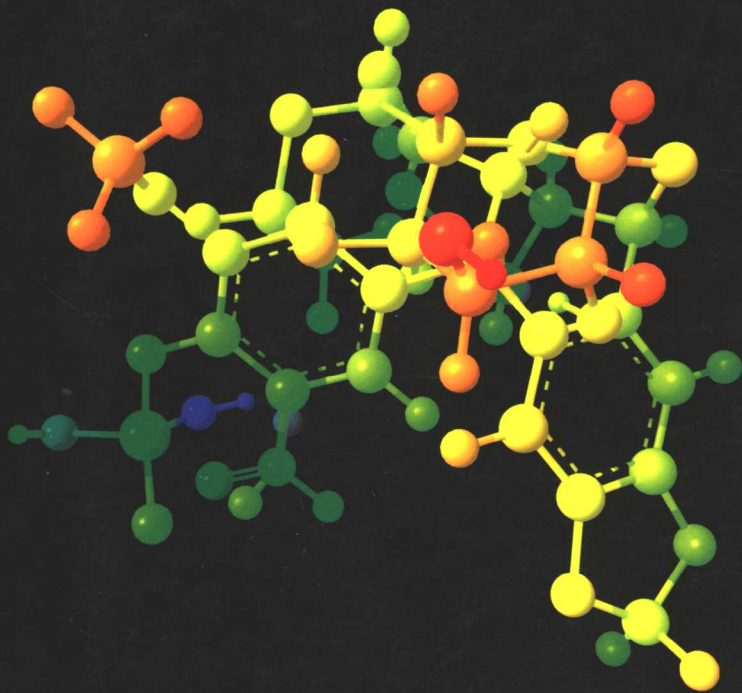


中英文通用名
商品名
化学结构
化学名称
性状
CA登录号
化学文摘号
专利号
知识产权状况
首创厂商
首次上市国家及时间
适应证
剂型规格
用法用量
药理作用
药动学
临床评价
不良反应
注意事项
中英文参考文献



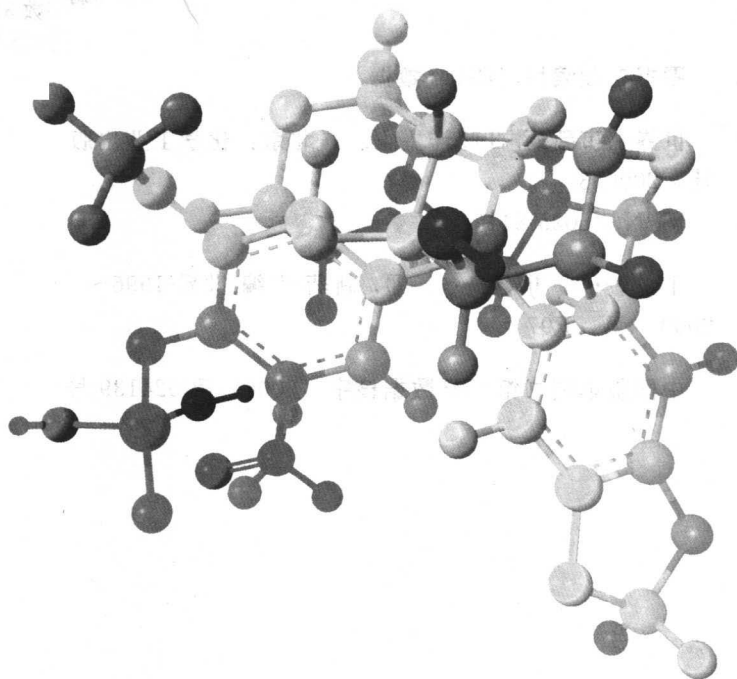
New Approved Drugs in the World

世界上市新药

汪啸洋 主编



化学工业出版社
现代生物技术与医药科技出版中心



New Approved Drugs in the World

世界上市新药

主编



化学工业出版社
现代生物技术与医药科技出版中心

· 北 京 ·

图书在版编目 (CIP) 数据

世界上市新药/汪啸洋主编. —北京: 化学工业出版社, 2006. 3

ISBN 7-5025-8416-1

I. 世… II. 汪… III. 新药-汇编-世界-1996~
2000 IV. R97

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2006) 第 024139 号

世界上市新药

汪啸洋 主编

责任编辑: 余晓捷 孙小芳 陈燕杰

责任校对: 李 林

封面设计: 胡艳玮

*

化 学 工 业 出 版 社 出版发行
现代生物技术与医药科技出版中心

(北京市朝阳区惠新里 3 号 邮政编码 100029)

