

## ▼グリコラン錠 [内]

【重要度】★★★【透析患者に投与禁忌】 【一般製剤名】メトホルミン塩酸塩 (U) metformin hydrochloride 【分類】経口血糖降下剤

【単位】▼250mg/錠

【常用量】500mg/日 [最大 750mg]

【用法】分2～3 食後

【透析患者への投与方法】禁忌 (1) 中等度、あるいは重篤な腎不全患者に使用すべきではない (3, Sambol NC, et al: J Clin Pharmacol 35: 1094-1102,1995)

【その他の報告】腎不全患者では乳酸アシドーシスになりやすい (Gan SC, et al: Arch Intern Med 152: 2333-2336,1992)

【保存期腎不全患者への投与方法】乳酸アシドーシスを起こしやすいため、高齢者を含む軽度腎障害を含み腎不全には投与禁忌 (1) 【その他の報告】GFR>50mL/min : 常用量の50%に減量、GFR 10～50mL/min : 常用量の25%に減量、GFR<10mL/min : 使用を避ける (12) GFR 50mL/min 未満では避ける (3)

【重要な基本的注意】ヨード造影剤を用いて検査を行う患者においては、本剤の併用により乳酸アシドーシスを起こすことがあるので、検査前には本剤の投与を一時的に中止すること (ただし、緊急に検査を行う必要がある場合を除く)。ヨード造影剤投与後 48 時間は本剤の投与を再開しないこと。なお、投与再開時には、患者の状態に注意すること (1) 【特徴】膵β細胞のインスリン分泌を介することなく血糖降下作用を示す。末梢での糖利用促進、肝での糖新生抑制、腸管からのグルコース吸収抑制などが主要な作用として提唱されている (1)

【主な副作用・毒性】乳酸アシドーシス (投与開始初期、投与量を増加した場合に発生しやすい)、低血糖、食欲不振、悪心、嘔吐、下痢、便秘 (消化器症状は乳酸アシドーシスの初期症状であることもある)、貧血、白血球減少、血小板減少、発疹、肝機能異常、未満全身倦怠感、頭痛、頭重、眠気。ビグアナイド剤による 乳酸アシドーシスは嘔気・嘔吐、腹痛、下痢、腎障害、昏睡を伴い死亡率は50% (Vambera M: Cas Lek Cesk 129 :562-566,1990)

【吸収】食事により吸収率低下 (U)

【F】50～60% (空腹時) 6時間にわたり吸収は続く (U) 52% (1)

【tmax】約2hr (U,11) 2.4hr (1)

【代謝】代謝されない (1,U,11)

【排泄】糸球体濾過と尿管管分泌により腎排泄され尿中未変化体排泄率 80～100% (1,U,11) 90～100% (12) 便中排泄 30%以下 (U) 【CL】7.62±0.30 mL/min/kg (1) 【腎 CL】450～513 mL/min (U) 腎不全患者では健常者に比しクリアランスが74～78%低下する (Sambol NC, et al: J Clin Pharmacol 35: 1094-1102,1995)

【t1/2】1.5hr (1) 1.5～4.5hr (11) α相 1.7～3hr, β相 9～17hr, 平均 6.2hr (U) 1～5hr (12) 【腎不全患者の t1/2】CCr に比例して 8.9～19hr へ延長する (11)

【蛋白結合率】ほとんど結合しない (1,U,11) 赤血球にゆっくりと結合する (11)

【Vd】654±358L/man (U) 63～276L/man (11) 1～4L/kg (12) 1.12±0.08 L/kg (1)

【MW】165.63

【透析 CL】QB 300mL/min での透析 CL170mL/min (1,11) 効率よく除去され、アシドーシスの補正にも有用 (1)

【TDM のポイント】TDM の対象にはならない 【pKa】5.7-7.7 (1) 【O/W 係数】低い (11) 資料なし (1)

【相互作用】ビタミンB12の吸収と拮抗する (U) 【併用注意】ヨード造影剤による腎機能低下を原因としてメトホルミンによる乳酸アシドーシスを起こすことがある。ヨード造影剤を用いて検査を行う場合には、メトホルミンの投与を一時的に中止し、造影剤投与後 48hr はメトホルミンを投与再開しない (1) ヨード造影剤使用の際は、使用の2日前から2日後までの間、投与を中止する (糖尿病治療ガイド p49,2010)

【効果発現】ラットに200mg/kgを静注し投与30分後に22%の血糖値の低下が認められている(1)

【備考】BG 剤の乳酸アシドーシスは、BG 薬が肝ミトコンドリア細胞膜に結合して、NADPH 上昇から、TCA サイクルの活性化、ピルビン酸デヒドロゲナーゼの低下から乳酸産生を増加させる機序がある。

【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。