

※2014年8月改訂14  
 ※2009年11月改訂13

日本標準商品分類番号
874224

抗悪性腫瘍剤

スタラシド®カプセル50  
 スタラシド®カプセル100  
 Starasid® Cap.50・100  
 シタラビン オクホスファート水和物製剤

※〈規制区分〉  
 劇薬、処方箋医薬品\*  
 〈貯法〉  
 室温保存  
 ※※〈使用期限〉  
 3.5年 (PTPシート及び外箱に表示)

承認番号	50	20400AMZ01120
	100	20400AMZ01121
薬価収載	1992年11月	
販売開始	1992年12月	
再審査結果	2006年12月	

\*注意-医師等の処方箋により使用すること



**【禁忌】** (次の患者には投与しないこと)  
 本剤に対し重篤な過敏症の既往歴のある患者

**【組成・性状】**

1. 組成

スタラシドカプセル50及びスタラシドカプセル100は、1カプセル中にそれぞれ次の成分を含有する。

	成分	含有量	
		50	100
有効成分	シタラビン オクホスファート水和物 (無水物として)	51.5mg (50mg)	103mg (100mg)
添加物	ヒドロキシプロピルセルロース、D-マンニトール*、炭酸ナトリウム、ステアリン酸マグネシウム (カプセル本体) ラウリル硫酸ナトリウム、赤色3号、青色1号		

\*スタラシドカプセル50のみ

2. 製剤の性状

スタラシドカプセル50及びスタラシドカプセル100は、いずれも白色と赤紫色からなる硬カプセル剤で、内容物は微黄白色の粒状の粉末である。

	識別コード	外形	質量(g)
スタラシドカプセル50	NK7025	表 裏 3号カプセル	0.241
スタラシドカプセル100	NK7021	表 裏 2号カプセル	0.331

**【効能・効果】**

- 成人急性非リンパ性白血病 (強力な化学療法が対象となる症例にはその療法を優先する。)
- 骨髄異形成症候群(Myelodysplastic Syndrome)

**【用法・用量】**

- 成人急性非リンパ性白血病  
 シタラビン オクホスファートとして、1日100~300mgを2~3週間連続経口投与し、2~3週間休薬する。これを繰り返す。なお、投与量は疾患、症状等により適宜増減する。本剤の投与時期は食後とし、1日1~3回に分けて服用する。

● 骨髄異形成症候群(Myelodysplastic Syndrome)

シタラビン オクホスファートとして、1日100~200mgを2~3週間連続経口投与し、2~3週間休薬する。これを繰り返す。なお、投与量は疾患、症状等により適宜増減する。本剤の投与時期は食後とし、1日1~3回に分けて服用する。

**【使用上の注意】**

1. 慎重投与 (次の患者には慎重に投与すること)

- (1) 骨髄抑制のある患者  
 [骨髄抑制を増悪することがある。]
- (2) 感染症を合併している患者  
 [骨髄抑制により、感染症を増悪させることがある。]
- (3) 薬物過敏症の既往歴のある患者
- (4) 肝障害のある患者  
 [代謝機能等が低下しているため、副作用が強くあらわれることがある。]
- (5) 高齢者  
 [[5.高齢者への投与]の項参照]
- (6) 小児  
 [[7.小児等への投与]の項参照]

2. 重要な基本的注意

- (1) 本剤はその薬物動態及び臨床試験の成績から2~3週間連日投与により効果が発現されることから、寛解導入療法などの強力な化学療法が対象となる患者には本剤の投与は避け寛解導入療法を優先的に実施すること。
- (2) 本剤による骨髄抑制に伴う出血症状の発現又は増悪に十分注意すること。
- (3) 本剤の投与により原疾患による骨髄不全に伴う出血症状の増悪が起こることがあるので、出血の有無の確認、血液検査、臨床症状の観察を十分行うこと。
- (4) 骨髄抑制等の重篤な副作用が起こることがあるので、頻回に臨床検査(血液検査、肝機能検査、腎機能検査等)を行うなど、患者の状態を十分に観察すること。異常が認められた場合には減量、休薬、中止等の適切な処置を行うこと。また、使用が長期間にわたると副作用が強くあらわれ、遷延性に推移することがあるので、投与は慎重に行うこと。
- (5) 感染症の発現又は増悪に十分注意すること。
- (6) 生殖可能な年齢の患者に投与する必要がある場合には、性腺に対する影響を考慮すること。

3. 相互作用

併用注意 (併用に注意すること)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
抗悪性腫瘍剤	骨髄抑制等の副作用が増強することがある。併用療法を行う場合は、患者の状態を観察しながら、減量するなど用量に注意すること。	ともに骨髄抑制作用を有する。

4. 副作用

<概要>

総症例708例（承認時163例、使用成績調査545例）における副作用及び臨床検査値異常の発現率は55.7%であり、主なものは血小板減少19.1%、白血球減少18.2%、食欲不振18.2%、悪心・嘔吐14.1%、ヘモグロビン減少12.4%、赤血球減少12.3%、発熱9.5%、AST (GOT) 上昇9.0%、ALT (GPT) 上昇9.0%、倦怠感8.5%、LDH上昇8.5%などであった。〔再審査終了時〕

(1) 重大な副作用

- 1) 汎血球減少（0.8%）等の骨髄抑制：汎血球減少、貧血、血小板減少、白血球減少、顆粒球減少等があらわれることがあるので、頻回に血液検査を行うなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には減量、休薬、中止等の適切な処置を行うこと。
- 2) 間質性肺炎（0.3%）：発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部X線異常、好酸球増多等を伴う間質性肺炎があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤の投与など適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

