

濟而剛錠 Ziagen Tablets

衛署藥輸字第022869號
本藥須由醫師處方使用

【**性狀與組成**】
Ziagen錠的主要成分為abacavir sulfate，每錠含量相當於abacavir 300mg。為雙凸面、膠囊形黃色刻痕錠，雙面印有GX 623字樣。
【**劑型**】
含刻痕的膜衣錠
【**適應症**】
用於抗反轉錄病毒組合療法，以治療成人及兒童之人類免疫缺乏病毒（HIV）感染。
【**用法、用量**】
治療必須由對處置HIV感染有經驗的醫師開始。
Ziagen可於飯後服用，也可空腹服用。
為確保能給予病患完整的劑量，理想狀況下，請吞服此錠劑，勿磨粉。
Abacavir具有口服液劑型，可供不適合服用錠劑之患者服用。或者，可將此錠劑磨粉加入少量半固體的食物或液體，並儘速服用（請見藥品動力學性質）。
• 成人及12歲以上青少年：
Ziagen之建議劑量為每日600毫克。這個劑量可以每日兩次300毫克(一顆錠劑)或者每日一次600毫克(兩顆錠劑)的方式投與。
• 3個月至12歲的兒童：
體重介於14-21公斤的兒童：一個剝半的Ziagen錠劑，一天兩次。
體重大於21公斤而小於30公斤的兒童：早上服用一個剝半的Ziagen錠劑，傍晚服用一個完整的Ziagen錠劑。
體重至少30公斤的兒童：應服用成人劑量，每日兩次300毫克。
體重少於14公斤的兒童及不適合服用錠劑之患者，可給予口服液劑型。
Ziagen的建議劑量為8mg/kg每日二次，每日最高劑量為600mg(兩顆錠劑或30毫升口服液劑型)。
• 3個月以下之嬰兒：
針對此年齡層的Ziagen使用的研究數據非常有限（請見藥品動力學性質）。
• **腎功能不全：**
腎功能衰竭之病患無須調整劑量（請見藥品動力學性質）。
• **肝功能不全：**
Abacavir主要由肝臟代謝。對於肝功能輕微受損的病人（Child-Pugh指數5-6），Ziagen的建議劑量為200mg，每天二次。在治療這些病人時，為了能夠降低劑量，應該使用Ziagen口服液。因為針對肝功能中度或嚴重受損病人的藥物動力學尚未被研究，因此Ziagen禁用於此類病人（請見藥物動力學性質）。
【**禁忌症**】
Ziagen不得用於已知對**abacavir、Ziagen錠或Ziagen口服液**中任何成分過敏之患者。
Ziagen禁用於**肝功能中度或嚴重受損病人**。
【**注意事項及警語**】
過敏（請見不良反應）：
大體而言，於篩選病患是否具有HLA-B*5701對偶基因之前實施的臨床試驗中，接受Ziagen之受試者約有5%出現過敏反應，其中有少數案例已被證實會致命。
• **風險因子**
研究顯示HLA B*5701基因質與abacavir過敏反應的風險顯著增加有關。在前瞻性的研究CNA106030 (PREDICT-1)中，治療前篩選HLA B*5701 基因質的病患並避免帶有 HLA B*5701 基因質的病患使用abacavir可以使臨床上可能的abacavir過敏反應發生率由7.8% (66 of 847)降低至 3.4% (27 of 803) (p<0.0001)。且由皮膚貼布試驗確認的過敏反應發生率從2.7% (23 of 842)降低至0.0% (0 of 802) (p<0.0001)。根據這個研究，估計帶有HLA B*5701基因質的病患中有48%到 61%將會在abacavir治療中發生過敏反應，而沒有HLA B*5701基因質的病患其發生比率則為0%到4%。
臨床醫師應該考慮對之前未曾使用abacavir的病患將HLA B*5701基因質篩選。對曾受過abacavir治療，且對治療可耐受但未知是否具有HLA-B*5701對偶基因的HIV感染者，再次使用abacavir治療前，亦建議先行實施HLA-B*5701對偶基因篩選(請參閱「中斷abacavir治療後的特殊考量」)。不建議帶有HLA B*5701基因質的病患使用abacavir，只有當潛在利益大於臨篩選時才應使用並且要有密切的醫療監督。
