



核准日期：2022 年 02 月 11 日

修改日期：2022 年 04 月 08 日

修改日期：2023 年 05 月 06 日

修改日期：2025 年 04 月 03 日

## 盐酸伊托必利片说明书

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：盐酸伊托必利片

英文名称：Itopride Hydrochloride Tablets

汉语拼音：Yansuan Yituobili Pian

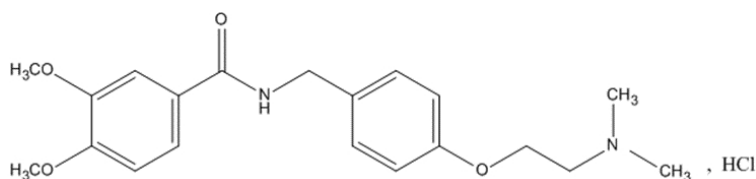
### 【成份】

本品主要成份为盐酸伊托必利。

化学名称：*N*-[4-[2-(*N,N*-二甲基氨基)乙氧基]苄基]-3,4-二甲氧基苯甲酰胺

盐酸盐

化学结构式：



分子式： $C_{20}H_{26}N_2O_4 \cdot HCl$

分子量：394.89

### 【性状】

本品为白色薄膜衣片，除去包衣后显白色或类白色。

### 【适应症】

本品适用于因胃肠动力减慢（如功能性消化不良、慢性胃炎等所致）引起的消化不良症状，包括上腹部饱胀感、上腹痛、食欲不振、恶心和呕吐等。

### 【规格】

50mg

### 【用法用量】

成人常用剂量为一次 50mg，每日三次，餐前口服。根据患者年龄和症状可相应调整剂量，可将药片分切后口服。若用药 2 周后症状改善不明显，宜停药。

### 【不良反应】

#### 严重不良反应

1、休克和过敏性样反应（发生率不明<sup>①</sup>）：使用本品可能会发生休克和过敏性样反应，故应密切观察。若出现低血压、呼吸困难、喉水肿、荨麻疹、脸色苍白和出汗等任何休克和过敏性样反应的征兆，应停药，采取适当的治疗措施。

2、肝功能异常和黄疸（发生率不明<sup>①</sup>）：使用本品可能会发生伴天门冬氨酸氨基转移酶（AST）、丙氨酸氨基转移酶（ALT）和 $\gamma$ -谷氨酰转肽酶（ $\gamma$ -GTP）等增高的肝功能异常和黄疸，故应密切观察。若有异常现象发生，应停药，采取适当的治疗措施。

#### 其它不良反应

	$\geq 0.1\% \sim < 5\%$	$< 0.1\%$	发生率不明 <sup>①</sup>
过敏 <sup>②</sup>			皮疹、潮红和瘙痒
锥体束外综合征		震颤等	

②			
内分泌 <sup>②</sup>		血催乳素升高	男子乳腺发育
血液学 <sup>②</sup>		血小板减少, 白细胞减少等	
胃肠道	腹泻、便秘、腹痛等	恶心, 唾液分泌增加等	
精神神经		头痛、激动、睡眠改变和头晕	
肝脏	AST 和 ALT 增高	γ-GTP 增高, 碱性磷酸酶 (ALP) 增高等	
肾脏		尿素氮和肌酐水平增高等	
心血管			低血压
其它		胸背痛和疲乏感	血胆红素升高

注:

① 来自自发性报告。

② 如发现异常, 应立即采取停药等处理措施。

#### 【禁忌】

1. 因胃肠动力增强可能加重胃肠道出血、机械性梗阻或穿孔的损害, 故此类患者禁用本品。
2. 已知对伊托必利过敏, 或对本品中的任何成份有过敏史的患者禁用本品。

#### 【注意事项】

- 1、本品能增强乙酰胆碱的作用, 必须谨慎使用。
- 2、本品使用中若出现心电图 QTC 间期延长, 应停药。
- 3、虽然未证实本品对驾驶和操作机器的能力有影响, 但由于偶尔可发生头晕和激动, 故应注意药物对人体机敏性的影响。
- 4、尚未获得长期用药数据。

