

核准日期：2011 年 10 月 21 日

阿达帕林凝胶说明书

外

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：阿达帕林凝胶
英文名称：Adapalene Gel
汉语拼音：Adapalin NingJiao

【成份】

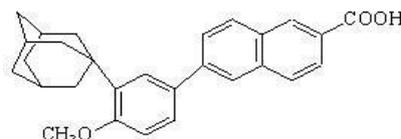
本品主要成份为阿达帕林。

化学名称：6-[3-(1-金刚烷基)-4-甲氧基苯基]-2-萘甲酸。

化学结构式：

分子式： $C_{28}H_{28}O_3$

分子量：412.53



【性状】本品为白色半透明凝胶。

【适应症】本品适用于以粉刺、丘疹和脓疱为主要表现的寻常型痤疮的皮肤治疗。亦可用于治疗面部、胸和背部的痤疮。

【规格】0.1% (30g: 30mg)

【用法用量】本品每天一次，睡前清洁患处并待干燥后使用，涂一薄层于皮肤患处。

对于必须减少用药次数或暂停用药的患者，当证实患者已恢复对阿达帕林的耐受时可恢复用药次数。请勿使用可导致粉刺产生和有收缩性的化妆品。

【不良反应】

本品在最初治疗的 2~4 周里最常见的不良反应为红斑、干燥、鳞屑、瘙痒、灼伤或刺痛，在程度上多为轻、中度。较少发生的不良反应有晒伤、皮肤刺激、皮肤不适的烧灼和刺痛。极少发生的不良反应包括：痤疮红肿、皮炎和接触性皮炎、眼浮肿、结膜炎、红斑、瘙痒、皮肤变色、红疹和湿疹等。如不良反应严重，应减少用药次数或停药。

【禁忌】对阿达帕林或凝胶赋形剂中的任何成份过敏者禁用。

【注意事项】

1、如果产生过敏或严重的刺激反应，应停止用药。确定局部刺激反应程度后，患者可在医生指导下减少用药次数，暂时停用或完全停止用药。

2、使用本品期间，如果暴露在日光下，包括发出紫外线的太阳灯，应将剂量降低到最小用量。对于经常暴露在强日光下和自身对阳光过敏的患者，在户外锻炼时应特别注意。当在阳光下是不可避免时，建议在治疗区域上使用防晒产品和保护服；当气候极端异常时，如有大风或寒冷，对接受本品治疗的患者也可能产生刺激性。

3、避免接触眼、唇、口腔、鼻粘膜、内眦和其它粘膜组织，本品不应用在刀伤、擦伤、湿疹或晒伤的皮肤上，亦不得应用于十分严重的痤疮患者，或患有湿疹样的皮肤创面。当用其它维生素 A 酸类药物或使用“蜡质”脱毛方法时，应避免使用本品进行治疗。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

目前尚无有关产品对孕妇的疗效报告。建议在妊娠时不要使用本品。目前尚不知道本品是否随乳汁分泌。因许多药物随乳汁分泌，建议哺乳期妇女若必须使用本品时多加小心，请勿涂抹于胸部。

【儿童用药】在 12 岁以下儿科患者中，其安全性和有效性尚未确定。

【老年用药】临床试验中，受试者年龄均在 12~30 岁之间，因此尚不明确 65 岁以上老年人与年轻人之间是否不同。

【药物相互作用】

目前尚未发现本品与其他可能同时在皮肤使用的药品间存在相互作用。但不应同时使用其它有相似作用机制的维酸类药物或其它药物。

阿达帕林的化学结构稳定，在空气和日光下不易分解。广泛的动物和人体研究未发现光毒性和光敏性。但反复暴露于日光或紫外线照射时动物和人使用阿达帕林的安全性尚未可知。使用本品时应避免过量日晒和紫外线照射。阿达帕林的透皮吸收很低，因而不可能发生与系统用药的相互作用。没有证据表明避孕药、抗生素等口服药的疗效会受到皮肤使用本品的影响。

