

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2018（2019年更新版）に準拠して作成

選択的DPP-4阻害薬

[2型糖尿病治療薬]

ビルダグリプチン錠

ビルダグリプチン錠50mg「ニプロ」

Vildagliptin Tablets

剤形	錠剤（素錠）
製剤の規制区分	処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	ビルダグリプチン錠 50mg「ニプロ」 1錠中 ビルダグリプチン 50mg
一般名	和名：ビルダグリプチン（JAN） 洋名：Vildagliptin（JAN）
製造販売承認年月日	製造販売承認年月日：2024年8月15日
薬価基準収載年月日	薬価基準収載年月日：2024年12月6日
販売開始年月日	販売開始年月日：2024年12月6日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：ニプロ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ニプロ株式会社 医薬品情報室 TEL：0120-226-898 FAX：050-3535-8939 医療関係者向けホームページ： https://www.nipro.co.jp/

本IFは2025年10月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

(2020年4月改訂)

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IFと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、「IF記載要領2018」が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってIFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IFを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目 次

I. 概要に関する項目	5. 臨床成績	12
1. 開発の経緯	1	
2. 製品の治療学的特性	1	
3. 製品の製剤学的特性	1	
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	2	
6. RMPの概要	2	
II. 名称に関する項目	VI. 薬効薬理に関する項目	
1. 販売名	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	17
2. 一般名	2. 薬理作用	17
3. 構造式又は示性式	VII. 薬物動態に関する項目	
4. 分子式及び分子量	1. 血中濃度の推移	18
5. 化学名（命名法）又は本質	2. 薬物速度論的パラメータ	20
6. 慣用名，別名，略号，記号番号	3. 母集団（ポピュレーション）解析	21
	4. 吸収	21
	5. 分布	21
	6. 代謝	22
	7. 排泄	22
	8. トランスポーターに関する情報	23
	9. 透析等による除去率	23
	10. 特定の背景を有する患者	23
	11. その他	25
III. 有効成分に関する項目	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	
1. 物理化学的性質	1. 警告内容とその理由	26
2. 有効成分の各種条件下における安定性	2. 禁忌内容とその理由	26
3. 有効成分の確認試験法，定量法	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	26
	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	26
	5. 重要な基本的注意とその理由	26
	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	27
	7. 相互作用	28
	8. 副作用	29
	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	31
	10. 過量投与	31
	11. 適用上の注意	31
	12. その他の注意	31
IV. 製剤に関する項目	IX. 非臨床試験に関する項目	
1. 剤形	1. 薬理試験	33
2. 製剤の組成	2. 毒性試験	33
3. 添付溶解液の組成及び容量		
4. 力価		
5. 混入する可能性のある夾雑物		
6. 製剤の各種条件下における安定性		
7. 調製法及び溶解後の安定性		
8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）		
9. 溶出性		
10. 容器・包装		
11. 別途提供される資材類		
12. その他		
V. 治療に関する項目	X. 管理的事項に関する項目	
1. 効能又は効果	1. 規制区分	34
2. 効能又は効果に関連する注意	2. 有効期間	34
3. 用法及び用量		
4. 用法及び用量に関連する注意		

3. 包装状態での貯法	34	14. 保険給付上の注意	35
4. 取扱い上の注意	34		
5. 患者向け資材	34	X I . 文献	
6. 同一成分・同効薬	34	1. 引用文献	36
7. 国際誕生年月日	34	2. その他の参考文献	37
8. 製造販売承認年月日及び承認番号, 薬価 基準収載年月日, 販売開始年月日	34	X II . 参考資料	
9. 効能又は効果追加, 用法及び用量変更 追加等の年月日及びその内容	34	1. 主な外国での発売状況	38
10. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及び その内容	35	2. 海外における臨床支援情報	38
11. 再審査期間	35	X III . 備考	
12. 投薬期間制限に関する情報	35	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行う にあたっての参考情報	39
13. 各種コード	35	2. その他の関連資料	41

略語表

略語	略語内容
ALP	alkaline phosphatase : アルカリホスファターゼ
ALT	alanine aminotransferase : アラニンアミノトランスフェラーゼ (=GPT)
AST	aspartate aminotransferase : アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ (=GOT)
AUC	area under curve : 血中濃度-時間曲線下面積
CK (CPK)	creatine kinase : クレアチンキナーゼ (creatine phosphokinase : クレアチンホスホキナーゼ)
CL _{cr}	creatinine clearance : クレアチニンクリアランス
CL _R	腎クリアランス
C _{max}	最高血漿中濃度
CRP	C-reactive protein : C反応性蛋白〔質〕
CT	computed tomography、computerized tomography : コンピュータ断層撮影、コンピュータトモグラフィ
CYP	cytochrome P450 (シトクロム P450)
DPP-4	dipeptidyl peptidase 4 : ジペプチジルペプチダーゼ 4
GLP-1	glucagon-like peptide-1 : グルカゴン様ペプチド-1
γ-GTP	gamma-glutamyl transpeptidase : γグルタミルトランスぺプチダーゼ
HbA1c	hemoglobin A1c : ヘモグロビン A1c
IC ₅₀	50%阻害濃度
JDS	Japan Diabetes Society : 日本糖尿病学会
K _i	inhibition constant : 阻害定数
LC/MS/MS	液体クロマトグラフィー/タンデムマススペクトロメトリー
LDH	lactate dehydrogenase : 乳酸デヒドロゲナーゼ、乳酸脱水素酵素
MAO	monoamine oxidase : モノアミン酸化酵素、モノアミノオキシダーゼ
NGSP	National Glycohemoglobin Standardization Program
NYHA	New York Heart Association : ニューヨーク心臓協会
RMP	Risk Management Plan : 医薬品リスク管理計画
S. D.	standard deviation : 標準偏差
SGLT	sodium dependent glucose transporter : ナトリウム依存性糖輸送体
t _{1/2}	消失半減期
T _{max}	Time to reach maximum concentration in plasma : 最高血漿中濃度到達時間

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

ビルダグリプチン製剤は、選択的 DPP-4 阻害薬であり、本邦では 2010 年に上市されている。1錠中にビルダグリプチンを 50mg 含有するビルダグリプチン錠 50mg「ニプロ」は、ニプロ株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬食発 1121 第 2 号（平成 26 年 11 月 21 日）に基づき規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2024 年 8 月に承認を取得、2024 年 12 月に販売を開始した。

なお、ビルダグリプチン錠 50mg「ニプロ」は後発医薬品として、ニプロ株式会社、全星薬品工業株式会社の合計 2 社による共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得た。

2. 製品の治療学的特性

○ビルダグリプチンは、DPP-4 を選択的かつ可逆的に阻害し、内因性 GLP-1 の濃度を高めることで、血糖依存性にインスリン分泌を促進させるとともにグルカゴン分泌を抑制し、血糖降下作用を発揮する¹⁾⁻³⁾。

○臨床的には、2 型糖尿病に有用性が認められている。

○重大な副作用としては、肝炎、肝機能障害、血管性浮腫、低血糖、横紋筋融解症、急性膵炎、イレウス、間質性肺炎、類天疱瘡が報告されている。（「VIII. 8. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

○錠剤には、「一般名」・「含量」（表面） / 「一般名」・「含量」・「屋号」（裏面）の両面インクジェット印字を施した。

○PTP シートの表面には、1 錠ごとに「一般名」・「含量」、1 スリットごとに「糖尿病用薬」を表示し、裏面には、1 錠ごとに「一般名」・「含量」・「屋号」・「GS1 コード」・「糖尿病用薬」を表示した。

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料、 最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先
RMP	無	
追加のリスク最小化活動として 作成されている資料	無	
最適使用推進ガイドライン	無	
保険適用上の留意事項通知	無	

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

Ⅱ. 名称に関する項目

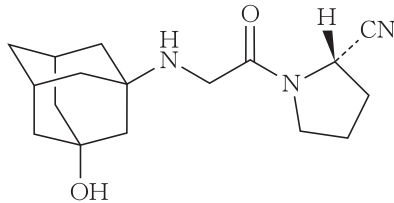
1. 販売名

- (1) 和 名 : ビルダグリプチン錠 50mg 「ニプロ」
- (2) 洋 名 : Vildagliptin Tablets
- (3) 名称の由来 : 有効成分であるビルダグリプチンに剤形及び含量を記載し、社名である「ニプロ」を付した。

2. 一般名

- (1) 和 名(命名法) : ビルダグリプチン (JAN)
- (2) 洋 名(命名法) : Vildagliptin (JAN)
- (3) ステム (stem) : dipeptidyl aminopeptidase-IV inhibitors : -gliptin

