

○エストロサイトカプセル [内]

【重要度】 【一般製剤名】 エストラムスチンリン酸エステルナトリウム水和物 (U) estramustine phosphate sodium hydrate 【分類】 前立腺癌治療アルキル化剤

【単位】 ○156.7mg/Cap [140mg]

【常用量】 4cap/日

【用法】 分2

【透析患者への投与方法】 透析患者への投与方法に言及した文献はないが、肝代謝によって消失する薬物であるため減量の必要はないと思われる (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 腎不全患者への投与方法に言及した文献はないが、肝代謝によって消失する薬物であるため減量の必要はないと思われる (5)

【特徴】 エストラジオールとナイトロジェンマスタードが結合されプロドラッグ化されたものであり活性体が前立腺に選択的に集積される。

【主な副作用・毒性】 血栓症, 心不全, 心筋梗塞, 狭心症悪化, 血球減少, 白血球増多, 肝障害, 代謝異常, 高血圧, 心悸亢進, 消化器症状, 女性化乳房, 過敏症, 息切れ, 胸膜浸出液の出現, 頭痛, 発熱, 疲労, 全身倦怠感, 性欲減退など

【安全性に関する情報】 二次発がんの可能性 (1)

【モニターすべき項目】 血清 acid phosphatase, ALP, CBC, 血圧, 肝機能, 血清 Ca・P 濃度

【吸収】 75%が吸収 (U) ミルクや乳製品, その他の高 Ca 食品により吸収が低下する (U)

【F】 44%, 吸収率が低いのではなく初回通過効果を受けて代謝されるため (Eur J Clin Pharmacol 26: 113-9,1984)

【tmax】 2.2hr (1)

【代謝】 経口投与により腸管壁及び血漿中で脱リン酸化され, 肝通過時に 17 位が部分酸化をうけてエストロムスチンとなり, さらにカルバメート結合が加水分解されエストロンが生じるとともに, 酸化を受けなかったエストラムスチンからはエストラジオールが生じる (1) 肝で抱合され代謝される (U) 代謝が主要な消失経路 (Eur J Clin Pharmacol 26: 113-9,1984)

【排泄】 胆汁・糞中排泄が主で, 腎排泄は少ない (1,U) 代謝物の排泄は未変化体より遅い (U) 【CL】 資料なし (1)

【t1/2】 α 相 0.16hr, β 相 1.27hr, γ 相 10~20hr (Eur J Clin Pharmacol 26: 113-9, 1984) 消失相 20hr (U) 13.6hr (1)

【蛋白結合率】 資料なし (1)

【Vd】 小さい. Vc 43mL/kg, Vt 108mL/kg (Eur J Clin Pharmacol 26: 113-9,1984) 資料なし (1)

【MW】 582.36

【透析性】 資料なし (1)

【TDMのポイント】 一般的に TDM は実施されていない 【O/W 係数】 2500 (11) 資料なし (1) 【pKa】 4.47, 8.13 (1)

【相互作用】 ACE 阻害薬との併用で血管浮腫発現リスクが高まる (1) 牛乳, 乳製品, Ca を多量に含有する食物, Ca 製剤と同時に服用することにより吸収が抑制 [不溶性の複合体形成] (1)

【更新日】 20151006

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、直接または間接的に生じた一切の問題について、当院ではいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。