

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2013に準拠して作成

速効型インスリン分泌促進剤

レパグリニド錠0.25mg「サワイ」
レパグリニド錠0.5mg「サワイ」

REPAGLINIDE Tablets [SAWAI]

レパグリニド錠

剤形	割線入り素錠
製剤の規制区分	劇薬、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	錠0.25mg：1錠中レパグリニド0.25mg含有 錠0.5mg：1錠中レパグリニド0.5mg含有
一般名	和名：レパグリニド 洋名：Repaglinide
製造販売承認年月日 薬価基準収載 ・発売年月日	製造販売承認年月日：2020年2月17日 薬価基準収載年月日：2020年6月19日 発売年月日：2020年6月19日
開発・製造販売(輸入)・提携 ・販売会社名	製造販売元：沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL：0120-381-999、FAX：06-7708-8966 医療関係者向け総合情報サイト： https://med.sawai.co.jp/

本IFは2022年4月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ<https://www.pmda.go.jp/>にてご確認ください。

IF利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

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、添付文書と略す)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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和63年に日本病院薬剤師会(以下、日病薬と略す)学術第2小委員会が「医薬品インタビューフォーム」(以下、IFと略す)の位置付け並びにIF記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成10年9月に日病薬学術第3小委員会においてIF記載要領の改訂が行われた。

更に10年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成20年9月に日病薬医薬情報委員会においてIF記載要領2008が策定された。

IF記載要領2008では、IFを紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF等の電磁的データとして提供すること(e-IF)が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版のe-IFが提供されることとなった。

最新版のe-IFは、(独)医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ(<http://www.info.pmda.go.jp/>)から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IFを掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせてe-IFの情報を検討する組織を設置して、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・検討することとした。

2008年より年4回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF記載要領の一部改訂を行いIF記載要領2013として公表する運びとなった。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・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、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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の様式]

①規格はA4版、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体(図表は除く)で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。

- ②IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

[IFの作成]

- ①IFは原則として製剤の投与経路別(内用剤、注射剤、外用剤)に作成される。
- ②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとのIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領2013」(以下、「IF記載要領2013」と略す)により作成されたIFは、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体(PDF)から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IFの発行]

- ①「IF記載要領2013」は、平成25年10月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF記載要領2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果(臨床再評価)が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはIFが改訂される。

3. IFの利用にあたって

「IF記載要領2013」においては、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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薬剤師等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、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信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、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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を薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IFは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IFがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013年4月改訂)

目次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	20
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	20
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	20
II. 名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	20
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	20
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	20
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	21
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	21
5. 化学名(命名法)	3	8. 副作用	24
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	9. 高齢者への投与	25
7. CAS登録番号	3	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	25
III. 有効成分に関する項目	4	11. 小児等への投与	25
1. 物理化学的性質	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	25
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	13. 過量投与	25
3. 有効成分の確認試験法	4	14. 適用上の注意	26
4. 有効成分の定量法	4	15. その他の注意	26
IV. 製剤に関する項目	5	16. その他	26
1. 剤形	5	IX. 非臨床試験に関する項目	27
2. 製剤の組成	5	1. 薬理試験	27
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	6	2. 毒性試験	27
4. 製剤の各種条件下における安定性	6	X. 管理的事項に関する項目	28
5. 調製法及び溶解後の安定性	9	1. 規制区分	28
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	9	2. 有効期間又は使用期限	28
7. 溶出性	9	3. 貯法・保存条件	28
8. 生物学的試験法	12	4. 薬剤取扱い上の注意点	28
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	12	5. 承認条件等	29
10. 製剤中の有効成分の定量法	12	6. 包装	29
11. 力価	12	7. 容器の材質	29
12. 混入する可能性のある夾雑物	12	8. 同一成分・同効薬	29
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	12	9. 国際誕生年月日	29
14. その他	12	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	29
V. 治療に関する項目	13	11. 薬価基準収載年月日	29
1. 効能又は効果	13	12. 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	30
2. 用法及び用量	13	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	30
3. 臨床成績	13	14. 再審査期間	30
VI. 薬効薬理に関する項目	15	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	30
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	15	16. 各種コード	30
2. 薬理作用	15	17. 保険給付上の注意	30
VII. 薬物動態に関する項目	16	XI. 文献	31
1. 血中濃度の推移・測定法	16	1. 引用文献	31
2. 薬物速度論的パラメータ	17	2. その他の参考文献	31
3. 吸収	18	XII. 参考資料	32
4. 分布	18	1. 主な外国での発売状況	32
5. 代謝	18	2. 海外における臨床支援情報	32
6. 排泄	19	XIII. 備考	32
7. トランスポーターに関する情報	19	その他の関連資料	32
8. 透析等による除去率	19		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

レパグリニド錠0.25mg/錠0.5mg「サワイ」は、レパグリニドを含有する速効型インスリン分泌促進剤である。

レパグリニドは、膵β細胞においてATP感受性カリウムチャンネルを閉鎖することによりインスリン分泌を促進する。¹⁾

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、製造方法並びに規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、承認を得て上市に至った。

承認申請に際し準拠した通知名	平成26年11月21日 薬食発1121第2号
承認	2020年2月
上市	2020年6月

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- 1) 識別性を考慮し、錠剤本体に成分名及び含量を両面印字している。
- 2) 錠剤本体に両面割線を施している。
- 3) 錠剤が見えるPTPシートである。
- 4) PTPシートを2錠単位で切り離しても「糖尿病用剤」、「食直前に服用」の情報を記載している。
- 5) スルホニルウレア類と同様に、膵β細胞においてATP感受性カリウムチャンネルを閉鎖することによりインスリン分泌を促進する。¹⁾
- 6) 重大な副作用として、低血糖、肝機能障害、心筋梗塞が報告されている(頻度不明)。

II. 名称に関する項目

II. 名称に関する項目

1. 販売名

1) 和名

レパグリニド錠0.25mg「サワイ」

レパグリニド錠0.5mg「サワイ」

2) 洋名

REPAGLINIDE Tablets [SAWAI]

3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

2. 一般名

1) 和名(命名法)

レパグリニド(JAN)

