

新编 XINBIAN

# 实用抗肿瘤药物手册

● 主编/杜文力/田培虹

SHIYONG KANG ZHONGLIU YAOWU SHOUCHE



■ 河北科学技术出版社

**主 编** 杜文力 田培虹  
**副主编** 王 欣 钟晓伟 齐惠珍 周霞瑾  
**编 委** 张俊贞 刘 江 王明霞 侯 娟 牛玉凤  
冯 锐 李 伟 吴振华 董占军 张翠欣  
张旭东 韩学静

### 图书在版编目(CIP)数据

新编实用抗肿瘤药物手册/杜文力,田培虹主编. —  
石家庄:河北科学技术出版社,2007.12  
ISBN 978-7-5375-3630-1

I. 新… II. ①杜…②田… III. 抗癌药—手册  
IV. R979.1-62

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2007)第 195917 号

### 新编实用抗肿瘤药物手册

杜文力 田培虹 主编

---

出版发行 河北科学技术出版社  
地 址 石家庄市友谊北大街 330 号(邮编:050061)  
印 刷 河北科技大学印刷厂  
经 销 新华书店  
开 本 850×1168 1/32  
印 张 12.5  
字 数 310000  
版 次 2008 年 5 月第 1 版  
2008 年 5 月第 1 次印刷  
印 数 200  
定 价 26.00 元

---

# 前 言

近年来,由于生产抗肿瘤药物技术的飞速发展,越来越多的新药相继研制、开发出来,不断投入临床应用。大量抗肿瘤新药的上市给临床药物市场注入活力的同时也带来了诸多问题,比如药品名称、规格的增加给选药、用药造成了混乱。为了配合临床医师、药师和护理人员正确地了解和正确使用抗肿瘤药物,我们编写了这本手册,以备医护工作者参考。

该书内容基本涵盖了临床上应用的抗肿瘤药物,内容分为烷化剂、抗代谢药、抗肿瘤抗生素、抗肿瘤植物药、激素类抗肿瘤药、其他抗肿瘤药及辅助治疗药、免疫调节剂、抗肿瘤中成药等8个章节200余种药物。为了方便临床医护人员使用,本书采用尽可能详尽的形式概括了各药物的性状、药理作用及作用机制、适应证、注意事项、不良反应、药物相互作用、使用说明、用法与用量、制剂与规格等内容。对于一药多名,包括不同厂家标识的中英文商品名,我们也尽可能地汇总,以便于大家查询。

该书资料全面、新颖实用,实为肿瘤临床医师、药师、护理人员及医药院校师生的重要参考书。在本书编写过程中虽然对文献资料作了大量收集和阅读,但限于人力和水平,在审阅和核对中也难免遗漏和错误,请读者不吝赐教,提出宝贵意见。

编 者

2007年10月

# 目 录

## 一、烷化剂

氮芥 .....	(1)	多潘 .....	(25)
甲氧氮芥 .....	(3)	噻替哌 .....	(26)
甘露醇氮芥 .....	(5)	卡波醌 .....	(27)
苯丁酸氮芥 .....	(6)	卡莫司汀 .....	(29)
美法仑 .....	(8)	洛莫司汀 .....	(31)
胸腺嘧啶氮芥 .....	(10)	雷莫司汀 .....	(33)
嘧啶苯芥 .....	(10)	司莫司汀 .....	(35)
邻脂苯芥 .....	(11)	尼莫司汀 .....	(37)
异芳芥 .....	(11)	雷佐生 .....	(38)
环磷酰胺 .....	(12)	六甲蜜胺 .....	(40)
异环磷酰胺 .....	(17)	去水卫矛醇 .....	(41)
白消安 .....	(20)	亚胺醌 .....	(43)
雌莫司汀磷酸钠 .....	(23)		

## 二、抗代谢药

甲氨蝶呤 .....	(45)	氟尿苷 .....	(58)
氨蝶呤钠 .....	(49)	去氧氟尿苷 .....	(60)
氟尿嘧啶 .....	(51)	替加氟 .....	(62)
复方氟尿嘧啶 .....	(55)	卡莫氟 .....	(64)
复方呋喃氟尿嘧啶和 尿嘧啶 .....	(57)	阿糖胞苷 .....	(65)
		卡倍他滨 .....	(69)

