

# 紫杉醇注射液说明书

【药品名称】 通用名：紫杉醇注射液 英文名：Paclitaxel Injection 汉语拼音：Zishanchun Zhushuye 本品化学名称为：5 $\beta$ ，20-环氧-1，2 $\alpha$ ，4，7 $\beta$ ，10 $\beta$ ，13 $\alpha$ -六羟基紫杉烷-11-烯-9-酮-4，10-二乙酸酯-2-苯甲酸酯-13-[(2' R, 3' S)-N-苯甲酰-3-苯基异丝氨酸酯

## 【药品名称】

通用名：紫杉醇注射液

英文名：Paclitaxel Injection

汉语拼音：Zishanchun Zhushuye

本品化学名称为：5 $\beta$ ，20-环氧-1，2 $\alpha$ ，4，7 $\beta$ ，10 $\beta$ ，13 $\alpha$ -六羟基紫杉烷-11-烯-9-酮-4，10-二乙酸酯-2-苯甲酸酯-13-[(2' R, 3' S)-N-苯甲酰-3-苯基异丝氨酸酯其结构式为：

分子式：C<sub>47</sub>H<sub>51</sub>N<sub>0</sub>O<sub>14</sub>

分子量：853.92

【性状】本品为无色至淡黄色的澄明黏稠的液体。

## 【药理毒理】

本品是新型抗微管药物，通过促进微管蛋白聚合，抑制解聚，保持微管蛋白稳定，抑制细胞有丝分裂。体外实验证明紫杉醇具有显著的放射增敏作用，可能是使细胞中止于对放疗敏感的G<sub>2</sub>和M期。

## 【药代动力学】

静脉给予紫杉醇，药一时曲线呈二室模型。本品蛋白结合率89%~98%。紫杉醇主要在肝脏代谢，随胆汁进入肠道，经粪便排出体外(>90%)。经肾清除只占总清除的1%~8%，紫杉醇在肝肾功能不全的病人体内代谢尚不明确。

## 【适应症】

卵巢癌和乳腺癌及非小细胞肺癌(NSCLC)的一线 and 二线治疗。对于头颈癌、食管癌，精原细胞瘤，复发非何金氏淋巴瘤等有一定疗效。

## 【用法用量】

为了预防发生过敏反应，在紫杉醇治疗前12小时和6小时均分别口服地塞米松20mg，治疗前30~60分钟肌注或口服苯海拉明50mg，静注西咪替丁300mg或雷尼替丁50mg。单药剂量为135~200mg/m<sup>2</sup>，在粒细胞集落刺激因子(G-CSF)支持下，剂量可达250mg/m<sup>2</sup>。将紫杉醇用生理盐水、5%葡萄糖或5%葡萄糖生理盐水稀释成0.3~1.2mg/ml溶液，静滴3小时。联合用药剂量为135~175mg/m<sup>2</sup>，3~4周重复。

## 【不良反应】

1. 过敏反应：发生率为39%，其中严重过敏反应发生率为2%。多数为1型变态反应，表现为支气管痉挛性呼吸困难，荨麻疹和低血压。几乎所有的反应发生在用药后最初的10

分钟。

2. 骨髓抑制：为主要剂量限制性毒性，表现为中性粒细胞减少，血小板降低少见，一般发生在用药后 8~10 日。严重中性粒细胞减少发生率为 47%，严重的血小板降低发生率为 5%。贫血较常见。

3. 神经毒性：周围神经病变发生率为 62%，最常见的表现为轻度麻木和感觉异常，严重的神经毒性发生率为 6%。

4. 心血管毒性：可有低血压和无症状的短时间心动过缓。30%有心电图异常改变。

5. 肌肉关节疼痛：发生率为 55%，发生于四肢关节，发生率和严重程度呈剂量依赖性。

6. 胃肠道反应：恶心，呕吐，腹泻和黏膜炎发生率分别为 59%，43%和 39%，一般为轻和中度。

7. 肝脏毒性：有 ALT，AST 和 AKP 升高。

8. 脱发：发生率为 80%。

9. 局部反应：输注药物的静脉和药物外渗局部的炎症。

#### 【禁忌】

禁用于：

1. 对本品或其它用聚氧乙烯蓖麻油配制的药物过敏者。

2. 白细胞低于  $1.5 \times 10^9/L$  严重骨髓抑制者。

3. 怀孕和哺乳妇女。

#### 【注意事项】

1. 为预防有可能发生的过敏反应，紫杉醇治疗前应用地塞米松，苯海拉明和 H<sub>2</sub> 受体拮抗剂进行预处理。

2. 配制紫杉醇时必须加以注意，宜带手套操作。倘若皮肤接触本品，立即用肥皂彻底清洗皮肤，一旦接触粘膜应用水彻底清洗。

3. 静脉注射时一旦药液漏至血管外应立即停止注入，局部冷敷和以 1%普鲁卡因局封等相应措施。

4. 本品滴注开始 1 小时内，每 15 分钟测血压、心率和呼吸一次，注意过敏反应。

5. 滴注紫杉醇时应采用非聚氯乙烯材料的输液瓶和输液器，并通过所连接的过滤器，过滤器的微孔膜应小于 0.22 微米。

6. 紫杉醇浓缩注射液在静脉滴注前必须加以稀释，可用生理盐水、5%葡萄糖或 5%葡萄糖生理盐水稀释，最后稀释浓度为 0.3~1.2mg/ml。

7. 本品应在有经验的肿瘤化疗医师指导下使用，患者必须住院，注射本品前须备有抗过敏反应的药物及相应的抢救器械。

#### 【孕妇及哺乳期妇女用药】

紫杉醇在动物实验中证实影响胚胎生长，故孕妇禁用。育龄妇女，治疗期不宜怀孕。

### 【药物相互作用】

1. 由于奎奴普汀/达福普汀是细胞色素 P450-3A4 酶抑制剂，同时给药可增加本药血药浓度。
2. 与特拉珠玛合用，特拉珠玛的血清谷浓度水平增加约 1.5 倍。临床试验证明二者合用效果较好。
3. 顺铂可使本药的清除率降低约 1/3，若使用顺铂后再给本药，可产生更为严重的骨髓抑制。
4. 与阿霉素合用，研究表明先给本药 24 小时持续滴注，再给阿霉素 48 小时持续滴注，可明显降低阿霉素的清除率，加重中性粒细胞减少和口腔炎。
5. 使用本药后立即给予表阿霉素，可加重本药毒性。
6. 酮康唑可抑制本药的代谢。
7. 磷苯妥英、苯妥英可通过诱导细胞色素 P450 而降低本药作用。
8. 使用本药时接种活疫苗(如轮状病毒疫苗)，可增加活疫苗感染的风险。国外资料建议使用本药时禁止接种活疫苗。处于缓解期的白血病人，化疗结束后间隔至少三个月才能接种活疫苗。

**【药物过量】**尚无相应的解毒药。用药过量最主要的、可预测的并发症包括骨髓抑制、外周神经毒性及黏膜炎。

**【规格】**5ml：30mg。

**【贮藏】**遮光，密闭，25℃以下保存。

**【包装】**

**【有效期】**

**【批准文号】**

**【生产企业】**

企业名称：

地 址：

邮政编码：

电话号码：

质量咨询：

传真号码：