

盐酸吉西他滨 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文
https://www.100test.com/kao_ti2020/314/2021_2022__E7_9B_90_E9_85_B8_E5_90_89_E8_c22_314050.htm 药品名称盐酸吉西他滨
药物别名健择 Gemzer 英文名称gemcitabine hydrochloride 类别
其他抗肿瘤药及辅助治疗药制剂粉针剂：200mg/瓶，1g/瓶分
子式成分2-脱氧-2, 2-盐酸二氟脱氧胞苷（ β -异构体）药理
毒理本品是细胞周期特异性抗代谢类药物，主要作用于DNA
合成期的肿瘤细胞，即S期细胞，在一定条件下，可以阻
止G1期向S期的进展；它对各种培养的人及鼠肿瘤有明显的
细胞毒活性，其抗癌活性与抗药的方式有关，如天天给药会
导致动物死亡，而抗癌活性很少，当每3~4d给1次药，在非
致死量时，对鼠的多种肿瘤均有很好的抗癌活性。吉西他滨
作为一种前药在细胞内是脱氧胸苷激酶磷酸化的良好底物，
在酶的作用下转化成下列代谢物：吉西他滨一磷酸盐
（dFdCMP）、吉西他滨二磷酸盐（dFdCDP）和吉西他滨三
磷酸盐（dFdCTP）其中dFdCDP和dFdCTP为活性产物
。dFdCDP抑制核糖核苷酸还原酶，从而减少了DNA合成的
修复所需的脱氧核苷酸的量（尤其是dCTP），低水平
的dCTP逆转了脱氧胸苷激酶正常的负反馈抑制，导致dFdCTP
更多的积聚。同时dFdCDP抑制了dCTP诱导的脱氧胞氨酶
对dFdCMP的脱氨作用，且dFdCTP直接抑制脱氧胞苷脱酶，
从而使更多的dFdCMP转化成活性代谢物dFdCMP的脱氨作用
，且dFdCTP直接抑制脱氧胞苷脱氨酶，从而使更多
的dFdCMP转化成活性代谢物dFdCDP，dFd-CTP而dFdCTP则
与dCTP竞争结合进入DNA链，插入至DNA链中脱氧胞苷的
位点，并答应鸟苷与其配对，吉西他滨分子就被此鸟苷掩蔽

使其免受核糖核酸外切酶的移除修复，然后DNA链合成停止，进而DNA断裂、细胞死亡。药动学本品在静注后，很快分布到体内各组织，输注时间越长，分布体积就越广、越深入，半衰期也就越长。在短时间的输注下，本品的T_{1/2}约为32~94min；在结束输注5min内，本品的血浆峰浓度为3.2~45.5 μg/ml；本品仅有少数与蛋白质结合，能被胞苷脱氨酸在肝脏、肾、血液和其他组织中快速、完全的代谢，只有不到10%的原药与代谢物从尿中排泄；它的总清除率为29.2~92.2L/(h.m²)与性别、年龄有关（个体差异为52.2%）。适应症非小细胞肺癌、胰腺癌、膀胱癌、乳腺癌及其他实体肿瘤。

不良反应

血液系统：有骨髓抑制作用，可出现贫血、白细胞降低和血小板减少。

胃肠道：约2/3的患者出现肝脏转氨酶异常，多为轻度、非进行性损害；约1/3的患者出现恶心和呕吐反应，20%的患者需要药物治疗。

肾脏：约1/2的患者出现轻度蛋白尿和血尿，有部分病例出现不明原因的肾衰。

过敏：约25%的患者出现皮疹，10%的患者出现瘙痒，少于1%患者可发生支气管痉挛。

其他：约20%的患者有类似于流感的表现；水肿/四周性水肿的发生率约30%；脱发、嗜睡、腹泻、口腔毒性及便秘发生率则分别为13%，10%，8%，7%和6%。

用法用量 成人使用本品推荐剂量为1000mg/m²，静脉滴注30min，1次/周，连续3周，随后休息1周，每4周重复1次，依据患者的毒性反应相应减少剂量。65岁以上的高龄患者也能对本品很好耐受，不需要调整剂量。

注意事项 对本药过敏的患者禁用。 孕妇及哺乳期妇女避免使用。 肝、肾功能损害的患者应慎用。 与其他抗癌药配伍进行联合或者序贯化疗时，应考虑对骨髓抑制作用的

蓄积。 滴注药物时间的延长和增加用药频率可增大药物的毒性，需密切观察，包括实验室的监测。 本品可引起轻度困倦，患者在用药期间应禁止驾驶和操纵机器。 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