

尺寸: 160x230mm

核准日期: 2011年08月15日  
修改日期: 2013年06月03日 2016年09月07日 2020年04月28日 2025年09月09日  
2014年01月23日 2018年10月29日 2023年06月15日

# Iremod 艾得辛® Igaratimod Tablets

# 艾拉莫德片说明书

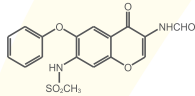
请仔细阅读说明书并在医师或药师指导下使用

### 【药品名称】

通用名称: 艾拉莫德片  
商品名称: 艾得辛®  
英文名称: Igaratimod Tablets  
汉语拼音: Ailamode Pian

### 【成份】

本品活性成份为艾拉莫德。  
化学名称: N-[3-(甲酰胺基)-4-氧-6-苯氧基-4H-1-苯并吡喃-7-基]-1-甲磺酰胺  
化学结构式:



分子式: C<sub>17</sub>H<sub>14</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>S  
分子量: 374.37

【性状】 本品为白色或类白色片。

【适应症】 活动性类风湿关节炎。

【规格】 25mg。

【用法用量】 口服。一次25mg (1片), 饭后服用, 一日2次, 早、晚各1次。

### 【不良反应】

1、在国内的 II、III 期临床试验中, 共有 518 例活动性类风湿关节炎患者使用了本品。II 期临床试验有 192 例活动性类风湿关节炎患者使用了本品。在 II 期临床试验中: 常见药物不良反应(>1/100, <1/10)主要有上腹部不适、氨基转移酶升高、恶心、纳差、皮疹或皮肤瘙痒、头痛、头晕、白细胞下降、耳鸣或听力下降、乏力、腹胀、下肢水肿、心悸、血红蛋白下降、失眠、多汗、呕吐、胸闷、血小板升高、血小板下降、心电图异常、畏寒、嗜睡、精神不佳、双手肿胀、月经失调、牙龈出血、面部水肿。

III 期临床试验有 326 例活动性类风湿关节炎患者使用了本品。在 III 期临床试验中: 很常见药物不良反应(>1/10)主要有氨基转移酶升高;

常见药物不良反应(>1/100, <1/10)主要有白细胞减少、胃部不适、纳差、上腹部不适、恶心、腹胀、胃痛、血小板减少、反酸、腹痛、胃胀、视物模糊、皮肤瘙痒、十二指肠炎、胃炎、大便秘结、脱发、失眠、心电图异常、月经失调、血红蛋白下降;

少见药物不良反应(>1/1000, <1/100)主要有腹泻、消化不良、嗝气、胃胀、反流性食管炎、十二指肠溃疡、胃窦部出血、呕吐、发热、咳嗽、口干、口腔溃疡、面部水肿、皮肤水肿、疲乏、胸闷、胸痛、尿蛋白阳性、总胆红素升高、流感样症状、上呼吸道感染、皮疹样胃炎。以上多数不良反应均在停药后自行缓解或消失。

2、据文献资料报道, 在日本临床试验中的不良反应如下:

本品单独用药时

在日本单独使用本品的临床试验中, 共有 798 例患者使用了本品。主要的不良反应有丙氨酸氨基转移酶 (ALT) 升高 148 例 (18.55%)、谷氨酸氨基转移酶 (AST) 升高 132 例 (16.54%)、γ-GTP 升高 86 例 (15.72%)、547 例中)、ALP 升高 119 例 (14.91%)、NAG 升高 72 例 (9.02%)、尿中 β2 微球蛋白升高 59 例 (7.39%)、总胆红素升高 22 例 (5.71%)、385 例中)、腹痛 44 例 (5.51%)、皮疹 41 例 (5.14%) 等。