本品可能有轻微的局部刺激作用，当与脱皮剂、收缩剂或刺激性物质同时使用时可导致额外的刺激反应。因此，清晨使用其它皮肤用抗痤疮药如红霉素(浓度<4%)、磷酸氯林可霉素(1%)溶液或过氧

化苯甲酰水性凝胶(浓度<10%)，晚上使用本品时，可避免药物相互降解或蓄积刺激作用的产生。

【药物过量】本品仅供在皮肤上，过量应用并不会获得更快或更好的疗效，且可出现显著的发红、脱屑或皮肤不适。

【药理毒理】

药理作用

阿达帕林是一种维甲酸类化合物，在体内与体外炎症模型中被证明具有抗炎特性。阿达帕林的化学结构稳定，在空气和光照下不易分解。作用机理方面，阿达帕林同维甲酸一样与特异的维甲酸核受体结合，与维甲酸不同的是阿达帕林不与和蛋白结合的细胞质受体相结合。

在小鼠建立的动物模型进行的皮肤用药试验中证明，阿达帕林可治疗粉刺，并对作为寻常痤疮病因的表皮异常角化和分化过程也有作用，具有调节细胞分化和增殖的活性。阿达帕林的作用机制被认为是通过使毛囊上皮细胞正常分化而减少微小粉刺形成。

在体内与体外标准抗炎分析中，阿达帕林优于维甲酸，它可抑制人类多核白细胞的化学趋化反应，并可通过抑制花生四烯酸经脂氧化反应转化为炎症介质媒介物来抑制多形核白细胞的代谢，这说明阿达帕林应用于痤疮患处，可缓解由细胞反应介导的炎症反应，人体临床试验研究表明阿达帕林可缓解痤疮的炎症反应（如脓包和丘疹等）。

毒理研究

本品在小鼠和大鼠中口服的LD₅₀大于10ml/kg，该药物长期摄入可能导致一些与过量口服维生素A相关的副作用。小鼠局部剂量为0.3、0.9和2.6mg/kg/day；大鼠口服剂量为0.15、0.5和1.5mg/kg/day，即人的每天最大外用剂量的4~75倍，进行致癌试验研究。口服试验，雌性大鼠卵细胞性腺瘤和甲状腺癌的发生率、雄性大鼠肾上腺髓质良性和恶性嗜铬细胞瘤的发生率呈线性正关系。未进行光致癌性试验，但动物试验显示与阿达帕林作用相似的药物（如维甲酸），暴露于实验室的紫外线或阳光下，增加癌症的发生危险。虽然该结果对人体用药的指导意义尚不明确，但仍建议用药患者尽量减少或避免暴露于阳光或紫外线。动物体内、体外研究表明本品没有致突变或遗传毒性。大鼠口服阿达帕林20mg/kg/天，无生殖毒性。大鼠、兔口服阿达帕林分别达到最大人用推荐总剂量的24、48倍时出现了致畸作用。

【药代动力学】阿达帕林的透皮吸收率很低。临床试验中，对大面积粉刺患处的皮肤长期用药，分析敏感率为0.15ng/ml时，血浆中阿达帕林浓度水平低至无法测出。

分别给大鼠（静注、腹腔注射、口服和皮肤用药）、兔子（静注、口服和皮肤用药）使用¹⁴C标记的阿达帕林，在许多组织有放射活性分布，肝、脾、肾上腺和卵巢水平最高。阿达帕林在动物体内主要是通过氧一脱甲基、羟基化和结合反应而代谢。主要通过胆汁排泄。

【贮藏】遮光，密封，在干燥处保存。

【包装】铝管装，10克/支/盒、15克/支/盒、20克/支/盒、30克/支/盒。

【有效期】24个月

【执行标准】YBH03822011

【批准文号】国药准字H20113373

【生产企业】

企业名称：江苏福邦药业有限公司

生产地址：江苏省连云港市灌南县新安镇人民东路3号

邮政编码：222500

电话：0518-83228917

传真号码：0518-83231017

网址：www.fbpharm.com