

阿糖胞苷〔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__E9_98_BF_E7_B3_96_E8_83_9E_E8_c22_313667.htm 药品名称阿糖胞苷〔典〕〔基〕 药物别名Cytosine Arabinoside,CYTOSAR, ARA-C 英文名称Cytarabine 类别抗代谢药性状常用其盐酸盐，为白色晶末。极易溶于水。熔点189~195（分解）。制剂注射用阿糖胞苷：每安瓿50mg；100mg。分子式成分药理及应用为抗嘧啶药物，在细胞内先经脱氧胞苷酶催化磷酸化，转变为有活性的阿糖胞苷酸（Ara-CMP），再转为二磷酸及三磷酸阿糖胞苷（Ara-CDP及Ara-CTP）而起作用，主要用于急性白血病，但对少数实体瘤也有效。现认为本品主要通过三磷酸脱氧胞苷竞争，而抑制DNA多聚酶，干扰核苷酸参入DNA。并能抑制核苷酸还原酶，阻止核苷酸转变为脱氧核苷酸。但对RNA和蛋白质的合成无显著作用。属于一作用于S期的周期特异性药物，并对G1/S及S/G2转换期也有作用。本品口服吸收少，且易在消化系统内脱氨失活。静脉注射后迅速从血中消失，T_{1/2}为3~15分，消除相的T_{1/2}为2~3小时，药物在体内主要在肝中由苷脱氨酶催化脱氨，转变为无活性的阿糖尿苷。24天后从尿中排出70%~90%，主要为代谢物。静脉滴注药物可通过血脑屏障，脑脊液浓度为血浆中的40%，因脑脊液中脱氨酶含量低，其t_{1/2}长达2~11小时。相互作用：四氢尿苷可抑制脱氨酶，延长阿糖胞苷血浆半衰期，提高血中浓度，起增效作用。使用胞苷也有类似增效作用。本品可使细胞部分同步化，继续应用柔红霉素、阿霉素、环磷酰胺及亚硝脲类药物可以增效。在用药后6~8小时，再用6-MP

可加强对粒细胞白血病的疗效。本品不应与5-FU并用。临床适应证：Ara-C主要治疗急性白血病及消化道癌，对多数实体肿瘤无效。眼部带状疱疹、单纯疱疹性结膜炎也有一定疗效。贮存避光，严封，在冷处保存。干燥的药粉在22℃下可保存2年不变。配制好的注射液可在冰箱中保存7天，室温下仅能保存24小时。用法用量静脉注射，1次1~2mg/kg，每日1次，连用10~14天为一疗程。或4~6mg/kg，每周2次。也可静脉滴注，每日5~7.5mg/kg，点滴8~12小时，连用4~5天。皮下注射，多用于维持治疗，每次1~3mg/kg，每周1~2次。鞘内注射，每次25~75mg溶于生理盐水5~10ml中，隔日1次，共2次。预防脑膜白血病，每6周注射1次。注重事项骨髓抑制、消化道反应常见，少数病人可有肝功异常、发热、皮疹。用药期间应严格检查血象。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