

核准日期:

修改日期:

特殊药品、外用药品标识

盐酸依匹斯汀胶囊说明书

请仔细阅读说明书并在医生指导下使用。

【药品名称】

通用名称: 盐酸依匹斯汀胶囊

英文名称: Epinastine Hydrochloride Capsules

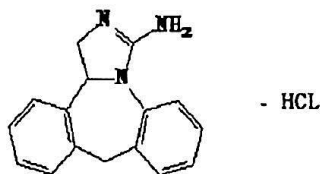
汉语拼音: Yansuan Yipisiting Jiaonang

【成份】

本品主要成份为盐酸依匹斯汀。

化学名称: 3-氨基-9,13b-二氢-1H-二苯[c,f]咪唑并[1,5-a]氮杂革盐酸盐。

化学结构式:



分子式: $C_{16}H_{15}N_3 \cdot HCl$

分子量: 285.77

【性状】

本品内容物为白色粉末。

【适应症】

本品为组胺 H_1 受体拮抗剂, 适用于过敏性鼻炎、荨麻疹、湿疹、皮炎、皮肤瘙痒症、痒疹、伴有瘙痒的寻常性银屑病及过敏性支气管哮喘的防治。

【规格】(1) 10 mg (2) 20 mg

【用法用量】

(1) 过敏性鼻炎: 成人, 口服本品一次 10~20 mg, 一日一次。或按病情遵医嘱服用。

(2) 荨麻疹、湿疹、皮炎、皮肤瘙痒症、银屑病、支气管哮喘通常成人口服本品一次 20 mg, 一日一次。或按年龄、症状遵医嘱服用。

【不良反应】

(1) 严重不良反应

1) 肝功能障碍、黄疸 (频率不明): 可见天门冬氨酸氨基转移酶 (AST)、丙氨酸氨基转移酶 (ALT)、 γ -谷酰转肽酶 (γ -GTP)、血清碱性磷酸酶 (Al-P)、乳酸脱氢酶 (LDH) 升高等肝功能障碍 (初期症状: 全身倦怠感、食欲不振、发热、恶心、呕吐等) 和黄疸, 故应充分观察, 出现异常情况时, 应终止给药, 并采取适当措施。

2) 血小板减少 (频率不明): 可见血小板减少, 故应充分观察, 出现异常情况时, 应终止给药, 并采取适当措施。

(2) 其他不良反应

出现下列不良反应时, 应根据症状采取适当措施。

	$\geq 0.1\%$ 、 $< 5\%$	$< 0.1\%$	频率不明
过敏症 ^{注1)}		浮肿 (面部、手足等)、皮疹、荨麻疹、瘙痒、瘙痒性红斑	
精神神经系统	困倦、倦怠感、头痛	眩晕、失眠、恶梦、麻木感、发呆	幻觉、幻听
消化系统	恶心、胃部不适、腹痛、口干	口内炎、食欲不振、呕吐、胃部坠胀感、胃积食感、腹泻、便秘、口唇干燥、腹胀	
肾脏		蛋白尿	
泌尿系统 ^{注2)}		尿频、血尿等膀胱炎样症状、尿闭	
循环系统		心悸	
呼吸系统		呼吸困难、咳痰困难、鼻塞	
血液 ^{注2)}		白细胞数增多	血小板减少
其他		月经异常、燥热、口苦、味觉下降、胸痛	女性化乳房、乳房肿大

注 1): 出现该情况时, 应终止给药, 并采取适当措施。

注 2): 应充分观察, 出现异常情况时, 应终止给药, 并采取适当措施。

【禁忌】

对本药任何一种成分过敏者禁用。

【注意事项】

1、下列患者应慎重给药 肝病患者或有上述既往病史者(有可能引起肝病恶化、复发)。

2、重要的基本注意事项 (1)本品与支气管扩张剂、类固醇剂等不同,它不是快速减轻气喘发作和症状的药物,所以在临床应用中应对患者进行必要说明。(2)长期接受类固醇剂治疗的患者在开始服用本品时,应适当减少类固醇剂的服用量。(3)因本品有困倦作用,故提醒正在服用本品的患者,在进行车辆驾驶等伴有危险性质的机械操作时应提高警惕。(4)季节性过敏患者服用本品时,应从易发病季节即将到来前开始服用,且持续到该季节结束。(5)服用本品无效的患者,不能盲目及长期地服用本品。(6)报告显示空腹服用本品时的血药浓度高于餐后用药。(支气管哮喘及过敏性鼻炎睡前用药,荨麻疹、湿疹、皮炎、皮肤瘙痒症、痒疹、伴有瘙痒的寻常性银屑病餐后用药的有效性 & 安全性已获证实。)(7)置于儿童不宜取到处。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

