核准日期： 2006 年 10 月 25 日
修改日期： 2010 年 10 月 1 日 2013 年 10 月 16 日 2015 年 6 月 8 日 2015 年 11 月 30 日 2019 年 12 月 1 日 2020 年 12 月 30 日 2024 年 9 月 10 日 2024 年 10 月 29 日 2025 年 7 月 18 日 2025 年 10 月 1 日 2026 年 1 月 26 日

注册商标

阿奇霉素胶囊说明书

注册商标

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：阿奇霉素胶囊

英文名称：Azithromycin Capsules

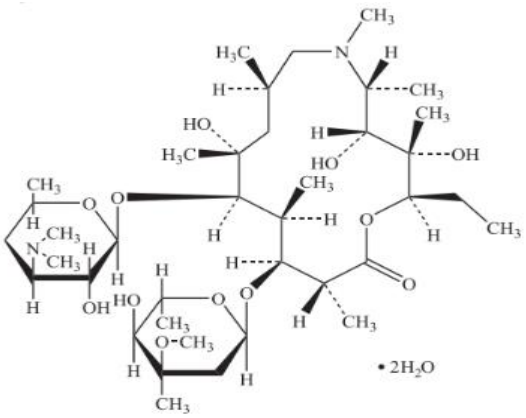
汉语拼音：Aqimeisu Jiaonang

【成份】

本品的活性成份为阿奇霉素。

化学名称：（2*R*,3*S*,4*R*,5*R*,8*R*,10*R*,11*R*,12*S*,13*S*,14*R*）-13-［（2,6-二脱氧-3-*C*-甲基-3-*O*-甲基-*α*-L-核-己吡喃糖基）氧］-2-乙基-3,4,10-三羟基-3,5,6,8,10,12,14-七甲基-11-[[3,4,6-三脱氧-3-（二甲氨基）-*β*-D-木-己吡喃糖基]氧]-1-氧杂-6-氮杂环十五烷-15-酮二水合物

化学结构式：



分子式：$C_{38}H_{72}N_2O_{12}\cdot 2H_2O$

分子量：785.03

辅料：微晶纤维素、十二烷基硫酸钠、硬脂酸镁和明胶空心胶囊

【性状】

本品内容物为白色至微黄色结晶性粉末和、或块状物。

【适应症】

阿奇霉素是一种大环内酯类抗菌药物，适用于治疗由指定微生物敏感菌株在下列具体病症中引起的轻度至中度感染。

- 流感嗜血杆菌、卡他莫拉菌或肺炎链球菌引起的慢性支气管炎细菌感染急性发作。

- 肺炎衣原体、流感嗜血杆菌、肺炎支原体或肺炎链球菌引起的社区获得性肺炎。
- 流感嗜血杆菌、卡他莫拉菌或肺炎链球菌引起的急性中耳炎。
- 流感嗜血杆菌、卡他莫拉菌或肺炎链球菌引起的急性细菌性鼻窦炎。
- 化脓性链球菌引起的咽炎/扁桃腺炎。
- 金黄色葡萄球菌、化脓性链球菌或无乳链球菌引起的单纯性皮肤和皮肤结构感染。
- 沙眼衣原体或淋病奈瑟氏球菌引起的尿道炎和子宫颈炎。
- 杜克雷嗜血杆菌引起的男性生殖器溃疡病（软下疳）。由于临床试验招募的女性人数太少，因此尚未确定阿奇霉素治疗女性软下疳的疗效。

使用限制

阿奇霉素不得用于因中度至重度疾病或风险因素而被认为不适宜口服治疗的肺炎患者，例如：

- 囊肿性纤维化患者，
- 医院获得性感染患者，
- 确诊或疑似菌血症患者，
- 需要住院的患者，
- 老年或体弱患者，或者
- 患重大基础疾病以致机体对疾病的反应能力受损（包括免疫缺陷或功能性无脾）的患者。

【规格】

0.25g（按 $C_{38}H_{72}N_2O_{12}$ 计）

【用法用量】

成人患者

阿奇霉素应每日口服给药一次，整粒吞服，应在饭前至少一小时或饭后至少两小时服用。以阿奇霉素胶囊治疗各种感染性疾病，其疗程及使用方法如下：

对沙眼衣原体、杜克嗜血杆菌或敏感淋球菌所致的性传播疾病，仅需单次口服本品 1000mg。

对其他感染的治疗：总剂量 1500mg，每日一次服用本品 500mg 共三天。或总剂量相同，首日服用 500mg，第二至第五日每日一次口服本品 250mg。

肾功能不全患者

轻、中度肾功能不全者（肾小球滤过率为 10～80mL/min）不需要调整剂量。严重肾功

能不全者慎用（肾小球滤过率<10mL/min）（参见**【注意事项】**和**【药代动力学】**）。

肝功能不全患者

轻中度肝功能不全患者，本品的用法与用量同肝功能正常者（参见**【注意事项】**和**【药代动力学】**）。

为减少耐药菌的产生以及维持阿奇霉素和其他抗菌药物的效果，阿奇霉素应只用于治疗经确诊或高度怀疑由敏感菌引起的感染。在选择或调整抗菌疗法时应考虑已获得的培养和药敏信息。如果缺少这些数据，本地流行病学和敏感性现状可能对经验性选择疗法有帮助。

