

核准日期: 2022 年 01 月 30 日
修改日期: 2023 年 06 月 19 日



阿卡波糖片说明书

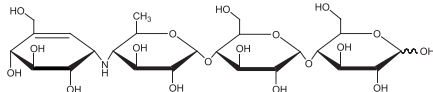
请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

【药品名称】

通用名称: 阿卡波糖片
英文名称: Acarbose Tablets
汉语拼音: Akabotang Pian

【成份】

本品活性成份为阿卡波糖。
化学名称: 0-4,6- 双去氧 -4-[(1S,4R,5S,6S)-4,5,6- 三羟基 -3-(羟甲基) 环己烯 -2-基]氨基]- α -D- 吡喃葡萄糖基 -(1 \rightarrow 4)-O- α -D- 吡喃葡萄糖基 -(1 \rightarrow 4)-D- 吡喃葡萄糖。
化学结构式:



分子式: $C_{23}H_{45}NO_{18}$
分子量: 645.63
辅料: 微晶纤维素、玉米淀粉、胶态二氧化硅、硬脂酸镁。

【性状】

本品为类白色或淡黄色片。

【适应症】

配合饮食控制,用于:
(1) 2 型糖尿病。
(2) 降低糖耐量减低者的餐后血糖。

【规格】

(1) 50mg; (2) 0.1g

【用法用量】

用餐前即刻整片吞服或与前几口食物一起咀嚼服用,剂量需个体化。

一般推荐剂量为:起始剂量为一次 50mg,一日 3 次,以后逐渐增加至一次 100mg,一日 3 次。个别情况下,可增加至每次 200mg,一日 3 次。或遵医嘱。

如果病人在服药 4~8 周后疗效不明显,可以增加剂量。如果病人坚持严格的糖尿病饮食仍有不适时,就不能再增加剂量,有时还须适当减少剂量,平均剂量为一次 100mg,一日 3 次。

【不良反应】

据文献报道

按照 CIOMS III 类别的频率 (截止至 2006 年 2 月 10 日安慰剂对照研究中患者人数: 阿卡波糖 N=8595, 安慰剂 N=7278), 基于临床研

究的药物不良反应如下:

在同一频率分组中,不良反应事件是按照严重程度降低排序。

十分常见 发生率 $\geq 10\%$
常见 发生率 $\geq 1\% < 10\%$
偶见 发生率 $\geq 0.1\% < 1\%$
罕 见 发生率 $\geq 0.01\% < 0.1\%$

未知不良反应仅在上市后监测中确定 (截止至 2005 年 12 月 31 日),且发生率不能评估。

系统器官分类	十分常见	常见	偶见	罕见	未知
血液和淋巴系统异常					血小板减少
免疫系统异常					过敏反应(皮疹、红斑、荨麻疹)
血管异常				水肿	
胃肠道异常	腹泻、 胃胀气	恶心、 呕吐、 和腹部 疼痛	消化不良		不完全肠梗阻、肠梗阻、 肠壁囊样积气
肝胆异常		肝酶升高	黄疸		肝炎
皮肤及皮下组织类疾病					急性全身发性脓疱性皮病

已有肝病、肝功能异常和肝损伤的上市后报告,在日本发现个别患者发生暴发性肝炎而死亡,但是否与阿卡波糖有关尚不明确。

如果不遵守规定的饮食,则胃肠道副作用可能加重。

如果控制饮食后仍有严重的不适症状,应咨询医生并且暂时或长期减小剂量。

在接受阿卡波糖每日 150 至 300mg 治疗的患者中,观察到个别患者发生与临床有关的功能检查异常,但这种异常在阿卡波糖治疗过程中是一过性的 (超过正常上限 3 倍,参考注意事项部分)。

【禁忌】

1. 对阿卡波糖和 / 或非活性成份过敏者禁用。
2. 有明显消化和吸收障碍的慢性胃肠功能紊乱患者禁用,尤其是炎性肠病。
3. 患有由于肠胀气而可能恶化的疾患 (如胃心综合征 (Roemheld)、严重的疝、肠梗阻或有肠梗阻倾向、肠溃疡) 的病人禁用。
4. 严重肾功能损害 (肌酐清除率 $< 25\text{ml/min}$) 的患者禁用。
5. 严重肝病 (严重肝功能不全) 和肝硬化。
6. 糖尿病酮症酸中毒。

【注意事项】

1. 病人应遵医嘱调整剂量,并严格注意饮食。
2. 本品在使用大剂量时会发生无症状的肝酶升高,因此应考虑在用药最初 6~12 个月监测肝酶的变化。如果观察到肝酶升高,尤其是在持续升高的情况下,可能需要减少剂量或停止治疗。国外已有报告致死性的暴发性肝炎,但与阿卡波糖的关系尚不明确。
3. 本品与其他降血糖药物 (如磺脲类药物、二甲双胍或胰岛素)

合用时,增加低血糖可能性,应调整合并用药的剂量。本品可使蔗糖分解为果糖和葡萄糖的速度更加缓慢,因此如果发生急性的低血糖,不宜使用蔗糖,而应该使用葡萄糖纠正低血糖反应。严重低血糖可能需要静脉输注葡萄糖或注射胰高血糖素。

4. 糖尿病患者若在发热、创伤、感染或手术时,可能发生暂时的血糖控制失败,这种情况下暂时的胰岛素治疗可能是必要的。

5. 一项来自于 7 个有关阿卡波糖治疗 2 型糖尿病的安慰剂对照临床试验(共 2180 例患者,1248 例服用阿卡波糖,932 例服用安慰剂)的荟萃分析显示,发生任一心血管事件的风险减少了 24%,发生心肌梗死的风险减少了 64%。这两种变化都有统计学意义。

