

▼ウェリレグ錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 ベルズチファン Belzutifan 【分類】 抗悪性腫瘍剤 [HIF-2 α 阻害剤]

【単位】 ▼40mg/錠

【常用量】 120mg/日 [適宜減量]

【用法】 1日1回

【透析患者への投与方法】 設定されていないが、PKに大きな影響はない (1) 貧血の進行に対してはESAを選択 (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 AUCにおいてeGFRは有意な共変量ではない (1, Marathe DD, et al: CPT Pharmacometrics Syst Pharmacol 2023 PMID: 37596839) 貧血の進行に対してはESAを選択 [HIF-PHiを使用しない] (5)

【特徴】 低分子低酸素誘導因子 (HIF) -2 α の阻害剤。

通常、フォン・ヒッペル・リンドウ (VHL) 蛋白がHIF-2 α を分解するが、機能喪失のあるフォン・ヒッペル・リンドウ病ではHIF-2 α が過度に安定化された結果、血管新生、増殖及び腫瘍代謝に関連する低酸素下で誘導される遺伝子が過剰発現する。本剤は、HIF-2 α とARNTのヘテロ二量体形成を選択的に阻害してVHL蛋白の機能が喪失している状態において低酸素下で誘導される遺伝子の転写を阻害する。また、HIF経路の活性化が腫瘍の増殖・進展に関与している腎細胞癌にも適用される。当然、特にRCCにはHIF-PH阻害薬は使用してはならない。

【主な副作用・毒性】 貧血 (EPO投与を検討)、低酸素症、疲労、悪心、無力症、関節痛、皮膚障害、霧視、動悸、呼吸困難など

【安全性に関する情報】 UGT2B17及びCYP2C19の両酵素がPMの場合にAUCが増大し、休業に至った有害事象、Grade 3以上の貧血及びESAの投与を要する貧血の発現割合の増加が認められた (1)

【F】 不明も糞便中に未変化体は微量 (1)

【tmax】 2hr (1)

【代謝】 UGT 2B17及びCYP2C19により代謝 (1) 主代謝物はO-グルクロン酸抱合体 (M16) で活性はない (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 6% [po] (1) 尿中回収率 49.6%で、主にM16 (1)

【CL/F】 5.89L/hr (1)

【t1/2】 CYP2C19のEM14.1hr, IM17.6hr, PM25.0hr (1)

【蛋白結合率】 45% (1)

【Vd/F】 120L/body (1)

【MW】 383.34

【透析性】 わずかに除去の影響がある程度 (1)

【O/W係数】 LogD=2.2 [pH7.0] (1)

【相互作用】 CYP3A4を誘導 (1) UGT2B17, OCT1, MATE1/2-Kを阻害 (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】 20250729

※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。