

复习指导：阿糖胞苷使用方法执业医师资格考试 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/508/2021_2022__E5_A4_8D_E4_B9_A0_E6_8C_87_E5_c22_508054.htm

药理：药效学 本品为主要作用于细胞S增殖时相的嘧啶类抗代谢药物，通过抑制细胞DNA的合成，干扰细胞的增殖；对单纯疱疹病毒、牛痘病毒的繁殖及免疫反应亦均有抑制作用。阿糖胞苷进入人体后经激酶磷酸化后转为阿糖胞苷三磷酸及阿糖胞苷二磷酸，前者能强有力地抑制DNA聚合酶的合成，后者能抑制二磷酸胞苷转变为二磷酸脱氧胞苷，从而抑制细胞DNA聚合及合成。本品为细胞周期特异性药物，对处于S增殖期细胞的作用最为敏感，对抑制RNA及蛋白质合成的作用则十分轻微。

药动学 口服吸收量少，又极易被胃肠道粘膜及肝脏的胞嘧啶核苷酸的脱氨作用而失去活性，故不宜口服。可经静脉、皮下、肌肉或鞘内注射而吸收。静脉注射后能广泛分布于体液、组织及细胞内，静脉滴注后约有中等量的药物可透入血脑屏障，其浓度约为血浆浓度的40%。本品在肝、肾等组织内代谢，在血及组织中很容易被嘧啶核苷酸迅速脱氨而形成无活性的尿嘧啶阿拉伯糖苷。在脑脊液内，由于脱氨酸含量较低，故其脱氨作用较缓慢。静脉给药时， $T_{1/2}$ 为10~15分钟， $T_{1/2}$ 为2~2.5小时；鞘内给药时， $T_{1/2}$ 可延至11小时。在24小时内约10%以阿糖胞苷，90%以尿嘧啶阿糖胞苷为主的无活性物质形式从肾脏排泄。

适应症：适用于急性淋巴细胞及非淋巴细胞白血病的诱导缓解期及维持巩固期；慢性粒细胞白血病的急变期。本品亦适用于恶性淋巴瘤。

用法用量：1.成人常用量 诱导。静脉注射每日按体重2mg / kg，连

用10日，如无明显不良反应，剂量可增大至每日按体重4mg/kg；静脉滴注每日按体重0.5—1mg/kg，持续1—24小时，连用10日，如无明显不良反应，剂量可增大至每日按体重2mg/kg。维持。完全缓解后改用继续治疗量，方法为按体重1mg/kg，每日皮下注射1—2次。

2.小儿常用量诱导。皮下、肌肉或静脉注射，每日按体表面积100mg/平方米连用57日。

[制剂与规格]注射用盐酸阿糖胞苷100mg 静注：一次1-3mg/kg（相当于成人50-150mg），一日1次，连用10-15日。或4-6mg/kg，每周2次。静滴：5-7.5mg/kg，点滴8-12小时，连用4-5天。皮下注射：用于维持治疗，1-2mg/kg，每周1-2次。治眼病毒感染，50mg静滴，隔日1次，总量150-300mg，同时用本品滴眼剂及氯霉素滴眼。

禁用慎用：（1）本品有增加胎儿死亡及先天性畸形的危险，故应避免在妊娠初期的3个月内使用。哺乳期妇女慎用。（2）由于老年人对化疗药物的耐受性差，用药需减量并注意根据体征等及时调整药量。

百考试题网站整理（3）下列情况应慎用；骨髓抑制、白细胞及血小板显著减低者、肝肾功能不全、有胆道疾患者、有痛风病史、尿酸盐肾结石病史、近期接受过细胞毒药物或放射治疗。

给药说明：（1）使用本品时，应适当增加患者液体的摄入量，使尿液保持碱性，必要时可同用别嘌醇以防止血清尿酸增高及尿酸性肾病的形成。（2）快速静脉注射虽引起的恶心、呕吐反应较严重，但对骨髓的抑制较轻，患者亦更能耐受大的阿糖胞苷剂量。（3）用药期间应定期检查：周围血象、血细胞和血小板计数、骨髓涂片以及肝肾功能。

不良反应：（1）对造血系统可有白细胞及血小板减少，严重者可发生再生障碍性贫血。（2）白血病、淋巴瘤患者

治疗初期可发生高尿酸血症，严重者可发生尿酸性肾病。

(3) 较少见的有口腔炎、食道炎、肝功能损害、血栓性静脉炎。胃肠道反应，恶心，呕吐，食欲不振。骨髓抑制，白细胞及血小板减少，贫血。发热，脱发，皮疹，可引起肝损害。可有过敏反应，头痛，烦躁不安，心律失常。此药大剂量可发生可逆或不可逆的小脑综合征。418例用此药36~48g/平方米，35例(8%)发生严重的不可逆转的小脑毒性作用，死亡4例(1%)，50岁以上者比青年人易发生小脑综合征。有报告每天给与10mg/kg总量达40mg/kg可发生周身强直、言语凌乱、肌阵挛性反射及较明显的震颤。此药可引起肝脏中心静脉及肝小叶静脉闭塞，导致黄疸、肝肿大、腹痛、腹水及脑病。此药引起肝细胞坏死是罕见的。有些患者可发生高胆红素血症及氨基转移酶升高。此药可引起口炎，应用大剂量常出现眼毒性作用，它也可致有男性生殖功能失常。

"#F8F8F8" 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