(1)怀孕期:孕期的妇女尤其前三个月不建议使用或在医生对治疗的有益性与危险性作出判断后才可用药。

(2)哺乳期:实验表明药物可向母乳中转移,因此不建议哺乳中的妇女使用,必须使用时应终止哺乳行为。

【儿童用药】

尚不明确。

【老年用药】

多数高龄患者肝、肾功能低下,本品主要是从肾脏排泄,应定期进行不良反应和临床症状(发疹、口渴、胃不适)的观察,出现异常时,应适当减少用量(例如 10 mg/日)或者立即停止用药等处理。

【药物相互作用】

与合成抗菌药物等其它药物合用未见特殊情况。

【药物过量】

尚不明确。

【药理毒理】

1. 药理作用

依匹斯汀为组胺 H₁受体拮抗剂。本品对组织胺、白三烯 C₄、PAF、5-羟色胺有抑制作用,并能抑制组胺、慢反应物质 A (SRS-A) 化学介质的释放。由于本品化学结构的特点,本品难以通过血脑屏障,对中枢神经系统的 H₁受体拮抗作用弱。

2. 毒理作用

(1) 重复给药: 大鼠连续给药 12 个月, 剂量为 1、6 和 60 mg/kg, 大剂量组动物见血中甘油三酯含量减少。猴连续给药 12 个月, 剂量为 1、8 和 60 mg/kg, 大剂量组动物有流涎、呕吐、腹泻现象。

(2) 生殖毒性: 大鼠妊娠前妊娠初期给予依匹斯汀 5、30、120 mg/kg/d, 在 120 mg/kg/d 剂量下, 动物都有摄食量的减少和体重增加的抑制, 雄性动物睾丸重量相对增加, 雌性动物出现发情期不规则及妊娠率明显降低, 对母体毒性无影响剂量为 30 mg/kg/d。各剂量组对胎仔无明显影响, 对子代无影响剂量为 120 mg/kg/d。大鼠胎儿器官形成期给予依匹斯汀, 剂量为 5、35 和 200 mg/kg/d, 大剂量组动物有 5/23 只动物死亡, 死亡动物可见肺表面颜色改变及肺和心肌水肿, 对胎仔无明显影响, 本试验对母体毒性无影响剂量为 5 mg/kg/d, 对子代无影响剂量为 200 mg/kg/d。家兔胎儿器官形成期给予依匹斯汀, 剂量为 5、15 和 75 g/kg/d, 大剂量组可见母体动物流产和吸收胎, 存活胎仔数明显减少, 本试验对母体及子代无影响剂量为 15 mg/kg/d。大鼠围产期和哺乳期给予依匹斯汀, 剂量为 5、30 和 120 mg/kg/d, 120 mg/kg/d 组母体动物摄食量减少, 但对分娩、哺育未见明显影响, 对子代的发育、形态分化、机能活动及繁殖能力未见明显影响, 本试验对母体动物无影响剂量为 30 mg/kg/d, 对子代无影响剂量为 120 mg/kg/d。

【药代动力学】

1. 吸收、代谢、排泄

健康成人口服盐酸依匹斯汀 20 mg, 1.9 小时达血药峰值浓度。血浆浓度消除半衰期为 9.2 小时。

健康成人口服给药吸收率约为 40%, 生物利用度约为 39%。

健康成人口服或静脉给药, 尿或粪便提取物中的放射性均为原形物, 代谢物的总量很少。健康成人口服给药尿中及粪便中排泄率分别为 25.4%、70.4%。

2. 分布

口服 ^{14}C -盐酸依匹斯汀在胃、小肠内容物、肝脏、肾脏中呈高浓度的放射性, 在下垂体、唾液腺、胰脏、消化道粘膜层中略呈高浓度分布趋势。不向中枢神经系统转移, 但可向乳汁中转移 (大鼠)。

【贮藏】密封, 置干燥处保存。

【包装】双铝泡罩, 6 粒/板, 12 粒/板。

【有效期】 (1) 24 个月 (规格 10mg) (2) 12 个月 (规格 20mg)

【执行标准】

【批准文号】

【生产企业】

企业名称：重庆药友制药有限责任公司

生产地址：重庆市渝北区人和镇星光大道 100 号

电话号码：（023）67518018

传真号码：（023）67527018

邮政编码：401121

网 址：www.yaopharma.com