

PRACTICE OF MEDICAL
ONCOLOGY TREATMENT

实用 肿瘤内科治疗

第2版

周际昌 主编



北京科学技术出版社

实用肿瘤内科治疗

(第2版)

周际昌 主编

 北京科学技术出版社

图书在版编目(CIP)数据

实用肿瘤内科治疗/周际昌主编. —2版. —北京:北京科学技术出版社, 2016. 4

ISBN 978 - 7 - 5304 - 8153 - 0

I. ①实… II. ①周… III. ①肿瘤 - 内科 - 治疗学
IV. ①R730. 5

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2015)第 311780 号

实用肿瘤内科治疗(第2版)

主 编:周际昌

责任编辑:杨 帆

责任校对:贾 荣

责任印制:李 茗

封面设计:耕者设计工作室

出 版 人:曾庆宇

出版发行:北京科学技术出版社

社 址:北京西直门南大街 16 号

邮政编码:100035

电话传真:0086 - 10 - 66135495(总编室)

0086 - 10 - 66113227(发行部)

0086 - 10 - 66161952(发行部传真)

电子信箱:bjkj@bjkjpress.com

网 址:www. bkydw. cn

经 销:新华书店

印 刷:三河国新印装有限公司

开 本:787mm × 1092mm 1/16

字 数:804 千

印 张:36. 25

版 次:2016 年 4 月第 2 版

印 次:2016 年 4 月第 1 次印刷

ISBN 978 - 7 - 5304 - 8153 - 0/R · 2017

定 价:120. 00 元



京科版图书, 版权所有, 侵权必究。
京科版图书, 印装差错, 负责退换。

内 容 提 要

全书共分为4篇、25章,内容包括抗肿瘤药物(含新药和分子靶向药)138种、辅助治疗药物31种、肿瘤的内科治疗方案43种及肿瘤的介入治疗方案10种。书中详细介绍了不同肿瘤的病理分类、临床分期、治疗原则、综合治疗、肿瘤内科治疗及化疗方案。

本书根据现代肿瘤治疗的进展,收集大量国内外资料和编者的临床经验,从实际需要出发,内容实用全面,可供肿瘤科和有关科室医师、药剂人员和肿瘤防治人员等参考使用。

编委名单

主 编 周际昌

编 委 (按章次出现先后排序)

- | | |
|--------|-----------------------|
| 张 频 | 中国医学科学院肿瘤医院内科主任医师 |
| 周立强 | 中国医学科学院肿瘤医院内科主任医师、博士 |
| 杨渤彦 | 中国医学科学院肿瘤医院综合科主任医师、博士 |
| 刘 姗 | 中国医学科学院肿瘤医院综合科主治医师、博士 |
| 李峻岭 | 中国医学科学院肿瘤医院内科主任医师、博士 |
| 冯奉仪 | 中国医学科学院肿瘤医院内科主任医师 |
| 周爱萍 | 中国医学科学院肿瘤医院内科主任医师、博士 |
| 张 雯 | 中国医学科学院肿瘤医院内科主治医师、硕士 |
| 王 燕 | 中国医学科学院肿瘤医院内科主任医师、博士 |
| 胡兴胜 | 中国医学科学院肿瘤医院内科副主任医师 |
| 王佳玉 | 中国医学科学院肿瘤医院内科副主任医师、博士 |
| 董 梅 | 中国医学科学院肿瘤医院内科主任医师、博士 |
| 马 飞 | 中国医学科学院肿瘤医院内科副主任医师、博士 |
| 王金万 | 中国医学科学院肿瘤医院内科主任医师 |
| 依荷芭丽·迟 | 中国医学科学院肿瘤医院内科副主任医师、博士 |
| 孙永琨 | 中国医学科学院肿瘤医院内科副主任医师 |
| 李 斌 | 中国医学科学院肿瘤医院妇科主任医师、博士 |
| 肖会廷 | 天津医科大学肿瘤医院妇科主治医师、硕士 |
| 李小平 | 北京大学人民医院妇科主任医师、博士 |
| 张 建 | 衡水市第二医院肿瘤医院肿瘤内科副主任医师 |
| 刘复生 | 中国医学科学院肿瘤医院病理科主任医师 |
| 周际昌 | 中国医学科学院肿瘤医院内科主任医师 |

