

有报告显示患者服用舍曲林后尿免疫测定筛查实验出现苯二氮卓类药物假阳性的结果。这是由于该筛查实验缺乏特异性。停用舍曲林后数天内可能出现假阳性结果。气相色谱法 / 质谱分析法等验证性检查可区分苯二氮卓类药物和舍曲林。

从选择性 5- 羟色胺再摄取抑制剂 (SSRIs)、抗抑郁药物或治疗强迫药物转换为舍曲林治疗

从其他 SSRIs、抗抑郁药物或治疗强迫药物转换为舍曲林治疗的最佳时机，这方面的对照研究经验有限。换药治疗时应小心并进行慎重的医学评价，特别是由长效药物如氟西汀换为舍曲林治疗时。由一种选择性 5- 羟色胺再摄取抑制剂转换为另一种同类药的清洗期尚未确定。

一般注意事项

1. 引起躁狂 / 轻躁狂 – 在上市前的试验中，接受舍曲林治疗的病人约 0.4% 出现轻躁狂或躁狂。应用其他已上市的抗抑郁药物或治疗强迫药物治疗情感性障碍时，也有报道少数病人出现躁狂或轻躁狂。

2. 体重下降 – 一些患者应用舍曲林时，可能出现显著体重下降。但平均而言，在临床对照试验中，与安慰剂比较，应用舍曲林后仅出现轻微的 1 或 2 磅的体重下降。罕见患者因体重下降而停药。

3. 癫痫发作 – 抗抑郁药物和治疗强迫药物有诱发癫痫发作的潜在危险。舍曲林尚未在癫痫患者中进行评估。所以应避免将舍曲林用于不稳定癫痫患者；对于病情已控制的癫痫患者，应密切监测。舍曲林上市前临床试验中排除了这些患者。应用舍曲林治疗约 3000 例的抑郁症患者中，未发现癫痫发作者。然而，在约 1800 名（有 220 名患者 <18 岁）接受舍曲林治疗的强迫症患者中，有 4 人（约 0.2%）出现癫痫发作，其中 3 例患者为青少年，2 例患有癫痫，1 例患者有癫痫家族史，所有这 4 例患者都没有接受抗惊厥药物治疗。舍曲林与上述患者癫痫发作的关系尚未确定。因此，癫痫患者应慎用舍曲林。

4. 停用舍曲林治疗

舍曲林和其它 SSRIs 和 SNRIs（5- 羟色胺及去甲肾上腺素再摄取抑制剂）上市后，有停药时发生不良事件的自发性报告，尤其是在突然停药时，包括下列症状：情绪烦躁、易激惹、激越、头晕、感觉障碍 [如感觉异常（如电击样感觉）]、焦虑、意识模糊、头痛、昏睡、情绪不稳定、失眠和轻躁狂。尽管这些事件一般为自限性，但曾有严重停药症状的报告。

当停用舍曲林时，应监测这些症状。如果可能，推荐逐渐减量而非突然停药。若减量或停药后出现无法耐受的症状，可考虑恢复先前的剂量。随后，医生可以继续减量，但应采用更慢的减量速度（见【用法用量】）。

5. 异常出血

SSRIs（包括舍曲林）和 SNRIs 可能增加出血事件的风险。如果合用如非典型的抗精神病药和吩噻嗪类药物、大部分三环类抗抑郁药物、阿司匹林、非甾体类抗炎药（NSAIDs）、华法林和其它抗凝药可能会增加该风险。病例报告和流行病学试验（病例对照和队列设计）显示，服用影响 5- 羟色胺再摄取的药物后可出现胃肠道出血事件。与使用 SSRIs 和 SNRIs 有关的出血事件包括瘀斑、血肿、鼻衄、瘀点，以及可危及生命的出血。

