

核准日期: 2006 年 09 月 04 日
修改日期: 2014 年 09 月 26 日
2019 年 06 月 25 日
2023 年 03 月 20 日



盐酸左西替利嗪片说明书

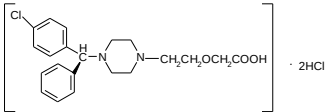
请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

【药品名称】

通用名称: 盐酸左西替利嗪片
商品名称: 西可新[®]
英文名称: Levocetirizine Dihydrochloride Tablets
汉语拼音: Yansuan Zuoxitiliqin Pian

【成份】

活性成份: 盐酸左西替利嗪
化学名称: [2-[4-[(R)-(4-氯-苯基)-苯甲基]-1-哌嗪基]乙氧基]乙酸二盐酸盐
化学结构式:



分子式: C₂₁H₂₅ClN₂O₃·2HCl
分子量: 461.8

【性状】

本品为薄膜衣片, 除去包衣后显白色或类白色。

【适应症】

治疗下述疾病的过敏相关症状, 如季节性过敏性鼻炎、常年性过敏性鼻炎、慢性特发性荨麻疹。

【规格】

5mg

【用法用量】

成人、6 岁及以上儿童: 每日口服 1 片 (5mg), 空腹或餐中或餐后均可服用。

肾功能损害的患者: 轻度肾功能损害患者无需调整剂量, 中重度肾功能损害患者用法用量根据下表调整:

病人肾功能状态 肌酐清除率 (ml/min) a 剂量和服药次数
中度肾功能损害 30-49 每 2 日一次, 5mg
重度肾功能损害 <30 每 3 日一次, 5mg
肾透析患者采用透析疗法的患者 <10 禁忌症

a. 血清肌酐清除率 = $\frac{[140 - \text{年龄}(\text{年})] \times \text{体重}(\text{kg})}{72 \times \text{血清肌酐}(\text{mg/dl})} \times \{0.85 (\text{女性患者系数})\}$

肝功能损害患者: 仅有肝功能损害的患者, 无需调整给药剂量; 如伴有肾功能损害的患者, 请参照“肾功能损害患者”的用法用量。

老年患者: 对于中度和重度肾功能损害的老年病人, 建议调整给药剂量, 请参照“肾功能损害患者”的用法用量。

【不良反应】

原研产品临床研究

儿科患者:

原研产品在 6-11 月龄和 1-6 岁儿科患者中完成两项安慰剂对照研究, 159 例受试者暴露的暴露量为左西替利嗪每日 1.25mg, 共给药 2 周, 每日 2 次, 每次 1.25mg。在安慰剂对照组或左西替利嗪治疗组中, 下述药物不良反应的发生率为 1% 或 1% 以上。

系统器官分类和首选术语	安慰剂 (n=83)	左西替利嗪 (n=159)
胃肠道疾病		
腹泻	0	3(1.9%)
呕吐	1(1.2%)	1(0.6%)
便秘	0	2(1.3%)
神经系统疾病		
嗜睡	2(2.4%)	3(1.9%)
精神疾病		
睡眠障碍	0	2(1.3%)

原研产品在 6-12 岁患儿完成的一项双盲安慰剂对照研究, 有 243 例患儿暴露给药时间不等 (1 周-13 周) 的 5mg 左西替利嗪。在安慰剂对照组或左西替利嗪治疗组中, 下述药物不良反应的发生率为 1% 或 1% 以上。

首选术语	安慰剂 (n=240)	5mg 左西替利嗪 (n=243)
头痛	5(2.1%)	2(0.8%)
困倦	1(0.4%)	7(2.9%)

成人和 12 岁以上的儿童:

原研产品在 12-71 岁男女患者完成的治疗性研究 5mg 左西替利嗪治疗组和安慰剂对照组中, 分别有 15.1% 患者、11.3% 患者发生至少 1 例次药物不良反应。91.6% 药物不良反应的严重性为轻度至中度。在治疗性研究 5mg 左西替利嗪治疗组和安慰剂对照组中, 因不良事件而造成的脱落率分别为 1.0% (9/935) 和 1.8% (14/771)。

原研左西替利嗪的临床治疗性研究包括每日暴露 5mg 本品的 935 例受试者。汇总分析后, 5mg 左西替利嗪治疗组或安慰剂对照组中发生率为 1% 或 1% 以上 (常见: $\geq 1/100$, $< 1/10$) 的药物不良反应报道如下:

首选术语 (WHOART)	安慰剂 (n=771)	5mg 左西替利嗪 (n=935)
头痛	25(3.2%)	24(2.6%)
嗜睡	11(1.4%)	49(5.2%)
口干	12(1.6%)	24(2.6%)
疲乏	9(1.2%)	23(2.5%)

