

核准日期: 2025 年 11 月 18 日
修改日期: 2025 年 12 月 09 日



外

盐酸依匹斯汀滴眼液说明书

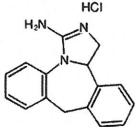
请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

【药品名称】

通用名称: 盐酸依匹斯汀滴眼液
英文名称: Epinastine Hydrochloride Eye Drops
汉语拼音: Yansuan Yipisiting Diyanye

【成份】

本品活性成份为盐酸依匹斯汀。
化学名称: (±)-3- 氨基 -9,13b- 二氢 -1H- 二苯 [c,f] 咪唑并 [1,5-a] 氮杂萘盐酸盐
化学结构式:



分子式: $C_{16}H_{15}N_3 \cdot HCl$

分子量: 285.78

辅料: 氯化钠、磷酸二氢钠、苯扎氯铵 (0.1mg/ml)、依地酸二钠、氢氧化钠、盐酸、注射用水。

【性状】

本品为无色的澄清液体。

【适应症】

用于治疗季节性过敏性鼻炎的症状。

【规格】

0.05% (5ml: 2.5mg)

【用法用量】

成年人推荐剂量为患眼每次 1 滴, 每日 2 次, 症状持续期间持续给药。

目前尚无本品使用超过 8 周的临床研究数据。

老年人群

本品尚未在老年人群中开展过研究。盐酸依匹斯汀片剂 (最高剂量 20 mg, 每日 1 次) 上市后的安全性数据表明, 与成年患者相比, 老年患者未见特殊的安全性问题。因此认为, 本品可用于老年患者, 剂量与成年患者相同, 无需调整剂量。

儿科人群

本品在 ≥ 12 岁儿童中的安全性和有效性已在临床试验中得到证实, 本品可用于 ≥ 12 岁儿童, 剂量与成年人相同。

本品用于 12 岁以下儿童患者的安全性和有效性尚未确定。(详见【儿童用药】)

肝功能不全人群

本品未在肝功能不全人群中开展过研究。盐酸依匹斯汀片剂 (最高剂量 20 mg, 每日 1 次) 上市后的安全性数据表明, 与肝功能正常的成年患者相比, 肝功能不全患者不良反应的发生率更高。10 mg 依匹斯汀片的日剂量是本品日剂量的 100 倍以上。此外, 依匹斯汀在人体内的代谢极少 (<10%)。因此认为, 本品用于肝功能不全的患者, 无需调整剂量。

肾功能不全人群

本品未在肾功能不全人群中开展过研究。盐酸依匹斯汀片剂 (最高剂量 20 mg, 每日 1 次) 上市后的安全性数据表明, 肾功能不全患者中未见特殊的安全性问题。因此认为, 本品用于肾功能不全的患者, 无需调整剂量。

给药方法

本品只能眼部滴用。

为避免眼睛和滴眼液受到污染, 请勿让滴眼液瓶口与眼睑、眼周等任何表面接触。

若与其他眼科药物同时使用, 两种用药之间应间隔至少 10 分钟。

【不良反应】

在原研药品国外临床研究中, 盐酸依匹斯汀滴眼液不良反应的总体发生率小于 10%, 未发生严重不良反应。大多数为轻度的眼部不良反应。最常见的不良反应是眼睛灼烧感 (多为轻度), 其他不良反应均为不常见。

不良反应根据系统器官类别, 按照严重程度的递减顺序呈现。不良反应按照下述情况进行分类: 非常常见 ($\geq 1/10$), 常见 ($\geq 1/100 \sim < 1/10$), 不常见 ($\geq 1/1000 \sim < 1/100$), 罕见 ($\geq 1/10000 \sim < 1/1000$), 非常罕见 ($< 1/10,000$), 未知 (无法根据现有数据估计)。

国外临床试验期间报告的不良反

系统器官分类	发生频率	不良反应
神经系统异常	不常见	头痛
	常见	眼睛灼烧感, 眼刺激
眼部异常	不常见	结膜 / 眼充血、眼分泌物、眼干、眼瘙痒、视力异常
	常见	鼻咽炎、上呼吸道感染
呼吸、胸部和纵隔异常	不常见	哮喘、鼻刺激、鼻炎、咳嗽
	不常见	味觉异常