任何以abacavir治療的病患必須依據過敏反應的臨床診斷作臨床決策。即使沒有HLA B*5701基因質，因為潛在的嚴重或甚至致命的反應，如果臨床上不能排除過敏反應，永久停用abacavir且不再給予abacavir是很重要的。
• **臨床說明：**
過敏反應的特徵為出現涉及多重器官、系統的症状。大部分的病人有發燒和/或皮疹現象。
其他的過敏症狀可能包括疲勞，抑鬱，腸胃症狀如噁心、嘔吐、腹瀉或腹脹，呼吸症狀如呼吸困難、喉嚨痛或咳嗽，及不正常的胸部X光發現（顯著地局部浸潤）。Abacavir的過敏反應可能發生於治療的任何時刻，但通常發生在前六週。隨著療程的持續，症狀會惡化並有可能威脅病人生命。這些症狀通常會在停用abacavir後消除。
• **臨床處理：**
不論病患是否具有HLA-B*5701對偶基因，任何病人在出現過敏徵兆或症狀時必須立即向醫師求診。如經診斷為過敏反應，必須立即停用abacavir。在發生過敏反應後，絕不可再度使用Ziagen或其他任何包含abacavir的藥品（如KIVEXA, TRIZIVIR），因其將導致更嚴重的症狀迅速在數小時內重新出現，且可能包括威脅生命的低血壓或死亡。
為避免延後診斷並降低過敏反應的致命性，如無法排除過敏反應的可能性，應永遠停用Ziagen，即使這些症狀可能有其他的診斷（呼吸道疾病、類似感冒的疾病、胃腸炎或對其他藥物的反應）。縱使症狀在使用其他藥物治療後又重新出現，仍不應再使用Ziagen,或其他含有abacavir的藥物（如KIVEXA, TRIZIVIR）。
• **abacavir治療中斷後的特殊考量：**
不論病患是否具有HLA-B*5701對偶基因，若曾中斷任何含有abacavir的藥物之治療，而後考慮再度給予abacavir，應評估停藥原因並確定病人沒有過敏症狀。如無法排除過敏反應的可能性，則不應再次使用Ziagen，或其它包含abacavir的藥物（如KIVEXA, TRIZIVIR）。
有些罕見的報告指出，病患因先前的單一過敏症狀（皮疹、發燒／疲勞、腸胃症狀或呼吸症狀）中斷使用，重新再使用abacavir之後，出現過敏反應。如決定對於這些病患再次使用abacavir，只能在有直接醫療監視之下進行。
在極少數的情況下，過敏反應會發生在重新開始療程及先前無過敏反應的病人身上。如決定重新使用abacavir，只能在醫療照護隨時可得的情況下進行。
針對先前接受abacavir治療可耐受但未知是否具**有HLA-B*5701對偶基因**的病患，再度以abacavir治療之前，建議先實施HLA-B*5701對偶基因檢測。若檢測結果證實病患具有HLA-B*5701對偶基因，即不建議再度使用abacavir治療。除非治療效果可能高於過敏風險，且於嚴密的醫療監督下，才可考慮使用abacavir治療。
• **重要病患資訊**
醫師須確定病人完全得知下列有關過敏反應的資訊：
一 病人須明白abacavir過敏反應造成致命反應或死亡的可能性。以及若具有HLA-B*5701對偶 基因，發生過敏反應的風險會增加。
二 也必須告知病患，即使病患不具HLA-B*5701對偶基因，亦有可能對abacavir產生過敏反應。因此，任何病患若疑似出現對abacavir過敏的徵候或症狀，必須立即聯絡其醫師。
一 提醒對abacavir過敏的病人，不論其是否具有HLA-B*5701對偶基因，皆絕不可再使用Ziagen或任何包含abacavir的藥物（如KIVEXA,TRIZIVIR）。
• 為避免再度使用Ziagen，應要求發生過敏反應的病人將Ziagen交還藥師。
• 一旦停用Ziagen，特別舉因於可能的副作用或疾病，欲再次使用前須求診。
