

医药商品介绍

抗肿瘤用药

专车

上海医药采购供应站

医药商品介绍
抗肿瘤用药专辑

上海医药采购供应站

(上海福州路 221 号)

收工本费：0.34元

(包括邮寄费)

毛主席语录

思想上政治上的路线正确与否是决定一切的。

应当积极地预防和医治人民的疾病，推广人民的医药卫生事业。

把医疗卫生工作的重点放到农村去。

前 言

恶性肿瘤是一类常见病和多发病,对广大劳动人民的身体健康危害极大。在毛主席的无产阶级卫生路线指引下,我国的肿瘤防治研究工作取得了很大成绩,抗肿瘤药物的生产也有较大的发展。为了贯彻毛主席关于“应当积极地预防和医治人民的疾病,推广人民的医药卫生事业。”的教导。更好的为广大劳动人民健康服务,为无产阶级政治服务。我们汇编了这本《抗肿瘤用药专辑》供各医疗单位在临床用药时的参考。

本专辑承上海市肿瘤医院张志义医师审校,特此表示感谢。由于我们的水平有限,又缺乏实践经验,在汇编中存在的缺点和错误,希望广大读者批评指正。

上海医药采购供应站

1975 年 10 月

抗肿瘤用药专辑

目 录

一、烷化剂（细胞毒素类）.....（1）

*盐酸氮芥（1）*瘤可宁（4）*抗瘤氨酸（6）*环磷酰胺（8）*甲酰溶肉瘤素（10）*甲氧芳芥（12）*消瘤芥（14）*卡氮芥（17）*环己亚硝脒（20）噻替派（23）*亚胺醌（26）*白血福恩（28）二溴甘露醇（30）

二、抗代谢类.....（33）

*氨基蝶呤（33）*甲氨蝶呤（35）*6—巯基嘌呤（38）*溶瘤呤（40）*硫唑嘌呤（43）*硫鸟嘌呤（45）*氟脲嘧啶（47）*复方氟脲嘧啶（50）*阿糖胞苷（52）*环胞苷（56）

三、抗菌素类.....（59）

*争光霉素（59）*光辉霉素（63）*自力霉素（65）*更生霉素（68）盐酸正定霉素（71）

四、中草药及植物类.....（74）

硫酸长春碱（74）*硫酸醛基长春碱（78）*喜树碱（82）
复方秋水仙碱注射液（85）秋水仙酰胺（85）~~秋水仙碱注射液~~
（88）肿节风（88）斑蝥素（90）

五、杂类化合物..... (93)

*甲基苄肼 (93) *丙咪胍 (96) *抗癌锑 (98) *抗癌片 (102) 羟基脲 (103) L-门冬酰胺酶 (105)

六、促进白细胞增生药物.....(108)

*鲨肝醇 (108) *甲酰四氢叶酸钙 (109) *DNA 单核苷酸混合注射液 (111) *维生素 B₄ (112) 复方氨基嘌呤 (113) 利血生 (114) *肌苷 (115) *5'-肌苷酸钠 (117) *核苷酸 (119) *复合磷酸酯酶 (120) *辅酶 A (121) *健肝片 (122)

【注】 本专辑共收载抗肿瘤药物42只及辅助治疗药12只，共54只品种，其中*者为本站经营品种。

〔附录一〕 各种常见人体实体癌的药物选择

〔附录二〕 抗癌药物在细胞增殖周期的作用点

〔附录三〕 抗癌药物毒性反应之对策

〔附录四〕 抗癌药物的体表面积 (M²) 计算表

一、烷化剂(细胞毒素类)

烷化剂类又名细胞毒素类药物，亦称“类放射线物质”。这类药物通过它们的化学作用直接伤害肿瘤细胞。其选择性不高，在伤害肿瘤细胞的同时，亦能伤害正常细胞。在剂量选择适当时，能够发挥一定的治疗作用。

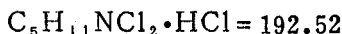
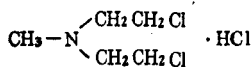
盐 酸 氮 芥

Mechlorethamini Hydrochloridum

(Nitrogen Mustard; Mustargen;
Chlormethine, Embichin, HN₂)

