

貯 法：室温保存
開封後は高温・高湿を避けて保存すること
使用期限：外箱に表示
規制区分：処方箋医薬品^(注)
注)注意-医師等の処方箋により使用すること

日本標準商品分類番号
873969

	OD錠0.2mg	OD錠0.3mg
承認番号	21900AMX00354000	21900AMX00355000
薬価収載	2007年7月	2007年7月
販売開始	2007年7月	2007年7月
* 効能追加	2014年4月	—

*食後過血糖改善剤

ボグリボースOD錠0.2mg「MED」

ボグリボースOD錠0.3mg「MED」

VOGLIBOSE OD

ボグリボース口腔内崩壊錠

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

- 1)重症ケトosis、糖尿病性昏睡又は前昏睡の患者〔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)本剤の成分に対する過敏症の既往歴のある患者

75g経口ブドウ糖負荷試験の血糖2時間値が140~199mg/dL)と判断され、糖尿病発症抑制の基本である食事療法・運動療法を3~6ヵ月間行っても改善されず、かつ高血圧症、脂質異常症(高トリグリセリド血症、低HDLコレステロール血症等)、肥満(Body Mass Index : BMI 25kg/m²以上)、2親等以内の糖尿病家族歴のいずれかを有する場合に限定すること。

【組成・性状】

・組成

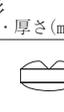
ボグリボースOD錠0.2mg「MED」：1錠中に日局ボグリボース0.2mgを含有する。

添加物として、アスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)、粉末還元麦芽糖水アメ、軽質無水ケイ酸、黄色三酸化鉄、ステアリン酸マグネシウム、マルトース、D-マンニトールを含有する。

ボグリボースOD錠0.3mg「MED」：1錠中に日局ボグリボース0.3mgを含有する。

添加物として、アスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)、粉末還元麦芽糖水アメ、軽質無水ケイ酸、黄色三酸化鉄、ステアリン酸マグネシウム、マルトース、D-マンニトールを含有する。

・製剤の性状

品名	剤形	外形			性状
		直径(mm)	重量(mg)	厚さ(mm)	
ボグリボースOD錠0.2mg「MED」	割線入り素錠(口腔内崩壊錠)				帯黄白色
ボグリボースOD錠0.3mg「MED」	素錠(口腔内崩壊錠)				微黄色

*【効能・効果】

○糖尿病の食後過血糖の改善

(ただし、食事療法・運動療法を行っている患者で十分な効果が得られない場合、又は食事療法・運動療法に加えて経口血糖降下剤若しくはインスリン製剤を使用している患者で十分な効果が得られない場合に限る)

○耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制【OD錠0.2mgのみ】

(ただし、食事療法・運動療法を十分に行っても改善されない場合に限る)

*【用法・用量】

○糖尿病の食後過血糖の改善の場合

通常、成人にはボグリボースとして1回0.2mgを1日3回毎食直前に経口投与する。なお、効果不十分な場合には、経過を十分に観察しながら1回量を0.3mgまで増量することができる。

○耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制の場合

【OD錠0.2mgのみ】

通常、成人にはボグリボースとして1回0.2mgを1日3回毎食直前に経口投与する。

*【用法・用量に関連する使用上の注意】

全効能共通

本剤は口腔内に崩壊するが、口腔の粘膜から吸収されることはないため、唾液又は水で飲み込むこと。〔適用上の注意〕の項参照)

耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制の場合

【OD錠0.2mgのみ】

本剤投与中は適切な間隔で血糖管理に関する検査を行い、常に投与継続の必要性に注意すること。〔重要な基本的注意〕の項参照)

【使用上の注意】

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- 1)他の糖尿病用薬を投与中の患者〔低血糖が起こることがある。〕(〔重大な副作用〕の項参照)
- 2)開腹手術の既往又は腸閉塞の既往のある患者〔腸内ガス等の増加により腸閉塞が発現しやすい。〕
- 3)消化・吸収障害を伴った慢性腸疾患の患者〔本剤の作用により病態が悪化することがある。〕
- 4)ロエムヘルド症候群、重度のヘルニア、大腸の狭窄・潰瘍等の患者〔腸内ガス等の増加により症状が悪化することがある。〕
- 5)重篤な肝障害のある患者〔代謝状態が変化することがあるため血糖管理状況が大きく変化のおそれがある。また、重篤な肝硬変例で、高アンモニア血症が増悪し意識障害を伴うことがある。〕
- 6)重篤な腎障害のある患者〔代謝状態が変化することがあるため血糖管理状況が大きく変化のおそれがある。〕
- 7)高齢者〔「高齢者への投与」の項参照〕

