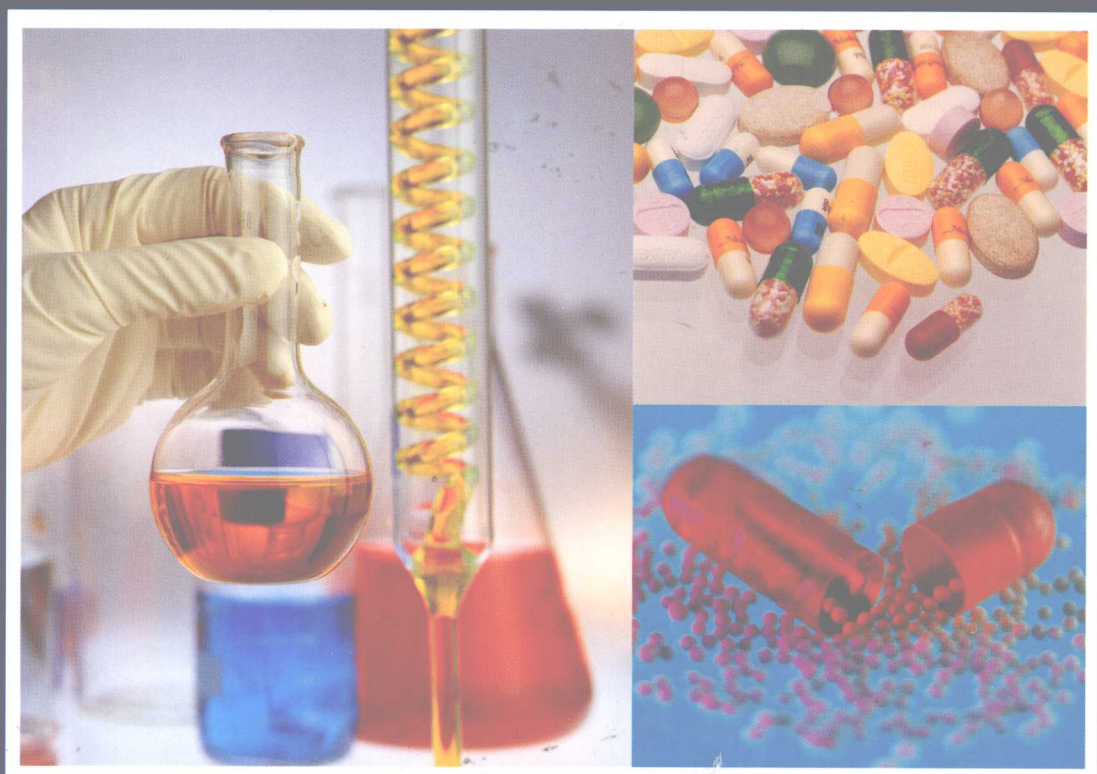


# 美国抗癌药物化学合成速查

A Fast Guide to Anticancer Drug Substances,  
Drug Products and Their Chemical Synthesis

陈清奇 编著



科学出版社

[www.sciencep.com](http://www.sciencep.com)

# 美国抗癌药物化学合成速查

A Fast Guide to Anticancer Drug Substances,  
Drug Products and Their Chemical Synthesis

陈清奇 编著

科学出版社

北京

## 内 容 简 介

本书介绍了近 60 年来美国 FDA 批准过的抗癌药物共 128 种。其中小分子药物 97 种, 生物技术药物 31 种, 药品制剂共 831 个, 几乎覆盖了目前美国市场上所有的抗癌药物和药品。全书按药物通用名的英文字母顺序编排, 系统地介绍了药物的化学结构信息、适应证、药物简介、药品上市信息。本书针对小分子药物, 全面介绍了其各种化学合成路线和文献出处; 针对生物大分子药物及非化学合成来源的小分子药物则给出了与药物原料、药品配方、开发研究相关的文献。

