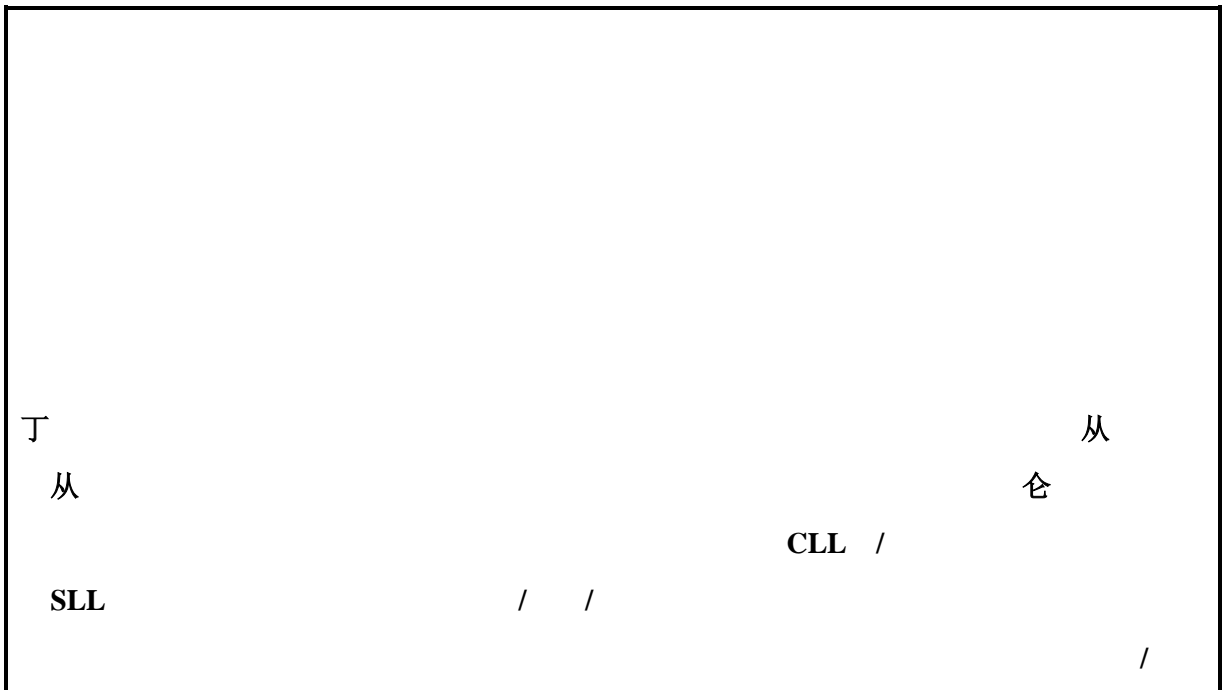


2007	02	20
2008	02	20
2008	07	29
2010	04	08
2011	11	05
2013	06	17
2014	10	22
2015	12	24
2016	06	03
2017	10	26
2018	06	14
2019	02	27
2019	04	12
2020	07	01
2022	10	20
2023	04	10



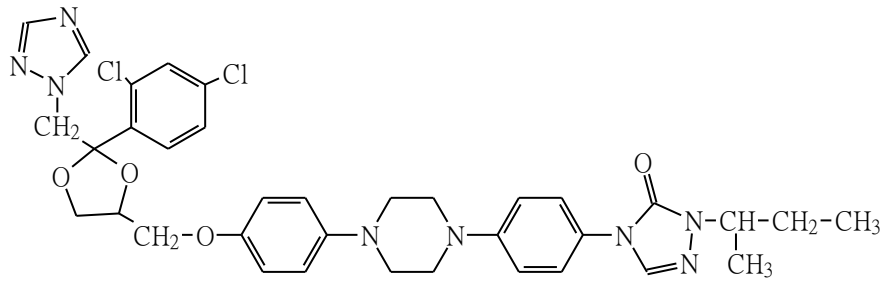
QT

®

Itraconazole Oral Solution

Yiqukangzuo Koufuye

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



$C_{35}H_{38}Cl_2N_8O_4$

705.64

- -

了

1 HIV 但 /

2 <500

/ 1

/

150ml: 1.5g

1

1

/

20

从

2

1

/

200mg 2

20ml

1 2

1

1

1

2

/

2

100

200mg

1 2

10

20ml

2

2

2

400mg

14

3

5mg/kg

2

了

了

但了 100

/ 1

>1000

3

亲

1

了

但

2

3

了

了

了 5mg/kg/

了 亲

了

4

了 了 了  
 但  
 从  
 5

了

了

了

/

ADR

/

/

从

从

889

6

624

4

1

1%

1

**1 10**

**1%**

	% =889
	3.6
	1.5
	1.1
	1.8
	9.1



2: 10 <1%


/  
下

从

但

但

-

250 6 14 5

了

了

36.0% 30.8% 28.4% 23.2% 22.8%



QT

CLL /

SLL

/ /

3. 了

CHF

4. 了

5.

