核准日期：2006年07月07日
修改日期：2013年03月11日　2025年10月01日
2013年10月11日
2013年12月01日
2015年12月01日
2020年10月19日
2020年12月14日
2021年07月06日

Nhwa 恩华®

一泰纳

氢溴酸西酞普兰片说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用。

警示语

自杀倾向和抗抑郁药物

对抑郁症（MDD）和其他精神障碍的短期临床试验结果显示，与安慰剂相比，抗抑郁药物增加了儿童、青少年和青年（<24岁）患者自杀观念和实施自杀行为（自杀倾向）的风险。任何人如果考虑将本品或其他抗抑郁药物用于儿童、青少年或青年（<24岁），都必须权衡临床需求和风险。短期临床试验没有显示出，与安慰剂相比年龄大于24岁的成年人使用抗抑郁药物会增加自杀倾向的风险；在年龄65岁及以上的成年人中，使用抗抑郁药物使自杀倾向的风险有所降低。抑郁和某些精神障碍本身与自杀风险的增加有关，必须密切观察和合理监测所有年龄患者使用抗抑郁药物治疗开始后的临床症状的恶化、自杀倾向、行为的异常变化。应建议家属和看护者必须密切观察并与医生进行沟通。本品未被批准用于儿童患者（见【警告】、【注意事项】和【儿童用药】）。

【药品名称】

通用名称：氢溴酸西酞普兰片

商品名称：一泰纳

英文名称：Citalopram Hydrobromide Tablets

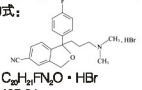
汉语拼音：Qingxiusuan Xitaipulan Pian

【成份】

活性成份：氢溴酸西酞普兰

化学名称：（±）-1-［3-（二甲氨基）丙基］-1-（4-氟苯基）-1，3-二氢-5-异苯并呋喃甲腈氢溴酸盐

化学结构式：



分子式：$C_{20}H_{21}FN_2O \cdot HBr$

分子量：405.31

【性状】本品为白色片或薄膜衣片，除去包衣后显白色或类白色。

【适应症】治疗抑郁症。

【规格】20mg（按西酞普兰计）。

【用法用量】

成人：每日服用一次，每次20mg。

根据个体患者的应答，可增加剂量，最大剂量为每日40mg。

治疗持续时间

通常在服药2～4周后开始出现抗抑郁效果。抗抑郁治疗属于对症治疗，因此，必须持续适当长的时间（通常至恢复后6个月），以防止复发。在复发的抑郁症患者中，可能需要继续进行多年的维持治疗，以防止重新发作。

老年患者（>65岁）

老年患者应将剂量减少至建议剂量的一半，即每日10～20 mg。建议最大剂量为每日20 mg。

儿童和青少年（<18岁）

本品不适用于儿童和18岁以下的青少年。

肾功能降低者

轻度至中度肾功能损伤患者，不需要进行剂量调整。重度肾功能损伤（肌酸酐清除率小于30 mL/分钟，参见【药代动力学】）的患者中需谨慎使用。

肝功能降低者

建议轻度或中度肝功能损伤的患者在最开始两周的治疗中使用每天10 mg的初始剂量。根据个体患者的应答，最大剂量可增加至每天20 mg。重度肝功能降低患者在进行剂量调整时需格外谨慎。

CYP2C19弱代谢的患者

对于已知在CYP2C19方面为弱代谢的患者，建议在最开始两周的治疗中使用每天10 mg的最初剂量。根据个体患者的应答，最大剂量可增加至每天20 mg。

停药

本品应避免突然停药。当停止使用本品治疗时，应在至少1～2周内逐渐减少剂量，以便降低停药反应的风险。如果在剂量降低后或在治疗停止后出现不可耐受的症状，则可以考虑重新恢复先前的处方剂量。随后，医师可继续降低剂量，但应以更加平缓的速率进行。

给药方法：每日口服一次。

本品可在一天的任何时候服用，不需要考虑食物摄入情况。

【不良反应】

所观察到本品的不良反应通常为轻度且持续短暂。在治疗的第1～2周出现最频繁，随后通常会逐渐缓解。不良反应术语选自ICH国际医学用语词典（MedDRA）的首选术语目录。

