

雷替曲塞粉针 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文  
[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/313/2021\\_2022\\_\\_E9\\_9B\\_B7\\_E6\\_9B\\_BF\\_E6\\_9B\\_B2\\_E5\\_c22\\_313963.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/313/2021_2022__E9_9B_B7_E6_9B_BF_E6_9B_B2_E5_c22_313963.htm) 药品名称雷替曲塞粉针 英文名称Raltitrexed Injection 类别其他抗肿瘤药及辅助治疗药制剂本品为白色冻干粉末，每瓶含雷替曲塞2 mg。分子式成分N-[5-[N-甲基-N-(2-甲基-4-氧代-3,4-二氢喹啉-6-基甲基)氨基]-2-噻吩甲酰基]-L-谷氨酸 药理毒理药理学研究表明，雷替曲塞为新一代水溶性胸苷酸合酶抑制剂，该药通过细胞膜外还原型叶酸盐载体系统将本品主动摄入细胞内，而后迅速代谢为多谷氨酸类化合物抑制胸苷酸合酶的活性，并能在细胞内滞留，长时间发挥作用。它对结肠直肠癌细胞系的抑制作用强于5-氟尿嘧啶，雷替曲塞的IC<sub>50</sub>长期给药为1.3 ~ 3.9 nmol/L，短期给药为80 nmol/L，而5-氟尿嘧啶与甲酰四氢叶酸合用长期给药IC<sub>50</sub>为330 ~ 5800 nmol/L，短期给药为150000 nmol/L。体外研究观察到雷替曲塞与5-氟尿嘧啶联合用药有协同作用，这种作用依靠于给药方案和剂量。对176例晚期结肠直肠癌患者进行的II期临床试验，给予雷替曲塞3 mg/m<sup>2</sup>，每3周1次，有25.6%产生综合疗效，从治疗到病情进展平均时间为4.2周，存活期平均为11.2月。1300多例晚期结肠直肠癌患者的3项III期临床研究结果表明，雷替曲塞治疗组（每3周1次，每次3 mg/m<sup>2</sup>）与5-氟尿嘧啶加甲酰四氢叶酸治疗组（5-氟尿嘧啶425mg/m<sup>2</sup>加甲酰四氢叶酸20 mg/m<sup>2</sup>或5-氟尿嘧啶400 mg/m<sup>2</sup>加甲酰四氢叶酸200 mg/m<sup>2</sup>，天天1次，连续5天，每4 ~ 5周重复1次），所产生的客观有效率相似，分别为14.3% ~ 19.3%和15.2% ~ 18.1%，中位缓解时间分别为3.1 ~ 4.8和3.6 ~ 5.3个月，中位生存期分别为9.7 ~ 10.9和10.2 ~ 12.7

个月。药动学患有不同程度实体瘤的患者给予本品3 mg/m<sup>2</sup>治疗后，药物浓度与时间呈三室模型，C<sub>max</sub>的平均值为833 μg/L，AUC为1090 μg/L.h，分布相半衰期T<sub>1/2</sub>为0.8~3 h，最终消除半衰期T<sub>1/2</sub>为8.2~105 h，与给药剂量无关。雷替曲塞主要消除途径是以原型药物形式从肾脏排出，患有轻、中度肾功能不全的患者的T<sub>1/2</sub>明显延长，AUC比正常肾功能患者增加2倍。适应症晚期直肠结肠癌的一线治疗。不良反应静脉滴注本品后常见副作用为血液毒性包括骨髓抑制，中性粒细胞减少、血小板减少等，胃肠道副作用有恶心、呕吐、腹泻，头痛、失眠、皮疹等现象，一般患者耐受性良好，副作用发生率较低。相互作用未见本品与华法林、非甾体抗炎药的相互作用，建议本品不与亚叶酸钙、叶酸和维生素制剂联合用药，以免发生相互作用，与其他细胞毒药物联合用药的安全尚未确立。用法用量推荐给药剂量为每次3 mg/m<sup>2</sup>，用25至250 ml 0.9%生理盐水或5%葡萄糖稀释后静脉滴注15 min以上，每3周重复给药1次。#093.药物服用过量的产生严重的骨髓抑制等血液毒性和胃肠道毒性，应避免使用过量或遵医嘱，药物过量时可每6 h给予亚叶酸钙25 mg/m<sup>2</sup>。注重事项对本品过敏者及有严重并发症者禁用。孕妇及哺乳期妇女禁用。本品只能做单独给药，避免与其它药物混合使用。本品用0.9%生理盐水或5%葡萄糖水溶液稀释后应避光保存，在24小时内使用。轻度和中毒肝损伤患者使用时无需调整本品剂量，但本品部分经粪便排泄，严重肝损伤患者使用时应注重。孕妇及哺乳期妇女禁用本品。儿童患者使用本品的安全性尚未确立，儿童慎用。#093.药代动力学研究表明肾功能损伤的老年患者血浆清除率降低，可发生体内积蓄，应降低本

品的剂量肌苷清除率在55 ~ 65 mL/min，应给予推荐剂量的75%，肌苷清除率在25 ~ 54 mL/min，应给予推荐剂量的50%，每4周重复给药1次。100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 [www.100test.com](http://www.100test.com)