

## a1. チロシンキナーゼ阻害薬

オシメルチニブメシル酸塩  
Osimertinib Mesilate

●タグリッソ(アストラゼネカ)

錠: 40mg, 80mg.

[警告] 1. 専門医療施設で専門医が対応。患者・家族に十分な説明と同意。

2. 間質性肺疾患で死亡例、合併既往歴がないか事前に胸部CT検査、問診。

[特] 上皮成長因子受容体(EGFR)のT790M遺伝子変異及び活性化変異の選択的かつ不可逆的EGFRチロシンキナーゼ阻害薬。

[効] a. EGFRチロシンキナーゼ阻害薬に抵抗性のEGFR T790M変異陽性の手術不能又は再発非小細胞肺癌。

b. EGFR T790M変異陽性に限る。

c. 術後補助化学療法は未承認。

[用] a. 80mgを1日1回、適宜減量(40mg)。

b. 抗癌薬との併用は未承認。

c. 副作用時の休業、減量又は中止基準は添付文書参照。

[体内動態] a. ピークは6時間、半減期は48時間

b. 主にCYP3A, CYP3A5で代謝, BCRPを阻害。

c. 食事の影響はない。

d. 尿へは2%排泄。

[真] 1. 間質性肺疾患, その既往→死亡例。特に投与12週は注意。

2. 中等度又は重度の肝機能障害。

3. QT間隔延長, その既往→QT間隔延長。

[禁] 1. 妊婦,

2. 投与終了後一定期間は男女とも避妊。

3. 授乳中は投与禁, 又は授乳を中止

[併] B. 慎: a. CYP3A誘導剤(フェニトイン, リファンピシン, カルバマゼピン, SJW等)で血中濃度低下→効果減弱。

リファンピシンで70%低下。

b. BCRPの基質(ロスバスタチン, サラゾスルファピリジン等)の

血中濃度上昇→副作用。

c. QT延長薬(キニジン, プロカインアミド, オンダンセトロン, クラリスロマイシン等)でQT間隔延長。

[副] 86%**A. 重大**: a. ●間質性肺疾患2%

b. ●QT延長2%

c. ●血小板減12%, ●好中球減8%,

●白血球減9%, ●貧血5%

d. ●肝機能障害7%

**D.** ●発疹・ざ瘡等37%, ●皮膚乾燥・湿疹等28%, ●爪の障害(爪囲炎を含む)28%, ●そう痒症11%, 脱毛, 手掌・足底, 発赤知覚不全, 皮膚剥脱皮膚潰瘍,

毛髪障害, 毛質異常, 多毛, 爪毒性, 爪痛,

皮膚疼痛, 皮膚変色, 皮膚感染, 皮膚反応, 皮膚囊腫, 蕁麻疹, 黄色板腫, 脂欠乏性湿疹, 過角化, 斑, 類天疱瘡, 光線過敏, 毛細血管拡張症, 蜂巣炎, 裂傷, 皮膚擦過傷, メラノサイト性母斑, ●下痢36%, ●口内炎20%, 嘔吐, 食欲不振, 便秘, 口内乾燥, 腹痛, 胃食道逆流, 口唇炎, 口唇びらん, 舌痛, 口腔知覚不全, 腹部膨満, 上部消化管炎症, 消化不良, 腹部不快感, 心窩部不快感, 食道痛, 胃腸炎, 呼吸臭, 便意切迫, 肛門周囲痛, 痔出血, 放屁, リンパ球減, 活性化部分トロンボプラスチン時間延長, 内出血増加傾向, 播種性血管内凝固, 汎血球減, 脾臓梗塞, 味覚異常, 頭痛, めまい, 末梢性ニューロパチー, 末梢性感覚ニューロパチー, 感覚鈍麻, 振戦, 脳梗塞, 回転性めまい, 体位性めまい, 記憶障害, 異常感覚, 構語障害, 知覚過敏, 眼乾燥, 結膜炎, 霧視, 眼瞼炎, 角膜炎, 黄斑浮腫, 網膜出血, 眼感染, 白内障, 流涙増加, 眼刺激, 羞明, 視力低下, 視力障害, 夜盲, 眼そう痒症, 眼精疲労, 眼の異物感, 呼吸困難, 鼻乾燥, 気管支炎, 肺感染, 細菌性肺炎, 肺塞栓症, インフルエンザ, 鼻出血, 鼻漏, 鼻の炎症, 鼻咽頭炎, 咽頭炎, 鼻炎, 鼻粘膜障害, 咽頭出血, 咽頭潰瘍, 咽喉乾燥, 喉頭痛, 気胸, 気縦隔症, 胸膜炎, 咳嗽, 湿性咳嗽, 労作性呼吸困難, しゃっくり, 発声障害, 駆出率減少, 動悸, 非心臓性胸痛, 房室ブロック, クレアチニン↑, 頻尿, 尿路感染, 膀胱炎, 排尿困難, 血尿, 腎結石症, 腎機能障害, ●疲労6%, 無力症, 発熱, ほてり, 末梢性浮腫, 悪寒, 四肢腫瘍, 倦怠感, 顔面浮腫, 筋痙縮, 関節痛, 筋肉痛, 四肢痛, 背部痛, 筋骨格痛, 頸部痛, 筋骨格硬直, 後天性鉤爪趾, 骨盤痛, 骨感染, 外耳炎, 乳頭炎, 脱水, 高血糖, 高K血症, 低K血症, 低リン酸血症, 高コレステロール血症, うつ病, 錯乱状態, 幻覚, 易刺激性深部静脈血栓症, 静脈炎, 高血圧, 外陰腫痛, 体重減少, ALP↑, 低アルブミン血症, 低Ca血症, 低ナトリウム血症, 血中クレアチニンホスホキナーゼ↑, 高リパーゼ血症, アミラーゼ↑, 血中コレステロール↑。