▼ネクサバール錠　［内］

【重要度】　【一般製剤名】ソラフェニブ トシル酸塩（U）　Sorafenib Tosilate　【分類】抗悪性腫瘍剤［キナーゼ阻害薬］
【単位】▼200mg/錠
【常用量】1回400mgを1日2回［副作用により1回400mg1日1回さらに1回400mg隔日投与への減量も考慮］
【用法】1日2回［高脂肪食時に吸収が低下するためタイミングをずらす］
【透析患者への投与方法】検討されていないので推奨できない（1）
【その他の報告】1日1回200mg（Miller AA, et al: J Clin Oncol 2009 PMID: 19255312）
副作用発現率が高いので200mg/日から開始して400mg/日まで増量するなど慎重に使用（Kennoki T, et al: Jpn J Clin Oncol 2011 PMID: 21367805）
透析患者に400mg/日から開始し800mg/日まで増量したが手足症候群のため減量を要し，最終的に400mg/日で使用（Rey PM, et al: Oncology 2008 PMID: 18716419）
400mg/日から開始して800mg/日に増量して効果が認められた（Ruppin S, et al: Eur Urology 2009 PMID: 19004541）
200mg×2/日，400mg×1/日（HD日はHD後）で使用した症例では用量調節の必要性は示唆されていない（Hilger RA, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 2009 PMID: 19203541）200mgを1日1～2回（17）

【保存期CKD患者への投与方法】腎機能低下はPKに影響しない（1）
【その他の報告】経験的にCcr 40mL/min未満では1日1回200mg，しかしCcr 20mL/min未満は不明（Miller AA, et al: J Clin Oncol 2009 PMID: 19255312）
腎機能正常者に比べ腎障害患者では下痢の頻度が高く，減量を要する頻度も高かった（Parsa VK, et al: Genitourinary Cancers Symp [abstract] 2008）
Ccr 40mL/min以上：400mgを1日2回，Ccr 20～39mL/min：200mgを1日2回，Ccr 20mL/min未満：データがなく提示できない（17）
【特徴】根治切除不能又は転移性の腎細胞癌，切除不能な肝細胞癌に適用される受容体チロシンキナーゼ阻害剤.
【主な副作用・毒性】ショック・アナフィラキシー，急性肺障害，間質性肺炎，手足症候群，剥脱性皮膚炎，高血圧クリーゼ，可逆性後白質脳症，消化管穿孔，出血，心筋梗塞，劇症肝炎，出血性腸炎，虚血性腸炎，肝障害，膵炎，血球減少，動脈解離など
【安全性に関する情報】手足症候群や下痢と腸内細菌との関連の可能性（Yamamoto K, et al: Anticancer Res 2020 PMID: 32014907
【F】38～49%［空腹時～通常食］（U）29%［高脂肪食］（U）
【tmax】3hr（U）4～8hr（1）腸肝循環して2相性のピークが認められる（1）
【代謝】CYP3A4による酸化的代謝とグルクロン酸転移酵素（UGT1A9）によるグルクロン酸抱合により代謝される（1,U）UGT1A1，UGT1A9，CYP2B6，CYP2C9及びCYP2C8を阻害する（1）血漿中主代謝物（ピリジン基のN-酸化体）のAUCは未変化体の6～12%（1）CYP2C19，2D6，3A4を阻害するが，それぞれのプローブ基質への影響は少ない（1）一部の代謝物には活性がある（1）
【排泄】糞中に77%，尿中に19%が回収［投与後2週間］（1）糞中には未変化体として50.7%，カルボン酸体として19.1%排泄され，尿中にはソラフェニブのグルクロン酸抱合体14.8%，ピリジン基のN-酸化体のグルクロン酸抱合体が2.7%排泄される（1）
【CL】0.13～0.15L/hr/kg［マウス・イヌ］（1）単回経口投与時のAUCよりCL/F=5.8L/hr（5）
【t1/2】約1日（1）25～48hr（U）
【蛋白結合率】99.5%［主にAlb］（1,U）
【Vd】0.74L/kg［イヌ］（1）
【MW】637.03
【透析性】透析されないと思われる（5）資料なし（1）
【O/W係数】LogP=5.6［推定値］（1）
【相互作用】UGT1A1を阻害し，イリノテカンおよびSN-38のAUCを上昇させる（1）パクリタキセル／カルボプラチンとの併用によりソラフェニブのAUCが47%増加，パクリタキセルのAUCが29%増加，パクリタキセル活性代謝物［6-OH体］のAUCが50%増加（1）
【備考】二次発がんの可能性が示唆されている（1）
【更新日】20250528

※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、当院では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。