

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「フェルゼン」
Vildagliptin Tablets [FELDSENF]

剤形	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「フェルゼン」： 1錠中、ビルダグリプチン 50mg 含有する
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 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2024年8月15日 薬価基準収載年月日：2024年12月6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：ダイト株式会社 販売元：株式会社フェルゼンファーマ
医薬情報担当者の 連絡先	
問い合わせ窓口	株式会社フェルゼンファーマ 安全管理部 TEL:03-6368-5160 FAX:03-3580-1522 医療関係者向けホームページ https://www.feldsenpharma.co.jp

本IFは2024年12月改訂の添付文書の記載に基づき作成した。

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。

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、I F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I Fの位置付け、I F記載様式、I F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I F記載要領の改訂を行ってきた。

I F記載要領2008以降、I F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I Fが速やかに提供されることとなった。最新版のI F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（<http://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I F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I F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、I F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. I Fとは

I F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。

I Fに記載する項目配列は日病薬が策定したI F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I F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I F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。

I F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. I Fの利用にあたって

電子媒体のI F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I Fを作成・提供するが、I Fの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やI F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、I F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、I F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、I F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

I F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。I F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・表現には薬機法の広告規則や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、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I F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、I Fを活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。

(2020年4月改訂)

目 次

I. 概要に関する項目		8. 他剤との配合変化(物理化学的变化)……………	8
1. 開発の経緯……………	1	9. 溶出性……………	8
2. 製品の治療学的特性……………	1	10. 容器・包装……………	9
3. 製品の製剤学的特性……………	1	(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……………	9
4. 適正使用に関して周知すべき特性……………	2	(2)包装……………	9
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項……………	2	(3)予備容量……………	9
(1)承認条件……………	2	(4)容器の材質……………	9
(2)流通・使用上の制限事項……………	2	11. 別途提供される資材類……………	9
6. RMPの概要……………	2	12. その他……………	9
II. 名称に関する項目		V. 治療に関する項目	
1. 販売名……………	3	1. 効能又は効果……………	10
(1)和名……………	3	2. 効能又は効果に関連する注意……………	10
(2)洋名……………	3	3. 用法及び用量……………	10
(3)名称の由来……………	3	(1)用法及び用量の解説……………	10
2. 一般名……………	3	(2)用法及び用量の設定経緯・根拠……………	10
(1)和名(命名法)……………	3	4. 用法及び用量に関連する注意……………	10
(2)洋名(命名法)……………	3	5. 臨床成績……………	10
(3)ステム……………	3	(1)臨床データパッケージ……………	10
3. 構造式又は示性式……………	3	(2)臨床薬理試験……………	10
4. 分子式及び分子量……………	3	(3)用量反応探索試験……………	10
5. 化学名(命名法)又は本質……………	3	(4)検証的試験……………	10
6. 慣用名、別名、略号、記号番号……………	3	1)有効性検証試験……………	10
III. 有効成分に関する項目		2)安全性試験……………	12
1. 物理化学的性質……………	4	(5)患者・病態別試験……………	13
(1)外観・性状……………	4	(6)治療の使用……………	13
(2)溶解性……………	4	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	13
(3)吸湿性……………	4	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……………	13
(4)融点(分解点)、沸点、凝固点……………	4	(7)その他……………	13
(5)酸塩基解離定数……………	4	VI. 薬効薬理に関する項目	
(6)分配係数……………	4	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群……………	14
(7)その他の主な示性値……………	4	2. 薬理作用……………	14
2. 有効成分の各種条件下における安定性……………	4	(1)作用部位・作用機序……………	14
3. 有効成分の確認試験法、定量法……………	4	(2)薬効を裏付ける試験成績……………	14
IV. 製剤に関する項目		(3)作用発現時間・持続時間……………	14
1. 剤形……………	5	VII. 薬物動態に関する項目	
(1)剤形の区別……………	5	1. 血中濃度の推移……………	15
(2)製剤の外観及び性状……………	5	(1)治療上有効な血中濃度……………	15
(3)識別コード……………	5	(2)臨床試験で確認された血中濃度……………	15
(4)製剤の物性……………	5	(3)中毒域……………	16
(5)その他……………	5	(4)食事・併用薬の影響……………	16
2. 製剤の組成……………	5	2. 薬物速度論的パラメータ……………	17
(1)有効成分(活性成分)の含量及び添加剤……………	5	(1)解析方法……………	17
(2)電解質等の濃度……………	5	(2)吸収速度定数……………	17
(3)熱量……………	5	(3)消失速度定数……………	17
3. 添付溶解液の組成及び容量……………	6	(4)クリアランス……………	17
4. 力価……………	6		
5. 混入する可能性のある夾雑物……………	6		
6. 製剤の各種条件下における安定性……………	6		
7. 調製法及び溶解後の安定性……………	8		