观察到下列不良反应具有剂量相关性：多汗、口干、失眠、嗜睡、腹泻、恶心和乏力。

下表显示了在双盲安慰剂对照试验≥ 1%的患者中或上市后观察到的与SSRIs（选择性5-羟色胺再摄取抑制剂类药物）和/或氢溴酸西酞普兰有关的药物不良反应的百分比。发生频率定义：十分常见（≥1/10）；常见（≥1/100，<1/10）；偶见（≥1/1000，<1/100）；罕见（≥1/10000，<1/1000）；十分罕见（<1/10000），未知（不能根据现有数据进行估算）。

MedDRA 分类	频率	不良反应
血液和淋巴疾病	未知	血小板减少症
免疫系统疾病	未知	超敏反应、过敏反应
内分泌疾病	未知	ADH分泌异常
新陈代谢和营养疾病	常见	食欲下降、体重下降
	偶见	食欲增加、体重增加
	罕见	低钠血症
	未知	低钾血症
精神疾病	常见	激越、性欲降低、焦虑、神经质、混乱状态、异常性高潮（女性）、做梦异常
	偶见	攻击性、人格解体、幻觉、躁狂
	未知	惊恐发作、磨牙症、坐立不安、自杀意念、自杀行为†
神经系统疾病	十分常见	嗜睡、失眠
	常见	震颤、感觉异常、头晕、注意力障碍
	偶见	晕厥
	罕见	抽搐大发作、运动障碍、味觉障碍
	未知	惊厥、5-羟色胺综合征、锥体外系障碍、静坐不能、运动障碍
眼科疾病	偶见	散瞳症
	未知	视觉障碍
耳朵和迷路疾病	常见	耳鸣
心脏疾病	偶见	心动过缓、心动过速
	未知	心电图QT延长、室性心律失常（包括尖端扭转型室性心动过速）
血管疾病	罕见	出血
	未知	直立性低血压
呼吸胸腔及纵隔疾病	常见	打呵欠
	未知	鼻出血
肠胃疾病	十分常见	口干、恶心
	常见	腹泻、呕吐、便秘
	未知	胃肠出血（包括直肠出血）
肝胆疾病	罕见	肝炎
	未知	肝功能检测异常
皮肤和皮下组织疾病	十分常见	多汗
	常见	瘙痒
	偶见	荨麻疹、脱发、皮疹、紫癜、光敏感
	未知	瘀斑、血管神经性水肿
MedDRA 分类	频率	不良反应
肌肉骨骼、结缔组织和骨骼疾病	常见	肌痛、关节痛
肾脏和泌尿疾病	偶见	尿潴留
生殖系统和乳腺疾病	常见	阳痿、射精障碍、射精失败
	偶见	女性：月经过多
	未知	乳溢
		女性：子宫出血
		男性：阴茎异常勃起
一般疾病和给药部位疾病	常见	疲劳
	偶见	水肿
	罕见	发热

患者数量：氢溴酸西酞普兰组/安慰剂组= 1346 / 545

注：†在氢溴酸西酞普兰治疗期间或治疗停药后的早期，报告了数例自杀意念和自杀行为。

骨折

主要在50岁和50岁以上患者中进行的流行病学研究表明，接受SSRIs（去甲肾上腺素和5-羟色胺双重抑制剂类药物）和TCAs（三环类抗抑郁药物）患者的骨折风险会增加。导致此风险的机制未知。

Qt间期延长

在上市后期间，主要在女性患者、低钾血症的患者、或预先存在其他心脏病的QT间期延长的患者中，有QT间期延长和室性心律失常的报告，包括尖端扭转型室性心动过速。

SSRI治疗停止时观察到的停药症状

本品的停药（尤其是突然停药）通常会产生停药症状，最常报告的反应：头晕、感觉障碍（包括感觉异常）、睡眠障碍（包括失眠和多梦）、激越或焦虑、恶心和/或呕吐、震颤、混乱、出汗、头痛、腹泻、心悸、情绪不稳定、易激惹和视觉障碍。通常，这些不良事件为轻度至中度，并且呈自限性，然而，在某些患者中可能表现为重度和/或长期。因此，建议不再需要进行本品治疗时，应该通过逐渐减少剂量来逐渐进行停药。

