

細胞癌由来細胞株 (Hep 3B2.1-7、LIXC-012及びPLC/PRF/5)、肝細胞癌患者由来腫瘍組織片 (LI0050及びLI0334)、ヒト胸腺癌由来細胞株 (Ty-82) 及びマウス腎細胞癌由来細胞株 (RAG) を移植したマウスにおいて、腫瘍増殖抑制作用を示した^{21)~24)}。

19. 有効成分に関する理化学的見聞

一般名：レンバチニブメシル酸塩 (Lenvatinib Mesilate)

化学名：4-{3-Chloro-4-[(cyclopropylcarbamoyl)amino]phenoxy}-7-methoxyquinoline-6-carboxamide monomethanesulfonate

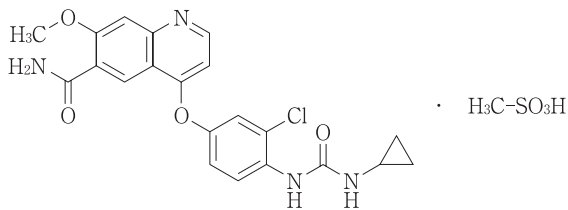
分子式：C₂₁H₁₉ClN₄O₄・CH₄O₃S

分子量：522.96

性状：レンバチニブメシル酸塩は白色～うすい帯赤黄色の粉末である。

本品は水、メタノール又はN-メチルピロリドンに溶けにくく、エタノール (99.5) にほとんど溶けない。

構造式：



融点：221~224℃ (分解)

分配係数：log P=3.30 (1-オクタノール/水系)

21. 承認条件

医薬品リスク管理計画を策定の上、適切に実施すること。

22. 包装

〈レンビマカプセル4mg〉

20カプセル [10カプセル (PTP) ×2]

〈レンビマカプセル10mg〉

20カプセル [10カプセル (PTP) ×2]

23. 主要文献

- * * 1) NDBを用いた調査結果の概要 (VEGF/VEGFR阻害作用を有する薬剤の動脈解離に関するリスク評価) : <https://www.pmda.go.jp/files/000266521.pdf>
- 2) 社内資料：固形がん患者を対象とした臨床第I相試験 (国内試験) (2015年3月26日承認、CTD 2.7.6.6) [LEN-0001]
- 3) Shumaker R. et al. : Int. J. Clin. Pharmacol. Ther.,2014 ; 52 (4) : 284-291 [LEN-0002]
- 4) 社内資料：血漿蛋白結合率 (*in vitro*) (2015年3月26日承認、CTD 2.6.4.4.2) [LEN-0005]
- 5) Yamada K. et al. : Clin. Cancer Res.,2011 ; 17 (8) : 2528-2537 [LEN-0006]
- 6) 社内資料：代謝 (*in vitro*及び*in vivo*) (2015年3月26日承認、CTD 2.7.2.3.2.3) [LEN-0003]
- 7) 社内資料：がん患者を対象としたマスパランス試験 (外国試験) (2015年3月26日承認、CTD 2.7.2.2.2.2.1,2.7.6.9) [LEN-0004]
- 8) 社内資料：腎機能障害患者を対象とした臨床薬理試験 (外国試験) (2015年3月26日承認、CTD 2.7.2.2.2.3.2) [LEN-0009]
- 9) 社内資料：肝機能障害患者を対象とした臨床薬理試験 (外国試験) (2015年3月26日承認、CTD 2.7.2.2.2.3.1) [LEN-0008]
- 10) 社内資料：ケトコナゾールとの薬物相互作用試験 (外国試験) (2015年3月26日承認、CTD 2.7.2.2.2.3.3.1) [LEN-0010]

- 11) 社内資料：リファンピシンの薬物相互作用試験 (外国試験) (2015年3月26日承認、CTD 2.7.2.2.2.3.3.2) [LEN-0011]
- 12) 社内資料：トランスポーター (*in vitro*) (2015年3月26日承認、CTD 2.6.4.8.1) [LEN-0018]
- 13) 社内資料：¹³¹I 難治性の甲状腺分化癌患者を対象とした臨床第Ⅲ相試験 (国際共同試験) (2015年3月26日承認、CTD 2.7.6.17) [LEN-0012]
- 14) 社内資料：進行性甲状腺癌患者を対象とした臨床第Ⅱ相試験 (国内試験) (2015年3月26日承認、CTD 2.7.6.16) [LEN-0014]
- 15) 社内資料：切除不能な肝細胞癌患者を対象とした臨床第Ⅲ相試験 (国際共同試験) (2018年3月23日承認、CTD 2.7.6.1) [LEN-0168]
- 16) 社内資料：NCCH1508試験 (2021年3月23日承認、CTD 2.7.6.1) [LEN-0470]
- 17) 社内資料：進行子宮体癌患者を対象とした臨床第Ⅲ相試験 (国際共同試験) (2021年12月24日承認、CTD 2.7.6) [LEN-0653]
- * 18) 社内資料：根治切除不能又は転移性の腎細胞癌患者を対象とした臨床第Ⅲ相試験 (国際共同試験) [LEN-0720]
- 19) 社内資料：*In vitro*薬理試験 (1) (2015年3月26日承認、CTD 2.6.2.2.1) [LEN-0015]
- 20) 社内資料：*In vitro*薬理試験 (2) (2018年3月23日承認、CTD 2.6.2.2.1) [LEN-0169]
- 21) 社内資料：*In vivo*薬理試験 (1) (2015年3月26日承認、CTD 2.6.2.2.2) [LEN-0016]
- 22) 社内資料：*In vivo*薬理試験 (2) (2018年3月23日承認、CTD 2.6.2.2.2) [LEN-0170]
- 23) 社内資料：効力を裏付ける試験 (2021年3月23日承認、CTD 2.6.2.2) [LEN-0508]
- * 24) 社内資料：*In vivo*薬理試験 (3) [LEN-0721]

24. 文献請求先及び問い合わせ先

エーザイ株式会社 hhcホットライン
〒112-8088 東京都文京区小石川4-6-10
フリーダイヤル 0120-419-497

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

エーザイ株式会社
東京都文京区小石川4-6-10

26.2 販売提携

MSD株式会社
東京都千代田区九段北1-13-12