

核准日期：2007年05月14日

修改日期：2015年03月16日

修改日期：2015年11月25日

注射用紫杉醇脂质体说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用。

【药品名称】

通用名称：注射用紫杉醇脂质体

商品名称：力扑素

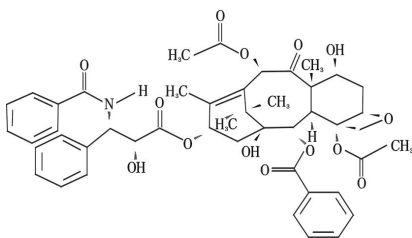
英文名称：Paclitaxel Liposome for Injection

汉语拼音：zhushheyong zishanchun zhizhiti

【成份】本品的主要成份为紫杉醇，辅料为：卵磷脂、胆固醇、苏氨酸、葡萄糖。

化学名称：5 β ，20-环氧-1，2 α ，4，7 β ，10 β ，13 α -六羟基紫杉烷-11-烯-9-酮-4，10-二乙酰酯-2-苯甲酸酯-13 [(2' R, 3' S) -N-苯甲酰-3-苯基异丝氨酸酯]

化学结构式：



分子式：C₄₇H₅₁NO₁₄

分子量：853.92

【性状】本品为类白色或淡黄色块状物，微有卵磷脂腥味。

【适应症】

本品可用于卵巢癌的一线化疗及以后卵巢转移性癌的治疗、作为一线化疗，本品也可以与顺铂联合应用。

本品也可用于曾用过含阿霉素标准化疗的乳腺癌患者的后续治疗或复发患者的治疗。

本品可与顺铂联合用于不能手术或放疗的非小细胞肺癌患者的一线化疗。

【规格】30mg。

【用法用量】

常用剂量为 135-175mg / m²，使用前先向瓶内加入 10ml 5%葡萄糖溶液，置专用振荡器(振荡频率 20Hz，振幅：X 轴方向 7mm、Y 轴方向 7 mm、Z 轴方向 4 mm)上振摇 5 分钟，待完全溶解后，注入 250-500ml 5%葡萄糖溶液中，采用符合国家标准的一次性输液器静脉滴注 3 小时。

为预防紫杉醇可能发生的过敏反应，在使用本品前 30 分钟，请进行以下预处理：静脉注射地塞米松 5-10mg；肌肉注射苯海拉明 50mg；静脉注射西米替丁 300mg。

【不良反应】

- 1、过敏反应：表现为潮红、皮疹、呼吸困难、低血压及心动过速，如发生严重过敏反应，应停药并进行治疗，曾发生过敏的患者不宜再次使用本品。
- 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%，严重的小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，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。
- 5、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。
- 6、肝脏毒性：为 ALT，AST 和 AKP 升高。
- 7、脱发：发生率为 80%。
- 8、局部反应：输注药物的静脉和药物外渗局部的炎症。

【禁 忌】

- 1、紫杉醇类药物过敏者禁用。
- 2、中性粒细胞低于 $1500 \text{ 个} / \text{mm}^3$ 者禁用。

【注意事项】

- 1、用药期间应定期检查外周血象和肝功能。
- 2、本品只能用 5% 葡萄糖注射液溶解和稀释，不可用生理盐水或其他溶液溶解、稀释，以免发生脂质体聚集。本品溶于 5% 葡萄糖注射液后，在室温(25℃)和室内灯光下 24 小时内稳定。
- 3、肝功能不全者慎用。
- 4、本品在运输期间允许-10-8℃ 累计时间不大于 72 小时，8-15℃ 累计时间不大于 24 小时。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

对妊娠妇女未进行过系统研究，如果它被用于妊娠妇女或在应用本品期间病人怀孕，应立即告知病人具有的潜在危险。哺乳期妇女若使用本品，必须中止哺乳。

【儿童用药】目前尚未有用于儿童的临床经验，要慎重使用。

【老年用药】未进行有关实验且无可靠参考文献。

【药物相互作用】

药代动力学资料证明顺铂后给予本品，本品清除率大约降低 30%。骨髓毒性较为严重。同时应用酮康唑影响本品的代谢。

【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。

【药理毒理】

药理作用

本品为细胞毒类抗肿瘤药，可促进微管双聚体装配并阻止其解聚，也可导致整个细胞周期微管的排列异常和细胞分裂期间微管星状体的产生，从而阻碍细胞分裂，抑制肿瘤生长。

毒理研究

遗传毒性：体外（人淋巴细胞染色体畸变试验）和体内（小鼠微核试验）试验显示紫杉醇是一种诱裂剂，但在 Ames 试验和 CHO / HGPRT 基因突变试验中未见其有致突变性。