【不良反应】

以下具有临床意义的不良反应描述参见说明书的其他部分：

- 过敏反应（参见**【注意事项】**）。
- 肝毒性（参见**【注意事项】**）。
- 婴儿肥厚性幽门狭窄 (IHPS)（参见**【注意事项】**）。
- QT 间期延长（参见**【注意事项】**）。
- 心源性死亡（参见**【注意事项】**）。
- 难辨梭菌相关性腹泻 (CDAD)（参见**【注意事项】**）。
- 重症肌无力恶化（参见**【注意事项】**）。

（一）临床试验经验

由于临床试验在不同的条件下完成，在临床试验中观察到的一种药物的不良反应率不能直接和其他药物在临床试验中的不良反应率相比较，且未必反映在实际应用中的不良反应率。

在临床试验中，所报道的不良反应多数为轻至中度，且停药后可恢复。已有血管性水肿和胆汁淤积性黄疸这两种潜在严重不良反应的报告。在为期 5 天的多剂量临床试验中，约有 0.7%的患者（成年和儿童患者）因治疗相关不良反应而中止阿奇霉素治疗。在接受 3 天的 500 mg/天剂量治疗的成人中，因治疗相关不良反应而停药的比率为 0.6%。在临床试验中，儿童患者服用 30 mg/kg 本品（单剂量或 3 天内分次服用），因治疗相关不良反应而停止试验的比率约为 1%。导致停药的不良反应大多与胃肠道有关，例如恶心、呕吐、腹泻或腹痛。

成人：

多剂量方案：总体来说，在接受阿奇霉素多剂量方案的成人患者中，最常见的治疗相关不良反应大多与胃肠系统有关，其中最常报告的有腹泻/稀便（4～5%）、恶心（3%）以及腹痛（2～3%）。

在接受阿奇霉素多剂量方案的患者中，没有出现其他发生率高于 1%的治疗相关不良反

应。发生率不高于 1%的不良反应包括：

心血管：心悸、胸痛；

胃肠道：消化不良、肠胃胀气、呕吐、黑便及胆汁淤积性黄疸；

泌尿生殖系统：念珠菌病、阴道炎及肾炎；

神经系统：头晕、头痛、眩晕及嗜睡；

全身性：疲劳；

过敏：皮疹、瘙痒、光敏反应及血管性水肿。

1 克单剂量方案：总体来说，在接受阿奇霉素 1 克单剂量方案的患者中，最常见的不良反应大多与胃肠系统有关，而且比在接受多剂量方案的患者中发生率更高。

在接受阿奇霉素 1 克单剂量方案的患者中，发生率不低于 1%的不良反应包括腹泻/稀便（7%）、恶心（5%）、腹痛（5%）、呕吐（2%）、消化不良（1%）及阴道炎（1%）。

2 克单剂量方案：总体来说，在接受阿奇霉素 2 克单剂量方案的患者中，最常见的不良反应大多与胃肠系统有关。在本研究的患者中，发生率不低于 1%的不良反应包括恶心（18%）、腹泻/稀便（14%）、呕吐（7%）、腹痛（7%）、阴道炎（2%）、消化不良（1%）及头晕（1%）。这些主诉中大多数症状轻微。

儿童患者：

单剂量和多剂量方案：与成人相比，虽然儿童患者出现的不良反应类型相似，但采用建议的剂量方案时，儿童患者的不良反应发生率有所不同。

急性中耳炎：采用建议的 30 mg/kg 总剂量方案时，治疗引起的最常见不良反应（≥1%）有腹泻、腹痛、呕吐、恶心及皮疹。

各剂量方案下发生率如下表所示：

剂量方案	腹泻	腹痛	呕吐	恶心	皮疹
1 天	4.3%	1.4%	4.9%	1.0%	1.0%
3 天	2.6%	1.7%	2.3%	0.4%	0.6%
5 天	1.8%	1.2%	1.1%	0.5%	0.4%

社区获得性肺炎：采用在第 1 天服用 10mg/kg 并在第 2～5 天服用 5mg/kg 的建议剂量方案时，治疗引起的最常见不良反应有腹泻/稀便、腹痛、呕吐、恶心及皮疹。

