

核准日期：2014 年 12 月 30 日  
修改日期：2018 年 03 月 14 日  
2018 年 10 月 31 日  
2020 年 09 月 03 日  
2021 年 09 月 01 日  
2022 年 01 月 12 日  
2025 年 04 月 02 日

2018 年 07 月 27 日  
2019 年 03 月 29 日  
2021 年 07 月 20 日  
2021 年 09 月 06 日  
2022 年 08 月 29 日



## 盐酸奥洛他定片说明书

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：盐酸奥洛他定片

英文名称：Olopatadine Hydrochloride Tablets

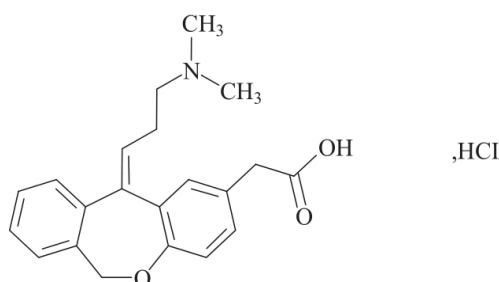
汉语拼音：Yansuan Aoluotading Pian

### 【成份】

本品活性成份为盐酸奥洛他定。

化学名称：{11-[(1Z)-3-(二甲氨基)亚丙基]-6,11-二氢二苯并[b,e]恶庚英-2-基}乙酸盐盐酸盐

化学结构式：



分子式：C<sub>21</sub>H<sub>23</sub>NO<sub>3</sub>·HCl

分子量：373.88

**【性状】** 本品为薄膜衣片，除去包衣后显白色或类白色。

**【适应症】** 过敏性鼻炎、荨麻疹、瘙痒性皮肤病（湿疹、皮炎、痒疹、皮肤瘙痒症、寻常性银屑病、渗出性多形红斑）。

**【规格】** 5mg

### 【用法用量】

本品为口服片剂。成人用量通常为 1 日 2 次，1 次 5mg，早晨和晚上睡前各服 1 次。

根据年龄及症状适当增减。

肝肾功能不全者慎用（见【注意事项】）。

### 【不良反应】

国外注册试验及上市后调查（包括长期使用调查）的 9620 例患者中，有 1056 例（发生率 11.0%）发生不良反应或实验室检查值异常，共计 1402 件。

主要不良反应为嗜睡 674 件（7.0%），丙氨酸氨基转移酶（ALT/GPT）上升 68

件（0.7%），倦怠感 53 件（0.6%），天冬氨酸氨基转移酶（AST/GOT）上升 46 件（0.5%），口渴 36 件（0.4%）等。

1)严重不良反应

暴发性肝炎、肝功能损害、黄疸（发生率不明）：有可能发生暴发性肝炎、伴随 AST（GOT）、ALT（GPT）、 $\gamma$ -谷氨酰转肽酶（ $\gamma$ -GTP）、乳酸脱氢酶（LDH）、碱性磷酸酶（ALP）上升等的肝功能损害、黄疸，故应注意观察。若出现异常，应停药并进行适当处置。

2)其他不良反应

有可能发生以下不良反应，故应注意观察，发现异常时应进行减量或停药等适当处置。

	≥5%	≥0.1%且<5%	<0.1%	发生率不明
过敏症 —注)		红斑等发疹、浮肿（颜面/四肢等）	瘙痒、呼吸困难	
神经系统	嗜睡	倦怠感、口渴、头痛/头重感、头晕	注意力低下，麻木感	不随意运动（颜面/四肢等）
消化系统		腹部不适感、腹痛、痢疾、恶心	便秘、口内炎/口角炎/舌痛、胃部烧灼感、食欲亢进	呕吐
肝脏		肝功能异常[AST（GOT）、ALT(GPT)、 $\gamma$ -GTP、LDH、ALP、总胆红素上升]		
血液		白细胞增多/减少、嗜酸性粒细胞增多、淋巴细胞减少	白细胞减少、血小板减少	
肾脏、泌尿系统		尿潜血	BUN 上升、尿蛋白阳性、血肌酐上升、尿频、排尿困难	
循环系统			心悸、血压上升	
其他		血清胆固醇上升	尿糖阳性、胸部不适感、味觉异常、体重增加、潮热	月经异常、肌肉痛、关节痛

