



核准日期：2006 年 12 月 31 日

## 盐酸曲马多胶囊说明书

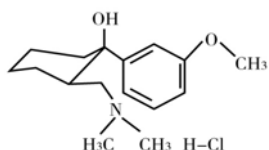
请仔细阅读说明书并在医师指导下使用。

### 【药品名称】

通用名称：盐酸曲马多胶囊  
商品名称：舒敏®  
英文名称：Tramadol Hydrochloride Capsules  
汉语拼音：Yansuan Qumaduo Jiaonang

### 【成份】

本品活性成份为盐酸曲马多。  
化学名称：(1R, 2R)-2-(二甲氨基)-1-(间-甲氧苯基)-环己醇盐酸盐  
化学结构式：



分子式： $C_{16}H_{25}NO_2 \cdot HCl$   
分子量：299.84

【性状】本品为绿、淡黄双色硬胶囊，内容物为白色至淡黄色无臭细粉末。

【适应症】中度至重度疼痛。

【规格】50 mg

### 【用法用量】

本品用量视疼痛程度而定。除另有医嘱外，本品的用法和用量如下（与用餐无关）：

单次剂量：1-2 个胶囊就少量水服用（50-100 mg 盐酸曲马多）。

如果镇痛不满意，30-60 分钟以后可再给予 1 个胶囊。如果疼痛较剧烈，镇痛要求较高，应给予较高的初始剂量（2 个胶囊）。

每日剂量：一般情况下每日本品总量 400 mg（8 个胶囊）已足够，但在治疗癌性疼痛和重度术后疼痛时，可使用更高的日剂量。

肝肾功能不全者：肝肾功能受损的病人，本品作用持续时间可能延长，应延长给药间隔时间。

疗程：本品的疗程不应超过治疗所需。如因疾病性质和严重程度需长期应用本品，应定期作仔细检查（必要时中断治疗）以便决定进一步用药程度及是否继续用药。

### 【不良反应】

最常见的药物不良反应是恶心和眩晕。

偶见呕吐、便秘、口干、出汗、头痛及精神不振等不良反应发生。

在少数病例中，可能出现对人心血管调节有影响（如心悸、心动过速、体位性低血压或心血管虚脱），尤其在静脉给药或病人精神紧张时更易发生。在极个别病例中可能出现心动过缓及血压升高。另外亦可能出现干呕、胃肠道刺激症状（如胃受压感、胃胀）和皮肤反应（如瘙痒、皮疹、荨麻疹）。

在极少数病例中，出现食欲改变、感觉异常、震颤。当本品用量大大超过推荐剂量或合并应用其他中枢抑制药物时，则呼吸抑制的可能性不能排除。在极个别病例中可能出现癫痫性惊厥，主要发生在大剂量使用曲马多或其他能够降低癫痫发作阈值的药物一起使用以后出现。

在极少数病例中可能出现运动乏力、视力模糊和排尿异常（排尿困难及尿潴留）。在极个别病例中可能出现幻觉、错乱、睡眠紊乱和梦魇。应用后在极少数病例中可出现不同的精神症状，其强度和性质因个体而异（取决于个体差异和用药持续时间），这些包括情绪改变（通常为情绪高涨，偶为抑郁）、活动改变（通常为抑制，偶为增强）以及认知和感觉能力改变（如决策行为和感觉障碍）。

在极个别病例中，可能有变态反应（如呼吸困难、支气管痉挛、喘鸣、血管神经性水肿）和过敏反应发生。与阿片类药物撤药时相似的戒断症状可能发生：比如激动、焦虑、神经质、失眠、运动机能亢进、震颤及胃肠道症状。其他一些非常罕见的戒断症状包括：恐慌、重度焦虑、幻觉、感觉异常、耳鸣以及其他不常见的中枢神经系统症状。在极个别病例中发现哮喘症状加重，但这是否由盐酸曲马多引起还尚未确定。

在极个别的患者中发现肝药酶水平升高，可能与使用盐酸曲马多有暂时性的关联。

### 【禁忌】

对盐酸曲马多或其赋形剂过敏，酒精、镇静剂、镇痛剂或其他中枢神经系统作用药物急性中毒的患者禁用。本品不

宜用于正在接受单胺氧化酶（MAO）抑制剂治疗或在过去的 14 天内已服用过上述药物的患者。  
本品不能用于经治疗未能充分控制的癫痫患者。  
本品不能用于戒毒治疗。

