

エンザルタミド Enzalutamide

●イクスタンジ(アステラス)

軟カプセル(21mm×10mm):40mg.

[特]a.アンドロゲン受容体のアンドロゲン結合を阻害,核内移行を阻害,核内でDNA結合を阻害.

b.両側除睾術,又はGnRH類投与後の無効例(PSA>2)に用いる.

c.上記以外は未承認.

[生存期間] 18.4ヵ月(プラセボ13.6ヵ月)

[効]去勢抵抗性前立腺癌.

[用]160mgを1日1回.

[体内動態]a.血中濃度は1~2時間でピーク,半減期は4.7日~8.4日.

b.反復投与時:未変化体は1ヵ月,活性代謝物は2ヵ月で定常となる.

[慎]てんかん等の痙攣性疾患:  
→痙攣発作.

[患]1.車の運送に注意(→痙攣発作).

2.重度肝機能障害→血漿中濃度上昇.

[併]主としてCYP2C8で代謝.CYP3A4, CYP2C9,CYP2C19,CYP2B6,UGT, P糖蛋白を誘導,P糖蛋白,BCRP, OCT1,OAT3を阻害.

B.慎:a.痙攣発作の閾値を低下する薬(フェノチアジン系抗精神病薬,三環系及び四環系抗うつ薬,ニューキノロン系抗菌薬)で痙攣発作.

b.CYP2C8阻害薬で濃度2倍に上昇.

c.CYP2C8誘導薬(リファンピシシン等)で濃度低下,作用減弱

d.CYP3A4の基質(ミダゾラム等)CYP2C9の基質(ワルファリン),CYP2C19の基質(オメプラゾール等)の濃度低下.

[副 66%]A.重大:痙攣発作.●疲労21%, ●無力症10%,錯乱状態,

D.貧血,ヘモグロビン減,白血球減,好中球減,QT延長,頻尿,めまい,流涙,●悪心20%,●下痢8%,●嘔吐6%,●便秘4%,口内乾燥,腹部膨満,上腹部痛,消化不良,腹痛,鼓腸,胃炎,口内炎,腹部不快感,末梢性浮腫,体重減,疼痛,悪寒,倦怠感,●食欲減退12%,低K血症,脱水,関節痛,筋肉痛,背部痛,筋力低下,筋骨格痛,筋痙縮,四肢痛,筋骨格硬直,頭痛,味覚異常,錯感覚,感覚鈍麻,嗜眠,記憶障害,傾眠,下肢静止不能,末梢性ニューロパチー,認知障害,注意力障害,失神,健忘,不眠,不安,うつ病,幻覚,女性化乳房,呼吸困難,咳,鼻出血,皮膚乾燥,発疹,そう痒,多汗,寝汗,脱毛,紅斑,斑状丘疹状皮疹,●ほてり15%,高血圧,潮紅,転倒,脊椎圧迫骨折,骨折.