＊＊2026年11月改訂（第3版、効能変更）
＊2025年11月改訂（第2版）

日本標準商品分類番号
874291

承認番号	30700AMX00225000
販売開始	2025年11月

抗悪性腫瘍剤／HER2[注1)]阻害剤
ゾンゲルチニブ
劇薬、処方箋医薬品[注2)]

貯法：室温保存
有効期間：30箇月

ヘルネクシオス®錠60mg
HERNEXEOS® Tablets 60mg

＊＊（一部）条件付承認品目

®＝登録商標

Boehringer Ingelheim

注1）HER2：Human Epidermal Growth Factor Receptor Type 2（ヒト上皮増殖因子受容体2型、別称：c-*erb*B-2）
注2）注意－医師等の処方箋により使用すること

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）
本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3．組成・性状
3.1 組成

販売名	ヘルネクシオス錠60mg
有効成分	1錠中ゾンゲルチニブ60mg
添加剤	ヒプロメロース酢酸エステルコハク酸エステル、結晶セルロース、D-マンニトール、クロスカルメロースナトリウム、軽質無水ケイ酸、フマル酸ステアリルナトリウム、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、タルク、酸化チタン、グリセリン脂肪酸エステル、ラウリル硫酸ナトリウム、黄色三二酸化鉄

3.2 製剤の性状

販売名	ヘルネクシオス錠60mg
色・剤形	黄色のフィルムコート錠
外形	
大きさ	長径約15mm、短径約7mm
厚さ	約5mm
重量	約414mg
識別コード	L6

＊＊4．効能又は効果
***HER2*（*ERBB2*）遺伝子変異陽性の切除不能な進行・再発の非小細胞肺癌[注)]**
注）条件付承認の対象は「がん化学療法未治療の*HER2*（*ERBB2*）遺伝子変異陽性の切除不能な進行・再発の非小細胞肺癌」である。

5．効能又は効果に関連する注意
5.1 十分な経験を有する病理医又は検査施設における検査により、*HER2*（*ERBB2*）遺伝子変異が確認された患者に投与すること。検査にあたっては、承認された体外診断用医薬品又は医療機器を用いること。なお、承認された体外診断用医薬品又は医療機器に関する情報については、以下のウェブサイトから入手可能である：
https://www.pmda.go.jp/review-services/drug-reviews/review-information/cd/0001.html
5.2 本剤の術前・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。
＊＊5.3 臨床試験に組み入れられた患者の遺伝子変異の種類等について、「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、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。［17.1.1参照］

6．用法及び用量
通常、成人には、ゾンゲルチニブとして1日1回120mgを経口投与する。なお、患者の状態により適宜減量する。

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 本剤投与により副作用が発現した場合には、以下の基準を参考に本剤を休薬、減量又は中止すること。1日1回60mgに減量しても忍容性が認められない場合は、本剤の投与を中止すること。

本剤の休薬、減量又は中止基準

副作用	重症度[注)]	処置
肝機能障害	Grade 3又は4のALT又はAST増加	Grade 1以下又はベースラインに回復するまで休薬し、回復後は60mgで再開できる。
	Grade 3の総ビリルビン増加	Grade 1以下又はベースラインに回復するまで休薬し、回復後は60mgで再開できる。
	Grade 4の総ビリルビン増加	投与を中止する。
	ALT又はASTが基準値上限の3倍以上かつ総ビリルビンが基準値上限の2倍以上	投与を中止する。
下痢	Grade 2かつ止瀉薬の投与を行っても症状が2日以上継続する場合	Grade 1以下に回復するまで休薬し、回復後は60mgで再開できる。
	Grade 3又は4	Grade 1以下に回復するまで休薬する。 14日以内に回復した場合は60mgで再開できる。支持療法を行っても14日以内に回復しない場合は、投与を中止する。
発熱性好中球減少症	全Grade	Grade 1以下又はベースラインに回復するまで休薬し、回復後は60mgで再開できる。ただし、必要に応じて投与を中止することも考慮する。

