▼タイケルブ錠　［内］

【重要度】　【一般製剤名】ラパチニブトシル酸塩水和物　Lapatinib Tosilate Hydrate　【分類】抗悪性腫瘍剤［TKI］
【単位】▼250mg/錠
【常用量】1250mg/日［適宜減量］
【用法】1日1回食事の1時間以上前又は食後1時間以降に経口投与［カペシタビンと併用］［食後投与や分割投与は避ける］
【透析患者への投与方法】検討されていない（1）
【その他の報告】レトロゾールと併用で治療したHD患者の乳癌症例（Piacentini F, et al: Tumori 99: e134-5, 2013 PMID: 24158084）
【保存期CKD患者への投与方法】検討されていない（1）
【特徴】HER2過剰発現が確認された手術不能または再発乳癌に対し，カペシタビンと併用して用いる．EGFR及びHER2チロシン自己リン酸化を選択的かつ可逆的に阻害してアポトーシスを誘導.
【主な副作用・毒性】［カペシタビンと併用時の副作用を含む］疲労，下痢，そう痒，肝障害，間質性肺炎，心障害，手掌・足底発赤知覚不全症候群，神経障害，骨髄抑制，消化器症状など．下痢は用量依存的に発現する（Burris HA 3rd, et al: J Clin Oncol 23: 5305-13, 2005）
【吸収】空腹時投与に比べ食後投与でCmax［2.5～3倍］，AUC［3～4倍］が上昇（1, Koch KM, et al: J Clin Oncol 27:1191-1196, 2009）分割投与によってAUCが上昇（1）食後投与によるAUCの個人差は空腹時投与のものと同等であり，減量した用量設定で食後投与にすべきではないかとの意見がある（Tannock IF: J Clin Oncol 27: e42, 2009）
【F】27.8%［ラット］，50%［マウス］，63.2%［イヌ］（1）
【tmax】4hr（1）
【代謝】CYP3A，3A5により代謝され，一部2C19，2C8が関与（1）P-gp，BCRPの基質（1）CYP3A4，CYP2C8，P-gp，BCRP，OATP1B1を阻害する（1）代謝物の活性は高くても未変化体の10%未満（1）
【排泄】尿中回収率2%未満（1）92%は糞便中に回収され，27%は未変化体（1）肝障害患者では消失が遅延する（1）
【t1/2】24hr（1）
【蛋白結合率】99%以上（1）
【Vd】中枢移行する（1）
【MW】943.48
【透析性】蛋白結合率が高いため，有効に除去されないと思われる（1）
【O/W係数】LogP=6.0［1-オクタノール/水系］（1）
【相互作用】アゾール系抗真菌薬［CYP3A4阻害剤］，カルバマゼピン［CYP3A4誘導剤］の影響を受ける（Smith DA, et al: Br J Clin Pharmacol 67:421-6, 2009）パゾパニブの血中濃度上昇（1）
【更新日】20240921

※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。