

△フルツロンカプセル [内]

【重要度】 【一般製剤名】ドキシフルリジン doxifluridine [5'-DFUR] 【分類】抗悪性腫瘍剤 [代謝拮抗薬]

【単位】▼100mg・△200mg/cap

【常用量】800～1200mg/日

【用法】分3～4

【透析患者への投与方法】400mg/日. 透析により除去されやすいので, 透析日は透析後の投与が望ましい (腎と透析 44:113-6, 1998)

【保存期 CKD 患者への投与方法】Ccr>50mL/min : 800mg/日, Ccr 10～50mL/min : 600mg/日, Ccr<10mL/min : 400mg/日 (5)

【特徴】腫瘍組織内で高い活性を有するピリミジンスクレオシドホスホリラーゼによって 5-FU に変換され抗腫瘍作用を示す. このため一般毒性が弱く骨髄・免疫の抑制が軽微であるが, 単独での有効性は低く他の抗癌剤との併用が必要である.

【主な副作用・毒性】骨髄抑制, 肝障害, 脱水, 重篤な腸炎, 白質脳症, 口内炎, 嗅覚脱失, 間質性肺炎, 安静狭心症など

【安全性に関する情報】代謝酵素であるジヒドロピリミジンデヒドロゲナーゼ (DPD) の遺伝的欠損者では副作用が起りやすい (1)

【吸収】速やかに吸収され lag time は 29min 以内 (Van Der Heyden SA, et al: Br J Clin Pharmacol 47: 351-6,1999)

【F】34～47% (Van Der Heyden SA, et al: Br J Clin Pharmacol 47: 351-6,1999)

【tmax】1hr (1) 5-FU も 1hr であるが Cmax は未変化体より 1/10 低い (1)

【代謝】用量増加に伴いにより 5'-DFUR の代謝が飽和し, 非腎クリアランスが 40%低下する (Eur J Clin Pharmacol 34: 439-43, 1988) 血漿 5'-DFUR は用量に伴い直線的に増加し, 腎クリアランスも非線形にはならない (Cancer Chemother Pharmacol 25: 274-8, 1990)

【排泄】5'-DFUR, 5-FU および代謝物として尿中に 45.3%が排泄 (薬理と治療 15: 3257-61,1987) 尿中未変化体排泄率 14.8% [po, 12hr まで] (1) 5-FU として尿中に 0.4%排泄 [po, 12hr まで] (1)

【CL】836.9mL/min (Cancer Chemother Pharmacol 25: 274-8,1990) 5'-DFUR の腎および非腎 CL の患者間の変動は大きい (Cancer Chemother Pharmacol 25: 274-8,1990) 投与量が 600mg/m², 800mg/m², 1000mg/m² と増加するごとに CL はそれぞれ 2.7, 2.0, 1.9mL/min/m² に低下する (Van Der Heyden SA, et al: Br J Clin Pharmacol 47: 351-6,1999) 5'-DFUR の腎 CL 108.9mL/min/m², 5-FU の腎 CL 100.8mL/min/m² (Cancer Chemother Pharmacol 25: 274-8, 1990)

【非腎 CL】728mL/min/m² (Cancer Chemother Pharmacol 25: 274-8, 1990) 【非腎 CL/総 CL】87.0% (Cancer Chemother Pharmacol 25: 274-8, 1990)

【t1/2】消失相 16.1～27.7hr (Eur J Clin Pharmacol 34: 439-43,1988) 静注時: 投与量とともに延長し 15～22min, 600～1000mg/m² 経口投与時: 32～45min (Van Der Heyden SA, et al: Br J Clin Pharmacol 47: 351-6,1999)

【蛋白結合率】14.6～40.8% [高濃度で低下] (1)

【Vd】19.8～20.4L/man (Eur J Clin Pharmacol 34: 439-43,1988)

【MW】246.19

【透析性】血中濃度の変化率は 5'-DFUR : 66%, 5-FU : 77% (腎と透析 44:113-6,1998) 資料なし (1)

【TDM のポイント】有効血中濃度は 5'-DFUR として 0.10 μg/mL 以上 (腎と透析 44:113-116,1998) 一般的に TDM は実施されていない 【O/W 係数】0.0042 [1-オクタノール/buffer, pH7.4]

【相互作用】TS-1 投与後 7 日間は投与禁忌 (1) トリフルリジン・チピラシル塩酸塩配合剤と併用注意 (1)

【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。