(5) 分布容積	17	IX. 非臨床試験に関する項目	1. 薬理試験	28
(6) その他	17		(1) 薬効薬理試験	28
3. 母集団(ポピュレーション)解析	17		(2) 安全性薬理試験	28
(1) 解析方法	17		(3) その他の薬理試験	28
(2) パラメータ変動要因	17		2. 毒性試験	28
4. 吸収	18		(1) 単回投与毒性試験	28
5. 分布	18		(2) 反復投与毒性試験	28
(1) 血液-脳関門通過性	18		(3) 遺伝毒性試験	28
(2) 血液-胎盤関門通過性	18		(4) がん原性試験	28
(3) 乳汁への移行性	18		(5) 生殖発生毒性試験	28
(4) 髄液への移行性	18		(6) 局所刺激性試験	28
(5) その他の組織への移行性	18	(7) その他の特殊毒性	28	
(6) 血漿蛋白結合率	18	X. 管理的事項に関する項目	1. 規制区分	29
6. 代謝	18		2. 有効期間	29
(1) 代謝部位及び代謝経路	18		3. 包装状態での貯法	29
(2) 代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種、寄与率	18		4. 取扱い上の注意	29
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	19		5. 患者向け資材	29
(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率	19		6. 同一成分・同効薬	29
7. 排泄	19		7. 国際誕生年月日	29
8. トランスポーターに関する情報	19		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	29
9. 透析等による除去率	19		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	29
10. 特定の背景を有する患者	19		10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	30
11. その他	21		11. 再審査期間	30
VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目			12. 投薬期間制限に関する情報	30
1. 警告内容とその理由	22		13. 各種コード	30
2. 禁忌内容とその理由	22		14. 保険給付上の注意	30
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	22	XI. 文献	1. 引用文献	31
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	22		2. その他の参考文献	32
5. 重要な基本的注意とその理由	22	XII. 参考資料	1. 主な外国での発売状況	33
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	22		2. 海外における臨床支援情報	33
(1) 合併症・既往歴等のある患者	22	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	34
(2) 腎機能障害患者	23		(1) 粉砕	34
(3) 肝機能障害患者	23		(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性	36
(4) 生殖能を有する者	23	2. その他の関連資料	36	
(5) 妊婦	23			
(6) 授乳婦	23			
(7) 小児等	23			
(8) 高齢者	23			
7. 相互作用	24			
(1) 併用禁忌とその理由	24			
(2) 併用注意とその理由	24			
8. 副作用	24			
(1) 重大な副作用と初期症状	25			
(2) その他の副作用	25			
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	26			
10. 過量投与	26			
11. 適用上の注意	26			
12. その他の注意	26			
(1) 臨床使用に基づく情報	26			
(2) 非臨床試験に基づく情報	26			

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

ビルダグリプチン錠 50mg「フェルゼン」は、インクレチン〔消化管ホルモン；グルカゴン様ペプチド-1 (glucagon-like peptide-1, GLP-1)など〕の分解酵素であるジペプチジルペプチダーゼ-4 (dipeptidyl peptidase-4, DPP-4)を選択的、かつ可逆的に阻害することにより血糖降下作用を示す DPP-4 阻害薬で、2 型糖尿病治療薬である。

ビルダグリプチン錠 50mg「フェルゼン」は、後発医薬品としてダイト株式会社が開発を企画し、「医薬品の承認申請について（平成 26 年 11 月 21 日薬食 1121 第 2 号）」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 月に製造販売承認を取得した。なお、ビルダグリプチン錠 50mg「フェルゼン」は後発医薬品として、ダイト株式会社、日新製薬株式会社の 2 社で共同開発を実施し、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

- (1) 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⁾。

【「VI-2. 薬理作用」の項参照】

- (2) 重大な副作用として、肝炎、肝機能障害、血管浮腫、低血糖、横紋筋融解症、急性膵炎、腸閉塞、間質性肺炎、類天疱瘡（いずれも頻度不明）が報告されている。

【「VIII-8. 副作用」の項参照】

3. 製品の製剤学的特性

- (1) 錠剤には識別性向上のため、表面に「ビルダグリプチン」「含量」、裏面に「含量」「フェルゼン」を印刷している。

【「IV-1. 剤形」の項参照】

- (2) PTP シート表面には、1 錠単位で成分名、含量、「フェルゼン」を表記している。

- (3) PTP シート裏面には、薬剤の判別を容易にするため 1 錠単位で販売名と GS1 コードを表記している。

- (4) 外箱には、切り離し可能な切り取りタグ、差し込みフラップを施している。

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材、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	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 「フェルゼン」