*【効能・効果に関連する使用上の注意】

耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制の場合

【OD錠0.2mgのみ】

本剤の適用は、耐糖能異常(空腹時血糖が126mg/dL未満かつ

* 2. 重要な基本的注意

全効能共通

- 1) 糖尿病の診断が確立した患者又は耐糖能異常を有する者に対してのみ適用を考慮すること。これら以外にも尿糖陽性等の類似症状を呈する疾患(腎性糖尿、老人性糖代謝異常、甲状腺機能異常、慢性膵炎等の膵臓疾患、薬剤起因性の耐糖能異常等)があることに留意すること。
- 2) 本剤の適用はあらかじめ糖尿病治療及び糖尿病発症抑制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。
- 3) 本剤は低血糖症状を起こすことがあるので、糖尿病患者又は耐糖能異常を有する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。また、高所作業、自動車の運転等に従事している糖尿病患者又は耐糖能異常を有する者に投与するときには注意すること。〔「重大な副作用」の項参照〕

糖尿病の食後過血糖の改善の場合

- 1) 糖尿病治療の基本である食事療法・運動療法のみを行っている患者では、投与の際の食後血糖2時間値は200mg/dL以上を示す場合に限る。
- 2) 食事療法、運動療法に加えて経口血糖降下剤又はインスリン製剤を使用している患者では、投与の際の空腹時血糖値は140mg/dL以上を目安とする。
- 3) 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、常に投与継続の必要性について注意を払うこと。本剤を2～3ヵ月投与しても食後血糖に対する効果が不十分な場合(静脈血漿で食後血糖2時間値が200mg/dL以下にコントロールできないなど)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。
なお、食後血糖の十分なコントロール(静脈血漿で食後血糖2時間値が160mg/dL以下)が得られ、食事療法・運動療法又はこれらに加えて経口血糖降下剤若しくはインスリンを使用するのみで十分と判断される場合には、本剤の投与を中止して経過観察を行うこと。

耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制の場合

本剤の投与開始後は、1～3ヵ月毎を目安に空腹時血糖、随時血糖、HbA1c等の糖代謝関連検査及び体重測定を実施するとともに、6～12ヵ月毎を目安に75g経口ブドウ糖負荷試験を実施して十分に経過観察し、常に投与継続の必要性に留意すること。また、血糖高値(空腹時血糖、75g経口ブドウ糖負荷試験の血糖2時間値)や糖負荷後初期インスリン分泌低下等を有する場合には、糖尿病発症リスクが高くなるとの報告があるので、十分な観察を行うこと。
なお、2型糖尿病と診断された場合には、適切と考えられる治療への変更を考慮すること。また、本剤投与開始後に耐糖能異常が改善し、食事療法・運動療法のみで十分と判断される場合には、本剤の投与を中止して糖代謝関連検査等による経過観察を行うこと。

3. 相互作用

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・機序等
糖尿病用薬 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 インスリン抵抗性改善剤	インスリン及びスルホニルウレア系薬剤と併用した際に、低血糖発現の報告があるので、左記薬剤との併用時には、低血糖発現の可能性を考慮し、低用量から投与を開始するなど慎重に投与すること。

薬剤名等	臨床症状・措置方法・機序等
糖尿病用薬及びその血糖降下作用を増強又は減弱する薬剤を併用している場合 1) 糖尿病用薬の血糖降下作用を増強する薬剤 β遮断剤 サリチル酸剤 モノアミン酸化酵素阻害剤 フィブラート系の高脂血症治療剤 ワルファリン 等	左記の併用に加え更に本剤を併用する場合には、糖尿病用薬の使用上の注意に記載の相互作用に留意するとともに、本剤の糖質吸収遅延作用が加わることによる影響に十分注意すること。
2) 糖尿病用薬の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	

4. 副作用

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。

1) 重大な副作用(頻度不明)

- (1) 他の糖尿病用薬との併用で**低血糖**があらわれることがある。また、他の糖尿病用薬を併用しない場合でも**低血糖**が報告されている。本剤は二糖類の消化・吸収を遅延するので、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など適切な処置を行うこと。
- (2) 腹部膨満、鼓腸、放屁増加等があらわれ、腸内ガス等の増加により、**腸閉塞**があらわれることがあるので、観察を十分に行い、持続する腹痛、嘔吐等の症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- (3) **劇症肝炎**、AST(GOT)、ALT(GPT)の上昇等を伴う**重篤な肝機能障害**、**黄疸**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。
- (4) **重篤な肝硬変例に投与した場合**、便秘等を契機として**高アンモニア血症が増悪し、意識障害**を伴うことがあるので、排便状況等を十分に観察し、異常が認められた場合には直ちに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

