

◎グルコバイ錠 [内]

【重要度】★★ 【一般製剤名】アカルボース (U) acarbose 【分類】糖尿病治療薬 [α -GI]

【単位】▼50mg・◎100mg/錠

【常用量】150~300mg/日 (1) ■その他の報告: 75mg 分3から開始し、体重60kgまでの患者は150mg 分3まで漸増、60kg以上の患者は300mg 分3まで増量 (Am J Health Syst Pharm 53: 2277-90,1996)

【用法】1日3回食直前

【透析患者への投与方法】不明 (3)

【その他の報告】データがなく提示できないが、低用量から開始 (17) 腎不全では消化器症状などの副作用 (吐血、タール便などの重篤な例も含まれる) が高率に出現するため慎重に投与すべきだという報告もある (Diabetes Frontia 6: 738-41,1995 および透析会誌 29:141-7,1996)

【PD】不明 (3) データがなく提示できないが、低用量から開始 (17) 常用量使用可能 (日本透析医学会:血液透析患者の糖尿病治療ガイド 2012)

【CRRT】避ける (3,17)

【保存期 CKD 患者への投与方法】GFR 50mL/min 以上: 減量の必要なし, GFR 50mL/min 未満は避ける (3)

【その他の報告】GFR>50mL/min: 常用量の50~100%量, GFR<50mL/min: 使用を避ける (12) Ccr 25mL/min 未満の患者では未変化体および活性代謝物の血中濃度が腎機能正常者に比べて4~5倍上昇する (1) データがなく提示できないが、低用量から開始 (17) CKD G3以降では避ける (Lalau JD, et al: Kidney Int 87: 308-22, 2015)

【特徴】小腸の α -グルコシダーゼ (糖質分解酵素) を阻害し、糖質の腸管内での消化・吸収を遅延させることにより、食後の急激な血糖上昇を抑制する作用を示す。 α -アミラーゼ活性も阻害する。

【主な副作用・毒性】劇症肝炎等の肝機能障害 (投与開始後6ヶ月以内に認められることが多いので投与開始後6ヶ月までは月1回、その後も定期的な肝機能検査を行う)、腸閉塞様症状、低血糖、下部消化管症状 (放屁増加、腹部膨満・鼓腸、軟便、排便回数増加、下痢、腹痛など)、精神神経系症状、過敏症、貧血、白血球減少、頻尿

【モニターすべき項目】血糖値、尿糖値、HbA1c、トランスアミナーゼ値、肝機能検査

【吸収】活性体として吸収されるのは2%以下。消化管内で作用するためFは低い方が望ましいが投与量の35%が代謝物として吸収される (U) 初回通過効果はわずか (11)

【F】1% (1) 0.7~1.6% (Pract Diabetes, Supple10: 55,1993) 活性体として2% (U) 1~2% (11)

【tmax】アカルボース 1hr (2) 代謝物 12~24hr (2)

【代謝】消化管内で主に腸内細菌によっていくらかは消化酵素によって代謝され、少なくとも13種類の代謝物になる。それらの1つがアカルボースからブドウ糖分子の分裂によって形成され、 α -グルコシダーゼ活性を持つ。他の主な代謝物は主に硫酸・メチル・グルクロン酸抱合体 (U) 活性代謝物 M-1 の酵素阻害活性はアカルボースとの相対強度で α -アミラーゼに対して0.9、スクラーゼに対して0.3 (1)

【排泄】吸収されなかったアカルボースは96時間以内に投与量の51%が糞便排泄。投与量の約34%が代謝物として尿中排泄。未変化体及び活性代謝物の尿中排泄は投与量の2%以下 (U) 投与量の94%が空腸中に回収されるため小腸では分解も吸収もされない (Gastroenterology 95: 93-9,1988) 尿中未変化体排泄率35% (12) 尿中回収率0.2% [24hr まで] (1)

【t1/2】2hr (U) 2.8hr (11) 3~9hr (12) 【腎不全患者のt1/2】腎機能正常者に比べ延長 (12)

【蛋白結合率】8.5~14.5% (1) 13~18% (11) 15% (12)

【Vd】0.32L/kg (11,12)

【MW】645.6

【透析性】除去されやすい特徴を有している (5) 資料なし (1)

【TDMのポイント】ほとんど吸収されないためTDMの対象にはならない (5)

【O/W係数】<0.004 (11) 水相に分配 [1-オクタノール/水系] (1) 【pKa】5.1

【相互作用】ジゴキシンの血中濃度低下 (1) ジアスターゼ製剤は併用しないのが望ましい (1)

【備考】腹部膨満感、腹鳴、放屁、軟便などの副作用の頻度が高いが、一般に時間の経過と共に消失することが多い。他の糖尿病薬との併用で低血糖を発現することがあるが、その時にはショ糖ではなくブドウ糖を用いる。顕性肝性脳症患者で血中アンモニア濃度を低下させる (Gentile S, et al: Clin Gastroenterol Hepatol 3:184-91,2005)

【更新日】20170123

※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。