

○アリミデックス錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 アナストロゾール (U) Anastrozole 【分類】 閉経後乳癌治療剤 [アロマターゼ阻害剤]

【単位】 0.1mg/錠

【常用量】 1mg/日

【用法】 1日1回

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (Langenegger T, et al: Breast Cancer Res Treat 100: 177-81, 2006)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (5)

【その他の報告】 安全性未確立 (1) 使用経験がないため慎重投与 [中等度障害までは常用量] (18)

【特徴】 閉経後女性におけるエストロゲン生成の最終段階を触媒する酵素であるアロマターゼは、脂肪組織や筋肉などに広く分布している。このアロマターゼの活性を選択的かつ強力に阻害することによりアンドロゲンからエストロゲンの生成を阻害し、乳癌の増殖を抑制する。

【主な副作用・毒性】 アナフィラキシー、血管浮腫、SJS、肝障害、間質性肺炎、血栓塞栓症、骨塩量低下、高コレステロール血症、ほてり、頭痛、無力症、脱毛、抑うつ、性器出血、消化器障害、傾眠、発疹、関節痛、硬直、膣乾燥など

【安全性に関する情報】 骨粗鬆症、骨折が起こりやすくなるので、骨密度等の骨状態を定期的に観察 (1)

【吸収】 小腸から結腸の範囲 (1)

【F】 80% (13) ほぼ100%吸収される (11) 82% [イヌ] (1)

【tmax】 1.3±0.2hr (1) 【Cmax】 3mg 単回経口投与で46ng/mL (13)

【代謝】 約75%以上が肝で代謝され、主代謝物はトリアゾール、グルクロン酸抱合体、水酸化物のグルクロン酸抱合体 (1) N脱アルキル化、水酸化、グルクロン酸抱合により代謝され活性を失う (U) 主代謝物であるトリアゾールはアロマターゼ活性を阻害しない (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率10%以下 (13) 7%以下 (11) 主に尿中、一部糞便中 (1) 85%が胆汁中排泄 (U) 尿中回収率70%以上でほぼ代謝物 [po, 336hr まで] (1) 代謝物を含め74.6%が尿中排泄 (11)

【CL/F】 18.8±1.1mL/min [po] (1)

【t1/2】 50hr (13) 55.9~57.7hr (1) 約50hr (U) 40~50hr (11)

【蛋白結合率】 約40% (1,U) 40%以下 (13) 44% (11)

【Vd】 およそ1.5L/kg程度と思われる (5) 0.77L/kg [ラット, iv] (1)

【MW】 293.37

【透析性】 資料なし (1) ダイアライザーは通過するが、透析性は検討されていない (5)

【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=1.59 [1-オクタノール水系] (1) 【pKa】 1.4

【相互作用】 CYP1A2, CYP2C9, CYP3A4の活性を阻害したが臨床使用に問題ない程度 (1)

【主な臨床報告】 タモキシフェン併用による追加効果なし (Howell A, et al: Lancet 365: 60-2, 2005 PMID: 15639680)

閉経後乳がんのアジュバント療法で2年間に比べ5年継続のメリットを認めず [骨折も増加] (Gnant M, et al: N Engl J Med 2021 PMID: 34320285)

【効果発現時間】 血清estradiolの70%低下は24時間以内に得られ、80%低下は14日後に得られる (U)

【効果持続時間】 抗エストロゲン作用は服薬中止後6日間持続する (U)

【備考】 閉経前への投与は避ける。術後補助化学療法としての有用性は未確立 (1)

【更新日】 20230531

※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。