购书咨询: (010)64982530

(010)64918013

购书传真: (010)64982630

<http://www.cip.com.cn>

*

新华书店北京发行所经销

大厂聚鑫印刷有限责任公司印刷

三河市东柳万龙印装有限公司装订

开本 720mm×1000mm 1/16 印张 19¼ 字数 384 千字

2006 年 5 月第 1 版 2006 年 5 月北京第 1 次印刷

ISBN 7-5025-8416-1

定 价: 49.00 元

版权所有 违者必究

该书如有缺页、倒页、脱页者, 本社发行部负责退换

序

随着科学技术的飞速发展，药学研究领域也有较大的进展，每年国外都有许多新药上市，如何及时充分地了解并利用这些信息资源为我国人民防病、治病服务和加快我国药物研究的进程，已是广大医药卫生战线科研人员十分关注的问题。

《世界上市新药》一书针对这一问题，较为全面地介绍了国外上市的新药的化学结构、化学名称、性状和知识产权有关的药物基本信息；与药物临床应用有关的资料与评价以及国内外的参考文献。这些信息不仅为临床医药专业人员介绍了有用的用药参考资料，也为从事新药研究开发的技术人员提供了重要的研究信息。作者在此基础上不断总结国外上市新药的资料出版后，将会促进我国新药的应用和研发。

国内介绍国外新药的参考书已有不少，但像这样全方位地提供药物信息的尚不多见。收集和整理文献的工作非常艰辛，希望作者能坚持不懈地在形成自己特色的同时，为国为民多做贡献。

廖清江
2005 年 4 月

前 言

《世界上市新药》是介绍国外新上市药物的系列参考书，本书主要收集了近年来国外制药企业上市的药物共 145 个，2001 年及以后上市的药物正在编写当中，将陆续出版。

目前临床用药、药物手册以及新药介绍的书林林总总，作者从开始构思收集材料和着手编写此书开始，几次修改编写大纲和调整稿件项目内容，力图形成自身的特色和风格。总结起来，书中对所介绍的每种药物主要提供三部分的信息。第一部分是有关药物的基本信息，包括新药的中英文通用名、中英文化学名、英文商品名、药物的化学结构、性状、CA 登录号、专利号和所对应的化学文摘号以及知识产权状况分析。第二部分是药物应用方面的信息，主要有适应证、剂型规格、用法用量、药理作用、药动学、临床评价、不良反应及注意事项。第三部分是有关该药物的参考文献，注重选择该药物重要的和综合性评价方面的国内外参考文献。力图通过这三部分的介绍，为读者提供比较全面的新药研究开发和应用的信息及参考资料。

近年来上市的新药中，有很多是生物制品或生物技术药物，这些药物的有关资料少见介绍，很难收集齐全，故在本书编写过程中，有选择地收集和介绍了一部分，未能将这 5 年间所有新上市的生物技术药物逐个予以介绍，给本书留下了一些遗憾，我们将在本书后续的出版中努力加以弥补。

本书主要材料来源于《Drugs》、《Drugs of the Future》、《Drugs Today》等国外药物研究权威杂志。另外作者还有选择性地参考了一些国内外期刊、杂志，以期为读者提供最新的可靠和有价值信息资料。

