

## ◎テネリア OD錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】 テネリグリプチン臭化水素酸塩水和物 Teneligliptin Hydrobromide Hydrate 【分類】 経口血糖降下剤 [選択的DPP-4阻害薬]

【単位】 ◎20mg/錠, ◎40mg/OD錠

【常用量】 20mg/日 [効果不十分な場合 40mg/日まで]

【用法】 1日1回

【透析患者への投与方法】 減量の必要はないが 40mg/日の投与経験は限られている (1)

【その他の報告】 20mg/日 (血液透析患者の糖尿病治療ガイド 2012) 20mg/日はビルダグリプチン 50mg よりも効果が強く, HD 患者の血糖コントロールに有用で低血糖は経験されなかった (Otsuki H, et al: Int Urol Nephrol 46: 427-32, 2014)

CGMにより HD 患者の HD 日, 非 HD とも血糖値の AUC を低下させ, 重度の低血糖をきたさなかった (Wada N, et al: J Diabetes Complications 29: 1310-3, 2015 PMID: 26298521)

T2DM のインスリン必要量を減量可能であり (CGM による) 低血糖頻度も低下された (Yajima T, et al: Diabetes Res Clin Pract 122: 78-83, 2016 PMID: 27810689)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要はないが 40mg/日の投与経験は限られている (1)

【その他の報告】 健常人の AUC と比較して, Ccr 50~80mL/min : 1.25 倍, Ccr 30~49mL/min : 1.68 倍, Ccr 30mL/min 未満 1.49 倍 (1)

腎排泄, 肝代謝両方から消失するので腎障害時の PK 変化は小さいと思われる (Nakamaru Y, et al: Xenobiotica 44: 242-53, 2014)

腎機能低下によっても効果は期待でき, 副作用が増加する傾向は認めない [PMS] (Haneda M, et al: Diabetes Ther 9: 1083-1097, 2018 PMID: 29637459)

【特徴】 DPP-4 阻害により GLP-1 の分解を抑制し, 血糖降下作用を示す。肝, 腎の両ルートで消失し, 半減期が他の DPP-4 阻害薬に比べて長く, 不規則な食生活の T2DM 患者に有用である可能性がある。

【主な副作用・毒性】 低血糖, 腸閉塞, 便秘, 腹痛, 肝機能障害, 間質性肺炎, 蛋白尿, 皮膚障害, CK 上昇, 倦怠感, めまい, 末梢性浮腫, 類天疱瘡など

【安全性に関する情報】 SU 剤, インスリンと併用する場合にはそれらを減量して開始する (1) QT 延長に注意 (1)

【F】 44~83% [サル] (1)

【tmax】 1.0~1.8hr (1) 食後で 2.6hr (1) 1.33hr (Nakamaru Y, et al: Xenobiotica 44: 242-53, 2014)

【代謝】 およそ 20%が肝代謝され, M1~M5 に変換される (1) 主に CYP3A4 が関与 (1) 主代謝物は M1 で活性は低い (1) M4 の活性は未変化体と同程度であるが, AUC 比は 0.3% (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 22% [po, 72hr まで] (1) 尿中回収率 45% [po, 216hr まで] で, 未変化体として 14.8%, M1 として 17.7% (Nakamaru Y, et al: Xenobiotica 44: 242-53, 2014)

【CL】 CL/F 0.169L/hr/kg (1) 腎 CL 37mL/hr/kg (1) 【輸送蛋白】 P-gp の基質で, OAT3 の阻害作用がある (1) P-gp の基質であることが示唆 (Nakamaru Y, et al: Clin Ther 36: 760-9, 2014)

【t1/2】 26~30hr (1)

【蛋白結合率】 77.6~82.2% (1)

【Vd】 資料なし (1) Vd/F=300L/man [計算値] (5)

【MW】 628.86 [anhydrate]

【透析性】 15.6%除去される (1)

【OW 係数】 酸性領域で小さい (1)

【相互作用】 SU 剤またはインスリン製剤との併用時には低血糖発現に特に注意 (1) ケトコナゾール併用でも AUC 上昇度は 1.6 倍 (Nakamaru Y, et al: Clin Ther 36: 760-9, 2014)

【主な臨床報告】 日本人 DM 患者におけるプラセボ対照 RCT (Kadowaki T, et al: Diabetes Obes Metab 15: 810-8, 2013) 40mg に増量後の HbA1c 低下効果は 52.9% に認められ, 有害事象は増加せず, HbA1c の再上昇は体重増加と関連 (Kadowaki T, et al: Diabetes Ther 9: 623-636, 2018 PMID: 29435909)

【備考】 粉砕は推奨していない (1) 簡易懸濁不可。

【更新日】 20211209

※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, 当院では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。