一 提醒病人閱讀包含在Ziagen包裝內之仿單。
• **乳酸性酸中毒/嚴重肝腫大脂肪變性**
已有報告指出，其中包括一些致命案例，乳酸性酸中毒及嚴重肝腫大、肝脂肪變性與抗反轉錄核甘類似物的使用有關，亦包括abacavir，不論是單一或合併使用。而這些主要的案例多發生在女性。
可作為乳酸性酸中毒指標的臨床特徵，包括一般的虛弱，厭食及不明原因的體重減輕，腸胃症狀及呼吸症狀（呼吸困難及呼吸促迫）。
對病患應提醒其小心使用abacavir，尤其是有著肝病危險因子的病人。對於出現臨床或檢驗值上發現可能的乳酸性酸中毒或是否為肝炎的病人（可能包括肝腫大及肝脂肪變性，即使未出現顯著的transaminase 升高），應中止使用abacavir的治療。
• **脂肪重分佈**
某些接受抗反轉錄病毒合併療法的病人中，觀察到體脂肪重新分佈和累積，包括腹部肥胖、背與頸部的脂肪腫大(水牛肩)、周邊消瘦、臉部消瘦、乳房腫大、血脂及血糖升高；這些症狀可能是個別出現或合併出現。
儘管所有類別的蛋白酶抑制劑及核苷類似物反轉錄酶抑制劑，都與一般歸類於像是脂質營養失調併發症等這些一項或多項的特殊不良事件相關，但資料顯示，每一類別的不同藥品間仍有各自不同的風險。
此外，脂質營養失調併發症有著多重因素的病原學，例如HIV疾病情況，較長的年齡及抗反轉錄病毒藥物治療時間的長短，都扮演了重要甚至可能是協同作用的角色。
長期而言，這些事件的結果目前並不清楚。
臨床試驗應包括脂肪重新分佈生理徵兆的評估。應注意血脂及血糖的測量。脂質失調應予妥善處理。
• **免疫重組併發症**
對於嚴重免疫不足的HIV感染病患，一開始使用抗反轉錄病毒藥物治療時，無症狀或殘餘的同機性感染所引起的發炎反應，都可能會引起或造成嚴重的臨床狀況或者是症狀的惡化。典型來說，在開始抗反轉錄病毒藥物治療的前幾個星期或幾個月內會觀察到如此的反應。相關的案例有巨細胞病毒視網膜炎、全身性及/或焦點的分枝桿菌感染及Pneumocystis jiroveci(P. carinii)肺炎。任何發炎反應都必須即時診斷，必要時則加以治療。自體免疫紊亂(例如葛瑞夫茲氏症[Graves' disease]、多發性肌炎症[polymyositis syndrome]、格林-巴利氏症[Guillain-Barre syndrome])亦曾被報導發生在免疫重組的情況下。然而，發生的時間變異很大，可能在開始治療的數個月後，有時可能為非典型的表現。
• **伺機性感染**
接受abacavir或任何其他抗反轉錄病毒藥物治療的病人，仍有可能發生伺機性感染及其他HIV感染的併發症。因此，病人應持續由有治療HIV相關疾病經驗的醫師密切觀察。
• **感染的傳染**
應告訴病人目前抗反轉錄病毒藥物治療，包括abacavir，並未被證實可以避免HIV經由性接觸或血液污染物傳染的風險。應持續保持警覺。
• **心肌梗塞**
為探討抗反轉錄病毒組合療法對病患的心肌梗塞發生率所設計的一個前瞻、觀察性流行病學研究中，在前六個月使用abacavir與心肌梗塞風險增加有關。據GSK資助之臨床研究的一項整合分析中，abacavir的使用並沒有觀察到心肌梗塞有風險過量的狀況。沒有已知的生物機制可以解釋潛在的風險增加。整體而言，由觀察性世代研究以及對照臨床試驗所得的資料並未確定abacavir治療與心肌梗塞風險的關係。
當使用抗反轉錄病毒療法，包括abacavir時，應該考慮心血管疾病的潛在風險並減少所有可更改的風險因子(像是高血壓、高血脂、糖尿病以及抽煙)。
【**交互作用**】