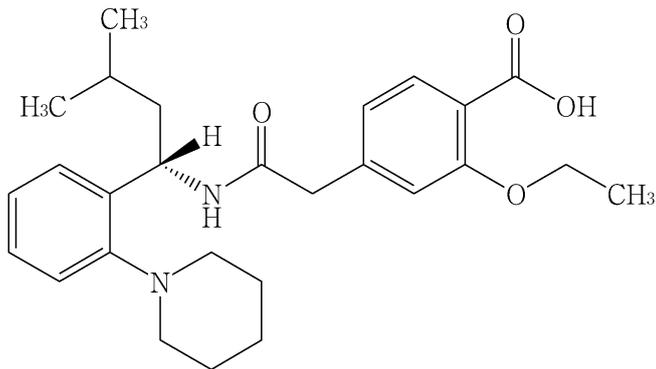
2) 洋名(命名法)

Repaglinide(JAN、INN)

3) ステム

—gli— : 抗高血糖剤

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : $C_{27}H_{36}N_2O_4$

分子量 : 452.59

5. 化学名(命名法)
(+)-(S)-2-Ethoxy-4-[2-[3-methyl-1-(2-piperidinophenyl)butylamino]-2-oxoethyl]benzoic acid
6. 慣用名、別名、略号、記号番号
特になし
7. CAS登録番号
135062-02-1

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～灰白色の結晶性の粉末である。
 - 2) 溶解性
メタノール又はエタノール(99.5)にやや溶けやすく、アセトニトリルにやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。
 - 3) 吸湿性
該当資料なし
 - 4) 融点(分解点)、沸点、凝固点
融点：130～131℃²⁾
 - 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
比旋光度 $[\alpha]_D^{20}$ ：+6.97° (c=0.975、メタノール)、+7.45° (c=1.06、メタノール)³⁾
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……………
 - 1) 紫外可視吸光度測定法
 - 2) 赤外吸収スペクトル測定法
4. 有効成分の定量法……………
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、外観及び性状

品名	剤形	表 (直径mm)	裏 (重量mg)	側面 (厚さmm)	性状
レパグリニド錠0.25mg「サワイ」	割線入り素錠	 7.0×5.0	 約95	 2.8	淡赤色
レパグリニド錠0.5mg「サワイ」	割線入り素錠	 6.0	 約95	 3.0	白色

2) 製剤の物性

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局一般試験法 溶出試験法(パドル法)の項により試験を行うとき、規格に適合する。

3) 識別コード

- レパグリニド錠0.25mg「サワイ」：レパグリニド 0.25 サワイ
- レパグリニド錠0.5mg「サワイ」：レパグリニド 0.5 サワイ

4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等

該当資料なし

2. 製剤の組成

1) 有効成分(活性成分)の含量

- レパグリニド錠0.25mg「サワイ」：1錠中にレパグリニド0.25mgを含有する。
- レパグリニド錠0.5mg「サワイ」：1錠中にレパグリニド0.5mgを含有する。

2) 添加物

●レパグリニド錠0.25mg「サワイ」

添加物として、クロスポビドン、結晶セルロース、三二酸化鉄、ステアリン酸Mg、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレングリコール、D-マンニトール、メグルミン、メタケイ酸アルミン酸Mgを含有する。

●レパグリニド錠0.5mg「サワイ」

添加物として、クロスポビドン、結晶セルロース、ステアリン酸Mg、ヒドロキシプロピルセルロース、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレングリコール、D-マンニトール、メグルミン、メタケイ酸アルミン酸Mgを含有する。

IV. 製剤に関する項目

3) その他

該当資料なし

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性

●レパグリニド錠0.25mg「サワイ」

1) 加速試験³⁾

本製剤の安定性を確認するため、加速試験(3ロット、繰り返し3回)を実施した。

その結果、規格に適合し、1ロット目の試験結果を次表に示した。

PTP： [PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔

[ピロー]アルミニウム袋、乾燥剤

	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	淡赤色の楕円形の割線入り素錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験 [※]	100.0	99.5

※：表示量に対する含有率(%), 平均値

2) 無包装下の安定性試験⁴⁾

無包装の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験(1ロット、繰り返し1回)を行った。

その結果、湿度の条件で硬度低下、光の条件で含量低下が観察された。

	イニシャル	温度 (40°C・遮光3ヵ月)	湿度(25°C75%RH・遮光)	
			1ヵ月	3ヵ月
性状	淡赤色の楕円形の割線入り素錠	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg) ^{※1}	5.2/4.3	5.6/4.5	3.5/3.2	3.7/3.2
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験 ^{※2}	100.0	99.7	99.3	99.3

IV. 製剤に関する項目

	イニシャル	光* (総照射量120万lx・hr)	室温 (25°C60%RH・ 遮光3ヵ月)
性状	淡赤色の楕 円形の割線 入り素錠	変化なし	変化なし
硬度(kg) ^{※1}	5.2/4.3	4.1/3.5	4.7/3.9
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験 ^{※2}	100.0	95.7	99.1

※1：長径方向/短径方向

※2：イニシャルを100としたときの含有率(%)

*：25°C60%RH、白色蛍光灯(2000lx)、開放シャーレ

「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 日本病院薬剤師会)に準じて試験を実施した。

3) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験⁵⁾

PTP包装品(ピロー包装なし)の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験(1ロット、繰り返し1回)を行った。

その結果、以下のとおりであった。

	イニシャル	光*
性状	淡赤色の楕円形の割線入り素錠	変化なし
硬度(kg) ^{※1}	5.9/4.7	4.9/4.0
溶出試験	問題なし	問題なし
定量試験 ^{※2}	100.0	99.8

※1：長径方向/短径方向

※2：イニシャルを100としたときの含有率(%)

*：総照射量120万lx・hr、総近紫外放射エネルギー200W・hr/m²

25°C60%RH、白色蛍光ランプ(4000lx)+近紫外蛍光ランプ(10W/m²)

