

扎鲁司特 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/313/2021\\_2022\\_\\_E6\\_89\\_8E\\_E9\\_B2\\_81\\_E5\\_8F\\_B8\\_E7\\_c22\\_313354.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/313/2021_2022__E6_89_8E_E9_B2_81_E5_8F_B8_E7_c22_313354.htm) 药品名称扎鲁司特药物

别名安可来 英文名称zafirlukast 类别其他药物制剂片剂：20 mg。分子式成分药理毒理在哮喘发病的病理生理学中，认为白三烯产物(LT)与其受体结合后产生的作用包括平滑肌收缩、气道水肿和炎性细胞活性改变（如嗜酸细胞肺浸润）均与哮喘的症状和体征有关。本药作为一种抗炎药，能减少这些炎性介质的作用。本药作为一种强力口服多肽性LTC<sub>4</sub>、LTD<sub>4</sub>和LTE<sub>4</sub>等超敏反应的慢反应物质的白三烯受体拮抗剂，属于竞争性抑制，具有高选择性的特点。体外研究显示本药拮抗在人体传导气道平滑肌的所有3个白三烯多肽的收缩活性（白三烯C<sub>4</sub>、D<sub>4</sub>及E<sub>4</sub>），并且程度相同。动物实验显示本药的作用主要是：有效地预防白三烯多肽所致的血管通透性增加，后者能引起气道水肿；抑制白三烯多肽产生的气道嗜酸细胞的浸润。临床研究也证实本药的特异性，仅作用于白三烯受体，但不影响前列腺素、血栓素、胆碱能和组织胺受体。经临床验证显示，本药具有抗炎特性，五日剂量的本药能减少气道因抗原刺激引起的细胞和非细胞性炎性物质。安慰剂对照研究发现抗原激发48 hr后的支气管肺泡灌洗液中，扎鲁司特能抑制嗜酸细胞、淋巴细胞和组织细胞的升高，以及减少因肺泡巨噬细胞刺激所产生的过氧化物。本药能抑制抗原激发的气道高反应和血小板活性因子引起的支气管痉挛。药动学扎鲁司特的血浆浓度多在口服本药后约3 hr达到峰值。如每日二次服用本药(30-80 mg bid)，则可见扎鲁司特的血浆蓄积从难以检测到首剂值的2.9倍，平均1.45，中值1.27。扎鲁司特

的消除半衰期约为10 hr，稳态血浆浓度取决于剂量并可用单剂量药代动力学资料推算。扎鲁司特在哮喘青年和成年人的药代动力学与健康成人相似。按体重用药时，扎鲁司特的药物代谢无性别差异。与食物同服，将增加本药生物利用度的差异性，大部分患者（75%）的生物利用度降低，下降幅度可达40%。扎鲁司特代谢完全，通过同位素标记证实，尿排泄为口服剂量的10%，粪便排泄为89%，但尿中难以测得扎鲁司特。标化体外活性测定，人血浆中扎鲁司特代谢物活性至少较原药差90倍。在老年和酒精性肝硬化稳定期患者用同量的本药时，其峰浓度和曲线下面积较正常者增高2倍。扎鲁司特的药代动力学在正常人群和肾损害病人之间无明显差异。扎鲁司特的血浆结合率为99%，主要是白蛋白(浓度范围为0.25-4.0 mg/mL)。适应症哮喘的预防和长期治疗。不良反应本药的耐受性良好，使用时可能引起头痛或胃肠道反应，这些症状通常较稍微。包括荨麻疹及血管神经性水肿的过敏反应已见报道，皮疹及水疱也见报道。临床实验中已观察到服用本药可出现转氨酶升高，但不常见。继续治疗或停药后可恢复正常。极少数患者因药物介导的肝炎而转氨酶持续异常，这种情况常在停用本药后恢复正常。通过安慰剂的对照观察发现，使用本药的老年患者感染的发生率增加，但症状较轻，主要影响呼吸道，不必中止治疗。相互作用本药可与其它哮喘和过敏症常规治疗药联合使用。与吸入糖皮质激素、吸入和口服支气管扩张剂、抗生素和抗组织胺药等合用时未见不良相互作用。本药与口服避孕药同服时未见不良相互作用。与阿斯匹林合用，可使扎鲁司特的血浆浓度升高约45%，但其不至于引起相应临床效应。与红霉素合用，使