根據臨床試驗資料及已知的abacavir主要代謝途徑，與abacavir相關之藥物交互作用的可能性很低。Abacavir不會抑制由細胞色素P450 CYP 3A4醇酶媒介之代謝。體外試驗也證實，其不會與CYP 3A4、CYP 2C9或CYP 2D6酵素所代謝之藥物相互作用。臨床試驗未觀察到誘發肝臟代謝的現象。因此，其與抗反轉錄病毒之蛋白質酶抑制劑及其他主要經由P450代謝之藥物產生交互作用的可能性很小。臨床研究顯示，在abacavir、zidovudine、及lamivudine之間，並沒有具臨床意義的交互作用。
酒精：
同時授予酒精會改變abacavir的代謝，使abacavir的AUC增加41%。根據abacavir的安全性資料，目前不認為這些現象具臨床意義。Abacavir不會影響酒精的代謝。
Methadone：
在藥品動力學試驗中，methadone與每天兩次，每次600mg abacavir同時授予病人，顯示abacavir的Cmax降低35%，tmax延遲1小時，但其AUC不變。這些藥品動力學的改變不被認為具有臨床重要性。此項研究中，abacavir增加methadone的平均全身清除率達22%。對於大部分的病人，這項改變並不認為具有臨床相關性，然而，可能需要重新調整methadone的劑量。
Retinoids：
Retinoid化合物，例如isotretinoin，乃經由乙醇脫氫酶排出體外，其可能與abacavir產生交互作用，但尚未有相關研究。
【**懷孕與授乳**】
已在抗反轉錄病毒懷孕登記庫(the Antiretroviral Pregnancy Registry)內評估超過2000名懷孕暴露於Abacavir（請見臨床研究）。針對懷孕婦女並沒有足夠且設計良好的臨床試驗，因此人類於懷孕期間使用abacavir的安全性尚未確立。經由動物生殖研究，abavavir被認為與生育有關。因此，只有在對母體的利益大於可能對胎兒的危險性時，才可考慮在懷孕期間使用abacavir。
有些報告指出，當要兒或胎兒還在子宮中或即將臨盆之際，若母親使用核苷反轉錄酶抑制劑，可能是由於粒線體的機能障礙，導致輕微的及暫時性的血清乳酸升高。對於暫時性的血清乳酸升高，臨床相關性目前尚不清楚。還有其他極罕見的報告，關於發展遲緩、癲癇及其他神經學的疾病。然而，以上這些情況與核苷反轉錄酶抑制劑在懷孕或胎兒出生時的使用，其關係並未建立。這些發現不足以影響目前為防止垂直傳播HIV，而對孕婦使用抗反轉錄病毒療法的建議。
健康專家建議，感染 HIV 的婦女如果可能的話不要餵母乳，以免傳染HIV。當以配方乳餵養是不可實行的條件下，在考量於抗反轉錄病毒治療過程中哺餵母乳需適當當正式哺乳及給予母乳的指引。
在一個重複口服給予300毫克abacavir一天兩次(給予TRIZIVIR)的試驗中，其乳汁濃度與母體血漿比率為0.9。大部分嬰兒(9個其中的8個)未檢出abacavir(分析靈敏度為16ng/mL)。目前，其與血清中測得藥物濃度之臨床相關性尚屬未知。
【**對於開車及機械操作能力的影響**】
目前尚無證據顯示abacavir會影響開車或機械操作的能力。
【**不良反應**】
過敏反應(請見注意事項及警語)：
大體而言，於篩選病患是否具有HLA-B*5701對偶基因之前實施的臨床試驗中，約有5%之受檢者出現過敏反應，極少數案例已被證實是致命的。過敏反應的特徵為涉及多重器官/系統的症状出現。
幾乎所有發生過敏的病人都有發燒和/或皮疹（通常為斑丘疹或尋麻疹）的症狀，然而有的過敏反應沒有發燒和/或皮疹的發生。
在abacavir治療期間，任何時間點都可能發生這些症狀，不過通常會出現在開始治療的六週內（中位數是11天）。
過敏反應的徵候和症狀如下所列。過敏反應的發生機率10%以上者以底線顯示。
皮膚： **皮疹**（通常為斑丘疹或尋麻疹）
胃腸道： **噁心、嘔吐、腹瀉、腹脹、口腔潰瘍**

呼吸道： **呼吸困難、咳嗽、喉嚨痛、成人呼吸窘迫症候群、呼吸衰竭**
其他： **發燒、昏睡、不適、水腫、淋巴腺病變、低血壓、結膜炎、急性過敏反應**