「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 日本病院薬剤師会)に準じて試験を実施した。

4) 分割後の安定性試験⁶⁾

本製剤を割線に沿って二分割後、下記条件で保存し、安定性試験(1ロット、繰り返し1回)を行った。

その結果、光の条件で含量低下が観察された。

	イニシャル	光*		室温 (25°C60%RH・ 遮光3ヵ月)
		総照射量 60万lx・hr	総照射量 120万lx・hr	
性状	表面	淡赤色	変化なし	変化なし
	分割面	淡赤色	変化なし	変化なし
定量試験 [※]	100.0	97.4	96.0	99.3
含量均一性試験 (参考)	問題なし			

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

*：25°C60%RH、白色蛍光灯(2000lx)、開放シャーレ

分割操作は「錠剤ハサミ お薬チョッキン」を使用

IV. 製剤に関する項目

●レパグリニド錠0.5mg「サワイ」

1) 加速試験⁷⁾

本製剤の安定性を確認するため、加速試験(3ロット、繰り返し3回)を実施した。
その結果、規格に適合し、1ロット目の試験結果を次表に示した。

PTP： [PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔
[ピロー]アルミニウム袋、乾燥剤

	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の割線入り素錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験 [※]	100.2	99.3

※：表示量に対する含有率(%), 平均値

2) 無包装下の安定性試験⁸⁾

無包装の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験(1ロット、繰り返し1回)を行った。
その結果、湿度の条件で硬度低下、光条件で含量低下が観察された。

	イニシャル	温度 (40°C・遮光3ヵ月)	湿度(25°C75%RH・遮光)	
			1ヵ月	3ヵ月
性状	白色の割線入り素錠	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg) ^{※1}	4.3/4.5	4.0/5.1	2.9/2.9	3.3/3.3
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験 ^{※2}	100.0	101.2	100.5	101.3

	イニシャル	光* (総照射量120万lx・hr)	室温 (25°C60%RH・ 遮光3ヵ月)
性状	白色の割線入り素錠	変化なし	変化なし
硬度(kg) ^{※1}	4.3/4.5	3.9/4.0	4.2/4.7
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験 ^{※2}	100.0	96.6	100.2

※1：割線に対して水平方向/垂直方向

※2：イニシャルを100としたときの含有率(%)

*：25°C60%RH、白色蛍光灯(2000lx)、開放シャワーレ

「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 日本病院薬剤師会)に準じて試験を実施した。

3) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験⁹⁾

PTP包装品(ピロー包装なし)の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験(1ロット、繰り返し1回)を行った。

その結果、以下のとおりであった。

IV. 製剤に関する項目

	イニシャル	光*
性状	白色の割線入り素錠	変化なし
硬度(kg)※ ¹	5.6/5.9	4.4/4.7
溶出試験	問題なし	問題なし
定量試験※ ²	100.0	99.6

※1：割線に対して水平方向/垂直方向

※2：イニシャルを100としたときの含有率(%)

*：総照射量120万lx・hr、総近紫外放射エネルギー200W・hr/m²

25℃60%RH、白色蛍光灯(4000lx) + 近紫外蛍光灯(10W/m²)

「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 日本病院薬剤師会)に準じて試験を実施した。

4) 分割後の安定性試験¹⁰⁾

本製剤を割線に沿って二分割後、下記条件で保存し、安定性試験(1ロット、繰り返し1回)を行った。

その結果、光の条件で含量低下が観察された。

性状	表面 分割面	イニシャル	光*		室温 (25℃60%RH・ 遮光3ヵ月)
			総照射量 60万lx・hr	総照射量 120万lx・hr	
		白色	変化なし	変化なし	変化なし
		白色	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験※		100.0	97.4	95.4	98.5
含量均一性試験 (参考)		問題なし			

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

*：25℃60%RH、白色蛍光灯(2000lx)、開放シャーレ
分割操作は「錠剤ハサミ お薬チョッキン」を使用

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)

該当資料なし

7. 溶出性

<溶出挙動における同等性及び類似性>

●レパグリニド錠0.25mg「サワイ」¹¹⁾

試験方法	「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)に従い、試験を実施した。	
試験条件	パドル法	50rpm : pH1.2、pH5.0、pH6.8、水
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	レパグリニド錠0.25mg「サワイ」	
標準製剤	レパグリニド錠0.5mg「サワイ」	

IV. 製剤に関する項目

【結果及び考察】

<50rpm : pH1.2>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。

<50rpm : pH5.0>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。

<50rpm : pH6.8>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。

<50rpm : 水>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

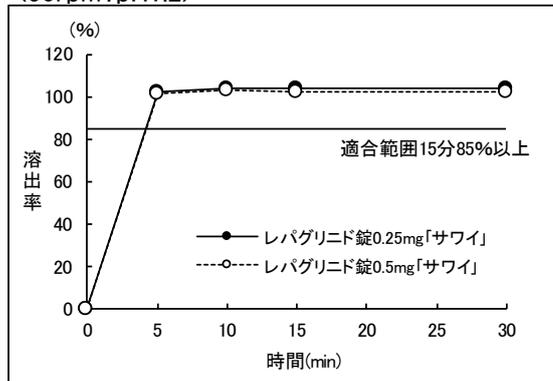
最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。

以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。

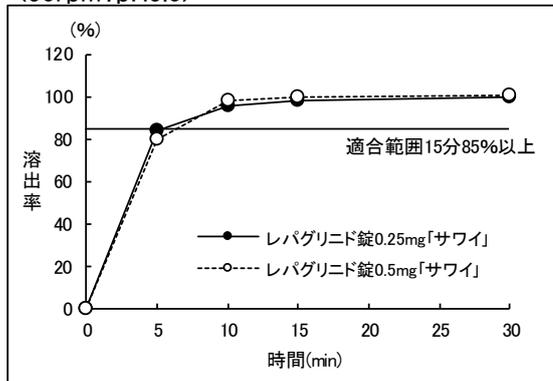
本剤の処方変更水準はB水準であり、両製剤の溶出挙動は同等であったことから、両製剤は生物学的に同等であるとみなした。

(溶出曲線)