(2) 洋名

Vildagliptin Tablets 50mg [FELDSENF]

(3) 名称の由来

「有効成分名」+「剤形」+「含量」+「屋号」より命名した。

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

ビルダグリプチン（JAN）

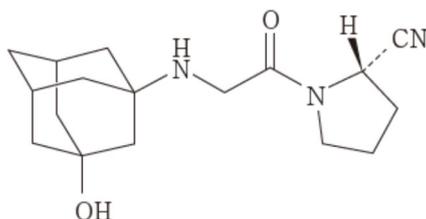
(2) 洋名（命名法）

Vildagliptin（JAN）

(3) ステム(stem)

ジペプチジルペプチダーゼ（DPP）-4 阻害薬：-gliptin

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₁₇H₂₅N₃O₂

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]aminolacetyl]pyrrolidine-2-carbonitrile

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

CAS 登録番号：274901-16-5

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

溶媒	日局表現
水	溶けやすい
メタノール	溶けやすい
エタノール (99.5)	溶けやすい
アセトニトリル	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

液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

素錠

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	ビルダグリプチン錠 50mg 「フェルゼン」		
性状・剤型	白色～微黄白色の片面割線入りの素錠		
外形	表	裏	側面
			
大きさ	直径：6.5mm 厚さ：2.5mm 質量：100mg		

(3) 識別コード

なし

(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	ビルダグリプチン錠 50mg 「フェルゼン」
有効成分	1錠中 ビルダグリプチン 50mg
添加剤	D-マンニトール、クロスポビドン、ヒプロメロース、結晶セルロース、ステアリン酸マグネシウム

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

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

(1) 加速試験⁴⁾

包装形態：PTP 包装した製品

試験条件：40℃、75%RH、3ロット (n=3)

試験項目	開始時	6 ヶ月
性状	白色の片面割線入りの素錠	同左
確認試験	適合	同左
純度試験 類縁物質	規格内	同左
製剤均一性	適合	同左
溶出率 (%) : 15 分間 85%以上	96.8~102.6	98.5~103.3
含量 (%) : 95.0~105.0%	100.0~101.1	99.6~100.8

(2) 長期保存試験⁴⁾

包装形態：PTP 包装した製品

試験条件：25℃、60%RH、3ロット (n=3)

試験項目	開始時	36 ヶ月
性状	白色の片面割線入りの素錠	同左
確認試験	適合	同左
純度試験 類縁物質	規格内	同左
製剤均一性	適合	同左
溶出率 (%) : 15 分間 85%以上	96.8~102.6	97.6~102.3
含量 (%) : 95.0~105.0%	100.0~101.1	97.9~99.6

(3) 無包装状態の安定性⁵⁾

試験条件：温度：40℃±1℃、遮光、気密容器

湿度：25℃±2℃、75%RH±5%RH、遮光、シャーレ開放

光：D65-1000lx、成り行き、成り行き

試験項目	開始時	温度	湿度	光
		3 ヶ月	3 ヶ月	120 万 lx・hr
性状	白色の片面割線入りの素錠	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験 類縁物質	規格内	規格内	規格内	規格内
溶出率 (%)	適合	適合	適合	適合
規格:15 分間 85%以上	98.6~100.5	98.6~101.2	99.2~102.5	100.2~103.7
含量 (%)	規格内	変化なし	変化なし	変化なし
規格:95.0~105.0%	100.0	100.4	99.1	99.5
硬度	規格内	変化なし	変化あり* (規格内)	変化なし
規格(参考値)20N 以上	48.4	53.9	29.5	46.6

*：48.4N（開始時）→32.1N（規格内、1 ヶ月）→29.5N（規格内、3 ヶ月）

「(社)日本病院薬剤師会：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)、平成11年8月20日」を参考に評価した。

【評価基準】

分類	外観	含量	硬度	崩壊性 溶出性 類縁物質
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合	含量低下が 3%未満の場合	硬度変化が 30%未満の場合	規格値内の場合
変化あり (規格内)	わずかな色調変化(退色等)等を認めるが、品質上、問題とされない程度の変化であり、規格を満たしている場合	含量低下が 3%以上で、規格値内の場合	硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kgf (20N) 以上の場合	
変化あり (規格外)	形状変化や著しい色調変化等を認め、規格を逸脱している場合	規格値外の場合	硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kgf (20N) 未満の場合	規格値外の場合