【禁忌】

1. 对本品活性成份和／或本品中任何辅料过敏者禁用。
2. 单胺氧化酶抑制剂(MAOIs)

在不可逆性MAOI停药后的14天期间，接受单胺氧化酶抑制剂（MAOIs）（包括司来吉兰日剂量超过10mg）治疗的患者不应同时服用本品，或者在可逆性MAOI（RIMA）处方中规定的RIMA停药后的某一规定时间段内，不应给予本品。在本品停药后的14天期间，不应给予MAOIs。

3. 禁止与利奈唑胺合并用药，除非有密切观察和监测血压的装置存在，详见【药物相互作用】部分。
4. 禁止与匹莫齐特合并用药，详见【药物相互作用】。
5. 在已知患有QT间期延长或先天性QT综合征的患者中，禁止使用本品。

【警告】

1. 临床症状的恶化和自杀风险

抑郁症本身固有症状可能出现自杀念图，自残和自杀（自杀相关的事件），并会一直持续，直至由于治疗而出现显著改善。由于在治疗的最初几周或其后数周内可能尚未改善，因此使用抗抑郁剂的患者在疾病改善前应进行密切监测。临床经验普遍认为在恢复的早期阶段，自杀的风险可能会增加。

使用本品发生的其他精神类事件也和自杀相关事件风险的增加有关。另外，精神类事件可能并发于抑郁障碍。当治疗抑郁伴发的其他精神障碍时，也应进行此类预防。

在本品治疗前有过自杀相关事件或有严重自杀观念的患者，已知其有自杀意念或自杀企图的风险更大，在治疗期间应该谨慎监护。

在对成年抑郁障碍患者的抗抑郁药物和安慰剂对照研究的meta分析表明，在25岁以下的患者中，抗抑郁药物治疗的患者比安慰剂治疗的患者出现自杀行为的风险增高。应该在抗抑郁药物治疗期间，密切监察患者，特别是有高风险的患者或是治疗早期和剂量调整期。

应提醒患者的家属和护理者应该密切监视任何临床恶化、自杀行为或意念和异常的行为变化，如果这些症状出现应立即就医。

抗抑郁药物不适用于儿童和18岁以下的青少年。在儿童和18岁以下的青少年的临床试验中，发现氢溴酸西酞普兰组发生与自杀相关的行为（自杀企图和自杀观念）和敌意（攻击性，对抗行为和易怒）的频率高于安慰剂组。

2. QT间期延长的风险

研究发现氢溴酸西酞普兰能够导致剂量依赖性QT间期延长，上市后期间已报告了QT间期延长以及包括尖端扭转型室性心动过速在内的室性心律失常病例，其中主要为伴有低血钾，或先前存在QT延长或其他心脏疾病的女性患者。

在患有严重心动过缓的患者中或在最近出现急性心肌梗死或者失代偿性心力衰竭的患者用药时应谨慎，如必须用药，应进行ECG监测。

电解质紊乱如低血钾或低血镁可增加恶性心律失常的风险，因此应该在开始本品治疗之前进行校正。

如果治疗处于稳定期心脏疾病的患者，在开始治疗之前应该参考前期ECG结果。

如果本品治疗期间发生心律失常，应该停止治疗，并且进行ECG检查。

3. 与单胺氧化酶抑制剂（MAOIs）潜在的相互作用

已有抗抑郁药合并MAOIs产生严重、甚至致死性的不良反应报道。如MAOIs合并使用SSRIs类药物，这些不良反应包括：高热、强直、肌痉挛和生命体征不稳定、精神状态的改变（包括极度的激越，逐渐进展为谵妄和昏迷）。有时病例特征类似于恶性综合征。有限的动物研究提示SSRIs类药物和MAOIs联合使用产生血压升高和激发行为异常兴奋的协同作用。

