▼ロズリートレクカプセル　［内］

【重要度】　【一般製剤名】エヌトレクチニブ　Entrectinib　【分類】抗悪性腫瘍剤［TKI］
【単位】▼100mg・▼200mg/Cap
【常用量】1日1回600mg［適宜減量］
【用法】1日1回
【透析患者への投与方法】PKからは常用量（5）
【保存期CKD患者への投与方法】PKからは常用量（5）
【特徴】全身作用と中枢神経系作用の両方を持つTRKA/B/C，ROS1，ALKの強力かつ選択的なチロシンキナーゼ阻害剤.
【主な副作用・毒性】心臓障害，QT間隔延長，認知障害，運動失調，間質性肺疾患，味覚異常，めまい，下痢，便秘，疲労，浮腫，体重増加など多数
【安全性に関する情報】MATE1を阻害することにより，血清クレアチニンが上昇する偽性腎障害の可能性（Chen MF, et al: J Thorac Oncol 2024 PMID: 37748692）
【吸収】食事の影響を受けない（1）
【F】31～76%［animal］（1）
【tmax】3hr（1）
【代謝】CYP3A4で代謝されM5が生成（1）M5には未変化体と同等の活性あり（1）グルクロン酸抱合を受ける（1）
【排泄】尿中回収率3%［po］（1）糞便中排泄がメイン（Meneses-Lorente G, et al: Invest New Drugs 2021 PMID: 33462752）
未変化体はP-gpの基質で，M5はP-gpおよびBCRPの基質（1）
【CL/F】36.1L/hr［po］（1）
【t1/2】未変化体：18hr，M5：40hr（1）
【蛋白結合率】99%以上（1）
【Vd/F】961L/body（1）
【MW】560.64
【透析性】除去されない（5）
【O/W係数】
【相互作用】CYP3A4を阻害（1）未変化体はBCRP，OATP1B1，MATE1を阻害，M5はMATE1を阻害（1）CYP3A4阻害剤や誘導剤の影響を受けるが，代謝物M5にも活性があるため解釈に注意（5）
【主な臨床報告】
【更新日】20250527

※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。