

麦考酚酸酯 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__E9_BA_A6_E8_80_83_E9_85_9A_E9_c22_314112.htm 药品名称麦考酚酸酯
药物别名骁悉 CellCept 英文名称Mycophenolate mofetil 类别其他抗肿瘤药及辅助治疗药制剂胶囊：橙色与蓝色的双色胶囊，内容物为白色粉末。片剂：淡紫色薄膜衣片，除去膜衣后显白色或类白色。药理毒理霉酚酸酯(简称MMF)是霉酚酸(MPA)的2-乙基酯类衍生物。MPA是高效、选择性、非竞争性、可逆性的次黄嘌呤单核苷酸脱氢酶(IMPDH)抑制剂，可抑制鸟嘌呤核苷酸的经典合成途径。MPA对淋巴细胞具有高度选择作用。抑制淋巴细胞增殖所需的MPA浓度，对大多数淋巴细胞无抑制作用，MPA还能通过直接抑制B细胞的增殖来抑制抗体的形成。治疗量的MMF并不抑制多糖激活人外周血淋巴细胞产生白介素-1，也不抑制有丝分裂原激活的外周淋巴细胞合成白介素-1和其受体表达，这点也不同于环孢霉素、FK-506。此外，MPA介导的体外淋巴细胞三磷酸鸟苷的耗竭可抑制甘露糖和岩藻糖转化成糖蛋白。通过这种机制，MPA可降低淋巴细胞和单核细胞在慢性炎症部位的聚集。

药动学口服后迅速大量吸收，并代谢为活性成份MPA。口服平均生物利用度为静脉注射的94%(根据MPA曲线下面积)，口服后在循环中测不出MMF。肾移植病人口服MMF，其吸收不受食物影响，但进食后血MPA峰值将降低40%。由于肠肝循环作用，服药后6-12 hr将出现第二个血浆MPA高峰，与消胆胺同时服用将使MPA曲线下面积减少约40%，表明MPA通过肠肝循环的量很多。在临床有效浓度下，97%的MPA与血浆蛋白结合。MPA主要通过葡萄糖醛酸转移酶，代谢成MPA的

的酚化葡萄糖苷糖(MPAG)，MPAG无药理活性。MMF代谢成的MPA有极少量($lt.40\text{日}$)，平均曲线下面积(AUG)和血峰值(C_{max})比正常志愿者和移植肾功能稳定的病人约低50%。单剂研究显示，严重的慢性肾功能损害(肾小球滤过率 $\leq 10\text{ mL/min/1.73 m}^2$)，用药过量($gt.100\text{ }\mu\text{g/mL}$)，能清除小部分MPAG。MPA可通过药物排出增加(如给予消胆胺)而得到清除。注重事项对MMF或MPA发生过敏反应的病人不能使用本药禁用。服用本药的病人在第一个月每周1次进行全血细胞计数，第二和第三个月每月2次，余下的一年中每月1次，假如发生中性粒细胞减少(中性粒细胞绝对计数小于 $1.3 \times 10^3/\mu\text{L}$)时，应停止或减量使用本药，并对这些病人密切观察。严重慢性肾功能损害(肾小球滤过率小于 $25\text{ mL/min/1.73 m}^2$)的病人服用单剂量后，血浆MPA和MPAG的曲线下面积比轻度肾功能损害的病人及健康人高。应避免使用超过 1 g/次 ，每日2次的剂量，并且应对这些病人密切观察。肾移植后肾功能恢复的病人，平均0-12 hr MPA曲线下面积与正常恢复病人相仿。但MPAG的0-12 hr曲线下面积前者比后者高2-3倍。对这些肾功能延迟恢复的病人无须作剂量调整，但应密切观察。接受免疫抑制疗法的病人常使用联合用药方式。本药作为联合应用免疫抑制药物时，有增加淋巴瘤和其它恶性肿瘤(非凡是皮肤瘤)发生的危险。这一危险性与免疫抑制的强度和持续时间关，而不是与某一特定药物有关。免疫系统的过度抑制也可能导致对感染的易感性增加。临床试验中，本药已与以下药物联合应用：抗淋巴细胞球抗体、环孢素和皮质激素类药物，以预防排斥反应和治疗难治性排斥反应。对妊娠和哺乳的影响 动物实验中发现本药有致胎儿畸形的可能。尽管还未对孕妇作充分和良

好的对照研究，只有在本药的潜在优点超过对胎儿的潜在危险时方予应用。应在妊娠试验阴性后，才开始服用本药。服用本药期间，应采取有效避孕措施。对大鼠的研究发现MMF可通过乳汁分泌，是否可从人乳中分泌尚不清楚，并且，MMF能对哺乳期婴儿可能有潜在的严重副作用，应根据MMF对于母亲的重要性作出用药决定。对儿童的影响儿童使用该药的安全性和有效性尚未确证。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