

————— 医薬品の適正使用に欠かせない情報です。必ずお読みください。 —————

## 「使用上の注意」改訂のお知らせ

2025 年 11 月

劇薬、処方箋医薬品<sup>注)</sup>

抗悪性腫瘍剤/チロシンキナーゼ阻害剤

レボトレクチニブカプセル

**オータイロ<sup>®</sup> カプセル 40mg**  
**オータイロ<sup>®</sup> カプセル 160mg**  
Augtyro<sup>®</sup> capsules

注)注意－医師等の処方箋により使用すること

この度、標記製品の「効能又は効果」及び「用法及び用量」の製造販売承認事項一部変更承認の取得に伴い、「効能又は効果」、「用法及び用量」及び「使用上の注意」を改訂致しましたので、お知らせ致します。

今後のご使用に際しましては、電子化された添付文書（電子添文）をご参照くださいますようお願い申し上げます。

今回の改訂内容は医薬品安全対策情報（DSU）No. 342（2026 年 1 月）に掲載されます。

改訂後の電子添文は独立行政法人医薬品医療機器総合機構（PMDA）のホームページ「医薬品に関する情報」

（<https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>）及び弊社製品ホームページ

（<https://www.bmshealthcare.jp/>）に掲載されています。

≪「**効能又は効果**」、「**用法及び用量**」改訂内容≫
 (下線は変更箇所)

改訂後 (2025 年 11 月改訂 第 4 版)	改訂前 (2025 年 9 月改訂 第 3 版)						
<b>4. 効能又は効果</b> ○ <u>ROS1 融合遺伝子陽性の切除不能な進行・再発の非小細胞肺癌</u> (変更なし) ○ <u>NTRK 融合遺伝子陽性の進行・再発の固形癌</u>	<b>4.効能又は効果</b> 省略 ←追記						
<b>6. 用法及び用量</b> <u>〈ROS1 融合遺伝子陽性の切除不能な進行・再発の非小細胞肺癌〉</u> 省略 (変更なし) <u>〈NTRK 融合遺伝子陽性の進行・再発の固形癌〉</u> 通常、レボトレクチニブとして以下の用量を 1 日 1 回 14 日間経口投与する。その後、同用量を 1 日 2 回経口投与する。なお、患者の状態により適宜減量する。 ・成人には、1 回 160mg ・4 歳以上の小児には、体重に合わせて次の用量 <table border="1"> <thead> <tr> <th>体重</th><th>1 回投与量</th></tr> </thead> <tbody> <tr> <td>30kg 以上</td><td>160mg</td></tr> <tr> <td>30kg 未満</td><td>120mg</td></tr> </tbody> </table>	体重	1 回投与量	30kg 以上	160mg	30kg 未満	120mg	<b>6. 用法及び用量</b> 省略 ←追記
体重	1 回投与量						
30kg 以上	160mg						
30kg 未満	120mg						

≪「**効能又は効果**」、「**用法及び用量**」改訂理由≫

ROS1、NTRK 又は ALK 融合遺伝子陽性の進行・再発の固形癌患者を対象とした国際共同第 I/II 相試験 (以下、TRIDENT-1 試験) 及び 25 歳以下の ROS1、NTRK 又は ALK 融合遺伝子陽性の進行・再発の固形癌患者を対象とした海外第 I/II 相試験 (以下、CARE 試験) のうち、NTRK 融合遺伝子陽性固形癌患者より得られた結果に基づき、「NTRK 融合遺伝子陽性の進行・再発の固形癌」に対する効能又は効果及び用法及び用量について、製造販売承認事項の一部変更承認を取得致しました。

本剤の成人患者における推奨用法及び用量は、レボトレクチニブの有効性及び安全性を検討した TRIDENT-1 試験、PPK 及び曝露－反応解析の結果に基づき設定しました。また、4 歳以上の小児患者における推奨用法及び用量は、レボトレクチニブの有効性及び安全性を検討した CARE 試験及び PPK 解析の結果より設定しました。

≪「**使用上の注意**」改訂内容≫
 (下線は変更箇所、取消し線は削除箇所)