本书可供药物研究开发相关专业的科研和教学人员参考使用。

### 图书在版编目(CIP)数据

美国抗癌药物化学合成速查/陈清奇编著. —北京: 科学出版社, 2009  
ISBN 978-7-03-022496-5

I. 美… II. 陈… III. 抗癌药-药物化学-化学合成 IV. TQ460.31

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2008) 第 102462 号

策划编辑: 沈红芬 / 责任编辑: 王 霞 / 责任校对: 宋玲玲  
责任印制: 刘士平 / 封面设计: 黄 超

版权所有, 违者必究。未经本社许可, 数字图书馆不得使用

科 学 出 版 社 出 版

北京东黄城根北街 16 号

邮政编码: 100717

<http://www.sciencep.com>

双 青 印 刷 厂 印 刷

科学出版社发行 各地新华书店经销

\*

2009 年 2 月 第 一 版 开本: 787×1092 1/16

2009 年 2 月 第一次印刷 印张: 42

印数: 1—2 000 字数: 1 002 000

定 价: 148.00 元

如有印装质量问题, 我社负责调换

# 前 言

癌症已成为仅次于心血管疾病的第二号人类“杀手”。美国癌症协会的统计资料显示,2002年全球有670万人被癌症夺去了生命,约占当年总死亡人数的12%,预计这一数字将在2020年上升到1030万<sup>①</sup>。全球目前的肿瘤患病人数估计超过4000万<sup>②</sup>。癌症已成为常见且严重威胁人类生命和影响人类生活质量的重大问题之一。由癌症而引发的问题也越来越成为社会经济发展的负担。以美国为例,2006年美国全年用于癌症相关的总花费为2063亿美元,其中直接的医疗费用为782亿美元<sup>③</sup>。与国外相似,我国癌症的每年新发现病例、死亡人数都呈上升趋势。据中国抗癌协会统计,2005年,我国的癌症新发病例220万,因癌症死亡人数为160万~170万,现有患癌病人310万<sup>④</sup>。由于对癌细胞的病变和转移、抗癌药物对癌细胞的作用机制认识的局限性,人类目前尚不能完全治愈癌症,至多只能非常有限地延长癌症病人的存活时间。癌症疾病的长期存在、癌症新发病例的大幅增加及癌症难于治愈的特点决定人类社会对抗癌药物的需求将不断增长。这种发展趋势也将会给制药工业带来巨大的商机。我国作为正在崛起的大国,近年来在政府、制药企业、广大科技人员的通力合作下,已在抗癌药物和药品的研发和生产上取得了很大成就。我国目前已有能力生产40多种抗癌药物,原料药总产量多达44吨以上<sup>⑤</sup>。然而,也应该看到我国抗癌药物的研究和生产与发达国家比还是有一定距离。在供求关系的杠杆作用下,预计我国政府和制药工业都会加大对抗癌药物的投入,今后几年内,抗癌药物的研究和开发将会是科研部门和制药工业界的热门研发领域之一。本书就是为顺应我国抗癌药物的发展潮流而编写的。

读者通过本书可以很快了解到下列信息:①美国所有已批准的抗癌药物,包括其化学结构、用途和作用机制。②每一种药物有多少种制剂在美国上市和详细的产品信息,如商品名、剂型、剂量、是处方药还是非处方药(即OTC药品)、市场状态(指正在上市还是停止上市)、FDA产品申请号、批准时间、申报厂商等。③化学药物的合成路线和相应的参考文献。

全书共介绍128种抗癌药物。其中生物技术药物(主要是生物大分子,如抗体、酶等)31个;药品制剂共831个,几乎覆盖了目前美国市场上所有的抗癌药物和制剂。针对每一个小分子药物,本书比较全面地列出了其化学合成方法。为了节省篇幅,全书使用了有机合成专业中通用的化学合成路线图来描述该药物的生产制造方法。其中化学合成路线主要是利用多种大型化学和药物数据库通过数种方法检索而来。为了方便读者查找原文,本书在合成路线之后还给出了详细的文献出处。

---

① 数据来源于美国癌症协会: [http://www.cancer.org/docroot/stt/stt\\_0.asp](http://www.cancer.org/docroot/stt/stt_0.asp)。

② 数据来源于参见中国药网: <http://www.chinapharm.com.cn/html/scfx/10464920050113.html>。

③ 数据来源于中国生物医学工程学会肿瘤靶向学术委员会,2006年抗肿瘤药物市场研究报告——国际国内抗肿瘤药物市场状况,参见中国药网: <http://www.chinapharm.com.cn/html/scfx/1192678456437.html>。

我要借此机会感谢家人的大力支持与帮助，没有家人的支持和理解，我不可能牺牲大量业余时间夜以继日地花上数千小时来编写本书。我还要感谢周文能、周小知、赵云清、汪秋安、杨定桥等老朋友多年来的友谊和大力帮助。最后，我希望借此机会感谢其他所有帮助过我的朋友、同学和同事。

虽然笔者竭尽全力希望把本书编写得尽善至美，但限于知识水平，加之时间仓促，书中不足与错误之处难免，恳请同行和读者批评指正。

陈清奇 博士

2008年10月于美国北卡罗来纳州教堂山市

# 使用说明

## 1. 药物中文通用名

本书中的药物中文通用名以《中华人民共和国药典》的现行版和《中国药品通用名称》为准。对于《中华人民共和国药典》的现行版和《中国药品通用名称》没有收入的药物则主要从医药专业刊物和医药中文网站里所提供的中文名称中挑选。选择的依据是尽量符合国家药典委员会所制订的《中国药品通用名称命名原则》<sup>①</sup>。极少数药物在《中华人民共和国药典》、《中国药品通用名称》、公开刊物及医药网页中没有收入的，则标上“暂无中文名”，并按照国家药典委员会的《中国药品通用名称命名原则》提供试译名供读者参考。

## 2. 关于药物化学结构

药物的化学结构可从以下几个免费数据库中获得：

(1) 美国国家医学图书馆 (U. S. National Library of Medicine) 的化学身份证高级数据库 (CHEMIDPLUS ADVANCED)。其网页是 [chem.sis.nlm.nih.gov/chemidplus/](http://chem.sis.nlm.nih.gov/chemidplus/)。目前该数据库共含有 38 万多种化合物，可使用的检索方法有药品通用名、学名、商品名、美国化学会登记号、化学式、药物分类号、定位代码等。