**1**

从 从

**2**

但

400mg 了 但

了

了 /

从

**3**

从 / 从



了

从 CYP3A4

了

从

从

4

5

6

了

7

了

了

8

/

CYP3A4

但了

CYP3A4

/

QT

了

9

2.5mg/kg 2  
250ng/mL

16

50%

16

10

了

但

亲

从

11

了

了

12

了

了

了

但

从

13

/

了

14

了

了

15

了

16 从

了

了

了

丁 了  
了 位

了

了

了 5mg/kg/

了 亲  
了

了

了

了

但

从

了

CYP3A4

从

CYP3A4

CYP3A4

CYP3A4

但

但

CYP3A4

CYP3A4

P-

BCRP

CYP3A4

P-

/

BCRP

/

/

但

但

7 14

但

了

CYP3A4

但

1.

位

了

1) CYP3A4

/

2.

/

了

1) CYP3A4

2

2) CYP3A4/ P-

/BCRP

但

2

3.

/

了:

1) CYP3A4

2) CYP3A4/ P-

/BCRP

但

了

了

	/	
<b>α</b>		
	$C_{max}$ AUC      a $C_{max}$ AUC      a $C_{max}$ AUC      a	 /      /      2 c
IV	$C_{max}$ AUC      a $C_{max}$ AUC      a $C_{max}$ AUC  a,b	 /      /      /      c
	IV AUC a  从 a,b	 2 c
	$C_{max}$ AUC a	2 QT TdP
	R - $C_{max}$ AUC      a	2 QT      TdP
	$C_{max}$ AUC	c
	a,b	2 TdP
	$C_{max}$ AUC      a	2 TdP
	$C_{max}$ AUC a	2 QT
	$C_{max}$ AUC	2 QT TdP 但
	q.d. 2	位

	$C_{max}$ a	AUC	<sup>2</sup> c
	AUC	$C_{max}$	
	a,b	$C_{max}$	/ c /
	a,b		/ / c
	:	a,b	<sup>2</sup> 但
	AUC		
	a,b	:	$C_{max}$ c 但 <sup>2</sup>
	$C_{max}$	:	AUC
	a	AUC	<sup>2</sup> 从 QT TdP <sup>c</sup>
	a,b	:	
	AUC	$C_{max}$ a	/ / / <sup>2</sup> c
	AUC	$C_{max}$ a	
	AUC	$C_{max}$ a	
	AUC	$C_{max}$ a	
从	a,b	从 $C_{max}$ AUC a	/ 从 c / 从
	AUC	$C_{max}$ a	c
	$C_{max}$		<sup>2</sup>

	AUC <sup>a</sup>	
	a,b a,b	2 但 c
	: a,b : AUC	2 但
	AUC <sup>C<sub>max</sub></sup> AUC <sup>C<sub>max</sub></sup> <sup>a</sup>	/ / c
-	AUC <sup>C<sub>max</sub></sup> <sup>a</sup> AUC <sup>C<sub>max</sub></sup> <sup>a</sup> C <sub>max</sub> AUC	- / c
	a,b	2 QT
	AUC <sup>C<sub>max</sub></sup> <sup>a</sup>	2 -
	AUC <sup>C<sub>max</sub></sup> <sup>a</sup>	c
	AUC <sup>C<sub>max</sub></sup> <sup>a</sup>	2 QT TdP 从
从	AUC <sup>C<sub>max</sub></sup> <sup>a</sup> AUC <sup>C<sub>max</sub></sup> 从 <sup>a,b</sup>	c / / 从 / / 从
	AUC <sup>C<sub>max</sub></sup> <sup>a</sup>	2 QT
	b	2 QT TdP 从
	AUC <sup>C<sub>max</sub></sup>	c

