

靶向药名称	研发药厂	剂型	临床/上市状态	主要靶点	文字解释	有效率	入脑能力	临床剂量	服用方法	剂量调整	备注	换算比例（临床量：原料
Gefitinib/吉非替尼/易瑞沙/Iressa	阿斯利康	口服	已上市	EGFR	EGFR（EXON 18,19,21突变）：突变概率：中国腺癌66.3%，优势人群：东亚、女性、不吸烟、肺腺癌。	高	中	250mg每天	每天一次，空腹或半空腹	缓慢进展时可加量到每天1片半	脑膜转病人可使用脉冲方案，比如第1天吃4粒，停3天，循环	1:1
Erlotinib/厄洛替尼/特罗凯/Tarceva	罗氏	口服	已上市	EGFR	EGFR（EXON 18,19,21突变）	高	强	150mg每天	每天一次，空腹	副作用无法耐受可依次减量到100mg、50mg	脑膜转病人可使用脉冲方案，比如第1天吃4粒，停3天，循环	1:1.09盐酸盐
Icotinib/埃克替尼/凯美纳/Conmana	浙江贝达	口服	已上市	EGFR	EGFR（EXON 18,19,21突变）	高	强	125mg*3每天	每天三次，空腹			盐酸盐
Afatinib/BIBW2992/阿法替尼/妥复克	勃林格殷格翰	口服	已上市	EGFR、T790M、HER2	EGFR（EXON 18,19,21突变）、Her2突变	EGFR:高、HER2:中	中	40mg每天	每天一次，空腹	副作用无法耐受可依次减量到30mg、20mg	可采用吃8天停2天，提高耐受性	1:1.48马来酸盐
Dacomitinib/PF00299804	辉瑞	口服	3期临床	EGFR、T790M、HER2	EGFR（EXON 18,19,21突变）、Her2突变	中	强	45mg每天	每天一次，空腹	副作用无法耐受可依次减量到40mg、30mg	可采用吃8天停2天，提高耐受性	1:1
Lapatinib/拉帕替尼/泰克布/Tykerb	葛兰素史克	口服	已上市	EGFR、HER2	Her2突变：突变概率：4.2%（腺癌中9.8%），优势人群：不吸烟、肺腺癌，与性别、种族无关	低	强	1250mg每天	每天一次，空腹	与食物同时服用时，剂量减半		1:1.62盐酸盐
Pozotinib/HM781-36B	韩美	口服	2期临床	EGFR、T790M、HER2	EGFR（EXON 18,19,21突变）、Her2突变		未知	16mg每天	每天一次，空腹	副作用无法耐受可依次减量到14mg、12mg		1:1.06盐酸盐
CO-1686	Clovis	口服	2期临床	EGFR、T790M	EGFR（EXON 18,19,21突变）、T790突变		中	100-200mg原料量*2每天	每天二次，空腹			氢溴酸盐
AZD9291	阿斯利康	口服	1期临床	EGFR、T790M	EGFR（EXON 18,19,21突变）、T790突变		未知	20-80mg每天	每天一次，空腹			
HM61713	韩美	口服	1期临床	EGFR、T790M								
WZ4002	哈佛大学	口服	动物试验	EGFR、T790M	EGFR（EXON 18,19,21突变）、T790突变		中	100-200mg原料量*2每天	每天二次，空腹			氢溴酸盐
Vandetanib/凡德他尼	阿斯利康	口服	3期临床	EGFR、VEGFR-2、VEGFR-3、Ret	EGFR（EXON 18,19,21突变）、抗血管生成、Ret突变	RET:中	中	300mg每天	每天一次，空腹	副作用无法耐受可减量到250mg		1:1
BMS-690514	施贵宝	口服	2期临床	EGFR、HER2、VEGFR-1、VEGFR-2、VEGFR-3								
AP26113	Ariad	口服	2期临床	EGFR、T790M、ALK、ROS1	ALK突变、ROS1突变、ALK耐药突变	高	强	90-180mg每天	每天一次，空腹	90mg每天吃一周后，加量到120mg每天，脑转病人180mg每天		1:1
Cetuximab/西妥昔单抗/爱必妥/Erbitux	默克	静脉	已上市	EGFR								