#### 【孕妇及哺乳期妇女用药】

生育力: 尚无伊托必利对生育力的影响的人体数据。

妊娠: 尚无妊娠女性使用伊托必利的数据或数据量有限。作为预防措施, 妊娠期间

最好避免使用伊托必利。

哺乳：伊托必利可经动物的乳汁分泌，但伊托必利经人乳分泌的信息不足，不能排除对乳儿的风险。在决定停止哺乳还是停止伊托必利治疗之前，应考虑哺乳对婴儿的益处与治疗对母亲的益处。

#### 【儿童用药】

儿童应用本品的安全性尚未确定。

#### 【老年用药】

由于老年人常有生理功能减退，有可能易出现不良反应。老年人在使用本品过程中，应注意仔细观察，若出现不良反应，可减量或停药。

#### 【药物相互作用】

伊托必利的代谢不依赖于细胞色素 P450 酶，而主要经黄素单氧化酶途径代谢，故不易发生药物代谢方面的相互作用。

本品在血清蛋白结合力方面，未发现与华法林、地西洋（安定）、双氯芬酸、噻氯匹定、硝苯地平和尼卡地平的相互作用。

抗溃疡药物，如西咪替丁、雷尼替丁、替普瑞酮和西曲酸酯不影响本品的促动力作用。

抗胆碱能药物可减弱本品的作用，故应避免合用替喹溴胺、丁溴东莨菪碱、噻哌溴胺等抗胆碱药物。

伊托必利具有促胃动力作用，因此可能影响合并口服药物的吸收。与治疗指数窄的药物、缓释或肠溶药物合用时，应特别谨慎。

#### 【药物过量】

如果药物过量超过一定程度，应采取洗胃和对症治疗等常规措施。

## 【药理毒理】

### 药理作用

伊托必利具有多巴胺 D<sub>2</sub>受体拮抗活性和乙酰胆碱酯酶抑制活性，通过两者的协同作用发挥胃肠促动力作用。此外，由于有拮抗多巴胺 D<sub>2</sub>受体活性的作用，尚有一定的抗呕吐作用。

### 毒理研究

#### 遗传毒性

伊托必利 Ames 试验、体外人淋巴细胞染色体畸变试验、小鼠体内染色体畸变试验、小鼠微核试验结果均为阴性。一项中国仓鼠肺细胞（CHL）染色体畸变试验结果在最高浓度时为阳性，在另两项试验中使用经培养的 CHL 结果均为阴性。

#### 生殖毒性

在大鼠生育力试验中，伊托必利≥30mg/kg/天时雌性动物动情周期延长，认为这与继发于高催乳素血症有关。剂量达 300mg/kg/天时还可见交配前时间延长。300mg/kg/天剂量下伊托必利在妊娠大鼠中血浆浓度约为人临床给药剂量（50mg）下血清浓度的 100 倍，该剂量下对大鼠交配或生育力未见不良影响。在大鼠和兔胚胎-胎仔发育毒性试验中，母体剂量高达 300mg/kg 时未见致畸作用。给药期间，伊托必利剂量达 300mg/kg/天时，妊娠兔可见瞳孔缩小、上睑下垂、流泪，及摄食量减少。在围产期毒性试验中，大鼠经口给予伊托必利 10、100 和 300mg/kg/天，对胚胎和子代发育及母体生殖功能均未见影响。伊托必利可经动物的乳汁分泌。

