

**核准日期:** 2007 年 3 月 10 日  
**修改日期:** 2008 年 08 月 20 日  
2009 年 7 月 6 日  
2009 年 11 月 10 日  
2010 年 12 月 1 日  
2011 年 7 月 4 日  
2012 年 1 月 6 日  
2013 年 2 月 20 日  
2014 年 2 月 5 日  
2014 年 3 月 7 日  
2014 年 9 月 28 日  
2016 年 8 月 29 日  
2017 年 4 月 18 日  
2018 年 4 月 3 日  
2019 年 2 月 2 日  
2019 年 5 月 17 日  
2020 年 8 月 31 日

## 盐酸阿夫唑嗪缓释片说明书

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: 盐酸阿夫唑嗪缓释片

商品名称: 桑塔®

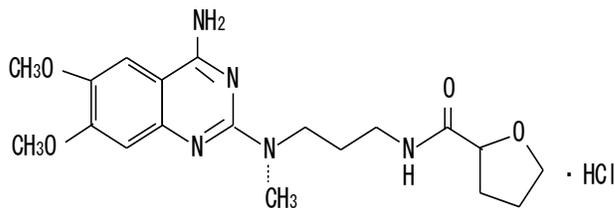
英文名称: Alfuzosin Hydrochloride Prolonged Release Tablets

汉语拼音: Yansuan Afuzuoqin Huanshipian

### 【成份】

化学名称: 盐酸阿夫唑嗪

化学结构式:



分子式:  $C_{19}H_{27}N_5O_4 \cdot HCl$

分子量: 425.92

### 【性状】

本品为圆形, 双凸三层片剂 (直径为 8mm); 内、外两层为黄色, 中间层为白色。

### 【适应症】

用于缓解良性前列腺增生症 (BPH) 引起的症状。

**【规格】**

10mg

**【用法用量】**

口服。

推荐剂量，每天一片（10mg）长效缓释片，晚饭后立即服用。

该片剂必须用水整片吞服（参见**【注意事项】**）**【不良反应】**

器官系统分类	发生率				
	常见 (≥1%—<10%)	少见 (≥0.1% — <1%)	罕见 (≥0.01% — <0.1%)	非常罕见 (<0.01%)	未知 (根据现有数据无法评估)
神经系统异常	虚弱/头晕, 头痛	晕厥, 眩晕, 嗜睡			潜在的脑血管疾病患者出现缺血性脑事故
心脏异常		心动过速, 心悸		患有冠心病患者出现心绞痛 (参见 <b>【注意事项】</b> )	心房颤动
眼部疾病					术中虹膜松弛综合征 (参见 <b>【注意事项】</b> )
呼吸, 胸廓和纵隔异常		鼻炎			
胃肠道异常	恶心, 腹痛	腹泻, 口腔干燥 呕吐			
肝胆管异常					肝细胞损伤, 胆汁淤积性肝病
皮肤和皮下组织异常		皮疹, 搔痒		荨麻疹, 血管性水肿	
全身性疾病和给药部位状况	乏力 不适	水肿, 胸痛			
生殖系统和乳房异常					阴茎异常勃起
血管异常		低血压 (体位性), 潮红			
血液及淋巴系统异常					中性粒细胞减少症, 血小板减少症

## 【禁忌】

本品在下列情况下禁止使用：

- 对阿夫唑嗪或本品中的任何成份过敏
- 与其他  $\alpha 1$  受体阻滞剂联合用药
- 与强 CYP3A4 抑制剂联合用药
- 肝功能衰竭
- 严重肾功能衰竭（肌酐清除率 $<30\text{ml}/\text{min}$ ）
- 体位性低血压