副作用	重症度[注)]	処置
駆出率減少	Grade 2	Grade 1以下に回復するまで休薬し、回復後は120mgで再開できる。ただし、休薬後4週間以内に正常範囲又はベースラインから5ポイント以内に回復しなかった場合、再開後にベースラインから10ポイント以上低下した場合は60mgに減量する。
	Grade 3又は4	Grade 1以下に回復するまで休薬し、回復後は60mgで再開できる。ただし、休薬後4週間以内に正常範囲又はベースラインから5ポイント以内に回復しなかった場合、再開後にベースラインから10ポイント以上低下した場合は投与を中止する。
間質性肺疾患	Grade 2	Grade 1以下に回復するまで休薬する。14日以内に回復した場合は60mgで再開できる。支持療法を行っても14日以内にGrade 1以下に回復しない場合は投与を中止する。
	Grade 3又は4	投与を中止する。
その他の副作用	Grade 3又は4	Grade 1以下又はベースラインに回復するまで休薬し、回復後は60mgで再開できる。ただし、必要に応じて投与を中止することも考慮する。

注)GradeはNCI-CTCAE v5.0に準じる。

8. 重要な基本的注意

8.1 肝機能障害があらわれることがあるので、本剤投与開始前及び投与中は定期的に肝機能検査を行い、患者の状態を十分に観察すること。[11.1.2参照]

8.2 血球減少があらわれることがあるので、本剤投与開始前及び投与中は定期的に血液検査を行い、患者の状態を十分に観察すること。[11.1.3参照]

8.3 間質性肺疾患があらわれることがあるので、初期症状(呼吸困難、咳嗽、発熱等)の確認及び胸部画像検査の実施等、患者の状態を十分に観察すること。また、患者に対して、初期症状があらわれた場合には、速やかに医療機関を受診するよう説明すること。[11.1.4参照]

8.4 左室駆出率(LVEF)低下があらわれることがあるので、本剤投与開始前及び本剤投与中は適宜心機能検査(心エコー等)を行い、患者の状態(LVEFの変動を含む)を十分に観察すること。[9.1.1参照]

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 左室駆出率(LVEF)が低下している患者

LVEF低下を悪化させるおそれがある。[8.4参照]

9.3 肝機能障害患者

＊＊**9.3.1 重度の肝機能障害(Child-Pugh分類C)を有する患者**

本剤は主に肝臓で代謝されるため、血中濃度が上昇する可能性がある。なお、重度の肝機能障害患者を対象とした臨床試験は実施していない。[16.6.2参照]

9.4 生殖能を有する者

9.4.1 妊娠する可能性のある女性には、本剤投与中及び最終投与後10日間において避妊する必要性及び適切な避妊法について説明すること。[9.5参照]

9.4.2 生殖可能な女性に投与する場合には、受胎能の低下があらわれる可能性があることを考慮すること。動物実験(ラット)において、子宮の萎縮、並びに子宮頸部及び膣の過形成/過角化が報告されている。

9.5 妊婦

妊婦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にのみ投与すること。生殖発生毒性試験(ラット)において、本剤の胎児への移行の可能性が推定され、本剤120mg投与時の4.4倍に相当する曝露量で胚・胎児死亡が報告されている。[9.4.1、9.6参照]

9.6 授乳婦

授乳しないことが望ましい。本剤が乳汁に移行する可能性があり、乳児が乳汁を介して摂取した場合、乳児に重篤な副作用が発現するおそれがある。[9.5参照]

9.7 小児等

小児等を対象とした本剤の有効性及び安全性は確立していない。

10. 相互作用

本剤は、主にCYP3Aによって代謝され、P-gp及びBCRPの阻害作用を示す。

10.2 併用注意(併用に注意すること)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
強いCYP3A誘導剤 カルバマゼピン、リファンピシン、フェニトイン等 [16.7.1参照]	本剤の有効性が減弱するおそれがあるため、これらの薬剤との併用は可能な限り避け、CYP3A誘導作用のない又は弱い薬剤への代替を考慮すること。	これらの薬剤がCYP3Aを誘導することにより、本剤の血中濃度が低下する可能性がある。
治療域の狭いP-gpの基質となる薬剤 シクロスポリン、エベロリムス、シロリムス等 [16.7.1参照]	これらの薬剤の副作用が増強されるおそれがあるため、患者の状態を慎重に観察し、副作用の発現に十分注意すること。	本剤がP-gpを阻害することにより、これらの薬剤の血中濃度が上昇する可能性がある。
BCRPの基質となる薬剤 ロスバスタチン、メトトレキサート、サラゾスルファピリジン等 [16.7.1参照]		本剤がBCRPを阻害することにより、これらの薬剤の血中濃度が上昇する可能性がある。

