

核准日期： 2009 年 04 月 09 日

发布或修订日期：

伊曲康唑分散片说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

警示语： 对本品过敏者禁用；孕妇禁用。除非用于系统性真菌病治疗，但仍应权衡对胎儿有潜在性伤害作用。

【药品名称】 【通用名称】 伊曲康唑分散片

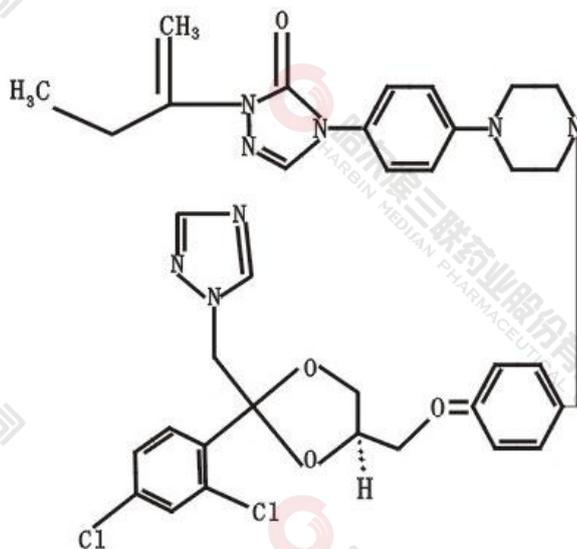
【商品名】

【英文名】 Itraconazole Dispersible Tablets

【汉语拼音】 Yiqukangzuo Fensan Pian

【成份】 【化学名称】 顺-4-[4-[4-[4-[[2-(2,4-二氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三氮唑基-1-甲基)-1,3-二氧环戊基-4-基]-甲氧基]苯基]-1-哌嗪基]-苯基]-2,4-二氢-2-(-1-甲基丙基)-3H-1,2,4-三氮唑-3-酮。

【化学结构式】



【性状】 本品为白色片。

【适应症】 伊曲康唑分散片适用于治疗以下疾病：

- ①妇科：外阴阴道念珠菌病。
- ②皮肤科/眼科：花斑癣、皮肤真菌病、真菌性角膜炎和口腔念珠菌病。
- ③由皮肤癣菌和/或酵母菌引起的甲真菌病。
- ④系统性真菌感染：系统性曲霉病及念珠菌病、隐球菌病（包括隐球菌性脑膜炎），组织胞浆菌病、孢子丝菌病、巴西副球孢子菌病、芽生菌病和其它各种少见的系统性或热带真菌病。

【规格】 0.1g

【用法用量】 为达到最佳吸收，用餐后立即给药。可加水分散均匀后口服，也可含于口中吮服或吞服。

- 1.念珠菌性阴道炎：每次 200mg，每天二次，疗程为 1 天或每次 200mg，每天一次，疗程为 3 天。
- 2.花斑癣：每次 200mg，每天一次，疗程为 7 天。
- 3.皮肤真菌病：每次 100mg，每天一次，疗程为 15 天。
高度角化区（如足底部癣、手掌部癣）需：延长治疗 15 日，每次 100mg，每天一次，疗程为 15 天。
- 4.口腔念珠菌病：每次 100mg，每天一次，疗程为 15 天。
- 5.真菌性角膜炎：每次 200mg，每天一次，疗程为 21 天。
- 6.对于一些免疫缺陷病人，如白血病、艾滋病或器官移植病人等，采用伊曲康唑分散片治疗真菌感染时，伊曲康唑的口服生物利用度可能会降低，剂量可加倍。
- 7.甲真菌病：
 - 1) 冲击治疗：每次 200mg，每天二次，连用一周为一个冲击疗程。对于指甲感染，推荐采用两个冲击疗程，每个疗程间隔 3 周；对于趾甲感染，推荐采用三个冲击疗程。每个疗程间隔 3 周。
 - 2) 或者采用连续治疗：每次 200mg，每天一次，连用三个月。本品从皮肤和甲组织中清除比血浆慢，因此，对皮肤感染来说，停药后 2~4 周达到最理想的临床和真菌学疗效，对甲真菌病来说在停药后 6~9 个月达到最理想的临床和真菌学疗效。
- 8.系统性真菌病:根据不同感染选择不同的剂量用法,详见下表:

【不良反应】 在已报告的伊曲康唑的不良反应中常见胃肠道不适,如厌食、恶心、腹痛和便秘;

少见的不良反应包括头痛、可逆性肝酶升高、月经紊乱、头晕和过敏反应（如瘙痒、红斑、风团和血管性水肿）。有个例报告出现了外周神经病变和 Stevens-Johnson 综合征（重症多形红斑）,但后者的原因不明。

已有重要的潜在病理改变并同时接受多种药物治疗的大多数患者,在接受伊曲康唑分散片长疗程(约一个月以上)治疗时,可见低血钾症、水肿、肝炎和脱发等症状。

【禁忌】 1. 对本品过敏者禁用。

2. 孕妇禁用。除非用于系统性真菌病治疗，但仍应权衡对胎儿有无潜在性伤害作用。

【注意事项】 1. 对持续用药超过 1 个月的患者，以及治疗过程中如出现厌食、恶心、呕吐、疲劳、腹痛或尿色加深的患者，建议检查肝功能。如果出现异常,应停止用药。

2. 伊曲康唑绝大部分在肝脏代谢，因而肝功能异常患者慎用（除非治疗的必要性超过肝损

伤的危險性)。

3. 当发生神经系统症状时应终止治疗。
4. 对肾功能不全的病人,本品的排泄减慢,建议监测本品的血浆浓度以确定适宜的剂量。
5. 育龄妇女使用本品时应采取适当的避孕措施。
6. 胃酸降低时,会影响本品吸收。需接受酸中和药物治疗者,应在服用伊曲康唑分散片至少2小时后,再服用这些药物。

