家庭常备药物应用指南（十四）

于猛 编著

需要全本请访问 www.ertongbook.com

目　　录

自由基清除剂 1
超氧化物歧化酶 SuperoxideDismutase 1
维生素 evitamine 3
抗代谢药 4
阿糖胞苷 Cytarabine 4
氟尿嘧啶 Fluorouracil 6
甲氨蝶呤 Methotrexate 7
羟基脲 hydroxycarbamide 10
巯嘌呤 Mercaptopurine 11
替加氟 Tegafur 12
优福定 13
抗肿瘤抗生素 15
阿克拉霉素 aclacinomycina 15
阿霉素 doxorubicin 16
吡喃阿霉素 Perarubicin 18
表阿霉素 Epirubicin 19
放线菌素 DDactinomycin 21
平阳霉素 bleomycina5 22
柔红霉素 Daunorubicin 23
丝裂霉素 Mitomycin 24
丝裂霉素的廓清 25
抗肿瘤植物生成 26
长春地辛 Vindesine 26
长春碱 Vinbastine 28
长春瑞宾 Vinorelbine 29
长春新碱 Vincristine 30

高三尖杉酯碱 homoharringtonine 31
羟喜树碱 hydroxycamptothecine 33
泰索帝 taxotere 34
替尼泊苷 Teniposide 35
香菇多糖 Lentinan 36
依托泊苷 Etoposide 37
紫杉醇 Paclitaxel 38
抗肿瘤激素类 42
氨鲁米特 Aminoglutethimide 42
福美司坦 Formestane 44
甲地孕酮 Megestrol 45
甲羟孕酮 Medroxyprogesterone 46
他莫昔芬 Tamoxifen 47
其他抗肿瘤药及辅助治 48
昂丹司琼 Ondansetron 48
丙卡巴肼 Procarbazine 50
达卡巴嗪 Dacarbazine 51
干扰素 interferon 53
环孢素 Ciclosporin 55
卡铂 Carboplatin 57
美司钠 mesna 58
门冬酰胺酶 Asparaginase 59
米托蒽醌 mitoxantrone 61
去甲斑蝥素 Norcantharidin 63
顺铂 Cisplatin 64
维 A 酸 Tretinoin 65
亚叶酸钙 CalciumFolinate 66
烷化剂 68

白消安 Busulfan 68
苯丁酸氮芥 Chlorambucil 69
氮甲 Formylmerphalan 70
氮芥 chlormethine 71
多潘 Chlorethylaminouracil 73
二溴卫矛醇 Dibromoducitol 73
甘磷酰芥 Glyfostin 73
甘露醇氮芥 Mannomustine 75
环磷酰胺 Cyclophosphamide 75
甲氧氮芥 Mechlorethaminoxide 77
甲氧芳芥 Methoxymerphalan 77
卡莫司汀 Carmustine 78
抗瘤氨酸 Betamerphalan 79
抗瘤新芥 Ocaphan 80
六甲蜜胺 Altretamine 80
洛莫司汀 Lomustine 81
美法仑 Melphalan 82
嘧啶苯芥 Uraphetin 83
尼莫司汀 Nimustine 84
尿嘧啶氮芥 Uramustine 85
塞替派 thiotepa 85
司莫司汀 Semustine 86
硝卡芒芥 Nitrocaphane 89
胸腺嘧啶氮芥 Thyminalkylamine 89
亚胺醌 Ethyleniminoquinone 90
异环磷酰胺 Ifosfamide 90
骨骼肌松驰药 92
阿库氯铵 AlcuroniumChloride 92

