

核准日期:

外

他扎罗汀凝胶说明书

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: 他扎罗汀凝胶

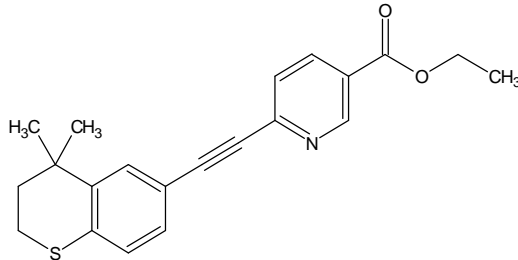
商品名称: 炔维[®]

英文名称: Tazarotene Gel

汉语拼音: Tazhaluoting Ningjiao

【成份】本品主要成份是他扎罗汀, 其化学名称为 6-[(3,4-二氢-4,4-二甲基-2H-1-苯并噻喃-6-基) 乙炔基]-3-吡啶羧酸乙酯,

化学结构式:



分子式: C₂₁H₂₁N₂O₂S

分子量: 351.46

【性状】本品为无色至淡黄色凝胶。

【适应症】本品适用于治疗寻常性斑块型银屑病。

【规格】30g:15mg、15g:7.5mg

【用法用量】

外用, 每晚临睡前半小时将适量本品涂于患处, 涂抹面积不能超过体表面积的20%。用药前, 先清洗患处; 待皮肤干爽后, 将药物均匀涂布于皮损上, 形成一层薄膜; 涂药后应轻轻揉擦, 以促进药物吸收; 之后再肥皂将手洗净。

【不良反应】

本品外用后, 主要不良反应为皮肤反应, 表现为瘙痒、灼热、刺痛、红斑、刺激感、皮肤疼痛、湿疹、脱屑、皮炎、开裂、浮肿、脱色、出血和干燥等。

【禁忌】

- 1、孕妇、哺乳期妇女及近期有生育愿望的妇女禁用。
- 2、对本品或其他维甲酸类药物过敏者禁用。

【注意事项】

1、育龄妇女在开始他扎罗汀凝胶治疗前 2 周内，必须进行血清或尿液妊娠试验，确认为妊娠试验阴性后，在下次正常月经周期的第 2 天或第 3 天开始治疗。

在治疗前，治疗期间和停止治疗后一段时间内，必须使用有效的避孕方法。

治疗期间，如发生妊娠，应立即与医生联系，共同讨论对胎儿的危险性及是否继续妊娠等。

2、避免药物与眼睛、口腔和粘膜接触，并尽量避免药物与正常皮肤接触。如果与眼接触，应用水彻底冲洗。

3、如出现瘙痒等皮肤刺激作用，尽量不要搔抓，可涂少量润肤剂；严重时，医生应建议患者停用本品或隔天使用一次。

4、本品不宜用于急性湿疹类皮肤病。

5、治疗期间，要避免在阳光下过多暴露。

6、涂抹面积超过体表面积 20% 的安全性资料尚未建立。

【孕妇及哺乳期妇女用药】 本品有生殖毒性，禁用于孕妇和哺乳期妇女。

【儿童用药】 12 岁以下儿童使用本品的疗效和安全性资料尚未建立。

【老年用药】 老年患者使用本品，与一般患者用药相同，不需特殊对待。

【药物相互作用】

1、患者在同时服用具有光敏性药物时（例如四环素、氟喹诺酮、酚噻嗪、磺胺），应小心使用。

2、应避免同时使用能使皮肤变干燥的药物和化妆品。

【药物过量】

过量使用本品不会加快皮损好转，还会产生皮肤发红、脱皮及其他不适。

【药理毒理】

本品为皮肤外用的类维生素 A 的前体药，具有调节表皮细胞分化和增殖等作用。在大多数生物系统中通过快速的脱酯作用而被转化为活性形式即他扎罗汀的同源羧酸，该活性产物可相对选择性地与维 A 酸受体的 β 和 γ 亚型结合，但其治疗银屑病的确切机理尚不清楚。

【药代动力学】

外用他扎罗汀凝胶，其结构中的酯被水解生成活性代谢物 AGN 190299，在血浆中几乎不能检测出原药。AGN 190299 与血浆蛋白高度结合（>99%）。他扎罗汀和其活性代谢物 AGN 190299，最终代谢成为砒、亚砒以及其它极性化合物，所有这些代谢物均通过尿和粪便排泄。无论健康人体或银屑病患者外用他扎罗汀凝胶时，AGN 190299 的半衰期相似，均为 18 小时。

以下描述的人体试验，均按大约 $2\text{mg}/\text{cm}^2$ 涂抹他扎罗汀凝胶，且该药保留在皮肤外时间为 10~12 小时。血浆峰浓度（ C_{max} ）和药时曲线下面积（AUC）都按活性代谢物计。

有两项独立的用¹⁴C标记外用他扎罗汀凝胶的试验。利用排泄物的放射活性分析，测得六名银屑病患者系统吸收小于应用剂量（没有包合）的1%；六名健康受试者系统吸收量为应用剂量（有包合）的5%。采用非放射性标记试验，比较六名健康受试者使用0.05%和0.1%的凝胶后，发现0.1%凝胶的C_{max}和AUC都比0.05%凝胶高40%。

24例健康受试者，在20%的体表面积处涂抹0.1%他扎罗汀凝胶，7天后，在最后一次涂抹9小时后，血药浓度达峰值，C_{max}为0.72±0.58ng/ml（平均值±平均偏差），AUC_{0-24h}为10.1±7.2ng.hr/ml。应用剂量下的系统吸收为0.91±0.67%。

对五名银屑病患者14天的研究，将测量剂量的0.1%他扎罗汀凝胶每天涂于患者皮肤（占体表总面积的8~18%；平均值±偏差：13±5%）。最后一个剂量6小时后，C_{max}为12.0±7.6ng/ml，AUC_{0-24hr}为105±55ng.hr/ml。应用剂量下，系统吸收为14.8±7.6%。外推这些数据来代表涂抹在20%身体皮肤的剂量，结果估计C_{max}为18.9±10.6ng/ml，AUC_{0-24hr}为172±88ng.hr/ml。

在体外经皮吸收试验研究中，以人体活性皮肤或人尸体皮肤为模型，涂抹放射性标记的凝胶。在涂抹凝胶24小时后，有大约4~5%应用剂量在角质层（他扎罗汀：AGN 190299=5:1）；2%~4%的应用剂量在活性表皮-真皮层（他扎罗汀：AGN 190299=2:1）。

【贮藏】 密闭，阴凉（不超过20℃）处保存。

【包装】 铝管包装,15 g/支/盒或30g/支/盒

【有效期】 暂定24个月

【执行标准】 国家药品标准 WS₁-（X-286）-2003 -2006Z

【批准文号】 国药准字 H20010159

【生产企业】

企业名称：重庆华邦制药股份有限公司

生产地址：重庆市歇台子南方花园科园四街55号

邮政编码：400041

用药咨询电话：023-67034120 800-8070618

销售电话：023-67886961

传真号码：023-67886970

投诉电话：023-68692612

<http://www.huapont.cn>