▼ゼルボラフ錠　［内］

【重要度】　【一般製剤名】ベムラフェニブ　Vemurafenib　【分類】抗悪性腫瘍剤［BRAF 阻害剤］
【単位】▼240mg/錠
【常用量】1 回 960mg を 1 日 2 回
【用法】1 日 2 回経口
【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】BRAF V600 キナーゼを選択的に阻害することにより抗腫瘍効果を発揮する分子標的薬で，BRAF 遺伝子変異を有する根治切除不能な悪性黒色腫に適用される．
【主な副作用・毒性】二次発癌，アナフィラキシー，過敏症，SJS，TEN，薬剤性過敏症症候群，QT 延長，肝不全，急性腎障害，皮膚障害，回転性めまい，眼障害，関節痛，筋骨格痛，血球減少，呼吸困難，消化器症状など多数．
【安全性に関する情報】棘細胞癌，皮膚以外の部位に扁平上皮癌，QT 間隔延長，肝不全，光線過敏症，ブドウ膜炎等の重篤な眼障害などをチェック（1）
【吸収】高脂肪食は Cmax を 2 倍，AUC を 3 倍に上昇させる［半減期は変わらない］（Ribas A, et al: J Clin Pharmacol 54: 368-74, 2014）
【F】資料なし（1）ラット 10%，イヌ 40%（1）
【tmax】4～6hr（1）
【代謝】肝代謝され，M3 への代謝には CYP3A4 が主に関与（1）
【排泄】尿中回収率 1%未満，糞便中回収率 94%であり，ほとんぼ胆汁排泄される（1）
【CL/F】29.3L/day［20.3mL/min］（1）ほぼ肝クリアランスで消失（Zhang W, et al: Clin Pharmacokinet 2017 PMID: 28255850）
【t1/2】単回 10～15hr，反復 60hr（1）57hr で，定常状態まで 2～3 週間（Zhang W, et al: Clin Pharmacokinet 2017 PMID: 28255850）
【蛋白結合率】99%以上（1）
【Vd/F】90.9L/man（1）P-gp と BCRP 阻害剤により消化管吸収や脳内移行が改善して脳転移例での効果増強が望める可能性（Durmus S, et al: Mol Pharm 9: 3236-45, 2012）
【MW】489.92
【透析性】資料なし（1）除去されないと思われる（5）
【薬物動態】240～960mg までは線形（Grippo JF, et al: Cancer Chemother Pharmacol 73: 103-11, 2014）
【O/W 係数】LogP=3.0（1）
【相互作用】CYP3A4 を誘導し，CYP1A2，2C9 を阻害する（1）CYP1A2 の基質薬物の血中濃度上昇の可能性（1）CYP3A4 誘導剤により血中濃度低下（1）CYP1A2 の基質であるチザニジンの血中濃度上昇（Zhang W, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2020 PMID: 32311241）
【肝障害患者における情報】重度の肝機能障害のある患者では安全性が確立しておらず慎重投与（1）
【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。