○

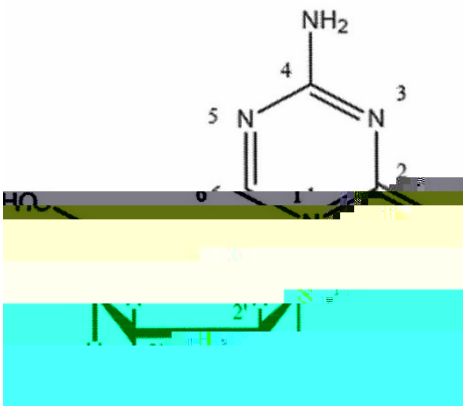
(1)10mg	2013	06	26	(2) 50mg	2013	06	26
	2015	03	15		2018	01	03
	2018	01	03		2020	12	24
	2020	12	24		2021	04	23
	2021	04	23				

Decitabine for Injection

Zhusheyong Dixitabin

5- -2 ’ -

4- -1-(2- - -D- -)-1 3 5- -2(1)-



$C_8H_{12}N_4O_4$

228.21

IPSS -1 -2

(MDS) MDS FAB

- -

1 10mg 2 50mg

MDS 3 5

4 4

4

15mg/m^2

• 3

1 3 4 MDS

3

3 1000/

μ L

500/ μ L

MDS

25000/ μ L

•3

•

•

≤ 5% 6 6

1000/ μ L 50000/ μ L 8

8 7

6

8

• 3

1 3 4 MDS

3

3 1000/
μ L

500/ μ L
MDS
25000/ μ L

•3

1 1000/ μ
L 50000/ μ L 6

- 6 8 - 2
11mg/m^2 8 1 33mg/m^2/ 99mg/m^2/
- 8 10 - 2
11mg/m^2 8 1 33mg/m$^{2/}$ 99mg/m^2/

- 10 - 10 7
6
10

1
1 ≥ 2mg/dL 2 ALT ≥ 2
ULN 3

USP 10mg 2ml

50mg 10ml ml 5.0mg

pH 6.7~7.3 0.9% 5%

0.15~1.0mg/ml 15

2 ~8 2 ~8

4

/

(Dacogen™)

3 5

3 N=66 N=98 N=99 1

N=83 N=81

(≥1

ă (Ó

NOS	23(28)	11(14)
	10(12)	6(7)
	4(5)	1(1)
NOS	5(6)	0(0)
	5(6)	0(0)
	35(42)	13(16)
	29(35)	11(14)
NOS	28(34)	13(16)
NOS	21(25)	7(9)
NOS	12(14)	5(6)
	11(13)	4(5)
	10(12)	5(6)
	10(12)	1(1)
	8(10)	2(2)
	7(8)	5(6)
	7(8)	3(4)
	6(7)	3(4)
	6(7)	2(2)
	5(6)	2(2)
NOS	5(6)	1(1)
	4(5)	3(4)
	4(5)	1(1)
	4(5)	1(1)
	4(5)	0(0)
	4(5)	0(0)

	44(53)	23(28)
	21(25)	13(16)
	18(22)	14(17)
NOS	15(18)	5(6)
NOS	11(13)	5(6)
	10(12)	3(4)
NOS	9(11)	0(0)
	7(8)	3(4)
	6(7)	3(4)
	5(6)	3(4)
	4(5)	1(1)
NOS	4(5)	1(1)
	4(5)	1(1)
	4(5)	0(0)
	4(5)	0(0)
	12(14)	4(5)
NOS*	18(22)	11(14)
	10(12)	6(7)
NOS	8(10)	1(1)
	7(8)	0(0)
NOS*	6(7)	1(1)
	6(7)	0(0)
	5(6)	2(2)
NOS	4(5)	2(2)
	4(5)	0(0)
	6(7)	3(4)

