

艾达乐™

外

5%咪喹莫特乳膏 说明书

【药品名称】

通用名：咪喹莫特乳膏

商品名：艾达乐

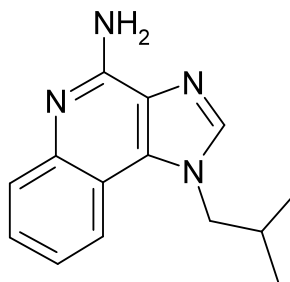
英文名：Imiquimod Cream

汉语拼音：Mikuimote Rugao

本品的主要成分为咪喹莫特。其化学名称为：1-(2-甲基丙基)-1H咪唑(4,5-C)喹啉-4-胺，其结构式为

分子式：C₁₄H₁₆N₄

分子量：240.31



【性状】

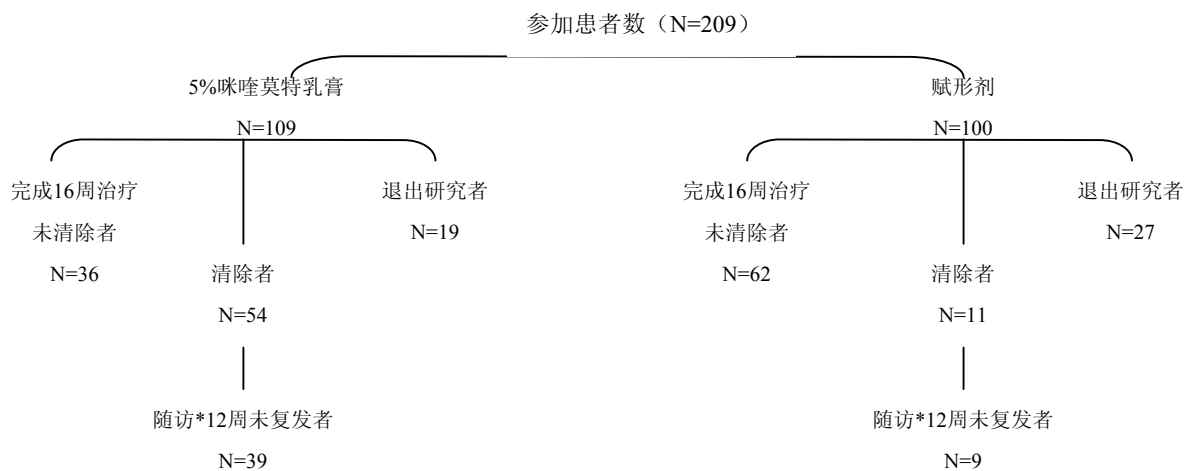
本品为乳剂型基质的白色或类白色乳膏。

【药理作用】

咪喹莫特治疗生殖器疣或肛周疣的作用机制尚不知道。其对培养细胞没有直接的抗病毒作用。对鼠皮肤研究显示，咪喹莫特诱导包括 α -干扰素在内的细胞因子的产生。然而，这些发现的临床相关性不清楚。

在一个双盲安慰剂对照试验中，209例18岁及18岁以上的生殖气疣/肛周疣的患者，外用5%的咪喹莫特乳膏或赋形剂（对照），每周3次，最长16周。疣基地的平均面积是69 mm²(范围8-5525 mm²)。患者的情况如下：

1004-IMIQ-患者情况



*其他患者失访或复发

完全治愈的患者数列在下表，平均治愈时间是10周。

治疗研究-1004

	治疗	疣完全清除患者	未随访患者	16周疣仍存在的患者
共计	5%咪喹莫特乳膏 (N=109)	50%	17%	33%
	赋形剂 (N=100)	11%	27%	62%
女性	5%咪喹莫特乳膏 (N=46)	72%	11%	17%
	赋形剂 (N=40)	20%	33%	48%
男性	5%咪喹莫特乳膏 (N=63)	33%	22%	44%
	赋形剂 (N=60)	5%	23%	72%

