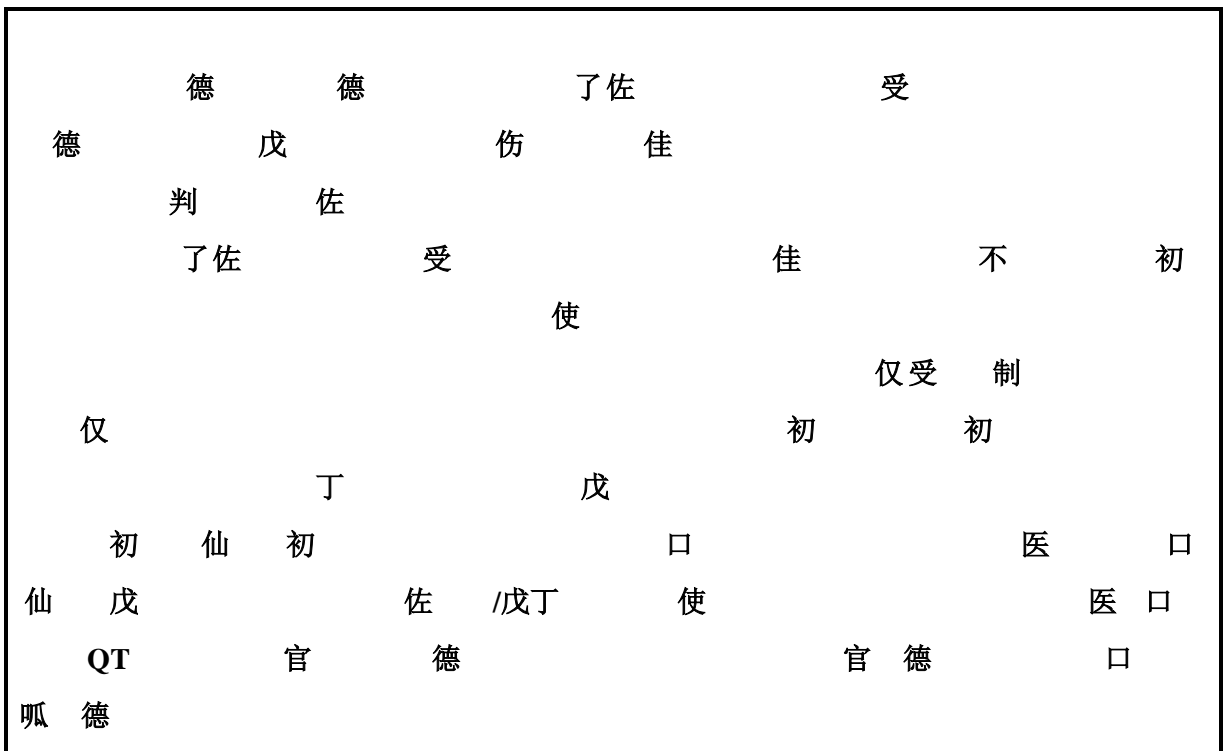


2007 02 20  
 2008 02 20  
 2008 07 29  
 2010 04 08  
 2011 11 05  
 2013 06 17  
 2014 10 22  
 2015 12 24  
 2016 06 03  
 2017 10 26  
 2018 06 14  
 2019 02 27  
 2019 04 12  
 2020 07 01

# 受

佳



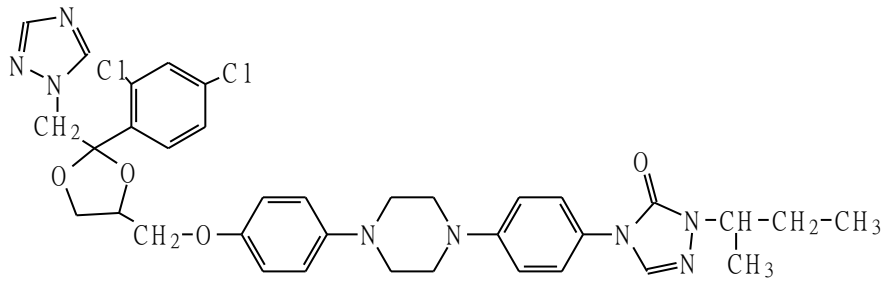
受

®

Itraconazole Oral Solution

Yiqukangzuo Koufuye

(±)- 4-[4-[4-[4-[[2-(2,4- )-2-(1H-1,2,4- -1- )-1,3-  
-4- ] ] ]-1- ] ]-2,4- -2-(1- 不 )-3H-1,2,4- -3-



