**氯雷他定**

文章版本号：3

最后发布时间：2014-8-15 10:57:52

**【药物名称】**

中文通用名称：氯雷他定

英文通用名称：Loratadine

其他名称：安瑞坦、奥慧丰、奥米新、奥纾、百为哈、百为乐、百为坦、邦诺、彼赛宁、毕研通、常克、大生瑞丽、菲格曼、福莱西、海王抒瑞、华畅、惠滋养、精威、开瑞坦、可米、克敏能、奎因、雷宁、氯羟他定、敏立可、敏息美、诺那他定、瑞孚、润来、舍泰、施诺敏、史泰舒、舒忆、顺平舒、顺他欣、泰明可、天晴正舒、天图、先宁、信达悦、星元佳、雪菲、伊利欣、怡邦、亿菲、逸舒长、芷敏、Claratyne、Claritin、Claritine、Clarityn、Clarityne、Fristamin、Lisino、Loratadinum。

**【药理分类】**

抗变态反应药>>抗组胺药

**【临床应用】**

**CFDA说明书适应症**

1.用于缓解过敏性鼻炎有关症状，如喷嚏、流涕、鼻痒、鼻塞、眼部瘙痒及烧灼感。

2.缓解慢性荨麻疹、瘙痒性皮肤病及其他过敏性皮肤病的症状及体征。

**其他临床应用参考**

用于治疗过敏性哮喘。

**【用法与用量】**

**成人**

◆常规剂量

·一般用法

1.口服给药  一次10mg，一日1次。

◆肾功能不全时剂量

肾功能不全者应减量给药，可一次10mg，隔日1次。

◆肝功能不全时剂量

肝功能不全者应减量给药，可一次10mg，隔日1次。

◆老年人剂量

老年患者用药无需调整剂量。

**儿童**

◆常规剂量

·一般用法

1.口服给药  (1)2-12岁儿童：体重小于或等于30kg者，一次5mg，一日1次；体重超过30kg者，一次10mg，一日1次。(2)12岁以上儿童，一次10mg，一日1次。

◆肾功能不全时剂量

肌酐清除率小于30ml/min时：2-6岁患儿，起始剂量为一次5mg，隔日1次；6岁以上患儿，起始剂量为一次10mg，隔日1次。

◆肝功能不全时剂量

肝功能不全时：2-6岁患儿，起始剂量为一次5mg，隔日1次；6岁以上患儿，起始剂量为一次10mg，隔日1次。

**【国外用法用量参考】**

**成人**

◆常规剂量

·慢性特发性荨麻疹、季节性过敏性鼻炎

1.口服给药  同国内用法与用量。

·过敏性哮喘

1.口服给药  一次10-20mg，一日1次，连用8周。

◆肾功能不全时剂量

肌酐清除率小于30ml/min的患者，起始剂量为一次10mg，隔日1次。

◆肝功能不全时剂量

肝功能不全者推荐剂量为一次10mg，隔日1次。

◆透析时剂量

血液透析时无需调整剂量。

**儿童**

◆常规剂量

·慢性特发性荨麻疹、季节性过敏性鼻炎

1.口服给药  2-5岁儿童，一次5mg，一日1次；6岁及以上儿童，一次10mg，一日1次。

◆肾功能不全时剂量

2-5岁肾功能不全(肾小球滤过率低于30ml/min)者，起始剂量一次5mg，隔日1次；6岁及以上肾功能不全者，起始剂量为一次10mg，隔日1次。

◆肝功能不全时剂量

2-5岁肝功能不全者起始剂量一次5mg，隔日1次；6岁及以上肝功能不全者，起始剂量为一次10mg，隔日1次。

**【给药说明】**

**给药方式说明**

口服给药  (1)口腔崩解片：置本药于舌面,无需用水,无需咀嚼，随唾液吞咽入胃。(2)糖浆：一茶匙含本药5ml(5mg)。(3)泡腾片和颗粒剂：完全溶解于温水后服用。(4)咀嚼片：咀嚼后服用。