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : $C_{17}H_{25}N_3O_2$

分子量 : 303.40

5. 化学名(命名法)又は本質

(2*S*)-1-[[(3-Hydroxytricyclo[3.3.1.1^{3,7}]dec-1-yl)amino]acetyl]pyrrolidine-2-carbonitrile (JAN)

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

該当資料なし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色～微黄白色又は微灰白色の粉末である。

(2) 溶解性

水、メタノール又はエタノール (99.5) に溶けやすく、アセトニトリルにやや溶けやすい。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点 (分解点), 沸点, 凝固点

該当資料なし

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

該当資料なし

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法, 定量法

確認試験法

赤外吸収スペクトル測定法 (臭化カリウム錠剤法)

定量法

電位差滴定法

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

錠剤（素錠）

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	性状	外形・大きさ		
		直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
ビルダグリプチン錠 50mg「ニプロ」	白色～微黄白色の割線 入りの素錠			
		8.0	3.6	205

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	有効成分	添加剤
ビルダグリプチン錠 50mg「ニプロ」	1錠中 ビルダグリプチン 50mg	乳糖水和物、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、クロスポビドン、ステアリン酸マグネシウム

(2) 電解質等の濃度

該当資料なし

(3) 熱量

該当資料なし

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

加速試験⁴⁾

試験条件：40±2℃、75±5%RH

PTP 包装：包装形態（無延伸ポリプロピレン、アルミ箔（アルミピロー））

項目及び規格	開始時	1 カ月	3 カ月	6 カ月
性状（白色～微黄白色の片面割線入りの素錠である）	適合	適合*	適合*	適合
確認試験	適合	—	—	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合
製剤均一性試験	適合	—	—	適合
溶出試験	適合	適合*	適合*	適合
含量（95.0～105.0%）	99.81	99.73	99.31	99.17
	99.92	99.91	99.40	99.25
	99.86	99.52	98.94	99.29

1 ロット（n=3、*n=1）、3 ロット

バラ包装：包装形態（高密度ポリエチレン瓶、ポリエチレン緩衝材、乾燥剤付きポリプロピレンキャップ）

項目及び規格	開始時	1 カ月	3 カ月	6 カ月
性状（白色～微黄白色の片面割線入りの素錠である）	適合	適合*	適合*	適合
確認試験	適合	—	—	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合
製剤均一性試験	適合	—	—	適合
溶出試験	適合	適合*	適合*	適合
含量（95.0～105.0%）	99.81	99.82	99.43	99.42
	99.92	99.68	99.56	99.75
	99.86	99.68	99.25	99.41

1 ロット（n=3、*n=1）、3 ロット

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 カ月）の結果、通常の市場流通下において 3 年間安定であることが推測された。

無包装状態での安定性⁵⁾

試験条件：①温度 40℃±2℃、3 カ月（保存形態：遮光、気密容器）

②湿度 75%RH±5%RH/25℃±2℃、3 カ月（保存形態：遮光・開放）

③光 120 万 lx・hr（25℃±2℃/60%RH±5%RH）（保存形態：透明・気密容器）

『錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）』における試験法を参考にし、同評価基準に従い評価した結果は以下の通りである。

試験結果：

保存条件	外観	含量	硬度 (19.6N 以上)	溶出性
〈開始時〉	白色の片面割線入りの素錠	[温度・湿度] 99.8% (適合) [光] 98.8% (適合)	[温度・湿度] 70N (適合) [光] 59N (適合)	適合
①温度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
②湿度	変化なし	変化なし	[1 カ月] 35N (規格内) [3 カ月] 26N (規格内)	変化なし
③光	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

〈参考〉

保存条件	純度試験 (類縁物質)	水分活性
〈開始時〉	適合	15.6%
①温度	規格内	[1 カ月] 18.0% [3 カ月] 17.7%
②湿度	規格内	[1 カ月] 67.4% [3 カ月] 67.4%
③光	規格内	[60 万 lx・hr] 52.44% [120 万 lx・hr] 52.62%

温度・湿度；試験回数（外観・溶出性：1 回、含量・純度試験（類縁物質）：3 回、硬度：5 回、水分活性：規格なし・20 回）

光；試験回数（外観・溶出性：1 回、含量・純度試験（類縁物質）：3 回、硬度：10 回、水分活性：規格なし・1 回）

分割後の安定性⁶⁾

試験条件：①温度 40℃±2℃、3 カ月（保存形態：遮光、気密容器）

②湿度 75%RH±5%RH/25℃±2℃、3 カ月（保存形態：透明・開放）

③光 120 万 lx・hr（25℃±2℃/60%RH±5%RH）（保存形態：透明・開放）

『錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）』における試験法を参考にし、同評価基準に従い評価した結果は以下の通りである。

試験結果：

保存条件	含量	溶出性
〈開始時〉	99.1%（適合）	適合
①温度	変化なし	変化なし
②湿度	変化なし	変化なし
③光	変化なし	変化なし

〈参考〉

保存条件	純度試験 （類縁物質）
〈開始時〉	適合
①温度	規格内
②湿度	規格内
③光	規格内

試験回数（溶出性：1 回、含量・純度試験（類縁物質）：3 回）

アルミピロー開封後の安定性⁷⁾

試験条件：湿度 75%RH±5%RH/25℃±2℃、3 カ月（保存形態：PTP 包装 [無延伸ポリプロピレン、アルミニウム]）

『錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）』における試験法を参考にし、同評価基準に従い評価した結果は以下の通りである。

試験結果：

保存条件	外観	含量	硬度 (19.6N 以上)	溶出性
〈開始時〉	白色の片面割線入りの素錠	99.8%（適合）	70N（適合）	適合
湿度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

〈参考〉

保存条件	純度試験 (類縁物質)	水分活性
〈開始時〉	適合	15.6%
湿度	規格内	[1 カ月] 35.0% [3 カ月] 51.1%

試験回数 (外観・溶出性：1回、含量・純度試験 (類縁物質)：3回、硬度：5回、水分活性：規格なし・20回)

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化 (物理化学的变化)

該当資料なし

9. 溶出性

溶出挙動における類似性⁸⁾

(「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン：平成9年12月22日 医薬審第487号、平成13年5月31日一部改正 医薬審発第786号、平成18年11月24日一部改正 薬食審査発第1124004号、平成24年2月29日一部改正 薬食審査発0229第10号及び令和2年3月19日一部改正 薬生薬審発0319第1号」)

試験方法：日本薬局方一般試験法溶出試験法 (パドル法)

試験条件

装置	回転数	試験液	試験液量	温度	製剤の投与数
パドル法	50rpm	pH1.2 = 日本薬局方溶出試験第1液	900mL	37±0.5℃	1錠/ 1ベッセル
		pH4.0 = 薄めた McIlvaine の緩衝液			
		pH6.8 = 日本薬局方溶出試験第2液			
		水			

判定基準：試験製剤の平均溶出率を、標準製剤の平均溶出率と比較する。

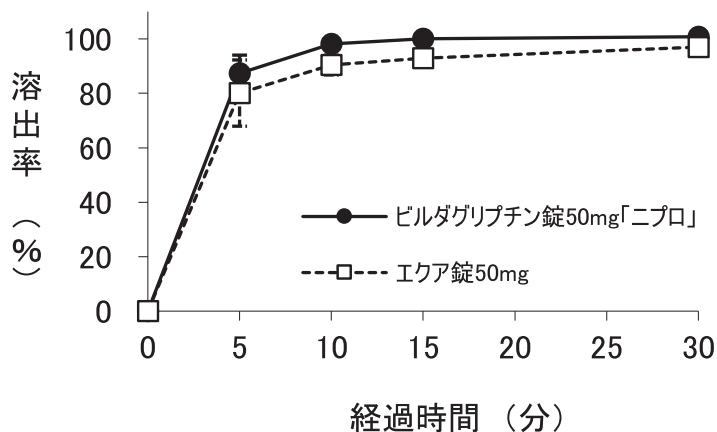
すべての溶出試験条件において、以下の基準に適合するとき、溶出挙動が類似しているとする。