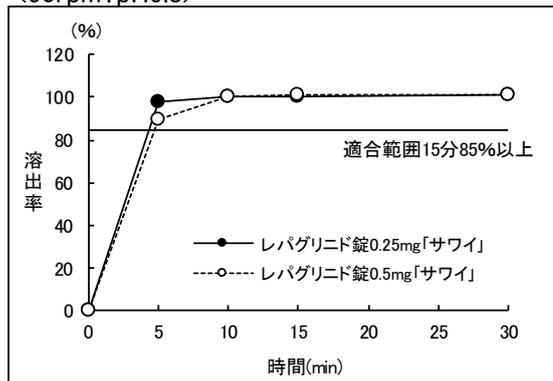
<50rpm : pH1.2>



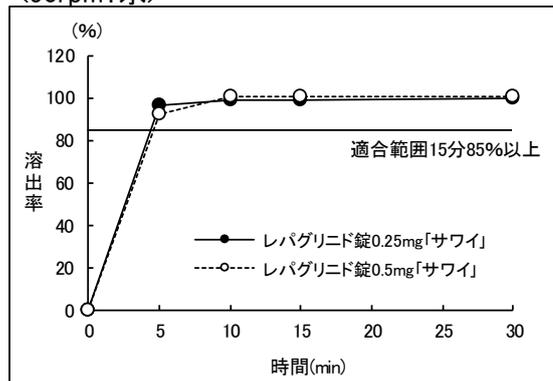
<50rpm : pH5.0>



<50rpm : pH6.8>



<50rpm : 水>



●レバグリニド錠0.5mg「サワイ」¹²⁾

試験方法	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)に従い、試験を実施した。	
試験条件	パドル法	75rpm : pH1.2、pH5.0、pH6.8、水
試験回数	12 ベッセル	

【結果及び考察】

<75rpm : pH1.2>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<75rpm : pH5.0>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<75rpm : pH6.8>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

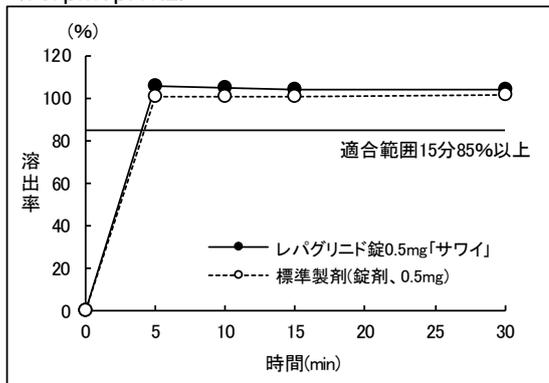
<75rpm : 水>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

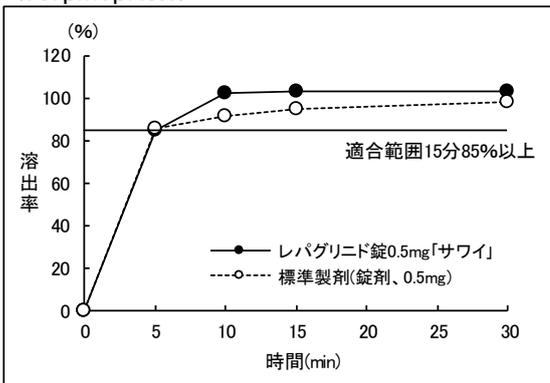
以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

(溶出曲線)

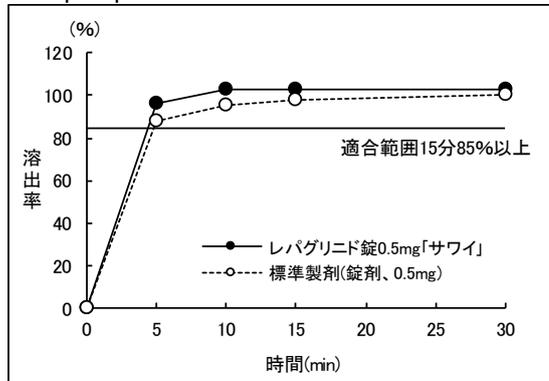
<75rpm : pH1.2>



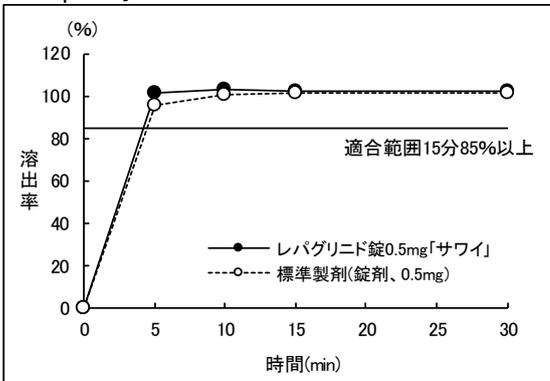
<75rpm : pH5.0>



<75rpm : pH6.8>



<75rpm : 水>



IV. 製剤に関する項目

8. 生物学的試験法
該当しない
9. 製剤中の有効成分の確認試験法
液体クロマトグラフィー
10. 製剤中の有効成分の定量法
液体クロマトグラフィー
11. 力価
該当しない
12. 混入する可能性のある夾雑物
該当資料なし
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報
該当資料なし
14. 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

<効能又は効果に関連する使用上の注意>

糖尿病の診断が確立した患者に対してのみ適用を考慮すること。糖尿病以外にも耐糖能異常・尿糖陽性等、糖尿病類似の症状(腎性糖尿、甲状腺機能異常等)を有する疾患があることに留意すること。

2. 用法及び用量

通常、成人にはレパグリニドとして1回0.25mgより開始し、1日3回毎食直前に経口投与する。維持用量は通常1回0.25~0.5mgで、必要に応じて適宜増減する。なお、1回量を1mgまで増量することができる。

<用法及び用量に関連する使用上の注意>

本剤は食後投与では速やかな吸収が得られず効果が減弱する。効果的に食後の血糖上昇を抑制するため、本剤の投与は毎食直前(10分以内)とすること。また、本剤は投与後速やかに薬効を発現するため、食事の30分以上前の投与では食事開始前に低血糖を誘発する可能性がある。

3. 臨床成績

レパグリニド製剤の臨床試験成績が以下のとおり報告されている。

1) 臨床データパッケージ

該当しない

2) 臨床効果

該当資料なし

3) 臨床薬理試験

該当資料なし

4) 探索的試験

該当資料なし

5) 検証的試験

(1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

(2) 比較試験

該当資料なし

V. 治療に関する項目

(3) 安全性試験

該当資料なし

(4) 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・特定使用成績調査(特別調査)・製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)