【化学名】 双(2-氯乙基)甲胺盐酸盐

【结构式】



【性状】 白色结晶性粉末，有引湿性与腐蚀性，熔点为108~111℃，易溶于水及乙醇，其水溶液极易分解，须临用前新鲜配制。

【作用特点】 本品为最早应用于临床的有效抗肿瘤药，于

1935年合成,1942年起系统地研究了药理作用,并应用于临床,目前仍有一定地位。本品进入机体后,即通过分子内成环,形成乙烯亚胺基。

乙烯亚胺基的化学性质极为活泼,可以和生物体内的重要物质如蛋白质的羧基、巯基、氨基、异吡唑基等起作用,因而影响细胞的代谢,而其中最重要的则是对核酸的影响。多数人认为,氮芥类对核酸的主要作用方式为与去氧核糖核酸(DNA)的磷酸键结合,形成不同类型的交叉键链,因而使DNA变性或失去活性。

本品对多种实验动物肿瘤有强烈的抑制作用。对增生活跃的细胞如肿瘤细胞、淋巴细胞、骨髓、肠上皮和生殖细胞均有抑制作用,作用原理与放射线有一定相同之处,因之也称为“拟放射线物质”。目前业已明确 本品对一切有生活能力的细胞均具有杀伤作用,与细胞的增殖周期各个阶段关系不大,其效应随剂量而增加,所以是一个“细胞增殖周期非特异性药物”。

【适应症】

(1) 恶性淋巴瘤,对何杰金氏病,淋巴肉瘤、网状细胞肉瘤、巨滤泡性淋巴瘤和蕈样霉菌病均有效。显效迅速,缓解期可达数月。

(2) 肺癌,尤其是未分化癌,疗效也较肯定。此外对肺癌引起的上腔静脉压迫症,静脉注射氮芥可得迅速缓解;对肺癌引起的胸腔和心包积液应用腔内注射,肺癌脑转移应用动脉内注射,均可取得一定姑息性效果。

(3) 对睾丸精原细胞瘤、乳腺癌、卵巢癌等也有一定疗效。

(4) 应用腹主动脉阻断、静脉注射大剂量氮芥的方法治疗头颈部癌(如鼻咽癌)有较好的疗效,可以保护部分骨髓,

相对提高上半身药物分布量。

(5) 此外,还有人应用小剂量氮芥治疗结核性淋巴结炎,慢性肾炎肾变期也均有好的近期效果。其0.05%酒精溶液(50毫克溶于95%酒精100毫升中)治疗白癰有一定疗效。

【用法与用量】 本品有显著的局部刺激作用,不能口服或肌内、皮下注射。

(1) 静脉冲入:通常用生理盐水10毫升溶解,从正在输注5%葡萄糖液的输液皮管中冲入。一般在药物溶化后10分钟内冲入,不宜放置过久。冲入后应继续输液一定时间,以减轻对静脉的刺激。目前常用的剂量是每次0.1毫克/公斤,一次量不超过8毫克,每周2~3次,总量30~60毫克为一疗程。有的医疗单位使用的剂量是每次0.3~0.4毫克/公斤,一次量不超过20毫克,每周1次,5~6次为一疗程,也有人主张应用较大剂量间隔较长的给药方法,但病人不易耐受。应用腹主动脉阻断法,剂量可提高至0.2毫克/公斤,每周3次,总量为60~70毫克。

(2) 胸腹腔和心包腔内注射,每次5~20毫克,溶于生理盐水20~40毫升中,在抽液后注入。注药后应嘱病人变换体位,使药液均匀分布。根据疗效每5~7天进行一次,一般不超过4~5次。

(3) 动脉内注射:每次剂量为5~10毫克,每日或隔日注射1次,总剂量可较静脉注射稍高。

【副作用与注意点】 本品毒性反应较大,因之必须由有经验的医生掌握使用。

(1) 局部反应:对皮肤粘膜有刺激作用,可引起发泡、破溃,如漏于血管外可引起疼痛及局部坏死。反复注射后可引起血管变硬、疼痛、栓塞性静脉炎。

(2) 全身反应：有疲倦、乏力、头昏、头痛、寒战及发热等。

(3) 胃肠道反应：大多数病人在注射氮芥后1~4小时有恶心、呕吐和腹泻。不同患者胃肠道反应的严重程度不同。

(4) 骨髓抑制：白细胞和血小板明显下降，少数有血红蛋白下降。用药期间应严格检查血象，当白细胞低于4000/立方毫米，血小板低于8万/立方毫米时，应即停药，一般在给药后7~10天即先有白细胞下降，停药后2周左右可恢复。

