▼メキニスト錠　［内］

【重要度】　【一般製剤名】トラメチニブ ジメチルスルホキシド付加物　Trametinib Dimethyl Sulfoxide　【分類】抗悪性腫瘍剤［MEK 阻害剤］
【単位】▼0.5mg・▼2mg/錠
【常用量】1 回 2mg，1 日 1 回［適宜 0.5mg 単位で減量］■ダブラフェニブと併用
【用法】1 日 1 回空腹時に経口投与
【透析患者への投与方法】おそらく減量の必要はない（5）
ダブラフェニブと併用で常用量を適用した転移性メラノーマの HD 症例（Hayakawa K, et al: Int J Dermatol 2021 PMID: 33165909）
【保存期 CKD 患者への投与方法】中等度腎機能障害患者までは PK に影響しない（Ouellet D, et al: Cancer Chemother Pharmacol 2016 PMID: 26940938）
【その他の報告】おそらく減量の必要はない（5）
【特徴】マイトジェン活性化プロテインキナーゼ（MAPK）シグナル伝達経路におけるマイトジェン活性化細胞外シグナル関連キナーゼ（MEK1/MEK2）の活性化及びキナーゼ活性を阻害する．BRAF 阻害剤との併用により，BRAF 阻害剤の耐性獲得抑制による抗腫瘍効果の持続が期待され，ダブラフェニブと併用にて適用される．
【主な副作用・毒性】発熱，心機能障害，肝機能障害，間質性肺炎，横紋筋融解症，深部静脈血栓症，脳血管障害，蜂巣炎，尿路感染，血球減少，食欲不振，低 Na 血症，浮動性めまい，頭痛，網膜静脈閉塞，網膜色素上皮剥離，霧視，視力障害，高血圧，出血，QT 延長，咳，消化器症状，腎不全，皮膚障害，筋肉痛，関節痛など多数
【安全性に関する情報】高頻度な副作用は，皮膚炎，ざ瘡，下痢であり，用量規制毒性は，発疹，下痢，網膜炎（Infante JR, et al: Lancet Oncol 2012 PMID: 22805291）光毒性を有する可能性（1）
【吸収】食事により吸収率が低下するので，食事の 1hr 前か食後 2 時間後に内服が望ましい（Cox DS, et al: J Clin Pharmacol 53: 946-54, 2013 PMID: 23893461）
【F】72.3%［po］で初回通過効果は軽度（1, Leonowens C, et al: Br J Clin Pharmacol 78: 524-32, 2014 PMID: 24606567）
【tmax】1hr（1）
【代謝】カルボキシルエステラーゼにより脱アセチル化され，わずかに CYP3A4 でも代謝（1）
【排泄】尿中回収率 9%［10 日まで］（1）P-gp，BSEP の基質（1）
【CL】3.21L/hr［iv］で QH の 1%（1, Leonowens C, et al: Br J Clin Pharmacol 2014 PMID: 24606567）
【t1/2】83hr（1）11 日（Leonowens C, et al: Br J Clin Pharmacol 2014 PMID: 24606567）
【蛋白結合率】96.3～98.6%（1）
【Vd】1060L/man（1）976L/man（［iv］Leonowens C, et al: Br J Clin Pharmacol 78: 524-32, 2014 PMID: 24606567）
【MW】693.53
【透析性】資料なし（1）透析除去されないと考えられる（1）透析されないと思われる（5）
【TDM のポイント】トラフ 10ng/mL 以上と有効性が関連（Ouellet D, et al: Cancer Chemother Pharmacol 2016 PMID: 26940938）
【O/W 係数】LogP=4.99（1）
【肝障害患者への投与方法】中等度以上の肝機能障害患者では AUC が増大するおそれがあり慎重投与（1）
【小児 CKD 患者における報告】
【妊婦・授乳婦への投薬】妊婦には投与しない（1）授乳は避ける（1）
【主な臨床報告】
【更新日】20240718

※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。