Nimotuzumab/尼妥珠单抗/泰欣生	百泰	静脉	已上市	EGFR								
Panitumumab/帕尼单抗/Vectibix	安进	静脉	已上市	EGFR								
Necitumumab/IMC-11F8	礼来	静脉	3期临床	EGFR								
Trastuzumab/曲妥珠单抗/赫赛汀	罗氏	静脉	已上市	HER2		低						
Crizotinib/克唑替尼/赛可瑞/Xalkori	辉瑞	口服	已上市	ALK、ROS1、cMET	ALK突变：突变概率3.0%（腺癌中3.9%）优势人群：60岁以下、女性、不吸烟、肺腺癌、ROS1突变：突变概率：0.9%（腺癌中1.2%），优势人群：不吸烟、肺腺癌、低分化、高侵袭性、Cmet扩增：突变概率：5%，优势人群：吸烟史、低分化、高侵袭性	ALK:高、cMET:中	极弱	250mg*2每天	每天二次，空腹	副作用无法耐受可减量到400mg		1:1
LDK378	诺华	口服	2期临床	ALK、ROS1	ALK突变、ROS1突变、ALK耐药突变	高	强	750mg每天	每天一次，空腹			盐酸盐
TSR-011	Tesaro	口服	1期临床	ALK、ROS1								
CEP-37440	Teva	口服	1期临床	ALK、ROS1								
X-396	Xcovery	口服	1期临床	ALK、ROS1								
PF-06463922	辉瑞	口服	1期临床	ALK、ROS1								
Alectinib/CH5424802	罗氏/Chugai	口服	2期临床	ALK	ALK突变、ALK耐药突变	高	强	300mg*2每天	每天二次，空腹			盐酸盐

靶向药名称	研发药厂	剂型	临床/上市状态	主要靶点	文字解释	有效率	入脑能力	临床剂量	服用方法	剂量调整	备注	换算比例（临床量：原料
Tivantinib/ARQ197	ArQule	口服	3期临床	cMET	Cmet扩增	中	未知	360mg*2每天	每天二次，空腹			
INC280/INCB28060	诺华	口服	1期临床	cMET	Cmet扩增	中	未知	100-400mg*2每	每天二次，空腹			盐酸盐
Cabozantinib/XL184/Cometriq/卡博替尼	Exelixis	口服	已上市	cMET、VEGFR-1、VEGFR-2、VEGFR-3、Ret	Cmet扩增、VGFR2、Ret融合：突变概率：0.9%（腺癌中1.2%），优势人群：60岁以下、不吸烟、肿块小、肺腺癌	CMET:中，RET:中	中	60mg每天	每天一次，空腹	副作用无法耐受可依次减量到50mg、40mg；联用剂量为40mg	可采用吃5天停2天，提高耐受性；如果胃肠道刺激大，可换用肠溶胶囊	1:1.27苹果酸
Foretinib/XL880	Exelixis	口服	2期临床	cMET、VEGFR-2、PDGFR、FLT3、Ret、AXL								
Sorafenib/索拉非尼/多吉美/Nexavar	拜耳	口服	已上市	cKIT、VEGFR-2、VEGFR-3、PDGFR、FLT3、RAS、BRAF、MEK、Ret	抗血管生成	RET:低 KRAS：低 NRAS:低	弱	400mg*2每天	每天二次，空腹			1:1.37甲苯磺酸盐
Sunitinib/舒尼替尼/索坦/Sutent	辉瑞	口服	已上市	cKIT、VEGFR-1、VEGFR-2、VEGFR-3、PDGFR、FLT3、MEK、Ret	抗血管生成、Ckit突变	RET:低	弱	50mg每天	每天一次，空腹	副作用无法耐受可减量到37.5mg	吃四周停二周	1:1.34苹果酸
Axitinib/阿西替尼	辉瑞	口服	已上市	cKIT、VEGFR-1、VEGFR-2、VEGFR-3、PDGFR	抗血管生成、Ckit突变		弱	5mg*2每天	每天二次，空腹	副作用无法耐受可依次减量到4mg*2、3mg*2		1:1