进一步观察到发生不常见不良反应 (不常见: $\geq 1/1000$, $< 1/100$) (比如: 乏力或腹痛)。

与安慰剂对照组相比 (3.1%), 下述镇静性药物不良反应在 5mg 左西替利嗪治疗组中发生率更高 (8.1%): 嗜睡、疲乏、乏力。

原研产品上市后经验

除临床研究期间报道的不良反应及上述不良反应外, 已在原研产品上市后经验中报道下述药物不良反应。由于数据不足, 因而无法预估这些不良反应在所治疗人群中的发生率。

- 免疫系统疾病: 超敏反应, 包括过敏性反应
- 代谢和营养疾病: 食欲增加
- 精神疾病: 焦虑、攻击性、情绪激动、幻觉、抑郁、失眠、自杀意念、噩梦
- 神经系统疾病: 惊厥、静脉窦血栓、感觉异常、头晕、晕厥、震颤、味觉障碍
- 耳朵和迷路疾病: 眩晕
- 视觉系统: 炎症、视力障碍、视力模糊
- 心脏疾病: 心绞痛、心悸、心动过速
- 血管疾病: 颈静脉栓塞
- 呼吸、胸廓和纵膈疾病: 鼻炎加重、呼吸困难
- 胃肠道疾病: 恶心、呕吐
- 肝胆疾病: 肝炎
- 肾脏和泌尿系统疾病: 排尿困难、尿滞留
- 皮肤和皮下组织疾病: 血管神经性水肿、皮疹、毛发稀少、固定药疹、瘙痒、皮疹、皸裂、荨麻疹、光敏反应/毒性
- 全身不适: 药物治疗无效、药物相互作用、粘膜干燥
- 骨骼肌、结缔组织和骨骼疾病: 肌痛, 关节痛

- 全身疾病和给药部位：水肿
- 干扰检测方法：交叉反应性
- 体格检查：体重增加、肝功能检验结果异常
- 选定不良反应的描述：
- 有报道在停止使用本品后，少数患者出现瘙痒。

【禁忌】

禁用于对左西替利嗪或本品任何成分过敏者或轻咳，咳嗽类衍生物过敏者。

禁用于肌酐清除率<10ml/分钟的肾病晚期患者。

禁用于伴有特殊遗传性疾病（包括患有罕见的半乳糖不耐受症、原发性乳糖酶缺乏（Lapp lactase）或葡萄糖-半乳糖吸收、不良）的患者。

【注意事项】

1、不建议6岁以下儿童使用本品，由于目前可使用的该产品的薄膜包衣片仍无法允许调整剂量。

2、建议饮酒后应谨慎使用。

3、有尿潴留诱发因素（例如：脊髓损伤、前列腺增生）的患者应谨慎用药，因为左西替利嗪可能增加尿潴留风险。

4、对驾驶和操作机械能力的影响：左西替利嗪可能导致嗜睡加重。因此，本品会影响车辆驾驶能力和机器操作能力。合并服用酒精或其他中枢神经系统抑制剂可能导致其警戒性降低和操作能力削弱。

5、有癫痫和惊厥风险的患者应谨慎用药，因为左西替利嗪可能会引起癫痫发作加重。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

孕妇

目前仅获得了有限的研究数据（前瞻性地采集自300例妊娠结局研究病例的数据），且这些结果均表明与左西替利嗪的畸形或胎儿/新生儿毒性不存在明确的因果关系。动物研究未表明存在妊娠、胚胎/胎儿发育、分娩和产后发育方面的直接或间接有害影响。孕妇慎用。

哺乳期

尽管尚未获得有关左西替利嗪是否分泌到乳汁中的数据，但鉴于左西替利嗪分泌到乳汁中，因此预期前者也会分泌到乳汁。不得在哺乳期使用左西替利嗪。

生育力

尚未获得有关左西替利嗪对生育力影响的临床数据，也不存在生育力影响方面的动物数据。

【儿童用药】

患【用法用量】项。在肾功能受损的儿童患者中，应基于患者的肾清除率和体重对剂量进行个体化调整。

【老年用药】

患【用法用量】项。

【药物相互作用】

目前尚无关于左西替利嗪的药物相互作用的研究（包括没有CYP3A4诱导剂的研究；此前对于西替利嗪溶旋体的研究显示其没有临床相关的药物间不良反应（与安替比林、伪麻黄碱、西咪替丁、酮康唑、红霉素、阿奇霉素、格列吡酮、地西洋））。在一项多剂量西替利嗪合用茶碱（400mg/日）的研究中发现，西替利嗪的清除率下降了16%，而茶碱的清除并未因为合用西替利嗪而改变。在一项利托那韦（每次600mg，每日两次）与西替利嗪（每日10mg）的多次给药研究中，西替利嗪的暴露程度增加了约40%，而利托那韦的分布也在联合用药时出现轻微改变（-11%）。尽管研究已表明外消旋体西替利嗪不会增强酒精（0.5 g/l的血浆水平）的作用，但西替利嗪与西替利嗪与酒精或其他中枢神经抑制剂的合用可能会导致警觉性的进一步降低并影响精神表现。进食可能会导致左西替利嗪的吸收速率下降，吸收程度不会降低。