依诺他滨 .....	(76)	羟基脲 .....	(82)
安西他滨 .....	(77)	羟胍 .....	(85)
吉西他滨 .....	(79)	培美曲塞 .....	(86)
磺巯嘌呤钠 .....	(81)		

### 三、抗肿瘤抗生素

放线菌素 D .....	(92)	阿柔比星 .....	(108)
丝裂霉素 .....	(95)	表柔比星 .....	(112)
平阳霉素 .....	(98)	吡柔比星 .....	(116)
柔红霉素 .....	(100)	博来霉素 .....	(119)
多柔比星 .....	(104)	色霉素 A <sub>3</sub> .....	(123)

### 四、抗肿瘤植物药

长春碱 .....	(124)	多西他赛 .....	(153)
长春新碱 .....	(127)	喜树碱 .....	(156)
长春地辛 .....	(131)	羟喜树碱 .....	(158)
长春瑞滨 .....	(134)	拓扑替康 .....	(159)
高三尖杉酯碱 .....	(137)	伊立替康 .....	(162)
鬼臼毒素 .....	(140)	依托泊苷 .....	(168)
秋水仙碱 .....	(143)	替尼泊苷 .....	(171)
石蒜碱 .....	(147)	斑蝥素 .....	(173)
石蒜内铵 .....	(148)	去甲斑蝥素 .....	(174)
紫杉醇 .....	(149)	靛玉红 .....	(176)

## 五、激素类抗肿瘤药

甲地孕酮·····	(179)	曲普瑞林·····	(210)
甲羟孕酮·····	(182)	己烯雌酚·····	(213)
氟他胺·····	(186)	溴醋己烷雌酚·····	(217)
复合睾酮脂·····	(187)	他莫昔芬·····	(218)
戈那瑞林·····	(189)	氨鲁米特·····	(221)
戈舍瑞林·····	(192)	福美司坦·····	(222)
亮丙瑞林·····	(195)	依西美坦·····	(225)
泼尼松·····	(199)	来曲唑·····	(229)
泼尼松龙·····	(203)		

## 六、其他抗肿瘤药及辅助治疗药

顺铂·····	(232)	重组人粒细胞集落刺激因子·····	(271)
卡铂·····	(237)	重组人粒细胞巨噬细胞集落刺激因子·····	(275)
奥沙利铂·····	(240)	丙卡巴胍·····	(279)
环硫铂·····	(242)	达卡巴嗪·····	(280)
美司钠·····	(243)	米托蒽醌·····	(282)
门冬酰胺酶·····	(244)	伊马替尼·····	(286)
利妥昔单抗·····	(250)	吉非替尼·····	(292)
群司珠单抗·····	(254)	埃罗替尼·····	(296)
西妥昔单抗·····	(259)	氨磷汀·····	(298)
贝伐单抗·····	(261)	重组人血管内皮抑制素·····	(300)
维 A 酸·····	(262)	昂丹司琼·····	(301)
西佐喃·····	(265)		
亚叶酸钙·····	(266)		
雷莫司琼·····	(269)		

托烷司琼····· (305)      格拉司琼····· (308)

## 七、免疫调节剂

重组人白介素-2 ····· (311)	灵菌素····· (334)
薄芝····· (314)	免疫核糖核酸····· (336)
干扰素····· (316)	溶链菌制剂····· (337)
短小棒状杆菌菌苗····· (318)	伤寒杆菌脂多糖····· (339)
A型链球菌甘露聚糖 ····· (320)	螺旋藻····· (340)
肺炎克雷白杆菌膜糖蛋白 ····· (323)	乌苯美司····· (340)
盖福润····· (324)	胸腺肽····· (342)
红色诺卡氏菌细胞壁骨架 ····· (324)	胸腺五肽····· (345)
聚肌苷酸—聚胞苷酸 ··· (326)	银耳多糖····· (346)
聚腺尿苷酸····· (328)	植物血球凝集素····· (347)
卡介苗····· (328)	猪苓多糖····· (348)
抗乙肝免疫核糖核酸 ····· (333)	转移因子····· (350)
	左旋咪唑····· (352)
	芸芝多糖····· (355)
	香菇多糖····· (357)
	保尔佳····· (359)