該当資料なし

(2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

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……………

膵β細胞刺激によるインスリン分泌促進作用(短時間速効型)：
ナテグリニド、ミチグリニドカルシウム水和物¹³⁾

2. 薬理作用……………

レパグリニドの薬理作用について以下のとおり報告されている。

1) 作用部位・作用機序

膵β細胞においてATP感受性カリウムチャンネルを閉鎖することによりインスリン分泌を促進する。¹⁾

2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

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

レパグリニド製剤の薬物動態について以下のとおり報告されている。

1. 血中濃度の推移・測定法

1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

2) 最高血中濃度到達時間

VII. -1. -3) 参照

3) 臨床試験で確認された血中濃度

<生物学的同等性試験>

●レパグリニド錠0.25mg「サワイ」¹¹⁾

レパグリニド錠0.25mg「サワイ」は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン(平成24年2月29日付 薬食審査発0229第10号)」に基づき、レパグリニド錠0.5mg「サワイ」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。(IV. -7. 参照)

●レパグリニド錠0.5mg「サワイ」^{14, 15)}

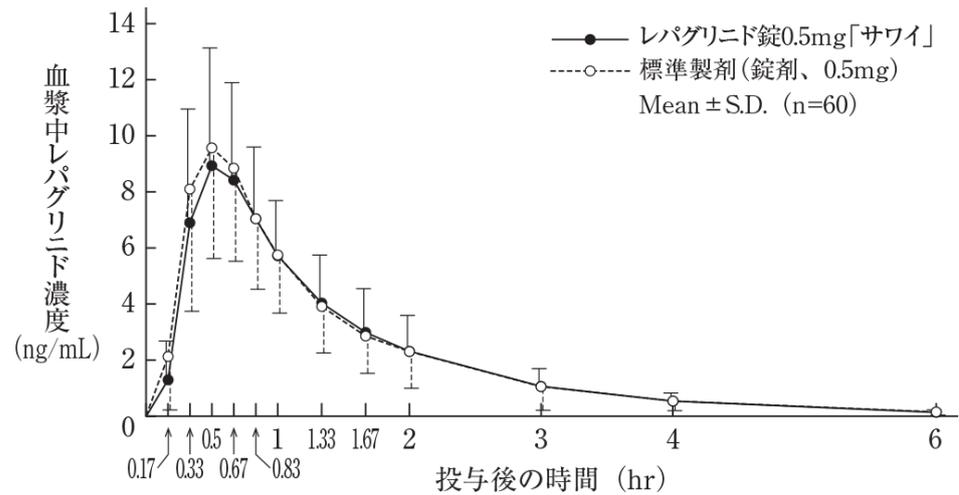
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)に準じ、レパグリニド錠0.5mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(レパグリニドとして0.5mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中レパグリニド濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

採血時点	0、0.17、0.33、0.5、0.67、0.83、1、1.33、1.67、2、3、4、6 hr
休薬期間	2日間
測定方法	LC/MS法

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-6hr} (ng・hr/mL)
レパグリニド錠 0.5mg「サワイ」	9.83±3.48	0.7±0.3	1.1±0.2	12.89±4.31
標準製剤 (錠剤、0.5mg)	10.50±3.82	0.6±0.2	1.1±0.2	13.24±5.08

(Mean±S.D., n=60)



	対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
AUC _{0-6hr}	log(0.99)	log(0.95) ~ log(1.03)
Cmax	log(0.94)	log(0.88) ~ log(1.00)

血漿中濃度ならびに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。

4) 中毒域

該当資料なし

5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

6) 母集団(ポピュレーション)解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

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) バイオアベイラビリティ

VII. -1. -3) 参照

4) 消失速度定数

●レパグリニド錠0.5mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(レパグリニドとして0.5mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数^{14,15)}

$$0.669 \pm 0.133 \text{hr}^{-1}$$

VII. 薬物動態に関する項目

5) クリアランス

該当資料なし

6) 分布容積

該当資料なし

7) 血漿蛋白結合率

98.3～98.6%¹⁶⁾

3. 吸収

消化管から急速に吸収される。¹⁾

4. 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

＜参考＞胎児の器官形成期に投与されたラット及びウサギでは胎児に致死作用及び骨格異常・骨格変異の発現頻度の増加がみられ、更に妊娠末期及び授乳期に投与されたラットでは出生児に四肢骨の異常が認められている。

3) 乳汁への移行性

＜参考＞ラットで乳汁中への移行が認められている。

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

5. 代謝

1) 代謝部位及び代謝経路

主として肝臓で代謝される。¹⁾

2) 代謝に関与する酵素(CYP450等)の分子種

主として薬物代謝酵素CYP2C8と一部CYP3A4で代謝される。

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比率

該当資料なし

5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄

1) 排泄部位及び経路

糞中に約90%¹⁷⁾、尿中に9%¹⁶⁾排泄される。

2) 排泄率

VII. -6. -1) 参照

3) 排泄速度

該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

レパグリニドの肝取り込みにトランスポーターOATP1B1が関与する報告がある。¹⁾

8. 透析等による除去率

透析により除去されない。¹⁶⁾

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……………
該当しない

2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)……………

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

- 1) 重症ケトアシドシス、糖尿病性昏睡又は前昏睡、1型糖尿病の患者〔輸液及びインスリンによる速やかな高血糖の是正が必須となるので本剤の投与は適さない。〕
- 2) 重症感染症、手術前後、重篤な外傷のある患者〔インスリン注射による血糖管理が望まれるので本剤の投与は適さない。〕
- 3) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人(「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)
- 4) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由……………
V. -1. 参照

