

核准日期:

修改日期:

盐酸甲氧氯普胺注射液说明书
请仔细阅读说明书并在医师指导下使用。

警示语

甲氧氯普胺治疗可引起迟发性运动障碍，这通常是不可逆的。目前尚无有效的治疗方法。发生迟发性运动障碍的风险随治疗时间和总累积剂量的增加而增加。应避免长时间使用甲氧氯普胺。

出现迟发性运动障碍的体征或症状的患者应马上停止甲氧氯普胺的治疗。在某些患者中，停止使用甲氧氯普胺治疗后症状可能会减轻或缓解。

【药品名称】

通用名称：盐酸甲氧氯普胺注射液

英文名称：Metoclopramide Hydrochloride Injection

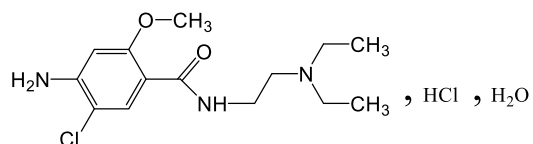
汉语拼音：Yansuan Jiayang Lüpu'an Zhusheye

【成份】

本品活性成份为盐酸甲氧氯普胺。

化学名称：*N*-(2-二乙氨基)乙基]-4-氨基-2-甲氧基-5-氯-苯甲酰胺盐酸盐一水合物

化学结构式：



分子式： $C_{14}H_{22}ClN_3O_2 \cdot HCl \cdot H_2O$

分子量：354.27

辅料：氯化钠（供注射用）、注射用水。

【性状】

本品为无色的澄明液体。

【适应症】

镇吐药。①用于化疗、放疗、手术、颅脑损伤、脑外伤后遗症、海空作业以及药物引起的呕吐；②用于急性胃肠炎、胆道胰腺、尿毒症等各种疾患之恶心、呕吐症状的对症治疗；③用于诊断性十二指肠插管前用，有助于顺利插管；胃肠钡剂 X 线检查，可减轻恶心、呕吐反应，促进钡剂通过。

【规格】

2ml: 10mg (按 $C_{14}H_{22}ClN_3O_2 \cdot HCl$ 计)

【用法用量】

肌内或静脉缓慢注射。成人，一次 10mg；小儿，6 岁以下每次 0.1mg/kg，6~14 岁一次 2.5~5mg。一日剂量不超过 0.5mg/kg。肾功能不全者，剂量减半。

【不良反应】

上市后不良反应监测数据显示甲氧氯普胺制剂可见以下不良反应/事件（发生率未知）：

(1) 神经系统损害：昏睡、头晕、嗜睡、头痛、困倦、感觉减退、迟发性运动障碍。大剂量长期应用可能因阻断多巴胺受体，使胆碱能受体相对亢进而导致锥体外系反应（震颤、抽动、共济失调、运动障碍、肌肉骨骼强直、斜颈、肌肉不自主收缩、肌肉痉挛状态、肌无力、言语障碍），可用苯海索等抗胆碱药物治疗。

(2) 全身性损害：乏力、胸部不适、寒战、发热、疲乏、口渴。

(3) 精神障碍：烦躁不安、躁动、精神障碍、易激惹、失眠。

(4) 胃肠系统损害：恶心、呕吐、腹泻、腹痛、口干、便秘。

(5) 皮肤及皮下组织损害：皮疹、瘙痒症、多汗、荨麻疹、潮红。

(6) 呼吸系统损害：呼吸困难、呼吸急促、窒息感。

(7) 免疫系统损害：超敏反应、过敏样反应、过敏性休克。

(8) 其他：心悸、心慌、视觉损害、斜视、发音困难、直立性低血压、乳腺肿痛。用药期间出现乳汁增多，由于催乳素的刺激所致。

国外文献报道的本品其他不良反应包括：心脏骤停、休克、心动过缓、房室传导阻滞、窦性停搏、QT 间期延长、心动过速、低血压、血压升高、月经不规律、乳房异常发育（男性乳腺发育）。

