

170mm

148mm

核准日期：2009年03月23日
修改日期：2013年01月03日
2013年06月17日
2015年07月03日
2016年01月20日
2019年03月21日
2020年12月01日
2021年03月01日
2023年05月22日
2024年05月22日

仙达安®

盐酸西替利嗪口服溶液说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用。

【药品名称】

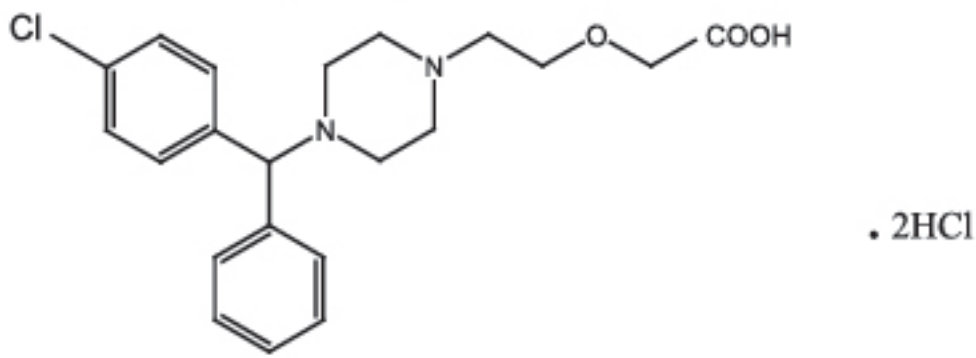
通用名称：盐酸西替利嗪口服溶液
英文名称：Cetirizine Hydrochloride Oral Solution
汉语拼音：Yansuan Xitiliqin Koufuruongye

【成份】

本品主要成份为盐酸西替利嗪。辅料为：羟苯甲酯、羟苯丙酯、山梨醇溶液（70%）、甘油、三氯蔗糖、冰醋酸、醋酸钠、食品用香精（什锦水果）。

化学名称：(RS)-2-[2- (4- (对氯-苯基)苄基)-1-哌嗪基]乙氧基]醋酸二盐酸盐。

化学结构式为：



分子式：C₂₁H₂₅ClN₂O₃·2HCl
分子量：461.8

【性状】

本品为无色的澄清液体。

【适应症】

季节性过敏性鼻炎、常年性过敏性鼻炎、过敏性结膜炎及过敏引起的瘙痒和荨麻疹的对症治疗。

【规格】

10ml：10mg

【用法用量】

推荐儿童使用。

6岁及6岁以上儿童：在大多数情况下，推荐剂量为每日10mg (10ml)，一次口服。若患者对不良反应较为敏感，可每日早晚各服一次，每次5mg (5ml)。

2~5岁的儿童：5mg (5ml)/次，每日一次；或2.5mg (2.5ml)/次，每日两次。

6个月~未满2岁儿童：早上和晚上各服用2.5mg (2.5ml)。

肝、肾功能损害患者的剂量调整：12岁以上 (含12岁) 的肾功能降低 (肌酐清除率为11~31ml/min) 患者、血液透析患者 (肌酐清除率小于7ml/min) 和肝功能损害患者，推荐剂量为5mg、每日一次。肝或肾功能损害的6~11岁儿童患者应使用较低的推荐剂量。因难以准确服用2.5mg以下剂量，并且缺乏6岁以下肝或肾功能损害的儿童患者的药代动力学及安全性信息，因此不推荐在6岁以下肝或肾功能损害的儿童患者中使用盐酸西替利嗪。

【不良反应】

在国外进行了6000多例12岁以上患者参与的对照和非对照临床试验，其中3900多例每日给予5mg~20mg盐酸西替利嗪。治疗期从1周到6个月，平均暴露时间为30天。

盐酸西替利嗪治疗期间报告的大部分不良反应多为轻微或中度。在安慰剂对照的临床试验中，在服用5mg或10mg盐酸西替利嗪的患者中，由于不良反应而中断治疗的发生率相比安慰剂无明显区别 (分别为2.9%和2.4%)。

在12岁以上患者中，盐酸西替利嗪相比安慰剂更频繁发生的常见不良反应是嗜睡。嗜睡的发生率与盐酸西替利嗪剂量相关，安慰剂为6%，5mg剂量为11%，10mg剂量为14%。