此书可作为临床医师、药师及从事药学服务的专业人士的用药参考书，亦可作为高等院校、科研单位、医药企业从事新药研究和开发人员的参考资料。

在本书的资料收集和写作过程中，得到了许多同事、同行、好友及家人的支持和帮助，借此机会一并表示深深的谢意。

由于作者水平有限，在对大量资料进行阅读、理解和整理过程中，可能存在疏漏，恳请广大读者提出宝贵意见和建议。

汪嘯洋

2006 年 2 月于南京

内 容 提 要

本书主要介绍了国外制药企业新上市的药物共 145 个，对每个药物品种主要提供三部分的信息，第一部分是药物的基本知识，包括中英文通用名和化学名、英文商品名、化学结构式、性状、CAS 登录号、专利号和化学文摘号以及知识产权状况分析；第二部分是药物应用方面的信息，包括适应证、剂型规格、用法用量、药理作用、药动学、临床评价、不良反应及注意事项；第三部分是有关该药物的中英文参考资料。力图通过这三方面的介绍，为读者提供全面系统的新药研究开发和应用的信息。

本书可作为临床医师、药师以及从事药学服务的专业人士的用药参考书，亦可作为从事新药研发的科研院校和企业的参考书。

目 录

第一章 抗感染药物	1
阿巴卡韦	1
安普那韦	4
头孢卡品酯	6
头孢噻利	8
西多福韦	11
重组甲肝和乙肝混合疫苗	13
地拉韦啉	14
正二十二烷醇	16
依非韦伦	17
福米韦生	20
呋罗培南钠	22
加替沙星	24
格帕沙星	26
灭活的甲型肝炎疫苗	29
茚地那韦	30
Alfacon-1 干扰素	32
咪喹莫特	34
利奈唑烷	36
罗匹那韦-利托那韦联用制剂	38
莫西沙星	41
奈非那韦	43
奈韦拉平	46
奥司他韦	48
PEG 干扰素 a-2b	50
喷昔洛韦	52
喹奴普丁和达福普丁复方制剂	53
扎那米韦	56
第二章 抗炎药物	59
呱氨托美丁	59
塞来昔布	60
右酮洛芬	63

依那西普	65
来氟米特	66
氯诺昔康	69
美洛昔康	71
罗非昔布	73
第三章 抗寄生虫病药物	76
蒿乙醚	76
蒿甲醚与苯茚醇复合制剂	78
第四章 麻醉用药	81
顺曲库铵	81
左布比卡因	83
瑞芬太尼	84
罗哌卡因	86
第五章 中枢神经系统药物	89
阿莫普坦	89
布地品	90
多奈哌齐	92
恩他卡朋	93
磷苯妥英钠	96
加兰他敏	98
左乙拉西坦	100
洛美利嗪	102
米那普仑	104
那拉曲坦	106
奥氮平	108
普拉克索	110
喹硫平	111
瑞波西汀	113
利鲁唑	115
卡巴拉汀	116
利扎曲普坦	118
罗匹尼罗	120
他利克索	122
坦度螺酮	124
噻加宾	126
托卡朋	128
扎奈普隆	129

佐米曲普坦	131
第六章 心脑血管系统药物	134
阿雷地平	134
阿托伐他汀钙	136
坎地沙坦西来昔替酯	138
西尼地平	140
氯吡格雷	141
考来维仑	144
依普罗沙坦	146
埃替非巴肽	148
伊布利特	151
厄贝沙坦	153
乐卡地平	155
奈必洛尔	157
尼非卡兰	159
瑞替普酶	161
替米沙坦	162
替罗非班	165
缬沙坦	167
第七章 呼吸系统药物	170
非索非那定	170
左旋沙丁胺醇	172
咪唑斯汀	174
孟鲁司特钠	176
雷马曲班	179
塞曲司特	180
扎鲁司特	182
齐留通	184
第八章 血液和造血系统药物	187
阿那格雷	187
比伐卢定	188
第九章 生殖及泌尿系统药物	190
西曲瑞克	190
屈螺酮与炔雌醇复方避孕制剂	193
重组促卵泡激素 α	195
重组促卵泡激素 β	196
酚妥拉明	198

