

**MEDA Pharma GmbH & Co. KG**  
Bad Homburg

核准日期: 2008年05月29日  
修改日期: 2009年03月13日, 2012年03月19日, 2013年10月10日  
2015年04月29日, 2015年07月23日, 2016年08月15日  
2017年08月31日, 2019年07月25日, 2020年09月10日,  
2020年11月24日, 2021年01月08日, 2022年03月09日

## 盐酸氮草斯汀鼻喷雾剂说明书

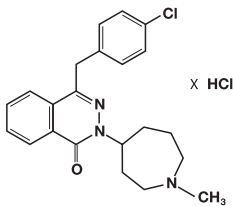
请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

### 【药品名称】

通用名称: 盐酸氮草斯汀鼻喷雾剂  
商品名称: 爱赛平®  
AZEP®  
英文名称: Azelastine Hydrochloride Nasal Spray  
汉语拼音: Yansuan Danzhuositing Bipenwuji

### 【成份】

本品主要成份为盐酸氮草斯汀。  
化学名称: (左右旋) -4- (氯苯基) 甲基-2- (六氢-1-甲基-1H-环己亚-4-胺) - (2H) - 二氮杂萘酮氯化氢  
化学结构式:



分子式: C<sub>22</sub>H<sub>24</sub>ClN<sub>3</sub>O · HCl  
分子量: 418.37

### 【性状】

本品为无色或几乎无色的澄清液体。

### 【适应症】

季节性过敏性鼻炎 (花粉症)  
常年性过敏性鼻炎

### 【规格】

10ml: 10mg, 60喷, 每喷0.14mg

### 【用法用量】

用法: 喷药时保持头部直立 (见使用方法)



用量: 1喷/鼻孔, 早晚各1次, 每日2次 (相当于每日0.56mg盐酸氮草斯汀剂量)  
或遵医嘱。在症状消失前应坚持使用本品。

### 【不良反应】

按照以下惯例对不良反应发生率进行分类。

十分常见 (≥1/10)	常见 (≥1/100至1/10)
偶见 (≥1/1,000至<1/100)	罕见 (≥1/10,000至<1/1,000)
十分罕见 (<1/10,000)	
未知 (无法从现有数据估算)	

#### 免疫系统疾病

十分罕见: 超敏反应;

#### 各类神经系统疾病

常见: 若给药方法不正确 (如头部后仰, 详见使用方法) 会有苦味的感觉, 偶尔会产生恶心的症状;  
十分罕见: 眩晕;

#### 呼吸系统, 胸及纵膈疾病

偶见: 喷药时可能会对发炎的鼻粘膜产生刺激 (例如刺痛、鼻痒)、喷嚏和鼻衄;

#### 胃肠道系统疾病

罕见: 恶心;

#### 皮肤和皮下组织类疾病

十分罕见: 皮疹、瘙痒、荨麻疹;

#### 全身性疾病及给药部位各种反应

十分罕见: 疲乏 (疲倦、乏力)、头晕或虚弱, 这些也可由疾病本身所导致。

### 【禁忌】

对本品活性成份或任一辅料超敏者禁用。

### 【注意事项】

- 仅限于鼻腔内局部使用, 避免接触口腔、眼部等。
- 用药期间应尽量避免服用含酒精的饮料。
- 如正在服用或最近使用过某种药物, 应告知医生。
- 应放置于儿童接触不到的地方。

#### 对驾车与操作机器的影响:

十分罕见: 疲乏、疲倦、乏力、头晕或虚弱可能由疾病本身引起, 也可能当使用本品时出现。这些情况可能会使驾驶和使用机械的能力下降。因此当跟酒精或者其他降低反应力的药物合用时, 应该特别注意。

#### 【孕妇及哺乳期妇女用药】

生育力

在动物实验中, 口服给药后可观察到对生育力的影响。

妊娠期

对动物进行超大剂量的药物试验并没有产生与药物相关的致畸反应, 但对于妊娠前3个月妇女, 治疗上不推荐使用该药物。

**哺乳期**

哺乳期妇女不应使用本品，因为本品在哺乳期的安全性数据尚未充分建立。

**【儿童用药】**

6岁及6岁以上儿童用药同成人用法用量。5岁及5岁以下儿童不推荐使用。

**【老年用药】**

见用法用量。

**【药物相互作用】**

迄今为止，尚无药物相互作用的报告。

**【药物过量】**

尚无人使用中毒剂量的实例。动物试验结果表明一旦发生药物服用过量或中毒，中枢神经系统会发生紊乱。须对症治疗，无已知的解毒剂。

**【药理毒理】****药理作用**

盐酸氮草斯汀是一种选择性组胺H<sub>1</sub>受体拮抗剂。动物实验数据表明，高浓度的盐酸氮草斯汀可以阻止过敏反应中某些化学介质的合成和释放（例如：白三烯、组胺、5-羟色胺）。

**毒理研究****重复给药毒性**

大鼠和犬重复给药毒性试验中，超过人体每日最大剂量75倍时观察到一般毒性症状。大鼠在剂量超过人体每日口服治疗剂量的200倍（根据体重计算）时，肝脏重量增加、胞体增大、脂肪浸润、血清谷草转氨酶（AST）、谷丙转氨酶（ALT）、碱性磷酸酶（ALP）升高，肾脏重量增加、尿素、尿量、钠、钾和氯的排泄增加，肝脏和肾脏为毒性靶器官。幼龄和成年动物的无毒性剂量高于人体每日最大口服治疗剂量的30倍。

