明书

TIZANIDINE HYDROCHLORIDE TABLETS

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：盐酸替扎尼定片
英文名称：Tizanidine Hydrochloride Tablets
汉语拼音：Yansuan Tizhaniding Pian
【规 格】本品主要成份为盐酸替扎尼定，化学名称为5-氯-4-[(2-咪唑啉-2-基)氨基]-2, 1, 3-苯并噻二唑盐酸盐。化学结构式：

分子式：C₁₄H₁₁ClN₃S·HCl
分子量：290.17

【性 状】本品为白色至类白色片。

【适 宜 症】盐酸替扎尼定片为中枢性骨骼肌松弛药，用于：

(1) 下列疾病造成的痉挛性肌痉挛的改善—颈、肩及腰部疼痛等局部疼痛综合征。

(2) 下列疾病引起的痉挛性肌强直—脑血管意外、手术后遗症（脊髓损伤、大面积损伤）、脊髓脑萎缩性、多发性硬化症、肌萎缩性侧索硬化症等。

【规 格】2mg (按C₁₄H₁₁ClN₃S计)

【用法用量】用于疼痛性肌痉挛时：

口服，一次2mg，一日1~3次。应根据患者年龄、症状酌情增减。通常初始剂量为一日2mg，可逐渐增加剂量，分次服用。初始剂量通常在临睡前服用。

用于中枢性肌强直时：

应根据患者需要而作剂量调整。初始剂量不应超过一日6mg(分3次服用)，并可每隔半周或一周逐渐增加2~4mg。通常一日12~24mg(分3~4次服用)的用量已可获得良好的疗效，每天的总量不能超过36mg。

【不良反应】应降低剂量治疗有癫痫性肌痉挛时，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意低血压、肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

特别注意事项：肝功能损害、镇静、致幻/精神障碍症状和过敏反应的发生，在【注意事项】中有详细描述。

【禁忌】替扎尼定对癫痫性肌痉挛的治疗，不良反应减少，通常轻微而短暂。包括嗜睡、疲乏、头昏、口干、恶心、胃肠道功能紊乱以及血压轻度降低。应用高剂量治疗中枢性肌强直时，上述不良反应应较明显。

【注意事项】

1、低血压

替扎尼定是一种可能导致低血压的α₂肾上腺素受体激动剂。上市后曾报道过晕厥。通过调整剂量并监测低血压的体征和症状，可以显著降低低血压发生的可能性。此外，患者从卧位转向直立位可能会增加低血压和直立效应的风险。

同时接受降压治疗的患者在使用替扎尼定时，应监测是否出现低血压。不建议替扎尼定与其他α₂肾上腺素受体激动剂一起使用。曾报道与氟伐沙明或环丙沙星伴用药以及单次服用4mg替扎尼定出现过具有临床意义的低血压（收缩压和舒张压均降低）。因此，禁止替扎尼定与氟伐沙明或环丙沙星（CYP1A2的强效抑制剂）合用使用。

2、肝功能损害

替扎尼定可能会导致肝损伤。任何肝损伤患者都应慎用替扎尼定。建议在基线时和达到最大剂量1个月后，或疑似出现肝损伤时，监测转氨酶水平。

3、镇静作用

替扎尼定可能会导致镇静，这可能会影响日常活动。在剂量研究中，患者镇静发生率在滴定一周后达到峰值，然后在研究的维持阶段保持稳定。替扎尼定、酒精和其他中枢神经系统抑制剂（如苯二氮卓类、阿片类药物、三环抗抑郁药）的抑制作用相叠加。监测替扎尼定与其他中枢神经系统抑制剂联合使用的患者是否出现过度镇静的症状。

镇静作用可能干扰患者的日常生活活动。因此，患者应该被告知该药有镇静作用，而某些职业如驾驶员、操作机械需要集中注意力的患者更应谨慎。

4、幻觉/精神障碍症状

使用替扎尼定会出现幻觉和妄想。在北美洲进行的两项对照临床研究中，170例患者中有5例(3%)报告有幻觉或妄想。大多数患者都意识到这些事件不真实。一例患者出现与幻觉相关的精神病。在这5例患者中，有1例患者在使用替扎尼定后，继续出现不良反应至少2周。对于出现幻觉的患者，考虑停用替扎尼定。