(4) 二分割後の安定性⁶⁾

試験条件：温度：40℃、遮光、気密容器

湿度：25℃、75%RH、遮光、シャーレ開放

光：D65-1000lx、成り行き、成り行き

試験項目	開始時	温度	湿度	光
		3 ヶ月	3 ヶ月	120 万 lx・hr
性状	白色の素錠 分割面に凸凹が 認められた	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験 類縁物質	規格内	規格内	規格内	規格内
溶出率 (%)	適合	適合	適合	適合
規格:15 分間 85%以上	97.0~101.6	100.5~103.0	96.9~98.6	100.0~101.5
含量 (%)	規格内	変化なし	変化なし	変化なし
規格:95.0~105.0%	99.1	99.2	100.2	100.0

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）

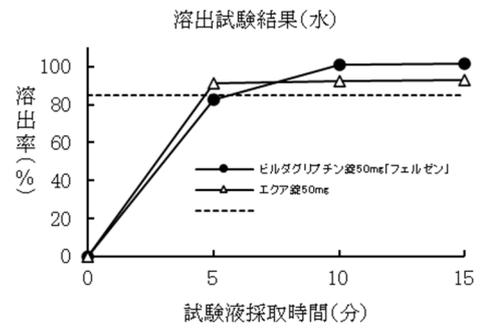
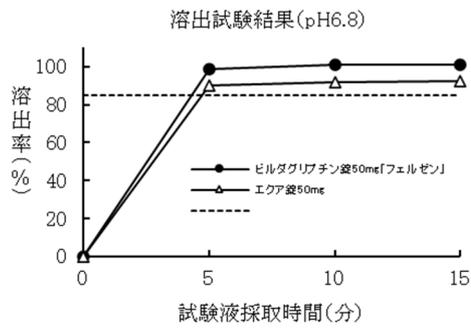
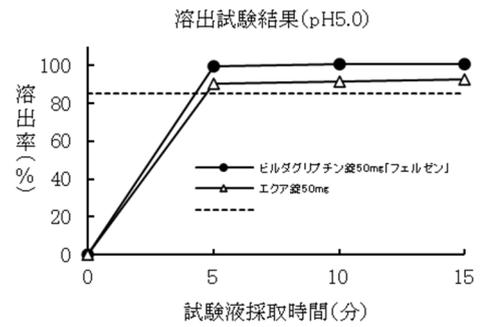
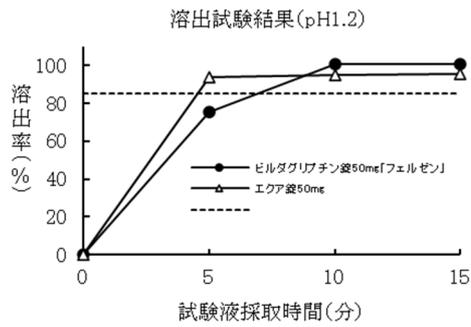
該当資料なし

9. 溶出性⁷⁾

全ての試験条件において、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（令和2年3月19日付薬生薬審発0319第1号別紙1）」に示された基準に適合し、ビルダグリプチン錠50mg「フェルゼン」と標準製剤（エクア錠50mg）の溶出挙動の類似性が確認された。

平均溶出率

回転数		50rpm			
試験液		pH1.2	pH5.0	pH6.8	水
判定時点 (分)		15	15	15	15
溶出率 (%)	標準製剤	95.5	92.4	92.4	93.2
	試験製剤	100.9	100.8	101.1	101.5
判定基準		85%以上	85%以上	85%以上	85%以上
判定		適合	適合	適合	適合



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

PTP : 100 錠 [10 錠 (PTP) × 10]

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 : ポリ塩化ビニル・ポリ塩化ビニリデン・ポリエチレン多層フィルム、アルミニウム箔
 ポリエチレンラミネートアルミニウムフィルムピロー

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

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

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

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^{8,9)}。(本剤の用法及び用量は 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)

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 50mg 1 日 1 回、50mg 1 日 2 回、100mg 1 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 (50mg 1 日 1 回、50mg 1 日 2 回、100mg 1 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¹⁰⁾。(本剤の用法及び用量は 50mg を 1 日 2 回又は 1 回である。)

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 50mg 1 日 2 回又はボグリボース 0.2mg 1 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^{11,12)}。

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		食後血糖 2 時間値	
	(%)		(mg/dL)		(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

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 50mg 1 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^{13,14)}。

2) 安全性試験

①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 50mg 1 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 50mg 1 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¹⁵⁾。

②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 50mg 1 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¹⁶⁾。[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

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50mg 1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¹⁷⁾。

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

ジペプチジルペプチダーゼ-4 阻害剤 (DPP-4 阻害剤)

