

核准日期:2007年04月13日

注射用洛铂说明书

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:注射用洛铂

英文名称:Lobaplatin for Injection

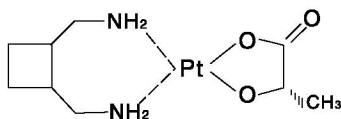
汉语拼音:Zhusheyong Luobo

【成份】

本品主要成份为洛铂。

化学名称:1, 2-二氨基-环丁烷-乳酸合铂。

化学结构式:



分子式: C₈H₁₆N₂O₆Pt

分子量: 397.34

【性状】本品为白色冻干粉末。

【适应症】

本品主要用于治疗乳腺癌、小细胞肺癌及慢性粒细胞性白血病。

【规格】50mg (以无水物计)。

【用法用量】

使用前用5ml注射用水溶解,此溶液应4小时内应用(存放温度2-8℃)。静脉注射按体表面积一次50mg/m²,再次使用时应待血液毒性或其他临床副作用完全恢复,推荐的应用间歇期为3周。如副作用恢复较慢,可延长使用间歇。

用药的持续时间:治疗持续时间应根据肿瘤的反应,最少应使用2个疗程。如肿瘤开始缩小,可继续进行,总数可达6个疗程。

【不良反应】

1、血液毒性:在洛铂的剂量限制性毒性中,血小板减

少最为强烈,约有26.9%实体瘤患者的血小板计数低于50,000/mm³。在已用大剂量化疗后的卵巢癌患者中,血小板减少发生的频率高达75%。血小板数降低常在注射洛铂后2周(14天)开始,血小板计数常在下降后1周恢复到100,000/mm³。在15%患者中(在大量化疗后卵巢癌患者中达32.5%)白细胞计数低于2000/mm³。血象改变呈可逆性,但可引起继发的副作用,如血小板减少引起出血,白细胞减少引起感染。

2、胃肠道毒性:34.3%患者发生呕吐,但仅有6.7%患者的呕吐比较严重;14.8%患者发生恶心,建议使用预防性止吐剂。3.5%的患者发生腹泻。

3、神经毒性:1.3%患者发生感觉异常,神经疾病、神经痛、耳毒性,精神错乱和视觉异常等,仅在不到0.5%患者中发生。

4、肾毒性:在应用洛铂时,大多数患者不需大量输液或/和强制利尿,发生肾功能异常很罕见。食欲缺乏患者应用洛铂后,液体摄入不足,严重呕吐可引起毒性肾功能衰竭。

5、肝毒性:应用洛铂后,偶然有轻度的可逆性SAST和SALT升高这种升高也可由于肝转移所致,但和洛铂的因果关系不能除外。

6、电解质变化:电解质变化不是洛铂的副作用。

7、过敏反应:约有1.9%患者发生过敏反应(如皮疹、紫癜、皮肤潮红、皮肤反应)这些副作用往往发生在过去用大量铂类化合物治疗的卵巢癌患者中,在慢性粒细胞性白血病中,无这种副作用。

8、其他副作用:对洛铂未进行长期致癌试验,和洛铂类似的相同机制的化合物有致畸和致癌作用。因此,在洛铂治疗时,不能排除发生继发性肿瘤的危险。洛铂对男性生育能力的副作用不能完全排除。

【禁忌】

有骨髓抑制患者,或有凝血机制障碍的患者(可增加出血的危险或出血)和已有肾功能损害的病人禁用。

对铂类化合物有过敏反应者禁用。

【注意事项】

用洛铂后患者发生严重的不良反应,必要时应减少剂量。

1、洛铂应在有肿瘤化疗经验的医师指导下应用。应有足够的诊断和治疗的设备来处理可能引起的并发症。洛铂对骨髓有毒性,血小板严重减少和重度贫血患者,特别在罕见的出血病例可能需要输血。

2、患者的监控:血液(包括血小板、白细胞和色素)和临床血化学(包括转氨酶)应定期检查,在每个疗程前和每次用药后第二周进行检查。

3、配伍禁忌:洛铂不能用氯化钠溶液溶解,这样可增加洛铂的降解。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

妊娠和哺乳期禁用,有生育能力的女性,在洛铂治疗期间,应避免怀孕,并在洛铂治疗终止后6个月内也应避免怀孕。

【儿童用药】尚不明确。

【老年用药】尚不明确。

【药物相互作用】

如洛铂和其他骨髓抑制药物同时应用,可能增加骨髓毒性作用。

【药物过量】

对洛铂没有特异性的解毒剂。如发生过量,建议给患者进行大量输液、强制性利尿,并进行严密监护和对症处理。

【药理毒理】

1、药理:具烷化作用,属烷化剂(广义),本品对多种动物和人肿瘤细胞株有明确的细胞毒作用,与顺铂的抑瘤作用相似或较强,对顺铂有抗药性的细胞株,仍有一定的细胞毒作用。

2、毒理:大鼠、犬的长期毒性试验表明,其毒性和卡铂相似,主要毒性为骨髓造血抑制。

3、骨髓毒性较低,在体内外试验均表现出有致突变作

用,尚未进行致癌试验,但这类烷化剂均有致畸和致癌的潜在作用。

【药代动力学】

静脉注射后,血清中游离铂的血药浓度一时间曲线与完整的洛铂基本上相同,在血液循环中没有或很少代谢产物存在。洛铂的两种立体异构体曲线也完全相同。用药患者的血清中总铂和游离铂的浓度时间曲线,在1小时内相似,在11小时后,血循环中约25%的洛铂浓度和血清蛋白结合。

游离铂的终末半衰期($t_{1/2}$)为 131 ± 15 min,总铂为 6.8 ± 4.3 天。游离铂标准化曲线下面积(AUG)(50 mg/m²)为 $(13.9 \pm 1.8) \text{ min} \cdot \text{m}^2/\text{L}$,总铂为 $(57 \pm 19) \text{ min} \cdot \text{m}^2/\text{L}$ 。游离铂标准化平均血浆清除率(1.73m²)约为 $(125 \pm 14) \text{ ml/min}$,总铂为 $(34 \pm 11) \text{ ml/min}$ 。游离铂平均分布容积为 $(0.28 \pm 0.51) \text{ L/kg}$,总铂为 $(4.8 \pm 2.61) \text{ L/kg}$ 。本品主要经肾脏排出。

【贮藏】遮光,密闭,在25℃下保存。

【包装】玻璃管制注射剂瓶,1瓶/盒。

【有效期】暂定36个月。

【执行标准】WS-016(X-014)-98。

【批准文号】国药准字H20050308。

【生产企业】

CAIP®

企业名称:海南长安国际制药有限公司
生产地址:海口国家高新技术产业开发区
邮政编码:570314
电话号码:0898-68635012
传真号码:0898-68635017
网址: <http://www.caip.cn>