

核准日期: 2025年01月14日
修改日期: 2025年04月30日
修改日期: 2025年06月03日

依帕司他片说明书

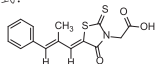
请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

【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】

本品活性成份为依帕司他。
化学名称: 5-[(1Z,2E)-2-甲基-3-苯丙烯叉]-4-氧代-2-硫代-3-噻唑烷乙酸。
化学结构式:



分子式: C₁₅H₁₃NO₃S₂

分子量: 319.40

辅料: 甘露醇、羟丙纤维素、羧甲基纤维素钙、硬脂酸镁、薄膜包衣预混剂。

【性状】

本品为红棕色薄膜衣片, 除去包衣后显橙黄色至橙红色。

【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、脱发、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更换其他治疗。

【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使用。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】

本品在儿童的安全性有效性尚未建立。

【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。

【临床药理】

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(3.9μg/mL)。血浆半衰期为1.8小时, 4小时后血药浓度为0.37μg/mL。动物实验证实本品主要分布于消化道、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。

【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、红细胞、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; 免胚胎-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、5000ppm24个月, 未见肿瘤发生率明显增加。

【贮藏】

遮光, 密封, 不超过30°C保存。

【包装】

药用铝箔和聚乙烯固体药用硬片包装。10片/板, 1板/盒, 10片/板, 2板/盒, 10片/板, 3板/盒

【有效期】

24个月

【执行标准】

国家药品监督管理局药品注册标准编号 YBH33742024

【批准文号】

国药准字H20253176

【上市许可持有人】

名称: 山东新华制药股份有限公司
注册地址: 淄博市高新技术产业开发区化工区
邮政编码: 255000

电话号码: 0533-2166666

传真号码: 0533-2184991

网址: www.xhzy.com

【生产企业】

企业名称: 宁波美诺华天康药业有限公司

生产地址: 浙江省宁波市北仑区大榭街道滨海西路85号

邮政编码: 315812

电话号码: 0574-86778710

网址: www.menovopharm.com

马建华 2025.07.03

九星印刷
Nine Stars

ARTWORK
报告单 / REPORT

上海九星核心商密·长期

N0.01

客户名称: 宁波美诺华天康药业有限公司

产品代码:

纸 张: 70克书纸

尺 寸: 110*180 mm

请对此稿的以下内容进行确认:

☐ 颜色 ☐ 文字 ☐ 尺寸 ☐ 条码 ☐ 刀线

客户签字:

日期:

产品名称: 0301001045_1_02 依帕司他片说明书
202505版

文件路径: W:\制作新区\03说明书\0301001045_1\02

加工工艺: 印刷、切成品、全检、包装

借用信息:

其他信息: YF202506240557

制 作 人: 朱海英

日期: 2025-06-24 条码级别: