

◎オングリザ錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】 サキサグリプチン Saxagliptin Hydrate 【分類】 経口血糖降下剤 [選択的 DPP-4 阻害薬]

【単位】 ◎2.5mg・△5mg/錠

【常用量】 5mg/日 [状態に応じて 2.5mg/日]

【用法】 1日1回 [服用タイミングの指定はない]

【透析患者への投与方法】 2.5mg/日 (1)

【その他の報告】 2.5mg/日 [HD 日はHD 後] (FDA) 2.5mg/日投与で血糖値の改善効果が得られた (生方政光, 他: 透析会誌 47:731-6, 2014) 2.5mg/日で適用できる (大月伯恭, 日腎会誌 59:866, 2017)

HD 患者に 2.5mg で適用可 (Abe M, et al: Diabetes Res Clin Pract 116: 244-52, 2016 PMID: 27321342)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 Ccr 50mL/min 未満 [男性 Scr 1.4, 女性 Scr 1.2 over] の中等度腎機能障害患者では排泄遅延により血中濃度が上昇するため 2.5mg/日 (1)

【その他の報告】 Ccr 30mL/min 未満: 未変化体の AUC が 2 倍に上昇 (1)

健康人に比べ、未変化体の AUC は軽度腎障害で 16%、中等度腎障害で 41%、高度腎障害で 108% 上昇し、5-水酸化体の AUC は軽度腎障害で 67%、中等度腎障害で 192%、高度腎障害で 347% 上昇する (Boulton DW, et al: Clin Pharmacokinet 50: 253-65, 2011)

GFR>55mL/min : 2.5~5mg/日, GFR 55mL/min 以下 : 2.5mg/日 (17)

CKD G3 以降は 2.5mg/日 (Lalau JD, et al: Kidney Int 87: 308-22, 2015)

腎障害患者では 2.5mg/日で有効で安全 (Nowicki M, et al: Int J Clin Pract 65: 1230-9, 2011)

微量アルブミン尿を改善 (Udell JA, et al: Diabetes Care 38: 696-705, 2015)

血糖コントロールとは独立してアルブミン尿を改善する可能性 (Mosenzon O, et al: Diabetes Care 40: 69-76, 2017 PMID: 27797925)

CKD に伴う CYP3A4 活性低下の PK への影響はわずか (Butrovich MA, et al: J Clin Pharmacol 2022 PMID: 35247279)

【特徴】 DPP-4 を阻害し、GLP-1 の血中濃度を上昇させる。すべての血糖降下剤、インスリンとの併用が可能。DPP-4 に対する Ki 値が低く、解離半減期が 50 分と他の DPP-4 阻害薬に比べ長い。心血管イベント・死亡のリスク低下作用も示されている。

【主な副作用・毒性】 低血糖、急性膵炎、過敏反応、腸閉塞、めまい、消化器症状、肝機能障害、霧視、動悸、鼻咽頭炎、咳など

【安全性に関する情報】 NYHA III~IV の心不全のある患者には慎重投与 (1) 心不全のリスク上昇に関連 [心不全の既往、NT-proBNP 高値、中等度以上の腎機能障害がリスク因子と思われる] (Scirica BM, et al: Circulation 130: 1579-88, 2014 PMID: 25189213)

【吸収】 ka=4.61/hr (1)

【F】 74.9%以上 [尿中回収率より] (1)

【tmax】 空腹時 0.8hr, 食後 1.5~2.0hr (1)

【代謝】 CYP3A4/5 により代謝 (1) P-gp の基質である (1) 5-水酸化体には活性がある (1) 肝障害患者では減量の必要はない (Boulton DW, et al: Clin Pharmacokinet 50: 253-65, 2011)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 15.8%、活性代謝物 22.2% [po, 24hr まで] (1) 24% [po, 168hr まで] (1) 尿中回収率 75% [po, 168hr まで] (1)

【CL/F】 35.9L/hr (1) 腎 CL 177mL/min で尿管分泌が関与 (1) 活性代謝物 5.95L/hr (1)

【t1/2】 6~11hr (1)

【蛋白結合率】 結合しない (1)

【Vd】 Vc 85.2L/man, Vt 102L/man (1)

【MW】 333.43

【透析性】 4hr の HD で 4%が除去 (1) 4hr の HD で活性体の合計として 23%除去される (Boulton DW, et al: Clin Pharmacokinet 50:253-65, 2011)

【O/W 係数】 0.607 [1-オクタノール/水系, pH7.0] (1) 【pKa】 7.3

【相互作用】 リファンピシンにより活性体の AUC が 27%低下するが、臨床的意義は小さい (Upreti VV, et al: Br J Clin Pharmacol 72: 92-102, 2011) CYP3A4 の強力な阻害剤との併用時は減量を考慮 (1)

【主な臨床報告】 CV リスク軽減を認めず (Scirica BM, et al: N Engl J Med 2013 PMID: 23992601)

【更新日】 20230323

※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、当院では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。