

## アファチニブマレイン酸塩

Afatinib Maleate

## ●ジオトリフ(ベアリンガー)

錠：20mg,30mg,40mg,50mg.

## 【警告】間質性肺疾患で死亡例：

- a.初期症状(呼吸困難,咳嗽,発熱等),  
服用中の注意事項,死亡例等を  
患者に十分説明・同意を得て投与.  
b.胸部画像を定期的に検査,  
初期症状を確認→異常時は中止.

【特】a.ゲフィチニブ,エルロチニブは  
EGFRの可逆的阻害薬,本剤はErbB  
ファミリー(EGFR,HER2,ErbB4等)  
のチロシンキナーゼ領域でのATP結  
合部位に不可逆的・選択的にその  
リン酸化を阻害→血中濃度が低下し  
てもキナーゼ活性を持続的阻害.  
b.無増悪生存期間(中央値)は本剤群で  
11.1カ月,PEM+CDDP群で6.9カ月.  
【効】EGFR遺伝子変異陽性の

手術不能又は再発非小細胞肺癌  
・但し,術後補助化学療法,抗癌薬と  
併用は未承認.

- 【用】a.1日1回40mgを空腹時服用  
(食事の1時間前～食後3時間は回避).  
・1日1回20mgで忍容性のない場合中止.  
・減量後は,増量しないこと.  
・3週以上下痢,皮膚障害,口内炎,グ  
レード2以上の副作用が無い場合:  
最大1日1回50mgまで増量可.  
b.副作用発現時の休薬,減量,中止は  
添付文書参照.

【体内動態】a.血中濃度のピークは  
3～4時間,半減期は14～37時間.  
b.8日投与で定常となる.  
c.高脂肪食では:空腹時比し  
AUC及びCmaxは夫々39%,50%低下.  
d.P-糖蛋白,BCRPの基質.  
e.CYP等の代謝酵素は不関与  
→マイケル付加反応で代謝.

- 【注】1.間質性肺疾患→増悪し死亡例.  
2.重度の肝機能障害.  
3.重度の腎機能障害.  
4.投与前に心機能を確認すること:  
心不全症状→悪化.  
左室駆出率が低下→悪化.

【患】1.授乳を中止.

2.避妊させる.

【併】B.慎：a.P-糖蛋白阻害薬(リトナビ  
ル,イトラコナゾール,ペラバミル等)  
で本剤の血中濃度増加

→本剤と同時に又は本剤の後に投与.

b.P-糖蛋白誘導薬(リファンピシン,  
カルバマゼピン,セイヨウオトギリ  
ソウ等)で本剤の血中濃度低下.

【副 100%】A.重大：a.間質性肺疾患3%,  
b.●重度の下痢27%,●下痢98%●脱水  
8%,急性腎不全:

対策：止瀉薬ロペラミド補液.

c.●重度の皮膚障害22%,皮膚粘膜眼  
症候群,●全身性発疹・斑状丘疹性・  
紅斑性皮膚疹88%,●爪囲炎74%,爪障害,  
●皮膚乾燥38%,●ざ瘡19%,●そう痒  
10%,●手掌・足底発赤知覚不全症候  
群5%,●皮膚剥脱5%,●皮膚亀裂5%,  
ざ瘡様皮膚炎,ひび・あかぎれ,過角化,  
嵌入爪,色素沈着障害,皮膚色素過剰,  
皮膚潰瘍,●脱毛症7%,多毛症,膿痂疹,  
脂漏性皮膚炎,紅斑,後天性魚鱗癬,  
d.●肝不全,肝障害6%●AST,ALT↑等11%,  
e.心障害0.8%,f.消化管潰瘍・出血.

D.筋痙縮,背部痛,筋力低下,肋骨痛,肩  
痛,筋肉痛,シェーグレン症候群,開口  
障害,●味覚異常16%,頭痛,感覚鈍麻,  
振戦,末梢性感覚ニューロパチー,●  
結膜炎14%,角膜炎,●眼乾燥5%,眼脂,  
白内障,眼瞼炎,睫毛乱生,硝子体剥離,  
結膜出血,角膜ひらん,後天性涙腺炎,  
眼痛,眼瞼障害,虹彩毛様体炎,網膜変  
性,霧視,耳鳴,不眠症,不安,激越,●口内  
炎71%,●悪心28%,●口唇炎26%,●嘔  
吐20%,●舌炎7%,歯肉炎,口唇炎,口内  
乾燥,胃炎,腹部膨満,上腹部痛,腹痛,消  
化不良,肛門周囲痛,肛門の炎症,痔核,  
口唇乾燥,口唇腫脹,食道炎,腹部不快  
感,心窩部不快感,急性膵炎,腸炎,小腸  
炎,大腸炎,肛門周囲炎,便秘,萎縮性小  
陰腔炎,●食欲減退46%,低K血症,高尿  
酸血症,低Na血症,上室性期外収縮,高  
血圧,低血圧,ほてり,血栓症,●鼻出血  
23%,●鼻の炎症14%,発声障害,鼻漏,  
しゃっくり,口腔咽頭不快感,鼻閉,鼻  
乾燥,口腔咽頭痛,湿性咳嗽,腎機能障  
害,蛋白尿,●尿中血陽性7%,排尿困難,  
血尿,膀胱炎,蜂巣炎,毛包炎,感染症(皮  
膚,尿路,鼻,咽頭,気管支,耳,爪),真菌感  
染症(皮膚,足部),ウイルス感染,帯状疱  
疹,鼓膜炎,敗血症,●白血球減少症5%,  
リンパ球減,好中球減,好酸球増,貧血,  
鉄欠乏性貧血,●疲労25%,●粘膜の炎  
症20%,●発熱8%,●倦怠感6%,浮腫,末  
梢性浮腫,粘膜乾燥,粘膜障害,胸部不  
快感,悪寒,顔面浮腫,炎症,●体重減  
25%,血中クレアチニン↑,総蛋白減,尿  
中白血球陽性,CK(CPK)↑,血中ビリル  
ビン↑,血中乳酸脱水素酵素↑,血中尿  
素↑,血中アルブミン↓,アミラーゼ  
↑,トロポニンT↑,血中アルカリホス  
ファターゼ↑,CK(CPK)-MB↑,心電図  
T波逆転,挫傷,創し開.

【保存】湿気と光に不安定→アルミ包装  
のまま保存,開封後は湿気と光を回避.

服用直前にPTPシートから取り出す.