

核准日期：2007年02月08日

修改日期：2008年04月17日

2008年07月28日

2013年02月21日

2013年07月22日

2017年06月09日

2017年09月14日

2017年11月28日

2018年02月12日

2019年05月09日

2019年12月23日

2020年03月18日

2020年12月03日

## 咪唑斯汀缓释片说明书

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：咪唑斯汀缓释片

商品名称：皿治林

英文名称：Mizolastine Sustained Release Tablets

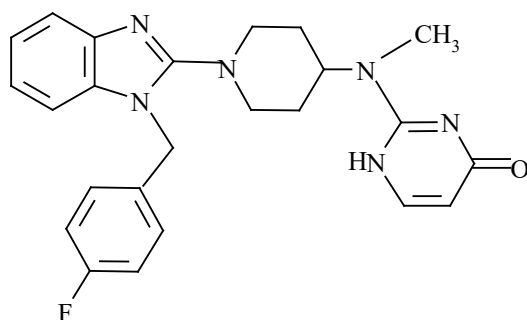
汉语拼音：Mizuositing Huanshipian

### 【成份】

活性成份：咪唑斯汀

化学名称：2-[[[1-[(4-氟苯基)甲基]-1氢-苯并咪唑-2-基]-4-哌啶基]甲基-氨基]-4(3-氢)-嘧啶酮

化学结构式：



分子式：C<sub>24</sub>H<sub>25</sub>FN<sub>6</sub>O

分子量：432.5

## 【性状】

本品为白色包衣片。

## 【适应症】

本品是长效的组胺 H1 受体拮抗剂，适用于成人或 12 岁以上的儿童所患的荨麻疹等皮肤过敏症状、季节性过敏性鼻炎（花粉症）及常年性过敏性鼻炎。

## 【规格】

10mg

## 【用法用量】

口服。

成人（包括老年人）和 12 岁以上儿童：每日 1 次，每次 1 片（10mg）。

或遵医嘱服用。

本品为缓释薄膜衣片，不能掰开服用。

## 【不良反应】

本药可能会使个别患者产生不良反应，根据频率由高至低依次为：

- 常见：腹泻、腹痛（包括消化不良）、口干、头痛、头晕、恶心、困意和乏力（通常为一过性的）、食欲增加并伴有体重增加。
- 偶见：低血压、心动过速、心悸、焦虑、抑郁、肝酶升高、关节痛、肌痛。
- 极个别病例：迷走神经异常（可能引起晕厥）、白细胞计数降低。
- 十分罕见：血管迷走神经发作、低中性粒细胞计数、过敏反应包括速发过敏反应、血管性水肿、全身性皮炎、荨麻疹、瘙痒和低血压。
- 有支气管痉挛以及哮喘加重的报道。但考虑到治疗人群中哮喘的发生率较高，因此尚不能确定与咪唑斯汀的相关性。
- 与某些抗组胺药物合用时，曾观察到 QT 间期延长的现象，这会增加高危人群发生严重心律失常的风险。
- 极罕见血糖或电解质水平的轻微变化，即使在健康人中发生此类轻微变化，其临床意义也不清楚。对于高危患者（特别是糖尿病、怀疑有电解质失衡和心律失常的患者），应对适当指标进行定期监测。
- 由于本品含有蓖麻油，可能会引起消化道不适，如恶心、呕吐和腹痛。治疗期间如出现不良反应请与医生联系。

## 【禁忌】

本药禁用于下列情况：

- 对本品任何一种成份过敏。
- 严重的肝功能损害。
- 与咪唑类抗真菌药（全身用药）或大环内酯类抗生素合用。
- 与已知可延长 QT 间期的药物合用，如：I类和 III 类抗心律失常药。
- 晕厥病史。
- 严重的心脏病或有心律失常（心动过缓、心律不齐或心动过速）病史。
- 明显或可疑 QT 间期延长或电解质失衡，特别是低血钾。
- 严重心动过缓。

如有疑问请征询医生或药剂师的意见。

## 【注意事项】

- 在个别病例中观察到，咪唑斯汀具有轻微的延长 QT 间期的可能性，该延长作用的程度适度，不伴随心脏节律紊乱。
- 如有心脏病、心源性不适或心悸病史，用药前请征求医生的意见。
- 大多数服用咪唑斯汀的患者可以驾驶或完成需要精神集中的工作。但为了识别个体是否对药物特殊敏感，建议在驾驶和进行复杂工作之前对个体进行评估。
- 如有疑问，请向医生或药师咨询。
- 置于儿童不易拿到处。

## 【孕妇及哺乳期妇女用药】

妊娠

孕妇使用咪唑斯汀的安全性尚未建立。动物试验未显示咪唑斯汀在妊娠期、围产期及产后期对胚胎或胎仔的发育有直接或间接的毒性。目前尚无孕妇使用咪唑斯汀的有关致畸性和胎儿毒性的充分资料，但和其它药物一样，孕期尤其前三个月不建议使用。