建议本品不能与MAOIs同时服用，在至少停用MAOIs 14天后，才能使用本品。同样，至少停用本品14天后，才能使用MAOIs。

4. 5-羟色胺综合征或恶性综合征（NMS）样反应

在单独应用SNRIs、SSRIs，包括本品，特别是与以下药物合并使用时：拟5-羟色胺药物（包括曲普坦类）与减低5-羟色胺代谢的药物（包括MAOIs），或与安定药或其他多巴胺拮抗剂，已有发生5-羟色胺综合征或神经抑制药恶性综合征（NMS）样反应的报道。5-羟色胺综合征可能包括精神状态的改变（例如，激动、幻觉、昏迷）、自主神经系统紊乱（例如，心动过速、血压变化、过高热）、神经肌肉系统失调（例如，反射亢进、动作失调）和/或胃肠道症状（例如，恶心、呕吐、腹泻）。最严重的5-羟色胺综合征与精神抑制药恶性综合征的表现相似，包括过高热、肌肉强直、自主神经不稳定可能伴有生命体征的快速波动，以及精神状态的改变。应对5-羟色胺综合征或精神抑制药恶性综合征样体征和症状进行监测。

禁止本品与MAOIs合用治疗抑郁症（见【禁忌】和【警告】）。如果临床上有合理需要，要联合使用本品和拟5-羟色胺药物（曲坦类），建议密切观察患者情况，尤其在治疗初期和增加剂量时（见【药物相互作用】）。

不推荐合并使用本品和5-羟色胺前体物质（如：色氨酸）。本品与任何拟5-羟色胺或抗多巴胺药物，包括安定药合用时，如果出现上述任何事件必须立即停药，并开始对症支持治疗。

【注意事项】

1. 停药反应

上市后使用本品、其他SNRIs和SSRIs陆续有一些停药后不良事件自发的报道，尤其在突然停药时常可见：情绪烦躁、易怒、激越、头昏、感觉异常（电击感）、焦虑、意识模糊、头痛、懒散、情绪不稳定、失眠、轻躁狂、耳鸣和癫痫发作等。以上表现一般为自限性，也有严重停药反应的报道。

当患者停用本品时，应注意监测这些可能出现的停药症状。推荐逐渐减量，避免突然停药。如果在减药和停药过程中出现难以耐受的症状时，可以考虑恢复至先前治疗剂量，随后医生再以更慢的速度减药。

2. 异常出血

已有使用SSRIs时出现皮下出血时间和/或出血异常的报告，例如，瘀斑、妇科出血、肠胃出血和其他皮肤或黏膜出血。在服用SSRIs（特别是合并使用已知会影响血小板功能的活性物质或可能增加出血风险的其他活性物质）的患者中以及在具有出血性疾病史的患者中需谨慎使用。

3. 低钠血症

罕有使用SSRI类药物出现低钠血症的报告，可能是由抗利尿激素（SIADH）的异常分泌引起，通常会在治疗终止时恢复正常。特别是老年女性患者可能易发生此类风险。

4. 静坐不能/精神运动性不安

SSRIs/SNRIs的使用已被认为与静坐不能的形成有关，其特点是主观上不愉快或令人不安的躁动，需要不停运动，并且不能安静地坐立。这在治疗的头几周内最可能出现。在患有这些症状的患者中，增加剂量可能是有害的。

5. 躁狂

躁狂抑郁症的患者可能转为躁狂发作。转为躁狂发作的患者应停止使用本品。

6. 癫痫发作

癫痫是使用抗抑郁药物时的一个潜在风险。癫痫发作的患者应该停止使用本品。在患有不稳定性癫痫症的患者中应该避免使用本品，对癫痫已经得到控制的患者应该仔细监控。如果癫痫发作频率增加，则应停止使用本品。

7. 糖尿病

在患有糖尿病的患者中，使用某种SSRI进行治疗可能会改变血糖控制。可能需要对胰岛素和/或口服降糖药的剂量进行调整。

8. ECT（电休克疗法）

同时给予SSRIs和ECT治疗的临床经验有限，因此，应予谨慎。

9. 圣约翰草

在合并使用本品和含有圣约翰草（贯叶连翘）的草药制剂期间，不良反应可能更常见。因此，不应同时服用本品和圣约翰草制剂。

10. 精神疾病

本品治疗具有抑郁发作的精神疾病患者可能会增加精神疾病症状。应在医生指导下用药。

11. 辅料

本品辅料中含有乳糖一水合物。罕见发生遗传性半乳糖不耐受问题，有乳糖酶缺乏症或对葡萄糖－半乳糖吸收不良的患者勿使用本品。

12. 对驾驶及操作机器能力的影响

本品对开车和使用机器的能力具有轻度或中度的影响。

精神药品可以降低判断能力和对紧急情况的反应能力。应该告知患者这些影响，并警告他们其开车或操作机器的能力可能会受到影响。

13. 请置于儿童不易拿到处。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

妊娠

已发布的有关妊娠妇女（超过2500例暴露结果）的数据表明，没有任何致畸性的胎儿/新生儿毒性。然而，妊娠期间不应使用本品，除非有明确需要且仅在认真考虑了风险/效益之后才使用。

