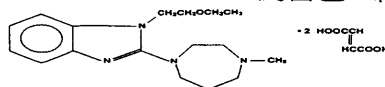


簡介：

EMADINE™ (Emedastine difumarate眼用溶液) 0.05%為含有Emedastine之無菌眼用溶液，局部給與在眼睛為一種相對選擇性的H<sub>1</sub>-接受體阻斷劑。Emedastine difumarate為白色、結晶、水可溶的微粒粉末；分子量為534.57；其化學結構式如下：



化學名：

1H-Benzimidazole,1-(2-ethoxyethyl)-2-(hexahydro-4-methyl-1H-1,4-diazepin-1-yl),(E)-2-butenedioate (1:2)

EMADINE 每毫升含：活性成份：0.884毫克Emedastine difumarate，相當於0.5毫克Emedastine；保存劑：Benzalkonium chloride 0.01%；賦形劑：Tromethamine、sodium chloride、Hydroxypropyl Methylcellulose、Hydrochloric acid/sodium hydroxide(調整酸鹼度)、及purified water。其酸鹼度約為7.4；Osmolality約為300 mOsm/kg。

臨床藥理學：

Emedastine是相對選擇性的組織胺H<sub>1</sub>接受體阻斷劑。Emedastine對組織胺接受體親和力的體外試驗檢查(H<sub>1</sub>: Ki=1.3 nM, H<sub>2</sub>: Ki=49,067 nM, H<sub>3</sub>: Ki=12,430 nM)，證實其對H<sub>1</sub>組織胺接受體相對選擇性。體內試驗研究顯示，局部眼部給與於結膜，因組織胺刺激所致之血管通透性具有濃度依賴性的抑制。Emedastine在腎上腺素、多巴胺、及羥基吲哚乙胺接受體上並沒有作用。

局部眼部給與於男性，顯示Emedastine之全身性曝露是低的。一項以10位正常志願者為對象的研究，以每天二次的劑量給與Emedastine 0.05%點眼液於雙眼持續15天，血漿中原型藥物之濃度一般都在定量分析之限度以下(<0.3 ng/mL)。Emedastine可定量的樣本，其範圍界於0.30-0.49 ng/mL。血漿中口服Emedastine之排除半衰期為3-4小時。大約44%的口服劑量，經過24小時在尿液中被回收，而僅有3.6%的劑量是以原型排出。兩種主要的代謝物5-及6-hydroxyemadastine，以游離型及結合型排於尿液中。5-及6-hydroxyemadastine的5-oxoanalogs，以及N-oxide亦被生成，而這些為次要的代謝物。

在周圍環境的研究中，患有過敏性結膜炎的病人以EMADINE治療六個禮拜，結果證實EMADINE可提供過敏性結膜炎在徵候及症狀上的舒緩。

在結膜抗原激發的研究中，在給藥後的最初及至4小時，受試者以抗原被激發，結果證實EMADINE在防止與過敏性結膜炎相關之眼睛癢方面，比安慰劑有更顯著的效果。

適應症：過敏性結膜炎症狀及徵候的暫時性緩解。

禁忌：已知對Emedastine difumarate或EMADINE中的任一成份過敏者禁用。

警告：EMADINE僅為局部使用，不可作為注射或口服之用。

注意事項：

患者：為了避免污染瓶口及溶液，應注意不要讓瓶口碰觸眼瞼或周邊部位。未使用時，請保持瓶蓋蓋緊。假如溶液已變色則勿用。假如患者之眼睛是紅的，建議勿戴隱形眼鏡。EMADINE不應被用於治療隱形眼鏡相關之刺激。EMADINE中的保存劑Benzalkonium chloride，可能會吸附於軟式隱形眼鏡上。戴隱形眼鏡及眼睛不紅的患者在點EMADINE之後，在戴回其隱形眼鏡之前應至少等待10分鐘。

致癌性、突變性、生育損害性：以50公斤成人0.002毫克/公斤/天的量為基礎，分別以超過80,000倍及26,000倍最大建議眼用人類使用劑量之Emedastine difumarate，投予於小鼠及大鼠進行終生的研究，結果證實Emedastine difumarate沒有致癌作用。較高劑量之試驗尚未被研究。在體外細菌逆突變試驗(Ames試驗)、體外Ames試驗之修飾、體外哺乳動物染色體迷亂試驗、體外哺乳動物正向突變試驗、及體外哺乳動物DNA修復合成之試驗中，以及體內哺乳動物姐妹染色體絲交換試驗及體內老鼠核仁之試驗中，確定Emedastine difumarate不會導致突變。在15,000倍最大建議眼用人類使用劑量時，並無證據顯示對老鼠生育或生殖能力有損害性。

懷孕：懷孕分類B。畸胎學及出生前後的研究，以Emedastine difumarate對老鼠及兔子進行。在15,000倍最大建議眼用人類使用劑量時，沒有發現Emedastine difumarate對老鼠及兔子有致畸胎性，並且對老鼠出生前後的發育沒有觀察到有所影響。然而，在70,000倍最大建議眼用人類使用劑量時，發現Emedastine difumarate會增加老鼠外部、內臟及骨骼異常之發生率。然而，沒有適合且受良好控制的研究於懷孕之婦女。因為動物試驗未必可預測人類的反應，因此在懷孕期間，唯有在明確需要的情況下，方可使用本品。

哺乳婦女：老鼠口服投予後，已確認Emedastine會出現於乳汁中。是否局部眼部給與會導致足夠的全身吸收，以致在乳汁中產生可測得的量則未知。雖然如此，給與EMADINE於哺乳婦女時仍應注意。

小孩使用：對三歲以下幼兒患者之安全性及有效性尚未被建立。

副作用：

於EMADINE長達42天之臨床研究中，最常見的副作用是頭痛(11%)。低於5%的患者被報導發生下述之副作用：異夢、無力、味覺差、視覺模糊、灼熱或刺痛、角膜浸潤、角膜染色、皮膚炎、不舒服、乾眼、異物感、充血、角膜炎、搔癢、鼻炎、竇炎及流淚。由一些研究發現有些副作用與疾病本身徵狀相似。

過量：

隨著每日口服投予，嗜眠及不適曾被報導。攝食15毫升的藥量相當於7.5毫克。萬一過量，處理方式是症狀療法及支持療法。

用法用量：

本藥須由醫師處方使用。

建議劑量是每次點一滴於患眼，每天二次。假如有需要，可一天點到四次。

包裝：100公撮以下無菌滴瓶裝。

貯藏：貯存於4°C - 30°C (39°F - 86°F)。

**Alcon**<sup>®</sup>  
TAIWAN

製造廠：s.a ALCON-COUVREUR n.v.

廠址：Rijksweg 14, B-2870 Puurs, Belgium

藥商：瑞士商愛爾康大藥廠股份有限公司台灣分公司

地址：台北縣新店市寶中路119號4樓

電話：(02)2917-2468