

斯皮仁诺胶囊 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文  
[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/310/2021\\_2022\\_\\_E6\\_96\\_AF\\_E7\\_9A\\_AE\\_E4\\_BB\\_81\\_E8\\_c22\\_310373.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/310/2021_2022__E6_96_AF_E7_9A_AE_E4_BB_81_E8_c22_310373.htm) 药品名称斯皮仁诺  
胶囊药物别名伊曲康唑、美扶、依康唑、伊康唑、依他康唑、  
亚特那唑 sporanox 英文名称Itraconazole 类别抗真菌药制剂  
本药为粉、蓝色胶囊：100mg/粒。分子式成分化学名：( /-)-2-sec-Butyl-4-[4-(4-{4-[(2R(\*), 4S(\*))-2-(2  
, 4-dichlorophenyl)-2-(1H-1, 2, 4-triazol-1-ylmethyl)-1, 3-  
dioxolan-4-ylmethoxy]phenyl}-piperazin-1-yl)phenyl]-2, 4-  
dihydro-1, 2, 4-triazol-3-one。分子式为C<sub>35</sub>H<sub>38</sub>Cl<sub>2</sub>N<sub>8</sub>O<sub>4</sub>，  
分子量为705.64。性状：本品为白色略带微黄色的粉末。pH  
值为1-12时不溶于水，微溶于乙醇，易溶于二氯甲烷。药理  
毒理本药是一种合成的广谱抗真菌药，为三氮唑衍生物，对  
皮肤癣菌、酵母菌、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感染有效。体外研究已证实本  
药可抑制真菌细胞膜的主要成分之一麦角甾醇的合成，从而  
发挥抗真菌的效应。能高度选择性地抑制真菌细胞膜上依靠  
细胞色素P450的14- $\alpha$ -去甲基酶，导致14- $\alpha$ -甲基固醇蓄积，  
使细胞麦角固醇合成受阻。由于麦角固醇是真菌细胞膜重要  
成分之一，因此膜通透性增加，细胞内重要物质外漏，导致  
真菌死亡；此外，14- $\alpha$ -甲基固醇还作用于细胞膜上结合  
的ATP酶，干扰真菌的正常代谢。药动学餐后立即服用本品  
, 生物利用度最高。口服后3-4 hr后血药浓度达峰值，血浆中  
清除呈双相性，终末半衰期为1-1.5日。长期给药时1-2周达稳  
定状态。在服药后3-4 hr伊曲康唑稳定血药浓度分别是：0.4

$\mu\text{g/mL}$ (100 mg, 每日1次); 1.1  $\mu\text{g/mL}$ (200mg, 每日1次)和2  $\mu\text{g/mL}$ (200 mg, 每日2次)。本品血浆蛋白结合率为99.8%。全血浓度为血浆浓度的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,而药物清除与表皮再生过程有关,连续用药4周后停药,7天后已不能测到药物的血浆浓度,但皮肤中药物仍可保持治疗浓度达2-4周。开始治疗1周后,在甲角质中就可以测到伊曲康唑,3个月疗程结束后,其药物浓度仍至少存在6个月。本药存在于皮肤中,汗液中也少量存在。伊曲康唑同时也集中地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时间是:200 mg每日1次治疗3天,可维持2天;200 mg每日2次治疗1天,则维持3天。本品主要在肝脏中代谢,代谢产物之一是羟基化伊曲康唑,体外研究发现其抗真菌活性与本品相似,生物分析法测得抗真菌药物水平约为高压液相色谱分析本品水平的3倍。大约35%以代谢物形式在1周内经尿排泄。适应症深部真菌感染如芽生菌病、组织胞浆菌病、球孢子菌病。浅表真菌感染如花斑糠疹,阴道念珠菌病、足癣、手癣、体癣等,亦用于AIDS患者隐球菌病的长程治疗和中性粒细胞减少症患者真菌感染的预防。不良反应常见胃肠道不适,如:厌食、恶心、腹痛和便秘。较少见的副作用包括头痛、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)。有个例报告可见Stevens-Johnson综合征。已有潜在病理改变并同时接受多种药物治疗的大多数患者,在接受本药作长疗程治疗时,可见低钾血症、水肿、肝炎和脱发等症状。有个例报告发现外周神经病变,但是否与

服用斯皮仁诺有关还不肯定。相互作用在斯皮仁诺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。尚未观察到本品与齐多夫定间的相互作用以及对炔雌醇和炔诺酮代谢的诱导效应。诱酶药物如：利福平和苯妥英可明显降低本药的生物利用度，因此，当与诱酶药物共同服用时应监测本药的血浆浓度。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、西米替丁、消炎痛、甲糖宁和磺胺二甲基嘧啶之间无相互作用。用法用量为达到最佳吸收，应餐后立即给药。胶囊应整个吞服。口服，成人，全身真菌感染：100mg~400mg/日，1次/日，视病原菌和程度而定。口腔念珠菌病：每日100mg(艾滋病人及嗜中性白血球减少症患者每日200mg)，连服15日。阴道念珠菌病：200mg，2次/日，服1日。花斑癣：200mg/日，连续7日。癣病：100mg/日。注重事项15-30 °C，存放于干燥处。为达到最佳吸收，应餐后立即服药，胶囊必须整个吞服。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。妊娠C类。对持续用药超过1个月的患者，以及治疗过程中出现厌食、恶心、呕吐、疲惫、腹痛或尿色加深的患者，建议检查肝功能。假如出现异常，应停止用药。患者肝功能异常时不应用药，除非治疗的必要性超过肝损坏的危险性。伊曲康唑绝大部分在肝脏代谢。肝硬化患者服药后的生物利用度降低。如必要服药，建议监测伊曲康唑的血浆浓度并选用适宜的剂量。当发生神经系统症状时应终止治疗。对肾功能不全的病人，本药的生物利用度可能降低，建议监测本品的血浆浓度以确

定适宜的剂量。对本药过敏者。孕妇禁用，除非用于系统性真菌治疗，但仍应权衡利弊。育龄妇女使用本品时应采用适当的避孕措施。哺乳期妇女不宜使用。对儿童的影响因伊曲康唑用于儿童的临床资料有限，因此建议不要用于儿童患者，除非潜在的利益优于可能出现的危害。100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 [www.100test.com](http://www.100test.com)