

## プレスリリース

2011年7月1日

報道関係 各位

日本ベーリンガーインゲルハイム株式会社  
日本イーライリリー株式会社

### 世界初の胆汁排泄型選択的 DPP-4 阻害剤「トラゼンタ<sup>®</sup>」、 2 型糖尿病を適応として製造販売承認を取得

- －長期にわたり、確実な HbA1c 低下作用を有する新規 DPP-4 阻害剤<sup>1</sup>
- －2 型糖尿病患者において腎機能の程度にかかわらず用量調整が不要<sup>2</sup>
- －米国での世界初の承認から短期間で、日本で承認

日本ベーリンガーインゲルハイム株式会社(本社:東京都品川区、社長:ジェラード・マッケナ、以下「日本ベーリンガーインゲルハイム」と日本イーライリリー株式会社(本社:兵庫県神戸市、代表執行役社長:アルフォンソ G. ズルエッタ、以下「日本イーライリリー」)は、食事療法、運動療法のみで十分な効果が得られない 2 型糖尿病患者の治療薬として、日本ベーリンガーインゲルハイムが、トラゼンタ<sup>®</sup>錠 5mg(一般名:リナグリプチン)の製造販売承認を 7 月 1 日に取得した旨、発表しました。

トラゼンタ<sup>®</sup>は、ベーリンガーインゲルハイムで創薬、開発された選択的経口 DPP-4 (ジペプチジルペプチダーゼ-4)阻害剤<sup>3</sup>で、2011 年 5 月、米国において承認され、国内では、米国での承認から、2 カ月で製造販売承認を取得しました。トラゼンタ<sup>®</sup>は日本で、日本ベーリンガーインゲルハイムが製造、販売を行い、両社で共同販促(コ・プロモーション)をいたします。

日本ベーリンガーインゲルハイム 医薬開発本部長 Dr. トーマス・クーナーは次のように述べています。

「米国でトラゼンタ<sup>®</sup>の承認を受けてから 2 カ月で、日本での承認を取得したことを誇りに感じます。トラゼンタ<sup>®</sup>は長期にわたり、確実な HbA1c 低下作用を有しています。また糖尿病になると腎機能低下のリスクを高く有している、もしくは、既に腎機能障害を起こしている患者さんが少なくないことから、1 日 1 回投与で、腎機能の程度にかかわらず用量調整を必要としないトラゼンタ<sup>®</sup>は、2 型糖尿病の患者さんや糖尿病治療に携わる医療従事者の方々のお役に立てることができると確信しています」。

ベーリンガーインゲルハイムならびにイーライリリー・アンド・カンパニーは、グローバルで糖尿病領域の戦略的アライアンスを結んでおり、今後ともトラゼンタ<sup>®</sup>の製品価値の最大化を図るとともに、糖尿病治療に一層の貢献をしていきます。

## 承認内容の概要について

トラゼンタ<sup>®</sup>は DPP-4 を選択的に阻害することにより、インクレチンホルモンである GLP-1 の血中濃度を高めることで、血糖低下作用が発揮されます<sup>4</sup>。GLP-1 は、血糖依存的に分泌されるため、DPP-4 阻害剤は、低血糖のリスクの発現が低いとされています。また、本剤は主に糞中に未変化体のまま排泄される世界初の胆汁排泄型選択的 DPP-4 阻害剤です<sup>5,6</sup>。

### <承認日>

2011 年 7 月 1 日

### <販売名>

トラゼンタ<sup>®</sup>錠 5mg

### <一般名>

リナグリプチン

### <効能・効果>

2 型糖尿病(ただし、食事療法・運動療法のみで十分な効果が得られない場合に限る。)

### <用法・用量>

通常、成人にはリナグリプチンとして 5mg を 1 日 1 回経口投与する。

## 安全性について

### <副作用>

国内で実施された臨床試験では、694 例中 76 例(11.0%)に臨床検査値の異常を含む副作用が認められました。主な副作用は便秘 14 件(2.0%)、鼓腸 11 件(1.6%)、腹部膨満 7 件(1.0%)等でした。(承認時までの集計)

## 糖尿病について

糖尿病はその成因によって、1 型糖尿病、2 型糖尿病、その他特定の機序・疾患による糖尿病、妊娠糖尿病の 4 つに分類されます。1 型および 2 型糖尿病の患者数は日本で約 2,210 万人<sup>7</sup>、世界で 2 億 2,000 万人<sup>8</sup>と推定されています。そして糖尿病全体の 95%以上は、2 型糖尿病であり、大半が高年に発症します。糖尿病は、インスリンというホルモンを生体が適切に生成したり、利用しにくくなった場合に発症する慢性疾患です<sup>9</sup>。

## 糖尿病と腎機能低下について

米国での調査によると、2 型糖尿病患者のおよそ 3 人に 2 人が、腎機能障害を起こすリスクを有している、または既に腎機能障害を合併しているとの報告があります<sup>10</sup>。腎機能が低下している患者は、慢性腎不全への進行および心血管病発症のハイリスク群であるため<sup>11</sup>、その進行を止めることは臨床重要になります。また、腎機能が低下している 2 型糖尿病患者は、低血糖リスクが高まることがわかっています<sup>12</sup>。そのため糖尿病治療においては、腎機能に配慮した治療法が求められています。

## ベーリンガーインゲルハイムとイーライリリー・アンド・カンパニー の提携について

2011年1月、ベーリンガーインゲルハイムとイーライリリー・アンド・カンパニーは、糖尿病領域におけるアライアンスを結び、糖尿病領域において大型製品に育成されることが期待される4つの治療薬候補化合物を中心に協働していくことを発表しました。同アライアンスは、ベーリンガーインゲルハイムが持つ研究開発主導型イノベーションの確かな実績とイーライリリーが持つ糖尿病領域での革新的な研究、経験、先駆的実績を合わせ、世界的製薬企業である両社の強みを最大限に活用するものです。この提携によって両社は、糖尿病患者のケアにおけるコミットメントを示し、患者のニーズに応えるべく協力しています。