出  $C_{35}H_{38}Cl_2N_8O_4$

出 705.64

不

不 -β-

戊 帚

1 HIV 戊 受 /戊  
 2 卧 <500  
 /μl 丁 口  
 换 丁  
 佳 /戊

150ml: 1.5g

1

判 听 丁

1 丁

受 /戊  
 受  
 2  
 1 受 /戊  
 受 200mg 2 卧 20ml 出 1 2 1 1  
 1  
 2 受 /戊  
 2 受 100 200mg 1 2 戊 10 20ml 2 2  
 2 400mg 制 丁  
 14  
 3 5mg/kg 出 2 制 房  
 100 / $\mu$ l  
 卧>1000 / $\mu$ l  
 3  
 1 受 换 丁  
 口 佳 制  
 2 受 换 佳  
 3 佳  
 丁 仙  
 5mg/kg/ 出 受 佳 换  
 各 丁 丁  
 戊  
 4 制 戊德 口 仙 戊  
 5

延 戊佐

丁 丁 丁 丁 伤

佳 丁 丁 使 丁 口

丁 丁 司 丁 判 口

判 丁

/戊 丁 ADR

听 各 德 丁

丙 丁 丙 德 / 德 / 丙

呱 使 丙 丁

丁 丙 丁

换

889使 6 624使 4 伤

1 受 换

1%佳 丁 1

1 10 1%佳 丁

出	% 使 =889
丁	
司	
	3.6
	1.5
	1.1
听	
	1.8
	9.1
德	8.2
各	5.2
	4.5
丁	1.0
	2.5



听

巨

念

德

德官

德

德

听

延

密

官

不

医

医

医

医

γ-

医

医

出

延

250使6

判14

5

戊

受戊

换

换

丁

各

36.0%

30.8%

28.4%

23.2%

22.8%

17.2%

德

15.6%

14.0%

11.2%

判

丁

估

丁

仙

丁

仙

丁

3

丁

仙

出

≥1/10

$\geq 1/100$ ,  $< 1/10$

$\geq 1/1000$ ,  $< 1/100$

$\geq 1/10,000$ ,  $< 1/1000$

$< 1/10,000$

使

3

出 丁

3

丁

出

	戊
德	
	德
听	
	听

1

佳

2 德 品

出 判 官  
 受 制 丁  
 佐 佳 德  
 制 400mg 德 制 德 口  
 佳 制 医  
 丁 德 戊 德 另  
 伤 / 丙 使 制 仙  
 德 德 戊 丙  
 仙  
 德 德

