

硫鸟嘌呤 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\\_A1\\_AB\\_E9\\_B8\\_9F\\_E5\\_98\\_8C\\_E5\\_c22\\_313638.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/313/2021_2022__E7_A1_AB_E9_B8_9F_E5_98_8C_E5_c22_313638.htm) 药品名称硫鸟嘌呤 英文名称Tioguanine 类别抗代谢药制剂本品为白色片：25mg、50mg、100mg。分子式成分化学名：2-氨基嘌呤-6(H)硫酮。分子式：C<sub>5</sub>H<sub>5</sub>N<sub>5</sub>S。分子量：167.19。药理毒理属于抑制嘌呤合成途径的常用嘌呤代谢拮抗药物，是细胞周期特异性药物，对处于S期细胞最敏感，除能抑制细胞DNA的合成外，对RNA的合成亦有轻度抑制作用。本品是鸟嘌呤的类似物，在人体内必需由磷酸核糖转移酶转为6-TG核糖核苷酸方具活性，本品的作用环节与巯嘌呤相似，此外，6-TG核糖核苷酸通过对鸟苷酸激酶的抑制作用，可阻止一磷酸鸟苷（GMP）磷酸化为二磷酸鸟苷（GPD）。本品经代谢为脱氧核糖三磷酸后，能掺入DNA，因而进一步抑制核酸的生物合成，巯嘌呤无此作用。本品与巯嘌呤有效交叉耐药，而与阿糖胞苷等药物合用，可提高疗效。药动学口服后吸收不完全，约30%。本品的活化及分解过程均在肝脏内进行，经甲基化作用转为氨甲基巯嘌呤或经脱氨作用转为巯嘌呤而失去活性，但灭活的代谢过程与黄嘌呤氧化酶无关，因而服用别嘌呤醇，对本品的代谢并无明显的抑制作用。一次口服，40%的药物在24小时内以代谢产物形式经尿液排出，尿中仅能测出微量的硫鸟嘌呤。适应症急性淋巴细胞白血病及急性非淋巴白血病的诱导缓解期及继续治疗期；慢性粒细胞白血病的慢性期及急变期。不良反应1、常见的毒性反应为骨髓抑制，可有白细胞和血小板减少；2、消化系统反应：恶心、呕吐、食欲减退等胃肠道反应及肝功能损害，可伴有黄疸；3、

开始治疗的白血病及淋巴瘤患者可出现高尿酸血症，严重者可发生尿酸性肾病；4、本品有抑制睾丸或卵巢功能的可能，引起闭经或精子缺乏，与药物的剂量和疗程有关，反应可能是不可逆的。相互作用本品有增加血尿酸含量的作用，因而和抗痛风药物同时使用时，须调节抗痛风药的剂量，以控制高尿酸症及痛风疾病；本品与其他对骨髓有抑制的抗肿瘤药或放射治疗合并使用时，会增强本品的效应，因而须考虑调节本品的剂量与疗程。用法用量成人常用量，口服，开始时每日2mg/kg或100mg/m<sup>2</sup>，一日一次或分次服用，如4周后临床未改进，白细胞未见抑制，可慎将每日剂量增至3mg/kg。维持量按每日2mg~3mg/kg或100mg/m<sup>2</sup>，一次或分次口服。联合化疗中75~200mg/m<sup>2</sup>一次或分次服，连用5~7日。注重事项已知对本品高度过敏的患者禁用。1、骨髓已有显著的抑制（血象表现有白细胞减少或血小板显著降低）。并出现相应严重的感染或明显的出血现象者，有肝、肾功能损害，胆道疾患者，有痛风病史，尿酸盐结石病史者，4~6周内已接受过细胞毒药物或放射治疗者均应慎用；2、用药期间应注重定期（每周）检查四周血象，检查肝功能，包括总胆红素，直接胆红素等，其它包括血尿素氮，血尿酸，肌酐清除率等；3、服用本品时，应适当增加水的摄入量，并使尿液保持碱性，或同时服用别嘌呤醇以防止患者血清尿酸含量的增高及尿酸性肾病的形成；4、本品可有迟缓的作用，因此在疗程中首次出现血细胞减少症，非凡是粒细胞减少症、血小板减少症、黄疸、出血或出血倾向时，即应迅速停药，当各实验值恢复后，可以小剂量开始服用。#093.有增加胎儿死亡或先天性畸形的危险，应避免在妊娠初期的3个月内服用

，哺乳期妇女慎用。 #093.小儿常用量，口服每日2.5mg/kg，一日1次或分次口服。 #093.老年患者对化疗药物的耐受性差，故用药时需加强支持疗法，并严密观察病情及可能出现的不良反应，及时调整剂量。 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)