

◎カソデックスOD錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 ビカルタミド (U) bicalutamide 【分類】 前立腺癌治療薬 [非ステロイド性抗アンドロゲン剤]

【単位】 ◎80mg/OD錠

【常用量】 80mg/日

【用法】 1日1回

【透析患者への投与方法】 腎障害があっても薬物動態に変化がないため減量の必要なし (Tyrrell CJ, et al: Eur Urol 33: 39-53,1998)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 腎障害があっても薬物動態に変化がないため減量の必要なし (Tyrrell CJ, et al: Eur Urol 33: 39-53,1998) 【その他の報告】 PKはCcrと関連しない (1)

【特徴】 半減期が長い1日1回投与の非ステロイド性抗アンドロゲン剤。ジドロテストステロンとアンドロゲン受容体との結合を競合的に阻害することにより抗アンドロゲン作用を発揮し、アンドロゲン依存性の臓器(前立腺・精囊)及び前立腺腫瘍の細胞増殖を抑制する。R体のみが活性を持つ (Denis L, et al: Urology 47(1A Suppl): 26-8; discussion 29-32,1996)

【主な副作用・毒性】 肝機能障害, 黄疸, 劇症肝炎, 白血球・血小板減少, 間質性肺炎 [投与1週~4か月に発症している], 心不全, 心筋梗塞, 乳房腫脹, 乳房疼痛, 血管浮腫, 勃起力低下, 性欲減退, 倦怠感, 発疹, 心電図異常, 口渇, 便秘, 胸痛, 貧血, 光線過敏症など

【吸収】 食物の影響を受けない (Cockshott ID, et al: Biopharm Drug Dispos 18: 499-507,1997)

【F】 良好に吸収される (U)

【tmax】 15.8hr (1) R体として31.3hr (U) 用量依存的に延長する。10~30mg単回投与時で8hr, 50mg単回投与時で最高48hr (Cockshott ID, et al: Eur Urol 18 Suppl 3: 10-17,1990) R体: 23.4hr, S体: 20.7hrで1回50mg単回投与時のCmaxはR体: 73ng/mL, S体: 84ng/mL, 1日1回50mg投与時の定常状態のCmaxはR/Sで8.9μg/mL (13) 【定常状態濃度】 10mg/日を12週間投与後の定常状態濃度は1.8μg/mL, 30mg/日を12週間投与後の定常状態濃度は6.89μg/mL, 50mg/日を12週間投与後の定常状態濃度は9.33μg/mL (Cockshott ID, et al: Eur Urol 18 Suppl 3: 10-17, 1990)

【代謝】 肝臓で主に水酸化体とグルクロン酸抱合体に代謝される (McKillop D, et al: Xenobiotica 23: 1241-53, 1993) CYP3A4を阻害する (1) 肝で光学異性体別に代謝 (U) 活性体のR体は酸化的に代謝不活性化され, その後グルクロン酸抱合を受け, 不活性のS体はグルクロン酸抱合される (U) S体の代謝はR体より速い (U) 水酸化体の活性は低い (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率1.7% (13) 尿中回収率36%, 糞中排泄率43% [9日まで] (1) 尿中には主に水酸化体とグルクロン酸抱合体として排泄され, 未変化体としてはほとんど尿中に排泄されない (McKillop D, et al: Xenobiotica 23: 1241-53, 1993) 主にグルクロン酸抱合体として尿中に34%, 糞便中に43% (U) 【CL】 R体: 0.043mL/min/kg, S体: 7.3mL/min/kg (13)

【t1/2】 5.44日 (1) R体として5.8~7日 (U) 重度肝障害患者で延長 (U) S体は急速に消失するが活性を持つR体のt1/2は約1週間 (Denis L, et al: Urology 47(1A Suppl):26-8; discussion 29-32, 1996) S体18hr, R体4.2日 (McKillop D, et al: Xenobiotica 23: 1241-53, 1993) R体: 139hr, S体: 29hrで肝障害で延長 (13) 約6日 (Cockshott ID, et al: Eur Urol 18 Suppl 3: 10-17, 1990) R体5.8日, S体1.2日 (Cockshott ID, et al: Biopharm Drug Dispos 18: 499-507, 1997)

【蛋白結合率】 96% (1,U,13)

【Vd】 0.8~1.2L/kg [イヌ] (1)

【MW】 430.37

【透析性】 低いと思われる (5) 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。50mg/日投与時のR体としてのCssは9μg/mL (U) 【O/W係数】 LogP=2.35 [1-オクタノール/水系] (1)

【pKa】 1.13, 11.89 (1)

【相互作用】 CYP3A4を阻害する。CYP2C9, 2C19, 2D6に対しても阻害作用を示すとの報告があるが相互作用を示す可能性は低い (1)

【肝障害患者への投与方法】 血中濃度が上昇する可能性 (1) R-ビカルタミドの消失半減期が長くなる傾向 (1)

【備考】 若干の苦みのあるオレンジ味で, 噛み砕いてもよい (1) 1包化可能 (1)

【更新日】 20170123

※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。