## 八、抗肿瘤中成药

### (一) 具有升白细胞作用的中成药

强力康冲剂····· (362)	参芪片····· (364)
灵芝糖浆····· (362)	生白片····· (364)
生血宝····· (363)	爱福宁····· (364)
生白口服液····· (363)	复方皂矾丸····· (365)

血生欣····· (365)

## (二)具有增强免疫力作用的中成药

回生口服液····· (366)	精黄芝口服液····· (369)
扶正女贞素片····· (366)	金菌灵····· (370)
香菇多糖····· (367)	云芝多糖 K ····· (370)
云芝糖肽····· (368)	猪苓多糖····· (370)
黄芪注射液····· (368)	参芪扶正注射液····· (371)
参麦注射液····· (369)	金克冲剂····· (372)

## (三)具有抗肿瘤作用的中成药

解毒维康片····· (372)	泰福康胶囊····· (379)
食道平散····· (372)	宫瘤清胶囊····· (379)
威麦宁胶囊····· (373)	安替可····· (379)
参莲胶囊····· (373)	平消片(胶囊)····· (380)
回生胶囊····· (374)	亚砷酸注射液····· (380)
软坚口服液····· (374)	复方苦参注射液····· (381)
金复康口服液····· (374)	艾迪注射液····· (382)
金龙胶囊····· (375)	乌头注射液····· (382)
鸦胆子油口服乳液····· (375)	肿节风注射液····· (383)
参一胶囊····· (376)	苦参总碱····· (383)
白花蛇舌草注射液····· (377)	华蟾素注射液····· (384)
消癌平片····· (377)	得力生注射液····· (385)
金蒲胶囊····· (377)	复方半边莲注射液····· (386)
消症益肝片····· (378)	榄香烯乳····· (387)
康力欣····· (378)	去甲斑蝥素····· (387)
楼莲胶囊····· (378)	



# 一、烷化剂

## 氮芥

**【别名】** 恩比兴、HN<sub>2</sub>。

**【性状】** 常用其盐酸盐,为白色结晶性粉末,有引湿性与腐蚀性。在水中极易溶解,在乙醇中易溶。熔点为 108~111℃。

**【药理作用及作用机制】** 氮芥是最早用于临床并取得突出疗效的抗肿瘤药物。为双氯乙胺类烷化剂的代表,它是一高度活泼的化合物。本品进入体内后,通过分子内成环作用,形成高度活泼的乙烯亚胺离子,在中性或弱碱条件下迅速与多种有机物质的亲核基团(如蛋白质的羧基、氨基、巯基、核酸的氨基羟基、磷酸根)结合,进行烷基化作用。氮芥最重要的反应是与鸟嘌呤第 7 位氮共价结合,产生 DNA 的双链内的交叉联结或 DNA 的同链内不同碱基的交叉联结。G<sub>1</sub> 期及 M 期细胞对氮芥的细胞毒作用最为敏感,由 G<sub>1</sub> 期进入 S 期延迟。大剂量时对各周期的细胞和非增殖细胞均有杀伤作用。该药水溶液极不稳定,进入体内作用迅速,在血中停留的时间只有 0.5~1 分钟,90%在 1 分钟内由血中消失。24 小时内 50%以代谢物形式排出。此外,本品尚有弱免疫抑制作用。

**【适应证】** 主要用于恶性淋巴瘤及癌性胸膜、心包及腹腔积液。目前已很少用于其他肿瘤,对急性白血病无效。与长春新碱(VCR)、甲基卡肼(PCZ)及泼尼松(PDN)合用治疗霍奇金病有较高的疗效,对卵巢癌、乳腺癌、绒癌、前列腺癌、精原细胞瘤、鼻咽癌

