

## ▼タフィンラーカプセル [内]

【重要度】 【一般製剤名】ダブラフェニブ メシル酸塩 Dabrafenib Mesilate 【分類】抗悪性腫瘍剤 [BRAF 阻害剤]

【単位】▼50mg・▼75mg/Cap

【常用量】300mg/日 [適宜減量]

【用法】1日2回, 空腹時

【透析患者への投与方法】腎機能はPKに影響しない (Ouellet D, et al: J Clin Pharmacol 54: 696-706, 2014 PMID: 24408395)

【その他の報告】トラメチニブと併用して適用できたHD患者の症例報告 (Park JJ, et al: Pigment Cell Melanoma Res 2016 PMID: 27863085)

【保存期CKD患者への投与方法】腎機能はPKに影響しない (Ouellet D, et al: J Clin Pharmacol 54: 696-706, 2014 PMID: 24408395)

【特徴】MAPキナーゼ経路の変異型BRAFキナーゼ活性を阻害する。トラメチニブとの併用療法にて適用。

【主な副作用・毒性】発熱、有棘細胞癌、皮膚以外の部位に悪性腫瘍の発現、心不全、ぶどう膜炎、肝機能障害、深部静脈血栓、感染症、血球減少、高血糖、血清電解質異常、めまい、視力障害、血圧変動、間質性肺炎、膝炎、消化器症状、発疹など多数

【安全性に関する情報】

【吸収】食事により吸収率が低下するので、食事の1時間前から食後2時間までの間の服用は避ける (1)

【F】94.5% (Denton CL, et al: J Clin Pharmacol 53: 955-61, 2013 PMID: 23846776)

【tmax】2hr (Denton CL, et al: J Clin Pharmacol 53: 955-61, 2013 PMID: 23846776)

【代謝】CYP2C8及び3A4により水酸化体にて代謝され、さらに3A4によりカルボン酸体にて代謝、カルボン酸体は非酵素的に脱メチル化される (1) 水酸化体と脱メチル体は活性を有する可能性 (1) 投与量の48%が酸化代謝されて胆汁排泄 (Bershas DA, et al: Drug Metab Dispos 41: 2215-24, 2013 PMID: 24097902)

【排泄】尿中回収率22.7% [po, 240hrまで] (1) Pgp, BCRPの基質 (1) 尿中に未変化体は排泄されない (Bershas DA, et al: Drug Metab Dispos 41: 2215-24, 2013 PMID: 24097902)

【CL】12L/hr [iv] (1, Denton CL, et al: J Clin Pharmacol 53: 955-61, 2013 PMID: 23846776) CL/F=34.3L/hr (Ouellet D, et al: J Clin Pharmacol 54: 696-706, 2014 PMID: 24408395)

【t1/2】4.8hr (Denton CL, et al: J Clin Pharmacol 53: 955-61, 2013 PMID: 23846776)

【蛋白結合率】99.7% (1)

【Vd】45.5L/man [iv] (1, Denton CL, et al: J Clin Pharmacol 53: 955-61, 2013 PMID: 23846776)

【MW】615.67 [塩]

【透析性】資料なし (1) 除去されないと思われる (5)

【O/W係数】LogP=2.9 (1)

【相互作用】CYP2B6, 2C9, 3A4を誘導し、CYP2C8, 2C19を阻害する (1) 臨床ではCYP2C9, 3A4を誘導し、vitroではCYP2B6, 3A4を誘導 ([https://www.pmda.go.jp/drugs/2016/P20160315002/300242000\\_22800AMX00372000\\_A100\\_1.pdf](https://www.pmda.go.jp/drugs/2016/P20160315002/300242000_22800AMX00372000_A100_1.pdf))

CYP3A4誘導剤による血中濃度低下の可能性 (1) 胃酸分泌抑制剤により吸収が低下する可能性 (1) CYP2C9誘導によるワルファリンの効果減弱の可能性がある。また、CYP3A4やCYP2C8の強力な阻害剤との併用は避けるべき (Suttle AB, et al: J Clin Pharmacol 55: 392-400, 2015 PMID: 25449654)

【肝障害患者への投与方法】軽度肝障害はPKに影響しない (Ouellet D, et al: J Clin Pharmacol 54: 696-706, 2014 PMID: 24408395)

【更新日】20220330

※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。