

卡莫司汀〔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_8D_A1_E8_8E_AB_E5_8F_B8_E6_c22_313588.htm 药品名称卡莫司汀〔典〕〔基〕 药物别名卡氮芥，氯乙亚硝脲，BCNU 英文名称Carmustine 类别烷化剂性状无色或微黄色结晶性粉末，无臭。溶于乙醇、聚乙二醇，不溶于水。熔点30~32（熔融时分解）。制剂注射液：为本品的聚乙二醇灭菌溶液，每支125mg（2ml）。分子式成分为亚硝脲类烷化剂，虽然其结构上有一个氯乙基，但化学反应与氮芥不同。由于能透过血胸屏障，故常用于脑瘤和颅内转移瘤。药理及应用现认为本品进入体内后，在生理条件下经过OH离子的作用形成异氰酸盐和重氮氢氧化物。异氰酸盐使蛋白质氨甲酰化，重氮氢氧化物生成正碳离子使生物大分子烷化。异氰酸盐可抑制DNA聚合酶，抑制DNA修复和RNA合成。产生DNA交叉链的第一步反应是使G-O6部位烷化，再在C-N1和G-N3之间以2碳键联生成链间交联。O6-烷基-鸟嘌呤（O6-A-G）转移酶可以除去第一步反应中生成的G-O6-烷基，从而防止交联的生成。缺少O5-A-G转移酶的细胞称为MER细胞，对亚硝脲类烷化剂敏感，而MER细胞则对其耐药，这是检测肿瘤的MER从而达到一定选择性化疗的基础。本品属周期非特异性药，与一般烷化剂无完全的交叉耐药。亚硝脲类药物的耐药与多药耐药基因（mdr）关系不大。本品注射后在血中的半衰期为1.5小时，第一相为6分，第二相为68分。注射后48小时有60%以降解产物形式由尿中排出。静脉注射后有相当部分进入脑脊液中，能透过血脑屏障。临床适应证：临床上主要用于脑瘤、恶

性淋巴瘤及小细胞肺癌，对多发性骨髓瘤、恶性黑色素瘤、头颈部癌和睾丸肿瘤也有效。用法用量静脉滴注，1日125mg（或100mg / m²），连用2天。使用时与生理盐水或5%葡萄糖液200ml混合，静脉滴注。注重事项不良反应主要为消化道反应及迟发的骨髓抑制，在用药后4~6周时白细胞达最低值。此外，对肝肾功能也有影响。高剂量时可引起迟发的骨髓抑制和肾功能损伤。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