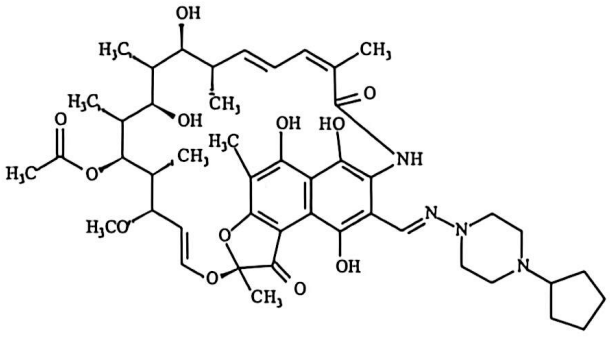
核准日期：2007年01月31日
修改日期：2020年01月02日

# 利福喷丁胶囊说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

【药品名称】
通用名：利福喷丁胶囊
英文名：Rifapentine Capsules
汉语拼音：Lifupending Jiaonang
【成　　份】本品主要成份为利福喷丁。
化学名称：3-[4-环戊基-1-哌嗪基-亚氨甲基]-利福霉素SV
化学结构式：



分子式：$C_{47}H_{64}N_4O_{12}$
分子量：877.04
【性　　状】本品内容物为砖红色或暗红色的结晶性粉末。
【适 应 症】
1.本品与其他抗结核药联合用于各种结核病的初治与复治，但不宜用于结核性脑膜炎的治疗。
2.适合医务人员直接观察下的短程化疗。
3.亦可用于非结核性分枝杆菌感染的治疗。
4.与其他抗麻风药联合用于麻风治疗可能有效。
【规　　格】0.15g
【用法用量】
口服，抗结核。成人一次0.6g（体重<55Kg者应酌减），一日1次，空腹时(餐前1小时)用水送服；一周服药1～2次。需与其他抗结核药联合应用，肺结核初始患者其疗程一般为6～9个月。
【不良反应】本品不良反应比利福平轻微，少数病例可出现白细胞、血小板减少；丙氨酸氨基转移酶升高；皮疹、头昏、失眠等。胃肠道反应较少。应用本品未发现流感症候群和免疫性血小板降低，也未发现过敏性休克样反应。如果出现这类不良反应须及时停药。
【禁　　忌】
1.对本品或利福霉素类抗菌药过敏者禁用。
2.肝功能严重不全、胆道阻塞者和孕妇禁用。
【注意事项】
1.本品与其他利福霉素有交叉过敏性。
2.酒精中毒、肝功能损害者慎用。肝功能减退患者必须密切观察肝功能的变化。
3.服用本品后引起白细胞和血小板减少患者，应避免进行拔牙等手术，并注意口腔卫生，剔牙需谨慎，直至血象恢复正常。
4.对诊断的干扰：可引起直接抗球蛋白试验（Coombs试验）阳性；干扰血清叶酸浓度测定和血清维生素$B_{12}$浓度测定结果；可使磺溴酞钠试验滞留出现假阳性；可干扰利用分光光度计或颜色改变而进行的各项尿液分析试验的结果；可使血液尿素氮、血清碱性磷酸酶、血清丙氨酸氨基转移酶、门冬氨酸氨基转移酶、血清胆红素及血清尿酸浓度测定结果增高。
5.应用本品过程中，应经常观察血象和肝功能的变化情况。
6.如曾间歇服用利福平因产生循环抗体而发生变态反应，如血压下降或休克、急性溶血贫血、血小板减少或急性间质性肾小管肾炎者，均不宜再用本品。
7.本品应在空腹时(餐前1小时)用水送服；国外推荐给予高脂和少量碳水化合物的早餐后服用本品可提高生物利用度。如服利福平出现胃肠道刺激症状者可改服本品。
8.本品单独用于治疗结核病可能迅速产生细菌耐药性，必须联合其他抗结核药治疗。
9.患者服用本品后，大小便、唾液、痰液、泪液等可呈橙红色。
【孕妇及哺乳期妇女用药】孕妇禁用。本品可经乳汁排泄，哺乳期妇女用药应充分权衡利弊后决定是否用药，如应需要使用本品时应暂停哺乳。
【儿童用药】本品在5岁以下小儿应用的安全性尚未确定。
【老年用药】老年患者肝功能有所减退，用药量应酌减。