標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合：

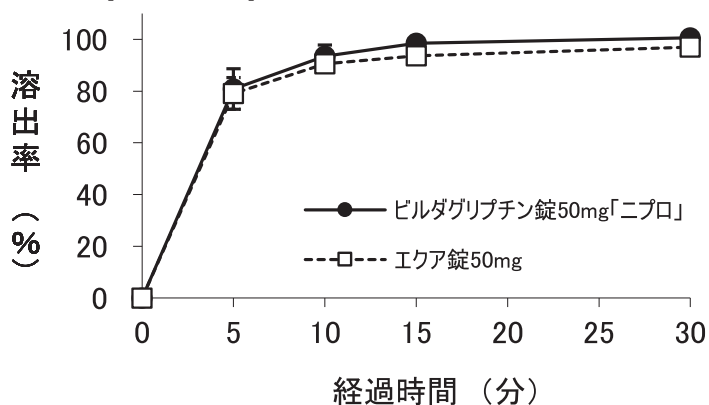
試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出する。

試験結果：同等性試験ガイドラインに従ってビルダグリプチン錠 50mg「ニプロ」と標準製剤（エクア錠 50mg）の溶出挙動を比較した。その結果、全ての条件において溶出挙動の類似性の判定基準を満たしていたため、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

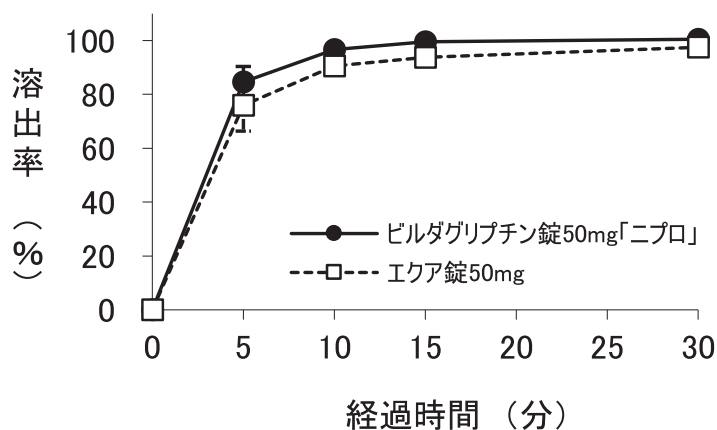
試験液 pH1.2 (50rpm) における平均溶出曲線 (mean±S.D.、n=12)



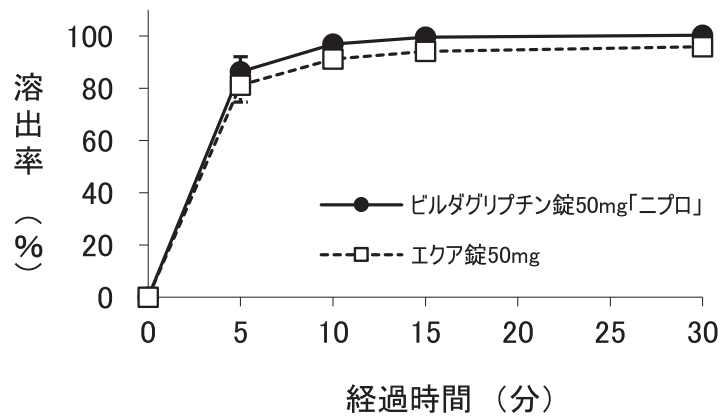
試験液 pH4.0 (50rpm) における平均溶出曲線 (mean±S.D.、n=12)



試験液 pH6.8 (50rpm) における平均溶出曲線 (mean±S.D.、n=12)



試験液 水 (50rpm) における平均溶出曲線 (mean±S. D.、n=12)



10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装, 外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

22. 包装

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

100錠 [瓶、バラ、乾燥剤入り]

500錠 [10錠 (PTP) ×50]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

PTP包装

PTP: ポリプロピレン、アルミニウム

アルミピロー: アルミニウム、ポリエチレン

バラ包装

容器: ポリエチレン

キャップ: ポリプロピレン、乾燥剤 (シリカ・アルミナ)

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

自動分包機への適合性確認試験⁹⁾

使用した分包機・試験条件において、未加湿品及び加湿品において欠けが認められた。なお、印字のかすれについては、いずれの条件下においても認められなかった。

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 効能・効果
2型糖尿病

2. 効能又は効果に関連する注意

5. 効能・効果に関連する注意
本剤の適用はあらかじめ糖尿病治療の基本である食事療法、運動療法を十分に行った上で効果が不十分な場合に限り考慮すること。

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

6. 用法・用量
通常、成人には、ビルダグリプチンとして50mgを1日2回朝、夕に経口投与する。
なお、患者の状態に応じて50mgを1日1回朝に投与することができる。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

7. 用法・用量に関連する注意
中等度以上の腎機能障害のある患者又は透析中の末期腎不全患者では、本剤の血中濃度が上昇するおそれがあるので、50mgを1日1回朝に投与するなど、慎重に投与すること。
[9.2.1、16.6.1参照]

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

17.1.1 国内第Ⅱ相試験

食事療法、運動療法のみで血糖コントロールが十分に得られていない2型糖尿病患者（291例）を対象に、ビルダグリプチン10、25、50mg又はプラセボを1日2回12週間経口投与し、プラセボ対照、二重盲検、比較試験を実施した。主要評価項目をHbA1c（JDS）値の投与前からの変化量として実施した。低血糖症の発現割合はビルダグリプチン10、25、50mg及びプラセボが、それぞれ4.2%（71例中3例）、0%（72例中0例）、2.6%（76例中2例）及び1.4%（72例中1例）であった^{10)、11)}。（本剤の用法・用量は50mgを1日2回又は1回である。）

プラセボ対照二重盲検比較試験（12週時）の結果

	HbA1c（JDS） （%）	
	投与前からの変化量	プラセボとの差
プラセボ	0.28	—
ビルダグリプチン10mg 1日2回	-0.53	-0.82 [#]
ビルダグリプチン25mg 1日2回	-0.67	-0.95 [#]
ビルダグリプチン50mg 1日2回	-0.92	-1.20 [#]

#：p<0.001（閉手順により検定の多重性を調整）

17.1.2 国内第Ⅲ相試験

食事療法、運動療法のみで血糖コントロールが十分に得られていない2型糖尿病患者（239例）を対象に、ビルダグリプチン50mg1日1回、50mg1日2回、100mg1日1回又はプラセボを12週間経口投与し、プラセボ対照、二重盲検、比較試験を実施した。主要評価項目をHbA1c（JDS）値の投与前からの変化量として実施した。投与12週のHbA1c（JDS）値の変化量（50mg1日1回、50mg1日2回、100mg1日1回、プラセボ）は、それぞれ-0.78%、-0.86%、-0.86%、0.13%であり、ビルダグリプチンはプラセボに対し、いずれも有意な低下を示し（p<0.001、有意水準5%（Hochbergのステップアップ法）、血糖コントロールを改善させた。また、低血糖症はいずれの投与群でも認められなかった¹²⁾。（本剤の用法・用量は50mgを1日2回又は1回である。）

17.1.3 国内第Ⅲ相試験

食事療法、運動療法のみで血糖コントロールが十分に得られていない2型糖尿病患者（380例）を対象に、ビルダグリプチン 50mg1日2回又はボグリボース 0.2mg1日3回を12週間経口投与し、実薬対照、二重盲検、比較試験を実施した。主要評価項目をHbA1c（JDS）値の投与前からの変化量として実施した。低血糖症の発現割合はビルダグリプチンが0%（188例中0例）、ボグリボースが0.5%（192例中1例）であった^{13), 14)}。

実薬対照二重盲検比較試験（12週時）の結果

	HbA1c（JDS） （%）		空腹時血糖 （mg/dL）		食後血糖2時間値 （mg/dL）	
	投与前から の変化量	ボグリボース との差	投与前から の変化量	ボグリボース との差	投与前から の変化量	ボグリボース との差
ボグリ ボース	-0.38	—	-7.81	—	-19.79	—
ビルダグ リプチン	-0.95	-0.57**	-24.06	-16.25**	-51.50	-31.71**

※：p<0.001

17.1.4 国内第Ⅲ相試験

食事療法、運動療法に加えスルホニルウレア剤単独で血糖コントロールが十分に得られていない2型糖尿病患者（202例）を対象に、ビルダグリプチン 50mg1日2回又はプラセボをスルホニルウレア剤に加え12週間経口投与し、プラセボ対照、二重盲検、比較試験を実施した。主要評価項目をHbA1c（JDS）値の投与前からの変化量として実施した。投与12週のHbA1c（JDS）値の変化量はビルダグリプチンが-1.00%、プラセボが-0.06%であり、ビルダグリプチンはプラセボに対し、有意（p<0.001）な低下を示し、血糖コントロールを改善させた。また、低血糖症の発現割合はビルダグリプチンが2.0%（102例中2例）、プラセボが1.0%（100例中1例）であった¹⁵⁾。