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 重度の下痢(3.0%)

＊＊**11.1.2 肝機能障害**(40.3%)

[8.1参照]

＊＊**11.1.3 血球減少**

発熱性好中球減少症(頻度不明)、好中球減少(10.6%)、貧血(22.5%)、血小板減少(7.2%)等があらわれることがある。[8.2参照]

＊＊**11.1.4 間質性肺疾患**(2.5%)

[8.3参照]

11.2 その他の副作用

	20～30%未満	10～20%未満	10%未満
胃腸障害	悪心	口内炎	
臨床検査			駆出率減少
＊＊皮膚および皮下組織障害	発疹、爪の障害	皮膚乾燥、そう痒症	

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

14.1.1 湿気を避けるため、乾燥剤を同封したボトル包装品のまま患者に交付すること。

14.1.2 湿気を避けるため、乾燥剤を同封した元の容器にて保存し、使用の都度、密栓するよう患者に指導すること。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 反復投与

HER2(*ERBB2*)遺伝子異常を有する進行固形癌患者24例(日本人患者6例含む)に本剤60、120、又は240mgを空腹時に1日1回15日間反復経口投与[注1)]したときのゾンゲルチニブの血漿中濃度の時間推移及び薬物動態パラメータは以下の図1及び表1のとおりであった[1)]。

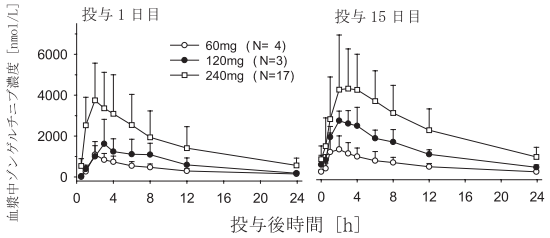


図1 本剤60、120又は240mgを1日1回反復経口投与[注1)]したときの血漿中濃度推移
（算術平均+標準偏差）

表1 本剤60、120又は240mgを1日1回反復経口投与[注1)]したときの薬物動態パラメータ

用量	投与日	例数	C_{max} (nmol/L)	t_{max}[※1] (h)	$AUC_{0\text{-}24h}$ (nmol·h/L)	$t_{1/2}$ (h)
60mg	1	4	1020 (44.2)	1.99 (1.97-2.05)	8240 (37.0)	9.41 (17.4)
	15	4	1230 (54.3)	2.04 (1.07-2.93)	11600 (48.4)	9.37 (15.2)
120mg	1	3	1610 (75.1)	3.03 (2.03-3.95)	14000 (61.8)	9.51 (9.87)
	15	3	2830 (20.6)	2.05 (1.03-3.97)	28900 (23.2)	8.52 (9.39)
240mg	1	17	3630 (45.1)	2.07 (0.967-5.95)	33900 (48.9)[※2]	9.19 (29.3)[※2]
	15	17	4760 (41.4)	2.95 (1.03-6.00)	52100 (43.2)	9.58 (30.1)

幾何平均値（幾何変動係数%）
※1：t_{max}は中央値（最小値-最大値）
※2：15例

16.2 吸収

16.2.1 バイオアベイラビリティ

健康成人（7例）に本剤60mg[注1)]を単回経口投与したときの絶対バイオアベイラビリティは76%であった[2)]。（外国人データ）

16.2.2 食事の影響

健康成人（16例）に本剤240mg[注1)]を単回経口投与したとき、空腹時投与に対する高脂肪食後投与におけるゾンゲルチニブの$AUC_{0\text{-}t}$及びC_{max}の幾何平均値の比は、それぞれ1.27及び1.26であった[3)]。（外国人データ）

16.3 分布

ゾンゲルチニブのヒト血漿タンパク結合率は99%超であり、主にアルブミンに結合した（*in vitro*）[4)]。ゾンゲルチニブの血液/血漿中濃度比は0.7であった（*in vitro*）[5)]。

16.4 代謝

ゾンゲルチニブは主にCYP3A4/5による酸化、UGT1A4によるグルクロン酸抱合及びグルタチオン抱合によって代謝される。健康成人（8例）に^{14}C標識されたゾンゲルチニブ60mg[注1)]を単回経口投与したとき、血漿中に未変化体及び6種類の代謝物が検出され、血漿中総放射能量（$AUC_{0\text{-}168h}$）の75%が未変化体であった[6)]。（外国人データ）

