

## ▼ジェムザール注射用 [注]

【重要度】 【一般製剤名】 ゲムシタピン塩酸塩 (U) gemcitabine hydrochloride 【分類】 抗悪性腫瘍剤 [代謝拮抗剤]

【単位】 ▼200mg・▼1000mg/V

【常用量】 ■非小細胞肺癌, 肺癌, 胆道癌, 尿路上皮癌, がん化学療法後に増悪した卵巣癌: 1回 1000mg/m<sup>2</sup>, 週1回投与を3週連続, 4週目休薬を1コース

■手術不能又は再発乳癌: 1回 1250mg/m<sup>2</sup>, 週1回投与を2週連続し, 3週目は休薬を1コース

【用法】 30分かけて点滴静注 [週2回以上あるいは1回の点滴を60分以上かけて行うと副作用が増強した例が報告されている] 200mgバイアルは5mL以上, 1gバイアルは25mL以上の生食に溶解

【透析患者への投与方法】 未変化体の薬物動態は腎機能正常者と同じであるが, 代謝物 dFdU のクリアランスは低下する。しかし, dFdU の HD による除去率は 50% と高く, 結論として投与量の補正は必要ないが, 慎重に投与すべきである (Masumori N, et al: Jpn J Clin Oncol 38: 182-5, 2008)

【その他の報告】 安全性に関する十分なデータがない (1) 投与 6~12hr 後に透析を施行して代謝物の毒性を軽減させる方法が推奨される (Kiani A, et al: Cancer Chemother Pharmacol 51: 266-70, 2003) 減量の必要はないと思われるが, ウラシル体の半減期が 5~10 倍延長するため慎重投与 (Janus N, et al: Ann Oncol 21: 1395-403, 2010)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 総 CL に対する腎 CL が 10% 以下であるため減量の必要はないと思われるが, dFdU の消失が障害されているため慎重投与 (5)

【その他の報告】 腎不全患者では安全性に関する十分なデータがない (1) 腎障害時の使用経験が少ないこと, HUS 発症例が報告されているため腎障害患者には慎重投与 (U)

【特徴】 S 期特異的な作用を示すヌクレオシド系代謝拮抗剤。細胞内で代謝されて活性型のヌクレオチドである二リン酸化物及び三リン酸化物となり, これらが DNA 合成を直接的及び間接的に阻害することにより殺細胞作用を示す。用量規制因子は骨髄抑制, 特に白血球減少, 好中球減少, 血小板減少。

【主な副作用・毒性】 骨髄抑制, 間質性肺炎, 心筋梗塞, うっ血性心不全, 肺水腫気管支痙攣, ARDS, 腎不全, 溶血性尿毒症症候群, 不整脈, 低酸素血, 呼吸困難, 高炭酸ガス血症, 肝障害, 食欲不振, 悪心・嘔吐, 下痢, 潰瘍性口内炎, 脱毛など

【モニターすべき項目】 CBC, 肝機能

【代謝】 肝・腎・血球等の組織においてシチジンデアミナーゼによりウラシル体へ代謝される。ウラシル体の活性はなし (1) 細胞内で 2 リン酸や 3 リン酸となり活性化され脱アミノ化により代謝される (U)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 10% 以下 (13) 5.3% [iv, 24hr まで] (1) ウラシル体として尿中に 56.3% 回収 [iv, 24hr まで] (1) 投与 1 週間後までに未変化体として 10% 以下, ウラシル代謝物として 89% が尿中に排泄 (U)

【CL】 37.8mL/min/kg, 加齢により低下 (13) 3117mL/min (1) 男性 67L/hr/m<sup>2</sup>, 女性 46L/hr/m<sup>2</sup>, ウラシル体 2.5L/hr/m<sup>2</sup> (11) 【腎 CL】 4.75L/hr/m<sup>2</sup> (1)

【非腎 CL/総 CL】 90% 以上 (11)

【t1/2】 男 19.7min, 女 40.9min (1) 0.63hr, 加齢により延長 (13) β相 18.3min (1) 11~26min, 代謝物 14hr (11)

【蛋白結合率】 10% (1) 10% 以下 (U) 無視できるくらい低い (13)

【Vd】 1.4L/kg (13) 46.1 L/man (1) 男性 15.6L/m<sup>2</sup>, 女性 11.3L/m<sup>2</sup>, ウラシル体 150L/m<sup>2</sup> (11) 46.1L/man (1) 70 分未満の点滴時: 50L/m<sup>2</sup> であるが, 70~285 分の点滴時には 370L/m<sup>2</sup> と大きく, 組織移行速度が遅い (U)

【MW】 299.66

【透析性】 投与後間もない HD ではある程度除去される可能性があるが, 組織中へ移行後は効率的な除去は困難と思われる (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。10mg/m<sup>2</sup>/min を 120~640min 点滴投与したときの定常状態濃度は 26.9 μM (13) 【OW 係数】 水相に分配 [クロロホルム系 pH3-11] (1) 【pKa】 4.2 (1)

【相互作用】 腹部放射線療法 (体外照射) と同時併用の場合, 重篤となる局所の合併症が発現することがある。基礎試験で濃度依存的に放射線照射の効果を増強し, 放射線感受性増加が認められている (1,U)

【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。