神經/精神： **頭暈、感覺異常**
血液： **淋巴球減少**
肝/胰： **肝功能指數上升、肝炎、肝衰竭**
肌肉骨骼： **肌痛、罕見的肌溶解、關節痛、肌酸磷酸激酶濃度上升**
泌尿： **肌酸酐濃度上升、腎衰竭**
部分發生過敏的病人起初被認為是呼吸道疾病（肺炎、支氣管炎、咽喉炎）、類似感冒的症狀、胃腸炎或對其他藥物的過敏反應。過敏反應的延遲診斷將造成abacavir持續或再度使用，導致更嚴重的過敏反應或死亡。因此，應為出現這些症狀的病患小心診斷。過敏反應無法排除時，Ziagen或其他含有abacavir的藥物（KIVEXA, TRIZIVIR）都不應再使用。
持續治療會惡化這些過敏反應的症狀，而通常在停用abacavir之後，症狀即可解除。
發生過敏反應後，再度使用abacavir會導致症狀在數小時內迅速重現。重新出現的過敏反應常比原先的表現更嚴重，甚至包括有生命威脅的低血壓及死亡。不論病患是否具有HLA-B*5701對偶基因，有發生過敏反應的病患須停用abacavir，且絕不可再使用Ziagen或含有abacavir的其他任何藥物（KIVEXA, TRIZIVIR）。
罕見的報告指出，過敏反應會發生於因單一主要症狀（如皮疹、發燒、不適／疲勞、腸胃症狀或呼吸道症狀）停用Ziagen，而後再度使用的病人。
在極罕有的情形下，某些重新療程、且之前無過敏症狀的病人，會出現過敏症狀。
至於其他已有報告的不良事件，並不清楚它們究竟是與abacavir有關、與治療HIV疾病的眾多藥物有關，亦或是疾病過程的結果。
以下所列許多症狀（噁心、嘔吐、腹瀉，發燒，疲勞、皮疹）通常發生時會被視為abacavir的過敏症狀。因此，對於發現這些症狀的病人必須小心診斷，以評估是否為過敏反應。如果是由於發生任一過敏症狀而停用abacavir的病人，一旦欲再度使用abacavir，應於有直接醫療監督下進行。（見「注意事項及警語」－“abacavir治療中斷後的特殊考量”）
以下所列多數的副作用並不導致治療受限。以下是分類的定義：極常見(>1/10)、常見(>1/100，<1/10)、不常見(>1/1,000，<1/100)、罕見(>1/10,000，<1/1,000)，與極罕見(<1/10,000)。
臨床試驗資料
新陳代謝及營養失調
常見： **厭食**
神經系統失調
常見： **頭痛**
腸胃失調
常見： **噁心、嘔吐、腹瀉**
一般性失調及投藥部位不適
常見： **發燒、昏睡、疲勞**
在對照臨床研究中，與abacavir有關的檢驗值異常並不常見，從abacavir治療組與對照組觀察到的發生率沒有差別。
上市後資料
新陳代謝及營養失調
常見： **血內乳酸過多**
罕見： **乳酸性酸中毒(請見注意事項及警語)**
體內脂肪的重分佈或累積(請見注意事項及警語)，其發生率受多重因素所影響，包括抗反轉錄病毒藥物組合治療。
腸胃失調
罕見： **曾有胰臟炎之報告，但其與 abacavir的關係不明。**
皮膚及皮下組織失調
常見： **皮疹（未有全身性的症狀）**
極罕見： **多形紅斑、Stevens-Johnson syndrome、毒性表皮壞死溶解症**
【**過量**】
臨床試驗曾經將高達1200mg之單次劑量，以及高達1800mg之每日劑量給予病人，結果並沒有非預期的副作用報告。更高劑量的作用不明。
如果過量，應監測患者有無中毒跡象，必要時給予標準的支持性治療。目前不知可否以腹膜透析或血液透析排除Abacavir。
【**藥理性質**】
藥效學：
藥物治療學分類：核苷類似物(nucleoside analogue)，ATC代碼：J05A F06。
作用機轉：