#### 【注意事项】

对阿片类药物依赖、有头部损伤、休克、不明原因的神志模糊、呼吸中枢及呼吸功能异常、颅内压增高的患者，应用本品应特别小心。

对阿片类药物敏感的患者慎用本品。

当使用超过推荐日剂量上限（400 mg）的盐酸曲马多时，有产生惊厥的危险性。另外，在服用其它药物使癫痫发作的阈值下降时，使用盐酸曲马多可使患者发生癫痫的危险增加（见“药物相互作用”）。癫痫患者或易感者在强制性条件下应只使用盐酸曲马多。

本品有产生依赖性可能，长期应用本品可能引起耐药及心身依赖。因此，对有药物滥用和依赖倾向的患者，应在医生严格指导下短期使用。

将本品用作阿片类药物依赖患者的替代品是不合适的。虽然盐酸曲马多是阿片受体激动剂，但其并不能抑制吗啡戒断症状。

驾驶员应注意：即使按照指导的用法使用本品，也有可能影响病人的驾驶和机械操作能力。治疗初期、从其它药物改用本品、与其它中枢作用药物、特别是与酒精合用时应特别小心。

#### 【孕妇及哺乳期妇女用药】

曲马多的动物实验说明极高的剂量才能影响器官的发育、骨化和新生儿死亡率。没有观察到致畸作用。曲马多可以通过胎盘。曲马多用于妊娠人体的安全性尚无充分证据，因此本品不能用于妊娠妇女。分娩前及分娩期间应用本品，不会影响子宫收缩。本品可能引起新生儿呼吸频率的改变，但通常无需临床处理。哺乳期使用，约有 0.1% 的剂量进入乳汁，单次应用无需中断喂奶。

#### 【儿童用药】

由于剂量原因，不推荐 12 岁以下儿童服用本品。

#### 【老年用药】

老年病人（年龄超过 75 岁）的药物清除时间可能延长，因此应根据个体需要延长给药间隔时间。

#### 【药物相互作用】

本品不能与单胺氧化酶（MAO）抑制剂联合使用。将本品与包括酒精在内的中枢抑制剂同时使用可引发 CNS 效应，因此在使用本品治疗期间最好不要饮酒。同时使用或用药前使用酰胺咪嗪（酶诱导剂）会导致镇痛效果及药物有效作用时间的降低。激动剂/拮抗剂混合物（如丁丙诺啡、纳布啡、镇痛新）与本品联合用药是不可取的，因为从理论上讲在这种情况下纯激动剂的镇痛效果下降。本品与三环类抗抑郁药及精神抑制药等合并使用时，有可能诱导惊厥的发生。

其它已知可抑制 CYP3A4 的药物，如酮康唑和红霉素，可抑制曲马多的代谢（O-去甲基化），也可抑制其活性 O-去甲基化代谢物的代谢。这一药物相互作用的临床价值尚未研究。

有报道 5-羟色胺综合症的散发病例与曲马多和其他 5-羟色胺能药物比如选择性 5-羟色胺再摄取抑制剂（SSRIs）一起使用有关。5-羟色胺综合症的症状可能是比如错乱、不安、发热、出汗、共济失调、反射亢进、肌阵挛和腹泻。停用 5-羟色胺能药物通常迅速改善。药物治疗依症状的性质和严重程度而定。

曲马多与香豆素衍生物（比如华法林）一起使用要小心，因为有报道有些患者 INR 和瘀斑会增多。

主要配伍禁忌：无。

#### 【药物过量】

症状：原则上，盐酸曲马多与其他中枢作用镇痛药（阿片类）引起的中毒症状相似，尤其是缩瞳、呕吐、心血管虚脱、神志模糊至昏迷、惊厥、呼吸抑制直至呼吸停止。

治疗：常规的急救措施为保持呼吸道通畅（吸入术），维持呼吸和循环。呼吸抑制的解毒剂为纳洛酮。动物实验发现纳洛酮对惊厥无作用，此时需静注安定。

#### 【药理毒理】

药理作用：

本品为中枢作用的阿片类镇痛药。该品为非选择性的  $\mu$ 、 $\delta$  和  $\kappa$  阿片受体完全激动剂，与  $\mu$  受体的亲和力最高。本品具镇咳作用。与吗啡相比，盐酸曲马多在推荐的镇痛剂量范围内无呼吸抑制作用。胃肠动力也不受本品的影响。对心血管系统的影响轻微。

