

▼カルセド注射用 [注]

【重要度】★ 【一般製剤名】アムルピシン塩酸塩 amrubicin hydrochloride 【分類】抗悪性腫瘍剤 [アンスラサイクリン系]

【単位】▼20mg・▼50mg/V

【常用量】1回 45mg/m²を1日1回3日間連日静脈内に投与し3~4週間休薬、を1クールとし投与を繰り返す

【用法】静注 [約20mLの生食あるいは5%ブドウ糖注射液に溶解]

【透析患者への投与方法】PKに変化なく減量の必要なし (Ohsawa M, et al: Gan To Kagaku Ryoho 36: 1311-4, 2009)

【その他の報告】設定されていない (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】副作用が強くあらわれるおそれがあるので慎重投与 (1)

【特徴】活性代謝物アムルピシノールとなり、DNA インターカレーション活性、トポイソメラーゼ II 阻害作用、トポイソメラーゼ II による cleavable complex の安定化を介した DNA 切断作用、ラジカル産生作用を示す。

【主な副作用・毒性】骨髄抑制、間質性肺炎、胃・十二指腸潰瘍、心筋障害、不整脈、肝機能障害、腎機能障害、食欲不振、口内炎、悪心、脱毛、めまい、発熱、倦怠感、皮膚障害など多数

【安全性に関する情報】DLT は好中球減少 (Okamoto I, et al: Cancer Chemother Pharmacol. 2006 Feb;57(3):282-8, 2006) 3回投与から 24hr 後のアムルピシノール濃度は血球減少症に関連 (Kimura T, et al: Anticancer Drugs 20: 513-8, 2009) アムルピシノールの血中濃度と骨髄抑制は関連 (Makino Y, et al: Cancer Chemother Pharmacol 69: 861-9, 2012) トキシソルピシンやエビルピシンよりも心筋への移行性が低く、心毒性が軽減 (Salvatorelli E, et al: J Pharmacol Exp Ther 341: 464-73, 2012) 臨床的に有意な QT 延長を引き起こさない (Chen N, et al: Cancer Chemother Pharmacol 71: 1083-94, 2013)

【代謝】肝で活性体アムルピシノールに変換され、アムルピシノールはグルクロン酸抱合等でさらに代謝される (1) NADPH-P450 還元酵素、NAD(P)H-キノン還元酵素、ケトン還元酵素が主に関与し、CYP の関与は少ない (1) アムルピシノールの腫瘍細胞増殖抑制作用は未変化体の 5~200 倍強い (1) 活性体はアムルピシノール (Yamaoka T, et al: Jpn J Cancer Res 89: 1067-73, 1998) 腫瘍細胞で活性体に変換されるので忍容性が高い (Noguchi T, et al: Jpn J Cancer Res 89: 1055-60, 1998, Noguchi T, et al: Jpn J Cancer Res 89: 1061-6, 1998) アムルピシノールの AUC は未変化体の 15% (Matsunaga Y, et al: Ther Drug Monit 28: 76-82, 2006)

【排泄】尿中未変化体と活性体の排泄率 2.7~19.6% [5 日連日投与後 24hr] で、未変化体として 0.22~1.71%，アムルピシノールとして 2.1~17.8% (1)

【CL】未変化体 15.4L/hr [iv] (Matsunaga Y, et al: Ther Drug Monit 28: 76-82, 2006)

【t_{1/2}】未変化体として 1.7hr, アムルピシノールとして 12hr (1)

【蛋白結合率】95~97% [主に Alb] (1)

【Vd】資料なし (1) 大きいと思われる (5)

【MW】519.93 [塩酸塩]

【透析性】資料なし (1) 除去されないと思われる (5)

【O/W 係数】240 [1-オクタノール水系, pH7.0] (1)

【薬物動態】アムルピシンとアムルピシノールの血中濃度評価は治療個別化に有用である可能性 (Matsunaga Y, et al: Ther Drug Monit 28: 76-82, 2006)

【備考】未変化体及び活性代謝物の尿中排泄により尿が赤色になることがある。

【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。