西地那非	200
托特罗定	203
第十章 消化系统药物	206
阿洛司琼	206
巴柳氮二钠	207
多拉司琼	209
乙溴替丁	211
艾司奥美拉唑镁	213
莫沙必利	215
雷贝拉唑钠	218
雷莫司琼	220
第十一章 降血糖药物	222
格拉胰岛素	222
重组赖脯人胰岛素	223
米格列醇	225
那格列奈	226
奥利司他	228
吡格列酮	231
瑞格列奈	234
罗格列酮	236
第十二章 抗骨质疏松药物	240
伊班膦酸	240
雷洛昔芬	241
利塞膦酸钠	243
替鲁膦酸二钠	246
曲美孕酮	247
第十三章 抗肿瘤药物	249
三氧化二砷	249
卡培他滨	251
依托泊苷磷酸酯	253
依西美坦	255
吉妥单抗	257
β -1a 干扰素	259
脂质体多柔比星	260
奥沙利铂	262
雷替曲塞	264
利妥昔单抗	266

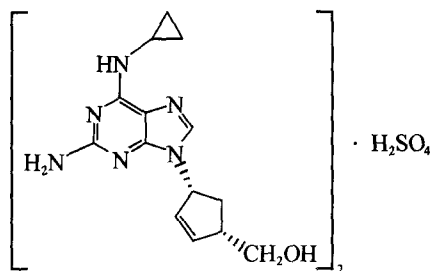
来昔决南钐 [^{153}Sm]	268
替莫唑胺	269
拓扑替康	271
曲促珠玛	273
第十四章 抗排斥反应药物	276
巴利昔单抗	276
贝卡普勒明	278
西罗莫司	279
第十五章 眼科用药物	282
溴莫尼定	282
拉坦前列素	283
替泊芬	285
第十六章 其他药物	288
达昔单抗	288
合多肽-1	289
他扎罗汀	290
沙利度胺	292
西布曲明	294
中文索引	297
英文索引	300

第一章 抗感染药物

阿巴卡韦 Abacavir

【商品名】 Ziagen™

【化学结构】



【化学名称】

(1S,4R)-4-[2-氨基-6-(环丙基氨基)-9H-嘌呤-9-基]-2-环戊烯-1-甲醇硫酸盐

(1S,4R)-4-[2-Amino-6-(cyclopropylamino)-9H-purin-9-yl]-2-cyclopentene-1-methanol sulfate sulfate

【性状】 游离碱为白色泡沫状固体, mp: 165°C。 $[\alpha]_D^{20} - 218.1^\circ$ ($c = 0.15$, CH₃OH)

【CA 登录号】 [188062-50-2], 游离碱 [136470-78-5]。

【化学文摘号】 CA 125: 87089

【专利号】 EN 173602, US 5034394, EP 349242

【知识产权状况】 中国专利申请日: 1998 年 11 月 12 日

中国专利公开日: 2001 年 2 月 28 日

【首创厂商】 英国 Glaxo Wellcome 公司。

【首次上市国家及时间】 1998 年 12 月在美国上市。

【适应证】 适用于抗 HIV-1 感染, 主要和其他药物 (拉米夫定和齐多夫定) 联用。

【剂型规格】 片剂: 每片含本品 300mg;

口服溶液剂: 含本品 20mg/mL。

【用法用量】 口服, 成人每次 300mg, 一日 2 次; 与其他抗逆转录病毒药物联合应用。青年和儿童 (3 个月~16 岁) 剂量按每次体重 8mg/kg 计, 一日 2 次 (最大剂量 300mg, 一日 2 次), 可与其他抗逆转录病毒药物同服。儿童可根据体重服用溶