(2) 中国国家医学图书馆和美国健康研究所 (NIH) 的 PUBCHEM 数据库，其入门网页是 <http://pubchem.ncbi.nlm.nih.gov/>。

(3) 药品说明书数据库：FDA 数据库 (<http://www.accessdata.fda.gov/scripts/cder/drugsatfda/>)、美国处方药品网 (<http://www.rxlist.com>)、美国药品网 (<http://www.drugs.com>) 几乎收集了所有药品的说明书，可使用药品的商品名或通用名检索。

(4) 药品生产企业的产品介绍网页及随药品包装的产品说明。

(5) 生物大分子药物的化学结构信息可从加拿大的药品银行网页中查找，其网页是 <http://redpoll.pharmacy.ualberta.ca/drugbank/index.html>。该数据库目前收集了 FDA 批准的小分子药物 1000 多个，生物大分子药物 100 多个，正在人体临床试验的药物 3000 多个。

## 3. 适应证

这部分内容主要摘自药品中文说明书。

## 4. 药物简介

这部分主要从该药品的说明书中摘录其“作用机制”部分内容，更详细的内容可从药

---

<sup>①</sup> 详见国家药典委员会的相关网页：<http://www.chp.org.cn/news/huayao/070808mc/fj4.htm>。

品说明书中查阅。

#### 5. 药品说明书参考网页

为了方便读者进一步查阅药品说明书原文,本书给出了详细的英文和中文参考网页地址,其中英文的药品说明书网页主要选自FDA官方网页,药品生产厂家或经销商的产品网页,专业药品网页(包括rxlist.com和drugs.com),因此具有较好的可靠性和专业水准。但由于我国的中文药品专业网站尚处于发展和有待完善的阶段,而我国相关的政府部门也没有一个权威部门从事这项工作,因此本书提供的药品说明书中文网页地址不一定完全准确。如果读者不能按本书所提供的网页地址找到相关的中文药品说明书,可能是该网站管理人员将网址修改或删除了。建议读者通过www.google.com网站使用关键词查找。

以下几个网站收集了比较完整和专业的英文药品说明书:

美国FDA官方网页: <http://www.accessdata.fda.gov/scripts/cder/drugsatfda/index.cfm> 或 <http://www.fda.gov/cder/drug/DrugSafety/DrugIndex.htm>。

美国处方药品网: <http://www.rxlist.com>。

美国药品网: <http://www.drugs.com>。

以下几个专业网站收集了很多药品中文说明书:

中国药网: <http://www.chinapharm.com.cn>。

药典在线: <http://www.newdruginfo.com>; <http://www.ydxx.cn>。

药源网: <http://www.wanneter.com>。

中国癌症信息库: <http://www.bufotanine.com>。

中华肿瘤医学网: <http://www.china.tumor.cn>。

中国抗肿瘤药品论坛: <http://www.tumourdrug.com>。

广州新稀特大药房: <http://www.newdrug.com.cn>。

印度抗肿瘤药房: <http://www.induyaofang.in>。

广州抗百济肿瘤药房网页: <http://www.cancerotc.com>。

天下医药网: <http://www.ayiyao.com>。

#### 6. 本品在美国的上市信息

这一部分主要介绍了美国FDA数据库中所有含有该活性成分的药品的上市申请。这些内容可以通过DRUG FUTURE药物在线网页(<http://www.drugfuture.com>)所提供的平台对FDA的数据库进行检索。读者也可从FDA的药品数据库中直接查阅这些信息(网站地址为<http://www.accessdata.fda.gov/scripts/cder/drugsatfda/>),读者也可以从FDA“橙色药品数据库”网站中查阅(其网址为<http://www.fda.gov/cder/ob/default.htm>)。针对每一个药品制剂,本书介绍了其活性成分、商品名、剂型、规格、美国FDA药品申请号、产品号、市场状态、TE代码、RLD信息、药品类别、申请机构。现将每个条款说明如下:

**【活性成分】**给出了中英文对照名;中文名置于括号内。

**【商品名】**该药品在美国的注册商标名。

**【剂型】**药物的剂型,简称药剂。到目前为止,药物剂型已有几十种之多。最常用的剂型有:①注射剂,简称针剂(包括溶液、水针剂、油针剂及粉针剂等)。②片剂。

③胶囊剂（包括硬胶囊剂、软胶囊剂和肠溶胶囊剂等）。④溶液剂（一般指药物的内服或外用溶液，其溶媒多为水、醇或油类）。⑤颗粒剂（又称冲剂或干糖浆，多用于儿科）。⑥软膏剂（药物加入辅料中制成的一种易涂于皮肤、黏膜或创面的半固体外用制剂）。⑦栓剂（通常用于肛门塞入做全身或局部治疗，少数用于阴道、尿道）。除上述剂型外，还有很多其他剂型如滴剂、散剂、丸剂、洗剂、气雾剂、喷剂等。