因嗜睡而终止盐酸西替利嗪治疗并不常见 (盐酸西替利嗪为1.0%，安慰剂为0.6%)。疲劳和口干似乎也是与治疗相关的不良反应。不良反应的发生率在年龄、种族、性别或体重这些因素间无差异。

表1. 国外盐酸西替利嗪临床试验 (最大剂量10mg) 中报告在12岁以上患者中发生率大于或等于2%的不良反

不良反	盐酸西替利嗪 (N=2034)	安慰剂 (N=1612)
嗜睡	13. 7	6. 3
疲劳	5. 9	2. 6
口干	5. 0	2. 3
咽炎	2. 0	1. 9
头晕	2. 0	1. 2

表1列举了在国外进行的5mg和10mg盐酸西替利嗪安慰剂对照试验中，12岁以上患者中相比安慰剂更常见的不良反应。此外，头疼和恶心在患者中的发生率高于2%，但在安慰剂组中发生率更高。

已进行了盐酸西替利嗪在儿童中的研究。超过1300例6个月至11岁的儿童患者参与了在国外进行的对照和非对照临床试验，其中900多例每日接受1. 25mg至10mg剂量的盐酸西替利嗪。治疗周期持续2至12周。为期4周的安慰剂对照的试验中有16例2岁至5岁儿童患者给予西替利嗪，大部分每日服用5mg一次。一项18个月的安慰剂对照试验中有399例12个月至24个月的患者用西替利嗪治疗 (0. 25mg/kg，每日两次)，另一项7天的安慰剂对照试验中有42例6个月至11个月的患者用西替利嗪治疗 (0. 25mg/kg，每日两次)。

2岁至11岁儿童患者中报道的主要不良反应是轻微或中度的。在安慰剂对照的试验中，接受高达10mg盐酸西替利嗪的儿童患者罕见发生由于不良反应而终止治疗 (盐酸西替利嗪0. 4%对比安慰剂1. 0%)。

表2. 国外6个月~11岁儿童患者盐酸西替利嗪临床试验 (5mg或10mg剂量) 中治疗组发生率≥2%，同时比安慰剂组发生率高的不良反应

不良反	安慰剂 (N=309)	盐酸西替利嗪	
		5mg (N=161)	10mg (N=215)
头疼	12. 3%	11. 0%	14. 0%
咽炎	2. 9%	6. 2%	2. 8%
腹痛	1. 9%	4. 4%	5. 6%
咳嗽	3. 9%	4. 4%	2. 8%
嗜睡	1. 3%	1. 9%	1. 9%
腹泻	2. 9%	3. 1%	1. 9%
鼻出血	1. 9%	3. 7%	1. 9%
支气管痉挛	1. 9%	3. 1%	1. 9%
恶心	1. 9%	1. 9%	2. 8%
呕吐	1. 0%	2. 5%	2. 3%

表2列举了在国外进行的6个月至11岁儿童患者接受5mg和10mg盐酸西替利嗪的安慰剂对照试验中相比安慰剂更常见的不良反应。其中，腹痛被认为是与治疗相关的，同时嗜睡似乎是和剂量相关的，安慰剂为1. 3%，5mg剂量为1. 9%，10mg剂量为4. 2%。2岁至5岁儿童患者的安慰剂对照试验中报道的不良反应在数量上与在6个月至11岁儿童试验中报道的相似，频率也基本相似。

在安慰剂对照的6个月至24个月儿童患者的试验中，不良反应的发生率在各治疗组中相当。接受西替利嗪和接受安慰剂的患者在嗜睡的发生率基本是相同的。一项在6个月~11个月儿童中持续1周的研究表明：接受西替利嗪的患者比接受安慰剂的患者表现出更多的易怒和烦躁。一项在12个月以上儿童中持续18个月的研究表明：与接受安慰剂的患者相比，接受西替利嗪的患者更易发生失眠 (9. 0%对比5. 3%)。每天接受5mg或更高剂量西替利嗪的患者相比接受安慰剂的患者，疲劳 (3. 6%对比1. 3%) 和不适 (3. 6%对比1. 8%) 更易发生。