改訂後 (2025 年 11 月改訂 第 4 版)	改訂前 (2025 年 9 月改訂 第 3 版)
<b>5. 効能又は効果に関連する注意</b> <u>〈ROS1 融合遺伝子陽性の切除不能な進行・再発の非小細胞肺癌〉</u> 省略 (変更なし) <u>〈NTRK 融合遺伝子陽性の進行・再発の固形癌〉</u> 5.3 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、 <u>NTRK 融合遺伝子陽性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：</u> <u><a href="https://www.pmda.go.jp/review-services/drug-reviews/review-information/cd/0001.html">https://www.pmda.go.jp/review-services/drug-reviews/review-information/cd/0001.html</a></u>	<b>5. 効能又は効果に関連する注意</b> 省略 ←追記

改訂後（2025 年 11 月改訂 第 4 版）	改訂前（2025 年 9 月改訂 第 3 版）																								
<p>5.4 本剤の手術の補助療法における有効性及び安全性は確立していない。</p> <p>5.5 臨床試験に組み入れられた患者のがん種等について、「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、17. 1. 2 参照]</p>																									
<p>7. 用法及び用量に関連する注意</p> <p>7.1～7.3 省略（変更なし）</p> <p><b>減量する場合の投与量</b></p> <table><tr><th>減量レベル</th><th colspan="2">1 回投与量</th></tr><tr><td>通常投与量</td><td>160mg</td><td>120mg</td></tr><tr><td>1 段階減量</td><td>120mg</td><td>80mg</td></tr><tr><td>2 段階減量</td><td>80mg</td><td>投与中止</td></tr></table> <p><b>休薬・減量・中止の基準</b></p> <p>省略（変更なし）</p>	減量レベル	1 回投与量		通常投与量	160mg	120mg	1 段階減量	120mg	80mg	2 段階減量	80mg	投与中止	<p>7. 用法及び用量に関連する注意</p> <p>7.1～7.3 省略</p> <p><b>減量する場合の投与量</b></p> <table><tr><th>減量レベル</th><th colspan="2">投与量</th></tr><tr><td>通常投与量</td><td>160mg1 日 1 回</td><td>160mg 1 日 2 回</td></tr><tr><td>1 段階減量</td><td>120mg1 日 1 回</td><td>120mg 1 日 2 回</td></tr><tr><td>2 段階減量</td><td>80mg1 日 1 回</td><td>80mg 1 日 2 回</td></tr></table> <p><b>休薬・減量・中止の基準</b></p> <p>省略</p>	減量レベル	投与量		通常投与量	160mg1 日 1 回	160mg 1 日 2 回	1 段階減量	120mg1 日 1 回	120mg 1 日 2 回	2 段階減量	80mg1 日 1 回	80mg 1 日 2 回
減量レベル	1 回投与量																								
通常投与量	160mg	120mg																							
1 段階減量	120mg	80mg																							
2 段階減量	80mg	投与中止																							
減量レベル	投与量																								
通常投与量	160mg1 日 1 回	160mg 1 日 2 回																							
1 段階減量	120mg1 日 1 回	120mg 1 日 2 回																							
2 段階減量	80mg1 日 1 回	80mg 1 日 2 回																							
<p>9. 特定の背景を有する患者に関する注意</p> <p>9.1～9.4 省略（変更なし）</p> <p>9.5 妊婦</p> <p>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。動物実験（ラット）で、母集団薬物動態解析に基づく推定曝露量（160mg1 日2回）の約2.4倍に相当する投与量で胎児に奇形（後肢異常回転）及び体重の低値が認められている。[9.4参照]</p> <p>9.6～9.7 省略（変更なし）</p>	<p>9. 特定の背景を有する患者に関する注意</p> <p>9.1～9.4 省略</p> <p>9.5 妊婦</p> <p>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。動物実験（ラット）で、臨床曝露量（160mg1 日2回）の約3倍に相当する投与量で胎児に奇形（後肢異常回転）及び体重の低値が認められている。[9.4参照]</p> <p>9.6～9.7 省略</p>																								
<p>11. 副作用</p> <p>11.1 重大な副作用</p> <p>11.1.1 中枢神経系障害</p> <p>めまい（59.0%）、運動失調（27.0%）、認知障害（18.2%）等の中枢神経系障害があらわれることがある。[7.3、8.1 参照]</p> <p>11.1.2 省略（変更なし）</p> <p>11.1.3 骨折（0.4%）</p> <p>11.2 その他の副作用</p> <table><tr><th></th><th>15%以上</th><th>5～15%未満</th><th>5%未満</th><th>頻度不明</th></tr><tr><td>神経系</td><td>味覚不全（味覚障害、味覚消失、感覚障害、異痛症、味覚減退、感覚消失）（53.4%）、錯感覚（知覚過敏、感覚鈍麻、異常感覚、灼熱感、無感覚、蟻走</td><td>頭痛</td><td></td><td></td></tr></table>		15%以上	5～15%未満	5%未満	頻度不明	神経系	味覚不全（味覚障害、味覚消失、感覚障害、異痛症、味覚減退、感覚消失）（53.4%）、錯感覚（知覚過敏、感覚鈍麻、異常感覚、灼熱感、無感覚、蟻走	頭痛			<p>11. 副作用</p> <p>11.1 重大な副作用</p> <p>11.1.1 中枢神経系障害</p> <p>めまい（60.6%）、運動失調（26.0%）、認知障害（19.6%）等の中枢神経系障害があらわれることがある。[7.3、8.1 参照]</p> <p>11.1.2 省略</p> <p>←追記</p> <p>11.2 その他の副作用</p> <table><tr><th></th><th>15%以上</th><th>5～15%未満</th><th>5%未満</th><th>頻度不明</th></tr><tr><td>神経系</td><td>味覚不全（味覚障害、味覚消失、感覚障害、異痛症、味覚減退、感覚消失）（52.9%）、錯感覚（知覚過敏、感覚鈍麻、異常感覚、灼熱感、無感覚、蟻走</td><td>頭痛</td><td></td><td></td></tr></table>		15%以上	5～15%未満	5%未満	頻度不明	神経系	味覚不全（味覚障害、味覚消失、感覚障害、異痛症、味覚減退、感覚消失）（52.9%）、錯感覚（知覚過敏、感覚鈍麻、異常感覚、灼熱感、無感覚、蟻走	頭痛						
	15%以上	5～15%未満	5%未満	頻度不明																					
神経系	味覚不全（味覚障害、味覚消失、感覚障害、異痛症、味覚減退、感覚消失）（53.4%）、錯感覚（知覚過敏、感覚鈍麻、異常感覚、灼熱感、無感覚、蟻走	頭痛																							
	15%以上	5～15%未満	5%未満	頻度不明																					
神経系	味覚不全（味覚障害、味覚消失、感覚障害、異痛症、味覚減退、感覚消失）（52.9%）、錯感覚（知覚過敏、感覚鈍麻、異常感覚、灼熱感、無感覚、蟻走	頭痛																							

