

▼ツイミーグ錠 [内]

【重要度】★★ 【一般製剤名】イメグリミン塩酸塩 Imeglimin Hydrochloride 【分類】2型糖尿病治療薬

【単位】▼500mg/錠

【常用量】1回1000mg, 1日2回

【用法】1日2回 朝・夕

【透析患者への投与方法】eGFR45未満でのデータがなく、投与は推奨されない(1)

【保存期CKD患者への投与方法】eGFR45未満でのデータがなく、投与は推奨されない(1)

プラセボと比較してHbA1cを0.87%低下(24週)させたphase3 [TIMES1] ではeGFR45未満は除外 (Dubourg J, et al: Diabetes Care 2021 PMID: 33574125)

【特徴】グルコース濃度依存的インスリン分泌促進作用及びインスリン抵抗性改善作用により、血糖降下作用を示す。作用機序はミトコンドリアへの作用を介するものと推定。

ミトコンドリア機能を酸化ストレスから保護(活性酸素産生の低下)、脂質酸化を促進し、耐糖能とインスリン感受性を正常化 [ラット] (Vial G, et al: Diabetes 2015 PMID: 25552598)

メトホルミンと類似したテトラヒドロトリアジン構造(グリミン系)。

【主な副作用・毒性】低血糖、消化器症状、

【安全性に関する情報】ピグアナイド系薬剤の作用機序と共通する点があると推測されており、乳酸アシドーシスの発現例は報告されていないが、要注意(1)QT延長に関与しない [健康人 イメグリミン 6000mg/日まで] (Dubourg J, et al: Eur J Clin Pharmacol 2020 PMID: 32556539) ミトコンドリア呼吸鎖への影響がメトホルミンと異なる [ラット] (Vial G, et al: Endocrinol Diabetes Metab 2021 PMID: 33855213)

【吸収】受動輸送と能動輸送の両者が関与 (Clemence C, et al: Drug Metab Dispos 2020 PMID: 33020063)

【F】44%が吸収されると推定(1)

【tmax】

【代謝】ほとんど代謝されない(1)CYPは関与せず、ヒトに特徴的な代謝物なし (Clemence C, et al: Drug Metab Dispos 2020 PMID: 33020063)

【排泄】尿中未変化体排泄率42% [po, 144hrまで] (1)OCT1/2, MATE1/2Kの基質(1)

【CL/F】66.9L/hr (1)

【t1/2】12hr (1)

【蛋白結合率】1.4~6.4% (1)

【Vd】Vc/F 142L/body, Vt/F 374L/body (1)

【MW】191.66 [salt]

【透析性】ある程度除去されるが寄与率は高くないと思われる(5)

【O/W係数】0.001 [1-オクタノール/buffer pH 7.4] (1)

【相互作用】腎トランスポーターOCT2/MATE系の基質であるが、シメチジンとの相互作用は軽度[AUC1.3倍] (Chevalier C, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokinet 2020 PMID: 32860624)

【肝障害患者への投与方法】中等度肝障害患者でAUC1.5倍 (Chevalier C, et al: Clin Pharmacokinet 2021 PMID: 33169345)

【小児CKD患者における報告】

【妊婦・授乳婦への投薬】

【主な臨床報告】

メトホルミンよりも安全性はより高いかもしれない (Pirags V, et al: Diabetes Obes Metab 2012 PMID: 22519919)

メトホルミンに追加投与してさらにHbA1cが低下 (Fouqueray P, et al: Diabetes Care 2013 PMID: 23160726)

DPP-4阻害薬に追加投与してさらにHbA1cが低下 (Fouqueray P, et al: Diabetes Care 2014 PMID: 24722500)

グルコース依存的なインスリン分泌を増強させ血糖降下作用の効率を上げる [グルカゴン分泌には影響しない] (Pacini G, et al: Diabetes Obes Metab 2015 PMID: 25694060)

小胞体のホメオスタシス経路を調節して膵臓β細胞のアポトーシスを抑制 (Li J, et al: Diabetes 2021 PMID: 34588186)

52週投与でHbA1cは単独で0.46%低下, 経口剤併用で0.56~0.92%低下 [TIMES 2] (Dubourg J, et al: Diabetes Obes Metab 2021 PMID: 34866306)

HOMA-IR, TG, LDL-C, HDL-Cなどには影響認めず [メタ解析] (Abdelhaleem IA, et al: Diabetes Metab Syndr 2021 PMID: 34717136)

※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業務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。