毒理研究：

在某些体外实验系统中发现了盐酸曲马多致突变作用的证据。体内实验未见这种作用。据目前所知，盐酸曲马多可被归入非致突变剂中。

在大鼠和小鼠体内进行了盐酸曲马多致癌能力研究。对大鼠的研究证明，不存在药物相关的肿瘤发生增加。对小鼠

的研究发现，在剂量大于 15 mg/kg 时，雄性动物肝细胞腺癌的发生会出现剂量依赖的、非显著性的增加，在雌性动物中肺肿瘤的发生增加。

给大鼠用的盐酸曲马多的剂量达到 50 mg/kg/天以上时，可在母鼠体内产生毒性效应并使新生大鼠的死亡率增加，雄鼠的生殖能力未受影响。大于 125 mg/kg/天的剂量可在雌性家兔中产生毒性效应，并使子代兔的骨骼异常。

给大鼠和狗重复口服曲马多和肠道外给药 6-26 周，给狗口服给药 12 个月，血液学、临床化学和组织学研究没有发现任何与药物有关的改变。只是在远远超过治疗范围的剂量下才出现中枢神经表现：坐立不安、流涎、惊厥和体重增长减慢。大鼠和狗分别能耐受 20 mg/kg 和 10 mg/kg 体重的口服剂量，狗能耐受 20 mg/kg 体重的直肠剂量而没有任何反应。

#### 【药代动力学】

口服后有 90% 的盐酸曲马多被吸收。无论是否与食物同时吸收，盐酸曲马多的绝对生物利用度为 70%。盐酸曲马多的吸收值与可测到的非代谢原药量的差异是由低首过效应引起的。口服后首过效应的最大值为 30%。

以液体形式口服 100 mg 盐酸曲马多后 1.2 小时达到血浆药物峰值， $C_{max}$  为  $309 \pm 90$  ng/ml。同样的剂量以固体形式口服后 2 小时达到血浆药物浓度高峰， $C_{max}$  为  $280 \pm 49$  ng/ml。盐酸曲马多的组织亲和性高 ( $V_d, \beta = 203 \pm 40$  l)。血浆蛋白结合率为 20%。

盐酸曲马多可穿过血脑屏障和胎盘屏障。

无论以何种方式给药，其清除半衰期  $t_{1/2, \beta}$  约为 6 小时。在大于 75 岁的老年人中，清除半衰期延长，延长因子约为 1.4。

盐酸曲马多及其代谢物几乎完全经肾排出。给药剂量的总放射活性的 90% 由尿排出。在肝肾功能受损的病例中其半衰期稍微延长。

在治疗剂量范围内，其药代动力学为线性。

其血浆浓度与止痛效果间的关系是剂量依赖性的，但这种关系在个体间变化较大。血浆浓度为 100-300 ng/ml 通常是有效的。

抑制曲马多生物转化中涉及到的一种或两种同功酶 CYP3A4 和 CYP2D6，可以影响曲马多或其活性代谢产物的血浆浓度。至今，尚无有临床意义的相互作用的报道。

#### 【贮藏】

储存勿超过 30°C。

#### 【包装】

铝箔水泡眼包装。10 粒，30 粒/盒。

#### 【有效期】

48 个月。

#### 【执行标准】

进口药品注册标准 JX20040102

#### 【批准文号】

进口药品注册证号：H20050063

精神药品进口准许证号：TPI20071105

#### 【生产企业】

公司名称：德国格兰泰有限公司 (Grunenthal GmbH)

公司地址：Zieglerstrasse 6, 52078 Aachen, Germany

生产厂名称：Farmaceutici Formenti S.p.A.

生产厂地址：Via die Vittorio 2, 21040 Origgio (VA), Italy

包装厂名称：德国格兰泰有限公司 (Grunenthal GmbH)

包装厂地址：Zweifaller Strasse 112, 52224 Stolberg, Germany

电话号码：0049 241 5690

传真号码：0049 241 5691498