

枸橼酸坦度螺酮胶囊说明书

TANDOSPIRONE CITRATE CAPSULES

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：枸橼酸坦度螺酮胶囊
商品名称：律康
英文名称：Tandospirone Citrate Capsules
汉语拼音：Juyuansuan Tanduluotong Jiaonang

【成份】本品主要成份为枸橼酸坦度螺酮，其化学名称为：(1S, 2R, 6S, 7R) -4- [4- [4- (2-嘧啶基) 哌嗪-1-基] 丁基] -4-氮杂三环 [5.2.1.0^{2,6}] 癸烷-3, 5-二酮枸橼酸盐，其化学结构式如下：

分子式： $C_{21}H_{29}N_5O_2 \cdot C_6H_8O_7$
分子量：575.62

【性状】本品为硬胶囊剂，内容物为白色粉末。

【适应症】

- 1.各种神经症所致的焦虑状态，如广泛性焦虑症。
2.原发性高血压、消化性溃疡等躯体疾病伴发的焦虑状态。

【规格】5mg

【用法用量】

通常成人每次口服10mg，一日3次。随病人年龄、症状等的不同可适当增减，最高日剂量不得超过60mg或遵医嘱。

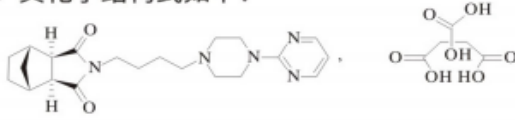
【不良反应】据国外文献报道，调查总例数1451例中有150例(10.3%)出现不良反应及实验室检查值异常。主要的不良反应有嗜睡43例(3.0%)、步态蹒跚16例(1.1%)、恶心13例(0.9%)、倦怠感11例(0.8%)、情绪不佳 11例(0.8%)、食欲下降10例(0.7%)。主要实验室检查值异常有AST(GOT)、ALT(GPT)升高。

(1) 严重不良反应

肝功能异常、黄疸 (<0.1%)
因为会出现伴AST (GOT)、ALT (GPT)、Al-P、γ-GTP升高的肝功能异常、黄疸等，所以应定期做肝功能检查，密切观察，如有异常现象发生时，应停药并进行适当处理。

(2) 其它不良反应

出现以下不良反应时，应根据需要采取减量或停药等适当处理。



	>1%	0.1~1%	<0.1%	频数不详
精神神经系统	嗜睡、步态蹒跚	眩晕、头痛、头重、失眠	震颤、恶梦	类似帕金森病样的症状
肝		AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-P升高	γ-GTP升高	
循环系统		心悸、心动过速、胸闷		
消化系统		恶心、呕吐、食欲不振、口渴、腹部不适感、胃痛、胃胀、腹胀、便秘、腹泻		
过敏反应*		皮疹、荨麻疹	瘙痒	
其它	尿中NAG升高	倦怠感、乏力、情绪不佳、四肢麻木、多汗(发汗、盗汗)、眼睛肿胀	恶寒、浮肿、发烧(脸红、灼热感)、BUN升高、嗜酸性细胞增加	

*出现这类异常症状时，应停药并进行适当处理。

【禁忌】对本品中任何成份过敏者禁用。

【注意事项】

1. 慎重给药 (对下列病人应慎重给药)
- (1) 器质性脑功能障碍的病人 (有可能增强本药的作用) ;
(2) 中度或严重呼吸功能衰竭的病人 (可能使症状恶化) ;
(3) 心功能障碍的病人 (可能使症状恶化) ;
(4) 肝、肾功能障碍的病人 (可能影响药代动力学) ;
(5) 老年人 (请参照“老年用药”) 。
2. 重要注意事项
- (1) 用于神经症病人时，若病人病程长 (3年以上)，病情严重或其它药物 (苯二氮卓类药物) 无效的难治型焦虑患者，本药可能也难以产生疗效。当1天用药剂量达60mg仍未见明显疗效时，应及时与医师联系。不得随意长期应用。
(2) 本药用于伴有严重焦虑症状的病人，难以产生疗效时，应慎重观察症状。
(3) 本药可引起嗜睡、眩晕等，故应嘱病人在服用本药过程中因本品会引起困倦、眩晕，请注意不要让服用本品的患者从事机动车驾驶等伴有危险性的机械操作。
(4) 因与苯二氮卓类衍生物没有交差依存性，所以当把苯二氮卓类衍生物替换成本品使用时会引起苯二氮卓类衍生物药性的减弱，症状恶化，请注意停用前药时逐渐减量。

枸橼酸坦度螺酮胶囊说明书
TANDOSPIRONE CITRATE CAPSULES

【孕妇及哺乳期妇女用药】

1. 只能在判断治疗的有益性超过危险性后，才可用于孕妇或有怀孕可能的妇女。（参考“生殖毒性”）
2. 最好不用于哺乳期妇女，不得已服药时应避免授乳。（参考“生殖毒性”）

【儿童用药】 尚无本药对早产儿、新生儿、婴儿、幼儿及小儿的安全性资料。

【老年用药】 据国外文献报道，对老年患者按照90mg/天（临床常用剂量的3倍）给药的药代动力学试验中，老年人的血中浓度高于青年人，故用于老年人时，从小剂量（如，每次5mg）开始。

