

核准日期：2010 年 2 月 20 日
修订日期：2020 年 12 月 30 日



异烟肼片说明书

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：异烟肼片

英文名称：Isoniazid Tablets

汉语拼音：Yiyanjing Pian

【成份】本品主要成份为异烟肼。

化学名称：4-吡啶甲酰肼

化学结构式：

分子式： $C_6H_7N_3O$

分子量：137.14

【性状】本品为白色或类白色片。

【适应症】（1）异烟肼与其它抗结核药联合，适用于各型结核病的治疗，包括结核性脑膜炎以及其他分枝杆菌感染。

（2）异烟肼单用适用于各型结核病的预防：①新近确诊为结核病患者的家庭成员或密切接触者；②结核菌素纯蛋白衍生物试验（PPD）强阳性同时胸部 X 射线检查符合非进行性结核病，痰菌阴性，过去未接受过正规抗结核治疗者；③正在接受免疫抑制剂或长期激素治疗的患者，某些血液病或网状内皮系统疾病（如白血病、霍奇金氏病）、糖尿病、尿毒症、矽肺或胃切除术等患者，其结核菌素纯蛋白衍生物试验呈阳性反应者；④35 岁以下结核菌素纯蛋白衍生物试验阳性的患者；⑤已知或疑为 HIV 感染者，其结核菌素纯蛋白衍生物试验呈阳性反应者，或与活动性肺结核患者有密切接触者。

【规格】0.1g。

【用法用量】口服 预防：成人一日 0.3g（3 片），顿服；小儿每日按体重 10mg/kg，一日总量不超过 0.3g（3 片），顿服。治疗：成人与其他抗结核药合用，按体重每日口服 5mg/kg，最高 0.3g；或每日 15mg/kg，最高 900mg（9 片），每周 2~3 次。小儿按体重每日 10~20mg/kg，每日不超过 0.3g（3 片），顿服。某些严重结核患儿（如结核性脑膜炎），每日按体重可高达 30mg/kg（一日量最高 500mg（5 片）），但要注意肝功能损害和周围神经炎的发生。

【不良反应】发生率较多者有步态不稳或麻木针刺感、烧灼感或手指疼痛（周围神经炎）；深色尿、眼或皮肤黄染（肝毒性，35 岁以上患者肝毒性发生率增高）；食欲不振、异常乏力或软弱、恶心或呕吐（肝毒性的前驱症状）。发生率极少者有视力模糊或视力减退，合并或不合并眼痛（视神经炎）；发热、皮疹、血细胞减少及男性乳房发育等。本品偶可因神经毒性引起的抽搐。

【禁忌】肝功能不正常者，精神病患者和癫痫病人禁用。

【注意事项】（1）交叉过敏反应，对乙硫异烟胺、吡嗪酰胺、烟酸或其他化学结构有关药物过敏者也可能对本品过敏。

（2）对诊断的干扰：用硫酸铜法进行尿糖测定可呈假阳性反应，但不影响酶法测定的结果。异烟肼可使血清胆红素、丙氨酸氨基转移酶及门冬氨酸氨基转移酶的测定值增高。

（3）有精神病、癫痫病史者、严重肾功能损害者应慎用。

(4) 如疗程中出现视神经炎症状，应立即进行眼部检查，并定期复查。

(5) 异烟肼中毒时可用大剂量维生素 B₆ 对抗。

【孕妇及哺乳期妇女用药】 (1) 本品可穿过胎盘，导致胎儿血药浓度高于母血药浓度。动物实验证实异烟肼可引起死胎，但在人类中虽未证实，孕妇应用时必须充分权衡利弊。异烟肼与其他药物联合时对胎儿的作用尚未阐明。此外，在新生儿用药时应密切观察不良反应。

(2) 异烟肼在乳汁中浓度可达 12mg/L，与血药浓度相近；虽然在人类中尚未证实有问题，哺乳期间应用仍应充分权衡利弊。如用药则宜停止哺乳。

【儿童用药】 严格按儿童用法用量使用。

【老年用药】 50 岁以上患者用本品引起肝炎的发生率较高。

【药物相互作用】 (1) 服用异烟肼时每日饮酒，易引起本品诱发的肝脏毒性反应，并加速异烟肼的代谢，因此需调整异烟肼的剂量，并密切观察肝毒性征象。应劝告患者服药期间避免酒精饮料。