再版前言

本书第1版于2010年出版,近几年在肿瘤内科治疗方面又有许多新进展,出现了许多新药物。为了与时俱进,给读者提供更新、更全面的肿瘤内科治疗信息和经验,我们组织了第2版的编写。再版时我们注意广泛收集国内外资料,临床分期采用近年UICC/AJCC分期,治疗部分参考近年美国国家综合癌症网络(NCCN)肿瘤临床实践指南,药物方面进一步补充新抗肿瘤药和新靶向药物、新化疗方案,以及综合治疗的新观念。第2版重点补充一些新的靶向药和近年发表的新资料,以期提高肿瘤内科治疗水平,提高肿瘤患者生存率和治愈率。

临床工作者在使用本书过程中,必须在治疗原则和综合治疗的基础上安排肿瘤内科治疗的实施。一定要根据患者的具体病情、身体状况和治疗反应恰当掌握,以期达到最佳效果。其中,引自国外资料的化疗方案和剂量,一定要结合我国患者的具体情况斟酌调整使用。希望本书在肿瘤内科规范化治疗方面对读者有所帮助。

本书在编写和出版过程中得到北京科学技术出版社的大力支持,在此对出版社及协助本书编写工作的医师表示感谢。由于我们的经验和水平有限,书中的不足和错误之处,望同道批评指正。

中国医学科学院
北京协和医学院 肿瘤研究所肿瘤医院

周际昌

2015年5月11日

前 言

当今肿瘤治疗进展迅速,尤其综合治疗更受到广泛重视,肿瘤内科治疗又是在综合治疗中起到非常重要的作用。肿瘤内科治疗已从经验医学发展到循证医学、规范化治疗和个体化治疗,各项治疗更加完善,更加贴近患者实际情况,治疗效果也大大提高。如今分子靶向药物的问世成为肿瘤内科研究的新亮点,使药物治疗作用发生重大变革,使肿瘤内科治疗有了重大进步,在不断完善的基础上,前景可观。肿瘤内科治疗的发展日新月异,我们只有不断更新知识,才能跟上这一形势,从而提高肿瘤内科治疗水平。

本书收入了2008年以前世界卫生组织(WHO)新的病理分类,2002年UICC/AJCC临床分期,治疗部分参考美国国家综合癌症网络(NCCN)肿瘤临床实践指南(2008, 2009),结合我们的经验,充实治疗原则、综合治疗、肿瘤内科治疗和化疗方案,并介绍分子靶向药物治疗。

临床工作者在使用本书过程中,必须在治疗原则和综合治疗的基础上安排肿瘤内科治疗的实施,一定要根据患者的具体病情、身体状况和治疗反应恰当掌握,以期达到最佳效果。其中引用的国外资料化疗方案和剂量,一定要结合国人情况斟酌调整使用。希望本书的出版在正确应用肿瘤内科治疗和规范化治疗方面对读者有所帮助。

本书在编写和出版过程中得到北京科学技术出版社的大力支持,在此对出版社及对协助本书编写工作的医师表示感谢。由于我们的经验和水平有限,书中有不足和错误之处,望请同道批评指正。

中国医学科学院
北京协和医学院

肿瘤研究所肿瘤医院

周际昌

2010年5月10日

目 录

第一篇 抗肿瘤药物

第一章 烷化剂	1
氮芥 (Chlormethine)	1
环磷酰胺 (Cyclophosphamide)	2
异环磷酰胺 (Ifosfamide)	3
美法仑 (Melphalan)	4
N-甲酰溶肉瘤素 (N-Formylsarcosine)	5
甘磷酰芥 (Glyfostin)	6
硝卡芥 (Nitrocaphane)	6
苯丁酸氮芥 (Chlorambucil)	7
卡莫司汀 (Carmustine)	8
洛莫司汀 (Lomustine)	8
司莫司汀 (Semustine)	9
尼莫司汀 (Nimustine)	10
福莫司汀 (Fotemustine)	11
雌莫司汀 (Estramustine)	12
泼尼莫司汀 (Prednimustine)	12
替莫唑胺 (Temozolomide)	13
塞替派 (Thiotepa)	16
白消安 (Busulfan)	16
二溴卫矛醇 (Mitolactol)	17
去水卫矛醇 (Dianhydrodulcitol)	18
第二章 抗代谢药	19
甲氨蝶呤 (Methotrexate)	19
巯嘌呤 (Mercaptopurine)	20
硫鸟嘌呤 (Thioguanine)	21
氟尿嘧啶 (Fluorouracil)	21
替加氟 (Tegafur)	22
优福定 (UFT)	23
替吉奥 (S-1)	23
卡莫氟 (Carmofur)	27

阿糖胞苷 (Cytarabine)	27
氟尿苷 (Floxuridine)	28
去氧氟尿苷 (Doxifluridine)	29
培美曲塞 (Pemetrexed)	29
洛拉曲塞 (Nolatrexed)	34
雷替曲塞 (Raltitrexed)	34
卡培他滨 (Capecitabine)	35
吉西他滨 (Gemcitabine)	36
安西他滨 (Ancitabine)	37
氟达拉滨 (Fludarabine)	38
羟基脲 (Hydroxyurea)	40
六甲蜜胺 (Hexamethylmelamine)	41
第三章 抗生素	43
放线菌素 D (Actinomycin D)	43
丝裂霉素 (Mitomycin C)	44
博来霉素 (Bleomycin)	45
平阳霉素 (Pingyangmycin)	45
培洛霉素 (Peplomycin)	46
光辉霉素 (Mithramycin)	46
柔红霉素 (Daunorubicin)	47
伊达比星 (Idarubicin)	48
多柔比星 (Doxorubicin)	49
多柔比星脂质体 (Doxorubicin Liposomal)	49
表柔比星 (Epirubicin)	51
吡柔比星 (Pirarubicin)	52
阿柔比星 (Aclarubicin)	53
氨柔比星 (Amrubicin)	53
伊沙匹隆 (Ixabepilone)	56
比生群 (Bisantrene)	59
链脲霉素 (Streptozotocin)	60
米托蒽醌 (Mitoxantrone)	60
第四章 植物药	62
长春新碱 (Vincristine)	62
长春地辛 (Vindesine)	63
长春瑞滨 (Vinorelbine)	63
依托泊苷注射剂 (Etoposide Injection)	64
依托泊苷软胶囊 (Etoposide Soft Capsules)	65
替尼泊苷 (Teniposide)	66