如果母亲持续使用本品直到妊娠后期（尤其是在晚期妊娠中使用），则应该对新生儿进行观察。妊娠期间应避免突然停止用药。

母亲在妊娠后期使用了SSRI/SNRI之后，以下症状可能出现在新生儿中：呼吸窘迫、发绀、窒息、惊厥、体温不稳定、进食困难、呕吐、低血糖、肌张力亢进、肌张力减退、反射亢进、震颤、神经过敏、应激性、昏睡、不断哭闹、嗜睡和睡眠困难。这些症状可能是由于5-羟色胺效应或停药症状造成的。在大多数病例中，并发症会在胎儿娩出后立即或很快（<24小时）开始。

流行病学数据表明，妊娠中（尤其是妊娠后期）使用SSRIs可能会增加新生儿持续肺动脉高压（PPHN）的风险。观察到的风险为每1000例妊娠大约5例。在一般人群中，每1000例妊娠大约会出现1～2例。

哺乳

西酞普兰会分泌到母乳中。据估计，哺乳婴儿将接收到与体重相关的母亲每日剂量（单位：mg/kg）的大约5%。在婴儿中没有观察到或仅观察到了轻度事件。然而，对于儿童风险的评估，现有信息不足。建议谨慎使用。

【儿童用药】

抗抑郁剂不适用于儿童和18岁以下的青少年。在儿童和18岁以下的青少年的临床试验中，发现本品组发生与自杀相关的行为（自杀企图和自杀观念）和敌意（攻击性，对抗行为和易怒）的频率高于安慰剂组。即使进行临床试验，仍需密切监测患者的自杀表现。

此外，儿童和青少年中涉及到生长、成熟以及认知和行为发展的长期安全性数据仍然缺乏。

【老年用药】

65岁以上的老年患者，每日最高剂量20 mg。

【药物相互作用】

药效学相互作用

药效学上，西酞普兰与吗氯贝胺和丁螺环酮合用时，已经报告了有病例出现5-羟色胺综合征。

禁忌合用药物

MAO抑制剂

同时使用西酞普兰和MAO抑制剂可能会导致严重的不良效应，包括5-羟色胺综合征。

在合用某种SSRI类抗抑郁药物与某种单胺氧化酶抑制剂（MAOI，包括不可逆的MAOI司来吉兰、可逆的MAOIs利奈唑胺和吗氯贝胺）的患者中，以及在最近停止SSRI治疗并开始进行MAOI治疗的患者中，已报告了几例严重的有时为致命的反应。

一些病例呈现出的特征与5-羟色胺综合征相似。有效物质与MAOI相互作用的症状包括：

体温过高、肌肉强直、肌阵挛、可能伴有的生命体征快速波动的自主神经失调以及包括混乱、应激性和正在向精神错乱和昏迷发展的极端烦躁在内的精神状态变化。

匹莫齐特

向使用消旋西酞普兰40 mg/天进行治疗的受试者联合给予一个单剂量的2 mg匹莫齐特，连续给药11天，导致了匹莫齐特的AUC和Cmax的增长（尽管在整个研究中这种增长并不一致）。匹莫齐特和西酞普兰的联合给药导致了QTc间期上大约10 msec的平均增长。由于在低剂量匹莫齐特水平下观察到的相互作用，西酞普兰和匹莫齐特的合并给药被禁止。

