

唑来膦酸 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__E5_94_91_E6_9D_A5_E8_86_A6_E9_c22_313994.htm 药品名称唑来膦酸 英文名称Zometa 类别甲状旁腺及降钙代谢药制剂注射用粉末，含本品4mg。分子式成分[1-羟基-2(1H-咪唑-1-基)亚乙基]二膦酸 药理毒理由瑞士Novartis研发，于2000年10月在加拿大首次上市，2001年5月在英国上市。高钙血症最常见于晚期癌症，由与肿瘤活性相关的破骨细胞引起。高钙血症病人，破骨细胞加速骨吸收，释放过多的钙于血液，由于肾脏无法代谢过多的钙，高钙血症通常可导致严重脱水，引起死亡，它是一种与癌症相关的最常见的危及生命的代谢并发症。本品通过抑制破骨细胞的异常活性，使高钙血症病人严重升高的血钙浓度正常化。本品2、4、8、16mg单剂量输注药动学数据具有剂量依靠型，由静脉给药的本品经三相消除。本品经体循环快速双相消除，半衰期为 $t_{1/2}$ 0.23和 $t_{1/2}$ 1.75小时继之以终点半衰期为 $t_{1/2}$ 167小时的长相消除。唑来膦酸经肾脏以原型排出。在起初的24小时内， $44\% \pm 18\%$ 的给药量可从尿中检测到，其余主要与骨组织结合。随后缓慢释放进入全身循环再经肾脏消除。本品全身清除率为每小时 5.6 ± 2.5 ，与剂量无关，也不受性别、年龄、种族和体重的影响。输注时间从5分钟提高到15分钟，输注终点本品浓度下降30%，但不影响AUC。与其它双膦酸盐一样，唑来膦酸药动学参数的个体差异显著。同时，未见唑来膦酸与细胞组分的亲和力，其血浆蛋白结合率较低（约为22%），且与药物浓度无关。

【临床研究】有280例具溶骨性损伤的病人参加的一项随机对照试验证实：每月静注本品4mg的疗效和安全性，与每月静

注90mg的帕米膦酸二钠（Aredia）相当。在287例病人中进行的扩大临床试验表明，本品的疗效优于帕米膦酸二钠，且耐受性相似；与后者相比，本品能更快、更持久地使血钙水平恢复正常，更强的作用使其输注时间由后所需的2小时减少至15分钟。两项多中心试验将275例患者分成两组，一组接受5分钟以上的4或8mg本品以上输注，另一组接受90mg单剂量帕米膦酸二钠2小时以上输注。当疗程进行到第10天时，血钙浓度正常率，4mg本品组为88.4%；8mg本品组为86.7%；而90mg帕米膦酸二钠组则为69.7%。此外，本品组完全有效（保持正常血钙浓度）的持续时间也长于帕米膦酸二钠组；4mg本品组为32天，8mg本品组为43天；90mg帕米膦酸二钠组仅为18天。适应症治疗由肿瘤引起的高钙血症（TIH或HCM）。不良反应本品最常见的不良反应有（大于10%）发烧，常见的有（1%~10%）各类血细胞减少、精神错乱、恶心、疲惫、关节痛、心动过缓、肌酐升高、味觉倒错、口渴、低钙血症、低磷酸盐血症、潜在癌症恶化、便秘和呼吸困难。用法用量成人及老推荐量为4mg，单次静脉输注15分钟；轻中度肾损害者（血清肌酸酐小于400 μmol/L），无需调整剂量；严重损害者（血清肌酸酐大于400 μmol/L）者；仅在权衡利弊后才使用；儿童的安全性和有效性尚未确定。注重事项孕妇和哺乳妇女及对本品及赋形剂或其它双膦酸盐过敏者禁用。本品慎与氨基糖苷类合用。用药后应监测血清钙、磷酸盐和镁的水平。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