

## ▼アフィニトール錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 エベロリムス everolimus 【分類】 抗悪性腫瘍剤 [分子標的薬]

【単位】 ▼5mg/錠

【常用量】 ■腎細胞癌, 膵神経内分泌腫瘍, 結節性硬化症に伴う腎血管筋間腫瘍: 10mg/日

■結節性硬化症に伴う上下大動脈性巨細胞性星細胞腫: 3.0mg/m<sup>2</sup>

【用法】 1日1回空腹時

【透析患者への投与方法】 HDはPKに影響しない (Thiery-Vuillemin A, et al: Ann Oncol 23: 2992-3, 2012 PMID: 23071263)

【その他の報告】 設定されていない (1)

【保存期 CKD患者への投与方法】 Cr 25~178mL/minの範囲ではCL/Fに有意な影響を及ぼさない (1)

【特徴】 シロリムスの誘導体で消化管吸収率を向上させている。細胞の増殖, 成長, 血管新生の調節因子である mTOR を阻害することにより, 直接的な腫瘍増殖抑制効果と間接的な血管新生抑制作用によって抗腫瘍効果を発揮する分子標的薬。

【主な副作用・毒性】 間質性肺炎, 肝炎ウイルスの再活性化, 感染症の合併, 口内炎, 発疹, 貧血, 疲労, 消化器症状, 高TG血症, 皮膚障害, 創傷治癒遅延など

【吸収】 Pgpの基質である (1) 吸収率は用量依存的に上昇する可能性 [ラット] (1) 初回通過効果を受ける [ラット] (1)

【F】 11%以上が吸収 (1)

【tmax】 2hr (1) 1.3~1.8hr (Kirchner GI, et al: Clin Pharmacokinet 43: 83-95, 2004 PMID: 14748618) 1~4hr (Xu B, et al: J Hematol Oncol 4:3, 2011 PMID: 21232120)

【代謝】 肝および腸管の CYP3A4 により代謝され, P-gp の基質でもある (1)

【排泄】 尿中および糞便中に未変化体は排泄されない (1) 尿中回収率 5%以下 (1)

【CL/F】 15L/hr (1) 16.3±6.2L/hr [健康人, po] (1) 8.8L/hr (Kovarik JM, et al: Clin Pharmacol Ther 70: 247-54, 2001 PMID: 11557912)

【t1/2】 30~40hr (1) ke=0.02/hr (1) 30hr (O' Donnell A, et al: J Clin Oncol 26: 1588-95, 2008 PMID: 18332470)

【蛋白結合率】 74% [健康成人および肝障害患者] (1)

【Vd】 875±223L/man [po] (1) Vd/F=110L/man (Kovarik JM, et al: Clin Pharmacol Ther 70: 247-54, 2001 PMID: 11557912)

【MW】 958.22

【透析性】 資料なし (1)

【薬物動態】 線形動態 (Kirchner GI, et al: Clin Pharmacokinet 43: 83-95, 2004 PMID: 14748618) 2-コンパートメントモデルに適合 (Saba NF, et al: Cancer 120: 3940-51, 2014 PMID: 25103371)

【O/W係数】 溶解度が低いため測定できない (1)

【相互作用】 CYP3A4 を阻害あるいは誘導する薬剤や P-gp に影響する薬剤との併用は可能な限り避ける (1) CYP3A4 阻害作用が比較的軽度な薬剤との併用時には 2.5mg/日に減量し, 認容性があれば 5mg/日も選択肢 (Up To Date) SJW で血中濃度低下, GFJ で血中濃度上昇 (1) EM, AZM 併用で CL/F が 19%低下 (Kovarik JM, et al: Clin Pharmacol Ther 70: 247-54, 2001 PMID: 11557912) EM 併用により血中濃度上昇 (Kovarik JM, et al: Eur J Clin Pharmacol 61: 35-8, 2005 PMID: 15785960)

【肝障害患者における情報】 肝機能低下により血中濃度が上昇 (1) 軽度~中等度肝障害患者で CL/F が 50%低下するため減量を考慮し, 血中濃度測定を推奨 (Kovarik JM, et al: Clin Pharmacol Ther 70: 425-30, 2001 PMID: 11719728)

【備考】 消失半減期が長いので, 週1回投与も選択肢となる可能性もある (Pal SK and Figlin RA: Oncology 4:43-53, 2010)

【更新日】 20201029

※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。