

司莫司汀〔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\\_\\_E5\\_8F\\_B8\\_E8\\_8E\\_AB\\_E5\\_8F\\_B8\\_E6\\_c22\\_313554.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/313/2021_2022__E5_8F_B8_E8_8E_AB_E5_8F_B8_E6_c22_313554.htm) 药品名称司莫司汀〔典〕〔基〕 药物别名甲环亚硝脲，甲基-CCNU，me-CCNU 英文名称Semustine 类别烷化剂性状微黄带淡红色结晶性粉末，对光敏感。几不溶于水，溶于乙醇。25℃下放置3个月未见分解。口服胶囊在0℃密封贮放4~5年无变化。制剂胶囊剂：每胶囊10mg；50mg。分子式成分为洛莫司汀（CCNU）的甲基衍生物。作用机制与CCNU相同。药理及应用在多数实验肿瘤中作用于BCNU和CCNU相似，但对Lewis肺癌、小鼠自发乳腺癌、B16恶性黑色素瘤疗效优于BCNU及CCNU，而毒性则较低。治疗指数为这两药的2~4倍。为一周期非特异性药物，但对M期和G1/S期的细胞有较大的杀伤力。耐药研究表明此药的耐药与mdr基因无关，主要由于细胞内O6-烷基-鸟转移酶增高。此酶可在C-6位置鸟氨酸结合的氯乙基脱落，因之阻止交叉键的形成。而对卡莫司汀（BCNU）的耐药则是由细胞内的谷胱甘肽和谷胱甘肽S转移酶的增加。所以检测肿瘤内的O6-烷基-鸟嘌呤转移酶，可在一定程度上猜测此药的疗效。本品很可能在进入体内后水解成为近似CCNU的环己基而起作用。人服用<sup>14</sup>C标记的本品后在胃中迅速分解。服药后呕吐物和粪便中均无原药存在。将环己基及氯乙基分别标记的本品120~290mg/m<sup>2</sup>给病人服用，服后10分钟血浆中即可测到两部分物质，1~8小时吸收的环己基部分达到最高值，6小时氯乙基部分达到最高峰。血浆环己基 相t<sub>1/2</sub>为24小时， 相t<sub>1/2</sub>为72小时；氯乙基为36小时。服药30分钟

后在脑脊液中可测到的放射性约为血浆浓度的15% ~ 30%。约有47%的标记物在24小时中可从尿中回收，从粪便排泄的在5%以内，由呼气中排出的不足10%。本品服后以肝、肾、胃、肺、肠中分布浓度较高。临床适应证：与BCNU及CCNU相同，对黑色素瘤、恶性淋巴瘤、脑瘤、肺癌等有良好的疗效。和氟尿嘧啶并用，对直肠癌、胃癌和肝癌均有效。我国学者试用于各类晚期恶性肿瘤306例，总有效率31.5%，有效病种与国外者相同。贮存防潮，在25℃以下保存，长期保存最好放置于8℃以下。用法用量口服，1次100 ~ 200mg / m<sup>2</sup>，每6 ~ 8周给药1次；也可36mg / m<sup>2</sup>，每周1次，6周为1疗程。合并其他药物时可给75 ~ 150mg / m<sup>2</sup>，6周给药1次；或30mg / m<sup>2</sup>，每周1次，连给6周。注重事项与BCNU、CCNU一样，对骨髓、消化道及肝肾有毒性。口服后最早在45分钟可出现恶心、呕吐，迟者到6小时出现，通常在次日可消失。如在服药前给予止呕剂，或将服药时间改在睡前，均可减轻消化道反应。血小板减少低谷出现在服药后4周左右，白细胞减少的低谷出现在5 ~ 6周，持续6 ~ 10天。其他如口腔炎、脱发、肝功损伤均是轻度。3种亚硝脲类药物的中等毒性剂量为：本品225mg / m<sup>2</sup>相当于BCNU250mg / m<sup>2</sup>，CCNU130mg / m<sup>2</sup>。用药期间应定期检查血象。

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)