2) 安全性試験

17.1.5 国内第Ⅲ相試験

食事療法、運動療法のみで血糖コントロールが十分に得られていない2型糖尿病患者（103例）、もしくは、食事療法、運動療法に加えスルホニルウレア剤単独で血糖コントロールが十分に得られていない2型糖尿病患者（53例）を対象に、ビルダグリプチン 50mg1日2回もしくはスルホニルウレア剤に加えビルダグリプチン 50mg1日2回を52週間経口投与し、長期投与試験を実施した。主要評価項目は長期投与時の安全性を確認することとした。いずれも投与開始初期

から血糖コントロールを改善し、52週にわたって安定した血糖コントロールが得られた。最終評価時のHbA1c (JDS) 値の変化量はそれぞれ-0.80%、-0.64%であった。また、低血糖症の発現割合はビルダグリプチン単剤投与が0% (103例中0例)、スルホニルウレア剤との併用療法が3.8% (53例中2例)であった¹⁶⁾。

17.1.6 国内第Ⅲ相試験

食事療法、運動療法に加えメトホルミン、チアゾリジン剤、 α -グルコシダーゼ阻害剤又は速効型インスリン分泌促進剤 (グリニド) 単独で血糖コントロールが十分に得られていない2型糖尿病患者 (58例、62例、62例、63例) を対象に、各薬剤に加えビルダグリプチン 50mg1日2回を52週間経口投与し、長期投与試験を実施した。主要評価項目は長期併用投与時の安全性を確認することとした。いずれも投与開始初期から血糖コントロールを改善し、52週にわたって安定した血糖コントロールが得られた。最終評価時のHbA1c (JDS) 値の変化量はメトホルミンとの併用では-0.75%、チアゾリジン剤との併用では-0.92%、 α -グルコシダーゼ阻害剤との併用では-0.94%、グリニドとの併用では-0.64%であった。また、低血糖症の発現割合はメトホルミンとの併用では1.7% (58例中1例)であった。チアゾリジン剤、 α -グルコシダーゼ阻害剤、グリニドとの併用では低血糖症は認められなかった¹⁷⁾。

[11.1.3 参照]

(5) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査 (一般使用成績調査, 特定使用成績調査, 使用成績比較調査), 製造販売後データベース調査, 製造販売後臨床試験の内容

17.2.1 国内製造販売後臨床試験

食事療法、運動療法に加えインスリン製剤単独又はインスリン製剤に加えメトホルミン併用で血糖コントロールが十分に得られていない2型糖尿病患者 (156例) を対象に、ビルダグリプチン 50mg1日2回又はプラセボをインスリン製剤併用下で12週間経口投与し、プラセボ対照、二重盲検、比較試験を実施した。主要評価項目はHbA1c (NGSP) 値の投与前からの変化量とした。投与12週のHbA1c (NGSP) 値の変化量はビルダグリプチンが-1.01%、プラセボが-0.11%であり、ビルダグリプチンはプラセボに対し、有意 ($p < 0.001$) な低下を示し、血糖コントロールを改善させた。また、低血糖症の発現割合はビルダグリプチンが6.4% (78例中5例)、プラセボが1.3% (78例中1例)であった¹⁸⁾。

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当資料なし

(7) その他

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

DPP-4 阻害薬

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

18.1 作用機序

グルカゴン様ペプチド-1 (GLP-1) は、インスリン分泌促進作用及びグルカゴン分泌抑制作用を有し、糖代謝において重要な役割を果たしている。ビルダグリプチンは、DPP-4 を選択的かつ可逆的に阻害し、内因性 GLP-1 の濃度を高めることで、血糖依存性にインスリン分泌を促進させるとともにグルカゴン分泌を抑制し、血糖降下作用を発揮する¹⁾⁻³⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 DPP-4 阻害作用

ビルダグリプチンはヒト血漿 DPP-4 を濃度依存的に阻害し、 IC_{50} 値は 2.7nM であった¹⁹⁾。また、ビルダグリプチンは、ヒト DPP-4 (組換え体) に対して高い親和性を示し、 K_i 値は 2~3nM であった¹⁾。

18.3 血漿 GLP-1 に対する作用

2 型糖尿病患者にビルダグリプチン 50mg を 1 日 2 回 7 日間反復経口投与すると、血漿 GLP-1 濃度が上昇した²⁰⁾。

18.4 インスリン抵抗性に対する作用

2 型糖尿病患者にビルダグリプチン 50mg を 1 日 2 回 41 日間反復経口投与し、インスリンクランプ試験を実施したところ、インスリン抵抗性を表す指標が改善した^{21)、22)} (外国人のデータ)。

18.5 血糖降下作用及び耐糖能改善作用

18.5.1 前糖尿病期及び 2 型糖尿病のカニクイザルにビルダグリプチンを 1 日 1 回 10 週間反復経口投与すると、HbA1c が、投与前値に比較してそれぞれ 0.6% 及び 1.2% 低下した²³⁾。

18.5.2 2 型糖尿病患者にビルダグリプチン 50mg を 1 日 2 回 7 日間反復経口投与すると、食後血糖及び空腹時血糖が低下した²⁰⁾。

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与

健康成人男子にビルダグリプチン 25、50、100、200 及び 400mg を単回経口投与したとき、ビルダグリプチンは速やかに吸収され、血漿中の未変化体は投与後 1.33～2.75 時間で最高血漿中濃度に到達した。また、 C_{max} 及び AUC は投与量の増加に比例して増大し、消失半減期は 200mg まで約 2 時間であった²⁴⁾。(本剤の用法・用量は 50mg を 1 日 2 回又は 1 回である。)

ビルダグリプチン 50mg を単回経口投与したときの血漿中薬物動態パラメータ

C_{max} (ng/mL)	T_{max} (h)	AUC _{0-t} (ng・h/mL)	$T_{1/2}$ (h)
272±77	2.00±1.26	1,139±80	1.77±0.23

n=6、平均値±標準偏差

16.1.2 反復投与

2 型糖尿病患者 (16 例) にビルダグリプチン 50mg を 1 日 2 回 7 日間反復経口投与したときの、投与 1 日目及び 7 日目の薬物動態パラメータを以下に示す。

血漿中トラフ濃度より算出した累積率はおよそ 1 であり、ビルダグリプチン 50mg を 1 日 2 回 7 日間反復投与したとき血漿中への累積は認められなかった^{20)、25)}。

ビルダグリプチン 50mg を 1 日 2 回 7 日間経口投与したときの
血漿中薬物動態パラメータ

投与日	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (h)	AUC _{0-12h} (ng・h/mL)	$T_{1/2}$ (h)	R_{ac}
1	524±186	※1.0 (0.5、2.0)	1,480±312	1.78±0.31	—
7	415±105	※1.0 (0.5、2.0)	1,490±344	2.41±0.77	1.01±0.11

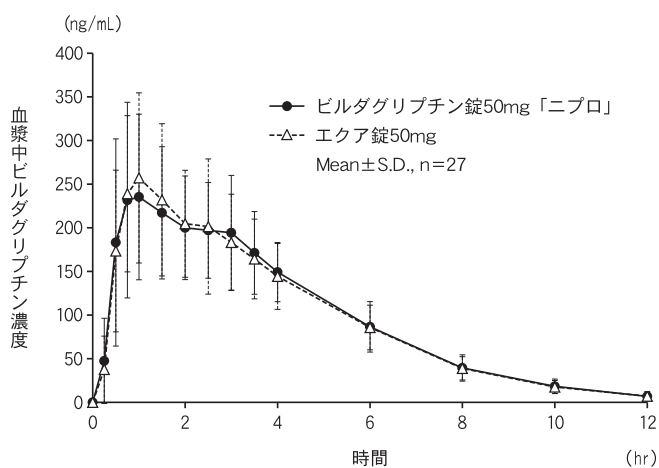
n=16、平均値±標準偏差、※：中央値 (最小値、最大値)、 R_{ac} ：累積率 [投与 7 日目の AUC_{0-12h}/投与 1 日目の AUC_{0-12h}]

生物学的同等性試験⁸⁾

生物学的同等性試験ガイドライン

(「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン：平成9年12月22日 医薬審第487号、平成13年5月31日一部改正 医薬審発第786号、平成18年11月24日一部改正 薬食審査発第1124004号、平成24年2月29日一部改正 薬食審査発0229第10号及び令和2年3月19日一部改正 薬生薬審発0319第1号」)

