

依硫磷酸 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_BE_9D_E7_A1_AB_E7_A3_B7_E9_c22_313943.htm 药品名称依硫磷酸
药物别名氨磷汀 amifostine，Ethyol，WR-2721，YM-08310 英文名称Ethiofos 类别其他抗肿瘤药及辅助治疗药制剂粉针剂
：500 mg/瓶。分子式成分分子名：2-（3-氨基丙胺基）-乙硫醇磷酸酯。分子式：C₅H₁₅N₂O₃PS。分子量：214.22。药理
毒理氨磷汀是一种新的细胞保护剂。它是一种亲核性含硫的前体药物，通过膜碱性磷酸酯酶作用脱磷酸成为有活性的代谢物WR-1065(游离硫醇)而起作用。氨磷汀在肿瘤组织与正常组织中的蓄积量比约为1：50～100，这种分布不均匀性可能与肿瘤及正常组织中膜碱性磷酸酯酶活性和pH值不同有关。肿瘤组织多为厌氧代谢，pH值较低，膜碱性磷酸酯酶活性远低于正常组织；基于pH的不同，WR-1065更易被正常组织所吸收。其细胞保护作用正是依靠于这种正常组织中的高浓度来清除自由基，灭活活性的细胞毒药物如铂类及烷化剂等，而在肿瘤组织中，该药浓度较低，故对肿瘤组织无保护作用，且不影响放、化疗效果。氨磷汀能广泛地分布于正常组织，对许多正常组织、器官起着保护作用。动物实验、临床前及临床实验已经证实氨磷汀能预防多种化疗药物如铂类、烷化剂、紫杉特尔、氟脲嘧啶等对肾、骨髓、心脏、肺、外周神经等的毒性反应；对放疗所致的粘膜损伤、口干症也有较好的预防作用。1999年6月，被美国FDA批准为第一个用于减轻肿瘤患者因放疗引起的口干症的治疗药物。药动学肿瘤病人按体表面积静注本品740mg/m²或910mg/m²，15分钟能达到最大的血药浓度。本品在血浆中快速地被清除，其分布半衰

期 ($T_{1/2}$) 小于1分钟，排除半衰期约8分钟。本品在用药6分钟后仅有少于10%在血浆中残存，它被快速地代谢为活性的游离巯基化合物。一个二硫化合物的代谢产物随后生成，其活性弱于游离的巯基化合物。10秒钟内一次推注 $150\text{mg}/\text{m}^2$ 本品，原药、巯基化合物及二硫化合物的排出量在给药后的那段时期是很低的，分别是注射量的0.69%、2.64%、2.22%。静脉输注本品5~8分钟后，骨髓细胞中已发现游离的巯基化合物，用地塞米松或甲氧氯普胺预先处理，对本品的药代动力学无影响。适应症正常细胞保护剂，主要用于各种癌症的辅助治疗。在对肺癌、卵巢癌、乳腺癌、鼻咽癌、骨肿瘤、消化道肿瘤、血液系统肿瘤等多种癌症患者进行化疗前应用本品，可明显减轻化疗药物所产生的肾脏、骨髓、心脏、耳及神经系统的毒性，而不降低化疗药物的药效。放疗前应用本品可显著减少口腔干燥和粘膜炎的发生。不良反应主要不良反应为低血压，发生率约为57%，需注重监控；有时有恶心、呕吐；另外还有发热(39%)、打喷嚏(25%)、头昏(11%)、寒战(4%)等；还可以引起低钙血症，非凡是对于每日用药者，可能是由于抑制甲状旁腺功能所致，因此应注重补钙。对不能耐受者，下周期可适当减量。相互作用若以 $10\text{mg}/\text{ml}$ 氨磷汀的 $50\text{g}/\text{L}$ 葡萄糖注射液与 $50\text{g}/\text{L}$ 葡萄糖注射液溶解的 $7\text{mg}/\text{ml}$ 阿昔洛韦混合，则在强光下1h内可形成针状结晶，4h内室内光线下会变成不可见的微小结晶。若以 $10\text{mg}/\text{ml}$ 氨磷汀的 $50\text{g}/\text{L}$ 葡萄糖注射液与 $0.6\text{mg}/\text{ml}$ 两性霉素B的 $50\text{g}/\text{L}$ 葡萄糖注射液混合，立即变浑浊。用法用量化疗保护：推荐成人剂量为 $910\text{mg}/\text{m}^2$ ，于每个化疗周期开始前30min开始静脉注射，注射时间不少于15min。放疗保护：

在高剂量放疗前给予本品5 00 mg/m² 静脉注射，注射时间不少于15 min。 #093.过量使用最可能的症状是低血压，可给予静脉滴注0.9%氯化钠注射液等措施。注重事项 有低血压倾向者禁用； 本品能与顺铂迅速形成复合物，影响疗效，故两者应间隔15 min后使用，切勿混合注射； 对接受抗高血压治疗的患者，在用氨磷汀前24h应停用降压药物。 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