＊＊16.5 排泄

健康成人（8例）に^{14}C標識されたゾンゲルチニブ60mg[注1)]を単回経口投与したとき、投与量のうち糞便中には93%（未変化体として31%）、尿中には1.3%（未変化体として0.2%）が排泄された[7)]。（外国人データ）

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 腎機能障害患者

母集団薬物動態解析を用いて、腎機能[注2)]が正常（187例）、軽度（120例）及び中等度（23例）の腎機能障害患者にゾンゲルチニブ120mgを1日1回反復経口投与したときの曝露量を推定した結果、①C_{max}及び②$AUC_{0\text{-}24h}$の幾何平均値は、それぞれ①2730、2690及び2600nmol/L、並びに②30800、31700及び31200nmol·h/Lと推定された。

注2）eGFR（mL/min/1.73m^2）が①90以上、②60以上90未満及び③30以上60未満の場合、それぞれ①正常、②軽度及び③中等度とされた[8)]。

＊＊16.6.2 肝機能障害患者

ゾンゲルチニブ120mgを単回経口投与したとき、健康成人（8例）に対する軽度（Child-Pugh分類A）の肝機能障害を有する患者（8例）の$AUC_{0\text{-}\infty}$及びC_{max}の幾何平均値の比はそれぞれ1.1及び0.97、中等度（Child-Pugh分類B）の肝機能障害を有する患者（8例）の$AUC_{0\text{-}\infty}$及びC_{max}の幾何平均値の比はそれぞれ0.83及び0.65であった[9)]。（外国人データ）［9.3.1参照］

16.7 薬物相互作用

16.7.1 臨床薬物相互作用試験

健康成人を対象とした臨床薬物相互作用試験から得られた、ゾンゲルチニブの薬物動態に及ぼす併用薬の影響及び併用薬の薬物動態に及ぼすゾンゲルチニブの影響は、以下の表2及び表3のとおりであった[10)~14)]。［10.2参照］

表2 ゾンゲルチニブの薬物動態に及ぼす併用薬の影響

併用薬	用法・用量		例数[※1]	ゾンゲルチニブの単独投与時に対する比[※2]	
	併用薬	ゾンゲルチニブ[注1)]		C_{max}	$AUC_{0\text{-}\infty}$
イトラコナゾール（強いCYP3A阻害剤）	200mg QD	15mg単回	16/16	1.27 (1.07, 1.51)	1.41 (1.26, 1.58)
カルバマゼピン（強いCYP3A誘導剤）	600mg QD[※3]	60mg単回	15/16	0.56 (0.45, 0.71)	0.36 (0.32, 0.42)
ラベプラゾール（プロトンポンプ阻害剤）	40mg QD	30mg単回	11/12	0.87 (0.67, 1.13)	0.97 (0.85, 1.10)

QD：1日1回
※1：併用/非併用時
※2：幾何平均値の比（90%信頼区間）
※3：カルバマゼピンは200mgを4日間QD、400mgを7日間QD、600mgを13日間QDの順に投与

表3 併用薬の薬物動態に及ぼすゾンゲルチニブの影響

併用薬	用法・用量		例数[※1]	併用薬の単独投与時に対する比[※2]	
	併用薬	ゾンゲルチニブ		C_{max}	$AUC_{0\text{-}\infty}$
ミダゾラム（CYP3A基質）	1mg単回	120mg QD	14/16	1.17 (1.08, 1.27)	1.06 (0.95, 1.17)
レパグリニド（CYP2C8基質）	0.5mg単回		14/16	1.44 (1.24, 1.69)	1.30 (1.10, 1.53)
オメプラゾール（CYP2C19基質）	20mg単回		13/15[※3]	0.62 (0.45, 0.86)	0.90 (0.62, 1.30)
ダビガトラン（P-gp基質）	150mg単回	120mg 単回	15/16	1.24 (0.96, 1.60)	1.34 (1.06, 1.70)
ロスバスタチン（OATP1B1、OATP1B3、BCRP基質）[※4]	10mg単回	120mg QD	16/16	3.02 (2.47, 3.68)	2.30 (1.96, 2.71)
メトホルミン（MATE1、MATE2-K基質）	10mg単回		16/16	0.76 (0.68, 0.84)	0.83 (0.76, 0.90)
フロセミド（OAT1、OAT3基質）[※5]	1mg単回		16/16	1.50 (1.16, 1.93)	1.38 (1.20, 1.58)

