

○ゾメタ点滴静注用 [注]

【重要度】★★ 【一般製剤名】ゾレドロン酸水和物 (U) Zoledronic Acid Hydrate 【分類】ビスホスホネート製剤

【単位】○4mg/5mL

【常用量】■悪性腫瘍による高Ca血症：4mgを生食又は5%ブドウ糖100mLに希釈し、15分以上かけて点滴静脈内投与。再投与時には少なくとも1週間の投与間隔をおく■多発性骨髄腫による骨病変及び固形癌骨転移による骨病変：4mgを生食又は5%ブドウ糖注射液100mLに希釈し、15分以上かけて3~4週間間隔で点滴静脈内投与 (1) 投与前には腎機能を評価する (U)

【用法】15分以上かけて点滴静注 [5分間でdivした場合に急性腎不全の発生が報告されている] (1)

【透析患者への投与方法】設定されていないが、高Ca血症に用いる場合には4mg (5)

【保存期CKD患者への投与方法】高Ca血症の治療に用いる場合は緊急性が高く、投与も短期間になるため減量の指示はされていない (1)

腎機能障害患者では、血漿中濃度が増加するので、高Ca血症の治療に用いる場合を除き腎機能の低下に応じて減量する。Ccr>60mL/min : 4mg, Ccr 50~60mL/min : 3.5mg, Ccr 40~49mL/min : 3.3mg, Ccr 30~39mL/min : 3.0mg, Ccr 30mL/min 未満 : 避ける (1, FDA)

【その他の報告】重篤な腎障害のある患者では慎重投与 (1) 腎機能の増悪のおそれあり。多発性骨髄腫及び固形癌骨転移患者でScr 3.0mg/dL以上、悪性腫瘍による高Ca血症患者でScrが4.5mg/dL以上の患者での使用経験少ない (1)

血清Cre値4.5mg/dL以上では副作用発現リスクを十分に考慮して使用する (U)

腎機能に応じて減量すれば腎障害の発現率は腎機能正常者と同等 (Shah SR, et al: Support Care Cancer 20: 87-93, 2012)

【特徴】破骨細胞に取り込まれ、細胞内メバロン酸経路におけるファルネシルピリン酸合成酵素活性を阻害し、破骨細胞のアポトーシスを誘導する。

【主な副作用・毒性】急性腎障害、うっ血性心不全 (輸液過剰による)、間質性腎炎、間質性肺炎、肝障害、血清電解質異常 (低Ca血症、低リン血症が多い)、発熱、嘔気、倦怠感、頭痛、骨痛、関節痛、血管炎、インフルエンザ様症状、顎骨壊死、歯周病、ファンゴニー症候群など。

【安全性に関する情報】ファンゴニー症候群発現症例 (Yoshinami T, et al: Intern Med 50:1075-9, 2011) 悪性腫瘍患者におけるビスホスホネート関連AKIの原因薬剤の87.5%はゾレドロン酸によるものである (Edwards BJ, et al: J Oncol Prac 9: 101-6, 2013) 多発性骨髄腫患者でイバンドロネートと比較して腎障害発現の危険性の相対危険度が3.6倍 (Weide R, et al: J Cancer Res Ther 6: 31-5, 2010 PMID: 20479544)

静注Bis投与時には頻度は少ないもののAKIのリスクを考慮して腎機能を観察しなければならない (Hirschberg R: Curr Opin Support Palliat Care 2012 PMID: 22710581)

【モニターすべき項目】血清Ca (テタニー)、Mg、IP、K、CBC、腎機能、顎骨壊死のサイン

【代謝】代謝されない (1) CYPを阻害しない (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率16%~32.6% [24時間まで] (1) 長期間体内に残存するため腎排泄率が低いわけではなく (5)、代謝されずに尿中排泄される (1) 腎排泄率44% (U)

【CL】7.4L/hr (1) 【腎CL】3L/hr (1) 3.7±2.0L/hr (U)

【t1/2】terminal phase : 146hr (U)

【蛋白結合率】55.1~63.1% (1) 約22%であるが、56%のデータあり (U)

【Vd】2.7L/kg [ラット] (1)

【MW】290.10

【透析性】組織移行したものは除去されない (5) データなし (1)

【薬物動態】軽度および中等度腎障害患者ではAUCがそれぞれ15%、43%上昇し、それによって腎障害が増悪する可能性がある (U) 【O/W係数】0.01未満 [1-オクタノール/リン酸buffer, pH7.4] (1)

【相互作用】肝薬物代謝酵素を阻害しない (1)

【備考】Caを含有する輸液剤と混和しない。単独で投与する。調製後冷所保存した場合には、室温に戻してから投与する。

【更新日】20220324

※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・配付を禁じます。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。