

## ◎ゾラデックスデポ・◎LA デポ [注]

【重要度】 【一般製剤名】ゴセレリン酢酸塩 (U) goserelin acetate 【分類】LH-RH アゴニスト

【単位】▼1.8mg/筒, ◎3.6mg/筒, ◎LA10.8mg/筒

【常用量】■1回3.6mgを4週間ごと ■LA:1回10.8mgを12~13週ごと

【用法】前腹部に皮下注 [投与部位は毎回変更する]

【透析患者への投与方法】腎不全患者では消失半減期が延長するがデポ剤となっているため用量調節する必要はない (U,10,11)

【保存期 CKD 患者への投与方法】重度腎障害患者では消失半減期が3倍に延長するが蓄積性はなく減量の必要なし (1)

【その他の報告】減量の必要なし (10)

【特徴】天然型 LH-RH と比べ血中半減期が長く、約 100 倍の生物活性を示す。最低 28 日間は連続して薬物を放出するように設計されている。持続投与すると脳下垂体の脱感作を招き、LH、FSH 分泌能を低下させ性腺機能を抑制する。1.8mg 製剤は子宮内膜症に、その他は前立腺癌もしくは閉経前乳癌に適用される。

【主な副作用・毒性】前立腺癌随伴症状の増悪、アナフィラキシー、間質性肺炎、血栓塞栓症、心不全、肝機能障害、黄疸、謝異常、出血・疼痛・硬結等の注射部位反応、頭重、ほてり、気分変動など。

【安全性に関する情報】■前立腺癌の場合：投与開始初期に骨性疼痛、尿管閉塞、排尿困難等が現れることがあり、このような場合には対症療法を行う。■閉経前乳癌：骨転移のある患者で投与開始初期に、まれに高 Ca 血症が現れることがある (1)

【モニターすべき項目】酸性フォスファターゼ濃度、PSA、血清テストステロン濃度 (U)

【吸収】腹部皮下組織より吸収 (1) 注射後、最初の 8 日間は徐々に吸収されるが、その後の吸収はやや速やかになる (U)

【F】67% [連続 2 回投与時] (1)

【tmax】2 週間後に約 2.0ng/mL (1) 3.6mg 投与で 2.5ng/mL (U)

【代謝】肝障害は PK に影響しない (1) ペプチド断片に活性はない (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率 10%以下 (10) 尿中回収率 90%以上 (1)

【CL】137mL/min (10) 7.98±1.56L/hr [sc] (1)

【t1/2】4~5hr [sc] (10) 4.2hr (11) 【透析患者の t1/2】やや延長 (U) 12hr (1,10,11)

【蛋白結合率】20~28% (1) 腎不全で低下 (11)

【Vd】0.2L/kg (10) 44.1±5.1L/man [sc] (1)

【MW】1329 (ゴセレリンとして 1269)

【透析性】分子量がやや大きいですが、血中からはある程度透析されると思われる (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】0 (11) 0.01 [1-オクタノール水系, pH7.0] (1) 【pKa】4.8, 6.2 (1)

【最大効果発現時間】約 2 週間後 (1) テストステロンの一過的な上昇が一週間以内に認められるが、2~4 週間以内に去勢レベルに低下する (U)

【効果持続時間】約 4 週間

【備考】妊婦または妊娠している可能性のある患者には禁忌。授乳中の患者には禁忌 (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。