シタグリブチンリン酸塩水和物、アログリブチン安息香酸塩、リナグリブチン、テネリグリブチン臭化水素酸塩水和物、アナグリブチン 等

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子化された添付文書を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・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。ビルダグリブチンは、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

1) DPP-4 阻害作用

ビルダグリブチンはヒト血漿 DPP-4 を濃度依存的に阻害し、IC₅₀ 値は 2.7nM であった¹⁸⁾。また、ビルダグリブチンは、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⁾。

2) 血漿 GLP-1 に対する作用

2型糖尿病患者にビルダグリブチン 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¹⁹⁾。

3) 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ブチン 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^{20,21)} (外国人のデータ)。

4) 血糖降下作用及び耐糖能改善作用

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ブチンを 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²²⁾。

②2型糖尿病患者にビルダグリブチン 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¹⁹⁾。

(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

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、Cmax 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²³⁾。(本剤の用法及び用量は 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

Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	AUC _{0-t} (ng・hr/mL)	T _{1/2} (hr)
272±77	2.00±1.26	1,139±80	1.77±0.23

n=6、平均値±標準偏差

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^{19,24)}。

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	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	AUC _{0-12hr} (ng・hr/mL)	T _{1/2} (hr)	Rac
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)、

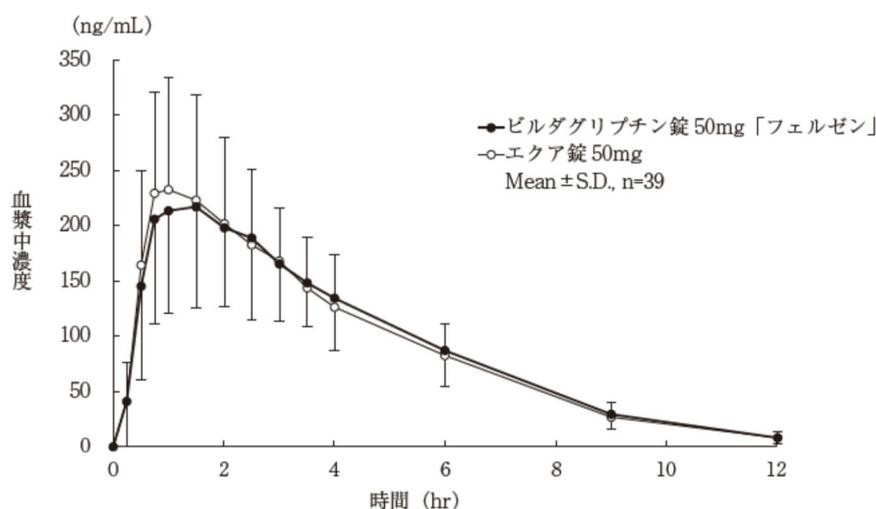
Rac：累積率 [投与 7 日目の AUC_{0-12hr}/投与 1 日目の AUC_{0-12hr}]

3) 生物学的同等性試験

ビルダグリプチン錠 50mg「フェルゼン」とエクア錠 50mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠(ビルダグリプチンとして 50mg)健康成人男性に絶食時単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、Cmax) 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、両製剤の生物学的同等性が確認された²⁵⁾。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₁₂ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
ビルダグリプチン錠 50mg「フェルゼン」	1121.805 ±222.134	269.602 ±84.643	1.6±0.8	1.8±0.3
エクア錠 50mg	1111.369 ±206.175	291.075 ±76.421	1.7±0.8	1.8±0.2

(Mean ± S.D., n=39)



血漿中濃度並びに AUC、Cmax 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

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、Cmax は空腹時投与に比べ 19%低下した。Tmax 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)。(本剤の用法及び用量は 50mg を 1 日 2 回又は 1 回である。)

2) 併用薬の影響

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_{0-12hr} 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

該当資料なし

(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

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

【「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>

動物実験(ラット)で乳汁中に移行することが報告されている。

【「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

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

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)。(本剤の用法及び用量は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

ビルダグリプチンはCYP2A6、2B6、2C8、2C9、2C19、2E1、2J2、3A4では代謝されなかつ

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

該当資料なし

7. 排泄

- (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/hr(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^{23,44)}。[10. 参照]
- (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)。(本剤の用法及び用量は 50mg を 1 日 2 回又は 1 回である。)
- (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 Km 値が 0.5mM 以上)⁴⁵⁾ (*in vitro*)。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

