核准日期：2025年06月24日
修改日期：2025年07月04日
2025年09月09日

其美司®

吡美莫司乳膏说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用。

【药品名称】

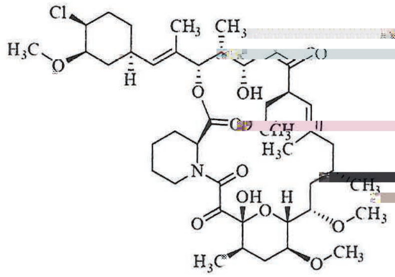
通用名称：吡美莫司乳膏
英文名称：Pimecrolimus Cream
汉语拼音：Bimeimosi Rugao

【成　　份】

活性成份：吡美莫司，每克吡美莫司乳膏含10毫克吡美莫司。

化学名称：（1R，9S，12S，13R，14S，17R，18E，21S，23S，24R，25S，27R）-12-[(1E)-2-[(1R，3R，4S)-4-氯-3-甲氧基环己基]-1-甲基乙烯基]-17-乙基-1，14-二羟基-23，25-二甲氧基-13，19，21，27-四甲基-11，28-二噁-4-氮杂三环[22.3.1.0]二十八碳-18-烯-2，3，10，16-四酮

化学结构式：



分子式：$C_{43}H_{68}NO_{11}Cl$

分子量：810.47

辅料：油醇、中链甘油三酸酯、十六醇、十八醇、丙二醇、单双硬脂酸甘油酯、十六十八烷基硫酸钠、无水枸橼酸、氢氧化钠、苯甲醇、纯化水。

【性　　状】

本品为白色乳膏。

【适 应 症】

适用于无免疫受损的3个月及3个月以上轻度至中度特应性皮炎患者。

- 短期治疗疾病的体征和症状。
- 长期间歇治疗，以预防病情加重。
- 对于24个月以下轻度至中度特应性皮炎患儿，本品应适用于不能或不宜使用外用糖皮质激素治疗的患者。

【规　　格】

1%（10g:0.1g）

【用法用量】

吡美莫司乳膏应由对特应性皮炎局部用药治疗有临床经验的医师开具处方。

本品可在短期内用于治疗特应性皮炎症状和体征，并可长期间歇使用预防病情加重。

临床试验观察结果支持吡美莫司乳膏用于长期间歇治疗，时间可达12个月。

本品治疗应该从早期出现特应性皮炎的体征和症状开始。本品应仅用于特应性皮炎受累部位。本品应在疾病发作期尽可能的短期使用。体征和症状消失后，患者或护理者应停用本品。本品治疗应具有间歇性、短期性且不可持续。

