

分類	抗アンドロゲン薬						
一般名	アパルタミド	アビラテロン	エンザルタミド		ダロルタミド	ビカルタミド	フルタミド
商品名	アーリーダ®	ザイティガ®	イクスタンジ®		ニューベクオ®	カソデックス®	オダイン®
規格	錠 60 mg	錠 250 mg	錠 40 mg	錠 80 mg	錠 300 mg	錠, OD錠 80 mg	錠 125 mg
薬価	¥2,311.0	¥3,759.3	¥2,397.7	¥4,648.2	¥2311.0	¥594.8	¥216.8
適応	遠隔転移を有しない 去勢抵抗性前立腺癌 遠隔転移を有する前立腺癌	去勢抵抗性前立腺癌 内分泌療法未治療のハイリスクの 予後因子を有する前立腺癌	去勢抵抗性前立腺癌 遠隔転移を有する前立腺癌		遠隔転移を有しない 去勢抵抗性前立腺癌	前立腺癌	前立腺癌
用法・用量	240 mg/day 分1	1000 mg/day 分1 (空腹時) プレドニゾンと併用	160 mg/day 分1		1200 mg/day 分2 食後	80 mg/day 分1	375 mg/day 分3 食後
用量調節	痙攣発作以外の副作用時は 減量レベルに応じて減量 (添付文書参照)	AST, ALTまたはT-bilの値 により減量または休薬 (添付文書参照)	Grade 3以上の副作用で 休薬または80~120 mg/ dayまで減量考慮		Grade 3以上の副作用で 600 mg/dayまで減量考慮	—	—
作用機序	アンドロゲン受容体阻害 核内移行・転写を阻害	CYP17阻害による アンドロゲン合成阻害	アンドロゲン受容体のシグナル 伝達を複数の段階で阻害		アンドロゲン受容体阻害 核内移行・転写を阻害	アンドロゲン受容体阻害	アンドロゲン受容体阻害
T <sub>1/2</sub> (hr)	167	17	202		14	118~125	14
T <sub>max</sub> (hr)	156	2.0	2.0		6.3	36	2.0
食事の影響	—	空腹時と比較して食後で AUC: 10倍、C <sub>max</sub> : 17倍	—		空腹時と比較して食後で AUC: 2.5倍、C <sub>max</sub> : 2.8倍	—	N.D.
B.A.(%)	100	≤10	84.2		30	≥36	N.D.
蛋白結合率 (%)	96	99.8	97~98		92	96	フルタミド: 99.1 OH-フルタミド: 93.6
排泄経路	尿中: 65% 糞中: 24%	尿中: 88% 糞中: 5%	尿中: 71.0% 糞中: 13.6%		尿中: 63.4% 糞中: 32.4%	尿中: 36% 糞中: 43%	尿: 8.6~84
主な代謝酵素	CYP2C8, 3A	CYP3A4	CYP2C8 一部3A4/5		CYP3A4 UGT1A9, 1A1	CYP3A4	N.D. 代謝物はグルクロン酸抱合体
併用注意	CYP2C8, 3A4阻害薬 CYP3A, 2C19, 2C9, P-gp, BCRP, OATP1B1基質薬 痙攣閾値を低下させる薬剤	CYP2C6基質 CYP3A4誘導薬	CYP2C8基質 CYP3A, 2C19誘導薬		CYP3A誘導薬 BCRP・OATP1B1, 1B3基質	ワルファリン、トルブタミド、 デキストロメトर्फアン、 CYP3A4基質	ワルファリン
その他の特徴	副作用: 疲労(18.8%)・ 皮疹(18.2%)・痙攣発作	副作用: 高血圧、浮腫、 骨折、骨粗鬆症	副作用: 痙攣発作、血小 板減少、間質性肺疾患		副作用: 心臓障害 蓄積率: 2.34	小児・女性には投与禁忌	重篤な肝機能障害あり▶定期 的な肝機能検査 尿色: 琥珀色または黄緑色