大鼠及犬连续6个月鼻腔给予最大可能的盐酸氮草斯汀鼻喷雾剂剂量（根据体重计算，分别约为人体鼻腔治疗剂量的130倍、25倍），未出现局部或器官特异性毒性。

**遗传毒性**

盐酸氮草斯汀在Ames试验、DNA损伤修复试验、小鼠淋巴瘤细胞正向突变试验、小鼠微核试验和大鼠骨髓染色体畸变试验中均未发现遗传毒性。

**生殖毒性**

大鼠经口给予盐酸氮草斯汀剂量达30mg/kg[以mg/m<sup>2</sup>计算，约为人体每日最大推荐剂量（MRHDID）1.096mg的270倍]，对雄性和雌性的生育力及生殖功能未见明显影响。在68.6mg/kg剂量下（以mg/m<sup>2</sup>计算，约为MRHDID的610倍），雌性大鼠发情周期延长，交配活动、妊娠次数减少，黄体数和着床数降低，但着床前丢失率未增加。

**胚胎-胎仔发育毒性试验**

小鼠在器官形成期经口给予盐酸氮草斯汀68.6mg/kg/日（以mg/m<sup>2</sup>计算，约为MRHDID的300倍），可引起母体毒性如体重降低，导致胚胎或胎仔死亡、畸形（腭裂、短尾或无尾、肋骨融合、缺失或分支）、骨化延迟及胎仔体重降低。在3mg/kg/日（以mg/m<sup>2</sup>计算，约为成人MRHDID的15倍）时，未见胎仔及母体毒性。

大鼠在妊娠期第7~17天的器官形成期经口给予盐酸氮草斯汀30mg/kg/日（以mg/m<sup>2</sup>计算，约为MRHDID的270倍），母体未见明显毒性，胎仔可见畸形（缺趾或短趾）、骨化延迟及骨骼变异。68.6mg/kg/日（以mg/m<sup>2</sup>计算，约为MRHDID的610倍）剂量，可引起胚胎-胎仔死亡、胎仔体重降低及严重的母体毒性。2mg/kg/日剂量（以mg/m<sup>2</sup>计算，约为MRHDID的20倍）对胎仔和母体未见明显影响。

兔在妊娠第6~18天经口给予盐酸氮草斯汀30mg/kg/日（以mg/m<sup>2</sup>计算，约为MRHDID的530倍），可导致流产、骨化延迟、胎仔体重降低及严重的母体毒性。0.3mg/kg/日剂量（以mg/m<sup>2</sup>计算，约为MRHDID的5倍）未见胎仔及母体毒性。

围产期发育毒性试验：大鼠在妊娠晚期至哺乳期（妊娠第17天至哺乳期第21天）经口给予盐酸氮草斯汀30mg/kg/日（以mg/m<sup>2</sup>计算，约为MRHDID的270倍），对幼仔发育未见不良影响。

动物试验中，少量盐酸氮草斯汀可透过胎盘并分泌到乳汁中。

**致癌性**

SD大鼠连续2年经口给予盐酸氮草斯汀，剂量达30mg/kg/日（以mg/m<sup>2</sup>计算，分别约为成人和儿童MRHDID的270倍、240倍）；NMR1小鼠连续2年经口给予盐酸氮草斯汀，剂量达25mg/kg/日（以mg/m<sup>2</sup>计算，分别约为成人和儿童MRHDID的110、100倍），均未见致癌性。

**【药代动力学】**

口服给药后，盐酸氮草斯汀能够迅速被人体吸收，绝对生物利用度为81%。食物对吸收无影响。主要分布在周围组织（80%-90%），尤其是在肺、皮肤、肌肉、肝脏和肾脏中，仅有微量分布在脑中，蛋白结合水平相对较低。单次给予盐酸氮草斯汀后，血浆清除半衰期盐酸氮草斯汀为20小时，具有治疗作用的活性代谢产物N-去甲氮草斯汀大约为45小时。已证明具有剂量线性动力学效应。本品及其代谢物大约有75%经粪便排泄，大约25%经肾脏排泄。最重要的代谢途径是环羟基化、N-二甲基化和氮杂环的氧化开环反应。

过敏性鼻炎患者使用日总剂量为0.56mg的盐酸氮草斯汀（例如每侧鼻孔每次1喷，每日2次）2小时后，观察到盐酸氮草斯汀的稳态平均血浆浓度大约为0.65 ng/ml，但是这并不会导致临床上相关系统的副作用。由于剂量线性效应，如果日剂量加大，可推测出平均血药浓度水平将会升高。

**【贮藏】**

8-30°C保存。

**【包装】**

玻璃瓶装，10毫升/瓶/盒

**【有效期】**

36个月。开瓶6个月后，请勿使用。

**【执行标准】**

进口药品注册标准：JX20200070

**【批准文号】**

国药准字HJ20150201

**【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： +49(0)617 2888 1112

**【生产企业】**

企业名称： Madaus GmbH  
生产地址： Luetticher Strasse 5, 53842 Troisdorf, Germany  
联系方式： +49(0)617 2888 1347  
传真： +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  
联系电话： 400 910 8830