

## △リベラス錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】セマグルチド（遺伝子組換え） Semaglutide (Genetical Recombination) 【分類】2型糖尿病治療剤 [経口 GLP-1 受容体作動薬]

【単位】△3mg・△7mg・△14mg/錠 [吸収促進剤 SNAC 300mg 含有]

【常用量】

■開始量：3mg/日（開始量3mg）：3mg で血糖コントロール良好なら維持量とすることができる

■3mg を4週以上投与後、7mg/日に増量（維持量7mg）

■7mg を4週以上投与しても効果不十分時14mg/日に増量可（強化用量14mg）

※DPP-4 阻害薬との併用不可

【用法】1日1回

1日の最初の食事または飲水の前の空腹時に水120mL以下（最低50mL）で服用

服用時および服用後30分は絶飲食、他薬内服も避ける

服用忘れ：翌日より予定通りに服用

▼休薬後の再開：基本的に3mgから再開（高用量からの再開のデータがないため）

【透析患者への投与方法】常用量（1）

【保存期 CKD 患者への投与方法】常用量（1）腎機能低下例で有害事象が増加していない（1）

PKは腎機能低下の影響を受けない（1, Granhall C, et al: Clin Pharmacokinet 2018 PMID: 29623579）

【特徴】経口 GLP-1 受容体作動薬。膵臓β細胞上の GLP-1 受容体に結合して、ATP から cAMP の産生を促進させ、グルコース濃度依存的にインスリンを分泌させる。血糖値が高い場合はグルカゴン分泌を抑制する。ヒト GLP-1 アナログで、リラグルチドと同様にアシル化して、さらに化学構造を修飾し、半減期を延長させている。吸収促進剤のサルカプロザートナトリウム（SNAC）により胃からの吸収を可能にしている。SNACは1錠あたり300mg固定。

【主な副作用・毒性】低血糖、胆石症、悪心、下痢、頭痛、便秘、浮動性めまい、味覚異常、疲労、体重減少など

【安全性に関する情報】GLP-1受容体作動薬による胆嚢収縮と排出抑制、胆汁酸の産生減少および炎症による変調が胆石形成を誘発する可能性（1）平均BMI 30.8の集団に対するタイトレーション治療12週間で体重2.7kg減（Gibbons C, et al: Diabetes Obes Metab 2021 PMID: 33184979）

【吸収】主に胃から吸収され、吸収促進剤としてサルカプロザートナトリウム含有（1）増量によりAUCはやや低下する非線形性（1）胃摘出患者には不適（1）SNACによる吸収促進に関する解析（Buckley ST, et al: Sci Transl Med 2018 PMID: 30429357）

【F】0.5～1%程度（1）

【tmax】1hr（1）

【代謝】ペプチドの分解、β酸化により代謝（1）SNACは代謝され数時間で消失する（1）

【排泄】尿中未変化体排泄率3.12% [sc]（1）尿中回収率53.0% [sc]（1）

【CL/F】293L/hr（1）

【t1/2】161hr（1）アルブミンの脂肪酸結合部位と特異的に高い親和性を有すること、DPP-4による分解からの保護により半減期が延長（1）

【蛋白結合率】99%以上（1）

【Vd】8L/man（1）アルブミンの分布パターンと同じ（1）

【MW】4113.58

【透析性】除去されないと思われる（5）

【O/W係数】資料なし。なお、pH2～6の範囲で溶解度が大幅に低下するが、SNAC添加によりPPI等併用の影響は認められていない（1）

【相互作用】GLP-1作用による胃排出速度遅延の影響あり [レボチロキシンのAUC増大]（1）

【肝障害患者への投与方法】

【小児CKD患者における報告】

【妊婦・授乳婦への投薬】妊婦には避ける（1）

【主な臨床報告】CVDハイリスク例でのCV死亡、全死亡を抑制（Husain M, et al: N Engl J Med 2019 PMID: 31185157）

HbA1c低下度においてデュラグルチド0.75mg/週とセマグルチド7mgが同等で、14mgなら低下度が有意に大きい[P3: PIONEER 10]（Yabe D, et al: Lancet Diabetes Endocrinol. 2020 PMID: 32333876）

【備考】分割、粉砕不可。14mg投与時は7mg錠を2錠適用しない。光に不安定、吸湿性あり、ミシン目以外で切り離さない。

服用後の30分間は食事を除く日常生活活動可能

他の経口血糖降下薬未使用で本剤を使用する際にはその理由をレセプトに記載（当然やせ薬として使用しない）

【更新日】20240911

※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。