	頻度不明
消化器	下痢、放屁、腹部膨満、軟便、腹鳴、腹痛、便秘、食欲不振、悪心、嘔吐、胸やけ、口渇、口内炎、味覚異常、腸管囊胞様気腫症
過敏症^{注)}	発疹、痒痒、光線過敏症
肝臓	AST(GOT)、ALT(GPT)、LDH、γ-GTP、Al-Pの上昇
精神神経系	めまい、頭痛、ふらつき、眠気
血液	貧血、血小板減少、顆粒球減少
その他	しびれ、顔面等の浮腫、眼のかすみ、ほてり、倦怠感、脱力感、高カリウム血症、血清アミラーゼ上昇、HDLコレステロール低下、発汗、脱毛

注)このような場合には投与を中止すること。

5. 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、低用量(例えば1回量0.1mg)から投与を開始するとともに、血糖値及び消化器症状の発現に留意するなど、経過を十分に観察しながら慎重に投与すること。

6. 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治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合のみ投与すること。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕

2)授乳中の婦人への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合は、授乳を避けさせること。〔動物試験(ラット)で、母動物の糖質吸収の抑制に起因する乳汁産生の抑制によると考えられる出生児の体重の増加抑制が認められている。〕

7.小児等への投与

小児に対する安全性は確立していない(使用経験がない)。

8.適用上の注意

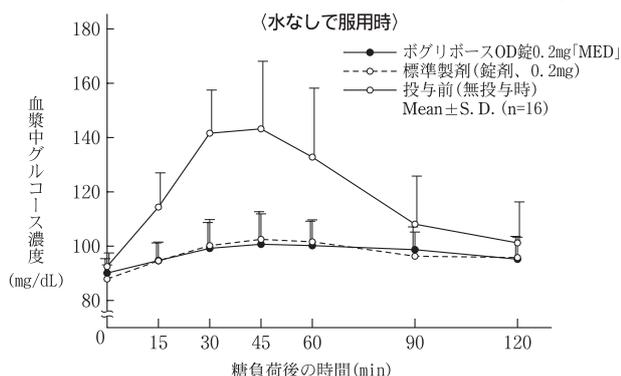
- 1)薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。(PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている)
- 2)服用時：本剤は舌の上のにせ唾液を浸潤させ舌で軽くつぶし、崩壊後唾液のみで服用可能である。また、水で服用することもできる。

【薬効薬理】

1. ボグリボースは腸管での糖質の消化・吸収を遅延させて、食後の急峻な血糖上昇を抑制する。
2. ボグリボースの糖質の消化・吸収遅延作用は、腸管において二糖類から単糖への分解に関与する二糖類水解酵素(α -グルコシダーゼ)を選択的に阻害することにより生ずると考えられている。
3. 生物学的同等性試験
 - ボグリボースOD錠0.2mg「MED」
 ボグリボースOD錠0.2mg「MED」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(ボグリボースとして0.2mg)を1日3回毎食直前にのべ4日間(9回)連続経口投与(クロスオーバー法)した。投与前及び最終投与直後にショ糖負荷(50%溶液、200ml)し経時的に血漿中グルコース濃度を測定した。得られたパラメータ(Δ AUC、 Δ Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾
 [Δ AUC：投与前後の血漿中グルコース濃度-時間曲線下面積の差、 Δ Cmax：投与前後の最高血漿中グルコース濃度の差]

		Δ Cmax (mg/dL)	Δ AUC _{0-120min} (mg·min/dL)
水なし	ボグリボースOD錠0.2mg「MED」	44.6±18.7	2689.0±1340.7
	標準製剤(錠剤、0.2mg)	43.8±21.0	2697.1±1343.7
水あり	ボグリボースOD錠0.2mg「MED」	50.8±16.9	3238.1±1355.1
	標準製剤(錠剤、0.2mg)	50.6±17.1	3315.7±1279.1

(Mean±S. D., n=16)