## ベーリンガーインゲルハイムについて

ベーリンガーインゲルハイムグループは、世界でトップ20の製薬企業のひとつです。ドイツのインゲルハイムを本拠とし、世界で145の関連会社と42,200人以上の社員が、事業を展開しています。1885年の設立以来、株式公開をしない企業形態の特色を生かしながら、臨床的価値の高いヒト用医薬品および動物薬の研究開発、製造、販売に注力してきました。

2010年度は126億ユーロの売上を示しました。革新的な医薬品を世に送り出すべく、医療用医薬品事業の売上の約24%相当額を研究開発に投資しました。ベーリンガーインゲルハイムについての詳細は以下のウェブサイトをご覧ください。<http://www.boehringer-ingelheim.com>

## ベーリンガーインゲルハイム ジャパンについて

日本ではベーリンガーインゲルハイム ジャパン株式会社が持ち株会社として、その傘下にある完全子会社の日本ベーリンガーインゲルハイム株式会社(医療用医薬品)、エスエス製薬株式会社(一般用医薬品)、ベーリンガーインゲルハイム ベトメディカ ジャパン株式会社(動物用医薬品)、ベーリンガーインゲルハイム製薬株式会社(医薬品製造)の4つの事業会社を統括しています。日本のグループ全体で約3,000人の社員が、革新的な医薬品の研究、開発、製造、販売に従事しています。

日本ベーリンガーインゲルハイムは、呼吸器、循環器、中枢神経などの疾患領域で革新的な医療用医薬品を提供しています。また、グローバルな研究・開発の一翼を担う医薬研究所を神戸に擁しています。

ベーリンガーインゲルハイム ジャパンについての詳細情報は以下のウェブサイトをご覧ください。<http://www.boehringer-ingelheim.co.jp>

## イーライリリー・アンド・カンパニーについて

1876年創業のイーライリリーは130年の歴史ある研究開発主導型の先進企業であり、世界140カ国以上、約38,000人の社員が自社の研究施設の最新の成果を応用するとともに、社外の研究機関との提携を通じて医薬品のポートフォリオを拡大しています。米インディアナ州インディアナポリスに本社を置くリリーは、医薬品と情報を通じて「こたえ」を提供し、世界で最も急を要する医療ニーズを満たしています。リリーについての詳細は以下のウェブサイトをご覧ください。[www.lilly.com](http://www.lilly.com)

## リリーの糖尿病事業について

リリーは 85 年以上にわたり糖尿病の患者さんの生命ならびに治療を支援する企業として、常に世界をリードしてきました。リリーは世界初の商業用インスリンを 1923 年に開発した企業であり、糖尿病を管理するための医薬品ならびに投与システム分野で今も最先端を走り続けています。また、リリーは、実用的なツール、教育、支援プログラムなど、治療以外のソリューションの提供にも注力しており、こうしたプログラムは長期にわたる糖尿病治療における障壁の克服に寄与しています。糖尿病と共に生き、治療を続ける患者さん一人ひとりの道のりが、リリーの活動の原動力となっています。詳細は以下のウェブサイトをご覧ください。

[www.lillydiabetes.com](http://www.lillydiabetes.com).

## 日本イーライリリーについて

日本イーライリリー株式会社は、イーライリリー・アンド・カンパニーの子会社で、革新的な医薬品の輸入・開発・製造・販売を通じて日本の医療に貢献しています。統合失調症、うつ、注意欠陥・多動性障害 (AD/HD)、がん (非小細胞肺癌、膵がん、胆道がん、悪性胸膜中皮腫、尿路上皮がん、乳がん、卵巣がん)、糖尿病、成長障害、骨粗鬆症をはじめとする、ニューロサイエンス領域、がん領域、糖尿病領域、成長障害領域や筋骨格領域における治療法を提供しています。詳細はホームページをご覧ください。

<http://www.lilly.co.jp>

###

\*\*\*\*\*

本件についてのお問い合わせ先:

- ・ ベーリンガーインゲルハイム ジャパン株式会社 広報部 TEL 03-6417-2145
- ・ 日本イーライリリー株式会社 渉外企画部 山本 TEL 078-242-9462

\*\*\*\*\*

References:

- 1 林直行 他:承認時資料 国内第Ⅲ相試験
- 2 Port A, et al: 承認時資料 腎機能障害患者における薬物動態試験
- 3 Thomas L, et al: J Pharmacol Exp Ther. 325(1):175,2008
- 4 Rauch T, et al: 承認時資料 2 型糖尿病患者を対象としたバイオマーカー検討試験
- 5 林直之他:承認時資料 健康成人を対象とした単回投与試験
- 6 林直之 他:承認時資料 健康成人を対象とした反復投与試験
- 7 厚生労働省 2007 年国民健康・栄養調査
- 8 World Health Organization. Fact Sheet No. 312: What is Diabetes? Available at: <http://www.who.int/mediacentre/factsheets/fs312/en/>. Accessed on: April 27, 2011.
- 9 International Diabetes Federation. Diabetes Atlas. 3rd edn. Brussels: International Diabetes Federation, 2006.
- 10 1999~2004 年における, NHANES IV(the Fourth National Health and Nutrition Examination Survey) に参加していた 20 歳以上の糖尿病患者 1462 例のデータに基づく
- 11 Cea-Calvo, et al. Cardiovascular Diabetology 2006;5:23
- 12 Haneda M, Morikawa A. Nephrol Dial Transplant 2009;24(2):338-41