

多西他赛多烯紫杉醇DocetaxelCAS号114977-28-5柯莱生物研发机构zhuangong

产品名称	多西他赛多烯紫杉醇DocetaxelCAS号114977-28-5 柯莱生物研发机构zhuangong
公司名称	杭州柯莱生物医药科技有限公司
价格	3356.00/件
规格参数	CAS号:114977-28-5 分子式:C ₄₃ H ₅₃ NO ₁₄ 英文名:Docetaxel
公司地址	浙江省杭州市上城区海运国际大厦1号楼1903室-12（自主申报）（注册地址）
联系电话	17357819709

产品详情

中文名称多西他赛中文同义词多西他赛1G;多烯紫杉醇;多西他赛及中间体;多烯紫杉醇(多西紫杉醇,多西他塞,多似紫杉醇,泰索帝);多西他赛、多Chemicalbook烯紫杉醇;多西他赛(低纯);多烯紫杉醇无水/多西他赛(标准品);DOCETAXEL多烯紫杉醇/多西他赛;多烯紫杉醇英文名称Docetaxel

药理毒理多西他赛为紫杉类药物，通过促进微管双聚体装配成微管，同时通过防止去多聚化过程而使微管稳定，阻滞细胞于G₂和M期，从而抑制癌细胞的有丝分裂和增殖。多西他赛的药理作用比紫杉醇强，在细胞内浓度比紫杉醇高3倍，并在细胞内滞留时间长，其对微管亲和力是紫杉醇的2倍；作为微管稳定剂和装配促进剂，活性比紫杉醇大2倍；作为微管解聚抑制剂，活性比紫杉醇大2倍。在体外抗瘤活性试验中，已证实多西他赛的抗瘤活性是紫杉醇的1.3~12倍。临床研究表明，对于蒽环类耐药乳腺癌，多西他赛较紫杉醇有更高的有效率。多西他赛是目前为止蒽环类耐药乳腺癌的二线治疗中最有效的药物；在非小细胞肺癌单药治疗和联合化疗中，多西他赛是最有效的药物之一。遗传毒性：在CHO-K1细胞染色体畸变试验和小鼠骨髓微核试验中，多西他赛表现出致断裂作用，但在Ames试验和CHO/HGPRT基因突变试验中未见致突变作用。生殖毒性：在大鼠静脉注射多西他赛0.3mg/kg（按体表面积折算，约为临床推荐剂量的1/50），未见对生育力的损伤，但可引起睾丸重量减轻。该结果与大鼠和犬10个周期（每21天给药1次，连续6个月）的重复给药试验结果有相关性；大鼠和犬静脉注射剂量分别为5mg/kg和0.375mg/kg时（按体表面积折算，分别约相当于临床推荐剂量的1/3和1/15），可见睾丸萎缩和变性，大鼠在低剂量时增加给药次数也表现出相似的作用。怀孕时使用多西他赛可导致胎儿损伤。大鼠和家兔在器官形成期分别给予多西他赛 0.3mg/kg/日和0.03mg/kg/日（按体表面积折算，分别相当于临床日推荐剂量的1/50和1/300），可见胚胎毒性和胎仔毒性（表现为子宫内死亡、吸收胎增加、胎仔体重减轻和骨化延迟）。以上剂量亦可引起母体毒性。目前尚无足够的和严格控制的孕妇临床研究资料。如果患者在孕期使用本品，或在使用本品期间怀孕，应被告之对胎儿的潜在危害和流产的潜在危险。有生育可能的妇女在使用本