Pazopanib/帕唑帕尼/Votrient	葛兰素史克	口服	已上市	cKIT、VEGFR-1、VEGFR-2、VEGFR-3、PDGFR	抗血管生成、Ckit突变		弱	800mg每天	每天一次，空腹			
Regorafenib/瑞格菲尼/Stivarga	拜耳	口服	已上市	cKIT、FGFR、VEGFR-1、VEGFR-2、VEGFR-3、PDGFR、BRAF、Ret	抗血管生成、Ckit突变		弱	160mg每天	每天一次，有或无食物			
Famitinib/法米替尼	恒瑞	口服	3期临床/上市申请	cKIT、VEGFR-2、VEGFR-3、PDGFR、FLT3、Ret	抗血管生成、Ckit突变		弱	50mg每天，吃四周停二周	每天一次，空腹	副作用无法耐受可减量到37.5mg	吃四周停二周	苹果酸
Apatinib/阿帕替尼	恒瑞	口服	3期临床/上市申请	cKIT、VEGFR-1、VEGFR-2、VEGFR-3、PDGFR	抗血管生成		弱	750mg每天	每天一次，空腹	副作用无法耐受可减量到500mg		
Tivozanib/TIVO-1	Aveo	口服	3期临床	cKIT、VEGFR-1、VEGFR-2、VEGFR-3、PDGFR	抗血管生成、Ckit突变		弱	1.5mg每天	每天一次，空腹			盐酸盐
Brivanib/BMS-584662	施贵宝	口服	3期临床	cKIT、FGFR、VEGFR-1、VEGFR-2、VEGFR-3	抗血管生成		弱	800mg每天	每天一次，空腹			
Cediranib/AZD2171/西地尼布/Recentin	阿斯利康	口服	3期临床	cKIT、VEGFR-1、VEGFR-2、VEGFR-3、PDGFR	抗血管生成、Ckit突变		强	30mg每天	每天一次，空腹	副作用无法耐受可减量到20mg		1:1.26马来酸盐
Vatalanib/PTK787	诺华	口服	2期临床	cKIT、VEGFR-1、VEGFR-2、VEGFR-3、PDGFR								
Dovitinib/多维替尼	诺华	口服	2期临床	cKIT、FGFR、VEGFR-1、VEGFR-2、VEGFR-3、PDGFR、FLT3	抗血管生成、Ckit突变、FGFR扩增	FGFR:低	弱	500mg每天	每天一次，空腹			乳酸盐
Imatinib/伊马替尼/格列卫/Glivec	诺华	口服	已上市	cKIT、PDGFR、Bac/Abl	BCR/ab突变、Ckit突变		未知	400mg每天	每天一次，空腹		吃5天停2天	
Nilotinib/Tasigna/尼洛替尼/达希纳	诺华	口服	已上市	cKIT、PDGFR、Bac/Abl	BCR/ab突变、Ckit突变、BCR/ab耐药突变		未知	400mg*2每天	每天二次，空腹			
Dasatinib/达沙替尼/施达赛/Sprycel	施贵宝	口服	已上市	cKIT、PDGFR、Bac/Abl、DDR2	BCR/ab突变、Ckit突变、BCR/ab耐药突变、DDR2突变:突变概率：鳞癌中4%，优势人群：男性+吸烟+鳞癌	DDR2:低	未知	100mg每天	每天一次，空腹	加速或急变期的CML患者,起始剂量为每天2次的70mg	可采用吃5天停2天，提高耐受性	
Panotinib/AP24534/Iclusig/泊那替尼	Ariad	口服	已上市	cKIT、FGFR、PDGFR、Bac/Abl	BCR/ab突变、Ckit突变、BCR/ab耐药突变	FGFR:低	未知	45mg每天	每天一次，空腹			
Lenalidomide/雷利度胺/来那度胺	Celgene	口服	已上市	FGFR、VEGFR-2	抗血管生成、免疫调节		弱	10mg每天	每天一次，空腹	副作用无法耐受可减量到5mg		
Vargatef/BIBF1120/尼达尼布	勃林格殷格翰	口服	3期临床/上市申请	FGFR、VEGFR-1、VEGFR-2、VEGFR-3、PDGFR	抗血管生成、抗肺部纤维化。FGFR1扩增概率：鳞癌中20-25%；FGFR2突变概率：鳞癌中5%；优势人群：男性+吸烟+鳞癌		弱	150mg*2每天	每天二次，空腹			