上市后临床实践中报告的不良反

系统器官分类	发生频率	不良反应
免疫系统异常	未知	过敏反应包括眼部过敏的症状或体征, 和眼外过敏反应, 包括血管性水肿、皮肤皮疹和发红
眼部异常	未知	流泪增多、眼痛、眼肿、眼睑水肿

【禁忌】

对本品任何成份过敏者禁用。

【注意事项】

- 本品只用于眼部滴用, 不能用于注射或口服。
- 为避免眼睛和滴眼液受到污染, 请勿让滴眼液瓶口与眼睑、眼周等任何表面接触。不用时应将药瓶口拧紧。
- 若与其他眼科用药同时使用, 两种用药之间应间隔至少 10 分钟。
- 苯扎氯铵常用作眼科药物的防腐剂, 曾罕见报道苯扎氯铵会导致点状角膜病变和 / 或毒性溃疡性角膜病。由于本品含有苯扎氯铵, 因此需要对频繁或长期使用本品的患者进行密切监测。而且, 苯扎氯铵会被软性角膜接触镜吸收并导致其变色, 使用本品前应摘除软性角膜接触镜, 并在本品滴眼 15 分钟后重新佩戴。当佩戴软性角膜接触镜时应避免使用本品。
- 本品含有磷酸盐, 曾有报道在角膜严重受损的患者使用含磷酸盐滴眼液后, 会出现角膜钙化, 但较为罕见。
- 根据本品药效学、不良反应报告和特定的心理测量学研究, 本品对驾驶和使用机器的能力没有影响或影响可以忽略不计。如果滴眼时感到视物模糊, 应等到视物清楚后才可以驾驶或操作机器。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

妊娠:

国外有限数量 (11 例) 妊娠暴露的数据表明, 依匹斯汀对妊娠或对胎儿 / 新生儿健康没有不利影响。到目前为止, 没有其他相关的流行病学数据。
动物研究未发现对妊娠、胚胎 / 胎儿发育、分娩或产后发育有直接或间接的有害影响。

如果怀孕, 或可能怀孕或正计划怀孕, 使用该药前请咨询医生或药剂师, 处方时应谨慎。

哺乳期妇女:

依匹斯汀可通过大鼠的母乳分泌, 但目前尚不清楚依匹斯汀是否可通过人的母乳分泌。因缺少相关经验, 在使用前, 如患者正在哺乳期, 请咨询医生或药剂师, 处方时应谨慎。

【儿童用药】

盐酸依匹斯汀滴眼液在 ≥ 12 岁儿童中的安全性和有效性已在国外临床试验中得到证实。本品在国内临床研究 (ZKO-EPI-202111) 中共有 7 例 ≥ 12 岁儿童接受盐酸依匹斯汀滴眼液治疗, 安全性和有效性与整体人群相似。本品可用于 ≥ 12 岁儿童, 剂量与成人相同。

国外一项随机、双盲、安慰剂对照临床研究, 共纳入 96 例 3-12 岁的眼部无症状的健康儿童, 按照 2:1 的比例分配至盐酸依匹斯汀滴眼液组或安慰剂组, 连续治疗 6 周。研究结果表明依匹斯汀在 3-12 岁儿童中耐受性良好, 任何安全性数据两组均无明显差异。不良反应有结膜滤泡 (依匹斯汀和安慰剂组均为 6.3%) 和结膜充血 (依匹斯汀组为 1.6%, 安慰剂组未发生)。

12 岁以下儿童中的安全性和有效性尚未确定, 没有相关数据。

【老年用药】

盐酸依匹斯汀滴眼液国外尚未在老年人中进行过研究。盐酸依匹斯汀片剂 (高达 20mg, 每日一次), 上市后安全性数据表明老年人与成人相比, 无特别的安全性问题。本品可用于老年人, 剂量与成人相同, 不需要调整剂量。

【药物相互作用】

未进行药物相互作用研究。

由于盐酸依匹斯汀滴眼给药后全身暴露浓度极低, 预计在人体中没有药物 - 药物相互作用。此外, 依匹斯汀主要以药物原形从人体排出, 表示其代谢水平较低。

【药物过量】

0.3% 盐酸依匹斯汀滴眼液, 每日滴眼 3 次 (相当于每日推荐剂量的 9 倍) 后, 观察到可逆的瞳孔缩小, 对视力及其他眼部参数无影响。

一瓶 5ml 装的 0.05% 盐酸依匹斯汀滴眼液, 含有 2.5mg 盐酸依匹斯汀。已上市的盐酸依匹斯汀片用法为每日一次, 剂量高达 20mg, 因此, 即使口服整瓶的盐酸依匹斯汀滴眼液也不会出现中毒。