注) 出现此类症状时应停止服药。

**【禁忌】**

对本品成份有过敏史的患者禁用。

**【注意事项】**

1. 慎重给药（以下患者应慎重服药）

1) 肾功能低下患者：有血药浓度持续偏高的可能，参照【药代动力学】部

分。

2) 老年人：高龄患者服药，参照【老年用药】、【药代动力学】部分。

3) 肝功能损害的患者：有可能造成肝功能损害的恶化。

## 2. 重要的基本注意事项

1) 因服用本品会产生嗜睡，服药患者应避免从事驾驶机动车等有危险的机械操作。

2) 长期接受类固醇治疗的患者若因服用本品而需减少类固醇量时应在严格管理下逐渐减量。

3) 季节性患者服用本品时，应考虑在多发季节即将来临时开始服药，并持续至多发季节结束。

4) 若使用本品无效，注意不要盲目地长期服药。

## 3. 用药须知

### 1) 发药时

对于 PTP 包装的药品，请指导患者从 PTP 板中取出药物后服用。（有因误服 PTP 板而造成坚硬边角刺入食道粘膜，从而引起穿孔和引发纵隔炎等严重并发症的报告）

### 2) 分割使用时

分割后应避光保存。

## 4. 其他注意事项

1) 由于服用本品会抑制过敏性皮内反应，影响过敏的确认，所以进行皮内反应检验前不要服用本品。

2) 虽因果关系尚不明确，但服用本品过程中曾有出现心肌梗死的报告。

## 【孕妇及哺乳期妇女用药】

1. 对于孕妇或可能处于妊娠期的妇女，只有在疗效高于危险性时方能服药。（尚未确立妊娠期妇女服药的安全性）

2. 哺乳期妇女应尽量避免服用本品，必须服用时应停止哺乳。[动物试验（大鼠）中有向乳汁中迁移和新生儿体重增加受抑制的报道。]

## 【儿童用药】

尚未明确低体重新生儿、新生儿、哺乳期婴儿、幼儿用药的安全性。（使用经验少）

## 【老年用药】

由于多数老年患者生理机能低下，更容易出现不良反应，所以应采取从低剂量开始等方法，在注意观察患者状态的同时慎重给药。

## 【药物相互作用】

尚不明确。

## 【药物过量】

在 1 期临床试验中，6 名健康成年男子单次口服本品 80mg，4 例出现嗜睡，1 例出现倦怠感（并发嗜睡），1 例出现注意力下降症状。

## 【药理毒理】

## 药理作用

本品主要对组胺 H<sub>1</sub> 受体具有选择性拮抗作用，并抑制化学递质（白三烯、凝血恶烷、PAF 等）的生成和游离，对神经递质速激肽的游离具有抑制作用。

### 1. 抗组胺作用

在受体结合试验中，对组胺 H<sub>1</sub> 受体具有很强的拮抗作用(Ki 值: 16nmol/L)，而对蕈毒碱 M<sub>1</sub> 受体几乎不显示亲合性，其作用具有选择性。另外，在对豚鼠的组胺诱导气管收缩反应中可显示抑制作用。

### 2. 实验性抗过敏作用

在过敏性鼻炎模型（豚鼠、大鼠）试验中，对抗原诱发的血管透过性亢进和鼻塞有抑制作用。对大鼠、豚鼠的被动皮肤过敏和过敏性气管收缩有较强的抑制作用。另外，对豚鼠的血小板活化因子（PAF）引起的过敏性气管亢进具有抑制作用。

### 3. 对递质的生成和游离过程的抑制作用

本品对大鼠腹腔肥大细胞释放的组胺的游离具有抑制作用（IC<sub>30</sub> 值，72μmol/L: 卵白蛋白刺激: 110μmol/L: 二硝基苯基牛血清白蛋白刺激: 26μmol/L: A-23187 刺激: 270μmol/L: 混合物 48/80 刺激），同时作用于花生油烯酸代谢体系，抑制人嗜中性粒细胞释放的白三烯(IC<sub>30</sub> 值: 1.8μmol/L)、凝血恶烷(thromboxane)(IC<sub>30</sub> 值: 0.77μmol/L)、PAF(生成: 10μmol/L 时抑制 52.8%; 游离: 10μmol/L 时抑制 26.7%)等脂质媒质的生成和游离。

