

依西美坦 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__E4_BE_9D_E8_A5_BF_E7_BE_8E_E5_c22_314057.htm 药品名称依西美坦 药物别名可怡 英文名称exemestane 类别其他抗肿瘤药及辅助治疗药 制剂25mg/片。 药理毒理 乳腺癌是妇女最常见的高发肿瘤和最主要的肿瘤死因。据报道，现全球9个妇女中就有1个在她们一生中的某个阶段被确诊为乳腺癌患者，其中仅美国和欧盟国家新诊患者数就达12.8和16万人，每年因此而死亡的分别4.6和7万人。近年来我国乳腺癌患者逐年增加，已成为一种严重危害妇女健康的恶性肿瘤。依西美坦由意大利Pharmaela & Upjo公司研究开发，是迄今临床应用的唯一一个芳构酶灭活剂，本品于1999年4月在英国首次被批准上市，并陆续在美国、德国、瑞士和北欧国家上市，2000年8月31日也被加拿大准用于他莫昔芬治疗无效物绝经后妇女晚期乳腺癌的治疗。依西美坦凭借自身的疗效和特点，显示出深远的临床应用潜力，其不仅在雌激素受体阳性绝经后妇女转移性乳腺癌治疗方面被证实疗效优于现行标准二线药物醋酸甲地孕酮，目前亦已有一定数据表明它用作此类患者的一线和三线疗法也有效，尤其前者的作用似还优于现行标准一线药物他莫昔芬。依西美坦为甾体芳构化酶抑制剂，与其他的芳构化酶抑制剂相比，依西美坦具有以下特点；1) 不可逆地抑制芳构化酶的活性 本品与来屈唑 (letrozole)、阿那曲唑(anastrozole)等可逆性芳构化酶抑制不同，它和芳构化酶的结合是不可逆的，实属芳构化酶蛋白水平的性质有益于减少复发率。2) 对芳构化酶的选择性高，抑制作用强 依西美坦是特异性芳构化酶抑制剂，它竞争性且时间依靠性地抑制此酶的活性，且不

抑制5 α -还原酶的活性，也不与性激素受体结合。药动学其抑制人胎盘芳构化酶的IC₅₀为42.5nmol/l，为氨鲁米特(TC30为1754nmol/l)的1/40倍。酶失活曲线显示其灭活芳构酶的T_{1/2}为13.9min，K_i为26.3)疗效肯定，临床应用潜力大动物试验表明，依西美坦下注射和经口给药均抑制绝经腺癌模型中肿瘤的生长和新生瘤的产生。769例经他莫西芬治疗失败的绝经后妇女转移性乳腺癌患者进行的I期临床试验证实依西美坦的作用优于醋酸甲地孕酮；欧洲进行了一项比较依西美坦(25mg/天)和他莫昔芬(20mg/天)用作绝经后妇女乳腺癌一线疗法的II期随机试验，结果依西美坦的总有效率明显高于他莫昔芬，而副作用明显低于他莫昔芬；另外，依西美坦还可用于早期乳腺癌辅助疗法，欧美目前都在进行他莫西芬5年辅助疗法后继续用依西美坦进行辅助治疗的临床试验。4)服用方便，口服吸收迅速依西美坦是第一个口服有效的甾体类芳构化酶抑制剂，口服吸收迅速，达峰时间(T_{max})为1~2小时，峰浓度(C_{max})为17.7 μ g/l，药时曲线下面积(AUC)为41 μ g/h，食物不影响其药效，依西美坦的消除半衰期(T_{1/2})为24小时。5)副作用少，患者易于耐受本品可长期用药，每日只需服用一片(25mg)，因此用药方便，患者易于接受。用药理12周的临床试验表明，本品对精皮质激素、酮固酮、黄体生成素、雄激素等均无明显影响，也未发现其它严重的毒副作用。适应症治疗绝经后妇女晚期乳腺癌不良反应恶心、口干、便秘、腹泻、头晕、呕吐、腹痛、食欲增加、体重增加等。其次文献报道还有高血压、抑郁、焦虑、呼吸困难、咳嗽。其他还有淋巴细胞计数下降，肝功能指标(如丙氨酸转移酶等)异常等。在临床试验中，只有3%的病人由于不良

反应终止治疗，主要在依西美坦治疗的前10周内，由于不良反应后期终止治疗者不常见（0.3%）。用法用量一次一片(25mg)，一日一次，饭后服用，轻度肝肾功能不全者不需要调节给药剂量。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