	5%以上	1～5%未満	1%未満
消化器	悪心・嘔吐、食欲不振	下痢、腹痛、口内炎	下血、黒色便
肝臓	AST (GOT) 上昇、ALT (GPT) 上昇、LDH 上昇、Al-P 上昇	総ビリルビン 上昇	γ-GTP 上昇
過敏症 <sup>※</sup>		発疹	
皮膚		脱毛	
泌尿器		BUN 上昇、クレアチニン 上昇	血尿
その他	発熱、倦怠感		血清蛋白減少

注) このような場合は投与を中止すること。

5. 高齢者への投与

本剤は、主として肝臓で代謝されるが、高齢者では肝機能等の生理機能が低下していることが多いため、用量に留意して患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、投与しないことが望ましい。  
〔動物実験(ラット、ウサギ)で催奇形作用が報告されている。〕
- (2) 授乳中の婦人へ投与することを避け、やむを得ず投与する場合には、授乳を中止させること。  
〔動物実験(ラット)で母乳中への移行が認められている。〕

7. 小児等への投与

小児に対する安全性は確立していないので、やむを得ず投与する場合は観察を十分に行い、慎重に投与すること。

8. 適用上の注意

薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するように指導すること。(PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている)

9. その他の注意

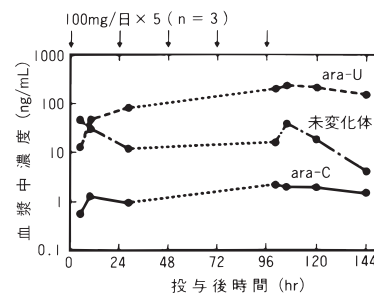
細菌を用いた復帰変異試験では、突然変異誘発性は陰性であったが、培養ヒトリンパ球を用いた染色体異常試験及びマウスを用いた小核試験では、染色体異常誘発能を有することが報告されている。

【薬物動態】

1. 血漿中濃度<sup>1)</sup>

悪性腫瘍患者3名に1日1回100mgを5日間連続経口投与した時の血漿中の活性代謝物ara-C濃度のCmaxは初回及び5日投与後で、各々1.2ng/mL、2.3ng/mLであり、5日目の方が高値を示した。本剤を連続投与すると、ara-Cの血漿中濃度はほぼ一定に推移するものと推定された。

5日間連日投与時の血漿中濃度の推移



2. 排泄

悪性腫瘍患者15名に1日1回100～900mgを5日間連続経口投与したとき、尿中には未変化体は排泄されず、活性代謝物のara-Cが投与量の0.5%以下、主要尿中代謝物としてara-Uが最大で23.2%排泄された。

【臨床成績】<sup>2)</sup>

本剤における臨床試験成績の概要は次のとおりである。

疾患名	寛解率
急性非リンパ性白血病	20.8%(11/53)
骨髄異形成症候群(MDS)	28.9%(13/45)

【薬効薬理】

1. 抗腫瘍作用<sup>3,4)</sup>

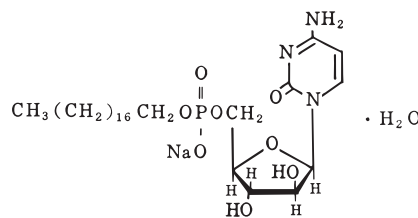
本剤は、経口投与で、L1210白血病をはじめとする各種マウス腫瘍に延命効果を示す。この効果は投与スケジュールに依存せず総投与量に依存する。また、マウスP388白血病でアドリマイシン、ダウノマイシン、マイトマイシンC、シスプラチン又はビンクリスチンとの2剤同時併用で顕著な相乗効果を示した。

2. 作用機序<sup>5)</sup>

本剤は、ara-Cのプロドラッグであり、体内で活性代謝物のara-Cに代謝された後、腫瘍細胞内でara-CTPとなり、DNAポリメラーゼを阻害することにより抗腫瘍作用を示す。

【有効成分に関する理化学的見解】

一般名：シタラビン オクホスファート水和物  
(Cytarabine Ocfosphate Hydrate)  
化学名：4-amino-1-β-D-arabinofuranosyl-2(1H)-pyrimidinone 5'-(sodium octadecyl phosphate) monohydrate  
分子式：C<sub>27</sub>H<sub>49</sub>N<sub>3</sub>NaO<sub>8</sub>P・H<sub>2</sub>O  
分子量：615.67  
構造式：



性状：シタラビン オクホスファート水和物は、白色の結晶  
又は結晶性の粉末である。  
水又はメタノールに溶けやすく、エタノール（95）に  
溶けにくく、ジエチルエーテルにはほとんど溶けない。

**【包装】**

スタラシドカプセル50：40カプセル 100カプセル  
スタラシドカプセル100：40カプセル

## ※※【主要文献及び文献請求先】

## 〈主要文献〉

- 1) 福岡正博他：癌と化学療法,17,2213(1990)
- 2) 巽 典之他：癌と化学療法,17,2387(1990)
- 3) 浴本久雄他：癌と化学療法,17,1437(1990)
- 4) 浴本久雄他：癌と化学療法,17,1351(1990)
- 5) Higashigawa M. et al. : Med. Oncol. &  
Tumor Pharmacother.,7,223(1990)

## 〈文献請求先〉

日本化薬株式会社 医薬事業本部  
営業本部 医薬品情報センター  
(住所) 〒100-0005 東京都千代田区丸の内二丁目1番1号  
(TEL) 0120-505-282 (フリーダイヤル)

® 登録商標

////////////////////////////////////  
※※ 製造販売元

 **日本化薬株式会社**  
東京都千代田区丸の内二丁目1番1号

R-8-11AH