阿曲库铵 Attacurium 92
八角枫碱 dl-Anabasin(消旋毒藜碱） 93
傣肌松 CissampelosineMethiodide 93
汉肌松 TetrandrineDimethiodide 93
琥珀胆碱 Suxamethonium 94
肌安松 Paramvon 95
己氨胆碱 Hexcarbacholine 95
加拉碘铵 GallamineTriethiodide 96
氯甲左箭毒 Dimethyl-L-curinedimethochloride ... 97
米库氯铵 MivacuriumChloride 97
哌库溴铵 PipecuroniumBromide 98
泮库溴铵 PancuroniumBromide 98
筒箭毒碱 Tubocurarine 99
维库溴铵 VecuroniumBromide 100
局部麻醉药 101
苯甲醇 BenzylAlcohol 101
苯佐卡因 Benzocaine 101
丙胺卡因 Prilocaine 102
布比卡因 Bupivacaine 102
达克罗宁 Dyylonlne 103
丁卡因 Tetracaine 103
甲哌卡因 Mepivacaine 104
可卡因 Cocaine 105
利多卡因 Lidocaine 105
氯普鲁卡因 Chloroprocaine 106
普鲁卡因 Procaine 107
三甲卡因 TrltheCaine 109
辛可卡因 Cinchocaine 109

需要全本请访问 www.ertongbook.com

依替卡因 Etidocaine 110
静脉麻醉药 110
阿法双酮 Alphadione 110
丙泮尼地 Pronanidid 111
硫喷妥钠 ThiopentalSodium 112
氯胺酮 Ketamine 113
米那索龙 minaxolone 115
普鲁泊福 propofol 115
羟丁酸钠 SodiumHydroxybutyrate 117
依诺伐 innovar 118
依托咪酯 Etomidate 118
吸入麻醉药 120
地氟烷 Desflurane 120
恩氟烷 Enflurane 120
氟烷 halothane 121
甲氧氟烷 Methoxyflurane 122
麻醉乙醚 AnestheticEther 123
七氟烷 Sevoflurane 125
氧化亚氮 Nitrousoxide 127
异氟烷 Isoflurane 127
酶类药物 128
阿糖苷酶 alglucerase 128
玻璃酸酶 Hyaluronidase 129
菠萝蛋白酶 Bromelains 130
超氧化物歧化酶 superoxidedismutase 131
泛癸利酮 Ubidecarenone 132
复合磷酸酯酶 phosphoesterasescomplex 133
胶原酶 collagenase 133

链激酶 Streptokinase 134
链脱酶 Streptodornase 137
糜蛋白酶 Chymotrypsin 138
糜胰蛋白酶 Trsnsin-Chsmotrypsin 139
溶菌酶 lysozyme 140
双链酶 streptokinase-strentodornase（sk-sd） . 141
胰蛋白酶 trypsin 142
抑肽酶 aprotinin 144

自由基清除剂

超氧化物歧化酶 SuperoxideDismutase

（SOD）

超氧化物歧化酶（SOD）为自由基清除剂。它广泛存在于生物体的各种组织中，能清除自由基O_2（超氧阴离子自由基），而O_2具有细胞毒性，可使脂质过氧化，损伤细胞膜，引起炎症、肿瘤和自身免疫性疾病，并可能促使机体衰老。

SOD可由牛、猪等的红细胞中提取，亦可由菠菜、小白菜、刺梨、酵母、细菌中提取。目前国内外已有SOD的制剂出现，如德国生产的Orgotein为由动物红细胞、肝等分离而得的水溶性Cu·Zn·SOD，分子量约为32000。国内已有不少科研、高校、生产单位研制500成功，如长沙生化制药厂试制出从猪红细胞提取的SOD。国内外曾进行有关SOD的多方面研究，结果显示：

（1）健康人红细胞SOD，20～29岁组显著低于儿童组；30～59岁间，每10岁组值逐步轻度下降，但组间无明显差异；60～99岁间，每10岁组值无明显升降；100～108岁组略有降低趋势。其中，中年期合计组SOD值较青年期合计组值有显著降低；但中老年组间、老年与长寿组间，SOD值无明显差异。总的趋势是SOD值随着增龄而下降。

