

环磷酰胺〔典〕〔基〕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__E7_8E_AF_E7_A3_B7_E9_85_B0_E8_c22_313508.htm 药品名称环磷酰胺〔典〕〔基〕药物别名环磷氮芥，癌得量，CYTOXAN

，ENDOXAN，NEOSAR，CTX 英文名称Cyclophosphamide
类别烷化剂性状白色结晶或结晶性粉末（失去结晶水即液化），在室温中稳定。溶于水，但溶解度不大。水溶液不稳定，故应在溶解后短期内使用。易溶于乙醇。制剂注射用环磷酰胺：100mg；200mg。片剂：每片50mg。分子式成分本品是进入体内被肝脏或肿瘤内存在的过量的磷酰胺酶或磷酸酶水解，变为活化作用型的磷酰胺氮芥而起作用的氮芥类衍生物。抗瘤谱广，是第一个所谓“潜伏化”广谱抗肿瘤药，对白血病和实体瘤都有效。药理及应用本品在体外无活性，它主要通过肝的酶P450水解成酸磷酸胺再运转到组织中形成磷酰胺氮芥而发挥作用。环磷酰胺可由脱氢酶转变为羧磷酰胺而失活，或以丙烯醛形式排出，导致泌尿道毒性。属于周期非特异性药，作用机制与氮芥相同。对环磷酰胺的耐药实验动物模型中主要表现为：醛脱氢酶的活性增高；通过谷胱甘肽转移酶与谷胱甘肽结合；DNA的修复增加，在临床上耐药的机制正在研究，很多学者认为与多药耐药基因和P糖蛋白相关。环磷酰胺有粉针剂和片剂两种。环磷酰胺口服后易被吸收，生物利用度为74%~97%。约1小时后血浆浓度达最高峰。与血浆结合不足20%。在体内半衰期为4~6.5小时。在48小时内可由肾脏排出50%~70%（大部为代谢物仅10%为原形）。环磷酰胺大部不能透过血脑屏障，脑脊液中的浓

度仅为血浆的20%。临床适应证：环磷酰胺为目前广泛应用的烷化剂。对淋巴瘤、白血病、多发性骨髓瘤均有效，对乳腺癌、睾丸肿瘤、卵巢癌、肺癌、鼻咽癌、神经母细胞瘤、横纹肌瘤及骨肉瘤也均有一定疗效。贮存应避免高热（32以下）及日光照射。用法用量静脉注射，1次0.2g，1日或隔日1次；或1次0.6~0.8g（或500~1000mg/m²），每周静脉注射1次，一疗程总量8~10g。口服50~100mg每日2~3次，一疗程总量10~15g。注重事项骨髓抑制（最低值1~2周，一般维持7~10天，3~5周恢复）、脱发、消化道反应、口腔炎、膀胱炎，个别报告有肺炎、过量的抗利尿激素（ADH）分泌等。一般剂量对血小板影响不大，也很少引起贫血。此外，环磷酰胺可杀伤精子，但为可逆性。超高剂量时（>120mg/kg）可引起心肌损伤及肾毒性。肝肾功能障碍时可使CTX毒性加强，药酶诱导剂如巴比妥类、皮质激素、别嘌呤醇及氯霉素等对本品的代谢、活性和毒性均有影响，并用时应注重。本品的代谢物对尿路有刺激，故应用时应鼓励病人多饮茶水。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