ビルダグリプチン錠50mg「ニプロ」とエクア錠50mgのそれぞれ1錠(ビルダグリプチンとして50mg)を、2剤2期のクロスオーバー法により健康成人男子に絶食単回経口投与してLC/MS/MS法にて血漿中ビルダグリプチン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ($AUC_{0\rightarrow 12hr}$ 、 C_{max})について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\rightarrow 12hr}$ (ng・hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
ビルダグリプチン錠50mg「ニプロ」	1175.71±159.58	307.75±100.91	1.6±1.0	1.7±0.2
エクア錠50mg	1173.82±167.21	307.93±77.49	1.5±0.9	1.7±0.2

(Mean ± S. D. , n=27)

血漿中濃度並びに AUC 、 C_{max} 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

16.2 吸収

16.2.1 食事の影響

健康成人（24例）にビルダグリプチン 100mg を食後に単回経口投与したとき、 C_{max} は空腹時投与に比べ 19%低下した。 T_{max} は、ビルダグリプチン投与前に食事を摂取することにより 1.75 時間から 2.5 時間に延長された²⁶⁾（外国人のデータ）。（本剤の用法・用量は 50mg を 1 日 2 回又は 1 回である。）

ビルダグリプチン 100mg を単回経口投与したときの血漿中薬物動態パラメータ

投与日	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (h)	AUC_{0-t} (ng・h/mL)
空腹時	538±149	*1.75 (0.75、4.0)	2,500±564
食後	431±95	*2.5 (0.5、6.0)	2,215±403

n=24、平均値±標準偏差、※：中央値（最小値、最大値）

16.7 薬物相互作用

日本人 2 型糖尿病患者（24 例）を対象にビルダグリプチン 50mg を 1 日 2 回及びボグリボース 0.2mg を 1 日 3 回 3 日間併用投与したとき、投与 3 日目のビルダグリプチンの C_{max} 及び AUC_{0-12h} は単独投与時と比べそれぞれ 34%及び 23%低下したが、DPP-4 阻害への影響は認められなかったことから、ボグリボースとの併用時にビルダグリプチンの用量調節は必要ないと考えられた²⁷⁾。

外国人健康成人を対象にアムロジピン、バルサルタン、シンバスタチン、ラミプリル、ワルファリン、ジゴキシリン、また、外国人 2 型糖尿病患者を対象にグリブライド、ピオグリタゾン、メトホルミンとの薬物間相互作用を検討した。ビルダグリプチン及び併用薬の薬物動態は変化しなかった²⁸⁾⁻³³⁾。

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

健康成人単回経口投与

投与量	50mg (50mg×1錠、n=27)
kel (/hr)	0.4076±0.0396

(Mean±S. D.)

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

16.2 吸収

16.2.2 生物学的利用率

健康成人（12例）にビルダグリプチン 50mg を経口投与したときのバイオアベイラビリティは約 85%であった³⁴⁾（外国人のデータ）。

5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

〈参考〉

「Ⅷ. 6. (5) 妊婦」の項参照。

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

〈参考〉

「Ⅷ. 6. (6) 授乳婦」の項参照。

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

(6) 血漿蛋白結合率

16.3 分布

ビルダグリプチンの *in vitro* 血漿蛋白結合率は 9.3%であった³⁵⁾。

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

16.4.2 健康成人男子（4例）に¹⁴C標識したビルダグリプチン 100mgを単回経口投与したとき、血漿中には主として未変化体（血漿中全活性の25.7%）及びシアノ基が加水分解された不活性代謝物（M20.7、55.5%）が存在し、その他グルクロン酸抱合体（9.5%）及びアミド結合の加水分解代謝物（8.1%）が認められた。尿及び糞中の主な代謝物は、M20.7（56.5%）であり、その他にグルクロン酸抱合体（4.4%）、アミド結合の加水分解代謝物（3.7%）が認められた。グルクロン酸抱合体はビルダグリプチンと同等のジペプチジルペプチダーゼ-4（DPP-4）阻害活性を示すが、M20.7の阻害活性は極めて弱く、アミド結合加水分解代謝物は阻害活性を示さなかった³⁶⁾⁻⁴⁰⁾（外国人のデータ）。（本剤の用法・用量は50mgを1日2回又は1回である。）

(2) 代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率

16.4 代謝

16.4.1 ビルダグリプチンはCYP2A6、2B6、2C8、2C9、2C19、2E1、2J2、3A4では代謝されなかった。また、CYP1A2、2B6、2C8、2C9、2C19、2D6、2E1、3A4/5を阻害せず、CYP1A2、2C8、2B6、2C9、2C19、3Aを誘導しなかった⁴¹⁾⁻⁴³⁾（*in vitro*）。

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

「VII. 6. (1) 代謝部位及び代謝経路」の項参照。

7. 排泄

16.5 排泄

16.5.1 健康成人男子（6例）にビルダグリプチン 50mgを単回経口投与した場合、投与後36時間までに未変化体として22.7%が尿中に排泄され、腎クリアランスは9.83L/h（164mL/min）であった。ビルダグリプチンの尿中への排泄は、能動的な尿細管分泌の関与が示唆される^{24)、44)}。[10. 参照]

16.5.2 健康成人男子（4例）に¹⁴C標識したビルダグリプチン 100mgを単回経口投与したとき、168時間以内に投与した放射能の85%が尿中に、15%が糞中に排泄された。尿及び糞中に排泄された未変化体の割合はそれぞれ投与量の23%及び5%であった³⁶⁾（外国人のデータ）。（本剤の用法・用量は50mgを1日2回又は1回である。）

〈参考〉

「VIII. 7. 相互作用」の項参照。

8. トランスポーターに関する情報

16.5 排泄

16.5.3 ビルダグリプチンは基底膜側の有機アニオントランスポーター、有機カチオントランスポーター等によって輸送されない。また、P糖蛋白の輸送基質であることが示されている（みかけの K_m 値が 0.5mM 以上）⁴⁵⁾ (*in vitro*)。

9. 透析等による除去率

「VII. 10. 特定の背景を有する患者」及び「VIII. 10. 過量投与」の項参照。

10. 特定の背景を有する患者

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 腎機能障害患者

軽度から重度の腎機能障害患者（24例）にビルダグリプチン 100mg を単回経口投与したとき、ビルダグリプチンの AUC_{0-t} は健康被験者に比べて軽度、中等度、重度の腎機能障害患者及び血液透析が必要な患者でそれぞれ 2.01 倍、1.31 倍、2.33 倍、1.42 倍高く、 C_{max} はそれぞれ 1.66 倍、1.08 倍、1.56 倍、1.24 倍高かった。M20.7 の AUC_{0-24h} は、軽度、中等度、重度の腎機能障害患者及び血液透析が必要な患者で健康被験者よりそれぞれ 1.7 倍、2.6 倍、6.1 倍、6.7 倍高く、 C_{max} はそれぞれ 1.6 倍、2.4 倍、5.4 倍、8.1 倍高かった。透析によってビルダグリプチンは投与量の約 3% が除去された。M20.7 は透析によって血漿中濃度が透析前の 50% 以下に低下した⁴⁶⁾。

軽度から重度の腎機能障害患者（48例）にビルダグリプチン 50mg を 1 日 1 回 14 日間経口投与したとき、ビルダグリプチンの AUC_{0-24h} は健康被験者に比べて軽度、中等度、及び重度の腎機能障害患者でそれぞれ 1.40 倍、1.71 倍、2.00 倍高く、 C_{max} はそれぞれ 1.37 倍、1.32 倍、1.36 倍高かった。M20.7 の AUC_{0-24h} は、軽度、中等度、及び重度の腎機能障害患者で健康被験者よりそれぞれ 1.66 倍、3.20 倍、7.30 倍高く、 C_{max} はそれぞれ 1.57 倍、2.56 倍、5.55 倍高かった。グルクロン酸抱合体の AUC_{0-24h} は、軽度、中等度、及び重度の腎機能障害患者で健康被験者よりそれぞれ 1.35 倍、2.69 倍、7.25 倍高く、 C_{max} はそれぞれ 1.13 倍、1.60 倍、3.00 倍高かった⁴⁷⁾（外国人のデータ）。（本剤の用法・用量は 50mg を 1 日 2 回又は 1 回である。）[7.、9.2.1 参照]

健康被験者及び腎機能障害患者にビルダグリプチン 100mg を単回経口投与時の薬物動態パラメータ

投与群 (腎機能障害の程度)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (h)	AUC_{0-t} (ng · h/mL)	$T_{1/2}$ (h)	CL_R (L/h)
健康被験者 n=24	477±114	*1.00 (0.50、2.00)	1,872±461	3.95±1.82	12.36±3.36
軽度 n=6	792±229	*1.50 (1.50、2.00)	3,764±967	2.83±0.76	6.06±2.71
中等度 n=6	514±279	*1.25 (0.50、2.00)	2,451±1,343	3.89±1.64	5.98±4.21
重度 n=6	745±235	*1.00 (0.50、4.00)	4,363±2,069	3.55±0.35	1.44±0.75
血液透析の 必要な患者 n=6	591±166	*1.50 (1.50、3.00)	2,656±532	8.05±6.26	—

