

格拉司琼 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/312/2021\\_2022\\_\\_E6\\_A0\\_BC\\_E6\\_8B\\_89\\_E5\\_8F\\_B8\\_E7\\_c22\\_312927.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/312/2021_2022__E6_A0_BC_E6_8B_89_E5_8F_B8_E7_c22_312927.htm) 药品名称格拉司琼药物别名格雷西龙，康泉，Kytril，BRL-43694 英文名

称Granisetron 类别止吐药、催吐药及胃肠推动药性状白色至微黄白色的结晶性粉末，无臭。易溶于水，难溶于甲醇，极难溶于乙醇，在乙醚中几乎不溶。熔点；290 ~ 292 。制剂注射液：每支3mg（3ml）。分子式成分药理及应用本品为一种强效高选择性外周和中枢神经系统5-HT<sub>3</sub>受体拮抗剂，通过对上端小肠腹部向心神经纤维和孤束核或呕吐化学感受区的5-HT<sub>3</sub>受体的阻断作用，抑制抗肿瘤药物和放疗引起的恶心和呕吐。但本品不能抑制由阿扑吗啡诱发的狗的呕吐，也不抑制由吗啡诱发的雪貂的呕吐，表明本品主要作用于5-HT<sub>3</sub>受体。动物止吐试验结果显示，本品呈现良好的量-效关系，止吐效力较昂丹司琼强5 ~ 11倍。健康志愿者1次快速静注本品20或40 μg / kg后，平均C<sub>max</sub>为13.7 μg / L和42.8 μg / L，C<sub>max</sub>和AUC与剂量呈线性关系，但t<sub>1/2</sub>、V<sub>d</sub>和CL无大的改变。在癌症患者体内，本品的V<sub>d</sub>为2.2 ~ 3.3L / kg；健康志愿者1次静脉注射本品后呈双相性消除，t<sub>1/2</sub>为2.3 ~ 5.9小时，而患者为9.2 ~ 12小时；多次重复给药4天后血浓度达稳态，此后逐渐减少，未见蓄积性；本品主要经肝脏消除，只有8% ~ 15%以原形自尿中排泄。在一项大型对比研究中，本品可使70%的肿瘤患者在接受化疗后24小时内完全停止呕吐。临床试验中比较了本品与昂丹司琼的止吐疗效，认为对中等致吐的抗肿瘤化疗，两者的疗效相同，而对顺铂引起的高度呕吐，本品则较昂丹司琼更为有效。治疗化疗或放疗所致的

恶心和呕吐。贮存置于30℃以下避光处贮存，不可冰冻。用法用量将本品以注射用生理盐水20～50ml稀释后，于化疗或放疗前每日1次静脉滴注，成人剂量每次40μg/kg，或给予标准剂量3mg，如症状未见改善可再增补1次；对老年患者及肾功能不全患者一般不需调整剂量。每1疗程可连续使用5天。

注重事项（1）本品仅限于化疗药物引起强烈恶心、呕吐时作为止吐剂使用。（2）小儿用药的安全性尚未确定，故禁用本品。（3）孕妇使用本品的安全性亦未确定，故应权衡利弊，慎重使用；哺乳妇女使用本品时应停止哺乳。（4）对本品或有关化合物过敏者禁用。（5）由于本品可减慢消化道运动，故消化道运动障碍患者使用本品时应严密观察。（6）患者对本品耐受性较好，主要不良反应为头痛，发生率约为10%～15%；其它少见的不良反应有便秘、嗜睡、腹泻、AST和ALT暂时性升高等；也曾观察到血压变化，但停药即消失，一般不需处理。未发现锥体外系反应及其它严重副作用。（7）本品直临时配制，稀释后贮存时间在无菌、避光和室温条件下不超过24小时；本品不应与其它药物混合于同一溶液中使用。

100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 [www.100test.com](http://www.100test.com)