

▼アプルウェイ錠・▼デベルザ錠 [内]

【重要度】★★【透析患者に投与禁忌】 【一般製剤名】トホグリフロジン水和物 tofogliflozin hydrate 【分類】糖尿病治療薬 [SGLT2 阻害剤]

【単位】▼20mg/錠

【常用量】20mg/日

【用法】1日1回、朝食前または朝食後

【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 (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 (1)

【その他の報告】副作用としての多尿、頻尿による脱水、血圧低下が AKI を誘発する可能性について考慮し、適切な水分補給を指導しておく (5)

血清クレアチニンの上昇、GFR の低下がみられることがあるため、腎機能を定期的に検査し、経過を十分に観察する (1)

腎 CL は全身 CL の 15%程度のため腎機能低下による PK への影響は限定的 (Schwab D, et al: Clin Pharmacokinetics 52: 463-73, 2013)

【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こりにくいとされる。低栄養を助長する可能性があるため要注意。SU 剤、インスリン製剤と併用する場合には低血糖リスクを軽減するために、SU 剤、インスリン製剤の減量を考慮する。

【主な副作用・毒性】低血糖、頻尿、血中ケトン体増加、口渇、尿路感染、尿量増加、めまい、便秘、下痢、腹痛、性器感染、発疹、尿路結石、頭痛、血圧上昇、上気道炎、体重減少、脱水、倦怠感など

【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) 適切な水分補給を指導する (1)

【吸収】ka=1.50/hr (1)

【F】97.5% (1, Schwab D, et al: Clin Pharmacokinetics 52: 463-473, 2013)

【tmax】

【代謝】肝機能障害患者へは慎重投与 (1) 主代謝物は酸化を受けたエチルフェニル体 (Zell M, et al: Xenobiotica 44: 369-78, 2014) 主代謝物はカルボン酸体でその他に水酸化体、ケトン体が検出 (1)

【排泄】尿中回収率 77% (Schwab D, et al: Clin Pharmacokinetics 52: 463-73, 2013) 尿中回収率 76%でフェニル酢酸体がメジャー (Zell M, et al: Xenobiotica 44: 369-78, 2014)

【CL】10.0L/hr、腎 CL=25.7±5.0mL/min で尿細管分泌を受ける (Schwab D, et al: Clin Pharmacokinetics 52: 463-73, 2013) 9.96±1.25L/hr [iv] (1)

【t1/2】5~6hr (1)

【蛋白結合率】未変化体 82.3~82.6%、カルボン酸体 52.7~55.0% (1)

【Vd】Vss=50.6±6.7L/man (Schwab D, et al: Clin Pharmacokinetics 52: 463-73, 2013) 0.631±0.106L/kg [iv] (1)

【MW】404.45

【透析性】資料なし (1) ある程度除去できると思われる (1)

【O/W 係数】

【相互作用】血糖降下剤：低血糖 (1) 利尿剤：作用の増強と脱水症状の発現に注意 (1) プロベネシド併用で AUC2.33 倍 (1)

【備考】半減期が短く、尿中ブドウ糖濃度の高値が持続しないため、尿路感染症の頻度が低くなる可能性 [マウスモデル] (Suzuki M, et al: Diabetes Obes Metab 2014)

【更新日】20190313

※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。