

## △ザイティガ錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 アビラテロン酢酸エステル Abiraterone Acetate 【分類】 抗悪性腫瘍剤 [前立腺癌治療薬]

【単位】 △250mg/錠

【常用量】 1000mg/日 ■休薬/減量基準により 500～750mg/日に設定

【用法】 1日1回空腹時■プレドニゾンと併用する

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (1) 鉍質コルチコイド濃度の上昇による血圧上昇, 低K血症, 体液貯留に注意する (1)

【その他の報告】 単回投与の AUC は腎機能正常者と同等 (Marbury T, et al: J Clin Pharmacol 54: 732-41, 2014)

【特徴】 去勢抵抗性前立腺癌に適用される 17 $\alpha$ -hydroxylase/C17, 20-lyase (CYP17) 阻害剤でアンドロゲンの合成を阻害する。化学療法の施行歴にかかわらず適用可能。ステロイド (プレドニゾン) と併用する。酢酸エステル化されたプロドラッグ。

【主な副作用・毒性】 心不全, 肝機能障害, 劇症肝炎, 低K血症, 高脂血症, ほてり, 尿路感染, 味覚異常, 高血圧, 徐脈, 心室性頻脈, 末梢性浮腫, 消化器症状など。

【安全性に関する情報】 過量投与により鉍質コルチコイドの増加に起因する低K血症 [無力症, 悪心, 嘔吐などの症状] が発現することがある (1)

【モニターすべき項目】 血清 K 値, スピロラクトンがアンドロゲン受容体と結合して PSA を上昇させる可能性 (1)

【吸収】 食事の影響により Cmax 及び AUC が上昇するため食事の1時間前から食後2時間までの間の服用は避ける (1)

【F】 空腹時 10%以下 (1)

【tmax】 2hr (1) 2～3hr (Matsubara N, et al: Cancer Sci 105: 1313-20, 2014 PMID: 25117615)

【代謝】 加水分解されアビラテロンとなり, さらに酸化, 抱合により代謝される (1) CYP3A4 の基質 (1) 主代謝物は硫酸抱合体, N-オキシド体の硫酸抱合体 (1) グルクロン酸抱合には UGT1A4, 硫酸抱合には SULT2A1 が関与 (1) アビラテロン硫酸抱合体の活性は, 未変化体の 69% (1)

【排泄】 糞便中に 87.9%, 尿中に 5.3%回収 [264hr まで] (1)

【t1/2】 15hr (1) 12hr (Mostaghel EA, et al: Cancer Manag Res 6: 39-51, 2014)

【蛋白結合率】 99.8% (1)

【Vd】 Vc 4150L/man, Vt 9920L/man (1) Vc=5620L/man, Vt=17400L/man (Stuyckens K, et al: Clin Pharmacokinet 53: 1149-60, 2014)

【MW】 391.55

【透析性】 資料なし (1) 除去されないと思われる (5)

【OW 係数】 LogP=5.12 [1-オクタノール/水系] (1) 【TDM のポイント】 TDM の対象ではない。特異的な解毒剤はない (1) 【薬物動態】 ほぼ線形 (Acharya M, et al: Cancer Chemother Pharmacol 69: 1583-90, 2012)

【相互作用】 CYP3A4 の基質であり, P-gp を阻害 [エステル] し, CYP2C8・2D6, OATP1B1 を阻害 (1) デキストロメトर्फアンの AUC を 3 倍に上昇させる [プレドニゾン併用時] (1, Chi KN, et al: Cancer Chemother Pharmacol 71: 237-44, 2013) CYP2C8 基質薬物 (ピオグリタゾン, レパグリニドなど) の代謝を阻害するため併用注意 (1)

【主な臨床報告】 早期からの使用によるメリット (Nagai T, et al: Prostate Int 6: 18-23, 2018 PMID: 29556485)

【更新日】 20220329

※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。