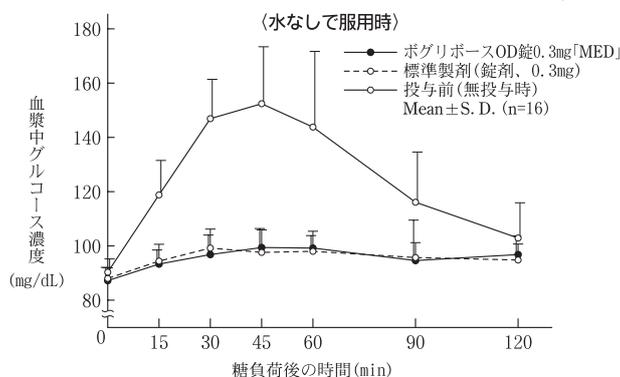


- ボグリボースOD錠0.3mg「MED」

ボグリボースOD錠0.3mg「MED」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(ボグリボースとして0.3mg)を1日3回毎食直前にのべ4日間(9回)連続経口投与(クロスオーバー法)した。投与前及び最終投与直後にショ糖負荷(50%溶液、200ml)し経時的に血漿中グルコース濃度を測定した。得られたパラメータ(Δ AUC、 Δ Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。²⁾
 [Δ AUC：投与前後の血漿中グルコース濃度-時間曲線下面積の差、 Δ Cmax：投与前後の最高血漿中グルコース濃度の差]

		Δ Cmax (mg/dL)	Δ AUC _{0-120min} (mg·min/dL)
水なし	ボグリボースOD錠0.3mg「MED」	53.4±19.1	3695.2±1467.9
	標準製剤(錠剤、0.3mg)	55.5±21.0	3673.7±1513.9
水あり	ボグリボースOD錠0.3mg「MED」	48.7±16.2	2939.0±1482.3
	標準製剤(錠剤、0.3mg)	48.4±15.3	3049.8±1388.5

(Mean±S. D., n=16)



血漿中グルコース濃度ならびに Δ AUC、 Δ Cmax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。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ボグリボース (Voglibose)

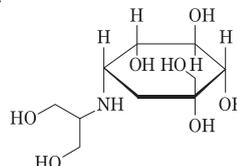
化学名：3, 4-Dideoxy-4-[2-hydroxy-1-(hydroxymethyl)ethylamino]-2-C-(hydroxymethyl)-D-*epi*-inositol

分子式：C₁₀H₂₁NO₇

分子量：267.28

融点：163~168℃

構造式：



性状：ボグリボースは白色の結晶又は結晶性の粉末である。水に極めて溶けやすく、酢酸(100)に溶けやすく、メタノールに溶けにくく、エタノール(99.5)に極めて溶けにくい。0.1mol/L塩酸試液に溶ける。

【取扱い上の注意】

・安定性試験

PTP包装(PTPシートをアルミピロー包装(乾燥剤入り))したものを用いた加速試験(40℃75%RH、6ヶ月)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。^{3), 4)}

【包装】

ボグリボースOD錠0.2mg「MED」

PTP：100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50)

ボグリボースOD錠0.3mg「MED」

PTP：100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50)

*【保険給付上の注意】

耐糖能異常における2型糖尿病の発症抑制(ただし、食事療法及び運動療法を十分に行っても改善されない場合に限る。)を目的に使用する場合、保険適用上の取扱いを以下のとおりとすること。

- 1)耐糖能異常(空腹時血糖が126mg/dL未満かつ75g経口ブドウ糖負荷試験の血糖2時間値が140~199mg/dL)と判断され、糖尿病発症抑制の基本である食事療法及び運動療法を3~6ヵ月間行っても改善されず、かつ高血圧症、脂質異常症(高トリグリセリド血症、低HDLコレステロール血症等)のいずれかを基礎疾患として有する患者を対象とする場合に限り、保険適用されるものとする。



2) 診療報酬明細書の摘要欄には、耐糖能異常と判断した根拠(判断した年月日とその結果)、食事療法及び運動療法を3～6ヵ月間行っても改善されなかった旨及び高血圧症又は脂質異常症の診断名を記載する。

【主要文献及び文献請求先】

・ **主要文献**

- 1)、2) メディサ新薬(株)社内資料[生物学的同等性試験]
- 3)、4) メディサ新薬(株)社内資料[安定性試験]

・ **文献請求先** [主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい]

日本ジェネリック株式会社 お客様相談室
〒100-6739 東京都千代田区丸の内一丁目9番1号
TEL 0120-893-170 FAX 0120-893-172



販売元

日本ジェネリック株式会社
東京都千代田区丸の内一丁目9番1号

製造販売元

メディサ新薬株式会社
大阪市淀川区宮原5丁目2-27

600049000-009
D09 A180209

A