皿治林 PDF转换可能丢失图片或格式,建议阅读原文 https://www.100test.com/kao_ti2020/314/2021_2022__E7_9A_BF_ E6_B2_BB_E6_9E_97_c22_314524.htm 药品名称皿治林药物别 名咪唑斯汀缓释薄膜衣片 英文名称mizolastine 类别耳鼻喉科 及口腔科用药制剂白色,椭圆形。10mg/片分子式成分2[[[1 (4-氟苯基)甲基]-1]氢-苯并咪唑-2-基]-4-哌啶基]甲基-氨 基14-(3氢)-嘧啶酮,分子式C24H25FN6O,相对分子质 量432.5。药理毒理咪唑斯汀具有独特的抗组胺和抗其他炎症 介质的双重作用,是一种强效和高度选择性的H1受体拮抗剂 咪唑斯汀可抑制活化的肥大细胞释放组胺及抑制炎性细胞 的趋化作用,同时,还抑制变态反应时细胞间粘附性分子-1 的释放。此外,咪唑斯汀具有抗炎活性,这可能是与其具有 抑制5-脂肪氧合酶的作用有关。咪唑斯汀在抗组胺剂量下没 有抗胆碱作用和镇静作用。 咪唑斯汀单次给药的急性毒性很 弱,大多数动物的最大非致死量达5000mgkg-1,对大鼠和非 人类灵长类动物用50mgkg-1d-1,用药1年,耐受性良好。在 生殖毒性研究中,咪唑斯汀对大鼠(剂量分别为525 和125mgkg-1d-1)和兔(剂量分别为535和245mgkg-1d-1)未 产生任何胚胎毒性和致畸作用。咪唑斯汀无致突变和致癌性 。药 动 学健康志愿者单剂量口服10mg咪唑斯汀片后,吸收迅 速,达峰时间为1.5h,血药浓度峰值为276ngmL-1,平均消除 半衰期为13.0h。咪唑斯汀的生物利用度约为65.5%,不受食物 和酒精的影响。其与血浆蛋白的结合率较高,约为98.4%。 咪 唑斯汀主要在肝脏经葡萄糖醛酸化代谢,其他代谢途径包括 由CYP3A4酶参与的芳香羟基化,以及脱4-氟苯基后的N-去烷 基化的嘧啶酮的甲基化,已确定的代谢产物均无药理活性。

只有极少量(0.5%)的药物以原形从尿中排出。适应症成人 或12岁以上的儿童所患的季节性过敏性鼻炎(花粉症)、常 年性过敏鼻炎及荨麻疹等皮肤过敏症状不良反应本药可能会 使个别患者产生的不良反应有:头痛、乏力、口干、胃肠功 能紊乱(腹泻或消化不良)、困意、低血压、焦虑、抑郁及 白细胞计数、血糖和电解质的轻度异常(罕见)。相互作用 本药不能与咪唑抗真菌类(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 。在同时使用西咪替丁、环孢素和心痛定时应非凡引起注重 说明【临床评价】在法国的一项双盲对照试验中#093.,61 例患有原发慢性风疹的患者中,随机分为咪唑斯汀组26例和 氯雷他定(Ioratadine)组25例,剂量均为10mg,po,qd,治疗周 期28d。 皮肤瘙痒程度采用视觉模拟法 (Visual Analogue Score, VAS) 积分表示。结果显示,每周疾病发作次数,咪唑 斯汀组是(5.6±16.3)次,氯雷他定组是(6.4±12.4)次 。VAS积分下降程度,咪唑斯汀组为(30.2 ± 39.0) mm,氯 雷他定组为(30.5 ± 28.5) mm。在整个治疗期间,患者疾病 发作次数和VAS积分下降,咪唑斯汀组要高于氯雷他定组。 试验证实,咪唑斯汀和氯雷他定都能改善过敏症状,但相比 之下,咪唑斯汀的疗效更加快速和持久。在另一项法国完成 的对照双盲目试验中#093.,咪唑斯汀组88例,氯雷他定组79 例,安慰剂组80例,剂量均为口服10mg,qd,治疗时间4周。 结果表明,咪唑斯汀组和氯雷他定组VAS积分显著下降(咪 唑斯汀组为36.7mm,P#061.0.0071;安慰剂组为16.3mm),并 且一直维持到治疗结束,其中咪唑斯汀组更为明显 (P#061.0.0061; 氯雷他定组8.3次, P=.0.0221; 安慰剂

组13.3次)。试验表明,咪唑斯汀组从d1开始,与其他2组比较,过敏症状的改善快速而且疗效好。用法用量po,qd或遵医嘱服用。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24h的包括QT间期和心律的心脏监测在内的全面症状监护。对肾功能不全的患者研究的结果表明,血液透析不会增加药物的清除。注重事项 本药禁用于下列情况:对本药任何一种成分过敏:严重的肝病;与咪唑类抗真菌药或大环内酯类抗生素同时使用;晕厥病史;严重的心脏病、心律失常(心动过缓、心律不剂或心悸)、心电图异常(明显或可疑QT间期延长)或低血钾。 如有心脏病、心源性不适或心悸病史。 孕期尤其前3个月和哺乳期不建议使用。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