5、与CYP1A2抑制剂的相关作用

由于潜在的药物相互作用，服用氟伐沙明或环丙沙星等强效CYP1A2抑制剂的患者替扎尼定。替扎尼定与其他CYP1A2抑制剂，如齐留通、除环丙沙星（禁用）外的噻唑酮类、抗心律失常药（胺碘酮、美西律、普鲁帕酮）、西咪替丁、法莫替丁、口服避孕药、阿普洛韦和噻氯匹定联合使用可能会导致低血压、心动过缓或过度嗜睡等不良反应。除非在临床上有必要进行替扎尼定治疗，否则应避免合用药物。

6、过敏反应

替扎尼定可能会导致过敏。曾报道过包括呼吸功能损伤、荨麻疹、喉头与舌血管性水肿在内的体征和症状。应告知患者重度过敏反应的症状。如果出现这些体征和症状，应停用替扎尼定，并立即就医。

7、肾功能损害者不良反应风险增加

肾功能不全（肌酐清除率<25mL/min）的患者应谨慎使用，因为清除率会降低超过50%。在这些患者中，滴定时应减少个体剂量。如果需要进行高剂量的，应增加剂量，而不是给药频率。应密切监测这些患者常见不良反应（口干、嗜睡、疲乏和头昏）的发作或严重程度增加的情况，作为肾功能过低的指标。

8、停药不良反应

停药不良反应应包括反跳性高血压、心动过缓和张力亢进。为了尽量减少这些不良反应的风险，特别是对于长期（9周或以上）接受高剂量（每天20至32mg）或可能与麻醉剂共同用药的患者，应逐渐降低剂量（每天2至4mg）。

9、药物滥用和依赖性

尚未在人体研究中对评估本品药物滥用的可能性。替扎尼定与可乐定关系密切，而可乐定常与麻醉剂联合使用，已知会在突然停药时引起症状。据报道，除了三例替扎尼定突然停药后出现症状反应的病例，病例报告提示这些患者也滥用了麻醉剂。相关症状包括高血压、心动过速、张力亢进、癫痫和焦虑。在使用高剂量的情况下，尤其是长期使用使用高剂量药物或同时使用麻醉剂时，更可能出现停药症状。如果必须停止治疗，应逐渐降低剂量，以减少停药症状的风险。

【孕妇及哺乳期妇女用药】本品在孕药及哺乳期妇女中尚未进行充分的研究，是否通过乳汁分泌未知，但由于本品的脂溶性，有可能进入乳汁。因此，在孕药及哺乳期妇女用药时应充分权衡利弊，谨慎使用。哺乳期妇女服用本品时，应密切监测婴儿是否出现低血压、心动过缓或过度嗜睡等不良反应，请减少或停止替扎尼定治疗。

【儿童用药】本品在儿童患者中的安全性和有效性尚未确立。

【老年用药】本品主要在肾脏进行排泄，对于老年患者，因肾功能有肾功低下，可导致血药浓度持续升高，因此应减少用量。本品有降低血压的作用，老年患者应慎用本品。建议对老年患者进行肾功能监测。

【药物相互作用】本品主要通过肝代谢细胞色素P450(CYP1A2)进行代谢，因此应注意是否有同时使用影响该酶活性的药物。尤其当与抑制CYP1A2的药物同时使用时，有可能导致本品的血药浓度上升。此外，当与激活CYP1A2的药物同时使用时，有可能导致本品的血药浓度降低。

1、氟伐沙明或环丙沙星
替扎尼定与氟伐沙明或环丙沙星合用，替扎尼定与氟伐沙明或环丙沙星一起用药会导致药代动力学发生变化，从而造成血压显著降低、嗜睡和精神运动障碍增加。

2、除环丙沙星和环丙沙星外的CYP1A2抑制剂
由于存在潜在的相互作用，应避免替扎尼定与其他CYP1A2抑制剂，如齐留通、除环丙沙星（禁用）外的噻唑酮类、抗心律失常药（胺碘酮、美西律、普鲁帕酮）、西咪替丁、法莫替丁、口服避孕药、阿普洛韦和噻氯匹定合用。如果在临床上有必要使用，初始治疗剂量应为2mg，然后根据患者对治疗反应，逐渐增加剂量。如果出现低血压、心动过缓或过度嗜睡等不良反应，请减少或停止替扎尼定治疗。

