

▼ザファテック錠 [内]

【重要度】★★ 【一般製剤名】トレラグリブチンコハク酸塩 **trelagliptin succinate** 【分類】経口血糖降下剤 [選択的DPP-4阻害薬]

【単位】▼25mg・▼50mg・▼100mg/錠

【常用量】1回100mg

【用法】1週間に1回経口投与

【透析患者への投与方法】25mg 週1回 (1)

【保存期CKD患者への投与方法】Ccr 30~49mL/min : 50mg 週1回 [AUCが2倍になるため], Ccr 30mL/min未満 : 25mg 週1回 [AUCが3倍になるため] (1)

【特徴】アログリブチンにフッ素を導入した製剤で、1週間に1回投与のDPP-4阻害剤。GLP-1を不活性化するDPP-4活性を阻害することにより、GLP-1の血中濃度を上昇させ、糖濃度依存的に膵臓からのインスリン分泌を促進させる。初期血中濃度が高いこととγ相の半減期が長いことがDPP4阻害活性の持続と関係していると思われる。

【主な副作用・毒性】低血糖、急性膵炎、腸閉塞、発疹、心房細動、肝機能検査値異常、鼻咽頭炎など

【安全性に関する情報】投与中止後も作用が持続するため注意 (1) 海外臨床試験において800mg単回投与時にQT延長が報告 (1)

【F】50.3% [ラット] (1) 尿中排泄率から76%以上 (1)

【tmax】1.3hr (1)

【代謝】CYP2D6によるN-脱メチル化により活性代謝物M-Iに代謝され、ヒト血漿中のM-Iは未変化体の1%未満 (1) M-Iは主にCYP2D6、他の代謝物は主にCYP3A4により生成 (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率76% [po, 168hrまで] (1)

【CL】CL/F=15L/hr, 腎CL=12L/hr (1)

【t1/2】β相19hr, γ相54hr (1) 腎機能低下により延長し、ESRDでは108hr (1)

【蛋白結合率】22.1~27.6% (1)

【Vd/F】700~1300L/man [po] (1)

【MW】475.47

【透析性】4hrのHDにより投与量の9.2%が除去 [po] (1)

【O/W係数】LogP=-0.99 [1-オクタノール/水系, pH7.0] (1) 【pKa】8.6

【相互作用】低血糖関連の相互作用に注意 [特にインスリン, SU剤] (1) P-gp基質 (1) OCT2を阻害, P-gpをわずかに阻害 (1)

【肝障害患者への投与方法】中等度肝障害患者のPKは健常人と同等 (1)

【主な臨床報告】100mg/週投与はアログリブチン25mg/日と効果が同等 (Inagaki N, et al: Lancet Diabetes Endocrinol 3: 191-7, 2015)

【更新日】20191128

※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・配付を禁じます。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。