需要谨慎合用药物

引起QT间期延长的药物

未进行西酞普兰和其他可延长QT间期的药品之间的药代动力学和药效学研究。不能排除西酞普兰与这些药品之间的叠加效应。因此，当西酞普兰与可延长QT间期的药品如Ia和III类抗心律失常药、抗精神病药（例如吩噻嗪类衍生物、匹莫齐特、氟哌啶醇）、三环抗抑郁药、某些抗微生物药（例如司帕沙星、莫西沙星、红霉素、喷他脒、抗疟疾治疗尤其是卤泛群）、某些抗组胺药（阿司咪唑、咪唑斯汀）共同给药时，应加以考虑。

拟5-羟色胺药物

锂盐或色氨酸：西酞普兰合用锂盐的临床研究中未发现药效学相互作用。然而，有合用SSRI类药物和锂盐或色氨酸产生协同效应的报告，因此应谨慎合用此类药物。对锂水平的常规监测应该和平常一样继续进行。

与拟5-羟色胺药物合用（如曲马多、舒马曲坦）可能导致该类药物的协同作用。在获得更多信息之前，不建议同时使用西酞普兰和5-HT激动剂，例如，舒马曲坦和其他曲坦类药物。

司来吉兰

与司来吉兰[一种不可逆的单胺氧化B（MAO-B）抑制剂]合并使用需谨慎，因为可能出现5-羟色胺综合征的危险。

影响出凝血的药物

对于正在同时使用抗凝血药、影响血小板功能的药品例如，［非甾体抗炎药（NSAID）］、乙酰水杨酸、双嘧达莫和噻氯匹定或其他可能增加出血风险的药品（例如，非典型抗精神病药、吩噻嗪类、三环类抗抑郁药）进行治疗的患者，需要注意。

降低癫痫发作阈值的药物

SSRIs可能会降低癫痫发作阈值。当合并使用能够降低癫痫发作阈值的其他药品［例如，抗抑郁药（三环，SSRIs）、神经安定类镇静药（吩噻嗪类、硫杂蒽类和丁酰苯类）、甲氟喹、安非他酮和曲马多］时需要谨慎。

地昔帕明、丙咪嗪

在一项药代动力学研究中，尽管地昔帕明（丙咪嗪的主要代谢物）的血药浓度上升了，但并未显示对西酞普兰或丙咪嗪的血药浓度具有任何影响。当地昔帕明与西酞普兰联合给药时，观察到了地昔帕明血浆浓度的升高。可能需要降低地昔帕明的剂量。

神经安定类镇静药

使用西酞普兰获得的经验并未显示其与神经安定类镇静药有任何临床相关的相互作用。但是，正如其他SSRIs一样，不能排除药效学相互作用的可能性。

圣约翰草

可能会出现SSRIs与草药圣约翰草（贯叶连翘）之间的动态相互作用，从而导致不良效应的增长。还没有对药代动力学相互作用进行研究。

酒精

在西酞普兰和酒精之间没有证明存在任何药效学或药代动力学相互作用。但是，不建议西酞普兰和酒精联合使用。

药代动力学相互作用

西酞普兰向去甲基西酞普兰的生物转化通过细胞色素P450系统的CYP2C19（大约38%）、CYP3A4（大约31%）和CYP2D6（大约31%）同工酶介导。由于一种酶的抑制可能被另一种酶补偿，所以，西酞普兰通过多个CYP进行代谢这一事实意味着其生物转化的抑制不太可能。因此，西酞普兰与其他药品的合并给药产生药代动力学相互作用的可能性非常低。

食物

尚无西酞普兰的吸收和其他药代动力学特性受到食物影响的报告。

影响本品药代动力学的其他药物

合用酮康唑（CYP3A4抑制剂）并不影响本品的药代动力学。

药代动力学相互作用研究显示合用锂盐不影响本品的药代动力学。

西咪替丁（CYP2D6，3A4和1A2酶抑制剂）会导致西酞普兰的稳态血药浓度中度升高。与西咪替丁联合给予西酞普兰时需要谨慎。可能需要进行剂量调整

本品对其他药物药代动力学的影响

一项药代动力学和药效学相互作用的研究显示，本品合用美托洛尔（CYP 2D6酶底物）时，美托洛尔的浓度升高两倍，但在健康志愿者中美托洛尔对血压和心率的作用并没有显著的统计学上的增加。建议在合并给予美托洛尔和西酞普兰时应谨慎。可能需要进行剂量调整。