(半身化疗法)等也有一定疗效;腔内注射用以控制癌性胸腹水有较好疗效;对由于恶性淋巴瘤等压迫呼吸道和上腔静脉压迫综合征引起的严重症状,可使之迅速缓解。

**【注意事项】** 1. 本药注射勿漏于血管外,一旦漏出血管外应立即局部皮下注射 0.25% 硫代硫酸钠或生理盐水及冷敷 6~12 小时。

2. 用药期间应每周查白细胞、血小板 1~2 次。

3. 氮芥溶解后极不稳定,使用时需新鲜配制,溶入 10ml 生理盐水后立即静脉注入。

4. 烷化剂有致突变或致畸胎作用,孕妇慎用。

5. 有致癌性,长期应用氮芥,继发性肿瘤发生的危险增加。

6. 本品可使血及尿中尿酸增加,血浆胆碱酯酶减少而干扰诊断。

7. 本品应新鲜配制,在 10 分钟内使用,且不能用于皮下注射、肌注和口服。

**【不良反应】** 1. 局部反应:氮芥对局部组织有较强刺激作用,反复注射的静脉可引起静脉炎和栓塞性静脉炎,药液漏于血管外可引起局部肿胀、疼痛,甚至组织坏死、溃疡。

2. 胃肠反应:食欲减退、恶心、呕吐或腹泻,其中呕吐较突出,可应用恩丹西酮或胃复安及地塞米松止吐。

3. 骨髓抑制:是氮芥的剂量限制性毒性反应,可引起明显白细胞、血小板减少,最低值出现在用药后 7~15 日,2~3 周可恢复。

4. 其他:可有头晕、乏力、脱发、闭经、不育等。

**【药物相互作用】** 烷化剂的耐药性与 DNA 受损后的修复能力有关,咖啡因、氯喹可阻止其修复,故可增效。本品与氯霉素及磺胺类药合用可加重骨髓的抑制作用。使用本品前宜加用止吐剂如恩丹西酮或格拉司琼等,减轻胃肠道反应。

**【用法与用量】** 因本品有明显的局部刺激作用,易引起组织

坏死,仅供动脉、静脉及腔内给药。

**静脉注射:**每次 5~10mg,每周 1~2 次,总量 30~60mg,疗程间隔 2~4 周,每次量用生理盐水 10ml 溶解,从正在输注 5%葡萄糖液的乳胶管中刺入慢速推注,注入后继续输液一定时间,以减轻对静脉的刺激。

**动脉注射:**每次 5~10mg,每日或隔日 1 次,用生理盐水溶解。

**腔内注射:**每次 10~20mg,溶于 20~40ml 生理盐水中,在抽液后注入胸或腹腔内,注入后 5 分钟内应多次变换体位,使药液在腔内分布均匀,每 5~7 日 1 次,4~5 次为 1 个疗程。

**腹主动脉下半身阻断给药:**每次 0.2mg/kg,每周 2~3 次,总量 60mg 为 1 个疗程。方法:用腹带加纱布团用血压计气囊加压阻断腹主动脉后,由上肢静脉快速注入药物,10~15 分钟后解除腹带。

**【制剂与规格】** 注射液:5mg : ml,10mg : 2ml;粉针剂:5mg,10mg。

**【贮藏】** 密闭、避光保存。

## 甲氧氮芥

**【别名】** 癌得命、癌得平、氧化氮芥。

**【性状】** 本品为白色结晶或结晶性粉末。从丙酮中得到柱状结晶,熔点(MP)109~110℃。无臭,易溶于水、乙醇、丙酮,微溶于乙醚。

**【药理作用及作用机制】** **药效学** 本品可抑制癌细胞的核分裂过程,使前、中、后各期的分裂现象减少,对癌细胞核酸代谢也有一定的抑制作用。本品在体内被还原成氮芥而起作用。本品局部刺激症状轻微,可用于口服及肌注。但见效慢,对骨髓抑制时间较长。

