

## ▼カイプロリス点滴静注用 [注]

【重要度】 【一般製剤名】 カルフィルゾミブ Carfilzomib 【分類】 抗悪性腫瘍剤 [プロテアソーム阻害剤]

【単位】 ▼10mg・▼40mg/V

【常用量】 ■1 サイクルの1～2日目：20mg/m<sup>2</sup>、それ以降27mg/m<sup>2</sup> [適宜減量]

■レナリドミド及びビデキサメタゾンとの併用で【1, 2, 8, 9, 15, 16日目】に点滴静注し、12日間休薬する28日間を1サイクルとし、12サイクルまで投与を繰り返す。13サイクル以降は【1, 2, 15, 16日目】に点滴静注し、12日間休薬

■投与量算出の最大BSAは2.2m<sup>2</sup>とする

【用法】1日1回、10分かけて点滴静注■10mg/5mL、40mg/20mLの割合で注射用水で溶解し、必要量を5%ブドウ糖液で希釈

【透析患者への投与方法】PKに影響なく、通常用量が適用できる (Badros AZ, et al: Leukemia 27: 1707-14, 2013 PMID: 23364621)

MMに対して常用量設定可 (Quach H, et al: Cancer Chemother Pharmacol 2017 PMID: 28424963)

【保存期CKD患者への投与方法】腎機能障害は未変化体のPKに影響しない (1)

PKに影響なく、通常用量が適用できる (Badros AZ, et al: Leukemia 27: 1707-14, 2013 PMID: 23364621)

【その他の報告】腎機能障害が進行してCcr 15mL/min未満で休薬し、Ccr 15mL/min以上に回復してから投与再開を検討 (1)

【特徴】不可逆的、選択的プロテアソーム阻害剤。プロテアソームのキモトリプシン活性を阻害し、がん細胞内のユビキチン化たんぱく質を蓄積させてアポトーシスを誘導する。ボルテゾミブ耐性細胞株にも効果を認めている。発売時、再発または難治性の多発性骨髄腫に適用。

【主な副作用・毒性】うっ血性心不全、QT延長、心筋梗塞、間質性肺炎、肺高血圧症、肝機能障害、急性腎不全、腎機能障害、血球減少、infusion reaction、高血圧、感染症、めまい、眼障害、消化器症状、皮膚症状、血清電解質異常など多数。

【安全性に関する情報】高頻度に報告された副作用は、血小板減少、貧血、疲労、悪心、下痢 (Thompson JL: Ann Pharmacother 47: 56-62, 2013 PMID: 23300152) 高血圧の増悪や新規発症、末梢神経障害の再発が報告 (Watanabe T, et al: Br J Haematol 172: 745-56, 2016 PMID: 26732066)

【代謝】主な代謝経路はエポキシド及びペプチド結合の加水分解でありCYPの関与は少ない (1) 主代謝物M14、M15、M16に活性はない (1) 代謝におけるCYPの関与は低く、全身CLは肝血流量より高く、組織中でペプチダーゼによる分解、エポキシド開裂により代謝 (Wang Z, et al: Drug Metab Dispos 41: 230-7, 2013 PMID: 23118326)

【排泄】尿中未変化体排泄率0.3%、M14として25.3%、M15として1.87%が尿中に回収 (1) P-gpの基質 (1)

【CL】105～132L/hr (1)

【t1/2】0.4～0.7hr (1) 0.5hr未満 (Alsina M, et al: Clin Cancer Res 18: 4830-40, 2012 PMID: 22761464) 0.29～0.48hr (Redic K: J Pharm Pharmacol 65: 1095-106, 2013 PMID: 23837578)

【蛋白結合率】96.9～97.3% (1)

【Vd】8.5～15.2L/man (1)

【MW】719.91

【透析性】資料なし (1) 透析性は低いと思われる (5)

【O/W係数】3.77 [1-オクタノール水系] (1)

【相互作用】P-gpの輸送活性を25%、BCRPの輸送活性を22.9%阻害 (1) CYP3A4を時間依存的に阻害するが、半減期が短いため影響はほとんどない (Wang Z, et al: Drug Metab Dispos 41: 230-7, 2013 PMID: 23118326)

【肝障害患者への投与方法】

【小児CKD患者における報告】小児への使用経験がない (1)

【妊婦・授乳婦への投薬】妊婦禁忌、授乳中止 (1)

【主な臨床報告】最小有効量11mg/m<sup>2</sup> (O' Connor OA, et al: Clin Cancer Res 15: 7085-91, 2009 PMID: 19903785)

【更新日】20220521

※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。