如果用药6周后病情仍然没有缓解，或疾病有所加重，应停用吡美莫司乳膏，并考虑采用其它治疗方法。

成人患者

在受累皮肤局部涂一薄层吡美莫司乳膏，每日两次，[illegible]。每处受累皮肤都应上药，直至皮疹消退，然后可停药。

吡美莫司乳膏可用于全身皮肤的任何部位，包括头颈部、面部、颈部和皱褶部位，但不能用于粘膜。吡美莫司乳膏不宜用于封包疗法（见【注意事项】）。

在长期应用吡美莫司乳膏治疗特应性皮炎时，应在症状和体征一出现时即外用吡美莫司乳膏，以预防病情加剧。吡美莫司乳膏应每日外用两次。

应用吡美莫司乳膏后，可立即使用润肤剂。但是淋浴之后，可以在应用吡美莫司乳膏前使用润肤剂。

由于吡美莫司乳膏吸收量很少，对每日用药量、用药面积或治疗持续时间没有限制。

儿童患者

婴儿（3-23个月）、儿童（2-11岁）和青少年（12-17岁）的用药剂量和用法与成人相同。

老年患者

特应性皮炎很少发生于65岁及65岁以上的患者。在吡美莫司乳膏临床试验中，因该年龄组患者数量较少，目前尚不能确定疗效是否与较年轻患者存在差异。

【不良反应】

研究报告显示，吡美莫司乳膏治疗最常见的不良反应为局部用药反应，治疗组发生率为19%，对照组为16%。不良反应通常发生于治疗早期，一般为轻度或中度，持续时间短。

在使用吡美莫司乳膏1%的临床试验中和上市后用药中观察到如下发生率的不良反应。

发生率定义如下：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），未知（根据现有数据无法估计）。

感染及侵染	
偶见	传染性软疣
免疫系统疾病	
十分罕见	超敏反应（包括过敏反应）
代谢及营养类疾病	
罕见	酒精不耐受（在大多数情况下摄入酒精后不久出现发红、皮疹、烧灼感、瘙痒或肿胀）
皮肤及皮下组织类疾病	
常见	皮肤感染（毛囊炎）
偶见	疖、脓疱疮、单纯疱疹、带状疱疹、单纯疱疹样皮炎（疱疹性湿疹）、皮肤乳头状瘤和病情加重
罕见	过敏反应（如，皮疹、荨麻疹、血管性水肿）、皮肤色素异常（如，色素减退、色素沉着过度）
全身性疾病及给药部位各种反应	
十分常见	用药部位烧灼感
常见	用药部位反应（刺激、瘙痒和红斑）
偶见	用药部位不适（皮疹、疼痛、感觉异常、脱屑、干燥、水肿）

上市后：使用吡美莫司乳膏的儿童和成人患者，已经报道过有恶性肿瘤的病例，包括皮肤和其他类型的淋巴瘤以及皮肤癌（见【注意事项】）。

上市后使用和临床试验中已报道淋巴结肿大病例，但尚未发现其与本品的因果关系（见【注意事项】）。

儿科人群：

对大规模的长达5年的吡美莫司乳膏1%治疗3个月及以上儿童的临床安全性数据审核，在观察到的不良事件的性质和频率上，婴儿、儿童和青少年的安全性具有可比性，最常见的不良反应为用药部位反应。

【禁　　忌】

已知对吡美莫司、其他大环内酰胺类或者本品中其它任何赋形剂过敏者。

【注意事项】

本品不建议用于先天性或获得性免疫缺陷患者或因治疗导致免疫抑制的患者。

吡美莫司乳膏对皮肤局部免疫受损患者和皮肤恶性肿瘤患者的长期作用尚不明确，因此不能用于可能存在恶性肿瘤或癌前病变的皮肤部位。应避免在任何年龄组持续长期外用钙调神经磷酸酶抑制剂（包括1%吡美莫司乳膏），且应用仅限于特应性皮炎受累区域。

吡美莫司乳膏不能用于急性皮肤病毒感染部位（单纯疱疹、水痘）。

吡美莫司乳膏对于临床治疗中感染的特应性皮炎治疗的疗效和安全性尚未得到评价，因此用吡美莫司乳膏进行治疗前，应清除治疗部位的感染灶。

特应性皮炎的患者易患浅表皮肤感染，包括疱疹性湿疹（Kaposi水痘样疹）。吡美莫司乳膏治疗可能导致皮肤单纯疱疹病毒感染或疱疹性湿疹（表现为水疱和糜烂快速播散）发生的风险增加。当出现皮肤单纯疱疹病毒感染时，应暂时中止在感染部位使用吡美莫司乳膏，待病毒感染清除后方可重新使用。

重度特应性皮炎患者[illegible]可能增加。

用吡美莫司乳膏治疗时在用药局部会发生轻度和一过性反应，如发热和/或烧灼感。如果用药局部反应严重，则应重新评价治疗的风险/获益比。

应避免药物接触眼睛和粘膜。如果不慎用于这些部位，应彻底擦去乳膏，并用水冲洗。

建议患者采取适当的防晒措施，例如尽量减少在阳光下的时间，使用防晒产品，以及用适当衣物遮盖皮肤（见【药物相互作用】）。

本品含有活性成份吡美莫司，其为钙调磷酸酶抑制剂。在器官移植患者中，系统用钙调磷酸酶抑制剂后，长期全身暴露于较强免疫抑制中与罹患淋巴瘤和皮肤恶性肿瘤的风险增加有关。使用局部钙调神经磷酸酶抑制剂包括吡美莫司乳膏患者已经报道恶性肿瘤病例，包括皮肤和其他类型的淋巴瘤以及皮肤癌（见【不良反应】）。然而，使用本品治疗特应性皮炎的患者中未发现有显著的吡美莫司全身浓度。