NOS	4(5)	1(1)
NOS	13(16)	9(11)
NOS	9(11)	7(9)
AST	8(10)	7(9)
	8(10)	1(1)
	7(8)	5(6)
	6(7)	0(0)
	5(6)	1(1)
	5(6)	1(1)
	4(5)	3(4)
	4(5)	1(1)
	4(5)	1(1)
NOS	27(33)	16(20)
	20(24)	14(17)
	20(24)	6(7)
	18(22)	10(12)
	16(19)	13(16)
NOS	13(16)	12(15)
	13(16)	8(10)
	11(13)	3(4)
	5(6)	4(5)
	17(20)	8(10)
	16(19)	8(10)
	14(17)	5(6)

	6(7)	1(1)
	5(6)	0(0)
	4(5)	1(1)
	23(28)	11(14)
	15(18)	10(12)
	9(11)	1(1)
	23(28)	11(14)
	10(12)	3(4)
	9(11)	8(10)
	5(6)	3(4)
	4(5)	1(1)
	33(40)	25(31)
	13(16)	6(7)
	12(14)	1(1)
	8(10)	7(9)
	8(10)	4(5)
	7(8)	2(2)
	4(5)	2(2)
	18(22)	12(15)
NOS	16(19)	7(9)
	12(14)	5(6)
NOS	9(11)	3(4)
	9(11)	2(2)
	7(8)	1(1)

*	5(5)
	5(5)
*	27(27)
	5(5)
	8(8)
	6(6)
	14(14)
	6(6)
	30(30)
	28(28)
	10(10)
	5(5)
	5(5)
	40(40)
	5(5)
	11(11)
	6(6)
	16(16)
	15(15)

	5(5)
	36(36)
	9(9)
	6(6)
*	20(20)
	6(6)
	8(8)
	5(5)
	10(10)
*	7(7)
	9(9)
	6(6)
	5(5)
	9(9)
	23(23)
	8(8)
	8(8)
	6(6)
	12(12)
	5(5)
	17(17)
	18(18)
	6(6)
	7(7)

	5(5)
	5(5)
	9(9)
	18(18)
	21(21)
	23(23)
	9(9)
	8(8)
	9(9)
	14(14)
	27(27)
	29(29)
	13(13)
	8(8)
	5(5)
	5(5)
	8(8)
	9(9)
	5(5)
	5(5)
	12(12)
	9(9)
	11(11)
	5(5)

	6(6)
	11(11)
§ *	

DACO-020 20mg/m^2 1 1

5 3 4 37%

24% 22% 78%

7

8 / 7

99 19

MDS 65

1

2

-

II

-
-
-
  1% 2%
-
  / G-CSF

MYE-3002 III
D-0007 DACO-020

2011 8
AE

SAE 20% SAE 11% 3%
5 4%
8 6% 3 3 5

≥5%

MedDRA	3 (N=34)	5 (N=97)	 (N=131)

	(%)	(%)	(%)
(TEAE)	32(94.1)	65(67.0)	97(74.0)
	30(88.2)	58(59.8)	88(67.2)
	22(64.7)	40(41.2)	62(47.3)
*	21(61.8)	32(33.0)	53(40.5)
	16(47.1)	27(27.8)	43(32.8)
	14(41.2)	19(19.6)	33(25.2)
	11(32.4)	11(11.3)	22(16.8)
	4(11.8)	7(7.2)	11(8.4)
	4(11.8)	4(4.1)	8(6.1)

	6(17.6)	9(9.3)	15(11.5)
	6(17.6)	8(8.2)	14(10.7)
	6(17.6)	8(8.2)	14(10.7)
	9(26.5)	5(5.2)	14(10.7)
	2(5.9)	5(5.2)	7(5.3)
	0	7(7.2)	7(5.3)
	3(8.8)	4(4.1)	7(5.3)
	3(8.8)	1(1.0)	4(3.1)
	2(5.9)	2(2.1)	4(3.1)
	2(5.9)	1(1.0)	3(2.3)
	3(8.8)	0	3(2.3)
	2(5.9)	1(1.0)	3(2.3)
	12(35.3)	22(22.7)	34(26.0)
	6(17.6)	8(8.2)	14(10.7)
	4(11.8)	7(7.2)	11(8.4)
	2(5.9)	1(1.0)	3(2.3)
	8(23.5)	22(22.7)	30(22.9)
	5(14.7)	5(5.2)	10(7.6)
	0	9(9.3)	9(6.9)
	2(5.9)	3(3.1)	5(3.8)
	7(20.6)	20(20.6)	27(20.6)
	7(20.6)	14(14.4)	21(16.0)
	1(2.9)	8(8.2)	9(6.9)
	0	8(8.2)	8(6.1)
	2(5.9)	4(4.1)	6(4.6)
	7(20.6)	19(19.6)	26(19.8)
	3(8.8)	12(12.4)	15(11.5)
*	4(11.8)	3(3.1)	7(5.3)
	7(20.6)	9(9.3)	16(12.2)

