

核准日期：2006 年 8 月 30 日

盐酸洛美利嗪片说明书

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：盐酸洛美利嗪片

商品名称：亚伊加

英文名称：Lomerizine hydrochloride Tablets

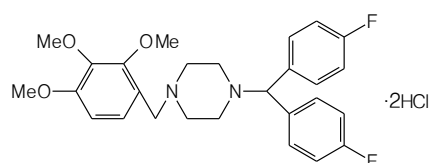
汉语拼音：Yansuan Luomeiliqin Pian

【成份】

本品活性成分为盐酸洛美利嗪。

化学名称：1-[双(4-氟苯基)甲基]-4-(2,3,4-三甲氧苄基)哌嗪二盐酸盐

化学结构式：



分子式： $C_{27}H_{30}F_2N_2O_3 \cdot 2HCl$

分子量：541.47

【性状】本品为白色或类白色片。

【适应症】偏头痛的预防性治疗。

【规格】5mg

【用法用量】成人 1 次 5mg（1 片），一日 2 次，早饭后及晚饭后或睡眠前服用。根据症状适量增减，但 1 日剂量不可超过 20mg（4 片）。

【不良反应】

主要为困倦、眩晕、蹒跚（摇晃）、恶心、发热感 0.3%，另外还可出现实验室检验值的变化：ALT 上升 2.2%、AST 上升 1.7%、GGT 上升 1.4%、LDH 上升 1.1%、AL-P 上升 0.9%。

(1) 严重的不良反应（类似药物）

锥体外系症状、抑郁症：类似化合物（盐酸氟桂利嗪）给药后有导致锥体外系症状和抑郁症的报道，所以对本品必须充分观察，在发现异常时应中止给药，进行适当处理。

(2) 其他不良反应

	1~5%	0.1~1%
精神神经系统		困倦、头疼、头晕、蹒跚（摇晃）
消化器官		恶心、腹痛、腹泻、软便、便秘、食欲不振、上腹疼痛、腹部不适、胃肠损伤、口内炎、口唇粘膜水肿、口腔粘膜水肿
肝脏 ^{注1}	ALT、AST、GGT、LDH 升高	AL-P 上升
过敏症 ^{注2}		皮疹
循环器官		血压下降
泌尿器官		排尿障碍、频尿
其他		发热感、胸痛、疲倦感、不适感、背部刺痛感、出汗、水肿、畏寒发热、乳头肿大

注1、发现异常时，应该停止给药，采取适当方法处理。

注2、 出现这种症状时，停止给药。

【禁忌】以下患者禁用

1. 对本品的成分有过敏史的患者。
2. 颅内出血或有此可能的患者[脑血流量增加会使症状恶化]。
3. 脑梗塞急性期的患者[急性期间病灶部处于代谢障碍状态，伴随非病灶部的血流量增加作用，会导致病灶部的血流量降低]。
4. 孕妇或者有妊娠可能性的妇女禁用[参见（孕期及哺乳期妇女用药）项下]。

【注意事项】

1. 以下患者必须慎用
 - 1) 严重肝功能损伤的患者[本品主要经肝脏代谢，经胆汁排泄、严重肝功能损伤者会维持高的血药浓度]。
 - 2) 疑有QT间期延长的患者（室性心律不齐、QT延长综合症、低钾血症、低钙血症等）[参见（其他注意）项]。
 - 3) 震颤麻痹患者[类似化合物（盐酸氟桂利嗪等）有导致发生锥体外系症状的报道，所以本品会使症状恶化]。
 - 4) 处于抑郁状态或有抑郁病史的患者[据报道，类似化合物（盐酸氟桂利嗪）有导致抑郁症的报道，所以本品也会导致症状恶化]。
 - 5) 老年患者[参加（老年用药）项]。

2. 特别注意

- (1) 本品必须用于偏头痛发作（每月发作2次以上）引起日常生活障碍的患者。
- (2) 由于本品不是缓解头痛发作的药物，因此在本品给药中发现头痛发作时，应根据需要使用头痛发作治疗药（酒石酸麦角胺，无水咖啡因等）。
- (3) 本品给药要充分观察症状的变化，如果由于头痛发作消失、减轻、患者的日常生活障碍消失，应该中止给药，充分权衡继续给药的必要性，症状没有得到改善时，应停止继续给药。
- (4) 因为本品会引起困倦，服用该药的患者必须注意不要从事驾驶等伴有危险性的机械操作工作。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