**【禁忌症】**

对本药过敏者。

**【慎用】**

1.肾功能不全者。

2.肝功能不全者(国外资料)。

3.有心律失常病史者。

4.妊娠期妇女。

5.哺乳期妇女。

**【特殊人群】**

**儿童**

1. 2岁以下儿童使用本药的安全性和有效性尚不明确。但有研究结果显示，1-2岁儿童应用2.5ml本药糖浆、分散片和颗粒剂后药代动力学与2岁以上儿童及成人相似。

2. 12岁以下儿童应用本药口腔崩解片的安全性和有效性尚不明确。

**老人**

因本药的抗胆碱能作用，患有其他疾病(如痴呆、谵妄)的老人可能不适用本药。

**妊娠期妇女**

1.妊娠期妇女使用本药的安全性尚未确定，应慎用。

2.美国食品药品管理局(FDA)对本药的妊娠安全性分级为B级。

**哺乳期妇女**

本药可随乳汁排泄，且抗组胺药对婴儿(尤其是对新生儿和早产儿)的危险性大，故哺乳期妇女慎用本药，或用药期间停止哺乳。

**【不良反应】**

1.心血管系统  高血压、低血压、心悸、室上性快速性心律失常、晕厥、心动过速等，发生率均低于2%。

2.呼吸系统  支气管炎、支气管痉挛、咳嗽、呼吸困难、鼻出血、咯血、喉炎、鼻干、咽炎、鼻窦炎、喷嚏等，发生率均低于2%。

3.肌肉骨骼系统  腿部肌肉痉挛、关节痛、肌痛等，发生率均低于2%。

4.泌尿生殖系统  尿频、尿液外观颜色改变、尿失禁、尿潴留、乳房痛、乳腺增生、痛经、月经过多、阴道炎、阳痿、性欲下降等，发生率均低于2%。

5.神经系统  发生率高于2%的有头痛、嗜睡。发生率低于2%的有健忘、失眠、眩晕、癫痫、震颤、感觉迟钝。

6.精神  激动、焦虑、精神错乱、抑郁、易怒，发生率均低于2%。

7.肝脏  肝功能异常(包括黄疸、肝炎和肝坏死)，发生率低于2%。

8.胃肠道  常见胃炎。发生率高于2%的有口干。发生率低于2%的有胃胀、味觉改变、食欲下降、便秘、腹泻、呃逆、食欲增加、恶心、呕吐、牙痛。

9.皮肤  真皮炎、毛发干燥、脱发、皮肤干燥、皮肤瘙痒、紫癜、皮疹、风疹、多形红斑等，发生率均低于2%。

10.眼  眼睑痉挛、流泪、视物模糊、眼痛，发生率均低于2%。

11.耳  耳痛、耳鸣，发生率均低于2%。

12.过敏反应  罕见过敏反应。

13.其他  发生率高于2%的有乏力。发生率低于2%的有胸痛、流涎、潮红、多汗、血管神经性水肿、光敏反应、体重增加、病毒感染。

**【药物相互作用】**

**药物-药物相互作用**

1.酮康唑、大环内酯类抗生素(如红霉素)、西咪替丁、茶碱等：

结果：合用可增加本药及其代谢产物脱羧乙氧氯雷他定的血浆浓度(西咪替丁和酮康唑的血药浓度不受影响，红霉素的血药浓度约增加15%)，但对心电图指数、临床实验室检查、生命体症和不良反应发生率均无明显影响。

机制：抑制本药代谢。

2.异卡波肼、帕吉林、苯乙肼、反苯环丙胺等：

结果：合用可增加本药的不良反应。

3.中枢神经系统抑制药(如巴比妥类、苯二氮卓类镇静药、吩噻嗪类镇静药、三环类抗抑郁药、肌松药、麻醉药、止痛药)：

结果：合用可引起严重嗜睡反应。

**药物-酒精/尼古丁相互作用**

酒精：

结果：精神运动试验表明，与酒精同服时，对本药无药效协同作用。

**药物-食物相互作用**

食物：

结果：食物可使本药曲线下面积(AUC)增加约40%，血药浓度达峰时间延迟约1小时，但食物不影响本药血药峰浓度。

**【注意事项】**

**用药警示**

1.皮试前48小时应停止使用本药，因抗组胺药能阻止或降低皮试的阳性反应发生。

2.高空作业者、驾驶人员、参赛前的运动员等需要精神高度集中者，用药量应严格控制在安全范围内。

3.本药的常规日剂量为10mg，如无特殊情况，不应擅自增加用量。出现耐药时，可暂时中断治疗。

**不良反应的处理方法**

用药期间如出现皮疹、皮肤瘙痒、恶心、呕吐等过敏反应，应及时停药，换用其他药物。

**比尔斯标准**

患有其他疾病(如痴呆、谵妄)的老人可能不适用本药。

**制剂注意事项**

苯丙氨酸：本药某些剂型含有苯丙氨酸。

**其他注意事项**

本药用于控制鼻塞症状时宜加用血管收缩药，如麻黄碱、伪麻黄碱等。

**【国外专科用药信息参考】**

**牙科用药信息**

与牙科治疗相关的主要不良反应：2-5岁儿童用药后可见口腔干燥(停药后唾液流量恢复正常)及口腔炎。

**精神状况信息**

对精神状态的影响：用药后常见嗜睡，可能导致焦虑或抑郁。

**心血管注意事项**

按推荐剂量服用本药，不会出现临床相关的QT间期延长或室性心律失常(如尖端扭转型室性心动过速)，但使用本药会导致室上性心律失常。

**【药物过量】**

**过量的表现**

成人过量服用本药(40-180mg)后，可出现嗜睡、心动过速和头痛等；儿童过量服用本药(＞10mg)可出现锥体外系反应、心悸等。

**过量的处理**

若发生药物过量，若患者清醒可采用催吐、用生理盐水洗胃及活性炭吸附的措施。也可使用盐类泻药(如硫酸钠)以阻止药物在肠道的吸收。本药血浆蛋白结合率较高，血液透析不能使本药清除，腹膜透析能否使本药清除尚不明确。严禁用组胺类药作为本药过量时的解救药。