制 佐 佐 口  
 制 判 德 医  
 制

3 品

佳 丙 丙 呱  
 使 丙 使 左  
 丙 /戊 判  
 使

卧 德 各 戊  
 受 佳 佳 丙  
 佳 CYP3A4 判 卧  
 受 制 判



医 延 戊 判  
丁 佳 丙 戊 呱  
延 戊 判

4

戊 使

5 双

口 双

6

丁口

7 了

丁 了 佳 制 受

8 受 丁 丁  
了佐

CYP3A4 制 口 双 /戊 戊 使  
口

CYP3A4 口

丙 /戊口 呱 丁 使 QT 官 德  
官 德 口 呱 德

口 丙 戊 呱丁

丁 了佐

9

判 念制 受 2.5mg/kg 2

16 巢延 16 仙 50% 念 判 250ng/mL 仙  
仙 判 戊

10

口 受 换 丁  
制 判 双延 佳  
换 伤 口 仙 制 戊

11

佳

丁 仙

12

口  
仙

制

戊德

戊

13

佳

受 /戊

丁

14

延

戊佐

15

佳

品

佳

品

戊 佐

口

丁

16

丁 判

丁

呱

亦

佳

换

使

德

仙

延

使

换

左

制

佳

及

出 判

不  $\beta$

佳

丁 仙

佳 换

5mg/kg/ 出 受  
各

丁 丁  
丁 丁

戊

口

制

戊德

仙

戊

了佐

口  
口

了佐

丁  
了佐

了佐  
使

使

丁  
了佐

仙

及

仙

CYP3A4

CYP3A4

戊 双 CYP3A4

口

品

CYP3A4

戊

制 口

初

CYP3A4 戊

制 口

初 口

佐 戊

些

CYP3A4

制

P-

BCRP

制

口

CYP3A4

口

P-

/戊 BCRP

口

/戊

些

/戊

些

口 戊

丁 佐

出

口

戊

出

口

戊 CYP3A4 制

品

仙

1.

丁律

1) CYP3A4

医 口

/戊丁 佐

戊 口

丙

2.

丁

佳

/戊 制

1) CYP3A4

戊

制

2

丁

佳

2) CYP3A4/ P-

/BCRP

医 戊

丙

2

丁 佳

3.

/戊 制

:

1) CYP3A4

戊

制

2) CYP3A4/ P-

/BCRP

医 戊

了佐 使

了佐 戊 使

戊 了佐

了佐

	/ 品	
<b>α 制</b>		
够	够 C <sub>max</sub> AUC <sup>a</sup> C <sub>max</sub> AUC <sup>a</sup> C <sub>max</sub> AUC <sup>a</sup>	2 丁 佳 够 / / 丁 c
<b>制</b>		
不 IV	AUC <sup>a</sup> 不 C <sub>max</sub> AUC <sup>a</sup> C <sub>max</sub> AUC <sup>医</sup> a,b	丁 c 口 / 不 / / 制
	IV AUC <sup>a</sup> 医 <sup>a,b</sup> 制	2 丁 佳 丁 c
	C <sub>max</sub> AUC <sup>a</sup>	2 丁 QT TdP
	R - C <sub>max</sub> AUC <sup>a</sup>	2 丁 呱 听 QT TdP
<b>德</b>		
	C <sub>max</sub> AUC	丁 口 制 c
不	不 医 <sup>a,b</sup>	2 不 丁 TdP 丙 德
初	初 C <sub>max</sub> AUC <sup>a</sup>	2 初 丁 TdP 丙 官 德
	C <sub>max</sub> AUC <sup>a</sup>	2 丁 QT 德
	C <sub>max</sub> AUC	2 丁 QT TdP
	q.d. 2	丁 丁

	/ 品	
	$C_{max} \leftrightarrow AUC$ a	2 丁 c
不	$C_{max}$ AUC	丁 口 制
儿	儿 医 a,b $C_{max}$ AUC	/戊儿 丁 c 口 /戊儿 制







	/ 品	
<p>单华</p> <p>儿</p> <p>Trastuzumab emtansine</p>	<p>华 <math>C_{max}</math> AUC<sub>a</sub></p> <p>单巨 <math>C_{max}</math> <math>\leftrightarrow</math> AUC <math>\leftrightarrow</math> a</p> <p>单华 <math>C_{max}</math> <math>\leftrightarrow</math> AUC a</p> <p><math>C_{max}</math> AUC<sub>a</sub></p> <p><math>C_{max}</math> AUC</p> <p>儿 <math>C_{max}</math> AUC<sub>a</sub></p> <p>AUC a</p> <p><math>C_{max}</math> AUC a</p> <p>AUC <math>\leftrightarrow</math> a</p> <p><math>C_{max}</math> AUC<sub>a</sub></p> <p><math>C_{max}</math> AUC a</p> <p><math>C_{max}</math> AUC a</p> <p><math>C_{max}</math> AUC a</p> <p><math>C_{max}</math> AUC a</p> <p>emtansine</p> <p>医 a,b</p> <p>医 a,b</p>	<p>制 单巨 了佐</p> <p>判 双 判</p> <p>双延</p>
	<p>AUC</p> <p>换 出伤 a</p>	<p>2 丁 佳</p> <p>口</p>
		<p>2</p>