## 【注意事项】

### 警告

- 同所有的  $\alpha 1$ -阻滞剂一样，在某些患者中，尤其是那些正在使用抗高血压药物治疗的患者，在服药后数小时内可能会出现症状性或无症状性（眩晕、疲乏、出汗）的体位性低血压。如发生这些症状，患者应平卧直至症状完全消退。以上这些症状通常是暂时的，发生在治疗开始时，一般不会妨碍继续治疗。上市后药物监测报道，存在潜在患病风险的病人（例如潜在心脏疾病和/或合并抗高血压药物治疗）用药后可能出现显著的血压下降现象。发生低血压及相关不良反应的风险在老年患者中可能较为严重。应告知患者这些可能出现的情况。
- 患有症状性体位性低血压的患者或者正在接受抗高血压或硝酸盐类药物治疗的患者，应该慎用本品。
- 存在脑缺血发作的风险，特别是那些既往存在无症状性或症状性循环系统疾病（如心律失常、心房颤动、短暂性脑缺血发作史）的老年患者，因为阿夫唑嗪给药后可能发生低血压。应告知患者存在发作上述风险的可能性。
- 与所有  $\alpha 1$  受体阻滞剂一样，急性心力衰竭患者应慎用本品。在获得性或先天性 QT 延长患者，有 QT 间期延长病史或服用延长 QT 间期药物的患者中使用时应谨慎。接受本药品治疗前期和整个治疗过程中都要接受监测。
- 阿夫唑嗪，与其他  $\alpha$  肾上腺素受体阻滞剂一样，被认为与阴茎异常勃起有关（与性行为无关的持续性的伴有疼痛的阴茎勃起）。因为如不采取适当的治疗，这种情况可导致永久性的阳痿，故应告知病人这种情况出现的严重性。（参见【不良反应】）
- 已经观察到一些正在或以前服用坦索罗新或  $\alpha 1$ -阻滞剂治疗的患者，在白内障手术当中出现术中虹膜松弛综合征（IFIS，小瞳孔综合征的变体）。虽然服用本品后该事件发生率非常低，但是，在白内障手术之前，应该将当前或以前的  $\alpha 1$ -受体阻滞剂应用情况告知眼科医生，因为 IFIS 可能导致手术并发症的增加。眼科医生应该准备对他们的手术技术进行可能的修改。
- 鉴于目前缺乏有关严重肾功能衰竭（肌酐清除率 $<30\text{ml}/\text{min}$ ）患者用药的安全性数据，故此类患者不能使用本品进行治疗。（参见【禁忌】）
- 本品含蓖麻油，可引起消化系统疾病（轻度腹泻）。

## 使用注意事项

- 对服用其他  $\alpha$  1-阻滞剂后有明显的低血压反应的患者，在使用本品时应谨慎。
- 伴有冠心病的患者不应单独给予阿夫唑嗪。针对冠状动脉功能不全的特定治疗应继续。如果心绞痛复发或加剧，应停止使用本品。
- 必须告知患者本品须整片吞服。禁止任何其他服药方式如咬碎、压碎、咀嚼、研磨或捣成粉。这些行为会导致药物不恰当地释放和吸收进而可能引起早发的不良反应。
- 与 PDE-5 抑制剂一起使用：本品与磷酸二酯酶-5 抑制剂（如西地那非、他达拉非和伐地那非）联合给药，可能导致某些患者出现症状性低血压。为降低发生直立性低血压的风险，开始用磷酸二酯酶-5 抑制剂治疗之前，应确保患者已能够接受稳定的  $\alpha$ -阻滞剂治疗。此外，建议以尽可能低的剂量开始磷酸二酯酶-5 抑制剂的治疗（参见【药物相互作用】）。

对驾车的影响没有可用的数据。

由于眩晕、头晕和乏力之类的不良反应主要发生在治疗初期，因此在驾车和操作机器时应予以注意。

### 【孕妇及哺乳期妇女用药】

治疗适应症中不涉及妇女。

在妊娠期间服用本品的安全性以及本品是否分泌入乳汁中尚不清楚。

### 【儿童用药】

治疗适应症中不涉及儿童。

尚未证明本品在年龄 2-16 岁儿童中的疗效。因此，本品不适用于儿科人群。

### 【老年用药】

在某些患者中，尤其是那些正在使用抗高血压药物治疗的患者，在服药后数小时内可能发生体位性低血压，同时可能伴有其它症状（头晕的感觉、疲劳和出汗）。

老年患者建议谨慎用药。（参见【注意事项】）

### 【药物相互作用】

#### 禁止联合用药的情况

- 禁止联合使用  $\alpha$  1 受体阻滞剂（参见【禁忌】）。
- 禁止联合使用强效 CYP3A4 抑制剂，比如波西普韦、克拉霉素、科比司他、红霉素、伊曲康唑、酮康唑、奈非那韦、泊沙康唑、利托那韦、特拉普韦、泰利霉素、伏立康唑，因为可能会导致阿夫唑嗪血药浓度升高以及出现药物不良反应的风险（参见【禁忌】和【药代动力学】）

#### 不建议联合用药的情况

- 不建议联合使用抗高血压  $\alpha$  受体阻滞剂（多沙唑嗪、哌唑嗪、乌拉地尔）。会增加降压作用，存在严重直立性低血压的风险（参见【注意事项】）

#### 联合用药需特别注意的情况

- 联合使用磷酸二酯酶 5 型抑制剂（阿伐那非、西地那非、他达拉非、伐地那非）存在直

立性低血压的风险，尤其老年患者。老年患者建议以最低剂量开始治疗，并根据需要逐渐调整剂量。（参见【注意事项】）。

#### 联合用药需注意的情况

- 硝酸盐类
- 联合使用除 $\alpha$ 受体阻滞剂以外的抗高血压药，会增加降压作用。存在发生严重直立性低血压的风险。
- 联合使用达泊西汀，存在不良反应加重的风险，尤其是眩晕或晕厥型不良反应。
- 联合使用降血压药物，低血压风险增加，特别是直立性低血压。

