

抗肿瘤药物 临床应用指南

江 滨 陈书长 主编

中国协和医科大学出版社

抗肿瘤药物临床应用指南

江 滨 陈书长 主编

编者（以姓氏笔画为序）

王 卉 （北京大学人民医院血研所）

江 倩 （北京大学人民医院血研所）

江 滨 （北京大学人民医院血研所）

白春梅 （中国医学科学院中国协和医科大学北京协和医院肿瘤化疗科）

宁晓红 （中国医学科学院中国协和医科大学北京协和医院肿瘤化疗科）

应红艳 （中国医学科学院中国协和医科大学北京协和医院肿瘤化疗科）

陈书长 （中国医学科学院中国协和医科大学北京协和医院肿瘤化疗科）

赵 林 （中国医学科学院中国协和医科大学北京协和医院肿瘤化疗科）

图书在版编目 (CIP) 数据

抗肿瘤药物临床应用指南 / 江滨, 陈书长主编. —北京: 中国协和医科大学出版社, 2005.3

ISBN 7-81072-654-4

I. 抗... II. ①江...②陈... III. 抗癌药—临床应用 IV. R979.1

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2005)第011411号

抗肿瘤药物临床应用指南

主 编: 江 滨 陈书长

责任编辑: 李春风

出版发行: 中国协和医科大学出版社

(北京东单三条九号 邮编 100730 电话 65260378)

网 址: www.pumcp.com

经 销: 新华书店总店北京发行所

印 刷: 北京丽源印刷厂

开 本: 787×960 毫米 1/32 开

印 张: 23.625

字 数: 400 千字

版 次: 2005 年 5 月第一版 2005 年 5 月第一次印刷

印 数: 1—5000

定 价: 41.00 元

ISBN 7-81072-654-4/R·647

(凡购本书, 如有缺页、倒页、脱页及其他质量问题, 由本社发行部调换)

前 言

近十年来，由于肿瘤研究的飞速进展，越来越多的化学治疗和生物治疗的药物相继开发出来，并供临床应用。特别是，国外分子靶向治疗和基因治疗药物的大量涌现和逐步进入临床应用，使人大有眼花缭乱之感。因而临床医生、医学生和护士迫切需要一本简明扼要、集中概述抗肿瘤药物应用的临床手册以供随时参考。中国医学科学院、中国协和医科大学、北京协和医院肿瘤化疗科和北京大学人民医院血研所部分临床医生用 1 年多时间共同编写了这本小书，希望对于从事肿瘤临床专业的相关医务同道有所帮助。

本书内容基本涵盖了临床上应用的抗肿瘤药物，内容分常用的化学治疗药物、生物反应调节剂、国外新开发的分子靶向和基因治疗药物，及常用的部分具有抗肿瘤和免疫调节作用的中药等四部分。分子靶向治疗药物大部分已经在国外上市，少部分为正在进行临床 II 期研究、有可能上市的药物。

为了方便临床医护人员使用，本书采用尽可能

简短的形式概括了该药物的作用机制、药代动力学、适应证、禁忌证、剂量、剂型、有效率、配伍及不良反应等内容。同时，结合我们临床应用经验及参考文献资料特别编写了临床应用规程一节，供同道参考。对于一药多名，包括不同厂家生产的中英文商品名，我们也尽可能地汇总，以便于大家查询。

由于参考资料可能不够全面，某些药物概述肯定会有遗漏和谬误之处，尤其是一些目前临床上很少应用的旧的化疗药物和一些中药，源于资料少及药物临床研究的局限性，其药代动力学和单药有效率等仅供参考。对于抗肿瘤药物的剂量，本书的列出的常用量仅供参考，临床应用时应针对不同患者个体情况、不同肿瘤治疗方案制定。在此提请临床医生特别注意。