（2）检查老年人高血压、冠心病、肺心病、糖尿病、

自身免疫性疾病及恶性肿瘤患者的SOD值，均与正常老年值有极显著差异。

（3）观察罗布麻茶、“春回”及五味子糖浆对健康老人红细胞SOD含量的影响，结果显示三者在给药后，SOD值均有显著提高。另一研究结果表明，五味子素能提高SOD活性，对O_2有显著的清除作用。给小鼠灌服人参茎叶皂甙后，红细胞SOD的活性与对照组比较有明显增高。

（4）对正常大鼠晶状体及半乳糖诱发大鼠白内障的晶状体中SOD的相对含量进行测定，结果白内障晶状体中SOD恬性下降，提示提高晶状体中SOD的活性（特别是在白内障形成的最初阶段），可能是防治白内障发展的途径之一。

（5）临床试用结果，SOD制剂用于类风湿关节炎、皮肌炎、心肌缺血、皮炎、视网膜损伤等有一定疗效，还可用于老年斑的消除、癌症的预防等。

【制剂】老来福：为SOD口服液。据称有增强机体免疫功能、消除老年斑、防癌等功效，用于老年人及体弱者的保健抗衰。

同类产品尚有“生命树SOD口服液”等。

附：抗氧素AntiOxidantBiofactor（AOB）一名“抗氧化生物素”，系以谷物（大豆、芝麻、薏苡仁等）为主要原料制成。为抗氧化剂，据报告其抗氧化作用强于维生素E，能提高机体SOD水平，保护细胞免受多余活性氧自由基的损伤而起到防病保健的作用。

维生素 evitamine

维生素e原用于治疗肌营养不良、习惯性流产等。后来发现，维生素e为体内抗氧化剂，有清除自由基的作用。当机体缺乏维生素e时，组成生物膜的脂质（主要是不饱和脂肪酸）容易生成过氧化脂质（lpo），结果生物膜的通透性发生改变，细胞膜发生破裂分解，同时细胞内的有膜结构（如线粒体和溶酶体）也发生破裂，造成细胞代谢和功能形态的改变，引起一系列衰老症状，例如结缔组织因胶原蛋白产生交联而收缩，使皮肤发皱等等。lpo还可与蛋白质聚合，最后形成脂褐素。动物缺乏维生素e时，细胞内会出现脂褐素的堆积。给予维生素e后，可消除脑组织等细胞中的这种褐色素。有人证明，心肌细胞中的脂褐素的数量大体随着年龄的增长而成比例地增加，每隔10年心肌细胞中沉积的脂褐素约达人体心脏重量的0.3%。这可能与老年人心脏疾病的增加有关。脂褐素在细胞中的沉积，可影响细胞的正常功能，加速组织细胞的衰老过程。利用抗氧化剂能阻止这种衰老过程。动物实验业已证实，维生素e可使动物的平均寿命延长，并使癌症发生率下降，但对最高寿命无明显影响。随着年龄的增长，人体内维生素e含量进行性下降，以致使脂质的过氧化作用不断增强，生物膜损伤加重，同时肌肉萎缩变性、脂褐素沉积、肝实质萎缩变性……，这些变化与相应组织生理性衰老时发生的变化十分相似。长期服用维生素e，可改善人体的一般状况，包括淋巴系统、骨骼肌和心血管系统的功能状态。研究结果还显示，作为自由基清除剂的维生素e可能还有预防白内障形成的作用。

前些年由于过多宣传维生素 e 有延缓衰老的作用，大剂量（每日量 200～600mg 或更多）服用此药者日渐增多，应引起警惕。据报道，长时间服用大剂量维生素 e，可引起某些毒副反应，如血栓性静脉炎、肺栓塞、下肢水肿、血清胆固醇值升高等，并可能影响免疫功能使其下降。因此大剂量维生素 e 的应用应加以限制，长期服用，一日量最好不超过 200mg。如果必须长时期应用较大剂量时，应在医生指导下进行。