应警告患者，舍曲林与 NSAIDs、阿司匹林或其它可影响凝血的药物合用存在出血风险。

6. 微弱的促尿酸排泄作用 – 应用舍曲林后可出现血清尿酸下降（平均约下降 7%）。该微弱的促尿酸排泄作用的临床意义未知。

7. 有伴发疾病患者的应用 – 舍曲林在伴发某种全身性疾病的患者中的临床应用经验有限。患有影响代谢或血液动力学疾病或状况的患者，应慎用舍曲林。

舍曲林上市前临床试验排除了近期出现心肌梗死或不稳定性心脏疾病的患者。但在双盲临床试验中，对服用舍曲林的 774 例患者进行了心电图（ECG）评估，显示应用舍曲林不伴显著 ECG 异常。

上市后一项安慰剂对照活剂量（舍曲林剂量范围 50~200mg/ 日，平均剂量 89mg/ 日）试验，对 372 例符合 DSM-IV 抑郁症诊断标准的患者进行了随机分组，这些患者近期因心肌梗死（MI）或不稳定性心绞痛而住院。除其它排除标准外，该试验还排除了下列患者：未控制的高血压、需要心脏手术、过去 3 个月内接受过冠状动脉搭桥术（CABG）、重度或有症状的心动过缓、非动脉粥样硬化性心绞痛、具有临床意义的肾功能损害（肌酐 >2.5mg/dl），和具有临床意义的肝功能障碍。患者在急性恢复期（MI 后 30 天内，或不稳定性心绞痛住院后）即开始应用舍曲林。第 16 周时与安慰剂比较，在下列终点的差异无显著性：左心室射血分数、所有心血管事件（心绞痛、胸痛、水肿、心悸、晕厥、体位性头晕、充血性心力衰竭（CHF）、MI、心动过速、心动过缓和血压变化）和涉及死亡或需要住院的严重心血管事件（MI、CHF、中风或心绞痛）。

肝功能损害患者：舍曲林在肝脏充分代谢。在慢性轻度肝功能损伤的患者中，舍曲林的清除率降低，导致 AUC 和 C_{max} 升高、清除半衰期延长。舍曲林对中、重度肝功能损伤患者的影响尚未评估。伴发肝脏疾病的患者须慎用舍曲林。若肝功能损伤患者服用舍曲林，应减低服药剂量或给药频率（见【注意事项】和【用法用量】）。

肾功能损害患者：舍曲林代谢充分，只有少量舍曲林以原型从尿中排出。1 项临床试验比较了健康志愿者和轻度 - 中度（肌酐清除率 30-60mL/min）至重度（需要血液透析治疗）（肌酐清除率 10-29mL/min）肾功能损伤患者，显示肾脏疾病不影响舍曲林的药代动力学（AUC₀₋₂₄ 或 C_{max}）和蛋白结合作用。基于该药代动力学结果，肾功能损伤患者无需调整剂量（见临床药理学）。

8. 对认知和运动功能的影响 - 对照试验中，舍曲林无镇静作用，亦不影响精神运动功能。虽然实验室数据显示舍曲林对正常受试者的复杂精神运动性活动无损伤。但作用于中枢神经系统的药物可能会对某些个体产生不利影响。因此应告知患者，在了解如何使用舍曲林之前，应谨慎从事需要保持警觉的活动，如驾车或操作机械。

9. 低钠血症 - 在应用 SSRIs（包括舍曲林）或 SNRIs（5- 羟色胺及去甲肾上腺素再摄取抑制剂）治疗时可能出现低钠血症。在许多病例中，低钠血症是抗利尿激素分泌过多综合征（SIADH）的结果。已有血清钠离子水平低于 110mmol/L 的病例报道。老年患者、服用利尿剂的患者或其它原因因容量减低的患者在应用 SSRIs 及 SNRIs 时发生低钠血症

的风险可能更大（见【老年用药】）。出现有症状的低钠血症后应考虑停用舍曲林并采取相应的治疗措施。

低钠血症的症状和体征包括：头痛、注意力集中困难、记忆力损伤、意识模糊，无力和平衡障碍（可能导致摔倒）。更严重和 / 或急性的低钠血症的症状及体征包括幻觉、晕厥、癫痫发作、昏迷、呼吸停止及死亡。