生殖毒性：大鼠在交配前和交配期间给予紫杉醇，剂量达 $1 \text{ mg} / \text{kg} / \text{天}$ （按体表面积折算，约为临床日推荐最大剂量的 0.04 倍）或以上时，可导致雌、雄大鼠生育力损伤，在此剂量下，本品引起生育力和生殖指数下降及胚胎毒性增加。

家兔在器官形成期给予紫杉醇 $3 \text{ mg} / \text{kg} / \text{天}$ ，（按体表面积折算，约为临床日推荐最大剂量的 0.2 倍），可引起子宫内死亡、吸收胎增加、死胎增加等胚胎和胎仔毒性，同时可见母体毒性。剂量为 $1 \text{ mg} / \text{kg} / \text{天}$ （按体表面积折算，约为临床日推荐最大剂量的 1 / 15）时，未见致畸作用。在更高剂量下，由于胎仔大量死亡，无法对本品的致畸性进行评价。尚无充分的和严格对照的孕妇临床研究资料，如果患者在妊娠期间使用本品，或在使用本品期间怀孕，应被告之本品对胎儿的潜在危害。接受本品治疗的育龄妇女应避免怀孕。

尚不清楚本品是否从人乳中排泄，大鼠在产后 9-10 天静脉给予碳-14 标记的紫杉醇，可见其乳汁中的放射浓度高于血浆，并与血浆浓度平行衰减。鉴于许多药物都能从人乳中排泄和本品可能给哺乳婴儿带来严重不良反应，在接受本品治疗时，建议停止哺乳。

【药代动力学】

据文献报道，肿瘤病人滴注紫杉醇后，血浆中药物呈双相消除，消除半衰期平均为 5.3-17.4 小时，89%-98% 的药物与血浆蛋白结合，血浆 C_{max} 与剂量及滴注时间相关，尿中仅有少量原形药排出。

【贮藏】遮光、密闭，在 2-8℃ 保存

【包装】西林瓶包装，1 瓶 / 盒。

【有效期】18 个月

【执行标准】国家食品药品监督管理总局国家药品标准 WS-718 (X-529)-2002-2015Z

【批准文号】国药准字 H20030357

【药品上市许可持有人、生产企业】

企业名称：南京绿叶制药有限公司

注册地址：南京高新开发区高新路 28 号

生产地址：南京市江北新区华康路 121 号

邮政编码：210061

电话号码：025-58840936；025-83121333

传真号码：025-58842287

网 址：www.njluye.cn

核准日期：2007年05月14日

修改日期：2015年03月16日

修改日期：2015年11月25日

注射用紫杉醇脂质体说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用。

【药品名称】

通用名称：注射用紫杉醇脂质体

商品名称：力扑素

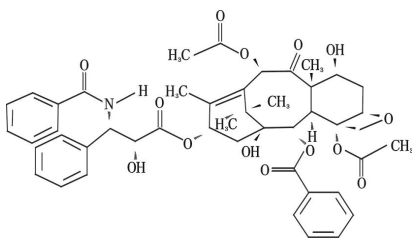
英文名称：Paclitaxel Liposome for Injection

汉语拼音：zhushheyong zishanchun zhizhiti

【成份】本品的主要成份为紫杉醇，辅料为：卵磷脂、胆固醇、苏氨酸、葡萄糖。

化学名称：5 β ，20-环氧-1，2 α ，4，7 β ，10 β ，13 α -六羟基紫杉烷-11-烯-9-酮-4，10-二乙酰酯-2-苯甲酸酯-13 [(2' R, 3' S) -N-苯甲酰-3-苯基异丝氨酸酯]

化学结构式：



分子式：C₄₇H₅₁NO₁₄

分子量：853.92

【性状】本品为类白色或淡黄色块状物，微有卵磷脂腥味。

【适应症】

本品可用于卵巢癌的一线化疗及以后卵巢转移性癌的治疗、作为一线化疗，本品也可以与顺铂联合应用。

本品也可用于曾用过含阿霉素标准化疗的乳腺癌患者的后续治疗或复发患者的治疗。

本品可与顺铂联合用于不能手术或放疗的非小细胞肺癌患者的一线化疗。

【规格】30mg。

【用法用量】

常用剂量为 135-175mg / m²，使用前先向瓶内加入 10ml 5%葡萄糖溶液，置专用振荡器(振荡频率 20Hz，振幅：X 轴方向 7mm、Y 轴方向 7 mm、Z 轴方向 4 mm)上振摇 5 分钟，待完全溶解后，注入 250-500ml 5%葡萄糖溶液中，采用符合国家标准的一次性输液器静脉滴注 3 小时。

为预防紫杉醇可能发生的过敏反应，在使用本品前 30 分钟，请进行以下预处理：静脉注射地塞米松 5-10mg；肌肉注射苯海拉明 50mg；静脉注射西米替丁 300mg。

