

复习指导：氟胞嘧啶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_ti2020/510/2021_2022__E5_A4_8D_E4_B9_A0_E6_8C_87_E5_c22_510156.htm 药理：药效学 本品穿透进入真菌细胞内转变为具有抗代谢作用的5-氟尿嘧啶，后者可取代尿嘧啶进入真菌的脱氧核糖核酸，从而阻断其核酸和蛋白质的合成。本品对真菌有选择性毒性作用，在人体细胞内并不能大量地将5-氟胞嘧啶转换为5-氟尿嘧啶。药动学 本品自胃肠道吸收迅速而完全。广泛分布在肝、肾、脾、心和肺组织中，其浓度约等于或大于同期血药浓度；炎症脑脊液中药物浓度约可达血药浓度的50~100%，本品也可进入感染的腹腔、关节腔和房水中。血清蛋白结合率很低。口服2g后2~4小时血药浓度达峰值，为30~40 μg/ml。T_{1/2}为2.5~8小时。约有给药的80~90%的药物不吸收随粪便排出。本品可经血液透析排出体外。适应症：适用于治疗念珠菌和隐球菌等敏感菌株所致的全身性真菌感染。用法用量：口服，每日按体重0.1-0.15g/kg，分4次服。[制剂与规格]氟胞嘧啶胶囊（1）0.25g（2）0.5g 口服，一日50-150mg/kg，分3-4次给药，疗程数周至数月。[用法]口服：1日4-6g，分4次服，疗程自数周至数月。静注，1日量50-150mg/kg，分2-3次单用本品时真菌易产生耐药性，宜与两性霉素B合用。[制剂]片剂：每片250mg；500mg.注射液：2.5g（250ml）。禁用慎用：动物实验有致畸作用，虽在人类中尚未证实有此问题存在，但因本品在体内部分可转变为5-氟尿嘧啶，孕妇使用必须权衡利弊。下列情况应慎用：骨髓抑制、血液系统疾病、或同时接受骨髓抑制药物；肝功能损害；肾功能损害，尤其

是同时接受两性霉素B或其他肾毒性药物时。肾功能损害者药物的消除半衰期明显延长，无尿患者可延至85小时，因此宜减量及延长给药间期，并应测定血药浓度调整用药。有肝病者不宜应用。肾功能损害者应用本品时需减量。恶性血质失调及骨髓储备力减少的病人，用此药应小心。多发性骨髓瘤、肾功能不全或有骨髓病的病人用此药有特殊危险性。妊娠妇女尤其是妊娠早期者，除非有绝对指征，一般不宜应用。

给药说明：单用本品在短期内可产生真菌对本品的耐药菌株。如单次服药量较大时，宜间隔一定时间（如15分钟）分次服用，以减少恶心和呕吐等不良反应。肾功能损害者药物的消除半衰期明显延长，无尿患者可延至85小时，因此宜减量及延长给药间期，并应测定血药浓度调整用药。定期进行透析治疗的患者，每次透析后按体重应补给37.5mg/kg一次剂量。

用药期间进行下列检查：造血功能，需定期检查周围血象；肝功能，定期检查血清氨基转移酶、碱性磷酸酶等；

肾功能，定期测定尿常规及血尿素氮和肌酐；根据病情需要监测血药浓度，最高不宜超过100 μg/ml，以50-75 μg/ml为宜，血药浓度过高（>100 μg/ml）者，易发生血液系统、肝脏等不良反应。不良反应：（1）本品可引起恶心、呕吐、腹泻和皮疹；较少见者有精神错乱、幻觉、头痛、头晕和嗜酸粒细胞升高。（2）本品可致肝毒性，大多表现肝功能改变，如血清转氨酶的升高引起血清胆红素升高及肝肿大者甚为少见；偶有发生肝坏死者。（3）本品可致白细胞或血小板减少，偶可发生全血细胞减少、骨髓抑制和再生障碍性贫血。合用两性霉素B者较单用本品者为多见，此类不良反应的发生与血药浓度过高有关。转氨酶及碱性磷酸酶升高。可

引起胃肠道症状。白细胞及血小板减少，贫血。可引起肾损害，头痛，视物模糊（复视），听力损害，运动障碍，皮疹，血清钾及钙磷值下降。[神经系统]有报告可发生末梢神经炎。[消化系统]少数病人应用本品可发生恶心、腹胀、腹泻，严重者可有呕吐，6%左右的病人发生严重腹泻，有报告出现肝功能异常，主要为轻度血清转氨酶或碱性磷酸酶升高，其发生率为5%，这些改变并不伴有临床症状。有报告血清胆红素升高和肝肿大，以上反应均属可逆。个别有报告：1例肝活检发现有肝细胞坏死；2例死于肝萎缩。肝毒性反应的发生与本品的高血浓度有关[泌尿系统]本品对肾脏无明显毒性反应，但因大部份自肾排泄，故在肾功能损害者应用本品时需减量，以免产生过高血浓度。[造血系统]本品可引起白细胞及血小板减少，偶可发生严重的全血细胞减少，骨髓抑制和再生障碍性贫血。白细胞和血小板减少一般均属可逆，在减量或停药后迅速恢复正常。[过敏反应]偶见引起过敏反应如皮疹和发热，一过性丘疹及荨麻疹曾有报道。相互作用：

（1）与两性霉素B联合应用有协同作用，两性霉素B也可增强氟胞嘧啶的毒性，此与两性霉素B可使真菌细胞摄入药物量增加以及肾排泄受损有关。（2）同时应用骨髓抑制药可增加毒性反应，尤其是造血系统的不良反应。本品与两性霉素B合用，可增加临床疗效，但毒性也有所增强。"#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