○ユーエフティ配合カプセル・▼ユーエフティーE配合顆粒 [内]

【重要度】 【一般製剤名】テガフル (FT) +ウラシル (U) tegafur/uracil 【分類】抗悪性腫瘍剤 [代謝拮抗剤]

【単位】○テガフル 100mg+ウラシル 224mg/Cap [T100], ▼テガフル 100mg+ウラシル 224mg/0.5g [配合顆粒 T100]・▼テガフル 150mg+ウラシル 226mg/0.75g [配合顆粒T150]・▼テガフル 200mg+ウラシル 448mg/1g [配合顆粒T200]

【常用量】テガフルとして 300~600mg/日

■テガフル・ウラシル通常療法, ホリナート・テガフル・ウラシル療法について添付文書参照

【用法】分2~3

【透析患者への投与方法】4カプセルまたはE顆粒2.0g/日投与でわずかに蓄積する(日本口腔外科学会誌 39: 1580, 1993)ため3カプセルまたはE顆粒1.5g/日投与(5)透析性が高いため透析日は透析後に投与(日化療会誌 37: 684,1989)

300mg/日で投与可(坂本 薫, 他: 癌と化学療法 22: 239-244, 1995)

【保存期CKD患者への投与方法】Ccr 10mL/min以上: 減量の必要なし, Ccr 10mL/min未満: 3カプセルまたはE顆粒1.5g/日(5)

【特徴】テガフル (FT) : ウラシル (U) =1 : 4のモル比で配合することにより, ウラシルが腫瘍細胞内でテガフルの代謝物である5-FUの分解を抑制し, 腫瘍内の抗腫瘍活性物質濃度を選択的に高めて抗腫瘍効果を増強する。骨髄機能の抑制は比較的弱いとされる。5-FU単独よりも経口バイオアベイラビリティが高く, 5-FUの血清濃度も高く, 消失半減期も長い(Ho DH, et al: Clin Cancer Res 4: 2085-8,1998)

【主な副作用・毒性】骨髄抑制, 重篤な肝障害, 下痢による脱水, 重篤な腸炎, 白質脳症, 嗅覚脱失, 味覚異常, 食欲不振, 悪心・嘔吐, 間質性肺炎, 安静狭心症, 急性腎不全, ネフローゼ, SJS, TEN, 口内炎, 消化性潰瘍など多数。代謝酵素であるジヒドロピリミジンデヒドロゲナーゼ (DPD) の遺伝的欠損者では副作用が起りやすい(1)

【吸収】食物の影響によりテガフルのCmaxは34%低下するがAUCには変化なし。そのため服用1時間前後は食物を摂取しない方がよい(Damle B, et al: Clin Cancer Res 7: 517-23, 2001)テガフル, ウラシルともに経口投与で直ちに吸収される(Ho DH, et al: Clin Cancer Res 4: 2085-8,1998)ホリナート・テガフル・ウラシル療法は食事の影響を受けるので食事の前後1時間を避けて投与(1)

【F】FTとして100%(1)

【tmax】FT 2hr, 5-FU・uracil 30min(1)【定常状態濃度】1.9nM/m²/日を5日間持続静注した時の定常状態濃度は2.3μM(Ho DH, et al: Clin Cancer Res 4: 2085-8,1998)

【代謝】テガフルは速やかに活性代謝物5-FUに代謝される(Ho DH, et al: Clin Cancer Res 4: 2085-8,1998)FTから5-FUへの代謝にはCY2A6Aが関与(1)FTの代謝物5-FU, FdUMP, FUTP等が活性体(1)

【排泄】尿中回収率24.7% [ラット, 24hrまで](1)

【CL】FT 1.9L/hr/m², Uracil 64.1L/hr/m²(1) FT 100~175mL/min(Ho DH, et al: Clin Cancer Res 4: 2085-8,1998)

【t1/2】FT 3.9~8h, 5-FUのt1/2α: 0.3~1.3hr, t1/2β: 4.9~7.0hr, Uracil t1/2α: 0.2~0.5hrで速やかに生体濃度に戻る(Ho DH, et al: Clin Cancer Res 4: 2085-8,1998)

【蛋白結合率】27% [牛血清アルブミン] 3.5% [ヒトガンマグロブリン](1)Uracilは結合しない(1)

【Vd】FT: 18.3~28.7L/man, Uracil: 341~1354L/man(Ho DH, et al: Clin Cancer Res 4: 2085-8,1998) FT: 17.3L/m², Uracil 60.5L/m²

【MW】テガフル200.17, ウラシル112.09

【透析性】投与2時間後の血漿テガフル濃度は透析日、非透析日の間に差がない(癌と化学療法 22: 239-44,1995)5-FU: 34.4%、テガフル 45.6%(日化療会誌 37: 684,1989)透析除去率 FT48.2%, 5-FU 41.6%, Uracil 43.4% [4hrHD](1)

【TDMのポイント】有効治療域10ng/mL、腫瘍内濃度50ng/mL以上(いずれもフルオロウラシルとして)有効血中濃度は5-FUとして50ng/mL以上(胃と腸14: 1613-1616,1979)テガフル、5-FU、ウラシル濃度は患者間で差が大きいため(Ho DH, et al: Clin Cancer Res 4: 2085-2088,1998)TDMは有用と思われるが、一般的には実施されていない【薬物動態】テガフルとして200mg投与4~5hr後、血中濃度は平均0.01mcg/mLに、胃癌組織内濃度は0.09μg/mLになる。経口投与後30分で作用発現、12時間以上作用が持続する

【相互作用】TS-1と併用禁忌(1)テガフルによってフェニトインの代謝が抑制され、フェニトインの血中濃度が上昇する(1)テガフルがワルファリンの作用を増強することがある(機序不明)(1)

【備考】E配合顆粒は原則としてヒートシール包装のまま調剤する[包装を開封して調剤すると、テガフルとウラシルの顆粒が不均一となり配合比率が変化することがある](1)

【更新日】20240627

※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。