目前没有使用过量的报道。

【临床药理】

药效学

在动物眼部局部给药后, 依匹斯汀显示出抗组胺活性, 对炎症细胞聚集的调节作用和肥大细胞的稳定作用。

国外研究, 在人过敏原激发试验中, 0.05% 盐酸依匹斯汀滴眼液能够有效改善由眼部过敏原激发而引起的眼部症状, 且持续时间至少为 8 小时。

药代动力学

吸收: 0.05% 盐酸依匹斯汀滴眼液 1 滴 / 眼, 每天给药 2 次, 给药后 2 小时的平均 C_{max} 为 0.042 ng/ml。

分布: 盐酸依匹斯汀的稳态分布容积为 417 L, 血浆蛋白结合率约为 64%。

代谢: 代谢率 < 10%。

排泄: 清除率为 928 ml/min, 终末血浆消除半衰期约 8 小时。依匹斯汀主要由肾脏以原形排出。肾脏清除主要通过肾小管的主动分泌。

体外和体内的临床前研究表明, 依匹斯汀与黑色素结合并在兔和猴的眼部色素组织中蓄积。体外实验数据表明, 与黑色素的结合是中度且可逆的。

【药理毒理】

药理作用

依匹斯汀是一种局部活性的、直接的 H_1 受体拮抗剂和肥大细胞释放组胺的抑制剂。依匹斯汀对组胺 H_1 受体有选择性, 对组胺 H_2 受体有亲和力。依匹斯汀对 α_1 、 α_2 - 和 5-HT₂ 受体也具有亲和力。

毒理研究

遗传毒性

新合成批次的依匹斯汀 Ames 试验和人淋巴细胞体外染色体畸变结果为阴性, 在早年进行的早期批次的依匹斯汀人外周血淋巴细胞和 V79 细胞体外染色体畸变试验结果为阳性。在包括小鼠微核试验和中国仓鼠染色体畸变试验的依匹斯汀体内遗传毒性试验结果均为阴性。依匹斯汀的叙利亚仓鼠胚胎细胞转化试验、V79/HGPRT 哺乳动物细胞点突变试验和大鼠原代肝细胞 (体内和体外) 程序外 DNA 合成试验结果均为阴性。

生殖毒性

依匹斯汀对雄性大鼠生殖力未见明显影响; 雌性大鼠经口给药剂量约为最大推荐人眼用剂量 (MROHD) 90000 倍时, 可见生育力下降。在胚胎 - 胎仔发育毒性试验中, 妊娠大鼠以 0.0014 mg/kg/ 天经口给予依匹斯汀, 约为 MROHD 的 150000 倍 (以 mg/kg 计) 可见母体毒性, 但未见对胚胎的影响。妊娠兔以约 MROHD 的 55000 倍剂量经口给予依匹斯汀可见胚胎完全吸收和流产, 以上两项试验均未见药物相关的致畸作用。妊娠大鼠以约为 MROHD 的 90000 倍剂量经口给予依匹斯汀可见幼鼠体重增长降低。

致癌性

小鼠 18 个月和大鼠两年掺食法给予依匹斯汀高达 40 mg/kg, 约为 MROHD 的 30000 倍 (假设人体和动物均为 100% 吸收), 未见致癌作用。

【贮藏】

遮光, 密闭, 不超过 25°C 保存。请将本品放在儿童不能接触的地方。

本品开封后请在 28 天内使用, 过期应丢弃。

【包装】

低密度聚乙烯药用滴眼剂瓶, 1 支 / 盒。

【有效期】

24 个月

【执行标准】

YBH27272025

【批准文号】

国药准字 H20256012

【上市许可持有人】

名称: 兆科 (广州) 眼科药物有限公司
注册地址: 广州市南沙区珠江工业园美德三路 1 号自编 A 区 5 层 501 房
邮政编码: 511466
电话和传真号码: 电话 020-39062828, 传真: 020-39062838
网址: <https://www.zkoph.com>
【生产企业】
企业名称: 兆科 (广州) 眼科药物有限公司
生产地址: 广州市南沙区珠江工业园美德三路 1 号自编 B 栋 5 楼
邮政编码: 511466
电话和传真号码: 电话 020-39062828, 传真: 020-39062838
网址: <https://www.zkoph.com>