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由……………
V. -2. 参照

5. 慎重投与内容とその理由……………

慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- 1) 肝機能障害のある患者〔本剤は主に肝臓で代謝されるため、血中濃度が上昇し低血糖を起こすおそれがある。重度の肝機能障害のある患者には低用量(1回0.125mg)から投与を開始するなど、慎重に投与すること。なお、国内では肝機能障害のある患者への投与経験が限られている。〕
- 2) 重度の腎機能障害のある患者〔血中濃度が上昇し低血糖を起こすおそれがある。なお、国内では透析を必要とする重度の腎機能障害のある患者への投与経験はない。〕
- 3) インスリン製剤を投与中の患者〔低血糖のリスクが増加するおそれがある。(「重要な基本的注意」、「相互作用」、「重大な副作用」の項参照)〕
- 4) 次に掲げる患者又は状態
 - (1) 虚血性心疾患のある患者〔外国において心筋梗塞を発症した症例が報告されている。(「重大な副作用」の項参照)〕
 - (2) 脳下垂体機能不全又は副腎機能不全〔低血糖を起こすおそれがある。〕
 - (3) 下痢、嘔吐等の胃腸障害〔低血糖を起こすおそれがある。〕
 - (4) 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〔低血糖を起こすおそれがある。〕
 - (5) 激しい筋肉運動〔低血糖を起こすおそれがある。〕
 - (6) 過度のアルコール摂取〔低血糖を起こすおそれがある。〕
 - (7) 高齢者(「高齢者への投与」の項参照)

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

重要な基本的注意

- 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。特に、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おそれがある。併用時の低血糖のリスクを軽減するため、インスリン製剤の減量を検討すること。(「慎重投与」、「相互作用」、「重大な副作用」の項参照)
- 2) 低血糖症状を起こすことがあるので、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。低血糖症状(めまい・ふらつき、ふるえ、空腹感、冷汗、意識消失等)が認められた場合には通常はショ糖を投与し、 α -グルコシダーゼ阻害剤(アカルボース、ボグリボース、ミグリトール)との併用により低血糖症状が認められた場合には、 α -グルコシダーゼ阻害剤が二糖類の消化・吸収を遅延するので、ショ糖ではなく**ブドウ糖**を投与するなど適切な処置を行うこと。(「重大な副作用」の項参照)
- 3) 本剤は、他の速効型インスリン分泌促進剤に比べて作用持続時間が長いため、投与後数時間は低血糖を起こすことがある。また、他の速効型インスリン分泌促進剤に比べて低血糖の発現頻度が高かったので注意すること。
- 4) 本剤投与中は、血糖を定期的に検査するとともに、経過を十分に観察し、本剤を2～3ヵ月投与しても効果が不十分な場合には、より適切と考えられる治療への変更を考慮すること。
- 5) 投与の継続中に、投与の必要がなくなる場合や、減量する必要がある場合があり、また患者の不養生、感染症の合併等により効果がなくなったり、不十分となる場合があるので、食事摂取量、血糖値、感染症の有無等に留意のうえ、常に投与継続の可否、投与量、薬剤の選択等に注意すること。
- 6) 本剤は速やかなインスリン分泌促進作用を有する。その作用点はスルホニルウレア剤と同じであり、スルホニルウレア剤との相加・相乗の臨床効果及び安全性が確立されていないので、スルホニルウレア剤と併用しないこと。
- 7) 本剤の適用においては、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うえで効果が不十分な場合に限り考慮すること。
- 8) 本剤を投与する際は、空腹時血糖が126mg/dL以上、又は食後血糖1時間値又は2時間値が200mg/dL以上を示す場合に限る。
- 9) 本剤とGLP-1受容体作動薬との併用における有効性及び安全性は検討されていない。

7. 相互作用

本剤は、主として薬物代謝酵素CYP2C8及び一部CYP3A4で代謝される。

1) 併用禁忌とその理由

該当しない

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

2) 併用注意とその理由

併用注意(併用に注意すること)			
1) 血糖降下作用を増強する薬剤			
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子	
インスリン製剤 ^{注)}	低血糖症状(空腹感、あくび、悪心、無気力、だるさ等の初期症状から、血圧上昇、発汗、ふるえ、顔面蒼白等の症状を経て意識消失、けいれん、昏睡にいたる)、血糖降下作用が増強されることがあるので、血糖値モニター、その他患者の状態を十分に観察し、必要であれば減量する。特に、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おそれがある。併用時の低血糖のリスクを軽減するため、インスリン製剤の減量を検討すること。 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ショ糖ではなくブドウ糖を投与すること。	機序の異なる血糖降下作用が相加的に増強される。	
ビグアナイド系薬剤 メトホルミン等			
α-グルコシダーゼ阻害剤 アカルボース ボグリボース ミグリトール			
チアゾリジン系薬剤 ピオグリタゾン			
DPP-4 阻害剤 シタグリプチン等			
GLP-1 受容体作動薬 ^{注)}			
SGLT 2 阻害剤			
イメグリミン塩酸塩			
β 遮断剤 プロプラノロール等			これらの薬剤の肝における糖新生の抑制及び末梢におけるインスリン感受性の増強作用による。
モノアミン酸化酵素阻害剤			
サリチル酸製剤 アスピリン等			サリチル酸製剤の血糖降下作用による。
タンパク同化ホルモン剤			一部の糖尿病患者ではタンパク同化ホルモン剤により血糖低下作用を示すことがある。
テトラサイクリン系抗生物質 テトラサイクリン ミノサイクリン 等			テトラサイクリン系抗生物質のインスリン感受性増強作用による。
シクロスポリン			シクロスポリンはCYP3A4及び肝取り込みトランスポーターOATP1B1を阻害し本剤の血中濃度を増加させる可能性がある。
デフェラシロクス クロピドグレル スルファメトキサゾール・トリメトプリム ファビピラビル	CYP2C8阻害作用により、本剤の代謝が抑制されると考えられている。併用により、本剤の血中濃度が増加したとの報告がある。		