	3(8.8)	3(3.1)	6(4.6)
	3(8.8)	2(2.1)	5(3.8)
	7(20.6)	7(7.2)	14(10.7)
	2(5.9)	2(2.1)	4(3.1)
	2(5.9)	1(1.0)	3(2.3)
	2(5.9)	0	2(1.5)
	5(14.7)	7(7.2)	12(9.2)
	3(8.8)	6(6.2)	9(6.9)
	4(11.8)	6(6.2)	10(7.6)
	3(8.8)	3(3.1)	6(4.6)
	1(2.9)	8(8.2)	9(6.9)
	2(5.9)	3(3.1)	5(3.8)
	2(5.9)	3(3.1)	5(3.8)
	2(5.9)	1(1.0)	3(2.3)
	2(5.9)	0	2(1.5)
	2(5.9)	0	2(1.5)
	2(5.9)	0	2(1.5)
MedDRA= N= TEAE= *			

Sweet

4

≥ 1/10

≥ 1/100 1/10

≥ 1/ 1000 1/100

≥ 1/10000 1/1000

1/10000

1

/

1 2

MDS

[CrCl] 30ml/min

3

DNA

D

8 9 10 11

0 0.9 3.0mg/m^2 2% 7%

3mg/m^2

3mg/m^2

9~12 2.4 3.6 6mg/m^2

5 8 13%

9 10 3.6mg/m^2

6.0mg/m^2 3.6mg/m^2

6.0mg/m^2

III 83 61 65

21 75

/

CYP450

CYP450

1%

P- P-gp

P-gp

1%

20

Cmax CYP450

CYP

P-gp

P-gp

20

DNA DNA DNA

DNA DNA

DNA DNA

L5178Y lac-I DNA

lac-I

0.15 0.3 0.45mg/m^2

0.3%~1% 3 7

≥ 0.3mg/m^2

≥ 0.3mg/m^2

8 9 10 11 0.9 3mg/m^2

2% 7% 3mg/m^2

3mg/m^2

9~12

2.4 3.6 6.0mg/m^2 5% 8% 13%

9

10 3.6mg/m^2

6.0mg/m^2

3.6mg/m^2

6.0mg/m^2 1 ¯ % / & ? ñ 9

Y5 ¸ `Q¯ % 2.43mg/m

70kg 1.73m^2 4

	5		3	
		95%CI		95%CI
C_{max} (ng/mL)	107	88.5~129	42.3	35.2~50.6
AUC_{cum} (ng.h/mL)	580	480~695	1161	972~1390
$t_{1/2}$ (min)	68.2	54.2~79.6	67.5	53.6~78.8
Vd_{ss} (L)	116	84.1~153	49.6	34.9~65.5
CL (L/h)	298	249~359	201	168~241
AUC= - CL= C_{max}= $t_{1/2}$= Vd_{ss}=				

0.5

<1%

Vdss

DNA

P450

2.4%

4%

P-gp

>200L/h

CV 50%

^{14}C-

90% 4%

4

40~87

70

MYE-3002 24 MDS

3 15mg/m^2 8

7 5 20mg/m^2 17 JPN-

MDS-101 8 MDS 15mg/m^2

5 3 20mg/m^2 5 5 MYE-3002

JPN-MDS-101

CYP

25

1

24

YBH02322021

(1) 10mg H20153045

(2) 50mg H20130067

5

222069

4008285227 9:00—17:00

http://www.hansoh.cn

5pÖ