【不良反应】

- 1、过敏反应：表现为潮红、皮疹、呼吸困难、低血压及心动过速，如发生严重过敏反应，应停药并进行治疗，曾发生过敏的患者不宜再次使用本品。
- 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%，严重的小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，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。
- 5、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。
- 6、肝脏毒性：为 ALT，AST 和 AKP 升高。
- 7、脱发：发生率为 80%。
- 8、局部反应：输注药物的静脉和药物外渗局部的炎症。

【禁忌】

- 1、紫杉醇类药物过敏者禁用。
- 2、中性粒细胞低于 $1500 \text{ 个} / \text{mm}^3$ 者禁用。

【注意事项】

- 1、用药期间应定期检查外周血象和肝功能。
- 2、本品只能用 5% 葡萄糖注射液溶解和稀释，不可用生理盐水或其他溶液溶解、稀释，以免发生脂质体聚集。本品溶于 5% 葡萄糖注射液后，在室温(25℃)和室内灯光下 24 小时内稳定。
- 3、肝功能不全者慎用。
- 4、本品在运输期间允许-10-8℃ 累计时间不大于 72 小时，8-15℃ 累计时间不大于 24 小时。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

对妊娠妇女未进行过系统研究，如果它被用于妊娠妇女或在应用本品期间病人怀孕，应立即告知病人具有的潜在危险。哺乳期妇女若使用本品，必须中止哺乳。

【儿童用药】目前尚无有用于儿童的临床经验，要慎重使用。

【老年用药】未进行有关实验且无可靠参考文献。

【药物相互作用】

药代动力学资料证明顺铂后给予本品，本品清除率大约降低 30%。骨髓毒性较为严重。同时应用酮康唑影响本品的代谢。

【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。

【药理毒理】

药理作用

本品为细胞毒类抗肿瘤药，可促进微管双聚体装配并阻止其解聚，也可导致整个细胞周期微管的排列异常和细胞分裂期间微管星状体的产生，从而阻碍细胞分裂，抑制肿瘤生长。

毒理研究

遗传毒性：体外（人淋巴细胞染色体畸变试验）和体内（小鼠微核试验）试验显示紫杉醇是一种诱裂剂，但在 Ames 试验和 CHO / HGPRT 基因突变试验中未见其有致突变性。

生殖毒性：大鼠在交配前和交配期间给予紫杉醇，剂量达 $1 \text{ mg} / \text{kg} / \text{天}$ （按体表面积折算，约为临床日推荐最大剂量的 0.04 倍）或以上时，可导致雌、雄大鼠生育力损伤，在此剂量下，本品引起生育力和生殖指数下降及胚胎毒性增加。

家兔在器官形成期给予紫杉醇 $3 \text{ mg} / \text{kg} / \text{天}$ ，（按体表面积折算，约为临床日推荐最大剂量的 0.2 倍），可引起子宫内死亡、吸收胎增加、死胎增加等胚胎和胎仔毒性，同时可见母体毒性。剂量为 $1 \text{ mg} / \text{kg} / \text{天}$ （按体表面积折算，约为临床日推荐最大剂量的 1 / 15）时，未见致畸作用。在更高剂量下，由于胎仔大量死亡，无法对本品的致畸性进行评价。尚无充分的和严格对照的孕妇临床研究资料，如果患者在妊娠期间使用本品，或在使用本品期间怀孕，应被告之本品对胎儿的潜在危害。接受本品治疗的育龄妇女应避免怀孕。

尚不清楚本品是否从人乳中排泄，大鼠在产后 9-10 天静脉给予碳-14 标记的紫杉醇，可见其乳汁中的放射浓度高于血浆，并与血浆浓度平行衰减。鉴于许多药物都能从人乳中排泄和本品可能给哺乳婴儿带来严重不良反应，在接受本品治疗时，建议停止哺乳。

【药代动力学】

据文献报道，肿瘤病人滴注紫杉醇后，血浆中药物呈双相消除，消除半衰期平均为 5.3-17.4 小时，89%-98% 的药物与血浆蛋白结合，血浆 C_{max} 与剂量及滴注时间相关，尿中仅有少量原形药排出。

【贮藏】遮光、密闭，在 2-8℃ 保存

【包装】西林瓶包装，1 瓶 / 盒。

【有效期】18 个月

【执行标准】国家食品药品监督管理总局国家药品标准 WS-718 (X-529)-2002-2015Z

【批准文号】国药准字 H20030357

【药品上市许可持有人、生产企业】

企业名称：南京绿叶制药有限公司

注册地址：南京高新开发区高新路 28 号

生产地址：南京高新开发区高新路 28 号

邮政编码：210061

电话号码：025-58840936；025-83121333

传真号码：025-58842287

网 址：www.njluye.cn