发生率如下表所示：

剂量方案	腹泻/稀便	腹痛	呕吐	恶心	皮疹

5 天	5.8%	1.9%	1.9%	1.9%	1.6%

咽炎/扁桃腺炎：采用在第 1～5 天服用 12mg/kg 的建议剂量方案时，治疗引起的最常见不良反应有腹泻、呕吐、腹痛、恶心及头痛。

发生率如下表所示：

剂量方案	腹泻	腹痛	呕吐	恶心	皮疹	头痛
5 天	5.4%	3.4%	5.6%	1.8%	0.7%	1.1%

采用任何治疗方案时，接受阿奇霉素治疗的儿童患者都没有出现发生率高于 1%的其他治疗相关不良反应。发生率不高于 1%的不良反应包括：

心血管：胸痛；

胃肠道：消化不良、便秘、厌食、肠炎、肠胃胀气、胃炎、黄疸、稀便及口腔念珠菌病；

血液和淋巴系统：贫血和白细胞减少；

神经系统：头痛（中耳炎剂量）、运动机能亢进、头晕、激越、紧张及失眠；

全身性：发烧、面部水肿、疲劳、真菌感染、不适及疼痛；

过敏：皮疹及过敏反应；

呼吸系统：咳嗽、咽炎、胸腔积液及鼻炎；

皮肤及其附属器：湿疹、真菌性皮炎、瘙痒、出汗、荨麻疹及水疱性皮疹；

特殊感觉：结膜炎。

（二）上市后应用的经验

阿奇霉素制剂上市后应用于成人和/或儿童患者，有以下不良事件的报道，但这些与阿奇霉素的偶发关系并不能被确立。

变态反应：关节痛、水肿、荨麻疹及血管神经性水肿。

心血管：心律失常（包括室性心动过速、低血压）。也有 QT 间期延长、尖端扭转型室性心动过速和心源性死亡的报道。

胃肠道：厌食、便秘、消化不良、肠胃胀气、呕吐/腹泻、伪膜性肠炎、胰腺炎、口腔念珠菌病、幽门狭窄以及舌变色。

全身反应：乏力、感觉异常、疲劳、不适和过敏性休克反应。

泌尿生殖系统：间质性肾炎、急性肾功能衰竭、阴道炎。

造血系统：血小板减少。

肝/胆：肝功能异常、肝炎、胆汁淤积性黄疸、肝坏死和肝衰竭。

神经系统：惊厥、头晕/眩晕、头痛、嗜睡、多动、神经质、激越及晕厥。

精神：攻击性反应和焦虑。

皮肤及其附属器：瘙痒、严重皮肤反应包括多形性红斑、急性泛发性发疹性脓疱病（AGEP）、Stevens-Johnson 综合征、中毒性表皮坏死松解症和伴嗜酸性粒细胞增多和全身症状的药物反应（DRESS）。

特殊感觉：听力障碍（包括听力丧失、耳聋和/或耳鸣），也有味觉/嗅觉异常和/或丧失的报道。

实验室检查异常：

成人：

据报告，在临床试验期间出现的有临床意义的异常状况（不论是否与药物相关）如下：发生率高于 1%：血红蛋白减少、血细胞压积下降、淋巴细胞减少、嗜中性粒细胞减少、血糖下降、血清肌酸磷酸激酶升高、钾升高、谷丙转氨酶升高、谷氨酰转肽酶升高、谷草转氨酶升高、尿素氮升高、肌酐升高、血糖升高、血小板计数增多、淋巴细胞增多、嗜中性粒细胞增多和嗜酸性粒细胞增多；发生率低于 1%：白细胞减少症、嗜中性粒细胞减少症、钠下降、钾下降、血小板计数下降、单核细胞增多、嗜碱性粒细胞增多、碳酸氢盐升高、血清碱性磷酸酶升高、胆红素升高、乳酸脱氢酶升高及磷酸盐升高。大部分血清肌酐升高的受试者在基线时该值也为异常。

随访发现上述实验室检查异常显示为可逆的。

在 5000 多例患者参加的阿奇霉素多剂给药临床试验中，4 名患者因治疗相关性肝酶异常而中止治疗，1 名患者因肾功能异常而中止治疗。

儿童患者：

一天、三天和五天方案

在采用两种 3 天方案（30 mg/kg 或 60 mg/kg，分 3 天给药）或两种 5 天方案（30 mg/kg 或 60 mg/kg，分 5 天给药）的对照临床试验中采集了实验室检查数据。结果发现，阿奇霉素方案的数据与所有对照组的合并数据类似，大部分有临床意义的实验室检查异常的发生率为 1～5%。在一项单中心试验中采集了单剂量服用 30 mg/kg 本品后患者的实验室检查数据。该试验观察到，就嗜中性粒细胞绝对计数在 500～1500 个/mm^3 之间的患者而言，单剂量服用 30 mg/kg 本品的患者中有 10 名（10/64），在分 3 天服用 30 mg/kg 本品的患者中有 9 名（9/62），而在对照组患者中有 8 名（8/63）。没有任何患者的嗜中性粒细胞绝对计数低于 500 个/mm^3。

在涉及大约 4700 名儿童患者的多剂量临床试验中，没有任何患者因治疗相关的实验室检查异常而中止治疗。

【禁忌】

已知对阿奇霉素、红霉素、其他大环内酯类或酮内酯类药物过敏的患者禁用。

以前使用阿奇霉素后有胆汁淤积性黄疸/肝功能不全病史的患者禁用。

【注意事项】

1、过敏反应

已有采用阿奇霉素治疗引起严重过敏反应的报道，包括血管神经性水肿、过敏性休克反应和皮肤反应（包括急性泛发性发疹性脓疱病（AGEP）、Stevens-Johnson 综合征和中毒性表皮坏死松解症）。

曾有死亡的报道。也有伴嗜酸性粒细胞增多和全身症状的药物反应（DRESS）病例的报告。某些患者出现过敏症状时，起初给予对症治疗有效，若过早停止治疗，即使未再用阿奇霉素，过敏症状仍可迅速复发。对这类患者需延长对症治疗和观察的时间。目前尚不知这些事件的发生是否与阿奇霉素在组织中的半衰期长因而机体暴露于抗原的时间较长有关。

如发生过敏反应，应立即停药并给予适当的治疗。医生应知道，停止对症治疗后，过敏症状可能再次出现。

2、肝毒性

曾有肝功能异常、肝炎、胆汁淤积性黄疸、肝坏死以及肝衰竭的报道，其中某些病例可能致死。如果出现肝炎症状和体征，应立即停止使用本品。

3、婴儿肥厚性幽门狭窄（IHPS）

在新生儿中使用阿奇霉素之后（出生后 42 天内的治疗），有发生婴儿肥厚性幽门狭窄（IHPS）的报告。指导家长和看护者，如果婴儿有伴随哺乳的呕吐和应激反应发生，需要联系医生。