10. 血小板功能 - 服用舍曲林患者中，罕见血小板功能改变和 / 或实验室检查异常结果的报告。尽管曾有几例服用舍曲林后出现异常出血或紫癜的报告，但不清楚是否由舍曲林所致。

11. 药物滥用和依赖

躯体和心理依赖：一项随机双盲、安慰剂对照试验比较了舍曲林、阿普唑仑和 d- 安非他明引起的滥用倾向。舍曲林未产生提示滥用可能的阳性主观效应，如欣快和喜欢服用药物，而这些症状均可见于其它两种药物。舍曲林上市前临床经验中，没有发现任何停药综合征倾向，也没有发现觅药行为。舍曲林动物试验中，没有发现潜在的刺激物或巴比妥样（镇静剂）滥用。不过，如同所有其它 CNS 活性药物，医生应仔细对患者进行药物滥用史评估，并对此类患者进行严格随访，观察他们是否有舍曲林的误用或滥用迹象（如耐受形成、剂量提高、觅药行为）。

12. 骨折

流行病学研究显示应用五羟色胺再摄取抑制剂（SRIs）包括舍曲林治疗的患者骨折风险增加。但导致骨折风险的作用机制尚不明确。

13. 儿童和青少年用药

现仅有有限的临床证据是关于儿童和青少年的长期安全性数据，包括对生长、性成熟、认知和行为发育的影响。对于长期治疗的儿童患者，医生须观察其生长发育异常。

14. 应告知患者，舍曲林可能导致轻度的瞳孔扩大，而在敏感个体中，可能会引起闭角型青光眼发作。现有青光眼大多为开角型青光眼，因为闭角型青光眼在确诊后可以通过虹膜睫状术治疗。开角型青光眼并非闭角型青光眼的风险因素。患者可能希望进行检查，以确定自己是否是高危的闭角型青光眼，若是则采用预防措施（例如虹膜切除术）。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

只有当妊娠期妇女服药的益处明显大于药物对胎儿的潜在风险时，方可服用舍曲林。

妊娠 - 非致畸性影响

在妊娠晚期暴露于舍曲林和其它 SSRIs 或 SNRIs 后，新生儿可出现并发症，并因此需要延长住院、呼吸支持及管饲。这些发现基于上市后报告。这些并发症可在分娩后立即出现。报告的临床表现包括呼吸困难、发绀、呼吸暂停、癫痫发作、体温不稳定、喂食困难、呕吐、低血糖、肌张力减低、肌张力增加、腱反射亢进、震颤、神经敏感、易激惹和持续哭闹。这些特点可能与 SSRIs 和 SNRIs 的直接毒性一致，或可能与停药综合征一致。应注意在一些病例中，临床表现与 5- 羟色胺综合征一致（见警告）。

婴儿在妊娠后期暴露于 SSRIs，可能会增加新生儿持续性肺动脉高压（PPHN）风险。在整体人群中，每 1,000 例活产婴儿中会有 1-2 例 PPHN，并可伴发显著的新生儿发病率和死亡率。一项回顾性病例对照研究，入组了 377 例婴儿出生时患有 PPHN 的女性，和 836 例婴儿出生时健康的女性。与妊娠期没有暴露于抗抑郁药的婴儿相比，妊娠第 20 周后暴露于 SSRIs 的婴儿发生 PPHN 的风险约升高 6 倍。目前尚无妊娠期暴露于 SSRIs 后出现 PPHN 风险的确凿证据；这是第 1 个研究了该潜在风险的试验。该试验服用单一 SSRI 的病例尚不足，故无法确定是否所有 SSRIs 均可造成类似程度的 PPHN 风险。对 1997-2005 年在瑞典出生的 831324 例婴儿进行的一项研究发现：根据报告，母亲在‘妊娠早期’服用 SSRIs，婴儿出现 PPHN 的风险比为 2.4(95%CI 1.2-4.3)（CI：可信区间）；根据‘妊娠早期’服用 SSRIs 母亲的报告及‘妊娠后期’处方 SSRI 的情况，婴儿出现 PPHN 的风险比为 3.6(95%CI 1.2-8.3)。