平均値±標準偏差、※：中央値（最小値、最大値）

軽度：CLcr が 50～80mL/min、中等度：CLcr が 30～50mL/min、重度：CLcr が 30mL/min 未満

16.6.2 肝機能障害患者

軽度から重度の肝機能障害患者（16例）にビルダグリプチン 100mg を単回経口投与したとき、軽度及び中等度の肝機能障害患者におけるビルダグリプチンの AUC_{0-t} は、それぞれ 20%及び 8%低下したが、重度の肝機能障害患者では 22%上昇した。軽度、中等度の肝機能障害患者の C_{max} は健康被験者と比べて約 25%低かったが、重度の肝機能障害患者では健康被験者と同程度であった。軽度、中等度、重度の肝機能障害患者の M20.7 の AUC_{0-t} は、健康被験者と比べてそれぞれ 27%、49%、92%高く、同様に C_{max} はそれぞれ 23%、46%、65%高かった^{48)、49)}（外国人のデータ）。（本剤の用法・用量は 50mg を 1 日 2 回又は 1 回である。）

健康被験者及び肝機能障害患者にビルダグリプチン 100mg を単回経口投与時の薬物動態パラメータ

投与群 (肝機能障害の程度)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (h)	AUC_{0-t} (ng · h/mL)	$T_{1/2}$ (h)
健康被験者 n=6	675 ± 263	*1.25 (1.00、3.00)	2,567 ± 428	2.01 ± 0.50
軽度 n=6	497 ± 229	*1.25 (1.00、2.00)	2,076 ± 514	4.92 ± 4.86
中等度 n=6	512 ± 166	*1.00 (0.50、3.00)	2,411 ± 740	3.08 ± 1.59
重度 n=4	632 ± 247	*2.04 (1.00、4.00)	3,322 ± 1,472	2.40 ± 0.25

平均値 ± 標準偏差、※：中央値（最小値、最大値）

軽度：Child-Pugh スコア 5～6、中等度：Child-Pugh スコア 7～9、重度：Child-Pugh スコア 10～12

16.6.3 高齢者

70歳以上の高齢者（20例）にビルダグリプチン 100mg を単回経口投与したときの AUC 及び C_{max} は、非高齢者（18～40歳）に比較してそれぞれ 1.32 倍及び 1.18 倍高かった⁵⁰⁾（外国人のデータ）。（本剤の用法・用量は 50mg を 1 日 2 回又は 1 回である。）

11. その他

該当資料なし

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

2.2 糖尿病性ケトアシドーシス、糖尿病性昏睡、1型糖尿病の患者 [インスリンの適用である。]

2.3 重度の肝機能障害のある患者 [9.3.1 参照]

2.4 重症感染症、手術前後、重篤な外傷のある患者 [インスリンの適用である。]

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

「V.2. 効能又は効果に関連する注意」を参照すること。

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「V.4. 用法及び用量に関連する注意」を参照すること。

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

8.1 本剤の使用にあたっては、患者に対し低血糖症状及びその対処方法について十分説明すること。[9.1.2、11.1.3 参照]

8.2 肝機能障害（肝炎を含む）があらわれることがあるので、本剤投与開始前、投与開始後1年間は少なくとも3ヵ月毎に、その後も定期的に肝機能検査を行うこと。[11.1.1 参照]

8.3 急性膵炎があらわれることがあるので、持続的な激しい腹痛、嘔吐等の初期症状があらわれた場合には、速やかに医師の診察を受けるよう患者に指導すること。[11.1.5 参照]

8.4 本剤投与中は、血糖、尿糖を定期的に検査し、薬剤の効果を確かめ、本剤を3ヵ月投与しても効果が不十分な場合には他の治療法への変更を考慮すること。

8.5 低血糖及び低血糖症状を起こすおそれがあるので、高所作業、自動車の運転等に従事している患者に投与するときには注意すること。[11.1.3 参照]

8.6 本剤と GLP-1 受容体作動薬はいずれも GLP-1 受容体を介した血糖降下作用を有している。両剤を併用した際の臨床試験成績はなく、有効性及び安全性は確認されていない。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 心不全（NYHA 分類Ⅲ～Ⅳ）のある患者

使用経験がなく安全性が確立していない。

9.1.2 低血糖を起こすおそれのある以下の患者又は状態

- ・脳下垂体機能不全又は副腎機能不全
- ・栄養不良状態、飢餓状態、不規則な食事摂取、食事摂取量の不足又は衰弱状態
- ・激しい筋肉運動
- ・過度のアルコール摂取者

[8.1、11.1.3 参照]

9.1.3 腹部手術の既往又はイレウスの既往のある患者

腸閉塞を含むイレウスを起こすおそれがある。[11.1.6 参照]

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 中等度以上の腎機能障害のある患者又は透析中の末期腎不全患者

用法・用量の調節を行うこと。[7.、16.6.1 参照]

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 重度の肝機能障害のある患者

投与しないこと。肝機能障害が悪化するおそれがある。[2.3 参照]

9.3.2 肝機能障害のある患者（重度の肝機能障害のある患者を除く）

肝機能障害が悪化するおそれがある。

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないことが望ましい。動物実験（ラット及びウサギ）で、胎児への移行が報告されている。

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。動物実験（ラット）で、乳汁中へ移行することが報告されている。

(7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

副作用発現に留意し、経過を十分に観察しながら慎重に投与すること。一般に生理機能が低下している。

7. 相互作用

10. 相互作用

本剤は主に代謝により消失し、未変化体の尿中排泄率は23%であった。[16.5.1 参照]

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

10.2 併用注意（併用に注意すること）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
血糖降下作用を増強する薬剤 糖尿病用剤 スルホニルアミド系及びスルホニルウレア系薬剤 ビグアナイド系薬剤 インスリン製剤 チアゾリジン系薬剤 α -グルコシダーゼ阻害剤 速効型インスリン分泌促進剤 GLP-1 受容体作動薬 SGLT2 阻害剤 イメグリミン等 β -遮断剤 サリチル酸剤 MAO 阻害剤 フィブラート系薬剤等 [11.1.3 参照]	低血糖症状が起こるおそれがある。血糖値、その他患者の状態を十分に観察しながら投与すること。特に、スルホニルウレア剤又はインスリン製剤と併用する場合、低血糖のリスクが増加するため、これらの薬剤の減量を検討すること。	血糖降下作用の増強による。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
血糖降下作用を減弱する薬剤 アドレナリン 副腎皮質ホルモン 甲状腺ホルモン等	血糖値が上昇してコントロール不良になるおそれがある。血糖値、その他患者の状態を十分に観察しながら投与すること。	血糖降下作用の減弱による。
アンジオテンシン変換酵素阻害剤 [11.1.2 参照]	アンジオテンシン変換酵素阻害剤を併用している患者では、併用していない患者に比べて血管性浮腫の発現頻度が高かったとの報告がある。	機序は不明である。

8. 副作用

11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 肝炎、肝機能障害（いずれも頻度不明）

ALT 又は AST の上昇等を伴う肝炎又は肝機能障害があらわれることがある。ALT 又は AST 等の肝機能検査値の異常を認めた場合には、本剤の投与を中止するなど適切な処置を行うこと。黄疸や肝機能障害を示唆するその他の症状があらわれた場合には、本剤の投与を中止し、その後回復した場合でも再投与しないこと。[8.2 参照]

11.1.2 血管性浮腫（頻度不明）

アンジオテンシン変換酵素阻害剤を併用している患者では、併用していない患者に比べて血管性浮腫の発現頻度が高かったとの報告がある。[10.2 参照]

11.1.3 低血糖（頻度不明）

低血糖があらわれることがある。スルホニルウレア剤との併用で重篤な低血糖症状があらわれ、意識消失を来す例も報告されている。低血糖症状が認められた場合には糖質を含む食品を摂取するなど適切な処置を行うこと。ただし、 α -グルコシダーゼ阻害剤との併用により低血糖症状が認められた場合にはブドウ糖を投与すること。[8.1、8.5、9.1.2、10.2、17.1 参照]

11.1.4 横紋筋融解症（頻度不明）

筋肉痛、脱力感、CK 上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇を特徴とする横紋筋融解症があらわれることがある。