4、难辨梭菌相关性腹泻（CDAD）

几乎所有抗菌药物（包括本品）的应用都有难辨梭菌相关性腹泻（CDAD）的报告，其严重程度可表现为轻度腹泻至致死性结肠炎。抗菌药物治疗可引起结肠内正常菌群的改变，导致难辨梭菌的过度繁殖。

难辨梭菌产生的毒素 A 和毒素 B 与 CDAD 的发病有关。高产毒的难辨梭菌导致发病率和死亡率升高，这些感染可能难以用抗菌药物治疗，可能需要结肠切除术。对于所有使用抗生素后出现腹泻的患者，必须考虑到 CDAD 的可能。由于曾经有给予抗菌药物治疗超过 2

个月后发生 CDAD 的报道，因此需仔细询问病史。

如果怀疑或确诊 CDAD，可能需要停用正在使用的并非针对难辨梭菌的抗生素。必须根据临床需要适当调节水和电解质、补充蛋白质，并给予对难辨梭菌有效的抗生素，必要时进行手术评估。

5、QT 间期延长

有报道，应用大环内酯类抗生素（包括阿奇霉素）可引起心室复极化和 QT 间期延长，从而有发生心律失常和尖端扭转型室性心动过速的风险。在对使用阿奇霉素患者的上市后监测中，有尖端扭转型室性心动过速病例的自发性报告。在权衡高危人群使用阿奇霉素的风险和获益时，医疗卫生保健人员应考虑可能致命的 QT 间期延长的风险，高危人群包括：

- 已知有 QT 间期延长、尖端扭转型室性心动过速病史、先天性 QT 间期延长综合征、缓慢性心律失常或失代偿性心力衰竭的患者。
- 服用已知可延长 QT 间期药物的患者，如抗精神病药物、抗抑郁药物和氟喹诺酮类药物治疗的患者。
- 处于致心律失常状态的患者，如未纠正的低钾血症或低镁血症、有临床意义的心动过缓，以及正在接受 IA 型（奎尼丁、普鲁卡因胺）和III型（多非利特、胺碘达隆、索他洛尔）抗心律失常药物的患者。
- 老年患者：老年患者可能对药物相关的 QT 间期影响更为敏感。

6、心源性死亡

一些观察性研究显示，相比其他抗菌药物（包括阿莫西林），在暴露于阿奇霉素的成人中，发生急性心源性死亡的短期潜在风险增加了约两倍。在这些研究中观察到的五天心血管死亡率范围为每一百万个阿奇霉素疗程 20 至 400 例。注意到该潜在风险在第一个阿奇霉素五天用药期内较高，并且似乎不局限于既存心血管疾病的患者。这些观察性研究中的数据不足以确立或排除急性心源性死亡与阿奇霉素用药之间的因果关系。开具本品处方时，应考虑将该潜在风险与治疗获益相平衡。

7、重症肌无力恶化

接受阿奇霉素治疗的患者曾报告过重症肌无力病情恶化和新发肌无力综合征的病例。

8、用于性传播感染

不可依赖建议剂量的阿奇霉素治疗梅毒。使用抗菌剂治疗非淋病性尿道炎可能会掩盖或延迟潜伏梅毒的症状。对于所有性传播性尿道炎或子宫颈炎患者，在诊断时应进行梅毒血清检测及适当的淋病检测。如果确诊感染，则应针对这些疾病开始适当的抗菌治疗和随访检查。

9、耐药菌的产生

在未确诊或并非高度怀疑细菌感染，或无预防指征的情况下，使用本品可能对患者无益，还会增加耐药菌产生的风险。

10、由于阿奇霉素主要经肝脏清除，故严重肝功能损害的患者应慎用阿奇霉素。GFR <10 mL/min 的受试者的资料有限，这类患者也应慎用阿奇霉素。

患者需知：

由于食物可减少阿奇霉素胶囊的吸收，因此病人应在饭前至少一小时或饭后至少两小时服用。

还应提醒患者阿奇霉素不得与含铝和镁的抗酸剂同服。

出现任何过敏反应征象时，应立即停用阿奇霉素，并与医生联系。

患者应被告知抗菌药物包括本品（阿奇霉素）只能用于治疗细菌感染，不能用于治疗病毒感染（例如普通感冒）。使用本品（阿奇霉素）治疗细菌感染时，必须告知患者虽然通常治疗初期会感觉好转，仍应当按照医师指导精确服药。漏服或未完成整个疗程可能会：（1）降低当前治疗的疗效；（2）增加细菌耐药的可能性，将导致将来阿奇霉素或其他抗菌药物无法治疗这些耐药菌。

抗生素治疗常常可引起腹泻，停用抗生素后通常可恢复。有时给予抗生素治疗后，患者甚至在最后 1 次用抗生素后 2 个月或更久后出现水样便或血性便（伴或不伴胃痉挛和发热）。如果出现这种情况，患者应尽快与医生联系。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

