

来氟米特 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/310/2021_2022__E6_9D_A5_E6_B0_9F_E7_B1_B3_E7_c22_310060.htm 药品名称来氟米特 药物别名爱若华 英文名称Leflunomide 类别抗炎镇痛药制剂10mg / 片，双铝包装。本品为白色薄膜衣片，除去薄膜衣呈白色。储藏温度25℃：答应范围15~30℃，避光。分子式成分，Cc1c(C(F)(F)F)nc(=O)c1-c2ccc(N)cc2-3氟-5甲基-异唑-N-酰基-对苯胺 药理毒理来氟米特是一个具有抗增生活性的异噻唑类免疫抑制剂其作用机理主要是抑制二氢乳清酸脱氢酶的活性，从而影响活化淋巴细胞的嘧啶合成。体内外试验表明本品具有抗炎作用。来氟米特的体内活性主要通过其活性代谢产物而产生。药动学口服给药，来氟米特被代谢为活性产物A771726(M1)，它在体内发挥所有主要的药理作用，来氟米特在血浆中的浓度非常低，达峰时间在 0.5581 ± 0.506 天，半衰期 8.79 ± 0.77 天。多剂量给药($20\text{mg} \cdot \text{d}^{-1}$ ，qd)连续30天，其M1血药浓度接近稳态。在临床应用中使用三天($100\text{mg} / \text{天}$)负荷剂量可以快速达到稳态浓度。来氟米特口服的生物利用度80%，高脂饮食对M1血浆浓度不会产生大的影响。分布：M1主要分布于肝、肾和皮肤组织，脑组织中分布较少。M1血浆浓度较低，并且广泛和血浆蛋白结合(99.3%)，结合蛋白量在治疗浓度时呈线性关系。代谢：来氟米特被代谢为主要产物M1及许多微量代谢物，肝脏和胃肠壁具有代谢作用，肝细胞质和细胞的微粒体是药物代谢的部位。适应症成人活动性类风湿性关节炎。不良反应主要表现为腹泻、搔痒、可逆性肝脏酶升高、脱发、皮疹等。用法用量每日一次，每次2片。最初三天给予负荷剂量($50\text{mg} / \text{日}$)，之后给予维持剂量 $20\text{mg} / \text{天}$ 。 注重事项1.

临床试验发现来氟米特可引起一过性的SGPT升高和白细胞下降，服药初始阶段应定期检查SGPT和白细胞。检查间隔视病人情况而定。2．严重肝脏损害和明确的乙肝或丙肝血清学指标的患者慎用。用药前及用药后每月检查SGPT，检测时间间隔视病人具体情况而定。3．免疫缺陷、未控制的感染、活动性胃肠道疾病、肾功能不全、骨髓发育不良的患者慎用。4．预备生育的男性应该考虑中断治疗，同时服药消胆胺。5．假如剂量过大或出现毒性时，可给予消胆胺或活性炭快速降低M1浓度。100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 www.100test.com