临床试验中，使用吡美莫司乳膏治疗的1544例患者，共报告了14例淋巴结病的病例（0.9%），通常这些病例与感染有关，并且在应用抗生素治疗后能够痊愈。这14例病例，绝大多数有明确病因，或者确认能够痊愈。对使用吡美莫司乳膏出现淋巴结病的患者，应该明确诊断淋巴结病的病因。如果没有明确的病因，或者出现急性传染性单核细胞增多症，应该停止使用本品。应密切监测出现淋巴结病的患者，以保证淋巴结病能够痊愈。

具有潜在较高全身系统暴露量风险的人群

尚没有吡美莫司乳膏治疗内塞顿综合征（Netherton's syndrome）的研究。由于有可能潜在增加吡美莫司的系统吸收，因此不推荐将吡美莫司乳膏用于治疗内塞顿综合征（Netherton's syndrome）。

由于尚没有关于吡美莫司乳膏治疗红皮病性皮炎的安全性数据，对这些患者不推荐采用本药进行治疗。

尚无吡美莫司乳膏用于封包疗法的研究，不推荐采用封包疗法。

[illegible]

本品含有可能导致局部皮肤反应（例如接触性皮炎）的十六醇和十八醇，可能会导致过敏反应和轻微局部刺激的苯甲醇。本品同样含有可能导致皮肤刺激的丙二醇（E1520）。

对驾驶和操作机器的影响

吡美莫司对驾驶和操作机器能力的影响尚不明确。

使用指导

吡美莫司乳膏可与润肤剂合用（见【用法用量】）。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

妊娠

吡美莫司乳膏用于妊娠妇女尚无足够的研究资料。动物试验未显示外用吡美莫司乳膏对胚胎/胎儿发育存在直接或间接的有害影响。口服给药的动物研究显示该药有生殖毒性（见【药理毒理】）。由于外用吡美莫司乳膏后吡美莫司吸收很少（见【药代动力学】），因此对人体的潜在危害性有限。但是妊娠期间应慎用吡美莫司乳膏。

哺乳

尚未进行外用吡美莫司对乳汁分泌影响的动物试验研究，目前尚未研究本品在哺乳期妇女的使用。局部应用吡美莫司乳膏后吡美莫司是否会分泌到乳汁中尚不明确。

然而，由于局部使用吡美莫司乳膏后，吡美莫司吸收很少（见【药代动力学】），因此对人体的潜在危险性有限。但吡美莫司乳膏仍应慎用于哺乳妇女。

如果哺乳妇女需要使用吡美莫司乳膏，请勿用于乳房部位，以免新生儿无意中经口摄入。

生育能力

目前尚无吡美莫司对男性或女性生育能力影响的临床数据（见【药理毒理】）。

【儿童用药】

见【用法用量】。

【老年用药】

见【用法用量】。

【药物相互作用】

对吡美莫司乳膏和其它药物可能存在的相互作用尚未系统评价。吡美莫司全部通过细胞色素酶P450 3A4代谢。由于外用的吸收很少，不太可能发生吡美莫司乳膏与其它系统给药之间的相互作用（见【药代动力学】）。

目前资料显示吡美莫司乳膏可与抗生素、抗组胺药和糖皮质激素（口服/鼻腔给药/吸入）合用。

基于其极低的吸收程度，本品不太可能与疫苗发生潜在的全身相互作用。然而这种相互作用尚未进行研究。因此，对于患有全身[illegible]患者，建议在非治疗期间接种疫苗。在一项为期5年针对3-12个月患有轻度至中度特应性皮炎的婴儿患者的研究中，使用吡美莫司乳膏或糖皮质激素的患者表现出正常的[illegible]。