由于我们水平有限，对于本书中谬误之处，请广大同道不吝指正。

北京协和医院肿瘤化疗科周艳萍、管梅、牛奕、邵亚娟等同志为本书做了大量资料查询、整理工作，特此一并致谢。

江 滨
陈书长

目 录

一、烷化剂	(1)	<u>1</u>
盐酸氮芥 (Nitrogen mustard)	(1)	目
左旋苯丙氨酸氮芥 (Malfalan)	(5)	录
苯丁酸氮芥 (Chlorambucil)	(10)	
泼尼氮芥 (Prednimustine)	(14)	
雌莫司汀磷酸盐 (Estramustine phosphate)	(16)	
消瘤芥 (Nitrocaphane)	(18)	
甘磷酰芥 (Glyciphosphoramide)	(21)	
环磷酰胺 (Cyclophosphamide)	(23)	
异环磷酰胺 (Ifosfamide)	(29)	
美司那 (Mesna)	(35)	
白消安 (Busulphan)	(38)	
卡莫司汀 (Carmustine)	(43)	
洛莫司汀 (Lomustine)	(48)	
尼莫司汀 (Nimustine)	(52)	
雷莫司汀 (Ranimustine)	(55)	
司莫司汀 (Semustine®)	(58)	

福莫司汀 (Fotemustine)	(60)
塞替派 (Thiotepa lederle)	(63)
亚胺醌 (Ethyleniminoquinonum)	(68)
阿多来新 (Adozelesin)	(70)
卡折来新 (Carzelesin)	(70)
特莫唑胺 (Temozolomide)	(72)
二溴卫矛醇 (Dibromodulcitol)	(76)
米托唑酶胺 (Mitozolamide)	(78)

二、抗代谢药物

甲氨蝶呤 (Methotrexat)	(79)
雷替曲塞 (Raltitrexed)	(88)
三甲曲沙 (Trimetrexate)	(91)
依达曲沙 (Edatrexate)	(95)
培美曲塞 (Pemetrexed)	(97)
硫鸟嘌呤 (Thioguanine)	(103)
巯嘌呤 (Mercaptopurine)	(106)
氟尿嘧啶 (Fluorouracil)	(110)
卡莫氟 (Carmofur)	(116)
替加氟 (Tegafur)	(120)
优福啶 (Tegafur-uracil)	(123)
5 - 氮杂胞嘧啶 (Azacitidine)	(125)
地西他滨 (Decitabine)	(128)
卡培他滨 (Capecitabine)	(131)

环胞苷 (Ancitabine)	(136)
吉西他滨 (Gemcitabine)	(139)
六甲蜜胺 (Hexamethylmelamine)	(145)
S - 1	(149)

三、抗肿瘤抗生素

(153)

阿霉素 (Adriamycin [®])	(153)
吡喃阿霉素 (Perarubicin)	(158)
表阿霉素 (Epirubicin ^[基])	(161)
柔红霉素 (Daunorubicin)	(166)
枸橼酸柔红霉素脂质体 (Daunorubicin citrate liposomal injection)	(171)
伊达比星 (Edarubicin)	(174)
米托蒽醌 (Mitoxantrone)	(178)
阿柔比星 (Aclarubicin ^基)	(184)
博来霉素 (Bleomycin)	(187)
盐酸平阳霉素 (Pingyangmycin)	(192)
培洛霉素 (Pepleomycin)	(194)
放线菌素 D (Dactinomycin)	(199)
丝裂霉素 (Mitomycin)	(203)
光辉霉素 (Mithramycin)	(206)
链脲霉素 (Streptozocin)	(210)
比生群 (Bisantrene)	(213)
9 - 甲氧基吡唑啉吡啶 (9 - methoxypyrazoloa-	

cridine)	(216)
----------------	-------

四、铂类 (218)

顺铂 (Cisplatin)	(218)
卡铂 (Carboplatin)	(224)
奥沙利铂 (Oxaliplatin)	(228)
乐铂 (Lobaplatin)	(233)
依铂 (Eptaplatin)	(235)
赛特铂 (Satraplatin)	(237)
奈达铂 (Nedaplatin)	(239)

五、生物碱 (242)

硫酸长春新碱 (Vincristine sulfate)	(242)
长春花碱 (Vinblastine)	(247)
长春瑞宾 (Vinorelbine)	(250)
长春地辛 (Vindesine)	(255)
紫杉醇 (Paclitaxel)	(259)
多西紫杉醇 (Docetaxel)	(265)
替尼泊苷 (Teniposide)	(269)
依托泊苷 (Etoposide)	(273)
依托泊苷磷酸盐 (Etoposide phosphate)	(278)
伊立替康 (Irinotecan)	(279)
拓扑替康 (Topotecan)	(284)
甲基羟基玫瑰树碱 (Methylhydroxy	

