

▼アルンブリグ錠 [内]

【重要度】★★ 【一般製剤名】ブリグチニブ Brigatinib 【分類】抗悪性腫瘍剤 [TKI]

【単位】▼30mg・▼90mg/錠

【常用量】1日1回90mgを7日間、その後1日1回180mg [適宜減量]

副作用発現時の休薬や減量の基準は添文参照

■休薬後の再開時は90mgより

【用法】1日1回

【透析患者への投与方法】AUC 1.9倍のため、50%に減量考慮 (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】eGFR 30 未満：AUC1.92倍のため減量考慮、慎重に観察 (1)

eGFR 30 未満では50%に減量を提案 (Gupta N, et al: Invest New Drugs 2021 PMID: 33742299)

【特徴】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される TKI.

【主な副作用・毒性】間質性肺疾患、肺炎、肝機能障害、高血圧、下痢、CK 上昇、嘔吐、光線過敏反応、筋肉痛、頭痛、味覚障害、徐脈、血球減少など

【安全性に関する情報】

【吸収】食事の影響を受けない (1) 高脂肪食で Cmax が 13%低下するが AUC には影響しない (Tugnait M, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2019 PMID: 30570839)

【F】50%前後 [サル] (1)

【tmax】2~4hr (1)

【代謝】CYP3A4/5, 2C8 で代謝 (1) 主代謝物 N-脱メチル化体とシステイン抱合体 (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率 21.4% [po, 240hr まで] (1) P-gp, BCRP, OATP1A2 の基質 (1)

【CL/F】8.88L/hr (1)

【t1/2】23.9hr (1)

【蛋白結合率】91% (1)

【Vd/F】306L/body (1)

【MW】584.09

【透析性】資料なし (1) 除去率は低いと思われる (5)

【O/W 係数】

【薬物動態】CL/F の共変量はアルブミン濃度 (Gupta N, et al: Clin Pharmacokinetics 2021 PMID: 32816246)

発疹、アミラーゼ上昇の抑制を目的としたトラフコントロールの有用性 (Koele SE, et al: Br J Clin Pharmacol 2022 PMID: 34545619)

生体曝露量が高いほど、頭蓋内奏効率は高いかも知れない (Gupta N, et al: Clin Transl Sci 2022 PMID: 35041775)

NSCLC への PK ガイド投与の試み (Koele SE, et al: Br J Clin Pharmacol 2022 PMID: 35350084)

【相互作用】CYP3A を誘導 (1) 膜透過性は高いので、輸送蛋白阻害の影響は受けにくいと推定 (1) CYP3A4 阻害剤の影響は吸収過程に存在する (Li W, et al: Pharmacol Res 2018 PMID: 30253203) CYP2C8 阻害剤併用による影響は小さいため考慮不良。CYP3A4 の強力な阻害剤併用では 50%に減量を提案。リファンピシム併用では AUC 80%低下 (Tugnait M, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2020 PMID: 31287236) 中等度 CYP3A4 阻害剤併用では 40%減量、CYP3A4 誘導剤では最大 2 倍に増量と計算される (Hanley MJ, et al: CPT Pharmacometrics Syst Pharmacol 2024 PMID: 38288787)

【更新日】20240813

※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。