#### **【药物过量】**

如果药物过量，患者应保持仰卧位并送医院治疗。应给予低血压的常规治疗。

如果发生严重低血压，可使用直接作用于血管肌纤维的血管收缩剂。

由于本品和蛋白高度结合，本品不易通过透析排除。

#### **【药理毒理】**

本品为一种经口服途径起效的喹诺唑啉类衍生物。它是一种选择性的、突触后 $\alpha 1$ -肾上腺素受体拮抗剂。体外药理学研究证实了本品对前列腺、膀胱三角区和尿道部位的 $\alpha 1$ -肾上腺素受体有选择性作用。

通过直接作用于前列腺组织的平滑肌， $\alpha$ -受体阻滞剂减少膀胱下流的阻力。动物的体内试验证明：本品能减少尿道压力，进而减少泌尿时尿流的阻力。在清醒的大鼠研究中证明其对尿道压力的影响大于对血压的影响。

在有关良性前列腺增生的安慰剂对照研究中，本品具有下列作用：

- 在那些尿液流速 $\leq 15\text{ml/秒}$ 的患者中，本品能明显增加其尿液流速平均达 30%。这种改善在首次给药后即可观察到。
- 明显减少逼尿肌的压力而增加膀胱尿液容量，进而激发排尿感；
- 明显减少残余尿量。

这些作用可使刺激性和梗阻性尿路症状得到改善。对性功能没有危害。

而且，服药后最大尿液流速的明显增加可保持 24 小时。

在 ALFAUR 研究中评价了阿夫唑嗪对恢复自主排尿的有效性。该研究对象为 375 名年龄在 50 岁以上的男性，因良性前列腺增生（BPH）第一次出现疼痛性急性尿潴留（AUR），且自导尿管插入后的一个小时内残余尿量在 500ml 到 1500ml 之间。该研究为双盲、随机、多中心研究，阿夫唑嗪长效缓释片 10mg/天和安慰剂两个平行对照组，评价接受阿夫唑嗪治疗至少两天的患者，在拔去导尿管 24 小时后的清晨恢复自主排尿的情况。

结果表明，阿夫唑嗪治疗组显著增加了第一次出现急性尿潴留（AUR）患者拔管后排尿的恢复率（ $P=0.012$ ），即阿夫唑嗪组 146 名患者（61.9%）对比安慰剂组 58 名患者（47.9%）恢复了排尿。

#### **【药代动力学】**

##### 阿夫唑嗪

盐酸阿夫唑嗪与血浆蛋白的结合率接近 90%。

阿夫唑嗪主要通过肝脏代谢，仅 11%的原形药物从尿中排泄。

大部分代谢物（非活性）在粪便中排泄（75-90%）。  
阿夫唑嗪在慢性心力衰竭患者中的药代动力学参数没有变化。

#### 长效缓释剂型

在健康中年志愿者中，服用 10mg 长效缓释片的生物利用度的平均值，为服用 7.5mg（2.5mg 片，每天 3 次）盐酸阿夫唑嗪快速释放剂型的 104.4%。长效缓释片血药浓度达峰时间为服药后 9 小时，快速释放剂型为服药后 1 小时。

消除半衰期为 9.1 小时。

研究显示，饭后服用本品生物利用度增加（参见【用法用量】）。

与中年健康志愿者比较，老年患者中药代动力学参数（C<sub>max</sub> 和 AUC）不增加。

与肾功能健全的患者比较，中度肾功能受损（肌酐清除率大于 30ml/min）的患者，其 C<sub>max</sub> 和 AUC 平均值会增加，消除半衰期保持不变。

肌酐清除率>30 ml/min 的肾功能受损的患者无需剂量调整。

#### **【贮藏】**

密封保存。

#### **【包装】**

铝塑包装，10 片/盒

#### **【有效期】**

36 个月

#### **【执行标准】**

进口药品注册标准 JX20150103

#### **【批准文号】**

进口药品注册证号：H20170035

进口药品分装批准文号：国药准字 J20140019

#### **【药品上市许可持有人】**

名称：Sanofi-Aventis France

注册地址：82 avenue Raspail, 94250 GENTILLY

#### **【生产企业】**

企业名称：SANOFI WINTHROP INDUSTRIE

生产地址：30-36 Avenue Gustave Eiffel 37100 Tours, France

#### **【分装企业】：**

名称：赛诺菲（杭州）制药有限公司

Sanofi (Hangzhou) Pharmaceutical Co., Ltd.

地址：杭州市滨江区江陵路325号

邮政编码：310051

传真：0571-88076189

**【境内联系机构】**

名称：赛诺菲（中国）投资有限公司  
地址：北京市朝阳区建国路 112 号 7 层  
邮政编码：100022  
产品咨询电话：800（400）-820-8884