核准日期：2006 年 10 月 25 日
修改日期：2011 年 07 月 25 日
修改日期：2012 年 02 月 20 日
修改日期：2013 年 09 月 26 日

注射用羟喜树碱说明书

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：注射用羟喜树碱

商品名称：拓僖

英文名称：Hydroxycamptothecin for Injection

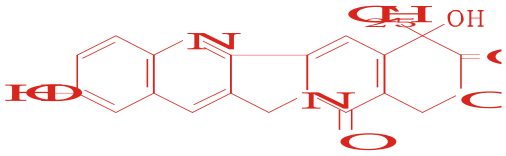
汉语拼音：Zhusheyong Qiangxishujian

【成份】

本品主要成份为羟喜树碱

化学名称：（S）－4，9－二羟基－4－乙基－1H－吡喃[3'，4，：6，7]氮茚[1，2-b]喹啉－3，14－（4H，12H）－二酮。

化学结构式：



分子式：$C_{20}H_{16}N_2O_5$

分子量：364.36

辅料：乳糖、甘氨酸、氢氧化钠

【性状】本品为黄色疏松块状物或粉末。

【适应症】抗肿瘤药。适用于原发性肝癌、胃癌、膀胱癌、直肠癌、头颈部上皮癌 、白血病等恶性肿瘤。

【规格】 （1）2mg；（2）5mg

【用法用量】本品不宜用葡萄糖等酸性药液溶解和稀释。

原发性肝癌：① 静脉注射，一日 4～6mg，用 0.9%氯化钠注射液 20ml 溶解后，缓缓注射，或遵医嘱。 ② 肝动脉给药，用 4mg 加 0.9%氯化钠注射液 10ml 灌注，每日 1 次，15～30 天为一个疗程。

胃癌：静脉注射，一日 4～6mg，用 0.9%氯化钠注射液 20ml 溶解后，缓缓注射，或遵医嘱。

膀胱癌：膀胱灌注后加高频透热 100 分钟，剂量由 10mg 逐渐加至 20mg，每周 2 次，10～15 次为一疗程。

直肠癌：经肠系膜下动脉插管，以羟喜树碱 6～8mg，加入 0.9%氯化钠注射液 500ml 动脉注入，每日一次，15～20 次为一疗程。

头颈部上皮癌：静脉注射，每日 4～6mg，用 0.9%氯化钠注射液 20ml 溶解后，缓缓注射，或遵医嘱。

白血病：成人剂量为按体表面积一日 6～8mg/m2，加入氯化钠注射液中静脉滴注，连

续给药，30 天为一疗程，或遵医嘱。

【不良反应】

（1） 对消化系统的影响：主要表现为恶心、食欲减退等反应，但不影响治疗，停药后上述症状很快减轻并消失。

（2）对造血系统的影响：血细胞有一定程度下降，但能维持在 1×10^9/L 以上；对红细胞、血小板未发现明显抑制作用。

（3） 对泌尿系统的影响：有少数病例出现尿急、尿痛及血尿，停药 1 周后逐渐消失。

（4）其它反应：有少数病例出现脱发，停药后可逐渐恢复。

【禁忌】 对本品过敏者禁用。

【注意事项】

（1）本品用药期间应严格检查血象。

（2）本品仅限于用 0.9%氯化钠注射液稀释。

（3）静脉给药时，药液切勿外溢，否则会引起局部疼痛及炎症。

【孕妇及哺乳期妇女用药】孕妇慎用。

【儿童用药】尚不明确。

【老年用药】尚不明确。

【药物相互作用】尚不明确。

【药物过量】尚不明确。

【药理毒理】

羟喜树碱是细胞毒类抗肿瘤药。该药为细胞周期特异性药物，主要作用于 S 期，对 DNA 拓扑异构酶 I(TOPO I)有选择性抑制作用。TOPO I 催化超螺旋 DNA 解旋而进行复制及转录，本品通过抑制 TOPO I 的活性从而阻滞 DNA 复制及转录，干扰肿瘤细胞增殖周期。近期研究文献提示，羟喜树碱可能还有诱导肿瘤细胞分化和凋亡的作用。

【药代动力学】

动物实验表明：羟喜树碱在血液中的清除过程呈双相曲线，第一个快速下降的生物半衰期为 4.5 分钟，第二个半衰期约 29 分钟。给药后 1 小时，胆囊、小肠内容物维持浓度最高，其次为癌细胞，其他依次为骨髓、胃、肺等器官。静脉注射的羟喜树碱主要从胆汁排泄，通过粪便排出体外。24 小时总排出量为 39%，从粪便中排出 29.6%，尿中不到 9%。癌细胞中药物浓度 24 小时内保持稳定水平。

【贮藏】 避光、密闭（10℃~30℃）保存。

【包装】（1）2mg：药用玻璃瓶、药用丁基胶塞；1 瓶/盒。

（2）5mg：药用玻璃瓶、药用丁基胶塞；1 瓶/盒。

【有效期】 30 个月

【执行标准】WS_1-(X-261)-2004Z

【批准文号】

（1）2mg：国药准字 H20010156

（2）5mg：国药准字 H20010157

【上市许可持有人】

企业名称：深圳万乐药业有限公司

地　　址：深圳市坪山新区兰竹东路国家生物医药产业基地万乐药业大厦

【生产企业】

企业名称：深圳万乐药业有限公司

生产地址：深圳国家生物医药产业基地坪山新区兰竹东路万乐药业大厦
邮政编码：518118
电话号码：0755-25843999，0755-25878771
传真号码：0755-82260086
网址：http://www.wanle.com.cn