【孕产妇及哺乳期妇女用药】

1. 因为缺乏有关本品在妊娠妇女中使用的临床研究资料,妊娠期妇女不得使用本品。

2. 哺乳期大鼠服用放射性标记的阿卡波糖后,在其乳汁中发现了少量的放射性活物质,在人类尚无类似的发现。即使如此,由于尚不能排除乳汁中阿卡波糖对婴儿的影响,原则上建议在哺乳期妇女不使用本品。

【儿童用药】

鉴于尚无本品对儿童和青春期少年的疗效和耐受性的足够资料,本品不应用于 18 岁以下的患者。

【老年用药】

对于 65 岁以上老年患者无须改变服药的剂量和次数。

【药物相互作用】

1. 服用阿卡波糖治疗期间,由于结肠内碳水化合物酵解增加,蔗糖或含有蔗糖的食物常会引起腹部不适,甚至导致腹泻。

2. 某些药物可引起血糖升高,如噻嗪类药物或其他利尿剂、糖皮质激素、吩噻嗪、甲状腺制剂、雌激素、口服避孕药、苯妥英、烟酸、拟交感神经药、钙通道阻断剂或异烟肼。如同时使用此类药物,应密切监测血糖。

3. 磺脲类药物或胰岛素可能引起低血糖,阿卡波糖与磺脲类或胰岛素联用可能引起进一步血糖降低,增加低血糖可能性;已有报告低血糖休克个案,应密切观察。如果发生低血糖,应调整合适的剂量。

4. 个别情况下,阿卡波糖可影响地高辛的生物利用度,因此需调整地高辛的剂量。

5. 考来烯胺、肠道吸附剂(如木炭)和含有碳水化合物分解酶的消化酶类制剂(如淀粉酶、胰酶)可能减弱阿卡波糖的药效,应避免同时使用。

6. 同时服用新霉素和本品可能会导致餐后血糖明显降低,并增加胃肠道不良反应的发生频率和严重程度。如果症状非常严重,可考虑暂时减少本品剂量。

7. 未发现与二甲硅油有相互作用。

【药物过量】

当过量的阿卡波糖片与含碳水化合物(多聚糖、低聚糖、二糖)的食物或饮料一起服用时,会发生严重的胃肠胀气和腹泻;如果空腹服用过量阿卡波糖片,一般情况下不会发生胃肠道反应。当服用了过量的阿卡波糖片时,在随后的 4-6 小时内要避免饮用或吃含碳水化合物食物。

【药物毒理】

阿卡波糖是一种生物合成的假性四糖。动物试验结果表明:本品对小肠壁细胞刷状缘的 α -葡萄糖苷酶的活性具有抑制作用,从而延

缓了肠道内多糖、寡糖或双糖的降解,使来自碳水化合物化合物的葡萄糖的降解和吸收入血速度变缓,降低了餐后血糖的升高,使平均血糖值下降。

【药代动力学】

据文献报道,对健康志愿者口服放射性标记的阿卡波糖 0.2g 的药代动力学的研究表明:口服阿卡波糖后,有 1%~2% 的活性抑制剂经肠道吸收,加上被吸收的经消化酶和肠道细菌分解的产物,共占服药剂量的 35%。

设有或未发现阿卡波糖在体内有可测定的代谢现象,相反在肠腔内阿卡波糖被消化酶和肠道细菌分解,其降解产物可于小肠下段被吸收。口服后阿卡波糖及其降解产物迅速完全地自尿中排出,服药剂量的 51% 在 96 小时内经粪便排出。

特殊人群

老年与青年受试者相比,阿卡波糖稳态时血药浓度时间曲线下面积(AUC)和最大浓度(C_{max})均约 1.5 倍,但差异没有统计学意义。

严重肾功能不全(肌酐清除率 < 25ml/min)患者与肾功能正常受试者相比,阿卡波糖的 C_{max} 高 5 倍、AUC 高 6 倍。

【贮藏】 遮光、密封,在 25℃ 以下保存。

【包装】

5mg: 聚氧乙烯/聚乙烯/聚偏二氯乙烯固体药用复合硬片和药用铝箔, 7 片/板 × 1 板/盒; 7 片/板 × 2 板/盒; 7 片/板 × 3 板/盒; 15 片/板 × 1 板/盒; 15 片/板 × 2 板/盒; 15 片/板 × 3 板/盒。

0.1g: 聚氧乙烯/聚乙烯/聚偏二氯乙烯固体药用复合硬片和药用铝箔; 15 片/板 × 1 板/盒; 15 片/板 × 2 板/盒; 15 片/板 × 3 板/盒。

【有效期】

50mg: 24 个月

0.1g: 24 个月

【执行标准】

国家药品监督管理局药品注册标准 YBH17242021

【批准文号】

50mg: 国药准字 H20223062

0.1g: 国药准字 H20237040

【上市许可持有人】

名称: 江苏德源药业股份有限公司
注册地址: 连云港经济技术开发区长江路 29 号

【生产企业】

企业名称: 江苏德源药业股份有限公司
生产地址: 连云港经济技术开发区长江路 29 号
邮政编码: 222047
电话号码: 0518-82342961 82340786
传真号码: 0518-82340788
网址: <http://www.pharmly.com>