本剤は血液透析により除去されない。

【「Ⅷ－10. 過量投与」の項参照】

10. 特定の背景を有する患者

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_{0-24hr} 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_{0-24hr} 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、Cmax はそれぞれ 1.37 倍、1.32 倍、1.36 倍高かった。M20.7 の AUC_{0-24hr} 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、Cmax 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_{0-24hr} 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、Cmax 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)。(本剤の用法及び用量は 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)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	AUC _{0-t} (ng・hr/mL)	T _{1/2} (hr)	CLR (L/hr)
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

【「Ⅷ－6. (2) 腎機能障害患者」の項参照】

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 Cmax 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 Cmax はそれぞれ 23%、46%、65%高かった^{48,49)}(外国人のデータ)。(本剤の用法及び用量は 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)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	AUC _{0-t} (ng・hr/mL)	T _{1/2} (hr)
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

【「Ⅷ－6．(3) 肝機能障害患者」の項参照】

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 Cmax 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)。(本剤の用法及び用量は 50mg を 1 日 2 回又は 1 回である。)

【「Ⅷ－6．(8) 高齢者」の項参照】

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」参照

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」参照

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、自動車の運転等に就い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腸閉塞の既往のある患者

腸閉塞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

用法及び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。
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 腸閉塞（頻度不明）

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
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

15.2 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 (50mg 1 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、50mg 1 日 2 回用量でのヒト曝露量 (AUC) に相当する 5mg/kg/日以上以上の用量で、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/日以上以上の用量で、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/日以上以上の用量で、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

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

【「VIII－6. (5) 妊婦」の項参照】

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

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「フェルゼン」 処方箋医薬品^{注)}

注) 注意一医師等の処方箋により使用すること

有効成分：ビルダグリプチン

2. 有効期間

有効期間：3年

3. 包装状態での貯法

貯法：室温保存

4. 取扱い上の注意

設定されていない

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：有り

くすりのしおり：有り

その他の患者向け資材：無し

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：

先発医薬品名：エクア錠 50mg

同 効 薬：

ジペプチジルペプチダーゼ-4 阻害剤 (DPP-4 阻害剤)

(シタグリプチンリン酸塩水和物、アログリプチン安息香酸塩、リナグリプチン、テネリグリプチン臭化水素酸塩水和物、アナグリプチン 等)

7. 国際誕生年月日

2007年2月14日

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	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
2024年8月15日	30600AMX00200000	2024年12月6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)期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

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
3969011F1110	3969011F1110	129717101	622971701

14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

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、申請資料概要 2.6.2-2.1.2.2)
- 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、申請資料概要 2.6.2-2.1.1.3)
- 3) Ahrén Bo : Best Pract. Res. Clin. Endocrinol. Metab. 2007 ; 21(4) : 517-533
- 4) ダイト株式会社 : 安定性に関する資料 (社内資料)
- 5) ダイト株式会社 : 無包装状態の安定性に関する資料 (社内資料)
- 6) ダイト株式会社 : 二分割後の安定性に関する資料 (社内資料)
- 7) ダイト株式会社 : 溶出性に関する資料 (社内資料)
- 8) Kikuchi M, et al. : Diabetes Res. Clin. Pract. 2009 ; 83(2) : 233-240
- 9) 国内第Ⅱ相試験 (エクア錠 : 2010 年 1 月 20 日承認、申請資料概要 2.7.6-4.1.1)
- 10) 菊池方利ほか : 新薬と臨牀.2010 ; 59(2) : 121-136
- 11) Iwamoto Y, et al. : Diabetes Obes. Metab. 2010 ; 12(8) : 700-708
- 12) 国内第Ⅲ相試験 (エクア錠 : 2010 年 1 月 20 日承認、申請資料概要 2.7.6-4.1.3)
- 13) Kikuchi M, et al. : Diabetes Res. Clin. Pract. 2010 ; 89(3) : 216-223
- 14) 国内第Ⅲ相試験 (エクア錠 : 2010 年 1 月 20 日承認、申請資料概要 2.7.6-4.1.4)
- 15) 菊池方利ほか : 新薬と臨牀. 2010 ; 59(2) : 137-154
- 16) 小田原雅人ほか : 新薬と臨牀. 2012 ; 61(12) : 2593-2611
- 17) Hirose T, et al. : Diabetes Ther. 2015 ; 6(4) : 559-571
- 18) 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、申請資料概要 2.6.2-2.1.1.1)
- 19) He Y.-L, et al. : Int. J. Clin. Pharmacol. Ther. 2010 ; 48(9) : 582-595
- 20) Azuma K, et al. : J. Clin. Endocrinol. Metab. 2008 ; 93(2) : 459-464
- 21) 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、申請資料概要 2.5-3.2.2.6)
- 22) 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、申請資料概要 2.6.2-2.2.4.2.4)
- 23) 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、申請資料概要 2.7.6-2.1.1)
- 24) 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、申請資料概要 2.7.6-3.2.2)
- 25) ダイト株式会社 : 生物学的同等性試験に関する資料 (社内資料)
- 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、申請資料概要 2.7.6-1.1.2)
- 27) Yamaguchi M, et al. : Int. J. Clin. Pharmacol. Ther. 2013 ; 51(8) : 641-651
- 28) He Y.-L, et al. : J. Clin. Pharmacol. 2008 ; 48(1) : 85-95
- 29) Ayalasmayajula SP, et al. : Curr. Med. Res. Opin. 2007 ; 23(12) : 2913-2920