Lucitanib/德立替尼	Servier	口服	1期临床	FGFR、VEGFR-1、VEGFR-2、VEGFR-								
Bevacizumab/贝伐单抗/阿瓦斯汀/Avastin	罗氏	静脉	已上市	VEGFR-2								
Ramucirumab	礼来	静脉	3期临床	VEGFR-2								

靶向药名称	研发药厂	剂型	临床/上市状态	主要靶点	文字解释	有效率	入脑能力	临床剂量	服用方法	剂量调整	备注	换算比例（临床量：原料
BKM120	诺华	口服	3期临床	PI3K	PI3K突变或者扩增：突变概率：2%，鳞癌中9%，优势人群：男性、吸烟、鳞癌、高侵袭性	中	强	100mg每天	每天一次，空腹	联用剂量为50-80mg	可采用吃5天停2天，提高耐受性	1:1.1
BEZ235	默克	口服	2期临床	PI3K、mTOR	PI3K/mTOR		未知	200-400mg*2每天	每天二次，空腹	此为联用剂量		solid dispersion system
XL765	赛诺菲	口服	2期临床	PI3K、mTOR	PI3K/mTOR		未知	50mg每天	每天一次，空腹	此为联用剂量		
Everolimus/依维莫司/Certican	诺华	口服	已上市	mTOR	mTOR		未知	10mg每天	每天一次，有或无食物		如需要中度CYP3A4或P-糖蛋白(PgP)抑制剂,减低AFINITOR剂量至2.5mg	
Temsirolimus/西罗莫司	惠氏	静脉/口服	已上市	mTOR								
Temsirolimus/馱瑞塞尔/坦罗莫司	惠氏	静脉	已上市	mTOR								
Vemurafenib/威罗菲尼/Zelboraf	罗氏	口服	已上市	BRAF	Braf突变：突变概率：3%，优势人群：吸烟史	高	未知	960mg每天	每天一次，空腹			
Dabrafenib/达帕菲尼/Tafinlar	葛兰素史克	口服	已上市	BRAF	Braf突变		强	150mg*2每天	每天二次，空腹			
Trametinib/曲美替尼/Mekinist	葛兰素史克	口服	已上市	MEK	Mek扩增		未知	2mg每天	每天一次，空腹	此为联用剂量		
Selumetinib/AZD6244/司美替尼	阿斯利康	口服	3期临床	MEK	Mek扩增	KRAS: 低 NRAS：低	未知	75mg*2每天	每天二次，空腹	副作用无法耐受可减量到50mg*2	易瑞沙/特罗凯联合司美替尼，早上易/特一粒，晚上司美替尼100mg一粒	硫酸氢盐
Ipilimumab/易普利姆玛/Yervoy	施贵宝	静脉	已上市	CTLA-4								
Ganetespib/STA-9090	Synta	静脉	3期临床	HSP90								
IPI-504	Infinity	静脉	2期临床	HSP90								
AT13387	Astex	静脉	2期临床	HSP90								
BIIB021/CNF-2024	Biogen Idec	口服	2期临床	HSP90	HSP90		未知	1200mg每周	每周二次或者三次，空腹			
Nivolumab/BMS-936558	施贵宝	静脉	3期临床	PD-1								
Lambrolizumab/MK-3475	默克	静脉	2期临床	PD-1								
MPDL3280A	罗氏	静脉	2期临床	PD-L1								
Synribo/Omapro/高三尖杉酯碱	ChemGenex	口服	已上市	Bac/Abl								
MK2206	诺华	口服	2期临床	AKT	AKT		未知	45mg隔天或者90mg每周	隔天一次或者每周一次，空腹	此为联用剂量		二盐酸盐
AXL1717	Axelar AB	口服	2期临床	IGF-1								
BGB324	BergenBio&Rige	口服	1期临床	AXL								
TP-0903	Tolero	口服	动物试验	AXL								