液剂。

如一次剂量漏服，应尽快补服并按原来规定时间用一次药物。

【药理作用】 本品为新型强效的核苷 HIV 逆转录酶抑制剂。它的抗人免疫缺陷病毒活性等于或超过齐多夫定 (AZT)，而对周围血淋巴细胞和 MT-4 细胞培养中，本品的活性强度比 AZT 大 100 倍，其渗透到脑内和脑脊液的能力也与 AZT 相似，因此它在治疗中枢神经系统感染的艾滋病毒具有强效作用。在初期试验中，证明本品单独在培养细胞中有较强的抗艾滋病毒活性。当与其他抗艾滋病毒药物联用时，观察到更强的活性。因而主要作为抗 HIV 的联合用药，与 AZT (齐多夫定，Zidovudine)，3TC (拉米夫定，Lamivudine) 和 d4T (司他夫定，Stavudine) 合用有很好的协同作用。在联合培养和抗-CD₃ 实验系统中，对潜伏艾滋病毒感染的细胞，本品的活性比 AZT 或 3TC 都强。而这 3 种药物在实验中各有不同表现，因此最佳的方案是选择 3 种药物联合应用，以显示出强大的临床疗效。此外，还有研究证明，本品与蛋白酶抑制剂安普那韦 (Amprenavir) 联合对抗艾滋病毒有明显的活性。研究表明，本品的体内抗 HIV 活性比在体外预测的要强。这可能是由于其通过脱氧鸟嘌呤核苷三磷酸酯 (dGTP) 的类似物，从而发挥很强的抑制 HIV 逆转录酶作用。

另几项临床前研究也发现，本品可顺利地通过 BBB 进入脑部和脊髓液，而这些部位正是病毒常在的隐蔽所和病毒重要的复制储存器。这意味着本品可以到达通常抗 HIV 药物所不能到达的地方从而更有效的抑制 HIV 病毒。在小鼠腹腔注射本品 10mg/kg 给药后，0.5~2 小时测定药物在 CNS 中的浓度是血浆中浓度的 7%~8%，药物浓度以超过临床 IC₅₀ 的浓度被维持在脑中至少 1 小时。

【药动学】 本品口服给药后，吸收迅速而充分。成年人口服本品的绝对生物利用度约为 83%。

口服本品片剂 100mg, 300mg, 600mg, 900mg, 1200mg, AUC 值从低到高分布在 1.07~33.12h·μg/mL，峰浓度为 0.59~9.61μg/mL，达峰时间为 1.26~1.56 小时，半衰期为 0.89~1.51 小时，其中 300mg 的 AUC 为 (6.02±1.73)h·μg/mL，峰浓度 (3.0±0.89)μg/mL。给药后 2 小时在脑髓液达峰浓度，AUC 为 4347h·μg/L，主要经尿排泄。

本品的表观分布容积约为 0.8L/kg，可自由地向组织内穿透。本品在肝脏代谢，代谢产物经尿排出。

【临床评价】 本品作为抗 HIV 的联合治疗用药，一般与 AZT, 3TC 和 d4T 配合使用。

在一项随机双盲三期临床试验中，173 名 HIV 感染者服用本品 (300mg/次，一日 2 次)/AZT (300mg/次，一日 2 次)/3CT (150mg/次，一日 2 次)，对照组服用安慰剂/AZT (300mg/次，一日 2 次)/3CT (150mg/次，一日 2 次)，连续服用 16 个星期。在第 16 周测病毒 RNA，67% 的患者血液中无法测到病毒 RNA (RNA

拷贝数 <400 个/mL)。在4种药联用的鸡尾酒疗法中,选择13个急性和12个慢性感染者,服用本品(300mg/次,一日2次)/AZT(300mg/次,一日2次)/3CT(150mg/次,一日2次)/安普那韦(Amprenavir)(1200mg/次,一日2次),持续7个月。在第8,12,20周时,分别有14/20,8/12,5/8的患者血浆中病毒RNA含量降到100拷贝数/mL以下。CD4⁺细胞数量在第12周时,在急性患者中上升了172个/ μ L,在慢性患者中上升了126个/ μ L。整个临床试验中,本品耐受性和联合用药性均良好,除了少数患者发生超敏反应需停药。

【不良反应】 本品安全性良好,使用本品最主要的不良反应是过敏反应,有3%的患者由于过敏反应而停止用药,其中一些过敏反应会危及生命。过敏反应的早期症状包括发热、恶心、不适和皮疹,很像流感。本品其他常见的一般不良反应有头痛、恶心、呕吐、身体衰弱、皮疹、腹泻和/或腹痛,这些与过敏反应不同之处在于若继续用药,过敏反应会进行性恶化,停药则缓解。不良反应通常出现在治疗的第6周内。