	/ 品	
	些 医 a,b	丁 呱
制		
仅 仅 单初 仅 iv 初 儿	仅 C <sub>max</sub> ↔ AUC  C <sub>max</sub> AUC 仅 C <sub>max</sub> ↔ AUC  C <sub>max</sub> AUC  单初 ( ) <sup>a,b</sup> C <sub>max</sub> AUC 仅 iv <sup>b</sup> 医 C <sub>max</sub> AUC  C <sub>max</sub> AUC a  C <sub>max</sub> AUC 初 医 <sup>a</sup> C <sub>max</sub> AUC a  儿 C <sub>max</sub> AUC	戊 丁 ° 口 制
	C <sub>max</sub> AUC a	2 丁 使 佐
仅 受	仅 受 C <sub>max</sub> AUC	2 仅 丁 听 德
	C <sub>max</sub> AUC a	2 丁 德 丁 口 QT TdP
否	否 医 a,b	2 否 丁 QT TdP

	/ 品	
仅	仅 $C_{max}$ AUC	2 仅 丁 佐 听 听
TDF	$C_{max}$ AUC a 医 a,b	
	$C_{max}$ AUC a 医 a,b	/戊 丁 c 口 制
Cobicistat	口 医 a,b 医 a,b	丁 口 制
单 Vaniprevir	单 $C_{max}$ AUC a Vaniprevir $C_{max}$ AUC a	单 /Vaniprevir 丁 c 口 单 /Vaniprevir 制
佳 初	佳 初 $C_{max}$ AUC a 佳 初 $C_{max}$ AUC a $C_{max}$ AUC a	丁 口 制
	$C_{max}$ AUC a 医 a,b	/戊 佳 初 丁 c 口 制
仅	仅: $C_{max}$ AUC : $C_{max}$ AUC	2 丁 佳 口
巨 /	巨 $C_{max} (\leftrightarrow)$ ,	丁 c

	/ 品	
	AUC ( ) <sup>a</sup> C <sub>max</sub> (↔), AUC ( ) <sup>a</sup>	巨 /
单 / 仅	单 C <sub>max</sub> ( ), AUC ( ) <sup>a</sup> 仅 C <sub>max</sub> (↔), AUC (↔ ) <sup>a</sup>	丁 <sup>c</sup> 单 / 仅
	<sup>b</sup> C <sub>max</sub> ↔ AUC	/戊 丁 <sup>c</sup> 口 /戊 制
	C <sub>max</sub> AUC <sup>a</sup>	丁 <sup>c</sup> 口 制
/ 初 /初 戊丁	C <sub>max</sub> ( ), AUC ( ) <sup>a</sup> C <sub>max</sub> (↔), AUC ( ) <sup>a</sup> 初 C <sub>max</sub> ( ), AUC ( ) <sup>a</sup> 初 C <sub>max</sub> ( ), AUC ( ) <sup>a</sup> C <sub>max</sub> ( ), AUC ( ) <sup>a</sup>	/戊 丁 <sup>c</sup> 口 制
初	C <sub>max</sub> AUC <sup>a</sup> 初 ↔ C <sub>max</sub> AUC <sup>a</sup>	/戊初 丁 <sup>c</sup> 口 制 初
	C <sub>max</sub> AUC <sup>a</sup> C <sub>max</sub> AUC <sup>a</sup>	/戊 丁 <sup>c</sup> 口 制
	C <sub>max</sub> AUC <sup>a</sup>	2 丁 佳
β 制		
	C <sub>max</sub> AUC	丁 <sup>c</sup> 口 制
制		
	医 <sub>a,b</sub>	2 丁 德 丁 TdP 官 德

	/ 品	
升	升 & 医 a,b	/戊 升 丁 c 口 /戊 升 制
单	$C_{max}$ AUC 单 a $C_{max}$ AUC a	2 丁
	医 a,b 医 a,b	/ 丁 c 口 / 制
德		
初 仅 初	初 仅 $C_{max}$ AUC 初 a / 医 品口 a,b	c 德 丁 2 丁 佳
	$C_{max}$ AUC a $C_{max}$ AUC a	/ / 丁 c 口 / 制
	$C_{max}$ AUC a	丁 2 德
	$C_{max}$ AUC a	丁 2 QT
*		
初	$C_{max}$ AUC a 初 $C_{max}$ AUC a	丁 c / 初
初 制		
初	初 $C_{max}$	2 初

