

核准日期: 2007年05月11日

修改日期: 2008年09月02日 2013年08月19日 2013年10月23日 2014年07月23日

2015年01月12日 2020年09月04日

尼目克司®

醋甲唑胺片说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

警示语: 严重皮疹

本品为磺胺类药物,可能引起磺胺类药物的皮肤不良反应严重皮疹,需要住院治疗和中断治疗,严重时可危及生命。

携带HLA-B59基因型的亚裔人种为本品严重皮疹不良反应的易感人群,尚未确定其余因素可预测本品引起皮疹的风险或严重程度。有建议认为以下情况会增加出现严重皮疹的风险,但尚未得到证实:**(1) 超过本品的推荐初始剂量, (2) 超说明书推荐剂量使用, (3) 合用本品和糖皮质激素。**

本品引起的严重皮疹主要出现在药物治疗1~21日内,个别病例在用药后几小时开始发生Stevens-Johnson综合征后逐步加重。临床表现为躯干、四肢、眼、嘴唇、口腔等部位出现红斑、破损,继而皮肤及黏膜病变迅速发展并扩散至全身,破损逐渐发展为大疱,自发性破裂,最后干燥结痂或糜烂。

虽然本品也会引起无害性皮疹,但是不能预测哪些皮疹是严重的或威胁生命的。因此,在首次出现皮疹迹象时通常就应立即停用本品,除非可确诊皮疹与此药无关。中断治疗也有可能不能阻止皮疹发展为威胁生命或永久性功能丧失或形成疤痕。

【药品名称】

通用名:醋甲唑胺片

商品名:尼目克司®

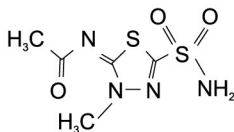
英文名: Methazolamide Tablets

汉语拼音: Cu Jia Zuo' An Pian

【成份】本品主要成份为醋甲唑胺

化学名称: N-(4-甲基-2-氨基磺酰基- Δ^2 -1,3,4-噻二唑啉-5-亚基)乙酰胺。

化学结构式:



分子式: $C_5H_8N_4O_3S_2$

分子量: 236.27

【性状】本品为白色片。

【适应症】降眼压药。

醋甲唑胺适用于慢性开角型青光眼、继发性青光眼。也适用于急性闭角型青光眼的术前治疗。

【规格】(1) 25mg; (2) 50mg

【用法用量】成人口服,初始用药时,每次用25mg,一日二次。早晚饭后各服一次。如用药后降眼压效果不理想,每次剂量可加为50mg,一日二次。

【不良反应】

1、本品属磺胺类药物,可能引起磺胺类药物的皮肤不良反应严重皮疹(参见[警示语])。

曾有报告出现罕见的、严重的、潜在威胁生命的皮疹,包括Stevens-Johnson综合征(SJS)和中毒性表皮坏死松懈症(TEN)。停药后大部分病人可以恢复,但一些患者经历了不可逆性斑痕。

在全球范围内的上市后经验中,SJS/TEN病例报告数量太少,尚不能精确估计其发生率。

一项对1995-2012年醋甲唑胺引起的SJS/TEN国内外文献荟萃分析表明,该ADR可能具有种族倾向性,已知27个病例均来自亚裔人种,欧美未见类似病例,其中16例患者进行了HLA基因型测定,其中15例为HLA-B59基因型,提示醋甲唑胺相关SJS/TEN具有基因敏感性。

有建议认为以下情况会增加出现SJS/TEN的风险,但尚未得到证实: (1) 超过本品的推荐初始剂量, (2) 超说明书推荐剂量使用, (3) 合用本品和糖皮质激素。

2、除严重皮疹外,本品其他不良反应大多发生于治疗早期,包括感觉异常,尤其是四肢末端的麻木感;听力障碍或耳鸣;疲劳;不适;食欲减退;味觉失常;胃肠功能紊乱如恶心、呕吐和腹泻;多尿;以及间断性嗜睡和意识模糊。也可能出现代谢性酸中毒和电解质紊乱。短暂性的近视也有报道,当减少或停止本品治疗后这种现象都会减退。

另有一些不良反应:包括荨麻疹、黑粪症、血尿、糖尿、肝功能不全、软瘫、光敏感、惊厥以及很少发

生的结晶尿和肾结石。

【禁忌】在下列情况下禁用醋甲唑胺:血清钾、钠水平偏低,严重肾、肝疾病或功能不全,肾上腺衰竭以及高血氯性酸中毒。在肝硬变的病人中,使用本品会加速肝性脑病的发生。

患有闭角型青光眼的病人应禁止长期服用醋甲唑胺,因为即使降低眼内压,器质性的闭角也会发生。

【注意事项】

1. 本品为磺胺类药物,对磺胺类药物罕见的严重反应会造成死亡,包括Stevens- Johnson综合征,中毒性表皮坏死松解症,暴发性肝坏死,粒细胞缺乏,再障以及血液恶液质。