**【规格】**该药品的有效成分的含量和该药品最小包装的描述。

**【申请号】**NDA 或 ANDA 申请号。通常药品申请人向美国 FDA 提交药品上市申请后，FDA 就会为该药品指定一个申请号码。NDA 是 new drug application 的缩写，意为新药申请。NDA 通常是全新的药物或创新药物，有时也称新分子实体药，表示该药物以前没有以任何形式上市。NDA 也适用于已知药物以新的配方、新剂型、新规格、新的给药方式和用于新的适应证而提出的申请。ANDA 是 abbreviated new drug application 的缩写，意为简化新药申请。通常 ANDA 主要是针对仿制药品，其专利已过期或很快要过期的药品。ANDA 是 FDA 设立的仿制药品简化申报办法。与 FDA 已批准的同类 NDA 药品相比较，ANDA 药品具有相同或非常近似的有效成分、剂型、效力、给药途径、使用方法、药品标签内容。ANDA 药品的售价通常较低。

**【产品号】**药品申请人的产品号码。

**【市场状态】**该药以处方药、非处方药的形式上市还是已停止上市了。

**【TE 代码】**TE 是 therapeutic equivalence 的英文缩写，意为治疗等效，或同等疗效，TE 代码是用于评估通用药（即按 ANDA 程序申报的药品）和创新药治疗等效性的代码。当两种产品在相同条件下以同一剂量给予时，两者的生物利用度没有明显差异，则认为具有生物等效性或治疗等效。关于 TE 代码的更详细说明，读者可参考 FDA 的官方网页，其网址是 <http://www.fda.gov/cder/ob/docs/preface/ecpreface.htm#TEC>。

**【批准日期】**FDA 批准该药品的日期。

**【RLD】**RLD 是 reference listed drug 的英文缩写，指药品参照物或药品参照标准，表示该药品是否已被作为其他申请机构申请 ANDA 药品的标准。

**【药品类别】**处方药、非处方药，或停止上市。

**【申请机构】**向 FDA 提出药品上市申请的申请人。

## 7. 化学合成路线

本书针对每个小分子药物，在通过系统而全面的化学合成数据库检索的基础上，精选出了比较有代表意义和有重要参考价值的化学合成方法。有些药物由于疗效好、价值高、用途广、对癌症治疗研究的影响面宽，各国政府、科研机构和制药公司都投入大量的人力和资金对这些药物进行深入、细致和长时间的研究和开发。通过这些研究，科学家们发表了大量有关这些药物的研究论文和发明专利。从检索的结果看，有些药物的研究论文多达上千甚至上万篇。限于篇幅，本书不可能将这些科研成果一一介绍，而是有选择地精心挑选出重点作为本书的介绍对象。本书对文献选择的优先顺序为期刊文献优先于专利文献。而对期刊文献的精选原则是 SCI 期刊影响因子高的优先，最近发表的优先。为了节省篇幅，本书采用合成路线提要的形式，即采用一步合成反应图来表示该药物的合成方法，并将目标产物置于黑框内使之更为醒目。同时还在该合成路线之后列出了相关的参考文献，包括论文作者、文件标题和期刊出处或专利号。本书的合成反应图中还给出了起始原料和



产物的化学结构、化学试剂、催化剂、反应条件（如时间、温度、压力等）。依据化学合成专业的惯例，本书的化学合成反应图中大量使用“通用缩写”（主要按美国化学会期刊中所使用的缩写方法）。为了便于读者理解和查阅，本书最后部分给出了缩写表和相关试剂、催化剂的化学结构。本书中的化学合成路线图有些比较简单，读者可以很容易地理解其详细的合成方法，但有些比较复杂，并不是那么容易可以一眼看出其详细的合成过程。在这种情况下，笔者建议读者依据合成路线后所附的文献，直接参考原始研究论文。另外需要说明的是，本书所引用的研究结果一般忠实于原作，直接引用其发表时的数据单位，不再做单位换算改动。本书所收文献的最后截止日期为 2007 年 11 月。

#### 8. 关于一些常用的缩写

按化学合成专业的惯例，本书的参考文献、专利文献和化学合成路线中大量使用了缩写。为了方便读者查阅，本书在书后提供了数个附录。其中附录 1 为氨基酸缩写，附录 2 为本书使用的词汇缩写表和相关的化学结构，附录 3 为期刊缩写表，附录 4 为专利代码缩写表。此外，有关药物产品中的缩写是按 FDA 统一规定编写的，详细的情况可参见 FDA 的网站 <http://www.fda.gov/cder/drugsatfda/glossary.htm>。

#### 9. 美国之外的抗癌药

为了让读者对全世界的抗癌药有一个比较全面的了解，附录 5 收集了那些尚未获得美国 FDA 批准上市，但已在中国或世界其他国家上市的抗癌药。这一部分编写格式与正文基本相似，主要给出了药物通用名、化学结构、适应证、药物简介。其中药物简介和适应证部分内容主要摘自中文药品说明书。

#### 10. 抗癌药的化学结构特点

抗癌药虽然品种很多、化学结构复杂，但其化学结构还是有一定规律的。通常结构相似的药物，其作用机制也相近。了解抗癌药的化学结构特点，对理解其作用机制有很大帮助。本书在附录 6 简单归纳了目前临床上使用的抗癌药的化学结构特点供读者参考。希望能对从事新药研究的读者和科研人员设计新药有一定的借鉴意义。