	/ 品	
	AUC a	丁
	AUC a	丁 / / 丁 c 口 / 制
初	初 医 a,b	2 初 丁 丙 德 QT 丙 官 德 TdP
	C <sub>max</sub> AUC	2 丁 丙 官 德 德
	C <sub>max</sub> AUC a	2 丁
		2 丁 佳 口
制	听 C <sub>max</sub> AUC ; 制 医 a,b	制 丁 c 口 制 制
单	听 C <sub>max</sub> AUC a iv 医 ↔ b	
儿	医 a,b C <sub>max</sub> ↔ iv 受 AUC iv 受 单 听 b 医 单 医 a,b 受 C <sub>max</sub> AUC	

	/ 品	
	iv AUC 儿 iv 医 b 儿 受 C <sub>max</sub> AUC a iv C <sub>max</sub> AUC a	
	C <sub>max</sub> AUC a C <sub>max</sub> AUC a	2 丁 佳 / 丁 c
	↔ C <sub>max</sub> AUC	制 丁 c 口
	C <sub>max</sub> AUC a	2 丁
	C <sub>max</sub> AUC C <sub>max</sub> AUC	2 / 丁 延
	C <sub>max</sub> AUC	口 制
听		
	C <sub>max</sub> AUC a	2 丁 佳 丁 c
<b>SSRI</b>		
	↔ C <sub>max</sub> AUC a C <sub>max</sub> AUC a	/ 丁 c 口 / 制
	C <sub>max</sub> AUC	2 丁 延

	/ 品	
	a	
	$C_{max}$ AUC	a 2 丁 丁
	$C_{max}$ AUC a $C_{max}$ AUC a	2 丁 佳 / 丁 c
	医 a,b $C_{max}$ AUC 医 b $C_{max}$ AUC a $C_{max}$ AUC a CYP2D6 $C_{max}$ AUC a $C_{max}$ AUC a	丁 c 口 制 ; 口 德
	$C_{max}$ AUC	a 2 戊 丁 丁 c 口 制
	$C_{max}$ AUC a	2 戊 丁 QT 丁 c 口 制
初 A 受 单	初 A $C_{max}$ AUC 单 $C_{max}$ AUC	初 A / 单 / 单 丁 c 口 初 A / 单 / / 单 制



	/ 品	
	医 口 a 单 C <sub>max</sub> AUC a	
	C <sub>max</sub> AUC a	2 戊 丁 德 德 丁 听 佳 丁 2 丁 c
初	CYP2D6 EM: 初 C <sub>max</sub> AUC a CYP2D6 IM/PM 仙 CYP2D6 制	2 CYP2D6 戊 制 CYP2D6 EM/ CYP2D6 IM PM 初 丁 使 PR QTc /戊 QRS 德 仙 德 丁 CYP2D6 EM 初 丁 c 口 初 制
	医 a b	2 丁 口
	C <sub>max</sub> ( ), AUC ( ) <sup>a</sup>	丁 c 口 制
单	单 C <sub>max</sub> AUC a	单 丁 c 口 单 制
单 / 单	单 C <sub>max</sub> AUC a 单 C <sub>max</sub> ↔ AUC ↔ a 口	2 2 丁 佳 口 单 丁 c
制		
	C <sub>max</sub> AUC a C <sub>max</sub> AUC a	2 丁 佳 / 丁 c
	C <sub>max</sub> AUC	丁 c 口 制

\*CYP3A4 制 口  
EM IM PM TdP 官

	/ 品	
--	-----	--

:  
 : < 100% 卧 < 2 ;  
 : 100-400% 卧 2 < 5 ;  
 : 400-900% 卧 5 < 10 ;  
 : 10 ;  
 :  
 : < 40%;  
 : 40-80%;  
 : > 80%;

双 : ↔;