3、口服避孕药

未进行专门的药代动力学研究来研究口服避孕药与替扎尼定之间的相互作用。然而，对替扎尼定单剂量和多剂量给药后人群药代动力学数据的回顾性分析表明，同时服用口服避孕药的女性的替扎尼定达峰率比未服用口服避孕药的女性低50%。

4、酒精

酒精使替扎尼定的AUC增加约20%，同时其C_{max}也增加约15%。这与替扎尼定的不良反应增加有关。替扎尼定和酒精的中枢神经系统抑制作用相叠加。

5、其他中枢神经系统抑制剂
替扎尼定与中枢神经系统抑制剂（如苯二氮卓类、阿片类药物、三环抗抑郁药）的镇静作用相叠加。应监测替扎尼定与其他中枢神经系统抑制剂一起服用时患者是否出现过度镇静的症状。

6、α₂肾上腺素受体激动剂
由于低血压效应可能叠加，因此不建议替扎尼定与其他α₂肾上腺素受体激动剂一起使用。

【药物过量】目前报道的药物过量都是有意或意外的服用过量药物，一些情况下可导致死亡。一些有意的过量服用药物的病例涉及服用多种药物，包括中枢神经系统抑制剂。

替扎尼定用药过量的临床表现与其已知药理学一致。在大多数情况下，观察到感觉减退，包括嗜睡、昏睡、意识模糊和昏迷。还观察到心动过缓，最严重的包括心动过缓和低血压。呼吸抑制和呼吸衰竭是服用替扎尼定用药过量的另一个常见特征。

如果出现用药过量，应采取基本的措施，以确保气道充足，并监测心血管和呼吸系统。替扎尼定是一种脂溶性药物，仅微溶于水中和甲醇。因此，透析不大可能从体内清除药物的有效方法。通常情况下，停用替扎尼定并给适当治疗后，包括洗胃、反复服用大量活性炭和强制利尿剂清除药物，症状在1至3天内消退。由于作用机制相似，替扎尼定用药过量的症状和处理与可乐定用药过量后的症状和处理相似。

【毒理学研究】

急性毒性研究：替扎尼定Ames试验、哺乳动物基因突变试验、中国仓鼠细胞染色体畸变试验、小鼠骨髓微核试验、中国仓鼠骨髓微核试验和细胞遗传学试验。小鼠急性致死试验和小鼠程序外DNA合成试验结果均为阴性。

生殖毒性研究：雄性大鼠给予替扎尼定10mg/kg，雌性大鼠3mg/kg（以mg/m²计算，分别相当于人最大推荐剂量的2.7倍和1倍），未见对生育力的影响。雄性大鼠给予替扎尼定30mg/kg，雌性大鼠10mg/kg时，生育力下降，母体出现镇静、体重减轻和运动失调等症。大鼠给予替扎尼定3mg/kg、家兔30mg/kg（以mg/m²计算，分别相当于人最大推荐剂量的1倍和16倍），未见致畸作用。给予1~6倍于人最大推荐剂量的替扎尼定可延长大鼠的妊娠期，导致围产期产仔数丢失增加、发育迟缓。家兔给予替扎尼定1mg/kg及更高剂量时，子宫着床后丢失增加。

致毒性研究：小鼠经口给予替扎尼定剂量达16mg/kg，连续78周，大鼠经口给予替扎尼定剂量达9mg/kg，连续104周[按mg/m²计算，分别相当于人最大推荐剂量的2倍和2.5倍]，肿瘤发生率均未见显著增加。

【药代动力学】替扎尼定口服吸收良好，其绝对口服生物利用度为40%（变异系数CV=24%）。口服后达峰浓度的时间为1.5h（CV=40%）；食物可明显延缓该药的血药浓度峰值（C_{max}）增加近1/3，使达峰时间缩短40min，但并不影响肾清除率对该药的总吸收。盐酸替扎尼定在体内分布广泛，健康志愿者静脉给药达稳态时的分布容积（V_d）为2.4L/kg（CV=21%）。该药与血浆蛋白结合率约为30%，且在治疗剂量范围内无明显剂量依赖性。肾脏对该药的肾清除率较大