尚未研究在接种疫苗部位出现局部反应期间涂用吡美莫司，故不推荐使用。

目前尚无吡美莫司乳膏与特应性皮炎的免疫抑制疗法（如UVB、UVA、PUVA、硫唑嘌呤和环孢菌素A）联合应用方面的经验。

吡美莫司乳膏在动物试验中未发现光致癌性（见【药理毒理】）。但由于人体的情况尚不清楚，因此在应用吡美莫司乳膏治疗期间，应避免皮肤过度光暴露，包括日光、PUVA、UVA或UVB治疗。

使用吡美莫司乳膏的患者摄入酒精不久后，罕见有发生发红、皮疹、烧灼感、瘙痒或肿胀（见【不良反应】）。

【药物过量】

目前尚无吡美莫司乳膏用量过量的经验。

尚没有误服吡美莫司乳膏的报道。

【药理毒理】

药理作用

吡美莫司用于特异性皮炎的作用机制尚不明确，虽然有观察到以下结果，但这些结果在特异性皮炎中的临床意义尚不明确。吡美莫司与[illegible]macrophilin-12[illegible]结合并抑制钙依赖性磷脂酶神经钙蛋白。因此，吡美莫司能通过阻断早期细胞因子抑制T细胞激活，尤其是吡美莫司能在纳摩级别浓度下抑制T细胞内白介素-2、干扰素γ（Th1型）和白介素-4、白介素-10（Th2型）细胞因子合成。此外，吡美莫司能抑制体外肥大细胞经抗原/IgE刺激后释放炎性细胞因子和介质。

毒理研究

遗传毒性

Ames试验、小鼠淋巴瘤L5178Y试验、中国仓鼠V79细胞染色体畸变试验和小鼠微核试验均未见吡美莫司有[illegible]。

生殖毒性

大鼠经口给药生育力和早期胚胎发育毒性试验中，在45 mg/kg/天剂量下（按AUC计，相当于人最大推荐剂量（MRHD）的38倍），可见发情周期紊乱、着床后丢失和窝仔数减少。在10 mg/kg/天剂量下（按AUC计，相当于MRHD的12倍），未见对雌性大鼠生育力有明显影响。在该试验最高剂量45 mg/kg/天剂量下（按AUC计，相当于MRHD的[illegible]倍），未见对雄性大鼠生育力有明显影响。

第二项大鼠经口给药生育力和早期胚胎发育毒性试验中，在45 mg/kg/天剂量下（按AUC计，[illegible]）[illegible]睾丸重量降低，[illegible]精子数和精子活度降低。[illegible]雌性大鼠发情周期紊乱、黄体[illegible]、着床及活胎数降低。在10 mg/kg/天剂量下（按AUC计，相当于MRHD的5倍），未见对雌性大鼠生育力有明显影响。在2 mg/kg/天剂量下（按AUC计，相当于MRHD的[illegible]7倍），未见对雄性大鼠生育力有明显影响。

胚胎-胎仔发育毒性试验中，大鼠、兔于器官发生期（大鼠于妊娠期第6~21天，兔于妊娠期第6~20天）局部经皮给予1%吡美莫司乳膏6小时/天，在最高试验剂量10 mg/kg/天剂量下（在大鼠中按体表面积计，相当于MRHD的0.14倍；在兔中按AUC计，相当于MRHD的0.65倍），未见明显母体毒性或胎仔毒性。

第[illegible]项胚胎-胎仔发育毒性试验中，妊娠大鼠于妊娠期第6~17天经皮给予吡美莫司剂量2、6、10 mg/kg/天（0.2%、0.6%和1%吡美莫司乳膏1 g/kg），每天暴露时间约22小时，在最高评价剂量10 mg/kg/天剂量下（按AUC计，相当于MRHD的0.66倍），未见与吡美莫司相关的母体、生殖或胚胎-胎仔毒性，所有剂量下均未见致畸性。