妊娠

风险概要

根据发表文献中的现有数据以及数十年来孕妇使用阿奇霉素的上市后经验，均未发现任何与药物相关的胎儿主要出生缺陷、流产或不良孕妇或胎儿结果的风险。在大鼠、小鼠和兔中进行的阿奇霉素发育毒性研究表明，剂量分别达到成人每日剂量 500 mg 的 4 倍、2 倍和 2 倍（按体表面积计算）时，也未出现任何药物诱导的胎仔畸形。从妊娠第 6 天至离乳，按相当于成人每日剂量 500 mg 的 4 倍（按体表面积计算）的剂量给予妊娠大鼠阿奇霉素后，在子代中观察到存活率降低和发育延迟。

适用人群发生主要出生缺陷和流产的估计背景风险尚不明确。所有妊娠均有发生出生缺陷、流产或其他不良结果的背景风险。

数据

人体数据

从数十年来已发表的观察性研究、病例系列和病例报告中获得的现有数据并未提示孕妇使用阿奇霉素会使胎儿主要出生缺陷、流产或不良孕妇或胎儿结果的风险增加。这些数据的局限性包括缺少随机化和无法控制混淆因素（如母体基础疾病和母体使用伴随用药）。

动物数据

参见【药理毒理】。

哺乳

风险概要

阿奇霉素会进入人乳汁中。有报告称，母亲使用阿奇霉素后，母乳喂养的婴儿出现了非严重不良反应。尚无阿奇霉素对乳汁生成的影响的现有数据。应综合考虑母乳喂养对婴儿发育和健康的益处、母亲对阿奇霉素的临床需求，以及阿奇霉素或母体基础病症对母乳喂养婴儿的任何潜在不良影响。

临床注意事项

建议女性监测母乳喂养的婴儿是否出现腹泻、呕吐或皮疹。

数据

20 名女性在分娩期间单次口服了 2 g 阿奇霉素，之后测量了乳汁中的阿奇霉素浓度。于产后第 3 天和第 6 天以及产后第 2 周和第 4 周采集乳汁样本进行检测，结果显示一直到给药后第 4 周乳汁中仍存在阿奇霉素。在另一项研究中，8 名女性在接受剖宫产手术前经静脉接受了 500 mg 单剂量的阿奇霉素。在给药后 12 至 48 小时期间采集一系列乳汁（初乳）样本进行检测，结果显示一直到给药后 48 小时乳汁中仍存在阿奇霉素。

【儿童用药】

参见【药代动力学】及【用法用量】。

尚未确定本品在治疗年龄不足 6 个月的急性中耳炎、急性细菌性鼻窦炎和社区获得性肺炎儿童患者时的安全性和有效性。根据在成人中开展的充分且良好对照的试验，阿奇霉素可用于治疗儿童患者（年满 6 个月）的急性细菌性鼻窦炎及社区获得性肺炎。

咽炎/扁桃腺炎：尚未确定本品在治疗未满 2 岁的咽炎/扁桃腺炎儿童患者时的安全性和有效性。

阿奇霉素胶囊仅适用于体重大于 45kg 的儿童，用法与用量同成人。

【老年用药】

在口服阿奇霉素的多剂量临床试验中，9% 的患者（458/4949）年满 65 岁，3%的患者

（144/4949）年满 75 岁。据观察，这些受试者和年轻受试者之间在安全性或有效性方面总体上无差异；在报告的其他临床经验中也未发现老年和年轻患者之间在机体反应方面存在差异，但不排除部分老年患者具有更高的敏感性。

与年轻患者相比，老年患者可能更容易发生尖端扭转型心律失常。（参见【注意事项】）

【药物相互作用】

奈非那韦：

稳态时，联合使用单剂阿奇霉素口服，可使阿奇霉素血清浓度升高。虽然与奈非那韦合用时无需调整阿奇霉素的剂量，但必须密切监测阿奇霉素已知的不良反应如肝酶异常和听力损害。

华法林：

在一项针对 22 名健康男性的研究中，为期 5 天的阿奇霉素治疗随后服用华法林并没有影响凝血酶原时间，尽管如此，自发性上市后报告提示合并使用阿奇霉素可能增强口服抗凝药的作用。患者合并使用阿奇霉素和口服抗凝药物时，应严密监测凝血酶原时间。

其他：

已针对阿奇霉素及其可能会合用的其他药物之间的相互作用开展了相关研究。按治疗剂量使用时，阿奇霉素对阿托伐他汀、卡马西平、西替利嗪、去羟肌苷、依非韦仑、氟康唑、茚地那韦、咪达唑仑、利福布丁、西地那非、茶碱（静脉和口服给药）、三唑仑、甲氧苄啶/磺胺甲基异噁唑或齐多夫定的药代动力学的影响不大。合用时，依非韦仑或氟康唑对阿奇霉素的药代动力学影响不大。阿奇霉素与上述任何药物合用时，无需调整任一药物的剂量。

临床试验中尚未报道过阿奇霉素与以下药物有相互作用。然而迄今未进行专门的研究评价阿奇霉素与这些药物之间潜在的相互作用。但应用其他大环内酯类药物时曾出现这些情况。因此，在尚无新的研究数据时，阿奇霉素与以下药物合用时宜对患者进行严密观察：

