

▼タルセバ錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 エルロチニブ塩酸塩 (U) erlotinib hydrochloride 【分類】 抗悪性腫瘍剤 [TKI]

【単位】 ▼25mg・▼100mg・▼150mg/錠

【常用量】 150mg/日 [症状により適宜減量]

【用法】 1日1回, 食事の1時間以上前又は食後2時間以降に経口投与

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし [非小細胞肺癌] (Togashi Y, et al: J Thorac Oncol 5: 601-5, 2010)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (Miller AA, et al: J Clin Oncol 25: 3055-60, 2007)

【特徴】 切除不能な再発・進行性で, がん化学療法施行後に増悪した非小細胞肺癌に選択 (一次化学療法および術後補助化学療法としての有効性・安全性は未確立) .
ヒト上皮増殖因子受容体 (EGFR) タイプ1 のチロシンキナーゼ阻害剤.

【主な副作用・毒性】 ざ瘡様皮疹等の発疹, 間質性肺炎, 肝機能障害, 消化性潰瘍, 下痢, 角膜穿孔, 角膜潰瘍, 急性腎不全, SJS, TEN など

【安全性に関する情報】 AUC と皮膚症状には一部関連があるが, 下痢とは関連がない (Lu JF, et al: Clin Pharmacol Ther 80: 136-45, 2006)

【F】 59% (1) 空腹時60%, 食後で100%まで上昇 (U)

【tmax】 4hr (U)

【代謝】 主にCYP3A4, 1A2により代謝 (1) 主にCYP3A4により代謝され, 1A2や1A1の関与は低い (U)

【排泄】 尿中回収率8%で未変化体はわずか [264hr まで] (1) 尿中回収率8%で未変化体0.3% (U) 糞便中に83%が回収され, 未変化体は1% (U)

【CL】 喫煙者のCLは24%高い (U) CL/F=3.95L/hr で, 総ビリルビン, AAG, 喫煙が関連 (Lu JF, et al: Clin Pharmacol Ther 80: 136-45, 2006)

【t1/2】 15~27hr (1) 36hr (U) 平均26.2hr (Lu JF, et al: Clin Pharmacol Ther 80: 136-45, 2006)

【蛋白結合率】 95%, アルブミンおよびAAGと結合 (1) 93% (U)

【Vd】 232L/man (U) Vss 83.84L±17.56L/man [iv] (1) Vd/F=233L/man (Lu JF, et al: Clin Pharmacol Ther 80: 136-45, 2006)

【MW】 429.90

【透析性】 低いと思われる (5)

【O/W 係数】 LogP=2.87 [1-オクタノール/buffer, pH7.4] (1)

【相互作用】 CYP3A4 阻害剤や誘導剤との併用に注意 (1) UGT1A1 阻害作用を有する (1) AUC はPPI との併用で46%, H2-blocker との併用で33%低下 (1) NSAIDs
やワルファリンとの併用で消化管出血の報告あり (U)

【更新日】 20180410

※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, 当院では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。