### 4. 对速激肽游离的抑制作用

感觉神经末梢游离的神经递质速激肽参与过敏性疾病的发生和恶化。在豚鼠的主要支气管肌肉标本试验中，本品可抑制电刺激时速激肽参与的收缩反应（IC<sub>30</sub> 值: 5.0μmol/L），是通过 K<sup>+</sup>通道活动（SKCa 通道: small conductance Ca<sup>2+</sup>-activated K<sup>+</sup>通道）抑制速激肽游离而发挥作用的。

## 毒理研究

1. 以小鼠、大鼠和狗为对象进行的经口单次给药毒性试验，其 LD<sub>50</sub> 均为 1000mg/kg 以上。

2. 大鼠连续经口给药 52 周的无毒性剂量为 10mg/kg。

3. 大鼠 400mg/kg 经口给药未见致畸性。

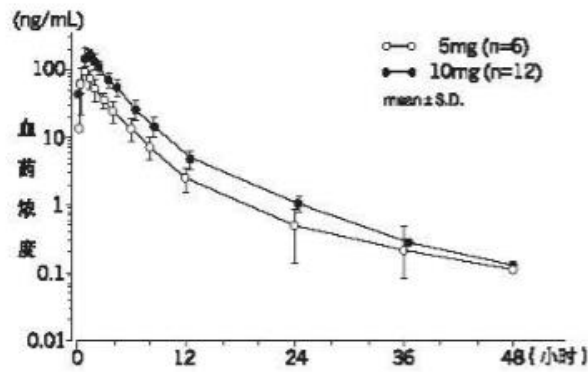
4. 用小鼠进行试验未见抗原性、致突变性、致癌性。

## 【药代动力学】

### 吸收

#### 1) 单次给药

健康成人在空腹条件下单次口服盐酸奥洛他定 5mg 和 10mg，血药浓度的变化和药代动力学参数如图表所示。主药的浓度用放射性免疫测定法（RIA 法）测定。



药代动力学参数

给药量 \ 参数	C <sub>max</sub> (ng/ml)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-∞</sub> (ng·hr/ml)
5mg	107.66 ± 22.01	1.00 ± 0.32	8.75 ± 4.63*	326 ± 63*
10mg	191.78 ± 42.99	0.92 ± 0.47	7.13 ± 2.21**	638 ± 136**

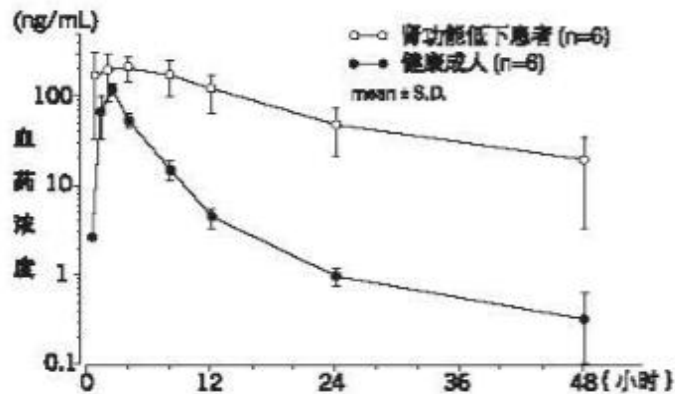
\*: n=4, \*\*: n=10

## 2) 多次给药

8 名健康成人口服盐酸奥洛他定 10mg/次，2 次/日，共 6 天，第 7 日服药 1 次，共计 13 次给药。第 4 天时血药浓度达稳态，C<sub>max</sub> 为单次服药时的 1.14 倍。（测定法：RIA 法）

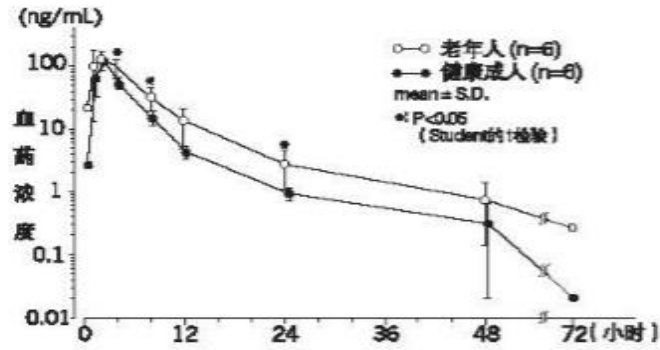
## 3) 肾功能低下患者（血液透析前）的单次服药

肌酐清除率为 2.3-34.4ml/min 的肾功能低下患者 6 名，于早饭后单次口服本品 10mg。血药浓度在服药后 1.0-8.0 小时达 C<sub>max</sub>，并呈一相性消失。肾功能低下患者的 C<sub>max</sub> 为健康成人的 2.3 倍，AUC 约为 8 倍（测定法：RIA 法）