【禁忌】

(1) 下列情况禁用：①对本品任何成份过敏者。②对普鲁卡因或普鲁卡因胺

过敏者。③癫痫发作的频率与严重性均可因用药而增加。④胃肠道出血、机械性肠梗阻或穿孔，可因用药使胃肠道的动力增加，病情加重。⑤嗜铬细胞瘤可因用药出现高血压危象。⑥不能用于因行化疗和放疗而呕吐的乳癌患者。⑦2 岁以下儿童禁用。⑧多巴胺激动剂或左旋多巴与甲氧氯普胺之间有相互拮抗作用，不建议合并使用。⑨因甲氧氯普胺可以加剧帕金森病的症状，故帕金森病患者禁用。⑩有 NADH-细胞色素 b5 还原酶缺乏引起高铁血红蛋白血症病史。

(2)下列情况慎用：①肝功能衰竭时，丧失了与蛋白结合的能力。②肾衰，即重症慢性肾功能衰竭使锥体外系反应危险性增加，用量应减少。

【注意事项】

(1) 12 岁以下及 65 岁以上患者使用本品时应谨慎，密切观察患者的用药反应。

(2) 避免合用可能引起锥体外系反应的药物。

(3) 建议使用时间不要超过 14 天。

(4) 静脉注射甲氧氯普胺须慢，1~2 分钟注完，快速给药可出现躁动不安，随即进入昏睡状态，易诱发锥体外系不良反应。甲氧氯普胺治疗可引起迟发性运动障碍，应避免长时间使用甲氧氯普胺。

(5) 注射甲氧氯普胺，尤其是经静脉注射，曾报告过严重的心血管不良事件，包括严重心动过缓、心血管性虚脱、心脏停搏和 QT 间期延长。老年患者、心脏传导障碍（包括 QT 间期延长）患者、电解质失衡患者、心动过缓患者以及服用其他已知会延长 QT 间期的药物的患者应慎用甲氧氯普胺，尤其是静脉注射。静脉注射时应缓慢给药，以降低不良反应（如低血压、静坐不能）的风险。

(6) 对晕动病所致呕吐无效。

(7) 醛固酮与血清催乳素浓度可因甲氧氯普胺的使用而升高。

(8) 严重肾功能不全患者剂量至少须减少 60%，这类患者容易出现锥体外系症状。

(9) 因本品可降低西咪替丁的口服生物利用度，若两药必须合用，间隔时间至少要 1 小时。

(10) 本品遇光变成黄色或黄棕色后，毒性增高。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

有潜在致畸作用，孕妇不宜应用。

【儿童用药】

小儿不宜长期应用。

【老年用药】

老年人长期大量应用，容易出现锥体外系症状。

【药物相互作用】

- ① 与对乙酰氨基酚、左旋多巴、锂化物、四环素、氨苄青霉素、乙醇和安定等同用时，胃内排空增快，使后者在小肠内吸收增加。
- ② 与乙醇或中枢抑制药等同时并用，镇静作用均增强。
- ③ 与抗胆碱能药物和麻醉止痛药物合用有拮抗作用。
- ④ 与抗毒蕈碱麻醉性镇静药并用，甲氧氯普胺对胃肠道的能动性效能可被抵消。
- ⑤ 由于其可释放儿茶酚胺，正在使用单胺氧化酶抑制剂的高血压病人，使用时应注意监控。
- ⑥ 与阿扑吗啡并用，后者的中枢性与周围性效应均可被抑制。
- ⑦ 与西咪替丁、慢溶型剂型地高辛同用，后者的胃肠道吸收减少，如间隔 2 小时服用可以减少这种影响；本品还可增加地高辛的胆汁排出，从而改变其血浓度。
- ⑧ 与能导致锥体外系反应的药物，如吩噻嗪类药等合用，锥体外系反应发生率与严重性均可有所增加。
- ⑨ 当甲氧氯普胺与米库氯铵或琥珀胆碱同时给药时，恢复时间将延长。
- ⑩ 甲氧氯普胺可能会提高环孢素浓度，需密切监测环孢素血浆浓度。
- ⑪ 甲氧氯普胺与利福平同时给药时，甲氧氯普胺的血浆浓度下降。在甲氧氯普胺与利福平联合使用时，应监测患者的治疗效果。
- ⑫ 甲氧氯普胺与 CYP2D6 强效抑制剂（如氟西汀）联合使用时，甲氧氯普胺的暴露量增加，使用时应监测不良反应。
- ⑬ 甲氧氯普胺与 5-羟色胺能药物如选择性 5-羟色胺再摄取抑制剂(SSRIs)联合使用时，有发生血清素综合征（SS）的报道。

