

▼オイグルコン錠 [内]

【重要度】★★★【透析患者に投与禁忌】 【一般製剤名】グリベンクラミド (U) Glibenclamide [Glyburide] 【分類】経口血糖降下剤 [SU 剤]

【単位】▼1.25mg・▼2.5mg/錠

【常用量】1.25～2.5mg/日から開始 [最大 10mg]

【用法】分 1～2. 原則として 1 回投与の場合は朝食前又は後, 2 回投与の場合は朝夕それぞれ食前又は食後

【透析患者への投与方法】重篤な腎機能障害のある患者では低血糖を起こすおそれがあるため禁忌 (1)

【その他の報告】未変化体, 活性代謝物 (Jonsson A et al: Eur J Clin Pharmacol 53: 429-35,1998) が腎不全患者では蓄積しやすい (Clin Pharmacokinet 31: 111-9,1996) ため使用を避ける (5) 低血糖リスクのため投与を避ける (17)

透析患者でも薬物動態には大きな変化はないが, 同一投与量でもインスリン分泌は亢進する (Am J Kidney Dis 29: 907-11,1997)

減量の必要なし (10)

【PD】低血糖リスクのため投与を避ける (17)

【CRRT】適用しない (17)

【保存期 CKD 患者への投与方法】CKD G3 以降では投与を避ける (Lalau JD, et al: Kidney Int 87: 308-22, 2015)

【その他の報告】Ccr<50mL/min : 使用を避ける (12)

未変化体, 活性代謝物 (Jonsson A, et al: Eur J Clin Pharmacol 53: 429-35,1998) が腎不全患者では蓄積しやすい (Clin Pharmacokinet 31: 111-119,1996) ため使用を避ける (5)

GFR>50mL/min : 1.25～10mg/日, GFR 30～50mL/min : 1.25～5mg/日, GFR 30mL/min 未満 : 低血糖リスクのため投与を避ける (17)

減量の必要なし (10)

【特徴】膵β細胞を刺激して内因性インスリンの分泌を促進して血糖値を下げる. SU 剤中最も強力な血糖降下作用を有する.

【主な副作用・毒性】低血糖 (投与中止後であっても数日間は再発に注意), 骨髄抑制, 肝機能障害, 胃腸障害, 皮膚過敏症, エタノール耐性低下, 甲状腺機能異常など

【安全性に関する情報】低血糖の相対リスクは他の SU 剤より 1.83 倍高く, 他の全てのインスリン分泌促進薬より 52%高い (Gangji AS, et al: Diabetes Care 30: 389-94, 2007 PMID: 17259518) 65 歳以上の CKD 患者において中止させても HbA1c は上昇しなかった (Aspinall SL, et al: Am J Geriatr Pharmacother 9: 58-68, 2011 PMID: 21459309)

【モニターすべき項目】血糖値, CBC, 尿糖, 尿中ケトン体, HbA1c, 血漿浸透圧, 血清 Na・K, 血清 pH

【吸収】90～100% (11) 吸収は早く良好だが個人差がある. 胃の運動障害や高血糖により吸収が遅延する. 高脂肪食では吸収が低下する (U)

【F】100% (14) 初回通過効果を受けない (11) 製剤により 64～100%と差がある (13) 45% (1)

【tmax】3.4～4.5hr (U) 2～4hr (1) 製剤により 1.5～4hr と変化する (13) 【Cmax】朝食とともに 3mg の経口 glynase 錠を健常者に投与した時の Cmax は 106ng/mL, 5mg の micronase 錠を投与した時の Cmax は 104ng/mL (13)

【代謝】主に CYP2C9, 3A4 で代謝 (1) 肝代謝 (U) 代謝物 4-OH 体のみに未変化体の 15%の活性あり (U) 4-OH 体は最大 75%, 3-OH 体は最大 50%の活性がある (11) CYP2C9*3 により CL/F が低下して AUC が増大 (Yin OQ, et al: Clin Pharmacol Ther 78: 370-7, 2005)

【排泄】尿中回収率 23%でほとんど代謝物 [48hr まで] (1) 尿中未変化体排泄率ほとんど無視できる (13) 糞中 50% (未変化体), 他は尿中排泄 [尿中未変化体排泄率 3%] (Clin Pharmacokinet 31: 111-9,1996) 腎 50%, 胆汁 50% (U) 100%肝代謝であるが, 弱い活性を有する代謝物が 50%尿中排泄 (Lalau JD, et al: Kidney Int 87: 308-22, 2015) 腎不全患者では尿中排泄率が 4-OH 体で 7.2%, 3-OH 体で 26.4% [24hr まで] と低く, 胆汁系などへの代償的な排泄経路が存在するか, 両代謝物が腸肝循環していることが示唆される (Jonsson A, et al: Eur J Clin Pharmacol 53: 429-35,1998)

【CL】91.7mL/min (10) 1.3mL/min/kg (13) 【非腎 CL/総 CL】100% (10)

【t1/2】2.7hr (1) 0.1～10hr (11) 6～12hr (2) 10～16hr (4,10) 1.5～10hr と報告により異なる (10) 15hr (Eur J Clin Pharmacol 53: 429-35,1998) 3.3hr (Am J Kidney Dis 1997 PMID: 9186077) 9hr (14) 4hr, 肝硬変・2型 DM で延長 (13) 【透析患者の t1/2】5.0hr に延長 (Am J Kidney Dis 1997 PMID: 9186077) terminal t1/2 は 15 時間に延長 (Jonsson A, et al: Eur J Clin Pharmacol 53: 429-35,1998)

【蛋白結合率】99%, nonionic (U) 99%以上 (10) 99.8%, 加齢により低下 (13)

【Vd】0.14～0.16L/kg (U) 0.1～0.21L/kg (11) 0.1L/kg (14) 0.20L/kg (13)

【MW】494.00

【透析性】蛋白結合率が高いため, 透析で除去されにくいと思われる (5)

【TDM のポイント】有効治療域 30～50ng/mL (16) 血糖値をモニターすれば投与設計が可能のため TDM の対象にはならない (5)

【相互作用】リファンピシン 600mg×5 日間の併用により AUC が 39%低下し, 血糖降下作用が 44%減弱する (Niemi M, et al: Clin Pharmacol Ther 69: 400-6, 2000) クラリスロマイシン併用により血糖降下作用が増強し, 低血糖症状が起こることがあるため併用注意 (1) インスリン分泌を促進するシベンズリン, ジソピラミド, ピルメノールとの併用注意 (1) オキシカム系消炎剤 : 低血糖 (1)

【効果持続時間】24hr

【更新日】20230316

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。