	a	
	a,b	2
Brentuximab vedotin	<p>AUC<sup>a</sup></p> <p>Brentuximab vedotin</p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>C<sub>max</sub> AUC</p> <p>C<sub>max</sub></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>C<sub>max</sub></p> <p>AUC</p> <p>C<sub>max</sub><sup>a</sup></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>C<sub>max</sub><sup>a</sup></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>C<sub>max</sub><sup>a</sup></p> <p>从 C<sub>max</sub><sup>a</sup></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>C<sub>max</sub> ↑ 、</p> <p>AUC ↑</p> <p>C<sub>max</sub><sup>a</sup></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>C<sub>max</sub><sup>a</sup></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>C<sub>max</sub><sup>a</sup></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>A C<sub>max</sub><sup>a</sup></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>从 C<sub>max</sub></p> <p>AUC</p>	c
	<p>C<sub>max</sub><sup>a</sup></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>a,b</p>	/ /
从	<p>C<sub>max</sub><sup>a</sup></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>C<sub>max</sub></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>从 C<sub>max</sub><sup>a</sup></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>C<sub>max</sub><sup>a</sup></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>C<sub>max</sub></p>	2 c
从	<p>C<sub>max</sub><sup>a</sup></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>从 C<sub>max</sub><sup>a</sup></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>C<sub>max</sub><sup>a</sup></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>C<sub>max</sub></p>	从 了



<p>Glasdegib</p> <p>Talazoparib</p> <p>Trastuzumab emtansine</p>	<p>AUC<sup>a</sup></p> <p>C<sub>max</sub></p> <p>AUC</p> <p>C<sub>max</sub></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>C<sub>max</sub></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>从 AUC<sup>a</sup></p> <p>恩曲替尼C<sub>max</sub> ↑、</p> <p>AUC ↑ ↑ ↑</p> <p>Glasdegib C<sub>max</sub></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>C<sub>max</sub></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>C<sub>max</sub></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>C<sub>max</sub></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>C<sub>max</sub></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>Talazoparib C<sub>max</sub></p> <p>AUC</p> <p>C<sub>max</sub></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>emtansine</p> <p>a,b</p> <p>a,b</p>	
	<p>AUC<sup>a</sup></p>	<p>2</p> <p>但</p>
	<p>a,b</p>	<p>2</p>
<p>Mobocertinib</p>	<p>Mobocertinib C<sub>max</sub> ↑</p> <p>↑、AUC ↑ ↑ ↑</p>	<p>2</p> <p>Mobocertinib<sup>c</sup></p>
	<p>C<sub>max</sub></p> <p>AUC<sup>a</sup></p> <p>a</p>	<p>了 /</p> <p>/ /</p> <p>2</p> <p>c</p>

iv	$C_{max}$ AUC $C_{max}$ AUC $C_{max}$ AUC ( ) <sup>a,b</sup> $C_{max}$ AUC iv b $C_{max}$ AUC $C_{max}$ AUC a AUC a $C_{max}$ b AUC a $C_{max}$ AUC	c
	$C_{max}$ AUC a	2 但
	$C_{max}$ AUC	2
	$C_{max}$ AUC a	2 QT TdP
	a,b	2 QT TdP
丁	丁 $C_{max}$ AUC	2 丁
TDF	$C_{max}$ AUC a a,b	

	AUC $C_{max}$ <sup>a</sup>	c /
	a,b	
Cobicistat	从 a,b a,b	
从 Vaniprevir	从 $C_{max}$ AUC <sup>a</sup> Vaniprevir $C_{max}$ AUC <sup>a</sup>	从 /Vaniprevir <sup>c</sup> 从 /Vaniprevir
	$C_{max}$ <sup>a</sup> AUC $C_{max}$ <sup>a</sup> AUC $C_{max}$ <sup>a</sup> AUC	
	AUC $C_{max}$ <sup>a</sup>	/ <sup>c</sup>
	$C_{max}$ : AUC : $C_{max}$ AUC	2 但
/	$C_{max}$ ), AUC ( ) <sup>a</sup> $C_{max}$ ), AUC ( ) <sup>a</sup>	c /
/ 从	$C_{max}$ ( ), AUC ( ) <sup>a</sup> 从 $C_{max}$ , AUC ) <sup>a</sup>	c / 从
	<sup>b</sup> $C_{max}$ AUC	c / /
	$C_{max}$ AUC <sup>a</sup>	c
从 / /	$C_{max}$ ( ), AUC ( ) <sup>a</sup>	c /