ellipticine)	(289)
靛玉红 (Indirubin)	(292)
羟基喜树碱 (Hydroxycamptothecin)	(294)
9-氨基喜树碱 (9-aminocamptothecin)	(297)
卢比替康 (9-nitrocamptothecin)	(299)
三尖杉酯碱 (Harringtonine)	(302)
秋水仙酰胺 (Colchicine amide)	(305)
榄香烯乳剂 (Elemene emulsion)	(307)
六、核酸类似物	(311)
氟达拉滨 (Fludarabine phosphate)	(311)
二氯脱氧腺苷 (2-Chlorodeoxy- adenosine)	(318)
喷司他丁 (Pentostatin)	(322)
七、激素及其拮抗剂	(328)
泼尼松 (Prednisone)	(328)
泼尼松龙 (Prednisolone [®])	(333)
甲基泼尼松龙 (Methylprednisolone)	(336)
氢化可的松 (Hydrocortisone)	(339)
地塞米松 (Dexamethasone)	(343)
己烯雌酚 (Estroben)	(348)
溴醋己烷雌芬 (Hexestrole bromoacetate) ...	(352)
甲孕酮 (Medroxyprogesterone)	(354)

甲地孕酮 (Megestrol acetate)	(358)
他莫昔芬 (Tamoxifen citrate)	(362)
屈洛昔芬 (Droloxifene)	(365)
托瑞米芬 (Toremifene)	(367)
氨鲁米特 (Aminoglutethimide)	(370)
福美司坦 (Formestane)	(375)
依西美坦 (Exemestane)	(378)
普洛美坦 (Plomestane)	(381)
阿那曲唑 (Anastrozole)	(382)
来曲唑 (letrozole)	(386)
伏氯唑 (Vorozole)	(389)
戈舍瑞林 (Goserelin)	(390)
戈那瑞林 (Gonadorelin)	(394)
曲普瑞林 (Triptorelin TM)	(397)
醋酸亮丙瑞林 (Leuprorelin)	(401)
丙酸睾丸酮 (Testosterone propionate)	(405)
氟他胺 (Flutamide)	(408)
尼鲁特米 (Nilutamide)	(411)
比卡鲁胺 (Bicalutamide)	(415)
奥曲肽 (Octreotide)	(419)

八、化疗保护剂 (423)

地拉佐生 (Dexrazoxane)	(423)
阿米福汀 (Amifostine)	(425)

九、杂类 (429)

羟基脲 (Hydroxyurea) (429)

盐酸甲基苄胍 (Procarbazine HCl) (433)

氯苯二氯乙烷 (Mitotane) (438)

乙双吗啉 (Bimolane) (442)

去甲斑蝥素 (Norcantharidin) (444)

帕米膦酸二钠 (Pamidronate disodium) (446)

唑来膦酸 (Zoledronate) (451)

达卡巴嗪 (Dacarbazine) (455)

门冬酰胺酶 (Asparaginase) (459)

培门冬酶 (Pegasparaginase) (464)

甲氧沙林 (Methoxsalen) (466)

安归宁 (Agrylin) (470)

甘氨双唑钠 (Sodium Glycididazole) (473)

十、免疫调节剂 (477)

α 干扰素 (Interferon α) (477)

β 干扰素 (Interferon β) (482)

γ 干扰素 (Interferon γ) (485)

白介素 - 2 (Interleukin - 2) (488)

白细胞介素 - 3 (Interleukin - 3) (493)

白细胞介素 - 6 (Interleukin - 6) (494)

白细胞介素 - 11 (Interleukin - 11) (495)

血小板生成素 (Thrombopoietin)	(499)
粒细胞集落刺激因子 (Granulocyte colony stimulating factor)	(503)
粒细胞巨噬细胞集落刺激因子 (Granulocyte - macrophage colony stimulating factor)	(509)
红细胞生成素 (Erythropoietin)	(513)
干细胞因子 (Stem cell factor)	(519)
肿瘤坏死因子 (Tumor necrosis factor)	(521)
胸腺肽 (Thymosin)	(524)
核糖核酸 (Ribonucleic acid)	(527)
香菇多糖 (Lentinan)	(530)
康莱特 (Kanglaite)	(532)
乌苯美司 (Ubenimex)	(535)
溶血性链球菌制剂 (Picibanil)	(540)
罗非昔布 (Rofecoxib)	(543)
左旋咪唑 (Levamisole Hydrochloride)	(548)