致癌性、致突变性、对生育的损伤

尚无对啮齿类动物的致癌性资料。在8种不同致突变系列实验中，没有发现异常，包括Ames，鼠淋巴瘤，CHO染色体异位，人类淋巴细胞染色体异位，SHE细胞转化，鼠骨髓细胞遗传学及鼠显著致死试验。在鼠交配、妊娠、分娩及授乳过程中，给予口服8倍于人类的剂量（按mg/m²计算），未见对生殖的影响。

【药代动力学】

对单独外用5 mg[14C]咪喹莫特乳膏的6名健康者的研究发现，[14C]咪喹莫特的经皮吸收是很少的。在血清中也未检测到其放射性活性（较低限度剂量：1 ng/mg），且外用后从尿液和粪便中排出的放射性标记剂量<0.9%。

【适应症】

成人外生殖器疣和肛周疣/尖锐湿疣。

【用法用量】

本品每周应用3次，于睡前外用，药物在皮肤上保留时间为6-10小时，然后用肥皂或清水清洗用药部位。每周3次的使用程式是：星期一、星期三、星期五；或星期二、星期四、星期六，均于睡前使用。红斑是常见的。如果患者出现不适或严重的局部皮肤反应，应停用几天，当反应消退后再继续治疗。当出现反应时应穿透气性的衣物如：棉纱、棉内衣裤。给予适当剂量的治疗可以达到本品的最大治疗效果。建议用药前后要洗手。本品包装在一次性使用的袋内，含有足以覆盖20 cm²的乳膏剂，应避免过量使用。应指导患者如何把乳膏应用于生殖器或肛周疣的皮损上。在疣表面涂上一薄层，然后摩擦直至不再看见乳膏剂为止。用药部位不必包扎。

【不良反应】

在临床对照实验中，最常报道的不良反应是局部皮肤和用药部位的反应；也有患者有全身反应。这些反应通常是轻至中度的，然而，在每周3次的治疗中也有报道出现严重不良反应的。每天1次疗法的副反应比1周3次的不良反应更多、更强烈。总的来说，在每周3次的疗法研究中，有1.2%（4/327）的患者因为局部皮肤或用药部位皮肤的反应而停止治疗。在临床对照研究实验中皮肤局部反应的发生率和严重性如下表：

每周3次疗法 - 调查者评估疣部位的反应

	轻度/中度				重度			
	女性		男性		女性		男性	
	5%咪喹莫特 N=114	赋形剂 N=99	5%咪喹莫特 N=156	赋形剂 N=157	5%咪喹莫特 N=114	赋形剂 N=99	5%咪喹莫特 N=156	赋形剂 N=157
红斑	61%	21%	54%	22%	4%	0	4%	0
糜烂	30%	8%	29%	6%	1%	0	1%	0
脱皮	18%	8%	25%	8%	0	0	1%	0
浮肿	17%	5%	12%	1%	1%	0	0	0
硬化	5%	2%	7%	2%	0	0	0	0
溃疡	5%	1%	4%	1%	3%	0	0	0
结痂	4%	0	13%	3%	0	0	0	0
水疱	3%	0	2%	0	0	0	0	0

应用5%咪喹莫特乳膏也有远部位的皮肤反应的报道，来自女性的远部位的皮肤反应为红斑（3%）、溃疡（2%）、水肿（1%）；男性为溃烂（2%）、红斑、水肿、硬化、蜕皮各为1%，被判定为与本品很可能有关或可能有关，并且发生率在5%以上的不良事件列于如下，其中包括疼痛、类似感冒症状和肌痛等症状。

每周3次疗法

	女性		男性	
	5%咪喹莫特 117人	赋形剂 103人	5%咪喹莫特 156人	赋形剂 158人
<u>用药部位紊乱:</u>				
治疗部位反应				
疣部位:				
瘙痒	32%	20%	22%	10%
烧灼感	26%	12%	9%	5%
疼痛	8%	2%	2%	1%
痛苦	3%	0	0	1%
<u>真菌感染*</u>	11%	3%	2%	1%
<u>系统反应:</u>				
头痛	4%	3%	5%	2%
类似感冒症状	3%	2%	1%	0
肌肉痛	1%	0	1%	1%

