

药化：抗肿瘤药物 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/17/2021\\_2022\\_\\_E8\\_8D\\_AF\\_E5\\_8C\\_96\\_EF\\_BC\\_9A\\_E6\\_c23\\_17003.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/17/2021_2022__E8_8D_AF_E5_8C_96_EF_BC_9A_E6_c23_17003.htm) 第十四章 抗肿瘤药物

第一节 烷化剂 烷化剂属细胞毒类药，对正常细胞同样抑制，恶心、呕吐、骨髓抑制、脱发。

一、氮芥类：烷化基部分(功能基) 载体部分(改变药物选择性) 盐酸氮芥：只对淋巴瘤有效，毒性大。氮甲：(甲酰溶肉瘤素)，氮甲 苯丙氨酸。精原细胞瘤显著，毒性低，可口服性质：1、遇光变红 2、碱中水解 3、茚三酮反应 环磷酰胺：前药。被P450氧化酶氧化，成4-羟基(酮基)环磷酰胺...毒性小，广谱。异环磷酰胺：前药。生成单氯乙基环磷酰胺。为骨骼抑制等肾脏毒性、尿道出血。与尿路保护剂美司钠合用。

三、亚硝基脲类：卡莫司汀(卡氮芥)：脑瘤及中枢瘤 性质：1、酸碱中均不稳定。二、乙撑亚胺类 塞替派：治疗膀胱癌的首选药。四、甲磺酸酯及多元醇类 白消安(马利兰)：治疗慢性粒细胞白血病。不良反应：消化道反应及骨骼抑制。性质：1、加NaOH 水解脱氢---乙醚样特臭四氢呋喃。

第二节 抗代谢药物通过对DNA合成干扰，抑制肿瘤细胞生存和复制所必须的代谢途径。多用于治疗白血病。生物电子等排原理作结构改动，与代谢物相似。

一、嘧啶拮抗物：1、尿嘧啶：氟尿嘧啶(5-FU)：实体肿瘤首选。疗效好，2、毒性大，3、严重消化道、骨骼抑制。性质：1、溶于稀HCl和NaOH 2、亚硫酸钠中不稳定 卡莫氟：是5-FU的前药。对结肠、直肠癌的疗效较高。2、胞嘧啶：盐酸阿糖胞苷：前药，体内转化成三磷酸阿糖胞苷，抑制DNA多聚酶阻止DNA合成。口服吸收较差，静脉连续滴注。用于

治疗急性粒细胞白血病。3、六甲蜜胺：HMM广谱，嘧啶类抗代谢药，抑制二氢叶酸还原酶。二、嘌呤拮抗物：巯嘌呤(6-MP)：前药，酶促为6-硫代次黄嘌呤核苷酸(硫代肌苷酸)，抑制嘌呤核苷酸生物合成。性质：1、黄色结晶性粉末。各种急性白血病的治疗。三、叶酸拮抗剂甲胺蝶呤：与亚叶酸钙合用降低毒性。主要用于治疗急性白血病。性质：1、黄色结晶粉末，溶稀碱稀酸2、二氢叶酸还原酶抑制剂四、羟基脲 羟基脲：为核苷酸还原酶抑制剂，阻止DNA合成。

第三节 抗肿瘤天然药物一、抗肿瘤抗生素：直接作用于DNA，为细胞周期非特异性药物。阿霉素、柔红霉素：急性粒细胞白血病淋巴细胞白血病，骨髓抑制，心脏毒性。米托蒽醌：细胞周期非特异性药物，作用是阿的5倍，心脏毒性小。急性白血病复发。二、抗肿瘤的植物药有效成分：喜树碱、长春新碱、紫杉醇

第四节 金属配合物抗肿瘤药物顺铂：DNA复制停止，阻碍细胞的分裂，反式无作用，胃肠道反应多见。性质：1、亮黄色或橙黄色。2、170 C转化为反式3、水液不稳，光、空气不敏感。卡铂：对肾脏、消化道反应及耳毒性较低，需静注。

第五节 其他抗肿瘤药物昂丹司琼：5-HT受体拮抗剂。辅助治疗，预防或治疗化疗药物和放疗药物引起的呕吐。他莫昔芬前药：环磷酰胺、异环磷酰胺、卡莫氟、盐酸阿糖胞苷、巯嘌呤口服：氮甲、白消安甲胺蝶呤、六甲蜜胺：二氢叶酸还原酶抑制剂黄色结晶性粉末：甲胺蝶呤、巯嘌呤顺铂

第十五章 甾体药物基本骨架为环戊烷并多氢菲，四个环之间都是反式稠合，即5a系，6个手性C。分雄、雌、孕甾。第一节 雄性激素和同化激素甲睾酮：C17位上引入甲基，空间位阻使代谢比较困难，可以口服。丙酸睾酮：17 -羟

基-雄甾-4-烯-3-酮丙酸酯 17位上羟基酯化，增加脂溶性，长效，一次2-4天苯丙酸诺龙：17-羟基-雌甾-4-烯-3-酮苯丙酸酯 19位失碳雄激素，最早使用的蛋白同化激素类，用于烫伤，恶性肿瘤手术前后、严重骨质疏松症，侏儒症及营养吸收不良等。达那唑：17a-孕甾-2,4-二烯-20-炔并[2,3-d]异恶唑-17-醇为弱雄激素，兼有蛋白同化和抗孕激素作用。治疗子宫内膜异位，系统性红斑狼疮，血小板减少性紫癜等。

第二节 雌激素雌二醇：雌甾-1,3,5-(10)-三烯-3,17-二醇 治疗卵巢功能不全引起的病症，更年期障碍、子宫发育不全及月经失调等。不易口服。炔雌醇：3-羟基-19-去甲-17a-孕甾-1,3,5-(10)-三烯-20-炔-17醇 与孕激素配伍成口服避孕药己烯雌酚：同雌二醇，活性更强，口服有效，尚用作应急事后避孕药。共性：1、碱性中与苯甲酰氯作用，酚羟基酰化。雌二醇、炔雌醇 2、硫酸中呈色：雌二醇(黄绿色)；炔雌醇(红色)；己烯雌酚(橙黄色)

第三节 孕激素黄体酮(孕酮)：孕甾-4-烯-3,20-二酮 两种晶形， $\beta$ ， $\alpha$ ，易转为 $\alpha$ ，活性无差别。1、C-20位上甲基酮，与高铁离子络合，生成蓝紫色。(其他淡紫或不显色) 2、羰基：盐酸羟胺反应 制成油注射剂，用于流产 3、与异烟肼生成浅黄色化合物 醋酸甲地孕酮：6-甲基-17a-羟基-孕甾-4,6-烯-3,20-二酮醋酸酯 与雌激素配伍为避孕药醋酸甲羟孕酮：6a-甲基-17a-羟基-孕甾-4-烯-3,20-二酮醋酸酯 安宫黄体酮，可作长效避孕

100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 [www.100test.com](http://www.100test.com)