

Kaletra 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_Kaletra_c22_310819.htm 药品名称Kaletra 类别抗病毒药制剂胶囊为橙黄色明胶软胶囊，每粒含洛匹那韦133.3mg，利托那韦33.3mg。口服液为淡黄色至橙色溶液，每5ml含洛匹那韦400mg，利托那韦100mg为42.4%乙醇溶液分子式成分洛匹那韦（lopinavir）和利托那韦（ritonavir）。【药理毒理】（美）Abbott公司研制开发，2000年9月在美国首次注册并上市。本品为含有两种蛋白酶抑制剂的复方制剂，可与HIV蛋白酶上的活性位点相结合，进而破坏酶的正常功能，最终导致形成不成熟的无感染性的病毒体。本品的抗病毒活性完全归功于洛匹那韦。洛匹那韦经肝细胞色素P450 CYP3A代谢，利托那韦为CYP3A4强抑制剂，能可逆性地抑制P450，使洛匹那韦的代谢受遏，从而增加洛匹那韦的血浆药物浓度，使之大大超过对多株HIV毒株的抑制浓度，包括对其它蛋白酶抑制剂（PI）耐药的某些毒株。本品可有效治疗耐多种PI的HIV毒株。但是，无法抑制HIV RNA水平高、多种（>5种）基因型耐药突变株或基线时高水平表型耐药毒株的HIV感染。药动学食物可增加本品的吸收和生物利用度。本品400/100mg，一旦2次可使洛匹那韦血浆浓度24小时保持恒定。本品可有效对抗耐利托那韦的HIV毒株，抗HIV蛋白酶的 K_i 为1.3pmol/L。适应症HIV/AIDS感染的治疗。亦可与其它抗逆转录病毒药物联用于成人和6个月以上儿童的HIV感染治疗。不良反应本品一般易于耐受，最常见的不良反应为腹泻（13.8%~23.8%）、恶心（2.2%~13.5%）、无力或疲惫（3.4%~7.1%）、头痛（1.6%~7.1%）、粪便异常（0~6.0%）、呕吐（1.6%~4.8%

)、腹痛 (1.1% ~ 4.8%)、出疹 (0.6% ~ 3.6%)、失眠 (1.1% ~ 2.4%) 和疼痛 (0.7% ~ 2.4%)。其它还有转氨酶活性增高 (肝功能测试异常)、甘油三酯和总胆固醇水平增高、高血糖症和身体脂肪分布改变等报道。亦有致命性胰腺炎和增加血友病患者出血的报道。值得注重的是, 临床研究中, 约1/4病人有严重或致命的实验室检测异常。相互作用本品可较大程度增高胆固醇和甘油三酯水平, 故治疗前和治疗期间需要监测。已有对本品交叉耐药的报道, 但对本品耐药的基因突变点尚未确定。已分离到对本品敏感性降低的毒株。本品经细胞色素P450代谢, 可抑制CYP3A4的活性, 在较低程度上抑制CYP2D6的活性。本品可增加或延长经这些途径代谢的许多药物的疗效和不良反应。因此, 本品禁与下列药物联用: 氟卡尼、普罗帕酮、阿司咪唑、特非那定、麦角生物碱 (去羟麦角胺、麦角新碱、麦角胺、甲麦角新碱或二血卞啉醚)、西沙必利、匹莫齐特、咪达唑仑、三唑仑、洛伐他汀和辛伐他汀。本品会增加其它常用药物的血清浓度, 如西地那非, 克拉霉素, 硝苯地平和利福布汀。长期治疗可能诱导CYP3A4。本品还会降低以雌激素为基础的口服避孕药和美沙酮的血药浓度。与利福平或金丝桃 (黑点叶金丝桃, *Hypericum perforatum*) 合用, 会降低本品的疗效。本品与西地那非合用时, 后者限量为每48小时25mg; 与去羟肌苷联用时, 后者必须在本品给药前1小时或给药后2小时使用。本品与利福布汀、双硫仑、甲硝唑和皮质激素有相互作用, 共同使用时需调整双方的剂量。本品有可能降低齐多夫定和阿巴卡韦 (abacavir) 血浆浓度, 但尚未经临床确证。用法用量 胶囊 成人一日2次, 每次3粒, 日剂量为6粒。与食物同服。

口服液 成人一日2次，每次5ml，日剂量为10ml。当对已治疗过的患者与依发韦仑（efavirenz）或奈韦拉平联用时，剂量为一日2次，每次4粒或6.5ml。儿童按体重调整剂量，7~15kg的为12mg/kg，15~40kg的为10mg/kg，每次最大剂量为400/100mg。当怀疑对洛匹那韦出现耐药性而与依发韦仑或奈韦拉平联用时，剂量可增加至533/133mg，每日2次。注重事项食物可增加本品的吸收，故本品应在就餐或吃点心时服用。对本品过敏者禁用；肝受损者慎用。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