地高辛和秋水仙碱：地高辛和秋水仙碱的血药浓度升高。

麦角胺或双氢麦角胺：急性麦角中毒，表现为严重外周血管痉挛和感觉迟钝。

特非那定、环孢霉素、海索比妥和苯妥英血药浓度升高。

对实验室检查的影响：未见对实验室检查结果有影响的报道。

【药物过量】

药物过量时发生的不良反应与推荐剂量的相似，尤其是恶心、腹泻和呕吐。如果药物过量，应视需要采取一般对症措施和支持措施。

【药理毒理】

药理作用

阿奇霉素为氮杂内酯类抗生素，其作用机理是通过与敏感微生物的 50s 核糖体的亚单位结合，从而干扰其蛋白质的合成（不影响核酸的合成）。

体外试验和临床研究均表明，阿奇霉素对以下多种致病菌有效：

革兰阳性需氧微生物：金黄色葡萄球菌、酿脓链球菌、肺炎链球菌、溶血性链球菌。

阿奇霉素对于耐红霉素的革兰阳性菌有交叉耐药性。大多数粪链球菌（肠球菌）以及耐甲氧西林的葡萄球菌对阿奇霉素耐药。

革兰阴性需氧微生物：流感嗜血杆菌、卡他摩拉菌。

其它微生物：沙眼衣原体。

体外试验和临床研究已证实，阿奇霉素可预防和治疗鸟胞内分支杆菌复合体（由鸟胞内分支杆菌和胞内分支杆菌组成）引起的疾病。

细菌产生的β-内酰胺酶不影响阿奇霉素的活性。

对以下微生物已有体外研究结果，但是其临床意义尚不清楚，包括链球菌属（C、F、G）草绿色链球菌、百日咳杆菌、空肠弯曲杆菌、杜克嗜血杆菌、嗜肺性军团菌、双路普雷沃氏菌、产气荚膜梭菌、消化链球菌属、包柔螺旋体、肺炎支原体、梅毒螺旋体、解脲支原体等。

毒理研究

遗传毒性：人淋巴细胞试验、小鼠骨髓微核试验和小鼠体外淋巴瘤细胞试验的结果表明阿奇霉素未表现出致突变作用。

生殖毒性：

大鼠和小鼠的生殖毒性试验均表明，当阿奇霉素（经口给药）剂量达产生中等程度的母体毒性的剂量水平（即 200mg/kg/日，按体表面积计算，均为人用药剂量 500mg/kg/日的 2-4 倍）时，未发现致畸胎作用。

尚未发现对生育力和胎儿的损害。目前尚无在妊娠妇女中进行充分的和严格对照的临床试验。由于动物生殖研究的结果并不总是能预测人的情况，因此，只有在确实必要时，孕妇才能使用本品。尚不知本品是否在人乳汁中分泌，由于许多药物经人乳汁分泌，因此哺乳期的妇女在使用时应注意。

致癌性：尚无有关本品动物长期用药的致癌性研究资料。

【药代动力学】

36 例禁食健康男性志愿者口服单剂量 500 mg（两片 250 mg 片剂）后，平均（标准差）

药代动力学参数为：AUC_{0-72}=4.3（1.2）μg·hr /mL；C_{max}=0.5（0.2）μg/mL；T_{max}=2.2（0.9）小时。两片阿奇霉素 250 mg 药片与一片 500 mg 药片之间具有生物等效性。

在一项双向交叉研究中，12 例健康的成人志愿者（6 例男性，6 例女性）每天单剂量服用 1500mg 阿奇霉素 5 天（第 1 天两片 250mg 药片，第 2~5 天每天一片 250mg 药片）或 3 天（第 1~3 天每天 500mg）。由于第 2 天（3 天方案）和第 2~4 天（5 天方案）的血清样本有限，各个受试者的血清浓度-时间曲线被拟合至一个 3 室模型，5 天方案和 3 天方案的拟合浓度曲线的 $AUC_{0-\infty}$相当。

	3 天方案		**5 天方案**	
药代动力学参数[平均值（标准差）]	**第 1 天**	**第 3 天**	**第 1 天**	**第 5 天**
C_{max}（血清，μg/mL）	0.44（0.22）	0.54（0.25）	0.43（0.20）	0.24（0.06）
血清 $AUC_{0-\infty}$（μg·hr/mL）	17.4（6.2）*		14.9（3.1）*	
血清 $T_{1/2}$	71.8 hr		68.9 hr	

*整个3天方案和5天方案的总AUC

吸收

阿奇霉素 250mg 胶囊的绝对生物利用度为 38%。在一项双向交叉研究中，12 例健康受试者服用单剂量 500 mg 阿奇霉素（两片 250 mg 药片），与或不与高脂肪食物同服。结果表明，食物可使 C_{max} 增加 23%，但对 AUC 无影响。

在 28 例健康成年男性受试者中，阿奇霉素口服混悬剂与食物同服时，C_{max} 增加 56%，而 AUC 不变。

分布

在大致相当于人体暴露量的浓度范围内，阿奇霉素的血清蛋白结合率随血药浓度变化而变化，血药浓度为 0.02 μg/mL 时的蛋白结合率为 51%，血药浓度升高到 2μg/mL 时，蛋白结合率降低到 7%。

阿奇霉素的抗菌活性与 pH 值有关，随 pH 降低而降低。然而，药物在组织中的广泛分布可能与其临床活性有关。

研究表明，阿奇霉素可渗透到人体组织中，包括皮肤、肺、扁桃腺和子宫颈。此外，还通过检测其他组织和体液（骨骼、精液、前列腺、卵巢、子宫、输卵管、胃、肝脏及胆囊）证实组织分布的广泛性。由于未从阿奇霉素治疗这些身体部位感染的充分和良好对照研究中获得相关数据，因此这些组织浓度数据的临床意义尚不清楚。

