

核准日期：2012 年 10 月 11 日

修改日期：2013 年 06 月 13 日

修改日期：2014 年 01 月 08 日

修改日期：2016 年 03 月 22 日

注射用盐酸罗沙替丁醋酸酯说明书

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：注射用盐酸罗沙替丁醋酸酯

英文名称：Roxatidine Acetate Hydrochloride For Injection

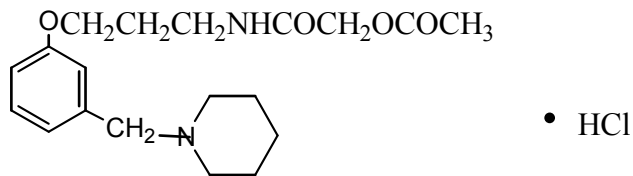
汉语拼音：Zhusheyong Yansuan Luoshatidingcusuanzhi

【成份】

本品主要成份为盐酸罗沙替丁醋酸酯。

化学名称：2-(乙酰氧基)-N-[3-[3-(1-哌啶甲基)苯氧基]丙基]乙酰胺盐酸盐。

化学结构式：



分子式：C₁₉H₂₈N₂O₄ • HCl

分子量：384.90

辅料为甘氨酸、谷氨酸。

【性状】

本品为白色或类白色冻干块状物或无定形粉末。

【适应症】

本品适用于上消化道出血（由消化性溃疡，急性应激性溃疡，出血性胃炎等引起）的低危患者。

【规格】 75mg

【用法用量】

成人 1 日 2 次（间隔 12 小时），每次 75mg，用 20mL 的生理盐水或葡萄糖注射液溶解，缓慢静脉推注，或用输液混合后静脉滴注。一般可在 1 周内显示疗效，能够口服后应改用口服药物进行治疗。

由于肾功能障碍患者的药物血药浓度可能持续，因此应减少剂量或延长给药间隔。

【不良反应】

据文献报告，本品批准时及上市后的使用情况调查结果显示，在被调查的 4533 例患者中有 156 例（3.44%）报告出现了不良反应（包括临床实验室检查指标异常）。主要的不良反应为门冬氨酸氨基转氨酶（AST），丙氨酸氨基转移酶（ALT）升高等肝脏、胆囊系统障碍（1.96%），白细胞减少、嗜酸性细胞增多等白细胞、网状内皮系统障碍（0.84%）等。

1. 严重的不良反应（<0.1%）

（1）休克

偶见休克（初期症状：不适、面色苍白、血压降低等）的情况，应密切注意观察，出现上述情况时应立即停止给药，并采取适当的措施处置。

（2）再生障碍性贫血，全血细胞减少症，粒细胞缺乏症，血小板减少

偶见再生障碍性贫血，全血细胞减少症，粒细胞缺乏症，血小板减少（初期症状：全身疲倦、无力、皮下及粘膜下出血、发热等）等情况，应定期进行血液检查，出现上述情况时应立即停止给药，并采取适当的措施处置。

（3）Stevens-Johnson 综合征、中毒性表皮松解坏死松解症（Lyell 综合征）

偶见发生 Stevens-Johnson 综合征、中毒性表皮松解坏死松解症（Lyell 综合征），一旦出现应立即停止给药并采取相应的措施处置。

（4）肝功能障碍、黄疸

偶见 AST, ALT, γ -三磷酸鸟苷（ γ -GTP）升高等肝功能障碍、黄疸等情况。应密切观察，出现上述情况应立即停止给药，并采取相应的措施处置。

（5）横纹肌溶解

偶见横纹肌溶解症，出现肌酸激酶[CK（CPK）]，乳酸脱氢酶（LDH）等肌酸酶急速升高、肌红蛋白尿、肌肉痛等异常情况时应立即停止给药，并采取适当的措施处置。

2. 同类药物也具有严重不良反应（发生率不详）

（1）过敏反应

使用其它 H_2 受体拮抗剂时偶见过敏反应的报告，因此应用本品出现上述的异常情况应停止给药，并采取适当的措施处置。

(2) 间质性肾炎

使用其它 H₂受体拮抗剂时偶见间质性肾炎[初期症状：发热、肾功能检查值异常（尿素氮，肌酐升高等）等]的报告。因此应用本品出现上述的异常情况时应停止给药，并采取适当的措施处置。

(3) 房室传导阻滞等心脏传导阻滞

使用其它 H₂受体拮抗剂时偶见房室传导阻滞等心脏传导阻滞的报告，因此使用本品出现上述的异常情况时应立即停止给药，并采取适当的措施处置。

(4) 心脏收缩功能不全

使用其他 H₂受体拮抗剂时，有心脏收缩功能不全的报道，因此应用本品出现上述异常情况时应停止给药，并采取适当的措施处置。

(5) 其它不良反应：

	发生率 0.1~5%	发生率 < 0.1%	发生率不详
过敏 ^{注1}		皮疹、瘙痒感等	
血液	嗜酸性细胞增多，白细胞减少 ^{注2}	贫血	
消化系统		恶心等	便秘，腹泻，腹胀、口渴等
肝脏	肝功能异常，AST，ALT，LDH 升高等	碱性磷酸酶（ALP）升高等	
精神神经系统 ^{注3}		眩晕、幻觉，可逆性的精神错乱	头痛、嗜睡、麻痹、失眠等
给药部位		一过性疼痛	
其他		血压升高，尿素氮升高	男性乳房女性化、乳汁分泌，倦怠感