含有维生素 e 的抗衰保健方剂不少，如维尔康、养命宝、盖福润、多维元素片等。

抗代谢药

阿糖胞苷 Cytarabine

（CytosineArabinoside），CYTOSAR，ARA-C）

【性状】常用其盐酸盐，为白色晶末。极易溶于水。熔点189～195℃（分解）。

【药理及应用】为抗嘧啶药物，在细胞内先经脱氧胞苷酶催化磷酸化，转变为有活性的阿糖胞苷酸（Ara-CMP），再转为二磷酸及三磷酸阿糖胞苷（Ara-CDP及Ara-CTP）而起作用，主要用于急性白血病，但对少数实体瘤也有效。现认为本品主要通过与三磷酸脱氧胞苷竞争，而抑制DNA多聚酶，干扰核苷酸参入DNA。并能抑制核苷酸还原酶，阻止核苷酸转变为脱氧核苷酸。但对RNA和蛋白质的合成无显著作用。属于一作用于S期的周期特异性药物，并对

需要全本请访问 www.ertongbook.com

G_1／S及S／G_2转换期也有作用。

本品口服吸收少，且易在消化系统内脱氨失活。静脉注射后迅速从血中消失，$T_{1/2}$为3～15分，消除相的$T_{1/2}$为2～3小时，药物在体内主要在肝中由苷脱氨酶催化脱氨，转变为无活性的阿糖尿苷。24天后从尿中排出70％～90％，主要为代谢物。静脉滴注药物可通过血脑屏障，脑脊液浓度为血浆中的40％，因脑脊液中脱氨酶含量低，其$t_{1/2}$长达2～11小时。

相互作用：四氢尿苷可抑制脱氨酶，延长阿糖胞苷血浆半衰期，提高血中浓度，起增效作用。使用胞苷也有类似增效作用。

本品可使细胞部分同步化，继续应用柔红霉素、阿霉素、环磷酰胺及亚硝脲类药物可以增效。在用药后6～8小时，再用6-MP可加强对粒细胞白血病的疗效。本品不应与5-FU并用。

临床适应证：Ara-C主要治疗急性白血病及消化道癌，对多数实体肿瘤无效。眼部带状疱疹、单纯疱疹性结膜炎也有一定疗效。

【用法】静脉注射，1次1～2mg／kg，每日1次，连用10～14天为一疗程。或4～6mg／kg，每周2次。也可静脉滴注，每日5～7.5mg／kg，点滴8～12小时，连用4～5天。皮下注射，多用于维持治疗，每次1～3mg／kg，每周1～2次。鞘内注射，每次25～75mg溶于生理盐水5～10ml中，隔日1次，共次。预防脑膜白血病，每6周注射1次。

【注意】骨髓抑制、消化道反应常见，少数病人可有肝功异常、发热、皮疹。用药期间应严格检查血象。

【制剂】注射用阿糖胞苷：每安瓿50mg；100mg。

【贮法】避光，严封，在冷处保存。干燥的药粉在22℃下可保存2年不变。配制好的注射液可在冰箱中保存7天，室温下仅能保存24小时。

氟尿嘧啶 Fluorouracil

（5-氟尿嘧啶，5-FU）

由于5-FU是第一个根据一定设想而合成的抗代谢药并在临床上是目前应用最广的抗嘧啶类药物，对消化道癌及其他实体瘤有良好疗效，在肿瘤内科治疗中占有重要地位。

【性状】白色或类白色结晶性粉末。略溶于水，在稀酸或碱溶液中溶解。熔点281～284℃（分解）

【药理及应用】本品需经过酶转化为5-氟脱氧尿嘧啶核苷酸而具有抗肿瘤活性。5-FU通过抑制胸腺嘧啶核苷酸合成酶而抑制DNA的合成。此酶的作用可能把甲酰四氢叶酸的一碳单位转移给脱氧尿嘧啶核苷一磷酸合成胸腺嘧啶核苷一酸。5-FU对RNA的合成也有一定抑制作用。