Abacavir為核苷類似物反轉錄酶抑制劑。它是一種有效的選擇性抗病毒劑，對抗HIV-1及HIV-2，包括對zidovudine、lamivudine、zalcitabine、didanosine或nevirapine感受性降低的HIV-1分離株。Abacavir經由細胞內代謝，轉變成為具活性的carbovir 5'-triphosphate (TP)。體外研究顯示，和HIV有關的作用機轉為抑制HIV反轉錄酶，導致鏈終止、干擾病毒的複製循環。Abacavir在細胞培養中的抗病毒活性，當和核苷反轉錄酶抑制劑(NRTIs；如didanosine, emtricitabine, lamivudine, stavudine, tenofovir, zalcitabine或zidovudine)、或非核苷反轉錄酶抑制劑(NNRTI；如nevirapine)或蛋白酶抑制劑(PI；如amprenavir)併用時，並沒有產生拮抗作用。
在一項針對20名每日服用兩次Ziagen 300毫克，且在24小時採樣期間前只服用一次300毫克劑量之受HIV感染病患的研究中，穩定期之carbovir-TP的幾何平均末端細胞內半衰期為20.6小時，相較於本研究中abacavir的血中半衰期為2.6小時。在一項針對27名受HIV感染的病患所作的交叉研究比較每日服用一次Ziagen 600毫克與每日服用兩次Ziagen 300毫克的穩定狀態藥物動力學性質。就週邊血液單核細胞的細胞內carbovir triphosphate暴露量而言，每日服用一次Ziagen 600毫克，其AUC24.ss(32％, higher), Cmax 24.ss (99% higher)以及trough values (18% higher)，比每日服用兩次300毫克的療法要高。這些結果支持使用每日一次abacavir 600毫克治療受HIV感染病患。此外，每日服用一次Ziagen的療效與安全性已在一項重要的臨床研究(CNA30021- 請見臨床試驗)中被證實。
體外試驗曾選出對abacavir具抗藥性的HIV-1分離株，其與反轉錄酶密碼區（密碼子M184V、K65R、L74V及Y115F）的特定基因型變化相關。病毒對abacavir的抗藥性於體內及體外之發展相對較緩，與野生型病毒株相比，需要多次突變才能增加八倍IC50，才達到具有臨床相關的程度。
有抗藥性的病毒株也顯示對lamivudine、zalcitabine及/或didanosine的敏感度降低，但依舊對zidovudine及stavudine具敏感性。Abacavir與蛋白酶抑制劑或非核苷反轉錄酶抑制劑間的交叉抗藥性不太可能出現。初始使用abacavir、lamivudine 及zidovudine的治療失敗主要與M184V有關，因此須備有多重治療選擇供作二線療程。
Abacavir可進入腦脊髓液，目前顯示可降低腦脊髓液內HIV-1 RNA的量。在與其他抗反轉錄病毒藥物併用時，abacavir可能扮演防止HIV相關的神經性併發症的角色，也可能延遲在這個區域抗藥性的發展。
【**藥物動力學**】
吸收：
Abacavir的口服吸收良好、迅速。成人口服abacavir的絕對生體可用率約83%。口服錠劑後，達到abacavir最高血中濃度的平均時間（tmax）約1.5小時。服用錠劑或口服液劑的AUC並無觀察到差異。在治療劑量下（每次300mg，每日二次），abacavir錠劑的穩定狀態Cmax約為3 mcg/ml，而於12小時給藥間隔的AUC約為6.02 mcg.h/ml（每日的AUC約為12.0 mcg.h/ml）。使用劑量600mg的abacavir錠劑之後，abacavir的平均Cmax為4.26 mcg/ml以及平均AUC。為11.95 mcg.h/ml。
食物延遲吸收及降低Cmax，但並不影響整體血中濃度（AUC）。因此，Ziagen可與食物併服，亦可空腹服用。將磨碎的錠劑與少量半固體的食物或液體一起服用，並不會對藥物的品質造成影響，也不會對臨床效果造成改變。假設病患將磨粉的錠劑完全地並立即地服用，這項結論是根據活性成分之生理化學、藥物動力學特性及abacavir錠劑在水中之體外溶離反應。