注 1:出现上述情况应停止给药。

注 2:出现上述异常时应停止给药。

注 3:有使用其他 H₂受体拮抗剂时出现痉挛（发生频率不明）的报告。

【禁忌】

对本品有药物过敏史者禁用，肝肾功能异常者及老年患者慎用。

【注意事项】

1. 下列患者应慎重给药：

- (1) 有药物过敏既往史的患者；
- (2) 有肝功能障碍的患者；
- (3) 有肾功能障碍的患者：由于此类患者药物血药浓度可能持续，因此应减少剂量或延长给药间隔
- (4) 老年患者：老年患者用药应减少给药剂量或延长给药间隔。

2. 重要的基本注意事项：

在治疗期间应密切观察，使用的剂量应为治疗所需的最低剂量，并在本品治疗无效时改用其他药物。另外还应注意患者的肝功能、肾功能及血象的变化。

3. 静脉给药会导致注射部位一过性疼痛，因此应十分注意注射部位、注射方法等。另外应注意注射时不要漏到血管外。
4. 给予本品时，每支药物用 20ml 稀释液稀释后应缓慢给予患者，注入时间应在 2 分钟以上。
5. 应用本品可能掩盖胃癌的症状，因此给药前应首先排除恶性肿瘤的可能性。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

1. 妊娠或有妊娠可能的女性应在判明治疗的获益高于风险时方可应用本品。

妊娠期间给药相关的安全性尚未确立。但是大鼠和家兔给药试验结果显示，在器官形成期给药试验中的大鼠 63mg/kg 剂量组和家兔 32mg/kg 剂量组，以及围产期、哺乳期给药试验中的大鼠 60mg/kg 剂量组中均有少量受试动物死亡。

2. 应注意在用药过程中禁止哺乳。动物（大鼠）试验结果显示药物有向乳汁中扩散的情况。

【儿童用药】

儿童用药的安全性尚未确立。

【老年用药】

由于本品主要经肾脏排泄，多数老年患者因肾功能降低，可能导致血药浓度持续的情况，因此老年患者用药应减少给药剂量或延长给药间隔。

【药物相互作用】

尚无本品与其他药物相互作用的信息。

【药物过量】

尚不明确。

【药理毒理】

罗沙替丁是一种组胺 H₂ 受体拮抗剂。盐酸罗沙替丁醋酸酯在机体内通过醋解作用脱乙酰基转化为代谢物罗沙替丁。盐酸罗沙替丁醋酸酯和罗沙替丁都具有药效活性，可以有效抑

制动物的基础胃酸分泌和刺激引起的胃酸分泌。

文献报道：Beagle 犬连续 52 周口服本品 10、30、70mg (kg. d)，70mg (kg. d) 剂量，动物肺泡内 I 型肺泡上皮细胞及肾小管远端上皮细胞出现嗜酸性片状小体等现象，以上与药物相关的病理变化在停药后恢复期内均可减缓或恢复。

【药代动力学】

据国外文献报告：

1. 血药浓度

(1) 健康成人

健康成人每次 75mg 静脉给药时的最大血药浓度是 773ng/ml，血浆中的半衰期是 3.36 小时。另外，健康成人连续 3 日每日两次静脉给予 75mg，血浆中药代动力学分析结果显示本品没有蓄积性。

(2) 肾功能障碍患者

肾功能障碍患者口服 75mg 剂量的药代动力学如下表所示，与健康成人比较其吸收过程未发生变化，但在达到最大血药浓度后药物的消除随肾功能的降低而延长。因此肾功能障碍患者应用本品时必须对给药剂量和给药间隔进行适当的调整。

肌酐清除率 (ml/min)	T _{1/2} (hr)	AUC (ng. hr/ml)
Ccr ≥ 90	3.94 ± 0.34	2362 ± 160
90 > Ccr ≥ 60	5.68 ± 0.51	4101 ± 618
60 > Ccr ≥ 30	7.70 ± 0.49	4981 ± 477
30 > Ccr	12.13 ± 1.13	12993 ± 1245

2. 代谢

健康成人口服 75mg 药物时，尿中的主要代谢物为脱乙酰基产物，其他较多的是羟酸衍生物。

3. 排泄

健康成人静脉给予 75mg 本品，24 小时内约有 67.5% 的本品以脱乙酰基产物的形式经尿液排出。

4. 胎儿中的扩散

行剖宫术患者在术前 2 次口服本品，结果显示脐带血中的药物浓度约为母体静脉中药物浓度的 60%，向羊水中扩散的药物不足给药剂量的 0.3%。

【贮藏】密闭，不超过 25℃ 保存。

【包装】西林瓶。2支/盒，6支/盒。

【有效期】24个月。

【执行标准】YBH02792012

【批准文号】国药准字H20120076

【生产企业】

企业名称：北京四环制药有限公司

地 址：北京市通州区张家湾广源西街13号

邮政编码：101113

联系电话：010—61563510

传真号码：010—61563510

网 址：www.sihuanpharm.com