扎鲁司特血浆浓度降低约40%，与茶碱合用能导致扎鲁司特血浆浓度下降30%，但不影响茶碱的血浆水平。与特非那丁合用能导致扎鲁司特曲线下面积降低54%，但对血浆特非那丁水平无影响。与华法令合用能导致最大凝血酶原时间延长约35%，因此在本药与华法令合用时，建议密切监测凝血酶原时间。二者之间的相互作用可能是由于扎鲁司特抑制了细胞色素P450 2C9异构酶系统。用法用量本药用于预防哮喘发作，因此应持续使用。成人和12岁以上(包括12岁)儿童起始剂量应是20 mg bid，一般维持剂量为20 mg bid，剂量逐步增加至一次最大量40 mg，每日二次时可能疗效更佳，用药剂量不应超过最大推荐量。因为食物能降低扎鲁司特的生物利用度，应避免本药在进食时服用。老年人65岁以上的老年人对扎鲁司特的清除率降低，因而峰浓度(C<sub>max</sub>)和曲线下面积(AUC)大约是年轻人的2倍，然而尚无资料证实扎鲁司特在老年人的蓄积。临床用药时，老年人在用量20 mg bid的情况下，不会增加药物的副作用或因副作用而停药。老年人的起始剂量应为20 mg bid，然后根据临床反应调整用量。儿童本药对12岁以下儿童的疗效和安全性目前尚无报道。肾功能不全者不需调整剂量。在酒精性肝硬化稳定期患者，扎鲁司特清除率降低，峰浓度(C<sub>max</sub>)和曲线下面积(AUC)大约为正常人的2倍。起始剂量应是20 mg bid，然后根据临床反应调整。尚未对本药在其它原因所致的肝功能损害病人中的应用进行观察，也未对肝硬化患者进行长期观察。注重事项对本药及其组分过敏者禁用。在哮喘的缓解期，仍应按时服用本药以保证疗效。在急性发作期，通常仍应维持本药治疗。与吸入糖皮质激素和色甘酸类药(色甘酸二钠，奈多罗米纳)相同

，本药不适用于解除哮喘急性发作时的支气管痉挛。有关本药治疗易变性哮喘或不稳定性哮喘的研究尚未报道。不宜用本药忽然替代吸入或口服的糖皮质激素。在重度哮喘患者的治疗中，在考虑减少激素用量时应谨慎。在停用口服激素的重度哮喘病人中，极少数发生嗜酸细胞浸润，偶表现为以全身血管炎为临床特点的Churg-Strauss综合征。但尚未发现本药与此综合征之间有因果关系。使用本药治疗期间，血清转氨酶有可能升高，通常表现短暂而无症状，但可能是肝毒性的早期表现。如有肝功能不全的症状或体征（如：恶心、呕吐、右上腹疼痛、倦怠、嗜睡、流感样症状、肝肿大、瘙痒及黄疸）出现，应该测定血清转氨酶，尤其是血清ALT，且随后对患者进行处理。是否中断本药治疗应在权衡肝功能损害和使用本药之间的利弊后，依个体情况决定。本药不被推荐用于肝硬化在内的肝功能损害病人。动物试验证实扎鲁司特不影响生育能力，无致畸作用和对胎儿的毒性作用。然而，尚未研究妊娠妇女服用本药的安全性，故妊娠期持续用药应权衡利弊。仅在确实需要时才使用本药。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](http://www.100test.com)