(5) 其它：氮芥治疗后可发生睾丸萎缩，但对月经和排卵影响不大，颈动脉注射和局部应用时可有脱发、皮肤色素沉着。大剂量颈动脉注射可引起神经系统损害如运动神经麻痹和抽搐等。

(6) 以往曾作过放射治疗、化学治疗和伴有其他骨髓功能不全的病人应慎用或减量。

(7) 肝肾功能不全的病人应用时也需特别小心。

【剂型与规格】 粉针剂：每支5毫克。

【有效期】 一年半

【生产厂】 上海第十三制药厂

瘤 可 宁

(苯丁酸氮芥；氯氮布西)

Chlorambucilum

(Leukeran; CB-1348)

【化学名】 γ -[对一双(2-氯乙基)胺基]苯代丁酸。

【结构式】



$$C_{14}H_{18}NO_2Cl_2 = 304.22$$

【性状】 为白色或微红色结晶性粉末，微臭，在水中不溶，在乙醇、氯仿、丙酮中易溶。熔点为64~68℃。

【作用特点】 本品于1953年合成。为氮芥的脂肪酸类衍生物，其作用与氮芥相似，对多种动物肿瘤有抑制作用。在细胞增殖周期中对G₁期和M期的细胞毒性最大。本品口服能全部吸收。临床前药理表明其反应局限于造血组织，本品虽没有完全的选择性，但抑制淋巴细胞增殖的作用超过对粒细胞的作用。

本品用于慢性淋巴白血病，淋巴肉瘤，何杰金氏病的姑息治疗，有一定的缓解作用。

本品和一般化学治疗剂相同，每一疗程的疗效均比前一疗程略差一些。对慢性淋巴白血病患者本品疗效很好，能迅速减少白血病细胞而对骨髓损害少。

本品对卵巢癌有一定疗效。对慢性粒细胞白血病或任何急性白血病无效。

【适应症】

- (1) 恶性淋巴瘤；作用与环磷酰胺相近，但缓解期较长。
- (2) 慢性淋巴细胞性白血病、淋巴肉瘤疗效较好。
- (3) 其他：对多发性骨髓瘤、卵巢癌神经母细胞病和睾丸肿瘤也有一定疗效。

【用法与用量】 口服，常用剂量为一日一次，每次5~15毫克，或每日3次，每次2~4毫克，一般显效较慢，需在2~6

周始能出现客观疗效。疗程总量为 200~500 毫克，疗程结束后，应继续根据血象情况给予一定的维持量，每日 0.03~0.1 毫克/公斤（成人 2~4 毫克）。

【副作用及注意点】 本品的副作用与氮芥相近，但肠胃道反应较氮芥轻，易为病人所耐受，一般在每天剂量超过 20 毫克时才有恶心、呕吐。治疗剂量对骨髓的影响主要表现为淋巴细胞下降，对粒细胞和血小板的抑制亦较轻。对红细胞影响很小。但剂量过大时，尤其是在有蓄积时也可引起全身血象下降。大剂量时可引起肝功能损伤出现黄疸。

服药后偶有消化系统不适，这与剂量和疗程有关系，骨髓中毒使淋巴细胞减少，嗜中性细胞减少，血小板减少，此时应减少剂量或停药，骨髓中毒问题就能解决。在治疗期间，应经常检查血象，至少每星期一次，查红细胞，白细胞，血红蛋白的数量，血小板亦须经常检查。

