

复习指导：阿托伐醌使用方法执业医师资格考试 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/507/2021_2022__E5_A4_8D_E4_B9_A0_E6_8C_87_E5_c22_507691.htm 药理：本品为羟基1,4-萘啉，是辅酶Q的同系物，具有抗几种原虫的活性。对疟原虫属，其作用部位为细胞色素bcl结合点（结合点）。本品能可逆性地与多肽上的11500Da分子集团结合。二氢乳清醒脱氢酶是吡啶生物合成中重要的酶，通过辅酶Q连接线粒体作电子传递，因此本品通过抑制电子传递阻止吡啶的合成。一些代谢酶通过辅酶Q参与线粒体的电子传递，因此，本品抑制电子传递作用实际上是抑制了这些酶的活性。100mg/kg剂量的本品可100%的防止和治疗小鼠P.carinii.其抑制的IC50范围为0.1~3.0 μg/ml。药动学 本品为高亲脂性，低溶于水的物质，在剂量750mg以上时其生物利用度减少很多且变化也大，给饮食正常的健康志愿者服用本品，其血浆浓度时间曲线表现为双峰，第一峰出现在服药后1至8小时，第二峰出现在服药后24至96小时。双峰说明了该药存在着肠肝循环。与肉类特别是脂肪同服，可增加吸收约30%。本品有较长的半衰期，正常人半衰期为 2.9 ± 0.8 天。AIDS病人半衰期为 2.2 ± 0.6 天。其原因主要为不经肾排泄，肠肝循环也延迟了其从粪便排泄的速度。在一多剂量试验中，给4名HIV血清阳性的志愿者服用本品，同时给予食物。生物利用度降低。每天最大剂量为300mg，其平均稳态血浓为 $40.0 \pm 19.0 \mu\text{g/ml}$ 。而每天服用750mg，稳态血浓为 $26.9 \pm 10 \mu\text{g/ml}$ 。给10名免疫受损的儿童用本品，其平均半衰期为 2.7 ± 1.6 天。这些儿童的平均年龄为5个月到13岁，体重在3.5kg到85.5kg.10mg/kg每天一

次的给药方案可达到平均稳态血浓度值 $7.5 \pm 4.6 \mu\text{g/ml}$ ，其中3名儿童每日给药达 40mg/kg ，其稳态血浓度平均值为 $14.0 \pm 2.2\text{mg/ml}$ 。本品血浆蛋白结合率达到99.9%。百考试题网站整理 适应症：适用于不能耐受SMZ-TMP的患轻度至中度卡氏肺炎的AIDS病人的口服治疗。用法用量：一日三次 750mg ，与食物同服，共21天。儿童剂量（14个月以上）为 40mg/kg 。体重超过 40kg 的儿童剂量按成人剂量。[制剂与规格] 250mg 片剂 给药说明：由于本品与血浆蛋白结合率高，所以在与其他高血浆蛋白结合率的药物同用时应注意其替代作用。不良反应：红斑23%，呕吐14%，恶心21%，头昏19%，头痛16%，发热14%，失眠10%，肝药酶活性增加。

"#F8F8F8" 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