- 30) He Y.-L, et al. : Curr. Med. Res. Opin. 2007 ; 23(5) : 1131-1138
- 31) He Y.-L, et al. : J. Clin. Pharmacol. 2007 ; 47(8) : 998-1004
- 32) Serra D, et al. : Int. J. Clin. Pharmacol. Ther. 2008 ; 46(7) : 349-364
- 33) He Y.-L, et al. : Curr. Med. Res. Opin. 2009 ; 25(5) : 1265-1272
- 34) He Y.-L, et al. : Clin. Pharmacokinet. 2007 ; 46(9) : 787-802
- 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、申請資料概要 2.6.4-4.2)
- 36) He H, et al. : Drug Metab. Dispos. 2009 ; 37(3) : 536-544
- 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、申請資料概要 2.7.6-2.1.6)
- 38) 代謝 (エクア錠 : 2010年1月20日承認、審査報告書)
- 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、申請資料概要 2.6.2-3.1.2)
- 40) *in vivo* 代謝 (エクア錠 : 2010年1月20日承認、申請資料概要 2.6.4-5.1)
- 41) CYP 代謝に関する検討(*in vitro*) (エクア錠 : 2010年1月20日承認、申請資料概要 2.6.4-7.2.2、2.6.5.10)
- 42) CYP 阻害に関する検討(*in vitro*) (エクア錠 : 2010年1月20日承認、申請資料概要 2.6.4-7.2.1)
- 43) CYP 誘導に関する検討(*in vitro*) (エクア錠 : 2010年1月20日承認、申請資料概要 2.6.4-7.2.3)
- 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、申請資料概要 2.6.4-7.1.2)
- 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、申請資料概要 2.6.4-7.1.1)
- 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、申請資料概要 2.7.6-2.3.3)
- 47) He Y.-L, et al. : Int. J. Clin. Pharmacol. Ther. 2013 ; 51(9) : 693-703
- 48) He Y.-L, et al. : Eur. J. Clin. Pharmacol. 2007 ; 63(7) : 677-686
- 49) 肝機能障害患者 (エクア錠 : 2010年1月20日承認、申請資料概要 2.7.6-2.3.2)
- 50) He Y.-L, et al. : Br. J. Clin. Pharmacol. 2008 ; 65(3) : 338-346
- 51) ダイト株式会社 : 粉碎後の安定性に関する資料 (社内資料)
- 52) ダイト株式会社 : 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性試験に関する資料 (社内資料)

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

(1) 妊婦への投与に関する海外情報

該当資料なし

(2) 小児等への投与に関する海外情報

該当資料なし

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⁾

ビルダグリプチン錠 50mg 「フェルゼン」について、粉碎後における各種条件下での安定性を検討した。

① 通常的环境下（温度：19.0～22.0℃、湿度：50.0～70.0%、照度：404～452lx）

試験項目	規格		試験結果			
			開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状	—		白色の粉末	同左	同左	同左
純度試験	類縁物質 A (%) : 0.2%以下		<LOQ [*]	<LOQ	<LOQ	<LOQ
	類縁物質 B (%) : 0.4%以下		<LOQ	<LOQ	<LOQ	<LOQ
	類縁物質 E (%) : 0.2%以下		0.038	0.040	0.041	0.039
	類縁物質 F (%) : 0.8%以下		<LOQ	0.024	0.059	0.061
	類縁物質 G (%) : 0.2%以下		<LOQ	<LOQ	<LOQ	<LOQ
	類縁物質 H (%) : 0.4%以下		<LOQ	<LOQ	<LOQ	0.018
	未知類縁物質 RRT013 (%) : 0.2%以下		<LOQ	<LOQ	0.015	<LOQ
	総類縁物質質量 (%) : 1.5%以下		0.038	0.064	0.115	0.119
溶出性	15 分間	最小値 (%)	97.3	98.3	97.4	97.2
	85%以上	最大値 (%)	98.4	98.8	98.9	98.1
定量試験	含量 (%) : 95.0～105.0		99.3	97.9	98.2	97.1

