

## ▼テプミトコ錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】テポチニブ 塩酸塩 水和物 Tepotinib Hydrochloride Hydrate 【分類】抗悪性腫瘍剤「TKI」

【単位】▼250mg/錠

【常用量】500mg/日 [適宜250mgに減量]

【用法】1日1回・食後

【透析患者への投与方法】常用量 (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】常用量 (1) 腎機能はPKに影響しない (Xiong W, et al: Cancer Chemother Pharmacol. 2022 PMID: 35385993) 腎機能障害に注意 (1)

【特徴】MET 遺伝子エクソン 14 スキッピング変異陽性の切除不能な進行・再発の非小細胞肺癌に適用されるキナーゼ阻害薬。

【主な副作用・毒性】間質性肺炎, 体液貯留, 肝障害, 腎障害,

【安全性に関する情報】

【吸収】ka=0.278/hr (1) 高脂肪食にて AUC1.63 倍 (1)

【F】62~85% (1) 72 [62~81] % (Johne A, et al: Invest New Drugs 2020 PMID: 32221754) 用量依存的に低下 (Xiong W, et al: Cancer Chemother Pharmacol 2022 PMID: 35385993)

【tmax】8hr (1)

【代謝】主要な経路ではないが, CYP3A4, 2C8 によって代謝 (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率 7% [po, 360hr まで] (1) P-gp の基質で阻害剤 (1) 尿中回収率 14.4%, 糞便中に 92.5%回収され, 45%が未変化体 (Johne A, et al: Invest New Drugs 2020 PMID: 32221754)

【CL/F】22.7L/hr (1)

【t1/2】30hr (1)

【蛋白結合率】98% (1)

【Vd/F】644L/man (1) CSF に 1.83%移行 (Tanaka H, et al: Cancer Commun (Lond) 2021 PMID: 33387444)

【MW】547.05 [salt hydrate]

【透析性】除去されない (5)

【OW 係数】

【相互作用】P-gp を阻害するため, P-gp の基質薬物の血中濃度上昇のおそれ (1) BCRP, OCT1, MATE1, MATE2-K を阻害 (1) 代謝物ケトン体 (R) は UGT1A1, OATP1B1, OCT1, MATE2-K を阻害 (1)

【肝障害患者への投与方法】

【主な臨床報告】P1 用量決定試験 (Falchook GS, et al: Clin Cancer Res 2020 PMID: 31822497)

日本人で 500mg/日の設定 (Shitara K, et al: Jpn J Clin Oncol 2020 PMID: 32328660)

P2 にて 500mg/日の支持 (Xiong W, et al: CPT Pharmacometrics Syst Pharmacol 2021 PMID: 33818908)

P-gp, BCRP を阻害するため, 抗がん剤耐性例において併用の有効性示唆 (Vagiannis D, et al: Int J Mol Sci 2021 PMID: 34769363)

【更新日】20220820

※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。