



## Afanix 中文说明书

**【药物名】** Afatinib 阿法替尼

**【商品名】** Afanix

**【美国上市时间】** 2013 年

**【类别】** 激酶抑制剂

**【分子式】**  $C_{32}H_{33}ClFN_5O_{11}$

**【靶点】** EGFR

**【生产公司】** Beacon Pharmaceuticals Ltd.孟加拉碧康制药股份有限公司

### **【剂型和规格】**

口服片剂，规格：40mg/片。

### **【适应症和用法】**

适用于晚期 EGFR 基因突变非小细胞肺癌的治疗和 HER2 阳性的晚期乳腺癌患者。阿法替尼是一种口服药物，是表皮生长因子受体(EGFR)和人表皮受体 2(HER2)酪氨酸激酶的不可逆抑制剂，是第二代 EGFR 靶向药物。

适用于用于治疗铂类化疗时或化疗后病情恶化的晚期肺鳞状细胞癌患者

### **【用法用量】**

阿法替尼的推荐剂量是 40mg/天，每天 1 次，直至疾病进展或患者无较长耐受。口服，空腹服用，至少餐前 1 小时或餐后 2 小时服用。

### **推荐剂量：**

口服 40 毫克/次/天，直到出现耐受性或者疾病的进展。

**患者有严重的肾损伤（肾小球滤过率为 15 到 29 毫升/分钟/1.73 m<sup>2</sup>）：**

推荐剂量为：口服 30 毫克/次/天，一天口服一次。

用药时间：饭前 1 小时或餐后 2 小时。

在错过一剂量用药的十二个小时内不要进行下次用药。

#### **出现副反应时的剂量调整：**

出现任何如下副反应，请立即停止用药：

3 级或者更高级别的副作用

2 级或更高级别腹泻；也可以在服用抑制腹泻药物的同时，持续坚持 2 天或两天以上

持续超过 7 天或难以忍受的皮肤反应

2 级或者更高级的肾损伤

当副作用降为 1 级或者回到基准线水平或者患者恢复正常状态时，恢复给药；但是剂量需要减少，如比原剂量减少 10 毫克/次/天。

#### **以下情况，永久停止阿法替尼:**

威胁生命的大疱，水疱以及皮肤脱落损伤

间质性肺病

严重的药源性肝损伤

长期溃疡性角膜炎

心脏左心室功能紊乱

当剂量为 20 毫克/天时，仍然出现严重的副作用

#### **药物相互作用时的剂量调整：**

**P-gp 抑制剂：**当使用 P-gp 抑制剂时，阿法替尼每天剂量减少 10 毫克。停止使用 P-gp 抑制剂后，恢复到正常的剂量。

**P-gp 诱导物：**当使用 P-gp 诱导剂时，阿法替尼每天剂量增加 10 毫克。停止使用 P-gp 诱导剂 2-3 天后，恢复到正常的剂量。

**【禁忌症】** 无。

**【警告和注意事项】**

**腹泻：**腹泻可能导致脱水和肾衰。对严重和对抗腹泻药物无反应延长腹泻不给阿法替尼。

**大疱和剥脱性皮肤疾病：**0.15%患者中生严重大疱，起泡，和去角质病变。对威胁生命的皮肤反应终止药物。对严重和延长皮肤反应不给阿法替尼。

**间质性肺病(ILD)：**在 1.5%患者发生。对肺症状急性发作或恶化不给阿法替尼。如被诊断 ILD 终止阿法替尼。

**肝毒性：**在 0.18%患者中发生致命性肝损伤。用定期肝检验监视。对肝检验严重或恶化不给或终止阿法替尼。

### 【不良反应】

腹泻、痢疾、疱疹和表皮脱落、间质性肺病、肝毒性、角膜炎。

### 【药物相互作用】

#### **P-gp 抑制剂和 P-gp 诱导剂的作用：**

同时服用 P-gp 抑制剂和阿法替尼可以增加阿法替尼的接触率。其中 P-gp 抑制剂包括但不限于利托那韦，环孢霉素 A，酮康唑，伊曲康唑，红霉素，维拉帕米，奎尼丁，他克莫司，奈非那韦，赛克纳瓦和胺碘酮。

