

ボスチニブ Bosutinib

●ボシュリフ(ファイザー)

錠：100mg

[特]Abl及びSrcチロシンキナーゼ阻害薬。
(血小板由来増殖因子受容体(PDGFR),
Kitチロシンキナーゼ阻害作用は弱い)。

b.イマチニブ耐性の変異型Bcr-Ablチロ
シンキナーゼ16種類に対し阻害活性。

[効]他剤で無効又は副作用で中止の
慢性骨髄性白血病。

後者の場合、経過観察し副作用に注意。

[用] a.1日1回500 mgを食後内服。

最大：1日1回600 mg。

b.他の抗癌薬との併用は未承認。

c.肝機能障害は、減量

(Cmax1.5～2倍上昇のため)

d.中等度以上の腎機能へは、減量

(血中濃度上昇)

e.次の場合：増量できる。

・重篤な副作用(グレード3以上)がない。

・8週投与で血液学的効果不十分。

・12週投与で細胞遺伝学的効果不十分。

f.副作用による休薬、減量又は

中止基準は添付文書参照。

[体内動態] a.ピークは4時間。

b.空腹時：Cmax67%へ低下。

[禁] 1.車の運転危険作業

(浮動性めまい、視力障害、疲労等)

2.妊婦、3.授乳を禁止。

[慎] 1.心疾患又はその既往→悪化。

QT間隔延長に注意。

2.他のチロシンキナーゼ阻害薬に不耐容。

3.高齢。

[注] 1.肝機能を検査：

最初の2ヵ月は2週毎、3ヵ月目は1回。

2.骨髄抑制のため、血液検査：開始前、

最初の1ヵ月は1週毎、以後1ヵ月毎、

3.体液貯留のため：急激な体重増加、

呼吸困難等は中止→利尿剤投与。

4.投与開始前及び投与中は腎機能検査。

[併] A.禁：プロトンポンプ阻害薬：

胃内pH上昇→吸収低下のため。

B.慎：

a.CYP3A阻害作用：イトラコナゾール、

ケトコナゾール、フルコナゾール、

ボリコナゾール、

クラリスロマイシン、エリスロマイシン、

リトナビル、

ジルチアゼム、ベラパミル、

イマチニブ、アプレビタント、

トフィソパム、シプロフロキサシン、

グレープフルーツで→血中濃度上昇。

b.CYP3A誘導作用：フェニトイン、

カルバマゼピン、リファンピシン、

リファブチン、フェノバルビタール、

ボセンタン、エファビレンツ、

モダフィニル、エトラビルン、セイヨ

ウオトギリソウで→血中濃度低下。

[副 100%] A.重大：a.●骨髄抑制57%

b.肺炎、●肝機能障害60%、c.肺炎3%

d.●重度の下痢12%、e.●体液貯留9%

f.ショック、アナフィラキシー

f.●心障害6%、g.●感染症36%

h.●出血15%、i.間質性肺炎患、j.腎不全、

k.肺高血圧症、l.腫瘍崩壊症候群。

D.●発疹49%、●そう痒9%、●脂漏性

皮膚炎7%、●ざ瘡6%、湿疹、皮脂欠乏性

湿疹、白斑、光過敏症、脱毛、薬疹、皮膚乾

燥、紅斑、過角化、色素沈着、全身紅斑、手

足症候群、爪破損、丘疹、皮膚色素減、蕁

麻疹、多形紅斑、剥脱性発疹、●頭痛6%

、傾眠、不安、味覚異常、不眠、肋間神経痛、

錯覚、ニューロパチー、白質脳症、高

血圧、浮腫、末梢冷感、●気管支炎6%、毛

包炎、膀胱炎、感染、帯状疱疹、瘋風、百日

咳、呼吸器感染、結膜炎、眼乾燥、結膜充

血、難聴、メニエール病、視神経乳頭浮

腫、網膜色素沈着、めまい、耳鳴、咳嗽、発

声障害、鼻閉、口腔咽頭痛、鼻漏、呼吸困

難、呼吸不全、心拡大、僧帽弁閉鎖不全、

心室性期外収縮、心膜炎、●リンパ球減

31%、●好酸球増6%、フィブリノゲン

増、INR減、INR増、プロトロンピン時間

延長～短縮、白血球増、発熱性好中球

減、●下痢93%、●悪心36%、●嘔吐36%

、●腹痛5%、●口内炎14%、●胃炎9%、●

便秘6%、●消化不良6%、●歯肉炎5%

、腹部膨満、肛門痛、口内乾燥、食道炎、歯

周炎、腹部不快、裂肛、口唇炎、消化管び

らん、舌炎、口腔内白斑、便潜血、歯痛、鼓

腸、●食欲減退22%、●低燐酸血症19%

、●アルブミン↓5%、●Ca減、K↓、Na減、

高脂血症、総蛋白↓、アルブミン↑、Ca

↑、Cl↓、コリンエステラーゼ↓、脱水、

高血糖、抗利尿ホルモン不適合分泌、高

K血症、●リパーゼ↑20%、●アマラー

ゼ↑7%、アマラーゼ↓、●クレアチニ

ン↑11%、●腎機能障害5%、BUN↑、尿

糖、尿蛋白、尿比重異常、尿酸↑、●クレ

アチンホスホキナーゼ↑9%、クレア

チンホスホキナーゼ↓、背部痛、筋肉

痛、関節痛、筋力低下、変形性関節症、骨

壊死、骨痛、●疲労11%、●発熱14%、●体

重減12%、LDH増、胸痛、血尿、インフル

エンザ、感覚消失、膀胱癌、悪寒、薬物過

敏症、耳新生物、覆汗、胸膜炎、関節リウ

マチ、結膜出血、鼻出血、咯血、皮下出血、

無力、疼痛