当总量达到每公斤体重 6.5 毫克时，可引起骨髓不可逆性的损伤。

【禁忌】 对癌细胞已侵入骨髓或以前曾用镭锭治疗或放射治疗而白细胞血小板严重下降者和有贫血者禁用。

【剂型与规格】 片剂（纸型片）：每片（格）内含 2 毫克。

【生产厂】 上海第十二制药厂（原料）

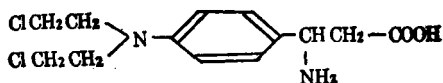
上海第十一制药厂（片剂）

抗 瘤 氨 酸

（合一-14；异氨基溶肉瘤素；异位溶肉瘤素）

【化学名】 对一双—(2—氯乙基)胺基— β —氨基苯丙酸。

【结构式】



$$\text{C}_{13}\text{H}_{18}\text{Cl}_2\text{N}_2\text{O}_2 = 305.07$$

【性状】 白色或黄白色粉末，易溶于冰醋酸、盐酸和氢氧化钠溶液，几乎不溶于水、乙醇和甲醇中。熔点 $188\sim 192^\circ\text{C}$ 。熔融时同时分解。

【作用特点】 本品系我国首创之抗癌药物，于1959年由上海医药工业研究院合成，并经上海中国科学院药物研究所进行药理实验。试验证明本品对八种动物实验肿瘤有显著疗效，其作用机制与溶肉瘤素相仿，主要是对肿瘤细胞核酸代谢及蛋白质的生物合成有显著抑制作用，而本品的毒性低于溶肉瘤素。

【适应症】 以慢性粒细胞型白血病，精原细胞瘤的疗效最为显著，对一些恶性淋巴瘤（何杰金氏病、淋巴肉瘤、网状细胞肉瘤）、多发性骨髓病、乳腺癌等有治疗作用，对骨转移性癌症的疼痛有止痛作用。

【用法与用量】 本品供口服，一般每日25毫克，白血病病人开始服用时可每日用50~75毫克，一天量分二至三次口服，随白细胞数下降速度和幅度逐渐减量至停药。维持量可每2~3日或每周12.5~25毫克，一个疗程用药总量约500~800毫克左右，儿童剂量酌减。

【副作用及注意点】 本品服用后可能出现乏力、头昏、食欲下降、恶心等，少数病人有呕吐或轻度腹泻，主要毒性反应是对造血系统有比较明显的抑制作用且持久，有时其副作用可持续

至停药后二周，国内临床在 92 名病例中白细胞下降至 4000/立方毫米以下的占 61.9%，血小板下降的则占 1/3，因此在服药时必须定期检查血象，如白细胞下降至 4000/立方毫米以下或血小板下降到 7 万/立方毫米以下时应即停药。本品必须在医生指导下使用，用于治疗慢性粒细胞型白血病时，治疗中如白细胞锐减，则应及早减量或停药；如白细胞数降到 2~1 万之间时，也应停药观察，以后再酌情使用，以免白细胞过度减少。

【禁忌】 明显的恶液质患者或白细胞计数低于 5000/立方毫米者禁用。

【临床情况】 上海肿瘤医院，北京日坛医院，杭州肿瘤医院，北京协和医院，河南医学院附属医院等已试用本品约 200 多例肿瘤患者，按全国肿瘤会议规定的化学药物疗效标准进行评价，92 例恶性肿瘤患者中客观有效率为 54.3%，其中精原细胞瘤 14 例近期效果较满意，恶性淋巴瘤近期有效率 72.7%；其中对淋巴肉瘤疗效较好，11 例中 9 例有效，9 例乳腺癌中有有效的 6 例。此外在 12 例骨转移性癌中 8 例有症状改善作用（止痛）。本品对慢性粒细胞型白血病有肯定的疗效，25 例在用药后全部有效，其中完全缓解的 7 例，部份缓解的 14 例，进步的 4 例，缓解期平均 3 个月左右。

【剂型与规格】 片剂：每片内含 25 毫克。

【生产厂】 上海第十二制药厂

环 磷 酰 胺

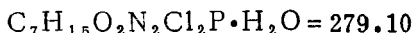
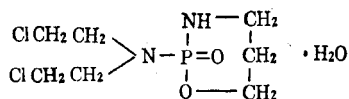
（环磷氮芥；癌得星）

Cyclophosphamidum

(Endoxan; Cytosan; B-518; Procytox;
Sendoxan)

【化学名】 N,N-双(2-氯乙基)-N'-(3-羟丙基)
磷酸内酯二胺

【结构式】



【性状】 白色结晶或结晶性粉末，失去结晶水即液化。本品在乙醇中易溶，在水、丙酮中溶解。在水中的溶解度为40克/升；在四氯化碳、二硫化碳中不溶。熔点为48.5~52℃。因本品水溶液不稳定，故应在溶解后短期内使用。

