**2026 年 11 月改訂（第 8 版、効能変更）

*2026 年 10 月改訂（第 7 版）

貯法：2～8℃で保存

有効期間：36 カ月

抗悪性腫瘍剤

ボロファラン（^{10}B）

日本標準商品分類番号
874291

承認番号	30200AMX00438000
販売開始	2020 年 5 月

処方箋医薬品
注意-医師等の処方箋により使用すること

ステボロニン®点滴静注バッグ 9000 mg/300 mL

STEBORONINE® 9000 mg/300 mL for infusion

1. 警　告

本剤は、緊急時に十分対応できる医療施設において、がん化学療法及び放射線治療に十分な知識・経験を持つ医師のもとで、本剤の投与が適切と判断される症例についてのみ投与すること。また、治療開始に先立ち、患者又はその家族に有効性及び危険性を十分説明し、同意を得てから投与すること。

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

2.2 腫瘍が頸動脈を全周性に取り囲んでいる患者［頸動脈出血を起こすおそれがある。］［11.1.6 参照］

3. 組成・性状

3.1 組成

	1 バッグ（300 mL）中の分量	
有効成分	ボロファラン（^{10}B）	9000 mg
添加剤	D-ソルビトール	9450 mg
	亜硫酸水素ナトリウム	60 mg
	pH 調節剤	適量

3.2 製剤の性状

剤型	注射剤（点滴バッグ）
性状	無色～微黄色澄明の液
pH	7.4～7.8
浸透圧比	1.0～1.5（生理食塩液対比）

4. 効能又は効果

切除不能な局所進行又は局所再発の頭頸部癌

****再発髄膜腫**

**5. 効能又は効果に関連する注意

〈効能共通〉

5.1 本剤の術後補助療法における有効性及び安全性は確立していない。

〈頭頸部癌〉

5.2 化学放射線療法等の標準的な治療が可能な場合にはこれらの治療を優先すること。

5.3 「17.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に理解した上で、適応患者の選択を行うこと。［17.1.1 参照］

〈再発髄膜腫〉

5.4 手術等の根治的治療が可能な場合にはこれらの治療を優先すること。

5.5 臨床試験に組み入れられた患者の前治療歴、組織学的悪性度、病変の部位等について、「17.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に理解した上で、適応患者の選択を行うこと。［17.1.2 参照］

6. 用法及び用量

通常、成人にはボロファラン（^{10}B）として、1時間あたり200 mg/kgの速度で2時間点滴静注する。その後、病巣部位への中性子線の照射を開始し、照射中は1時間あたり100 mg/kgの速度でボロファラン（^{10}B）を点滴静注する。

7. 用法及び用量に関連する注意

7.1 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。

7.2 本剤とともに癌を標的として使用することを目的として承認されたホウ素中性子捕捉療法用中性子照射装置を使用し、中性子を照射すること。

8. 重要な基本的注意

結晶尿があらわれることがあるため、投与終了後は必要に応じて輸液を行う等、排尿を促すこと。［11.1.5 参照］

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 頸動脈への腫瘍浸潤が認められる患者

頸動脈出血を起こすおそれがある[1]。［11.1.6 参照］

9.1.2 フェニルケトン尿症の患者

製剤中にフェニルアラニンを含むため、症状が悪化するおそれがある。

9.1.3 心不全のある患者

血液量の増加により心臓に負荷がかかり、心不全が悪化するおそれがある。

9.1.4 遺伝性果糖不耐症の患者

本剤の添加剤 D-ソルビトールが体内で代謝されて生成した果糖が正常に代謝されず、低血糖、肝不全、腎不全等が誘発されるおそれがある。

9.2 腎機能障害患者

本剤は主に腎臓から排泄される。腎機能障害患者を対象とした臨床試験は実施していない。［16.5 参照］

9.4 生殖能を有する者

9.4.1 妊娠可能な女性に対しては、治療終了後一定期間は適切な避妊を行うよう指導すること。［9.5 参照］

9.4.2 パートナーが妊娠する可能性のある男性に対しては、治療終了後一定期間は適切な避妊を行うよう指導すること。［15.2.2 参照］

9.5 妊婦

妊娠又は妊娠している可能性のある女性には治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合のみ投与すること。本剤の動物試験（ラット）において、発育遅延が認められている[2]。本剤を用いたホウ素中性子捕捉療法により胚・胎児発生に悪影響を及ぼすおそれがある。［9.4.1