育龄妇女使用舍曲林则应采取适当的避孕措施。

当妊娠妇女在妊娠晚期服用舍曲林时，医生应认真考虑治疗的潜在风险和收益。医生应注意，在一项 201 例有抑郁症病史的女性患者入组的前瞻性纵向试验中，妊娠开始时，她们服用抗抑郁药且情绪愉快。与继续服用抗抑郁药的女性相比，妊娠期间停用抗抑郁药的女性更可能病情复燃。

产程和分娩

舍曲林对人类产程和分娩的影响未知。

哺乳期妇女

对小样本中的哺乳期母亲及婴儿的零星研究提示，婴儿血清中舍曲林含量为阴性或无法测得；但乳汁中的舍曲林含量高于母体血清中的含量。不推荐哺乳期女性服用舍曲林，除非经临床医生判断使用舍曲林的利大于弊。

【儿童用药】

本品可以用于 6~17 岁的儿童和青少年强迫症患者。尽管儿童患者对舍曲林的代谢稍快，为了避免产生过高的血药浓度，对儿童强迫症患者建议使用较低剂量，尤其是 6~12 岁体重较轻的儿童。详见【用法用量】。

【老年用药】

临床试验入组了 663 例≥ 65 岁的美国老年抑郁患者，其中 180 例≥ 75 岁。与年轻受试者报告的不良反应相比，在老年患者临床试验中观察到的总体不良反应模式无差异。而且，根据报告的其它经验，尚未发现老年和年轻受试者间的安全性模式存在差异。和其它药物一样，不排除一些老年患者具有更高的敏感性。一项舍曲林与安慰剂对照的临床试验，入组了 947 例老年抑郁症患者。与年轻受试者报告的疗效相比，在老年患者临床试验中观察到的总体疗效模式无差异。

老年患者中的其它不良事件：在 354 例老年患者参加的舍曲林和安慰剂对照试验中，总体不良事件基本与本说明书中列出的不良事件相似。尿路感染是唯一未列出的不良事件，在安慰剂对照试验中，报告其发生率≥ 2%，且高于安慰剂组。

老年患者应用 SSRIs（包括舍曲林）和 SNRIs 后，可出现具有临床意义的低钠血症。该不良事件对老年患者的风险可能更大（见【注意事项】- 低钠血症）。

【药物相互作用】

单胺氧化酶抑制剂：舍曲林合单胺氧化酶抑制剂，包括选择性的单胺氧化酶抑制剂司来吉兰、可逆性的单胺氧化酶抑制剂吗氯贝胺、以及其它单胺氧化酶抑制剂药物（如，利奈唑胺），治疗出现了严重副反应，有时是致命性的。有些病例是类似 5- 羟色胺综合征的表现，包括：过高热、肌强直、肌肉痉挛、自主神经功能紊乱伴生命体征快速波动；精神状况的改变包括精神紊乱、易激惹及极度激越直至发展为谵妄和昏迷。所以，服用单胺氧化酶抑制剂时或停用单胺氧化酶抑制剂 14 天内不能服用舍曲林；同样，舍曲林停用后也需 14 天上才能开始单胺氧化酶抑制剂的治疗。

匹莫齐特：在一项单剂低剂量匹莫齐特（2mg）与舍曲林合用的研究中证实，两药同服可使匹莫齐特的血浆浓度升高。升高的水平未引起 EKG 的变化。这种药物相互作用的机制尚不清楚，由于匹莫齐特的治疗窗较窄，禁止舍曲林与匹莫齐特同服。

使 QT 间期延长的药物：与其它使 QTc 间期延长的药物（如某些抗精神病药物和抗生紊）合用会导致 QTc 延长 / 或室性心律失常（例如 TdP）的风险增加（参见【注意事项】）。

中枢神经系统抑制剂和酒精：每日同时服用舍曲林 200mg 不会增加乙醇、卡马西平、氟哌啶酮或苯妥英对健康受试者认知功能和精神运动性活动能力的作用，但不主张舍曲林与酒精合用。