# 目 录

ABARELIX (阿巴瑞克)	1
ALDESLEUKIN (阿地白介素)	2
ALEMTUZUMAB (阿来组单抗)	3
ALITRETINOIN (阿里维 A 酸)	5
ALLOPURINOL SODIUM (别嘌醇钠)	8
ALTRETAMINE (六甲蜜胺)	11
AMIFOSTINE (氨磷汀)	14
ANAKINRA (阿那白滞素)	16
ANASTROZOLE (阿那曲唑)	18
ARSENIC TRIOXIDE (三氧化砷)	21
ASPARAGINASE (门冬酰胺酶)	23
AZACITIDINE (阿扎胞苷)	24
BEVACIZUMAB (暂无中文名)	27
BEXAROTENE (蓓萨罗丁)	29
BLEOMYCIN (博莱霉素)	32
BORTEZOMIB (硼替佐米)	35
BUSULFAN (白消安)	37
CAPECITABINE (卡培他滨)	39
CARBOPLATIN (卡铂)	48
CARMUSTINE (卡莫司汀)	61
CETUXIMAB (西妥昔单抗)	65
CHLORAMBUCIL (苯丁酸氮芥)	66
CISPLATIN (顺铂)	68
CLADRIBINE (克拉屈滨)	71
CLOFARABINE (氯法拉滨)	78
CYCLOPHOSPHAMIDE (环磷酰胺)	82
CYTARABINE (阿糖胞苷)	90
DACARBAZINE (达卡巴嗪)	107
DACTINOMYCIN (放线菌素 D)	111
DALTEPARIN SODIUM (达肝素钠)	112
DARBEPOETIN ALFA (阿法达贝泊汀)	114
DASATINIB (达沙替尼)	117
DAUNORUBICIN (盐酸柔红霉素)	121
DECITABINE (地西他滨)	128
DENILEUKIN DIFTITOX (暂无中文名)	131
DEXRAZOXANE HYDROCHLORIDE (盐酸右雷佐生)	132
DOCETAXEL (多西他赛)	134

DOXORUBICIN (多柔比星)	156
DROMOSTANOLONE PROPIONATE (暂无中文名)	165
ECULIZUMAB (暂无中文名)	167
ELLIOTT'S B SOLUTION (暂无中文名)	168
EPIRUBICIN (表阿霉素)	169
EPOETIN ALFA (阿法依泊汀)	173
ERLOTINIB HYDROCHLORIDE (盐酸厄洛替尼)	176
ESTRAMUSTINE (雌莫司汀)	181
ETOPOSIDE PHOSPHATE (磷酸依托泊苷)	184
ETOPOSIDE VP-16 (依托泊苷)	189
EXEMESTANE (依西美坦)	198
FENTANYL (芬太尼)	202
FILGRASTIM (非格司亭)	214
FLOXURIDINE (氟尿苷)	216
FLUDARABINE PHOSPHATE (磷酸氟达拉滨)	223
FLUOROURACIL (氟尿嘧啶)	226
FULVESTRANT (氟维司群)	238
GEFITINIB (吉非替尼)	240
GEMCITABINE HYDROCHLORIDE (盐酸吉西他滨)	249
GEMTUZUMAB OZOGAMICIN (吉妥单抗)	261
GOSERELIN ACETATE (醋酸戈舍瑞林)	263
HISTRELIN ACETATE (醋酸组胺瑞林)	264
HYDROXYUREA (羟基脲)	266
IBRITUMOMAB TIUXETAN (替伊莫单抗)	270
IDARUBICIN (伊达比星)	273
IFOSFAMIDE (异环磷酰胺)	279
IMATINIB MESYLATE (甲磺酸伊马替尼)	284
INTERFERON ALFA-2a (干扰素 $\alpha$ -2a)	293
INTERFERON ALFA-2b (干扰素 $\alpha$ -2b)	295
IRINOTECAN HYDROCHLORIDE (盐酸伊立替康)	296
LAPATINIB DITOSYLATE (二苯磺酸拉帕替尼)	307
LENALIDOMIDE (来那度胺)	309
LETROZOLE (曲来唑)	310
LEUCOVORIN CALCIUM (亚叶酸钙)	319
LEUPROLIDE ACETATE (醋酸亮丙瑞林)	339
LEVAMISOLE HYDROCHLORIDE (左旋咪唑)	343
LOMUSTINE (洛莫司汀)	346
MECLORETHAMINE HYDROCHLORIDE (盐酸氮芥)	351
MEGESTROL ACETATE (醋酸甲地孕酮)	353
MELPHALAN HYDROCHLORIDE (盐酸美法仑)	358
MERCAPTOPYRINE (巯嘌呤)	360
MESNA (美司那)	363
METHOTREXATE (甲氨蝶呤)	367
METHOXSALLEN (甲氧沙林)	384