QD：1日1回
※1：併用/非併用時
※2：幾何平均値の比（90%信頼区間）
※3：$AUC_{0\text{-}\infty}$では9/10
※4：ゾンゲルチニブ非併用投与時に対する併用投与時のコプロポルフィリンI（OATP1B1及びOATP1B3の内因性バイオマーカー）のC_{max}及び$AUC_{0\text{-}72h}$の幾何平均値の比（90%信頼区間）は、それぞれ0.94（0.89, 0.98）及び0.86（0.82, 0.91）であった。
※5：フロセミドはBCRP基質でもあることが報告されている。

16.7.2 その他

ゾンゲルチニブはUGT2B17を阻害する可能性が示唆された[15)]。また、ゾンゲルチニブはP-gp及びBCRPの基質である（*in vitro*）[16)]。

注1）承認された用法及び用量は、ゾンゲルチニブとして1日1回120mgである。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

＊＊17.1.1 国際共同第Ⅰa／Ⅰb相試験（Beamion LUNG-1試験）[17)]
（jRCT2061220029）

HER2（*ERBB2*）遺伝子異常を有する切除不能な進行固形癌患者を対象とした国際共同第Ia／Ib相試験の第Ib相パートにおいて、*HER2*（*ERBB2*）遺伝子変異を有する切除不能な進行・再発の非小細胞肺癌患者322例に本剤120又は240mg[注1)]を1日1回経口投与した。

白金系抗悪性腫瘍剤を含む1つ以上の化学療法歴のある*HER2*（*ERBB2*）遺伝子（チロシンキナーゼドメイン）に変異を有する患者を対象としたコホートにおいて、主要評価項目であるRECIST ver.1.1に基づく盲検下独立中央審査判定による奏効割合［97.5%信頼区間］は、本剤120mg投与群（75例、日本人9例を含む）で66.7%［53.8, 77.5］（50/75例）であった（2024年5月23日データカットオフ）。

白金系抗悪性腫瘍剤を含む1つ以上の化学療法歴のある*HER2*（*ERBB2*）遺伝子（チロシンキナーゼドメイン以外）に変異を有する患者を対象としたコホートにおいて、RECIST ver.1.1に基づく治験担当医師判定による奏効割合は、本剤120mg投与群（12例）で41.7%（5/12例）であった（2024年8月29日データカットオフ）。

白金系抗悪性腫瘍剤を含む1つ以上の化学療法歴及びHER2を標的とした抗体薬物複合体による治療歴のある*HER2*（*ERBB2*）遺伝子（チロシンキナーゼドメイン）に変異を有する患者を対象としたコホートにおいて、RECIST ver.1.1に基づく盲検下独立中央審査判定による奏効割合［95%信頼区間］は、本剤120mg投与群（31例、日本人1例を含む）で41.9%［26.4, 59.2］（13/31例）であった（2024年8月29日データカットオフ）。

化学療法歴（6カ月以内の術前又は術後の補助化学療法又は化学放射線療法を含む治療歴）のない*HER2*（*ERBB2*）遺伝子（チロシンキナーゼドメイン）に変異を有する患者を対象としたコホートにおいて、主要評価項目

であるRECIST ver.1.1に基づく盲検下独立中央審査判定による奏効割合[96.98%信頼区間]は、本剤120mg投与群(74例、日本人12例を含む)で70.3%[57.8, 80.3](52/74例)であった(2024年11月29日データカットオフ)。また、各コホートにおける本剤120mg投与群の*HER2*(*ERBB2*)遺伝子変異の種類別の奏効割合の結果は、下表のとおりであった。
注1)承認された用法及び用量は、ゾンゲルチニブとして1日1回120mgである。

