

核准日期：2009 年 01 月 16 日

修改日期：2012 年 03 月 19 日，2013 年 09 月 22 日，2016 年 01 月 06 日，  
2016 年 06 月 15 日，2017 年 03 月 10 日，2018 年 03 月 01 日，  
2021 年 01 月 08 日，2021 年 01 月 29 日，2021 年 05 月 11 日，  
2022 年 04 月 16 日

外

## 盐酸氮卓斯汀滴眼液说明书

请仔细阅读说明书并在医生指导下使用

### 【药品名称】

通用名称：盐酸氮卓斯汀滴眼液

商品名称：爱赛平® Azep®

英文名称：Azelastine Hydrochloride Eye Drops

汉语拼音：Yan Suan Dan Zhuo Si Ting Di Yan Ye

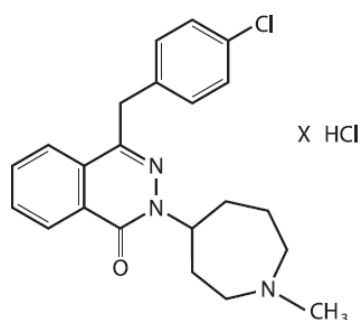
### 【成份】

主要成份为：盐酸氮卓斯汀

防腐剂为：苯扎氯铵，每 1ml 含有 0.125mg。

化学名称为：4-(对氯苯甲基)-2-(1-甲基-4-六氢氮卓基)-2,3-二氮杂萘-1(2H)-酮的盐酸盐

其化学结构为：



分子式：C<sub>22</sub>H<sub>24</sub>ClN<sub>3</sub>O • HCl

分子量：418.37

### 【性状】

本品为无色的澄清液体。

### 【适应症】

适用于治疗过敏性结膜炎引起的眼痒症状。

## 【规格】

6ml: 3mg

## 【用法用量】

眼部滴入，推荐剂量为每眼 1 滴，每眼每日 2 次。使用方法：



1 用洁净纸巾轻柔地拭干眼睛周围的水分  
2 旋开瓶盖



3 将头部略向后仰，轻轻地将下眼睑在靠中位置按下



4 将一滴滴眼液滴在下眼睑中间位置，注意勿让瓶尖触及眼睛



5 将按着下眼睑的指头转为轻按下眼睑内部靠近鼻梁的位置，保持轻按姿势并将眼睛眨数次，从而使滴眼液在眼球表面散开。拭干溢出眼睛的滴眼液  
6 在另一只眼睛重复上述程序

## 【不良反应】

按照以下发生频率评估不良反应：

非常常见 ( $\geq 1/10$ )

常见 ( $\geq 1/100$  至  $< 1/10$ )

不常见 ( $\geq 1/1,000$  至  $< 1/100$ )

罕见 ( $\geq 1/10,000$  至  $< 1/1,000$ )

非常罕见 ( $< 1/10,000$ )

未知 (不能从现有数据估算)

### 神经系统疾病

不常见：苦味。

### 眼部疾病

常见：眼睛的轻度、一过性刺激。

### 免疫系统疾病

非常罕见：过敏反应 (如皮疹和瘙痒)。

## 【禁忌】

对本品活性成份和任一辅料过敏者禁用。本品的辅料包含苯扎氯铵、依地酸二钠、羟丙甲纤维素、山梨糖醇液 (结晶)、氢氧化钠和注射用水。

## 【注意事项】

1. 盐酸氮卓斯汀滴眼液不适于眼部感染的治疗。
2. 本品含有防腐剂苯扎氯铵。苯扎氯铵可能会对眼睛产生刺激，特别是当患有干眼症或角膜疾病时。应避免接触软性隐形眼镜。使用产品前应将隐形眼镜摘除，并且在使用本品至少 15 分钟后才可佩戴。已知本产品会使软性隐形眼镜变色。

3. 对驾车与操作机器的影响：使用之后可发生轻度、一过性的刺激，对视力不太可能有更程度的影响。但是，如果对视力有任何一过性的影响，应当告知患者在该刺激消除之后才可以驾驶或操作机械。
4. 药品开启瓶封后，使用不可超过四周。

#### **【孕妇及哺乳期妇女用药】**

尚未在孕妇中进行充分且良好对照的临床试验。动物研究显示，在高剂量经口给药时，盐酸氮卓斯汀可导致动物胚胎死亡、生长迟缓和骨骼畸形。而眼睛局部给药时，本品的系统暴露量极低（血药浓度仅处在皮克级水平）。但，在孕妇中应慎用，只有经医生充分权衡利弊评估后认为获益大于潜在风险的前提下方可使用。

