

▼エザルミア錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 バレメトスタット トシル酸塩 Valemetostat Tosilate 【分類】

【単位】 ▼50mg・▼100mg/錠

【常用量】 200mg/日 [適宜減量]

強い、CYP3A 阻害剤又は P-gp 阻害剤と併用する場合の減量基準あり

【用法】 1 日 1 回、空腹時投与 [食事 1 時間前から食後 2 時間までの服用を避ける]

【透析患者への投与方法】

【保存期 CKD 患者への投与方法】 常用量 (1) AUC は AAG の影響を受ける (1)

【特徴】 ヒストン等のメチル基転移酵素である EZH1/2 の酵素活性に対する阻害作用を有し、EZH1/2 のメチル化活性を阻害することでヒストン H3 アミノ酸のメチル化を阻害することで腫瘍増殖抑制作用を示す。

【主な副作用・毒性】 骨髄抑制、感染症、脱毛症、味覚異常、皮膚症状、肝機能障害など

【安全性に関する情報】

【吸収】 食後投与により吸収率低下 [AUC 比 0.47~0.70] (1)

【F】 71% [イヌ] (1)

【tmax】

【代謝】 CYP3A4/5 によって代謝、一部 2C8 が関与 (1) 主代謝物には弱い活性あり (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 10%、尿中回収率 15.6% [po, 360hr まで] (1)

P-gp の基質、MATE1 及び MATE2-K の基質、MATE1 を阻害 (1)

【CL/F】 20~35L/hr (1)

【t1/2】 20~23hr (1)

【蛋白結合率】 94~95% [主に AAG] (1)

【Vd】 592L/body (1)

【MW】 660.22 [salt]

【透析性】

【O/W 係数】 1-オクタノール/水 : 4.3 (水相の pH10.8)

【相互作用】 CYP3A4, P-gp 阻害剤との相互作用あり (1)

【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】 20231205

※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。