#### 致癌性

尚未开展盐酸伊托必利致癌性试验。

#### 其他

盐酸伊托必利重复经口给药毒性试验中，高剂量 30mg/kg/天大鼠出现可逆性乳腺增生，这可能与高催乳素血症有关；犬（最高剂量 100mg/kg/天）或灵长类动物（最高剂量 300mg/kg/天）未见此类现象。在犬 3 个月经口给药毒性试验中，伊托必利 30mg/kg/天时可见前列腺萎缩，而在犬 6 个月更高剂量（100mg/kg/天）、大鼠或猴 6 个月更高剂量（300mg/kg/天）给药后未观察到该现象。

#### 【药代动力学】

本品口服后在胃肠道吸收迅速、完全，经肝脏首过代谢，其相对生物利用度约为 60%。食物对本品生物利用度没有影响。口服本品 50mg 后，血浆浓度约 0.5 小时达到峰值（ $C_{max}$  0.73 $\mu$ g/ml）。人血清蛋白结合率为 96%。

本品在肝脏主要通过黄素单氧化酶途径转化形成代谢物 M<sub>1</sub>、M<sub>2</sub> 和 M<sub>3</sub>。3 种代谢物中，仅其中之一有较弱的多巴胺 D<sub>2</sub> 受体阻滞作用，无药理学相关性。

本品及其代谢产物主要经肾脏排泄（75%），清除半衰期大约为 6 小时。本品的促动力作用在治疗剂量范围内与剂量呈线性相关。

【贮藏】 密封，在干燥处保存。

【包装】 聚氯乙烯固体药用复合硬片和药用铝箔。**4片/板**，1板/盒；4片/板，2板/盒；4片/板，3板/盒；4片/板，4板/盒；**5片/板**，1板/盒；5片/板，2板/盒；5片/板，3板/盒；5片/板，4板/盒；**6片/板**，1板/盒；6片/板，2板/盒；6片/板，3板/盒；6片/板，4板/盒；**7片/板**，1板/盒；7片/板，2板/盒；7片/板，3板/盒；7片/板，4板/盒；**8片/板**，1板/盒；8片/板，2板/盒；8片/板，3板/盒；8片/板，4板/盒；**9片/板**，1板/盒；9片/板，2板/盒；9片/板，3板/盒；9片/板，4板/盒；**10片/板**，1板/盒；10片/板，2板/盒；10片/板，3板/盒；10片/板，4板/盒；**11片/板**，1板/盒；11片/板，2板/盒；11片/板，3板/盒；11片/板，4板/盒；**12片/板**，1板/盒；12片/板，2板/盒；12片/板，

3板/盒; 12片/板, 4板/盒; **13片/板**, 1板/盒; 13片/板, 2板/盒; 13片/板, 3板/盒;  
13片/板, 4板/盒; **14片/板**, 1板/盒; 14片/板, 2板/盒; 14片/板, 3板/盒; 14片/板,  
4板/盒; **15片/板**, 1板/盒; 15片/板, 2板/盒; 15片/板, 3板/盒; 15片/板, 4板/盒;  
**16片/板**, 1板/盒; 16片/板, 2板/盒; 16片/板, 3板/盒; 16片/板, 4板/盒。

**【有效期】** 36个月

**【执行标准】** 国家药品监督管理局药品注册标准YBH17402021

**【批准文号】** 国药准字H20223071

**【上市许可持有人】**

名称: 珠海润都制药股份有限公司

注册地址: 珠海市金湾区三灶镇机场北路6号

邮政编码: 519041

电话号码: 0756-7630088      0756-7630122

传真号码: 0756-7637182

不良反应反馈: 电话: 13702329078, 邮箱: ywjj@rdpharma.cn

网    址: <http://www.rdpharma.cn>

**【生产企业】**

企业名称: 珠海润都制药股份有限公司

生产地址: 珠海市金湾区三灶镇机场北路6号

邮政编码: 519041

电话号码: 0756-7630088      0756-7630122

传真号码: 0756-7637182

不良反应反馈: 电话: 13702329078, 邮箱: ywjj@rdpharma.cn

网 址: <http://www.rdpharma.cn>

031037-03-01