5-FU可以静脉及腔内注射。口服吸收不完全。在人一次快速推注5-FU后，血浆中可达相当高的水平，但迅速清除，其血浆半衰期为10～20分钟，在脑脊液中的峰值出现于90分钟，在8小时内可保持相当水平。胸腔或腹腔内注射，在24小时内可维持相当水平。5-FU的代谢主要在肝中进行，开环后变成α-氟-β脲基丙酸。再进一步分解为α

-氟-β丙氨酸、氨、尿素及CO_2，故大部由呼吸中排出，只10％～30％由尿中排出。在缓慢静脉滴注时，其分解代谢比快速注射明显，毒性降低。

临床适应证：5-FU对多种肿瘤如消化道肿瘤、乳腺癌、卵巢癌、绒毛膜上皮癌、子宫颈癌、肝癌、膀胱癌、皮肤癌（局部涂抹）外阴白斑（局部涂抹）等均有一定疗效。

【用法】①静脉注射，1次0.25～0.5g，1日或隔日1次，一疗程总量5～10g。②静脉滴注，1次0.25～0.75g，1日1次或隔日1次，一疗程总量8～10g。治疗绒毛膜上皮癌时可将剂量加大到每日25～30mg／kg，溶于5％葡萄糖液500～1000ml中点滴6～8小时，每10天为1疗程。

【注意】不良反应有骨髓抑制，消化道反应，严重者可有腹泻，局部注射部位静脉炎，少数可有神经系统反应如小脑变性、共济失调，亦有人出现皮疹、色素沉着、甲床变黑等。用药期间应严格检查血象。

【制剂】注射液：每支125mg（5ml）；250mg（10m）。软膏：0.5％；2.5％。

【贮法】避光置阴暗处保存，温度不应低于10℃，亦不宜超过35℃。

甲氨蝶呤 Methotrexate

（氨甲蝶呤，MTX）

甲氨蝶呤是最早应用于临床并取得成功的抗叶酸制剂，不但对白血病有效，而且对实体瘤也有良好的疗效，为临床基本抗肿瘤药物之一。

【性状】橙黄色结晶性粉末，几不溶于水，溶于稀盐酸，易溶于稀碱溶液。

【药理及应用】四氢叶酸（FH_4）是叶酸的活性型，为核酸及某些氨基酸如甲硫氨酸、丝氨酸等生物合成过程中一碳单位的运载体。在细胞内叶酸变成FH_4需要叶酸还原酶参与。口服、肌肉或静脉注射MTX后，几分钟内叶酸还原酶即受到不可逆性抑制。1～24天后胸腺嘧啶核苷合成酶也受到抑制。这样，MTX可使细胞阻断在S期。是否影响从G_1期进入S期各专家意见尚不一致。此外，由于还原型叶酸不足，可导致嘌呤及胸腺嘧啶核苷酸合成的障碍，从而引起DNA、RNA及蛋白质合成的抑制。

MTX在高浓度时可通过被扩散使进入细胞内的数量增高，达到10^{7}M以上的有效浓度。此外，进入细胞内的MTX向外运转也较慢，因而可以提高选择性抑制。在此基础上发展的大剂量MTX-甲酰四氢叶酸钙解救疗法（HDMTX-CFR）在骨肉瘤的治疗上取得很大成功。由于所用浓度高，药物可进入瘤细胞抑制二氢叶酸还原酶，而肉瘤细胞对MTX及四氢叶酸所共用的运转系统不全，加上解救时四氢叶酸的浓度远低于MTX的浓度，故正常组织得到解救而瘤细胞却得不到。近年来还发现低浓度的MTX比高浓度的MTX易为胸腺嘧啶核苷所逆转，因之临床上已开始应用胸腺嘧啶核苷解救。

