

核准日期: 2021 年 12 月 27 日
修改日期: 2022 年 01 月 21 日
修改日期: 2022 年 11 月 17 日



依帕司他片说明书

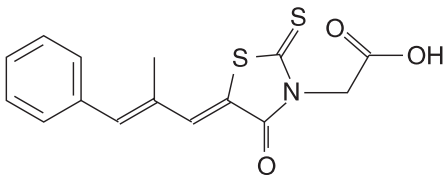
请仔细阅读说明书并在医师指导下使用。

【药品名称】

通用名称: 依帕司他片
英文名称: Epalrestat Tablets
汉语拼音: Yipasita Pian

【成份】

本品主要成份为依帕司他。
其化学名称为: 5-[[[(1Z,2E)-2-甲基-3-苯丙烯叉]-4-氧代-2-硫代-3-噻唑烷乙酸。
其结构式为:



分子式: $C_{15}H_{13}NO_3S_2$
分子量: 319.40

【性状】

本品为棕红色薄膜衣片, 除去包衣后显黄色或橙黄色。

【适应症】

糖尿病性神经病变。

【规格】

50mg

【用法用量】

通常成人剂量, 每次 50mg, 每日三次, 于饭前口服。

【不良反应】

文献报道通过临床试验和上市后监测, 8498 例患者中共有 119 例 (1.4%), 149 例次不良反应 (包括临床实验室检查异常)。其中肝功能异常 32 例 (0.4%), 主要是 AST (GOT)、ALT (GPT) 升高, 腹痛 9 例 (0.1%), 恶心 9 例 (0.1%), 倦怠感 6 例 (0.07%) 等。

严重不良反应

1. 血小板减少

可能会出现血小板减少 (概率不明), 若出现应停止用药。

2. 爆发性肝炎、肝功能损害、黄疸、肝功能衰竭

爆发性肝炎 (概率不明)、显著 AST (GOT)、ALT (GPT) 升高等肝功能异常 (0.04%)、黄疸 (概率不明)、肝功能衰竭 (概率不明) 等。出现这些不良反应后应立即停止用药。

其它不良反应

(1) 过敏: 偶见红斑、水泡、皮疹、瘙痒。

(2) 肝脏: 偶见胆红素、AST (GOT)、ALT (GPT)、 γ -谷氨酰转氨酶 (γ -GTP) 升高。

(3) 消化系统: 偶见腹泻、恶心、呕吐、腹痛、食欲不振、腹部胀满感、胃部不适、便秘。

(4) 肾脏: 偶见肌酐升高, 尿量减少, 尿频 (概率不明)。

(5) 血液系统: 偶见贫血、白细胞减少。

(6) 其他: 偶见倦怠感、头晕、头痛、僵硬、乏力、心悸、浮肿、肿痛、四肢痛感、灼热感、麻木、脱毛、紫斑、CK 升高、发热等概率不明。

【禁忌】

对本品中任何成份过敏者禁用。

【注意事项】

1. 本品应在医生指导下使用, 药品应放置在儿童不能接触的地点, 防止儿童误食。

2. 本品适合糖化血红蛋白 7.0% 以上患者使用。

3. 服用本品后, 尿液可能出现褐色, 因此有些检测项目 (如胆红素、酮体) 可能会受到影响。

4. 过敏体质史者慎用。一旦出现过敏表现, 应立即停药, 并进行适当处理。

5. 连续服用本品 12 周无效的患者应考虑改换其他

治疗。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

目前尚无本品用于妊娠期妇女的安全性资料,因此妊娠期妇女使用本品应当极为慎重,只有在获益大于风险时才可应用。动物实验表明依帕司他可通过乳汁分泌,因此哺乳期妇女应避免使用本品。

【儿童用药】

本品在儿童的安全有效性尚未建立。

【老年用药】

老年患者如有生理机能的改变,使用本品时应考虑适当减量。

【药物相互作用】

尚不明确。

【药物过量】

尚无本品药物过量的报道。

【药理毒理】

药理作用

依帕司他是一种可逆性的醛糖还原酶非竞争性抑制剂,对醛糖还原酶具有选择性抑制作用。临床研究显示,依帕司他能抑制糖尿病性外周神经病变患者红细胞中山梨醇的积累,与对照组比较能改善患者的自觉症状和神经功能障碍。动物试验结果显示,依帕司他显著抑制糖尿病模型大鼠的坐骨神经、视网膜中山梨醇的累积,提高其运动神经传导速度和自主神经机能;在神经形态学上,依帕司他可改善轴突流异常,增加其坐骨神经中有髓神经纤维密度、腓肠神经髓鞘厚度、轴突面积、轴突圆柱率;另外,依帕司他也可改善模型动物坐骨神经的血流并使其肌醇含量回升。

毒理研究

遗传毒性:依帕司他 Ames 试验、CHL 细胞染色体畸变试验、小鼠微核试验结果均为阴性。

生殖毒性:大鼠灌胃给予依帕司他 20、100、500mg/kg,生育力与早期胚胎发育毒性试验、胚胎-胎仔发育毒性试验和围产期毒性试验未见异常;兔胚胎-胎仔发育毒性试验中,灌胃给予 20、100、250、500mg/kg,可见 500mg/kg 剂量下流产及胎仔完全吸收的发生率增加。

致癌性:小鼠掺食法给予依帕司他 300、800、

2000ppm18 个月,大鼠掺食法给予依帕司他 500、1500、5000ppm 24 个月,未见肿瘤发生率明显增加。

【药代动力学】

据文献报道,健康成年人口服本品 50mg,1 小时后达血药浓度峰值(3.9 μ g/mL)。血浆半衰期为 1.8 小时,4 小时后血药浓度为 0.37 μ g/mL。动物实验证实本品主要分布消化道、肝脏及肾脏,24 小时后约有 8% 从尿中排出,80% 左右是从粪便中排出。

【贮藏】

遮光,不超过 30℃密封保存。

【包装】

聚氯乙烯固体药用硬片和药用铝箔:

10 片/板 \times 1 板/盒,

10 片/板 \times 2 板/盒,

10 片/板 \times 3 板/盒。

【有效期】

24 个月

【执行标准】

国家药品监督管理局注册标准 YBH16082021

【批准文号】

国药准字 H20213958

【药品上市许可持有人】

持有人名称:江苏德源药业股份有限公司

持有人地址:连云港经济技术开发区长江路 29 号

邮政编码:222047

电话号码:0518-82342961 82340786

传真号码:0518-82340788

网址:<http://www.pharmdy.com>

【生产企业】

企业名称:江苏德源药业股份有限公司

生产地址:连云港经济技术开发区长江路 29 号

邮政编码:222047

电话号码:0518-82342961 82340786

传真号码:0518-82340788

网址:<http://www.pharmdy.com>