分佈：
靜脈注射後，擬似分佈體積約為0.8L/kg，表示abacavir可自由進入身體組織。
對HIV感染者的研究顯示，abacavir具良好的腦脊髓液穿透性，腦脊髓液與血漿AUC比率介於30％至44％間。在第一階段藥物動力學研究，評估每日二次、每次300毫克的投藥後，abacavir進入CSF的穿透性。服藥1.5小時之後，abacavir於腦脊髓液內的平均濃度為0.14 mcg/ml。一項更進一步的藥物動力學研究顯示，每日兩次、每次600毫克的投藥後，abacavir於腦脊髓液內的平均濃度會隨著時間而增加，服用0.5小時至1小時後其濃度為0.13 mcg/ml，而3至4小時後則增為0.74 mcg/ml。尖峰濃度也許不會在四個小時之內達到，但觀察到的數值比abacavir的IC50（0.08 mcg/ml或0.26 micromolar）大9倍。體外血漿蛋白結合研究指出，abacavir在治療濃度下，僅低或中度（約49％）與人類血漿蛋白質結合。表示經由血漿蛋白質結合部位置換，而發生藥品交互作用的可能性很低。
代謝：
Abacavir主由肝代謝，約2%以原型由腎排出。人的主要代謝途徑為藉由乙醇脫氫酵素、尿苷酸化物酵素，產生5'-羧酸及5'-尿苷酸化物，其佔治療劑量的66%。代謝物則是經由尿液排除。
排泄：
Abacavir的平均半衰期約為1.5小時。口服多次abacavir（每次300mg、每日二次）的劑量後，無明顯藥物蓄積。Abacavir經肝代謝，其代謝物主由尿排出。尿中代謝物及abacavir原型約佔abacavir授予劑量的83%，其餘經糞便排出。
特殊病患族群：
兒童：
Abacavir口服液和錠劑給予兒童後，吸收良好、迅速。該兩種劑型的血漿avacavir暴露量在服用同劑量下是相同的。兒童依建議劑量服用口服液時，能達到與成人相似的血漿abacavir暴露量。兒童依建議劑量服用錠劑時，因其劑量按照體重換算後較口服液高，所以會比服用口服液的血漿abacavir暴露量高。(詳見用法用量)。小兒藥學研究已證實每日一次的劑量和分兩次服用相同總量的口服液和錠劑均能提供相似的AUC0-24，但每日一次的Cmax約為分兩次服用相同總量的1.6倍。關於3個月以下的嬰兒，尚無足夠的安全性資訊。有限的數據顯示，相較於給予較大幼兒的每次8mg/kg，小於30天的新生兒使用每次2mg/kg所得的AUC與其近似或較大。
老年人：
65歲以上老人尚無研究。當治療老年病患時，應注意其較常出現肝、腎及心臟功能下降的情形，同時注意其常同時罹患其他疾病、並使用其他的藥物。
腎功能不全：
Abacavir主由肝代謝，約2%以原型由腎排出。Abacavir在末期腎病病人的藥動學表現近似正常腎功能者，故腎功能不全者無須減量。
肝功能不全：
Abacavir主由肝代謝。曾於肝功能輕微受損的病人（Child-Pugh指數5-6）執行Abacavir的藥物動力學研究。結果顯示abacavir的AUC平均增加1.89倍，半衰期則增加1.58倍。肝臟疾病並未改變代謝物的AUC。然而，代謝物的形成及排泄比率卻降低了。
為達到未患有肝病病人之有效治療濃度，對於輕微肝功能不全的病人應給予每日兩次、每次200毫克的abacavir。對於中度或嚴重肝功能不全的病人目前並無藥物動力學的研究，因此這類病人嚴禁使用abacavir。
【**臨床研究**】