**药动学** 本品口服后能迅速吸收,半小时后血药浓度较高,以

后逐渐下降,3 小时后下降至较低水平。本品静注后很快水解,几分钟内 90%从血中消失。本品可通过与生理胺、胆碱共享的一种输送机制穿透细胞。吸收后可分布在多脏器组织及肿瘤中,而以骨髓、肾和肝中最高,主要从尿中排出,24 小时内约 50%代谢产物由尿排出,而原形排出量少于 0.01%。亦有少量从粪便中排出。

**【适应证】** 1. 主要用于恶性淋巴瘤及癌性胸膜炎、心包及腹腔积液。

2. 适用于慢性粒细胞白血病、恶性淋巴瘤、多发性骨髓瘤、骨转移性癌、乳腺癌、肺癌等。

**【注意事项】** 严重感染者;以前曾接受过化学治疗或放射治疗的患者慎用。

**【不良反应】** 1. 本品毒性反应与氮芥相似,主要毒性反应是骨髓抑制,约 1/3 患者有白细胞减少,白细胞减少与每日用药剂量有关。少数患者有血小板减少和出血倾向。个别病例停药后白细胞仍继续下降,一般在停药后或服用碳酸氢钠可减少该反应。

2. 其他尚有恶心、呕吐等不良反应。本品局部刺激作用和早期毒性反应都比氮芥轻。因此可口服或肌注。对骨髓抑制时间较长。

3. 其他毒性作用有:斑丘疹样皮疹、脱发、听力丧失和耳鸣、眩晕、黄疸、月经失调、精子形成受阻,完全性性腺发育不良,特别在淋巴瘤病人可发生血尿酸过多。给药前应适量饮水以防止尿酸性肾病。

4. 局部应用常出现变应性的过敏反应,常需进行脱敏。

**【用药须知】** 1. 本品有一定蓄积作用,故不宜大剂量连续用药,总剂量超过 700mg 应密切注意血象变化,在停药后 1~2 周内仍应观察血象。

2. 为了减少胃肠道反应,可与碳酸氢钠 1g 同服。

3. 一般每日量以不大于 50mg 较安全;显效量为 500mg 左

右,疗程总量为 500~1000mg。

4. 慢性粒细胞性白血病,用本品维持治疗时,缓解期显著延长,对白消安耐药的病例应用本品仍然有效。

**【用法与用量】** 肌内或静脉注射:每次按 0.5~1.0mg/kg 给药,每日或隔日注射 1 次,总量达 500~1000mg 为 1 个疗程。瘤体局部注射:每次 0.1g,溶于 10ml 生理盐水后注射,每 5~7 日注射 1 次,1 个疗程总量为 0.5g。腔内注射:每次 0.1g,溶于 10ml 生理盐水后注射,每 5~7 日注射 1 次,1 个疗程总量为 0.5g。口服给药,每日 25~50mg 和碳酸氢钠 1g 同服,一般用药剂量达到 500mg 以上时,应逐渐减量至每日 25mg,总量达 1000mg 为 1 个疗程。维持剂量视白细胞数及耐受情况而定,一般每次 25mg,每周 1~2 次。慢性粒细胞性白血病,起始剂量为每日 50~100mg,当白细胞迅速下降或低于  $20.0 \times 10^9/L$  时,则应减低每日剂量,当白细胞降至正常范围,即给予维持量。