哺乳期妇女用药时，在乳汁中可检测出微量的活性成份。因此，不推荐用于哺乳期妇女。

#### **【儿童用药】**

4 岁以下儿童使用盐酸氮卓斯汀滴眼液的安全有效性尚不明确，故不推荐该人群使用。

#### **【老年用药】**

在老年患者和年轻患者之间未观察到本品安全有效性上存在差异。

#### **【药物相互作用】**

未发现与其他药物或食物有相互作用。

#### **【药物过量】**

眼部用药过量后未发现特殊反应，经眼部途径给药预计不会出现药物过量情况。

目前没有人体接受过中毒剂量给药的经验。根据动物试验的结果，在过量或中毒剂量的情况下，有可能会发生中枢神经系统障碍，可对症治疗，无已知解毒剂。

#### **【药代动力学】**

##### **一般特点（全身药代动力学）：**

口服药物后，氮卓斯汀迅速被人体吸收，其绝对生物利用度为 81%。食物对吸收无影响，药物分布的容积较大，主要集中于周围组织。由于其蛋白结合水平相对较低（80-90%），药物发生置换反应的可能性不大。单剂量给予氮卓斯汀后，其血浆半衰期大约为 20 小时，而其活性代谢产物 N-Desmethyl 氮卓斯汀大约为 45 小时。排泄主要经粪便排除。粪便中少量药物的持久排泄提示药物可能进行肠肝循环。

##### **病人特点（眼部药代动力学）：**

患者反复眼部用盐酸氮卓斯汀滴眼液（每天四次，每次每眼一滴），其盐酸氮卓斯汀的稳态血浆  $C_{max}$  水平是非常低的，只有在定量限值水平或低于定量限值水平才可以被检测到。

## 【药理毒理】

### 药理作用

盐酸氮卓斯汀是相对选择性的组胺 H1 受体拮抗剂，可抑制参与过敏反应的细胞（如肥大细胞）释放组胺和其它介质。采用人细胞系进行的体外试验已证实盐酸氮卓斯汀可抑制参与过敏反应的其它介质（如白三烯和血小板活化因子）释放。另外，已证实盐酸氮卓斯汀可降低对嗜酸性粒细胞的激活和趋化。

### 毒理研究

#### 遗传毒性

盐酸氮卓斯汀 Ames 试验、DNA 损伤修复试验、小鼠淋巴瘤细胞正向突变试验、大鼠骨髓染色体畸变试验和小鼠微核试验结果均为阴性。

#### 生殖毒性

在大鼠生育力和早期胚胎发育毒性试验中，经口给药剂量高达人眼用最大推荐剂量（按照 30 $\mu$ L/滴计算，50kg 人最大推荐给药剂量约为 0.001mg/kg/天）的 25000 倍时，对雌、雄大鼠生育力未见明显影响；在 68.6mg/kg（人眼用最大推荐剂量的 57000 倍）剂量下，雌性大鼠发情周期延长，交配活动和妊娠大鼠数量减少，黄体数和着床数降低，但着床率未受影响。小鼠经口给予盐酸氮卓斯汀 68.6mg/kg/天（人眼用推荐剂量的 57000 倍），可见明显的胚胎-胎仔毒性和致畸作用（外观和骨骼异常）。大鼠经口给予盐酸氮卓斯汀 30mg/kg/天（人眼用推荐剂量的 25000 倍），可见骨化延迟（掌骨未骨化）和 14 肋骨发生率增加。大鼠经口给予盐酸氮卓斯汀 68.6mg/kg/天（人眼用推荐剂量的 57000 倍），可见胚胎吸收和胎仔毒性。这些仅在药物高暴露水平下发现的骨骼异常与人类相关性尚不明确。

#### 致癌性

大鼠和小鼠分别连续 24 个月经口给予盐酸氮卓斯汀高达 30mg/kg/天和 25mg/kg/天（分别为人眼用最大推荐剂量的 25000 倍和 21000 倍），未见致癌性。

## 【贮藏】

储存温度不高于 30°C。

## 【包装】

塑料瓶装，6ml/支/盒

## 【有效期】

36 个月。开启瓶封包装后，使用时间不超过 4 周。

## 【执行标准】

进口药品注册标准：JX20080041

**【药品批准文号】**

国药准字 HJ20171048

**【上市许可持有人】**

名称： MEDA Pharma GmbH & Co. KG

注册地址： Benzstrasse 1, 61352 Bad Homburg, Germany

联系方式： +49(0)617 2888 1347

传真号码： +49(0)617 2888 1112

**【生产企业】**

企业名称： Tubilux Pharma S.p.A.

生产地址： Via Costarica 20/22, 00071 Pomezia/Rome, Italy

联系方式： +49(0)617 2888 1347

传真号码： +49(0)617 2888 1112

**【境内联系机构】**

名称： 晖致医药有限公司

地址： 上海市静安区新闻路 669 号 46 层（名义楼层）

邮政编码： 200041

联系方式： 400 910 8830