▼スチバーガ錠　［内］

【重要度】　【一般製剤名】レゴラフェニブ水和物　Regorafenib Hydrate　【分類】抗悪性腫瘍剤［キナーゼ阻害薬］
【単位】▼40mg/錠
【常用量】1日1回160mgを食後に3週間連日投与し，1週間休薬を1クールとして投与を繰り返す［適宜40mgずつ減量し最低量は80mg］
【用法】空腹時投与，高脂肪食後の投与を避けて経口投与
【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）
【特徴】治癒切除不能な進行・再発の結腸直腸癌に適用される経口マルチキナーゼ阻害剤．血管新生，腫瘍形成，腫瘍微小環境の維持などの腫瘍の増殖や進行に関連する機序におけるキナーゼを阻害する．他の抗悪性腫瘍剤との併用の有用性は検証されていない．
【主な副作用・毒性】手足症候群，間質性肺疾患，高血圧，肝機能障害，動脈乖離，嗄声，めまい，疲労，血清電解質異常，甲状腺機能異常，発熱，感染，傾眠など
【安全性に関する情報】手足症候群のリスク因子は高齢と低アルブミン（徳丸隼平，他：医療薬学 41：687-94, 2015）
【吸収】食時により吸収率増大（1）
【F】不明（1）ラット89%未満，イヌ70%未満（1）
【tmax】4hr（1）
【代謝】CYP3A4によるM-2への代謝がメイン（1）活性代謝物M-2とM-5がありCYP3A4が関与（1）M-2とM-5は定常状態で未変化体と同程度の曝露となる（1, Strumberg D, et al: Br J Cancer 106: 1722-7, 2012））UGT1A9でグルクロン酸抱合されM-7，M-8が生成（1）活性代謝物のM-2とM-5はBCRPおよびP-gpの基質である（1）
【排泄】尿中回収率19%で主に未変化体のグルクロン酸抱合体のM-7（1）未変化体として47%が糞便中に回収（1）腸肝循環する（1）
【CL/F】3.08L/hr（1）
【t1/2】27hr（1）未変化体：26～28hr，M2：25hr，M5：51～64hr（Strumberg D, et al: Br J Cancer 106: 1722-7, 2012）
【蛋白結合率】99.5%［Alb］（1）
【Vd/F】93L/man（1）
【MW】500.83
【透析性】資料なし（1）透析されないと思われる（5）
【O/W係数】LogP=5.2［1-オクタノール/水系］（1）
【相互作用】CYP3A4誘導剤，阻害剤の影響を受ける（1）BCRPの基質薬物であるロスバスタチンのAUC増大（1）
【主な臨床報告】日本人での第1相試験（Sunakawa Y, et al: Invest New Drugs 32: 104-12, 2014）
【更新日】20240305

※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。