注)「重要な基本的注意」の項参照

2) 血糖降下作用を減弱する薬剤		
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
アドレナリン	血糖降下剤の効果を減弱させ、血糖値が上昇してコントロール不良になることがある。食後の血糖上昇が加わることによる影響に十分注意すること。併用する場合は頻回に血糖値を測定するなど血糖コントロールに注意し、必要に応じ投与量を調節すること。	アドレナリンの末梢でのブドウ糖取り込み抑制、肝での糖新生促進、インスリン分泌抑制による。
副腎皮質ホルモン メチルプレドニゾン 等		副腎皮質ホルモンの肝での糖新生促進作用及び末梢組織でのインスリン感受性低下作用による。
卵胞ホルモン エチニルエストラジオール等		機序は不明であるが、卵胞ホルモンによるコルチゾール分泌変化、組織での糖利用変化、成長ホルモンの過剰産生、肝機能の変化、末梢でのインスリン感受性低下等が考えられている。
ニコチン酸		ニコチン酸の肝でのブドウ糖同化抑制による。
ピラジナミド		機序は不明ではあるが、ピラジナミド服用患者では血糖のコントロールがより難しいとの報告がある。
フェノチアジン系薬剤 クロルプロマジン等		フェノチアジン系薬剤のインスリン遊離抑制作用及び副腎からのアドレナリン遊離作用による。
利尿剤 チアジド系等		利尿剤による血清カリウムの低下、インスリンの分泌障害、組織におけるインスリンの感受性低下が考えられている。
フェニトイン		フェニトインはインスリン分泌を直接抑制する。
リファンピシン	リファンピシンの薬物代謝酵素誘導により、本剤の血中濃度が低下する可能性がある。	
3) その他		
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
イソニアジド	血糖値その他患者の状態を十分観察しながら投与すること。	イソニアジドは本剤の主要代謝酵素であるCYP2C8の阻害作用を有するため、本剤の血中濃度が上昇する可能性がある。 また、イソニアジドの糖質代謝阻害により血糖値上昇及び耐糖能異常を引き起こす。
甲状腺ホルモン 乾燥甲状腺等		甲状腺ホルモンは糖代謝全般に作用し血糖値を変動させると考えられている。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

8. 副作用

1) 副作用の概要

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

2) 重大な副作用と初期症状

1) 重大な副作用(頻度不明)

- (1) **低血糖**: 低血糖及び低血糖症状があらわれることがある。めまい・ふらつき、ふるえ、空腹感、冷汗、意識消失等の低血糖症状が認められた場合には通常はショ糖を投与し、 α -グルコシダーゼ阻害剤(アカルボース、ボグリボース、ミグリトール)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**を投与するなど適切な処置を行うこと。
- (2) **肝機能障害**: 肝機能障害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し、適切な処置を行うこと。
- (3) **心筋梗塞**: 外国において心筋梗塞の発症が報告されているので、投与に際しては観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
(「その他の注意」の項参照)

3) その他の副作用

2) その他の副作用

次のような副作用が認められた場合には、必要に応じ、減量、投与中止等の適切な処置を行うこと。

	頻度不明
代 謝	血清カリウム上昇、尿酸上昇
消 化 器	下痢、便秘、腹痛、悪心、腹部膨満感、逆流性食道炎、胃炎
精 神 神 経 系	振戦、めまい・ふらつき、しびれ感、頭痛、眠気、イライラ感、浮遊感、集中力低下
過 敏 症 ^{注)}	蕁麻疹、そう痒、発疹、紅斑
肝 臓	ビリルビン上昇、AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、Al-P上昇、 γ -GTP上昇
腎 臓	クレアチニン上昇、BUN上昇
血 液	白血球増加
眼	羞明、視野狭窄、霧視
循 環 器	血圧上昇、期外収縮、動悸、頻脈
そ の 他	空腹感、倦怠感、脱力感、多汗、冷汗、浮腫、体重増加、ほてり、顔面蒼白、冷感、気分不良

注)このような症状が認められた場合には投与を中止すること。

4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)
 4) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

副作用

2) その他の副作用

次のような副作用が認められた場合には、必要に応じ、減量、投与中止等の適切な処置を行うこと。

	頻度不明
過 敏 症 <small>注)</small>	蕁麻疹、そう痒、発疹、紅斑

注) このような症状が認められた場合には投与を中止すること。

9. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので、血糖値に留意し、定期的に検査を行うなど経過を十分に観察しながら慎重に投与すること。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- 1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないこと。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。また、胎児の器官形成期に投与されたラット及びウサギでは胎児に致死作用及び骨格異常・骨格変異の発現頻度の増加がみられ、更に妊娠末期及び授乳期に投与されたラットでは出生児に四肢骨の異常が認められている。]
- 2) 授乳中の婦人に投与することを避け、やむを得ず投与する場合には授乳を中止させること。[ラットで乳汁中への移行が認められている。]

11. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない(使用経験がない)。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

14. 適用上の注意

薬剤交付時：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報告されている)

15. その他の注意

本剤と心血管イベントの関連について明確な結論は得られていないが、外国の疫学的研究で本剤投与群の急性冠動脈症候群の発現頻度がスルホニルウレア剤投与群に比べ高いことを示唆する報告がある。また、外国の臨床試験において本剤とNPHインスリン併用時に重篤な心筋虚血の発現が認められた症例が報告されている。

16. その他

IX. 非臨床試験に関する項目

レパグリニドの非臨床試験成績について以下のとおり報告されている。

1. 薬理試験.....
 - 1) 薬効薬理試験(「VI. 薬効薬理に関する項目」参照)

 - 2) 副次的薬理試験
該当資料なし

 - 3) 安全性薬理試験
該当資料なし

 - 4) 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) 生殖発生毒性試験
VIII. -10. 参照

 - 4) 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

	規制区分
製剤	劇薬、処方箋医薬品 ^{注)}
有効成分	劇薬

注) 注意一医師等の処方箋により使用すること

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年

3. 貯法・保存条件

室温保存

X. -4. 参照

4. 薬剤取扱い上の注意点

1) 薬局での取扱い上の留意点について

・取扱い上の注意

錠0.25mgは錠剤表面に使用色素による赤い斑点がみられることがある。

2) 薬剤交付時の取扱いについて(患者等に留意すべき必須事項等)

患者向医薬品ガイド：有り、くすりのしおり：有り

VIII. -14. 参照

レパグリニド錠「サワイ」を服用される方へ

■ レパグリニド錠0.25mg「サワイ」



(原寸)

レパグリニド 0.25mg Repaglinide 0.25mg



0.25 糖尿病用剤 0.25

■ レパグリニド錠0.5mg「サワイ」



(原寸)

