

○タキソテール点滴静注用 [注]

【重要度】 【一般製剤名】ドセタキセル水和物 (U) docetaxel hydrate 【分類】抗悪性腫瘍剤 [タキサン系]

【単位】○20mg/V [0.5mL]・▼80mg/V [2mL]

【常用量】添付文書参照 [1クール3~4週間]

【用法】1時間以上かけて点滴静注 (添付文書参照)

【透析患者への投与方法】減量の必要はなく、透析性もない (Janus N, et al: Ann Oncol 21:1395-403, 2010)

【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし (5)

【特徴】ヨーロッパイチの針薬抽出物から半合成されたタキサン環を有するタキソイド系抗悪性腫瘍剤。チューブリンの重合を促進し安定な微小管を形成すると共にその脱重合を抑制する。細胞内においては形態的に異常な微小管束を形成し、細胞の有糸分裂を停止させ抗悪性効果を発揮する。

【主な副作用・毒性】骨髄抑制、ショック・アナフィラキシー、肝障害、腎障害、間質性肺炎、心不全、DIC、腸管穿孔、胃腸出血、ARDS、心筋梗塞、静脈血栓塞栓症、口内炎、血管炎、皮膚剥離を伴う皮疹、末梢神経障害、感染症、Radiation Recall 現象、食欲不振、脱毛、全身倦怠感、悪心・嘔吐、下痢、血清電解質異常、発熱など

【安全性に関する情報】グルタチオン S トランスフェラーゼの一部の多型は血液毒性に関与している可能性 (Tran A, et al: Clin Pharmacol Ther 79: 570-80, 2006)

【モニターすべき項目】CBC, 肝機能

【Cmax】85mg/m²を1.6hrかけて静注したとき2.4μg/mL (13)

【代謝】肝でCYP3A4, モノオキシゲナーゼにより代謝される。1種の主代謝物と3種の副代謝物が同定されている (U) CYP3A4で代謝され、代謝物に活性はない (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率2.1% (13) 5~7% [iv, 168hrまで] (1) 5%以下 (11) 主に胆汁に排泄される (13) 糞中排泄率75% (1,11) 主として代謝物 (未変化体は8%未満) として糞便中排泄 (U)

【CL】22.6L/hr/m², 肝障害で低下 (13) 21L/hr/m² (11) 20.4L/hr/m² (1) α1-酸性糖蛋白と肝機能障害が全身クリアランスの主要な変動因子で、ASTまたはALTが60 IU/L以上の患者では全身CL21%減少 (1) 58歳以下 [21.8L/hr/m²] に比べて59歳以上ではクリアランスが1.28倍高い (尾上晴香, 他: 臨床薬理 45: S236, 2014)

【t1/2】2~3相性の消失パターンをとり、α相6.3min, β相46.4min, γ相18.8hr (1) α相4min, β相36min, γ相11.1hr (11) 13.6hr (13) α相4min, β相36min, γ相11.1hr (U,11)

【蛋白結合率】94% (13) 90%以上 (1) 95%以上がAAG, アルブミン, リポ蛋白と結合 (U,11) AAGに結合 (Loos WJ, et al: Clin Pharmacol Ther 74: 364, 2003)

【Vd】164.1L/m² (1) 113L/man (U) 67.3L/man (11) 72L/m²

【MW】861.93

【透析性】除去されない (Hochegger K, et al: Nephrol Dial Transplant 22: 289-90, 2007) 蛋白結合率が高くVdも大きいため透析されないと考えられる (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。遊離型濃度と好中球減少症は関連 (Baker SD, et al: Clin Pharmacol Ther 77: 43-53, 2005) 【O/W係数】LogP=3.2 [1-オクタノール水系] (1)

【相互作用】他の抗悪性腫瘍剤, 放射線照射: 骨髄抑制を等の副作用増強。CYP3A4 阻害剤のエリスロマイシン, ケトコナゾール, ミダゾラム, テストステロンとの併用は注意 (U) CYP3A4の強い阻害剤併用時には用量を減らす必要あり (Engels FK, et al: Clin Pharmacol Ther 75: 448-54, 2004)

【肝障害患者】CYP3A4活性評価による肝障害患者でのPPK解析 (Hooker AC, et al: Clin Pharmacol Ther 84: 111-8, 2008)

【備考】用量規制因子は好中球減少 (1) 前投薬としてデキサメタゾン, 5-HT₃ 受容体拮抗薬などが実施される (1) アルコール過敏の患者では添付溶解液を使用しない (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。