在非炎症性脑膜炎患者中，第一天给予 500 mg 后连续 4 天每天给予 250 mg 时，在脑脊液中检测到非常低的浓度（低于 0.01μg/mL）。

代谢

目前尚未开展评价阿奇霉素代谢的体外和体内研究。

消除

单剂 500 mg 口服和静脉给药后，阿奇霉素的血浆浓度以多相模式降低，平均表观血浆清除率为 630 mL/min，终末消除半衰期为 68 小时。一般认为终末半衰期延长是由于组织广泛摄取继之释放药物。经胆汁排泄是阿奇霉素的主要清除途径，且基本上以原型排出。在一周时间内，大约 6%的用药量以原形出现在尿液中。

特殊人群的药代动力学

肾损害患者

在 42 例有不同程度肾损害的成人（21 - 85 岁）中，对阿奇霉素的药代动力学进行了研究。口服单剂阿奇霉素 1.0 g（4 × 250 mg 胶囊）后，与肾功能正常（GFR > 80 mL/min）的受试者相比，轻度至中度肾损害（GFR 10-80 mL/min）受试者的平均 C_{max} 和 AUC_{0-120} 分别升高 5.1%和 4.2%。与肾功能正常（GFR > 80 mL/min）的受试者相比，重度肾损伤（GFR<10 mL/min）的患者中平均 C_{max} 和 AUC_{0-120} 分别升高 61%和 35%。

肝损伤患者

轻度（A 级）和中度（B 级）肝功能不全患者，其血浆药代动力学与肝功能正常者无明显区别，但这些患者尿中阿奇霉素回收率明显增加，这可能与代偿有关。

男性和女性患者

阿奇霉素在男性和女性受试者的体内过程无显著性差异。建议无需根据性别调整剂量。

老年患者

采用 5 天治疗方案时，老年志愿者（65~85 岁）的药代动力学参数与年轻成人（18~40 岁）相似。肝肾功能正常的老年患者采用该给药方案治疗时无需调整剂量。参见【老年用药】。

儿童患者

在两项临床研究中，以两组儿童患者（分别为1~5岁和5~15岁）为对象，在第1天给予10 mg/kg阿奇霉素口服混悬剂，然后在第2至第5天给予5 mg/kg。1~5 岁组的第5天平均药代动力学参数为C_{max}=0.216 μg/mL、T_{max}=1.9小时，以及AUC_{0-24}=1.822 μg·hr/mL；5~15岁组的第5天平均药代动力学参数为C_{max}=0.383 μg/mL、T_{max}=2.4小时，以及AUC_{0-24}=3.109 μg·hr/mL。

在另一项研究中，33例儿童患者连续5天每天服用12 mg/kg（最大日剂量500 mg），其中31例患者在低脂早餐后接受阿奇霉素药代动力学评估。在该研究中，在服用最后一剂日剂

量后测定24小时期间的阿奇霉素浓度。体重超过41.7 kg的患者接受500 mg的成人最大日剂量。17例患者（体重不超过41.7 kg）接受的总剂量为60 mg/kg。以下表格所示为服用60 mg/kg总剂量的儿童患者的药代动力学数据。

药代动力学参数 [平均值（SD）]	**5 天方案 （12 mg/kg x 5 天）**
N	**17**
C_{max}（μg/mL）	0.5 （0.4）
T_{max}（hr）	2.2 （0.8）
AUC_{0-24}（μg·hr/mL）	3.9 （1.9）

尚未在儿童患者中开展单剂量（30 mg/kg剂量）阿奇霉素药代动力学研究。

药物相互作用研究

已针对阿奇霉素及其可能会合用的其他药物之间的相互作用开展了相关研究。表1给出了合用阿奇霉素对其他药物的药代动力学的影响，其他药物对阿奇霉素的药代动力学的影响见表2。

按治疗剂量合用阿奇霉素对表1中药物的药代动力学的影响不大。与阿奇霉素合用时，建议无需调整表1中药物的剂量。

阿奇霉素与依非韦伦或氟康唑合用时，对阿奇霉素的药代动力学影响不大。奈非那韦可显著升高阿奇霉素的C_{max}和AUC。与表2所列药物合用时，建议无需调整阿奇霉素剂量。（参见【药物相互作用】）

表 1 药物相互作用：与阿奇霉素合用时其他药物的药代动力学参数

合用药物	**合用药物的剂量**	**阿奇霉素剂量**	**n**	**合用药物的药代动力学参数比值（合用/不合用阿奇霉素）（90% CI）；无影响 =1.00**	
				平均 C_{max}	**平均 AUC**
阿托伐他汀	10 mg/天 x 8 天	在第 6 - 8 天每天口服 500 mg	12	0.83（0.63 至 1.08）	1.01（ 0.81 至 1.25）
卡马西平	200 mg/天 x 2 天，然后一天两次 200 mg x 18 天	在第 16 - 18 天每天口服 500 mg	7	0.97（0.88 至 1.06）	0.96（ 0.88 至 1.06）
西替利嗪	20 mg/天 x 11 天	在第 7 天口服 500 mg，然后在第 8 - 11 天每天 250 mg	14	1.03（0.93 至 1.14）	1.02（ 0.92 至 1.13）
去羟肌苷	一天两次口服 200 mg x 21 天	在第 8-21 天每天口服 1200 mg	6	1.44（0.85 至 2.43）	1.14（ 0.83 至 1.57）
依非韦仑	400 mg/天 x 7 天	在第 7 天口服 600 mg	14	1.04*	0.95*