【药物过量】

①用药过量症状：深昏睡状态，神智不清；肌肉痉挛，如颈部及背部肌肉痉挛、拖曳步态、头部及面部抽搐样动作，以及双手颤抖摆动等锥体外系症状。②

药物过量时，使用抗胆碱药物、治疗帕金森病药物或抗组胺药，可有助于锥体外系反应的制止。

【临床药理】

进入血液循环后，13~22%迅速与血浆蛋白（主要为白蛋白）结合。经肝脏代谢。T_{1/2}一般为4~6小时，根据用量大小有别。作用开始时间：肌注10~15分钟，静注1~3分钟。持续时间一般为1~2小时。主要以游离型、结合型或代谢产物经肾脏排泄，也可自乳汁排出。

【药理毒理】

药理作用

甲氧氯普胺为多巴胺第2（D₂）受体拮抗剂，同时还具有5-羟色胺第4（5-HT₄）受体激动效应，对5-羟色胺第3（5-HT₃）受体有轻度抑制作用。可作用于延髓催吐化学感受区（CTZ）中多巴胺受体而提高CTZ的阈值，具有强大的中枢性镇吐作用。甲氧氯普胺亦能阻断下丘脑多巴胺受体，抑制催乳素抑制因子，促进泌乳素的分泌，故有一定的催乳作用。对中枢其它部位的抑制作用较微弱，有较弱的安定作用，较少引起催眠作用。对于胃肠道的作用主要在上消化道，促进胃及上部肠段的运动；提高静息状态胃肠道括约肌的张力，增加下食管括约肌的张力和收缩的幅度，使食管下端压力增加，阻滞胃-食管反流，加强胃和食管蠕动，并增强对食管内容物的廓清能力，促进胃的排空；促进幽门、十二指肠及上部空肠的松弛，形成胃窦、胃体与上部小肠间的功能协调。这些作用也可增强甲氧氯普胺的镇吐效应。甲氧氯普胺对小肠和结肠的传送作用尚不确定。

毒理研究

遗传毒性：

甲氧氯普胺 Ames 试验结果为阴性。

生殖毒性：

在大鼠、小鼠和兔生殖毒性试验中，分别以IM、IV、SC或PO给予剂量相当于12~250倍人体剂量的甲氧氯普胺后，未见生育力或显著的胚胎毒性。

致癌性

大鼠77周经口给予最高剂量相当于临床日用剂量40倍的甲氧氯普胺，可见催乳素水平升高并在给药期间持续。组织培养试验显示约1/3人乳腺癌在体外显

示催乳素依赖性，故曾确诊为乳腺癌的患者如要使用甲氧氯普胺则需注意该潜在因素。尽管已有数据报道，催乳素升高药物会引起诸如溢乳、闭经、男性乳房发育症和阳痿等疾病，但大多数患者的血清催乳素水平升高的临床意义尚不清楚。长期服用催乳素刺激性抗精神病药物和甲氧氯普胺后，啮齿类动物乳腺肿瘤的发病率增加。但目前临床研究和流行病学研究均未显示长期服用这些药物与乳腺肿瘤发生之间存在关联；以目前有限数据尚无法得出结论。

【贮藏】

避光，密闭，不超过 30℃ 保存。请将本品放在儿童不能接触的地方。

【包装】

中硼硅玻璃安瓿，10 支/盒。

【有效期】

18 个月

【执行标准】

【批准文号】

【上市许可持有人】

名称：中润药业有限公司

注册地址：广州市黄埔区开源大道 11 号 A3 栋 601 室

邮政编码：510530

电话号码：020-37620666-876

传真号码：020-31605103

网址：www.zorun.com

【生产企业】

企业名称：成都市海通药业有限公司

生产地址：成都市海峡两岸科技产业开发园柳台大道 222 号

邮政编码：611130

电话号码：028-82720780

网址：www.hepatunn.com