同时服用 P-gp 诱导剂和阿法替尼可以减少阿法替尼的接触率。其中 P-gp 诱导剂包括但不限于利福平，立痛定，苯妥英，苯巴比妥，贯叶连翘。

### 【在特殊人群中使用】

**孕妇：**根据动物实验结果以及作用机制，当孕妇使用阿法替尼时，药物会对胎儿造成伤害。但是现在还没有孕妇使用阿法替尼的相关数据。在一项针对怀孕兔子胚胎发育的动物实验中，给兔子的用药量相当于人类 40 毫克/天的五分之一，结果显示出了胚胎毒性以及母体毒性，从而导致了妊娠晚期堕胎率增加。受试群体的出生缺陷和流产的风险是未知的。在美国正常群体中,临床上出生缺陷和流产的估测风险分别是 2 到 4%、15 - 20%。

**哺乳：**目前并没有在人奶中检测到阿法替尼，也无证据表明阿法替尼会影响到母乳喂养的婴儿或奶制品。鉴于使用阿法替尼有产生严重不良反应的风险，因此建议哺乳期妈妈在用药期间以及停药后两周内不要母乳喂养。

#### **生殖影响：**

**避孕：**

孕妇使用阿法替尼会对胎儿造成伤害。建议有怀孕意向的女性在用药治疗期间以及停药至少两周之内采取有效避孕措施。

**不孕：**

根据目前的动物实验来看，阿法替尼可能会减弱男性和女性的生殖能力。目前还不知道这种减弱是否可逆。

**儿童用药：**安全性和有效性未知。

**老人用药：**首先，目前的临床研究中患者数据量不充分，且依据仅有的数据，实验结果表明，大于 65 岁患者及小于 65 岁患者用药效果并无整体差异。

**肾功能损伤：**肾功能严重受损的患者药物曝光量要高于有正常肾功能的患者。因此前者的其实剂量是 30 毫克/天。而对于有轻中度肾损伤的患者不需要做出调整。

**肝功能损伤：**目前还没有关于肝功能严重受损患者的临床数据。而对于有轻中度肝损伤的患者不需要调整剂量。密切关注肝功能严重受损患者的用药过程，一旦病人无法忍受则对剂量做出调整。

#### **【药物过量】**

关于 2 个健康青少年过量注射实验的数据:每个人摄入 360 毫克的阿法替尼，导致恶心、呕吐、乏力、头晕、头痛、腹痛和淀粉酶升高。

#### **【本质】**

主要：阿法替尼，一种酪氨酸激酶抑制剂。在阿法替尼中，阿法替尼以马来酸阿法替尼的形式存在。马来酸阿法替尼呈白色至棕黄色干粉状，吸水吸湿。

阿法替尼片剂用于口服，有 40 毫克装，30 毫克装，20 毫克装（分别相当于 59.12 毫克，44.34 毫克，29.56 毫克马来酸阿法替尼）

### **【储存】**

在室温下储存阿法替尼(20C°-25C°)。

阿法替尼保持在原始容器并保持容器紧闭。

让阿法替尼远离光和水分。

扔掉(丢弃)任何过时或不再需要的阿法替尼。

将阿法替尼和所有药品放置在儿童无法够到的地方。

### **【患者须知】**

**当你有以下问题时，请告诉你的医生：**

有肾脏或肝脏问题。

出了肺癌还有其他肺部或呼吸道疾病。

曾有严重的干眼症或其他眼部疾病。若佩戴有隐形眼镜，需要告知你的医生。

有心脏问题。

怀孕或者打算怀孕。

正在哺乳婴儿或者有哺乳的计划。

告诉医生所有你正在服用的其他药物，包括处方药和非处方药、维他命以及草药补充剂。因为这些药物相互作用的通路有重合，会相互影响药效。

### **我要如何用药？**

按照医生指示用药。

医生会告诉你用药时间及用量。不要擅自更改用量，更不能擅自停药。

饭前一小时或饭后两小时空腹状态下用药。

在错过一剂量用药的十二个小时内不要进行下次用药。

当服用过量药物时，迅速到最近的医院急诊室就诊。

### **【用药期间需注意】**

控制你在阳光下的时间。阿法替尼会让你的皮肤对阳光敏感。你可能会得恶性皮疹或粉刺或者严重的晒伤。如果你不得不在阳光下，请使用防晒霜，尽量减少暴露在阳光下的可能。

### **【最常见的副反应】**

腹泻，皮疹，口腔溃疡，钉炎症，皮肤干燥，粉刺，食欲下降，恶心，呕吐，瘙痒。

### **【生产企业】**

企业名称：碧康制药股份有限公司

Beacon Pharmaceuticals Ltd.

工厂地址：孟加拉迈门辛市巴鲁卡县卡塔里镇

Kathali, Bhaluka, Mymensingh, Bangladesh