锂剂：对正常志愿者进行的安慰剂对照试验中，舍曲林与锂剂合用未明显改变锂剂的药代动力学参数，但与安慰剂相比震颤增多，表明两药之间存在药理学相互作用的可能。舍曲林与其它经 5- 羟色胺能机制起作用的药物如锂剂合用时，应对病人进行监护。

苯妥英：在健康志愿者的安慰剂对照研究中，每日 200mg 舍曲林长期服药并不显著地抑制苯妥英的代谢。然而，如需与舍曲林合用，在开始加用舍曲林时应当监测苯妥英的血药浓度，同时适当调整苯妥英的剂量。另外，与苯妥英合用可引起舍曲林血药浓度的下降。

舒马普坦：在舍曲林上市后，有个别报道舍曲林与舒马普坦合并使用后，病人出现体弱、腱反射亢进、共济失调、意识模糊、焦虑和激越。如果临床上确实需要舍曲林与该药合用时的话，应当对病人进行密切的观察。

与蛋白结合的药物：因舍曲林与血浆蛋白结合，应注意舍曲林和其它与血浆蛋白结合药物之间相互作用的可能性。但是，舍曲林分别与地西泮、甲苯磺丁脲和华法林相互作用作用的三项正式研究中，未见舍曲林对这些药物的蛋白结合率有明显的影响。

华法林：舍曲林 200mg/ 日与华法林合用可引起较小的但有统计学意义的凝血酶原时间的延长，其临床意义尚不明确。因此，舍曲林与华法林联合应用或停用时应密切监测凝血酶原时间。

与其它药物的相互作用：已进行了舍曲林与其它药物间相互作用的研究。每日舍曲林 200mg 与地西泮或甲苯磺丁脲合用可导致一些药代动力学参数较小的、但有统计意义的改变。与西咪替丁合用可明显降低舍曲林的清除。这些改变的临床意义尚不清楚。舍曲林对阿替洛尔的 β- 肾上腺能阻滞作用无任何影响。每日舍曲林 200mg 与格列苯脲或地高辛之间无相互作用。

电休克治疗（ECT）：尚无考察舍曲林与电休克治疗合用优点或危险方面的临床试验。细胞色素 P450(CYP)2D6 代谢的药物：抗抑郁药物对药物代谢同功酶 CYP2D6 的抑制作用程度是不尽相同的。其临床意义需取决于抑制作用的程度及合用药物的治疗指数。治疗指数较窄的 CYP2D6 底物包括如普罗帕酮（propafenone）和氟卡尼（flecainide）在内的三环类抗抑郁药物和 1C 类抗心律失常药物。已有的药物相互作用研究表明，每日 50mg 舍曲林长期给药可使地西帕明（desipramine, CYP2D6 同功酶活性的标志物）稳态的血药浓度轻度增加（平均 30-40%）。

其他细胞色素（CYP）酶代谢的药物（CYP3A3/4, CYP2C9, CYP2C19, CYP1A2）：CYP3A3/4：体内药物相互作用试验表明长期服用舍曲林 200mg/ 日不会对 CYP3A3/4 介导的内生皮固醇的羟化或卡马西平及特非那定的代谢产生抑制作用。另外，每日 50mg 舍曲林长期给药不会对 CYP3A3/4 介导的阿普唑仑药物代谢产生抑制作用。数据显示舍曲林不是 CYP3A3/4 的抑制剂。

CYP2C9：长期服用舍曲林 200mg/ 日对甲苯磺丁脲、苯妥英和华法林的血药浓度没有明显影响。这说明舍曲林不是 CYP2C9 的临床相关抑制剂。

CYP2C19：长期服用舍曲林 200mg/ 日对地西泮血药浓度无明显影响，说明舍曲林也非 CYP2C19 的抑制剂。

CYP1A2：体外试验研究表明舍曲林对 CYP1A2 无明显抑制作用。

其它 5- 羟色胺能药物：舍曲林与可增强 5- 羟色胺神经传导作用的药物如色氨酸或芬氟拉明，5- 羟色胺激动剂，安非他明，或中草药贯叶连翘（金丝桃属）合用时应慎重考虑，避免出现可能的药效学相互作用。