羟喜树碱(Hydroxycamptothecine)	67
伊立替康(Irinotecan)	67
拓扑替康(Topotecan)	68
卢比替康(Rubitecan)	69
紫杉醇(Paclitaxel)	70
紫杉醇脂质体(Paclitaxel Liposome)	72
白蛋白结合型紫杉醇(Nanoparticle Albumin - Bound Paclitaxel)	74
多西他赛(Docetaxel)	76
第五章 激素及内分泌药物	79
泼尼松(Prednisone)	79
泼尼松龙(Prednisolone)	80
甲基泼尼松龙(Methylprednisolone)	81
地塞米松(Dexamethasone)	81
氢化可的松(Hydrocortisone)	82
丙酸睾酮(Testosterone propionate)	82
己烯雌酚(Diethylstilbestrol)	83
溴醋己烷雌酚(Hexoestrol dibromoacetate)	84
氟他胺(Flutamide)	85
甲羟孕酮(Medroxyprogesterone)	86
甲地孕酮(Megestrol acetate)	87
他莫昔芬(Tamoxifen)	88
托瑞米芬(Toremifene)	90
屈洛昔芬(Droloxifene)	91
雷洛昔芬(Raloxifene)	91
氟维司群(Fulvestrant)	93
氨鲁米特(Aminoglutethimide)	95
福美坦(Formestane)	96
依西美坦(Exemestane)	97
阿那曲唑(Anastrozole)	98
来曲唑(Letrozole)	99
戈舍瑞林(Goserelin)	101
亮丙瑞林(Leuporelin)	102
曲普瑞林(Triptorelin)	102
奥曲肽(Octreotide)	103
第六章 杂类药	105
门冬酰胺酶(Asparaginase)	105
丙卡巴肼(Procarbazine)	106
达卡巴嗪(Dacarbazine)	107

	顺铂 (Cisplatin)	107
	卡铂 (Carboplatin)	109
	奥沙利铂 (Oxaliplatin)	110
	奈达铂 (Nedaplatin)	110
	洛铂 (Lobaplatin)	111
	亚砷酸 (Arsenious Acid)	114
	全视黄酸 (All-trans Retinoic acid)	116
第七章	生物反应调节剂	118
	干扰素 (Interferon)	118
	聚乙二醇干扰素 $\alpha-2a$ (Peginterferon alfa-2a)	120
	白细胞介素-2 (Interleukin-2)	120
	左旋咪唑 (Levamisole)	121
	香菇多糖 (Lentinan)	122
	胸腺肽 (Thymopeptide)	122
	乌苯美司 (Ubenimex)	123
	毕西巴尼 (Picibanil, OK-432)	124
	重组人 p53 腺病毒注射液 (rHu Ad-p53 Injection)	124
	肿瘤坏死因子 (Tumor necrosis factor)	126
第八章	分子靶向药物	127
	伊马替尼 (Imatinib)	127
	吉非替尼 (Gefitinib)	129
	厄洛替尼 (Erlotinib)	134
	埃克替尼 (Icotinib)	138
	克唑替尼 (Crizotinib)	142
	拉帕替尼 (Lapatinib)	147
	西妥昔单抗 (Cetuximab)	150
	尼妥珠单抗 (Nimotuzumab)	154
	帕尼单抗 (Panitumumab)	157
	曲妥珠单抗 (Trastuzumab)	159
	贝伐珠单抗 (Bevacizumab)	162
	重组人血管内皮抑素 (rh-Endostatin)	169
	沙利度胺 (Thalidomide)	173
	来那度胺 (Lenalidomide)	179
	依维莫司 (Everolimus)	185
	利妥昔单抗 (Rituximab)	189
	阿仑珠单抗 (Alemtuzumab)	192
	硼替佐米 (Bortezomib)	195
	舒尼替尼 (Sunitinib)	199

