◎ネシーナ錠 [内]

【重要度】★★ 【一般製剤名】アログリプチン安息香酸塩 Alogliptin Benzoate 【分類】経口血糖降下剤 [選択的DPP-4阻害薬]

【単位】◎6.25mg・▼12.5mg・△25mg/錠

【常用量】25mg/日

【用法】1日1回

【透析患者への投与方法】1日1回6.25mg (1)

【その他の報告】

自己内服管理が困難な2型糖尿病患者に対し、比較的半減期の長いアログリプチンを毎透析後に6.25～12.5mg投与し、血糖コントロールを図った報告(松井道大, 他; 透析会誌 45:S842,2012)

【保存期CKD患者への投与方法】Ccr 30～49mL/min : 1日1回12.5mg, Ccr 30mL/min未満 : 1日1回6.25mg (1)

【その他の報告】高齢者では腎機能障害を有している例が多いため適切に用量を調節 (1)

【特徴】DPP-4阻害剤。腎排泄性であるが、分布容積が大きく消失は比較的遅い。α-GIにより糖質の吸収が小腸上部から下部へ移動することで小腸上部に存在するK細胞からのGIP分泌が抑制され、小腸下部L細胞からのGLP-1分泌が増加するため、α-GIとの併用でGLP-1の高濃度が持続する可能性が指摘されている。

【主な副作用・毒性】腹部膨満、鼓腹、イレウス、かゆみ、頭痛、めまい、倦怠感、低血糖(他の血糖降下剤併用時)、間質性肺炎、浮腫、便秘、類天疱瘡など

【吸収】ボグリボースとの併用でCmaxが10.3%、AUCが21.6%低下する(1) 消化管吸収にOATP(2B1以外)の関与が示唆(Morimoto K, et al: Biol Pharm Bull 2021 PMID: 33952821)

【F】35.8±7.1% [ラット], 85.4±4.9% [イヌ] (1) ヒトでは尿中回収率から70%以上と思われる(1)

【tmax】1hr以内 (Covington P, et al: Clin Ther 30: 499-512, 2008) 1～2hr (Christopher R, et al: Clin Ther 30: 513-27, 2008) 1.0～1.4hr (1)

【代謝】CYP2D6によりN-脱メチル化され活性代謝物M-1に、N-アセチル化により非活性代謝物M-2に代謝されるが、未変化体に対するAUC比はM-1で1%未満、M-2で6%未満(1) M-1の活性は未変化体と同等(1) N-脱メチル体のM-1、N-アセチル体のM-2が生成するが、未変化体のそれぞれ2%、6%未満(Christopher R, et al: Clin Ther 2008 PMID: 18405789) M-1以外の代謝には主にCYP3A4が関与(1)

【排泄】尿中回収率60.8～63.4% [72hrまで] (Covington P, et al: Clin Ther 2008 PMID: 18405788) 60～71% [72hrまで] (Christopher R, et al: Clin Ther 2008 PMID: 18405789) 尿管分泌が関与(1)

【CL】15.75L/hr (1) 腎CL10.7±1.3L/hr (1) で腎排泄の20～50%がOCTを介した尿管分泌によると推測される(1) 【非腎CL/全身CL比】0.32 (1)

【t1/2】12.5～21.1hr (Covington P, et al: Clin Ther 2008 PMID: 18405788) 12.4～21.4hr (Christopher R, et al: Clin Ther 2008 PMID: 18405789) 単回投与で17hr (1) 17～28hr (1) 軽度腎障害40hr, 中等度腎障害40hr, 高度腎障害60hr, 末期腎不全80hr (1)

【蛋白結合率】28～38% (1)

【Vd】430L/man [CV25%] (1)

【MW】461.51

【透析性】除去されない(1) 3hrのHDでの除去率7.2% (1)

【O/W係数】logP=-0.5 [1-オクタノール/水系, 25°C, pH7.4] (1) 【pKa】8.5 (1)

【相互作用】血糖に影響する他の薬剤 (1)

【主な臨床報告】ACS後の患者を対象にした試験ではCVイベント抑制を認めていない(White WB, et al: N Engl J Med 2013 PMID: 23992602)

【備考】SU剤との併用時には低血糖のリスクが高まることを考慮してSU剤を減量しておくなどの対応が必要(1) 粉砕は可能と思われるが原薬の苦みがある(フィルムコーティング錠) (1) チアグリジン系薬剤との併用時には浮腫に注意(1) 腹部手術の既往または腸閉塞の機能のある患者はイレウス発現の可能性のため慎重投与(1)

【更新日】20250528

※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。