【药物相互作用】
1.服用本品时每日饮酒，可导致本品肝毒性增加，故服用本品期间应戒酒。
2 对氨基水杨酸盐可影响本品的吸收，导致其血药浓度减低：如必须联合应用时，两者服用间隔至少6小时。
3.苯巴比妥类药，可能会影响本品的吸收，故不宜与本品同时服用。
4.本品与口服抗凝药同时应用时会降低后者的抗凝效果，应加以注意。
5.本品与异烟肼合用可致肝毒性发生危险增加，尤其是原有肝功能损害者和异烟肼快乙酰化患者。
6.本品与乙硫异烟胺合用可加重其不良反应。
7.制酸药合用会明显降低本品的生物利用度。
8.肾上腺皮质激素(糖皮质激素、盐皮质激素)、氨茶碱、茶碱、氯霉素、氯贝丁酯、环孢素、维拉帕米(异搏定)、妥卡尼、普罗帕酮、甲氧苄啶、香豆素或茚满二酮衍生物、口服降血糖药、促皮质素、氨苯砜、洋地黄苷类、丙吡胺、奎尼丁等与本品合用时，由于后者诱导肝微粒体酶活性，可使上述药物的药效减弱，因此除地高辛和氨苯砜外，在用本品前和疗程中上述药物需调整剂量。与香豆素或茚满二酮类合用时应每日或定期测定凝血酶原时间，据以调整剂量。
9.本品可诱导肝微粒体酶，增加抗肿瘤药达卡巴嗪(dacarbazine)、环磷酰胺的代谢，形成烷化代谢物，促使白细胞减低，因此需调整剂量。
10.与地西泮(安定)合用可增加后者的消除，使其血药浓度减低，故需调整剂量。
11.本品可增加苯妥因在肝脏中的代谢，故两者合用时应测定苯妥因血药浓度并调整用量。
12.本品可增加左旋甲状腺素在肝脏中的降解、因此两者合用时左旋甲状腺素剂量应增加。
13.本品亦可增加美沙酮、美西律在肝脏中的代谢，引起美沙酮撤药症状和美西律血药浓度减低，故合用时后两者需调整剂量。
14.丙磺舒可与本品竞争被肝细胞的摄入，使本品血药浓度增高并产生毒性反应。但该作用不稳定，故通常不宜加用丙磺舒以增高本品的血药浓度。
15.氯苯酚嗪可减少本品的吸收，达峰时间延迟且半衰期延长。
16.与咪康唑或酮康唑合用，可使后两者血药浓度减低，故本品不宜与咪唑类合用。
【药物过量】
逾量的处理：(1)洗胃，洗胃后给予活性炭糊，以吸收胃肠道内残余的利福喷丁；有严重恶心、呕吐者，给予止吐剂。(2)输液，给利尿药促进药物排泄。(3)出现严重肝功能损害达24～48小时以上者，可考虑进行胆汁引流，以切断本品的肝肠循环。
【药理毒理】
利福喷丁为半合成广谱杀菌剂，体外对结核杆菌有很强的抗菌活性，最低抑菌浓度(MIC)为0.12～0.25mg/L，比利福平强2～10倍；在小鼠体内的抗结核感染作用也优于利福平。麻风杆菌和其他分枝杆菌如堪萨斯分枝杆菌、蟾分枝杆菌也对本品敏感，但鸟分枝杆菌耐药。另外本品对多数革兰阳性球菌有高度抗菌活性，其MIC＜0.025mg/L；对革兰阴性菌的作用差。对衣原体属的作用与红霉素、多西环素相仿，较利福平差；对耐甲氧西林葡萄球菌作用较差。体外试验结果，衣原体、金黄色葡萄球菌和淋病奈瑟菌都会对本品产生耐药性。与多西环素联合，对淋病奈瑟菌有协同作用；与异烟肼联合，对结核杆菌的作用远远超过利福平与异烟肼联合。
其作用机制与利福平相同，为与依赖DNA的RNA多聚酶的亚单位牢固结合，抑制细菌RNA的合成，防止该酶与DNA连接，从而阻断RNA转录过程，使DNA和蛋白的合成停止。
动物实验证明本品有一定的肝功能毒性，对胎儿有致畸作用。
【药代动力学】
本品在胃肠道的吸收缓慢且不完全，健康成人单次口服4mg/kg，血药峰浓度($C_{max}$)平均 5.13mg/L，血消除半衰期($t_{1/2\beta}$)为14.1小时；单次口服8mg/kg，则血药峰浓度($C_{max}$)平均8.5mg/L，血消除半衰期($t_{1/2\beta}$) 19.9小时。本品蛋白结合率>98%，口服本品5～15小时后血浓度可达高峰。本品在体内分布广，尤其肝组织中分布最多，其次为肾，其他组织中亦有较高浓度，但不易透过血-脑脊液屏障。主要在肝内酯酶作用下去乙酰化，成为25-去乙酰利福平；后者在肝脏内去乙酰化比利福平慢，其蛋白结合率显著降低，它水解后形成无活性的3-甲酰利福霉素。本品存在肝、肠循环，故由胆汁排入肠道的原药部分可被再吸收。本品及其代谢产物主要经胆汁入肠道随粪排出，仅部分由尿中排出。
【贮　　藏】密封，在阴暗干燥处保存（不超过20℃）。
【包　　装】药品包装用铝箔/药用PVC硬片，10粒/板，2板/小盒
【有 效 期】24个月
【执行标准】$WS_1$-（X-283）-2004Z
【批准文号】国药准字H10840004
【上市许可持有人】四川明欣药业有限责任公司
【上市许可持有人地址】成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园青啤大道1069号
【生产企业】
企业名称：四川明欣药业有限责任公司
生产地址：成都市温江区成都海峡两岸科技产业开发园青啤大道1069号
邮政编码：611130
电话号码：028-82762664
传真号码：028-82762685
网　　址：Http://www.scmx.cn