【作用特点】 本品于1957年合成。为氮芥衍生物。在临床应用上较其他烷化剂具有更大的适应性，可供口服，静脉注射等。本品优点是在同等抗肿瘤效果的情况下，对多核巨细胞及血小板较少损害，且在体外几乎没有活性，据国外文献称在体内特别是在肿瘤中由于肿瘤细胞含有高浓度的磷酸酯酶和磷酸酶，因而使其转变为具有强力抗肿瘤作用的活性氮芥。

【适应症】 据国内临床情况看，本品适用于淋巴肉瘤、网状细胞肉瘤、何杰金氏病、慢性白血病、子宫癌、卵巢癌、支气管肺癌、睾丸肿瘤及膀胱癌等。国外文献报导还可用于骨肿瘤、神经肿瘤、喉癌、乳腺癌、胃癌、肝癌、结肠癌、皮肤癌、癌性腹膜炎等。

【用法与用量】 本品注射液应新鲜配制，供静脉注射，一般成人每日100~200毫克，总剂量8~10克，儿童每次2~6毫克/公斤，每日或隔日一次。

口服，成人一次 50~100 毫克，一日 100~200 毫克，共十四天。儿童每日 2~8 毫克/公斤，一次服用。

【副作用及注意点】 最常见的副作用有脱发，停药后 1~2 个月可恢复。食欲缺乏、恶心、呕吐也有发生，可缓慢注射或预先使用止吐剂等预防。白细胞减少则为最典型的副作用，故使用本品时必须严格检查血液，白细胞计数必须控制在 4000/立方毫米以上。本品必须在医师指导下应用。本品对于白细胞严重减少、骨髓恶性细胞浸润和最近曾接受放射或其他细胞毒素治疗的病例以及身体衰弱、肝功能障碍的病例均应特别慎重。明显恶液质患者忌用。

【剂型与规格】 粉针剂：每瓶 100 毫克及 200 毫克。

片剂：每片内含 50 毫克。

【有效期】 粉针剂二年

【生产厂】 上海第十二制药厂（原料及针剂）
上海第十一制药厂（片剂）

甲酰溶肉瘤素

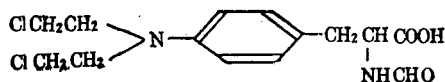
（氮甲，N-甲）

Formylphalanum

（N-F，N-Formyl Sarcolysine）

【化学名】 dl-N-甲酰-对〔双（ β -氯乙基）胺基]-苯丙氨酸。

【结构式】



$$\text{C}_{14}\text{H}_{18}\text{O}_3\text{N}_2\text{Cl}_2 = 333.21$$

【性状】 白色或米黄色结晶性粉末，遇光变色，不溶于水，溶于乙醇，在丙酮中微溶。熔点为 $150\sim 155^\circ\text{C}$

【作用特点】 本品于1959年由中国医学科学院药物研究所合成，并进行药理研究推荐临床应用。本品对大鼠吉田肉瘤腹水型及实体型、walker癌、肉瘤256、小鼠网状细胞肉瘤 L_2 ，腹水瘤 L_1 及krebs—2 癌有明显的抑制作用，其特点是对某些肿瘤细胞的选择性较高，对生长旺盛的正常组织损害作用较小。在它对肿瘤细胞的核酸及蛋白质生物合成有显著抑制的情况下，对骨髓、小肠及淋巴结的核酸及蛋白质生物合成无明显影响。本品的化学结构与溶肉瘤素相近，但溶肉瘤素对何杰金氏病及淋巴肉瘤无效而本品则有效。

【适应症】

(1) 睾丸精原细胞瘤：有效率高，缓解期可达几个月到几年，有的病例经应用本品治疗已生存10年以上，可从事正常劳动。

(2) 多发性骨髓瘤：疗效也较明显，缓解期较长，与环磷酰胺相比显效较慢。

(3) 恶性淋巴瘤：也有效，但显效较慢，可作为维持治疗。

(4) 其他肿瘤如肺癌、乳腺癌、卵巢癌个别病例也有一定疗效。

【副作用及注意点】 在治疗剂量时，本品的毒性反应主要