MITOMYCIN C (丝裂霉素)	389
MITOTANE (米托坦)	395
MITOXANTRONE HYDROCHLORIDE (盐酸米托蒽醌)	398
NANDROLONE PHENPROPIONATE (苯丙酸诺龙)	405
NELARABINE (奈拉滨)	409
NOFETUMOMAB (暂无中文名)	412
OPRELVEKIN (奥普瑞白介素)	413
OXALIPLATIN (奥沙利铂)	414
PACLITAXEL (紫杉醇)	417
PALIFERMIN (暂无中文名)	447
PAMIDRONATE DISODIUM (帕米膦酸二钠)	449
PANITUMUMAB (帕尼单抗)	455
PEGADEMASE (培加酶)	457
PEGASPARGASE (培门冬酶)	458
PEGFILGRASTIM (培非格司亭)	459
PEGINTERFERON ALFA-2B (培干扰素 $\alpha$ -2b)	460
PEMETREXED DISODIUM (培美曲塞二钠)	463
PENTOSTATIN (喷司他丁)	473
PIPOBROMAN (哌泊溴烷)	476
PLICAMYCIN (普卡霉素)	477
PORFIMER SODIUM (卟吩姆钠)	479
PROCARBAZINE HYDROCHLORIDE (盐酸丙卡巴胂)	481
RASBURICASE (拉布立酶)	482
RITUXIMAB (利妥昔单抗)	483
SARGRAMOSTIM (沙格司亭)	485
SORAFENIB (索拉非尼)	486
STREPTOZOCIN (链佐星)	489
SUNITINIB (舒尼替尼)	490
TALC (滑石粉)	495
TAMOXIFEN CITRATE (枸橼酸他莫昔芬)	496
TEMOZOLOMIDE (替莫唑胺)	510
TENIPOSIDE (替尼泊苷)	516
TESTOLACTONE (睾内酯)	518
THALIDOMIDE (沙利度胺)	521
THIOGUANINE (硫鸟嘌呤)	531
THIOTEPA (塞替派)	533
TOPOTECAN HYDROCHLORIDE (盐酸拓扑替康)	535
TOREMIFENE CITRATE (枸橼酸托瑞米芬)	539
TOSITUMOMAB (托西莫单抗)	541
TRASTUZUMAB (曲妥珠单抗)	542
TRETINOIN (维 A 酸)	543
URACIL MUSTARD (乌拉莫司汀)	558
VALRUBICIN (戊柔比星)	559
VINCRIStINE (长春新碱)	563

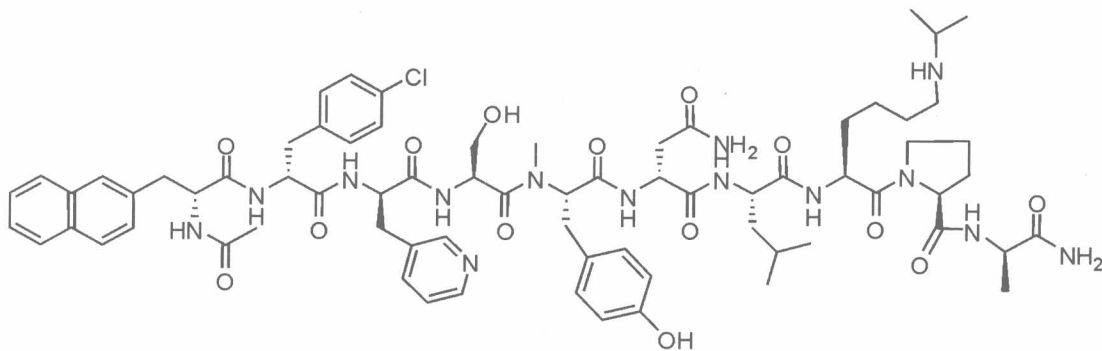
VINOELBINE TARTRATE (重酒石酸长春瑞滨)	571
VORINOSTAT (暂无中文名)	574
ZOLEDRONIC ACID (唑来膦酸)	577
附录 1 氨基酸缩写和化学结构对照表	582
附录 2 本书使用的词汇缩写表	585
附录 3 本书使用的期刊名称缩写表	602
附录 4 专利文献中使用的专利国家 (或地区及机构) 代码	609
附录 5 其他抗癌药物	611
附录 6 抗癌药物的化学结构特点	624
附录 7 本书中文药名索引	639
附录 8 总索引	641

## ABARELIX (阿巴瑞克)

药物中文名:

阿巴瑞克。

化学结构:



化学式:  $C_{72}H_{95}ClN_{14}O_{14}$

准确质量: 1414.68

相对分子质量: 1416.06

元素分析: C, 61.07; H, 6.76; Cl, 2.50; N, 13.85; O, 15.82

适应证:

阿巴瑞克可用于既不适宜接受促黄体生成素释放激素 (LHRH) 激动剂治疗又不能接受手术切除的晚期症状性前列腺癌 (PCA) 的姑息治疗。

药物简介:

阿巴瑞克对促黄体激素释放素 (LHRH) 受体具有高亲和性 ( $K_D=1\text{nmol/L}$ ), 属于 LHRH 拮抗剂。该药与 LHRH 受体结合后, 能阻断  $D\text{-His}^6\text{-GnRH}$  的激动作用。阿巴瑞克可被制成缓释剂型, 进入体内后, 在几天至几个月内连续释药。

药品说明书参考网页:

英文网页:

FDA 网页: <http://www.fda.gov/CDER/Drug/infopage/plenaxis/default.htm>;

美国药品网: <http://www.drugs.com/ppa/abarelix.html>;