【孕妇及哺乳期妇女用药】 孕妇禁用。除非用于系统性真菌治疗,但仍应权衡对胎儿有无潜在性伤害作用。

哺乳期妇女不宜使用。

【儿童用药】 因伊曲康唑用于儿童的临床资料有限,因此建议不要把伊曲康唑用于儿童患者,除非潜在利益优于可能出现的危害。

【老年用药】 尚不明确。

【药物相互作用】 1. 诱酶药物:如利福平和苯妥英可明显降低本品的口服生物利用度,因此,当与诱酶药物共同服用时应检测本品的血浆浓度。

2. 体外研究表明,在血浆蛋白结合方面本品与丙咪嗪、心得安、安定、西咪替丁、消炎痛、甲糖宁和磺胺二甲基嘧啶之间无相互作用。

3. 伊曲康唑能抑制由细胞色素3A酶催化的药物代谢,导致包括副作用在内的药物作用增加和/或延长。

因此:①在使用伊曲康唑分散片治疗期间不应服用特非那丁、阿司咪唑、西沙必利,口服咪达唑仑和三唑仑。若静脉注射咪达唑仑则更应格外谨慎,因为其静脉作用会延长;

②若需与伊曲康唑同时服用口服抗凝剂、地高辛、环孢素A、全身应用的甲泼尼龙(methylprednisolone),长春生物碱和他可林(tacrolimus)等,则应减少这些药物的剂量;

③对服用二氢吡啶钙离子通道阻断剂和奎尼丁的病人应监测其不良反应,如水肿和耳鸣/听力下降。必要时可减少这些药物的剂量;

④有报道罕见在做移植手术病人中同时接受伊曲康唑分散片、环孢菌素和羟甲基戊二酰辅酶A(HMG-CoA)还原酶抑制剂如洛伐他丁的治疗时,有横纹肌溶解发生,但伊曲康唑与横纹肌溶解的因果关系尚未建立。

4. 已报道本品与华法令和地高辛有相互作用。因此这些药物若与本品同时服用时,应减少剂量。

5. 尚未观察到本品与AZT(齐多夫定)间的相互作用。

6. 尚未观察到本品对炔雌醇和炔诺酮代谢的诱导效应。

【药物过量】 一旦发生,应采取支持疗法,包括洗胃等。本品不能经过血液透析清除,无特殊的解毒药。

【药理毒理】 本品为合成的三氮唑衍生物,具有广谱抗真菌作用,可抑制真菌细胞膜麦角甾醇的合成,从而发挥抗真菌效应。

本品对皮肤癣菌(毛癣菌属、小孢子菌属、絮状表皮癣菌)、酵母菌[新生隐球菌、糠秕孢子菌属、念珠菌属(包括白色念珠菌、光滑念珠菌和克柔念珠菌)]、曲霉菌属、组织胞浆菌属、巴西副球孢子菌、申克孢子丝菌、着色真菌属、枝孢霉属、皮炎芽生菌以及各种其它的酵母菌和真菌有抑制作用。

【药代动力学】 文献资料报道，餐后立即服用本品，生物利用度最高，口服后 3~4 小时血药浓度达峰值。本品血浆消除呈双相性，终末半衰期为 1~1.5 天。连续服用 1~2 周，本品血药浓度可达稳态状态。口服本品 100mg 每日一次、200mg 每日一次和 200mg 每日二次时，其稳态血药浓度分别为 0.4 μ g/ml、1.1 μ g/ml 和 2.0 μ g/ml。本品血浆蛋白结合率为 99.8%。全血中本品浓度为血浆浓度的 60%。在富含角蛋白的组织中，尤其是皮肤中的浓度比血浆浓度高 4 倍，且药物清除与表皮再生过程有关。连续用药 4 周后停药，7 天后已测不到血浆药物浓度，但皮肤中药物仍可保持治疗浓度达 2~4 周。开始治疗一周后，在甲角质中就可以测到伊曲康唑，3 个月疗程结束后，其在甲角质中药物浓度至少存在 6 个月时间。本品存在于皮脂中，汗液中也少量存在。伊曲康唑同时也集中的分布在易于受到真菌感染的部位。在肺、肾脏、肝脏、骨骼、胃、脾脏和肌肉中的药物浓度比相应的血浆浓度高 2~3 倍。在阴道组织中治疗浓度持续的时间是：200 mg 每日一次治疗 3 天，可持续二天；200 mg 每日二次治疗 1 天，则可持续 3 天。本品主要在肝脏中代谢，产生大量代谢产物。其中之一是羟基化伊曲康唑，其体外抗真菌活性与本品相似，生物分析法测得其抗真菌药物水平约为高压液相色谱分析本品水平的 3 倍。经粪排泄的原型药物约为所用剂量的 3~18%，经肾排泄的原型药则低于所用剂量的 0.03%，大约 35% 是作为代谢物在一周内经尿排泄。

【贮藏】 遮光，密闭，在阴凉（不超过 20 $^{\circ}$ C）干燥处保存。

【包装】 铝塑包装。7 片/板，2 板/盒。

【有效期】 暂定 24 个月。

【执行标准】 YBH04232009

【批准文号】 国药准字 H20090185