11.1.5 急性膵炎（頻度不明）

持続的な激しい腹痛、嘔吐等の異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。[8.3 参照]

11.1.6 イレウス（頻度不明）

腸閉塞を含むイレウスを起こすおそれがある。高度の便秘、腹部膨満、持続する腹痛、嘔吐等の異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。[9.1.3 参照]

11.1.7 間質性肺炎（頻度不明）

咳嗽、呼吸困難、発熱、肺音の異常（捻髪音）等が認められた場合には、速やかに胸部 X 線、胸部 CT、血清マーカー等の検査を実施すること。間質性肺炎が疑われた場合には投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

11.1.8 類天疱瘡（頻度不明）

水疱、びらん等があらわれた場合には、皮膚科医と相談し、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	1～5%未満	1%未満	頻度不明
血液及びリンパ系障害	—	血小板数減少	—
神経系障害	めまい、振戦	頭痛	—
心臓障害	動悸	—	—
血管障害	—	高血圧	—
胃腸障害	便秘、腹部膨満、血中アミラーゼ増加、リパーゼ増加	鼓腸、上腹部痛、腹部不快感、胃炎、悪心、下痢、消化不良、胃食道逆流性疾患	—
肝胆道系障害	—	ALT 増加、AST 増加、 γ -GTP 増加、ALP 増加	胆嚢炎
筋骨格系障害	—	関節痛	—
皮膚障害	多汗症	湿疹、発疹、そう痒症、蕁麻疹	皮膚剥脱、水疱、皮膚血管炎

	1～5%未満	1%未満	頻度不明
その他	空腹、無力症、血中CK増加、血中CK-MB増加	CRP増加、末梢性浮腫、体重増加、悪寒	—

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

13. 過量投与

13.1 処置

本剤は血液透析により除去されない。

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

15. その他の注意

15.2 非臨床試験に基づく情報

15.2.1 マウスを用いた104週間反復経口投与がん原性試験において、1,000mg/kg/日(50mg1日2回用量でのヒト曝露量(AUC)の199倍)群の雌で乳腺腺癌の発生例数が増加し、1,000mg/kg/日群の雌及び250mg/kg/日以上群の雄で血管肉腫の発生例数が増加した。

15.2.2 カニクイザルの13週間経口投与毒性試験において、50mg1日2回用量でのヒト曝露量(AUC)に相当する5mg/kg/日以上用量で、四肢、耳及び尾部等の皮膚病変(5mg/kg/日で投与期間中に消失した一過性の水疱、20mg/kg/日以上で落屑、痂皮等、80mg/kg/日以上で壊死等)が報告されている。

また、カニクイザルの他の経口投与毒性試験において、20mg/kg/日以上用量で、個体により初回投与後に急性毒性徴候として、骨格筋壊死、血液生化学的パラメータ（LDH、CK、ALT 及びAST）の上昇、体温低下、血圧低下又は頻脈を伴う体の先端部分の浮腫が報告されている。40mg/kg/日以上用量で、一部の個体で瀕死もしくは死亡が認められた一方で、生存例では症状は一過性で投与期間中に回復した。なお、同様の毒性所見は他の動物種（マウス、ラット、イヌ及びウサギ）及びヒトでは報告されていない。

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

「VI. 薬効薬理に関する項目」の項参照。

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

「VIII. 12. (2) 非臨床試験に基づく情報」の項参照。

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

「VIII. 12. (2) 非臨床試験に基づく情報」の項参照。

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：ビルダグリプチン錠 50mg 「ニプロ」 処方箋医薬品^{注)}

有効成分：ビルダグリプチン 該当しない

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

2. 有効期間

3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

該当しない

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド : あり

くすりのしおり : あり

その他の患者向け資材：ビルダグリプチン錠 50mg 「ニプロ」をお飲みになる患者さんへ
「XⅢ. 2. その他の関連資料」の項参照

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：エクア錠 50mg (ノバルティスファーマ=住友ファーマ) 他

同 効 薬：DPP-4 阻害薬

7. 国際誕生年月日

該当しない

8. 製造販売承認年月日及び承認番号，薬価基準収載年月日，販売開始年月日

製造販売承認年月日：2024年8月15日

承認番号 : 30600AMX00210000

薬価基準収載年月日：2024年12月6日

販売開始年月日 : 2024年12月6日

9. 効能又は効果追加，用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

10. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する期限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJ コード)	HOT (9桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
ビルダグリプチン 錠 50mg 「ニプロ」	3969011F1101	3969011F1101	129787401	622978701

14. 保険給付上の注意

本剤は、診療報酬上の後発医薬品に該当する。

X I . 文 献

1. 引用文献

- 1) 各種 DPP に対する阻害作用の検討 (エクア錠: 2010 年 1 月 20 日承認、CTD2.6.2.2.1.2.2) (L20221150)
- 2) DPP-4 に対する阻害様式の検討 (エクア錠: 2010 年 1 月 20 日承認、CTD2.6.2.2.1.1.3) (L20221151)
- 3) Ahrén Bo: Best Pract. Res. Clin. Endocrinol. Metab. 2007; 21 (4) : 517-533 (L20221152)
- 4) ニプロ(株)社内資料: 加速安定性試験
- 5) ニプロ(株)社内資料: 無包装状態での安定性試験
- 6) ニプロ(株)社内資料: 分割後の安定性試験
- 7) ニプロ(株)社内資料: アルミピロー開封後の安定性試験
- 8) ニプロ(株)社内資料: 生物学的同等性試験 (溶出、血漿中濃度測定)
- 9) ニプロ(株)社内資料: 自動分包機への適合性確認試験
- 10) Kikuchi M. et al.: Diabetes Res. Clin. Pract. 2009; 83 (2) : 233-240 (L20221143)
- 11) 国内第Ⅱ相試験 (エクア錠: 2010 年 1 月 20 日承認、CTD2.7.6.4.1.1) (L20240207)
- 12) 菊池方利ほか: 新薬と臨牀. 2010; 59 (2) : 121-136 (L20221144)
- 13) Iwamoto Y. et al.: Diabetes Obes. Metab. 2010; 12 (8) : 700-708 (L20221145)
- 14) 国内第Ⅲ相試験 (エクア錠: 2010 年 1 月 20 日承認、CTD2.7.6.4.1.3) (L20240208)
- 15) Kikuchi M. et al.: Diabetes Res. Clin. Pract. 2010; 89 (3) : 216-223 (L20221146)
- 16) 菊池方利ほか: 新薬と臨牀. 2010; 59 (2) : 137-154 (L20221147)
- 17) 小田原雅人ほか: 新薬と臨牀. 2012; 61 (12) : 2593-2611 (L20221148)
- 18) Hirose T. et al.: Diabetes Ther. 2015; 6 (4) : 559-571 (L20221149)
- 19) DPP-4 に対する阻害活性の検討 (エクア錠: 2010 年 1 月 20 日承認、CTD2.6.2.2.1.1.1) (L20221153)
- 20) He Y. -L. et al.: Int. J. Clin. Pharmacol. Ther. 2010; 48 (9) : 582-595 (L20221107)
- 21) Azuma K. et al.: J. Clin. Endocrinol. Metab. 2008; 93 (2) : 459-464 (L20221154)
- 22) インスリン抵抗性に対する作用 (エクア錠: 2010 年 1 月 20 日承認、CTD 2.5.3.2.2.6) (L20240209)
- 23) 前糖尿病期及び 2 型糖尿病カニクイザルの HbA1c に対する検討 (エクア錠: 2010 年 1 月 20 日承認、CTD2.6.2.2.2.4.2.4) (L20221155)
- 24) 健康成人を対象とした単回投与試験 (エクア錠: 2010 年 1 月 20 日承認、CTD2.7.6.2.1.1) (L20221065)
- 25) 2 型糖尿病患者を対象とした反復投与試験 (エクア錠: 2010 年 1 月 20 日承認、CTD2.7.6.3.2.2) (L20240199)
- 26) 健康成人を対象とした食事による薬物動態への影響 (エクア錠: 2010 年 1 月 20 日承認、CTD2.7.6.1.1.2) (L20221115)
- 27) Yamaguchi M. et al.: Int. J. Clin. Pharmacol. Ther. 2013; 51 (8) : 641-651 (L20221136)

