▼ローブレナ錠　［内］

【重要度】　【一般製剤名】ロルラチニブ　Lorlatinib　【分類】抗悪性腫瘍剤［TKI］
【単位】▼25mg・▼100mg/錠
【常用量】1日1回100mg■副作用グレードにより減量基準あり
【用法】1日1回
【透析患者への投与方法】減量考慮（1）
【保存期CKD患者への投与方法】eGFR＜30： 減量考慮（1）
重度腎障害時（平均eGFR20）には未変化体のAUCが41%増大するため75mgに減量を推奨（Lin S, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokinet 2022 PMID: 35018553）
【特徴】未分化リンパ腫キナーゼ（ALK）の受容体チロシンキナーゼに対する選択的ATP競合性低分子TKI. ALKチロシンキナーゼ阻害剤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】高コレステロール血症，間質性肺炎，QT延長，認知障害，言語障害，膵炎，肝機能障害，めまい，筋肉痛，関節痛，徐脈，心ブロック，下痢，便秘，嘔吐，視覚障害，浮腫，脱毛など
【安全性に関する情報】生体曝露量はコレステロール上昇などの有害作用と関連するかもしれない（Chen J, et al: Clin Pharmacol Ther 2021 PMID: 33973232）
【吸収】食事の影響を受けず，PPI併用時も問題なし（Xu H, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2021 PMID: 34288547）
【F】81%（Hibma JE, et al: Cancer Chemother Pharmacol 2022 PMID: 34698901）
【tmax】
【代謝】酸化及びグルクロン酸抱合により代謝（1, Stypinski D, et al: J Clin Pharmacol 2020 PMID: 32441835）CYP3AおよびUGT1A4が関与（1）代謝物に活性はない（1）反復投与により自己代謝酵素を誘導する（Chen J, et al: Clin Pharmacokinet 2021 PMID: 33937954）
【排泄】尿中未変化体排泄率1%未満［po，168hrまで］（1）尿中回収率47.7%，糞便中回収率40.9%［po，288hrまで］（1）糞便中に未変化体として9.1%回収（1）
【CL】単回9.04L/hr，反復時は自己代謝酵素誘導により約1週間後に14.5L/hr（Chen J, et al: CPT Pharmacometrics Syst Pharmacol 2021 PMID: 33449423）
【t1/2】21hr（1）
【蛋白結合率】66%（1）
【Vd】305L/man［iv］（1）脳内移行はP-gpにより制限されている（Li W, et al: Int J Cancer 2018 PMID: 29744867）P-gp阻害剤により脳内移行が増大［マウス］（Li W, et al: Eur J Pharm Biopharm 2019 PMID: 30660696）Vc 121L/body（Chen J, et al: CPT Pharmacometrics Syst Pharmacol 2021 PMID: 33449423）
【MW】406.41
【透析性】一部除去されるが効率的ではないと思われる（5）
【O/W係数】LogP=2.45［1-オクタノール/水，pH9］（1）
【相互作用】リファンピシンと併用禁忌（1）CYP3A4を誘導する（1）AUCが増大するため強力なCYP3A4阻害剤との併用は避けるべき（Patel M, et al: Invest New Drugs 2020 PMID: 31728714）
【肝障害患者への投与方法】
【小児CKD患者における報告】
【妊婦・授乳婦への投薬】
【主な臨床報告】
【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。