

△スーグラ錠 [内]

【重要度】★★【透析患者に投与禁忌】 【一般製剤名】 イブラグリフロジン L-プロリン Ipragliflozin L-proline 【分類】 糖尿病治療薬 [SGLT2 阻害薬]

【単位】 ▼25mg・△50mg/錠

【常用量】 50mg/日 [最大 100mg/日] ■50mg からの増量で 75mg を経る必要はない■肝機能障害時には 25mg/日

【用法】 分1 [朝食前または後] ■2型 DM にのみ適応

【透析患者への投与方法】 効果が期待できないので投与しない (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 中等度の腎機能障害患者では効果が十分に得られない可能性があり、投与の必要性を慎重に判断する [中等度腎障害患者ではグルコース排泄量が腎機能正常者の 50%程度になる] (1) 重度の腎機能障害患者では効果が期待できないため投与しない [グルコース排泄量が腎機能正常者の 25%程度になる] (1)

【その他の報告】 GFR 低下により尿糖排泄の絶対量は減少するが、CKD G4 まででは効果がある (Ferrannini E, et al: Diabetes Care 36: 1260-5, 2013)

多尿、頻尿により脱水、血圧低下が腎障害に関連する可能性あり注意する [特に高齢者、利尿剤併用者] (1)

一過性に血清 Cre 値の上昇がみられることがあるため腎機能を定期的に検査する (1)

【特徴】 近位尿細管でブドウ糖を再吸収するトランスポーター SGLT2 (Sodium-Glucose Co-transporter 2) の選択的阻害薬。体重増加や低血糖が起りにくいとされる。低栄養を助長する可能性があるため要注意。いずれの経口血糖降下薬との併用も可。1型 DM に関してはインスリンの代替薬とはならないため投与できない設定となっている。特にSU剤、グリニド、インスリンに上乘せ投与する場合には低血糖に注意が必要で、前治療薬の減量が望ましい。

【主な副作用・毒性】 ショック、アナフィラキシー、低血糖 [特に SU 剤、グリニド、インスリン]、腎盂腎炎、膀胱炎、消化器症状、多尿、頻尿、血中ケトン体上昇、尿中ケトン体陽性、eGFR の低下、体液量の減少、尿管結石、肝機能障害、浮動性めまい、陰部掻痒、口渇、体重減少など。腎機能障害が発現することがあるので腎機能を定期的に検査する。

【安全性に関する情報】 血糖コントロールが極めて不良の患者、高齢者、利尿剤併用患者等、脱水を起こしやすい患者には慎重投与 (1) 適度な水分補給を指導する (1) 市販後調査の副作用発現率 10%、皮膚障害が最多で 2.23% (Terauchi Y, et al: Expert Opin Pharmacother 2016 PMID: 26800061)

【吸収】 食事の影響を受けない (1)

【F】 90.2% (1)

【tmax】 1hr (Schwartz SL, et al: Diabetes Technol Ther 13: 1219-1227, 2011) 1~3hr (1)

【代謝】 中等度肝障害患者では減量の必要はない (Zhang W, et al: Clin Drug Investig 33: 489-96, 2013) 小腸では代謝されない (1) P-gp の基質になる (1) グルクロン酸抱合を受け、UGT2B7 が主代謝酵素で、UGT2B4, 1A8, 1A9 も寄与 (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 1% [po] (1) 尿中回収率 67.9%、主にグルクロン酸抱合体として尿中に排泄 [po, 144hr まで] (1) 【CL】 10.9L/hr [iv] (1) 重度腎障害患者では AUC が 1.47 倍に上昇 (1)

【t1/2】 10~15hr (1)

【蛋白結合率】 94.6~96.5% [主に Alb] (1)

【Vd】 127L/man [iv] (1)

【MW】 519.58

【透析性】 資料なし (1) ほとんど除去されないとされる (5)

【O/W 係数】 LogP=2.4 [1-オクタノール水系, pH7.0] (1)

【薬物動態】 線形動態 (Schwartz SL, et al: Diabetes Technol Ther 13: 1219-27, 2011, Kadokura T, et al: Clin Pharmacokinet 53: 975-88, 2014 PMID: 25316572)

【相互作用】 シタグリブチン、グリメピリド、ピオグリタゾンとの薬物動態学的相互作用は認めない (Smulders RA, et al: Diabetes Obes Metab 14: 937-43, 2012) メトホルミンの薬物動態に影響しない (Veltkamp SA, et al: Clin Ther 34: 1761-71, 2012) 利尿剤との併用で利尿作用が過剰に発現する可能性 (1)

【主な臨床報告】 男性に比べて、女性や高齢者被験者で尿中グルコース排泄量が低値の傾向 (Kadokura T, et al: Clin Pharmacokinet 53: 975-88, 2014)

腎機能低下によるグルコース排泄の低下の解析 (Hu S, et al: Front Endocrinol (Lausanne). 2022 PMID: 35154011)

【備考】 インスリン、GLP-1 受容体作動薬との併用における有効性・安全性は未検証 (1) 尿糖陽性、血清 1,5-AG 低値を示すためそれらは参考にできない (1) シックデイには脱水や低栄養を悪化させるおそれがあるため休薬を考慮 (1) 粉砕化可能 (30 日まで、微黄色に着色する可能性はある) であるが、経管栄養時に投与することは通常考えにくい (1,5)

【更新日】 20220507

※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。