

△リベラス錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】セマグルチド（遺伝子組換え） Semaglutide（Genetical Recombination） 【分類】2型糖尿病治療剤 [経口 GLP-1 受容体作動薬]

【単位】△3mg・△7mg・△14mg/錠

【常用量】

■開始量：3mg/日（開始量3mg）：3mgで血糖コントロール良好なら維持量とすることができる

■3mgを4週以上投与後、7mg/日に増量（維持量7mg）

■7mgを4週以上投与しても効果不十分時14mg/日に増量可（強化用量14mg）

【用法】1日1回

1日の最初の食事または飲水の前の空腹時に水120mL以下（最低50mL）で服用

服用時および服用後30分は絶食、他薬内服も避ける

服用忘れ：翌日より予定通りに服用

【透析患者への投与方法】減量の必要なし（5）

【保存期CKD患者への投与方法】PKは腎機能低下の影響を受けない（1, Granhall C, et al: Clin Pharmacokin. 2018 PMID: 29623579）腎機能低下例で有害事象が増加していない（1）

【特徴】経口GLP-1受容体作動薬。膵臓β細胞上のGLP-1受容体に結合して、ATPからcAMPの産生を促進させ、グルコース濃度依存的にインスリンを分泌させる。血糖値が高い場合はグルカゴン分泌を抑制する。ヒトGLP-1アナログで、リラグルチドと同様にアシル化して、さらに化学構造を修飾し、半減期を延長させている。吸収促進剤のサルカプロザートナトリウム（SNAC）により胃からの吸収を可能にしている。SNACは1錠あたり300mg固定。

【主な副作用・毒性】低血糖、胆石症、悪心、下痢、頭痛、便秘、浮動性めまい、味覚異常、疲労、体重減少など

【安全性に関する情報】GLP-1受容体作動薬による胆嚢収縮と排出抑制、胆汁酸の産生減少および炎症による変調が胆石形成を誘発する可能性（1）平均BMI30.8の集団に対するタイトレーション治療12週間で体重2.7kg減（Gibbons C, et al: Diabetes Obes Metab 2021 PMID: 33184979）

【吸収】主に胃から吸収され、吸収促進剤としてサルカプロザートナトリウム含有（1）増量によりAUCはやや低下する非線形性（1）胃摘出患者には不適（1）SNACによる吸収促進に関する解析（Buckley ST, et al: Sci Transl Med 2018 PMID: 30429357）

【F】0.5～1%程度（1）

【tmax】1hr（1）

【代謝】ペプチドの分解、β酸化により代謝（1）SNACは代謝され数時間で消失する（1）

【排泄】尿中未変化体排泄率3.12% [sc]（1）尿中回収率53.0% [sc]（1）

【CL/F】293L/hr（1）

【t1/2】161hr（1）アルブミンの脂肪酸結合部位と特異的に高い親和性を有すること、DPP-4による分解からの保護により半減期が延長（1）

【蛋白結合率】99%以上（1）

【Vd】8L/man（1）アルブミンの分布パターンと同じ（1）

【MW】4113.58

【透析性】除去されないと思われる（5）

【O/W係数】資料なし。なお、pH2～6の範囲で溶解度が大幅に低下するが、SNAC添加によりPPI等併用の影響は認められていない（1）

【相互作用】GLP-1作用による胃排出速度遅延の影響あり（1）

【肝障害患者への投与方法】

【小児CKD患者における報告】

【妊婦・授乳婦への投薬】妊婦には避ける（1）

【主な臨床報告】CVDハイリスク例でのCV死亡、全死亡を抑制（Husain M, et al: N Engl J Med 2019 PMID: 31185157）

【備考】分割、粉砕不可。14mg投与時は7mg錠を2錠適用しない。光に不安定、吸湿性あり、ミシン目以外で切り離さない。

服用後の30分間は食事を除く日常生活活動可能。

【更新日】20220526

※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。