在大鼠中开展了经口给药的生育力和胚胎-胎仔发育毒性组合试验，在兔中开展了经口给药胚胎-胎仔发育毒性组合试验。大鼠、兔于器官发生期（大鼠于交配前2周至妊娠期第16天，兔于妊娠期第6~18天）给予吡美莫司剂量分别达45 mg/kg/天、20 mg/kg/天，在大鼠试验中未见母体毒性，在45 mg/kg/天剂量下（按AUC计，相当于MRHD的38倍），可见胚胎-胎仔毒性（着床后丢失和窝仔数减少），未见胎仔致畸性；在兔试验最高剂量20 mg/kg/天剂量下（按AUC计，相当于MRHD的3.9倍），未见母体毒性、胚胎毒性或致畸性。

在大鼠中开展了第二项经口给药胚胎-胎仔发育毒性试验。大鼠于器官发生期（妊娠期第6~17天）经口给予吡美莫司2、10和45 mg/kg/天，在45 mg/kg/天剂量下（按AUC计，相当于MRHD的271倍），可见母体毒性、胚胎致死性和胎仔毒性，还可见骨骼变异轻微增加，表现为骨骼骨化延迟。在10 mg/kg/天剂量下（按AUC计，相当于MRHD的[illegible]倍），未见母体毒性、胚胎致死性或胎仔毒性。该试验任何剂量下均未见致畸性。

在兔中开展了第二项经口给药胚胎-胎仔发育毒性试验。兔于器官发生期（妊娠期第7~20天）经口给予吡美莫司2、6和20 mg/kg/天，在20 mg/kg/天剂量下（按AUC计，相当于MRHD的12倍），可见母体毒性、胚胎致死性和胎仔毒性，还可见骨骼变异轻微增加，表现为骨骼骨化延迟。在6 mg/kg/天剂量下（按AUC计，相当于MRHD的[illegible]倍），未见母体毒性、胚胎致死性或胎仔毒性。该试验任何剂量下均未见致畸性。

在大鼠中开展了经口给药围产期毒性试验。大鼠于妊娠期第[illegible]天至哺乳期第21天经口给予吡美莫司剂量达40 mg/kg/天，在最高剂量40 mg/kg/天剂量下，[illegible]只雌性大鼠中有[illegible]只产仔[illegible]。在该试验最高评价剂量10 mg/kg/天（按AUC计，相当于MRHD的13倍）剂量下，未见对产后存活率、F1代发育或随后的成熟或生育力有明显影响。

在大鼠、兔经口给药胚胎-胎仔发育毒性试验中吡美莫司可通过胎盘。

致癌性

为期2年的大鼠经皮给药致癌性试验中，相比溶媒和生理盐水对照组，1%吡美莫司乳膏在低、中和高剂量下可见雄性大鼠甲状腺滤泡细胞腺瘤发生率有统计学意义的升高。大鼠经皮给药致癌性试验中在最低剂量2 mg/kg/天剂量下（0.2%吡美莫司乳膏，按AUC计，相当于MRHD的1.5倍），可见甲状腺滤泡细胞腺瘤。大鼠经口给药致癌性试验中，剂量达10 mg/kg/天时（按AUC计，相当于MRHD的66倍），未见雄性大鼠甲状腺滤泡细胞腺瘤发生率升高。但是，经口给药试验可能不能反应经皮给药途径的持续暴露或相同代谢特征。吡美莫司乙醇溶液小鼠经皮给药致癌性试验中，在剂量[illegible] mg/kg/天（[illegible]）[illegible]按AUC计，相当于MRHD的2[illegible]倍）时，未见皮肤或其他器官的肿瘤发病率增加。吡美莫司乙醇溶液小鼠13周经皮给药毒性试验中，在25 mg/kg/天剂量下（按AUC计，相当于MRHD的[illegible]倍），可见淋巴增生性变化（包括淋巴瘤），在10 mg/kg/天剂量下（按AUC计，相当于MRHD的17倍），未见淋巴增生性变化，但是经皮给予溶于乙醇的吡美莫司，在100 mg/kg/天剂量下（按AUC计，相当于MRHD的[illegible]倍），淋巴瘤形成的潜伏期缩短至8周。

