

安瑞那韦 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__E5_AE_89_E7_91_9E_E9_82_A3_E9_c22_310828.htm 药品名称安瑞那韦 药物别名Agenerase 英文名称amprenavir 类别抗病毒药制剂 胶囊剂：50mg，150mg；口服液：15mg/mL-1 药理毒理安瑞那韦是一种新的（第五代）抗逆转录病毒蛋白酶抑制剂，通过阻断从受感染的宿主细胞表面释放新的、成熟的病毒粒子的形成过程，抑制病毒的蛋白酶而起作用。当长期应用本品时，通常可降低血中的HIV病毒载体，增加CD4细胞的计数，降低感染爱滋病的机会，提高生活质量，延长生命。通过对抗急性及慢性受感染的成淋巴细胞以及外周系统血中的淋巴细胞可评价其体外抗病毒活性，其IC₅₀对急性感染细胞是0.012~0.08mmol/L-1，对慢性感染细胞是0.41mmol/L-1。本品是一种新的用于爱滋病治疗的蛋白酶抑制剂，是目前6种蛋白酶抑制剂（沙奎那韦，利托那韦，茚地那韦，nelfinavir，安瑞那韦及ABT-378/r）中生物利用度最高的药物之一，与其他蛋白酶抑制剂或核苷类转录酶抑制剂的联用，可广泛用于爱滋病的治疗。据第4届爱滋病感染药物治疗国际年会的报告，本品与沙奎那韦、茚地那韦及nelfinavir3种蛋白酶抑制剂任一种联用，63%（10/16）的患者在48周时浆中RNA病毒降低到400copies/mL-1以下，42%（8/19）的患者在24周时血浆中RNA病毒降低到50copies/mL-1以下。通过48周的治疗，CD4细胞计数平均增加了100。与此同时，患者对药物的耐受性良好。在24周的治疗期间，96%的不良反是轻到中度。在48周的治疗期间，没有1例严重的不良反被认为是与药物有关。University of Central Florida的Jeffrey Goodgame研究（内部资

料未发表)表明,应用三联#093., 80%的患者RNA病毒降到400copiesmL⁻¹以下(超敏法), CD4细胞计数平均增加了113(24周)。药动学安瑞那韦吸收迅速,在1~2h内达血药浓度峰值。口服1200mg, bid, 3周后其C_{max}约为5.36 μgmL⁻¹。表观分布容积约430L, 体外蛋白结合率约90%。主要在肝中代谢, 通过肝中P450酶CYP3A4的生物转化而清除。消除半衰期T_{1/2}为7.1~10.6h。高脂肪食物可降低其吸收。其口服溶液剂的生物利用度比其胶囊剂约低14%, 因此它们之间不能按等量换算。适应症HIV感染的口服抗逆转病毒的治疗, 须与其他逆转病毒制剂结合应用。不良反应本品不良反应发生率约为15%~16%, 最常见为胃肠道不良反应, 如恶心、呕吐、胃痉挛、腹泻。潮红的发生率达28%, 虽然大多数都只是轻至中度带瘙痒的斑丘疹, 但潜在并具危险性的Stevens-Johnson综合征的发生率在潮红中占4%(总的发生率为1%)。其他的不良反应尚有口周的麻刺感或麻木、抑郁、情绪紊乱、味觉紊乱。相互作用本品不良反应发生率约为15%~16%, 最常见为胃肠道不良反应, 如恶心、呕吐、胃痉挛、腹泻。潮红的发生率达28%, 虽然大多数都只是轻至中度带瘙痒的斑丘疹, 但潜在并具危险性的Stevens-Johnson综合征的发生率在潮红中占4%(总的发生率为1%)。其他的不良反应尚有口周的麻刺感或麻木、抑郁、情绪紊乱、味觉紊乱。用法用量推荐剂量为1200mg, po, bid。服用了抗酸剂或地丹诺辛前后1h内不得服用本品。轻至中度肝功能不良的患者应降低剂量至450mg甚至300mg, bid。肾功能不良者勿需调整剂量。4~16岁的儿童推荐剂量为22.5mgkg⁻¹, bid(或17mgkg⁻¹, tid), 直至最大剂量2800mgd⁻¹。【注重事项】

服用本品或其他蛋白酶抑制剂时有下列倾向：自然出血、糖尿病或已有的糖尿病加重。还可出现三酰甘油、脂蛋白及肝酶水平的升高，因此有轻至中度肝功能不良的患者应降低剂量或慎用。本品并不能治愈HIV感染，患者有可能继续感染或出现与HIV疾病有关的其他并发症。没有证据表明本品能降低通过性接触或血液传染感染HIV的危险性。它仅作为抗HIV治疗整个方案的一部分。患者在服用本品时不要服用维生素E，因为本品中已含有维生素E。有糖尿病的患者需调整剂量。服药期间应避免怀孕或哺乳。采用激素避孕（节育丸）的应改用另一种避孕方式（如避孕套、子宫帽）。本品有增加体内脂肪的趋势，需注重脂肪的变化。严格按照处方服药，不能漏服。假如在4h之内发现漏服，应立即补上，且下次服药仍按常规时间服用。漏服时间超过4h则应等下次常规时间时再服。任何时候不能多服或少服，并在医生的严密监视下服药。食物对本品没有影响，但不能食用高脂肪食物，否则会降低疗效。中至重度肝功能不良的患者不推荐使用本品。此前已证实对本品处方中任一组分过敏者禁用由于本组分中含有磺胺基团，因此对磺胺过敏者也不得应用。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