

高三尖杉酯碱 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_AB_98_E4_B8_89_E5_B0_96_E6_c22_313781.htm 药品名称高三尖杉酯碱 英文名称homoharringtonine 类别抗肿瘤植物成分性状类白色或微黄色结晶性粉末或无定形疏松团体，味苦。有引湿性，遇光颜色变深。微溶于水，易溶于乙醇、氯仿。制剂注射液：每支1mg（1ml）；2mg（2ml）。分子式成分为从三尖杉科植物三尖杉（*cephalotaxus fortunei*）或其同属植物中得到的生物碱。三尖杉科三尖杉属植物共9种，其中8种产于我国。此属植物中含有多种生物碱，即三尖杉酯碱（harringtonine）、高三尖杉酯碱（homoharringtonine）、异三尖杉酯碱（isoharringtonine）及脱氧三尖杉酯碱（deoxyharringtonine），此外还提得非酯碱的三尖杉碱（即粗榧碱，cephalotaxine）等。国内研究了三尖杉（*c. forluncii*）、中华粗榧（*c. sinensis*）、海南粗榧（*c. hainanensis*）、篦子三尖杉（*c. omeii*）等种，提得的生物碱与国外报告者相似，并广泛开展了临床研究证实对白血病和淋巴瘤有效。目前高三尖杉酯碱已经美国nci组织的多中心临床试用，主要应用于急性非淋巴细胞白血病。在其他方面的应用尚在开发中。药理及应用高三尖杉酯碱对³H标记的门冬酰胺参入蛋白质有抑制作用，对³H标记的胸腺嘧啶核苷参入dna也有影响。高三尖杉酯碱还能诱导细胞分化，提高camp的含量，抑制糖蛋白合成。电子显微镜下可以看到染色质向核边缘集中、浓缩、形成染色体团块向核外膨出，发展成为与核分离的凋落小体，最后核碎裂。用³H标记物的高三尖杉酯碱静脉注射给大鼠，15分钟后放射性分布于肾、肝、骨髓、心、胃肠等。2小时后各脏器放射性明显降低，髓

中降低较缓慢。高三尖杉酯碱在血中的 $t_{1/2}$ 为2.1分钟， $t_{1/2}$ 为53.7分钟，24小时由尿中排出42.2%，粪中排出6.3%。其中原形药占15.9%。48小时自胆汁排出57.7%，原形药为20.2%。临床适应证：国内曾试用高三尖杉脂碱治疗急性粒细胞白血病44例，完全缓解者达27.3%，总缓解率为84.1%。与vcr、ara-c、泼尼松合用，可提高疗效。用于急性单核细胞性白血病及恶性淋巴瘤也有一定疗效。也可用于真性红细胞增多症、慢性粒细胞性白血病及早幼粒细胞性白血病等。用法用量静脉滴注，1日1~4mg，加于10%葡萄糖液250~500ml中，缓慢滴注，4~6日为1疗程，间歇1~2周后可再用。注重事项可有白细胞数下降，多数病人可以恢复。有时出现恶心、呕吐、厌食、口干等。曾引起心房扑动，应即停药。部分病例可见心肌损害。心律失常器质性心脏病、肝、肾功能不全患者慎用。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