

a3. BRAF V600キナーゼ阻害薬関連

トラメチンブジメチルスルホキシド付加物
Trametinib Dimethyl Sulfoxide

●メキニスト(ノバルティス)

錠：0.5mg, 2mg.

[警告] 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。

[特・効・用] → ダブラフェニブ。

[特] 0.5mg錠と2mg錠で吸収率同等でない。
相互に混用しないこと。

[体内動態] a. ピークは0.97時間,
半減期は82時間。

b. 21日連続投与でCmax7.82→32.5ng/mL
と4倍上昇。

c. 高脂肪・高カロリー食でCmax70%低下。

d. 主にカルボキシエステルで脱
アセチル化、わずかにCYP3A4で代謝。

[慎] 1. 中等度以上の肝機能障害。

2. 心疾患又はその既往→症状悪化。

[注] 1. 重篤な眼障害：網膜静脈閉塞、
網膜色素上皮剥離、網膜剥離等

→定期的検査、異常時は受診。

2. 高頻度の発熱、重度の脱水、低血圧

→減量、休薬、解熱薬の投与。

[禁] 1. 妊婦。

2. 投与終了後一定期間は避妊。

3. 授乳は中止。

[併] CYP2C8, 2C9, 2C19を阻害。

Pgp, BSEPの基質, Pgp, BCRP, OATP1B1,
OATP1B3, OAT1, OAT3, MATE1を阻害。

・本剤でダブラフェニブの

Cmax及びAUCは16及び23%増加。

[副] 100%] A. 重大：a. 心障害：心不全,
左室機能不全、●駆出率減少6%。

b. 肝機能障害：●ALT9%, AST9%。

c. 間質性肺疾患, d. 横紋筋融解症,

e. 深部静脈血栓、肺塞栓。

f. 脳血管障害：脳出血、脳血管発作。

D. <ダブラフェニブとの併用>

ダブラフェニブ(タフィンラー) → ■頁
<単剤>

蜂巣炎、●毛包炎9%、●爪囲炎9%、●膿

疱性皮疹5%、貧血、脱水、網膜静脈閉塞、

網膜色素上皮剥離、眼窩周囲浮腫、霧

視、視力障害、視神経乳頭浮腫、網脈絡

膜症、網膜剥離、視力低下、心拍数減少、

QT/QTc間隔延長、高血圧、リンパ浮腫、

出血(鼻出血、歯肉出血等)、徐脈、咳嗽、呼

吸困難、膀胱炎、●下痢33%、●悪心13%、●

嘔吐6%、●便秘7%、腹痛、●口内乾燥8

%、●口内炎5%、ALP増加、●発疹56%、

●ざ瘡様皮膚炎18%、●皮膚乾燥11%、

●脱毛症15%、●そう痒症9%、紅斑、手

掌・足底発赤知覚不全症候群、皮膚亀

裂、ひび・あかぎれ、血中CK(CPK)増加、
●疲労18%、●末梢性浮腫15%、発熱、顔
面浮腫、●粘膜の炎症6%、無力症、過敏
症