用本品治疗儿童患者比使用拉米夫定、齐多夫定的不良反应更常见,包括恶心、呕吐、发热、头痛、贪食或厌食。

【注意事项】 由于本品可能引起严重的过敏反应,因此第一次应用和再次使用本品时都应当详细告知患者有关过敏反应的情况,一旦发生过敏反应症状或全身不适的感觉,患者应该立即停药并看医生。过敏反应症状通常发生于接受本品治疗过程的前6周内。

联合用药可能产生危及生命的超敏反应如发热、皮疹、胃肠道不适、呼吸系统症状,这时应立即停药,并做检查,如确认无法避免发生超敏反应,则终身停药。

发生过敏反应的患者以后不应再服本品,因为可能在几小时内发生更严重的症状甚至威胁生命。临床上应该建立过敏反应的详细登记,以便顺利地收集和报告这些不良反应。

对有肝脏疾病的患者(如乳酸酸中毒、肝肿大、脂肪性变性)应慎用本品。本品为妊娠C类药。

【参考文献】

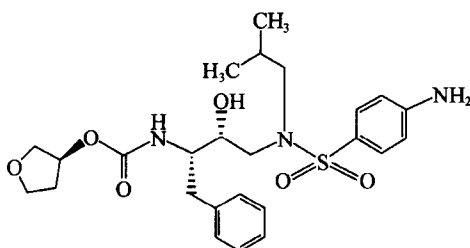
1. Daluge S M, LaFon S W, Good S S, St. Anti-HIV agent 1592U89 succinate-Progress from synthesis through clinical development. *Antiviral Res*, 1996, **30** (1); Abst 2.
2. Daluge S M, Good S S, Faletto M B, *et al.* 1592U89, a novel carbocyclic nucleoside analog with potent, selective antihuman immunodeficiency virus activity, *Antimicrob Agents Chemother*, 1997, **41**: 1082~1093.
3. Medowell J A, Symonds W T, Kumar P N. Initial phase I study of anti-HIV agent 1592U89 in a single-dose escalation design including food effect and dosage form evaluation, *35th Intersci Conf Antimicrob Agents Chemother*, 1995, Abst 1109.
4. Fischl M, Greenberg S, Clumeck N. Safety and activity of abacavir with 3TC/ZDV in antiretroviral naïve subjects, *12th World AIDS Conf*, 1998, Abst 12230.
5. Kost R, Cao Y, Vesanen M, *et al.* Combination therapy with abacavir, 141W94, and AZT/# TC in sub-

- jects acutely and chronically infected with HIV, *5th Conf Retroviruses Opportunistic Infect*, 1998, Abst 363.
6. Foster R H, Faulds D, Abacavir. *Drugs*, 1998, **55** (5): 729~736.
7. Staszewski S, Keiser P, Montaner J, *et al.* Abacavir-lamivudine-zidovudine vs indinavir-lamivudine-zidovudine in antiretroviral-naive HIV-infected adults: A randomized equivalence trial. *J Am Med Assoc*, 2001, **285** (9): 1155~1163.

安普那韦 Amprenavir

【商品名】 Agenerase™

【化学结构】



分子式: $C_{25}H_{35}N_3O_6S$ 分子量: 505.64

【化学名称】

[(1S,2R)-3-[[[(4-氨基苯基)磺酰基](2-甲基丙基)氨基]-2-羟基-1-(苯基甲基)丙基]氨基甲酸(3S)-四氢-3-呋喃酯

[(1S,2R)-3-[[[(4-Aminophenyl)sulfonyl](2-methylpropyl)amino]-2-hydroxy-1-(phenylmethyl)propyl]carbamic acid(3S)-tetrahydro-3-furanyl ester

【性状】 白色结晶性粉末; 无臭, 无味。易溶于水。

【CA 登录号】 [161814-49-9]

