

◎ゴナックス皮下注用 [注]

【重要度】 【一般製剤名】 デガレリクス酢酸塩 degarelix acetate 【分類】 前立腺癌治療薬 [徐放性 GnRH 受容体拮抗薬]

【単位】 ◎80mg・◎120mg/V [溶解液付]

【常用量】 初回240mg, 以後4週間隔で80mg

【用法】 120mg は注射用水3mLで溶解し, 3mLを腹部2か所に皮下注. 80mg は注射用水4.2mLで溶解し, 4mLを腹部1か所に皮下注.

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (5)

【特徴】 GnRH アンタゴニストで, 下垂体 GnRH 受容体と可逆的に結合することにより, 下垂体からの黄体形成ホルモン (LH) の放出を抑制して, 精巣からのテストステロン分泌を抑制し, 前立腺癌の増殖を抑制する. アゴニスト製剤では, 投与初期にテストステロンの一過性の上昇 (テストステロンサージ) に伴うフレアアップ症状を引き起こすことがあり, 骨痛の悪化, 尿管閉塞や脊髄圧迫等の症状の増悪を呈することがあるため, 投与初期に抗アンドロゲン剤の併用が行われることが多かったが, 本剤はアンタゴニスト製剤でありテストステロンサージを起こさず, 速やかにテストステロンを低下させるのが特徴である.

【主な副作用・毒性】 ショック, アナフィラキシー, 間質性肺炎, 肝機能障害, 糖尿病増悪, 心不全, 血栓塞栓症, 注射部位異常, 血球減少, 関節痛, 女性化乳房など

【F】 35~58% [sc, 高濃度で低下] (1)

【tmax】 1日 (1)

【代謝】 プロテアーゼによる加水分解によってペプチド鎖に分解 (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率20~30% (1) 取り込み・排出トランスポータの基質にならない (Sonesson A, et al: Drug Metab Dispos 41: 1339-46, 2013) 【CL】 3.2L/hr [iv] (1) 1歳に加齢とともに0.6%程度低下し, 体重が1kg増加すると0.7%増加すると推定 (1)

【t1/2】 17hr [iv] (1)

【蛋白結合率】 85.3~92.4% [Alb, AAG] (1)

【Vd】 0.24~0.61L/kg (1)

【MW】 1632.3 [free base]

【透析性】 資料なし (1) 透析性は高くないと思われる (5)

【相互作用】 CYP やトランスポータ関連の相互作用の影響は受けにくいと思われる (Sonesson A, et al: Drug Metab Dispos 41: 1339-46, 2013)

【備考】 静注不可

【更新日】 20170128

※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.