【药物过量】

有证据表明，舍曲林在过量服用时仍有很大的安全范围。曾有舍曲林单独过量服用高达 13.5 克的报道。曾有过量服用舍曲林导致死亡的报道，但大多出现于与其它药物和 / 或酒精联合应用的情况下。因此，应对任何过量服用给予积极治疗。

药物过量的症状包括由 5- 羟色胺引起的不良反应如心电图 QT 延长、尖端扭转型室性心动过速、嗜睡、胃肠不适（如恶心和呕吐）、心动过速、震颤、激越和头晕。罕有昏迷报道（参见【注意事项】，【药物相互作用】和【临床试验】）。舍曲林没有特效的解毒剂。开放并保持气道通畅确保充分的供氧及换气，可与导泻剂合用活性炭，可能与催吐或洗胃同样甚或更为有效。在对症治疗及支持疗法同时，建议进行心脏及生命体征监测。由于舍曲林有较大分布容积，强迫利尿，透析，血液灌注及换血疗法均没有明显意义。

【临床试验】

抑郁性障碍

对在参加了为期 8 周的舍曲林 50-200mg/ 日的开放性试验并治疗有效的抑郁症门诊患者进行了一项研究。将这些患者（N=295）随机分到舍曲林 50-200mg/ 日组或安慰剂组，继续进行 44 周的双盲实验。舍曲林组患者的复发率比安慰剂组患者显著降低。完成研究的患者的平均给药量为 70mg/ 日。

强迫症

在一项长期研究中，入选参加了为期 52 周的舍曲林 50-200mg/ 日的单盲实验并治疗有效的患者，这些患者符合 DSM- III -R 中的强迫症诊断标准。将这些患者（n=224）随机分到舍曲林或安慰剂组继续治疗 28 周，观察因病情复发或疗效不佳而脱落的患者比列。在继续治疗的 28 周期间，舍曲林组因病情复发或疗效不佳的患者比列明显低于安慰剂组。在男性和女性患者均显示出这一点。

【药理作用】

药理作用

盐酸舍曲林是一种选择性的 5- 羟色胺再摄取抑制剂。其作用机制与其对中枢神经元 5- 羟色胺再摄取的抑制有关。在临床剂量下，舍曲林阻断人血小板对 5- 羟色胺的摄取。研究提示舍曲林是一种强效和选择性的神经元 5- 羟色胺再摄取抑制剂，对去甲肾上腺素和多巴胺再摄取仅有微弱影响。体外研究显示，舍曲林对肾上腺素能受体（α₁、α₂、β）、胆碱能受体、GABA 受体、多巴胺受体、组胺受体、5- 羟色胺受体（5HT_{1A}、5HT_{1B}、5HT₂）或苯二氮卓受体没有明显的亲和力。动物长期给予舍曲林可使脑中去甲肾上腺素受体下调，这与临床上其它抗抑郁症药物的作用一致。舍曲林对单胺氧化酶没有抑制作用。

毒理研究

遗传毒性：细菌回复突变试验、小鼠淋巴瘤试验、体内小鼠骨髓和体外人淋巴细胞遗传学试验中，舍曲林均未出现遗传毒性。

生殖毒性：给药剂量为 80mg/kg[以 mg/m² 计，为人最大推荐剂量（MRHD）200mg/ 日的 3.1 倍] 时，两个大鼠试验之一观察到生育力降低。妊娠大鼠和家兔在器官形成期给予舍曲林剂量分别达 80mg/kg/ 日、40mg/kg/ 日（以 mg/m² 计，约相当于 MRHD 的 3.1 倍），未观察到致畸作用，但是剂量分别为 10mg/kg、40mg/kg（以 mg/m² 计，约相当于 MRHD 的 0.4 倍、3.1 倍）时观察到胎儿骨化延迟。雌性大鼠于妊娠后期及哺乳期给予舍曲林，剂量为 20mg/kg（以 mg/m² 计，约相当于 MRHD 的 0.8 倍）时死产幼鼠及出生后前 4 天幼鼠死亡数量增加，出生后前 4 天幼鼠的体重亦降低，幼鼠死亡无影响剂量为 10mg/kg（以 mg/m² 计，约相当于 MRHD 的 0.4 倍）。幼鼠存活率的降低是由舍曲林的子宫暴露所致。但这些作用的临床意义尚不清楚。