参照]

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。ヒトの乳汁中への移行は不明である。

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

11.1 重大な副作用

***11.1.1 嚥下障害（頻度不明）**

粘膜の炎症等を伴う嚥下障害があらわれ、誤嚥性肺炎を来すことがある。

****11.1.2 脳膿瘍（2.6%）**

****11.1.3 重度の皮膚障害（2.6%）**

放射線皮膚損傷（2.6%）等の重度の皮膚障害があらわれることがある。

****11.1.4 白内障（5.3%）**

****11.1.5 結晶尿（頻度不明）**

結晶尿があらわれ、血尿（7.9%）、急性腎障害（頻度不明）等を来すことがある。［8.参照］

11.1.6 頸動脈出血（頻度不明）[2.2、9.1.1 参照]

11.1.7 咽頭・喉頭浮腫（頻度不明）

咽頭・喉頭浮腫があらわれ、気道の狭窄や閉塞を来すことがある。

11.1.8 壊死、粘膜潰瘍、穿孔、瘻孔（いずれも頻度不明）

照射部位の壊死に伴い、粘膜潰瘍、穿孔、瘻孔があらわれることがある。

11.2 その他の副作用

	種類/頻度	20%以上	5～20%未満	5%未満	頻度不明
**	血液およびリンパ系障害		リンパ球数減少、フィブリンDダイマー増加、白血球数増加	鉄欠乏性貧血、リンパ球減少症、血中フィブリノゲン増加、血小板数減少	
	耳および迷路障害		耳痛	回転性めまい、聴力低下	
**	眼障害		眼瞼浮腫	眼乾燥、眼痛、涙器障害	
**	胃腸障害	アミラーゼ増加（50.0%）、悪心（44.7%）、口内炎（34.2%）、嘔吐（26.3%）	腹部不快感、便秘、唾液腺痛	下痢、嚥下痛、顎下腺腫大、耳下腺腫大	
**	一般・全身障害および投与部位の状態	倦怠感（34.2%）、口渇（23.7%）	発熱、疲労	顔面浮腫、顔面痛、腫脹 、潰瘍、創傷治癒遅延	
**	肝胆道系障害			ALT 増加	
**	感染症および寄生虫症	耳下腺炎（36.8%）	蜂巣炎、外耳蜂巣炎、外耳炎、中耳炎、結膜炎、唾液腺炎	膀胱炎、口腔カンジダ症	
**	傷害、中毒および処置合併症	放射線脱毛症（44.7%）			
**	代謝および栄養障害	食欲減退（39.5%）			
	筋骨格系および結合組織障害		頚部痛、顎痛、開口障害		
**	神経系障害	味覚異常（42.1%）	顔面不全麻痺、脳浮腫	頭痛、嗅覚錯誤、傾眠	痙攣発作
**	精神障害		譫妄	不眠症	
	腎および尿路障害			排尿困難	
	呼吸器、胸郭および縦隔障害		咽頭の炎症、鼻出血、口腔咽頭痛	しゃっくり、鼻閉、鼻の炎症	
**	皮膚および皮下組織障害	脱毛症（50.0%）	顔面腫脹、発疹	皮膚炎、紅斑、毛髪障害	
**	内分泌障害		血中プロラクチン異常、血中プロラクチン増加		
**	血管障害			潮紅	
**	良性、悪性および詳細不明の新生物				腫瘍出血

14. 適用上の注意

14.1 投与時の注意

他剤との混注はしないこと。

15. その他の注意

15.1 臨床使用に基づく情報

本剤は添加剤として亜硫酸塩を含有している。喘息患者では非喘息患者よりも亜硫酸塩に対する過敏症が多く認められるとの報告がある[3]。

15.2 非臨床試験に基づく情報

15.2.1 本剤の動物試験（ラット又はイヌ）で雌雄生殖器の変化（黄体肥大、卵胞数減少、腟粘膜上皮粘液変性、子宮内膜増生、精母細胞変性、精巣上体管腔内の精子数減少・細胞残屑、精嚢・前立腺萎縮等）及び神経症状（対光反射消失、縮瞳、傾眠、振戦、瞬膜弛緩等）が認められている[4)-7)]。

