

## ▼ロープレナ錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 ロルラチニブ Lorlatinib 【分類】 抗悪性腫瘍剤 [TKI]

【単位】 ▼25mg・▼100mg/錠

【常用量】 1日1回100mg■副作用グレードにより減量基準あり

【用法】 1日1回

【透析患者への投与方法】 減量考慮 (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 eGFR<30： 減量考慮 (1)

重度腎障害時 (平均 eGFR20) には未変化体の AUC が 41%増大するため 75mg に減量を推奨 (Lin S, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokin 2022 PMID: 35018553)

【特徴】 未分化リンパ腫キナーゼ (ALK) の受容体チロシンキナーゼに対する選択的 ATP 競合性低分子 TKI. ALK チロシンキナーゼ阻害剤に抵抗性又は不耐容の ALK 融合遺伝子陽性の切除不能な進行・再発の非小細胞肺癌に適用。

【主な副作用・毒性】 高コレステロール血症, 間質性肺炎, QT 延長, 認知障害, 言語障害, 肺炎, 肝機能障害, めまい, 筋肉痛, 関節痛, 徐脈, 心ブロック, 下痢, 便秘, 嘔吐, 視覚障害, 浮腫, 脱毛など

【安全性に関する情報】 生体曝露量はコレステロール上昇などの有害作用と関連するかもしれない (Chen J, et al: Clin Pharmacol Ther 2021 PMID: 33973232)

【吸収】 食事の影響を受けず, PPI 併用時も問題なし (Xu H, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2021 PMID: 34288547)

【F】 81% (Hibma JE, et al: Cancer Chemother Pharmacol 2022 PMID: 34698901)

【tmax】

【代謝】 酸化及びグルクロン酸抱合により代謝 (1, Stypinski D, et al: J Clin Pharmacol 2020 PMID: 32441835) CYP3A および UGT1A4 が関与 (1) 代謝物に活性はない (1) 反復投与により自己代謝酵素を誘導する (Chen J, et al: Clin Pharmacokin 2021 PMID: 33937954)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 1%未満 [po, 168hr まで] (1) 尿中回収率 47.7%, 糞便中回収率 40.9% [po, 288hr まで] (1) 糞便中に未変化体として 9.1%回収 (1)

【CL】 単回 9.04L/hr, 反復時は自己代謝酵素誘導により約 1 週間後に 14.5L/hr (Chen J, et al: CPT Pharmacometrics Syst Pharmacol 2021 PMID: 33449423)

【t1/2】 21hr (1)

【蛋白結合率】 66% (1)

【Vd】 305L/man [iv] (1) 脳内移行は P-gp により制限されている (Li W, et al: Int J Cancer 2018 PMID: 29744867) P-gp 阻害剤により脳内移行が増大 [マウス]

(Li W, et al: Eur J Pharm Biopharm 2019 PMID: 30660696) Vc 121L/body (Chen J, et al: CPT Pharmacometrics Syst Pharmacol 2021 PMID: 33449423)

【MW】 406.41

【透析性】 一部除去されるが効率的ではないと思われる (5)

【O/W 係数】 LogP=2.45 [1-オクタノール/水, pH9] (1)

【相互作用】 リファンピシンと併用禁忌 (1) CYP3A4 を誘導する (1) AUC が増大するため強力な CYP3A4 阻害剤との併用は避けるべき (Patel M, et al: Invest New Drugs 2020 PMID: 31728714)

【肝障害患者への投与方法】

【小児 CKD 患者における報告】

【妊婦・授乳婦への投薬】

【主な臨床報告】

【更新日】 20220818

※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。