

## ▼エクザール注射用 [注]

【重要度】 【一般製剤名】 ビンブラスチン硫酸塩 (U) vinblastine sulfate 【分類】 抗悪性腫瘍剤 [ビンカルカロイド]

【単位】 ▼10mg/V

【常用量】 ■悪性リンパ腫、絨毛性疾患：週1回0.1mg/kg, 0.05mg/kg/週ずつ増量し, 0.3mg/kg/週. その他は添付文書参照

【用法】 静注■1mgあたり1mLの割合に注射用水又は生理食塩液を加えて溶解

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (3,6,10,12)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (3,10,12)

【特徴】 キョウチクトウ科ニチニチソウから抽出されたアルカロイド. 微小管のチューブリンに結合して (有糸分裂の中期に作用) 細胞分裂を阻害する. 骨髄抑制 (特に好中球減少) が用量規制因子となる.

【主な副作用・毒性】 胃腸障害、抑うつ、骨髄障害、脱毛、神経障害など

【モニターすべき項目】 CBC、WBC 分画、AST・ALT、血清ビリルビン濃度、LDH、尿酸値 (U)

【代謝】 肝代謝され活性化 (U) 肝代謝 (6) CYP3A4 が関与する. デスアセチルビンブラスチン (ビンデシン) には活性あり (1) 肝障害患者では用量を 50%に減らすなど考慮 (U) 脱アセチル体の活性は未変化体より高い (Owellsen RJ, et al: Cancer Res 37: 2597-602, 1977 PMID: 889590)

【排泄】 主な経路は胆汁・糞便中で、二次経路は腎 (U) 尿中未変化体排泄率 13.6% [iv, 72hr まで] (1) 35% (10) 20% (6,14) 代謝物は主に胆汁排泄で尿中排泄率は低い (6)

【CL】 0.740±0.317L/hr/kg (1) ビンデシン 0.252±0.100L/hr/kg (1) 137mL/hr/kg (Lu K, et al: Cancer Res 43: 1405-8, 1983 PMID: 6825110) 552±182mL/min/m<sup>2</sup> (Ratain MJ, et al: Clin Pharmacol Ther 41: 61-7, 1987 PMID: 3802707)

【t<sub>1/2</sub>】 3 相性に消失 (1,10) α相 3.7min (U) 0.1hr (6) β相 1.64hr (U) 1hr (6) 0.1~2hr (2) γ相 24.8hr <i.v> (U) 22~29hr (6) 20hr (11) 25hr (14) 29.2±11.2hr (Ratain MJ, et al: Clin Pharmacol Ther 41: 61-7, 1987 PMID: 3802707) ビンデシンはα相 0.037hr, β相 0.912hr, γ相 24.2hr (1) 1~1.5hr (12)

【Kel】 0.190/hr, ビンデシン 0.527/hr (1)

【蛋白結合率】 43~99.7% (1,11) 大部分が組織と可逆的に結合している (U) 30% (4) 80% (6) 75% (12)

【Vd】 27.3L/kg (1) ビンデシン 8.84L/kg (1) 8~27L/kg (11) 27L/kg (14) 13~40L/kg (12) 8.6L/kg (Lu K, et al: Cancer Res 43: 1405-8, 1983 PMID: 6825110)

【分布】 ほとんど血液-脳関門を通過しない (U,11)

【MW】 909.05 (遊離塩基として 811)

【透析性】 除去されない (Onkologie 13: 289-294,1990) 資料なし (1)

【TDM のポイント】 一般的に TDM は実施されていない

【薬物動態】 PK は肝機能 (Alb) と投与量 (飽和) の影響を受ける (Ratain MJ, et al: Clin Pharmacol Ther 41: 61-7, 1987 PMID: 3802707)

【O/W 係数】 高い (11) 【pKa】 7.4

【更新日】 20170123

※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。