与甲氨蝶呤(6~8mg/周)的联合用药时

在日本与甲氨蝶呤(6~8mg/周)的联合用药的临床试验中, 共有 232 例患者使用了本品。主要的不良反应有 AST 升高 27 例 (11.64%)、ALT 升高 27 例 (11.64%)、淋巴细胞减少 21 例 (9.05%)、鼻咽炎 19 例 (8.19%)、血铁降低 19 例 (8.19%)、γ-GTP 升高 16 例 (6.90%)、尿中 β2 微球蛋白升高 13 例 (5.60%) 等。

(1) 重大不良反应

1) 肝功能障碍(0.49%)、黄疸(0.10%): 由于有可能出现伴有 AST、ALT 升高等的肝功能障碍、黄疸, 所以应采取定期检查等措施进行充分观察, 当发现异常时, 应采取中止用药等措施进行妥善处理。

2) 各类血细胞减少症、白细胞减少(均 0.10%): 由于有可能出现各类血细胞减少症、白细胞减少, 所以应采取定期检查等措施进行充分观察, 当发现异常时, 应采取中止用药等措施进行妥善处理。

3) 消化性溃疡(0.68%): 由于有可能出现认为是由环氧化酶抑制作用所导致的消化性溃疡, 所以当出现便血等消化系统症状时, 应中止用药, 并进行妥善处理。

4) 间质性肺炎(0.29%): 由于有可能出现间质性肺炎, 所以当出现发热、咳嗽、呼吸困难等症时, 应立即实施胸部 X 射线检查等, 在中止用药的同时, 采取给予肾上腺皮质激素类药物等措施进行妥善处理。

5) 感染(0.19%): 由于有可能出现败血症、脓胸等感染, 所以应进行充分观察, 当发现异常时, 应中止用药, 并进行妥善处理。

(2) 其它不良反应

当出现以下不良反应时, 应根据症状进行妥善处理。

种类	10~20%	1~10%	0.5~1%	0.5%
肝脏	AST 增加, ALT 增加, ALP 增加, γ-GTP 增加	总胆红素升高	血中胆红素升高	尿中原胆红素升高
血液	—	血红蛋白降低、红细胞压积降低、嗜中性粒细胞增多、淋巴细胞减少、白细胞增多、白细胞减少、红细胞减少	贫血	血小板减少、血小板增多、嗜中性粒细胞增多、嗜中性粒细胞减少、单细胞增多、淋巴细胞形态异常

消化器官	—	腹痛、口腔炎、便秘、血阳性、恶心、腹部不适、腹泻、消化性溃疡	胃炎、消化不良、呕吐、食欲减退、肝炎	便秘、腹部胀满、舌炎、食道炎、上腹部不适、胃肠炎、胃肠功能障碍、牙周炎
肾脏	—	NGA 升高、尿中 β2 微球蛋白升高、血中尿素氮升高、血中 β2 微球蛋白降低、尿中蛋白阳性、尿中红细胞阳性、尿中白细胞阳性、尿管型、尿沉渣阳性	血中肌酐升高	肾盂肾炎、尿频
过敏症状	—	皮疹、痒疹症	湿疹、荨麻疹	红斑、光过敏反应
代谢异常	—	血铁降低、BNP 升高	血中胆碱酯酶降低、总蛋白降低	尿中葡萄糖阳性、血中白蛋白降低、总铁结合能力减弱、不饱和铁结合能力增强
精神神经系统	—	—	眩晕	头痛、失眠、嗜睡、异常感
其他	—	血压升高、鼻咽炎、KL-6 升高	发热、脱毛、味觉异常、上呼吸道感染、浮肿	带状疱疹、倦怠感、耳鸣、咳嗽、痛经、念珠菌病、支气管炎、咽炎、皮肤干燥、心悸、咽喉炎、背痛、肌痉挛、寒战、膀胱炎、真菌病

### 【禁忌】

孕妇或有怀孕可能性的妇女。在动物试验(大鼠)中发现本品具有致畸性, 可导致早期胎儿死亡率升高以及胎儿动脉血管收缩。患有严重肝病者。由于艾拉莫德有可能引起肝功能障碍的不良反应, 所以可能会导致原有肝病进一步恶化。

