

异环磷酰胺〔典〕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\\_BC\\_82\\_E7\\_8E\\_AF\\_E7\\_A3\\_B7\\_E9\\_c22\\_313580.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/313/2021_2022__E5_BC_82_E7_8E_AF_E7_A3_B7_E9_c22_313580.htm) 药品名称异环磷酰胺

〔典〕药物别名和乐生，HOLOXAN，IFO 英文名称Ifosfamide〔 〕类别烷化剂制剂注射用异环磷酸胺：每瓶0.5g；1.0g；2.0g。分子式成分异环磷酰胺为磷酰胺类衍生物，已经合成多年，但直到80年代有了尿路保护剂美司纳（Mesna）后才进入临床。目前已在各国广泛应用，对多种实体瘤和某些白血病均有效，其抗癌谱与环磷酰胺不完全相同。药理及应用与环磷酰胺比较仅是一个氯乙基的位置不同，也是一种潜伏化药物，需要在进入体内经肝脏活化后才有作用。但有些重要的数量上的不同，可以解释其抗癌谱和毒性上与CTX的差异。IFO在肝脏水解过程较CTX慢，部分IFO在活化前经过脱氯乙基作用而形成氯乙醛和去氯乙基异环磷酰胺。这些代谢物无抗肿瘤作用，但有潜在细胞毒作用。而环磷酰胺只有很小部分去氯乙基化。所以血浆等效剂量异环磷酰胺3.5g / m<sup>2</sup>和CTX 1g / m<sup>2</sup>相等。IFO为双功能烷化基团，主要作用于DNA鸟氨酸N7位置，与CTX不同之处是IFO不形成去甲氮芥。IFO口服吸收良好，生物利用度接近100%。剂量为1~2g / m<sup>2</sup>时多数病人可耐受，但在较大剂量时病人呕吐严重，且有神经毒性。与血浆结合不足20%，排出半衰期为6h，主要以代谢物形式，只有15%~30%以原形由尿中排出，脑脊液浓度为血浆浓度的20%。连续5天给药可使IFO清除快，因而毒性减低而作用不减，尿中羟基异环磷酰胺的排出因人而异，所以必须应用尿路保护剂。临床适应证：骨及

软组织肉瘤、非小细胞肺癌、乳腺癌、头颈部癌、子宫颈癌、食管癌。贮存室温下保存，不能超过25℃。用法用量常用剂量为2.5~5.0g/m<sup>2</sup>，每日1次，静脉滴注，连续5天，每3~4周重复1次。最大剂量为18g/m<sup>2</sup>静脉滴注，连续4天。注重事项限制剂量提高的主要毒性为泌尿道刺激，如不给尿路保护剂有18%~40%可出现血尿。所以一般必须配合应用尿路保护剂美司纳及适当水化。肾毒性表现为血肌酐升高，高剂量时甚至可导致肾小管坏死。儿童长期应用异环磷酰胺可引起Fanconi综合征。所以肾功能不全的病人应慎用。剂量过高、肾功能不全和既往用过顺铂的病人可有神经毒性，常表现为昏睡、意识不清，常在药物治疗期内或停药后短期内出现。一般认为是异环磷酰胺去氯乙基后形成的氯乙醛引起。骨髓抑制也是剂量限制性毒性，白细胞和血小板下降常出现于给药后第8~12天。其他也可有恶心呕吐、脱发等。个别报告在高剂量可有肺炎和心脏毒性。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)