索拉非尼(Sorafenib)	203
凡德他尼(Vandetanib)	207

第二篇 辅助治疗药物

第九章 化学保护剂	210
亚叶酸钙(Calcium Folate)	210
美司钠(Mesna)	211
阿米福汀(Amifostine)	212
第十章 心脏保护药	214
右丙亚胺(Dexrazoxane)	214
辅酶 Q ₁₀ (Coenzyme Q ₁₀)	216
维生素 E(Vitamin E)	216
谷胱甘肽(Glutathione)	217
磷酸肌酸钠(Creatine Phosphate Sodium)	217
第十一章 增效剂	218
亚叶酸钙(Calcium Folate)	218
马蔺子素(Irisquinone)	218
甘氨酸双唑钠(Glycididazole Sodium)	219
汉防己甲素(Tetrandrine)	220
第十二章 止吐药	221
第一节 NCCN(2013)抗呕吐治疗指南	221
第二节 5-HT ₃ 受体拮抗剂	222
昂丹司琼(Ondansetron)	222
多拉司琼(Dolasetron)	223
格拉司琼(Granisetron)	223
托烷司琼(Tropisetron)	224
阿扎司琼(Azasetron)	225
帕洛诺司琼(Palonosetron)	225
第三节 NK-1受体拮抗剂	227
阿瑞匹坦(Aprepitant)	227
福沙匹坦(Fosaprepitant)	228
第十三章 生血药	230
第一节 NCCN(2013)骨髓造血生长因子应用指南	230
第二节 生白细胞药物	230
非格司亭(Filgrastim)	230
培非司亭(Pegfilgrastim)	231
沙格司亭(Sargramostim)	232

第三节 生血小板药物	233
白细胞介素-11 (Interleukin-11)	233
重组人血小板生成素 (Recombinant Human Thrombopoietin)	234
第四节 生红细胞药物	236
重组人红细胞生成素 (rHu Erythropoietin)	236
第十四章 骨溶解抑制剂	238
氯膦酸二钠 (Disodium Clodronate)	238
帕米膦酸钠 (Pamidronate Disodium)	239
伊班膦酸钠 (Ibandronate Sodium)	240
唑来膦酸 (Zoledronic Acid)	240
降钙素 (Calcitonin)	242

第三篇 各种肿瘤的内科治疗

第十五章 淋巴血液系统肿瘤	243
第一节 恶性淋巴瘤	243
霍奇金淋巴瘤	245
非霍奇金淋巴瘤	248
第二节 多发性骨髓瘤	257
第十六章 胸部肿瘤	270
第一节 乳腺癌	270
第二节 肺癌	285
小细胞肺癌	287
非小细胞肺癌	306
第三节 恶性胸膜间皮瘤	314
第四节 胸腺瘤	318
第十七章 消化系统肿瘤	323
第一节 食管癌	323
第二节 胃癌及贲门癌	330
第三节 结直肠癌	339
第四节 原发性肝癌	350
第五节 胆囊癌及胆管癌	356
第六节 胰腺癌	360
第七节 恶性胰岛细胞瘤	365
第八节 胃肠道间质瘤	366
第九节 胃肠胰神经内分泌癌	372

第十八章 头颈部肿瘤	380
第一节 头颈部癌	380
第二节 鼻咽癌	388
第三节 舌癌	393
第四节 喉癌	395
第五节 甲状腺癌	399
第十九章 泌尿系统肿瘤	404
第一节 肾癌	404
第二节 肾母细胞瘤	409
第三节 肾上腺皮质癌	412
第四节 恶性嗜铬细胞瘤	414
第五节 肾盂癌及输尿管癌	415
第六节 膀胱癌	417
第二十章 男性生殖系统肿瘤	422
第一节 睾丸癌	422
第二节 前列腺癌	428
第二十一章 女性生殖系统肿瘤	436
第一节 卵巢癌	436
第二节 绒毛膜癌	453
第三节 子宫颈癌	460
第四节 子宫内膜癌	468
第五节 子宫肉瘤	473
第二十二章 皮肤、软组织及骨肿瘤	479
第一节 皮肤癌	479
第二节 恶性黑色素瘤	481
第三节 软组织肉瘤	485
第四节 骨肉瘤	489
第五节 尤文肉瘤	495
第二十三章 其他肿瘤	499
第一节 横纹肌肉瘤	499
第二节 视网膜母细胞瘤	504
第三节 神经母细胞瘤	508
第四节 原发性脑瘤及脑转移瘤	512
第五节 恶性体腔积液	518