一項針對未受過abacavir治療的成人，執行48週的雙盲臨床研究中，透過初步的療效分析，abacavir、zidovudine、lamivudine的併用與indinavir、lamivudine、zidovudine的併用顯示出相同的抗病毒效果。接下來的分析中，對於血中毒病毒量HIV-1 RNA超過100,000 copies per ml的病人，在接受含有indinavir的併用療法後得到較好的效果。而血中毒病毒量HIV-1 RNA少於100,000 copies per ml的病人，則是對於兩種治療都有相同的反應。
另在一項針對770名受HIV感染且未接受治療之成人的多中心、雙盲、對照組研究(CNA30021)中，調查研究每日服用一次abacavir及lamivudine的治療方式。他們被隨機分配每日服用abacavir 600毫克一次或每日服用abacavir 300毫克兩次，且併用每日一次300毫克lamivudine及每日一次600毫克efavirenz。病人分別被分成：血中HIV-1 RNA≤100,000 copies/ml及>100,000 copies/ml。雙盲治療期間至少持續48週。結果摘要於下：
第48週之病毒性反應：血中HIV-1 RNA少於50 copies/ml、使用ITT的對象

對象	ABC 一天一次 + 3TC+EFV (n=384)	ABC 一天二次+3TC+EFV (N=386)
根據基礎值 RNA 之分類	—	—
≤100,000 copies/ml	141/217 (65%)	145/217 (67%)
> 100,000 copies/ml	112/167 (67%)	116/169 (69%)
總計	253/384 (66%)	261/386 (68%)

當與每日使用二次abacavir的治療組相較，不論是在全部或基礎值病毒數的次組中，每日使用一次的治療組並未顯示較差的結果。不良事件發生的機率在兩個治療組中是相似的。

嘗試以基因型分析評估所有關於病毒學上無效的問題（HIV RNA大於50 copies/ml）。在每日一次及每日兩次兩種治療組中都發現了低病毒學上無效(病毒讀數>50 copies/ml)之總體發生率。在接受含有indinavir的併用療法後得到較好的效果。而血中毒病毒量HIV-1 RNA少於100,000 copies/ml的樣本作為基因型的分析。這些因素導致只有小規模的樣本數。因此，無法在兩個治療組之間獲得確切結論。反轉錄酶鹼基酸殘餘物184—直以來最容易出現對NRTI的抗性相關突變(M184V或M184I)。次常發生的突變是L74V、Y115F及K65R突變則不常見。

一項針對孩童、非雙盲、比較NRTI併用療法（一組含未透露藥名的nelfinavir，一組未含nelfinavir）的研究顯示，abacavir & lamivudine治療組（73%）或 abacavir & zidovudine治療組（70%）與lamivudine & zidovudine治療組（44%）相較，在執行24週後，前兩組有較高比例的病人其體內的HIV-1 RNA量≤400 copies/ml。對於孩童使用大量的抗反轉錄病毒藥物療法，從abacavir、lamivudine及zidovudine的併用中觀察到一項程度不大但持續的影響。對於曾經接受過治療的病人，有益的程度將取決於前舊療法的性質與時間長短而定而定，而此舊療法常是為已對Abacavir產生交叉抗藥性的病人所設計。

抗反轉錄病毒懷孕登記庫(the Antiretroviral Pregnancy Registry)

抗反轉錄病毒懷孕登記庫已經收到超過2000筆在懷孕中有暴露於abacavir並最後順利生產的前瞻性報告，其中包含超過800筆暴露資料是在第一孕期，超過1100筆資料是在第二和第三孕期，而產生生育缺陷者分別為27筆和32筆。在第一孕期產生缺陷的盛行率為3.1%(95%信賴區間：2.0%，4.4%)，在第二和第三孕期為2.7%(95%信賴區間：1.9%，3.9%)。根據懷孕婦女的參考族群，觀察到生育缺陷的背景值為2.7%