

◎ピクトーザ皮下注 [注]

【重要度】★ 【一般製剤名】リラグルチド Liraglutide 【分類】糖尿病治療薬 [GLP-1 受容体作動薬]

【単位】◎6mg/mL [1本3mL]

【常用量】1日1回0.3mgから開始, 1週間以上の間隔を空けて0.3mgずつ増量し0.9mg/日まで増量 [胃腸障害を回避するための漸増]

■1日0.9mgで効果不十分な場合には, 1週間以上の間隔で0.3mgずつ最高1.8mgまで増量可

■消化器症状の発現がなければおよそ1週間程度で0.9mgに増量可能 (児玉暁人,他: 第33回日本病院薬剤師会近畿学術大会要旨集 p193,2012)

【用法】朝または夕に1日1回皮下注 [同時に投与することが望ましい]

■空打ちは1回0.12mgに相当し, 毎回必要■併用薬に制限はない

【透析患者への投与方法】減量の必要なし (1)

【その他の報告】透析患者でも内因性インスリン分泌能が保持されているならば, インスリンからの切り替えは治療の選択肢である (松下隆司, 他: 透析会誌 46: 923-9, 2013) PKは透析日と非透析日で変わらない (Osonoi T, et al: PLoS One 9: e113468, 2014 PMID: 25526642)

腎機能による用量調節の必要はない (Jacobsen LV, et al: Clin Pharmacokinet 55: 657-72, 2016 PMID: 26597252)

【保存期CKD患者への投与方法】減量の必要なし (1)

【その他の報告】腎障害時には減量の必要はないが, 使用経験は限られている (Lalau JD, et al: Kidney Int 87: 308-22, 2015)

腎機能による用量調節の必要はない (Jacobsen LV, et al: Clin Pharmacokinet 55: 657-72, 2016 PMID: 26597252)

消化器症状が発現しやすいため, 低用量で開始し, 増量期間を長くをとることを推奨 [ただし最大1.8mg/日でのデータ] (Idorn T, et al: Diabetes Care 39: 206-13, 2016 PMID: 26283739)

腎機能低下速度を抑制するかもしれない (Osonoi T, et al: Diabetes Technol Ther 2020 PMID: 32348695)

【特徴】インクレチン的一种であるヒトグルカゴン様ペプチド [GLP-1] に脂肪酸を付加して作用の持続化を図った GLP-1 アナログで, 膵β細胞上の GLP-1 受容体に結合してグルコース依存的なインスリン分泌を促す. 血糖が高い場合にはグルカゴン分泌を抑制する. 体重増加をきたしにくい. 膵β細胞機能を改善させるためDM初期への適用が reasonable. 胃腸障害の発現を軽減するために低用量から開始する. インスリン分泌能低下患者には効果が弱いのでインスリンの替わりにはならない

(1) 増量には1週間以上の間隔をおくが, SU剤併用時には2週間後に再受診して低血糖の評価を行った上で増量するなどの慎重さを要する (インクレチンの適正使用に関する委員会報告 2010.10)

【主な副作用・毒性】低血糖 (経口血糖降下剤との併用時に多く, 単独ではSU剤に比べ頻度は低い), 膵炎, 便秘, 下痢, 悪心, 頭痛, 肝機能検査値異常, 注射部位反応, 体重減少, 脱水など. 胃排泄速度の低下が認められ, 投与初期に消化器症状 [特に便秘] が多い (1) 朝にSU剤と併用した場合に低血糖が多い (1) 腹部手術の既往またはイレウスの既往のある患者は慎重投与.

【安全性に関する情報】AKIの症例報告 (Kaakeh Y, et al: Pharmacotherapy 32: e7-11, 2012 PMID: 22392833) 忍容性不良の場合には減量または休薬を考慮し, 1~2日間の減量または休薬で症状が消失すれば元の用量で再開可 (1)

【モニターすべき項目】血糖, 消化器症状

【F】55±37% [sc] (1) 注射部位による差異はない (1)

【tmax】7.5~11hr (1)

【代謝】GLP-1と同様の経路でより緩やかに代謝され, ジペプチジルペプチダーゼ, 中性エンドペプチダーゼが関与する (1) CYP阻害は認められないかごく弱い (1)

【排泄】未変化体としては排泄されず, 分解されて尿中もしくは糞便中に排泄される (1)

【CL】0.0131L/hr/kg [sc] (1)

【t1/2】10~14hr (1)

【蛋白結合率】98.7~99.2% [Alb] (1)

【Vd】0.2~0.29L/kg (1)

【MW】3751.20

【透析性】透析されないとされる (5)

【相互作用】特にインスリン, インスリン分泌を刺激する薬剤との併用時には低血糖に注意 (1)

【小児患者における報告】10~17歳では成人と同量 (Petri KC, et al: Clin Pharmacokinet 54: 663-70, 2015, Klein DJ, et al: Diabetes Technol Ther 16: 679-87, 2014)

【主な臨床報告】2型DM患者での心血管死亡, 非致死的心筋梗塞, 非致死の脳卒中イベントの低下効果 [1.8mg/日] (Marso SP, et al: N Engl J Med 375: 311-22, 2016 PMID: 27295427) 2型DM腎症の進行抑制に効果がある可能性 (Imamura S, et al: Tohoku J Exp Med 231: 57-61, 2013 PMID: 24064677) プラセボと比較してDM性腎症の発症および進展が抑制される (Mann JFE, et al: N Engl J Med 377: 839-48, 2017 PMID: 28854085)

【備考】使用開始後は室温保存し, 30日以内に使用 (1) 動物モデルで甲状腺腫瘍の発現あり (1) メトホルミンに追加した場合, リラグルチドはDPP-4阻害剤のシタグリプチンよりもHbA1cの低下作用に優れている (Pratley RE, et al: Lancet 9724:1447-56, 2010) SMBGも保険適用されている (1) 1本 [18mg] は0.3mg/日のとき42日分, 0.6mg/日のとき25日分, 0.9mg/日のとき17日分の注射が可能 [空打ち0.12mgを含めた計算で開封後30日以内に使用する] [1週間毎に0.3mgから0.6mg, 0.9mgに増量すれば, 1本で23日分となる] (1)

【更新日】20210801

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、直接または間接的に生じた一切の問題について、当院でいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。