MTX除口服、肌内注射、动脉静脉注射或滴注外，尚可鞘内注射。一般剂量吸收良好，1～4小时在血浆中达高峰。MTX的血浆消失曲线呈三相型，其半衰期分别为0.75，3.5及2.7小时，这些对临床应用，尤其是大剂量给药都具重要意义。但大剂量时口服吸收不全。MTX进入

血浆后有50％与血清蛋白结合，其分布容积占体重的67％～91％，在组织中的分布取决于细胞运转的能力和二氢酸还原酶在细胞内的水平。药物以尿中在24小时内以原形排出50％～90％。在肝、肾及胸腹腔积液中可潴留数周排除很慢。

临床适应证：MTX对急性白血病、绒毛膜上皮癌、骨肉瘤、乳腺癌、睾丸肿瘤等都有效。为联合化疗方案中常用的周期特异性药物。

【用法】①白血病，每日0.1mg／kg1次口服，一般有效疗程的安全剂量为50～150mg，总剂量应视骨髓情况而定。对急性淋巴细胞白血病，有颅内受侵的病人或作为缓解后预防其复发，可给鞘内注射每次10～15mg，每5～14日1次，共5～6次。②绒毛膜上皮癌，剂量应较大，成人一般10～30mg口服或肌内注射，每日1次，连续5日。以后视病人反应可再重复疗程。③实体癌，根据情况可给10～20mg静脉注射，每周2次，连续6周为1疗程。④骨肉瘤等，采用大剂量3～15g／m^2，溶于5％葡萄糖液500～1000ml静脉滴注4小时滴完后2～6小时开始应用甲酰四氢叶酸钙（CF），剂量为6～12mg肌内注射或口服，每6小时1次，共3日，为了保证药物能迅速从体内排出，应在前1日及给药后的第1、2日补充电解质、水分及碳酸氢钠，使尿量每日在3000ml以上，并保持碱性。对肝功能、肾功能、血象及血浆MTX的浓度均应逐日检测，并防止口腔炎、发热、骨髓抑制等毒性反应。

【注意】不良反应有骨髓抑制（最低值在7～10天，14～16天恢复），口腔炎，恶心呕吐（高剂量始有），腹泻，皮疹，肝肾功能损伤，脱发，肺炎，吸收不良，骨质

疏松，色素沉着等，妊娠早期可致畸胎。少数病人有月经延迟及生殖机能减退。鞘内注射剂量过高的可引起抽搐。用药期间应严格检查血象。肝、肾功能不全患者及孕妇禁用。

【制剂】片剂：每片2.5mg；5mg，10mg。注射用甲氨蝶呤：每瓶5mg；10mg；25mg；50mg；100mg；1000mg。近年来国外也有注射液供高剂量MTX治疗应用。

【贮法】密闭，避光保存。

羟基脲 hydroxycarbamide

（hydroxyurea，hydrea，hu）

【性状】白色结晶性粉末，无臭，味微涩。在室温下久置易引起分解，吸湿后更促进分解，对热不稳定。易溶于水，水溶液亦不稳定。

【药理及应用】为核苷酸还原酶抑制剂，抑制核糖核酸还原为脱氧核糖核酸。主要用于某些实体瘤。本品选择性地阻止dna合成，杀伤s期细胞。实验研究对l_{1210}白血病和其他多种肿瘤有抑制作用。

口服给药吸收良好。无论口服或静脉注射给药血中药物浓度均在1～2小时内很快达到高峰，然后迅速下降。24小时已不能测出。$t_{1/2}$=1.5～5小时，本品在肝、肾中代谢形成尿素由尿中排出。12小时内排出80％。

临床适应证：临床上主要用于黑色素瘤和慢性粒细胞白血病，与放射线合并应用治疗脑瘤也有一定疗效。

【用法】口服，1次0.5g，1日1～1.5g。连续用药直到

需要全本请访问 www.ertongbook.com