【药物相互作用】

药物名称	临床症状	机制，危险因素
丁酰苯类药物 氟哌啶醇、螺哌龙等	有可能增强锥体外系症状	因本药的弱抗多巴胺作用，有可能增强丁酰苯类药物的药理作用
钙拮抗剂 尼卡地平、氨氯地平、硝苯吡啶等	有可能增强降压作用	因本药有5-羟色胺受体介导的中枢性降压作用，有可能增强降压作用

【药物过量】 已有1例75岁患抑郁症的男性病人，一次口服72粒（360mg）枸橼酸坦度螺酮胶囊的报道。

该患者因抑郁症，先后几次住院治疗。最近一次因情绪低落、兴趣减退，自杀未遂入院，经文拉法辛150mg/d、米氮平45mg/d、坦度螺酮30mg/d及无抽搐电休克等治疗后好转出院。院外坚持服用米氮平45mg/d、坦度螺酮30mg/d，病情控制平稳。2个月无明确诱因自行一次口服枸橼酸坦度螺酮胶囊72粒（360mg），患者在服药后10小时内言行无异常，约10小时后送医院，查血常规、肝肾功能、心肌酶等均未见异常，心电图检查示窦性心律、室性早搏，与以往住院时比较无明显变化。一周后复查上述指标未见异常。

本例超剂量服用未发生不良反应，个体差异也是原因之一。

【药理毒理】

药理作用

坦度螺酮是一种抗焦虑药，可选择性地作用于脑内5-HT_{1A}受体。动物试验显示，坦度螺酮与地西泮具有相当的抗焦虑作用。心身疾病动物模型试验显示，坦度螺酮可抑制下丘脑刺激所致升压反应和电休克应激负荷所致的血浆肾素活性升高，抑制心理应激负荷所致的胃溃疡发生和强制浸水应激负荷所致的食欲低下。

毒理研究

慢性毒性 SD大鼠经口给予3~140mg/kg12个月时，可见流涎、缩瞳、蛋白和血脂参数变动、体重增加受限、脑和脊髓神经细胞内、肾小管脂褐质样物质沉着、肺泡沫细胞积聚等。

遗传毒性 坦度螺酮Ames试验结果为阴性，在有代谢活化时哺乳动物细胞染色体畸变试验结果阳性。

生殖毒性 一般生殖毒性试验中，SD大鼠给药剂量达50mg/kg以上时出现动情周期异常、受孕率下降、着床率减少、胎仔体重低下，未见无胚胎和胎仔死亡及畸形。致畸敏感期试验中，对SD大鼠给药剂量达80mg/kg以上时出现胎仔和幼仔体重低下，200mg/kg以上时可见波状肋骨增加，未见胎仔死亡。家兔给药剂量为150mg/kg以上时可见胎仔体重降低，未见胎仔死亡、畸形。围产期试验中，SD大鼠给药剂量为50mg/kg以上时可见幼仔出生后发育抑制。

致癌性 ICR小鼠经口给药20~180mg/kg连续18个月，SD大鼠经口给药10~90mg/kg连续24个月，未见肿瘤发生率升高。

依赖性 猴巴比妥依赖状态下单次给药的交叉依赖性试验、连续自行给药试验、大鼠连续4周经口给药后停药1周的依赖性试验，未见精神依赖性和身体依赖性结果。大鼠经口给药60和200mg/天对地西洋连续给药后停药时引起的体重减少无抑制作用，提示与苯二氮卓类药物之间无交叉依赖性。

【药代动力学】

1. 血中浓度

(1) 健康成人一次口服20mg时，吸收迅速，0.8~1.4小时后达到最高血中浓度（2.9~3.2ng/ml），其血中浓度半衰期约为1.2~1.4小时。基本不受进食影响。

剂量	给药条件	Tmax(hr)	Cmax (ng/ml)	AUC (ng·hr/ml)	T _{1/2} (hr)
20mg	禁食	0.8±0.1	3.2±0.6	8.2±2.1	1.2
	餐后	1.4±0.3	2.9±0.7	11.5±3.1	1.4

(2) 健康成人每次10mg，每日三次，5天连续口服时，血中浓度与一次口服时相同，无蓄积性。

(3) 心身疾病及神经症的病人给药时，血中浓度与健康成人相同，吸收迅速，无蓄积性。

2. 代谢、排泄

本药迅速分布在组织中，以肝脏和肾脏中分布浓度较高，在脑中也有分布。本药的主要代谢途径为丁烯链的开裂和降冰片烷环及嘧啶环的羟基化。

给健康成人口服¹⁴C-坦度螺酮，7天以内，70%从尿中排泄，21%从粪中排泄。吸收的坦度螺酮至尿中排泄时，基本完全被代谢。粪中坦度螺酮仅为0.3~0.5%，大部分经代谢后排泄到胆汁中。

【贮藏】 密封保存。

【包装】 铝塑包装。12粒/盒、16粒/盒、24粒/盒、32粒/盒、36粒/盒、40粒/盒、48粒/盒。

【有效期】 36个月。

【执行标准】 《中华人民共和国药典》2025年版二部

【批准文号】 国药准字H20052328

【药品上市许可持有人】

企业名称：四川科瑞德制药股份有限公司

注册地址：四川省泸州国家高新区医药产业园

【生产企业】

企业名称：四川科瑞德制药股份有限公司

生产地址：四川省泸州国家高新区医药产业园曲河西路8号

邮政编码：646100

电话号码：0830-8172266

传真号码：0830-8170118

网 址：https://www.creditpharma.com