HER2(*ERBB2*)遺伝子変異の種類別の奏効割合

HER2(*ERBB2*)遺伝子変異		奏効例数/評価例数	奏効割合[95% 信頼区間※1](%)
①全体		53/75	70.7[59.6, 79.8]
TKD変異	エクソン20	49/65	75.4[63.7, 84.2]
	エクソン18	0/1	0[0.0, 79.3]
	TKD点変異	4/9	44.4[18.9, 73.3]
②全体		57/74	77.0[66.3, 85.1]
TKD変異	エクソン20	51/66	77.3[65.8, 85.7]
	TKD点変異	5/7	71.4[35.9, 91.8]
	その他のTKD変異※2	1/1	100[20.7, 100]
③全体		6/18	33.3[16.3, 56.3]
TKD以外の変異	ECD点変異	3/11	27.3[9.7, 56.6]
	TMD点変異	3/7	42.9[15.8, 75.0]
④全体		15/31	48.4[32.0, 65.2]
TKD変異	エクソン20	15/29	51.7[34.4, 68.6]
	エクソン18	0/1	0[0.0, 79.3]
	TKD点変異	0/1	0[0.0, 79.3]

①:白金系抗悪性腫瘍剤を含む1つ以上の化学療法歴のある*HER2*(*ERBB2*)遺伝子(チロシンキナーゼドメイン)に変異を有する患者を対象としたコホート
②:化学療法歴のない*HER2*(*ERBB2*)遺伝子(チロシンキナーゼドメイン)に変異を有する患者を対象としたコホート
③:白金系抗悪性腫瘍剤を含む1つ以上の化学療法歴のある*HER2*(*ERBB2*)遺伝子(チロシンキナーゼドメイン以外)に変異を有する患者及び*HER2*(*ERBB2*)遺伝子(チロシンキナーゼドメイン)に変異を有する患者を対象としたコホート
④:白金系抗悪性腫瘍剤を含む1つ以上の化学療法歴及びHER2を標的とした抗体薬物複合体による治療歴のある*HER2*(*ERBB2*)遺伝子(チロシンキナーゼドメイン)に変異を有する患者を対象としたコホート
※1:Wilson法により算出
※2:詳細な*HER2*(*ERBB2*)遺伝子情報が不明
(①・④:2024年11月29日データカットオフ、②:2025年3月26日データカットオフ、③:2025年8月21日データカットオフ)

第Ⅰb相パートで本剤120mgが投与された236例(日本人23例を含む)のうち、副作用は213例(90.3%)に認められた。主な副作用は、下痢138例(58.5%)、発疹64例(27.1%)、悪心62例(26.3%)、ALT増加49例(20.8%)、爪の障害49例(20.8%)、AST増加48例(20.3%)、そう痒症40例(16.9%)であった。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

ゾンゲルチニブは、エクソン20挿入変異等を有するHER2のチロシンキナーゼ活性を阻害し、下流のシグナル伝達を阻害することにより、腫瘍増殖抑制作用を示すと考えられている。

18.2 抗腫瘍作用

18.2.1 *In vitro*

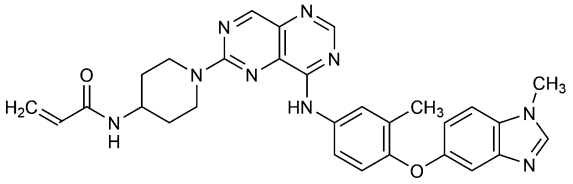
ゾンゲルチニブは、*HER2*(*ERBB2*)遺伝子のエクソン20挿入変異を有するヒト非小細胞肺癌(NSCLC)由来NCI-H1781細胞株等の増殖を抑制した[18]。

18.2.2 *In vivo*

ゾンゲルチニブは、*HER2*(*ERBB2*)遺伝子のエクソン20挿入変異を有するNSCLC患者由来ST3107腫瘍組織片を皮下移植したヌードマウス等において、腫瘍増殖抑制作用を示した[19]。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称
ゾンゲルチニブ(Zongertinib)(JAN)
化学名
N-[1-(8-{3-Methyl-4-[(1-methyl-1*H*-1,3-benzimidazol-5-yl)oxy]anilino}pyrimido[5,4-*d*]pyrimidin-2-yl)piperidin-4-yl]prop-2-enamide
分子式
$C_{29}H_{29}N_9O_2$
分子量
535.60g/mol
性状
黄色～暗黄色又は橙色の粉末である。
化学構造式



分配係数
log P=log D(pH7.4)=4.7

＊＊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。

21.2 化学療法歴のない*HER2*(*ERBB2*)遺伝子変異陽性の切除不能な進行・再発のNSCLC患者を対象に、本剤の有効性及び安全性を、白金系抗悪性腫瘍剤を含む化学療法及びペムブロリズマブの併用投与と比較することを目的とした国際共同第Ⅲ相試験(Beamion LUNG-2試験)の結果を速やかに提出するとともに、医療現場に適切に情報提供すること。