在美国进行的临床试验中，接受盐酸西替利嗪的3982名成人和12岁以上儿童或659名6个月至11岁儿童患者中很少观察到下列事件 (低于2%)，其中包含一项持续6个月的开放性成人试验。不常见事件和盐酸西替利嗪治疗间的因果关系尚未建立。

自主神经系统：厌食、面部潮红、流涎增多、尿滞留。

心血管：心力衰竭、高血压、心悸、心动过速。

中枢和外周神经系统：异常共济失调、共济失调、迷乱、发声困难、感觉过敏、多动、肌张力过高、感觉迟钝、腿部肌肉痉挛、偏头痛、脊髓炎、瘫痪、感觉异常、上睑下垂、晕厥、震颤、抽搐、眩晕、视野缺损。

胃肠道：肝功能异常、龋齿加重、便秘、消化不良、嗝气、胃肠胀气、胃炎、痔疮、食欲增加、黑便、结肠出血、口炎 (包括溃疡性口炎)、舌变色、舌水肿。

泌尿生殖系统：膀胱炎、排尿困难、血尿、尿频、多尿、尿失禁、尿路感染。

听力和前庭：耳聋、耳痛、耳毒性、耳鸣。

代谢/营养：脱水、糖尿病、口渴。

肌肉骨骼：关节炎、关节炎、关节病、肌无力、肌痛。

精神病学：思维异常、情绪激动、健忘、焦虑、性欲减退、人格解体、抑郁、情绪波动、欣快、注意力不集中、失眠、神经过敏、噩梦、睡眠障碍。

呼吸系统：支气管炎、呼吸困难、换气过度、多痰、肺炎、呼吸障碍、鼻炎、窦炎、上呼吸道感染。

生殖系统：痛经、女性乳房疼痛、经间出血、白带、月经过多、阴道炎。

网状内皮组织：淋巴结对病变。

皮肤：痤疮、脱发、神经性水肿、大疱疹、皮炎、皮肤干燥、湿疹、红疹、疖病、角化过度、多毛症、多汗、斑状丘疹、过敏反应、光敏毒性反应、瘙痒、紫癜、皮疹、皮脂溢、皮肤病变、皮肤结节、荨麻疹。

特殊感觉：嗅觉异常、味觉丧失、味觉反常。

视觉：失明、结膜炎、眼睛疼痛、青光眼、视觉调节丧失、眼出血、干眼症。

全身：意外受伤、虚弱、背痛、胸痛、腹胀、脸部水肿、发热、全身性水肿、脸潮红、体重增加、腿部水肿、不适、鼻息肉、疼痛、苍白、眼眶水肿、外周水肿、寒颤。

在西替利嗪的治疗过程中偶见暂时可逆转的肝转氨酶升高。有报道肝炎伴随转氨酶升高和胆红素升高与使用盐酸西替利嗪有关。

其它的罕见且可能严重的不良事件如下：过敏、胆汁淤积、肾小球性肾炎、溶血性贫血、肝炎、口面运动障碍、严重低血压、死胎、血小板减少、攻击反应和惊厥。

偶有报告患者有轻微和短暂不良反应。如头痛，头晕，嗜睡，激动不安，口干，腹部不适。在测定精神运动功能的客观试验中，本品的镇静作用和安慰剂相似。罕有报道过敏反应。

与第一代H1受体拮抗剂相比，西替利嗪进入中枢神经系统的能力更弱。临床研究表明，使用推荐剂量的西替利嗪有轻微的中枢神经系统不良反应，包括嗜睡、疲劳、麻木、注意力障碍、头晕和头痛。在某些病例中，也有中枢神经系统兴奋的报告。

客户名称	北京韩美药品有限公司	产品名称	盐酸西替利嗪口服溶液说明书ETC-006(170*148mm)-正
颜色标准	黑	成品尺寸	170X148mm
制作日期	2024年06月14日	版 号	5100001972
制 作 人	王广东	审 核 人	杨美丽
纸张材质	60g丽印双胶纸		
天津市泽阳印务有限公司 TIANJIN ZEYANG PRINTING CO.,LTD.			