品治疗期间应避免怀孕。尚不清楚多西他赛是否从人乳中排泄。鉴于许多药物都可从人乳中排泄，且多西他赛可能引起哺乳婴儿的严重不良反应，母亲在使用本品前应停止哺乳。现代药理学文献报道，对癌症病人进行了剂量为20-115mg/m²的药代动力学研究。当剂量为75-115mg/m²，静脉滴注1-2小时时，其AUC呈剂量相关性。本品的药代特点符合三室药代动力学模型， $t_{1/2\alpha}$ 、 $t_{1/2\beta}$ 、 $t_{1/2\gamma}$ 半衰期分别为4分钟、36分钟及11.1小时。初始阶段浓度迅速降低表明药物分布至周边室，后一时相部分原因是由于药物从周边室相对缓慢地消除。在1小时内静脉滴注给予多西他赛100mg/m²，平均峰浓度为3.7ug/ml，AUC为4.6ug/ml·h，总体清除率和稳态分布为21L/h/m²与113L。多西他赛及其代谢产物主要从粪便排泄。经粪便和尿排出的量分别约占所给剂量的75%和6%，仅有少部分以原型排出。体外研究表明，多西他赛的血浆蛋白结合率超过94-97%，地塞米松并不影响多西他赛与蛋白的结合。体外研究表明，多西他赛被CYP3A4同功酶所代谢，这种代谢可以被CYP3A4抑制剂所抑制。适应症1.适用于局部晚期或转移性乳腺癌的治疗。2.适用于局部晚期或转移性非小细胞肺癌的治疗，即使以顺铂为主的化疗失败后。用法和用量多西他赛只能用于静脉滴注。所有Chemicalbook病人在接受多西他赛治疗期前均必须口服糖皮质激素类，如地塞米松，在多西他赛滴注一天前服用，每天16mg，持续至少3天，以预防过敏反应和体液潴留。多西他赛的推荐剂量为70-75mg/m²，静脉滴注一小时，每三周一次。根据计算病人所用剂量，用注射器吸取所需剂量，稀释到5%葡萄糖注射液或0.9%氯化钠注射液中，轻轻摇动，混合均匀，最终浓度不超过0.74mg/ml。副作用与不良反应1.骨髓抑制：中性粒细胞减少是最常见的不良反应而且通常较严重（低于500个/mm³）。可逆转且不蓄积。据文献报道，有与中性粒细胞减少相关的发热及感染发生。贫血可见于多数病例，少数病例发生重度血小板减少。2.过敏反应：部分病例可发生严重过敏反应，其特征为低血压与支气管痉挛，需要中断治疗。停止滴注并立即治疗后病人可恢复正常。部分病例也可发生轻度过敏反应。如脸红、伴用或不伴用瘙痒的红斑、胸闷、背痛、呼吸困难、药物热或寒颤。3.皮肤反应常表现为红斑，主要见于手、足，也可发生在臂部、脸部及胸部的局部皮疹，有时伴有瘙痒。皮疹通常可能在滴注多西他赛后一周内发生，但可在下次滴注前恢复。严重症状如皮疹后出现脱皮则极少发生。可能会发生指（趾）甲病变，以色素沉着或变淡为特点，有时发生疼痛和指甲脱落。4.体液潴留包括水肿，也有报道极少数病例发生胸腔积液、腹水、心包积液、毛细血管通透性增加以及体重增加。经过4周期治疗或累计剂量400mg/m²后，下肢发生液体潴留，并可能发展至全身水肿，同时体重增加3公斤或3公斤以上。在停止多西他赛治疗后，液体潴留逐渐消失。为了减少液体潴留，应给病人预防性使用皮质类固醇。5.可能发生恶心、呕吐或腹泻等胃肠道反应。6.临床试验中曾有神经毒性的报道。7.心血管不良反应如低血压、窦性心动过速、心悸、肺水肿及高血压等有可能发生。8.其它不良反应包括：脱发、无力、粘膜炎、关节痛和肌肉痛、低血压和注射部位反应。9.肝功能正常者在治疗期间也有出现转氨酶升高、胆红素升高者，其与多西他赛的关系尚不明确。注意事项【禁忌】1.对多西他赛或吐温-80有严重过敏史的病人；2.白细胞数目小于1500/mm³的病人；3.肝功能有严重损害的病人。【孕妇及哺乳期妇女用药】目前尚无足够的和严格控制的孕妇临床研究资料。如果患者在孕期使用本品，或在使用本品期间怀孕，应被告之对胎儿的潜在危害和流产的潜在危险。有生育可能的妇女在使用本品治疗期间应避免怀孕。尚不清楚多西他赛是否从人乳中排泄。鉴于许多药物都可从人乳中排泄，且多西他赛可能引起哺乳婴儿的严重不良反应，母亲在使用本品前应停止哺乳。【儿童用药】多西他赛应用于儿童的有效性安全性尚未确定。【药物相互作用】体外研究表明CYP3A4抑制剂可能干扰本品的代谢，因此当与此类药物（如酮康唑、红霉素、环孢素等）同时应用时应格外小心。【药物过量】一旦发生过量，应将病人移至特殊监护病房内并严密监测重要器官功能。多西他赛过量时，尚无解毒药可用。可预料到的过量主要并发症包括中性粒细胞减少、皮肤反应和感觉异常。化学性质熔点232（甲醇）。[α]_D-36°（C=0.74，乙醇）。UV最大吸收：230，275，283nm（14800，1730，1670）。用途抗癌药。用于子宫癌。用途抗肿瘤植物药，用于转移性乳腺癌和非小细胞肺癌的治疗用途