

▼ゼジューラ錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 ニラパリブ トシル酸塩 水和物 Niraparib Tosilate Hydrate 【分類】 抗悪性腫瘍剤 [PARP 阻害剤]

【単位】 ▼100mg/錠

【常用量】 200mg/日

初回投与前の体重 77kg 以上かつ血小板数 15 万/ μ L 以上の成人には 300mg/日

■副作用により 100mg 単位で適宜減量

【用法】 1 日 1 回

【透析患者への投与方法】 不明 (Zhao D, et al: Drug Des Devel Ther 2022 PMID: 36405648)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 eGFR 30 以上では常用量だが、それ以下では不明 (Zhao D, et al: Drug Des Devel Ther 2022 PMID: 36405648)

【特徴】 卵巣癌における初回化学療法後の維持療法、白金系抗悪性腫瘍剤感受性の再発卵巣癌における維持療法、白金系抗悪性腫瘍剤感受性の相同組換え修復欠損を有する再発卵巣癌に適用されるポリアデノシン 5' -二リン酸 (ADP) リボースポリメラーゼ (PARP) 阻害剤。PARP-1/2 に選択性が高い。

【主な副作用・毒性】 貧血、消化器症状、血球減少、頭痛、倦怠感、動悸など

【安全性に関する情報】 グレードの高い有害事象は血小板減少と好中球減少 (Zhang J, et al: Oncologist 2020 PMID: 31439812) 他の PARP 阻害剤より骨髄移行性が高い (Snyder LA, et al: Mol Cancer Ther 2022 PMID: 35499386)

【吸収】 空腹時投与で Cmax 上昇しやすい (1) 食事の影響を受けない (Moore K, et al: Cancer Chemother Pharmacol 2018 PMID: 29322231)

【F】 72.7% (van AnDEL L, et al: Cancer Chemother Pharmacol. 2018 PMID: 29043410)

【tmax】 3~4hr (1) 3hr (Zhang J, et al: Oncologist 2020 PMID: 31439812)

【代謝】 カルボキシエステラーゼで代謝 (1) 主代謝物に活性はない (1)

【排泄】 尿中回収率 47.5%, 尿中未変化体排泄率 10.5% [po, 21 日まで] (1) P-gp, BCRP の基質 (1)

【CL/F】 17.2L/hr (1)

【t1/2】 定常状態で 36hr (1) 35hr 以内 (Zhang J, et al: Oncologist 2020 PMID: 31439812)

【蛋白結合率】 約 83% (1)

【Vd/F】 2170L/body (1)

【分布】 P-gp/BCRP 阻害剤により脳内移行性増大 (F Martins ML, et al: Mol Pharm 2021 PMID: 34730366)

【MW】 510.61 [hydrate]

【透析性】 除去率は低いと思われる (5)

【OW 係数】 資料なし (1)

【pKa】 9.95

【相互作用】 CYP1A2 を濃度依存的に誘導 (1) CYP3A, OATP 関連の相互作用は受けにくい (F Martins ML, et al: Mol Pharm 2021 PMID: 34730366)

【肝障害患者への投与方法】 中等度肝障害では 200mg/日より開始 (Akce M, et al: Cancer Chemother Pharmacol 2021 PMID: 34324028)

【主な臨床報告】 P1 dose-finding にて 300mg/日提案 (Sandhu SK, et al: Lancet Oncol 2013 PMID: 23810788)

日本腎の P1 dose-finding にて 200~300mg/日提案 (Yonemori K, et al: Jpn J Clin Oncol 2021 PMID: 33621324)

転移性去勢抵抗性前立腺癌に対するアピラテロンとの併用療法の無増悪生存期間延長効果 (Chi KN, et al: J Clin Oncol 2023 PMID: 36952634)

【備考】 保冷、遮光保管 (1) 相同組換え修復欠損診断を行う。

【更新日】 20240423

※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。