170mm

148mm

尽管西替利嗪是选择性的外周H1受体拮抗剂，没有明显的抗胆碱活性，但曾有个别关于排尿障碍、调节紊乱和口干的报告。

个别患者出现肝功能受损现象，并伴有肝酶水平和胆红素水平升高。通常在停药后，肝酶水平和胆红素水平会恢复正常。

来自原研产品临床研究的安全性数据：

下列安全性数据源自原研产品临床研究。这项临床研究中，将西替利嗪（3260例）（按推荐剂量服用，10毫克/日）与安慰剂或其他抗组胺药进行比较，观察到下列发生率至少为1%的副作用：嗜睡（9.63%）、头痛（7.42%）、头晕（1.10%）、咽炎（1.29%）、口干（2.09%）、恶心（1.07%）、腹痛（0.98%）、疲劳（1.63%）。

在针对儿童（6个月至12岁）的安慰剂对照的原研产品临床研究中观察到西替利嗪（1656例）有下列不良反应：嗜睡（1.8%）、鼻炎（1.4%）、腹泻（1.0%）、疲劳（1.0%）。

来自原研产品上市后研究的安全性数据（PMS）：

除了临床试验期间报告列出的不良反应，还有以下原研产品上市后报告的不良反应。

根据MedDRA系统器官分类并按基于上市后报告估算的频率描述不良事件：

频率定义如下：十分常见（≥1/10）；常见（≥1/100 - <1/10）；偶见（≥1/1,000 - <1/100）；罕见（≥1/10,000 - <1/1,000）；十分罕见（<1/10,000）；不详（从现有数据中无法估算）。

•心脏症状：

罕见：心动过速

•血液及淋巴症状：

十分罕见：血小板减少

•神经系统症状：

偶见：感觉异常

罕见：惊厥

十分罕见：味觉障碍，运动障碍，肌张力障碍，晕厥，震颤

不详：耳聋，遗忘，记忆障碍

•眼部症状：

十分罕见：视力调节障碍，视力模糊，眼球旋动

不详：血管炎

•耳及迷路症状：

不详：眩晕

•胃肠症状：

偶见：腹泻

•肾脏及泌尿系统症状：

十分罕见：排尿困难，遗尿

不详：尿滞留

•皮肤及皮下组织症状：

偶见：瘙痒症，皮疹

罕见：荨麻疹

十分罕见：血管神经性水肿，固定性药疹

•全身症状以及用药部位症状：

偶见：无力，不适

罕见：水肿

•免疫系统症状：

罕见：过敏反应

十分罕见：过敏性休克

•肝胆症状：

罕见：肝功能异常（转氨酶、碱性磷酸酶、γ-GT和胆红素升高）

•新陈代谢和营养失调：

不详：食欲增加

•精神症状：

偶见：激越

罕见：攻击性，意识错乱，抑郁，幻觉，失眠

十分罕见：抽动

不详：自杀观念

•实验室检查：

罕见：体重增加

【禁忌】

1. 对本品成份、羟嗪或任何其他哌嗪衍生物过敏者禁用。

2. 严重肾功能损害(肌酐清除率低于10mL/min)患者禁用。

【注意事项】

1. 由于可能发生额外的警觉性降低以及对中枢神经系统性能的额外损害，应避免盐酸西替利嗪与酒精或其它中枢神经系统抑制剂合并使用。

2. 因临床研究中某些患者服用西替利嗪出现嗜睡，司机或可能操作危险机器人员慎用。

3. 癫痫患者以及有惊厥风险的患者应慎用。

4. 因西替利嗪有可能增加尿滞留的风险，有尿滞留易感因素(例如脊髓损害、前列腺肥大)的患者慎用。

5. 抗组胺药物会降低皮肤过敏测试结果的灵敏度，所以接受这类测试前应停药3天。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

不适用。

【儿童用药】

见【用法用量】项。

【老年用药】

不适用。

【药物相互作用】

尚未发现与低剂量茶碱、阿奇霉素、伪麻黄碱、酮康唑或红霉素具有临床意义的药物相互作用。400mg剂量的茶碱导致西替利嗪的清除率有较小的降低,可能是由于较高的茶碱剂量具有较强的效果。