【化学文摘号】 CA 124: p359232a

【专利号】 EN 205414, WO 9405639, US 5585397

【知识产权状况】 2014 年专利到期。

【首创厂商】 英国 Glaxo Wellcome 公司。

【首次上市国家及时间】 1999 年在美国上市。

【适应证】 治疗 HIV 感染。常和其他抗病毒药物合用。

【剂型规格】 胶囊, 软胶囊: 每粒含本品 50mg, 150mg;

口服液: 含本品 15mg/mL。

【用法用量】 口服, 不受食物影响, 但高脂肪食物会降低本品的吸收, 应避免与高脂肪食物同服。本品胶囊对治疗 HIV 感染的成人和体重 $\geq 50\text{kg}$ 的 13~16 岁青少年的剂量为 1200mg/次, 一日 2 次; 对 4~12 岁的儿童和体重小于 50kg 13~16 岁的青少年剂量为 20mg/kg, 一日 2 次, 或 15mg/kg, 一日 3 次, 一日总剂量不得

超过 2400mg。

本品胶囊与口服液不具有生物等效性，因而不能在毫克基础上互换使用。口服液对 4~12 岁儿童和体重小于 50kg 13~16 岁的青少年剂量为 22.5mg/kg (1.5mL/kg)，一日 2 次或 17mg/kg (1.1mL/kg)，一日 3 次，总剂量不得超过 2800mg/d。

对于年龄 65 岁以上的老年患者应谨慎选择用药剂量，因为该年龄组更易出现肝、肾、心脏功能降低，死亡例数增多。

对于肝功能损伤的患者，应用本品应根据 Child-Pugh 分值进行调整：应用本品胶囊，对于 Child-Pugh 分值为 5~8 的患者剂量为 450mg/次，一日 2 次；9~12 的患者为 300mg/次，一日 2 次。肾功能损伤对本品的清除影响还待研究。

【药理作用】 本品为一种磺酰胺衍生物，为人免疫缺陷病毒 (HIV) 天冬氨酸蛋白酶抑制剂，用于抗 HIV 感染。本品通过抑制 HIV 病毒编码的蛋白酶，与 HIV-1 和 HIV-2 蛋白酶结合的 K_i 值分别为 0.6nmol/L 和 19nmol/L。对人天冬氨酸蛋白酶，如胃蛋白酶 $K_i = 3200\text{nmol/L}$ ，组织蛋白酶 D $K_i > 1000\text{nmol/L}$ ，肾素 $K_i = 1750\text{nmol/L}$ ，说明本品对病毒编码的天冬氨酸蛋白酶具有特异性，能抑制病毒编码的天冬氨酸蛋白酶，从而阻断 gag 和 gag 包膜多聚蛋白的加工，导致病毒无法处理 gag 和 gag-pol，从而使病毒失去活性，达到控制艾滋病的目的。本品与未处理的和部分处理的 gag 蛋白的出现以及完全处理过的核壳蛋白的消失的发生呈剂量依赖性，实验的 IC_{50} 值为 2.2nmol/L。

体外抗 HIV 活性：本品对病毒天冬氨酸蛋白酶的选择性比对人天冬氨酸蛋白酶高 5000 倍以上，对多种人细胞系的细胞毒性很小（平均毒性浓度 $> 50\mu\text{mol/L}$ ）。

本品具有特异性抗 HIV 病毒活性，在浓度 $\leq 100\mu\text{mol/L}$ 时，本品对其他几种病毒包括 I 型、II 型单纯疱疹病毒和水痘带状疱疹病毒没有抑制作用。

本品对 MT4 细胞 (T 细胞系) 和外周血淋巴细胞中的 HIV-I_{IIIB} 的半数抑制浓度 (IC_{50}) 分别为 $0.084\mu\text{mol/L}$ 和 $0.08\mu\text{mol/L}$ 。

病毒的耐药性：体外研究显示，HIV-1 蛋白酶底物结合部位密码子 50 的突变是导致病毒对本品耐药的重要因素。此突变使病毒对药物的敏感性降低约 2 倍，密码子 46 和密码子 50 的双突变使之降低 3~7 倍，而密码子 46，密码子 47 和密码子 50 的三突变则敏感性大约降低 14 倍。

