

▼ゼローダ錠 [内]

【重要度】★★★【透析患者に投与禁忌】 【一般製剤名】カペシタビン (U) capecitabine 【分類】抗悪性腫瘍剤 [代謝拮抗薬]

【単位】▼300mg/錠

【常用量】体表面積にあわせて投与 [添付文書参照]

【用法】1日2回でA法, B法, C法により投与 [添付文書参照]

【透析患者への投与方法】重篤な腎障害患者 [Ccr 30mL/min 未満] には投与禁忌 (U)

【その他の報告】MMKに対して1800~2400mg/日の投与は効果的で安全に使用できた [症例報告] (今 裕史, 他: 透析会誌 43: S355, 2010)

HD患者でのデータがない (Janus N, et al: Ann Oncol 21:1395-403, 2010)

【保存期CKD患者への投与方法】重篤な腎障害患者 [Ccr 30mL/min 未満] には投与禁忌 (1,U)

【その他の報告】Ccr 30mL/min 未満で5'-DFURのAUCが1.7倍に上昇 (1)

HDを含む腎不全 [平均GFR 20.9mL/min] 患者に250~1000mg/m²×2回/日から開始し, 副作用発現時には50%に減量するなどして安全に治療ができた (Jhaveri KD, et al: J Oncol Pharm Pract 18: 140-7, 2012)

腎機能低下はPKに大きな影響を与えないが, 加水分解産物のAUCが増大するため, 中等度腎障害患者では75%に減量して適用 (Poole C, et al: Cancer Chemother Pharmacol 49: 225-34, 2002)

Ccr 30mL/min 未満の患者でのデータがない (Janus N, et al: Ann Oncol 21:1395-403, 2010)

【特徴】経口5-FUのプロドラッグ。腫瘍組織内において5-FU濃度を選択的に高めることを目的としたフッ化ピリミジン系抗悪性腫瘍薬。手術不能又は再発乳癌, 結腸癌における術後補助化学療法, 治癒切除不能な進行・再発の結腸・直腸癌, そして胃癌に適用される。

【主な副作用・毒性】脱水症状, 手足症候群 (Hand-foot syndrome), 心障害, 肝障害, 黄疸, 骨髄抑制, 口内炎, 間質性肺炎など

【安全性に関する情報】指紋消失のリスク (van Doorn L, et al: JAMA Oncol 2016 PMID: 27560202)

【吸収】すみやかに吸収される (U) 96%以上が吸収 (1)

【tmax】1.1~1.3hr (1) カペシタビン1.5hr, 5-FU2hr (U)

【代謝】カルボキシルエステラーゼによって加水分解され5'-DFCR, 5'-DFURになり, 加水分解されて活性体の5-FUとなる (U) 消化管より未変化体のまま吸収され, 肝臓でカルボキシルエステラーゼにより5'-DFCRに代謝され, 次いで主として肝臓や腫瘍組織に存在するチジンデアミナーゼにより5'-DFURに変換される。さらに腫瘍組織に高レベルで存在するチジンホスホリラーゼ (TP) により活性体である5-FUに変換され抗腫瘍効果を発揮する (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率3% [24hrまで] (1) 大部分が代謝物 (FBAL) として尿中に排泄される (U) FBALの尿中回収率約50% [24hrまで] (1)

【CL/F】カペシタビンとして308±103L/hr (1)

【t1/2】0.4~0.8hr (1) カペシタビン, 5-FUとも約45分 (U)

【蛋白結合率】53~55% (1) 60%以下で35%はアルブミンと結合 (U)

【Vd】資料なし (1)

【MW】359.35

【透析性】ある程度透析されると思われる (U,5) 資料なし (1)

【O/W係数】4.5 [1-オクタノール/buffer, pH7.4] (1)

【薬物動態】腎障害時には5'-DFURと最終代謝物のFBALのAUCが増大する (Pool C, et al: Cancer Chemother Pharmacol 49: 225-34, 2002)

【相互作用】CYP2C9の酵素蛋白合成系に影響して酵素活性が低下する可能性がある (1) ワルファリン併用時はPTのチェックを定期的に行う [出血リスク上昇の可能性] (1) トリフルリジン・チピラシル塩酸塩配合剤と併用注意 (1)

【更新日】20191217

※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。