- 28) He Y. -L. et al. : J. Clin. Pharmacol. 2008; 48 (1) : 85-95 (L20221137)
- 29) Ayalasonmayajula S.P. et al. : Curr. Med. Res. Opin. 2007; 23 (12) : 2913-2920 (L20221138)
- 30) He Y. -L. et al. : Curr. Med. Res. Opin. 2007; 23 (5) : 1131-1138 (L20221139)
- 31) He Y. -L. et al. : J. Clin. Pharmacol. 2007; 47 (8) : 998-1004 (L20221140)
- 32) Serra D. et al. : Int. J. Clin. Pharmacol. Ther. 2008; 46 (7) : 349-364 (L20221141)
- 33) He Y. -L. et al. : Curr. Med. Res. Opin. 2009; 25 (5) : 1265-1272 (L20221142)
- 34) He Y. -L. et al. : Clin. Pharmacokinet. 2007; 46 (9) : 787-802 (L20221123)
- 35) 蛋白結合に関する検討 (*in vitro*) (エクア錠: 2010年1月20日承認、CTD2.6.4.4.2) (L20221124)
- 36) He H, et al. : Drug Metab. Dispos. 2009; 37 (3) : 536-544 (L20221128)
- 37) 健康成人を対象とした単回投与試験 (エクア錠: 2010年1月20日承認、CTD 2.7.6.2.1.6) (L20240201)
- 38) 代謝 (エクア錠: 2010年1月20日承認、審査報告書) (L20240202)
- 39) ヒトでの主要代謝物の *in vitro* における活性 (エクア錠: 2010年1月20日承認、CTD 2.6.2.3.1.2) (L20240203)
- 40) *In vivo* 代謝 (エクア錠: 2010年1月20日承認、CTD2.6.4.5.1) (L20240204)
- 41) CYP 代謝に関する検討 (*in vitro*) (エクア錠: 2010年1月20日承認、CTD2.6.4.7.2.2、2.6.5.10C) (L20240200)
- 42) CYP 阻害に関する検討 (*in vitro*) (エクア錠: 2010年1月20日承認、CTD2.6.4.7.2.1) (L20221126)
- 43) CYP 誘導に関する検討 (*in vitro*) (エクア錠: 2010年1月20日承認、CTD2.6.4.7.2.3) (L20221127)
- 44) *in vivo* トランスポーターに関する検討 (エクア錠: 2010年1月20日承認、CTD 2.6.4.7.1.2) (L20240205)
- 45) *in vitro* トランスポーターに関する検討 (エクア錠: 2010年1月20日承認、CTD2.6.4.7.1.1) (L20221131)
- 46) 腎機能障害患者における薬物動態の検討 (エクア錠: 2010年1月20日承認、CTD2.7.6.2.3.3) (L20221132)
- 47) He Y. -L. et al. : Int. J. Clin. Pharmacol. Ther. 2013; 51 (9) : 693-703 (L20221133)
- 48) He Y. -L. et al. : Eur. J. Clin. Pharmacol. 2007; 63 (7) : 677-686 (L20221134)
- 49) 肝機能障害患者 (エクア錠: 2010年1月20日承認、CTD2.7.6.2.3.2) (L20240206)
- 50) He Y. -L. et al. : Br. J. Clin. Pharmacol. 2008; 65 (3) : 338-346 (L20221135)
- 51) ニプロ(株)社内資料: 粉碎後の安定性試験
- 52) ニプロ(株)社内資料: 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報（オーストラリア分類）

本邦における使用上の注意「妊婦、授乳婦等への投与」の項の記載は以下のとおりであり、オーストラリア分類とは異なる。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないことが望ましい。動物実験（ラット及びウサギ）で、胎児への移行が報告されている。

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。動物実験（ラット）で、乳汁中へ移行することが報告されている。

	分類
オーストラリアの分類 (An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy)	B3*

* : Prescribing medicines in pregnancy database (Australian Government)

<<https://www.tga.gov.au/australian-categorisation-system-prescribing-medicines-pregnancy>> (2025年10月アクセス)

参考：分類の概要

オーストラリアの分類：

B3 : Drugs which have been taken by only a limited number of pregnant women and women of childbearing age, without an increase in the frequency of malformation or other direct or indirect harmful effects on the human fetus having been observed.

Studies in animals have shown evidence of an increased occurrence of fetal damage, the significance of which is considered uncertain in humans.

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意

本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

(掲載根拠：「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドラインに関する Q&A について (その3)」令和元年9月6日付 厚生労働省医薬・生活衛生局 監視指導・麻薬対策課 事務連絡)

(1) 粉碎⁵¹⁾

粉碎後の安定性

試験項目：外観、含量 残存率 (%)、純度試験 類縁物質

保存条件 保存形態		試験項目	開始時	2週間	1カ月	3カ月
温度	40±2℃ 遮光・ 気密容器	外観	白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
		含量 残存率 (%)	100.0	99.6	99.1	98.1
		純度試験 類縁物質	適合	規格内	規格内	規格内
湿度	75±5%RH /25±2℃ 遮光・開放	外観	白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
		含量 残存率 (%)	100.0	100.0	99.1	98.9
		純度試験 類縁物質	適合	規格内	規格内	規格外

保存条件 保存形態		試験項目	開始時	60万 lx・hr	120万 lx・hr
光	120万 lx・hr 透明・ 気密容器	外観	白色の粉末	変化なし	変化なし
		含量 残存率 (%)	100.0	100.1	100.1
		純度試験 類縁物質	適合	規格内	規格内

1ロット (外観 n=1、定量 n=3、純度試験 n=3)

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性⁵²⁾

試験方法

(1) 崩壊懸濁試験

シリンジのプランジャーを抜き取り、シリンジ内に錠剤1個を入れてプランジャーを戻し、約55℃のお湯20mLを吸い取り、5分間放置した。5分後にシリンジを手で180度15往復横転し、崩壊・懸濁の状況を目視で観察した。繰り返し数は3回とした。

(2) 通過性試験

得られた懸濁液を8Fr.チューブの注入端より、約2~3mL/secの速度で注入し、通過性を観察した。チューブはベッドの上の患者を想定し、体内挿入端から3分の2を水平にし、他端(注入端)を30cmの高さにセットした。懸濁液を注入した後、20mLの水を同じシリンジで吸い取り、注入してチューブ内を洗い、シリンジ及びチューブ内の薬の残存を確認した。また、チューブ通過後の液のpHを測定した。繰り返し数は3回とした。

試験結果

試験製剤	試験条件	繰り返し	放置時間	崩壊懸濁試験	通過性試験		pH
				観察結果	チューブサイズ	通過性及び残存	
ビルダグ リプチン 錠50mg 「ニプロ」	水 (約55℃)	1回目	5分	崩壊・懸濁した	8Fr.	残存なし	9.01
		2回目	5分	崩壊・懸濁した	8Fr.	残存なし	9.05
		3回目	5分	崩壊・懸濁した	8Fr.	残存なし	8.97

本試験は「内服薬 経管投与ハンドブック 第4版(株)じほう」に準じて実施。


2. その他の関連資料

患者向け資料


○ビルダグリプチン錠 50mg「ニプロ」をお飲みになる患者さんへ

ビルダグリプチン錠50mg「ニプロ」をお飲みになる患者さんへ

【監修】医薬情報研究所/株式会社エス・アイ・シー
公園前薬局(東京都)薬剤師 堀 美智子 先生




ビルダグリプチン錠50mg「ニプロ」は、血糖値を調節するインクレチンというホルモンの分解を防ぎ、血糖値に応じてインスリンの分泌を促進するなど、血糖値を下げる作用のあるお薬です。



表面 裏面

【お薬の用法・用量】
通常、1日2回朝・夕もしくは1日1回朝、1回につき1錠(50mg)



【お薬を飲むときの注意】

- 飲み忘れた場合は、気がついた時に1回分を飲んでください。ただし、次に飲む時間が近い場合は1回とばして、次の時間に1回分飲んでください。絶対に2回分を一度に飲んではいけません。
- 誤って多く飲んだ場合は、医師または薬剤師に相談してください。
- お薬を飲んだ後、体に異変を感じたら、自分で判断せずに、医師または薬剤師に相談しましょう。

副作用について

- 「空腹感」「便秘」「脱力感」などの症状があらわれることがあります。
- 以下の症状があらわれた場合は、急性膵炎の可能性があります。
「持続的な激しい腹痛」「嘔吐」「背部痛(まっすぐ立ってられないような背中から腰にかけての痛み)」

このような症状があらわれた場合には服用をやめて、すぐに医師の診察を受けてください。

少しでも気になる症状がある場合は、すぐに医師または薬剤師に相談してください。

裏面もお読みください

医療関係者向け情報 医薬品情報 <https://med.nipro.co.jp/pharmaceuticals>

ニフ.オ株式会社

大阪府摂津市千里丘新町3番26号