15.2.2 本剤を用いたホウ素中性子捕捉療法の動物試験（マウス）で染色体異常（小核誘発）が認められている[8)]。また、^{10}B 存在下で細胞に中性子線を照射した際に遺伝子変異が認められたとの報告がある[9),10)]。［9.4.2 参照］

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与

切除不能な局所再発頭頸部扁平上皮癌患者及び切除不能な局所進行又は局所再発の頭頸部非扁平上皮癌患者 9 例に本剤 500 mg/kg を投与開始後 2 時間は 200 mg/kg/時間、その後は 100 mg/kg/時間で点滴静注したときの本剤の薬物動態パラメータを表 16-1、血漿中濃度推移を図 16-1 に示す[11)]。また、全血中ホウ素濃度推移を表 16-2 に示す[11)]。

表 16-1　薬物動態パラメータ

AUC_{inf} (μg・h/mL)	C_{max} (μg/mL)	$t_{1/2}$ (h)	Vz/F (L)	CL/F (L/h)
5811 ± 770.1	812.0 ±115.9	9.47 ± 1.16	65.26 ± 23.10	4.72 ± 1.39

平均値±標準偏差

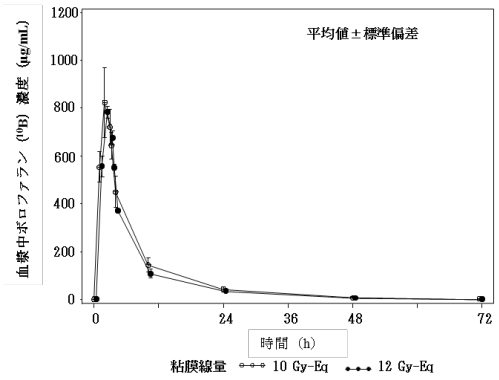


図 16-1　血漿中ボロファラン（^{10}B）濃度の推移

表 16-2　全血中ホウ素濃度の推移

投与開始後の時間	1 時間後	2 時間後	3 時間後
全血中ホウ素濃度（ppm）	18.78 ± 1.417	28.48 ± 3.773	26.93 ± 3.098

平均値±標準偏差

16.3 分布

ヒト血漿タンパク結合率は、10～1,000 μg/mL の濃度において、0～21.8%であった（*in vitro*）[12)]。

16.4 代謝

本剤は、主としてフェニルアラニントランスアミナーゼによりフェニルピルビン酸体やフェニル乳酸体に代謝され、一部がフェニルアラニンヒドロキシラーゼによりチロシンに代謝されることが推定される[11)]。

16.5 排泄

切除不能な局所再発頭頸部扁平上皮癌患者及び切除不能な局所進行又は局所再発の頭頸部非扁平上皮癌患者 9 例に本剤 500 mg/kg を投与したとき、投与 72 時間後までの尿中において、主に未変化体、フェニルピルビン酸体及びフェニル乳酸体が認められた（投与量に対する割合は、それぞれ 50.4、6.49 及び 4.66%）[11)]。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

〈頭頸部癌〉

17.1.1 国内第Ⅱ相臨床試験（JHN002 試験）

(1)化学放射線療法又は放射線療法後の切除不能な局所再発頭頸部扁平上皮癌患者又は (2) 切除不能な頭頸部非扁平上皮癌患者[注1)] 21 例を対象に、本剤500 mg/kg を投与開始後2 時間は200 mg/kg/時間、その後は100 mg/kg/時間で点滴静注した。また、本剤の投与開始2 時間後から、口腔、咽頭又は喉頭粘膜線量として12 Gy-Eq の中性子線を最大60 分間単回照射した。主要評価項目である中央判定（RECIST v.1.1）による奏効率（完全奏効と部分奏効を合計した割合）は、71.4%（90%信頼区間：51.3～86.8%）であった[13)]。

注1：以下の患者は除外された。
- 病変部位に対する放射線療法の最終照射日から90 日未満の患者。
- 病変部位に総線量75 Gy 以上の放射線照射を受けた患者。
- 照射軸上の皮膚表面から1.0～5.0 cm の範囲に粘膜が含まれない患者。

表17-1 JHN002試験の有効性に関する成績

	例数（%）
CR （完全奏効）	5 (23.8)
PR （部分奏効）	10 (47.6)
SD （安定）	5 (23.8)
PD （進行）	0 (0.0)
NE （評価不能）	1 (4.8)

