

亚砷酸 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\\_\\_E4\\_BA\\_9A\\_E7\\_A0\\_B7\\_E9\\_85\\_B8\\_c22\\_313939.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/313/2021_2022__E4_BA_9A_E7_A0_B7_E9_85_B8_c22_313939.htm) 药品名称亚砷酸 英文名称Arsenious Acid 类别其他抗肿瘤药及辅助治疗药 分子式成分三氧化二砷 arsenious acid，本品主要成分为三氧化二砷，其分子式为 $As_2O_3$ ，分子量为198。本品为无色澄明液体，味微咸。药理毒理本品对急性早幼粒细胞白血病（APL）有一定疗效，其作用机制尚不明确。目前的研究显示，染色体t易位（15：17）是急性早幼粒细胞性白血病的重要细胞遗传学特征，该易位导致早幼粒细胞白血病基因PML和维甲酸受体 $\alpha$ （RAR $\alpha$ ）基因融合，表达PML-RAR $\alpha$ 蛋白，这种融合蛋白的过度表达是APL发病的主要机制之一，过度表达的PML-RAR $\alpha$ 可抑制细胞的分化凋亡。实验发现，三氧化二砷通过调节NB4细胞内PML-RAR $\alpha$ 的水平，使细胞重又纳入程序化死亡的正常轨道。经维甲酸预处理的NB4细胞，三氧化二砷诱导其发生凋亡的作用并没有受到影响，这说明该药以一种不依赖于维甲酸调节途径的方式在发挥作用，二者之间不存在交叉耐药。三氧化二砷可显著抑制人肝癌细胞株SMMC-7721细胞生长，其机制与诱导肝癌细胞发生凋亡有关，且凋亡呈剂量依靠性和时间依靠性。细胞周期分析显示，1  $\mu$ g/mL三氧化二砷作用24-72h，使该细胞生长阻止于G2/M期。经三氧化二砷处理4天的食管癌细胞株EC8712和EC1.71出现显著的凋亡特征，并表现为剂量和时间依靠关系。动物毒性试验结果表明：比格犬以0.1、0.3、3.0 mg/kg连续静脉注射给药90天，低、中剂量组动物在给药末期出现心率下降；高剂量组动物红细胞和血红蛋白均显著降低。停药时进行病理组织学检查见

该组动物多数出现肝细胞变性，少数发生肝细胞坏死，肾小球萎缩，肾小球囊内可见嗜酸性细胞、坏死细胞及炎性细胞浸润。睾丸中大部分曲细精管细胞层次减少、精子生成受抑制。药动学本品静脉给药，组织分布较广，停药时检测组织中砷含量由高到低依次为皮肤、卵巢、肝脏、肾脏、脾脏、肌肉、睾丸、脂肪、脑组织等。停药四面后检测，皮肤中砷含量与停药时基本持平，脑组织中含量有所增加，其他组织中砷含量均有所下降。8例APL患者的药代动力学参数显示，在开始静滴后4小时达到峰浓度，随即被血浆快速清除，每日尿砷排泄量约为每日药物剂量的1~8%。停药后尿砷即开始下降，停药1-2个月尿砷排泄可下降25~75%不等。适应症适用于急性早幼粒细胞性白血病。不良反应主要不良反应为皮肤干燥、丘疹、红斑或色素沉着，恶心，胃肠胀满，指尖麻木，血清转氨酶升高。相互作用在本品的使用过程中，未发现与其他药品之间有药物相互作用。用法用量成人一次5-10 mg，用5%葡萄糖注射液或0.9%氯化钠注射液500 mL稀释后静脉滴注，一日一次，4-6周为一疗程；儿童每次0.16 mg/kg，用法同上。尚未发现因亚砷酸注射液用药过量引起不良反应的报道。如使用本品过量引起急性中毒，可用二巯基丙醇（BAL）抢救。注重事项请在专科医生指导下观察使用。有肝、肾功能损害者慎用。使用过程中如出现肝、肾功能损害应即停药，并进行对症治疗，待恢复后再继续使用。如肝功能异常是因白血病细胞浸润所致者，应同时并用保肝治疗。对妊娠和哺乳的影响 孕妇禁用，哺乳期妇女用药的安全性尚不明确。对儿童的影响 未发现儿童用药引起异常情况的报道。对老年患者的影响 未发现老年患者使用本品引发异常情况。

的报道 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)