

亚叶酸钙〔典〕〔基〕 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\\_E5\\_8F\\_B6\\_E9\\_85\\_B8\\_E9\\_c22\\_313997.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/313/2021_2022__E4_BA_9A_E5_8F_B6_E9_85_B8_E9_c22_313997.htm) 药品名称亚叶酸钙〔典〕〔基〕 药物别名亚乙酸，甲酰四氢叶酸钙，Citrovorum Factor，Leucovorin，CF 英文名称CalciumFolinate 类别其他抗肿瘤药及辅助治疗药 性状微黄色至黄色结晶或无定形粉末，无臭。易溶于水及氢氧化钠溶液。制剂注射液：3mg；6mg；注射用亚叶酸钙：每支3mg；5mg；100mg。分子式成分为四氢叶酸的甲酰衍生物，本品无抗肿瘤作用，主要用于高剂量甲氨蝶呤滴注时解救和与氟尿嘧啶同时应用加强后者的治疗作用。药理及应用甲氨蝶呤的主要作用是在细胞内与二氢叶酸还原酶结合，阻断二氢叶酸转变为四氢叶酸抑制DNA的合成。亚叶酸钙进入体内后通过四氢叶酸还原酶转变为四氢叶酸，从而能有效地对抗甲氨蝶呤的作用。所谓高剂量甲氨蝶呤-亚叶酸钙解救（HD MTX-CF）疗法是应用比常规剂量高100倍以上的MTX静脉点滴（一般为2～5g/m<sup>2</sup>点滴4～6小时），使一段时间内血液中药物浓度达到较高水平，促使MTX进入细胞内，达到10<sup>5</sup>M以上的有效浓度。血中药物浓度的增高可以扩散到血运较差的实体瘤中，并可通过血脑、血眼和睾丸等生理屏障。因之高剂量MTX可以取得较好的疗效。但高剂量MTX可以引起致命的毒性反应，所以在MTX点滴后一定时间内必须采取解毒措施。CF解救一般在点滴结束后2～18小时开始。6～15 μg/m<sup>2</sup>肌注或静脉注射，每6小时1次，一般用药3天（12次）。CF的剂量及注射时间因MTX点滴的剂量和时间而定。一般根据MTX的血药浓度降到安全阈

以下，107M以下时停止。此外，还要水化、碱化和给予一定的支持治疗。这样应用的CF一般为6mg水针剂。另一应用是与氟尿嘧啶并用提高氟尿嘧啶的疗效。在DNA合成过程中脱氧尿苷酸（dUMP）需在胸苷酸合成酶（TMPS）的催化下接受四氢叶酸（THF）转来的甲基形成脱氧胸苷酸（dTMP）。这时，需要二氢叶酸还原酶使二氢叶酸转变为四氢叶酸。而氟尿嘧啶的主要作用机制是进入体内后先变为氟尿嘧啶脱氧核苷酸，抑制胸苷酸合成酶（TMPS）。在反应过程中TMPS与THF、dUMP三者形成一个过渡性复合物。一般反应结束后复合物分解，释放二氢叶酸、TMPS酶和dTMP。但在给予氟尿嘧啶后形成的三联复合物不能分解，酶的功能受到抑制，不能生成dTMP。而氟尿嘧啶脱氧核苷酸与酶的结合力与THF的浓度成正比，提高THF的供给可使氟尿嘧啶抑制TMPS酶的作用增强。临床上需用高剂量CF滴注，一般用法为200 ~ 500mg / m<sup>2</sup>静脉滴注2小时，在滴注后静注氟尿嘧啶370mg / m<sup>2</sup>，一般连用5天。21 ~ 28天可重复治疗。这种CF-5FU联合治疗方法在大肠癌的治疗中取得较好的疗效，对比研究证实优于氟尿嘧啶单用。相对来说氟尿嘧啶的不良反应增加不多。用法用量用于HD-MTX解救：每次6 ~ 15mg / m<sup>2</sup>，肌注或静注，每6小时1次，共用12次（3天）；用于与5-FU并用增效：每次200 ~ 500mg / m<sup>2</sup>，静滴，与5-FU合用，每日1次，连用5天。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)