

bexarotene 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\\_bexarotene\\_c22\\_314172.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/314/2021_2022_bexarotene_c22_314172.htm) 药品名称bexarotene药物别名Targretin，蓓萨罗丁 类别其他抗肿瘤药及辅助治疗药制剂本品为75mg口服明胶软胶囊制剂。分子式成分4-[1-(5,6,7,8-四氢-3,5,5,8,8-五甲基-2-萘基)乙烯基]苯甲酸 药理毒理由美国Ligand制药公司研制，2000年1月15日在美国首次上市。本品可选择性地结合并激活视黄酸类（retinoid）X受体亚型（RXR $\alpha$ ，RXR $\beta$ ，RXR $\gamma$ ）。RXR可与多种受体形成异二聚体。这些受体一旦被激活可控制基因的表达，控制细胞分化和增生。在体外试验中，本品可抑制某些肿瘤细胞系的生长；在动物模型体内试验中，本品可诱使乳腺癌消退。本品口服后，约2小时达血浆峰浓度，半衰期约为7小时。含脂食物可增加本品吸收，较之葡萄糖溶液，含脂食物可使300mg本品的AUC及Cmax分别上升35%和48%；本品可与血浆蛋白高度结合（99%）。在血浆中能测得本品的四种代谢产物：6-和7-羟基bexarotene以及6-和7-氧代bexarotene。体外试验显示细胞色素P450 3A4是对氧化产物形成及氧化产物葡萄糖醛酸化起主要作用的酶。经对 型糖尿病患者进行本品及本品代谢物肾消除过程的检测，目前认为本品主要大部分随胆汁消除，基本不随尿液排出。适应症口服治疗顽固性皮肤T-细胞淋巴瘤的皮肤症状。不良反应本品的多数不良反应与剂量有关，使用本品后大部分病人会出现高甘油三酯血症、高胆固醇血症及高密度脂蛋白水平低下，通常需要对症治疗或减少本品的用药剂量；此外，尚易发生中枢性甲状腺机能减退并需要治疗，还常发生头痛、虚弱、白细胞减少、贫血、感染、皮疹、

光敏反应和脱发。临床研究中约30%的病人停药；亦有转氨酶升高、致命性胰腺炎和致命性胆汁郁积的报道。用法用量治疗皮肤T-细胞淋巴瘤的推荐剂量为一日300mg/m<sup>2</sup>，与食物同服；若8周后尚未见疗效，则可增加剂量至一日400mg/m<sup>2</sup>，最佳治疗时间目前尚未确定。注重事项本品可对胎儿造成伤害，故孕妇禁用。在动物试验中本品可致睾丸萎缩。本品理论上与P450 3A4诱导剂或抑制剂可发生相互作用；已发现经P450 3A4代谢的吉非贝齐（gemfibrozil）可升高本品血浆浓度，这至少部分归因于吉非贝齐能抑制细胞色素P4503A4；本品与胰岛素、磺酰脲类、二甲双胍、曹格列奈或噻唑烷二酮（格列酮）类药物合用时可致低血糖。由于本品是一种VA衍生物，与VA合用可增加药物的毒性作用。对bexarotene或该产品的其他成分过敏者禁用。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)