

▼ボシユリフ錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】ボスチニブ水和物 Bosutinib Hydrate 【分類】抗悪性腫瘍剤 [TKI]

【単位】▼100mg/錠

【常用量】500mg/日 [最大600mg]

【用法】1日1回・食後

【透析患者への投与方法】特に設定されていないが慎重投与 (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】中等度以上の腎機能障害のある患者では血中濃度上昇のため減量を考慮し、慎重に投与 (1) 中等度腎障害で AUC が 35% 上昇、重度腎障害患者で AUC が 60% 上昇 (1)

【その他の報告】腎機能の可逆的な低下に関連する可能性があり、CKD G3b 以上の進行 CKD 患者では注意深く腎機能を観察 (Cortes JE, et al: Clin Lymphoma Myeloma Leuk 2017 PMID: 28807791)

【特徴】Abl および Src チロシンキナーゼの選択的阻害剤で、前治療薬に抵抗性または不耐容の CML 患者に適用される。

【主な副作用・毒性】肝機能障害、下痢、骨髄抑制、体液貯留、ショック、心障害、感染症、出血、膵炎、間質性肺炎、腎障害、肺高血圧症、皮膚障害、頭痛、傾眠、ニューロパチー、耳鳴り、消化器症状など多数

【F】空腹時 50%、食後 64% [イヌ] (1) 33.85% (Hsyu PH, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2018 PMID: 29058816)

【tmax】6hr (1) 4~6hr (Abbas R, et al: Clin Pharmacokinetics 2016 PMID: 27113346)

【代謝】肝で CYP3A4 により代謝 (1) 血中代謝物は、酸化的脱クロル体、N-脱メチル体で、活性はごく弱い (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率 1% [po] (1) 1%未満 (Abbas R, et al: Cancer Chemother Pharmacol 69: 221-7, 2012 PMID: 21691746) 尿中回収率 3.29% [po, 9日まで] (1) P-gp, BCRP, MRP の基質 (1) 肝取り込みでの OATP1B1, 1B3 の寄与は小さい (1)

【CL/F】144~190L/hr (1) 2.25-3.81L/hr/kg (Abbas R, et al: Cancer Chemother Pharmacol 69: 221-7, 2012 PMID: 21691746)

【t1/2】単回投与 32~39hr, 連続投与 55hr (1) 32~39hr (Abbas R, et al: Cancer Chemother Pharmacol 69: 221-7, 2012 PMID: 21691746)

【蛋白結合率】94~96% (1) 肝障害、腎障害でも同程度 (1) 94% (Abbas R, et al: Clin Pharmacokinetics 2016 PMID: 27113346)

【Vd/F】4570±713.8L/man (1) Vd/F 131-214L/kg (Abbas R, et al: Cancer Chemother Pharmacol 69: 221-7, 2012 PMID: 21691746)

【MW】548.46 [1 水和物]

【透析性】資料なし (1) 除去されないと思われる (5)

【OW 係数】LogD=3.1 [1-オクタノール水系, pH7.4] (1)

【薬物動態】200~800mg まで線形 (Abbas R, et al: Clin Pharmacokinetics 2016 PMID: 27113346)

【相互作用】ケトコナゾール併用により AUC が 8 倍に上昇 (Abbas R, et al: J Clin Pharmacol 51: 1721-7, 2011 PMID: 21148045) 胃酸の pH 上昇により血中濃度低下 (1) P-gp の基質であり吸収過程の相互作用の原因 (Yamazaki S, et al: Drug Metab Dispos. 2018 PMID: 29739809)

【更新日】20200610

※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。