	从 $C_{max}$ AUC ( ) <sup>a</sup> $C_{max}$ ( ), AUC ( ) <sup>a</sup> $C_{max}$ ( ), AUC ( ) <sup>a</sup> $C_{max}$ ( ), AUC ( ) <sup>a</sup>	
	AUC $C_{max}$ a AUC $C_{max}$ a	c /
	$C_{max}$ AUC  $C_{max}$ AUC a	c /
<b>β</b>		
	AUC $C_{max}$	c
	a,b	2 TdP
	& a,b	c / /
	AUC $C_{max}$ a AUC $C_{max}$ a AUC	2 但
从	a,b a,b	/ / c
从		
从	AUC $C_{max}$ a $C_{max}$ AUC /从	c 2

	了 a,b	
	$C_{max}$ AUC <sub>a</sub> $C_{max}$ AUC <sub>a</sub>	/ / c
	$C_{max}$ AUC <sub>a</sub>	2
	$C_{max}$ AUC <sub>a</sub>	2 QT
*		
从	$C_{max}$ AUC <sub>a</sub> 从 $C_{max}$ AUC <sub>a</sub>	/ 从 c
	$C_{max}$ AUC <sub>a</sub>	2 但
	非奈利酮 $C_{max}$ (↑↑ )、AUC (↑↑↑ ) <sub>a</sub>	2 c
	AUC <sub>a</sub> $C_{max}$ AUC <sub>a</sub> $C_{max}$ AUC <sub>a</sub>	/ / c /
	a,b	2 QT TdP
	$C_{max}$ AUC	2
	$C_{max}$ AUC <sub>a</sub>	2
		2 但
	$C_{max}$ AUC ;	c

<p>从</p>	<p>从</p> <p>a,b</p> <p>C<sub>max</sub> AUC</p> <p>a</p> <p>iv</p> <p>b</p> <p>从</p> <p>a,b</p> <p>C<sub>max</sub> iv</p> <p>AUC</p> <p>iv</p> <p>b</p> <p>a,b</p> <p>C<sub>max</sub></p> <p>AUC</p> <p>iv</p> <p>AUC</p> <p>从</p> <p>iv</p> <p>b</p> <p>从</p> <p>C<sub>max</sub> AUC</p> <p>a</p> <p>iv C<sub>max</sub></p> <p>AUC</p> <p>a</p>	
	<p>C<sub>max</sub></p> <p>AUC</p> <p>a</p> <p>C<sub>max</sub></p> <p>AUC</p> <p>a</p>	<p>2</p> <p>/</p> <p>c</p>
<p>Voclosporin</p>	<p>Voclosporin C<sub>max</sub> ↑</p> <p>↑ ↑) 、 AUC ↑ ↑</p> <p>↑ ↑) a</p>	<p>2</p> <p>Voclosporin</p> <p>c</p>
<p>从</p>	<p>从 C<sub>max</sub></p> <p>AUC</p>	<p>从</p> <p>从</p> <p>c</p>
<p>从</p>	<p>从 C<sub>max</sub></p> <p>AUC</p> <p>a</p>	<p>2</p> <p>从</p>
<p>从</p>	<p>从 C<sub>max</sub></p>	<p>2</p> <p>从</p>

从	AUC 从 C <sub>max</sub> AUC	/ 从
	AUC C <sub>max</sub>	但
	AUC C <sub>max</sub> a	2 c
<b>SSRI 丁</b>		
	AUC C <sub>max</sub> a AUC C <sub>max</sub> a	/ / c
	AUC C <sub>max</sub> a	2
	AUC C <sub>max</sub> a	2 但
	AUC C <sub>max</sub> a AUC C <sub>max</sub> a	/ 2 c
从  从	从 a,b AUC C <sub>max</sub> b AUC C <sub>max</sub> a 从 AUC C <sub>max</sub> a CYP2D6 a C <sub>max</sub> AUC AUC C <sub>max</sub> a	; 从 了 从 从 从
	AUC C <sub>max</sub> a	2 了