※LOQ 定量限界

② 湿度 (25°C±2°C・75%RH±5%RH)

試験項目	規格		試験結果			
			開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状	—		白色の粉末	同左	同左	同左
純度試験	類縁物質 A (%) : 0.2%以下		<LOQ [*]	<LOQ	<LOQ	<LOQ
	類縁物質 B (%) : 0.4%以下		<LOQ	<LOQ	<LOQ	<LOQ
	類縁物質 E (%) : 0.2%以下		0.038	0.037	0.039	0.038
	類縁物質 F (%) : 0.8%以下		<LOQ	0.079	0.219	0.283
	類縁物質 G (%) : 0.2%以下		<LOQ	0.017	0.030	0.020
	類縁物質 H (%) : 0.4%以下		<LOQ	0.031	0.102	0.140
	未知類縁物質 RRT013 (%) : 0.2%以下		<LOQ	<LOQ	<LOQ	<LOQ
	総類縁物質質量 (%) : 1.5%以下		0.038	0.164	0.390	0.481
溶出性	15 分間	最小値 (%)	97.3	95.3	96.3	95.7
	85%以上	最大値 (%)	98.4	99.0	97.9	96.8
定量試験	含量 (%) : 95.0~105.0		99.3	97.4	97.6	98.2

※LOQ 定量限界

③ 光 (温度 : 21.5~28.1°C、湿度 : 35.2~57.2%、照度 : 906~1116lx)

試験項目	規格		試験結果		
			開始時	30 万 lx・hr	60 万 lx・hr
性状	—		白色の粉末	同左	同左
純度試験	類縁物質 A (%) : 0.2%以下		<LOQ [*]	<LOQ	<LOQ
	類縁物質 B (%) : 0.4%以下		<LOQ	<LOQ	<LOQ
	類縁物質 E (%) : 0.2%以下		0.038	0.038	0.039
	類縁物質 F (%) : 0.8%以下		<LOQ	<LOQ	0.015
	類縁物質 G (%) : 0.2%以下		<LOQ	<LOQ	<LOQ
	類縁物質 H (%) : 0.4%以下		<LOQ	<LOQ	<LOQ
	未知類縁物質 RRT013 (%) : 0.2%以下		<LOQ	<LOQ	<LOQ
	総類縁物質質量 (%) : 1.5%以下		0.038	0.038	0.054
溶出性	15 分間	最小値 (%)	97.3	96.6	96.0
	85%以上	最大値 (%)	98.4	98.6	97.5
定量試験	含量 (%) : 95.0~105.0		99.3	99.2	99.1

※LOQ 定量限界

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性⁵²⁾

ビルダグリプチン錠 50mg 「フェルゼン」の錠剤を用いて下記の試験を行った。

1) 崩壊懸濁試験

「内服薬経管投与ハンドブック 第4版」を参考に注入器（30mLPP 製シリンジ）の押し子部を抜き取り、注入器内に錠剤をそのまま 1 個入れて押し子部を戻し注入器に 55℃のお湯 20mL を吸い取り、筒先の蓋をして 5 分間自然放置した。5 分後に、崩壊・懸濁の状況を観察した。5 分後に崩壊しない場合、さらに 5 分間放置後、注入器を手で 180 度 15 往復横転して攪拌し崩壊・懸濁の状況を再度確認することとした。

試験結果：錠剤を 5 分間自然放置した後、崩壊・懸濁の状況を観察したところ、崩壊・懸濁した。

2) 通過性試験

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液の入った注入器を経管チューブ（8Fr.）に接続し約 2~3mL/秒（10 秒で 20mL）の速度で注入した。チューブは体内挿入端から 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。経管チューブ（サイズ 8Fr.、長さ 120cm）に注入し通過性を観察した。懸濁液を注入後、適量の水（20mL 程度）を同じ注入器で吸い取り、チューブを洗うこととした。

試験結果：経管チューブ（8Fr.）を通過し、薬剤の残存は認められなかった。

2. その他の関連資料

1) 患者向け資料

該当資料なし

2) バーコード等

販売名	包装単位	GS1 コード	
		調剤包装単位コード	販売包装単位コード
ビルダグリプチン錠 50mg 「フェルゼン」	PTP100 錠	(01) 04987923508805	(01) 14987923506853
	PTP500 錠		(01) 14987923506860

販売元



株式会社フェルゼンファーマ
札幌市中央区北10条西24丁目3番地

製造販売元

DAITO **ダイト株式会社**
富山県富山市八日町326番地