美国处方药品网: <http://www.rxlist.com/cgi/generic/plenaxis.htm>。

中文网页: 暂无。

本品在美国的上市信息:

【活性成分】 ABARELIX (阿巴瑞克)

【商品名】 PLENAXIS

【剂型】 肌内注射剂

【规格】 100mg/小瓶

【申请号】 021320

【产品号】 001

【市场状态】 停止上市

【TE 代码】 没有

【批准日期】 Nov 25, 2003

【RLD】 无

【药品类别】 停止上市

【申请机构】 SPECIALITY EUROPEAN PHAR-  
MA LTD

**药物原料, 药品配方, 开发研究相关文献:**

- Buchalter JH, Horak ID, 2002. Combined therapy against tumors comprising estramustine phosphate and LHRH agonists or antagonists. WO 2002039996.
- Delansorne R, Bonnet P, Paris J. 2000. Pharmaceutical compositions based on  $\alpha$ -cyclodextrin for the oral administration of LH-RH analogues. WO 2000018423.
- Graul A, Rabasseda X, Castaner J. 1998. Abarelix: antineoplastic LHRH antagonist. *Drugs of the Future*, 23 (10): 1057~1061.
- Jabbour HN, Millar RP, Naor Z. 2006. Combination treatment methods combination treatment methods using GnRH and/or GnRH analog and prostaglandin synthesis inhibitor and/or prostaglandin receptor antagonist. WO 2006106311.
- Leivin D, Weissman A, Shoham Z. 2003. Gonadotropin releasing hormone antagonists: synthesis, pharmacology and clinical applications in human reproduction. *Biotechnology of Human Reproduction* (2003): 67~74.
- Lizio R, Damm M, Sarlikiotis W, et al. 2002. Solid peptide preparations for inhalation and their production. WO 2002017882.
- Lizio R, Petereit H-U, Roth E, et al. 2005. Multiparticle pharmaceutical dosage form containing a mucoadhesively formulated peptide or protein active substances and method for production. WO 2005007139.
- Solca F, Amelsberg A, Stehle G, et al. 2007. Combination treatment of cancer comprising EGFR/HER2 inhibitors. WO 2007054551.

## ALDESLEUKIN (阿地白介素)

**药物中文名:**

阿地白介素。中文别名: 阿地白介素、阿地流津、T 细胞生长因子、安捷素、安特鲁克、白介素-2、白细胞介素 2、德路生、基因工程白细胞介素-2、金路康、赛迪恩、辛洛尔、欣吉尔、新德路生、因特康、英路因、远策欣、悦康仙、重组人白介素 2、重组人白细胞介素-2。

**化学结构:**

本品为生物大分子。其化学式为  $C_{690}H_{1115}N_{177}O_{202}S_6$ , 其氨基酸序列<sup>①</sup>为:

PTSSSTKKTQLQLEHLLLDLQMLNGINNYKNPKLTRMLTFKIFYMPKKATELKHLL  
QCLEEELKPLEEVLNLAQSKNFHLRPRDLISININVIVLELKGSETTFMCEYADETA  
TIVEFLNRWITFAQSIISTLT

**适应证:**

阿地白介素可用于肾细胞癌、恶性黑素瘤、恶性淋巴瘤等恶性肿瘤。

**药物简介:**

阿地白介素可促进 T 淋巴细胞的增殖与分化; 维护白细胞介素-2 细胞系的长期增殖, 激活淋巴细胞的有丝分裂; 诱导及增强白细胞介素-2 对肿瘤细胞的杀伤力。

**药品说明书参考网页:**

英文网页:

FDA 网页: <http://www.fda.gov/cder/biologics/products/aldechi010998.htm>;

制药厂产品网页: <http://www.proleukin.com>;

美国处方药品网: <http://www.rxlist.com/cgi/generic/aldesleukin.htm>;

<sup>①</sup> 参见加拿大药物银行数据库, 网页为 <http://www.drugbank.ca/cgi-bin/getCard.cgi?CARD=DB00041>。

美国药品网: <http://www.drugs.com/ppa/aldesleukin.html>。

中文网页:

广东省人民医院人民医学部网页: 58.248.40.83/yxb/ypjs\_detail.asp? d\_id=877;

台大药事通讯: <http://www.ntuh.gov.tw/phar/inter/bulletin/2303.doc>。

#### 本品在美国的上市信息:

【活性成分】ALDESLEUKIN (阿地白介素)

【商品名】PROLEUKIN

【剂型】小瓶装

【规格】22MIU<sup>①</sup>小瓶

【申请号】103293

【产品号】001

【市场状态】上市

【TE代码】没有

【批准日期】May 5, 1992

【RLD】无

【药品类别】处方药

【申请机构】CHIRON

#### 药物原料, 药品配方, 开发研究相关文献:

Alessi TR, Moran SM. 2004. Method using a polymorphic form of 7- [3- (4-acetyl-3-methoxy-2-propylphenoxy) propoxy] -3, 4-dihydro-8-propyl-2H-1-benzopyran-2-carboxylic acid for mitigating the adverse effects of interleukin 2 (IL-2) . US 2004242676.

