

DI 委員会トピックス

世界初、週 1 回の経口血糖降下薬

持続性選択的 DPP-4 阻害剤－2 型糖尿病治療剤－「ザファテック®錠」

糖尿病治療においては、血糖コントロールのため長期にわたる治療継続が必要である。しかし薬の飲み忘れや、低血糖・体重増加といった副作用発現などによる服薬コンプライアンスの低下が大きな問題となっていた。

近年、2 型糖尿病に対しては、DPP-4 阻害薬や GLP-1 受容体作動薬、選択的 SGLT2 阻害薬など作用機序が異なる薬剤が登場し、広く臨床で使用されている。

〈インクレチンと DPP-4〉

食物の流入を感知して消化管から分泌されるインクレチン（グルカゴン様ペプチド-1 [GLP-1 : Glucagon-like peptide-1] などの消化管ホルモン）は、分解酵素であるジペプチジルペプチダーゼ-4 (DPP-4 : Dipeptidyl peptidase-4) により、体内では半減期 2～3 分という短い時間で分解される。インクレチンは膵β細胞からのインスリン分泌を増強する作用を持つが、血糖値が下がるとインクレチンを介したインスリンの分泌が停止するため、単剤では低血糖が極めて起きにくいとされている。また、GLP-1 は、胃内容の排出遅延、β細胞保護、グルカゴン分泌の抑制といった作用も有している。

トレラグリプチンコハク酸塩錠（ザファテック®錠）は、持続性選択的 DPP-4 阻害剤であり、2015 年 3 月 26 日に製造販売が承認された。2 型糖尿病に対する、世界初、週 1 回の経口血糖降下薬である。

〈用法用量〉

通常、成人にはトレラグリプチンとして 100mg を 1 週間に 1 回経口投与する。

※中等度腎機能障害患者では、排泄の遅延により本剤の血中濃度が上昇するため、投与量を減量する。

〈作用機序〉

食事の経口摂取刺激により腸管から血中に分泌される GLP-1 を不活性化する DPP-4 活性を阻害することにより、GLP-1 の血中濃度を上昇させ、糖濃度依存的に膵臓からのインスリン分泌を促進させる。

〈薬理作用〉

①DPP-4 に対する阻害作用 ②活性型 GLP-1 濃度増加作用 ③耐糖能改善作用

〈副作用〉

承認時までの国内の臨床試験では、901 例中の 103 例（11.4%）に臨床検査値の異常を含む副作用が認められた。主なものは、低血糖、鼻咽頭炎、リパーゼ上昇等。重大な副作用として低血糖（0.1～5%未満）、急性膵炎（類薬）、腸閉塞（類薬）があらわれることがある。

本剤は週 1 回服用する薬剤であり、適正使用のための患者指導が不可欠である。①同一曜日に服用すること、②服用を忘れた場合は気づいた時点で決められた用量のみを服用し、その後はあらかじめ定められた曜日に服用すること、などを具体的に患者に説明しておく必要がある。

参考

- ・ザファテック®錠 添付文書
- ・ザファテック錠 100mg・50mg 製品紹介 <http://www.takedamed.com/hpdr/rootDir/medicine/zafatek/>
- ・糖尿病リソースガイド <http://dm-rg.net/>
- ・「インクレチン（GLP-1 受容体作動薬と DPP-4 阻害薬）の適正使用に関する委員会」から：日本糖尿病学会 <http://www.jds.or.jp/uploads/photos/797.pdf>
- ・日経メディカル <http://medical.nikkeibp.co.jp/>