【药物过量】

症状：成人嗜睡，儿童为起初兴奋，随后嗜睡。

处理：尚无特效的解毒剂。过量服用本品后，建议采取对症支持及支持性治疗；如刚服用可考虑洗胃；透析不能完全去除左西替利嗪。

【药理毒理】

药理作用

药理作用

本品为口服选择性组胺H1受体拮抗剂。无明显抗胆碱

和抗5-羟色胺的作用，中枢抑制作用较小。

毒理研究

遗传毒性：

本品Ames试验、人淋巴细胞染色体畸变试验、小鼠淋巴瘤试验和大鼠微核试验结果均为阴性。

生殖毒性：

小鼠生育力和一般生殖毒性试验结果提示，西替利嗪经口给药剂量达64mg/kg（按体表面积折算，约相当于成人临床推荐最大日口服剂量的25倍）时，对生育力无损伤。

小鼠、大鼠和兔经口给药剂量分别达96、225和135mg/kg（按体表面积折算，分别约相当于成人临床推荐最大日口服剂量的40、180和220倍）时，均未见致畸作用。但目前尚无充分且严格控制的孕妇临床研究资料。由于动物生殖研究并不总能预测药物对人的影响，所以只有当确实需要时，才可以在怀孕期间服用本品。

哺乳期小鼠（母鼠）经口给药剂量达96mg/kg（按体表面积折算，约相当于成人临床推荐最大日口服剂量的40倍）时，可引起仔鼠体重增长延迟。Beagle犬的研究表明，给药量的大约3%经乳汁排泄。

致癌性：

大鼠连续2年经口给药的致癌性试验中，剂量达20mg/kg（按体表面积折算，约相当于成人临床推荐最大日口服剂量的15倍，或儿童临床推荐最大日剂量的7倍）时，未见致癌性。小鼠连续2年经口给药的致癌性试验中，剂量达16mg/kg（按体表面积折算，约相当于成人临床推荐最大日口服剂量的6倍，或儿童临床推荐最大日剂量的3倍）时，可引起雄性动物良性肝肿瘤的发生率增加；剂量达4mg/kg（按体表面积折算，约相当于成人临床推荐最大日口服剂量的2倍，或相当于儿童临床推荐最大日剂量）时，未见肝肿瘤发生率增加。上述发现的临床意义尚不清楚。

【药代动力学】

左西替利嗪的药代动力学特征是血浆浓度水平和给药剂量呈线性关系，个体间差异小。

左西替利嗪在人体内的吸收迅速且完全，进食可能导致左西替利嗪的吸收速度和血药浓度峰值下降，但是总的吸收度不会降低，左西替利嗪的吸收程度与给药剂量无关。临床试验结果显示5mg左西替利嗪片剂的相对生物利用度近100%，成人给药后约0.9小时血药浓度达到峰值；左西替利嗪和血浆蛋白结合牢固，血浆蛋白结合率约为90%，表观分布容积为0.4L/kg；血浆消除半衰期为7.9±1.9小时，每日一次给药5mg，连续2天后血药浓度达到稳态；单剂量给药5mg后血药浓度峰值为270ng/ml，再次给药5mg后血药浓度稳态峰值为308ng/ml。

左西替利嗪的代谢没有首过效应，其在人体内的代谢率小于给药剂量的14%，因此推测肝酶的个体差异或合并服用肝酶抑制剂对其影响甚微，与其它物质产生相互作用的可能性小。左西替利嗪平均85.4%以原型由尿液排出，12.9%由粪便排出。在吸收和清除的过程中左西替利嗪不会转换为右西替利嗪。

【贮藏】遮光，密封，干燥处保存。

【包装】聚酯/铝/聚乙烯药用复合膜、袋。6片/板×1板/盒，6片/板×2板/盒，6片/板×3板/盒。

【有效期】24个月

【执行标准】YBH06122019

【批准文号】国药准字H20060333

【上市许可持有人】

名称：苏州东瑞制药有限公司

地址：江苏省苏州吴中经济开发区区民丰路268号

【生产企业】

企业名称：苏州东瑞制药有限公司

生产地址：江苏省苏州吴中经济开发区区民丰路268号

邮政编码：215124

电话号码：0512-65626868

传真号码：0512-65626868

网 址：www.dawnrays.com

产品咨询热线：400 030 9000