哺乳

尚缺乏用药后咪唑斯汀在母乳中浓度的资料，因此不建议在哺乳期使用。

## 【儿童用药】

尚无 12 岁以下儿童用药方面的资料。

## 【老年用药】

老年患者用药同成人。

老年患者可能对咪唑斯汀潜在的镇静作用和对心脏复极化作用较为敏感。

## 【药物相互作用】

尽管本品口服利用度较高，且主要通过葡萄糖醛酸化代谢，但与全身给药的咪唑类抗真菌药（如酮康唑）或大环内酯类抗生素（如红霉素、醋竹桃霉素、克拉霉素或交沙霉素）同时使用时，咪唑斯汀的血浆浓度会有一定程度的升高。因此本品不应与上述药物合用。

与肝氧化酶 CYP3A4 的强效抑制剂或底物合用，应谨慎。这些底物有：西咪替丁、环孢菌素、硝苯地平等。

研究显示咪唑斯汀不会加重酒精引起的镇静和行为异常。

服用多种药物时，为避免可能出现的药物间相互作用，请与医生或药剂师联系。

## 【药物过量】

发生药物过量时，建议在用常规方法清除未吸收药物的同时，进行至少 24 小时的包括心脏监测（QT 间期和心率）在内的全面症状监护。

对肾功能损害患者研究的结果表明，血液透析不会增加药物的清除。

## 【药理毒理】

### 1. 药理作用

咪唑斯汀具有独特的抗组胺和抗过敏反应炎症介质的双重作用。体内和体外药理学试验均表明咪唑斯汀是一种强效的、高选择性的组胺 H<sub>1</sub> 受体拮抗剂。在利用过敏反应动物模型进行的试验中，咪唑斯汀还可抑制活化的肥大细胞释放组胺（0.3mg/kg，口服）以及抑制嗜中性粒细胞等炎性细胞的趋化作用（3mg/kg，口服）。同时，咪唑斯汀还抑制变态反应时细胞间粘附性分子-1 的释放。药理试验显示咪唑斯汀具有抗炎活性，这可能与其具有抑制 5-脂肪氧合酶的作用有关。

人体内进行的组胺诱导的风团和红斑研究显示，给予本品 10mg 后，其抗组胺作用迅速、强效（4 小时后抑制 80% 症状）和持久（24 小时）。长疗程给药后，未发生耐药现象。

临床前及临床研究均表明咪唑斯汀在抗组胺剂量下没有抗胆碱能作用和镇静作用。

### 2. 毒理研究

对若干种属动物的研究显示，在咪唑斯汀剂量超过治疗剂量 10~20 倍时，仅出现对心脏复极化的影响。在对清醒的犬进行的试验显示，在 70 倍于治疗剂量下，心电图结果显示了咪唑斯汀与酮康唑的药理学相互作用。

## 【药代动力学】

本品口服后吸收迅速，血浆浓度达峰时间( $T_{max}$ )中值为 1.5 小时，生物利用度约为 65%，药代动力学呈线性，平均消除半衰期为 13.0 小时，血浆蛋白结合率约为 98.4%。

在肝功能损害的患者体内，咪唑斯汀的吸收减慢，分布相延长，药时曲线下面积 (AUC) 增加 50%。

咪唑斯汀主要在肝脏通过葡萄糖醛酸化进行代谢，其它代谢途径之一是通过细胞色素 P450 3A4 酶形成羟基化代谢产物。本品的代谢产物均无药理活性。

在与酮康唑和全身性给药的红霉素合并用药的研究中，可观察到咪唑斯汀的血浆浓度有所升高，与单剂量单独口服咪唑斯汀 15~20mg 的血浆浓度相当。

在对健康志愿者进行的研究中，未发现本品可与食物、华法令、地高辛、茶碱、氯羟安定或硫氮草酮产生具有临床意义的相互作用。

#### **【贮藏】**

密闭保存。

#### **【包装】**

铝铝水泡板包装：7 片/盒、15 片/盒

#### **【有效期】**

24 个月

#### **【执行标准】**

JX20160275

#### **【批准文号】**

进口药品注册证号：H20171170

进口药品分装批准文号：国药准字 J20171079

#### **【上市许可持有人】**

名 称：Therabel Pharmaceuticals Limited

注册地址：1A Shelbourne House, Shelbourne Road, Ballsbridge, Dublin 4, Ireland

#### **【生产企业】**

企业名称：Sanofi Winthrop Industrie

生产地址：30 a 36 avenue Gustave Eiffel, 37 100 TOURS, FRANCE

**【分装企业】**

名称：赛诺菲（杭州）制药有限公司

Sanofi (Hangzhou) Pharmaceutical Co., Ltd.

地址：杭州市滨江区江陵路 325 号

传真：0571-88076189

产品咨询电话：800(400)-820-8884