**【制剂与规格】** 注射剂:50mg; 片剂:20mg,25mg。

**【贮藏】** 于阴凉处避光保存。

## 甘露醇氮芥

**【别名】** 甘露莫司汀、NSC-9698。

**【性状】** 常用其盐酸盐,本品为从 80% 乙醇中得到结晶,无臭或几乎无臭。熔点(MP)239~241℃(分解),溶于水(1:2),微溶于乙醇,不溶于无水乙醇、乙醚和氯仿;2.5% 水溶液 pH 值为 2~3.5,在室温下稳定。

**【药理作用及作用机制】** 本品为烷化剂,为细胞毒抗肿瘤药。

**【适应证】** 主要适用于慢性白血病、淋巴肉瘤、多发性骨髓瘤等。

**【不良反应】** 毒性反应与氮芥相似但较轻,注于血管外可引起局部组织坏死,长期大量使用可引起肝功损害。

**【用法与用量】** 静脉注射:每次 50~100mg,每日或隔日 1 次。口服给药,维持量每周 100~150mg,如白细胞降至  $3 \times 10^9/L$ ,应停药。

**【制剂与规格】** 注射剂:50mg。

## 苯丁酸氮芥

**【别名】** 苯丁酰氮芥、氯氨布西、瘤可宁、瘤可然、CB-1348、CLB。

**【性状】** 类白色结晶性粉末,微臭。遇光或放置日久,色渐变深。不溶于水,易溶于乙醇、氯仿,在丙酮中极易溶解。熔点为  $64 \sim 68^\circ\text{C}$ 。

**【药理作用及作用机制】 药效学** 本品为细胞周期非特异性抗肿瘤药物,通过形成不稳定的亚乙基亚胺而产生细胞毒性作用,作用较慢,骨髓抑制的出现及恢复亦较慢。本品干扰 DNA 及 RNA 的功能,能与 DNA 发生交叉联结,对细胞周期中 M 期及  $G_1$  期细胞的作用最强。本品低剂量时选择性地抑制淋巴细胞,使淋巴组织萎缩,抑制抗体的合成;较大剂量可致各类白细胞减少,造成严重的骨髓抑制。其免疫抑制诱导时间明显地较环磷酰胺长,但严重的骨髓抑制较少发生。

**药动学** 口服后吸收完全。本品及其代谢物与血浆蛋白结合广泛,蛋白结合率约 99%。半衰期为 1.5 小时。由肾排泄,50% 在 24 小时内随尿液排出。

**【适应证】** 1. 主要用于慢性淋巴细胞白血病,也适用于恶性淋巴瘤、多发性骨髓瘤、巨球蛋白血症、卵巢癌。

2. 作免疫抑制剂使用。

**【注意事项】** 1. 禁忌证:妊娠初期的 3 个月(因烷化剂有致突变及致畸胎作用,可增加胎儿死亡及先天性畸形)。

2. 有骨髓抑制、痛风、感染或泌尿道结石史者慎用;过去接受

过放射治疗或反复多次多种药物联合化疗者慎用。

3. 用药期间须定期检查白细胞计数及分类、血小板计数,定期作肾功能检查(尿素氮、肌酐清除率),定期检查肝功能(血清胆红素及丙氨酸氨基转移酶)和测定血清尿酸水平。

**【不良反应】** 1. 造血系统:最常见的不良反应是免疫抑制与骨髓抑制,尤其是长期服用本品者。主要为淋巴细胞减少,对粒细胞和血小板的抑制较轻,如能及时停药,一般是可逆的,但也有造成严重不可逆骨髓损伤的报道。此药有致肿瘤作用,有报道应用它治疗巨球蛋白血症、慢性淋巴性白血病、类风湿性关节炎、乳腺癌等时发生急性白血病、恶性组织细胞增多症及发生急性髓细胞白血病。

2. 消化系统:本品常引起恶心、呕吐、腹泻及口腔溃疡。少见的不良反应有肝损伤和黄疸。

3. 神经系统:震颤、肌紧张、神志不清、激动、共济失调等均有报告,一般停药后可以逐渐恢复。偶见本品引起昏迷。此药的神经毒性作用罕见,主见于儿童用药过量或肾病综合征患者。

4. 本品还可能引起肺纤维化、间质性肺炎、药物热、皮肤过敏、皮炎、膀胱炎、不育症、继发性肿瘤等。应用此药达 400mg,可出现进行性及可逆性精子减少,总剂量在 400mg 以上则出现精子缺乏及睾丸生殖障碍。长期应用对青春期患者也可产生精子缺乏或持久不育。此药常致卵巢功能失常,并与剂量及年龄有关。