Alex S, Gupta SL, Minor JR, et al. 1995. Compatibility and activity of aldesleukin (recombinant interleukin-2) in presence of selected drugs during simulated Y-site administration; evaluation of three methods. Am. J. Health-Sys. Pharm., 2 (21): 2423~2426.

Hank JA, Surfus J, Gan J, et al. 1999. Distinct clinical and laboratory activity of two recombinant interleukin-2 preparations. Clin. Cancer Res. 5 (2): 281~289.

Hora M. 2006. Preparing microaggregates of aldesleukin (recombinant IL-2) with SDS suitable for pharmaceutical (anticancer) use. EP 1688146.

Hora M. 2006. Recombinant human interleukin-2 and use for cancer therapy. GB 2415904.

Moran SM. 2002. Method of diminishing the adverse effects of interleukin-2 with leukotriene B4 antagonist Biomed 101. U. S. Pat. Appl. Publ.

Nunberg JH, Newell AD, Doyle MV, et al. 1987. Treating animals using IL-2, formulations therefor and their preparation. EP 219979.

Parkhurst MR. 2007. Autologous natural killer cells and lymphodepleting chemotherapy for the treatment of cancer. WO 2007103901.

Safar M, Junghans RP. 2000. Interleukin 2 maintains biologic stability and sterility over prolonged time. Immunopharmacology. 49 (3): 419~423.

Solca F, Amelsberg A, Stehle G, et al. 2007. Combination treatment of cancer comprising EGFR/HER2 inhibitors. WO 2007054551.

## ALEMTUZUMAB (阿来组单抗)

#### 药物中文名:

阿来组单抗。

#### 化学结构:

本品为人源性单克隆抗体, 属于生物大分子。其化学式为 C<sub>6468</sub> H<sub>10066</sub> N<sub>1732</sub> O<sub>2005</sub> S<sub>40</sub>。

① MIU=million IU, 百万国际单位。



**适应证:**

可用于治疗那些对烷化剂和氟达拉滨耐药的 B 细胞慢性淋巴细胞白血病。

**药物简介:**

阿来组单抗是抗白血病药物, 在结构上是一种人源性单克隆抗体, 主要作用于 B 和 T 淋巴细胞上的 CD52 抗原, 从而破坏淋巴细胞。

**药品说明书参考网页:**

英文网页:

FDA 网页: <http://www.fda.gov/cder/foi/label/2001/alemmil050701LB.htm>;

制药厂产品网页: <http://www.campath.com>;

美国药品网: <http://www.drugs.com/ppa/alemtuzumab.html>;

美国处方药品网: <http://www.rxlist.com/cgi/generic/campath.htm>。

中文网页:

中国肿瘤医学网: [tumor.sosyao.com/Html/tumour\\_drug/WM/WM-A3/10\\_11\\_28\\_20\\_8549.htm](http://tumor.sosyao.com/Html/tumour_drug/WM/WM-A3/10_11_28_20_8549.htm);

广州抗百济肿瘤药房网页: <http://www.cancerotc.com/show-xinyao.asp?id=34>。

**本品在美国的上市信息:**

产品一:

【活性成分】 ALEMTUZUMAB (阿来组单抗)

【商品名】 CAMPATH

【剂型】 小瓶装; 静脉注射液

【规格】 10mg/ml

【申请号】 103948

【产品号】 001

【市场状态】 上市

【TE 代码】 没有

【批准日期】 May 07, 2001

【RLD】 无

【药品类别】 处方药

【申请机构】 ILEX PHARMACEUTICAL

产品二:

【活性成分】 ALEMTUZUMAB (阿来组单抗)

【商品名】 CAMPATH

【剂型】 小瓶装; 静脉注射液

【规格】 30mg/ml

【申请号】 103948

【产品号】 002

【市场状态】 上市

【TE 代码】 没有

【批准日期】 May 07, 2001

【RLD】 无

【药品类别】 处方药

【申请机构】 ILEX PHARMACEUTICAL

**药物原料, 药品配方, 开发研究相关文献:**

Alinari L, Lapalombella R, Andritsos L, et al. 2007. Alemtuzumab (Campath-1H) in the treatment of chronic lymphocytic leukemia. *Oncogene*, 26 (25): 3644~3653.

Bauzon M, Harkins RN, Hermiston T, et al. 2006. Synthetic regulatory and expression systems for the interferon- $\beta$  gene in treatment of autoimmune disease. WO 2006122972.

Duke RC, Franzusoff A, Haller AK, et al. 2006. Fusion proteins of hepatitis C virus proteins for use in vaccines and their manufacture in a yeast host. WO 2006044923.

Gaedicke GK, Veit G, Raphaela L, et al. 2006. Use of ligands of the antigen CDw52 for the treatment of diseases that are related to degenerated macrophages. EP 1645284.

Krenn V. 2005. Use of ligands of the antigen CD52 for the treatment of solid tumours and bone-related cancerous diseases. EP 1544213.

Mathew JM, DeFaria W, Kato T, et al. 2005. Abrogation of the alloreactive responses of cadaveric donor intestinal lymphocytes by intraoperative campath-1h exposure. *Transplant. Proceed.*, 37 (2): 1375~1378.