

DI 委員会トピックス

タイトル

抗悪性腫瘍剤 ロンサーフ配合錠について

ロンサーフは、トリフルリジン (FTD) とチピラシル塩酸塩 (TPI) を 1 : 0.5 のモル比で配合した新規経口ヌクレオシド系抗悪性腫瘍剤です。

・FTD はロンサーフの抗癌活性成分であり、腫瘍内の DNA に取り込まれて抗腫瘍効果 (複製時にチミジンの代わりに直接 DNA 鎖に取り込まれ、DNA の機能障害を引き起こす) を示すと考えられています。

・TPI は FTD の分解酵素であるチミジンホスホリラーゼ (TPase) の特異的阻害剤であり、TPI の配合により、FTD のバイオアベイラビリティを高めます。

なお、FTD は細胞分裂が活発な骨髄などにも取り込まれ、骨髄抑制を起こします。

(効能・効果)

治癒切除不能な進行・再発の結腸・直腸癌 (標準的な治療が困難な場合に限る)

<効能・効果に関連する使用上の注意>

1. 検証的な試験成績は得られていない。
2. ロンサーフ錠の一次治療及び二次治療としての有効性及び安全性は確立していない。
3. ロンサーフ錠の術後補助化学療法における有効性及び安全性は確立していない。
4. 臨床試験に組み入れられた患者の前治療歴について、「臨床成績」の項の内容を熟知し、本剤の有効性及び安全性を十分理解した上で、本剤以外の治療の実施についても慎重に検討し、適応患者の選択を行うこと。

<用法・用量>

通常、成人には初回投与量 (1 回量) を体表面積に合わせてトリフルリジンとして約 $35\text{mg}/\text{m}^2$ 回、朝食後及び夕食後に 1 日 2 回 5 日間連続経口投与したのち 2 日間休薬をし、これを 2 回繰り返したのち 14 日間休薬します。1 コースは 28 日間として投与を繰り返します。1 日目の夕食後より投与を開始した場合は、6 日目の夕食後より休薬となります。

<投与スケジュール>



重篤な副作用が発現するおそれがあるため、必ずロンサーフを 2 日間休薬

1 コース (28 日間)

- ・他の抗悪性腫瘍剤との併用について、有効性及び安全性は確立していない。
- ・空腹時に本剤を投与した場合、食後投与と比較してトリフルリジン（FTD）の Cmax の上昇が認められることから、空腹時投与を避けること。

国内臨床試験における副作用発現率は 96.6%（115/119 例）でした。主な副作用は、白血球減少 76.5%（91 例）、好中球減少 73.1%（87 例）、ヘモグロビン減少 63.9%（76 例）、悪心 63.0%（75 例）、食欲減退 55.5%（66 例）、疲労 52.9%（63 例）、血小板減少 41.2%（49 例）、リンパ球減少 33.6%（40 例）、下痢 33.6%（40 例）、赤血球減少 31.9%（38 例）、嘔吐 28.6%（34 例）、ヘマトクリット減少 28.6%（34 例）、血中ビリルビン増加 19.3%（23 例）、感染症 15.1%（18 例）、口内炎 15.1%（18 例）でした（承認時）。

重大な副作用として、骨髄抑制、感染症、間質性肺疾患があらわれることがあります。

参考資料

大鵬薬品工業株式会社ホームページ

<http://www.taiho.co.jp/>