

◎テラルビシン注射用, ▼ピノルビン注射用 [注]

【重要度】 【一般製剤名】ピラルビシン塩酸塩 pirarubicin hydrochloride 【分類】抗悪性腫瘍剤 [アンスラサイクリン系]

【単位】◎10mg・▼20mg/V

【常用量】添付文書参照■勝注：10mg あたり溶解液 10～20mL で溶解

【用法】静注，動注，膀胱内注

【透析患者への投与方法】尿中排泄率が低いため減量の必要はないと思われる (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし (5)

【特徴】ドキシソルビシン (アドリアシン) の誘導体 [4'-O-位にテトラヒドロピラン修飾]。アドリアシン耐性細胞にも有効で、アドリアシンよりも心毒性が低く、脱毛の発現頻度が少なく、消化器症状の発現程度が低い。アドリアマイシンよりも細胞内移行が速やか、テラルビシンは溶解補助剤としてニコチン酸アミドを添加している。DNA との複合体を形成して核酸合成を阻害し、細胞周期の G2 期と S 期の進行を停止させる。

【主な副作用・毒性】心筋障害、骨髄抑制、ショック、萎縮膀胱、肝障害、腎障害、胃腸障害、脱毛、色素沈着、発熱、動悸。膀胱内注入療法により排尿痛、血尿などの膀胱刺激症状が現れることがある。DLT は骨髄抑制で特に白血球減少症。心筋障害の発現には、ラジカルの関与が示唆されている (Bachur NR, et al: Mol Pharmacol 13:901-910, 1977)

【代謝】グルクロン酸抱合，硫酸抱合される (1) グルコシド型には活性があるが、アグリコンは不活性 (1) 主要代謝物は doxorubicin であり単回投与では pirarubicin よりも血漿濃度は低いが、連用により高くなる。他に doxorubicinol, pirarubicinol (Eur J Cancer Clin Oncol 24: 1289-94,1988) アルドーケト還元酵素，グリコシダーゼ，グルクロン酸転移酵素，硫酸転移酵素などで代謝され，アグリコン，グルクロン酸抱合体，硫酸抱合体などに代謝され，尿中，胆汁中に排泄される (久松 充，他：化学療法の領域 4:72-85,1988)

【排泄】尿中回収率 7%以下でそのうち 30～40%が未変化体 (1) 投与量の約 6%が尿中に排泄される (Eur J Cancer Clin Oncol 24: 1289-94,1988)

【CL】51mL/min/kg (1) 3.06±0.98L/hr/kg (1) 1500mL/min/m² (Eur J Cancer Clin Oncol 24: 1289-94,1988)

【t1/2】α相 22min, β相 12.7hr (Eur J Cancer Clin Oncol 24: 1289-94, 1988)

【蛋白結合率】10 μg/mL で 76.2%，100 μg/mL で 19.0%と高濃度で低下 (1)

【Vd】46.8L/kg (1) 組織移行性が大きく非腫瘍部位よりも腫瘍内でピラルビシン濃度が高い (1) 1380L/m² (Eur J Cancer Clin Oncol 24: 1289-94,1988)

【MW】627.64

【透析性】Vd が非常に大きいため効率的には除去できないと考えられる (5) 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

【O/W 係数】LogP=1.81 [1-オクタノール/水系, pH7] (1) 【pKa】7.5 (1)

【備考】勝注後はトイレに流す [蓄尿は避ける] (5)

【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・配付を禁じます。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。