第四篇 肿瘤介入治疗

第二十四章 肿瘤血管介入治疗	522
第一节 概述	522

第二节	各种肿瘤的血管介入治疗	525
第二十五章	肿瘤非血管介入治疗	533
第一节	肿瘤消融治疗	533
第二节	放射性粒子植入治疗	535

附 录

附录一	肿瘤内科治疗的疗效评定标准(WHO)	538
附录二	患者生活质量状况的评定	540
附录三	抗肿瘤药物不良反应的分度标准(WHO 标准)	541
附录四	卡铂剂量 AUC 的计算方法	543
附录五	人体体表面积计算图	544
附录六	抗肿瘤药和辅助药的英文缩写与中文对照	546
药名索引		549

第一篇 抗肿瘤药物

第一章 烷化剂

烷化剂是一类可以与核酸、蛋白质及许多小分子物质相结合的化合物。烷化剂的亲电子基团在体内产生带正电的极性分子,这些极性分子可与大多数细胞的富含电子区域产生相互作用,而烷化剂的细胞毒作用正是其亲电子基团与 DNA 相互作用产生替代性反应、交链反应、链断裂反应,导致 DNA 分子编码发生改变,最终导致突变或细胞死亡。因此,烷化剂在抗肿瘤同时有诱发产生畸形和致癌的潜在危险。烷化剂属细胞周期非特异性药物,对 G_0 期细胞也有杀伤作用,但在 G_1 、S 期更有效。烷化剂之间、烷化剂与非烷化剂之间的交叉耐药较少。

氮芥 (Chlormethine)

【别名】恩比兴、双氯乙基甲胺盐酸盐、盐酸氮芥、Nitrogen Mustard、Mustin、Mustargen,简称 HN2、NM。化学名为 2,2'-二氯-N-甲基二乙胺。

【药理作用】氮芥在体内迅速转变成缺电子、具有高度活性的中间产物乙撑亚胺离子,后者与生物大分子中富含电子的基团共价结合,即烷化反应。最重要的反应是与鸟嘌呤(G)第 7 位氮原子(N7)发生共价结合,产生 DNA 的双链内交叉联结或 DNA 的同链内不同碱基的交叉联结,抑制 DNA 复制,并且对 RNA 和蛋白质合成也有抑制作用。 G_1 期和 M 期肿瘤细胞对氮芥最为敏感, G_1 期进入 S 期明显延迟。大剂量时对各期细胞均有杀伤作用,属于周期非特异性药物。

氮芥进入血后迅速水解或与细胞的某些成分结合,0.5~1 分钟内即清除 90% 以上,迅速分布到肺、小肠、肝、脾、肾及肌肉等组织中,脑中含量最少。氮芥的半衰期很短,给药后 6 小时与 24 小时血中及组织中含量很低,药物代谢物中 20% 以二氧化碳形式经呼吸道排出(多在 6 小时内),多种代谢产物从尿中排出,原形物从尿中排出不到 0.01%。大鼠、小鼠口服氮芥吸收不规则,剂量较大时可引起特有的药物反应,故不能用于口服。氮芥易从皮肤吸收,故可外用。

【适应证】①恶性淋巴瘤:对霍奇金淋巴瘤的客观有效率为 70%,缓解期 1~6 个月;对非霍奇金淋巴瘤的单药有效率为 20%~70%;对蕈样真菌病可静脉给药,也可皮肤外涂。②小细胞肺癌:30%~40% 有效。③癌性胸腔积液、腹腔积液及心包积液:尤其对恶性淋巴瘤、小细胞肺癌、乳腺癌、卵巢癌所致的恶性积液疗效更好。④恶性肿瘤所致上腔静脉综合征:常可迅速缓解症状。⑤目前很