21.3 *HER2*(*ERBB2*)遺伝子変異陽性の切除不能な進行・再発のNSCLC患者に対する本剤の有効性を確認することを目的とした観察研究において、化学療法歴のない*HER2*(*ERBB2*)遺伝子のTKD以外に変異を有する切除不能な進行・再発のNSCLC患者における本剤の有効性を検討した上で、当該観察研究の結果を速やかに提出するとともに、医療現場に適切に情報提供すること。

21.4 *HER2*(*ERBB2*)遺伝子変異陽性の切除不能な進行・再発のNSCLC患者を対象に本剤の安全性、有効性等を検討することを目的としたBeamion LUNG-1試験の第Ⅰb相パートのコホート3において、化学療法歴のない*HER2*(*ERBB2*)遺伝子のTKD以外に変異を有する切除不能な進行・再発の非扁平上皮NSCLC患者における本剤の有効性を検討した上で、当該試験の結果を速やかに提出するとともに、医療現場に適切に情報提供すること。

22. 包装

14錠(ボトル、乾燥剤入り)

23. 主要文献

1)社内資料:国際共同第I相試験(Beamion LUNG-1)(2025年9月19日承認、CTD 2.7.2.3)
2)社内資料:ヒトADME試験(2025年9月19日承認、CTD 2.7.2.2)
3)社内資料:食事の影響試験(2025年9月19日承認、CTD 2.7.1.2)
4)社内資料:非臨床薬物動態試験(*in vitro*血漿タンパク結合)(2025年9月19日承認、CTD 2.6.4.4)
5)社内資料:非臨床薬物動態試験(*in vitro*血球移行性)(2025年9月19日承認、CTD 2.6.4.4)
6)社内資料:ヒトADME試験における代謝物同定(2025年9月19日承認、CTD 2.6.4.5)
7)社内資料:ヒトADME試験(2025年9月19日承認、CTD 2.7.2.2、CTD 2.7.2.3)
8)社内資料:母集団薬物動態解析(2025年9月19日承認、CTD 2.7.2.3)
＊＊9)社内資料:肝機能障害試験(2026年11月16日承認、CTD 2.7.2.2)
10)社内資料:イトラコナゾールとの薬物相互作用試験(2025年9月19日承認、CTD 2.7.2.2)
11)社内資料:カルバマゼピンとの薬物相互作用試験(2025年9月19日承認、CTD 2.7.2.2)
12)社内資料:ラベプラゾールとの薬物相互作用試験(2025年9月19日承認、CTD 2.7.1.2)
13)社内資料:CYP基質とのカクテル薬物相互作用(2025年9月19日承認、CTD 2.7.2.2)
14)社内資料:トランスポーター基質とのカクテル薬物相互作用(2025年9月19日承認、CTD 2.7.2.2)
15)社内資料:非臨床薬物動態試験(*in vitro*薬物代謝酵素誘導及び阻害)(2025年9月19日承認、CTD 2.6.4.5)
16)社内資料:非臨床薬物動態試験(薬物トランスポーターによる輸送)(2025年9月19日承認、CTD 2.6.4.7)
17)社内資料:国際共同第I相試験(Beamion LUNG-1)
18)社内資料:非臨床薬効薬理試験(*in vitro*、がん細胞株における増殖阻害作用)(2025年9月19日承認、CTD 2.6.2.2)
19)社内資料:非臨床薬効薬理試験(*in vivo*、PDXモデルマウスにおける腫瘍増殖抑制作用)(2025年9月19日承認、CTD 2.6.2.2)

24. 文献請求先及び問い合わせ先

日本ベーリンガーインゲルハイム株式会社
DIセンター
〒141-6017 東京都品川区大崎2丁目1番1号
ThinkPark Tower
0120-189-779
(受付時間)9:00～18:00
(土・日・祝日・弊社休業日を除く)

＊25. 保険給付上の注意

本剤は新医薬品であるため、厚生労働省告示第107号(平成18年3月6日付)に基づき、2026年11月末日までは、投薬は1回14日分を限度とされている。

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

日本ベーリンガーインゲルハイム株式会社
東京都品川区大崎2丁目1番1号