

安吡啶 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_AE_89_E5_90_96_E5_95_B6_c22_313907.htm 药品名称安吡啶 英文名称Amsacrine 类别抗肿瘤激素类制剂注射剂：1.5ml：75mg。分子式成分化学名：N-[4-(9-吡啶氨基)-3-甲氧苯基]-甲基磺酰胺。分子式：C₂₁H₁₉N₃O₃S。分子量：393.47。药理毒理本品为第1个吡啶类抗癌药。作用机理类似于蒽环类，通过嵌入DNA而阻止其正常转录和合成，并通过改变细胞膜结构而阻止细胞增殖。细胞周期中S和G₂时相的细胞对本品最敏感。体外药效学试验表明，安吡啶对小鼠白血病L1210细胞及人肿瘤细胞株HCE及HEP均有较强的杀伤作用。小鼠体内抑瘤试验也证实，本品可显著抑制白血病L1210及S180肉瘤的生长。大鼠和犬的毒性试验表明，本品可导致骨髓抑制和肝脏损害等。此外，本品还有一定的致突变性和胚胎毒性，也可能具有潜在的致癌性。药动学本品可口服，但口服后吸收较差，通常经静脉给药。静注后可分布到全身各组织，以肝、脾、肾中浓度较高。在体内分布范围与柔红霉素相似，但在组织、细胞内存留积蓄较柔红霉素大。血清半衰期有两个时相，即 $t_{1/2}$ 为0.5h， $t_{1/2}$ 为6h左右。本品在肝内与谷胱甘肽结合而代谢，主要代谢产物经胆汁排泄。肾损伤病人清除半衰期稍增长，但严重肝功能障碍的病人则大大增长。适应症成人急性白血病、乳腺癌。本品对急性白血病的各种类型均有较好的治疗效果，在病人已对蒽环类化合物（如柔红霉素）或阿糖胞苷等产生抗药性后，本品仍可产生较好疗效。不良反应（1）主要是骨髓抑制，白细胞和血小板减少，故需注重预防和控制感染及出血；（2）消化道反应为食欲下

降、恶心、呕吐、腹泻、便血、粘膜炎、肝功能异常等；（3）有心脏毒性，静注剂量过大时有发生心脏停搏可能；（4）其它尚有脱发、静脉炎等。1次剂量稀释到150ml以上的液体中可避免发生静脉炎。相互作用不能与含有Cl⁻的溶液配伍，稀释时不能用塑料注射器。用法用量静滴：诱导剂量每日75mg ~ 125mg/m²，每5日为一疗程，每疗程间隔3周 ~ 4周。维持剂量为上述剂量的1/2，可每隔4周 ~ 8周重复1次。注重事项禁用于骨髓抑制患者。（1）本品遇氯离子易发生沉淀，全部输注过程中应避免与等渗盐水或其它含氯离子的器皿、溶液接触；（2）本品未经稀释前应避免接触塑料制品，包括注射器，最好用玻璃注射器吸药；（3）本品未稀释前应避免与皮肤或粘膜直接接触，以免可能发生的组织刺激性；（4）本品必须在有经验的医师指导和严密观察下使用。用药期间应每日查白细胞总数及其分类，必要时应查骨髓像；（5）肝肾功能不良时慎用，或需要调整剂量。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