患有消化性溃疡的患者, 或有消化性溃疡既往史的患者。由于艾拉莫德有可能引起消化性溃疡的不良反应, 所以可能会导致原有消化性溃疡进一步恶化。

对本品所含成份有过敏既往史的患者。

### 【注意事项】

1、慎重用药(对以下患者应慎重用药)

哺乳期妇女: 患有肝病或有肝病既往史的患者; 低体重患者; 伴有贫血、白细胞减少症、血小板减少症的患者; 骨髓功能低下患者; 患有肾病的患者。

2、基本注意事项

(1) 肝毒性: 由于在临床试验中发现氨基转移酶升高的发生率较高, 在服用本品前必须进行肝功能检查。大多数氨基转移酶升高为轻度[≤ 2 倍 正常值上限(Upper Limit of Normal, 简称 ULN)], 且通常在继续治疗过程中缓解; 显著升高(>3 倍 ULN)不常发生, 且通过降低剂量或停药可缓解。大多数患者氨基转移酶升高发生在用药 3 个月内, 服药初始阶段应定期检查血液 ALT 和 AST, 检查间隔视病人情况而定。

有肝脏损害和明确的乙型肝炎或者丙型肝炎血清学指标阳性的患者慎用。用药前及用药后每月检查 ALT, 检查时间间隔视病人具体情况而定。

(2) 如果用药期间出现 ALT 升高, 调整剂量或中断治疗的原则: ①如果 ALT 升高在正常值上限的 2~3 倍, 在密切监测下可继续给予艾拉莫德, 剂量降低至 25mg/日。②ALT 升高 2~3 倍正常值上限, 如果剂量降低后 ALT 仍维持在 2~3 倍正常值上限及 3 倍以上, 须停药, 并加强护肝治疗且密切观察。

(3) 活动性胃肠道疾病: 对于有活动性胃肠道疾病的患者慎用, 告知患者一旦发生黑便、贫血、异常胃/腹痛等症时, 及时通知医生并尽早去医院就诊, 一旦确诊为胃溃疡或十二指肠溃疡, 应立即停药并进行对症治疗。

(4) 在服用本品前必须进行血液、肾功能等检查。在用药过程中应对临床症状进行充分观察, 当发现异常时进行妥善处理。需要说明的是, 当出现红细胞减少、白细胞减少、血小板减少等血液疾病时, 应根据需要中止或暂停本品的使用, 并进行妥善处理。

(5) 由于有可能出现间质性肺炎, 所以在本品用药过程中应注意发热、咳嗽、呼吸困难等症, 当出现异常时进行妥善处理。

(6) 由于在单独使用本品的临床试验中发现低体重(不足 40 kg)患者的不良反应发生率较高, 因此当对低体重患者使用本品时, 应对患者的状态进行充分观察, 当发现异常时进行妥善处理。

(7) 由于尚未明确与甲氨蝶呤以外抗风湿药联合用药时的有效性和安全性, 应需要特别留意联合用药临床观察。

(8) 由于没有在治疗期间接种免疫活疫苗的效果和安全性的临床资料, 因此服药期间不应使用免疫活疫苗。

### 【孕妇及哺乳期妇女用药】

无相关临床试验资料, 基于大鼠动物生殖毒性试验结果提示, 妊娠期妇女、哺乳期妇女以及治疗期间有生育要求的妇女禁用。

### 【儿童用药】

尚未在儿童和青少年对本品的有效性和安全性进行足够的和良好对照的研究, 且无可靠参考文献。儿童和青少年应避免使用本品。

### 【老年用药】

未进行系统的老年患者用药安全性研究, 老年人的生理功能普遍降低, 在用药的过程中应对患者的状态进行观察, 如使用需在医生指导下慎用。

文献报道, 在日本以健康成年男子为对象的临床药理试验中, 老年人的血浆中药物浓度始终略高于非老年人。虽然在本品单独用药的临床试验中有效性和不良反应发生率不存