少用于其他肿瘤,但对慢性淋巴细胞白血病、卵巢癌、精原细胞瘤、鼻咽癌、乳腺癌、前列腺癌等有一定疗效。

【用法】①静脉注射:先以5%葡萄糖液或生理盐水静脉滴注,确认针头在静脉内、液体滴注正常后再配制氮芥。每次 $3 \sim 6\text{mg}/\text{m}^2$ (体表面积) (一般给5mg),溶于生理盐水10ml,用皮内针头从输液器胶管接近针头处穿刺推注,并用5%葡萄糖液或生理盐水冲洗血管,减轻药物对静脉的刺激,减少静脉炎的发生。每周1次,连用2次,休息1~2周重复。②动脉注射:每次5~10mg,每日或隔日1次,共2~3次,间隔2~3周。③腔内给药:每次5~10mg,溶于生理盐水20ml中,在抽液后及时腔内注入。④局部皮肤涂抹:用氮芥5mg溶于生理盐水50ml中,每日1~2次。治疗皮肤蕈样肉芽肿。

【不良反应】①骨髓抑制:为剂量限制性毒性,主要是白细胞、血小板减少,严重时全血细胞减少。注射本品第7~10天后白细胞下降到最低值,停药1~2周多可恢复。②胃肠道反应:恶心、呕吐常出现在注射后3~6小时,可持续24小时。③其他反应:脱发、乏力、头晕。④局部反应:药物刺激静脉可发生栓塞性静脉炎。若药物漏出血管外,可导致局部组织坏死。⑤生殖功能影响:睾丸萎缩、精子减少,精子活动能力降低、不育,妇女可致月经紊乱、闭经。⑥致畸、致癌作用:早孕妇女应用可致畸,长期应用可致第二原发肿瘤。⑦局部涂抹可产生迟发性皮肤过敏反应。

【注意事项】①全身用药目前只用于霍奇金淋巴瘤。②氮芥水溶液极易分散,故药物开封后应在10分钟内注入体内。③因可导致局部组织坏死,故严禁口服、皮下及肌内注射。腔内给药时必须确定注入腔内,谨防注入组织间。④药物一旦漏出血管外,应即刻停用药物,并立即用5%~10%硫代硫酸钠注射液或生理盐水局部皮下注射,冰袋局部冷敷6~12小时。及时、正确处理可减轻皮下组织损伤。⑤剂量限制性毒性为骨髓抑制,应密切监测血象变化,每周查血象1~2次。

【规格】注射剂:5mg(1ml),10mg(2ml)。

【贮存】密封、避光、阴凉处保存。

(张 频 马文玥)

环磷酰胺 (Cyclophosphamide)

【别名】环磷氮芥、癌得星、安道生、Endoxan、Cytosan、Procytox、Neosar、Sendoxan,简称CTX、CYT、CAP。化学名为N,N-双-(2-氯乙基)N'-丙撑基-磷酸酯二胺。

【药理作用】环磷酰胺体外无抗癌活性,进入体内后在肝经微粒体酶 P_{450} 水解,转变为具有烷化活性的磷酰胺氮芥而发挥细胞毒作用,是第一个所谓“潜伏化”广谱抗肿瘤药物。其作用机制与氮芥相同,主要作用于DNA,属氮芥类烷化剂以及细胞周期非特异性药物。环磷酰胺可由脱氢酶转变为羧磷酰胺而失活,或以丙烯醛的形式排出,导致泌尿道毒性。

环磷酰胺可口服或静脉注射。口服后易被吸收,生物利用度为74%~97%。约1小时后达血浆峰浓度,血浆半衰期为4~6.5小时,48小时内可由肾排出50%~70%,大部分为代谢物,仅10%为原形。环磷酰胺大部分不能透过血脑屏障,脑脊液中的浓度仅为血浆的20%。

【适应证】①恶性淋巴瘤:单药有效率为60%,对蕈样肉芽肿有一定疗效。②急性、慢性淋巴细胞白血病。③乳腺癌:单药有效率为35%~40%。可与其他药物联合作为术后辅助治疗或晚期乳腺癌化疗。④多发骨髓瘤:单药有效率为29%,VBMCP方案有效率为72%。⑤肺癌:小细胞肺癌单