*所报告的事件的发生与本品无因果关系

被判定为与本品很可能有关或可能有关，并且发生率在1%以上的不良事件包括：用药部位的异常：疣部位的反应（烧灼、色素减退、刺激、瘙痒、疼痛、潮红、敏感、痛苦、刺痛、触痛）；远部位的反应（流血、烧灼、瘙痒、疼痛、触痛、足癣）；全身反应：疲劳、发热、类似感冒症状；中枢和周围神经系统：头痛；胃肠道：腹泻；肌肉-骨骼；肌痛。

【禁忌症】

对本品过敏者禁用。

【注意事项】

本品尚未进行治疗尿道、阴道、宫颈、直肠内的人类乳头瘤病毒感染的评估，因而不推荐用于这些情况的治疗。

一般情况：

局部常可见红斑、糜烂、表面脱落及水肿。如果出现严重的局部皮肤反应，应用温和的肥皂水洗去药物，皮肤反应消退后可继续治疗。没有应用其它药物治疗生殖器及肛周疣后，立即应用本品的临床经验，因此在任何先前使用药品或外科手术治疗生殖器/肛周疣后，伤口未愈合之前，并不推荐使用本品。本品有加重皮肤炎症的可能。

给患者的讯息：

应用本品的患者应注意以下的信息和说明，本品对生殖器和肛周疣传播的作用尚不知道。本品可能会损害避孕套和阴道隔膜，因此不主张同时使用。

- 1、遵医嘱使用该药，仅供外用，避免接触到眼睛。
- 2、治疗部位不能包扎。
- 3、当皮肤上有药物时应避免性接触（生殖器、肛周、口）。
- 4、建议使用本品6-10小时后，用温和肥皂或水清洗治疗部位。
- 5、患者用药部位或邻近部位皮肤出现诸如红斑、糜烂、表面脱落及水肿等局部反应是常见的。大多数反应是轻至中度的，若出现严重的皮肤反应应立即进行适当处理。
- 6、未进行包皮环切的男性治疗包皮下疣时应将包皮翻起，并每天清洗。
- 7、患者应了解在治疗过程中可能会有新的疣出现，因为本品并不能治愈疣。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

妊娠分类B：对妊娠妇女没有充分和很好的对照研究。在鼠或兔的致畸研究中未发现咪喹莫特的致畸作用。给母系鼠毒性剂量的咪喹莫特（按mg/m²计算，28倍于人的剂量），可观察到幼鼠的体重减轻，以及成骨发育延迟。在用咪喹莫特（8倍于人类剂量）治疗孕鼠的后代的发育研究中，未发现副作用。

外用咪喹莫特是否从乳液中排出还不清楚。

【儿童用药】

尚未建立18岁以下的患者的有效性和安全性。

【药物相互作用】 尚不明确。

【药物过量】

本品的用药过量不可能是由于其微弱的经皮吸收。动物研究表明咪喹莫特的兔致死剂量超过1600 mg/m²。持续外用过量的本品会导致严重的皮肤反应。临床上报道的最严重的反应是在多次口服咪喹莫特超过200 mg后出现的低血压，经口服或静脉补液后可恢复。

【规格】 250mg:12.5mg

【贮藏】 密闭保存。

【包装】 每袋250mg，每盒12袋，一次性包装

【有效期】 暂定2年。

【批准文号】 H20040797

【生产企业】 3M Healthcare Limited

企业名称：3M中国有限公司

地址：上海市虹桥开发区兴义路8号万都中心大厦38楼

邮政编码：200336

电话号码：86-21-62753535

传真号码：86-21-52082205

网址：<http://www.3m.com/intl/cn/index.html>

620352852

3M

3M Healthcare Limited
Derby Road, Loughborough
England