【药动学】 口服本品吸收迅速，生物利用度可达 80% 以上。在人体内的终末半衰期约为 7.0~10.2 小时，迅速代谢为无毒产物排出体外。本品在 150~1200mg 的剂量范围内 $\text{AUC}_{(10-\infty)}$ 与剂量呈线性关系。单剂量给予 HIV 感染志愿者本品 1200mg，药物平均血浆浓度在给药后 8~12 小时仍比体外抗外周血淋巴细胞中 HIV-I_{IIIB} 的本品 IC_{50} 值高 10 倍以上。本品与人血浆蛋白结合率约 90%，其中主要是 α_1 -酸糖蛋白。从体内和体外动物实验的数据可知，本品的肝代谢有限，主要由胆汁排泄。

【临床评价】 单一使用一个抗病毒药, 不仅抗 HIV 效果有限, 而且容易产生病毒耐药株, 因此国际上早已不主张单剂使用以治疗艾滋病。本品可用于鸡尾酒疗法, 可与拉米夫定、齐多夫定和阿巴卡韦等药物制成复合制剂, 对抑制 HIV 具有较好的效果。

在一非盲观察性试验中, 35 例从未使用过抗逆转录病毒药物的患者日同服本品 1200mg/次和阿巴卡韦 300mg/次, 一日 2 次。28 例在 2~4 周后血浆中 HIV-1 RNA 水平比基线急剧下降。

在 II 期临床试验中, 80 例患者服用本品, 900, 1050, 1200mg/次, 一日 2 次, 并与齐多夫定和拉米夫定同服。此试验的最初数据显示, 高剂量组 (1200mg) 12 周后, 使病毒负荷基线降低了 $2.65\log_{10}$ 个拷贝/mL ($>99.8\%$)。13 例患者服用本品 1200mg/次加阿巴卡韦 300mg/次, 一日 2 次, 连续 16 周后 HIV-RNA 水平均下降 $2.42\log_{10}$ 个拷贝/mL, 其中 11 例患者 (占 85%) 检测不到病毒水平 (<400 个拷贝/mL)。

【不良反应】 本品的一般不良反应 $\geq 5\%$, 如恶心、腹泻、呕吐、感觉异常、皮疹 (包括 Stevens-Johnson 综合征)、情绪异常和味觉异常, 可因此中止用药。皮疹轻微无系统表现者可以不停药, 但严重的也可致命。对轻微至中度皮疹者停药后可再次使用本品。

【注意事项】 禁用于对其任何成分过敏的患者。严重的皮肤反应可能致命。可引起高血糖症, 对糖尿病患者应调整降糖药物剂量并监测血糖浓度。中度或严重肝损害患者慎用。本品可导致自发出血, 甲、乙型血友病患者慎用, 必要时需加止血药。本品属 C 类妊娠药。4 岁以下儿童和 65 岁以上老人慎用。使用本品需认真考虑与其他药物之间的相互作用, 严格在医生指导下使用。

【参考文献】

1. Murphy R L, Gulick R M, DeGruttola V *et al.* Treatment with amprenavir alone or amprenavir with zidovudine and lamivudine in adults with human immunodeficiency virus infection. *J Infect Dis*, 1999, **179** (4): 808~816.
2. Navia M A, Sato V L, Tung R D. Design of VX-478, a potent inhibitor of protease. *Int Antiviral News*, 1995, **3** (9): 143~145.
3. Adkins J C, Faulds D. Amprenavir. *Drugs*, 1998, **55** (6): 837~842.
4. FDA approves amprenavir, first new protease inhibitor in more than two years. *Daily Drug News. Com.* April 19, 1999.
5. Vertex and Glaxo Wellcome begin shipping new anti-HIV compound. *Daily Drug News. Com.* April 27, 1999.
6. HIV protease inhibitor AgeneraseTM now available in oral solution. *Daily Drug News. Com.* June 28, 1999.

头孢卡品酯 Cefcapene pivoxil

【商品名】 Flomox