



色瑞替尼安全用药须知

（请仔细阅读本须知，按本须知或在医生指导下用药）

【药品商品名】

Cerini，品名：色瑞替尼，通用名：Ceritinib。

【适应症】

Ceritinib适用为有间变性淋巴瘤激酶（ALK）-阳性转移，对克唑替尼治疗出现疾病进展或不能耐受的非小细胞肺癌（NSCLC）患者的治疗。

【剂量和给药方法】

1、给药方法

- Ceritinib 的推荐剂量为 750mg 每天 1 次口服直至疾病进展或不可接受的毒性，在空胃给予 Ceritinib，不要在进餐的 2 小时内给予。

- 对有中度至严重肝受损患者尚未确定推荐剂量。
- 如忘记服用，弥补除非下一次服用时间在12小时内。

2、剂型规格:

- 胶囊，150mg。

3、禁忌症：无。

【警告和注意事项】

● 严重和持续胃肠道毒性

研究 1 中用 CERITINIB 治疗 255 例患者的 96%发生腹泻，恶心，呕吐，或腹痛包括 14%严重病例患者。38%患者由于腹泻，恶心，呕吐，或腹痛发生调整剂量。

监视和用标准医护处置患者，包括指示时止泻药，止吐药，或补液。根据不良药物反应的严重程度，如表 1 内描述不给 Ceritinib 与在减低剂量恢复。

● 肝毒性

用 CERITINIB 治疗患者发生药物-诱发肝毒性。研究 1 中 255 例患者的 27%发生谷丙转氨酶（ALT）升高大于正常上限（ULN）5 倍。一例患者（0.4%）由于转氨酶升高和黄疸需要永远终止。

监视有肝实验室测试包括 ALT，天门冬氨酸氨基转移酶（AST），和总胆红素每月 1 次和当临床指示，发生转氨酶升高患者中更频测试。根据不良药物反



应的严重程度，如表 1 所述不给 Ceritinib 与减低剂量恢复，或永久终止 Ceritinib。

● 间质性肺疾病（ILD）/肺炎

用 CERITINIB 治疗患者中可能发生严重，危及生命，或致命性 ILD/肺炎。在研究 1 中，255 例用 Ceritinib 治疗患者 4% 中报道肺炎。在研究 1 中 3% 患者中报道 CTCAE3 或 4 级 ILD/肺炎，和 1 例患者（0.4%）报道致命性 ILD/肺炎。在研究 1 中 1% 患者由于 ILD/肺炎终止 Ceritinib。

对患者监视肺部症状指示性 ILD/肺炎。除外 ILD/肺炎其他潜在原因，和在被诊断有治疗相关 ILD/肺炎患者永久终止 Ceritinib。

● QT 间期延长

用 Ceritinib 治疗患者发生 QTc 间期延长。在研究 1 中 255 例患者中有 3% 经受 QTc 间期延长超过基线大于 60msec。跨越 Ceritinib 的开发计划，1/304 例患者（小于 1%）用 Ceritinib 治疗剂量范围从 50 至 750mg 被发现有 QTc 大于 500msec 和 3% 患者有 QTc 从基线延长大于 60msec。一项药代动力学分析提示 Ceritinib 致浓度-依赖性 QTc 间期延长。

当可能时，在有先天性长 QT 综合征患者避免使用 Ceritinib。有充血性心脏衰竭，缓慢性心律失常，电解质异常患者，或用药物已知延长 QTc 间期患者定期进行监视心电图（ECGs）和电解质。对至少 2 次分开独立 ECGs 发生 QTc 间期大于 500msec 的患者不给 Ceritinib 直至 QTc 间期小于 481msec 或恢复至基线，如 QTc 间期是大于或等于 481msec，那么如同表 1 所述在减低剂量恢复 CERITINIB。当患者发生 QTc 间期延长与尖端扭转[Torsadedepointes]或多形性室性心动过速[polymorphicventriculartachycardia]或严重心律失常的体征/症状的组合时永久终止 Ceritinib。

● 高血糖

接受 Ceritinib 患者可能发生高血糖。在研究 1 中，CTCAE3-4 级高血糖，根据实验室值，发生在 255 例患者的 13%。在有糖尿病或葡萄糖不耐受患者中 CTCAE3-4 级高血糖的风险增加 6-倍和用皮质激素患者风险增加 2-倍。

当临床指示监视血清葡萄糖水平。当指示开始或优化抗高血糖药物。根据不良药物反应严重程度，不给 Ceritinib 直至高血糖被适当控制，然后如表 1 所述减低剂量恢复 Ceritinib。如不能用药物处理实现适当控制血糖，永久终止



Ceritinib。

● 心动过缓

接受 Ceritinib 患者可能发生心动过缓。在研究 1 中，窦性心动过缓，被定义为心率小于 50 跳每分，被注意到为 255 例患者的 1%新发现。在研究 1 中 3% 患者报道心动过缓。

避免用 Ceritinib 与其他已知致心动过缓可能程度药物（如， β -阻断剂，非二氢吡啶钙通道阻断剂，可乐定[clonidine]，和地高辛[digoxin]）联用。定期监视心率和血压。在症状性心动过缓病例不是危及生命，不给 Ceritinib 直至恢复至无症状心动过缓或至心率 60bpm 或以上，评价同时药物使用，和调整 Ceritinib 的剂量。如没有同时药物被鉴定对危及生命心动过缓永久终止 Ceritinib；但是，如与已知致心动过缓或低血压同时药物关联，不给 Ceritinib 直至恢复无症状心动过缓或至心率 60bpm 或以上，而如同时药物可被调整或终止，如表所述在减低剂量恢复 Ceritinib 恢复至无症状心动过缓或至心率 60bpm 或以上，与频繁监视。

● 胚胎胎儿毒性

根据其作用机制，Ceritinib 当被给予妊娠妇女可能致胎儿危害。在动物研究中，在器官形成期大鼠和兔给予 Ceritinib 在母体血浆暴露低于推荐人最大剂量每天 750mg 时在大鼠和兔中致骨骼异常。忠告有生殖潜能妇女对胎儿潜在危害。忠告有生殖潜能女性用 Ceritinib 治疗期间和完成治疗后至少 2 周使用有效避孕。

【不良反应】

包括：严重和持续胃肠道毒性、肝毒性、间质性肺疾病/肺炎、QT 间期延长、高血糖、心动过缓等。

【储存方法】

贮存在 25°C (77°F)；外出允许 15°C 至 30°C (59°F 至 86°F)。