小鼠经口给药致癌性试验中，相比溶媒对照组，在高剂量下可见雌雄小鼠[illegible]发生率有统计学意义的升高。在45 mg/kg/天剂量下（按AUC计，相当于MRHD的258~340倍）可见淋巴瘤，在15 mg/kg/天剂量下（按AUC计，相当于MRHD的60~133倍）未见药物相关的肿瘤。

大鼠经口给药致癌性试验中，相比溶媒对照组，吡美莫司在10 mg/kg/天剂量下，可见雌雄大鼠良性胸腺瘤发病率有统计学意义的升高。另外，在另一项大鼠经口给药致癌性试验中，相比溶媒对照组，吡美莫司在5 mg/kg/天剂量下，[illegible]性胸腺瘤发病率显著升高。在1 mg/kg/天剂量下（按AUC计，相当于MRHD的1.[illegible]倍）雄性大鼠和[illegible]5 mg/kg/天剂量下（按AUC计，相当于MRHD的21倍）均未见药物相关的肿瘤。

52周皮肤光致癌性试验中，在长期局部给予吡美莫司乳膏同时暴露于紫外线照射后（给药期40周，[illegible]观察12周），无毛小鼠皮肤肿瘤形成[illegible]位发病时间减少。相比空白乳膏，添加活性成分吡美莫司后，未见对肿瘤发展的额外作用。

猴连续39周经口给予吡美莫司15、45和120 mg/kg/天毒性试验中，可见与淋巴瘤疾病（一种与人类EB病毒相关的猴淋巴病毒）相关的免疫抑制相关淋巴增生障碍（IRLD）的发生呈剂量依赖性增加。猴IRLD反映了移植患者在经长期全身免疫抑制治疗后、移植后淋巴增生性疾病（PTLD）经长期全身免疫抑制治疗后的情况。IRLD和PTLD都可以发展为淋巴瘤，这取决于全身免疫抑制治疗的剂量和持续时间。在该项猴试验中，可见机会性感染（全身免疫抑制的信号）呈剂量依赖性增加，未确定IRLD和机会性感染的无明显不良反应水平（NOAEL）。在该项试验中，[illegible]最低剂量15 mg/kg/天持续给药39周（按AUC计，相当于1%吡美莫司乳膏MRHD的31倍）可见IRLD，停止给药后，部分[illegible]。

【药代动力学】

动物试验资料

在小型猪单次皮肤给药（半封包22小时）后，吡美莫司[illegible]0.03%[illegible]部位，放射性物质标记的药物活性成份相关物质的量，持续10天没有明显改变。

人体研究资料

成人的吸收情况

对12名患有特应性皮炎的成人患者进行了吡美莫司系统吸收情况的研究。患者每日使用吡美莫司乳膏两次，为期3周。受累皮肤面积（BSA）范围为15-59%。结果显示77.5%的吡美莫司血药浓度低于0.5ng/ml（[illegible]），99.8%的吡美莫司血药浓度低于1 ng/ml。仅在一名患者测得吡美莫司的最高血药浓度为1.4ng/ml。

40名成人患者使用吡美莫司乳膏治疗1年，初始受累皮肤面积为14-62%，98%的患者吡美莫司血药浓度持续保持在低水平，大多数低于0.5ng/ml，测得的最高血浓度为0.8ng/ml，仅见于治疗第6周的两名患者。[illegible]12个月[illegible]中，患者的血药浓度均未升高。在8名成人特应性皮炎患者中，[illegible]至少三次测定AUC水平，AUC[illegible]的值为2.5~11.4ng·h/ml。

婴儿、儿童和青少年的吸收情况

在58名年龄为3个月至14岁的儿科患者中进行了吡美莫司系统吸收情况的研究，患者受累皮肤面积为10~92%，每日两次使用吡美莫司乳膏，为期3周，58名患者中的5名患者（8.6%）（包括2名3~6个月的患者和3名6~12个月的患者）因治疗需要使用长达1年。

