

▼スタラシドカプセル [内], ○キロサイド注 [注]

【重要度】★ 【一般製剤名】シタラビンオクホスファート、シタラビン (U) cytarabine ocfosfate, cytarabine (Ara-C) 【分類】抗悪性腫瘍剤

【単位】▼50・▼100mg/Cap, ○20mg/A [1mL]

【常用量】■内服：●成人急性非リンパ性白血病：100～300mg/日を2～3週間連続経口投与し、2～3週間休薬を1コースとして繰り返す

●MDS：100～200mg/日を2～3週間連続経口投与し、2～3週間休薬を1コースとして繰り返す

■注射：●AML：寛解導入に小児0.6～2.3mg/kg/日、成人0.8～1.6mg/kg/日を250～500mLの5%ブドウ糖液あるいは生食に混合して、点滴で静脈内投与するか又は20mLの20%ブドウ糖液あるいは生食に混合して、ワンシヨットで静注。通常2～3週間連続投与を行う。維持療法として上記用量を週1回そのまま皮下、筋注、静注●消化器癌、肺癌、乳癌、女性性器癌等：他の抗腫瘍剤と併用して、1回0.2～0.8mg/kgを1週間に1～2回点滴静脈または静注

●局所動脈内注射：1日0.2～0.4mg/kg/日を他の抗腫瘍剤と併用して持続注入ポンプで投与

●膀胱腫瘍：単独では200～400mg、他の抗腫瘍剤と併用しては100～300mgを10～40mLの生食又は注射用水に混合して1日1回又は週2～3回膀胱内に注入

【用法】■内服：分1～3食後■注射：点滴静注、静注、筋注、皮下注、膀胱内注入

【透析患者への投与方法】通常用量では減量の必要はないが、難治性白血病や骨髄腫に用いられる高用量（1～3g/m²を12時間おきに）投与では中枢毒性、神経毒性が表れやすいため慎重投与（5）

【その他の報告】神経毒性の発現頻度は、Ccr 60mL/min以上では8%であるのに対し、Ccr 60mL/min以下では86～100%の高頻度（Cancer Treat Rev 21: 33-64, 1995）腎不全で蓄積する（臨床血液 32: 1558-63, 1991）注射：減量の必要はないが、腎不全患者では高用量投与（2～3g/m²）により腎毒性が増す（3,6）

【保存期 CKD 患者への投与方法】Ccr 10mL/min以上：減量の必要なし（3,10,12）Ccr < 10mL/min：高用量投与では中枢毒性、神経毒性が表れやすいため慎重投与（5）

高用量での神経毒性との関連（Damon LE, et al: J Clin Oncol 1989 PMID: 2778484）

【特徴】代謝拮抗剤で殺細胞効果は時間依存性。フルオロウラシル類と比べ造血系に対する抑制作用が強く、急性骨髄性白血病を初めとする造血器腫瘍に効果を発揮する。Ara-Cには抗ウイルス作用や免疫抑制作用もある。内服はAra-Cのプロドラッグで肝臓で代謝されAra-Cになって抗腫瘍効果を現す。血中での半減期が長い。

【主な副作用・毒性】骨髄抑制、消化器症状、下血、口内炎、肝機能障害、皮疹、BUN上昇、クレアチニン上昇、血尿、小脳神経障害、振戦、幻覚、昏睡、進行性肝不全、ARDS、消化器障害、過敏症。大量投与で脳性運動失調など

【モニターすべき項目】血清AST・ALT・ビリルビン・LDH、CBC、血清尿酸値、骨髄像

【F】20%以下（13）膀胱粘膜から0.2%（1）

【tmax】注射：20～60min（皮下注）【Cmax】200mg/m²をbolus静注投与でCmaxは5μg/mL以下、112mg/m²/日の持続静注で定常状態濃度は0.05～0.1μg/mL（13）

【代謝】肝臓、血中で90%以上が代謝され、Ara-Uとなる（1）80～90%が血中および組織（特に肝）でcytidine deaminaseによって速やかに代謝。髄液中ではほとんど代謝されない（U）尿中主要代謝物は不活性のara-U（1）

【排泄】尿中未変化体排泄率0.5%以下 [スタラシド]（1）7.1% [Ara-C, iv, 24hrまで]（1）10%（U,14）11%（13）6%（12）

【CL】6.29L/min [iv]（1）917mL/min（10）13mL/min/kg（13）【非腎CL/総CL】90%（10）

【t1/2】2～3hr（1）2.3hr（10,14）2.6hr（13）α相10～15min、β相1～3hr（U）0.5～3hr（12）【透析患者のt1/2】正常腎機能者と同じ（12）

【蛋白結合率】15%（U）13%（10,12,13）スタラシドと98%以上（1）13.3% [Ara-C]（1）

【Vd】2.5L/kg（10,14）2.6L/kg（12）3.0L/kg（13）3.5L/kg（1）16.23～28.77L/man [iv]（1）

【MW】243.22

【透析性】透析で除去される（臨床血液 32: 1558-1563, 1991）除去されない（Onkologie 13: 289-94, 1990）の相反する報告があるが、Vdが大きいため除去率は低いと考えられる（5）資料なし（1）

【TDMのポイント】有効治療域100～400ng/mL（16）10～100ng/mL（14）一般的にTDMは行われぬ【O/W係数】LogP=-2.7 [1-オクタノール水系, pH7.0, Ara-C]（1）0.0019 [1-オクタノール水系, pH7]（1）【pKa】3.9（1）

【備考】骨髄抑制の副作用が最も重要であるので頻回に臨床検査を行い、異常が認められたら減量・休薬する。効果は2～3週間連日投与により現れるので、寛解導入療法など強力な化学療法が必要な患者にはその療法を優先する。また大量投与では発熱、発疹、結膜炎等の眼症状を起こすことがあるのでステロイドの併用ならびに同点眼など速やかに対応できるよう注意を払う必要がある。

【更新日】20240627

※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。