	品	卧佳	品	出戊			
a	制 了佐	换	了佐	戊 CYP3A4	使	制 /戊 P-	戊 BCRP 伤
b	律	换		了佐		伤	
c	丁						

了佐

1

丁 佳 丁

2

及

德

丁

佐  
佐

口仙

出 些 佐

平

换 CLSI  
 (CLSI M27-A2) CLSI  $\leq 0.125$  制 0.25-0.5  $\geq 1$   
 $\mu\text{g/mL}$  换 CLSI  
 左 EUCAST  $\leq 1$   
 $\text{mg/L}$  2  $\text{mg/L}$  EUCAST  
 制  $\leq 1 \mu\text{g/mL}$  口

帚

巨 儿  
 口佐 初  
 仙  
 儿  
 丁  
 些

14 $\alpha$ - ERG11 双 左 ERG11  
 /戊佳 左 判 双口 丁 亦  
 些  
 左 左  
 丁 出

双佐

换 品  
 40 80 160  $\text{mg/kg}$  仙 制 MRHD 1 2 8 口  
 判 制  
 判 口

80 mg/kg 制 仙 MRHD 9 先 判 佐

80 mg/kg 23 20 mg/kg 24  
80 mg/kg 制 仙 MRHD 4 判

医

受 戊  
仙

40 80 mg/kg/ 仙 MRHD 2 4

双 40 mg/kg/ 160 mg/kg/ 制 口 判口 双  
双 双 戊

双

20 mg/kg 制 仙

MRHD 4 判

3 口

双

不 -β- HP-β-CD

不 -β- 双佐 丁 DNA

双 双

不 -β- 品

不 -β- 佐

换 制

5000mg/kg/ 出 500mg/kg/ 制 医  
换 制 受 制 不 -β-

500mg/kg/ 制 不 -β- 1.7

不 -β- 医 / 双

出

佐 判 换 12 戊 2 丁

受 平 品 不 -β- HP-β-CD  
口 30 佳 制  
不 -β- 口些 双  
Beagle 13 受 不 -β- 1200mg/kg 4  
官

1  
受 受 2.5 口  
口 受 15 口 念 C<sub>max</sub> AUC 出  
4~7 受 制 200mg 念 C<sub>max</sub> 口 判 2μg/ml  
16~28 34~42  
换 制 丁 7~14  
律 278ml/min 制

2 听  
受 受 听 制 受 受 2.5 口  
判 初 55% 念 受  
初 口 30%  
制 佳

3 出  
99.6% 99.8% 亦 0.2% 些  
出 >700L 出 平 仙  
2 3

4

左

4

些 CYP3A4

些

些

2

5

受

仙

些

35%

54%

些

1%

制

制

受

制

3~18%

出口丁

4

丁

口仙

2~4

1

卧口律

3

口

6

1

12 使

6 使

制 受

100mg

判

C<sub>max</sub>

47%

2

出

37±17

16±5

换 AUC

估

佳

换

2

受

3

n=7

n=7

n=5

佳

200mg

4

50mg

换 AUC

13ml/min×1.73m<sup>2</sup>

戊

T<sub>max</sub>

C<sub>max</sub>

AUC<sub>0-8h</sub>

品

3

巢延

CrCl<sub>150~79ml/min</sub>

制

CrCl<sub>120~49ml/min</sub>

CrCl<sub><20ml/min</sub>

估

42~49

48

换 AUC

30% 40%

佳

换

品

3

佳 换 受 制 5  
 17 受 制 制  
 1.5 12.5mg/kg/ 戊 制 仙 2.5mg/kg  
 戊 戊 2.5mg/kg 判 AUC  
 出 判 出  $C_{max}$   
 出 估  
 不  $-\beta-$   
 不  $-\beta-$  佐 受 制 受 初 0.5%  
 不  $-\beta-$  估 不  $-\beta-$  受 初 丁  
 双 估

在 25 以下保存。

帚 “ ” 150ml/ 1 /

佳 帚

卧

24

1

JX20070064

受

H20130425

口

些 与

与 初 Janssen Pharmaceutica NV  
 些 Turnhoutseweg 30,B-2340 Beerse 初

些与

710

400 888 9988

029 82576616

<http://www.xian-janssen.com.cn>