在此组患者中，吡美莫司血药浓度持续较低，且与皮疹的面积或治疗时间无关，血药浓度变化范围与成人患者相似。

大约67%[illegible]的吡美莫司血液样本低于0.5 ng/ml，93%低于2 ng/ml（3~23个月龄）。在3~6个月年龄组，31%的血液样本中吡美莫司浓度低于0.5 ng/ml，99%低于2 ng/ml，仅在一名患者样本中观察到最高的血药浓度为4.1[illegible]。

在6~12个月年龄组，66%的血液样本中吡美莫司浓度低于0.5 ng/ml，90%低于2.0 ng/ml，仅在一名患者样本中观察到最高的血药浓度为2.6 ng/ml。

在12~24个月年龄组，80%的血液样本中吡美莫司浓度低于0.5 ng/ml，97%低于2.0 ng/ml，仅在一名患者样本中观察到最高的血药浓度为2.0 ng/ml。

在5名治疗时间长达1年的儿童中（2名3~6个月以及3名6~12个月的患者），血药浓度持续较低，最高的血药浓度为1.94 ng/ml，仅见于一名3~6个月的患者。在12个月的治疗期间，所有患者的血药浓度均无升高。

在儿童和青少年的所有样本中（2~14岁），66%的吡美莫司血液浓度低于0.5 ng/ml，99%低于2.0 ng/ml，在一名患者样本中观察到最高的血药浓度为2.0 ng/ml。

8名年龄为2~14岁的患者每月至少测定三次血药浓度，观察到的AUC[illegible]范围为5.4~18.8 ng·h/ml。AUC变化范围在受累面积小于40%的患者和受累面积大于等于40%的患者相[illegible]。

在临床药理学研究中，治疗的最大受累皮肤体表面积为92%，在III期临床试验中治疗的最大受累皮肤体表面积达100%。

口服药代动力学数据的比较

在[illegible]患者口服吡美莫司的试验中，服用剂量范围为[illegible]每天5mg一次到每天30mg两次，持续4周，所有剂量包括高剂量耐受性良好，没有明显的不良反应事件报告。体检、生命体征和试验室（[illegible]

[illegible]h/ml，该试验对比成人和儿童特应性皮炎患者局部使用吡美莫司乳膏每天两次，持续3周时的系统暴露量（AUC[illegible]分别为1.4ng·h/ml~18.8ng·h/ml）分别高26倍和16倍。

分布、代谢和排泄

与皮肤选择性作用机理一致，吡美莫司外用后血药浓度极低。因此，局部用药后无法测定吡美莫司的代谢。

体外的血浆蛋白结合试验的结果表明，血浆中99.6%的吡美莫司与血浆蛋白结合。血浆中吡美莫司主要和不同的脂蛋白结合。

健康受试者单次口服放射标记的吡美莫司后，原型吡美莫司为血中主要活性成分，另有许多具有中等极性的次要代谢产物，可能是氧-脱甲基化和氧化产物。

在人皮肤的体外研究中未发现吡美莫司的代谢。

放射标记的吡美莫司主要通过粪便排出（78.4%），只有一小部分（2.5%）通过尿液排出。总的平均放射性物质检测率是80.9%。尿液中检测不到原药，粪便中仅测得不足1%是原型吡美莫司。

【贮　　藏】遮光，密封，不超过25℃保存，不得冷冻。

【包　　装】铝质药用软膏管，[illegible]。

【有 效 期】24个月，首次开封后最长使用期限为12个月且不应超出本品的有效期。

【执行标准】YBH13812025

【批准文号】国药准字H20234015

【上市许可持有人】

名　　称：海南皇隆制药股份有限公司
注册地址：海南省海口国家高新技术产业开发区药谷三横路8号
邮政编码：570311
电话号码：0898-6861[illegible]0
传真号码：0898-68616811
网　　址：http://www.[illegible]nghuanglong.com

【生产企业】

企业名称：海南皇隆制药股份有限公司
生产地址：海南省海口国家高新技术产业开发区药谷三横路8号
邮政编码：570311
电话号码：0898-68616800
传真号码：0898-68616811
网　　址：http://www.hnhuanglong.com