

表阿霉素 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__E8_A1_A8_E9_98_BF_E9_9C_89_E7_c22_313748.htm 药品名称表阿霉素药物别名表柔比星，PHARMORUBICIN，E-ADM，EPI 英文名称Epirubicin〔 〕类别抗肿瘤抗生素性状桔红色粉末状结晶，可溶于水，在生理盐水中稳定。微溶于酒精，不溶于两酮、氯仿等。当pH为7时桔红色，如pH超过9则变成蓝紫色。其盐酸盐在4℃避光条件下至少可保存1年以上。冷冻干燥的制剂在室温中可保存3年以上。但在日光下、高暖和高湿度下不稳定，在碱性溶液中可迅速分解成有色素的混合物。制剂注射用表阿霉素：每安瓿10mg。分子式成分为阿霉素的同分异构体，4'位置上的羟基由顺位变为反位。经20余年的临床应用，证实其疗效与阿霉素相等，而毒性尤其是心脏毒性低于阿霉素。药理及应用作用机制是直接嵌入DNA核碱对之间，干扰转录过程，阻止mRNA的形成，从而抑制DNA和RNA的合成。此外，表阿霉素对拓扑异构酶Ⅱ也有抑制作用。为一细胞周期非特异性药物，对多种移植性肿瘤均有效。与阿霉素相比，疗效相等或略高。体内代谢与阿霉素相近，但有一些特点：在带瘤动物中给药后1、24、48小时，本品在心脏、脾脏的浓度以及48小时在肾脏的浓度低于阿霉素；在体内代谢、排出均较阿霉素快。血浆 $t_{1/2}$ 为30小时， $t_{1/2}$ 为 3.1 ± 4.8 分钟， $t_{1/2}$ 为1.3~2.6小时， $t_{1/2}$ 为20~40小时；而阿霉素为43小时。血浆清除率本品为1440ml/分，而阿霉素为880ml/分。本品与阿霉素一样主要经胆道排泄，48小时尿中排出10%，4天内胆道排出40%。其中绝大部分以原形及与葡萄糖醛酸的结合物排出。这种结合发生在本品氨基糖苷的第4位

置上的OH基，而在阿霉素则未发现这种结合，这可能部分地解释了本品排出较快，药物动力学不同及急性毒性较低的原因。90%以上与血浆蛋白结合。在血浆中和尿中可测出本品的主要代谢产物为表阿霉素醇，以及表阿霉素和表阿霉素醇与葡萄糖醛酸的结合物。其血浆清除率高，而排泄相对缓慢，表明其与组织广泛结合。本品不能透过血脑屏障。尿中排出为注射剂量的7%~23%，肾功能正常与否对本品的药代动力影响不大。但由于主要由肝胆系统排出，约占40%~45%，对有肝转移和肝功能受损的病人，本品在血浆中的浓度维持时间较长，故应适当减低剂量，一般可给半量。临床适应证：与阿霉素相同。贮存室温避光下保存。用法用量170~90mg/m²，静脉注射，每3周1次。注重事项与阿霉素相同，但毒副作用一般较轻，尤其是心脏毒性。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