(2) 含铝制酸药可延缓并减少异烟肼口服后的吸收，使血药浓度减低，故应避免两者同时服用，或在口服制酸剂前至少 1 小时服用异烟肼。

(3) 抗凝血药（如香豆素或茚满双酮衍生物）与异烟肼同时应用时，由于抑制了抗凝药的酶代谢，使抗凝作用增强。

(4) 与环丝氨酸同服时可增加中枢神经系统不良反应（如头昏或嗜睡），需调整剂量，并密切观察中枢神经系统毒性征象，尤其对于从事需要灵敏度较高的工作的患者。

(5) 利福平与异烟肼合用时可增加肝毒性的危险性，尤其是已有肝功能损害者或为异烟肼快乙酰化者，因此在疗程的头 3 个月应密切随访有无肝毒性征象出现。

(6) 异烟肼为维生素 B₆ 的拮抗剂，可增加维生素 B₆ 经肾排出量，因而可能导致周围神经炎，服用异烟肼时维生素 B₆ 的需要量增加。

(7) 与肾上腺皮质激素（尤其泼尼松龙）合用时，可增加异烟肼在肝内的代谢及排泄，导致后者血药浓度减低而影响疗效，在快乙酰化者更为显著，应适当调整剂量。

(8) 与阿芬太尼（alfentanil）合用时，由于异烟肼为肝药酶抑制剂，可延长阿芬太尼的作用；与双硫仑（disulfiram）合用可增强其中枢神经系统作用，产生眩晕、动作不协调、易激惹、失眠等；与安氟醚合用可增加具有肾毒性的无机氟代谢物的形成。

(9) 与乙硫异烟胺或其他抗结核药合用，可加重后二者的不良反应。与其他肝毒性药合用可增加本品的肝毒性，因此宜尽量避免。

(10) 异烟肼不宜与酮康唑或咪康唑合用，因可使后两者的血药浓度降低。

(11) 与苯妥英钠或氨茶碱合用时可抑制二者在肝脏中的代谢，而导致苯妥英钠或氨茶碱血药浓度增高，故异烟肼与两者先后应用或合用时，苯妥英钠或氨茶碱的剂量应适当调整。

(12) 与对乙酰氨基酚合用时，由于异烟肼可诱导肝细胞色素 P450，使前者形成毒性代谢物的量增加，可增加肝毒性及肾毒性。

(13) 与卡马西平同时应用时，异烟肼可抑制其代谢，使卡马西平的血药浓度增高，而引起毒性反应；卡马西平可诱导异烟肼的微粒体代谢，形成具有肝毒性的中间代谢物增加。

(14) 本品不宜与其他神经毒药物合用，以免增加神经毒性。

【药物过量】 尚不明确

【药理毒理】本品是一种具有杀菌作用的合成抗菌药，本品只对分枝杆菌，主要是生长繁殖期的细菌有效。其作用机制尚未阐明，可能抑制敏感细菌分枝菌酸（mycolic acid）的合成而使细胞壁破裂。

【药代动力学】本品口服后迅速自胃肠道吸收，并分布于全身组织和体液中，包括脑脊液、胸水、腹水、皮肤、肌肉、乳汁和干酪样组织。并可穿过胎盘屏障。蛋白结合率仅 0~10%。口服 1~2 小时血药浓度可达峰值，但 4~6 小时后血药浓度根据患者的乙酰化快慢而不一，快乙酰化者， $T_{1/2}$ 为 0.5~1.6 小时，慢乙酰化者为 2~5 小时，肝、肾功能损害者可能延长。代谢主要在肝脏中乙酰化而成无活性代谢产物，其中有的具有肝毒性。乙酰化的速率由遗传所决定。慢乙酰化者常有肝脏 N-乙酰转移酶缺乏，未乙酰化的异烟肼可被部分结合。

本品主要经肾排泄（约 70%），在 24 小时内排出，大部分为无活性代谢物。快乙酰化者中 93% 以乙酰化型在尿液中排出，慢乙酰化者为 63%。快乙酰化者尿液中 7% 的异烟肼呈游离或结合型，而慢乙酰化者则为 37%。本品易通过血脑屏障，亦可从乳汁排出，少量可自唾液、痰液和粪便中排出。相当量的异烟肼可经血液透析与腹膜透析清除。

【贮藏】遮光，密封，在干燥处保存。

【包装】口服固体药用高密度聚乙烯瓶装；100 片/瓶。

【有效期】24 个月

【执行标准】中国药典 2020 年版二部。

【批准文号】国药准字 H41021767

【上市许可持有人】海南制药厂有限公司制药二厂

【地 址】林州市史家河工业园区

【生产企业】

企业名称：海南制药厂有限公司制药二厂

生产地址：林州市史家河工业园区

邮政编码：456592

电话号码：0372-6515111

传真号码：0372-6515111