

▼ジカディアカプセル・▼錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】セリチニブ ceritinib 【分類】抗悪性腫瘍剤 [TKI]

【単位】▼150mg/Cap・錠

【常用量】450mg/日 [適宜減量] ■減量, 中止基準あり, 最小150mg/日

【用法】1日1回食後

【透析患者への投与方法】おそらく減量の必要はない (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】おそらく減量の必要はない (5)

【特徴】未分化リンパ腫キナーゼ (ALK) 阻害剤。クリゾチニブに抵抗性又は不耐容の ALK 融合遺伝子陽性の切除不能な進行・再発の非小細胞肺癌に適用。

【主な副作用・毒性】間質性肺炎, 肝機能障害, QT 延長, 徐脈, 高度な下痢, 高血糖, 糖尿病, 肺炎, 感染症, 貧血, 視力障害, 肝機能障害, 腎機能障害, 発疹, 疲労, 食道障害, 悪心, 嘔吐, 下痢など

【安全性に関する情報】リパーゼ上昇, 肝機能障害が用量規制因子. 悪心が95%に下痢と嘔吐が75%に出現 (Nishio M, et al: J Thorac Oncol 10: 1058-66, 2015 PMID: 26020125)

【吸収】食後投与で Cmax, AUC 増大 (1) ka=0.4/hr (1) 食事の内容にかかわらず, 食事により AUC が増大 (Lau YY, et al: J Clin Pharmacol 56: 559-66, 2016 PMID: 26272586)

【F】資料なし (1)

【tmax】5~6hr (1)

【代謝】肝代謝される (1) CYP3A が関与 (1) 一次代謝経路は一酸素付加, O-脱アルキル化及びN-ホルミル化で, 一次代謝物を含む二次代謝経路は, グルクロン酸抱合及び脱水素化 (1)

【排泄】尿中回収率1.3%で未変化体としては排泄されない (1) 糞便中に91%が回収され, 68%は未変化体 (1) P-gp の基質 (1)

【CL/F】50~279L/hr [po] (1) 体重と肝機能が CL (ss) の共変量 (1)

【t1/2】22~33hr (1)

【蛋白結合率】97.2% (1)

【Vd】BBB を通過 [ラット] (1) 3170L/man (1)

【MW】558.14

【透析性】資料なし (1) 除去されないと思われる (5)

【薬物動態】300~750mg の範囲で線形動態 (Nishio M, et al: J Thorac Oncol 10: 1058-66, 2015 PMID: 26020125)

【O/W 係数】4.6 [1-オクタノール/水系] (1)

【相互作用】QT 延長, 徐脈を起こす薬剤との併用注意 (1) CYP3A4 阻害剤および誘導剤との併用注意 (1) CYP3A4 を強く阻害し, CYP2C9 を阻害する (1) トリアゾラムと併用禁忌 (1)

【備考】以前は750mg 空腹時投与であったが, 消化器症状のため450mg 食後投与に再設定された (2019..2)

【更新日】20221208

※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。