**【药理】**

**药效学**

本药为三环类长效抗组胺药。对外周组胺H1受体有较强的选择性拮抗作用，对中枢组胺H1受体的亲和性较低，对乙酰胆碱和肾上腺素α1受体作用极小，因此不具有中枢镇静作用，也无明显的抗胆碱作用。

近年通过动物试验发现，本药对变态反应中黏附分子的表达有抑制作用，尤其对于细胞间黏附分子(ICAM)与血管细胞黏附分子(VCAM)的表达有明显抑制作用，可降低炎症细胞向过敏灶的趋化，从而控制过敏的迟发性反应。

本药抗组胺作用比阿司咪唑、特非那定强。

**药动学**

本药口服后迅速自胃肠黏膜吸收，1.3小时后血药浓度达峰值。单次口服10mg、20mg、40mg，1-1.5小时达血药峰浓度(Cmax)，分别为5μg/ml、11μg/ml、26μg/ml，Cmax与给药剂量成比例。单次口服10mg，30分钟后可在血中测得，血浆半衰期约为12小时，血浆蛋白结合率为98%。

大部分药物在肝脏代谢，首过代谢为仍具有抗组胺活性的去羧甲基乙氧基氯雷他定。本药及其代谢物均不易通过血-脑脊液屏障，其代谢产物随尿液、粪便、汗液、乳汁等排出体外。每日口服40mg，连续10日，未见药物蓄积。

慢性酒精性肝病患者服用本药，氯雷他定和脱羧乙氧氯雷他定的血浆半衰期随肝脏损伤程度的加重而延长。慢性肾功能不全患者和健康老年人血浆氯雷他定和脱羧乙氧氯雷他定AUC和Cmax增加。血液透析不能清除本药，腹膜透析能否清除本药尚未明确。

**遗传、生殖毒性与致癌性**

◆遗传毒性  在Ames试验、正向点突变试验、DNA损伤试验和染色体畸变试验中，均未见本药有致突变作用。在小鼠淋巴瘤试验中，非活化状态下结果为阳性，活化状态下为阴性。

◆生殖毒性  (1)雄性大鼠经口给予本药，剂量为64mg/kg(按体表面积折算，约相当于临床推荐最大日口服剂量的50倍)时，可致生育力下降，表现为雌鼠受孕率降低。经口给予本药剂量达24mg/kg(按体表面积折算，约相当于临床推荐最大日口服剂量的20倍)时，对雌雄大鼠生育力无影响。(2)大鼠和家兔经口给予本药剂量达96mg/kg(按体表面积折算，分别约相当于临床推荐最大日口服剂量的75和150倍)时，未见致畸作用。

◆致癌性  小鼠连续18个月经口给予本药，剂量达40mg/kg，雄性小鼠肝细胞瘤(包括腺癌和癌)的发生率明显增加；大鼠连续2年经口给予本药，剂量为10mg/kg组雄鼠和25mg/kg组雌雄大鼠肝细胞瘤(包括腺癌和癌)的发生率明显增加。人长期服用本药，上述发现的临床意义尚不明确。

**【制剂与规格】**

氯雷他定片  10mg。

氯雷他定分散片  (1)5mg。(2)10mg。

氯雷他定咀嚼片  5mg。

氯雷他定口腔崩解片  10mg。

氯雷他定泡腾片  10mg。

氯雷他定胶囊  (1)5mg。(2)10mg。

氯雷他定颗粒  5mg。

氯雷他定糖浆  (1)50ml:50mg。(2)60ml:60mg。(3)70ml:70mg。(4)80ml:80mg。(5)100ml:100mg。

**【贮藏】**

片剂：遮光，密闭保存。

分散片：遮光，密闭保存。

咀嚼片：密闭，于阴凉(不超过20℃)干燥处保存。

口腔崩解片：遮光，密闭保存。

泡腾片：遮光，密闭保存。

胶囊：遮光，密闭保存。

颗粒：密闭保存。

糖浆：遮光、密闭，于干燥处保存。

使用UpToDate临床顾问须遵循[用户协议](http://www.uptodate.com/contents/license)。

专题 91961 版本 1.0