**【用药须知】** 1. 为防止用药期间出现尿酸性肾病或高尿酸血症,可采用大量补液、碱化尿液,或给予别嘌醇。

2. 间歇给药比每日小剂量维持对骨髓毒性较小,前一用药方式在两疗程间可使骨髓恢复。

3. 白细胞(特别是粒细胞)突然减少,应减量。

4. 本品在治疗后 3 周左右才能在临床上看到疗效,不应在 4 周内因未见明显改善而停止治疗。

5. 活疫苗使感染的风险增加,故接受本药免疫抑制化疗的病人将不接种活疫苗。白血病患者除外,但在停止化疗至接种活疫苗之间至少间隔 3 个月。

6. 与其他骨髓抑制药物同时应用可增加疗效,但剂量必须适当调整。

**【用法与用量】** 1. 抗癌:每日按体重 0.2mg/kg 给药,每 3~4 周连服 10~14 日或按体重 0.4mg/kg 给药,每 2 周用药 1 次。

2. 免疫抑制:每日 3~6mg,早饭前 1 小时或晚饭后 2 小时服用,连服数周,待疗效或骨髓抑制出现后减量,总量一般为 300~500mg。

**【制剂与规格】** 片剂:2mg。

## 美法仑

**【别名】** 癌克安、爱克兰、L-苯丙氨酸氮芥、瘤克安、马尔法兰、米尔法兰、马法兰、美法仑、L-溶血瘤素、左旋溶肉瘤素、左旋溶血瘤素。

**【性状】** 本品为白色至微黄色粉末,无臭。几乎不溶于水、氯仿、乙醚,溶于乙醇和稀矿酸,微溶于甲醇。对光、热和湿不稳定。其左旋体为 L-苯丙氨酸氮芥(L-PAM),其消旋体为溶肉瘤素。

**【药理作用及作用机制】** **药效学** 本品是双功能烷化剂,是细胞周期非特异性药物,具有细胞毒性作用。主要用于与 DNA 及 RNA 发生交叉联结,以抑制蛋白质的合成。

**药动学** 由于食物降低其吸收,故从胃肠道吸收本品不完全,生物利用度在 25%~89% 之间。吸收后,它通过体液迅速地分布,分布容积约 0.5L/kg,主要通过自发的水解失活。蛋白质结合率最初为 50%~60%,12 小时后渐增为 80%~90%。本品的半衰期为 40~140 分钟。可随尿排泄,其中约 10% 为原形。

**【适应证】** 本品对多发性骨髓瘤有明显疗效,也适用于卵巢



癌。

**【注意事项】** 1. 禁忌证:近期患水痘或带状疱疹者;妊娠初期的3个月。

2. 肾功能损害者,有痛风史者,泌尿道结石者慎用。

3. 其他注意事项:本品可引起血及尿中尿酸增高,也可引起羟基吲哚醋酸(5-HIAA)增加。用药期间应定期检查白细胞、血小板以及血尿素氮、肌酐、尿酸。

**【不良反应】** 1. 血液系统:骨髓抑制是最常见的不良反应,可致血细胞及血小板下降,白细胞及血小板在给药后2~3周最低,在4~8周可恢复正常。长期应用致癌的危险性明显增加,特别是白血病或骨髓增生综合征。

2. 消化系统:多数患者在服药后数小时有恶心、呕吐及食欲减退等,严重者可持续2~4日。

3. 其他:对性腺功能有抑制作用,造成精子缺乏及闭经(对性腺功能的影响与治疗的剂量及时间有关);长期给药的病例中可发生严重的复发性脉管炎及肺纤维化;偶见过敏反应,表现为荨麻疹及皮疹。

**【药物相互作用】** 1. 本品可引起血尿酸增加,别嘌醇可防止或缓解本品所引起的高尿酸血症。

2. 苯丙氨酸氮芥与环孢菌素合用会增加其不良反应。

3. 食物降低苯丙氨酸氮芥的生物利用度。

**【用药须知】** 1. 本品过量将引起死亡。已报道伴随胃肠外的本品过量的毒性作用包括:严重的恶心和呕吐、意识障碍,癫痫发作、肌肉麻痹及拟胆碱能作用。

2. 儿童用大剂量本品与萘啶酸合用,会引起致命的出血性小肠结肠炎。

**【用法与用量】** 口服给药:多发性骨髓瘤,每日按体重0.25mg/kg给药,连用5日,每5~6周重复疗程。卵巢癌,每日按