1. 孕妇，或可能妊娠的妇女不可服用本品[动物试验（大鼠）表明本品有致畸作用（骨骼、外形异常）]。

2. 哺乳妇女

哺乳期妇女不可服用本品，如必须服用时，需避免哺乳。[动物试验（大鼠）表明本品会进入乳汁中]。

【儿童用药】目前尚无儿童用药的安全性资料。

【老年用药】

1. 对老年患者的剂量选择应十分谨慎，主要考虑大多数老年患者可能出现肝功能减退的情况，会导致持续的血药浓度偏高或更高的潜在的安全性风险。

2. 类似化合物（盐酸氟桂利嗪）给药后易导致老年患者锥体外系症状和抑郁症，所以在老年患者用药过程中，需严密监测该反应，一旦发生异常情况时应停止给药，并采取适当的处理方法。

【药物相互作用】合并用降压药会引起相互作用增强，导致血压降低。

【药物过量】目前尚无药物过量的报道，一旦发生过量，可按照药物过量的一般处理原则进行治疗。

【药理毒理】

药理作用

本品为二苯哌嗪类钙通道阻滞剂，具有选择性的脑血管舒张作用。

毒理研究

遗传毒性：微生物回复突变试验、染色体畸变试验和小鼠微核试验结果均为阴性。

生殖毒性：对雄性大鼠生育能力的无毒性剂量为 100mg/kg/日，雌性大鼠的为 30mg/kg/日。大鼠胎仔器官形成期毒性试验显示，雌性大鼠 10mg/kg/日以上的剂量组，可见分娩异常、幼鼠出生率下降；30mg/kg/日剂量组可见母体阴道出血、体重增加抑制和摄食量减少，胎仔死亡数增加、体重减低及以手指缺失为主要表现的外形异常。对母鼠、胎鼠和出生后幼鼠的无毒性剂量为 3mg/kg/日。家兔胎仔器官形成期毒性试验结果显示，5、15、45mg/kg/日三个剂量组给药对母体动物未见明显影响。45mg/kg/日组可见胎仔死亡率上升，存活率下降，未见致畸作用。孕兔的安全剂量为 45mg/kg/日，家兔胎仔的为 15mg/kg/日。大鼠围产期及哺乳期的毒性试验结果显示，30mg/kg/日剂量组可见母体体重增加抑制、分娩障碍，同时可见同组幼鼠出现因哺乳不良而出现的一般状况恶化、体重下降、生存率下降。哺乳期间，给药 10mg/kg/日以上剂量组可见幼鼠有低体重倾向及耳廓分离完成率低下。围产期和哺乳期母鼠的安全剂量为 10mg/kg/日，幼鼠的为 3mg/kg/日。

【药代动力学】

据国外文献报道

1、血药浓度

在健康成人饭后单次口服盐酸洛美利嗪 10mg，血浆中盐酸洛美利嗪的浓度在给药后 4.8 小时达到最高值，消除半衰期为 3.4 小时。空腹给药与饭后给药比较，达峰时间缩短，对其他的药代动力学指标未见影响。

药物速度参数（平均值±标准偏差）

给药量 (mg)	例数	C _{max} (ng/ml)	T _{max} (h)	T _{1/2} (-12h) a)	AUCO-12h (ng.h/ml)
10	6	7.7±2.7	4.8±1.3	3.4±0.6	45.5±15.1

a) 给药后 12 小时消除半衰期

在健康成人 1 日 1 次共 14 日口服盐酸洛美利嗪时血浆中盐酸洛美利嗪浓度在第 10 日前后达到稳定状态， α 相及 β 相的消除半衰期分别是 3.0 小时，108.3 小时。

2、代谢

健康成人单次口服盐酸洛美利嗪 40mg，血浆中除了洛美利嗪，作为代谢物主要有三甲氧基苯甲基的 O-脱甲基物及其葡萄糖醛酸结合物和由哌嗪环的 4 位 N-脱烷基化产生的二苯甲基哌嗪。

（注）本品认可的 1 日剂量可以根据症状适当增减，但不超过 20mg。

3、[参考]动物的吸收、分布、排泄

单次口服 ¹⁴C-盐酸洛美利嗪后，经消化道迅速良好地被吸收（大鼠、狗）。在肺、肝、脂肪、肾上腺、胰脏等组织中高浓度分布（大鼠）。

观察到本品进入到胎仔及乳汁中（大鼠）。单次给药后 5 日内 10% 由尿、85% 由粪排泄（大鼠、狗）。单次给药后 48 小时，胆汁中的排泄率约 70%，其中约 80% 由消化道重新吸收（大鼠）。

【贮藏】密封保存。

【包装】铝塑包装，每盒 12 片×1 板或 2 板。

【有效期】暂定 24 个月。

【执行标准】国家食品药品监督管理局标准（试行）YBH11892006

【批准文号】国药准字 H20060792

【生产企业】

企业名称：江苏亚邦爱普森药业有限公司

生产地址：盐城市响水县城经济开发区

邮政编码：224600

电话号码：0515—86869900

传真号码：0515—86869908