		从 <sup>c</sup>
	AUC <sup>C<sub>max</sub><sub>a</sub></sup>	2 了 QT 从 <sup>c</sup>
从 从		
A	A <sup>C<sub>max</sub><sub>a</sub></sup> AUC <sup>C<sub>max</sub><sub>a</sub></sup> AUC <sup>C<sub>max</sub><sub>a</sub></sup>  A <sup>C<sub>max</sub><sub>a</sub></sup> AUC <sup>C<sub>max</sub><sub>a</sub></sup>	A / / / <sup>c</sup> A / / /
仓	仓 <sup>C<sub>max</sub><sub>a</sub></sup> AUC <sup>C<sub>max</sub><sub>a</sub></sup>	2 了 仓 但 从 仓 2 <sup>c</sup>
	CYP2D6 EM: <sup>C<sub>max</sub><sub>a</sub></sup> AUC <sup>C<sub>max</sub><sub>a</sub></sup> CYP2D6 IM/PM CYP2D6	2 了 CYP2D6 CYP2D6 EM/ CYP2D6 IM PM PR QT <sup>c</sup> / QRS CYP2D6 EM <sup>c</sup>
	<sup>a,b</sup>	2
从	从 <sup>C<sub>max</sub>( )</sup> , AUC ( ) <sup>a</sup>	从 <sup>c</sup>
	<sup>C<sub>max</sub><sub>a</sub></sup> AUC <sup>C<sub>max</sub><sub>a</sub></sup>	<sup>c</sup>
/	<sup>C<sub>max</sub><sub>a</sub></sup> AUC <sup>C<sub>max</sub><sub>a</sub></sup>  <sup>C<sub>max</sub><sub>a</sub></sup> AUC <sup>C<sub>max</sub><sub>a</sub></sup> 但	2 2 但 <sup>c</sup>
	<sup>C<sub>max</sub></sup> AUC	2 <sup>c</sup>
	<sup>C<sub>max</sub></sup> AUC	/ <sup>c</sup>



	<sup>a</sup> $C_{max}$ AUC	
	$C_{max}$ AUC	<sup>c</sup>

\*CYP3A4

EMs                      IMs                      PMs                      TdP

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

了

<sup>a</sup> 了                      从 CYP3A4                      / P-                      BCRP  
 /

了      从

<sup>b</sup>  
<sup>c</sup>

亲

亲

1

2

1

2.5

15

$C_{max}$       AUC

	4~7	200mg	C <sub>max</sub>	2μg/ml
		16~28		34~42
			278ml/min	7~14
2				了
				2.5
	30%		55%	
3		了		
	99.6%	99.8%		0.2%
		>700L		
			2 3	
		4		但
4				
			CYP3A4	
		2		
5				
				35%
54%				了 1%
			3~18%	
	4			2~4
		1	3	
6				
	亲			

1

12 6

100mg  $C_{max}$

47% 2 37±17 16±5

AUC 伴

2

3

n=7 n=7 n=5 200mg

4 50mg AUC 13ml/min×1.73m<sup>2</sup>

亲 但

T<sub>max</sub> C<sub>max</sub> AUC<sub>0-8h</sub> 位 3

CrCl150~79ml/min CrCl20~49ml/min

n CrCl<20ml/min 伴

42~49 48 AUC

30% 40%

3

亲 5

17

了 1.5 12.5mg/kg/ 2.5mg/kg

2.5mg/kg 了

亲 AUC

伴 C<sub>max</sub>

-β-

-- 但了 0.5%

-- 伴 -- 但

伴

丁  
CLSI  
mg/L 1mg/L  
0.06 mg/L 0.06 mg/L  
EUCAST EUCAST  
EUCAST EUCAST  
EUCAST  
≥ 1  
0.125 mg/L 0.125 mg/L  
EUCAST  
≥ 1 µg/mL 亲

了  
从

ERG11

- ERG11

/

丁

40 80 160 mg/kg 亲 MRHD 1 2 8

80 mg/kg MRHD 9

80 mg/kg 23 20 mg/kg 24  
80 mg/kg MRHD 4

40 80 mg/kg/ MRHD 2 4

40 mg/kg/ 160 mg/kg/

MRHD 4 但 20 mg/kg  
3 但

-β- HP-β-CD

-β- DNA

- -

- -

5000mg/kg/ 亲

了 500mg/kg/ -β- 1.7 -β-

-β- /

但

12 2

亲

-β- HP-β-CD

30 了亲

-β-

Beagle 13 -β- 1200mg/kg 4

在 25 以下保存。

150ml/ 1 /

24

1

JX20070064

H20130425

亲

Janssen-Cilag NV

Antwerpseweg 15-17, B-2340 Beerse, Belgium

Janssen Pharmaceutica NV  
Turnhoutseweg 30, B-2340, Beerse,

19

710304

400 888 9988

029 82576616

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

**\*\*\*END OF DOCUMENT\*\*\***