致癌性：在 CD-1 小鼠和 Long-Evans 大鼠上进行了剂量达 40mg/kg/ 日（以 mg/m² 计，分别约相当于 MRHD 的 1 倍和 2 倍）的终生致癌性研究。在剂量为 10~40mg/kg（以 mg/m² 计，分别约相当于 MRHD 的 0.25~1 倍）时，雄性小鼠出现剂量相关性的肝腺瘤增加，在雌性小鼠或大鼠上未观察到肝腺瘤的增加，也未见肝细胞癌的增加。CD-1 小鼠肝腺瘤的自发生率具有波动性，该结果对人类的意义尚不清楚。剂量为 40mg/kg 时雌性大鼠出现甲状腺滤泡腺瘤增加，不伴有甲状腺增生。与对照组比较，10~40mg/kg（以 mg/m² 计，分别约相当于 MRHD 的 0.5~2 倍）给药组大鼠子宫腺瘤增加，但尚不明确该结果与药物的相关性。

依赖性：动物研究未显示本品有兴奋作用或巴比妥样（中枢抑制剂）滥用的潜在性。

幼龄动物毒性：幼龄大鼠于出生后第 21 天至第 56 天经口给予舍曲林 10、40、80 mg/kg/ 日，雄性大鼠 80 mg/kg/ 日和雌性大鼠≥ 10 mg/kg/ 日时观察到性成熟延迟，除了给药结束时 40、80 mg/kg/ 日的雌性大鼠出现听觉惊跳反射减退（停药后未见影响）外，未见对雄性和雌性生育力和神经行为学发育的影响。高剂量（80mg/kg/ 日）所产生舍曲林血浆水平（AUC）相当于儿科患者（6~17 岁）给予 MRHD 的 5 倍。
【药代动力学】

男性每日口服舍曲林一次 50-200mg，舍曲林表现出与用药剂量成正比的药代动力学特性，连续用药 14 天，服药 4.5-8.4 小时人体血药浓度达峰值（Cmax）。青少年和老年人的药代动力学参数与 18-65 岁之间成人无明显差别。舍曲林平均半衰期为 22-36 小时。与终末清除半衰期相一致，每天给药一次，一星期后达稳态浓度，在这过程中有两倍的浓度蓄积。舍曲林的血浆蛋白结合率为 98%。动物实验结果表明，舍曲林有较大的分布容积。

舍曲林主要首先通过肝脏代谢，血浆中的主要代谢产物 N- 去甲基舍曲林的药理活性在体外明显低于舍曲林，约是舍曲林的 1/20，没有证据表明其在抗抑郁模型体内有药理活性，它的半衰期是 62-104 小时。舍曲林和 N- 去甲基舍曲林的最终代谢产物从粪便和尿中等量排泄，只有少量（< 0.2%）舍曲林以原形从尿中排出。

食物对舍曲林片剂的生物利用度无明显的影响。

【贮藏】密封保存。

【包装】聚氯乙烯固体药用硬片及药用铝箔包装，14 片 / 板，1 板 / 盒。

【有效期】24 个月

【执行标准】YBH13312023

【批准文号】国药准字 H20060316

【上市许可持有人】

名 称：山西仟源医药集团股份有限公司
注册地址：大同市经济技术开发区恒安街 1378 号
邮政编码：037010

电话号码：0352-6116505

传真号码：0352-6116515

网 址：http://www.cy-pharm.com

【生产企业】

企业名称：山西仟源医药集团股份有限公司
生产地址：山西省大同市经济技术开发区恒安街 1378 号
邮政编码：037010

电话号码：0352-6116505

传真号码：0352-6116515

网 址：http://www.cy-pharm.com