レパグリニド 0.5mg Repaglinide 0.5mg



0.5 糖尿病用剤 0.5

食後の高血糖を改善するお薬です。低血糖をおこすことがありますので、以下の点にご注意ください。

..... 服用時の注意

- このお薬は必ず食事の直前(食事前10分以内)にお飲みください。お薬を飲んだらすぐに食事をとるようにしてください。すぐに食事をとらないと、食事をとる前に低血糖をおこすことがあります。
- このお薬は、食後に飲まないでください。食後に飲むと、お薬の効き目が弱くなったり、お薬を飲んでから次の食事までの間に低血糖をおこすことがあります。
- 飲み忘れたときは、次の時間に1回分をお飲みください。食事中に気がついた場合も、1回分をとばして、次の時間に1回分をお飲みください。絶対に2回分を一度に飲んではいけません。
- 食事がとれないときは、このお薬は飲まないでください。

(ウラもご覧ください) 2020年6月8日

GUREPA01P0V01 沢井製薬株式会社

このお薬により、低血糖をおこすことがあります。

■ 低血糖の症状 ■ 低血糖とは、血液中の糖分が少なくなりすぎた状態です。主に次のような症状があらわれます。



強い空腹感



頭が重い



冷や汗、動悸



手足のふるえ



意識を失う

(その他の症状) 眠気、あくび、顔面蒼白、目のちらつき、ふらつき、いつもと人柄の違ったような異常な行動をとる

症状が重い場合は、けいれんをおこしたり、意識を失うこともあります。高所作業や自動車の運転など危険を伴う機械を操作する際は、特に注意してください。危険を伴う機械を操作しているときに低血糖をおこすと事故につながります。

■ 低血糖の対処法 ■

- 症状が軽い場合は糖分をとると治ります。普段から砂糖(ショ糖)などを持ち歩き、症状があらわれた場合は、すぐにその場でとるようにしましょう。ただし、アカルボース、ボグリボース、ミグリトールといったお薬と一緒に飲んでいる場合は、砂糖では効果がすぐにあらわれません。必ずブドウ糖をとってください。
- 十分に注意していても、意識を失うような低血糖がおこってしまうことがあります。すぐに治療してもらるように、自分が現在糖尿病で薬を飲んでいることを書いたカードなどを身につけておくことで安心です。
- 低血糖の症状があらわれた際は、必ず早めに医師に連絡してください。

■ 低血糖の予防 ■

- 医師または薬剤師の指示通りに服用してください。
- 自己判断により服用を中止したり、服用する量を変更したりすることは危険ですので、絶対にしないでください。
- 食事をみだりに減らしたり、抜いたりしないよう食事療法はきちんと守ることが大切です。お酒の飲みすぎ、激しい運動、下痢などは低血糖をおこしやすくなるため、注意してください。食事がとれないときは、医師に相談しましょう。
- このお薬と一緒に飲むと低血糖をおこすお薬があります。他のお薬を飲む場合は、必ず医師または薬剤師に相談してください。他の医療機関で何かお薬を処方してもらったときは、レパグリニド錠「サワイ」を飲んでいることを伝えてください。

この注意は必ず家族やまわりの方にもお知らせください。

注) 当説明書は変更・改訂される場合があります。

3) 調剤時の留意点について

該当しない

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

●レパグリニド錠0.25mg「サワイ」

PTP：100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50)

●レパグリニド錠0.5mg「サワイ」

PTP：100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50)

7. 容器の材質

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔
[ピロー]アルミラミネートフィルム

8. 同一成分・同効薬

同一成分：シュアポスト錠0.25mg/錠0.5mg

同効薬：膵β細胞刺激によるインスリン分泌促進作用(短時間速効型)：ナテグリニド、ミチグリニドカルシウム水和物¹³⁾

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

●レパグリニド錠0.25mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2020年2月17日、承認番号：30200AMX00354000

●レパグリニド錠0.5mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2020年2月17日、承認番号：30200AMX00355000

11. 薬価基準収載年月日

2020年6月19日

X. 管理的事項に関する項目

12. 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

13. 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

14. 再審査期間……………
 該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報……………
 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。

16. 各種コード……………

品名	HOT番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算 コード
レパグリニド錠0.25mg 「サワイ」	128134701	3969013F1038	622813401
レパグリニド錠0.5mg 「サワイ」	128135401	3969013F2034	622813501

17. 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。

XI . 文 献

1. 引用文献
- 1) 高折修二他監訳, グッドマン・ギルマン薬理書, 第12版, 廣川書店, 2013, p. 137, p. 1613-1614.
 - 2) The Merck Index 14th edition, 2006, p. 1402.
 - 3) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験]レパグリニド錠0.25mg「サワイ」
 - 4) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験]レパグリニド錠0.25mg「サワイ」
 - 5) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験]レパグリニド錠0.25mg「サワイ」
 - 6) 沢井製薬(株) 社内資料[分割後の安定性試験]レパグリニド錠0.25mg「サワイ」
 - 7) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験]レパグリニド錠0.5mg「サワイ」
 - 8) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験]レパグリニド錠0.5mg「サワイ」
 - 9) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験]レパグリニド錠0.5mg「サワイ」
 - 10) 沢井製薬(株) 社内資料[分割後の安定性試験]レパグリニド錠0.5mg「サワイ」
 - 11) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験]レパグリニド錠0.25mg「サワイ」
 - 12) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験]レパグリニド錠0.5mg「サワイ」
 - 13) 薬剤分類情報閲覧システム<<http://www.iryohoken.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>> (2019/11/29 アクセス)
 - 14) 渡辺礼他, 新薬と臨牀, **69**(5), 616(2020).
 - 15) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験]レパグリニド錠0.5mg「サワイ」
 - 16) 平田純生他編, 透析患者への投薬ガイドブック 慢性腎臓病(CKD)の薬物治療, 改訂3版, じほう, 2017, p. 617-618.
 - 17) USP DI : Vol. 1, Drug Information for the Health Care Professional, 27th ed., 2007, p. 2499-2502.
2. その他の参考文献

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備考

その他の関連資料