本剤が投与されホウ素中性子捕捉療法が行われた21例において、21例（100%）に副作用が認められた。主な副作用は、脱毛症90.5%（19/21例）、アミラーゼ増加85.7%（18/21例）、悪心81.0%（17/21例）、味覚異常71.4%（15/21例）、耳下腺炎及び食欲減退66.7%（14/21例）、口内炎61.9%（13/21例）であった[13)]。［5.3 参照］

〈再発髄膜腫〉

**17.1.2 国内第Ⅱ相臨床試験（OMC-BNCT001DR試験）（jRCT2051190044）

腫瘍摘出術で治癒が困難な再発高悪性度[注2)]髄膜腫患者[注3)] 18例を対象に、本剤を用いたホウ素中性子捕捉療法とBest Supportive Care（BSC）の有効性及び安全性を比較することを目的とした無作為化非盲検比較試験を実施した。本剤群12例に対して本剤500 mg/kg を投与開始後2 時間は200 mg/kg/時間、その後は100 mg/kg/時間で点滴静注した。また、本剤の投与開始2 時間後から、皮膚線量と

して7.5 Gy-Eqの中性子線を最大60 分間単回照射した。主要評価項目である中央画像効果判定による改変Macdonald基準[注4)]によるpseudo-progression を考慮した[注5)] 無増悪生存期間（PFS）の主解析の結果、PFSの中央値は本剤群（11例[注6)]）で14.4ヵ月（95%信頼区間：7.9～ 26.4ヵ月）、BSC群（6例）で1.4ヵ月（95% 信頼区間：1.0～9.0ヵ月）であり、BSC 群と比較して本剤群で統計学的に有意な結果が認められた（ハザード比0.19［95%信頼区間：0.05～0.83］、p=0.0157［log-rank 検定］、有意水準（両側）0.10、2024年7月24日データカットオフ）[14)]

注2：WHO腫瘍分類（2016）に基づきグレード2 又は3 と診断された患者。
注3：標的病変部位に対する放射線治療歴がある患者。
また、以下の患者は除外された。
・標的病変部位に対する前放射線治療の初回照射日から90 日未満の患者。なお、組み入れられた患者における標的病変部位に対する前放射線治療終了から本剤を用いたホウ素中性子捕捉療法実施までの期間の中央値（最小値、最大値）は826（406、3,075）日であった。
・標的病変部位に1 回2Gy のX 線分割換算で総線量65 Gy を超える放射線治療歴がある患者。
・標的病変の主座がテント下である患者。
注4：Macdonald 基準のCR、PR 及びPD 判定根拠からステロイド使用に関する項目、CR 判定根拠から測定不能病変に関する項目、及びPR 判定根拠から新規病変に関する項目を削除した基準が用いられた。また、ベースラインで測定可能病変を含む治療対象となる病変を標的病変として選択（最大5個）し、T1Gd 強調画像で最長径×直交径の積（複数病変は積の合計）を腫瘍測定値として記録する運用とされた。登録時点で画像上の再発又は増悪が確認された造影病変を評価対象として標的病変が設定された。
注5：本剤群では16 週間連続してPD と判定された場合に増悪とすることとされた。
注6：皮膚線量が基準に満たなかった1 例を除く。

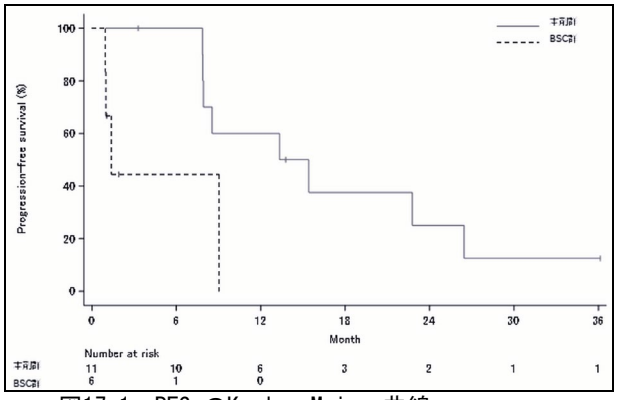


図17-1　PFS のKaplan-Meier 曲線

本剤が投与されホウ素中性子捕捉療法が行われた12例において、12例（100%）に副作用が認められた。主な副作用は、放射線脱毛症100%（12/12例）、放射線壊死25.0%（3/12例）、倦怠感、脳浮腫及び譫妄16.7%（2/12例）であった。［5.5 参照］