改訂後（2025 年 11 月改訂 第 4 版）					改訂前（2025 年 9 月改訂 第 3 版）				
	感） （35.0%）、 末梢性ニューロパチー（神経痛、末梢性感覚ニューロパチー、末梢性運動ニューロパチー、多発ニューロパチー）					感） （36.9%）、 末梢性ニューロパチー（神経痛、末梢性感覚ニューロパチー、末梢性運動ニューロパチー、多発ニューロパチー）			
消化器	便秘 （26.4%）	悪心、下痢、嘔吐、 口の錯感覚	口の感覚鈍麻		消化器	便秘 （26.3%）	悪心、下痢、嘔吐、 口の感覚鈍麻		
全身	疲労		発熱、食欲亢進		全身		疲労	発熱	
筋骨格系	筋力低下	筋肉痛	関節痛、四肢痛		筋骨格系	筋力低下	筋肉痛、 関節痛、四肢痛		骨折
（中略）					（中略）				
眼			霧視、眼窩周囲浮腫、羞明、視力障害、眼瞼痙攣、色覚異常、複視、眼球浮腫、眼痛、眼部腫脹、眼瞼そう痒症、眼窩浮腫、視野欠損、ドライアイ、眼精疲労、夜盲、同名性半盲	結膜炎、白内障、視力低下、硝子体浮遊物、眼血腫、眼瞼損傷、緑内障、眼帯状疱疹	眼		霧視、眼窩周囲浮腫、羞明、視力障害、眼瞼痙攣、色覚異常、複視、眼球浮腫、眼痛、眼部腫脹、眼瞼そう痒症、眼窩浮腫、視野欠損	ドライアイ、眼精疲労、夜盲、結膜炎、白内障、視力低下、硝子体浮遊物、眼血腫、眼瞼障害、眼瞼損傷、緑内障、眼帯状疱疹	
（中略）					（中略）				
その他	貧血 （27.3%）、 ALT 増加、 AST 増加、 血中クレアチンホスホキナーゼ増加	体重増加、 好中球数減少、白血球数減少、 γ-GTP 増加	血中 ALP 増加、心嚢液貯留、転倒、光線過敏性反応		その他	貧血 （25.3%）、 ALT 増加、 AST 増加、 血中クレアチンホスホキナーゼ増加	体重増加、 好中球数減少、白血球数減少	γ-GTP 増加、 血中 ALP 増加、 心嚢液貯留、転倒、 光線過敏性反応	
<b>15. その他の注意</b> <b>15.2.1</b> 省略（変更なし） <b>15.2.2</b> 幼若ラットにおいて、中枢神経系への影響（運動失調、活動性低下）が成熟ラット（30mg/kg/日）よりも低用量である 10mg/kg/日以上で認められた。幼若ラットにおいて、母集団薬物動態解析に基づく小児の推定曝露量（Cmax）の約 2.24 倍の曝露量で中枢神経系に関連した死亡が認められ、母集団薬物動態解析に基づく小児の推定曝露量（AUC）の約 0.1 倍の曝露量で大腿骨長の減少が認められている。					<b>15. その他の注意</b> <b>15.2.1</b> 省略 <b>15.2.2</b> 幼若ラットにおいて、中枢神経系への影響（運動失調、活動性低下）が成熟ラット（30mg/kg/日）よりも低用量である 10mg/kg/日以上で認められた。また、幼若ラットでは、3mg/kg/日群（成人の臨床曝露量（AUC）の約 0.2 倍）で、骨への影響（大腿骨長低値）が認められた。				