西酞普兰和去甲基西酞普兰对CYP 2C9、CYP2E1和CYP3A4几乎无抑制作用，其他SSRI类药物对CYP1A2、CYP2C19和CYP2D6明显的抑制作用相比，但西酞普兰和去甲基西酞普兰仅有微弱的抑制作用。左美丙嗪、地高辛、卡马西平

当西酞普兰与CYP1A2底物（氯氮平和茶碱）、CYP2C9（华法林）、CYP2C19（丙咪嗪和美芬妥英）、CYP2D6（司巴丁、丙咪嗪、阿米替林、利培酮）和CYP3A4（华法林、卡马西平（及其代谢物卡马西平环氧化物）和三唑仑）一起给药时，没有观察到或仅观察到了非常小的临床重要性变化。

在西酞普兰和左美丙嗪、或地高辛之间没有观察到任何药代动力学相互作用，表明西酞普兰既不会诱导也不会抑制P糖蛋白。

【药物过量】

毒性

有关西酞普兰过量的综合临床数据是有限的，许多病例涉及到其他药物/酒精的合并过量。已有单独使用西酞普兰过量致命的病例报道；然而，绝大多数的致命病例涉及到使用合并药物时的过量。

症状

在报告的西酞普兰过量中，已观察到了以下症状：惊厥、心动过速、嗜睡、QT间期延长、昏迷、呕吐、震颤、低血压、心脏骤停、恶心、5-羟色胺综合征、激越、心动过缓、头晕、束支传导阻滞、QRS延长、高血压、瞳孔散大、尖端扭转型室性心动过速、昏睡、出汗、发绀、过度换气、以及房性和室性心律失常。

治疗

对于西酞普兰，尚无已知的特殊解毒药。应给与对症及支持治疗。应考虑使用活性炭、有渗透作用的泻药（例如硫酸钠）和胃排空。如果出现意识障碍，则应该对患者进行气管插管。监测ECG和生命体征。

患有充血性心力衰竭/缓慢性心律失常的患者、已使用延长QT间期的合并药物的患者、或者存在代谢异常（例如，肝损伤）的患者，如果过量使用本品，最好进行ECG监测。

【药理毒理】

药理作用

西酞普兰为抗抑郁病药，是一种二环氧化酞类衍生物。西酞普兰抗抑郁病的作用机制可能与抑制中枢神经系统神经元对5-HT的再摄取，从而增强中枢5-羟色胺神经的功能有关。体外试验及动物试验提示，西酞普兰是一种高选择性的5-HT再摄取抑制剂，对去甲肾上腺素和多巴胺的再摄取影响较小。大鼠给予西酞普兰14天，抑制5-HT摄取的作用未见耐受。西酞普兰是消旋体，其抑制5-HT再摄取的作用主要由其(S)-对映体发挥。

西酞普兰对5-HT_{1A}、5-HT_{2A}、D_1受体、D_2受体、α$_1$受体、α$_2$受体、β受体、H_1受体、GABA受体、M受体、苯二氮卓受体无亲和力，或仅具有较低的亲和力。

毒理研究

遗传毒性

Ames试验中，在无代谢活化剂存在时，5个试验菌株中有2个菌株（TA98和TA1537）结果为阳性。在CHL染色体畸变试验中，无论有或无代谢活化剂存在时，结果均为阳性。体外小鼠淋巴细胞基因突变试验（HPRT）、体外/体内结合的大鼠肝脏细胞程序外DNA合成试验、体外人淋巴细胞染色体畸变试验、小鼠微核实验结果均为阴性。

生殖毒性

生育力与早期胚胎发育毒性试验中，大鼠经口给予西酞普兰16/24（雄/雌）、32、48、72 mg/kg/天，可见各剂量组交配率降低，剂量≥32 mg/kg/天［按mg/m^{2}计算（下同），相当于人最大推荐日剂量60 mg（MRHD)的5倍]时生育力降低，剂量为48 mg/kg/天（相当于MRHD的8倍）时妊娠时间延长。胚胎-胎仔发育毒性试验中，大鼠经口给予西酞普兰32、56、112 mg/kg/天，在最高剂量（相当于MRHD的18倍）时，可见胚胎/胎仔生长抑制、胎仔存活率降低，胎仔异常率增加（包括心血管和骨骼肌缺陷）及母体毒性，无影响剂量为56 mg/kg/天。家兔经口给予西酞普兰剂量高达 16 mg/kg/天（相当于MRHD的5倍）未见异常。围产期大鼠经口给予西酞普兰4.8、12.8、32 mg/kg/天，最高剂量组（相当于MRHD的5倍）可见出生后4天内幼鼠死亡率增加，幼鼠生长停滞。12.8 mg/kg/天剂量下未见异常。

