▼カイプロリス点滴静注用　［注］

【重要度】　【一般製剤名】カルフィルゾミブ　Carfilzomib　【分類】抗悪性腫瘍剤［プロテアソーム阻害剤］
【単位】▼10mg・▼40mg/V
【常用量】■1 サイクルの 1～2 日目：20mg/m^2，それ以降 27mg/m^2［適宜減量］
■レナリドミド及びデキサメタゾンとの併用で【1，2，8，9，15，16 日目】に点滴静注し，12 日間休薬する 28 日間を 1 サイクルとし，12 サイクルまで投与を繰り返す．13 サイクル以降は【1，2，15，16 日目】に点滴静注し，12 日間休薬
■投与量算出の最大 BSA は 2.2m^2 とする
【用法】1 日 1 回，10 分かけて点滴静注■10mg/5mL，40mg/20mL の割合で注射用水で溶解し，必要量を 5%ブドウ糖液で希釈
【透析患者への投与方法】PK に影響なく，通常用量が適用できる（Badros AZ, et al: Leukemia 27: 1707-14, 2013 PMID: 23364621）
MM に対して常用量設定可（Quach H, et al: Cancer Chemother Pharmacol 2017 PMID: 28424963）
【保存期 CKD 患者への投与方法】腎機能障害は未変化体の PK に影響しない（1）
PK に影響なく，通常用量が適用できる（Badros AZ, et al: Leukemia 27: 1707-14, 2013 PMID: 23364621）
【その他の報告】腎機能障害が進行して Ccr 15mL/min 未満で休薬し，Ccr 15mL/min 以上に回復してから投与再開を検討（1）
【特徴】不可逆的，選択的プロテアソーム阻害剤．プロテアソームのキモトリプシン活性を阻害し，がん細胞内のユビキチン化たんぱく質を蓄積させてアポトーシスを誘導する．ボルテゾミブ耐性細胞株にも効果を認めている．発売時，再発または難治性の多発性骨髄腫に適用．
【主な副作用・毒性】うっ血性心不全，QT 延長，心筋梗塞，間質性肺炎，肺高血圧症，肝機能障害，急性腎不全，腎機能障害，血球減少，infusion reaction，高血圧，感染症，めまい，眼障害，消化器症状，皮膚症状，血清電解質異常など多数．
【安全性に関する情報】高頻度に報告された副作用は，血小板減少，貧血，疲労，悪心，下痢（Thompson JL: Ann Pharmacother 47: 56-62, 2013 PMID: 23300152）高血圧の増悪や新規発症，末梢神経障害の再発が報告（Watanabe T, et al: Br J Haematol 172: 745-56, 2016 PMID: 26732066）
【代謝】主な代謝経路はエポキシド及びペプチド結合の加水分解であり CYP の関与は少ない（1）主代謝物 M14，M15，M16 に活性はない（1）代謝における CYP の関与は低く，全身 CL は肝血流量より高く，組織中でペプチダーゼによる分解，エポキシド開裂により代謝（Wang Z, et al: Drug Metab Dispos 41: 230-7, 2013 PMID: 23118326）
【排泄】尿中未変化体排泄率 0.3%，M14 として 25.3%，M15 として 1.87%が尿中に回収（1）P-gp の基質（1）
【CL】105～132L/hr（1）
【t1/2】0.4～0.7hr（1）0.5hr 未満（Alsina M, et al: Clin Cancer Res 18: 4830-40, 2012 PMID: 22761464）0.29～0.48hr（Redic K: J Pharm Pharmacol 65: 1095-106, 2013　PMID: 23837578）
【蛋白結合率】96.9～97.3%（1）
【Vd】8.5～15.2L/man（1）
【MW】719.91
【透析性】資料なし（1）透析性は低いと思われる（5）
【O/W 係数】3.77［1-オクタノール/水系］（1）
【相互作用】P-gp の輸送活性を 25%，BCRP の輸送活性を 22.9%阻害（1）CYP3A4 を時間依存的に阻害するが，半減期が短いため影響はほとんどない（Wang Z, et al: Drug Metab Dispos 41: 230-7, 2013 PMID: 23118326）
【肝障害患者への投与方法】
【小児 CKD 患者における報告】小児への使用経験がない（1）
【妊婦・授乳婦への投薬】妊婦禁忌，授乳中止（1）
【主な臨床報告】最小有効量 11mg/m^2（O’Connor OA, et al: Clin Cancer Res 15: 7085-91, 2009 PMID: 19903785）
【更新日】20220521

※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。