

## ○ファルモルピシン注射用・▼エピルピシン塩酸塩注射液 [注]

【重要度】 【一般製剤名】 エピルピシン塩酸塩 (U) Epirubicin Hydrochloride 【分類】 抗腫瘍性抗生物質[アンスラサイクリン系]

【単位】 ○10mg/V

【常用量】 添付文書参照

【用法】 静注, 動注, 膀胱内注

【透析患者への投与方法】 腎障害により薬物動態は影響を受けないため減量の必要なし (3,11)

【その他の報告】 減量の必要はないと思われ, 透析性が不明のため HD 後か非 HD 日に投与 (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 (3,5,12)

【その他の報告】 高度腎障害患者以外はクリアランス変化の問題はないだろう (Camaggi CM, et al: Drugs Exp Clin Res 11: 285-94, 1985)

【特徴】 ドキソルピシンの 4' 位の OH 基が反転した立体異性体 (エピマー)。ドキソルピシンと同様、DNA・RNA 生合成を抑制することにより、抗腫瘍効果を示すが、心毒性は軽減されている。細胞周期の S 期および初期 G2 期で最大の致死作用を示す。

【主な副作用・毒性】 心筋障害, 骨髄抑制, 間質性肺炎, 萎縮膀胱, 肝障害ショック, アナフィラキシー, 脱毛, 食欲不振, 悪心, 嘔吐, 口内炎, 頻尿, 排尿痛など

【Cmax】 50mg/m<sup>2</sup> を単回 bolus 静注投与後の Cmax は 1.5~1.8 μg/mL (13)

【代謝】 ほとんど肝で代謝され、還元代謝物 (エピルピシノール) の他に主にグルクロン酸抱合される (11) エピルピシノールはエピルピシンの 1/3 の活性を有する (U) 加水分解, グルクロン酸抱合, 還元などで不活性体に変換 (U)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 6% (11) 6.4% (13) 15%未満 (10,12) 2%未満 [iv] (Tjuljandin SA, et al: Cancer Res 50: 5095-101, 1990) 尿中回収率 20% (1,U) 10.7% [48hr まで] (1) 胆汁中に 35%排泄 (1) 代謝物ほとんど胆汁排泄され最終的に糞便中に排泄される (11) 尿中回収率 11.9% (Camaggi CM, et al: Cancer Chemother Pharmacol 21 :221-8, 1988)

【CL】 1.07±0.38L/hr/kg (1) 65~95L/hr (11) 43L/hr/m<sup>2</sup>, 肝障害で低下 (13) 胆汁 CL は 8~33L/hr で腎 CL は 4.4L/hr (11) 全身 CL 35.6~133.4L/hr, 腎 CL 1.7~7.0L/hr (Camaggi CM, et al: Cancer Chemother Pharmacol 21 :221-8, 1988)

【t1/2】 35hr (12) α相 3.1~4.8min, β相 1.1~2.6hr, γ相 30~38hr (11) 31.2hr, 肝障害で延長 (13) α相 3分, β相 2.5hr, γ相 33hr (U) 【腎不全患者の t1/2】 腎機能正常者と同じ (12) 最終相 44.8hr (Hu OY, et al: Cancer Chemother Pharmacol 24: 332-7, 1989) 42hr (Tjuljandin SA, et al: Cancer Res 50: 5095-101, 1990)

【蛋白結合率】 77% (13,U) 80~85% (12) アルブミンと結合 (U) 82% [ラット] (1)

【Vd】 46.6±27.7L/kg (1) 21~27L/kg (U) 31.8L/kg と大きく、組織で脂質などの成分と結合している (11) 1272L/m<sup>2</sup> (13) 10~40L/kg (12)

【分布】 赤血球に分布するため全血濃度は血漿濃度よりも高い。肝には最も高濃度に分布し、癌細胞や骨格筋にも高濃度で分布し、20mg/週を 8 回投与すると骨髄には血漿濃度の 100 倍の濃度になるが、分布の個人差・臓器差は大きい (11)

【MW】 579.98

【透析性】 除去されない (Onkologie 13: 289-294,1990)

【TDM のポイント】 個人差が大きく同一投与量でも AUC や Cmax に 10 倍の差がでてくる。一般的に TDM は実施されていない 【O/W 係数】 6.4 (11) LogP=9.14 [1-オクタノール水系, pH 8] (1) 【pKa】 7.77 (1)

【相互作用】 シメチジンが P450 を阻害し AUC を増加させる (1) 心毒性のため、アンスラサイクリン系抗がん剤の累積投与量に注意 (1)

【肝障害患者での情報】 胆汁流出障害があれば減量を考慮 (Camaggi CM, et al: Cancer Chemother Pharmacol 18: 47-50, 1986)

【備考】 他の抗がん剤と併用時、二次性白血病, MDS 発生の報告あり (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。