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

ボロファラン（^{10}B）は、フェニルアラニン誘導体である4-ボロノ-L-フェニルアラニンに含まれるホウ素中の^{10}Bの存在比を高めた薬剤である。体外より中性子線を照射することで腫瘍細胞に取り込まれた^{10}B が中性子を捕捉し、核反応により生成されたアルファ線及びリチウム原子核を放出することにより、腫瘍増殖抑制作用を示すと考えられている[15)]。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名 ： ボロファラン（^{10}B）（Borofalan(^{10}B)）

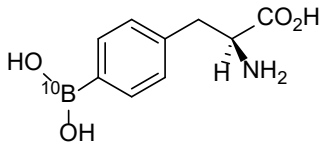
化学名 ： (*S*)-2-amino-3-[4-(^{10}B)dihydroxyboranyl phenyl]propanoic acid

分子式 ： $C_9H_{12}{}^{10}BNO_4$

分子量 ： 208.21

性状 ： ボロファラン（^{10}B）は白色の結晶性の粉末である。ギ酸に溶けやすく、水及びエタノールにほとんど溶けない。

構造式 ：



20. 取扱い上の注意

製品の品質を保持するために脱酸素剤を封入しており、また、遮光保存する必要があるため、使用直前までピロー包装を開封しないこと。

21. 承認条件

21.1 医薬品リスク管理計画を策定の上、適切に実施すること。

〈頭頸部癌〉

21.2 国内での治験症例が極めて限られていることから、製造販売後、一定数の症例に係るデータが集積されるまでの間は、全症例を対象に使用成績調査を実施することにより、本剤の使用患者の背景情報を把握するとともに、本剤の安全性及び有効性に関するデータを早期に収集し、本剤の適正使用に必要な措置を講じること。

22. 包装

ピロー包装入り300 mLソフトバッグ×5袋

**23. 主要文献

1) Aihara T, et al. Appl Radiat Isot 2015; 106: 202-6
2) 社内資料：生殖発生毒性試験（2020年3月25日承認、CTD2.6.6.6）
3) 医薬品・医療機器安全性情報No.427（2026年3月10日公表）
4) 社内資料：単回投与毒性試験（ラット）（2020年3月25日承認、CTD2.6.6.2.1.1、2.6.6.2.1.2）
5) 社内資料：単回投与毒性試験（イヌ）（2020年3月25日承認、CTD2.6.6.2.1.3、2.6.6.2.1.4）
6) 社内資料：反復投与毒性試験（ラット）（2020年3月25日承認、CTD2.6.6.3.1、2.6.6.3.2）
7) 社内資料：反復投与毒性試験（イヌ）（2020年3月25日承認、CTD2.6.6.3.3、2.6.6.3.4）
8) 社内資料：マウスを用いたBNCT毒性試験（急性期）（2020年3月25日承認、CTD2.6.6.2.2.1）
9) Kinashi Y, et al. Appl Radiat Isot 2009;67:S325-7
10) Kinashi Y, et al. Int J Radiat Oncol Biol Phys 2007;68:508-14
11) 社内資料：国内第I相（JHN001）試験（2020年3月25日承認、CTD2.7.2.2、2.7.2.3）
12) 社内資料：血漿タンパク結合および結合タンパクの同定試験（2020年3月25日承認、CTD2.7.2.2.1.1）
13) 社内資料：国内第Ⅱ相（JHN002）試験（2020年3月25日承認、CTD2.7.6.3）

14) 社内資料：国内第Ⅱ相（OMC-BNCT001DR）試験（2026年11月16日承認、CTD2.7.6.2）
15) Locher GL, et al. AJR Am J Roentgenol. 1936; 36: 1-13

24. 文献請求先及び問い合わせ先

ステラファーマ株式会社　お客様相談センター
電話 0120-262-620

25. 保険給付上の注意

〈頭頸部癌〉

本剤の効能又は効果に関連する注意に、「化学放射線療法等の標準的な治療が可能な場合にはこれらの治療を優先すること。」と記載されているので、本剤の投与が必要と判断した理由を診療報酬明細書に記載すること。

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

ステラファーマ株式会社
〒541-0043
大阪市中央区高麗橋3丁目2番7号　ORIX高麗橋ビル
電話 (06)4707-1516　FAX (06)4707-2077