## 4) 老年患者的单次给药

6 名老年患者(70 岁以上) 单次口服本品 10mg，血药浓度比健康成人高，C<sub>max</sub> 约为 1.3 倍，AUC 约为 1.8 倍。T<sub>1/2</sub> 基本相同，为 10-11 小时。（测定法：RIA 法）



## 分布

·组织内分布（参考：大鼠试验中的数据）

对大鼠经口给予  $^{14}\text{C}$ -盐酸奥洛他定 1mg/kg，大部分组织在给药 30 分钟后达最高放射能浓度。消化道及肝脏、肾脏和膀胱中的放射能浓度高于血浆中的放射能浓度。

·通透性、迁移性（参考：大鼠试验中的数据）

血脑屏障的通透性	对大鼠经口给予 $^{14}\text{C}$ -盐酸奥洛他定 1mg/kg 后，脑内放射能浓度在所有测定组织中最低，其 $C_{\text{max}}$ 约为血浆中放射能的 $C_{\text{max}}$ 的 1/25。
胎盘屏障的通透性	对妊娠大鼠经口给予 $^{14}\text{C}$ -盐酸奥洛他定 1mg/kg 后，胎儿血浆中和组织内的放射能浓度约为母体血浆中放射能浓度的 0.07-0.38 倍。
向母乳中的迁移性	对哺乳期大鼠经口给予 $^{14}\text{C}$ -盐酸奥洛他定 1mg/kg 后，乳汁中放射能的 $\text{AUC}_{0-\infty}$ 约为血浆中放射能的 $\text{AUC}_{0-\infty}$ 的 1.5 倍。

·蛋白结合率（体外超滤法）

添加浓度 (ng/ml)	0.1	10	1000
血清蛋白结合率 (%)	54.7	55.2	54.7

## 代谢

健康成人单次口服本品 80mg，血浆中代谢物为：N-氧化物约 7%，N-单脱甲基物约 1%（与原形药物的 AUC 比），尿中代谢物分别约为 3%和 1%（48 小时的累积尿中排泄率）。（测定法：LC/MS/MS 法）。

## 尿中排泄

健康成人单次口服本品 5mg 和 10mg，48 小时的原形药物的累积尿排泄率为给药量的 63.0~71.8%。

另外，多次给药 10mg/次，2 次/日，共 6 日，第 7 日服药 1 次，共计 13 次，尿中排泄率与单次服药基本相同。（测定法：LC/MS/MS 法）。

【贮藏】密封保存。

**【包装】** 铝铝包装，7片/板/盒，7片/板×2板/盒，14片/板×2板/盒，14片/板×3板/盒，14片/板×4板/盒。

**【有效期】** 36个月

**【执行标准】** 国家药品监督管理局标准 YBH10082021

**【批准文号】** 国药准字 H20143415

**【上市许可持有人】**

企业名称：北京四环科宝制药股份有限公司

注册地址：北京市丰台区科技园区海鹰路11号[园区]

邮政编码：100070

电话号码：010-63786796（药品安全咨询电话）

010-63786797（药品服务咨询电话）

网 址：[www.shkb.com.cn](http://www.shkb.com.cn)

**【生产企业】**

企业名称：安徽四环科宝制药有限公司

生产地址：安徽省阜阳市太和县经济开发区祥和路甲1号

邮政编码：236600

电话号码：0558-8585662

传真号码：0558-8583922

**【生产企业】**

企业名称：北京四环科宝制药股份有限公司

生产地址：北京市大兴区中关村科技园区大兴生物医药基地祥瑞街5号

邮政编码：102629

电话号码：010-63786796（药品安全咨询电话）

010-63786797（药品服务咨询电话）

传真号码：010-63786798