致癌性

NMRI/BOM小鼠经口给予西酞普兰，连续18个月，在剂量高达240 mg/kg/天（相当于MRHD的20倍）时未见致癌性。COBS WI大鼠经口给予西酞普兰，连续24个月，在剂量为8或24 mg/kg/天（按mg/m^{2}计算，分别相当于MRHD的1.3和4倍）时，可见小肠肿瘤的发生率增加。此现象与人的相关性尚不明确。

【药代动力学】

吸收

口服吸收完全，不受食物的影响（平均3小时达到血浆峰浓度），口服生物利用度约为80%。

与片剂相比，西酞普兰的口服滴剂、溶液的生物利用度大约要高25%。

分布

表观分布容积（$V_{d,\beta}$/F）约为12～17L/kg。西酞普兰及其主要代谢物的血浆蛋白结合率低于80%。

代谢

西酞普兰在肝脏内代谢为去甲基西酞普兰，去二甲基西酞普兰，西酞普兰-N-氧化物和无活性的去氨基丙酸衍生物。所有的活性代谢物仍是SSRI类化合物，但作用比西酞普兰弱。血浆中主要存在的是西酞普兰原形药；去甲基西酞普兰，去二甲基西酞普兰的浓度分别是西酞普兰的30%～50%和5%～10%。西酞普兰经CYP 2C19（约38%），CYP3A4（约31%）和 CYP2D6（约31%）转化为去甲基西酞普兰。

消除

多次给药后西酞普兰的消除半衰期（T1/2）约为1.5天，系统血浆清除率（Cl_s）约为0.3～0.4 L/分钟，口服给药的血浆清除率（Cl_{oral}）约为0.4 L/分钟。

西酞普兰主要经肝脏排泄(85%)，其余（15%）经肾脏排泄，日剂量中的12%～23%的西酞普兰以原形从尿液中排泄。肝脏残余清除率约为0.3L/分钟，肾脏约为0.05～0.08L/分钟。

线性

西酞普兰的药代动力学呈线性，大约1～2周后达到稳态血浆浓度，每日剂量40mg的平均稳态血浆浓度为300nmol/L（范围：165～405 nmol/L）。

老年患者（>65岁）

由于老年患者的代谢减慢，故药物的半衰期延长（1.5～3.75天），清除率下降（0.08～0.3L/分钟）。相同剂量下，老年患者的稳态血药浓度是年轻患者的2倍。

肝功能降低者

肝损伤患者体内西酞普兰的代谢速度减慢。其半衰期及平均稳态浓度约为肝功正常患者的2倍。

肾功能降低者

轻中度肾功能降低患者体内西酞普兰的代谢速度减慢，但对其药代动力学无严重影响。尚无重度肾功能降低患者(清除率< 30 mL/min)的资料。

多态性

体内研究显示西酞普兰的代谢对司巴丁/异噻胍的氧化作用（CYP 2C6）和美芬妥英的羟基化作用（CYP 2C19）无临床多态性。对于CYP2C19，作为一种预防措施，对弱代谢者应该考虑使用10 mg的初始剂量。

【贮藏】

密封保存。

【包装】

铝塑泡罩板，12片/板/盒。

【有效期】

24个月

【执行标准】

《中国药典》2025年版二部

【批准文号】

国药准字H20051923

【上市许可持有人】

药品上市许可持有人：江苏恩华药业股份有限公司

注册地址：徐州经济技术开发区杨山路18号

【生产企业】

企业名称：江苏恩华药业股份有限公司

生产地址：徐州经济技术开发区杨山路18号

邮政编码：221004

电话号码：4009002262

传真号码：0516－87767118

网　　址：www.nhwa-group.com

222-3-09