

## ▼フトラフルカプセル [内], ▼フトラフル注 [注] (2023.3 販売中止)

【重要度】 【一般製剤名】テガフル tegafur 【分類】抗悪性腫瘍剤 (代謝拮抗剤)

【単位】▼200mg/Cap, ▼400mg/A [10mL]

【常用量】■内服：800～1200mg/日■注射：1日20mg/kg

【用法】■内服：分2～4■注射：点滴静注又は静注

【透析患者への投与方法】1日600mg 継続投与しても蓄積しないため減量の必要はないが、副作用は高率で発症する。透析性が高いため透析日は透析後に投与 (日化療会誌 37: 684,1989)

【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし (5)

【特徴】代謝拮抗性抗悪性腫瘍剤の5-FUのmasked compoundで、主に肝臓で活性化の5-FU等に代謝されるといわれるが、標的細胞内で活性化されるという説もある。骨髄抑制作用が弱いので併用投与しやすい。

【主な副作用・毒性】汎血球減少、骨髄機能抑制、劇症肝炎等重篤な副作用、脱水、腸炎、白質脳症、嗅覚脱失、味覚異常、間質性肺炎、安静狭心症、SLE 様皮疹など

【モニターすべき項目】CBC, 肝機能, 腸炎症状

【F】経口98%、動脈内投与61% (Schuller J, et al: Pharmazie 46: 587-588, 1991) 経口吸収は完全で著しい初回通過効果も受けない (Anttila MI, et al: Cancer Chemother Pharmacol 10: 150-153, 1983)

【tmax】Eカプセル：4hr, 坐：2hr (1) 3.2hr (Anttila MI, et al: Cancer Chemother Pharmacol 10: 150-153,1983)

【代謝】5-FUの異化生成物、同化生成物に加え、2 hydroxytetrahydrofuran-5-fluorouracil 誘導体が代謝される (Benvenuto JA, et al: Cancer Res 38(11 Pt 1): 3867-70,1978)

【排泄】尿中未変化体排泄率20% [24hr まで] (Benvenuto JA, et al: Cancer Res 38(11 Pt 1): 3867-70,1978)

【CL】69mL/hr/kg [iv] (1, Anttila MI, et al: Cancer Chemother Pharmacol 10: 150-3,1983)

【t1/2】7.6hr (1) 8.8hr (Benvenuto JA, et al: Cancer Res 38(11 Pt 1): 3867-70,1978) α相1.0hr、β相7.6hr (Anttila MI, et al: Cancer Chemother Pharmacol 10: 150-3,1983)

【蛋白結合率】2.7% (1)

【Vd】0.66L/kg (1, Anttila MI, et al: Cancer Chemother Pharmacol 10: 150-153,1983)

【分布】脳脊髄液中にはテガフル、5-FUともに高濃度で存在する。このことはテガフル大量投与時の中枢毒性を説明できる (Benvenuto JA, et al: Cancer Res 38(11 Pt 1): 3867-70,1978)

【MW】200.17

【透析性】5-FU：34.4%、テガフル45.6% (日化療会誌 37: 684, 1989) 除去率はテガフル約60%、5-FU約45% (1)

【TDMのポイント】有効治療濃度30ng/mL (16) 一般的にTDMは行われない【O/W係数】0.108 [クロロホルム/水系,pH8] (1) 5-FU：0.1 (1) 【pKa】7.65 (1)

【相互作用】TS-1と併用禁忌 [7日以上あける] (1) フェニトインの代謝を抑制し血中濃度上昇 (1) ワルファリンの作用増強の可能性 (1) トリフルリジン・チピラシル塩酸塩配合剤：骨髄毒性の増強 (1)

【備考】活性化酵素活性が小腸で高いため特に下痢の頻度が高い。ときに皮膚の色素沈着がある

【更新日】20220720

※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。