2. Stevens-Johnson综合征(SJS,又称重症多形红斑、重型多形渗出性红斑)和中毒性表皮坏死松解症(TEN)在我国已有报道。目前可用HLA-B59基因型检测来预测醋甲唑胺所致SJS/TEN,除HLA-B59基因型外,不排除SJS/TEN与给药方式、联合用药及患者个人身体状态等因素有关。研究表明,皮肤过敏试验不能用于预测此类ADR的发生,醋甲唑胺和磺胺类药物可能也不存在交叉过敏现象。有条件的机构可以进行HLA-B59基因检测,评价患者是否适合使用。

醋甲唑胺诱发SJS/TEN临床表现为躯干、四肢、眼、嘴唇、口腔等部位出现红斑、破损,继而皮肤及黏膜病变迅速发展并扩散至全身,破损逐渐发展为大疱,自发性破裂,最后干燥结痂或糜烂。

本品用药后,应密切关注皮肤不良反应,当患者出现SJS/TEN症状时,应立即停用本品,并尽快安排患者住院治疗,以减少并发症。

3. 再次服用磺胺时,可能发生过敏反应。如果过敏反应或其他严重的反应出现,该药应停止服用。

4. 慎用于有代谢性酸中毒及低血钾危险的患者。

5. 闭角型青光眼不应用醋甲唑胺代替手术治疗,否则可引起永久性粘连性房角关闭。

6. 本品不能长期用于控制眼压。

7. 50mg规格片剂体外药物释放较快,不良反应程度可能有所变化,应注意密切观察。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

本品可引起啮齿类动物畸形,孕妇应避免服用。

尚不清楚本品是否分泌至乳汁中,哺乳期妇女使用本品治疗,应停止哺乳。

【儿童用药】本品对儿童的安全性和疗效尚不清楚。

【老年患者用药】老年人和成年人对本品有很好的耐受性,故本品适用于老年患者。

【药物相互作用】

1. 碳酸酐酶抑制剂与高剂量阿斯匹林合用可引起严重的代谢紊乱。因此,本品与水杨酸制剂合用要慎重。

2. 低剂量醋甲唑胺本身不引起低血钾,但碳酸酐酶抑制剂可增加其他药物的排钾作用。

3. 与促肾上腺皮质激素、糖皮质激素联合使用,可以导致严重的低血钾,在联合用药时应注意监护血清钾的浓度及心脏功能。亦应估计到长期同时使用有增加低血钙的危险,可以造成骨质疏松,因为这些药增加钙的排泄。

【药物过量】本品因过量服用引起急性中毒目前没有报道,动物试验证明本品高剂量给药没有毒性。目前尚无特效解毒剂,当发生急性中毒时应立即停药及对症治疗。

【药理毒理】本品为碳酸酐酶抑制剂。通过抑制睫状体中的碳酸酐酶,使房水形成减少,从而降低眼内压。对醋甲唑胺进行口服和腹腔注射,两种途径的小鼠LD50测定,测得醋甲唑胺小鼠口服的LD50和95%可信限分别为2525.86(2250.49~2834.92)mg/kg,小鼠腹腔注射的LD50和95%可信限分别为1270.54(1118.16~1443.69)mg/kg。

【药代动力学】本品口服后吸收迅速,给药后1-2小时即可达到最高血药浓度。25mgB.i.d、50mgB.i.d、100mgB.i.d多剂量给药药代动力学研究显示,血药浓度和给药剂量存在线性关系。25mg、50mg、100mgB.i.d血药浓度峰值分别为2.5µg/ml、5.1µg/ml和10.7µg/ml。其药时曲线下面积(AUC)分别为1130µg.min/ml、2571µg.min/ml和5418µg.min/ml。

醋甲唑胺分布到全身各组织,包括血浆、脑脊液、房水、红细胞、胆汁、细胞外液。平均表现分布容积为17~23L。约55%的醋甲唑胺与血浆蛋白结合。

本品达到稳定后,血浆消除半衰期为14小时,约25%在给药期间以原形从尿中排出。

【贮藏】密封,在干燥处保存。

【包装】铝塑包装,10片/板

【有效期】36个月

【执行标准】WS₃-(X-060)-2013Z

【批准文号】(1) 国药准字H20000035(25mg) (2) 国药准字H20083760(50mg)

【药品上市许可持有人】

【生产企业】

名称:杭州仟源保灵药业有限公司

企业名称:杭州仟源保灵药业有限公司

注册地址:浙江省杭州市钱塘新区23号大街668号

生产地址:浙江省杭州市钱塘新区23号大街668号

邮政编码:310018

邮政编码:310018

电话号码:0571-85318276

电话号码:0571-85318276

网址:www.cybl-pharm.com

网址:www.cybl-pharm.com