## 《「使用上の注意」改訂理由》

### 1) 「5. 効能又は効果に関連する注意」の項

- 5.3 本剤の作用機序を考慮すると、TRIDENT-1 試験及び CARE 試験の臨床試験成績から期待される効果を得るためには、*NTRK* 融合遺伝子陽性を適切な検査によって確認することが重要であることから設定しました。
- 5.4 本剤の手術の補助療法としての有効性及び安全性に関する臨床試験成績が得られていないため設定しました。
- 5.5 本剤の臨床試験における対象患者の情報、及び得られた臨床成績に基づいて適応患者を適切に選択できるようにするため設定しました。

### 2) 「7. 用法及び用量に関連する注意」の項

「*NTRK* 融合遺伝子陽性の固形癌」の用法及び用量の追加に伴い、表「減量する場合の投与量」の記載を変更致しました。

### 3) 「9.5. 妊婦」の項

*NTRK* 融合遺伝子陽性の固形癌患者を含む母集団薬物動態解析による推定曝露量に基づき変更致しました。

### 4) 「11. 副作用」の項

本薬の臨床試験における結果に基づき、「11.1 重大な副作用」に「骨折」、「11.2 その他の副作用」に「口の錯感覚」、「食欲亢進」、「同名性半盲」を新たに記載致しました。本項における副作用発現頻度については、TRIDENT-1 試験及び CARE 試験の結果を合わせて算出し、記載整備致しました。

### 5) 「15. その他の注意」の項

*NTRK* 融合遺伝子陽性の固形癌小児患者を含む母集団薬物動態解析に基づく推定曝露量に変更致しました。

【16. 薬物動態】、【17. 臨床成績】、【18. 薬効薬理】、【21. 承認条件】及び【23. 主要文献】の項につきましても改訂していますので、改訂電子添文をご参照いただきますようお願い申し上げます。

製造販売元

**ブリistol・マイヤーズ スクイブ 株式会社**

東京都千代田区大手町1-2-1

製品に関するお問合せ先

TEL : 0120-093-507 (メディカル情報グループ)

AT/2025-23