▼ゼローダ錠　［内］

【重要度】★★★【透析患者に投与禁忌】　【一般製剤名】カペシタビン（U）　Capecitabine　【分類】抗悪性腫瘍剤［代謝拮抗薬］
【単位】▼300mg/錠
【常用量】体表面積にあわせて投与［添付文書参照］
【用法】1日2回でA法，B法，C法により投与［添付文書参照］
【透析患者への投与方法】重篤な腎障害患者［Ccr 30mL/min 未満］には投与禁忌（U）
【その他の報告】MMK に対して 1800～2400mg/日の投与は効果的で安全に使用できた［症例報告］（今 裕史，他: 透析会誌 43: S355, 2010）
HD 患者でのデータがない（Janus N, et al: Ann Oncol 21:1395-403, 2010）

HD 患者の大腸癌術後再発に対して XELOX＋Bevacizumab 療法を施行した症例（武田 和，他: 癌と化学療法 42: 1594-1596, 2015）
カペシタビン 1250mg/m^2/日による CapeOX 療法が奏効した HD 患者の大腸癌多発肝転移症例（山岸俊介，他: 癌と化学療法 43: 1767-1769, 2016）
カペシタビン 1000 mg/m^2/日（day1-14）で CapeOX 療法を適用した上部消化管癌の 2 症例（Sasaki K, et al: Intern Med 2019 PMID: 31243213）
【保存期 CKD 患者への投与方法】重篤な腎障害患者［Ccr 30mL/min 未満］には投与禁忌（1,U）
【その他の報告】Ccr 30mL/min 未満で 5’-DFUR の AUC が 1.7 倍に上昇（1）
HD を含む腎不全［平均 GFR 20.9mL/min］患者に 250～1000mg/m^2×2 回/日から開始し，副作用発現時には 50%に減量するなどして安全に治療ができた（Jhaveri KD, et al: J Oncol Pharm Pract 2012 PMID: 22392964）
腎機能低下は PK に大きな影響を与えないが，加水分解産物の AUC が増大するため，中等度腎障害患者では 75%に減量して適用（Poole C, et al: Cancer Chemother Pharmacol 49: 225-34, 2002）
Ccr 30mL/min 未満の患者でのデータがない（Janus N, et al: Ann Oncol 21:1395-403, 2010）
血漿ウラシルレベルによる DPD 活性は腎不全時に評価不良となる可能性（Carriat L, et al: Br J Clin Pharmacol 2022 PMID: 35939355）
Ccr 50 未満で CAPOX 療法の忍容性低下（Yamazaki K, et al: Jpn J Clin Oncol 2020 PMID: 31665356）
腎機能障害はカペシタビンレジメンによる重篤な毒性発現と関連（Meulendijks D, et al: Eur J Cancer 2016 PMID: 26761784）
【特徴】経口 5-FU のプロドラッグ．腫瘍組織内において 5-FU 濃度を選択的に高めることを目的としたフッ化ピリミジン系抗悪性腫瘍薬．手術不能又は再発乳癌，結腸癌における術後補助化学療法，治癒切除不能な進行・再発の結腸・直腸癌，胃癌に適用される．
【主な副作用・毒性】脱水症状，手足症候群（Hand-foot syndrome），心障害，肝障害，黄疸，骨髄抑制，口内炎，間質性肺炎など
【安全性に関する情報】指紋消失のリスク（van Doorn L, et al: JAMA Oncol 2016 PMID: 27560202）
【吸収】すみやかに吸収される（U）96%以上が吸収（1）
【tmax】1.1～1.3ｈｒ（1）カペシタビン 1.5hr，5-FU2hr（U）
【代謝】カルボキシルエステラーゼによって加水分解され 5’-DFCR，5’-DFUR になり，加水分解されて活性体の 5-FU となる（U）消化管より未変化体のまま吸収され，肝臓でカルボキシルエステラーゼにより 5’-DFCR に代謝され，次いで主として肝臓や腫瘍組織に存在するシチジンデアミナーゼにより 5’-DFUR に変換される．さらに腫瘍組織に高レベルで存在するチミジンホスホリラーゼ（TP）により活性体である 5-FU に変換され抗腫瘍効果を発揮する（1）
【排泄】尿中未変化体排泄率 3%［24hr まで］（1）大部分が代謝物（FBAL）として尿中に排泄される（U）FBAL の尿中回収率約 50%［24hr まで］（1）
【CL/F】カペシタビンとして 308±103L/hr（1）
【t1/2】0.4～0.8ｈｒ（1）カペシタビン，5-FU とも約 45 分（U）
【蛋白結合率】53～55%（1）60%以下で 35%はアルブミンと結合（U）
【Vd】資料なし（1）
【MW】359.35
【透析性】ある程度透析されると思われる（U,5）資料なし（1）
【O/W 係数】4.5［1-オクタノール/buffer, pH7.4］（1）
【薬物動態】腎障害時には 5’-DFUR と最終代謝物の FBAL の AUC が増大する（Pool C, et al: Cancer Chemother Pharmacol 49: 225-34, 2002）
【相互作用】CYP2C9 の酵素蛋白合成系に影響して酵素活性が低下する可能性がある（1）ワルファリン併用時には PT のチェックを定期的に行う［出血リスク上昇の可能性］（1）トリフルリジン・チピラシル塩酸塩配合剤と併用注意（1）
【更新日】20230621

※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。