

▼ハラヴェン静注 [注]

【重要度】★ 【一般製剤名】エリブリン メシル酸塩 eribulin mesilate 【分類】抗悪性腫瘍剤 [チューブリン重合阻害]

【単位】▼1mg/V [2mL]

【常用量】1.4mg/m² (体表面積) [週1回, 1, 2週に投与して3週目休薬を1クール]

【用法】2~5分間かけて静注 [希釈時は生食] [0.02mg/mL未満の濃度に希釈しない]

【透析患者への投与方法】設定されていない (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】AUCが増加する傾向があるため慎重投与 [t_{1/2}は変化しないがAUCが増大] (1)

【特徴】手術不能又は再発乳癌に適用。チューブリンの重合を阻害して微小管の伸長を抑制することで正常な紡錘体形成を妨げ、G2/M 期で細胞分裂を停止させてアポトーシスによる細胞死を誘導し、腫瘍増殖抑制作用を示す。Halichondrin B 誘導体でアンストラサイクリン系およびタキサン系抗悪性腫瘍薬を含む化学療法施行後の増悪もしくは再発例に適用。

【主な副作用・毒性】SJS, 骨髄抑制, 感染症, 末梢神経障害, SJS, 肝障害, 間質性肺炎, 悪心, 嘔吐, 口唇炎, 発熱, 倦怠感, 浮腫, 味覚異常, 頭痛, めまい, 食欲不振, 筋肉痛, 血清電解質異常, 咳, 脱毛など多数 解毒剤なし。

【安全性に関する情報】QTc 延長に関与しない (Lesimple T, et al: Invest New Drugs 31: 900-9, 2013 PMID: 23143778) 好中球減少に関連する因子の解析 (van Hasselt JG, et al: Br J Clin Pharmacol 76: 412-24, 2013 PMID: 23601153)

【代謝】ほとんど代謝されないが, 代謝には CYP3A4 が関与 (1) 代謝されない (Dubbelman AC, et al: Drug Metab Dispos 40: 313-21, 2012 PMID: 22041109)

【排泄】尿中未変化体排泄率 8.9% [168hr まで] (1) 8.1% (Dubbelman AC, et al: Drug Metab Dispos 40: 313-21, 2012 PMID: 22041109) 糞便中未変化体排泄率 77.6% [168hr まで] (1) 非腎経路で消失 (Tan AR, et al: Clin Cancer Res 15: 4213-9, 2009 PMID: 19509146) 尿中回収率 5~13% (Mukohara T, et al: Invest New Drugs 30: 1926-33, 2012 PMID: 21887501)

【CL】1.3~2.3L/hr/m² (1) 肝障害患者でクリアランスが低下 (1) 1.89±0.33L/hr/m² (1) 1.32~2.37L/hr/m² (Mukohara T, et al: Invest New Drugs 30: 1926-33, 2012 PMID: 21887501) 全身 CL 3.93L/hr, 腎 CL 0.3L/hr (Dubbelman AC, et al: Drug Metab Dispos 40: 313-21, 2012 PMID: 22041109)

【t_{1/2}】約 40hr (1) 消失相で 2 日 (Tan AR, et al: Clin Cancer Res 15: 4213-9, 2009 PMID: 19509146) 36.4~59.9hr (Mukohara T, et al: Invest New Drugs 30: 1926-33, 2012 PMID: 21887501)

【蛋白結合率】49~65% (1)

【Vd】76.3±19.2L/m² (1) 70L/m² (1) P-gp の基質であり脳内移行は低い (1) 105~140L/m² (Mukohara T, et al: Invest New Drugs 30: 1926-33, 2012 PMID: 21887501)

【MW】826.00

【透析性】資料なし (1) ある程度は透析されると思われる (5)

【薬物動態】線形動態 (Tan AR, et al: Clin Cancer Res 15: 4213-9, 2009 PMID: 19509146)

【O/W 係数】2.25 [1 - オクタノール/buffer] (1)

【相互作用】抗がん剤, 放射線療法: 骨髄抑制の増強 (1) ケトコナゾール併用の影響を受けない (Devriese LA, et al: Invest New Drugs 31: 381-9, 2013 PMID: 22555773) リファンピシン併用の影響を受けない (Devriese LA, et al: Br J Clin Pharmacol 75: 507-15, 2013 PMID: 22803519)

【肝障害患者における情報】AUCが増大するので減量を推奨 (Devriese LA, et al: Cancer Chemother Pharmacol 70: 823-32, 2012 PMID: 23010853)

【更新日】20180529

※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。