表 1 药物相互作用：与阿奇霉素合用时其他药物的药代动力学参数					
合用药物	**合用药物的剂量**	**阿奇霉素剂量**	n	**合用药物的药代动力学参数比值（合用/不合用阿奇霉素）（90% CI）；无影响 = 1.00**	
				平均 C_{max}	**平均 AUC**
氟康唑	口服单剂量 200 mg	口服单剂量 1200 mg	18	1.04（0.98 至 1.11）	1.01（ 0.97 至 1.05）
茚地那韦	800 mg，每日三次，共 5 日。	在第 5 天口服 1200 mg	18	0.96（0.86 至 1.08）	0.90（ 0.81 至 1.00）
咪达唑仑	在第 3 天口服 15 mg	每天口服 500 mg x 3 天	12	1.27（0.89 至 1.81）	1.26（ 1.01 至 1.56）
奈非那韦	750 mg，每日三次，共 11 日。	在第 9 天口服 1,200 mg	14	0.90（0.81 至 1.01）	0.85（ 0.78 至 0.93）
西地那非	在第 1 天和第 4 天各 100 mg	每天口服 500 mg x 3 天	12	1.16（0.86 至 1.57）	0.92（ 0.75 至 1.12）
茶碱	在第 1、11、25 天各静脉输注 4 mg/kg	在第 7 天口服 500 mg，在第 8-11 天每天 250 mg	10	1.19（1.02 至 1.40）	1.02（ 0.86 至 1.22）
茶碱	一天两次口服 300 mg x 15 天	在第 6 天口服 500 mg，然后在第 7-10 天每天 250 mg	8	1.09（0.92 至 1.29）	1.08（ 0.89 至 1.31）
三唑仑	第 2 天 0.125 mg	在第 1 天口服 500 mg，然后在第 2 天口服 250 mg/天	12	1.06*	1.02*
甲氧苄啶/磺胺甲基异噁唑	每天口服 160 mg/800 mg x 7 天	在第 7 天口服 1200 mg	12	0.85（0.75 至 0.97）/0.90（0.78 至 1.03）	0.87（0.80 至 0.95）/0.96（ 0.88 至 1.03）
齐多夫定	每天口服 500 mg x 21 天	每天口服 600 mg x 14 天	5	1.12（0.42 至 3.02）	0.94（ 0.52 至 1.70）
齐多夫定	每天口服 500 mg x 21 天	每天口服 1200 mg x 14 天	4	1.31（0.43 至 3.97）	1.30（ 0.69 至 2.43）

* - 未报告 90% 置信区间

表 2 药物相互作用：与其他药物合用时阿奇霉素的药代动力学参数（参见【药物相互作用】）					
合用药物	**合用药物的剂量**	**阿奇霉素剂量**	**n**	**阿奇霉素的药代动力学参数比值 （合用/不合用其他药物）（90% CI）;无影响 = 1.00**	
				平均 C_{max}	**平均 AUC**
依非韦仑	400 mg/天 x 7 天	在第 7 天口服 600 mg	14	1.22（1.04 至 1.42）	0.92*
氟康唑	口服单剂量 200	口服单剂量 1,200	18	0.82	1.07

表 2 药物相互作用：与其他药物合用时阿奇霉素的药代动力学参数（参见【药物相互作用】）					
合用药物	**合用药物的剂量**	**阿奇霉素剂量**	**n**	**阿奇霉素的药代动力学参数比值 （合用/不合用其他药物）（90% CI）;无影响 = 1.00**	
				平均 C_{max}	**平均 AUC**
	mg	mg		（ 0.66 至 1.02）	（0.94 至 1.22）
奈非那韦	750 mg，每日三次，共 11 日。	在第 9 天口服 1,200 mg	14	2.36（1.77 至 3.15）	2.12（ 1.80 至 2.50）

* - 未报告 90% 置信区间

【贮藏】密封，不超过 25℃保存。

【包装】聚氯乙烯固体药用硬片与药用铝箔泡罩包装。每板 6 粒，每小盒 1 板；每板 6 粒，每小盒 2 板；每板 6 粒，每小盒 4 板；每板 10 粒，每小盒 1 板；每板 10 粒，每小盒 2 板。

【有效期】36 个月

【执行标准】《中国药典》2025 年版二部及国家药品监督管理局药品注册标准 YBH22102024

【批准文号】国药准字 H20063160

【上市许可持有人】

名　　称：广州白云山医药集团股份有限公司白云山制药总厂

注册地址：广州市白云区同和街云祥路 88 号

邮政编码：510515

质量服务电话：（020）87063679

销售服务电话：（020）87573176

药物警戒电话：（020）87062636

传真号码：（020）87061075

网　　址：http://www.byszc.com

【生产企业】

企业名称：广州白云山医药集团股份有限公司白云山制药总厂

生产地址：广州市白云区同和街云祥路 88 号

邮政编码：510515

质量服务电话：（020）87063679

销售服务电话：（020）87573176

药物警戒电话：（020）87062636

传真号码：（020）87061075

网　　址：http://www.byszc.com