十一、靶向治疗药

伊马替尼 (Imatinib)	(551)
利妥昔单抗 (Rituximab)	(556)
泽娃灵 (Zevalin)	(560)
Alemtuzumab	(563)
曲妥珠单抗 (Trastuzumab)	(568)

西妥昔 (Cetuximab)	(574)
达昔单抗 (Daclizumab)	(579)
Denileukin diftitox	(581)
吉妥单抗 (Gemtuzumab ozogamicin)	(585)
阿瓦斯丁 (Avastin®)	(589)
血管内皮抑素 (Endostatin)	(594)
癌立消 (Neovastat)	(595)
巴马司他 (Batimastat)	(597)
COL-3	(599)
马立马司他 (Marimastat)	(601)
全反式维甲酸 (All-trans retinoic acid)	(605)
蓓萨罗丁 (Bexarotene)	(608)
亚砷酸 (Arsenious acid)	(614)
吉非替尼 (Gefitinib)	(618)
埃罗替尼 (Erlotinib)	(623)
沙立度胺 (Thalidomide)	(627)
Revimid	(631)
依那西普 (Etanercept)	(634)
Bortezomib	(638)
今又生 (Gendicine)	(644)
Lonafarnib	(648)
Tipifarnib	(650)
Genasense	(652)

十二、附录 (654)

- (一) 化疗药物处方和医嘱书写规程..... (654)
- (二) 止吐药..... (655)
- (三) 高钙血症..... (671)
- (四) 癌痛的处理..... (673)
- (五) 患者体力状况评分标准..... (679)
- (六) 实体肿瘤判定疗效标准..... (680)
- (七) 不良反应标准..... (682)
- (八) NCI-CTC 毒性标准分级 (688)
- (九) 临床肿瘤研究的主要网址..... (696)
- (十) 体表面积换算表..... (704)

十三、索引 (706)

- (一) 中文索引..... (706)
- (二) 英文索引..... (722)

一、烷 化 剂

盐酸氮芥(Nitrogen mustard)

1

烷
化
剂

【一】 其他名:

1. 中文名: 恩比兴、甲氯乙胺、甲氯乙胺盐酸盐、双氯乙基甲胺。

2. 英文名: Chlormethinum hydrochloride、Chlor-ethazine、Chlormethini hydrochloridum、Chlormethinum、Caryolysine[®]、Embichin、Emlikhine、Miloxine、Mustargen[®]、Mustargen hydrochloride、Mustine、Mustine hydrochloride、Stocktofflost、Mechlorethamine HCL。

3. 略语: NSC - 762、WR - 147650、HN2、N - Lost。

【二】 来源:

1935 化学年合成, 1942 年开始用于临床, 是最早用于治疗恶性肿瘤的药物。

【三】 作用机制:

氮芥是一种有双功能基的烷化剂, 它和 DNA 上的鸟嘌呤结合, 导致 DNA 碱基配对错误, 并和 DNA 链交联, 也可使 DNA 链断裂, 抑制细胞增殖, 发挥抗肿瘤作用。对 RNA 和蛋白合成也有抑制作

用。氮芥为周期非特异性药物，对 G_1 和 M 期细胞抑制作用最强。

【四】 药代动力学：

1. 吸收：氮芥口服不吸收。主要通过静脉注射。有通过浆膜腔注射的报道，但临床很少应用。药物可能同时被吸收入血，出现骨髓抑制。

2. 分布：静脉注射后，迅速分布于肺、小肠、脾、肾和肌肉中，脑组织中含最少。

3. 蛋白结合：不详。

4. 代谢：主要在体液和组织中迅速水解代谢。

5. 半衰期：在血浆中具有烷化活性产物的半衰期为 15~20 分钟。给药 24 小时后，血及组织中药物含量很低。

6. 清除：在用药后的头 24 小时，约 50% 无活性的氮芥从尿中排出。20% 药物以 CO_2 形式经呼吸道排出，有多种代谢产物，从尿液中排泄，原形药经尿液排出量 $< 0.01\%$ 。

【五】 药物相互作用：

硫代硫酸钠直接使氮芥失效。

【六】 适应证：

霍奇金淋巴瘤，恶性积液，非霍奇金淋巴瘤，慢性淋巴细胞白血病。

【七】 单药有效率：

霍奇金淋巴瘤的单药有效率为 70%。

【八】 剂型：

针剂：每支 10mg。