【药物过量】

已有盐酸西替利嗪的药物过量报道。1名成年患者服用150mg盐酸西替利嗪，该患者未表现出除嗜睡以外的临床症状和血液化验和血液学结果。1名18个月的儿童患者服用了过量的盐酸西替利嗪(约180mg),起始观察到躁动和易怒,随后为困倦。若发生服药过量,应考虑其他伴随服用的药物进行对症治疗或支持治疗。尚无已知针对盐酸西替利嗪的特异解药。盐酸西替利嗪无法通过透析有效去除，除非同时服用一种可透析药物。

【药理毒理】

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,中枢抑制作用较少。

毒理研究

急性毒性：小鼠的急性最小口服致死剂量为237mg/kg(根据体表面积计算,约为成人每日最大推荐剂量的95倍或婴幼儿每日最大推荐剂量的40倍)，大鼠为562mg/kg(根据体表面积计算,约为成人每日最大推荐剂量的460倍或婴幼儿每日最大推荐剂量的190倍)。啮齿动物中,急性性靶器官为中枢神经系统,多剂量毒性靶器官为肝脏。

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96mg/kg、225mg/kg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。

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,或婴幼儿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，或婴幼儿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，或相当于婴幼儿临床推荐最大日剂量)时,未见肝肿瘤发生率的增加。上述发现的临床意义尚不清楚。

【药代动力学】

口服盐酸西替利嗪在5-60mg剂量范围内,血浆浓度水平和给药剂量呈线性关系。

血浆清除半衰期大约为10小时,表现分布容积为0.5L/kg。在每天服用10mg,连续服用10天盐酸西替利嗪后，未发现蓄积。稳态血药浓度峰值约为300ng/ml。西替利嗪和血浆蛋白结合牢固,血浆蛋白结合率为93%。西替利嗪的代谢无首过效应，给药剂量的三分之二以原形药物由尿液排出。西替利嗪的吸收不受进食影响。西替利嗪的溶液剂、胶囊和片剂的生物利用度相仿,个体间的吸收非常一致。

7至12岁儿童患者口服单剂量5mg西替利嗪胶囊,Cmax均值为275ng/mL,基于交叉试验比较且权重化的儿童人群的表现全身清除率比成人高33%、消除半衰期比成人短33%；2至5岁儿童患者口服单剂量5mg西替利嗪,Cmax均值为660ng/mL,基于交叉试验比较且权重化的儿童人群的表现全身清除率比成人高81%~111%、消除半衰期比成人短33%~41%；6至23个月婴幼儿患者按0.25mg/kg单剂量口服西替利嗪口服溶液(平均剂量为0.23mg),Cmax均值为390ng/mL,基于交叉试验比较且权重化的儿童人群的表现全身清除率比成人高304%、消除半衰期比成人短63%。6个月至2岁儿童服用最大剂量西替利嗪溶液(每次2.5mg,每日两次)时的AUC(0-t)均值预计是成人每日服用一次10mg西替利嗪时AUC(0-t)均值的2倍多。

【贮藏】

遮光，密闭，常温(10-30℃)保存。

【包装】

PET瓶装，带有量杯,100ml/瓶。

【有效期】

24个月。

【执行标准】

YBH11112024

【批准文号】

国药准字H20093320

【药品上市许可持有人】

名称：北京韩美药品有限公司

注册地址：北京市顺义区天竺空港工业区A区天柱西路10号

邮政编码：101312

联系方式：800-810-1156 400-650-5676

网 址：www.bjhanmi.com.cn

【生产企业】

企业名称：北京韩美药品有限公司

生产地址：北京市顺义区天竺空港工业区A区天柱西路10号

邮政编码：101312

联系方式：800-810-1156 400-650-5676

网 址：www.bjhanmi.com.cn

如有问题可与药品上市许可持有人联系

5100001972

客户名称	北京韩美药品有限公司	产品名称	盐酸西替利嗪口服溶液说明书ETC-006(170*148mm)-背
颜色标准	黑	成品尺寸	170X148mm
制作日期	2024年06月14日	版 号	5100001972
制 作 人	王广东	审 核 人	杨美丽
纸张材质	60g丽印双胶纸		
 天津市泽阳印务有限公司 TIANJIN ZEYANG PRINTING CO.,LTD.			